

【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7年3月24日(2025.3.24)

【国際公開番号】WO2022/197756

【公表番号】特表2024-510503(P2024-510503A)

【公表日】令和6年3月7日(2024.3.7)

【年通号数】公開公報(特許)2024-043

【出願番号】特願2023-557352(P2023-557352)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 7 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 4 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 0 1 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 1 7 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

10

20

【 F I 】

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 8 A

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 3 1 1

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 C S P

A 6 1 K 3 1 / 5 0 6

A 6 1 P 7 / 1 0

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 8 Q

A 6 1 K 3 1 / 4 4 4

A 6 1 K 3 1 / 5 0 1

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7

A 6 1 K 3 1 / 5 1 7

A 6 1 K 3 1 / 5 0 2

30

【手続補正書】

【提出日】令和7年3月13日(2025.3.13)

【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

40

【補正の内容】

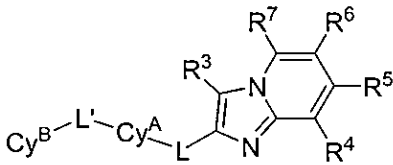
【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物：

50

【化1】



(I)

またはその薬学的に許容される塩であって、

10

式中：

Cy^A が、4員の単環式カルボシクレン、酸素、窒素、及び硫黄から選択される1~3個のヘテロ原子を有する3~7員の飽和または部分的不飽和の単環式ヘテロシクレン、フェニレン、酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される1~3個のヘテロ原子を有する5~6員の単環式ヘテロアリーレン、酸素、窒素、及び硫黄から選択される1~4個のヘテロ原子を有する7~10員の飽和もしくは部分的不飽和の二環式ヘテロシクレン、または酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される1~4個のヘテロ原子を有する8~12員の二環式ヘテロアリーレンであり、 Cy^A が、0~4個の R^A 基で置換されており、

各 R^A が、オキソ、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)_2R$ 、 $-C(O)N(R)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R)_2$ 、 $-N(R)C(O)R$ 、 $-N(R)C(O)_2R$ 、 $-N(R)S(O)_2R$ 、 $-OR$ 、 $-OC(O)R$ 、 $-OC(O)N(R)_2$ 、 $-SR$ 、 $-S(O)R$ 、 $-S(O)_2R$ 、 $-S(O)N(R)_2$ 、 $-S(O)_2N(R)_2$ 、ならびに C_1-6 脂肪族、フェニル、3~7員の飽和もしくは部分的不飽和の単環式カルボシクリル、酸素、窒素、及び硫黄から選択される1~2個のヘテロ原子を有する3~7員の飽和もしくは部分的不飽和の単環式ヘテロシクリル、ならびに酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される1~4個のヘテロ原子を有する5もしくは6員の単環式ヘテロアリールから選択される任意に置換された基から独立して選択され、

20

各 R が、独立して水素または任意に置換された C_1-6 脂肪族基であり、

Cy^B が、フェニル、8~10員の二環式アリール、7~10員の飽和もしくは部分的不飽和の二環式カルボシクリル、酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される1~3個のヘテロ原子を有する5もしくは6員のヘテロアリール、酸素、窒素、及び硫黄から選択される1~3個のヘテロ原子を有する7~10員の飽和もしくは部分的不飽和の二環式ヘテロシクリル、ならびに酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される1~4個のヘテロ原子を有する7~10員のヘテロアリールから選択され、 Cy^B が、0~5個の R^B 基で置換されており、

30

各 R^B が、オキソ、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)_2R$ 、 $-C(O)N(R)_2$ 、 $-C(NR)NR_2$ 、 $-C(NR)NROR$ 、 $-C(NR)NRC(O)OR$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R)_2$ 、 $-N(R)C(O)R$ 、 $-N(R)C(O)_2R$ 、 $-N(R)S(O)_2R$ 、 $-OR$ 、 $-OC(O)R$ 、 $-OC(O)N(R)_2$ 、 $-SR$ 、 $-S(O)R$ 、 $-S(O)_2R$ 、 $-S(O)N(R)_2$ 、 $-S(O)_2N(R)_2$ 、ならびに C_1-6 脂肪族、酸素、窒素、及び硫黄から選択される1~2個のヘテロ原子を有する3~7員の飽和もしくは部分的不飽和の単環式ヘテロシクリル、ならびに酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される1~4個のヘテロ原子を有する5~6員のヘテロアリールから選択される任意に置換された基から独立して選択され、

40

L' が、共有結合または任意に置換された C_1-4 炭化水素鎖であり、その場合、1~3個のメチレン単位が、任意にかつ独立して、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-NR^Z-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 SO_2- 、 $-S(NH)(O)-$ 、またはシクロプロピレンで置換され、

各 R^Z が、水素、 $-(CH_2)_{0-3}OR$ 、 $-(CH_2)_{0-3}C(O)OR$ 、及び任意に置換された C_1-6 脂肪族基から独立して選択され、

L が、任意に置換された C_1-2 炭化水素鎖であり、その場合、1つのメチレン単位が

50

、任意にかつ独立して、 $-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^2-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、もしくは $-SO_2-$ で置換され、または、Lが、酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される1～3個のヘテロ原子を有する、任意に置換された5もしくは6員の飽和もしくは部分的不飽和ヘテロシクレンであり、

各 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 が、水素及び $-L^C-R^C$ から独立して選択され、式中、

各 L^C が、共有結合及び任意に置換された C_{1-6} 炭化水素鎖から独立して選択され、その場合、1～3個のメチレン単位が、任意にかつ独立して $-O-$ または $-NR-$ で置換され、

各 R^C が、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)_2R$ 、 $-C(O)N(R)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R)_2$ 、 $-N(R)C(O)R$ 、 $-N(R)C(O)_2R$ 、 $-N(R)S(O)_2R$ 、 $-OR$ 、 $-OC(O)R$ 、 $-OC(O)N(R)_2$ 、 $-SR$ 、 $-S(O)R$ 、 $-S(O)_2R$ 、 $-S(O)N(R)_2$ 、 $-S(O)_2N(R)_2$ 、 Cy^C 、及び任意に置換された C_{1-6} 脂肪族から独立して選択され、

各 Cy^C が、3～7員の飽和もしくは部分的な不飽和の単環式カルボシクリル、酸素、窒素、及び硫黄から選択される1～2個のヘテロ原子を有する3～7員の飽和もしくは部分的な不飽和の単環式ヘテロシクリル、酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される1～3個のヘテロ原子を有する5～6員の単環式ヘテロアリール、フェニル、酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される1～3個のヘテロ原子を有する6～12員の飽和もしくは部分的な不飽和の縮合二環式ヘテロシクリル、架橋二環、並びに酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される1～3個のヘテロ原子を有する6～12員の飽和もしくは部分的な不飽和二環式スピロヘテロシクリルから独立して選択される任意に置換された環である、前記化合物、またはその薬学的に許容される塩。

10

20

30

40

50

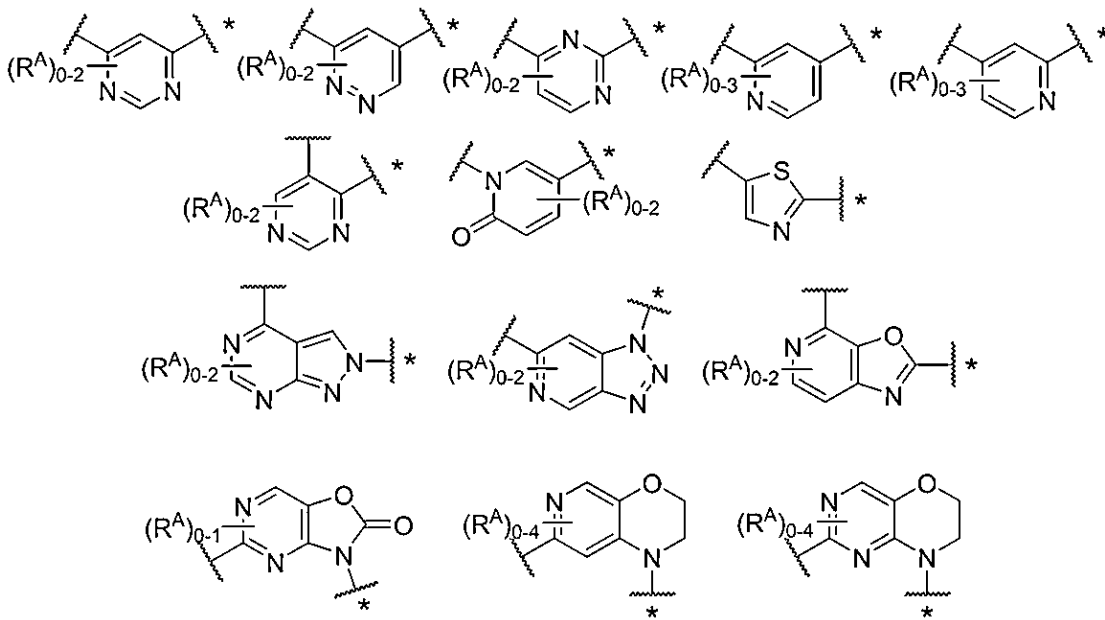
【請求項2】

Cy^A が、4員の単環式カルボシクレン、酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される1～3個のヘテロ原子を有する3～7員の飽和または部分的な不飽和の単環式ヘテロシクレン、酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される1～3個のヘテロ原子を有する5もしくは6員の単環式ヘテロアリーレン、酸素、窒素、及び硫黄から選択される1～4個のヘテロ原子を有する7～10員の飽和もしくは部分的な不飽和の二環式ヘテロシクレン、または酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される1～4個のヘテロ原子を有する7～10員の二環式ヘテロアリーレンであり、 Cy^A が、0～4個の R^A 基で置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

