

【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2年10月22日(2020.10.22)

【公表番号】特表2019-526606(P2019-526606A)

【公表日】令和1年9月19日(2019.9.19)

【年通号数】公開・登録公報2019-038

【出願番号】特願2019-513756(P2019-513756)

【国際特許分類】

C 07 D 213/64 (2006.01)
C 07 D 215/227 (2006.01)
C 07 D 401/06 (2006.01)
C 07 D 471/04 (2006.01)
C 07 D 401/14 (2006.01)
C 07 D 401/12 (2006.01)
C 07 D 215/38 (2006.01)
A 61 K 31/506 (2006.01)
A 61 K 31/4709 (2006.01)
A 61 K 31/501 (2006.01)
A 61 K 31/5377 (2006.01)
A 61 K 31/4704 (2006.01)
A 61 K 31/496 (2006.01)
A 61 K 31/4375 (2006.01)
A 61 K 31/497 (2006.01)
A 61 K 31/4418 (2006.01)
A 61 K 31/444 (2006.01)
A 61 K 31/4412 (2006.01)
A 61 K 45/00 (2006.01)
A 61 P 43/00 (2006.01)
A 61 P 11/00 (2006.01)
A 61 P 17/10 (2006.01)
A 61 P 35/02 (2006.01)
A 61 P 5/38 (2006.01)
A 61 P 1/16 (2006.01)
A 61 P 29/00 (2006.01)
A 61 P 31/18 (2006.01)
A 61 P 37/08 (2006.01)
A 61 P 11/06 (2006.01)
A 61 P 31/10 (2006.01)
A 61 P 27/02 (2006.01)
A 61 P 17/14 (2006.01)
A 61 P 25/28 (2006.01)
A 61 P 21/00 (2006.01)
A 61 P 1/14 (2006.01)
A 61 P 7/10 (2006.01)
A 61 P 3/00 (2006.01)
A 61 P 1/02 (2006.01)
A 61 P 1/04 (2006.01)
A 61 P 19/02 (2006.01)
A 61 P 9/10 (2006.01)

| | | |
|---------|-------|-----------|
| A 6 1 P | 17/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 37/06 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 39/02 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 19/08 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 17/02 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 35/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 9/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 9/14 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 15/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 13/12 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 31/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 27/06 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 19/06 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 7/06 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 27/16 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 3/06 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 3/10 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 33/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 3/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 17/06 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 9/12 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 33/02 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 31/06 | (2006.01) |

【 F I 】

| | | |
|---------|---------|---------|
| C 0 7 D | 213/64 | |
| C 0 7 D | 215/227 | C S P |
| C 0 7 D | 401/06 | |
| C 0 7 D | 471/04 | 1 1 3 |
| C 0 7 D | 401/14 | |
| C 0 7 D | 401/12 | |
| C 0 7 D | 471/04 | 1 1 4 A |
| C 0 7 D | 215/38 | |
| A 6 1 K | 31/506 | |
| A 6 1 K | 31/4709 | |
| A 6 1 K | 31/501 | |
| A 6 1 K | 31/5377 | |
| A 6 1 K | 31/4704 | |
| A 6 1 K | 31/496 | |
| A 6 1 K | 31/4375 | |
| A 6 1 K | 31/497 | |
| A 6 1 K | 31/4418 | |
| A 6 1 K | 31/444 | |
| A 6 1 K | 31/4412 | |
| A 6 1 K | 45/00 | |
| A 6 1 P | 43/00 | 1 1 1 |
| A 6 1 P | 11/00 | |
| A 6 1 P | 17/10 | |
| A 6 1 P | 35/02 | |

| | | |
|---------|-------|-------|
| A 6 1 P | 5/38 | |
| A 6 1 P | 1/16 | |
| A 6 1 P | 29/00 | |
| A 6 1 P | 31/18 | |
| A 6 1 P | 43/00 | 1 7 1 |
| A 6 1 P | 37/08 | |
| A 6 1 P | 11/06 | |
| A 6 1 P | 31/10 | |
| A 6 1 P | 27/02 | |
| A 6 1 P | 17/14 | |
| A 6 1 P | 25/28 | |
| A 6 1 P | 43/00 | 1 0 5 |
| A 6 1 P | 21/00 | |
| A 6 1 P | 1/14 | |
| A 6 1 P | 7/10 | |
| A 6 1 P | 3/00 | |
| A 6 1 P | 1/02 | |
| A 6 1 P | 1/04 | |
| A 6 1 P | 19/02 | |
| A 6 1 P | 9/10 | 1 0 1 |
| A 6 1 P | 17/00 | |
| A 6 1 P | 37/06 | |
| A 6 1 P | 39/02 | |
| A 6 1 P | 19/08 | |
| A 6 1 P | 17/02 | |
| A 6 1 P | 35/00 | |
| A 6 1 P | 9/04 | |
| A 6 1 P | 25/00 | |
| A 6 1 P | 9/14 | |
| A 6 1 P | 25/04 | |
| A 6 1 P | 15/00 | |
| A 6 1 P | 13/12 | |
| A 6 1 P | 31/04 | |
| A 6 1 P | 27/06 | |
| A 6 1 P | 19/06 | |
| A 6 1 P | 7/06 | |
| A 6 1 P | 27/16 | |
| A 6 1 P | 3/06 | |
| A 6 1 P | 3/10 | |
| A 6 1 P | 33/00 | |
| A 6 1 P | 3/04 | |
| A 6 1 P | 17/06 | |
| A 6 1 P | 9/12 | |
| A 6 1 P | 29/00 | 1 0 1 |
| A 6 1 P | 9/10 | |
| A 6 1 P | 33/02 | |
| A 6 1 P | 31/06 | |

【手続補正書】

【提出日】令和2年9月10日(2020.9.10)

【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

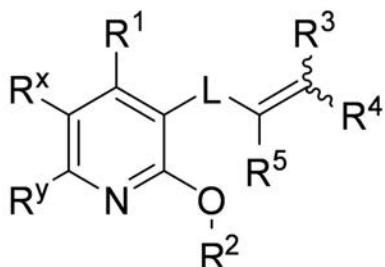
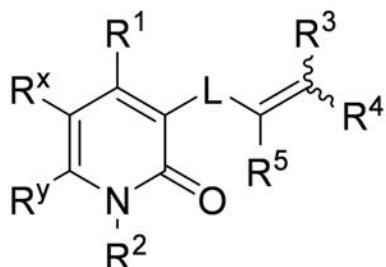
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iまたは式II：

