

【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4年6月21日(2022.6.21)

【国際公開番号】WO2020/006557

【公表番号】特表2021-529752(P2021-529752A)

【公表日】令和3年11月4日(2021.11.4)

【出願番号】特願2020-572891(P2020-572891)

【国際特許分類】

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

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

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

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

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

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

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

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

10

【 F I 】

C 0 7 C 5 7 / 6 0 C S P

A 6 1 K 3 1 / 1 9 4

A 6 1 K 3 1 / 2 0 5

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 P 3 1 / 0 0

A 6 1 P 3 7 / 0 6

A 6 1 P 2 9 / 0 0

C 0 7 C 2 2 9 / 4 4

20

【手続補正書】

【提出日】令和4年6月13日(2022.6.13)

【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

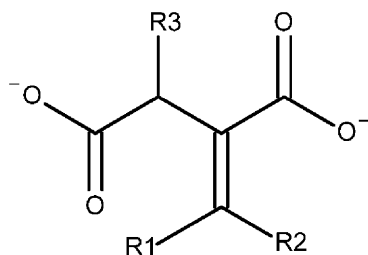
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(2)：

【化1】



40

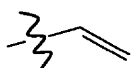
(式中、

R1、R2及びR3は、水素、重水素、C1～C6アルキル、C2～C6アルケニル、C2～C6アルキニル、C3～C14シクロアルキル、C1～C6アルキルベンゼン、アリール、ヘテロアリール、アリール(C1～C6アルキル)、-CN、アミノ、(C1～C

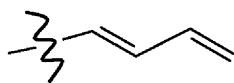
50

6) アルキルアミノ、ジアルキル(C₁~C₆)アミノ、ハロアルキル(C₁~C₆)、(C₁~C₆)アルコキシ、(C₁~C₆)ハロアルコキシ、ヘテロアリール(C₁~C₆アルキル)、(C₄~C₁₅)複素環、(C₄~C₁₅)複素環(C₁~C₆アルキル)、C₃~C₇シクロアルコキシ、C₆~C₁₀-アリールオキシ、並びに(a-1)、(a-2)及び(a-3)の部分からなる群から独立して選択され、前記アルキル、アルキルベンゼン、アリール、シクロアルキル、複素環、ヘテロアリール、アルコキシ、シクロアルコキシ、ハロアルキル又はハロアルコキシは、-C₁~C₆アルキル、ハロ、CN、CF₃、-COOH、-OH、-(C₁~C₆)アルコキシ、-NH₂、-(C₁~C₆アルキル)NH₂、-(C₁~C₆アルキル)NH(C₁~C₆アルキル)、-(C₁~C₆アルキル)N(C₁~C₆アルキル)₂、-NH(C₁~C₆アルキル)、-N(C₁~C₆アルキル)₂、-CONH₂、-NH(CO)(C₁~C₆アルキル)、-N(C₁~C₆アルキル)CO(C₁~C₆アルキル)、-SO₂-(C₁~C₆アルキル)、-(SO)NH₂、(SO)NH(C₁~C₆アルキル)及び(SO)N(C₁~C₆アルキル)₂からなる群から選択される1以上の置換基で更に任意に置換され、
【化2】

10

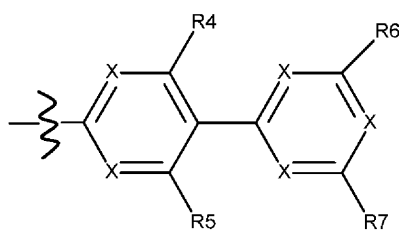


(a-1)



(a-2)

20



(a-3)

30

Xは、N又はCR₈のいずれかであり、

R₄、R₅、R₆、R₇及びR₈は、水素、重水素、C₁~C₆アルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₃~C₁₄シクロアルキル、C₁~C₆アルキルベンゼン、アリール、ヘテロアリール、アリール(C₁~C₆アルキル)、-CN、アミノ、(C₁~C₆)アルキルアミノ、ジアルキル(C₁~C₆)アミノ、ハロアルキル(C₁~C₆)、(C₁~C₆)アルコキシ、(C₁~C₆)ハロアルコキシ、ヘテロアリール(C₁~C₆アルキル)、(C₄~C₁₅)複素環、(C₄~C₁₅)複素環(C₁~C₆アルキル)、C₃~C₇シクロアルコキシ、C₆~C₁₀-アリールオキシからなる群から独立して選択され、前記アルキル、アルキルベンゼン、アリール、シクロアルキル、複素環、ヘテロアリール、アルコキシ、シクロアルコキシ、ハロアルキル又はハロアルコキシは、C₁~C₆アルキル、ハロ、CN、CF₃、-COOH、-OH、C₁~C₆アルコキシ、-NH₂、-(C₁~C₆アルキル)NH₂、-(C₁~C₆アルキル)NH(C₁~C₆アルキル)、-(C₁~C₆アルキル)N(C₁~C₆アルキル)₂、-NH(C₁~C₆アルキル)、-N(C₁~C₆アルキル)₂、-CONH₂、-NH(CO)(C₁~C₆アルキル)、-N(C₁~C₆アルキル)CO(C₁~C₆アルキル)、-SO₂-(C₁~C₆アルキル)、-(SO)NH₂、(SO)NH(C₁~C₆アルキル)及び(SO)N(C₁~C₆アルキル)₂からなる群から選択される1以上の置換基で更に任意に置換される)の化合物。

