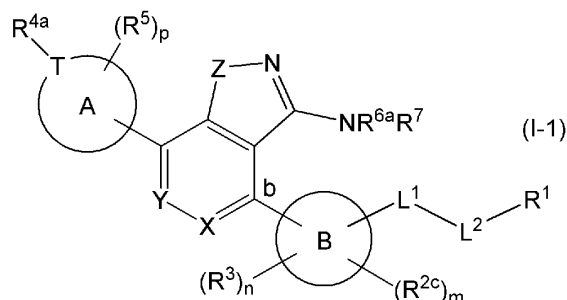


請求の範囲

[請求項1] 一般式 (I-1)

[化1]



[式中、XおよびYは各々-C H=または窒素原子を表し（但し、XおよびYの両方が同時に-C H=を表さない。）、Zは、酸素原子または硫黄原子を表し、Tは、炭素原子または窒素原子を表し、環Aは、5～7員単環を表し、環Bは、5～7員単環または8～10員二環を表し、L¹は、結合手、-O-、-CONH-、-CO-、-CO₂-、-S-、-SO₂-または-SO-を表し、L²は、結合手、C1～3アルキレン基、C3～7シクロアルキレン基またはフェニレン基を表し、R¹は、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、N(R^{1a})₂（ここで、二つのR^{1a}は、各々独立して、水素原子またはC1～4アルキル基を表す。）、C1～4アルキル基、カルボキシ基、C1～4アルコキシカルボニル基、C1～4ハロアルキル基、メチル-d₃基、C3～7シクロアルキル基、フェニル基または3～7員単環式非芳香族複素環を表し、R^{2c}は、水素原子、水酸基、ハロゲン原子、オキソ基、ニトロ基、シアノ基、C1～4アルコキシ基または-CH₂NR^{2d}R^{2e}もしくはNR^{2d}R^{2e}（ここで、R^{2d}は、水素原子、C1～4アルキル基またはR^{FR}を表し、R^{2e}は水素原子を表す。）を表し、mは0または1の整数を表し、R³は、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、C1～4アルキル基、C1～4アルコキシ基、C1～4ハロアルキル基、C1～4ハロアルコキシ基またはアミノ基を

表し、 n は1～16の整数を表し（ここで、 n が2以上の場合、複数の R^3 が表す基は同じでも異なってもよい。）、 R^{4a} は、水素原子、C1～4アルキル基、カルボキシ基または R^{FR} を表し、 R^5 はC1～4アルキル基を表し、 p は0～5の整数を表し（ここで、 p が2以上の場合、複数の R^5 が表す基は同じでも異なってもよい。）、 R^{6a} は、水素原子、C1～4アルキル基または R^{FR} を表し、 R^7 は水素原子を表し、 b は環Bの結合位置を表し、 R^{FR} は、 $-(CR^{Fb_2})_qOP(=O)(OR^{Fa})_2$ [式中、 R^{Fa} は、各々独立して、水素原子、C1～4アルキル基、C3～6シクロアルキル基、 $-(CH_2)_2OH$ または $-CH_2OCO_2CH(CH_3)_2$ を表し、 R^{Fb} は、水素原子またはメチル基を表し、 q は1または2の整数を表す（ここで、複数の R^{Fb} が表す基は同じでも異なってもよい。）。]を表す。但し、 R^{2d} 、 R^{4a} および R^{6a} のうちの二つ以上は、同時に R^{FR} を表さない。]で示される化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

- [請求項2] 環Aが、(a) C5～6単環式炭素環もしくは(b)酸素原子、窒素原子および硫黄原子から選択される1～4個のヘテロ原子を含む5～6員単環式複素環である、請求項1記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。
- [請求項3] 環Bが、(a) C5～6単環式炭素環もしくは(b)酸素原子、窒素原子および硫黄原子から選択される1～4個のヘテロ原子を含む5～6員単環式複素環である、請求項1もしくは2記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。
- [請求項4] 環Aが、(a) ベンゼン環もしくは(b) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子から選択される1～4個のヘテロ原子を含む5～6員単環式芳香族複素環である、請求項1もしくは3記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。
- [請求項5] 環Bが、(a) ベンゼン環もしくは(b) 酸素原子、窒素原子および

