

【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4月17日(2023.4.17)

【国際公開番号】WO2020/210308

【公表番号】特表2022-527395(P2022-527395A)

【公表日】令和4年6月1日(2022.6.1)

【年通号数】公開公報(特許)2022-097

【出願番号】特願2021-559883(P2021-559883)

【国際特許分類】

10

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

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

C 0 7 D 4 0 9 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

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

A 6 1 K 3 1 / 4 2 8 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 7 0 9 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 1 9 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 9 (2 0 0 6 . 0 1)

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

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

20

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

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

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

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

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

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

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

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

【 F I 】

C 0 7 D 4 0 5 / 0 4

30

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

C 0 7 D 4 0 9 / 1 4

C 0 7 D 4 0 5 / 1 4

A 6 1 K 3 1 / 4 2 8

A 6 1 K 3 1 / 4 7 0 9

A 6 1 K 3 1 / 4 1 9 2

A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 9

A 6 1 P 1 / 0 4

A 6 1 P 1 / 1 6

A 6 1 P 9 / 0 0

40

A 6 1 P 1 1 / 0 0

A 6 1 P 1 3 / 1 2

A 6 1 P 1 7 / 0 0

A 6 1 P 2 7 / 0 2

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 P 2 9 / 0 0

A 6 1 P 1 9 / 0 2

【手続補正書】

【提出日】令和5年4月7日(2023.4.7)

50

【 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

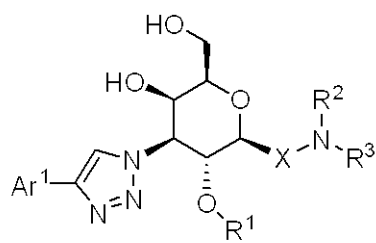
【 補正の内容 】

【 特許請求の範囲 】

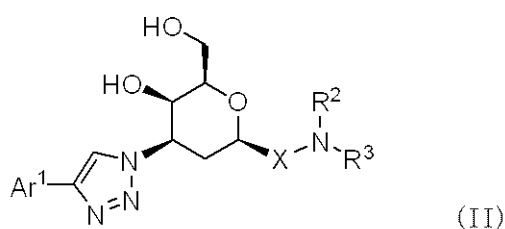
【 請求項 1 】

式(I)または(II):

【 化 1 】



10



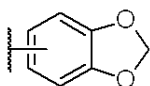
20

[式中、

Xは、独立して、-C(O)-、-CH₂-、および-CH₂C(O)-から選択され;Ar¹は、独立して、フェニルまたはナフチルであり;ここで各環は、シアノ、ハロゲン、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄ハロアルキル、およびC₁₋₄ハロアルコキシから選択される1~5個の置換基で置換され;R¹は、独立して、C₁₋₄アルキル、およびC₁₋₄ハロアルキルから選択され;R²は、独立して、HまたはC₁₋₄アルキルであり;R³は、独立して、Ar²、-(CH₂)₁₋₂Ar²、および-CH₂CH₂NR⁴Ar²から選択され;Ar²は、独立して、フェニル、

30

【 化 2 】



、および5~10個の環原子を含み、ここで1~4個の環原子はそれぞれ独立してN、N(R⁵)、O、およびSから選択されるヘテロアリールから選択され;各環は、OH、シアノ、ハロゲン、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄ハロアルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄ハロアルコキシ、N(C₁₋₄アルキル)₂、-SO₂(C₁₋₄アルキル)、-OPh、-OBn、C₃₋₆シクロアルキル;およびシアノ、ハロゲン、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄ハロアルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄ハロアルコキシ、-NH₂、-NH(C₁₋₄アルキル)、および-N(C₁₋₄アルキル)₂から選択される0~1個の置換基で置換されたフェニルから選択される0~4個の置換基で置換され;

40

R⁴は、独立して、HまたはC₁₋₄アルキルであり;およびR⁵は、独立して、HまたはC₁₋₄アルキルである]

