

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成29年12月28日(2017.12.28)

【公表番号】特表2017-502940(P2017-502940A)

【公表日】平成29年1月26日(2017.1.26)

【年通号数】公開・登録公報2017-004

【出願番号】特願2016-538535(P2016-538535)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/4375 (2006.01)

A 6 1 K 31/5375 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

A 6 1 K 31/5386 (2006.01)

A 6 1 K 31/4155 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 31/4965 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 471/10 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/02 (2006.01)

C 0 7 D 471/08 (2006.01)

C 0 7 D 403/14 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/04 C S P

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 31/4375

A 6 1 K 31/5375

A 6 1 K 31/505

A 6 1 K 31/551

A 6 1 K 31/5386

A 6 1 K 31/4155

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/517

A 6 1 K 31/4965

C 0 7 D 471/04 1 0 4 H

C 0 7 D 471/04 1 0 6 C

C 0 7 D 487/04 1 3 7

C 0 7 D 487/04 1 5 0

C 0 7 D 487/04 1 4 9

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 471/10  
 C 0 7 D 403/12  
 C 0 7 D 401/14  
 C 0 7 D 405/14  
 C 0 7 D 471/04 1 0 1  
 C 0 7 D 487/04 1 4 2  
 C 0 7 D 403/02  
 C 0 7 D 471/08  
 C 0 7 D 403/14  
 C 0 7 D 471/04 1 0 6 H

## 【手続補正書】

【提出日】平成29年11月15日(2017.11.15)

## 【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

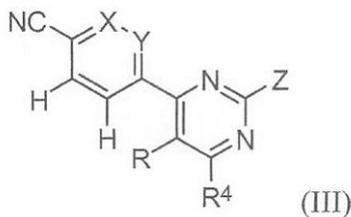
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(III)の構造を持つ化合物、又はその薬学的に許容可能な塩であって、

【化1】



式中、

XとYはそれぞれ独立して、C-H、C-F、C-CH<sub>3</sub>、又はNから独立して選択され；

Zは、-G、-CH<sub>2</sub>-G、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-G、-N(R<sup>1</sup>)-G、-N(R<sup>1</sup>)-CH<sub>2</sub>-G、-OG、-O-CH<sub>2</sub>-G、又は-C(O)N(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)から選択され；

Gはカルボシクリル、アリール、ヘテロシクリル、又はヘテロアリールであり；

R<sup>1</sup>は水素又はアルキルであり；

R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>は、独立して、水素、アルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキルから選択され、或いは、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>はN結合型複素環系を形成するために結合し；

Rは、アルコキシ、カルボシクリルアルキルオキシ、カルボシクリル、カルボシクリルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アルキニル、カルボシクリルアルキニル、ヘテロシクリルアルキニル、又はヘテロアリールアルキニルから選択され；及び

R<sup>4</sup>は、水素、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ、又は-N(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)である

ことを特徴とする化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項2】

XはC-Hである、ことを特徴とする請求項1に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項3】

XはC - Fである、ことを特徴とする請求項1に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項4】

XはC - CH<sub>3</sub>である、ことを特徴とする請求項1に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項5】

XはNである、ことを特徴とする請求項1に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項6】

YはC - Hである、ことを特徴とする請求項1乃至5に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項7】

YはC - Fである、ことを特徴とする請求項1乃至5に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項8】

YはC - CH<sub>3</sub>である、ことを特徴とする請求項1乃至5に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項9】

YはNである、ことを特徴とする請求項1乃至5に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項10】

XはC - Hであり、YはC - Hである、ことを特徴とする請求項1に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項11】

Zは-O - CH<sub>2</sub> - Gである、ことを特徴とする請求項1乃至10に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項12】

Zは-O - Gである、ことを特徴とする請求項1乃至10に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項13】

Zは-N(R<sup>1</sup>) - CH<sub>2</sub> - Gである、ことを特徴とする請求項1乃至10に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項14】

Zは-N(R<sup>1</sup>) - CH<sub>2</sub> - Gであり、R<sup>1</sup>は水素である、ことを特徴とする請求項1乃至10に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項15】

Zは-N(R<sup>1</sup>) - CH<sub>2</sub> - Gであり、R<sup>1</sup>はアルキルである、ことを特徴とする請求項1乃至10に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項16】

Zは-N(R<sup>1</sup>) - Gである、ことを特徴とする請求項1乃至10に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項17】

Zは-N(R<sup>1</sup>) - Gであり、R<sup>1</sup>は水素である、ことを特徴とする請求項1乃至10に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項18】

Zは-N(R<sup>1</sup>) - Gであり、R<sup>1</sup>はアルキルである、ことを特徴とする請求項1乃至10に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項19】

