

【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】WO2018/032012

【公表番号】特表2019-524814(P2019-524814A)

【公表日】令和1年9月5日(2019.9.5)

【出願番号】特願2019-507271(P2019-507271)

【国際特許分類】

C 0 7 C 2 3 5 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

10

C 0 7 C 2 3 5 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 C 2 3 5 / 1 6 (2 0 0 6 . 0 1)

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

C 0 7 C 2 5 9 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 C 3 0 9 / 1 5 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 C 2 5 5 / 2 9 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 C 2 3 5 / 2 4 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 C 2 4 3 / 2 8 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 C 2 3 5 / 0 8 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 3 0 5 / 0 8 (2 0 0 6 . 0 1)

20

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

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

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

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

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

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

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

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

【 F I 】

C 0 7 C 2 3 5 / 0 6

30

C 0 7 C 2 3 5 / 1 0 C S P

C 0 7 C 2 3 5 / 1 6 A

C 0 7 C 3 1 1 / 4 9

C 0 7 C 2 5 9 / 0 6

C 0 7 C 3 0 9 / 1 5

C 0 7 C 2 5 5 / 2 9

C 0 7 C 2 3 5 / 2 4 Z

C 0 7 C 2 4 3 / 2 8

C 0 7 C 2 3 5 / 0 8

C 0 7 D 3 0 5 / 0 8

40

A 6 1 K 3 1 / 2 7 7

A 6 1 K 3 1 / 3 3 7

A 6 1 P 2 5 / 0 0

A 6 1 K 3 1 / 1 6 4

A 6 1 K 3 1 / 1 6

A 6 1 P 3 7 / 0 2

A 6 1 P 2 1 / 0 2

A 6 1 P 2 5 / 2 8

【誤訳訂正書】

50

【提出日】令和4年6月7日(2022.6.7)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】明細書

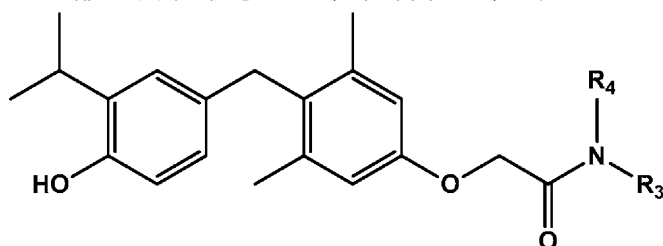
【訂正対象項目名】0013

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0013】

一部の実施形態では、化合物は、式III:



10

の化合物またはその薬学的に許容される塩であり、式中、 R_4 は H 及び C_{1-6} アルキルから選択され、 R_3 は、

(a) H、OH、 NH_2 、 $-NH(C_{1-6}$ アルキル)、 $-N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、 $-SO_2H$ 、 $-SO_2(C_{1-6}$ アルキル)、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、または、O、N 及び S から選択される 1 個のヘテロ原子を含有する 3 ~ 6 員環のヘテロシクリル環、

20

(b) それぞれが OH、ハロゲン、 NH_2 、 $-NH(C_{1-6}$ アルキル)、 $-N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、 $-SO_2H$ 、 $-SO_2(C_{1-6}$ アルキル)、CN、 C_{3-6} シクロアルキル、O、N 及び S から選択される 1 個のヘテロ原子を含有する 3 ~ 6 員環のヘテロシクリル環、または、それぞれが OH、 NO_2 及びハロゲンからなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよい C_{1-6} アルキル、

(c) それぞれが OH、ハロゲン、 NH_2 、 $-NH(C_{1-6}$ アルキル)、 $-N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、 $-SO_2H$ 、 $-SO_2(C_{1-6}$ アルキル)、CN、 C_{3-6} シクロアルキル、O、N 及び S から選択される 1 個のヘテロ原子を含有する 3 ~ 6 員環のヘテロシクリル環、または、それぞれが OH、 NO_2 及びハロゲンからなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよい $-O-C_{1-6}$ アルキル、 または

30

(d) それぞれが OH、 NO_2 及びハロゲンからなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基、 である。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0014

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0014】

一部の実施形態では、化合物は、式IV:

40

50

(d) それぞれが OH、NO₂ 及びハロゲンからなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基、である。

【誤訳訂正 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0016

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0016】

式 IV の化合物の特定の実施形態では、R₃ は、

(a) H、OH、NH₂、-SO₂H、-SO₂(CH₃)、C₂~3 アルケニル、C₂~3 アルキニル、C₃~6 シクロアルキル、1 個の酸素ヘテロ原子を含有する 3~6 員環のヘテロシクリル環、

(b) それぞれが OH、F、NH₂、-SO₂H、-SO₂(CH₃)、CN、C₃~6 シクロアルキル、1 個の酸素ヘテロ原子を含有する 3~6 員環のヘテロシクリル環、または、それぞれが OH、NO₂ 及び F からなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよい C₁~4 アルキル、

(c) それぞれが OH、F、NH₂、-SO₂H、-SO₂(CH₃)、CN、C₃~6 シクロアルキル、1 個の酸素ヘテロ原子を含有する 3~6 員環のヘテロシクリル環、または、それぞれが OH、NO₂ 及び F からなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよい O-C₁~4 アルキル、または、

(d) それぞれが OH、NO₂ 及び F からなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基、である。

【誤訳訂正 5】

【訂正対象書類名】明細書

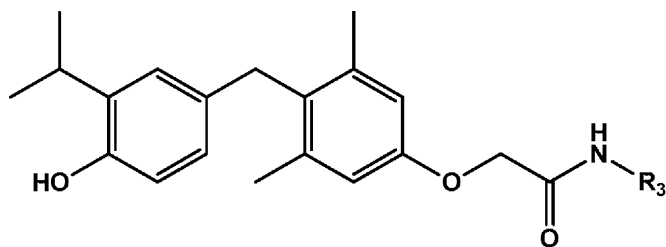
【訂正対象項目名】0021

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0021】

一部の実施形態では、化合物は、式 IV :



