

【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6年5月15日(2024.5.15)

【国際公開番号】WO2021/071812

【公表番号】特表2022-551198(P2022-551198A)

【公表日】令和4年12月7日(2022.12.7)

【年通号数】公開公報(特許)2022-225

【出願番号】特願2022-546590(P2022-546590)

【国際特許分類】

10

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

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

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

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

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

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

C 0 7 D 4 9 1 / 1 1 3 (2 0 0 6 . 0 1)

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

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

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

20

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

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

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

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

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

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

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

A 6 1 K 3 1 / 4 4 5 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 5 2 3 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 5 3 (2 0 0 6 . 0 1)

30

A 6 1 K 3 1 / 4 5 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 9 5 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7 (2 0 0 6 . 0 1)

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

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

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

A 6 1 P 3 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

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

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

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

40

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

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

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

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

A 6 1 P 2 5 / 2 8 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 9 / 0 0 (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 7 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

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

A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

50

C 0 7 D 2 0 9 / 5 2 (2 0 0 6 . 0 1)**【 F I 】**

C 0 7 D 2 1 1 / 6 0	C S P	
C 0 7 D 2 2 3 / 0 8		
C 0 7 D 2 0 5 / 0 4		
C 0 7 D 2 4 1 / 0 4		
C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 4 5		
C 0 7 D 4 9 1 / 1 0 7		
C 0 7 D 4 9 1 / 1 1 3		
C 0 7 D 4 0 1 / 0 4		10
C 0 7 D 4 0 5 / 0 2		
C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 6 H		
C 0 7 D 4 7 1 / 1 0 1 0 1		
C 0 7 D 2 0 7 / 0 8		
A 6 1 K 3 1 / 3 9 7		
A 6 1 K 3 1 / 4 0		
A 6 1 K 3 1 / 4 0 3		
A 6 1 K 3 1 / 4 3 7		
A 6 1 K 3 1 / 4 3 8		
A 6 1 K 3 1 / 4 4 5		20
A 6 1 K 3 1 / 4 5 2 3		
A 6 1 K 3 1 / 4 5 3		
A 6 1 K 3 1 / 4 5 4		
A 6 1 K 3 1 / 4 9 5		
A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7		
A 6 1 K 3 1 / 5 5		
A 6 1 P 1 / 0 2		
A 6 1 P 1 / 0 4		
A 6 1 P 3 / 0 4		
A 6 1 P 3 / 1 0		30
A 6 1 P 9 / 1 0		
A 6 1 P 1 3 / 1 2		
A 6 1 P 1 7 / 0 0		
A 6 1 P 1 7 / 0 6		
A 6 1 P 1 9 / 0 2		
A 6 1 P 2 5 / 0 0		
A 6 1 P 2 5 / 2 8		
A 6 1 P 2 9 / 0 0		
A 6 1 P 2 9 / 0 0 1 0 1		
A 6 1 P 3 5 / 0 0		40
A 6 1 P 3 7 / 0 2		
A 6 1 P 3 7 / 0 6		
A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 0 1		
C 0 7 D 2 0 9 / 5 2		

【 手 続 補 正 書 】**【 提 出 日 】** 令 和 6 年 5 月 2 日 (2 0 2 4 . 5 . 2)**【 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

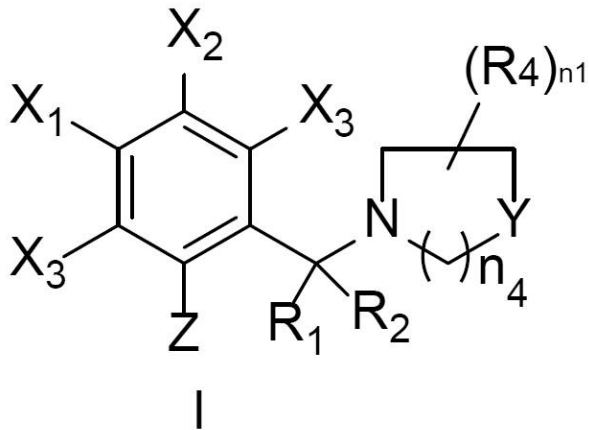
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物またはその薬学的に許容される塩