硫黄原子から選択される 1～4 個のヘテロ原子を含む 5～6 員単環式芳香族複素環である、請求項 1、2 および 4 の何れか一項記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

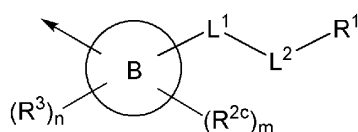
[請求項6] 環 A が、1～4 個の窒素原子を含み、その他のヘテロ原子を含まない 5～6 員単環式芳香族含窒素複素環を表す、請求項 1、3 および 5 の何れか一項記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

[請求項7] Z が酸素原子である、請求項 1～6 の何れか一項記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

[請求項8] X が窒素原子であり、Y が $-CH=$ である、請求項 1～7 の何れか一項記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

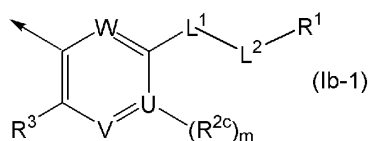
[請求項9] 一般式 (I-1) の

[化2]



[式中、矢印は一般式 (I-1) 中の b で示される炭素原子に結合し、その他の記号は請求項 1 と同じ意味を表す。] が、式 (Ib-1)

[化3]

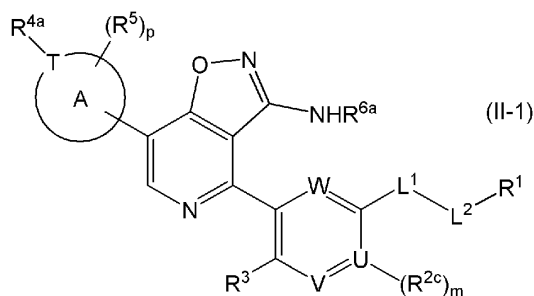


[式中、U は窒素原子または炭素原子を表し（ここで、U が窒素原子を表す場合、m は 0 を表し、U が炭素原子を表す場合、m は 1 を表す。）、W は $-CR^3=$ または窒素原子を表し、V は $-CH=$ または窒素原子を表し、式 (Ib-1) が複数の R^3 を有する場合、それらが表す基は同じでも異なってもよく、その他の記号は前記および請

求項 1 と同じ意味を表す。] で示される基である、請求項 1 ～ 8 の何れか一項記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

[請求項10] 一般式 (I-1) で示される化合物が、一般式 (II-1)

[化4]



[式中、すべての記号は請求項 1 および 9 と同じ意味を表す。] で示される化合物である、請求項 1 記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

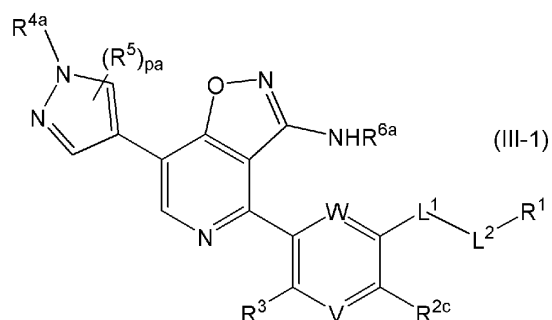
[請求項11] T が窒素原子である、請求項 1 ～ 10 の何れか一項記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

[請求項12] U が炭素原子である、請求項 9 ～ 11 の何れか一項記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

[請求項13] 環 A が、ピラゾール、トリアゾール、テトラゾール、オキサゾール、イソオキサゾール、イミダゾール、チアゾールまたはイソチアゾールである、請求項 1、3、5 および 7 ～ 12 の何れか一項記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

[請求項14] 一般式 (I-1) で示される化合物が、一般式 (III-1)

[化5]