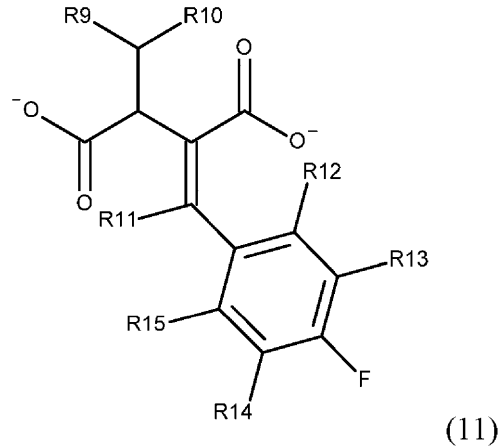
40

【請求項2】

式(11):

50

【化 3】



10

20

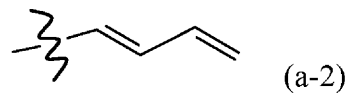
30

(式中、

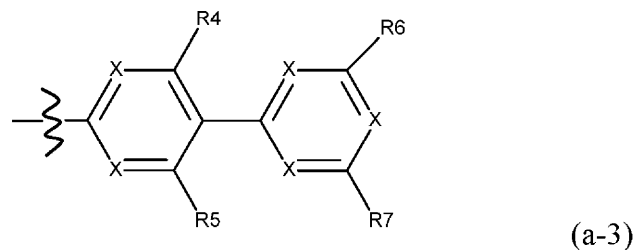
R 9、R 10 及び R 11 は、水素、重水素、C 1 ~ C 6 アルキル、C 2 ~ C 6 アルケニル、C 2 ~ C 6 アルキニル、C 3 ~ C 14 シクロアルキル、C 1 ~ C 6 アルキルベンゼン、アリール、ヘテロアリール、アリール (C 1 ~ C 6 アルキル)、-CN、アミノ、(C 1 ~ C 6) アルキルアミノ、ジアルキル (C 1 ~ C 6) アミノ、ハロアルキル (C 1 ~ C 6)、(C 1 ~ C 6) アルコキシ、(C 1 ~ C 6) ハロアルコキシ、ヘテロアリール (C 1 ~ C 6 アルキル)、(C 4 ~ C 15) 複素環、(C 4 ~ C 15) 複素環 (C 1 ~ C 6 アルキル)、C 3 ~ C 7 シクロアルコキシ、C 6 ~ C 10 - アリールオキシ、並びに (a - 1)、(a - 2) 及び (a - 3) の部分からなる群から独立して選択され、前記アルキル、C 1 ~ C 6 アルキルベンゼン、アリール、シクロアルキル、複素環、ヘテロアリール、アルコキシ、シクロアルコキシ、ハロアルキル又はハロアルコキシは、-C 1 ~ C 6 アルキル、ハロ、CN、CF₃、-COOH、-OH、-C 1 ~ C 6 アルコキシ、-NH₂、-(C 1 ~ C 6 アルキル)NH₂、-(C 1 ~ C 6 アルキル)NH(C 1 ~ C 6 アルキル)、-(C 1 ~ C 6 アルキル)N(C 1 ~ C 6 アルキル)₂、-NH(C 1 ~ C 6 アルキル)、-N(C 1 ~ C 6 アルキル)₂、-CONH₂、-NH(CO)(C 1 ~ C 6 アルキル)、-N(C 1 ~ C 6 アルキル)CO(C 1 ~ C 6 アルキル)、-SO₂-(C 1 ~ C 6 アルキル)、-(SO)NH₂、(SO)NH(C 1 ~ C 6 アルキル) 及び (SO)N(C 1 ~ C 6 アルキル)₂ からなる群から選択される 1 以上の置換基で更に任意に置換され、