【化 1】



10

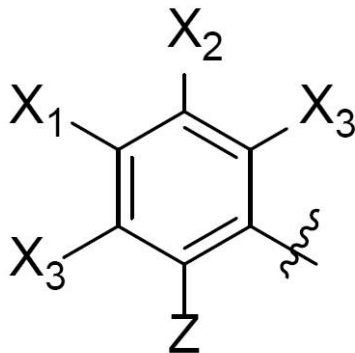
(式中、

20

Y の各出現は独立に、 $C(R_4)_2$ 、 NR_4 、 O 、 S 、 SO 、 SO_2 、または $SO(=NR_a)$ であり；

前記構造部分

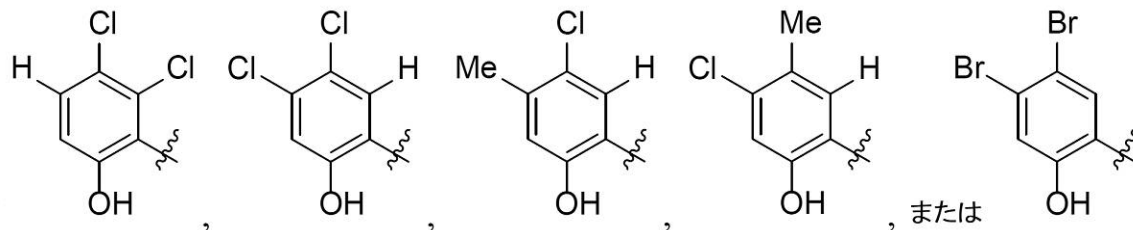
【化 2】



30

が、

【化 3】



40

の構造を有し、

R_1 および R_2 はそれぞれ独立に、 H 、アルキル、 $(CR_6R_7)_{n_3}OR_a$ 、 $(CR_6R_7)_{n_3}NR_aR_b$ 、 $(CR_6R_7)_{n_3}(C=O)NR_bR_a$ 、または $(CR_6R_7)_{n_3}NR_b(C=O)R_a$ であり；

R_4 の各出現は独立に、 H 、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ハロゲン化アルキル、ハロゲン化シクロアルキル、任意選択で置換された飽和複素環、任意選択で置換され

50

たアリール、任意選択で置換されたヘテロアリール、CN、オキソ、 $(C=O)R_b$ 、 $(C=O)OR_b$ 、 $(CR_6R_7)_{n_3}OR_a$ 、 $(CR_6R_7)_{n_3}NR_aR_b$ 、 $(CR_6R_7)_{n_3}SO_2R_a$ 、 $(CR_6R_7)_{n_3}SO_2NR_aR_b$ 、 $(CR_6R_7)_{n_3}NR_aSO_2R_b$ 、 $(CR_6R_7)_{n_3}NR_a(C=O)R_b$ 、 $(CR_6R_7)_{n_3}(C=O)NR_aR_b$ 、 $(CR_6R_7)_{n_3}NR_a(C=O)NR_aR_b$ 、 $(C=O)(CR_6R_7)_{n_3}OR_b$ 、 $(C=O)(CR_6R_7)_{n_3}NR_aR_b$ 、またはそれぞれN、O、およびSからなる群から選択される1~3個のヘテロ原子を含有する任意選択で置換された5もしくは6員複素環であり；

あるいは2つの R_4 は一緒になって、それぞれN、O、およびSからなる群から選択される0~3個のヘテロ原子を含有する任意選択で置換された炭素環、飽和複素環、またはヘテロアリールを形成し；

R_6 および R_7 の各出現は独立に、H、アルキル、シクロアルキル、任意選択で置換されたアリール、または任意選択で置換されたヘテロアリールであり；

R_a および R_b の各出現は独立に、H、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、ハロゲン化アルキル、ハロゲン化シクロアルキル、任意選択で置換された飽和複素環、任意選択で置換されたアリール、または任意選択で置換されたヘテロアリールであり；あるいは R_a および R_b は、これらが結合している窒素原子と一緒に、窒素原子ならびにそれぞれN、O、およびSからなる群から選択される0~3個の追加のヘテロ原子を含む任意選択で置換された複素環を形成し；

該当する場合、 R_1 、 R_2 、 R_4 、 R_6 、および R_7 のアルキル、シクロアルキル、炭素環、複素環、アリール、およびヘテロアリールは、原子価が許す場合、アルキル、シクロアルキル、ハロゲン化シクロアルキル、ハロゲン化アルキル、ハロゲン、 $(CR_aR_b)_{n_3}OR_a$ 、 $(CR_aR_b)_{n_3}NR_aR_b$ 、 $(CR_aR_b)_{n_3}NR_a(C=O)R_b$ 、 $(CR_aR_b)_{n_3}(C=O)NR_aR_b$ 、およびオキソからなる群からそれぞれ独立に選択される1~4個の置換基によって任意選択で置換されており；

n_1 の各出現は独立に、原子価が許す場合、1、2、0、3、または4であり；

n_3 の各出現は独立に、0~4の整数であり；

n_4 の各出現は独立に、0、1、2または3である）。

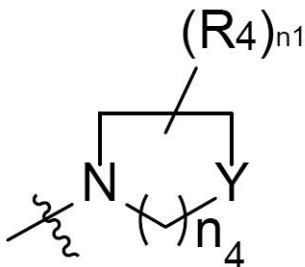
【請求項2】

Yが $C(R_4)_2$ であるか、Yが NR_4 であるか、YがOであるか、YがS、SO、SO₂、またはSO(=NR_a)であるか、Yが NR_4 、 $CMeR_4$ 、または CHR_4 である、請求項1に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項3】