[式中、 p_a は0～2の整数を表し、その他の記号は請求項1および9と同じ意味を表す。]で示される化合物である、請求項1記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

[請求項15] L^2 が、結合手またはC1～3アルキレン基である、請求項1～14の何れか一項記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

[請求項16] L^1 が、 $-CONH-$ （但し、当該基の左側が環Bに結合する。）、 $-CO-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-$ または $-SO-$ である、請求項1～15の何れか一項記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

[請求項17] R^1 が、水素原子またはC1～4アルキル基である、請求項1～16の何れか一項記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

[請求項18] R^{2c} が、ニトロ基または $NR^{2d}R^{2e}$ である、請求項1～17の何れか一項記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

[請求項19] R^3 が、水素原子、ハロゲン原子または水酸基である、請求項1～18の何れか一項記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

[請求項20] R^{4a} が水素原子または R^FR であり、 R^{2d} および R^{6a} がともに水素原子である、請求項1～19の何れか一項記載の化合物、その薬学的に

許容される塩またはそれらの溶媒和物。

[請求項21] R^{F^R} が表す $-(CR^{F^b})_qOP(=O)(OR^{F^a})_2$ が、 $-CH_2OP(=O)(OH)_2$ 、 $-CH(CH_3)OP(=O)(OH)_2$ または $-CH_2OP(=O)(OH)(OCH_2OCO_2CH(CH_3)_2)$ である請求項1～20の何れか一項記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

[請求項22] p および p_a が、ゼロまたは1である、請求項1～21の何れか一項記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

[請求項23] 一般式(1-1)で示される化合物が、

(1) 4-(4-アミノ-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-7-(1H-ピラゾール-4-イル)イソキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-3-アミン、

(2) 4-(4-アミノ-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-7-(1H-ピラゾール-4-イル)イソキサゾロ[4, 5-c]ピリジン-3-アミン、

(3) 4-(4-アミノ-3-メトキシフェニル)-7-(1H-ピラゾール-4-イル)イソキサゾロ[4, 5-c]ピリジン-3-アミン、

(4) 4-(4-アミノ-2-フルオロ-5-(メチルチオ)フェニル)-7-(1H-ピラゾール-4-イル)イソキサゾロ[4, 5-c]ピリジン-3-アミン、

(5) 4-(4-アミノ-2-フルオロ-5-(メトキシ- d_3)フェニル)-7-(1H-ピラゾール-4-イル)イソキサゾロ[4, 5-c]ピリジン-3-アミン、

(6) 4-(4-アミノ-2-フルオロ-5-(メチルスルホニル)フェニル)-7-(1H-ピラゾール-4-イル)イソキサゾロ[4, 5-c]ピリジン-3-アミン、

(7) 4-(4-アミノ-5-(エチルチオ)-2-フルオロフェ

ニル) - 7 - (1H-ピラゾール-4-イル) イソキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-3-アミン、

(8) 4 - (4-アミノ-2-フルオロ-5 - (メチルスルフィニル) フェニル) - 7 - (1H-ピラゾール-4-イル) イソキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-3-アミン、

(9) 4 - (4-アミノ-2-フルオロ-3-メトキシフェニル) - 7 - (1H-ピラゾール-4-イル) イソキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-3-アミン、

(10) メチル 2-アミノ-5 - (3-アミノ-7 - (1H-ピラゾール-4-イル) イソキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-4-イル) - 4-フルオロベンゾエート、

(11) 2-アミノ-5 - (3-アミノ-7 - (1H-ピラゾール-4-イル) イソキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-4-イル) - 4-フルオロ安息香酸、

(12) 2-アミノ-5 - (3-アミノ-7 - (1H-ピラゾール-4-イル) イソキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-4-イル) - 4-フルオロベンズアミド、

(13) 4 - (4-アミノ-2-フルオロ-5-メトキシフェニル) - 7 - (3-メチル-1H-ピラゾール-4-イル) イソキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-3-アミン、