(a - 1)、(a - 2) 及び (a - 3) の基は、

【化 4】



40



であり、

50

XはN又はCR₈のいずれかであり、

R₄、R₅、R₆、R₇及びR₈は、水素、重水素、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₃～C₁₄シクロアルキル、C₁～C₆アルキルベンゼン、アリール、ヘテロアリール、アリール(C₁～C₆アルキル)、-CN、アミノ、(C₁～C₆)アルキルアミノ、ジアルキル(C₁～C₆)アミノ、ハロアルキル(C₁～C₆)、(C₁～C₆)アルコキシ、(C₁～C₆)ハロアルコキシ、ヘテロアリール(C₁～C₆アルキル)、(C₄～C₁₅)複素環、(C₄～C₁₅)複素環(C₁～C₆アルキル)、C₃～C₇シクロアルコキシ、C₆～C₁₀-アリールオキシからなる群から独立して選択され、前記アルキル、アルキルベンゼン、アリール、シクロアルキル、複素環、ヘテロアリール、アルコキシ、シクロアルコキシ、ハロアルキル又はハロアルコキシは、C₁～C₆アルキル、ハロ、CN、CF₃、-COOH、-OH、C₁～C₆アルコキシ、-NH₂、-(C₁～C₆アルキル)NH₂、-(C₁～C₆アルキル)NH(C₁～C₆アルキル)、-(C₁～C₆アルキル)N(C₁～C₆アルキル)₂、-NH(C₁～C₆アルキル)、-N(C₁～C₆アルキル)₂、-CONH₂、-NH(CO)(C₁～C₆アルキル)、-N(C₁～C₆アルキル)CO(C₁～C₆アルキル)、-SO₂-(C₁～C₆アルキル)、-(SO)NH₂、(SO)NH(C₁～C₆アルキル)及び(SO)N(C₁～C₆アルキル)₂からなる群から選択される1以上の置換基で更に任意に置換され、

10

R₁₂、R₁₃、R₁₄及びR₁₅は、水素、重水素、C₁～C₆アルキル、ハロ、CN、CF₃、-COOH、-OH、C₁～C₆アルコキシ、-NH₂、-(C₁～C₆アルキル)NH₂、-(C₁～C₆アルキル)NH(C₁～C₆アルキル)、-(C₁～C₆アルキル)N(C₁～C₆アルキル)₂、-NH(C₁～C₆アルキル)、-N(C₁～C₆アルキル)₂、-CONH₂、-NH(CO)(C₁～C₆アルキル)、-N(C₁～C₆アルキル)CO(C₁～C₆アルキル)、-SO₂-(C₁～C₆アルキル)、-(SO)NH₂、(SO)NH(C₁～C₆アルキル)及び(SO)N(C₁～C₆アルキル)₂からなる群から独立して選択される)の化合物。

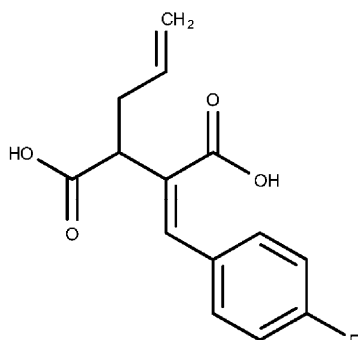
20

【請求項3】

R₉が水素であり、R₁₀が基(a-1)であり、R₁₁～R₁₅が水素であり、下記構造：

【化5】

30



化合物(7)

40

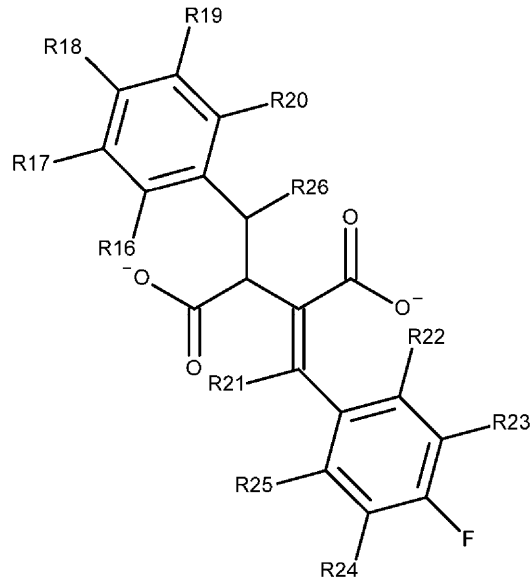
を有する、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

式(12)：

50

【化 6】



(12)

10

20

30

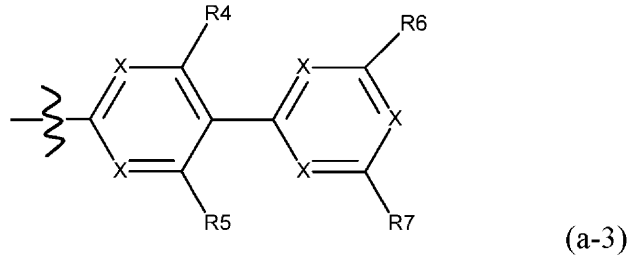
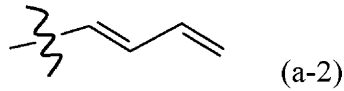
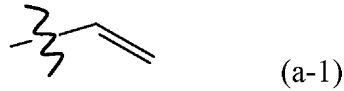
40