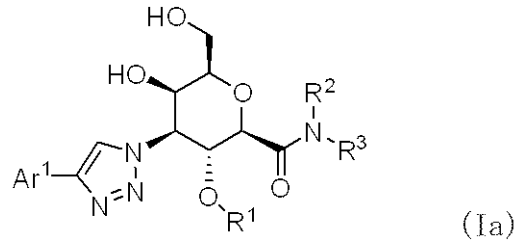
の化合物またはその医薬的に許容される塩。

【 請求項 2 】

化合物が式(1a):

50

【化3】



10

である、請求項1の化合物またはその医薬的に許容される塩。

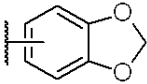
【請求項3】

Ar¹が、独立して、フェニルまたはナフチルであり；ここで各環は、シアノ、ハロゲン、C₁₋₄アルキル、およびC₁₋₄アルコキシから選択される1～3個の置換基で置換され；

R¹が、独立して、C₁₋₄アルキルであり；および

Ar²が、独立して、フェニル、

【化4】



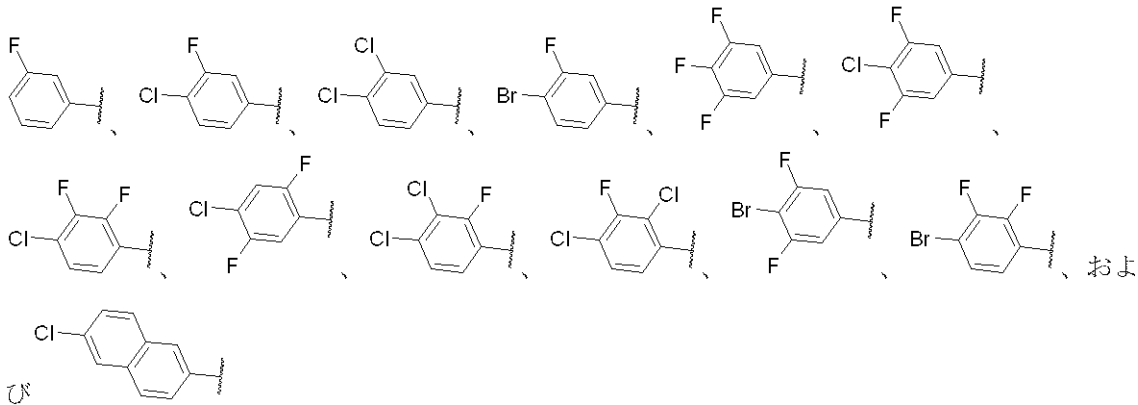
20

、ピリジニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリル、N-(C₁₋₄アルキル)-インダゾリル、およびキノリニルから選択され；各環は、OH、シアノ、ハロゲン、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄ハロアルキル、C₁₋₄ハロアルコキシ、N(C₁₋₄アルキル)₂、-SO₂(C₁₋₄アルキル)、-OPh、および-OBnから選択される0～4個の置換基で置換される、請求項1または請求項2の化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項4】