(14) メチル 2-アミノ-5 - (3-アミノ-7 - (1 - ((ホスホノオキシ) メチル) - 1H-ピラゾール-4-イル) イソキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-4-イル) - 4-フルオロベンゾエート、

(15) 1 - (2-アミノ-5 - (3-アミノ-7 - (1H-ピラゾール-4-イル) イソキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-4-イル) - 4-フルオロフェニル) エタン-1-オン、

(16) 4 - (4-アミノ-2-クロロ-5 - (メチルチオ) フェ

ニル) - 7 - (1H-ピラゾール-4-イル) イソキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-3-アミン、

(17) エチル 2-アミノ-5-(3-アミノ-7-(1H-ピラゾール-4-イル) イソキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-4-イル) -4-フルオロベンゾエート、

(18) (4-(4-(5-アセチル-4-アミノ-2-フルオロフェニル) -3-アミノイソキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-7-イル) -1H-ピラゾール-1-イル) メチル 二水素ホスフェート、

(19) エチル 2-アミノ-5-(3-アミノ-7-(1-(ホスホノオキシ) メチル) -1H-ピラゾール-4-イル) イソキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-4-イル) -4-フルオロベンゾエート、

(20) 2-アミノ-5-(3-アミノ-7-(1H-ピラゾール-4-イル) イソキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-4-イル) -4-フルオロ-N-メチルベンズアミド、

(21) 1-(2-アミノ-5-(3-アミノ-7-(1H-ピラゾール-4-イル) イソキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-4-イル) -4-フルオロフェニル) プロパン-1-オン、

(22) 2-アミノ-5-(3-アミノ-7-(1H-ピラゾール-4-イル) イソキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-4-イル) -N-エチル-4-フルオロベンズアミド、

(23) 1-(2-アミノ-5-(3-アミノ-7-(1H-ピラゾール-4-イル) イソキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-4-イル) フェニル) エタン-1-オン、

(24) メチル 2-アミノ-5-(3-アミノ-7-(1H-ピラゾール-4-イル) イソキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-4-イル) ベンゾエート、

(25) 2-アミノ-5-(3-アミノ-7-(1H-ピラゾール-4-イル)イソキサゾロ[4,5-c]ピリジン-4-イル)-N-プロピルベンズアミド、

(26) 1-(2-アミノ-5-(3-アミノ-7-(1H-ピラゾール-4-イル)イソキサゾロ[4,5-c]ピリジン-4-イル)-4-フルオロフェニル)ブタン-1-オン、

(27) 2-アミノ-5-(3-アミノ-7-(1H-ピラゾール-4-イル)イソキサゾロ[4,5-c]ピリジン-4-イル)-4-フルオロ-N-プロピルベンズアミド、

(28) 1-(2-アミノ-5-(3-アミノ-7-(1H-ピラゾール-4-イル)イソキサゾロ[4,5-c]ピリジン-4-イル)フェニル)ブタン-1-オン、

(29) 2-ヒドロキシエチル 2-アミノ-5-(3-アミノ-7-(1H-ピラゾール-4-イル)イソキサゾロ[4,5-c]ピリジン-4-イル)-4-フルオロベンゾエート、

(30) 2-アミノ-5-(3-アミノ-7-(1H-ピラゾール-4-イル)イソキサゾロ[4,5-c]ピリジン-4-イル)ベンズアミド、

(31) 2-アミノ-5-(3-アミノ-7-(1H-ピラゾール-4-イル)イソキサゾロ[4,5-c]ピリジン-4-イル)-N-メチルベンズアミド、

(32) (4-(3-アミノ-4-(4-アミノ-5-(エチルカルバモイル)-2-フルオロフェニル)イソキサゾロ[4,5-c]ピリジン-7-イル)-1H-ピラゾール-1-イル)メチル ニ水素ホスフェート、

