

【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5年2月6日(2023.2.6)

【国際公開番号】WO2020/159904

【公表番号】特表2022-519239(P2022-519239A)

【公表日】令和4年3月22日(2022.3.22)

【年通号数】公開公報(特許)2022-050

【出願番号】特願2021-544435(P2021-544435)

【国際特許分類】

10

C 0 7 D 2 1 3 / 8 2 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 0 3 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 1 3 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 2 3 7 / 2 4 (2 0 0 6 . 0 1)

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

C 0 7 D 4 0 5 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

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

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

20

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

A 6 1 P 2 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 7 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 9 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

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

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

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

A 6 1 K 3 1 / 4 4 2 7 (2 0 0 6 . 0 1)

【 F I 】

C 0 7 D 2 1 3 / 8 2

30

C 0 7 D 4 0 3 / 1 2 C S P

C 0 7 D 4 1 3 / 1 2

C 0 7 D 2 3 7 / 2 4

C 0 7 D 4 0 1 / 1 2

C 0 7 D 4 0 5 / 1 4

C 0 7 D 4 1 7 / 1 4

A 6 1 K 3 1 / 4 4

A 6 1 K 3 1 / 5 0 1

A 6 1 K 3 1 / 5 0

C 0 7 D 4 1 7 / 1 2

40

A 6 1 P 2 9 / 0 0

A 6 1 P 3 7 / 0 0

A 6 1 P 2 9 / 0 0 1 0 1

A 6 1 P 1 9 / 0 2

A 6 1 P 1 7 / 0 6

A 6 1 P 1 7 / 0 0

A 6 1 P 1 / 0 4

A 6 1 K 3 1 / 4 4 2 7

【手続補正書】

50

【提出日】令和5年1月27日(2023.1.27)

【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】

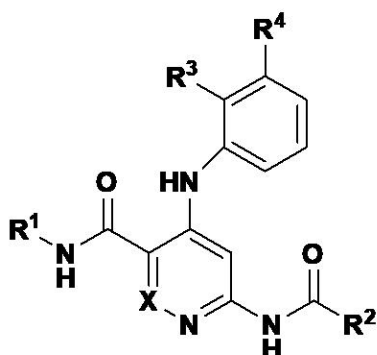
【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I：

【化1】

10



I

20

[式中：

Xは、NまたはCHであり；

R¹は、H、CD₃、C₁-₃アルキルまたはC₃-₆シクロアルキルであり；

R²は、C₁-₆アルキル、C₁-₆アルコキシ、-(CH₂)_r-3~14員の炭素環(0~1個のR^{2a}で置換)、-NR^aC₁-₆アルキル(0~2個のR^{2a}で置換)、-NR^a-アリール(0~2個のR^{2a}で置換)、-NR^a-ヘテロ環(0~2個のR^{2a}で置換)、NR^aCO-C₁-₆アルキル、NR^a-C₃-₆シクロアルキル(0~2個のR^{2a}で置換)または5~8員のヘテロ環(0~3個のR^{2a}で置換)であり；

30

R^{2a}は、各々独立して、H、CN、ハロゲン、C₁-₆アルキル、C₃-₆シクロアルキル、C₃-₆アリールまたは5~8員のヘテロ環であり；

R³は、C₁-₃アルキル、C₁-₃アルコキシ、-NHS(O)_pR^aまたは-S(O)_pR^aであり；

R⁴は、存在しないか、または5~7員のヘテロ環(0~3個のR⁵で置換)であり；

R⁵は、H、ハロゲン、C₁-₃アルキル、C₁-₃アルキルC₁-₃アルコキシ、-(CH₂)_r-5~8員のヘテロ環(0~2個のR^{5a}で置換)または-CO-3~8員のヘテロ環であり；

R^{5a}は、SO₂-C₁-₆アルキルまたはCOO-C₁-₆アルキルであり；

R^aは、C₁-₃アルキルまたはC₃-₆シクロアルキルであり；

40

pは1または2であり；

rは0、1、2、3、4または5である]

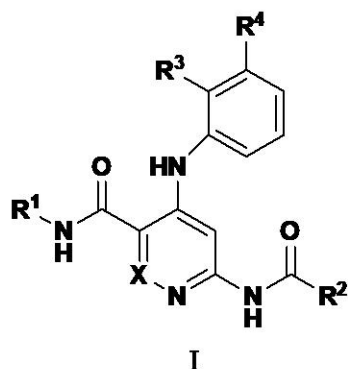
で示される化合物、あるいはその立体異性体または医薬的に許容される塩。

【請求項2】

式：

50

【化 2】



10

[式中 :