Zは-CH<sub>2</sub> - CH<sub>2</sub> - Gである、ことを特徴とする請求項1乃至10に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 20】

Zは -CH<sub>2</sub>-Gである、ことを特徴とする請求項 1 乃至 10 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 21】

Zは -Gである、ことを特徴とする請求項 1 乃至 10 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 22】

Zは -C(O)N(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)である、ことを特徴とする請求項 1 乃至 10 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 23】

Zは -C(O)N(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)であり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>は独立して水素又はアルキルから選択される、ことを特徴とする請求項 1 乃至 10 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 24】

Zは -C(O)N(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)であり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>は独立して水素、アルキル、又はヘテロシクリルから選択される、ことを特徴とする請求項 1 乃至 10 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 25】

Zは -C(O)N(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)であり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>は独立して水素、アルキル、又はヘテロシクリルアルキルから選択される、ことを特徴とする請求項 1 乃至 10 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 26】

Zは -C(O)N(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)であり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>は、N結合型ヘテロシクリル環系を形成するために結合する、ことを特徴とする請求項 1 乃至 10 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 27】

Zは -C(O)N(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)であり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>はN結合型ヘテロシクリル環系を形成するために結合し、ヘテロシクリルは、随意に置換したピペリジニル、ピペリジニル、モルホリニル、又はピロリジニルの基から選択される、ことを特徴とする請求項 1 乃至 10 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 28】

Zは -C(O)N(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)であり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>は共にアルキルであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>は、N結合型ヘテロシクリル環系を形成するために結合する、ことを特徴とする請求項 1 乃至 10 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 29】

R<sup>4</sup>は水素である、ことを特徴とする請求項 1 乃至 28 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 30】

R<sup>4</sup>はC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシである、ことを特徴とする請求項 1 乃至 28 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 31】

R<sup>4</sup>は -N(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)である、ことを特徴とする請求項 1 乃至 28 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 32】

R<sup>4</sup>は -N(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)であり、R<sup>2</sup>は水素であり、R<sup>3</sup>はメチルである、ことを特徴とする請求項 1 乃至 28 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 33】

R<sup>4</sup>は -N(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)であり、R<sup>2</sup>は水素であり、R<sup>3</sup>はエチルである、ことを特徴とする請求項 1 乃至 28 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 34】

$R^4$  は  $-N(R^2)(R^3)$  であり、 $R^2$  はメチルであり、 $R^3$  はメチルである、ことを特徴とする請求項 1 乃至 28 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 35】

G はヘテロシクリルである、ことを特徴とする請求項 1 乃至 34 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 36】

G は窒素含有ヘテロシクリルである、ことを特徴とする請求項 1 乃至 34 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

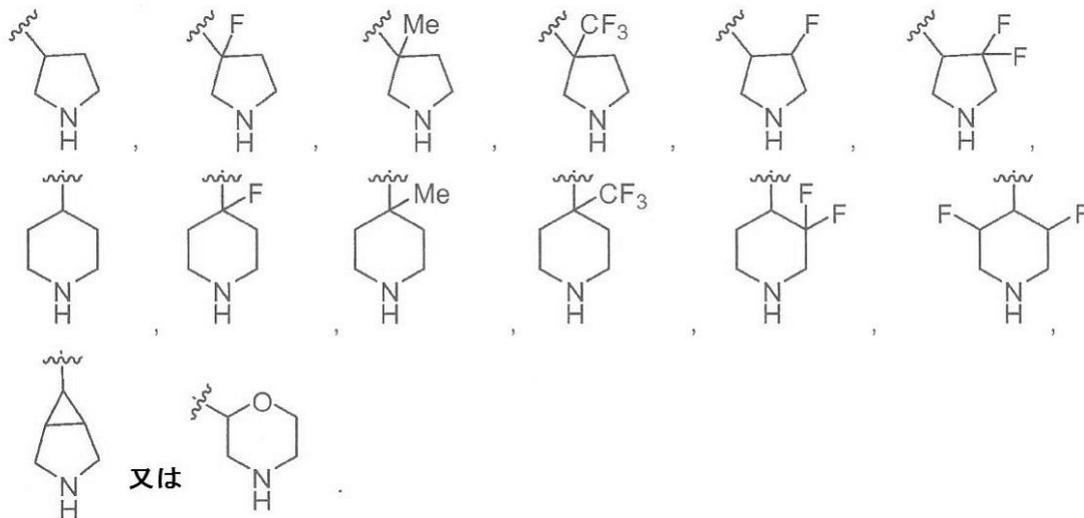
【請求項 37】

G は窒素含有ヘテロシクリルであり、窒素含有ヘテロシクリルは 5 員又は 6 員のヘテロシクリルである、ことを特徴とする請求項 1 乃至 34 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 38】