Ar¹が、独立して、

【化5】



30

40

から選択される、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

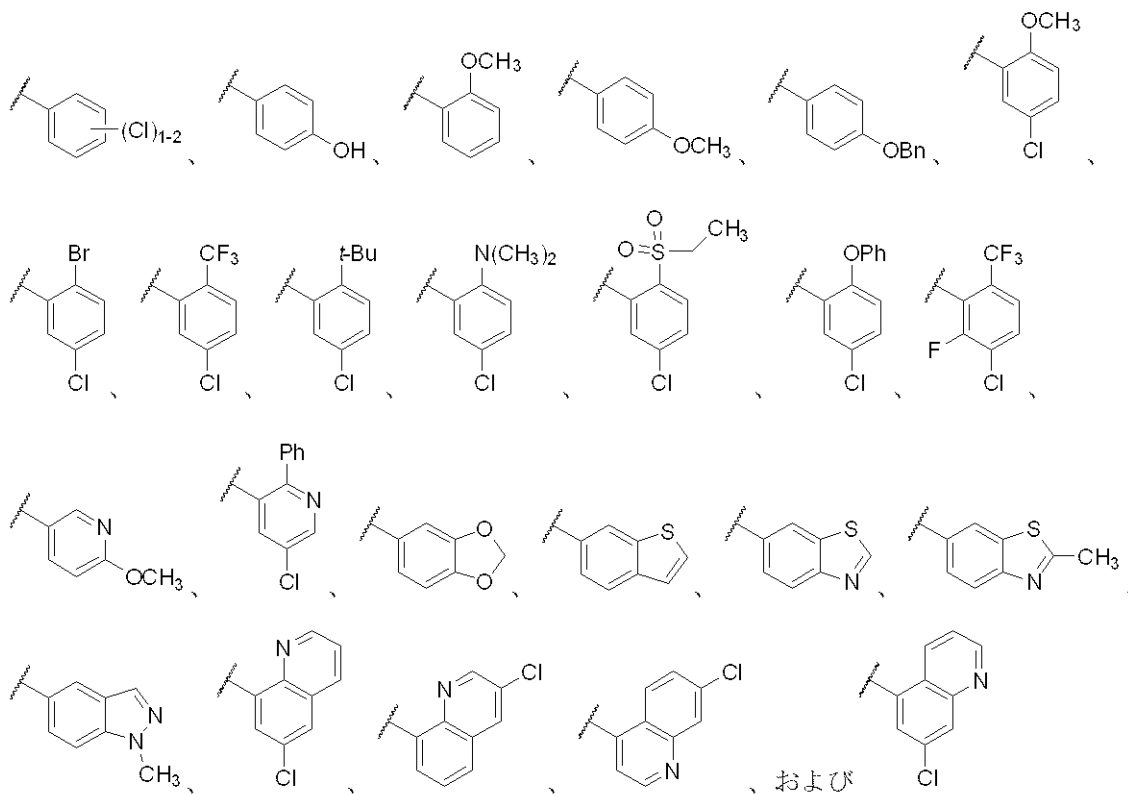
【請求項5】

R³が、独立して、Ar²、-(CH₂)₁₋₂Ar²、および-CH₂CH₂NR⁴Ar²から選択され；

Ar²が、独立して、

50

【化 6】



10

20

から選択される、請求項1～4のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 6】

R¹が、独立して、CH₃であり；

R²が、独立して、H、CH₃、-CH₂CH₃、および-CH(CH₃)₂から選択され；および

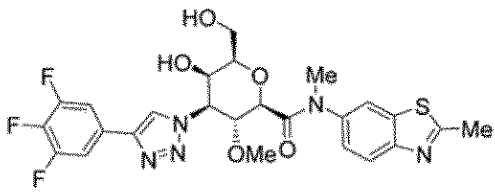
R⁴が、独立して、HまたはCH₃である、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