式 IV

の化合物またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R₃ は、それぞれが OH、F、NH₂、-SO₂H、-SO₂(CH₃)、CN、C₃~6 シクロアルキル、及び、1 個の酸素ヘテロ原子を含有する 3~6 員環のヘテロシクリル環からなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよい C₁~6 アルキルである。

【誤訳訂正 6】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0022

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0022】

一部の実施形態では、化合物は、式 IV :

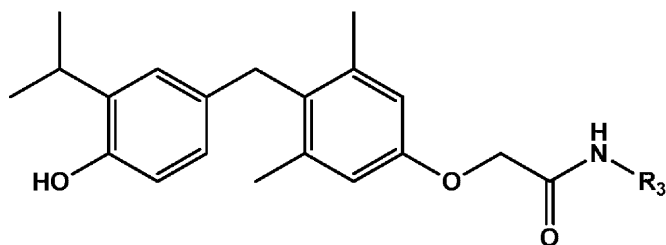
10

20

30

40

50



式 IV

の化合物またはその薬学的に許容される塩であり、式中、 R_3 は、それぞれが OH 、 F 、 NH_2 、 $-SO_2H$ 、 $-SO_2(CH_3)$ 、 CN 、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、及び、1 個の酸素ヘテロ原子を含有する 3 ~ 6 員環のヘテロシクリル環からなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよい $C_1 \sim 4$ アルキルである。

10

【誤訳訂正 7】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0054

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0054】

一部の実施形態では、アルキルアミノは、 X_1 が H または置換されていてもよい $C_1 \sim 6$ アルキルであり、 X_2 が、それぞれが OH 、ハロゲン、 NH_2 、 $-NH(C_1 \sim 6$ アルキル)、 $-N(C_1 \sim 6$ アルキル) $_2$ 、 $-SO_2H$ 、 $-SO_2(C_1 \sim 6$ アルキル)、 CN 、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、 O 、 N 及び S から選択される 1 個のヘテロ原子を含有する 3 ~ 6 員環のヘテロシクリル環、または、それぞれが OH 、 NO_2 及びハロゲンからなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよい $C_1 \sim 6$ アルキルである、構造 $-NX_1X_2$ を有する。

20

【誤訳訂正 8】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0055

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0055】

一部の実施形態では、アルキルアミノは、 X_1 が H または置換されていてもよい $C_1 \sim 6$ アルキルであり、 X_2 が、それぞれが OH 、ハロゲン、 NH_2 、 $-NH(C_1 \sim 6$ アルキル)、 $-N(C_1 \sim 6$ アルキル) $_2$ 、 $-SO_2H$ 、 $-SO_2(C_1 \sim 6$ アルキル)、 CN 、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、 O 、 N 及び S から選択される 1 個のヘテロ原子を含有する 3 ~ 6 員環のヘテロシクリル環、または、それぞれが OH 、 NO_2 及びハロゲンからなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよい $-O-C_1 \sim 6$ アルキルである、構造 $-NX_1X_2$ を有する。

40

【誤訳訂正 9】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

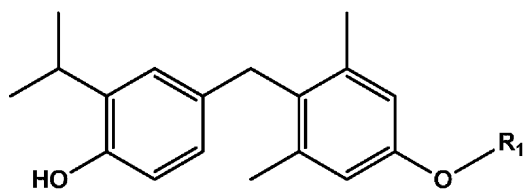
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

50



式 I

の化合物、またはその薬学的に許容される塩であって、

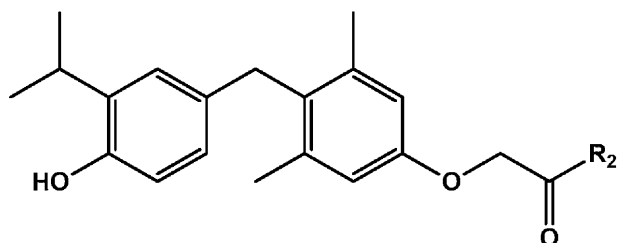
式中、R₁ はアミドである、

前記式 I の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

10

前記化合物が式 I I :



式 II

の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

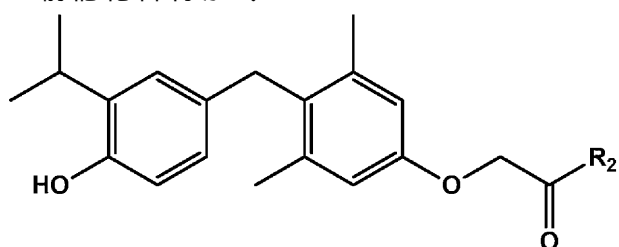
20

式中、R₂ はアルキルアミノである、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

前記化合物が式 I I I :



式 II

30

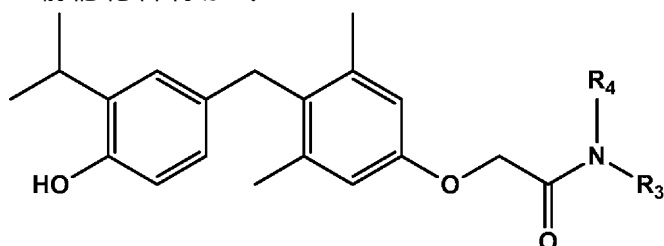
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、R₂ はアミノである、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

前記化合物が式 I I I I :



式 III

40

の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、R₃ 及び R₄ のそれぞれは独立して、H、アルキル、シクロアルキル、置換アルキル、非置換アルキル、ヘテロアルキル、飽和アルキル、不飽和アルキル、アリール、アミノまたはエトキシである、

請求項 1 または請求項 2 に記載の化合物。

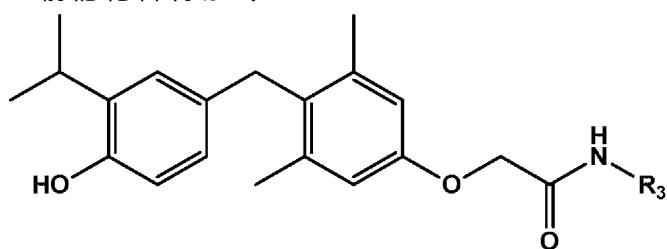
50

【請求項 5】

式中、 R_3 がメチルであり、 R_4 がメチルである、請求項 4 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】