【化1】



[式中：

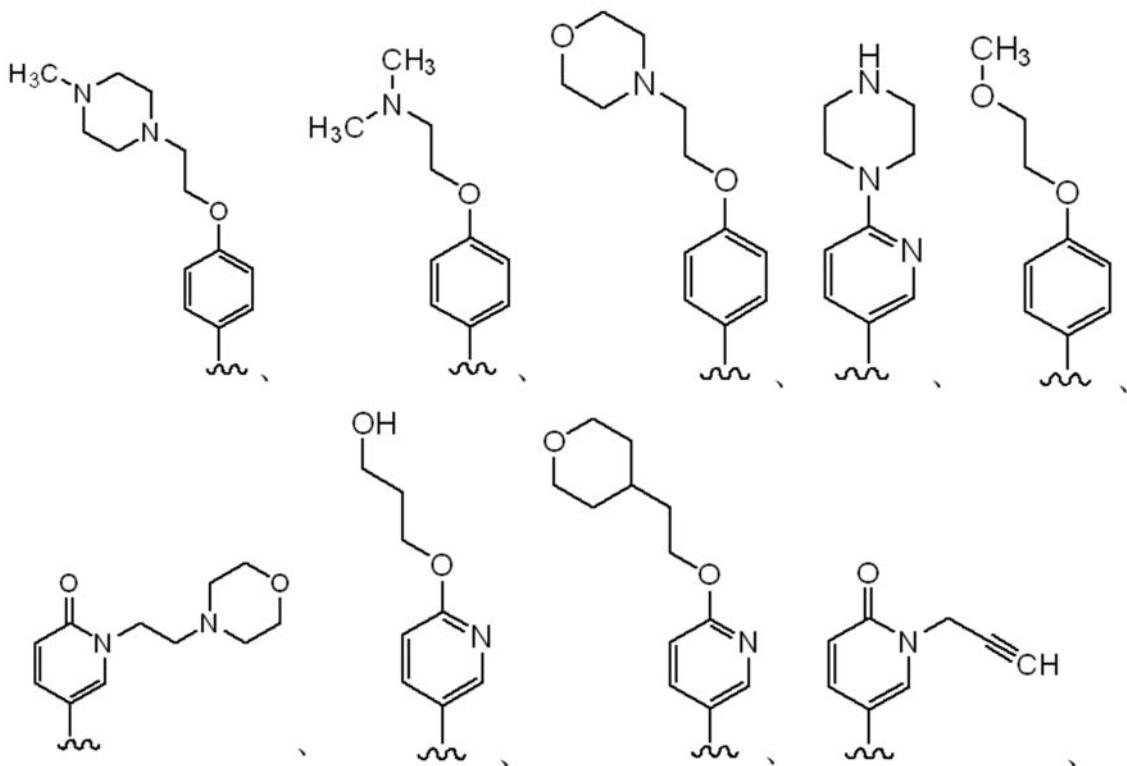
R^1 は、水素であるか、あるいは脂肪族、フェニル、5～6員单環式ヘテロアリール環(窒素、酸素または硫黄から独立して選択される1～3個のヘテロ原子を含有する)または4～7員单環式飽和または部分不飽和のヘテロ環式環窒素(酸素または硫黄から独立して選択される1～2個のヘテロ原子を含有する)から選択される所望により置換されていてもよい基であり；

R^2 は、水素であるか、または所望により置換されていてもよい C_{1-6} 脂肪族であり；

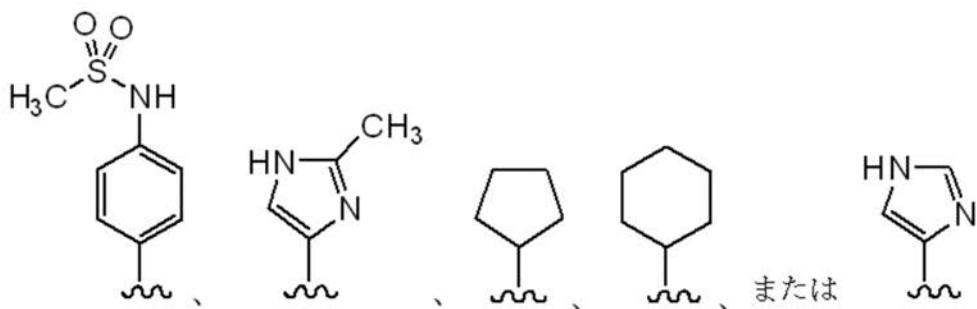
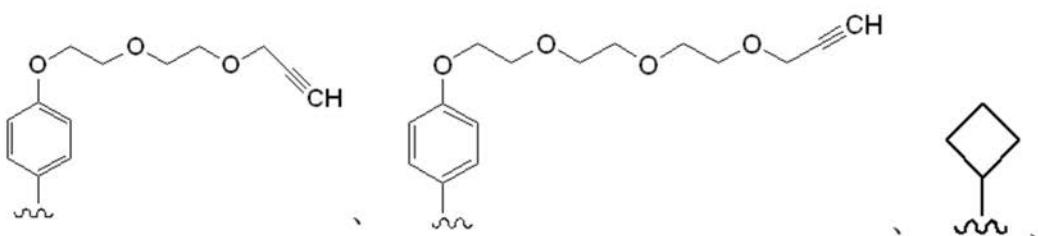
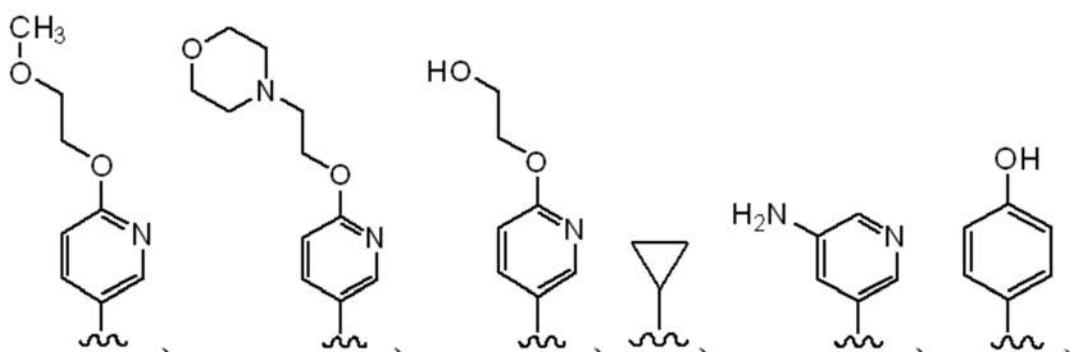
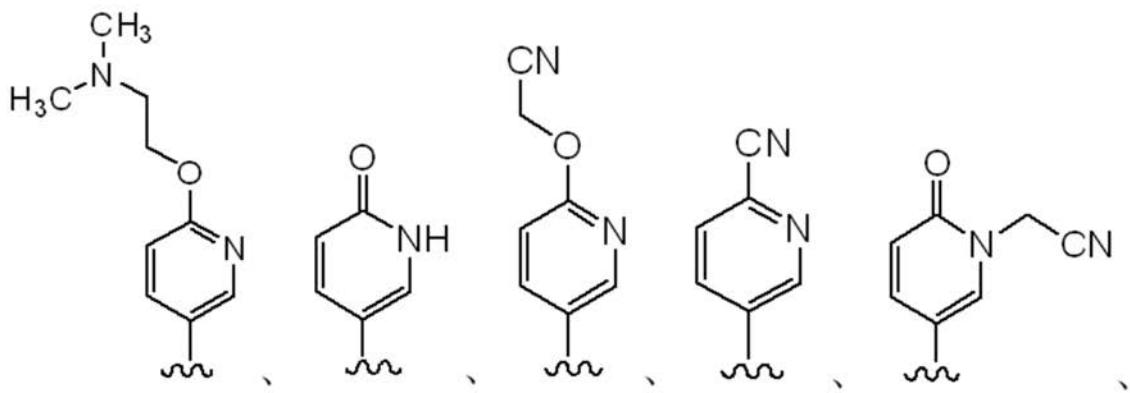
L は、共有結合であるか、または C_{1-6} 二価炭化水素鎖(ここで、 L の1または2つのメチレンユニットは、独立して、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)NH-$ 、 $-NH C(O)-$ または $-S(O)_2-$ により所望により置換されていてもよい)であり；