構造部分

【化4】



が、

(a)

10

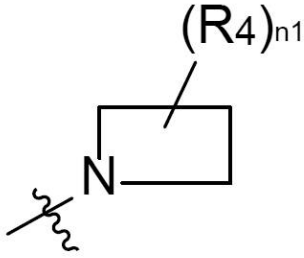
20

30

40

50

【化 5】

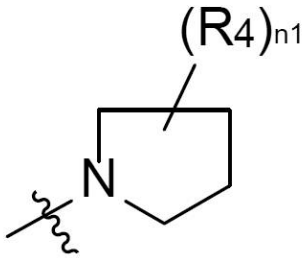


の構造を有するか、

10

(b)

【化 6】

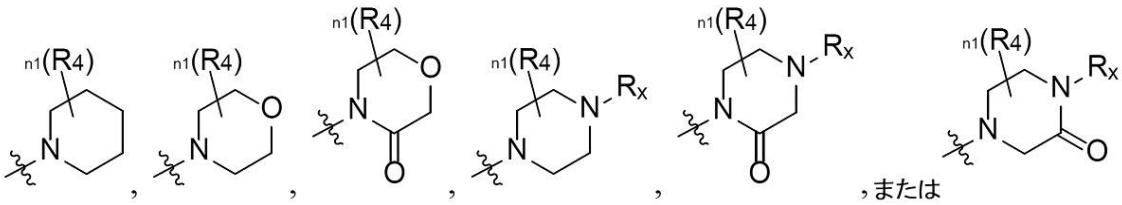


20

の構造を有するか、

(c)

【化 7】

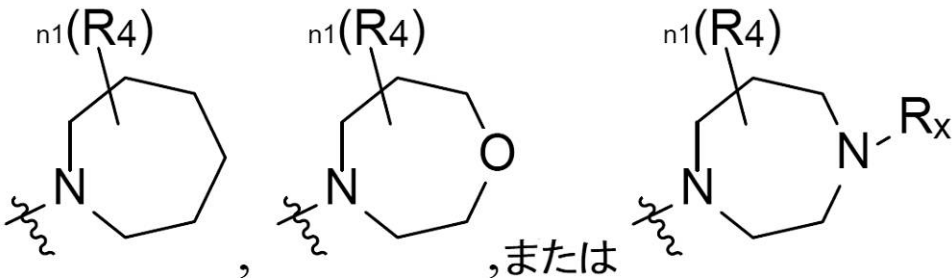


30

(R_x は R₄ である) の構造を有するか、または、

(d)

【化 8】



40

(R_x は R₄ である) の構造を有する、

請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 4】

R₁ および R₂ がそれぞれ独立に、

(a) H または アルキル であるか、

(b) H または Me であるか、

(c) H、(C R₆ R₇)_{n3} O R_a、(C R₆ R₇)_{n3} N R_a R_b、(C R₆ R₇)_{n3} 50

(C=O)NR_bR_a、または(CR₆R₇)_{n3}NR_b(C=O)R_aであるか、または、
 (d) H、CH₂OH、CH₂NH₂、またはCONH₂である、
 請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 5】

(a) R₄の少なくとも1つの出現が独立に、(CR₆R₇)_{n3}OR_a、(CR₆R₇)_{n3}NR_aR_b、(CR₆R₇)_{n3}SO₂R_a、(CR₆R₇)_{n3}NR_a(C=O)R_b、または(CR₆R₇)_{n3}(C=O)NR_aR_bであるか、

