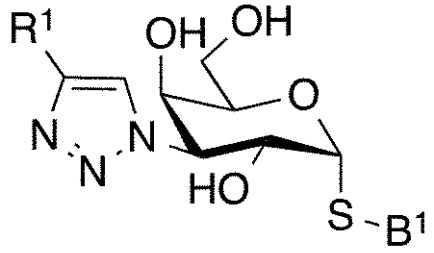
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和4年1月13日(2022.1.13)

【国際公開番号】WO2019/137971
【公表番号】特表2021-510692(P2021-510692A)
【公表日】令和3年4月30日(2021.4.30)
【出願番号】特願2020-538084(P2020-538084)
【国際特許分類】
C07H 19/056(2006.01)
A61K 31/7056(2006.01)
A61K 31/706(2006.01)
A61P 43/00(2006.01)
A61P 29/00(2006.01)
A61P 11/00(2006.01)
A61P 1/16(2006.01)
A61P 13/12(2006.01)
A61P 27/02(2006.01)
A61P 17/00(2006.01)
A61P 9/00(2006.01)
A61P 35/00(2006.01)
A61P 35/02(2006.01)
A61P 35/04(2006.01)
A61P 21/00(2006.01)
A61P 37/06(2006.01)
A61P 37/02(2006.01)
A61P 17/06(2006.01)
A61P 1/04(2006.01)
A61P 3/00(2006.01)
A61P 9/04(2006.01)
A61P 9/10(2006.01)
A61P 3/10(2006.01)
A61P 3/04(2006.01)
A61P 11/06(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｈ １９/０５６ ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ ３１/７０５６
Ａ６１Ｋ ３１/７０６
Ａ６１Ｐ ４３/００ １１１
Ａ６１Ｐ ２９/００
Ａ６１Ｐ １１/００
Ａ６１Ｐ １/１６
Ａ６１Ｐ １３/１２
Ａ６１Ｐ ２７/０２
Ａ６１Ｐ １７/００
Ａ６１Ｐ ９/００
Ａ６１Ｐ ３５/００
Ａ６１Ｐ ３５/０２
Ａ６１Ｐ ３５/０４
Ａ６１Ｐ ２１/００

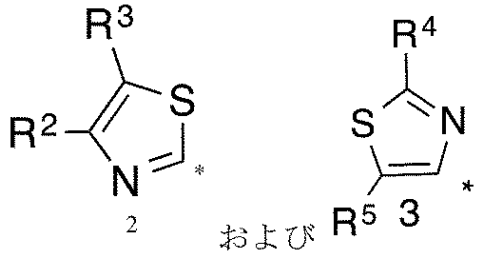
Ａ６１Ｐ　３７／０６
Ａ６１Ｐ　３７／０２
Ａ６１Ｐ　１７／０６
Ａ６１Ｐ　２９／００　１０１
Ａ６１Ｐ　　１／０４
Ａ６１Ｐ　　３／００
Ａ６１Ｐ　　９／０４
Ａ６１Ｐ　　９／１０　１０１
Ａ６１Ｐ　　３／１０
Ａ６１Ｐ　　３／０４
Ａ６１Ｐ　１１／０６

【手続補正書】
【提出日】令和４年１月４日(２０２２.１.４)
【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】
下記の式（１）のＤ－ガラクトピラノース化合物であって、
【化１】



（１）

式中、ピラノース環はα－Ｄ－ガラクトピラノースであり、
Ｒ１は、
【化２】



（式中、星印＊は、式（１）のトリアゾール基に共有結合するヘテロ芳香族環の炭素原子を示し；
式中、Ｒ２は、ＯＨ及びハロゲンからなる群から選択され；
Ｒ３は、水素、Ｃ１～６アルキル及びハロゲンからなる群から選択され；
Ｒ４は、ＯＨ及びハロゲンからなる群から選択され；
Ｒ５は、水素、Ｃ１～６アルキル及びハロゲンからなる群から選択される）