R^3 は、

【化 2】



【化 3】



から選択され；

R^4 は、 R または $-C(O)OR$ であり；

各 R は、独立して、水素であるか、または 1 ~ 3 個のフッ素原子で所望により置換され
ていてもよい C₁ ~ C₆ 脂肪族であり；

R⁵ は、水素であるか、または C N であるか：

R^5 および R^4 は、それらの間に存在する原子と一緒にになって、トリアゾール環を形成するか；または

R^5 および R^3 は、それらの間に存在する原子と一緒にになって、トリアゾール環を形成してあり；および

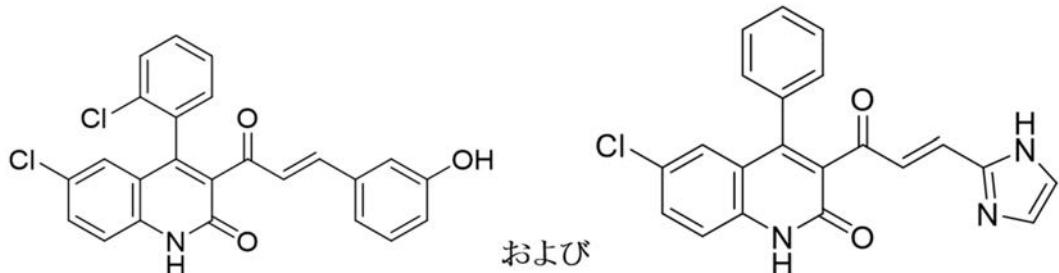
R^x および R^y は、各々独立して、水素、ハロゲン、所望により置換されていてもよい
 C_{1-6} 脂肪族から選択されるか：または

R^x および R^y は、それらの間に存在する原子と一緒にになって、所望により置換されて

いてもよい5～6員の飽和、部分不飽和または芳香族縮合環(窒素、酸素または硫黄から独立して選択される1～2個のヘテロ原子を含有する)を形成している；

但し、式Iの化合物は、

【化4】



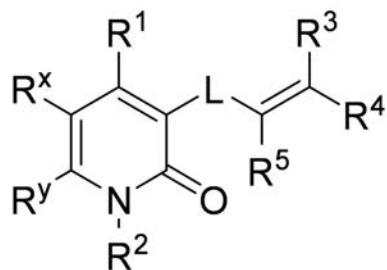
以外である]