50

(式中、

R 2 1 及び R 2 6 は、水素、重水素、C 1 ~ C 6 アルキル、C 2 ~ C 6 アルケニル、C 2 ~ C 6 アルキニル、C 3 ~ C 1 4 シクロアルキル、C 1 ~ C 6 アルキルベンゼン、アリー
 ル、ヘテロアリール、アリール (C 1 ~ C 6 アルキル)、-CN、アミノ、(C 1 ~ C 6)
 アルキルアミノ、ジアルキル (C 1 ~ C 6) アミノ、ハロアルキル (C 1 ~ C 6)、(C 1 ~ C 6)
 アルコキシ、(C 1 ~ C 6) ハロアルコキシ、ヘテロアリール (C 1 ~ C 6
 アルキル)、(C 4 ~ C 1 5) 複素環、(C 4 ~ C 1 5) 複素環 (C 1 ~ C 6 アルキル)
 、C 3 ~ C 7 シクロアルコキシ、C 6 ~ C 1 0 - アリールオキシ、並びに (a - 1)、(a - 2)
) 及び (a - 3) の部分からなる群から独立して選択され、前記アルキル、C 1 ~
 C 6 アルキルベンゼン、アリール、シクロアルキル、複素環、ヘテロアリール、アルコキ
 シ、シクロアルコキシ、ハロアルキル又はハロアルコキシは、-C 1 ~ C 6 アルキル、ハ
 ロ、CN、CF₃、-COOH、-OH、-C 1 ~ C 6 アルコキシ、-NH₂、-(C 1
 ~ C 6 アルキル)NH₂、-(C 1 ~ C 6 アルキル)NH(C 1 ~ C 6 アルキル)、-(
 C 1 ~ C 6 アルキル)N(C 1 ~ C 6 アルキル)₂、-NH(C 1 ~ C 6 アルキル)、-
 N(C 1 ~ C 6 アルキル)₂、-CONH₂、-NH(CO)(C 1 ~ C 6 アルキル)、
 -N(C 1 ~ C 6 アルキル)CO(C 1 ~ C 6 アルキル)、-SO₂-(C 1 ~ C 6 アル
 キル)、-(SO)NH₂、(SO)NH(C 1 ~ C 6 アルキル)及び(SO)N(C 1
 ~ C 6 アルキル)₂ からなる群から選択される 1 以上の置換基で更に任意に置換され、
 (a - 1)、(a - 2) 及び (a - 3) の基は、

【化 7】



10

であり、

XはN又はCR₈のいずれかであり、

R₄、R₅、R₆、R₇及びR₈は、水素、重水素、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₃～C₁₄シクロアルキル、C₁～C₆アルキルベンゼン、アリール、ヘテロアリール、アリール(C₁～C₆アルキル)、-CN、アミノ、(C₁～C₆)アルキルアミノ、ジアルキル(C₁～C₆)アミノ、ハロアルキル(C₁～C₆)、(C₁～C₆)アルコキシ、(C₁～C₆)ハロアルコキシ、ヘテロアリール(C₁～C₆アルキル)、(C₄～C₁₅)複素環、(C₄～C₁₅)複素環(C₁～C₆アルキル)、C₃～C₇シクロアルコキシ、C₆～C₁₀-アリールオキシからなる群から独立して選択され、前記アルキル、アルキルベンゼン、アリール、シクロアルキル、複素環、ヘテロアリール、アルコキシ、シクロアルコキシ、ハロアルキル又はハロアルコキシは、C₁～C₆アルキル、ハロ、CN、CF₃、-COOH、-OH、C₁～C₆アルコキシ、-NH₂、-(C₁～C₆アルキル)NH₂、-(C₁～C₆アルキル)NH(C₁～C₆アルキル)、-(C₁～C₆アルキル)N(C₁～C₆アルキル)₂、-NH(C₁～C₆アルキル)、-N(C₁～C₆アルキル)₂、-CONH₂、-NH(CO)(C₁～C₆アルキル)、-N(C₁～C₆アルキル)CO(C₁～C₆アルキル)、-SO₂-(C₁～C₆アルキル)、-(SO)NH₂、(SO)NH(C₁～C₆アルキル)及び(SO)N(C₁～C₆アルキル)₂からなる群から選択される1以上の置換基で更に任意に置換され、