G は窒素含有ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルは以下から選択される、ことを特徴とする請求項 1 乃至 34 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

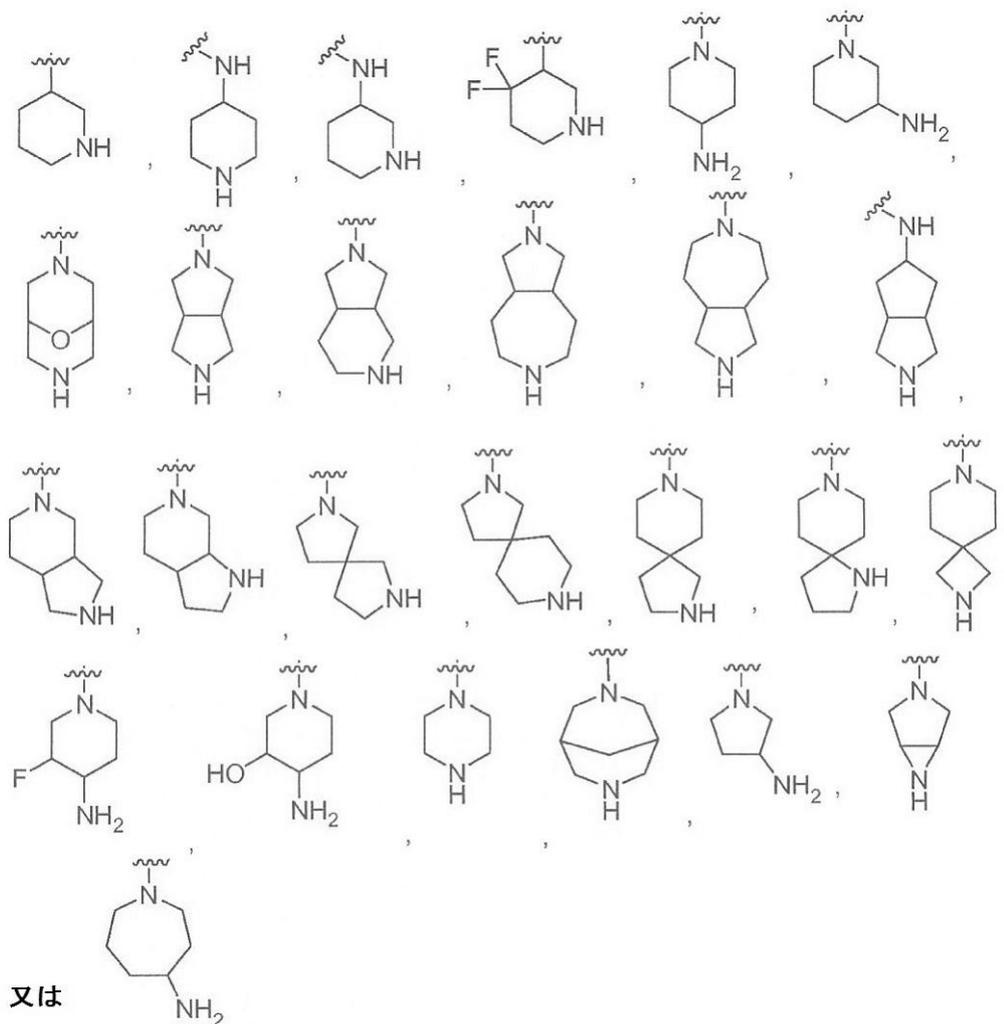
【化 2】



【請求項 39】

G は窒素含有ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルは以下から選択される、ことを特徴とする請求項 1 乃至 34 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【化 3】



## 【請求項 4 0】

Gはヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルは、随意に置換したピペリジニル、ピペリジニル、モルホリニル、又はピロリジニルの基から選択される、ことを特徴とする請求項 1 乃至 3 4 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 4 1】

Rは、アルキニル、カルボシクリルアルキニル、ヘテロシクリルアルキニル、又はヘテロアリアルアルキニルから選択される、ことを特徴とする請求項 1 乃至 4 0 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 4 2】

Rはアルコキシ又はカルボシクリルアルキルオキシから選択される、ことを特徴とする請求項 1 乃至 4 0 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 4 3】

Rはヘテロアリアル又はヘテロシクリルから選択される、ことを特徴とする請求項 1 乃至 4 0 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 4 4】

