

【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 3 年 2 月 12 日 (2021.2.12)

【公表番号】特表 2020-510693 (P2020-510693A)

【公表日】令和 2 年 4 月 9 日 (2020.4.9)

【年通号数】公開・登録公報 2020-014

【出願番号】特願 2019-556790 (P2019-556790)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/501 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/502 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 5/42 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 403/04 C S P

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 471/04 1 0 7 E

C 0 7 D 403/14

C 0 7 D 417/14

A 6 1 K 31/501

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/502

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 5/42

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 9/00

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 12 月 22 日 (2020.12.22)

【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

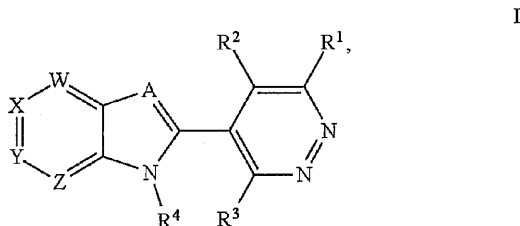
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

【化 1】



(式中、

Aは、N又はCR⁵であり、

Wは、N又はCR⁶であり、

Xは、N又はCR⁶であり、

Yは、N又はCR⁶であり、

Zは、N又はCR⁶であり、

但し、W、X、Y及びZのうち2つ以下はNであることを条件とし、

R¹は、ハロゲン、シアノ、アシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルキル、シクロアルコキシ、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、NR^aR^b、NHSO₂R^c、CH₂NR^aR^b、CH₂NHSO₂R^d、CO₂R^e、COR^f、S(O)R^d、S(O)₂R^d、CH₂OR^f若しくはCR^eR^fOHであり、任意のR¹は、1～3個の独立した置換基R⁷で、任意選択で置換されていてよく、

R²は、水素、ハロゲン、シアノ、アルキル若しくはハロアルキルであり、

又はR¹及びR²は、それらが結合している原子と一緒に、アリール、ヘテロシクロアルキル若しくはシクロアルキル環を形成し、

R³は、水素、ハロゲン、シアノ、アシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルキル、シクロアルコキシ、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、NR^aR^b、NHSO₂R^c、CH₂NR^aR^b、CH₂NHSO₂R^d、CO₂R^e、COR^f、CH₂OR^f又はCR^eR^fOHであり、

R⁴は、アルキル、シクロアルキル、又はハロアルキルであり、

R⁵は、水素、アルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル又はシクロアルキルであり、

R⁶は出現する毎に、独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ハロアルキル、アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、ハロアルキル又はカルボキシルであり、

R⁷は出現する毎に、独立して、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、カルボキシル、アリール、1～3個の独立したハロゲンで置換されているアリール、-(CH₂)_nC(O)NR^gR^h、-S(O)₂Rⁱ、-CO₂Rⁱ又はNR^gR^hであり、

各nが、独立して、1、2、3、4、5、6、7、8、9又は10であり、

R^a、R^b、R^c、R^d、R^e及びR^fは出現する毎に、独立して、水素、アシル、アルコキシアルキル、アルキル、アルケニル、アルキニル、ヘテロアルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、C(O)OC₁₋₆アルキル、C(O)C₁₋₆アルキル、窒素原子に結合している場合は窒素保護基、若しくは酸素原子に結合している場合は酸素保護基であり、又は、R^a及びR^bは、それらが結合している原子と一緒に、ヘテロシクロアルキル環を形成し、又はR^e及びR^fは、それらが結合している原子と一緒に、シクロアルキル環を形成し、

R^g、R^h、Rⁱ及びR^jは出現する毎に、独立して、水素、アシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、ヘテロアルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、C(O)OC₁₋₆アルキル、C(O)C₁₋₆アルキルであり、又は、R^g及びR^hは、それらが結合している原子と一緒に、ヘテロシクロアルキル環を形成する)の化合物、又は医薬として許容されるその塩。

【請求項 2】

R^1 が、ハロゲン、シアノ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルキル、シクロアルコキシ、アリール、 NR^aR^b 、 $NHSO_2R^c$ 、 $CH_2NR^aR^b$ 、 $CH_2NHSO_2R^d$ 、 COR^f 若しくは CR^eR^fOH であり、又は R^1 及び R^2 が、それらが結合している原子と一緒に、アリール環を形成する、請求項1に記載の化合物、又は医薬として許容されるその塩。

【請求項 3】

R^1 が、ハロゲン、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルコキシ、アリール、 NR^aR^b 、 $CH_2NHSO_2R^d$ 若しくは CR^eR^fOH であり、又は R^1 及び R^2 が、それらが結合している原子と一緒に、アリール環を形成する、請求項1に記載の化合物、又は医薬として許容されるその塩。

【請求項 4】

R^1 が、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、 $CH_2NHSO_2R^d$ 又は NR^aR^b であり、 R^a 、 R^b 及び R^d が、独立して、水素、アルキル又はハロアルキルである、請求項1に記載の化合物、又は医薬として許容されるその塩。