20

30

R₁₆、R₁₇、R₁₈、R₁₉、R₂₀、R₂₂、R₂₃、R₂₄及びR₂₅は、水素、重水素、C₁～C₆アルキル、ハロ、CN、CF₃、-COOH、-OH、C₁～C₆アルコキシ、-NH₂、-(C₁～C₆アルキル)NH₂、-(C₁～C₆アルキル)NH(C₁～C₆アルキル)、-(C₁～C₆アルキル)N(C₁～C₆アルキル)₂、-NH(C₁～C₆アルキル)、-N(C₁～C₆アルキル)₂、-CONH₂、-NH(CO)(C₁～C₆アルキル)、-N(C₁～C₆アルキル)CO(C₁～C₆アルキル)、-SO₂-(C₁～C₆アルキル)、-(SO)NH₂、(SO)NH(C₁～C₆アルキル)及び(SO)N(C₁～C₆アルキル)₂からなる群から独立して選択される)の化合物。

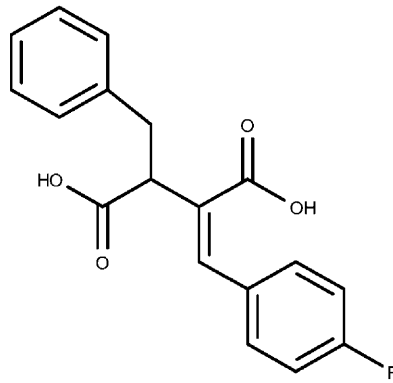
40

【請求項 5】

R₁₆～R₂₆が水素であり、下記構造：

50

【化 8】



化合物(6)

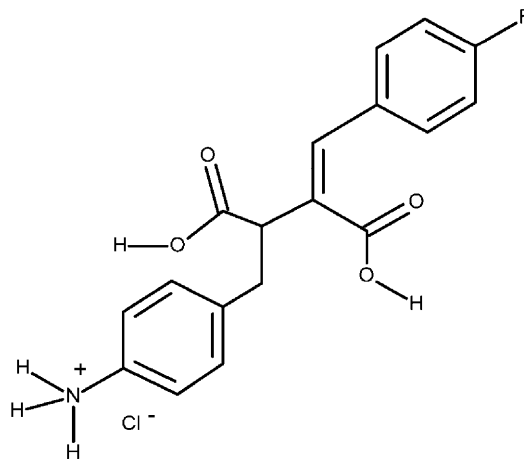
10

を有する、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

R 1 6、R 1 7 及び R 1 9 ~ R 2 6 が水素であり、R 1 8 が -NH₂ であり、下記構造：

【化 9】



化合物(8)

20

30

を有する、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 7】

請求項 1 に記載の 1 種以上の化合物を含む、免疫系の抑制を特徴とする疾患を治療するための医薬組成物。

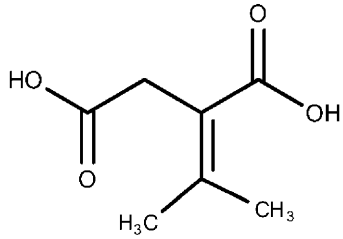
【請求項 8】

前記疾患が癌であり、前記医薬組成物が化合物 (3) ~ 化合物 (8) :

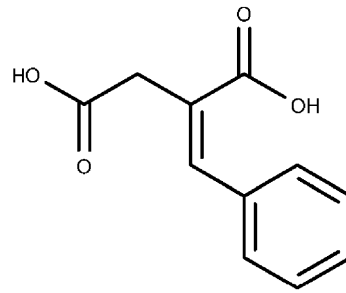
40

50

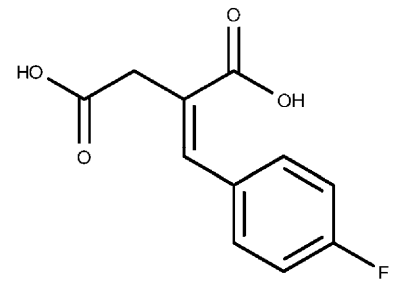
【化 1 0】



化合物(3)

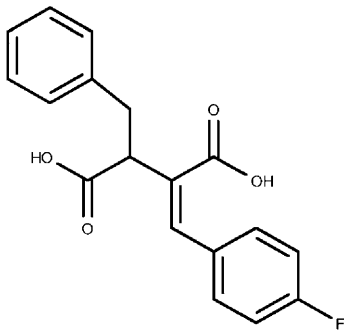


化合物(4)

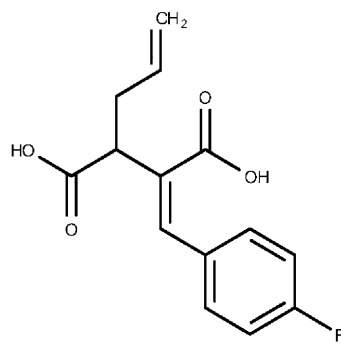


化合物(5)