30

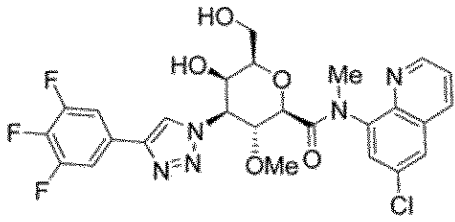
【請求項 7】

40

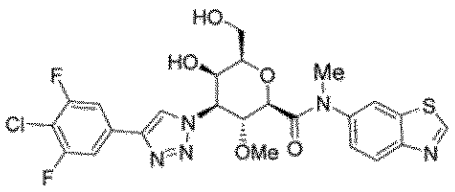
50



(实施例 1)、



(实施例 3)、



(实施例 4)、

10

20

30

40

50

EX #	
9	
10	
11	
12	
13	
14	

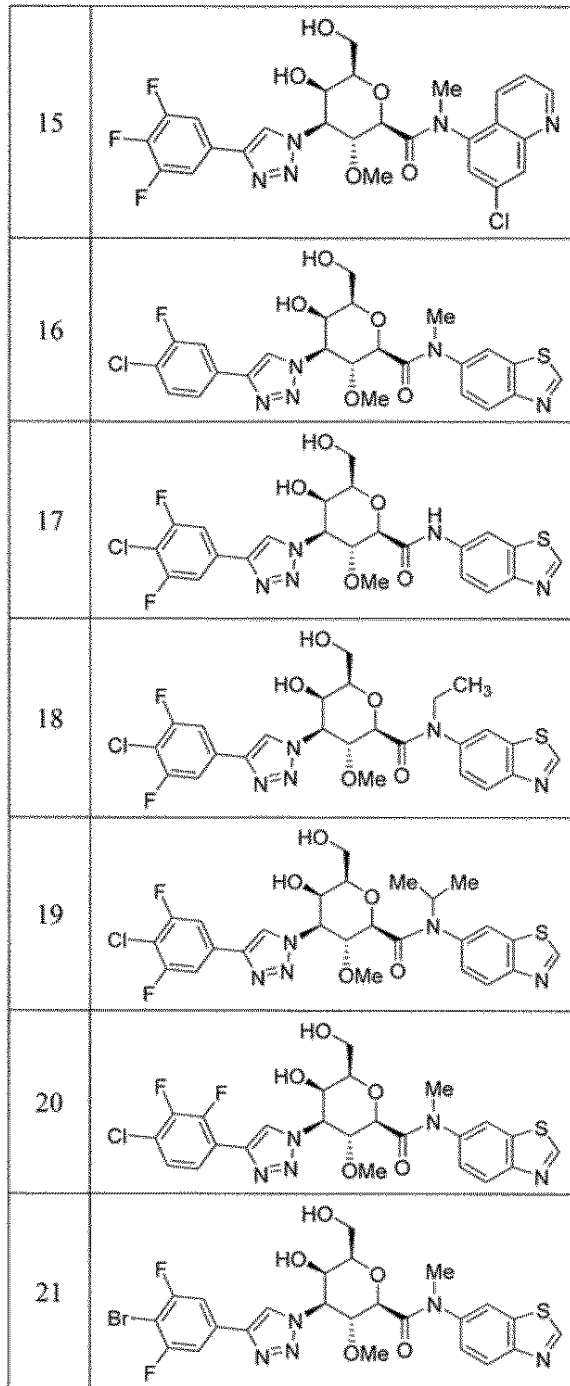
10

20

30

40

50



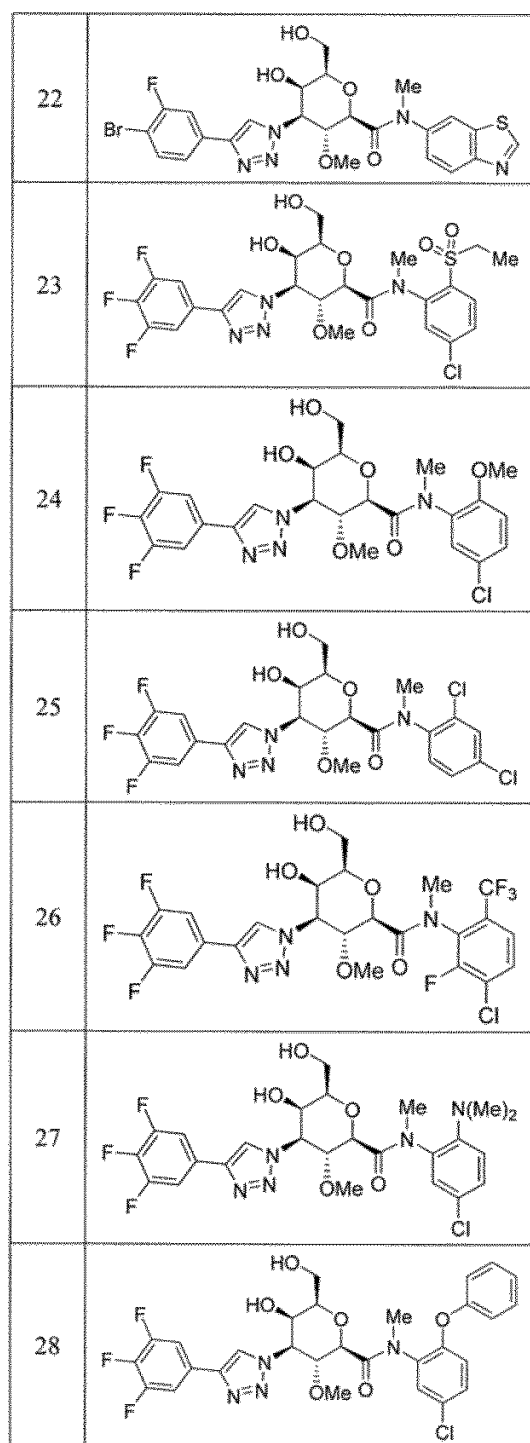
10

20

30

40

50



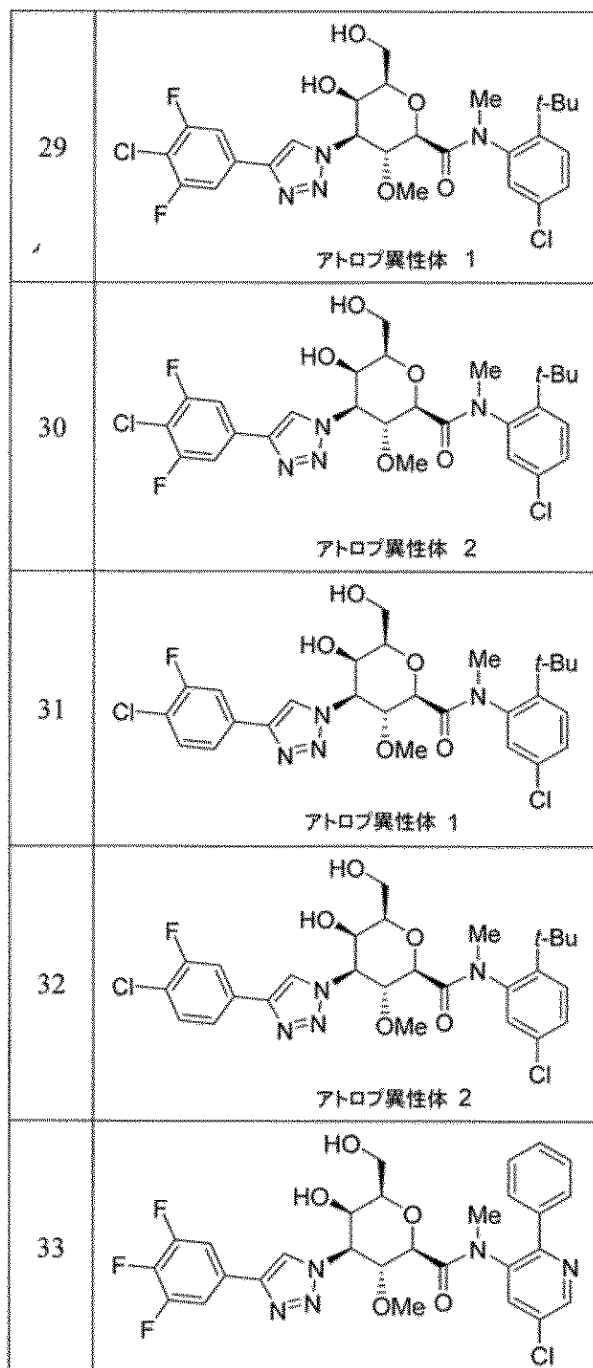
10

20

30

40

50



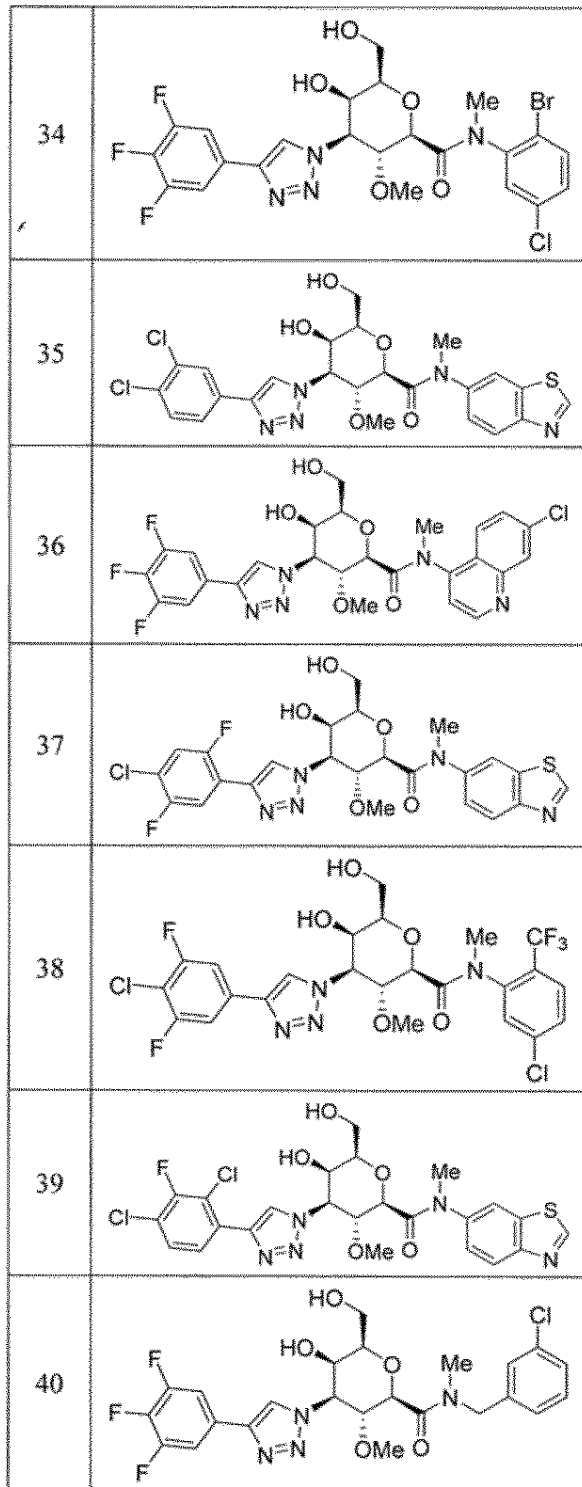
10

20

30

40

50