(b) R₄の少なくとも1つの出現が独立に、(CR₆R₇)_{n3}NR_a(C=O)R_bまたは(CR₆R₇)_{n3}(C=O)NR_aR_bであるか、

(c) R₄の1つまたは複数の出現が(CR₆R₇)_{n3}OR_aまたは(CR₆R₇)_{n3}NR_aR_bであるか、

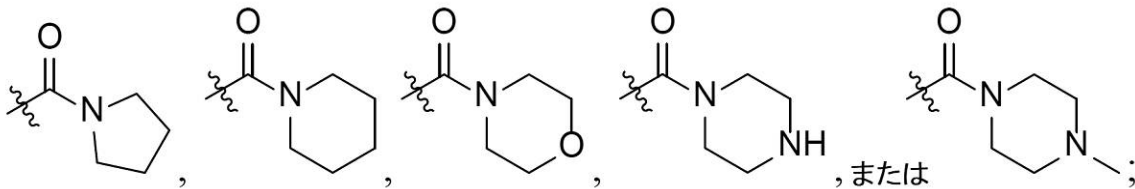
(d) R₄の1つまたは複数の出現がOR_a、NR_aR_b、-CH₂OR_a、-CH₂NR_aR_b、-CH₂CH₂OR_a、または-CH₂CH₂NR_aR_bであるか、

(e) R₄の少なくとも1つの出現が、それぞれN、O、およびSからなる群から選択される1~3個のヘテロ原子を含有する任意選択で置換された5または6員複素環であるか、

(f) 2つのR₄が、一緒になって、それぞれN、O、およびSからなる群から選択される0~3個のヘテロ原子を含有する任意選択で置換された炭素環、飽和複素環、またはヘテロアールを形成するか、

(g) R₄の少なくとも1つの出現がCH₂OH、CH₂NH₂、

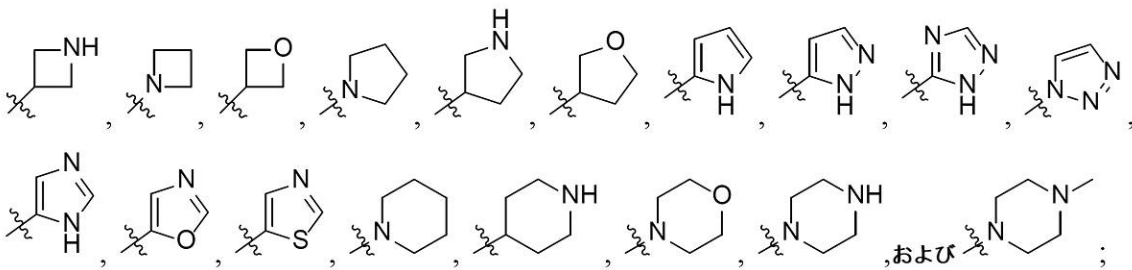
【化 9】



であるか、

(h) R₄の少なくとも1つの出現が

【化 10】



からなる群から選択される複素環であり；前記複素環が、原子価が許す場合、アルキル、OH、オキソ、または(C=O)C₁₋₄アルキルによって任意選択で置換されているか、

(i) R₄の少なくとも1つの出現が、H、アルキル、シクロアルキル、任意選択で置換された飽和複素環、任意選択で置換されたアール、任意選択で置換されたヘテロアール、CN、CF₃、OCF₃、OR_a、(CR₆R₇)_{n3}OR_a、またはオキソであるか、

(j) R₄の少なくとも1つの出現が、(C=O)R_b、(C=O)OR_b、SO₂R_a、(C=O)(CR₆R₇)_{n3}OR_b、(C=O)(CR₆R₇)_{n3}NR_aR_b、(CR₆R₇)_{n3}NR_aR_b、(CR₆R₇)_{n3}NR_aSO₂R_b、(CR₆R₇)_{n3}NR_a(C=O)R_b、(CR₆R₇)_{n3}NR_a(C=O)NR_aR_b、または(CR₆R

10

20

30

40

50

7) $n_3 (C=O)NR_aR_b$ であるか、

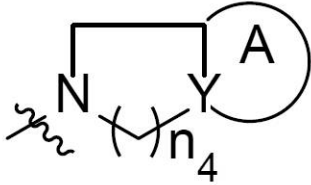
(k) R_4 の少なくとも1つの出現が独立に、Hまたはアルキルであるか、

(l) 2つの R_4 基が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、3~7員の任意選択で置換された炭素環または複素環を形成する、
請求項1から4のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項6】