(33) 1-(2-アミノ-5-(3-アミノ-7-(1H-ピラゾール-4-イル)イソキサゾロ[4,5-c]ピリジン-4-イル)-4-ヒドロキシフェニル)エタン-1-オン、

(34) 2-アミノ-5-(3-アミノ-7-(1H-ピラゾール-4-イル)イソキサゾロ[4,5-c]ピリジン-4-イル)-N-エチルベンズアミド、

(35) 1-(2-アミノ-5-(3-アミノ-7-(1H-ピラゾール-4-イル)イソキサゾロ[4,5-c]ピリジン-4-イル)フェニル)プロパン-1-オン、

(36) 2-アミノ-5-(3-アミノ-7-(1H-ピラゾール-4-イル)イソキサゾロ[4,5-c]ピリジン-4-イル)-4-クロロ-N-エチルベンズアミド、

(37) (4-(3-アミノ-4-(4-アミノ-2-フルオロ-5-(メチルチオ)フェニル)イソキサゾロ[4,5-c]ピリジン-7-イル)-1H-ピラゾール-1-イル)メチル 二水素ホスフェート、

(38) (4-(3-アミノ-4-(4-アミノ-2-フルオロ-5-プロピオニルフェニル)イソキサゾロ[4,5-c]ピリジン-7-イル)-1H-ピラゾール-1-イル)メチル 二水素ホスフェート、

(39) (4-(4-(3-アセチル-4-アミノフェニル)-3-アミノイソキサゾロ[4,5-c]ピリジン-7-イル)-1H-ピラゾール-1-イル)メチル 二水素ホスフェート、

(40) 4-(2-フルオロ-5-メトキシ-4-ニトロフェニル)-7-(1H-ピラゾール-4-イル)イソキサゾロ[4,5-c]ピリジン-3-アミン、

(41) (4-(3-アミノ-4-(4-アミノ-2-フルオロ-5-(メチルスルホニル)フェニル)イソキサゾロ[4,5-c]ピリジン-7-イル)-1H-ピラゾール-1-イル)メチル 二水素ホスフェート、

(42) (4-(3-アミノ-4-(4-アミノ-5-(エチルカ

ルバモイル) - 2 - クロロフェニル) イソキサゾロ [4, 5 - c] ピリジン - 7 - イル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) メチル ニ水素ホスフェート、

(43) 1 - (2 - アミノ - 5 - (3 - アミノ - 7 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) イソチアゾロ [4, 5 - c] ピリジン - 4 - イル) - 4 - フルオロフェニル) エタン - 1 - オン、および

(44) 4 - (4 - アミノ - 2 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 7 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) イソキサゾロ [4, 5 - c] ピリジン - 3 - アミンからなる群から選択される化合物である、請求項1記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

[請求項24]

一般式 (I - 1) で示される化合物が、

(1) メチル 2 - アミノ - 5 - (3 - アミノ - 7 - (1 - (ホスホノオキシ) メチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) イソキサゾロ [4, 5 - c] ピリジン - 4 - イル) - 4 - フルオロベンゾエート、

(2) (4 - (4 - (5 - アセチル - 4 - アミノ - 2 - フルオロフェニル) - 3 - アミノイソキサゾロ [4, 5 - c] ピリジン - 7 - イル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) メチル ニ水素ホスフェート、

(3) エチル 2 - アミノ - 5 - (3 - アミノ - 7 - (1 - (ホスホノオキシ) メチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) イソキサゾロ [4, 5 - c] ピリジン - 4 - イル) - 4 - フルオロベンゾエート、

(4) (4 - (3 - アミノ - 4 - (4 - アミノ - 5 - (エチルカルバモイル) - 2 - フルオロフェニル) イソキサゾロ [4, 5 - c] ピリジン - 7 - イル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) メチル ニ水素ホスフェート、