の化合物またはその医薬的に許容される塩。

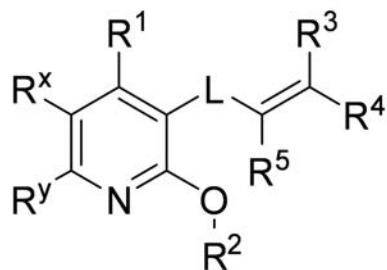
【請求項2】

式I-i、I-ii、II-iまたはII-ii：

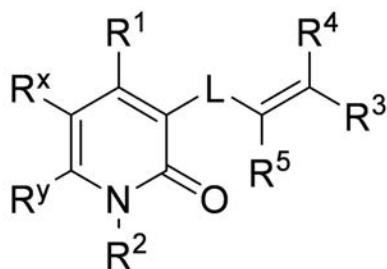
【化5】



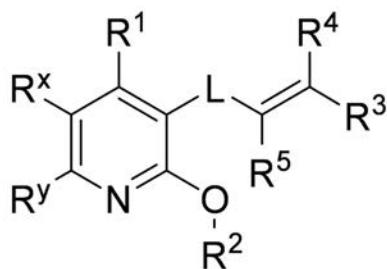
I-i



II-i



I-ii



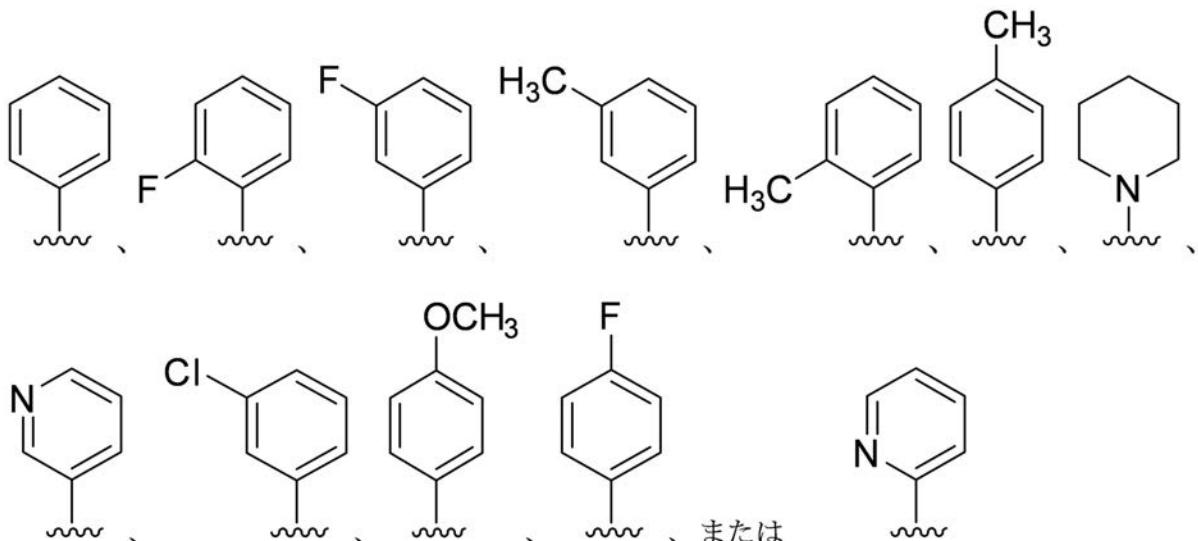
II-ii

の化合物またはその医薬的に許容される塩から選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

R¹が、-S(CH₃)₂、

【化 6】

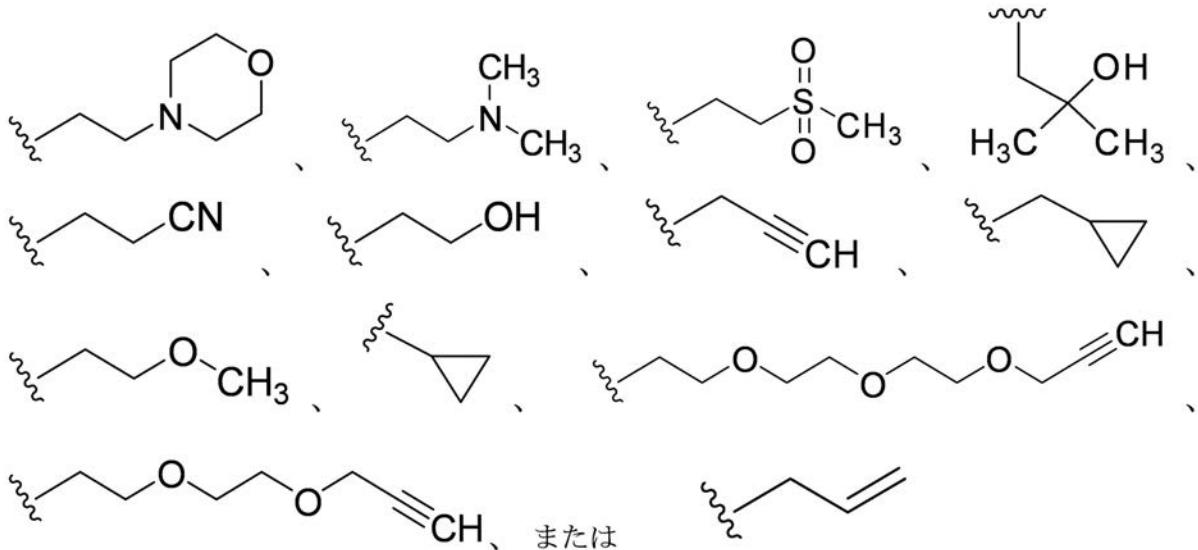


である、請求項1記載の化合物。

【請求項4】

R² が、H、メチル、エチル、
【化7】

18

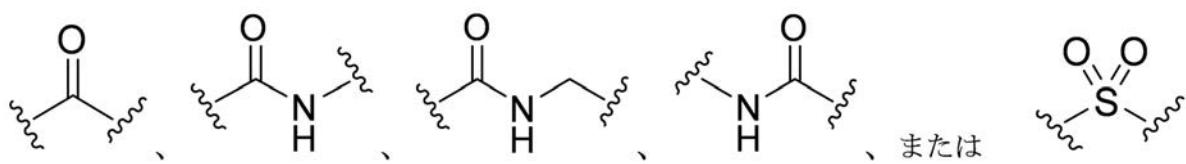


である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項5】

L が、

【化 8】



である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項6】

R^4 が、H、 CH_3 または $-C(O)OR$ である、請求項1～5いずれか一項記載の化合物。

【請求項 7】

R⁵ が、水素または C N であるか：または、