2つの R_4 基が、これらが結合している2個の炭素原子と一緒にあって、

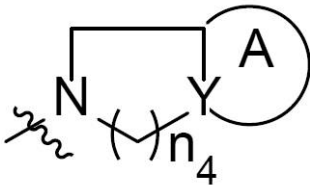
【化11】



10

(式中、Aは3~7員の任意選択で置換された炭素環、飽和複素環、またはヘテロアリアルである)の構造を有する縮合二環状系を形成し、
好ましくは、前記構造モチーフ

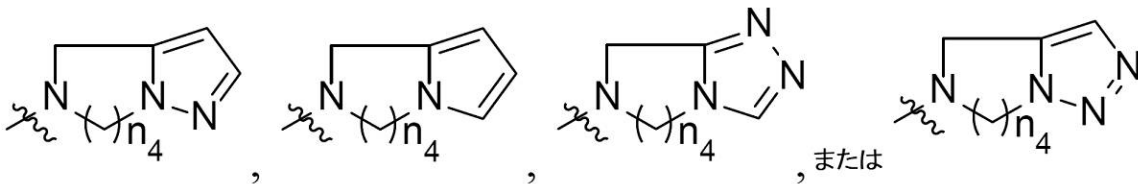
【化12】



20

が、

【化13】



30

の構造を有する、

請求項1または2に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項7】

R_6 および R_7 の各出現が独立に、Hまたはアルキルである、請求項1から4のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項8】

n_1 が0、1、2、または3である、請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項9】

n_3 の各出現が独立に、0、1、または2である、請求項1から8のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項10】

n_4 が1または2である、請求項1に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

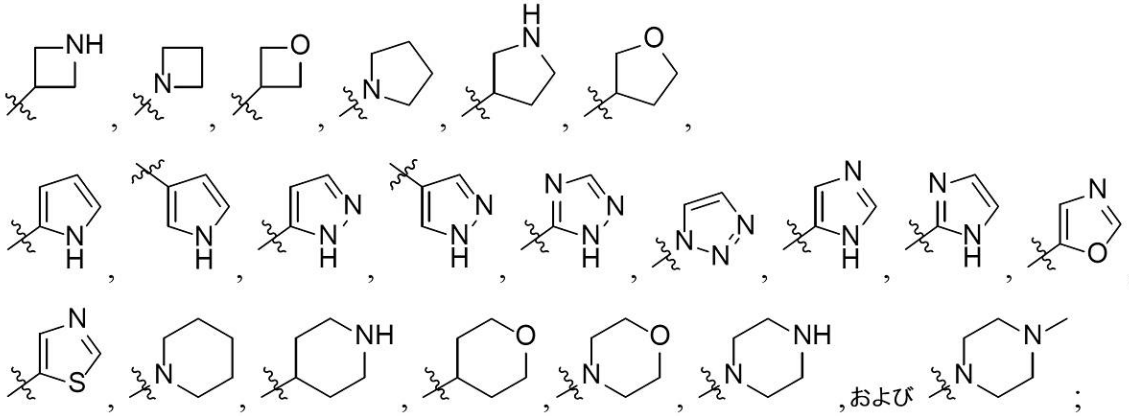
【請求項11】

(a) R_a または R_b の少なくとも1つの出現が独立に、H、アルキル、シクロアルキル、飽和複素環、アリアル、またはヘテロアリアルであるか、

50

(b) R_a または R_b の少なくとも 1 つの出現が独立に、H、Me、Et、Pr、または

【化 1 4】



10

からなる群から選択される複素環であり；前記複素環が、原子価が許す場合、アルキル、OH、オキソ、または (C=O)C₁₋₄ アルキルによって任意選択で置換されているか、または、

(c) R_a および R_b が、これらが結合している窒素原子と一緒に、窒素原子ならびにそれぞれ N、O、および S からなる群から選択される 0 ~ 3 個の追加のヘテロ原子