Cy^A が：

【化 2】



10

20

からなる群から選択され、

式中、* が、L への結合点を表す、請求項 1 ~ 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

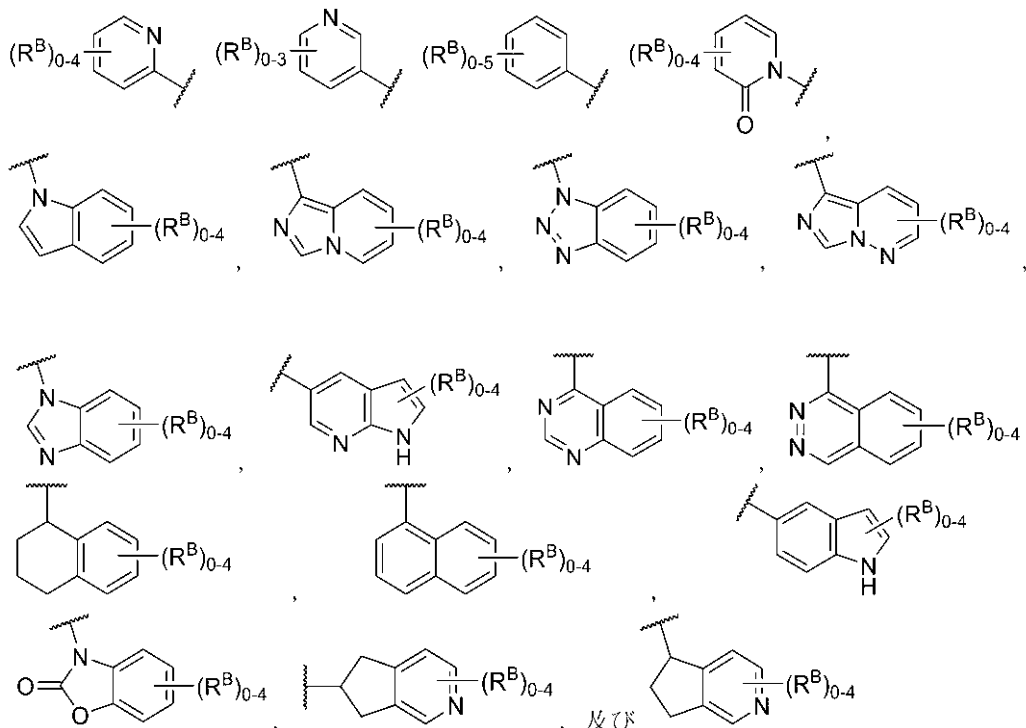
【請求項 4】

各 R^A が、オキソ、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)_2R$ 、 $-OR$ 、及び $C_1 - 6$ 脂肪族または酸素、窒素もしくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 6 員の単環式ヘテロアリアルから選択される任意に置換された基から独立して選択される、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】

Cy^B が：

【化 3】



30

40

50

からなる群から選択される、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6】

各 R^B が、オキソ、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-C(O)N(R)_2$ 、 $-C(NR)NR_2$ 、 $-C(NR)NROR$ 、 $-C(NR)NRC(O)OR$ 、 $-N(R)_2$ 、 $-OR$ 、ならびに C_{1-6} 脂肪族ならびに酸素、窒素及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 5 もしくは 6 員のヘテロアリールから選択される任意に置換された基から独立して選択される、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7】

L が、任意に置換された C_{1-2} 炭化水素鎖であり、その場合、1 つのメチレン単位が、任意に、 $-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^Z-$ で置換され、または、L が、酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、任意に置換された 5 ~ 6 員の飽和もしくは部分的不飽和ヘテロシクレンである、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

10

【請求項 8】

L が、 $-CH_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CF_2-$ 、または $-C(OH)H-$ 、 $^*-NHCHH(Me)-$ 、 $^*-NHCH_2-$ 、 $^*-OCH_2-$ 、または $^*-N(CH_3)CH_2-$ であり、式中、* が、 Cy^A への結合点を表す、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9】

L' が、任意に置換された C_{1-4} 炭化水素鎖であり、その場合、1 ~ 3 個のメチレン単位が、任意にかつ独立して、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-NR^Z-$ 、 SO_2- 、 $-S(NH)(O)-$ 、またはシクロプロピレンで置換される、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

20

【請求項 10】

L' が：

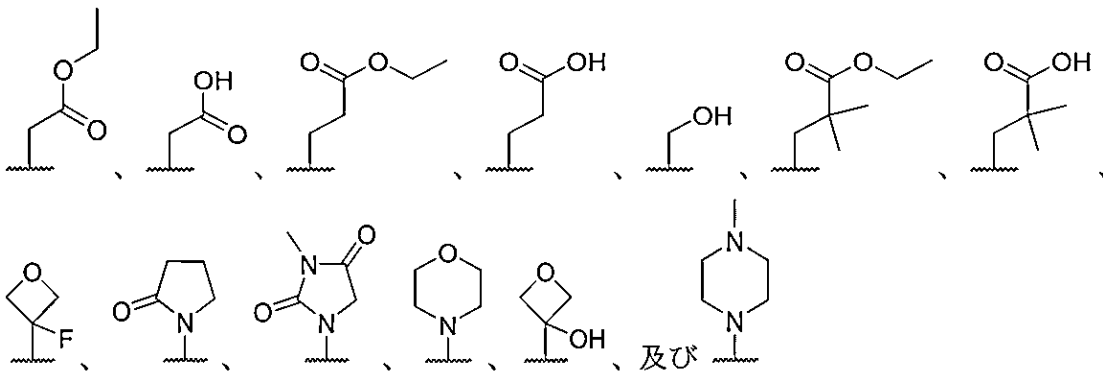
- CH_2- 、 $-NH_2-$ 、
- CH_2CH_2- 、

30

40

50

【化 5】



10

からなる群から選択される、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 4】

R⁵ が、水素またはシクロプロピルである、請求項 1 ~ 1 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 5】

R⁶ が、水素またはシクロプロピルである、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

20

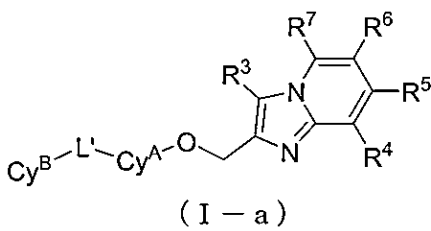
【請求項 1 6】

R⁷ が水素である、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 7】

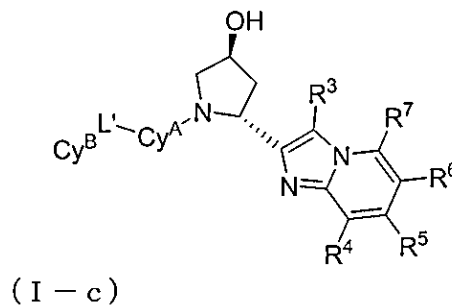
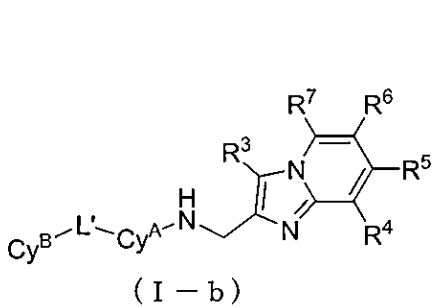
前記化合物が、式 (I - a)、式 (I - b)、もしくは式 (I - c) の化合物：

【化 6 - 1】



30

【化 6 - 2】



40

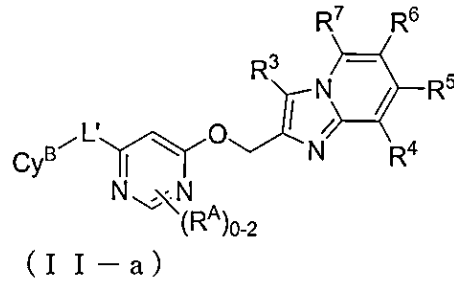
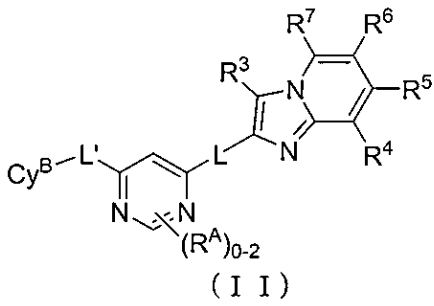
またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 8】

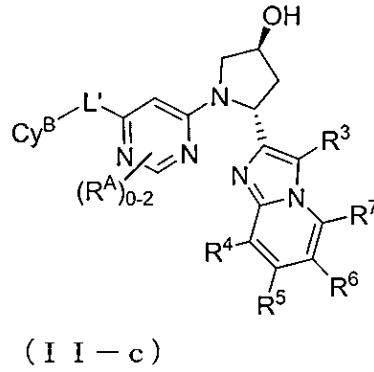
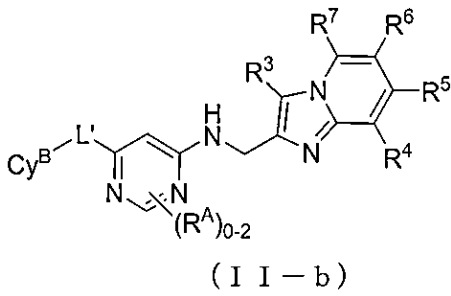
前記化合物が、式 (II)、式 (II - a)、式 (II - b)、もしくは式 (II - c) の化合物：

50

【化 7】



10



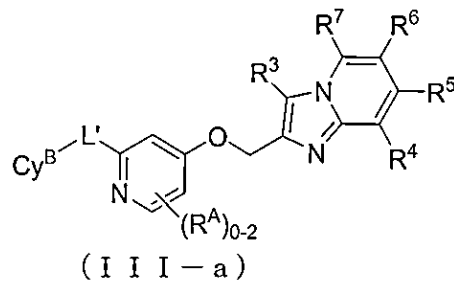
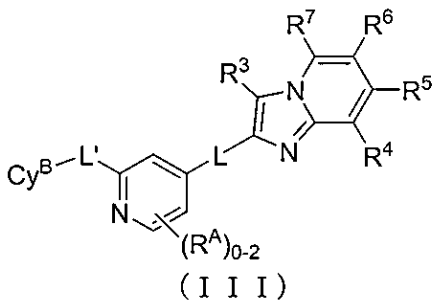
20

またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

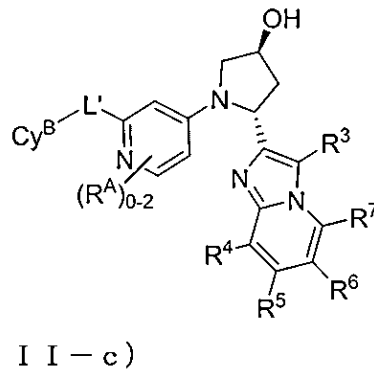
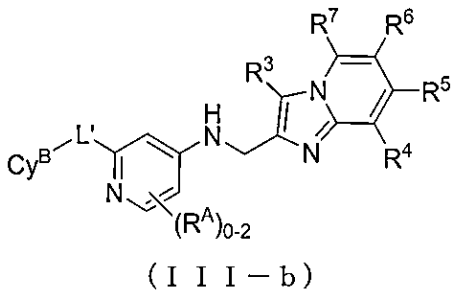
【請求項 19】