X は、N または CH であり ;

R¹ は、H または CD₃ であり ;

R² は、C₁-6 アルキル、C₁-6 アルコキシ、-(CH₂)_r-3~14 員の炭素環 (0~1 個の R^{2a} で置換)、-NR^aC₁-6 アルキル (0~2 個の R^{2a} で置換)、-NR^a-アリーール (0~2 個の R^{2a} で置換)、-NR^a-ヘテロ環 (0~2 個の R^{2a} で置換)、NR^aCO-C₁-6 アルキル、NR^a-C₃-6 シクロアルキル (0~2 個の R^{2a} で置換) または 5~8 員のヘテロ環 (0~3 個の R^{2a} で置換) であり ;

20

R^{2a} は、各々独立して、H、CN、ハロゲン、C₁-6 アルキル、C₃-6 シクロアルキル、C₃-6 アリーールまたは 5~8 員のヘテロ環であり ;

R³ は、C₁-3 アルキル、C₁-3 アルコキシ、-NHS(O)_pR^a または -S(O)_pR^a であり ;

R⁴ は、存在しないか、または 5~7 員のヘテロ環 (0~3 個の R⁵ で置換) であり ;

R⁵ は、H、ハロゲン、C₁-3 アルキル、C₁-3 アルキル C₁-3 アルコキシ、-(CH₂)_r 5~8 員のヘテロ環 (0~2 個の R^{5a} で置換) または -CO-3~8 員のヘテロ環であり ;

R^{5a} は、SO₂-C₁-6 アルキル または COO-C₁-6 アルキル であり ;R^a は、C₁-3 アルキル または C₃-6 シクロアルキル であり ;

30

p は 1 または 2 であり ;

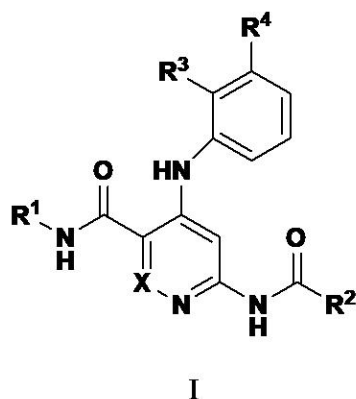
r は 0、1、2、3、4 または 5 である]

で示される請求項 1 に記載の化合物、あるいはその立体異性体または医薬的に許容される塩。

【請求項 3】

式 :

【化 3】



40

[式中 :

50

X は、N または CH であり；

R¹ は、H または CD₃ であり；

R² は、C₁-6 アルキル、C₁-6 アルコキシ、-(CH₂)_r-3~14 員の炭素環 (0~1 個の R^{2a} で置換)、-NR^aC₁-6 アルキル (0~2 個の R^{2a} で置換)、-NR^a-アリーール (0~2 個の R^{2a} で置換)、-NR^a-ヘテロ環 (0~2 個の R^{2a} で置換)、NR^aCO-C₁-6 アルキル、NR^a-C₃-6 シクロアルキル (0~2 個の R^{2a} で置換) または 5~8 員のヘテロ環 (0~3 個の R^{2a} で置換) であり；

R^{2a} は、各々独立して、H、CN、ハロゲン、C₁-6 アルキル、C₃-6 シクロアルキル、C₃-6 アリーールまたは 5~8 員のヘテロ環であり；

R³ は、C₁-3 アルキル、C₁-3 アルコキシ、-NHS(O)_pR^a または -S(O)_pR^a であり；

R⁴ は、存在しないか、または 5~7 員のヘテロ環 (0~3 個の R⁵ で置換) であり；

R⁵ は、H、ハロゲン、C₁-3 アルキル、C₁-3 アルキルC₁-3 アルコキシ、-(CH₂)_r 5~8 員のヘテロ環 (0~2 個の R^{5a} で置換) または -CO-3~8 員のヘテロ環であり；

R^{5a} は、SO₂-C₁-6 アルキルまたは COO-C₁-6 アルキルであり；

R^a は、C₁-3 アルキルまたは C₃-6 シクロアルキルであり；

p は 2 であり；

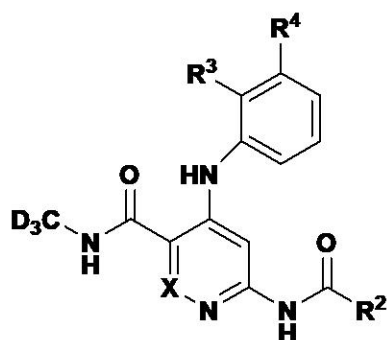
r は 0、1、2、3、4 または 5 である]