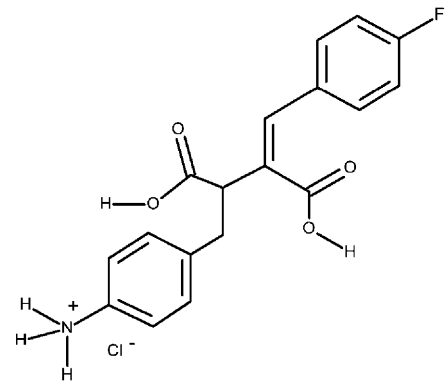
10



化合物(6)



化合物(7)



化合物(8)

20

からなる群から選択される 1 種以上の化合物を含む、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

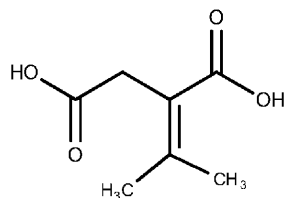
前記疾患が感染性疾患であり、前記医薬組成物が化合物(3)～化合物(8)：

30

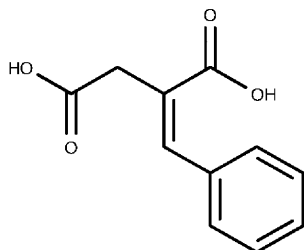
40

50

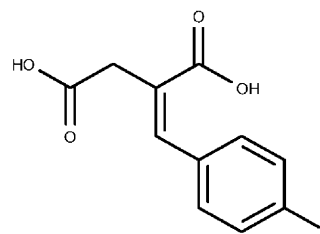
【化 1 1】



化合物(3)

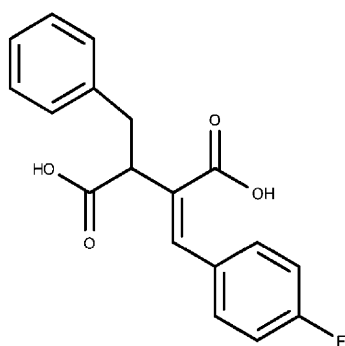


化合物(4)

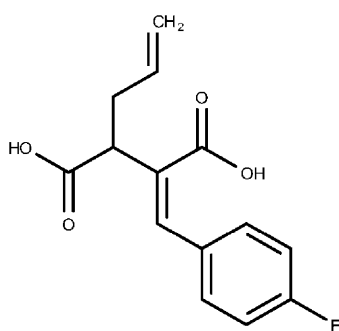


化合物(5)

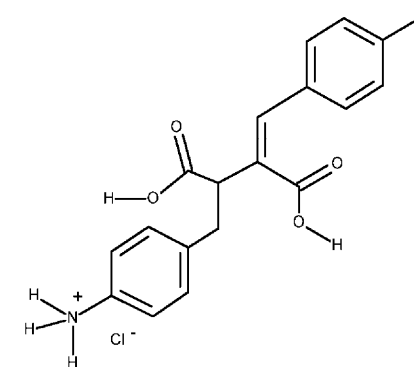
10



化合物(6)



化合物(7)



化合物(8)

20

からなる群から選択される 1 種以上の化合物を含む、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

請求項 1 に記載の 1 種以上化合物を含む、異常な T 細胞活性化を特徴とする疾患を治療するための医薬組成物。

【請求項 11】

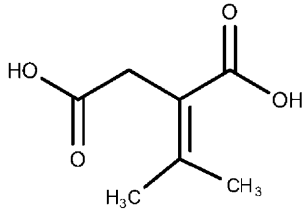
前記疾患が自己免疫疾患であり、前記医薬組成物が化合物(3)～化合物(8)：

30

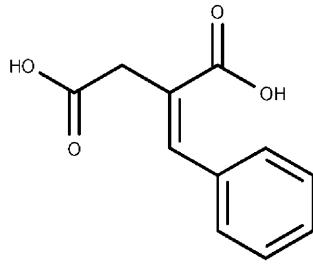
40

50

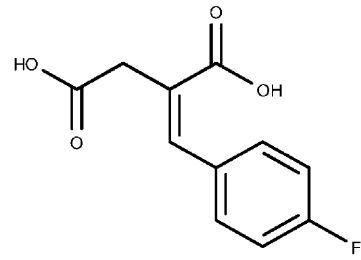
【化 1 2】



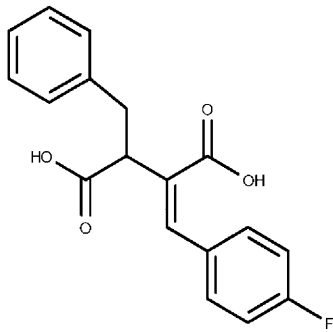
化合物(3)