前記化合物が、式 (III)、式 (III-a)、式 (III-b)、もしくは式 (III-c) の化合物：

【化 8】



30



40

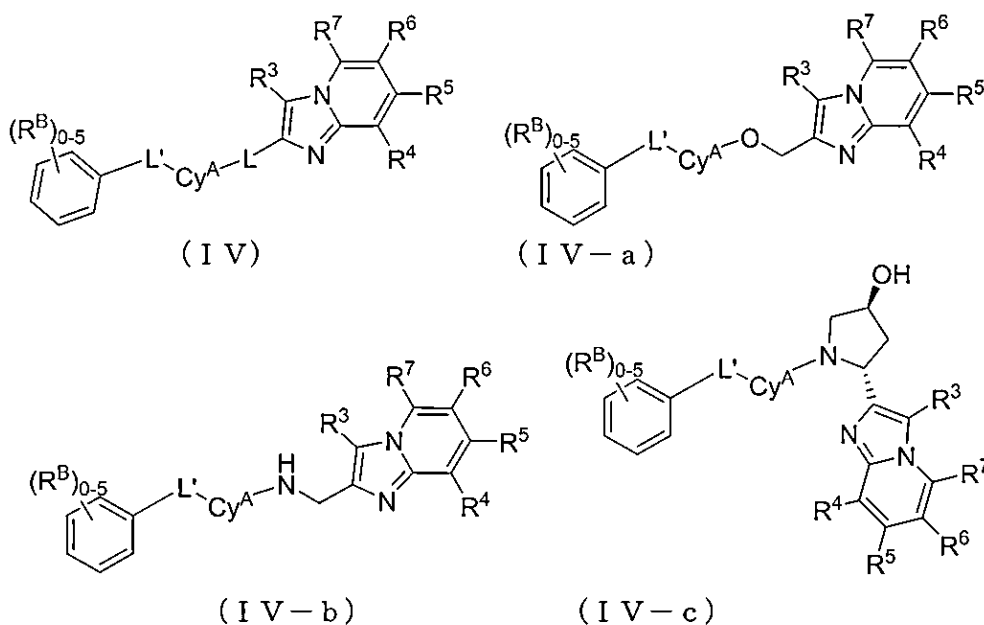
またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 20】

前記化合物が、式 (IV-a)、式 (IV-b)、式 (IV-c)、もしくは式 (IV-d) の化合物：

50

【化 9】



10

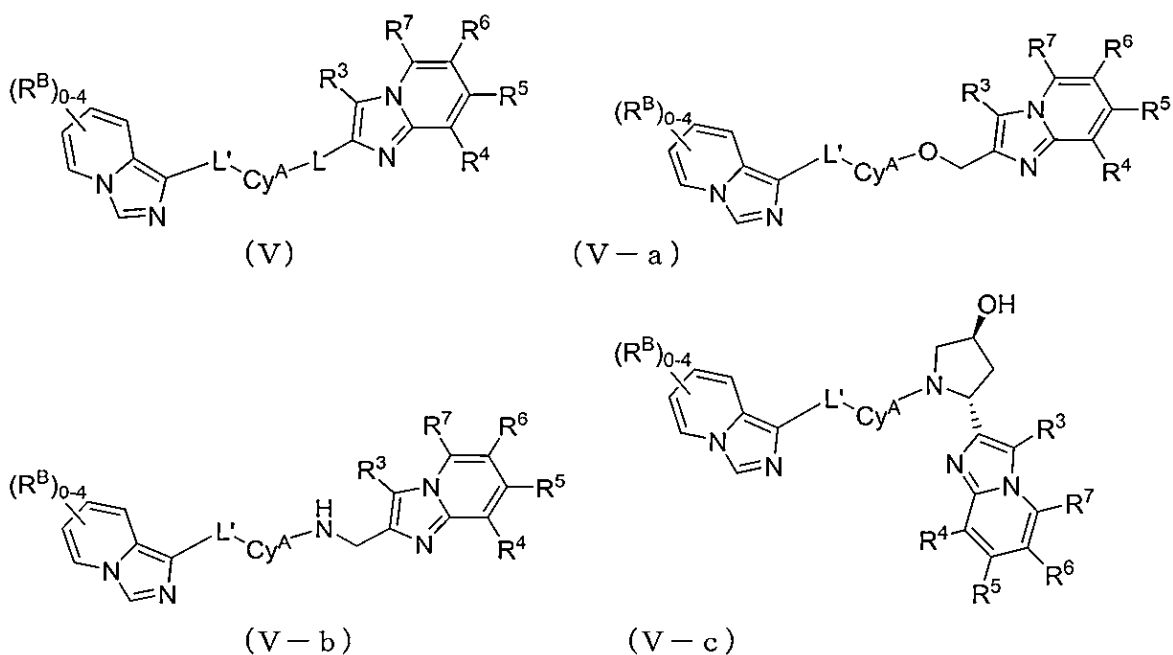
20

またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 1】

前記化合物が、式 (V)、(V-a)、式 (V-b)、もしくは式 (V-c) の化合物
:

【化 10】



30

40

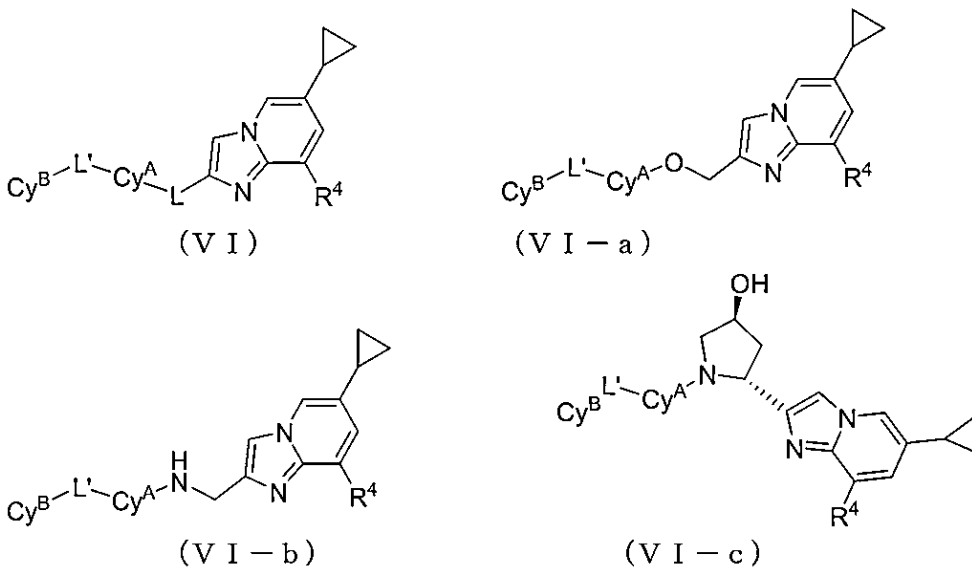
またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 2】

前記化合物が、式 (VI)、(VI-a)、式 (VI-b)、もしくは式 (VI-c) の化合物
:

50

【化 1 1】



10

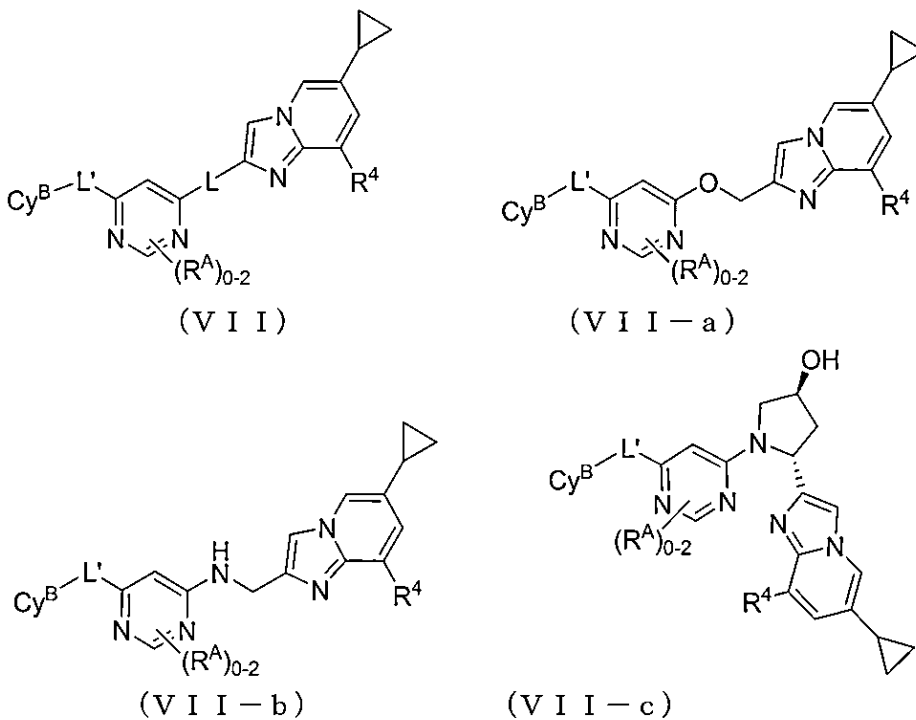
またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 3】

20

前記化合物が、式 (VII)、(VII-a)、式 (VII-b)、もしくは式 (VII-c) の化合物：

【化 1 2】



30

40

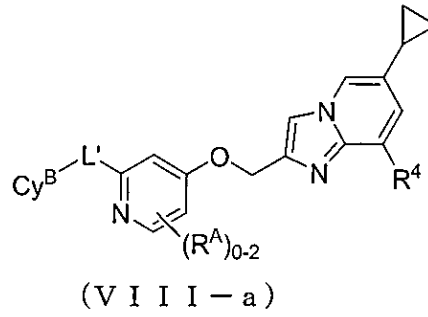
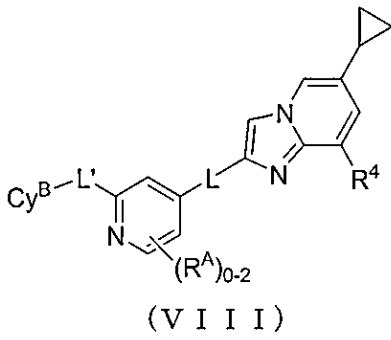
またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

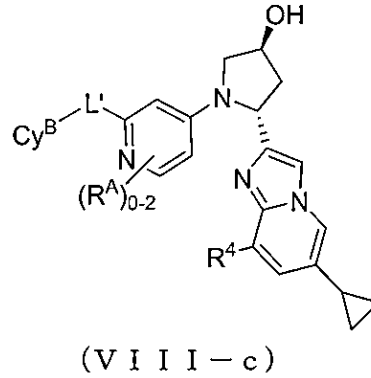
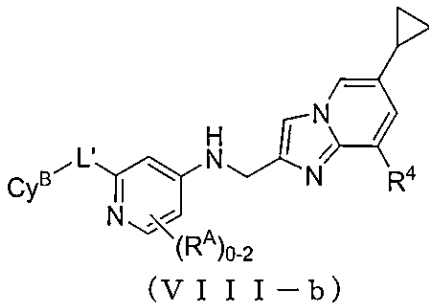
前記化合物が、式 (VIII)、(VIII-a)、式 (VIII-b)、もしくは式 (VIII-c) の化合物：