前記化合物が式 I V :



式 IV

10

の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

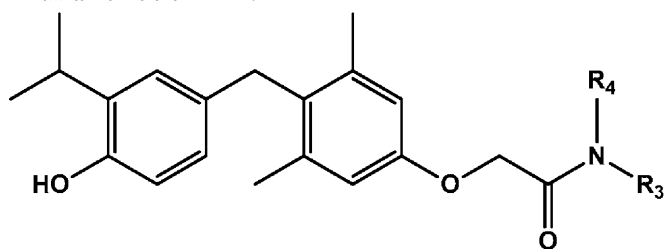
式中、 R_3 は、H、ヒドロキシル、アミノ、メチル、エチル、プロピル、シクロプロピル、2-ヒドロキシエチル、1-ヒドロキシプロパン-2-イル、2-ヒドロキシプロピル、2-アミノエチルアセテート、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、フェニル、(4-ニトロ)フェニル、2-フェニルエチル、2-(2-ヒドロキシフェニル)エチル、2-(3-ヒドロキシフェニル)エチル、2-(3,4-ジヒドロキシフェニル)エチル、3-フルオロエチル、S-メチルスルホニル、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-ヒドロキシエチル、2-プロペニル、2-プロピニル、メトキシ、2-エチルスルホン酸ナトリウム、シアノメチルまたはオキセタンである、

20

請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 7】

前記化合物が式 I I I :



式 III

30

の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、 R_4 は、H 及び $C_1 \sim 6$ アルキルから選択され、

R_3 は、

(a) H、OH、 NH_2 、 $-NH(C_1 \sim 6$ アルキル)、 $-N(C_1 \sim 6$ アルキル) $_2$ 、 $-SO_2H$ 、 $-SO_2(C_1 \sim 6$ アルキル)、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、または、O、N 及び S から選択される 1 個のヘテロ原子を含有する 3 ~ 6 員環のヘテロシクリル環、

40

(b) それぞれが OH、ハロゲン、 NH_2 、 $-NH(C_1 \sim 6$ アルキル)、 $-N(C_1 \sim 6$ アルキル) $_2$ 、 $-SO_2H$ 、 $-SO_2(C_1 \sim 6$ アルキル)、CN、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、O、N 及び S から選択される 1 個のヘテロ原子を含有する 3 ~ 6 員環のヘテロシクリル環、または、それぞれが OH、 NO_2 及びハロゲンからなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよい $C_1 \sim 6$ アルキル、

(c) それぞれが OH、ハロゲン、 NH_2 、 $-NH(C_1 \sim 6$ アルキル)、 $-N(C_1 \sim 6$ アルキル) $_2$ 、 $-SO_2H$ 、 $-SO_2(C_1 \sim 6$ アルキル)、CN、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、O、N 及び S から選択される 1 個のヘテロ原子を含有する 3 ~ 6 員環のヘテロ

50

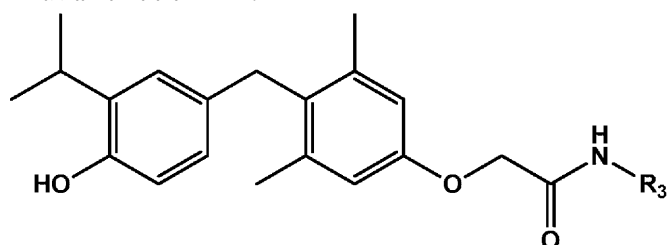
シクリル環、または、それぞれがOH、NO₂及びハロゲンからなる群から独立して選択される1、2または3個の置換基で置換されているフェニル基から独立して選択される1、2または3個の置換基で置換されている-O-C₁~6アルキル、または

(d)それぞれがOH、NO₂及びハロゲンからなる群から独立して選択される1、2または3個の置換基で置換されているフェニル基、
である、

請求項1または請求項2に記載の化合物。

【請求項8】

前記化合物が式IV：



式IV

の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、R₃は、

(a) H、OH、NH₂、-NH(C₁~6アルキル)、-N(C₁~6アルキル)₂、-SO₂H、-SO₂(C₁~6アルキル)、C₂~6アルケニル、C₂~6アルキニル、C₃~6シクロアルキル、または、O、N及びSから選択される1個のヘテロ原子を含有する3~6員環のヘテロシクリル環、

(b)それぞれがOH、ハロゲン、NH₂、-NH(C₁~6アルキル)、-N(C₁~6アルキル)₂、-SO₂H、-SO₂(C₁~6アルキル)、CN、C₃~6シクロアルキル、O、N及びSから選択される1個のヘテロ原子を含有する3~6員環のヘテロシクリル環、または、それぞれがOH、NO₂及びハロゲンからなる群から独立して選択される1、2または3個の置換基で置換されているフェニル基から独立して選択される1、2または3個の置換基で置換されているC₁~6アルキル、

(c)それぞれがOH、ハロゲン、NH₂、-NH(C₁~6アルキル)、-N(C₁~6アルキル)₂、-SO₂H、-SO₂(C₁~6アルキル)、CN、C₃~6シクロアルキル、O、N及びSから選択される1個のヘテロ原子を含有する3~6員環のヘテロシクリル環、または、それぞれがOH、NO₂及びハロゲンからなる群から独立して選択される1、2または3個の置換基で置換されているフェニル基から独立して選択される1、2または3個の置換基で置換されている-O-C₁~6アルキル、または

(d)それぞれがOH、NO₂及びハロゲンからなる群から独立して選択される1、2または3個の置換基で置換されているフェニル基、
である、

請求項7に記載の化合物。

【請求項9】

式中、R₃が、

(a) H、OH、NH₂、-SO₂H、-SO₂(C₁~3アルキル)、C₂~3アルケニル、C₂~3アルキニル、C₃~6シクロアルキル、O、N及びSから選択される1個のヘテロ原子を含有する3~6員環のヘテロシクリル環、