(5) (4 - (3 - アミノ - 4 - (4 - アミノ - 2 - フルオロ - 5

ー（メチルチオ）フェニル）イソキサゾロ〔4, 5-c〕ピリジン-7-イル）-1H-ピラゾール-1-イル）メチル 二水素ホスフェート、

(6) (4-(3-アミノ-4-(4-アミノ-2-フルオロ-5-プロピオニルフェニル)イソキサゾロ〔4, 5-c〕ピリジン-7-イル)-1H-ピラゾール-1-イル)メチル 二水素ホスフェート、

(7) (4-(4-(3-アセチル-4-アミノフェニル)-3-アミノイソキサゾロ〔4, 5-c〕ピリジン-7-イル)-1H-ピラゾール-1-イル)メチル 二水素ホスフェート、

(8) (4-(3-アミノ-4-(4-アミノ-2-フルオロ-5-(メチルスルホニル)フェニル)イソキサゾロ〔4, 5-c〕ピリジン-7-イル)-1H-ピラゾール-1-イル)メチル 二水素ホスフェート、および

(9) (4-(3-アミノ-4-(4-アミノ-5-(エチルカルバモイル)-2-クロロフェニル)イソキサゾロ〔4, 5-c〕ピリジン-7-イル)-1H-ピラゾール-1-イル)メチル 二水素ホスフェートからなる群から選択される化合物である、請求項1記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物。

[請求項25] 請求項1～24の何れか一項記載の化合物の薬学的に許容される塩がアルカリ金属塩である、請求項1～24の何れか一項記載の化合物の薬学的に許容される塩またはその溶媒和物。

[請求項26] 請求項1～25の何れか一項記載の化合物またはその薬学的に許容される塩の溶媒和物が水和物である、請求項1～25の何れか一項記載の化合物またはその薬学的に許容される塩の溶媒和物。

[請求項27] 一般式(1-1)で示される化合物またはその薬学的に許容される塩および薬学的に許容される担体を含有する医薬組成物。

[請求項28] 一般式(1-1)で示される化合物もしくはその薬学的に許容される

塩を有効成分として含む、がんもしくは感染症の進行抑制、再発抑制および／または治療剤。

- [請求項29] がんが、固形がんまたは血液がんである、請求項28記載の剤。
- [請求項30] 固形がんが、悪性黒色腫、非小細胞肺癌、小細胞肺癌、頭頸部癌、腎細胞癌、乳癌、卵巣癌、卵巣明細胞腺癌、鼻咽頭癌、子宮癌、肛門癌、大腸癌、直腸癌、結腸癌、肝細胞癌、食道癌、胃癌、食道胃接合部癌、膀胱癌、尿路上皮癌、前立腺癌、卵管癌、原発性腹膜癌、悪性胸膜中皮腫、胆嚢癌、胆管癌、胆道癌、皮膚癌、精巣癌（胚細胞腫瘍）、陰嚢癌、外陰部癌、陰茎癌、小腸癌、内分泌系癌、甲状腺癌、副甲状腺癌、副腎癌、脊椎腫瘍、神経芽細胞腫、髓芽腫、眼網膜芽細胞腫、神経内分泌腫瘍、脳腫瘍および扁平上皮癌から選択される1以上の癌である、請求項29記載の剤。
- [請求項31] 固形がんが、骨・軟部肉腫またはカポジ肉腫である、請求項29記載の剤。
- [請求項32] 血液がんが、多発性骨髄腫、悪性リンパ腫、白血病、中枢神経系原発悪性リンパ腫、骨髄異形成症候群および骨髄増殖症候群から選択される1以上のがんである、請求項29記載の剤。
- [請求項33] さらに1種以上の他の抗がん剤と併用して投与されることを特徴とする、請求項28～32の何れか一項記載の剤。
- [請求項34] 他の抗がん剤が、がん免疫治療薬である、請求項33記載の剤。
- [請求項35] がん免疫治療薬が、抗PD-1抗体または抗PD-L1抗体である、請求項34記載の剤。
- [請求項36] 一般式（I-1）で示される化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの溶媒和物を有効成分として含むSTING作動剤。