【請求項 5】

R^1 がハロアルキルである、請求項1に記載の化合物、又は医薬として許容されるその塩。

【請求項 6】

R^2 が、水素又はアルキルである、請求項1に記載の化合物、又は医薬として許容されるその塩。

【請求項 7】

R^4 が、アルキル又はシクロアルキルである。請求項1に記載の化合物、又は医薬として許容されるその塩。

【請求項 8】

R^4 が、 $C_1 - 4$ アルキル又は $C_3 - 5$ シクロアルキルである、請求項1に記載の化合物、又は医薬として許容されるその塩。

【請求項 9】

各 R^6 が、独立して、水素、ハロゲン、シアノ、アルコキシ、ハロアルキル又はカルボキシルである、請求項1に記載の化合物、又は医薬として許容されるその塩。

【請求項 10】

各 R^6 が、独立して、水素、ハロゲン又はシアノである、請求項1に記載の化合物、又は医薬として許容されるその塩。

【請求項 11】

A が CR^5 であり、 R^5 が、水素、 $C_1 - 4$ アルキル又は $C_3 - 5$ シクロアルキルである、請求項1に記載の化合物、又は医薬として許容されるその塩。

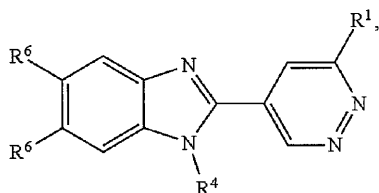
【請求項 12】

A が N である、請求項1に記載の化合物、又は医薬として許容されるその塩。

【請求項 13】

化合物が、式 I-f

【化 2】



I-f

のものである、請求項1に記載の化合物、又は医薬として許容されるその塩。

【請求項 14】

- 5-(1-シクロプロピル-6-フルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-カルボニトリル(2);
- 2-(6-クロロピリダジン-4-イル)-1-シクロプロピル-6-フルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(3);
- 1-シクロプロピル-6-フルオロ-2-(6-ビニルピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(4);
- メチル5-(1-シクロプロピル-6-フルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-カルボキシレート(5);
- 1-シクロプロピル-2-(6-エチルピリダジン-4-イル)-6-フルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(6);
- 1-(5-(1-シクロプロピル-6-フルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)-2,2,2-トリフルオロエタン-1-オール(7);
- N-((5-(1-シクロプロピル-6-フルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)メチル)プロピオンアミド(8);
- エチル((5-(1-シクロプロピル-6-フルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)メチル)カルバメート(9);
- 4-(5-(1-シクロプロピル-6-フルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)モルホリン(10);
- 1-シクロプロピル-6-フルオロ-2-(6-(4-(4-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イル)ピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(11);
- 2-(5-(1-シクロプロピル-6-フルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)プロパン-2-オール(12);
- 5-(1-シクロプロピル-6-フルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)ピリダジン-3-アミン(13);
- 4-(1-シクロプロピル-6-フルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)シンノリン(14);
- 1-シクロプロピル-6-フルオロ-2-(6-メチルピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(15);
- N-(5-(1-シクロプロピル-6-フルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)エタンスルホンアミド(16);
- 2-(6-クロロピリダジン-4-イル)-1-エチル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-カルボニトリル(17);
- 2-(4-(5-(1-シクロプロピル-6-フルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)ピペラジン-1-イル)-N-イソプロピルアセトアミド(18);
- 1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-2-(6-メチルピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(19);
- 2-(4-(5-(1-シクロプロピル-6-フルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)ピペラジン-1-イル)-1-(ピロリジン-1-イル)エタン-1-オン(20);
- 5-(1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-メチルピリダジン-3-アミン(21);
- 2-(6-クロロピリダジン-4-イル)-1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(22);
- 1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-2-(6-メトキシピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(23);
- 1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-2-(6-イソプロポキシピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(24);
- 5-(1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N,N-ジメチルピリダジン-3-アミン(25);
- 1-エチル-6-フルオロ-2-(6-メチルピリダジン-4-イル)-1H-インドール(26);
- 1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-2-(6-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリダジン-4-イ