からなる群から選択され；
Ｂ１は、ａ）ハロゲン；ＣＮ；－ＣＯＯＨ；－ＣＯＮＲ２９Ｒ３０（式中、Ｒ２９及びＲ３０は独立して、Ｈ、Ｃ１～３アルキル、シクロプロピル及びイソ－プロピルから選択される）；Ｃ１～３アルキル、必要な場合にはＦにより置換されるＣ１～３アルキル；シクロプロピル、必要な場合にはＦにより置換されるシクロプロピル；イソプロピル、必要な場合にはＦにより置換されるイソプロピル；ＯＣ１～３アルキル、必要な場合にはＦにより置換されるＯＣ１～３アルキル；ＳＣ１～３アルキル、必要な場合にはＦにより置換されるＳＣ１～３アルキル；Ｏ－シクロプロピル、必要な場合にはＦにより置換されるＯ－シクロプロピル；Ｏ－イソプロピル、必要な場合にはＦにより置換されるＯ－イソプロピル；ＮＲ３１Ｒ３２（式中、Ｒ３１及びＲ３２は独立して、Ｈ、Ｃ１～３アルキル及びイソプロピルから選択される）；ＯＨ；及びＲ３３－ＣＯＮＨ－（式中、Ｒ３３は、Ｃ１～３アルキル及びシクロプロピルから選択される）から選択される基により任意選択で置換されるアリール（例えば、フェニル又はナフチルなど）；ｂ）ハロゲン；ＣＮ；－ＣＯＯＨ；－ＣＯＮＲ３５Ｒ３６（式中、Ｒ３５及びＲ３６は独立して、Ｈ、Ｃ１～３アルキル、シクロプロピル及びイソ－プロピルから選択される）；Ｃ１～３アルキル、必要な場合にはＦにより置換されるＣ１～３アルキル；シクロプロピル、必要な場合にはＦにより置換されるシクロプロピル；イソプロピル、必要な場合にはＦにより置換されるイソプロピル；ＯＣ１～３アルキル、必要な場合にはＦにより置換されるＯＣ１～３アルキル；Ｏ－シクロプロピル、必要な場合にはＦにより置換されるＯ－シクロプロピル；ＳＣ１～３アルキル、必要な場合にはＦにより置換されるＳＣ１～３アルキル；Ｏ－イソプロピル、必要な場合にはＦにより置換されるＯ－イソプロピル；ＮＲ３７Ｒ３８（式中、Ｒ３７及びＲ３８は独立して、Ｈ、Ｃ１～３アルキル及びイソプロピルから選択される）；ＯＨ；及びＲ３９－ＣＯＮＨ－（式中、Ｒ３９は、Ｃ１～３アルキル及びシクロプロピルから選択される）から選択される基により任意選択で置換される複素環（例えば、ヘテロアリール又はヘテロシクロアルキルなど）から選択される
上記Ｄ－ガラクトピラノース化合物、又はその医薬的に許容され得る塩もしくは溶媒和物。

【請求項２】
Ｒ１が式２から選択され、ここで、Ｒ２は、ＯＨ及びハロゲンからなる群から選択され、かつＲ３は、水素、Ｃ１～６アルキル及びハロゲンからなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。

【請求項３】
Ｒ２がＯＨであり、かつＲ３がＨである、請求項２に記載の化合物。

【請求項４】
Ｒ２がハロゲンであり、かつＲ３が、水素及びハロゲンからなる群から選択される、請求項２に記載の化合物。

【請求項５】
Ｒ１が式３から選択され、ここで、Ｒ４は、ＯＨ及びハロゲンからなる群から選択され、かつＲ５は、水素、Ｃ１～６アルキル及びハロゲンからなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。

【請求項６】
Ｒ４がＯＨであり、かつＲ５が、水素、Ｃ１～６アルキル及びハロゲンからなる群から選択される、請求項５に記載の化合物。

【請求項７】
Ｒ４がハロゲンであり、かつＲ５が、水素、Ｃ１～６アルキル及びハロゲンからなる群から選択される、請求項５に記載の化合物。

【請求項８】
Ｂ１が、ハロゲン、Ｆにより任意選択で置換されるＳＣ１～３アルキル、Ｃ１～６アルキル、ＣＮ、及びＣＯＮＲ３５Ｒ３６（式中、Ｒ３５及びＲ３６は独立して、Ｈ、Ｃ１～３アルキル、シクロプロピル及びイソ－プロピルから選択される）から選択される基により