(b)それぞれがOH、ハロゲン、NH₂、-NH(C₁~6アルキル)、-N(C₁~6アルキル)₂、-SO₂H、-SO₂(C₁~3アルキル)、CN、C₃~6シクロアルキル、O、N及びSから選択される1個のヘテロ原子を含有する3~6員環のヘテロシクリル環、または、それぞれがOH、NO₂及びハロゲンからなる群から独立して選択

10

20

30

40

50

される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよい C₁ ~ 4 アルキル、

(c) それぞれが OH、ハロゲン、NH₂、-NH(C₁ ~ 6 アルキル)、-N(C₁ ~ 6 アルキル)₂、-SO₂H、-SO₂(C₁ ~ 6 アルキル)、CN、C₃ ~ 6 シクロアルキル、O、N 及び S から選択される 1 個のヘテロ原子を含有する 3 ~ 6 員環のヘテロシクリル環、または、それぞれが OH、NO₂ 及びハロゲンからなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよい -O-C₁ ~ 4 アルキル、または

(d) それぞれが OH、NO₂ 及びハロゲンからなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基、
である、

請求項 7 または 請求項 8 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】

式中、R₃ が、

(a) H、OH、NH₂、-SO₂H、-SO₂(CH₃)、C₂ ~ 3 アルケニル、C₂ ~ 3 アルキニル、C₃ ~ 6 シクロアルキル、1 個の酸素ヘテロ原子を含有する 3 ~ 6 員環のヘテロシクリル環、

(b) それぞれが OH、F、NH₂、-SO₂H、-SO₂(CH₃)、CN、C₃ ~ 6 シクロアルキル、1 個の酸素ヘテロ原子を含有する 3 ~ 6 員環のヘテロシクリル環、または、それぞれが OH、NO₂ 及び F からなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよい C₁ ~ 4 アルキル、

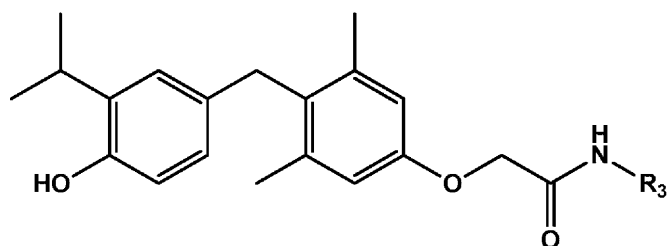
(c) それぞれが OH、F、NH₂、-SO₂H、-SO₂(CH₃)、CN、C₃ ~ 6 シクロアルキル、1 個の酸素ヘテロ原子を含有する 3 ~ 6 員環のヘテロシクリル環、または、それぞれが OH、NO₂ 及び F からなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよい -O-C₁ ~ 4 アルキル、または、

(d) それぞれが OH、NO₂ 及び F からなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基、
である、

請求項 7 ~ 9 のいずれか 1 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 11】

前記化合物が、式 IV :



式 IV

の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、R₃ は -(CH₂)ⁿ⁻¹-フェニルであり、式中、n¹ は 0、1、2、3 または 4 から選択される整数であり、フェニル環は、それぞれが OH、NO₂ 及びハロゲンからなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されていてもよい、請求項 1、請求項 2、請求項 4 及び請求項 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 12】

前記化合物が、式 IV :

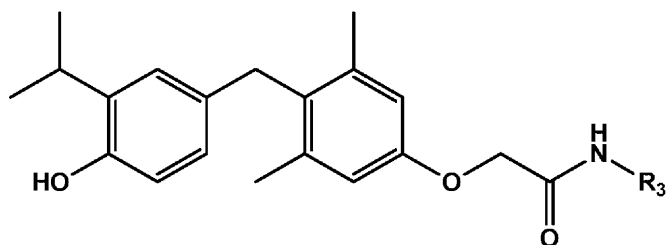
10

20

30

40

50



式IV

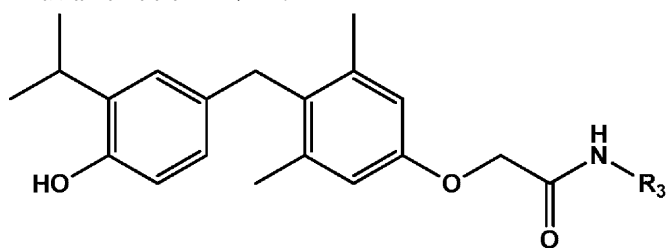
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、R₃は-(CH₂)ⁿ-フェニルであり、式中、nは0、1または2から選
 択される整数であり、前記フェニル環は、それぞれがOH、NO₂及びハロゲンからなる
 群から独立して選択される1、2または3個の置換基で置換されていてもよい、
 請求項1、請求項2、請求項4及び請求項7のいずれか1項に記載の化合物。

10

【請求項13】

前記化合物が、式IV：



式IV

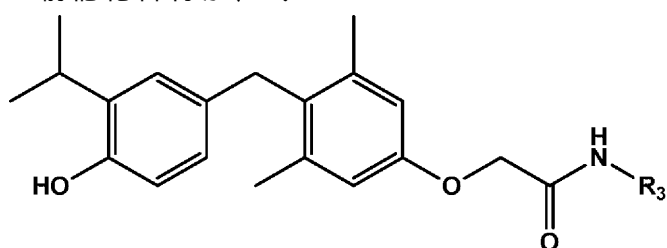
20

の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、R₃は-(CH₂)ⁿ-フェニルであり、式中、nは0、1または2から選
 択される整数であり、前記フェニル環は、それぞれがOH、NO₂及びFからなる群から
 独立して選択される1、2または3個の置換基で置換されていてもよい、
 請求項1、請求項2、請求項4及び請求項7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項14】