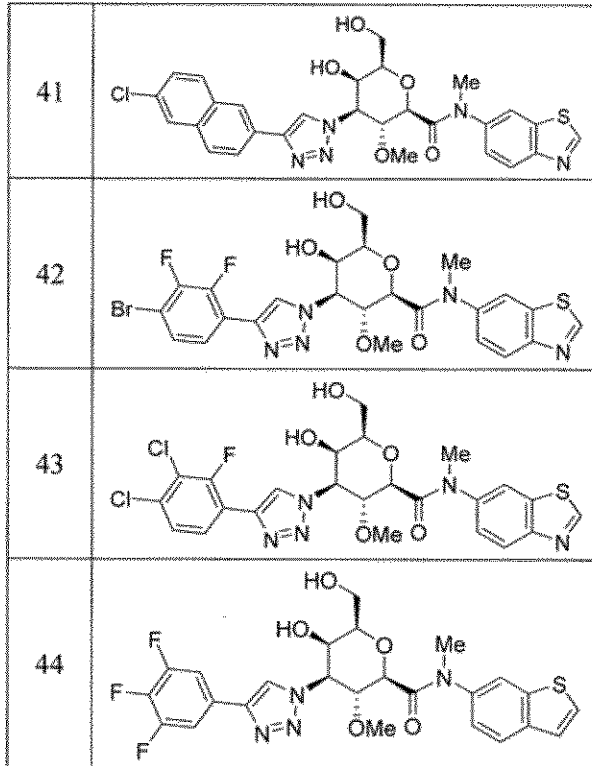
10

20

30

40

50



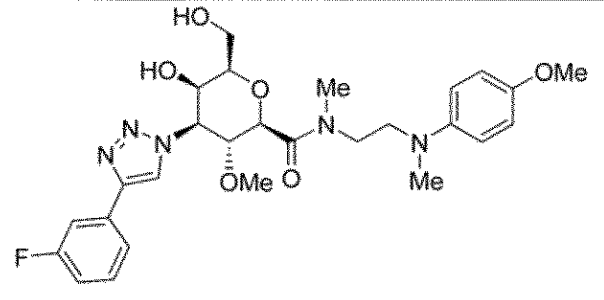
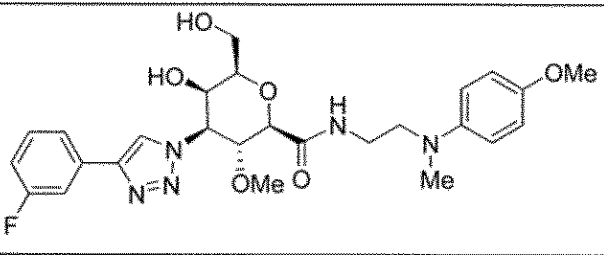
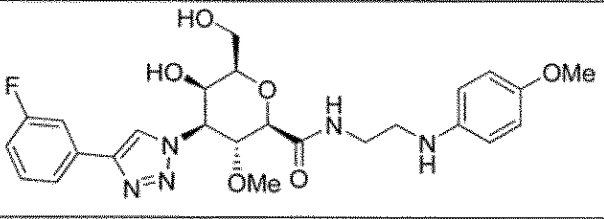
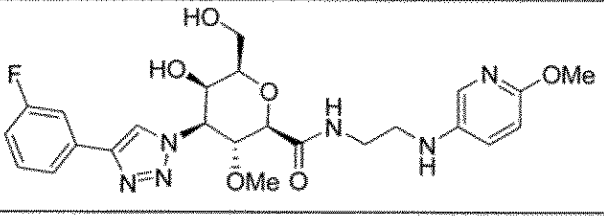
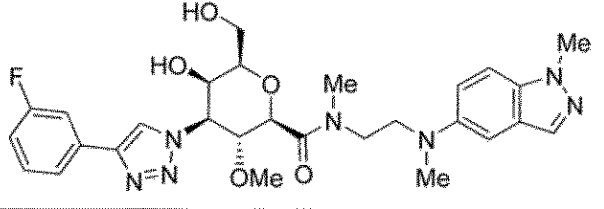
10

20

30

40

50

EX #	
B14	
B15	
B16	
B17	
B18	

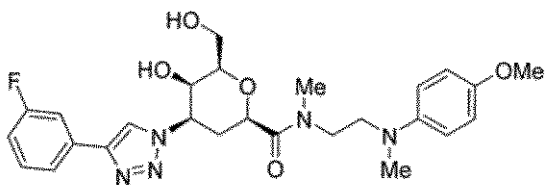
10

20

30

および

40



(実施例 B19)

から選択される、請求項1の化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項8】