で示される請求項 1 に記載の化合物、あるいはその立体異性体または医薬的に許容される塩。

【請求項 4】

式：

【化 4】



30

[式中：

X は、N または CH であり；

R² は、C₁-6 アルキル、C₁-6 アルコキシ、-(CH₂)_r-3~14 員の炭素環 (0~1 個の R^{2a} で置換)、-NR^aC₁-6 アルキル (0~2 個の R^{2a} で置換)、-NR^a-アリーール (0~2 個の R^{2a} で置換)、-NR^a-ヘテロ環 (0~2 個の R^{2a} で置換)、NR^aCO-C₁-6 アルキル、NR^a-C₃-6 シクロアルキル (0~2 個の R^{2a} で置換) または 5~8 員のヘテロ環 (0~3 個の R^{2a} で置換) であり；

R^{2a} は、各々独立して、H、CN、ハロゲン、C₁-6 アルキル、C₃-6 シクロアルキル、C₃-6 アリーールまたは 5~8 員のヘテロ環であり；

R³ は、C₁-3 アルキル、C₁-3 アルコキシ、-NHS(O)_pR^a または -S(O)_pR^a であり；

R⁴ は、存在しないか、または 5~7 員のヘテロ環 (0~3 個の R⁵ で置換) であり；

R⁵ は、H、ハロゲン、C₁-3 アルキル、C₁-3 アルキルC₁-3 アルコキシ、-(CH₂)_r 5~8 員のヘテロ環 (0~2 個の R^{5a} で置換) または -CO-3~8 員のヘテロ環であり；

R^{5a} は、SO₂-C₁-6 アルキルまたは COO-C₁-6 アルキルであり；

50

R^a は、 C_{1-3} アルキルまたは C_{3-6} シクロアルキルであり；

p は 2 であり；

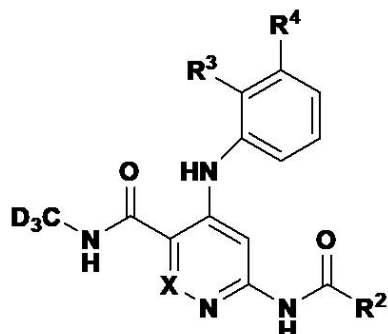
r は 0、1、2、3、4 または 5 である]

で示される請求項 3 に記載の化合物、あるいはその立体異性体または医薬的に許容される塩。

【請求項 5】

式：

【化 5】



10

[式中：

X は、 N または CH であり；

20

R^2 は、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 $-(CH_2)_r-3 \sim 14$ 員の炭素環（0～1個の R^{2a} で置換）、 $-NR^aC_{1-6}$ アルキル（0～2個の R^{2a} で置換）、 $-NR^a$ -アリーール（0～2個の R^{2a} で置換）、 $-NR^a$ -ヘテロ環（0～2個の R^{2a} で置換）、 NR^aCO-C_{1-6} アルキル、 NR^a-C_{3-6} シクロアルキル（0～2個の R^{2a} で置換）または5～8員のヘテロ環（0～3個の R^{2a} で置換）であり；

R^{2a} は、各々独立して、 H 、 CN 、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} アリーールまたは5～8員のヘテロ環であり；

R^3 は、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコキシ、 $-NHS(O)_pR^a$ または $-S(O)_pR^a$ であり；

R^4 は、存在しないか、または5～7員のヘテロ環（0～3個の R^5 で置換）であり；

30

R^5 は、 H 、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルキル C_{1-3} アルコキシ、 $-(CH_2)_r5 \sim 8$ 員のヘテロ環（0～2個の R^{5a} で置換）または $-CO-3 \sim 8$ 員のヘテロ環であり；

R^{5a} は、 SO_2-C_{1-6} アルキルまたは $COO-C_{1-6}$ アルキルであり；

R^a は、 C_{1-3} アルキルまたは C_{3-6} シクロアルキルであり；

p は 2 であり；

r は 0、1 または 2 である]