前記化合物が、式IV：



式IV

30

の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

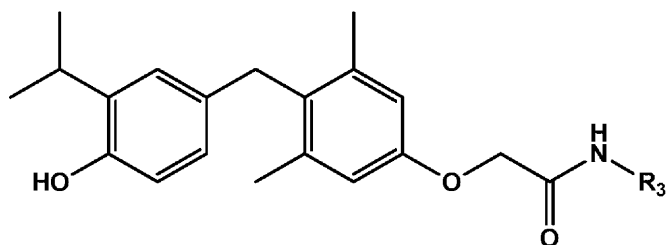
式中、R₃は-(CH₂)-フェニルであり、式中、前記フェニル環は、それぞれがO
 H、NO₂及びFからなる群から独立して選択される1、2または3個の置換基で置換さ
 れていてもよい、
 請求項1、請求項2、請求項4及び請求項7のいずれか1項に記載の化合物。

40

【請求項15】

前記化合物が、式IV：

50



式 IV

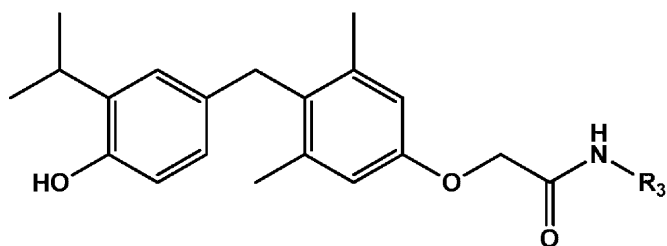
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、 R_3 は、それぞれが OH 、 F 、 NH_2 、 $-SO_2H$ 、 $-SO_2(CH_3)$ 、 CN 、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、及び、1個の酸素ヘテロ原子を含有する3～6員環のヘテロシクリル環からなる群から独立して選択される1、2または3個の置換基で置換されていてもよい $C_1 \sim 6$ アルキルである、

請求項1、請求項2、請求項4及び請求項7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項16】

前記化合物が、式IV：



式 IV

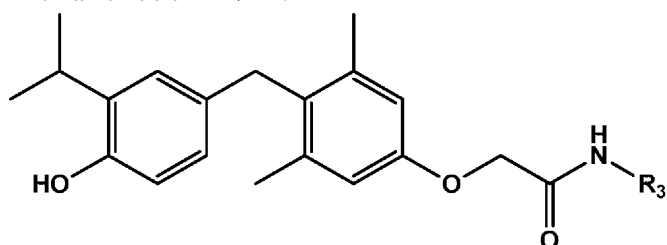
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、 R_3 は、それぞれが OH 、 F 、 NH_2 、 $-SO_2H$ 、 $-SO_2(CH_3)$ 、 CN 、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、及び、1個の酸素ヘテロ原子を含有する3～6員環のヘテロシクリル環からなる群から独立して選択される1、2または3個の置換基で置換されていてもよい $C_1 \sim 4$ アルキルである、

請求項1、請求項2、請求項4及び請求項7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項17】

前記化合物が、式IV：



式 IV

の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、 R_3 は、それぞれが OH 、 F 、 NH_2 、 CN 、 $-SO_2H$ 及び $-SO_2(C_1 \sim 6$ アルキル) からなる群から独立して選択される1、2または3個の置換基で置換されていてもよい $C_1 \sim 6$ アルキルである、

請求項1、請求項2、請求項4及び請求項7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項18】

前記化合物が、式IV：

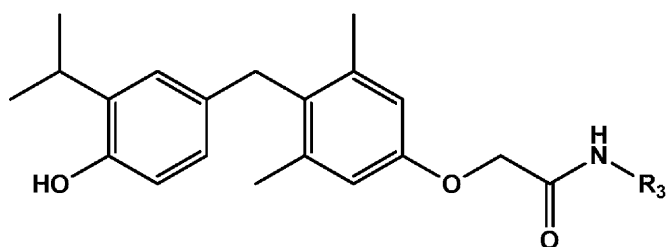
10

20

30

40

50



式 IV

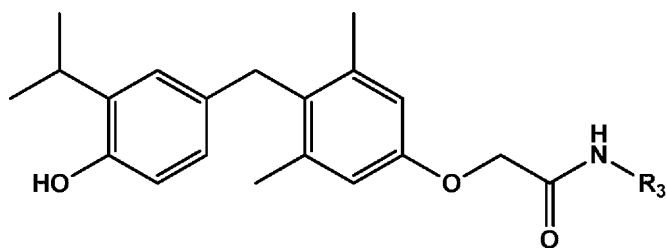
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、R₃は、1、2または3個のOH置換基で置換されていてもよいC₁~6アルキルである、

請求項1、請求項2、請求項4及び請求項7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項19】

前記化合物が、式IV：



式 IV

20

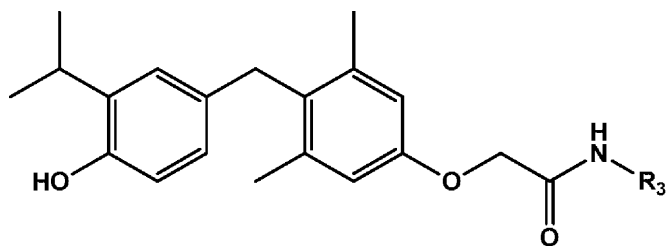
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、R₃は、1、2または3個のOH置換基で置換されていてもよいC₁~4アルキルである、

請求項1、請求項2、請求項4及び請求項7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項20】

前記化合物が、式IV：



式 IV

30

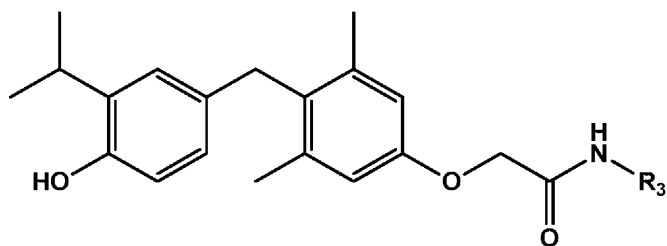
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、R₃は、1、2または3個のF置換基で置換されていてもよいC₁~6アルキルである、