Rはカルボシクリル、カルボシクリルアルキル、アリアル、又はアラルキルから選択される、ことを特徴とする請求項 1 乃至 4 0 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 4 5】

Rはアリアルである、ことを特徴とする請求項 1 乃至 4 0 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 4 6】

Rはアリールであり、アリール基は随意に置換したフェニル基である、ことを特徴とする請求項1乃至40に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項47】

Rはアリールであり、アリール基は、4-メチルフェニル、4-クロロフェニル、4-フルオロフェニル、4-シアノフェニル、4-(メチルスルホニル)フェニル、又は4-トリフルオロメチルフェニルから選択される、随意に置換したフェニル基である、ことを特徴とする請求項1乃至40に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項48】

Rはヘテロアリールである、ことを特徴とする請求項1乃至40に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項49】

Rはヘテロアリールであり、ヘテロアリール基は、随意に置換したピラゾリル、イミダゾリル、ピロリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、又はピリダジニルである、ことを特徴とする請求項1乃至40に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

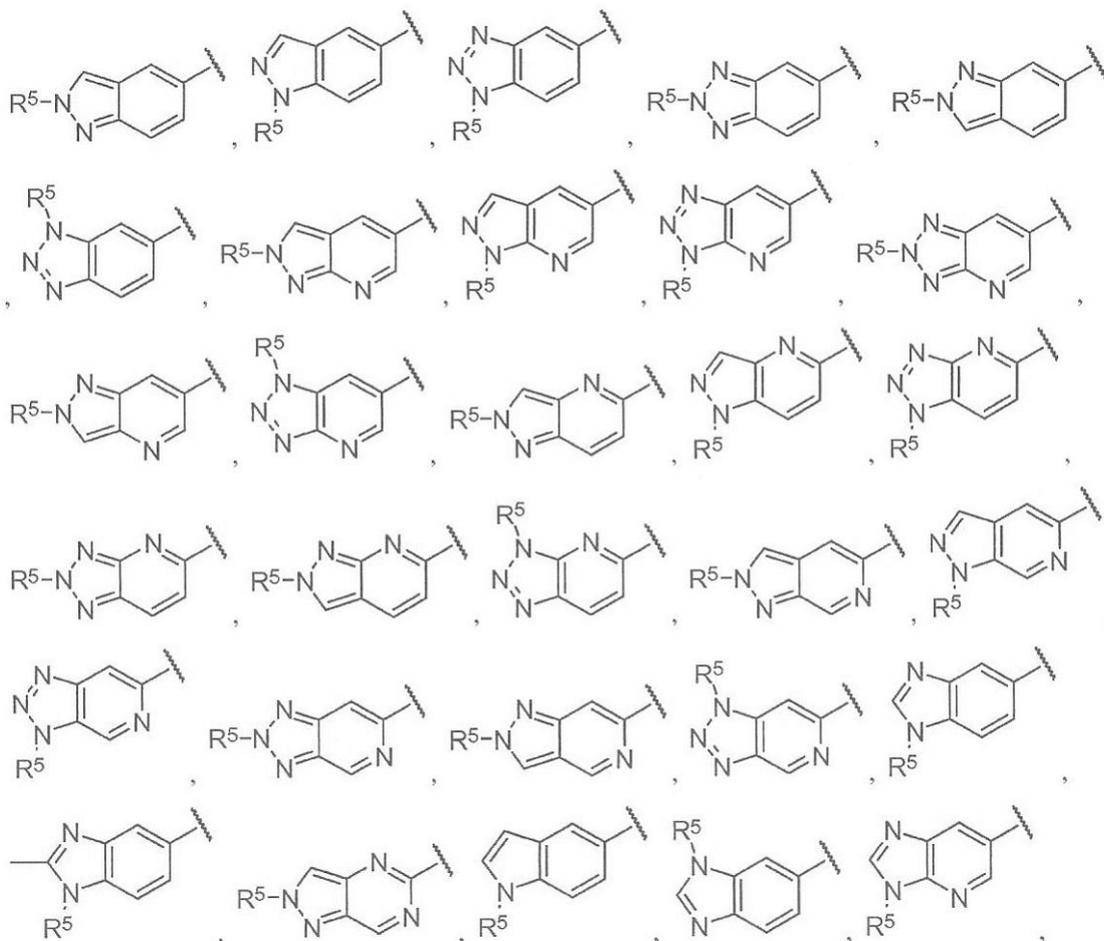
【請求項50】

Rは二環式の窒素含有環である、ことを特徴とする請求項1乃至40に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