任意選択で置換されるフェニルから選択される、請求項１～７のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項９】
B^1が、Ｃｌ、Ｆ、Ｂｒ、CF_3、SCF_3、CH_3、ＣＯＮ（CH_3）$_2$及びＣＮから選択される１つ、２つ又は３つの置換基により置換されるフェニルから選択される、請求項１～７のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１０】
B^1が、ハロゲン；－ＣＯＯＨ；－ＣＯＮＲ３５Ｒ３６（式中、Ｒ３５及びＲ３６は独立して、Ｈ、$C_{1～3}$アルキル、シクロプロピル及びイソ－プロピルから選択される）；イソプロピル、必要な場合にはＦにより置換されるイソプロピル；ＣＮ；及びＦにより任意選択で置換されるメチルから選択される基により任意選択で置換されるピリジニルから選択される、請求項１～７のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１１】
B^1が、Ｃｌ、Ｂｒ、イソプロピル、ＣＯＯＨ、$CONH_2$、ＣＮ、ＣＯＮ（CH_3）$_2$及びCF_3からなる群から選択される１つ又は２つの置換基により置換されるピリジニルから選択される、請求項１～７のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１２】
５－ブロモ－６－トリフルオロメチル－ピリジン－３－イル３－［４－（４－クロロチアゾール－２－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－３－デオキシ－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
５－ブロモ－６－トリフルオロメチル－ピリジン－３－イル３－［４－（４－ブロモチアゾール－２－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－３－デオキシ－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
５－クロロ－６－シアノ－ピリジン－３－イル３－［４－（４－クロロチアゾール－２－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－３－デオキシ－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
５－ブロモ－２－シアノ－ピリジン－３－イル３－［４－（４－クロロチアゾール－２－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－３－デオキシ－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
５－クロロ－２－シアノ－ピリジン－３－イル３－［４－（４－クロロチアゾール－２－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－３－デオキシ－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
５－ブロモ－６－シアノ－３－ピリジル３－［４－（４－クロロチアゾール－２－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－３－デオキシ－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
３，４－ジクロロフェニル３－［４－（２－クロロチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－３－デオキシ－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
３，４－ジクロロフェニル３－デオキシ－３－［４－（２－フルオロチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
３，４－ジクロロフェニル３－デオキシ－３－［４－（４－フルオロチアゾール－２－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
３，４－ジクロロフェニル３－デオキシ－３－［４－（４，５－ジフルオロチアゾール－２－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
３，４－ジクロロフェニル３－デオキシ－３－［４－（４－（ヒドロキシチアゾール－２－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、

３，４－ジクロロフェニル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
５－クロロ－６－シアノ－ピリジン－３－イル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
５－ブロモ－２－シアノ－ピリジン－３－イル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
５－ブロモ－６－シアノ－３－ピリジル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
５－クロロ－２－シアノ－３－ピリジル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
５－クロロ－６－トリフルオロメチル－ピリジン－３－イル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
３，５－ジクロロ－４－フルオロ－フェニル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
３－クロロ－４－フルオロ－フェニル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
３，４，５－トリクロロフェニル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
３，５－ジブロモ－４－フルオロフェニル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
３－ブロモ－４－シアノフェニル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
５－ブロモ－６－トリフルオロメチル－３－ピリジル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
３－クロロ－４－トリフルオロメチルフェニル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
３－クロロ－４－トリフルオロメチルチオフェニル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
３－クロロ－４－メチルフェニル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
５－クロロ－ピコリンアミド－３－イル３－［４－（４－クロロチアゾール－２－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－３－デオキシ－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
２－カルボキシ－５－クロロピリジル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－