50

【化 1 3】



10



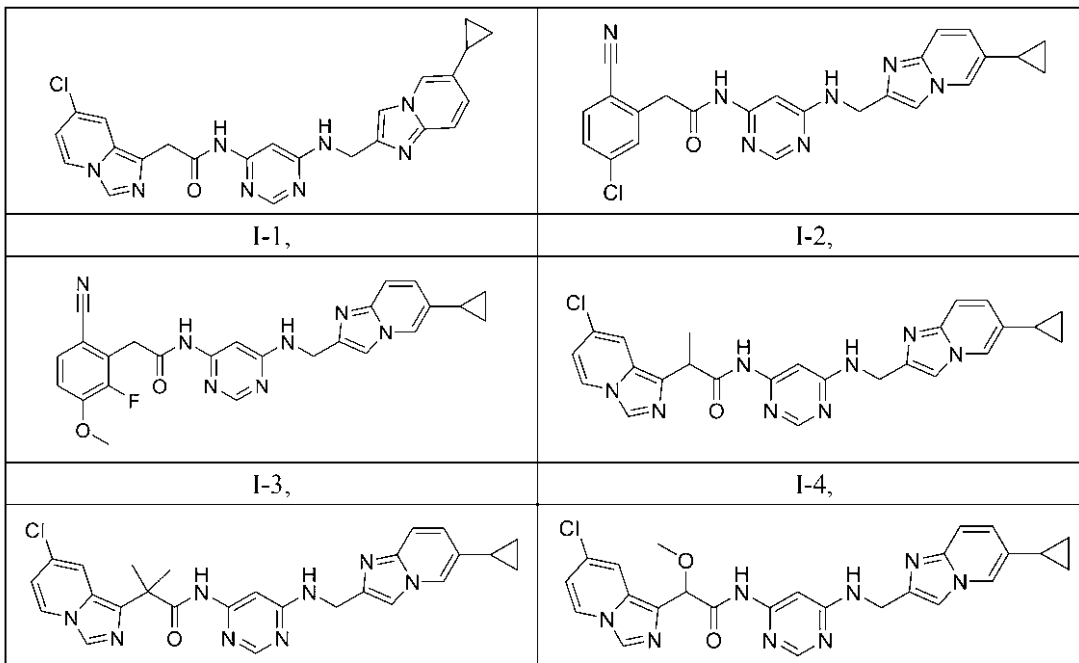
20

またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

前記化合物が、

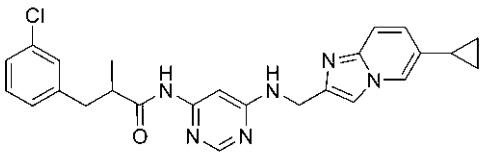
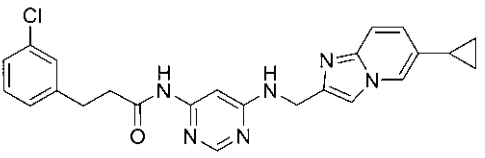
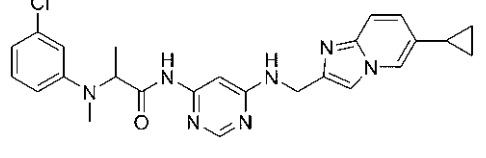
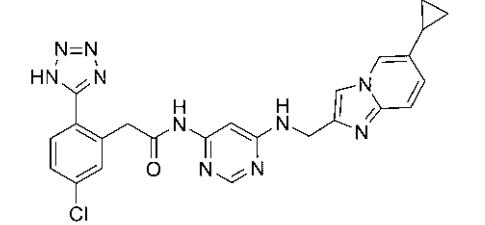
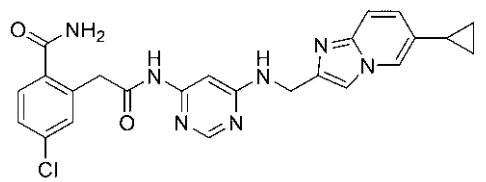
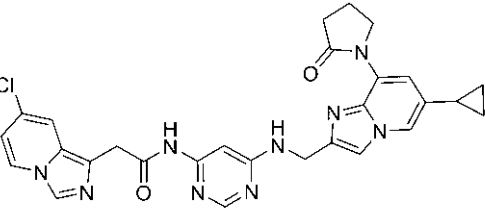
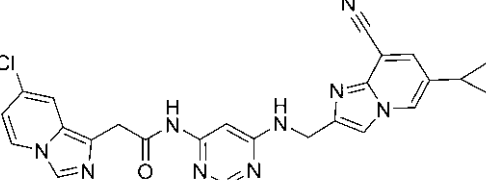
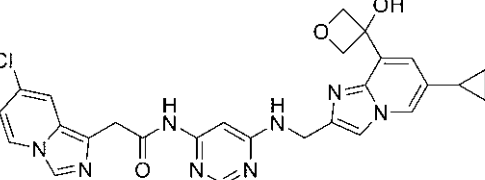
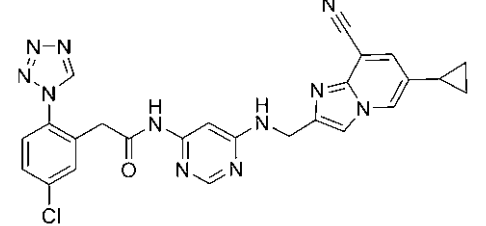
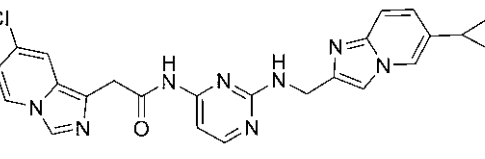
【化 1 4】