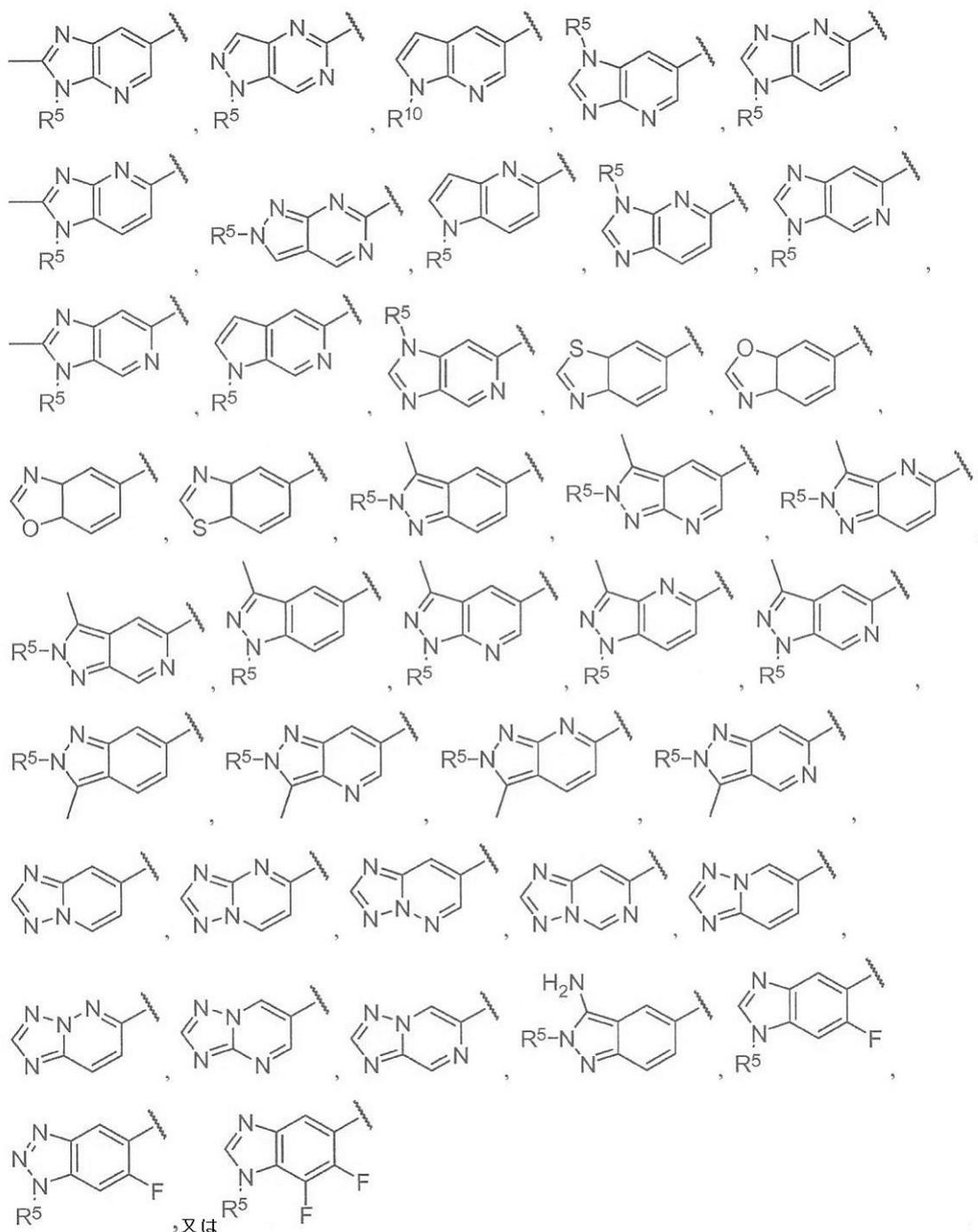
【請求項51】

Rは以下から選択され：

【化4-1】



## 【化 4 - 2】



式中、R<sup>5</sup>は、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アリール又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシである、ことを特徴とする請求項1乃至40の何れか1つに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項52】

式(III)の化合物又はその薬学的に許容可能な塩と、薬学的に許容可能な賦形剤とを含む、医薬組成物。

## 【請求項53】

式(III)の化合物にリジン特異的デメチラーゼ1酵素をさらすことにより、リジン特異的デメチラーゼ1の活性を阻害することを含み、細胞の遺伝子転写を調節するための薬物の製造における、請求項1乃至51の何れか1つに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用。

## 【請求項54】

式(III)の化合物又はその薬学的に許容可能な塩を、必要とする患者に投与するこ

とを含む、患者の癌を処置するための薬物の製造における、請求項 1 乃至 5 1 の何れか 1 つに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用。