R⁵ および R⁴ が、それらの間に存在する原子と一緒にになって、トリアゾール環を形成しているか；または

R⁵ および R³ は、それらの間に存在する原子と一緒にになって、トリアゾール環を形成している、請求項 1 ~ 5 いずれか一項記載の化合物。

【請求項 8】

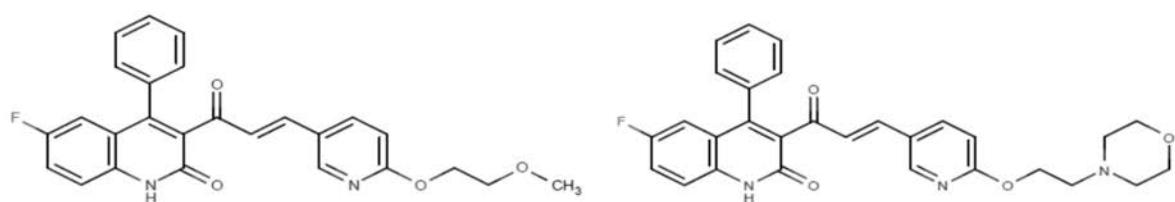
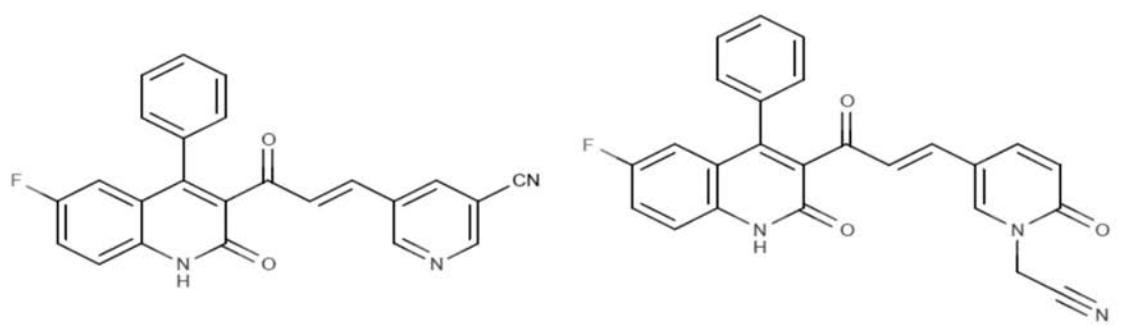
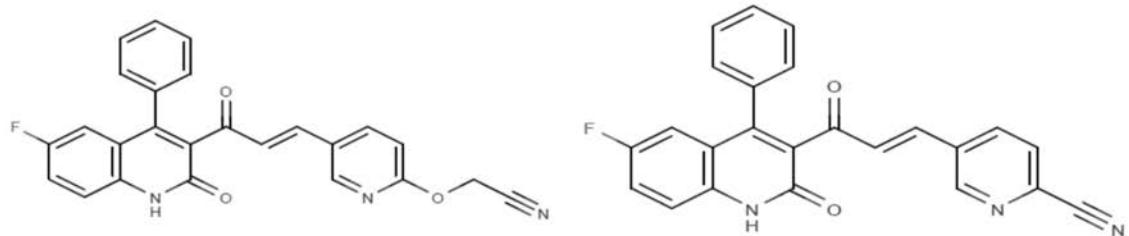
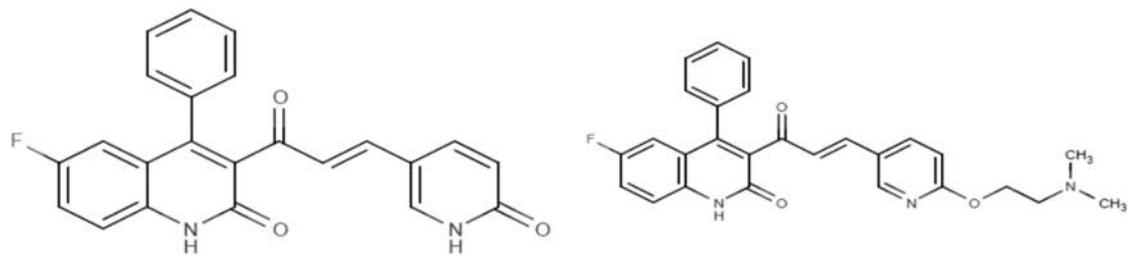
R^x および R^y は、各々独立して、水素、ハロゲンまたは所望により置換されていてもよい C_{1 - 6} 脂肪族である、請求項 1 ~ 7 いずれか一項記載の化合物。

【請求項 9】

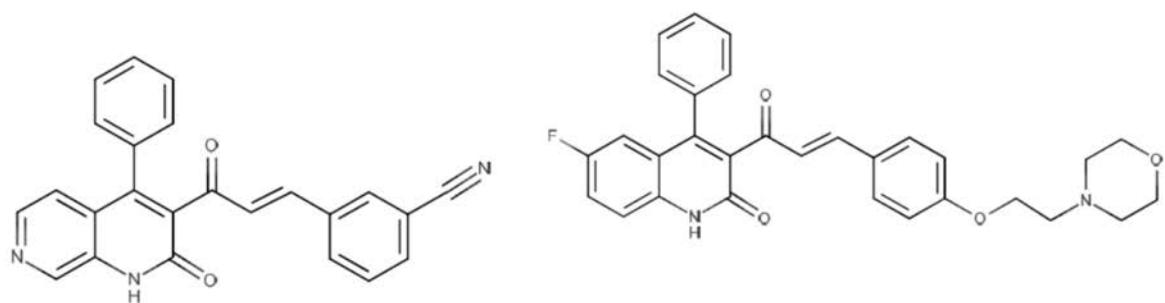
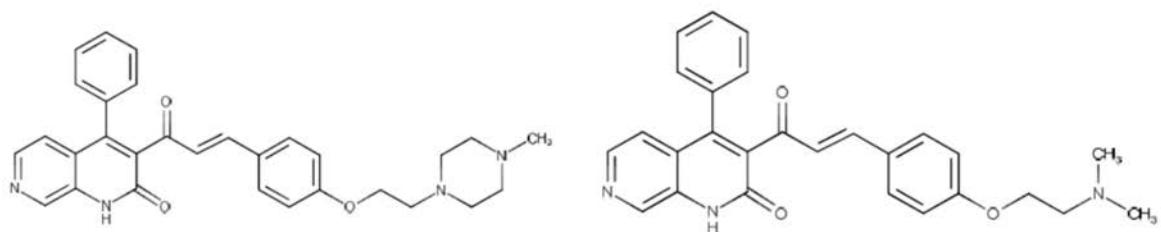
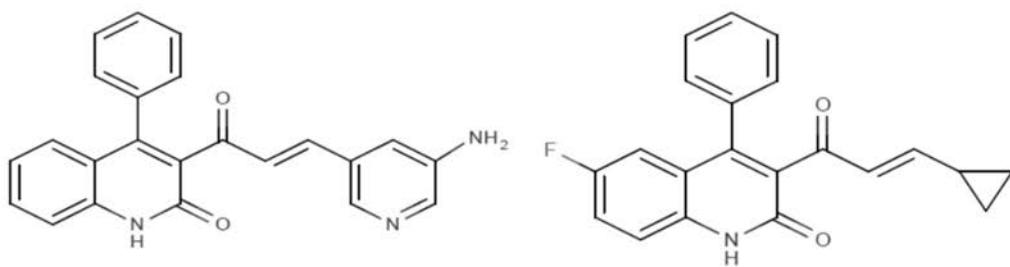
R^x および R^y が、それらの間に存在する原子と一緒にになって、所望により置換されていてもよい 5 ~ 6 員の飽和、部分不飽和または芳香族縮合環(窒素、酸素または硫黄から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を含有する)を形成している、請求項 1 ~ 7 いずれか一項記載の化合物。