30

40

50

I-5, 	I-6, 
I-7, 	I-8, 
I-9, 	I-10, 
I-11, 	I-12, 
I-13, 	I-14, 
I-15, 	I-16,

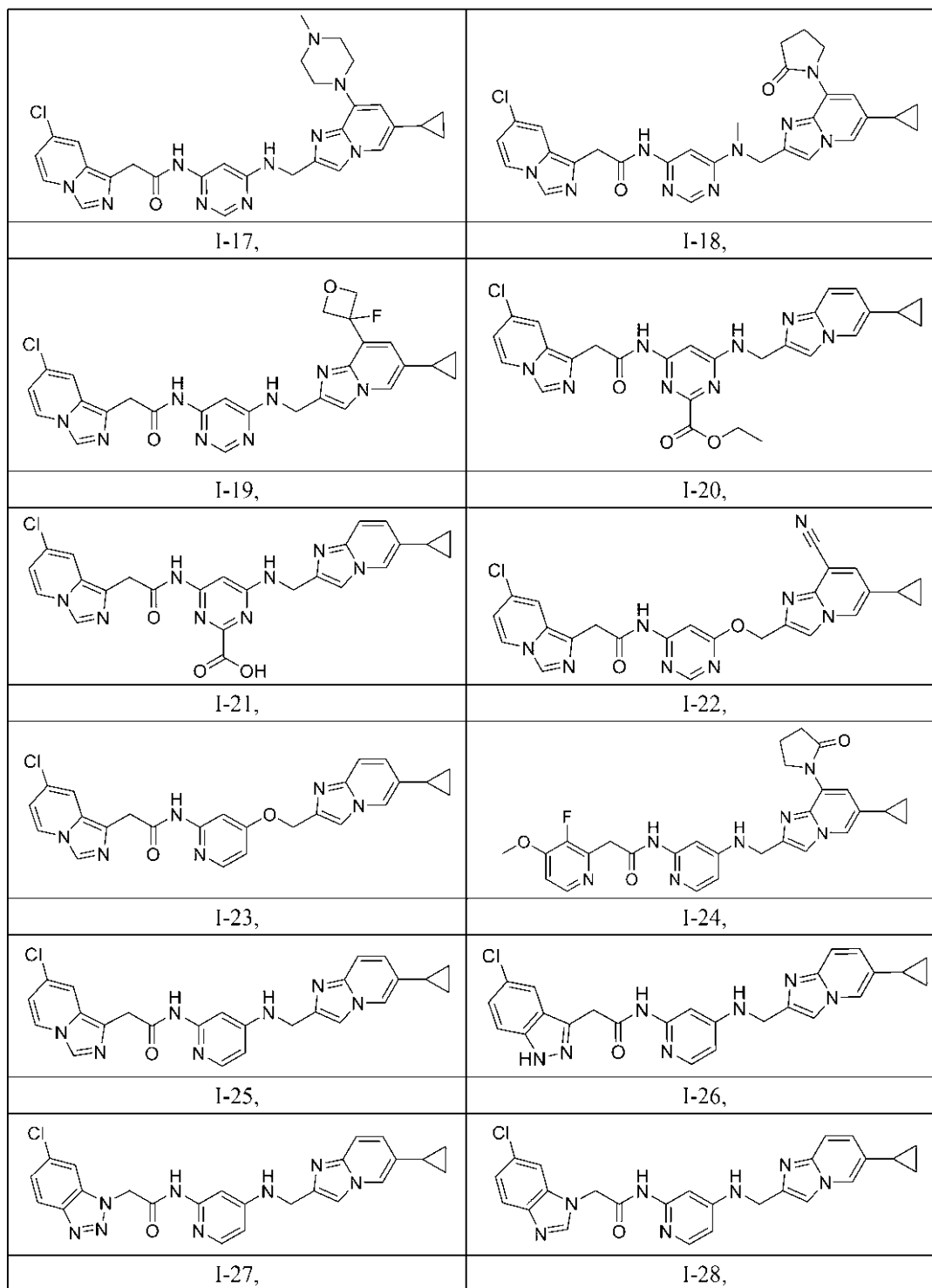
10

20

30

40

50



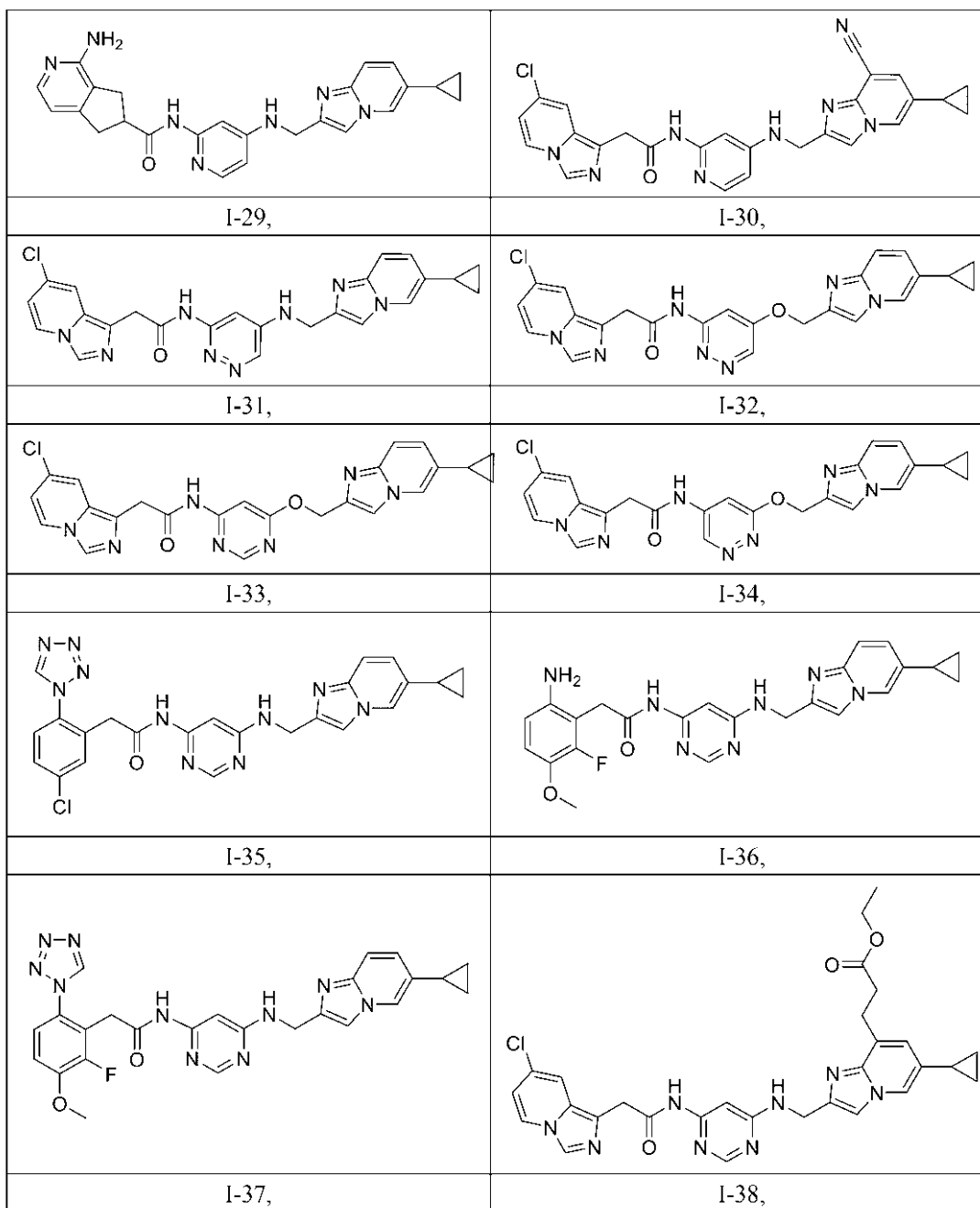
10

20

30

40

50



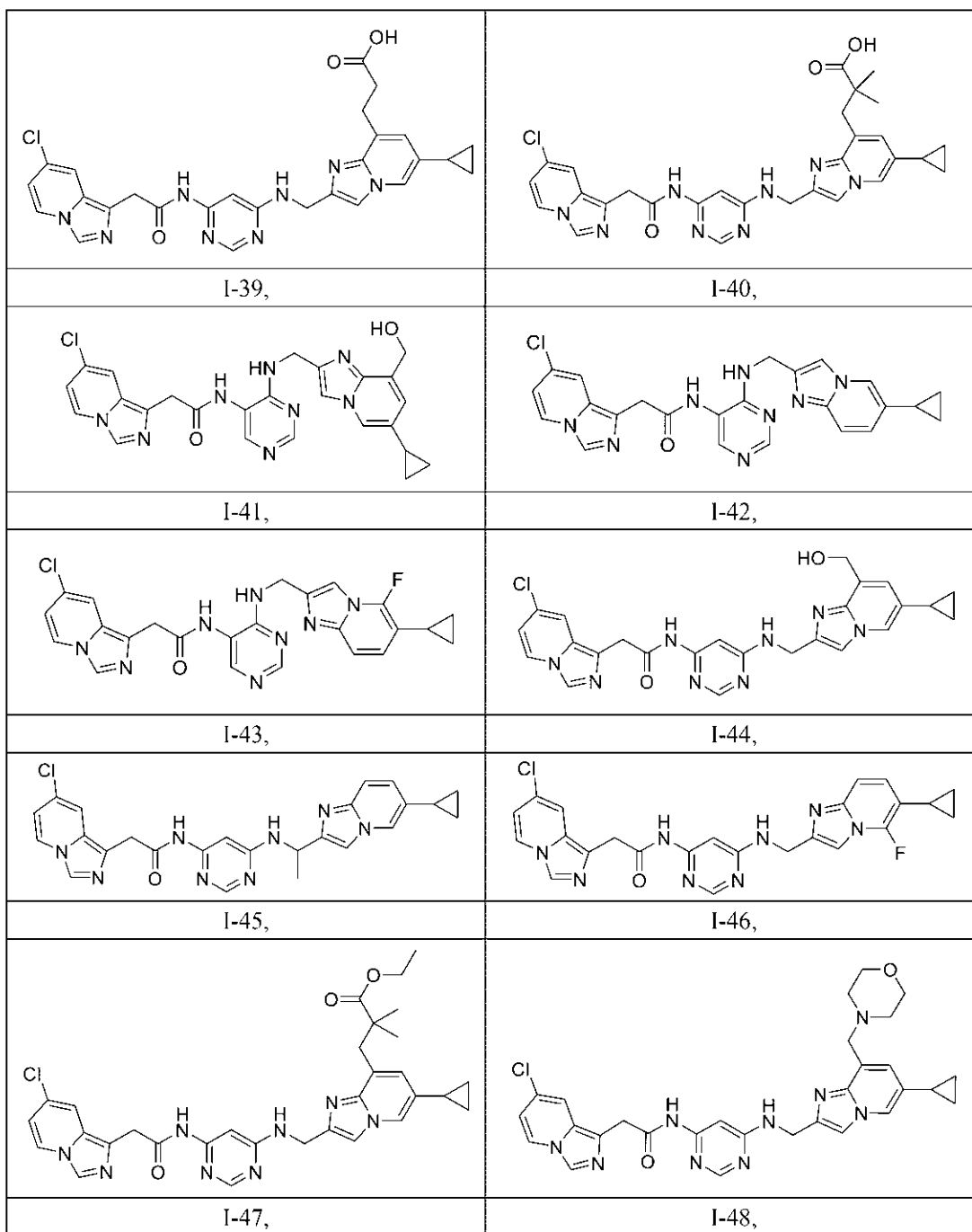
10

20

30

40

50



10

20

30

40

50

<p>I-49,</p>	<p>I-50,</p>
<p>I-51,</p>	<p>I-52,</p>
<p>I-53,</p>	<p>I-54,</p>
<p>I-55,</p>	<p>I-56,</p>
<p>I-58,</p>	<p>I-62,</p>

10

20

30

40

50

I-63,	I-64,
I-65,	I-66,
I-67,	I-68,
I-69,	I-70,
I-71,	I-72,

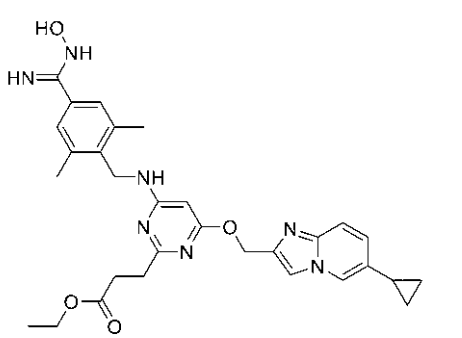
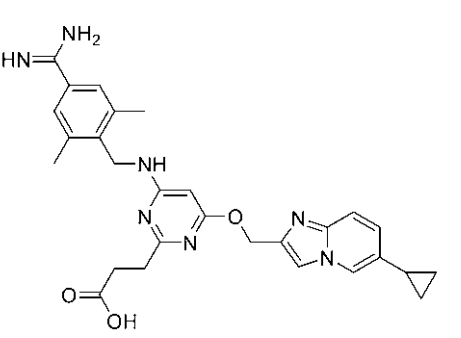
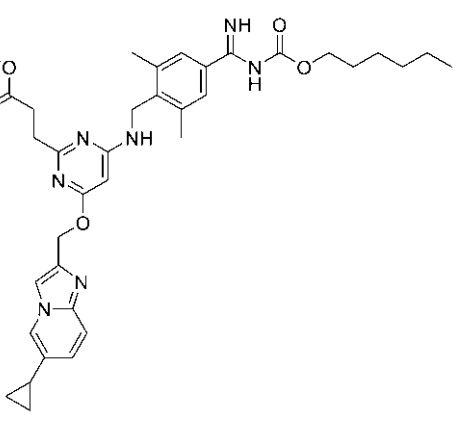
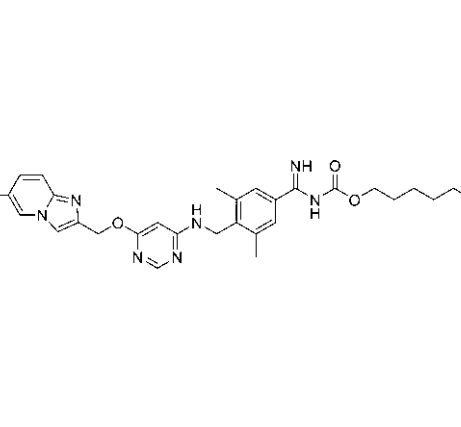
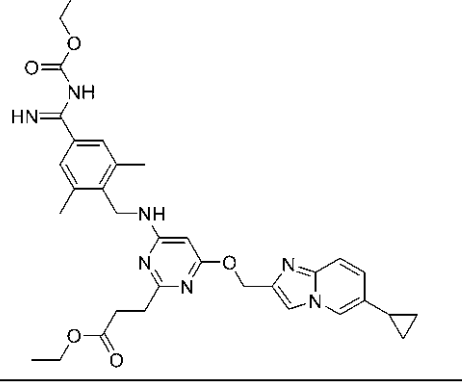
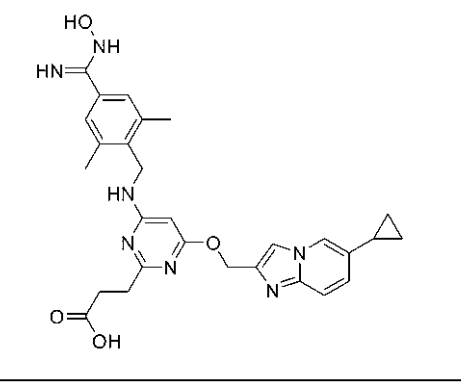
10