で示される請求項 4 に記載の化合物、あるいはその立体異性体または医薬的に許容される塩。

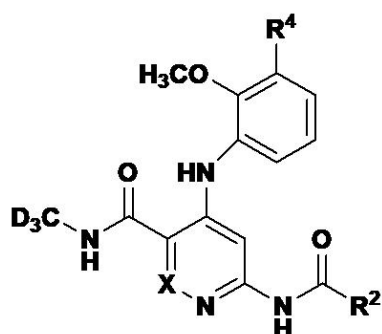
【請求項 6】

40

式：

50

【化6】



10

[式中：

X は、N または CH であり；

R² は、C₁-6 アルキル、C₁-6 アルコキシ、-(CH₂)_r-3~14 員の炭素環 (0~1 個の R^{2a} で置換)、-NR^aC₁-6 アルキル (0~2 個の R^{2a} で置換)、-NR^a-アリーール (0~2 個の R^{2a} で置換)、-NR^a-ヘテロ環 (0~2 個の R^{2a} で置換)、NR^aCO-C₁-6 アルキル、NR^a-C₃-6 シクロアルキル (0~2 個の R^{2a} で置換) または 5~8 員のヘテロ環 (0~3 個の R^{2a} で置換) であり；

R^{2a} は、各々独立して、H、CN、ハロゲン、C₁-6 アルキル、C₃-6 シクロアルキル、C₃-6 アリーールまたは 5~8 員のヘテロ環であり；

20

R⁴ は、存在しないか、または 5~7 員のヘテロ環 (0~3 個の R⁵ で置換) であり；

R⁵ は、H、ハロゲン、C₁-3 アルキル、C₁-3 アルキル C₁-3 アルコキシ、-(CH₂)_r 5~8 員のヘテロ環 (0~2 個の R^{5a} で置換) または -CO-3~8 員のヘテロ環であり；

R^{5a} は、SO₂-C₁-6 アルキルまたは COO-C₁-6 アルキルであり；R^a は、C₁-3 アルキルまたは C₃-6 シクロアルキルであり；

p は 2 であり；

r は 0、1 または 2 である]

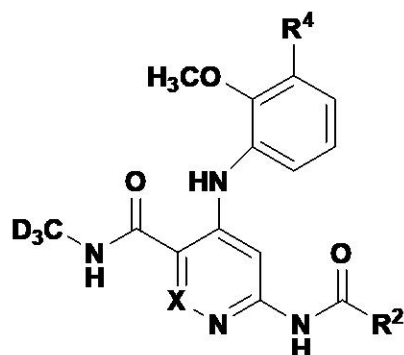
で示される請求項 5 に記載の化合物、あるいはその立体異性体または医薬的に許容される塩。

30

【請求項 7】

式：

【化 7】



40

[式中：

X は、N または CH であり；

R² は、C₁-6 アルキル、C₁-6 アルコキシ、-(CH₂)_r-3~14 員の炭素環 (0~1 個の R^{2a} で置換)、-NR^aC₁-6 アルキル (0~2 個の R^{2a} で置換)、-NR^a-アリーール (0~2 個の R^{2a} で置換)、-NR^a-ヘテロ環 (0~2 個の R^{2a} で置換)、NR^aCO-C₁-6 アルキル、NR^a-C₃-6 シクロアルキル (0~2 個の R^{2a} で置換) または 5~8 員のヘテロ環 (0~3 個の R^{2a} で置換) であり；

50

R^{2a} は、各々独立して、H、CN、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} アリールまたは5～8員のヘテロ環であり；

R^4 は、存在しないか、またはトリアゾール、チアゾール、テトラゾールまたはオキサジアゾール基であり、その各々は0～3個の R^5 で置換され；

R^5 は、H、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルキル C_{1-3} アルコキシ、 $-(CH_2)_r$ 5～8員のヘテロ環（0～2個の R^{5a} で置換）または $-CO-$ 3～8員のヘテロ環であり；

R^{5a} は、 SO_2-C_{1-6} アルキルまたは $COO-C_{1-6}$ アルキルであり；

R^a は、 C_{1-3} アルキルまたは C_{3-6} シクロアルキルであり；

pは2であり；

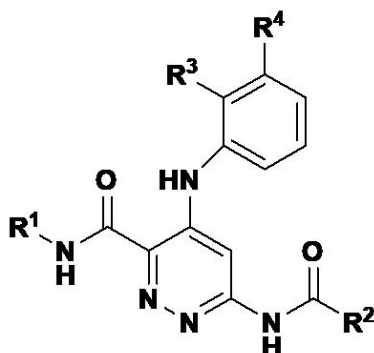
rは0、1または2である]