請求項1、請求項2、請求項4及び請求項7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項21】

前記化合物が、式IV：



式 IV

50

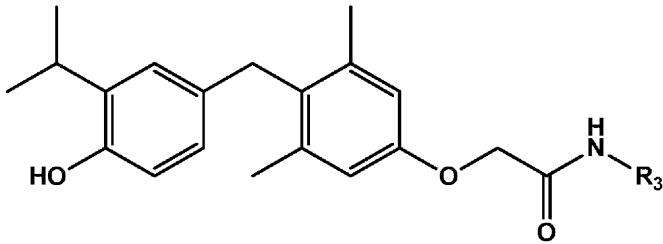
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、 R_3 は、1、2または3個のF置換基で置換されていてもよいC₁~4アルキルである、

請求項1、請求項2、請求項4及び請求項7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項22】

前記化合物が、式IV：



式IV

10

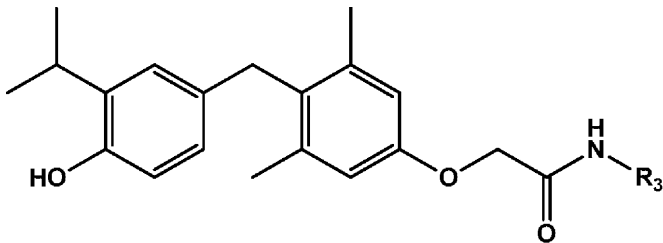
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、 R_3 は、1、2または3個のF置換基で置換されていてもよい-O-C₁~6アルキルである、

請求項1、請求項2、請求項4及び請求項7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項23】

前記化合物が、式IV：



式IV

20

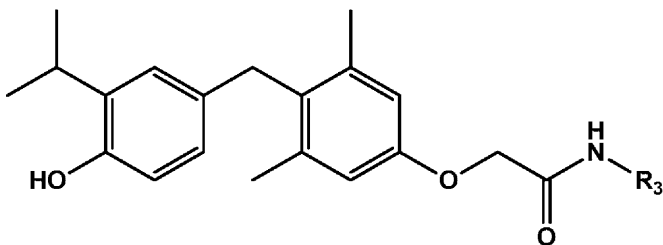
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、 R_3 は、1、2または3個のF置換基で置換されていてもよい-O-C₁~4アルキルである、

請求項1、請求項2、請求項4及び請求項7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項24】

前記化合物が、式IV：



式IV

30

40

の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

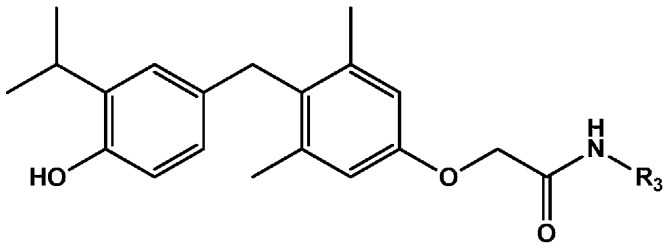
式中、 R_3 は-O-C₁~6アルキルである、

請求項1、請求項2、請求項4及び請求項7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項25】

前記化合物が、式IV：

50



式 IV

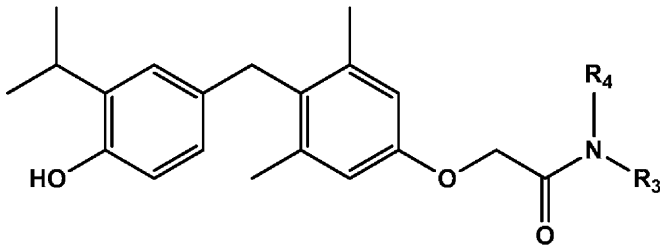
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、 R_3 は -O-C₁~4 アルキルである、

請求項 1、請求項 2、請求項 4 及び請求項 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 26】

前記化合物が、式 III :



式 III

の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、 R_3 及び R_4 のそれぞれは独立して、H、置換脂肪族、非置換脂肪族、置換フェニル、非置換フェニル、 OR_{N1} 、 $-N(R_{N1})_2$ または $-SO_2(R_{N2})$ であり、

式中、それぞれの R_{N1} は独立して、H、置換脂肪族または非置換脂肪族であり、 R_{N2} は、OH、非置換脂肪族または置換脂肪族であり、

一方の R_N が OR_{N1} 、 $-N(R_{N1})_2$ または $-SO_2(R_{N2})$ である場合、もう一方の R_N は H、置換脂肪族、非置換脂肪族、置換フェニルまたは非置換フェニルである、

請求項 1 または請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 27】

式中、 R_3 が H または非置換脂肪族である、請求項 26 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 28】

式中、 R_4 が H、置換脂肪族または非置換脂肪族である、請求項 26 または請求項 27 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 29】

式中、 R_3 がメチルである、請求項 27 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 30】

式中、 R_4 がメチルである、請求項 26 ~ 29 のいずれか 1 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 31】