20

30

40

50

	
I-73,	I-74,
	
I-75,	I-76,
	
I-77,	I-78,

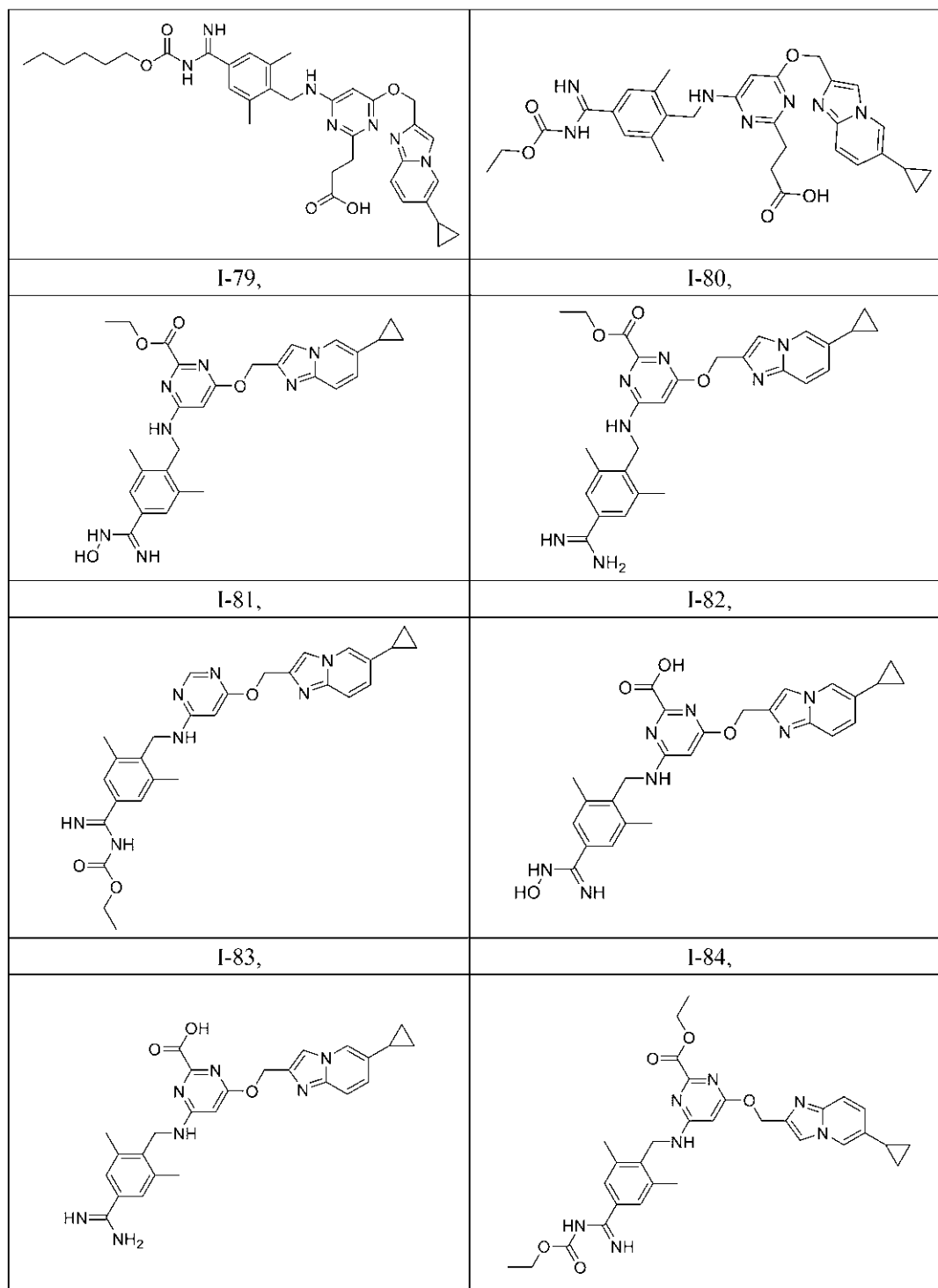
10

20

30

40

50



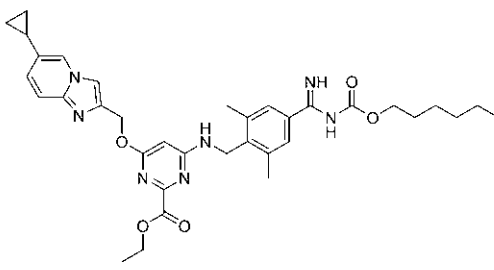
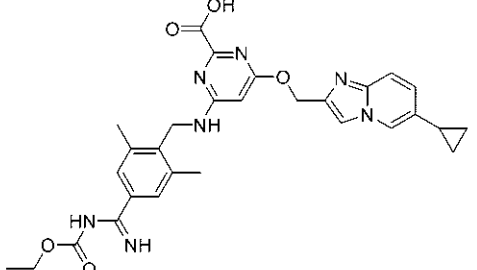
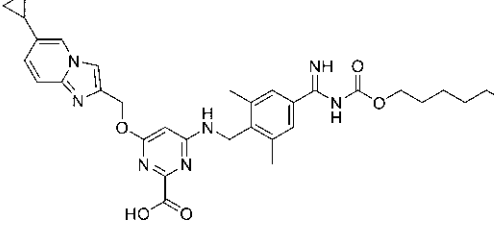
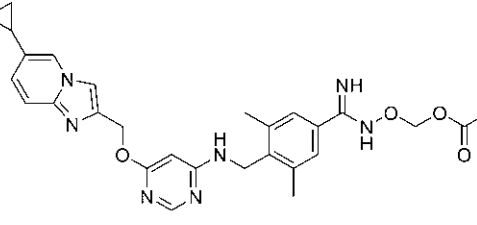
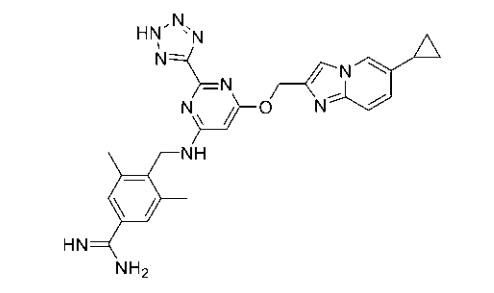
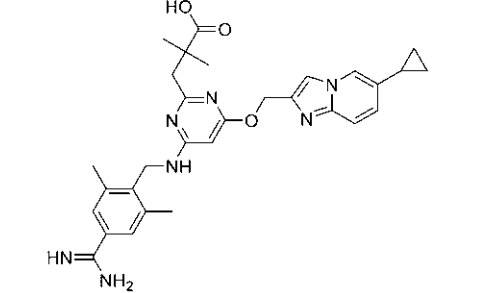
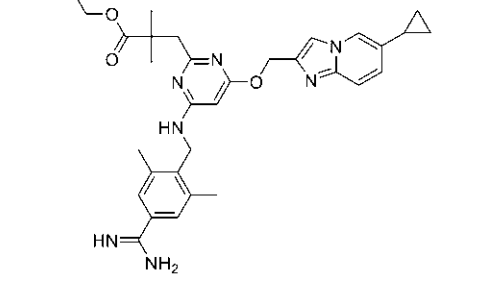
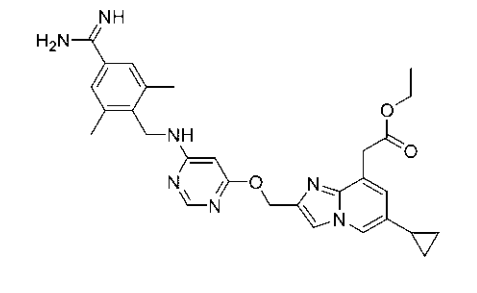
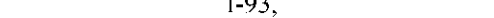
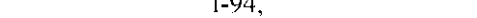
10

20

30

40

50

I-85, 	I-86, 
I-87, 	I-88, 
I-89, 	I-90, 
I-91, 	I-92, 
I-93, 	I-94, 

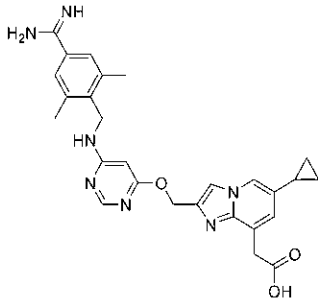
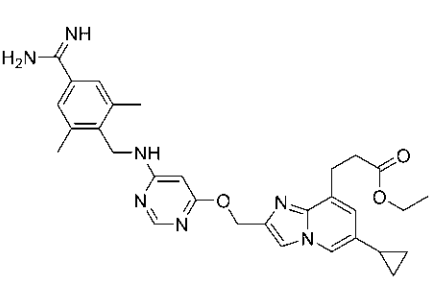
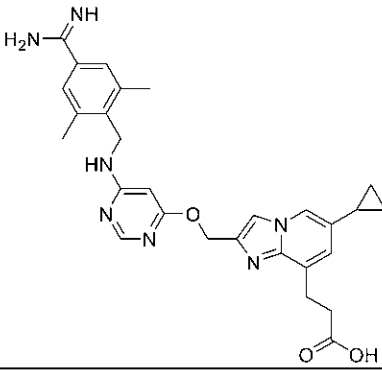
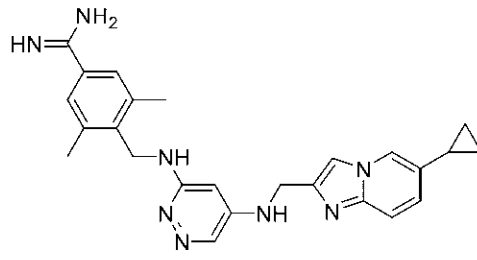
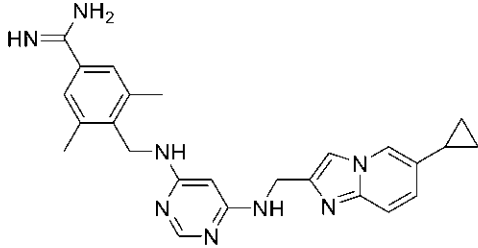
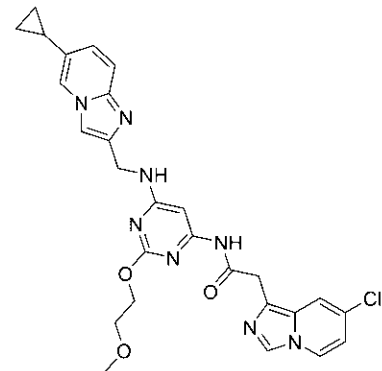
10