で示される請求項6に記載の化合物、あるいはその立体異性体または医薬的に許容される塩。

【請求項8】

式：

【化8】



[式中：

R^1 は、H、 CD_3 、 C_{1-3} アルキルまたは C_{3-6} シクロアルキルであり；

R^2 は、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 $-(CH_2)_r$ 3～14員の炭素環（0～1個の R^{2a} で置換）、 $-NR^aC_{1-6}$ アルキル（0～2個の R^{2a} で置換）、 $-NR^a$ -アリール（0～2個の R^{2a} で置換）、 $-NR^a$ -ヘテロ環（0～2個の R^{2a} で置換）、 NR^aCO-C_{1-6} アルキル、 NR^a-C_{3-6} シクロアルキル（0～2個の R^{2a} で置換）または5～8員のヘテロ環（0～3個の R^{2a} で置換）であり；

R^{2a} は、各々独立して、H、CN、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} アリールまたは5～8員のヘテロ環であり；

R^3 は、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコキシ、 $-NHS(O)_pR^a$ または $-S(O)_pR^a$ であり；

R^4 は、存在しないか、または5～7員のヘテロ環（0～3個の R^5 で置換）であり；

R^5 は、H、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルキル C_{1-3} アルコキシ、 $-(CH_2)_r$ 5～8員のヘテロ環（0～2個の R^{5a} で置換）または $-CO-$ 3～8員のヘテロ環であり；

R^{5a} は、 SO_2-C_{1-6} アルキルまたは $COO-C_{1-6}$ アルキルであり；

R^a は、 C_{1-3} アルキルまたは C_{3-6} シクロアルキルであり；

pは1または2であり；

rは0、1、2、3、4または5である]

で示される請求項1に記載の化合物、あるいはその立体異性体または医薬的に許容される塩。

【請求項9】

式：

10

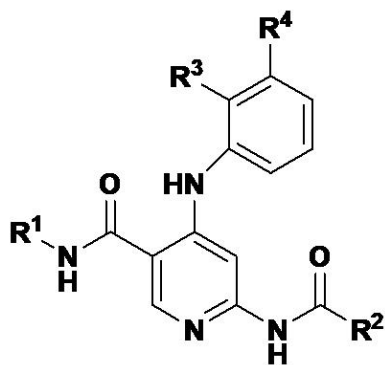
20

30

40

50

【化 9】



10

[式中 :

R^1 は、H、 CD_3 、 C_{1-3} アルキルまたは C_{3-6} シクロアルキルであり；

R^2 は、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 $-(CH_2)_r-3 \sim 14$ 員の炭素環（0～1個の R^{2a} で置換）、 $-NR^aC_{1-6}$ アルキル（0～2個の R^{2a} で置換）、 $-NR^a$ -アリーール（0～2個の R^{2a} で置換）、 $-NR^a$ -ヘテロ環（0～2個の R^{2a} で置換）、 NR^aCO-C_{1-6} アルキル、 NR^a-C_{3-6} シクロアルキル（0～2個の R^{2a} で置換）または5～8員のヘテロ環（0～3個の R^{2a} で置換）であり；

R^{2a} は、各々独立して、H、CN、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} アリーールまたは5～8員のヘテロ環であり；

R^3 は、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコキシ、 $-NHS(O)_pR^a$ または $-S(O)_pR^a$ であり；

R^4 は、存在しないか、または5～7員のヘテロ環（0～3個の R^5 で置換）であり；

R^5 は、H、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルキル C_{1-3} アルコキシ、 $-(CH_2)_r-5 \sim 8$ 員のヘテロ環（0～2個の R^{5a} で置換）または $-CO-3 \sim 8$ 員のヘテロ環であり；

R^{5a} は、 SO_2-C_{1-6} アルキルまたは $COO-C_{1-6}$ アルキルであり；

R^a は、 C_{1-3} アルキルまたは C_{3-6} シクロアルキルであり；

p は1または2であり；

r は0、1、2、3、4または5である]

30

で示される請求項1に記載の化合物、あるいはその立体異性体または医薬的に許容される塩。

【請求項10】

請求項1に記載の1または複数の化合物、あるいはその立体異性体または医薬的に許容される塩、および医薬的に許容される担体または希釈剤を含む、医薬組成物。

【請求項11】

請求項1に記載の化合物、あるいはその立体異性体または医薬的に許容される塩を含む、疾患の治療剤であって、該疾患が炎症性または自己免疫性疾患である、治療剤。

【請求項12】

炎症性または自己免疫性疾患が、多発性硬化症、関節リウマチ、強直性脊椎炎、炎症性腸疾患、全身性エリテマトーデス、乾癬、乾癬性関節炎、クローン病、シェーグレン症候群または強皮症である、請求項11に記載の治療剤。

40

50