以下：

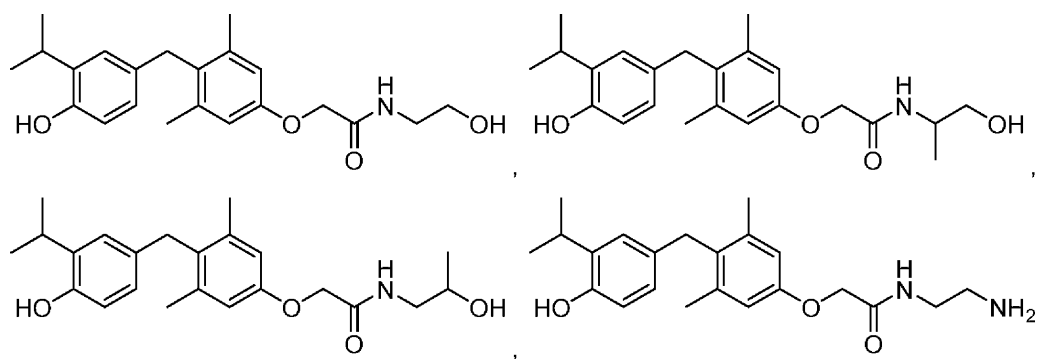
10

20

30

40

50



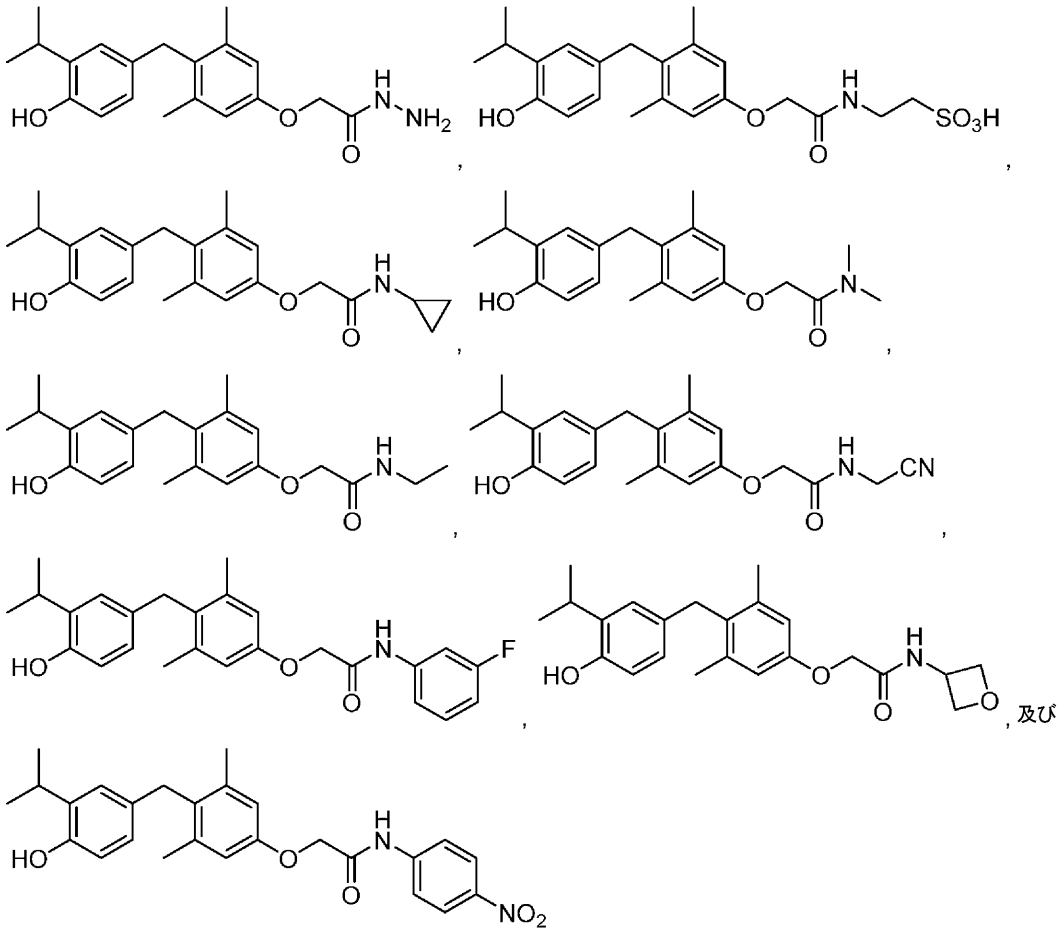
10

20

30

40

50



10

20

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。

【請求項 3 2】

前記化合物が、以下：

- 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) - N - (2 - ヒドロキシエチル) アセトアミド、 30
- 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) - N - (1 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) アセトアミド、
- 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) - N - (2 - ヒドロキシプロピル) アセトアミド、
- 2 - (2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) アセトアミド) エタン - 1 - アミニウムアセテート、
- 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) アセトアミド、
- N - (2 , 2 - ジフルオロエチル) - 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) アセトアミド、 40
- 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) - N - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) アセトアミド、
- 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) - N - メチルアセトアミド、
- 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) - N - (2 - ヒドロキシフェニル) アセトアミド、
- 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - N - (3 - ヒドロキシフェニル) アセトアミド、
- 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノ 50

- キシ) - N - (2 - (メチルスルホンアミド) エチル) アセトアミド、
 N - (1 , 3 - ジヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) アセトアミド、
 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) - N - プロピルアセトアミド、
 N - (2 - フルオロエチル) - 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) アセトアミド、
 N - アリル - 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) アセトアミド、
 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) - N - (プロパ - 2 - イン - 1 - イル) アセトアミド、
 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) - N - メトキシアセトアミド、
 N - (3 , 4 - ジヒドロキシフェネチル) - 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) アセトアミド、
 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) - N - フェネチルアセトアミド、
 N - ヒドロキシ - 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) アセトアミド、
 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) アセトヒドラジド、
 2 - (2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) アセトアミド) エタン - 1 - スルホネート、
 N - シクロプロピル - 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) アセトアミド、
 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) - N , N - ジメチルアセトアミド、
 N - エチル - 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) アセトアミド、
 N - (シアノメチル) - 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) アセトアミド、
 N - (3 - フルオロフェニル) - 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) アセトアミド、
 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) - N - (オキセタン - 3 - イル) アセトアミド、及び、
 2 - (4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピルベンジル) - 3 , 5 - ジメチルフェノキシ) - N - (4 - ニトロフェニル) アセトアミド、またはその薬学的に許容される塩、からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。
- 【請求項 3 3】
 薬学的有効量の、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩と、1 種または複数種の薬学的に許容される担体とを含む、医薬組成物。 40
- 【請求項 3 4】
 神経変性疾患を有する対象を治療する方法であって、薬学的有効量の、請求項 1 ~ 3 2 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその薬学的に許容される塩または請求項 6 に記載の医薬組成物を前記対象に投与することにより、前記神経変性疾患を治療することを含む、前記方法。
- 【請求項 3 5】
 前記神経変性疾患が脱髄性疾患である、請求項 3 4 に記載の方法。
- 【請求項 3 6】
 前記神経変性疾患が、X 連鎖副腎白質ジストロフィーまたは多発性硬化症である、請求 50