20

を含む任意選択で置換された複素環を形成する、

請求項 1 から 10 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 2】

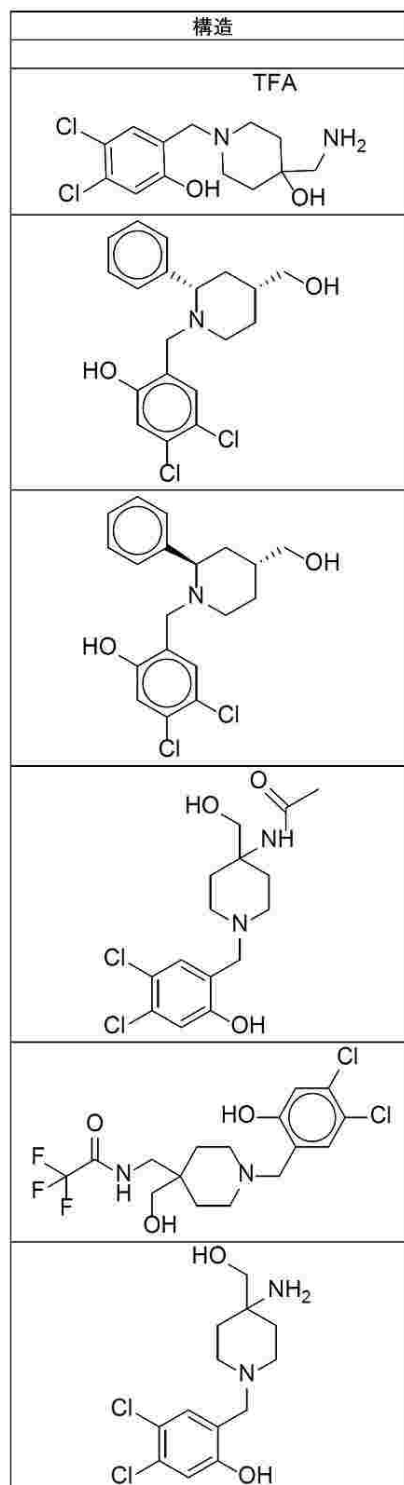
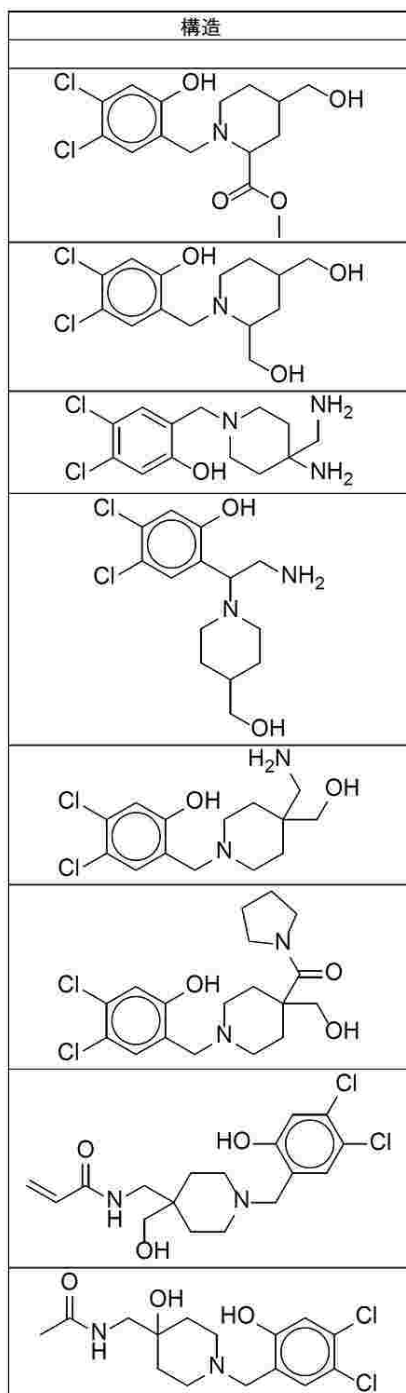
以下に示される化合物からなる群から選択される、化合物またはその薬学的に許容される塩。

30

40

50

【化 1 5】



10

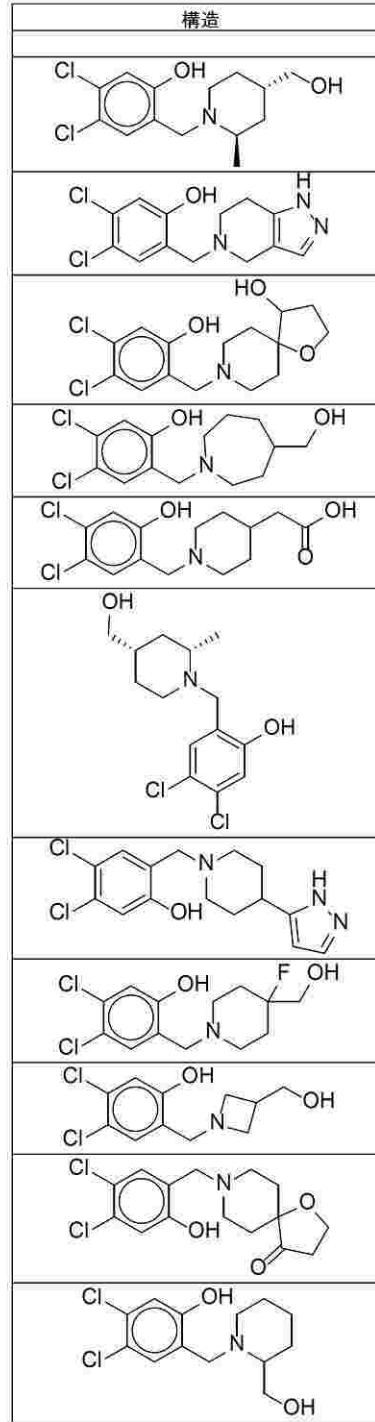
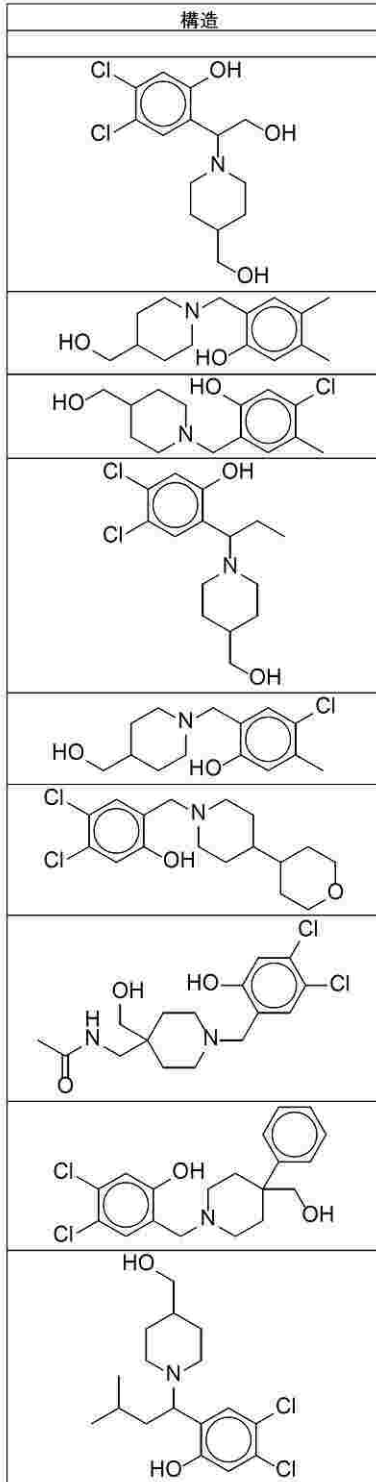
20