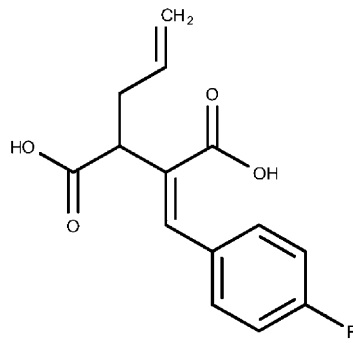
化合物(4)



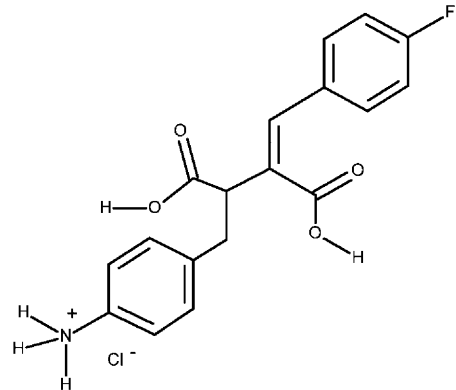
化合物(5)



化合物(6)



化合物(7)



化合物(8)

からなる群から選択される 1 種以上の化合物を含む、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2】

前記疾患が同種移植片拒絶反応であり、前記医薬組成物が化合物(3)～化合物(8)：

10

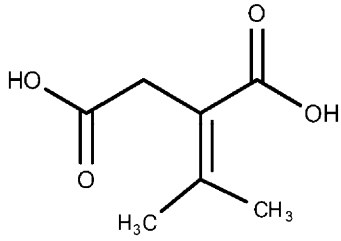
20

30

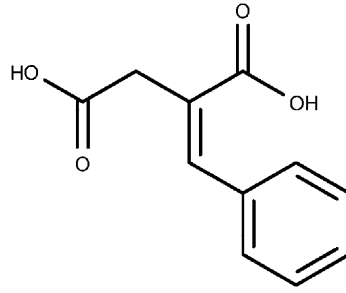
40

50

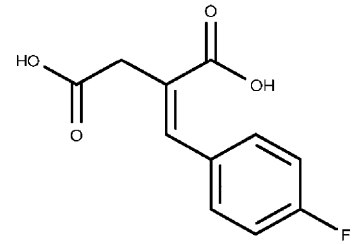
【化 1 3】



化合物(3)

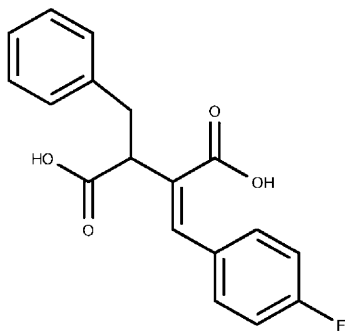


化合物(4)

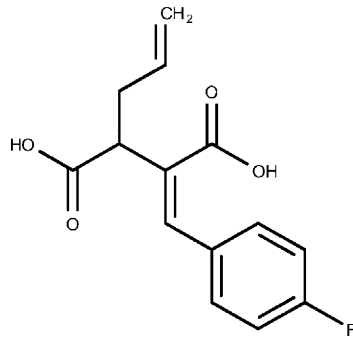


化合物(5)

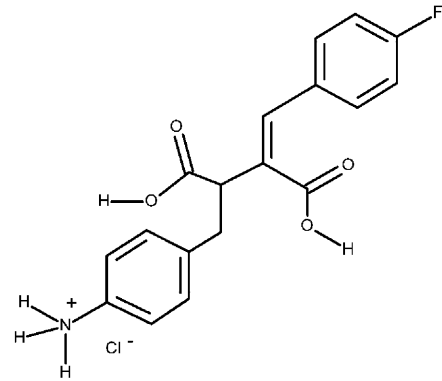
10



化合物(6)



化合物(7)



化合物(8)

20

からなる群から選択される 1 種以上の化合物を含む、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3】

請求項 1 に記載の 1 種以上の化合物を含む、IRG1 発現を特徴とする疾患を治療するための医薬組成物。

30

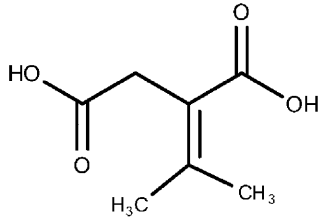
【請求項 1 4】

前記医薬組成物が化合物(3)～化合物(8)：

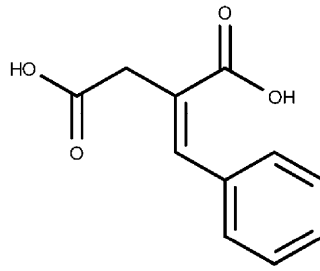
40

50

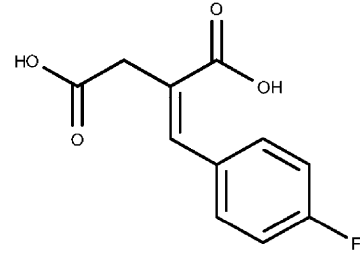
【化 1 4】



化合物(3)