ガラクトピラノシド、
５－ブロモ－６－トリフルオロメチル－ピリジン－３－イル３－デオキシ－３－［４－（４，５－ジクロロチアゾール－２－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
５－ブロモ－２－イソプロピル－ピリジン－３－イル３－［４－（４－クロロチアゾール－２－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－３－デオキシ－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
３，４－ジクロロ－６－フルオロ－フェニル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
４－クロロ－Ｎ，Ｎ’－ジメチルベンズアミド－２－イル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド、
５－クロロ－Ｎ，Ｎ’－ジメチル－ピコリンアミド－３－イル３－デオキシ－３－［４－（２－ヒドロキシチアゾール－４－イル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル］－１－チオ－α－Ｄ－ガラクトピラノシド
から選択される請求項１～１１のいずれか一項に記載の化合物、又はその医薬的に許容され得る塩もしくは溶媒和物。

【請求項１３】
医薬品としての使用のための、請求項１～１２のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１４】
請求項１～１３のいずれか一項に記載の化合物、及び任意選択で医薬的に許容され得る添加剤（例えば、キャリア又は賦形剤など）を含む医薬組成物。

【請求項１５】
ガレクチン－１がリガンドに結合することに関連する障害を哺乳動物（例えば、ヒトなど）において処置するための、請求項１４に記載の医薬組成物。

【請求項１６】
障害が、炎症；線維症、例えば、肺線維症、肝線維症、腎線維症、眼科学的線維症、ならびに皮膚及び心臓の線維症など；瘢痕化；ケロイド形成；異常な瘢痕形成；強皮症；硬化症；手術癒着；敗血症性ショック；がん、例えば、がん腫、肉腫、白血病及びリンパ腫（例えば、Ｔ細胞リンパ腫など）など；転移性がん；がんに関連づけられる血管新生；自己免疫疾患、例えば、乾癬、関節リウマチ、クローン病、潰瘍性大腸炎、強直性脊椎炎、全身性エリテマトーデスなど；移植片拒絶；代謝障害；心臓疾患；心不全；病理学的血管形成、例えば、眼の血管形成、又は眼の血管形成に伴う疾患もしくは状態など、例えば、がんに関連づけられる血管新生；ならびに眼疾患、例えば、加齢性黄斑変性及び角膜血管新生など；アテローム性動脈硬化；代謝性疾患、例えば、糖尿病など；肥満；喘息及び他の間質性肺疾患（ヘルマンスキー・パドラック症候群、中皮腫を含む）；肝障害（例えば、非アルコール性脂肪性肝炎など）からなる群から選択される、請求項１５に記載の医薬組成物。

【請求項１７】
ガレクチン－１がリガンドに結合することに関連する障害を哺乳動物（例えば、ヒトなど）において処置するための医薬を調製するための、請求項１～１２のいずれか一項に記載の少なくとも１つ化合物の使用。

【請求項１８】
障害が、炎症；線維症、例えば、肺線維症、肝線維症、腎線維症、眼科学的線維症、ならびに皮膚及び心臓の線維症など；瘢痕化；ケロイド形成；異常な瘢痕形成；強皮症；硬化症；手術癒着；敗血症性ショック；がん、例えば、がん腫、肉腫、白血病及びリンパ腫（例えば、Ｔ細胞リンパ腫など）など；転移性がん；がんに関連づけられる血管新生；自己免疫疾患、例えば、乾癬、関節リウマチ、クローン病、潰瘍性大腸炎、強直性脊椎炎、全身性エリテマトーデスなど；移植片拒絶；代謝障害；心臓疾患；心不全；病理学的血管形

成、例えば、眼の血管形成、又は眼の血管形成に伴う疾患もしくは状態など、例えば、がんに関連づけられる血管新生；ならびに眼疾患、例えば、加齢性黄斑変性及び角膜血管新生など；アテローム性動脈硬化；代謝性疾患、例えば、糖尿病など；肥満；喘息及び他の間質性肺疾患（ヘルマンスキー・パドラック症候群、中皮腫を含む）；肝障害（例えば、非アルコール性脂肪性肝炎など）からなる群から選択される、請求項１７に記載の使用。