30

40

50

【化 1 6】



10

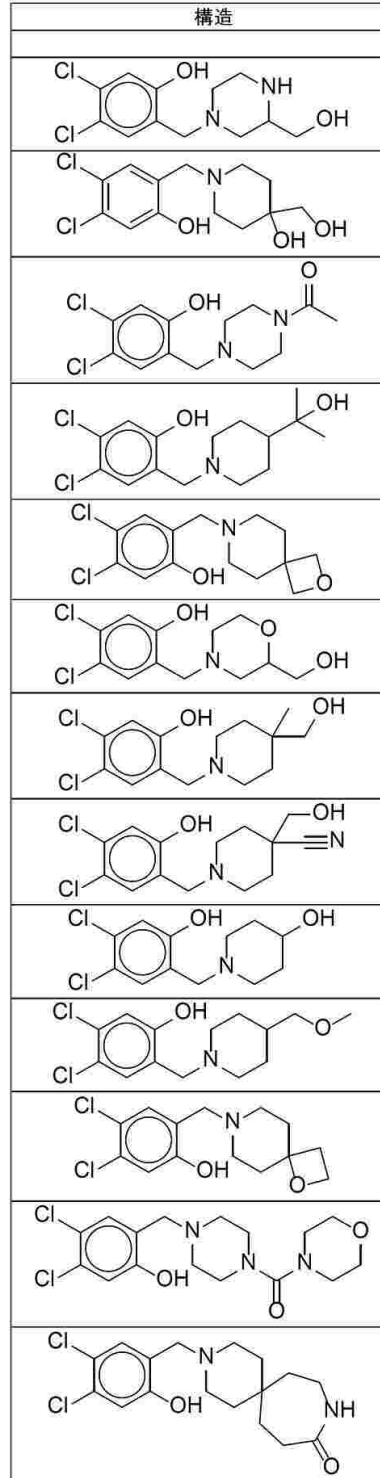
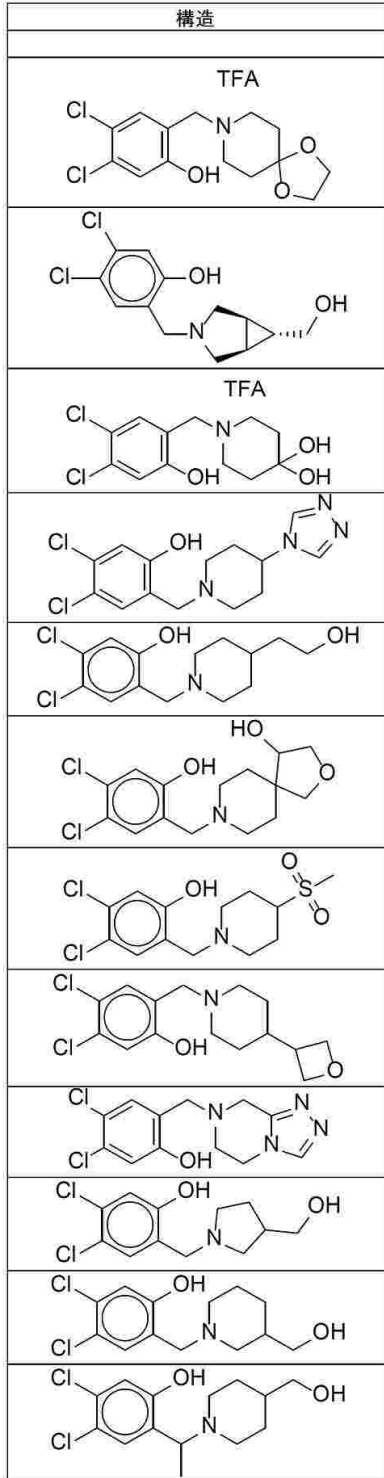
20