【請求項 10】

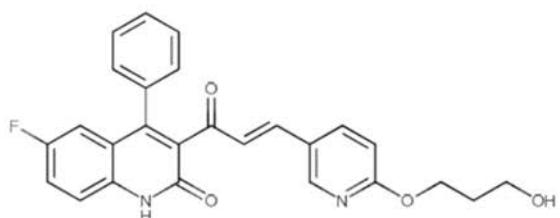
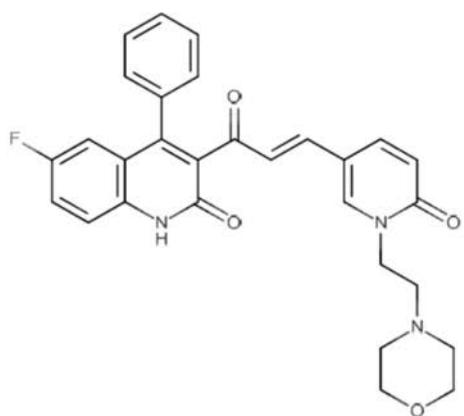
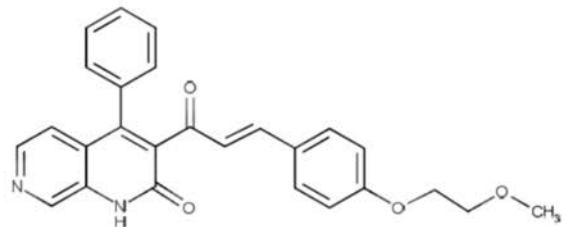
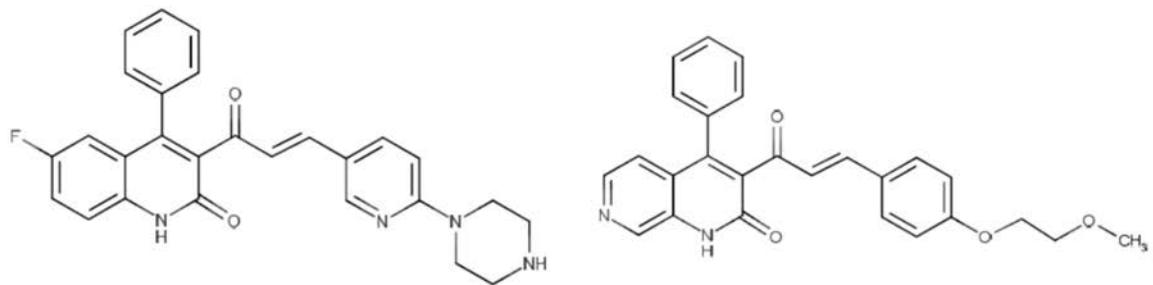
【化9】



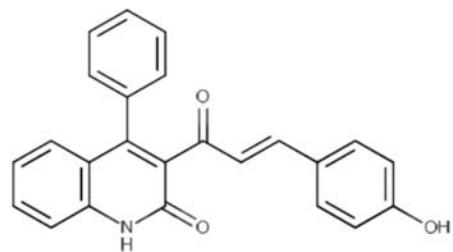
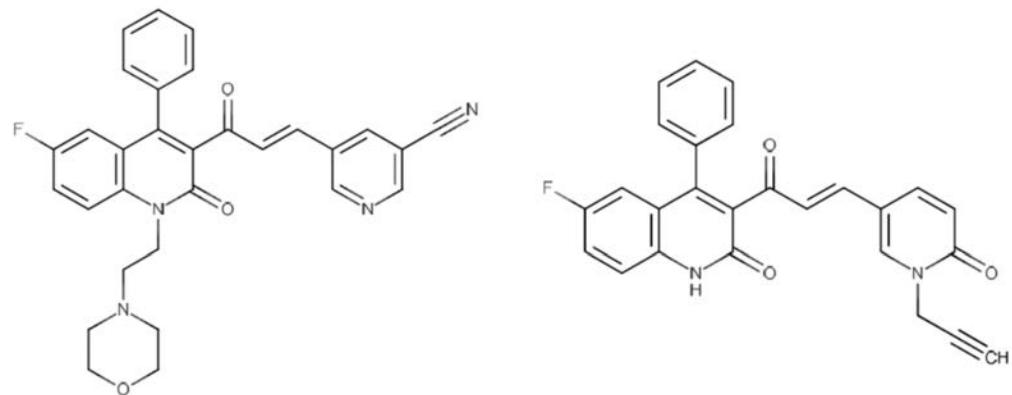
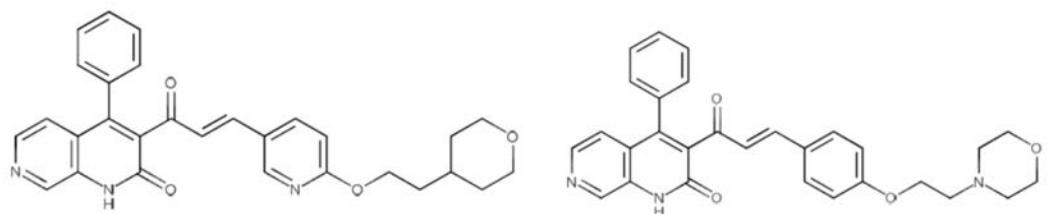
【化 10】



