

【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1年6月20日(2019.6.20)

【公表番号】特表2018-515572(P2018-515572A)

【公表日】平成30年6月14日(2018.6.14)

【年通号数】公開・登録公報2018-022

【出願番号】特願2017-560759(P2017-560759)

【国際特許分類】

C 0 7 D	413/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/538	(2006.01)
A 6 1 P	1/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	1/18	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D	413/12
A 6 1 K	31/538
A 6 1 P	1/00
A 6 1 P	1/16
A 6 1 P	1/18
A 6 1 P	9/00
A 6 1 P	13/12
A 6 1 P	11/00
A 6 1 P	17/02
A 6 1 P	25/00
A 6 1 P	25/16
A 6 1 P	25/14
A 6 1 P	25/24
A 6 1 P	25/28
A 6 1 P	31/04
A 6 1 P	29/00
A 6 1 P	43/00

1 1 1

【手続補正書】

【提出日】令和1年5月15日(2019.5.15)

【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

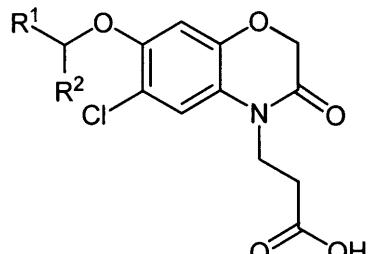
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式(I)の化合物またはその塩：

【化1】



(I)

(式中、

R<sup>1</sup>は、メチル、エチル、ハロ、または=Oにより置換されていてもよいヘテロアリールであり、かつ

R<sup>2</sup>は、H、メチル、またはエチルである)。

【請求項2】

R<sup>1</sup>は、オキサゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、およびイミダゾリルからなる群から選択され、ここでオキサゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、およびピリダジニルは、メチル、エチル、クロロ、またはフルオロにより置換されていてもよい、請求項1に記載の化合物またはその塩。

【請求項3】

R<sup>1</sup>は、エチル、メチル、クロロ、またはフルオロにより置換されていてもよいピリジニルである、請求項1または2に記載の化合物またはその塩。

【請求項4】

R<sup>2</sup>はエチルである、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

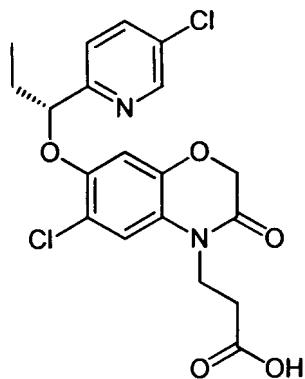
【請求項5】

下記からなるリストから選択される化合物またはその塩：

(3 - (6 - クロロ - 7 - (1 - (5 - クロロピリジン - 2 - イル) プロポキシ) - 3 - オキソ - 2 H - ベンゾ [b] [1, 4] オキサジン - 4 (3 H) - イル) プロパン酸；  
 3 - {6 - クロロ - 3 - オキソ - 7 - [1 - (ピリジン - 2 - イル) エトキシ] - 3 ,  
 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル} プロパン酸；  
 3 - {6 - クロロ - 7 - [1 - (2 - メチル - 1 , 3 - オキサゾール - 5 - イル) エト  
 キシ] - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル} プロパン酸；  
 3 - {6 - クロロ - 7 - [1 - (1 , 3 - オキサゾール - 2 - イル) エトキシ] - 3 -  
 オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル} プロパン酸；  
 3 - {6 - クロロ - 7 - [1 - (1 H - イミダゾール - 2 - イル) エトキシ] - 3 - オ  
 キソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル} プロパン酸；  
 3 - {6 - クロロ - 3 - オキソ - 7 - [1 - (ピリミジン - 2 - イル) エトキシ] - 3  
 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル} プロパン酸；  
 3 - [6 - クロロ - 3 - オキソ - 7 - (ピリジン - 2 - イルメトキシ) - 3 , 4 - ジヒ  
 ドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル] プロパン酸；  
 3 - {6 - クロロ - 7 - [1 - (5 - メチルピリジン - 2 - イル) エトキシ] - 3 - オ  
 キソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル} プロパン酸；  
 3 - {6 - クロロ - 7 - [1 - (5 - クロロピリジン - 2 - イル) エトキシ] - 3 - オ

キソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル } プロパン酸 ;  
 3 - { 6 - クロロ - 7 - [ 1 - ( 5 - フルオロピリジン - 2 - イル ) エトキシ ] - 3 -  
 オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル } プロパン酸 ;  
 3 - ( 6 - クロロ - 3 - オキソ - 7 - [ 1 - ( ピリダジン - 3 - イル ) エトキシ ] - 3  
 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル } プロパン酸 ;  
 3 - { 6 - クロロ - 7 - [ ( 6 - メチルピリダジン - 3 - イル ) メトキシ ] - 3 - オキ  
 ソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル } プロパン酸 ;  
 3 - ( 6 - クロロ - 7 - [ 1 - ( 6 - メチルピリダジン - 3 - イル ) エトキシ ] - 3 -  
 オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル } プロパン酸 ;  
 3 - { 6 - クロロ - 7 - [ 1 - ( 5 - メチルピリジン - 2 - イル ) プロポキシ ] - 3 -  
 オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル } プロパン酸 ;  
 3 - { 6 - クロロ - 3 - オキソ - 7 - [ 1 - ( ピリジン - 2 - イル ) プロポキシ ] - 3  
 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル } プロパン酸 ;  
 3 - { 6 - クロロ - 7 - [ ( 5 - クロロピリジン - 2 - イル ) メトキシ ] - 3 - オキソ  
 - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル } プロパン酸 ;  
 3 - { 6 - クロロ - 7 - [ ( 5 - メチルピリジン - 2 - イル ) メトキシ ] - 3 - オキソ  
 - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル } プロパン酸 ;  
 3 - { 6 - クロロ - 7 - [ 1 - ( 5 - エチルピリジン - 2 - イル ) エトキシ ] - 3 - オ  
 キソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル } プロパン酸 ;  
 3 - { 6 - クロロ - 3 - オキソ - 7 - [ 1 - ( ピリミジン - 2 - イル ) プロポキシ ] -  
 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル } プロパン酸 ;  
 3 - { 6 - クロロ - 7 - [ 1 - ( 5 - メチルピリミジン - 2 - イル ) プロポキシ ] - 3  
 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル } プロパン酸  
 ;  
 3 - { 6 - クロロ - 7 - [ 1 - ( 5 - クロロピリミジン - 2 - イル ) プロポキシ ] - 3  
 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル } プロパン酸  
 ;  
 3 - { 6 - クロロ - 3 - オキソ - 7 - [ 1 - ( ピリダジン - 3 - イル ) プロポキシ ] -  
 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル } プロパン酸 ;  
 および  
 3 - { 6 - クロロ - 7 - [ 1 - ( 6 - メチルピリダジン - 3 - イル ) プロポキシ ] - 3  
 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 4 - イル } プロパン酸  
 。  
**【請求項 6】**  
 下記式の ( R ) - 3 - ( 6 - クロロ - 7 - ( 1 - ( 5 - クロロピリジン - 2 - イル ) プ  
 ロポキシ ) - 3 - オキソ - 2 H - ベンゾ [ b ] [ 1 , 4 ] オキサジン - 4 ( 3 H ) - イル  
 ) プロパン酸である、化合物またはその塩 :

## 【化2】



## 【請求項7】

遊離酸としての、請求項6に記載の化合物。

## 【請求項8】

請求項1～6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可能な塩。

## 【請求項9】

a) 請求項1～7のいずれか一項に記載の治療的に有効な量の化合物またはその薬学的に許容可能な塩、およびb) 薬学的に許容可能な賦形剤を含んでなる、医薬組成物。

## 【請求項10】

KMOによって媒介される症状または障害の処置に用いられる、請求項9に記載の医薬組成物。

## 【請求項11】

急性膵炎、慢性腎疾患、急性腎疾患、急性腎傷害、全身性炎症反応症候群（SIRS）に関連する他の症状、ハンチントン病、アルツハイマー病、脊髄小脳失調症、パーキンソン病、AIDS痴呆合併症、HIV感染症、筋萎縮性側索硬化症（ALS）、うつ病、統合失調症、敗血症、心血管系ショック、重篤な外傷、急性肺傷害、急性呼吸窮迫症候群、急性胆囊炎、重症熱傷、肺炎、広範囲にわたる外科手術、虚血性腸疾患、重篤な急性肝疾患、重篤な急性肝性脳症、または急性腎不全の処置に用いられる、請求項9に記載の医薬組成物。

## 【請求項12】

KMOによって媒介される症状または障害の処置用の医薬の製造における、請求項1～7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可能な塩の使用。

## 【請求項13】

急性膵炎、慢性腎疾患、急性腎疾患、急性腎傷害、全身性炎症反応症候群（SIRS）に関連する他の症状、ハンチントン病、アルツハイマー病、脊髄小脳失調症、パーキンソン病、AIDS痴呆合併症、HIV感染症、筋萎縮性側索硬化症（ALS）、うつ病、統合失調症、敗血症、心血管系ショック、重篤な外傷、急性肺傷害、急性呼吸窮迫症候群、急性胆囊炎、重症熱傷、肺炎、広範囲にわたる外科手術、虚血性腸疾患、重篤な急性肝疾患、重篤な急性肝性脳症、または急性腎不全の処置用の医薬の製造における、請求項1～7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可能な塩の使用。