20

30

40

50

	
I-95,	I-96,
	
I-97,	I-98,
	
I-99,	I-100,

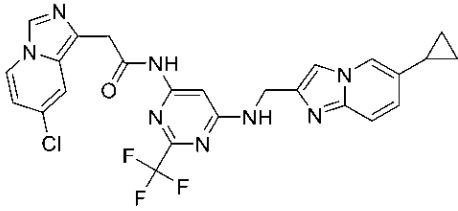
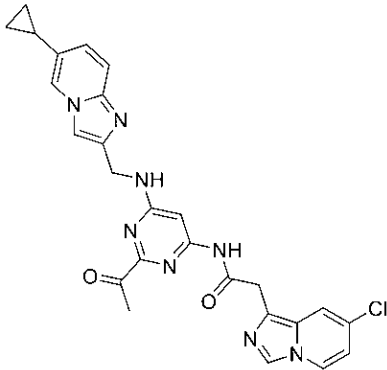
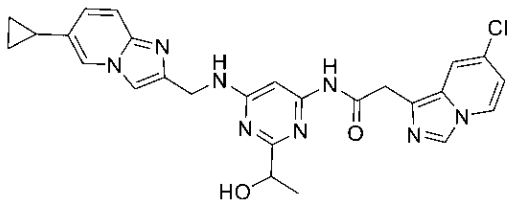
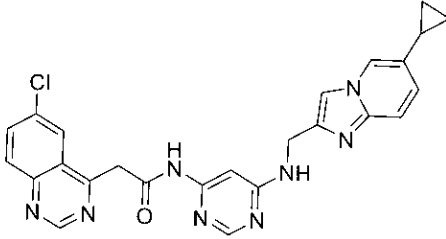
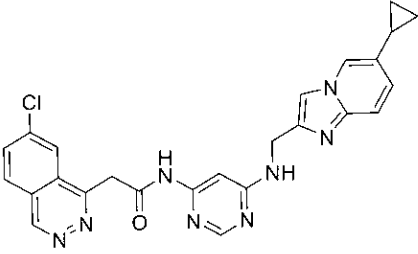
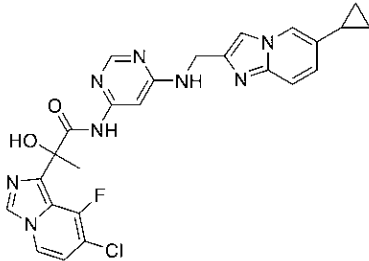
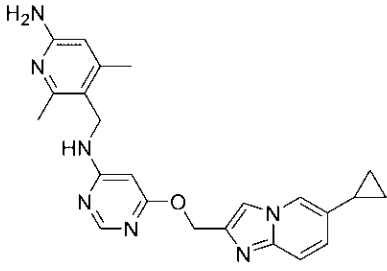
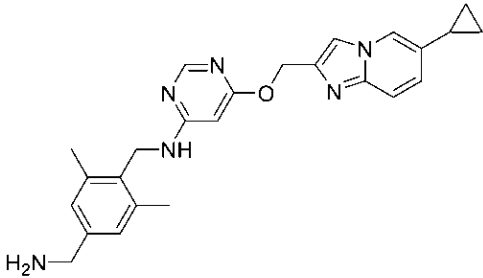
10

20

30

40

50

	
I-101,	I-102,
	
I-103,	I-104,
	
I-105,	I-106,
	
I-107,	I-108,

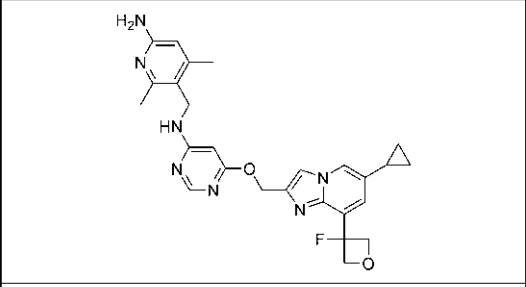
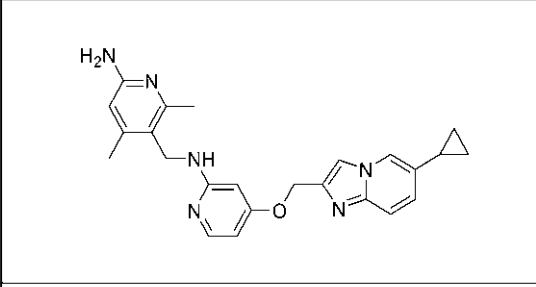
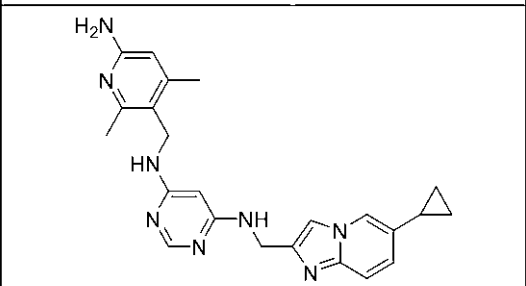
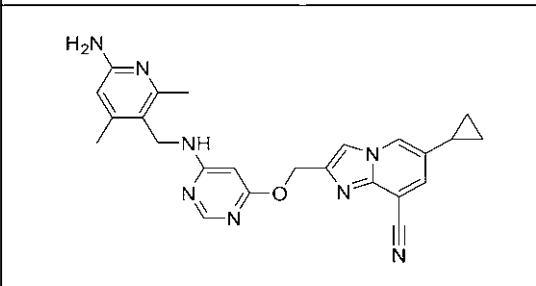
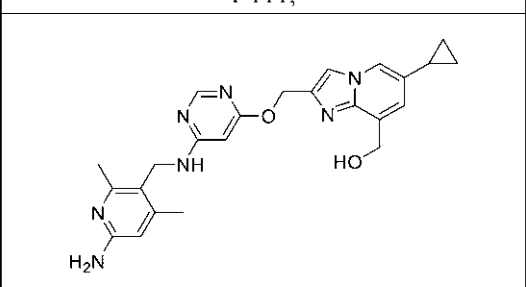
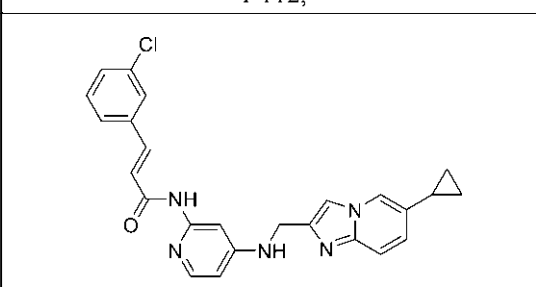
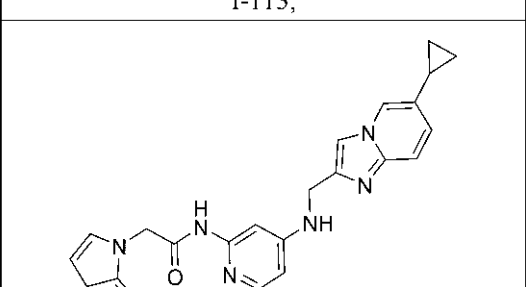
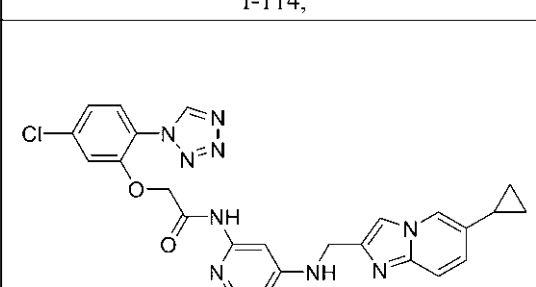
10

20

30

40

50

	
I-109,	I-110,
	
I-111,	I-112,
	
I-113,	I-114,
	
I-115,	I-116,

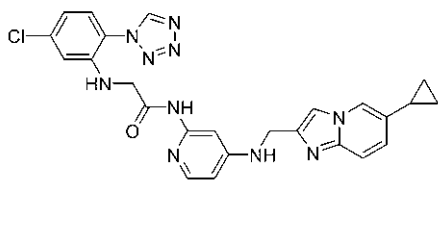
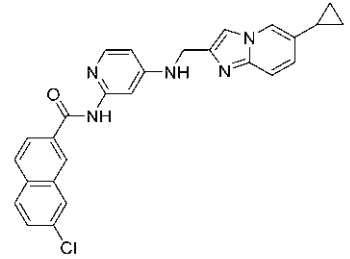
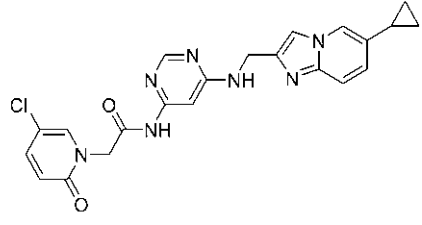
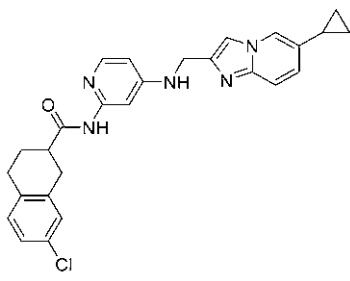
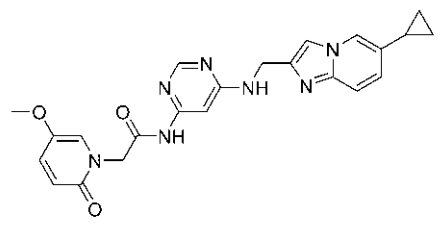
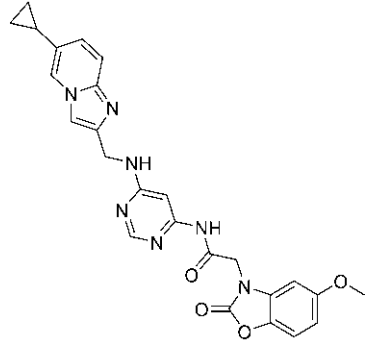
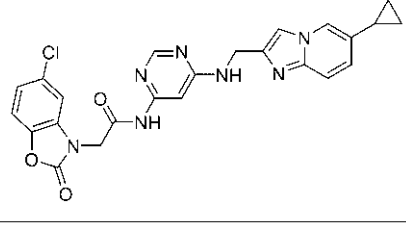
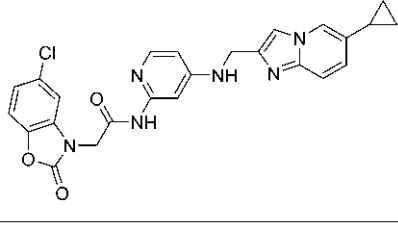
10