ル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(27);
5-(1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(2-メトキシエチル)ピリダジン-3-アミン(28);
1-シクロプロピル-2-(6-メトキシピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-カルボニトリル(29);
1-シクロプロピル-6-フルオロ-2-(6-メチルピリダジン-4-イル)-1H-インドール(30);
N-((5-(1-シクロプロピル-6-フルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)メチル)エタンスルホンアミド(31);
5-(1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)ピリダジン-3-アミン(32);
1-シクロプロピル-2-(6-エチルピリダジン-4-イル)-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(33);
2-(6-クロロピリダジン-4-イル)-1-シクロプロピル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-カルボニトリル(34);
1-シクロプロピル-2-(6-メチルピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-カルボニトリル(35);
1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-2-(6-(4-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(36);
1-(4-(5-(1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)ピペラジン-1-イル)エタン-1-オン(37);
1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-2-(6-(4-(メチルスルホニル)ピペラジン-1-イル)ピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(38);
1-tert-ブチル-4-(5-(1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)ピペラジン-1-カルボキシレート(39);
1-エチル-2-(6-メトキシピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-カルボニトリル(40);
1-エチル-2-(6-エチルピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-カルボニトリル(41);
1-シクロプロピル-2-(6-(ジフルオロメチル)ピリダジン-4-イル)-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(42);
2-(6-シクロブトキシピリダジン-4-イル)-1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(43);
1-シクロプロピル-2-(6-(4,4-ジフルオロピペリジン-1-イル)ピリダジン-4-イル)-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(44);
5-クロロ-3-シクロプロピル-2-(6-メチルピリダジン-4-イル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(45);
1-シクロプロピル-2-(6-(3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル)ピリダジン-4-イル)-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(46);
1-(5-(1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)-2,2,2-トリフルオロエタン-1-オール(47);
1-(5-(1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)-N,N-ジメチルピロリジン-3-アミン(48);
1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-2-(6-(4-フルオロフェニル)ピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(49);
1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-2-(6-((4-フルオロフェニル)エチニル)ピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(50);
1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-2-(6-イソプロピルピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(51);
N-((5-(1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)メチル)エタンスルホンアミド(52);

- 1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-2-(6-((1,1,1-トリフルオロプロパン-2-イル)オキシ)ピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(53);
- 3-シクロプロピル-2-(6-メチルピリダジン-4-イル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-5-カルボニトリル(54);
- 1-シクロプロピル-2-(6-(2,2-ジフルオロプロボキシ)ピリダジン-4-イル)-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(57);
- 1-シクロプロピル-2-(6-シクロプロピルピリダジン-4-イル)-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(59);
- 2-(6-クロロピリダジン-4-イル)-3-シクロプロピル-5-メトキシ-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(60);
- 1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-2-(6-(4-フルオロ-2-メチルフェニル)ピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(61);
- 1-シクロプロピル-2-(6-(2,4-ジフルオロフェニル)ピリダジン-4-イル)-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(62);
- 1-シクロプロピル-2-(6-(3,4-ジフルオロフェニル)ピリダジン-4-イル)-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(63);
- 1-(5-(1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)エタン-1-オン(64);
- 2-(6-クロロピリダジン-4-イル)-1-エチル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(65);
- 1-シクロプロピル-2-(6-(ジフルオロメチル)ピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-カルボニトリル(66);
- 2-(6-(ジフルオロメチル)ピリダジン-4-イル)-1-エチル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(67);
- 2-(6-クロロピリダジン-4-イル)-1-エチル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-カルボニトリル(68);
- 2-(6-(ジフルオロメチル)ピリダジン-4-イル)-1-エチル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-カルボニトリル(69);
- 1-シクロプロピル-2-(6-(1,1-ジフルオロエチル)ピリダジン-4-イル)-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(70);
- 1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-2-(6-(2,2,2-トリフルオロエチル)ピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(71);
- 2-(6-シクロプロピルピリダジン-4-イル)-1-エチル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(72);
- 5-クロロ-3-シクロプロピル-2-(6-(ジフルオロメチル)ピリダジン-4-イル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(73);
- 1-シクロプロピル-2-(6-シクロプロピルピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-カルボニトリル(75);
- 3-シクロプロピル-2-(6-(ジフルオロメチル)ピリダジン-4-イル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-5-カルボニトリル(76);
- N-((5-(1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)メチル)メタンスルホンアミド(77);
- N-((5-(1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)メチル)-N-メチルメタンスルホンアミド(78);
- N-((5-(1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)メチル)プロパン-2-スルホンアミド(79);
- 1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-2-(6-(メチルスルホニル)ピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(80);
- 1-シクロプロピル-2-(6-(エチルスルホニル)ピリダジン-4-イル)-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(81);

1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-2-(6-(メチルスルフィニル)ピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(82);
1-シクロプロピル-2-(6-(エチルスルフィニル)ピリダジン-4-イル)-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(83);
5-クロロ-3-シクロプロピル-2-(6-シクロプロピルピリダジン-4-イル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(84);
1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-2-(6-(トリフルオロメチル)ピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(85);
1-シクロプロピル-2-(6-(トリフルオロメチル)ピリダジン-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-カルボニトリル(86);
3-シクロプロピル-2-(6-シクロプロピルピリダジン-4-イル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-5-カルボニトリル(87);
2-((5-(1-シクロプロピル-5,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピリダジン-3-イル)メチル)イソチアゾリジン1,1-ジオキシド(88);
3-シクロプロピル-2-(6-(トリフルオロメチル)ピリダジン-4-イル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-5-カルボニトリル(89);
1-シクロプロピル-2-(6-メチルピリダジン-4-イル)-6-(トリフルオロメチル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール(90)

からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物、及び医薬として許容されるそれらの塩。

【請求項15】

請求項1に記載の化合物又はその医薬として許容される塩、及び医薬として許容される担体を含む、医薬組成物。