

【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 8 月 1 日(2022.8.1)

【国際公開番号】WO2020/021097

【公表番号】特表 2021-531308(P2021-531308A)

【公表日】令和 3 年 11 月 18 日(2021.11.18)

【出願番号】特願 2021-504186(P2021-504186)

【国際特許分類】

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

10

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

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

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

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

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

A 6 1 K 4 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

【 F I 】

C 0 7 D 4 0 1 / 1 2

A 6 1 P 1 3 / 1 2

A 6 1 K 3 1 / 4 4 1 8

20

A 6 1 K 3 1 / 5 0 6

C 0 7 D 2 1 3 / 8 2

C 0 7 D 2 1 3 / 8 1

A 6 1 K 4 5 / 0 0

【手続補正書】

【提出日】令和 4 年 7 月 22 日(2022.7.22)

【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

30

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

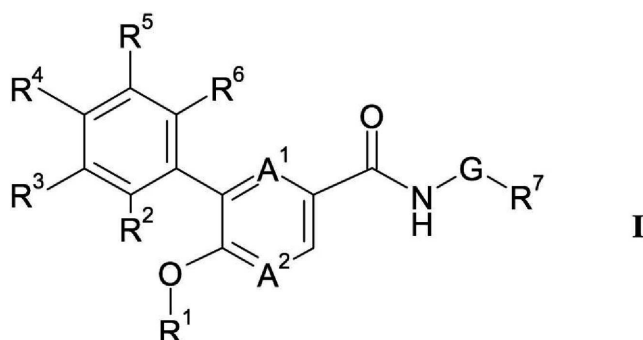
A B C A 1 誘導因子化合物、並びに薬学的に許容される担体及び / 又はアジュバントを含む、腎疾患の処置で使用するための医薬組成物。

【請求項 2】

前記 A B C A 1 誘導因子化合物 が式 I

【化 3】

40



[式中、

50

A¹ 及び A² の一方は N であり、A¹ 及び A² の他方は CH であり、

R¹ は、C₁ ~ 7 アルキル、C₃ ~ 7 シクロアルキル、C₃ ~ 7 シクロアルキル - C₁ ~ 7 アルキル、C₁ ~ 7 アルコキシ - C₁ ~ 7 アルキル、ハロゲン - C₁ ~ 7 アルキル、ヘテロシクリル - C₁ ~ 7 アルキル（ここで、前記ヘテロシクリル基は非置換であるか、又はオキシにより置換されている）、及びヘテロアリール - C₁ ~ 7 アルキル（ここで、前記ヘテロアリール基は非置換であるか、又は低級アルキルによりモノ又はジ置換されている）からなる群から選択され、

R² 及び R⁶ は互いに独立して水素又はハロゲンであり、

R³ 及び R⁵ は互いに独立して水素、C₁ ~ 7 アルキル、C₁ ~ 7 アルコキシ、ハロゲン、ハロゲン - C₁ ~ 7 アルキル、ハロゲン - C₁ ~ 7 アルコキシ、及びシアノからなる群から選択され、

R⁴ は水素、C₁ ~ 7 アルキル、C₁ ~ 7 アルコキシ、ハロゲン、ハロゲン - C₁ ~ 7 アルキル、ハロゲン - C₁ ~ 7 アルコキシ、アミノ、及びシアノからなる群から選択され、

R⁷ は C₁ ~ 7 アルキル、C₃ ~ 7 シクロアルキル（前記シクロアルキルは非置換であるか又はヒドロキシにより置換されている）、ヘテロシクリル（前記ヘテロシクリルは、N、O 及び S から選択される 1、2、又は 3 つのヘテロ原子を含み、非置換であるか、又はヒドロキシ若しくはオキシにより置換されている、3 ~ 7 個の環原子を有する）、フェニル（ここで、フェニルは非置換であるか、又は C₁ ~ 7 アルキル、ヒドロキシ、C₁ ~ 7 アルコキシ、シアノ、ハロゲン、及びハロゲン - C₁ ~ 7 アルキルからなる群から選択される 1 つ又は 2 つの基により置換されている）、及びヘテロアリール（ここで、ヘテロアリールは非置換であるか、又は C₁ ~ 7 アルキル、ヒドロキシ、C₁ ~ 7 アルコキシ、シアノ、ハロゲン、及びハロゲン - C₁ ~ 7 アルキルからなる群から選択される 1 つ又は 2 つの基により置換されている）からなる群から選択され、

G は - (CH₂)_m - （式中、m は 0 又は 1 から選択される）、及び - NR₈ （式中、R₈ は水素又は C₁ ~ 7 アルキルである）からなる群から選択される。]

で表される化合物又は薬学的に許容されるその塩であることを特徴とする、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

G が結合であり、R⁷ が C₃ ~ 7 シクロアルキル（前記シクロアルキルは非置換であるか又はヒドロキシにより置換されている）である、請求項 1 又は 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

R⁷ がヒドロキシにより置換されたシクロヘキシルである、請求項 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