30

40

50

【化 1 7】



10

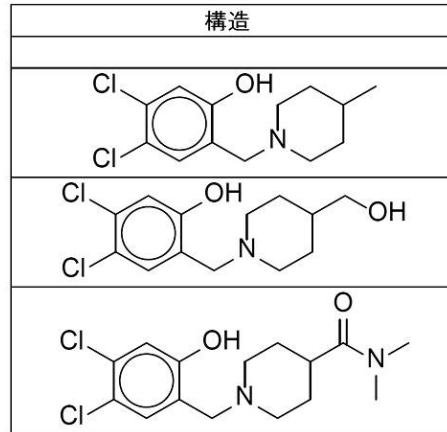
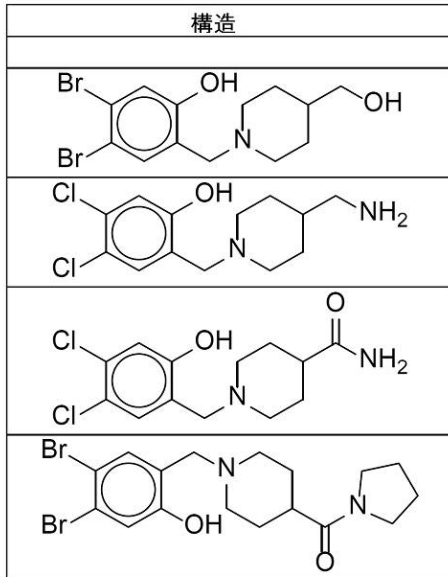
20

30

40

50

【化 1 8】



10

【請求項 1 3】

少なくとも 1 つの請求項 1 から 1 2 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される担体または希釈剤とを含む医薬組成物。

20

【請求項 1 4】

請求項 1 から 1 2 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含む、医薬組成物。

【請求項 1 5】

それを必要とする哺乳動物種の状態を処置する方法における使用のための、請求項 1 から 1 2 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含む、医薬組成物であって、

前記方法が、治療有効量の前記化合物またはその薬学的に許容される塩を前記哺乳動物種に投与するステップを含み、前記状態が、がん、免疫学的障害、中枢神経系 (CNS) 障害、炎症性障害、胃腸病学的障害、代謝障害、心血管障害、および腎臓疾患からなる群から選択され、

30

任意選択で、前記状態が、

(a) 移植片拒絶または自己免疫疾患である免疫学的障害であり、前記自己免疫疾患が、任意選択で、関節リウマチ、多発性硬化症、全身性エリテマトーデス、または I 型糖尿病であるか、

(b) アルツハイマー病である中枢神経系 (CNS) 障害であるか、

(c) 炎症性皮膚状態、関節炎、乾癬、脊椎炎、歯周炎、または炎症性ニューロパチーである炎症性障害であるか、

(d) 炎症性腸疾患である胃腸病学的障害であるか、

40

(e) 肥満または II 型糖尿病である代謝障害であるか、

(f) 虚血性脳卒中である心血管障害であるか、

(g) 慢性腎臓疾患、腎炎、または慢性腎不全である腎臓疾患であるか、または、

(h) がん、移植片拒絶、関節リウマチ、多発性硬化症、全身性エリテマトーデス、I 型糖尿病、アルツハイマー病、炎症性皮膚状態、炎症性ニューロパチー、乾癬、脊椎炎、歯周炎、クローン病、潰瘍性大腸炎、肥満、II 型糖尿病、虚血性脳卒中、慢性腎臓疾患、腎炎、慢性腎不全、およびこれらの組合せからなる群から選択されるものであり、任意選択で、前記哺乳動物種がヒトである、

医薬組成物。

50