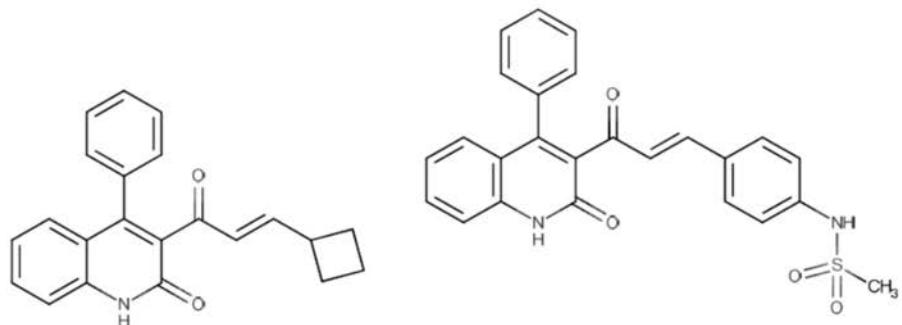
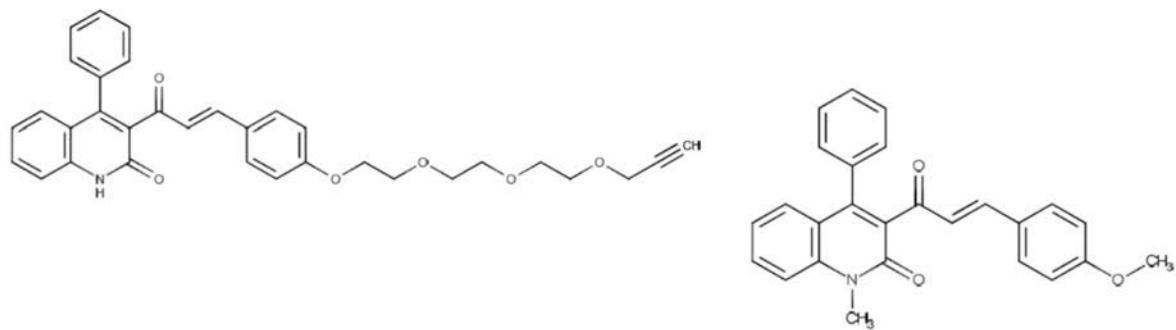
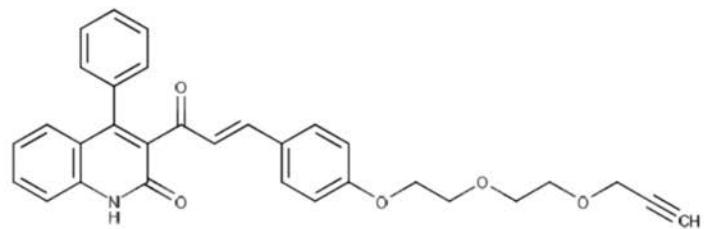
【化 11】