R² 及び R⁶ がそれぞれ水素であり、R⁴ がハロゲンであり、R³ 及び R⁵ の一方がハロゲンであり、R³ 及び R⁵ の他方が水素である、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

R¹ がハロゲン - C₁ ~ 7 アルキルである、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

R¹ が - CF₃、- CHF₂、- CH₂Cl、- CH₂CF₃、- CH(CF₃)₂、- CF₂-CF₃ から選択される、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

6 - (3, 4 - ジクロロフェニル) - N - [(1R, 2R) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル] - 5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリジン - 2 - カルボキサミドである、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

5 - (3, 4 - ジクロロ - フェニル) - N - ((1R, 2R) - 2 - ヒドロキシ - シク

ロヘキシル) - 6 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - エトキシ) - ニコチンアミドである、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 0】

前記腎疾患が慢性腎疾患、一次若しくは二次糸球体性疾患、又はタンパク尿腎疾患から選択される、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 1】

前記糸球体性疾患がアルポート症候群又は巣状分節性糸球体硬化症である、請求項 1 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2】

前記腎疾患が糖尿病性腎疾患から選択される、請求項 1 0 に記載の医薬組成物。

10

【請求項 1 3】

経口投与用に製剤化されている、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

局所、経鼻、眼内、静脈内、筋肉内、皮下、硝子体内、髄腔内、又は経皮での投与用に製剤化されている、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

1 日の用量が 2 0 ~ 8 0 0 m g / 日である、請求項 1 ~ 1 2 の一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

1 日の用量が 2 0 0 m g / 日である、請求項 1 ~ 1 2 の一項に記載の医薬組成物。

20

【請求項 1 7】

投与レジメンが 1 日 1 回、1 日 2 回、1 日 3 回、3 日に 1 回、1 週間に 1 回、2 週間に 1 回、又はひと月に 1 回である、請求項 1 ~ 1 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

負荷用量レジメンが、最初の 7 日間、1 4 日間、又は 3 0 日間に用量を 2 倍にする、請求項 1 ~ 1 7 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

アンギオテンシン変換酵素 (A C E) 阻害剤薬物、R A S 遮断剤；アンギオテンシン受容体遮断薬 (A R B) ；プロテインキナーゼ C (P K C) 阻害剤；A G E 依存性経路の阻害剤；抗炎症剤；G A G ；ピリドキサミン；エンドセリンアンタゴニスト、C O X - 2 阻害剤、P P A R - γ アンタゴニスト、並びに、アミホスチン、カプトプリル、シクロホスファミド、チオ硫酸ナトリウム、トラニラスト又はシクロデキストリンなどのその他の化合物及びこれらの誘導体、ビタミン D 誘導体、抗高血糖剤並びに抗高コレステロール血症剤からなる群から選択される化合物と同時、逐次的、又は個別に使用するための、請求項 1 ~ 1 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

30

【請求項 2 0】

腎疾患の治療及び / 又は予防用の医薬を調製するための、請求項 2 ~ 9 で定義された式 I の化合物、又は薬学的に許容されるその塩の使用。

【請求項 2 1】

処置に有効な量の請求項 1 ~ 9 のいずれか一項で定義された A B C A 1 誘導因子を投与することを含む、それを必要とする対象における腎疾患の処置用の請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

40

【請求項 2 2】

前記 A B C A 1 誘導因子が、局所、経口、経鼻、眼内、静脈内、筋肉内、皮下、硝子体内、髄腔内、又は経皮の経路により投与される、請求項 2 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

前記投与が 1 日 1 回、1 日 2 回、1 日 3 回、3 日に 1 回、1 週間に 1 回、2 週に 1 回、又はひと月に 1 回、好ましくは 1 日 1 回である、請求項 2 1 又は 2 2 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 4】

50

請求項 1 ~ 9 のいずれか一項で定義された A B C A 1 誘導因子の 1 日用量が、20 ~ 800 mg / 日の範囲である、請求項 2.1 又は 2.2 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 2.5】

前記 A B C A 1 誘導因子が、処置に有効な量のアンギオテンシン変換酵素阻害剤又はアンギオテンシン受容体遮断剤と組み合わせて、同時に、個別に、又は逐次的に投与される、請求項 2.1 ~ 2.4 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 2.6】

前記 A B C A 1 誘導因子が、アンギオテンシン変換酵素 (ACE) 阻害剤薬物；RAS 遮断剤；アンギオテンシン受容体遮断薬 (ARB)；プロテインキナーゼ C (PKC) 阻害剤；AGE 依存性経路の阻害剤；抗炎症剤；GAG；ピリドキサミン；エンドセリンアンタゴニスト、COX-2 阻害剤、PPAR- γ アンタゴニスト、並びに、アミホスチン、カプトプリル、シクロホスファミド、チオ硫酸ナトリウム、トラニラスト又はシクロデキストリンなどのその他の化合物及びこれらの誘導体、ビタミン D 誘導体、抗高血糖剤並びに抗高コレステロール血症剤からなる群から選択される処置有効量の化合物と組み合わせて同時に、個別に、又は逐次的に投与される、請求項 2.1 ~ 2.4 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

10

20

30

40

50