項 3 4 または 請求項 3 5 に記載の方法。

【請求項 3 7】

前記神経変性疾患が、急性散在性脳脊髄炎、急性出血性白質脳炎、成人レフサム病、アレキサンダー病、アルツハイマー病、バロー同心円硬化症、カナバン病、橋中央ミエリン溶解、脳性麻痺、脳腱黄色腫症、慢性炎症性脱髄性多発ニューロパチー、デビック症候群、びまん性ミエリン破壊性硬化症、ギランバレー症候群、特発性炎症性脱髄性疾患、乳児レフサム病、クラッペ病、レーパー遺伝性視神経症、マールブルグ多発性硬化症、マルキアファーヴァビニャミ病、異染性白質ジストロフィー、多巣性運動ニューロパチー、異常タンパク性脱髄性多発ニューロパチー、ペリツェウスメルツバッハー病、腓骨筋萎縮症、進行性多巣性白質脳症、横断性脊髄炎、熱帯性痙性不全対麻痺、van der Knaap病、X連鎖副腎白質ジストロフィー及びツェルヴェーガー症候群からなる群から選択される、請求項 3 4 ~ 3 6 のいずれか 1 項に記載の方法。

10

【請求項 3 8】

アルツハイマー病を有する対象を治療する方法であって、薬学的有効量の、請求項 1 ~ 3 2 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその薬学的に許容される塩または請求項 3 3 に記載の医薬組成物を前記対象に投与することにより、前記アルツハイマー病を治療することを含む、前記方法。

【請求項 3 9】

急性散在性脳脊髄炎 (A D E M)、急性出血性白質脳炎 (A H L または A H L E)、成人レフサム病、乳児レフサム病、アレキサンダー病、アルツハイマー病、バロー同心円硬化症、カナバン病、橋中央ミエリン溶解 (C P M)、脳性麻痺、脳腱黄色腫症、慢性炎症性脱髄性多発ニューロパチー (C I D P)、デビック症候群、びまん性ミエリン破壊性硬化症、脳脊髄炎、ギランバレー症候群、特発性炎症性脱髄性疾患 (I I D D)、クラッペ病、レーパー遺伝性視神経症、白質ジストロフィー、マールブルグ多発性硬化症、マルキアファーヴァビニャミ病、異染性白質ジストロフィー (M L D)、多巣性運動ニューロパチー (M M N)、多発性硬化症 (M S)、異常タンパク性脱髄性多発ニューロパチー、ペリツェウスメルツバッハー病 (P M D)、進行性多巣性白質脳症 (P M L)、熱帯性痙性不全対麻痺 (T S P)、X連鎖副腎白質ジストロフィー (X - A L D、A L D または X 連鎖 A L D) 及びツェルヴェーガーからなる群から選択される疾患または症状を有する対象を治療する方法であって、薬学的有効量の、請求項 1 ~ 3 2 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその薬学的に許容される塩または請求項 3 3 に記載の医薬組成物を前記対象に投与することにより、前記疾患または症状を治療することを含む、前記方法。

20

30

【請求項 4 0】

神経変性疾患の治療に使用するための、請求項 1 ~ 3 2 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその薬学的に許容される塩または請求項 3 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 1】

前記神経変性疾患が脱髄性疾患である、請求項 4 0 に記載の使用のための化合物もしくはその薬学的に許容される塩または医薬組成物。

【請求項 4 2】

前記神経変性疾患が X 連鎖副腎白質ジストロフィーまたは多発性硬化症である、請求項 4 0 または請求項 4 1 に記載の使用のための化合物もしくはその薬学的に許容される塩または医薬組成物。

40

【請求項 4 3】

前記神経変性疾患が、急性散在性脳脊髄炎、急性出血性白質脳炎、成人レフサム病、アレキサンダー病、アルツハイマー病、バロー同心円硬化症、カナバン病、橋中央ミエリン溶解、脳性麻痺、脳腱黄色腫症、慢性炎症性脱髄性多発ニューロパチー、デビック症候群、びまん性ミエリン破壊性硬化症、ギランバレー症候群、特発性炎症性脱髄性疾患、乳児レフサム病、クラッペ病、レーパー遺伝性視神経症、マールブルグ多発性硬化症、マルキアファーヴァビニャミ病、異染性白質ジストロフィー、多巣性運動ニューロパチー、異常タンパク性脱髄性多発ニューロパチー、ペリツェウスメルツバッハー病、腓骨筋萎縮症、

50

進行性多巣性白質脳症、横断性脊髄炎、熱帯性瘧性不全対麻痺、van der Knaap病、X連鎖副腎白質ジストロフィー及びツェルヴェーガー症候群からなる群から選択される、請求項40に記載の使用のための化合物もしくはその薬学的に許容される塩または医薬組成物。

【請求項44】

アルツハイマー病の治療に使用するための、請求項1～32のいずれか1項に記載の化合物もしくはその薬学的に許容される塩または請求項33に記載の医薬組成物。

【請求項45】

急性散在性脳脊髄炎(ADEM)、急性出血性白質脳炎(AHLまたはAHLE)、成人レフサム病、乳児レフサム病、アレキサンダー病、アルツハイマー病、パロー同心円硬化症、カナバン病、橋中央ミエリン溶解(CPM)、脳性麻痺、脳髄黄色腫症、慢性炎症性脱髄性多発ニューロパチー(CIDP)、デビック症候群、びまん性ミエリン破壊性硬化症、脳脊髄炎、ギランバレー症候群、特発性炎症性脱髄性疾患(IIDD)、クラッペ病、レーバー遺伝性視神経症、白質ジストロフィー、マールブルグ多発性硬化症、マルキアファーヴァビニヤミ病、異染性白質ジストロフィー(MLD)、多巣性運動ニューロパチー(MMN)、多発性硬化症(MS)、異常タンパク性脱髄性多発ニューロパチー、ペリツェウスメルツバッハー病(PMD)、進行性多巣性白質脳症(PML)、熱帯性瘧性不全対麻痺(TSP)、X連鎖副腎白質ジストロフィー(X-ALD、ALDまたはX連鎖ALD)及びツェルヴェーガー症候群からなる群から選択される疾患または症状の治療に使用するための、請求項1～32のいずれか1項に記載の化合物もしくはその薬学的に許容される塩または請求項33に記載の医薬組成物。

10

20

30

40

50