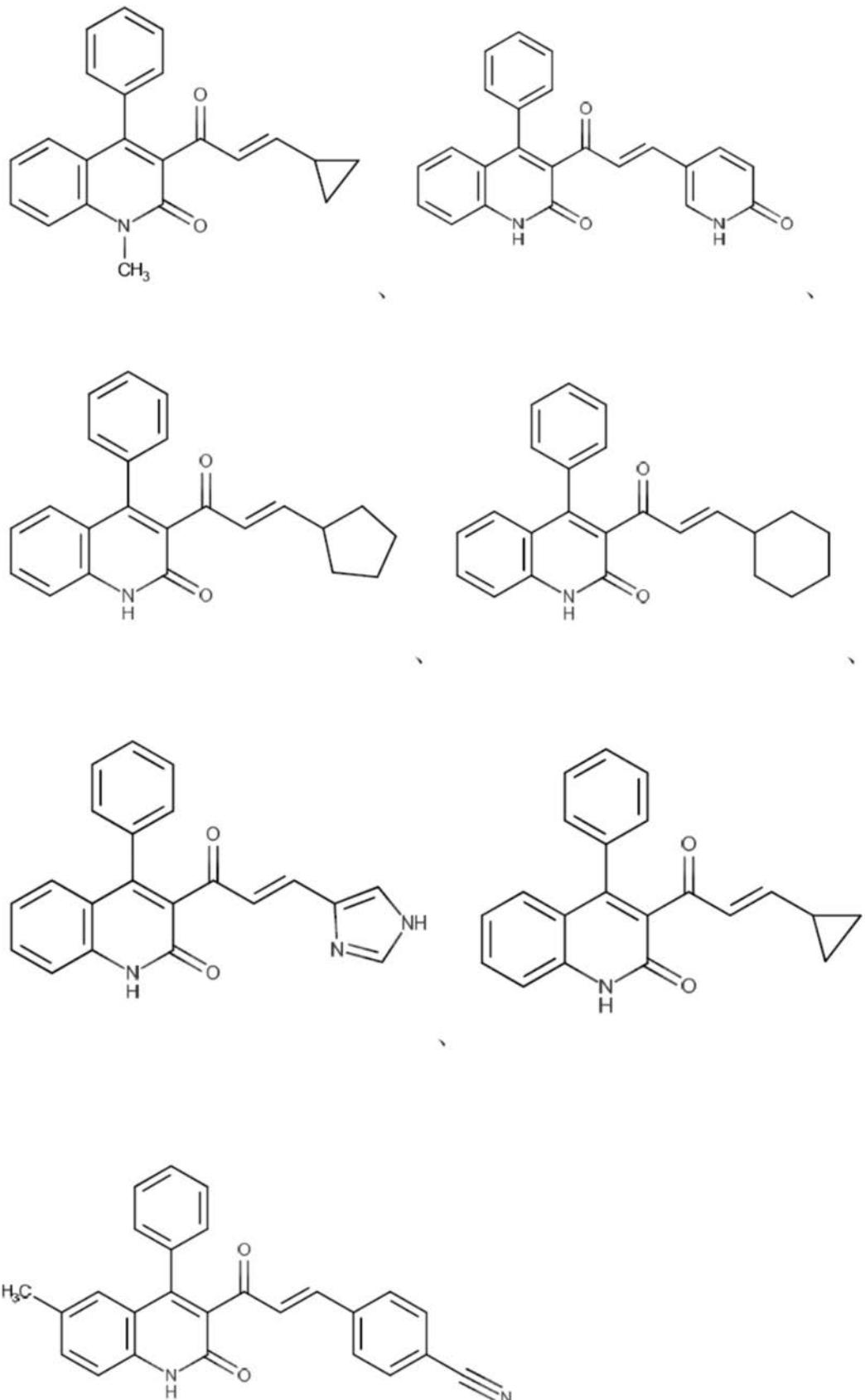
【化 12】



【化 1 3】



【化14】



から選択される化合物またはその医薬的に許容される塩である、請求項1記載の化合物。

【請求項11】

請求項1～10項いずれか一項記載の化合物およびその医薬的に許容される担体、アジュバントまたはビヒクルを含む、医薬的に許容される組成物。

【請求項 1 2】

別の治療薬と組み合わされる、請求項 1 1 記載の組成物。

【請求項 1 3】

P A D 4 介在性疾患、障害または症状の治療のための請求項 1 1 または 1 2 記載の組成物であって、前記 P A D 4 介在性疾患、障害または症状が、酸誘発性肺傷害、ざ瘡(P A P A)、急性リンパ性白血病、急性呼吸窮迫症候群、アジソン病、副腎過形成、副腎皮質機能不全、老化、エイズ、アルコール性肝炎、アルコール性肝炎、アルコール性肝疾患、アレルギー性喘息、アレルギー性気管支肺アスペルギルス症、アレルギー性結膜炎、脱毛症、アルツハイマー病、アミロイドーシス、筋萎縮性側索硬化症および体重減少、狭心症、血管性浮腫、無汗性外胚葉形成不全症(A H E D - I D)、強直性脊椎炎、前眼部炎症、抗リン脂質症候群、アフタ性口内炎、虫垂炎、関節炎、喘息、アテローム性動脈硬化症、アトピー性皮膚炎、自己免疫性疾患、自己免疫性肝炎、蜂刺傷誘発炎症、ベーチェット病、ベーチェット症候群、ベル麻痺、ベリリウム中毒症、プラウ症候群、骨痛、細気管支炎、火傷、滑液包炎、癌、心臓肥大、手根管症候群、異化障害、白内障、脳動脈瘤、化学的刺激物誘発性炎症、脈絡網膜炎、慢性心不全、未熟児の慢性肺疾患、慢性リンパ性白血病、慢性閉塞性肺疾患、大腸炎、複合性局所疼痛症候群、膠原病、角膜潰瘍、クローン病、クリオピリン関連周期熱症候群、クリプトコッカス症、嚢胞性線維症、インターロイキン-1-受容体アンタゴニスト(D I R A)欠損症、皮膚炎、皮膚炎内毒素血症、皮膚筋炎、小児脳幹部グリオーマ、子宮内膜症、内毒素血症、上頸炎、赤芽球減少症、家族性アミロイド多発性神経障害、家族性寒冷蕁麻疹、家族性地中海熱、胎児発育遅延、緑内障、糸球体疾患、糸球体腎炎、痛風、痛風性関節炎、移植片対宿主病、消化器疾患、頭部外傷、頭痛、難聴、心臓病、溶血性貧血、ヘノッホ・シェーライン紫斑病、肝炎、遺伝性周期性発熱症候群、帯状疱疹と単純ヘルペス、H I V - 1、ホジキン病、ハンチントン病、新生児呼吸窮迫症候群、高アンモニア血症、高カルシウム血症、高コレステロール血症、反復性発熱を伴う高免疫グロブリン血症D症候群(H I D S)、再生不良性貧血および他の貧血、再生不良性貧血、特発性血小板減少性紫斑病、色素失調症、伝染性单核球症、炎症性腸疾患、炎症性肺疾患、炎症性神経障害、炎症性疼痛、虫刺さ誘発性炎症、虹彩炎、刺激性誘発性炎症、虚血/再灌流、若年性関節リウマチ、角膜炎、腎臓病、寄生虫感染により起こる腎障害、寄生虫感染により起こる腎障害、腎臓移植拒絶反応の予防、レプトスピラ症、白血病、レフラー症候群、肺外傷、肺外傷、狼瘡、狼瘡、狼瘡性腎炎、リンパ腫、髄膜炎、中皮腫、混合型膠原病、マックルウェルズ症候群(蕁麻疹型難聴アミロイドーシス)、多発性硬化症、筋肉疲労、筋ジストロフィー、重症筋無力症、心筋炎、菌状息肉症、菌状息肉腫、骨髄異形成症候群、筋炎、副鼻腔炎、壞死性全腸炎、新生児期発症多臓器系炎症性疾患(N O M I D)、ネフローゼ症候群、神経炎、神経病理学的疾患、非アレルギー誘導性の喘息、肥満、眼アレルギー、視神経炎、臓器移植、骨関節炎、中耳炎、ページエット病、疼痛、肺炎、パーキンソン病、天疱瘡、心膜炎、周期性発熱、歯周炎、腹膜子宮内膜症、百日咳、咽頭炎やリンパ節炎(P F A P A 症候群)、植物刺激誘発性炎症、肺炎(pneumonia)、肺臓炎(pneumonitis)、ニューモシスチス肺炎、アメリカカツタウルシ/ウルシオール油誘導性炎症、結節性多発動脈炎、多発性軟骨炎、多発性囊胞腎疾患、多発性筋炎、乾癬、乾癬、乾癬、乾癬、心理社会的ストレス疾患、肺疾患、肺高血圧症、肺線維症、壞疽性臍皮症、化膿性無菌性関節炎、腎疾患、網膜疾患、リウマチ性心筋炎、リウマチ性疾患、関節リウマチ、サルコイドーシス、脂漏症、敗血症、激痛、鎌状赤血球症、鎌状赤血球貧血、シリカ誘発性疾患、シェーグレン症候群、皮膚疾患、睡眠時無呼吸、固形腫瘍、脊髄損傷、スティーヴンス・ジョンソン症候群、卒中、クモ膜下出血、日焼け、側頭動脈炎、腱鞘炎、血小板減少症、甲状腺炎、組織移植、TNF受容体関連周期性症候群(T R A P S)、トキソプラズマ症、移植、外傷性脳損傷、結核、I型糖尿病、II型糖尿病、潰瘍性大腸炎、蕁麻疹、ブドウ膜炎および多発血管炎性肉芽腫症からなる群から選択される、前記組成物。

【請求項 1 4】

前記 P A D 4 介在性疾患、障害または症状が、関節リウマチ、血管炎、全身性エリテマ

トーデス、潰瘍性大腸炎、癌、囊胞性線維症、喘息、皮膚エリテマト - デスおよび乾癬から選択される、請求項 1 3 記載の組成物。