治療上有効量の、請求項1～7のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬的に許容

50

される塩、および1つ以上の医薬的に許容される担体を含む、組成物。

【請求項9】

医薬として用いるための、請求項1～7のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩、または請求項8の組成物。

【請求項10】

臓器(肝臓、腎臓、肺、心臓および皮膚など)の線維症、肝臓疾患および病態(急性肝炎、慢性肝炎、肝線維症、肝硬変、門脈圧亢進症、肝再生不全、非アルコール性脂肪肝炎(NASH)、肝機能低下、および肝血流障害など)、細胞増殖性疾患およびがん疾患(固形腫瘍、固形腫瘍転移、血管線維腫、骨髄腫、多発性骨髄腫、カポジ肉腫、白血病、慢性リンパ性白血病(CLL)およびがん細胞の湿潤転移など)、炎症性疾患および病態(乾癬、腎症、および肺炎など)、消化管疾患および病態(過敏性腸症候群(IBS)、炎症性腸疾患(IBD)、および異常膵液分泌など)、腎臓疾患および病態、尿路関連疾患および病態(良性前立腺肥大症、または神経因性膀胱関連疾患、脊髄腫瘍、椎間板ヘルニア、脊柱管狭窄、および糖尿病関連症状など)、下部尿路疾患および病態(下部尿路閉塞など)、下部尿路炎症性疾患および病態(排尿障害および頻尿など)、膵臓疾患および病態、異常血管形成関連疾患および病態(動脈閉塞など)、強皮症、脳関連疾患および病態(脳梗塞および脳出血など)、神経障害性疼痛および末梢神経障害、眼疾患および病態(加齢黄斑変性症(AMD)、糖尿病性網膜症、増殖性硝子体網膜症(PVR)、瘢痕性類天疱瘡、および緑内障濾過手術後瘢痕など)を治療するための、請求項1～7のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩を含む、医薬組成物。

10

20

【請求項11】

疾患または病状が、腎線維症、肺線維症、肝線維症、動脈性線維症、または全身性硬化症である、請求項10の医薬組成物。

30

40

50