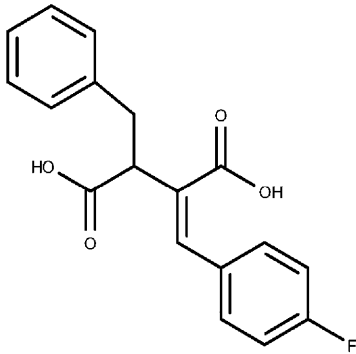


化合物(4)

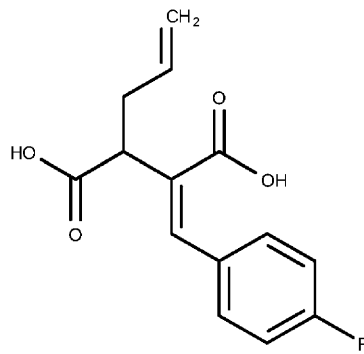


化合物(5)

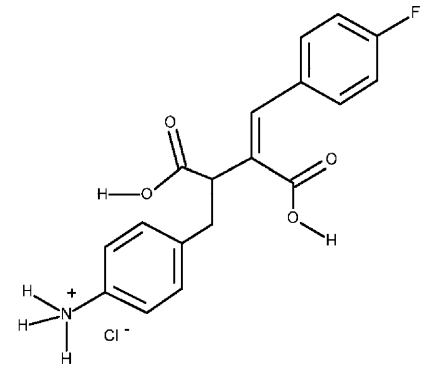
10



化合物(6)



化合物(7)



化合物(8)

20

からなる群から選択される 1 種以上の化合物を含む、請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

請求項 1 に記載の 1 種以上の化合物を含む、炎症性の障害又は疾患を治療するための医薬組成物。

【請求項 1 6】

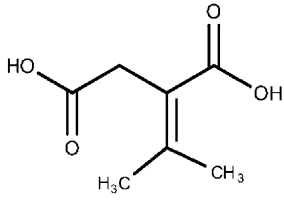
前記医薬組成物が化合物(3)～化合物(8)：

30

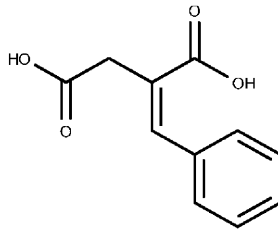
40

50

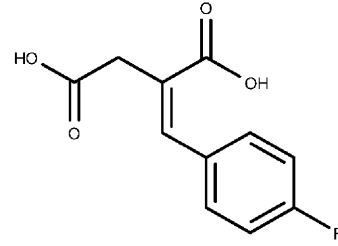
【化 1 5】



化合物(3)

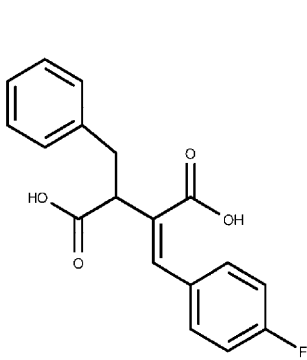


化合物(4)

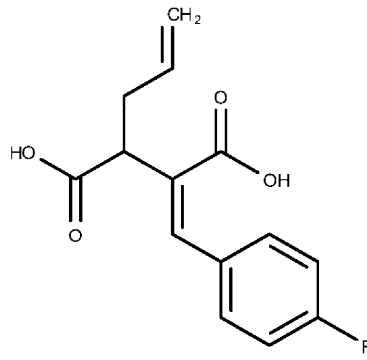


化合物(5)

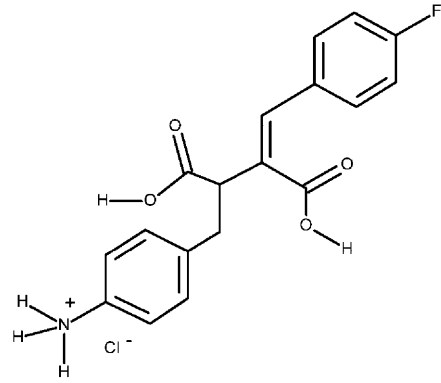
10



化合物(6)



化合物(7)



化合物(8)

20

からなる群から選択される 1 以上の化合物を含む、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

30

40

50