20

30

40

50

	
I-117,	I-118,
	
I-119,	I-120,
	
I-121,	I-122,
	
I-123,	I-124,

10

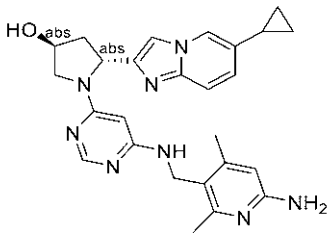
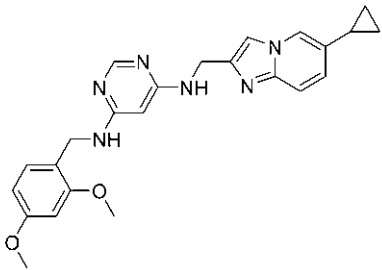
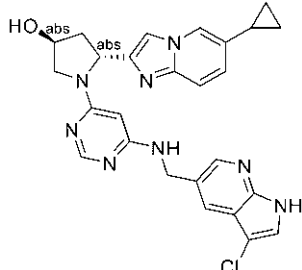
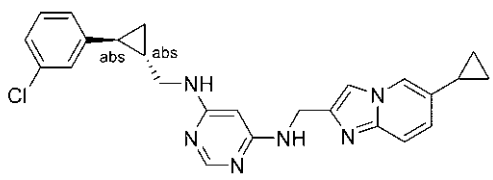
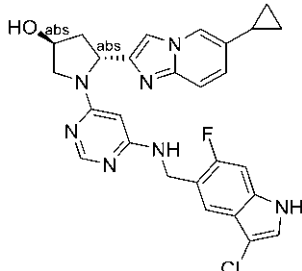
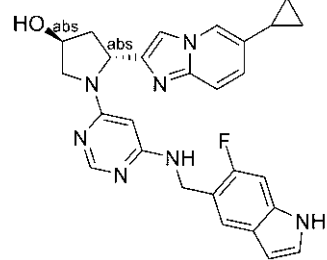
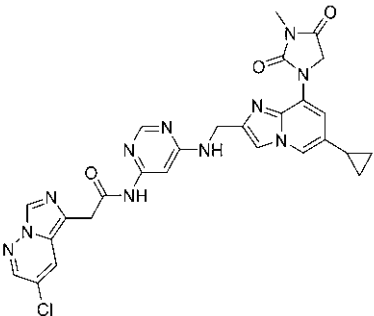
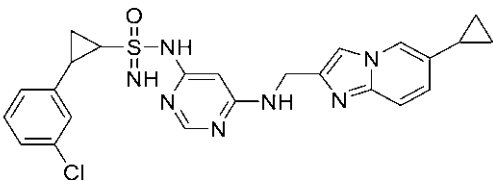
20

30

40

50

		10
I-125,	I-126,	
		20
I-127,	I-128,	
		30
I-129,	I-130,	
		40
I-131,	I-132,	
I-133,	I-134,	50

	
I-135,	I-136,
	
I-137,	I-138,
	
I-139,	I-140,
	
I-141,	I-142,

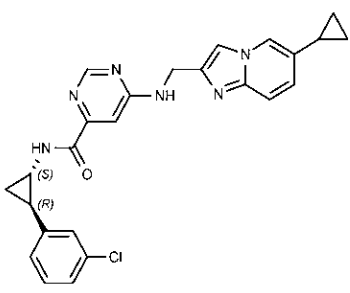
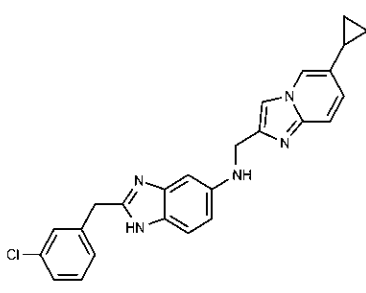
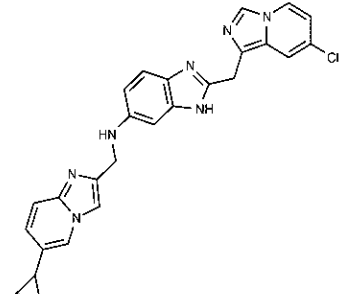
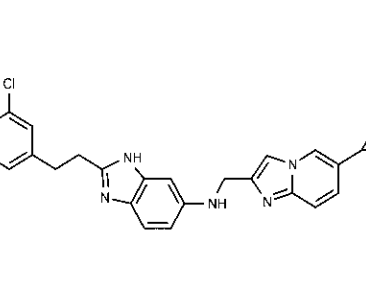
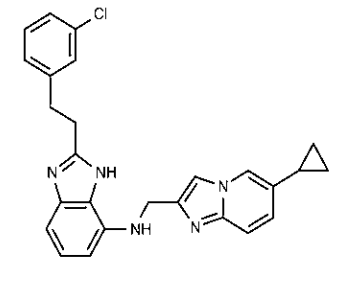
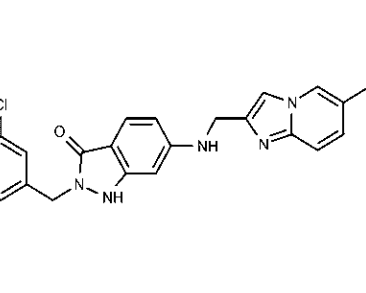
10

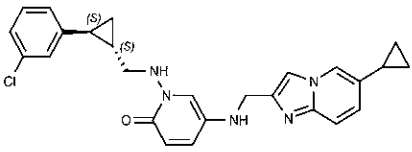
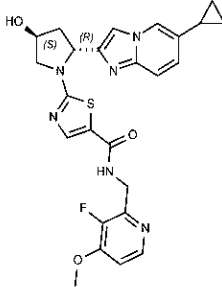
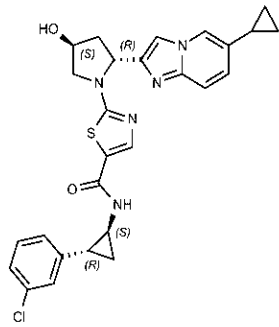
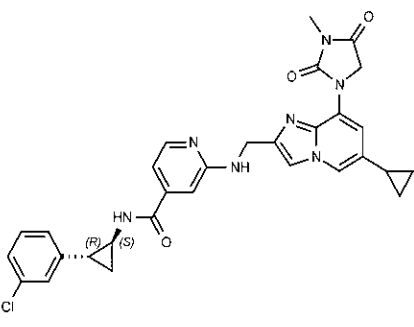
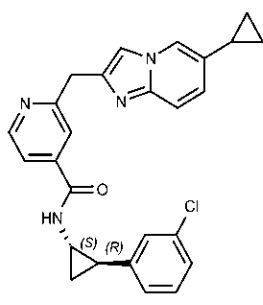
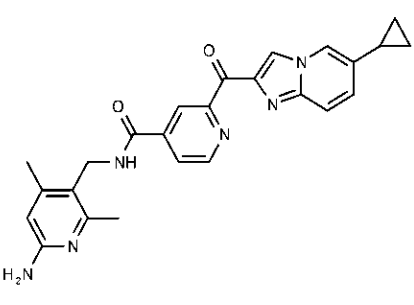
20

30

40

50

		10
I-143,	I-144,	
		20
I-145,	I-146,	
		30
I-147,	I-148,	

	
I-149,	I-150,
	
I-151,	I-152,
	
I-154,	I-155,

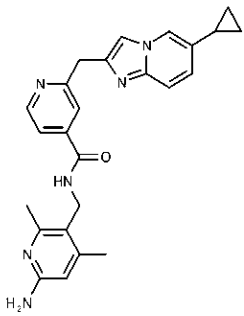
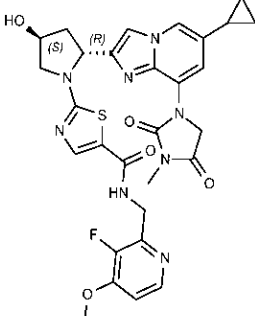
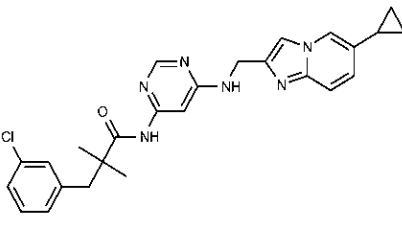
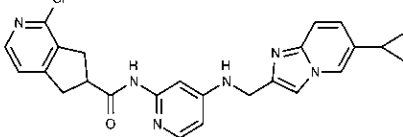
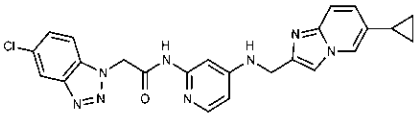
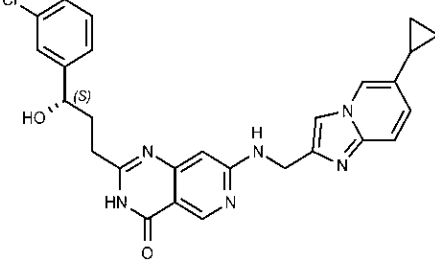
10

20

30

40

50

		10
I-156,	I-157,	
		20
I-158,	I-159,	
		30
I-160, 及び	I-161	

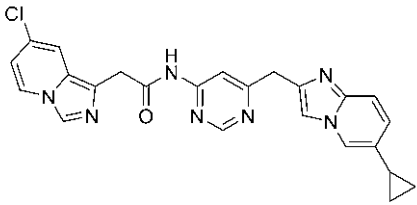
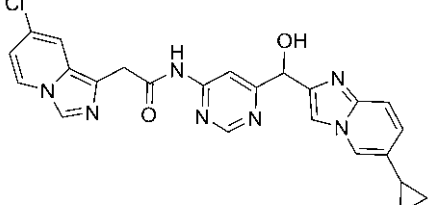
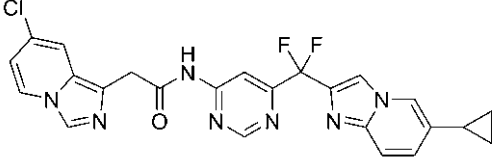
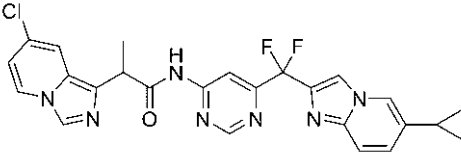
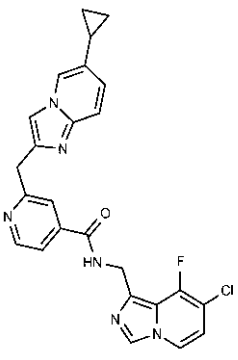
またはその薬学的に許容される塩から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 6】

40

50

【化 1 5】

	
I-57,	I-59,
	
I-60,	I-61, 及び
	
I-153,	

10

20

またはその薬学的に許容される塩から選択される、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

30

【請求項 2 7】

請求項 1 ~ 2.6 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 2 8】

血漿カリクレインにより媒介される疾患または障害の治療における使用のための、請求項 1 ~ 2.7 のいずれか一項に記載される化合物または組成物。

【請求項 2 9】

前記疾患または障害が、遺伝性血管浮腫または糖尿病黄斑浮腫である、請求項 2.8 に記載の化合物または組成物。

40

50