

【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24日(2022.6.24)

【国際公開番号】WO2019/243822

【公表番号】特表2021-533085(P2021-533085A)

【公表日】令和3年12月2日(2021.12.2)

【出願番号】特願2020-571480(P2020-571480)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 0 1 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1) 10

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

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

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

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

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

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

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

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

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

A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1) 20

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

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

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

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

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

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

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

A 6 1 P 3 / 0 8 (2 0 0 6 . 0 1)

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

【 F I 】 30

C 0 7 D 4 0 1 / 1 4 C S P

A 6 1 K 3 1 / 5 0 6

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 1 3

C 0 7 D 4 0 3 / 0 4

C 0 7 D 4 1 7 / 1 4

C 0 7 D 4 1 7 / 0 4

A 6 1 K 3 1 / 4 3 7 5

A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 9

A 6 1 K 3 1 / 4 2 7

A 6 1 K 3 1 / 4 7 0 9

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 4 40

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 P 1 7 / 0 2

A 6 1 P 3 1 / 2 2

A 6 1 P 3 1 / 1 2

A 6 1 P 1 7 / 0 0

A 6 1 P 1 1 / 0 0

A 6 1 P 1 3 / 1 2

A 6 1 P 3 / 0 8 50

A 6 1 P 3 / 0 0

【手続補正書】

【提出日】令和4年6月16日(2022.6.16)

【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】

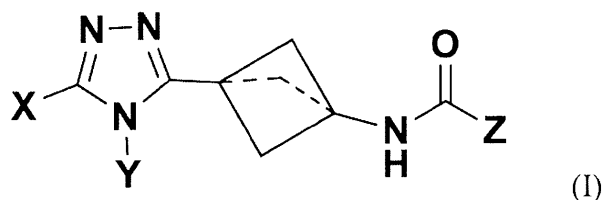
【特許請求の範囲】

10

【請求項1】

一般式(I)の化合物であって、

【化233】



20

式中、

破線が、任意の結合を示し、

Xが、

- ハロゲン(すなわち、F、Cl、Br、I)、C₁-6アルキル(例えば、C₁-3アルキル)、C₁-6ハロアルキル(例えば、C₁-3ハロアルキル)、C₁-6アルコキシ(例えば、C₁-3アルコキシ)、-CN、-NO₂、-N(R)₂、および-SO₂R(式中、各Rが独立して、HまたはC₁-6アルキル、例えば、HまたはC₁-3アルキルである)から独立して選択される1つ以上(例えば、1つ、2つ、または3つ)の置換基によって任意に置換された5員または6員の不飽和複素環基、

- C₁-6アルキル(好ましくは、C₁-3アルキル)、C₁-6ハロアルキル(例えば、C₁-3ハロアルキル)、およびC₁-6アルコキシ(例えば、C₁-3アルコキシ)から独立して選択される1つ以上(例えば、1つまたは2つ)の置換基によって任意に置換されたC₃-5シクロアルキル基、または

30

- ハロゲン(すなわち、F、Cl、Br、I)、C₁-6アルキル(例えば、C₁-3アルキル)、C₁-6ハロアルキル(例えば、C₁-3ハロアルキル)、およびC₁-6アルコキシ(例えば、C₁-3アルコキシ)から独立して選択される1つ以上(例えば、1つ、2つ、または3つ)の置換基によって任意に置換されたアリール基を表し、

Yが、

- ハロゲン(すなわち、F、Cl、Br、I)、C₁-6アルキル(例えば、C₁-3アルキル)、C₁-6ハロアルキル(例えば、C₁-3ハロアルキル)、およびC₁-6アルコキシ(例えば、C₁-3アルコキシ)から独立して選択される1つ以上(例えば、1つ、2つ、または3つ)の置換基によって任意に置換されたアリールまたはヘテロアリール基、

40

- C₁-6アルキル(好ましくは、C₁-3アルキル)、C₁-6ハロアルキル(例えば、C₁-3ハロアルキル)、およびC₁-6アルコキシ(例えば、C₁-3アルコキシ)から独立して選択される1つ以上(例えば、1つ、2つ、または3つ)の置換基によって任意に置換された5員または6員の飽和複素環基、または

- C₁-6アルキル(好ましくは、C₁-3アルキル)、C₁-6ハロアルキル(例えば、C₁-3ハロアルキル)、およびC₁-6アルコキシ(例えば、C₁-3アルコキシ)から独立して選択される1つ以上(例えば、1つまたは2つ)の置換基によって任意に置

50

換された C₃ - 6 シクロアルキル基を表し、
Z が、

- ハロゲン (すなわち、F、Cl、Br、I)、C₁ - 6 アルキル (例えば、C₁ - 3 アルキル)、C₁ - 6 ハロアルキル (例えば、C₁ - 3 ハロアルキル)、C₁ - 6 アルコキシ (例えば、C₁ - 3 アルコキシ)、-CN、-NO₂、-N(R)₂、および -SO₂R (式中、各 R が独立して、H または C₁ - 6 アルキル、例えば、H または C₁ - 3 アルキルである) から独立して選択される 1 つ以上 (例えば、1 つ、2 つ、または 3 つ) の置換基によって任意に置換されたアリール基、または

- ハロゲン (すなわち、F、Cl、Br、I)、C₁ - 6 アルキル (例えば、C₁ - 3 アルキル)、C₁ - 6 ハロアルキル (例えば、C₁ - 3 ハロアルキル)、C₁ - 6 アルコキシ (例えば、C₁ - 3 アルコキシ)、-CN、-NO₂、-N(R)₂、および -SO₂R (式中、各 R が独立して、H または C₁ - 6 アルキル、例えば、H または C₁ - 3 アルキルである) から独立して選択される 1 つ以上 (例えば、1 つ、2 つ、または 3 つ) の置換基によって任意に置換された不飽和 5 ~ 10 員の単環式または二環式複素環基を表す、化合物、またはその互変異性体、立体異性体、薬学的に許容される塩、もしくはプロドラッグ。

10

【請求項 2】

X が、

- ハロゲン (すなわち、F、Cl、Br、I)、C₁ - 6 アルキル (例えば、C₁ - 3 アルキル)、C₁ - 6 ハロアルキル (例えば、C₁ - 3 ハロアルキル)、C₁ - 6 アルコキシ (例えば、C₁ - 3 アルコキシ)、-CN、-NO₂、-N(R)₂、および -SO₂R (式中、各 R が独立して、H または C₁ - 6 アルキル、例えば、H または C₁ - 3 アルキルである) から独立して選択される 1 つ以上 (例えば、1 つ、2 つ、または 3 つ) の置換基によって任意に置換された 5 員または 6 員の不飽和複素環基、または

20

- C₁ - 6 アルキル (好ましくは、C₁ - 3 アルキル)、C₁ - 6 ハロアルキル (例えば、C₁ - 3 ハロアルキル)、および C₁ - 6 アルコキシ (例えば、C₁ - 3 アルコキシ) から独立して選択される 1 つ以上 (例えば、1 つまたは 2 つ) の置換基によって任意に置換された C₃ - 5 シクロアルキル基を表す、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

X が、任意に置換された 5 員または 6 員の不飽和複素環基である、請求項 1 または請求項 2 に記載の化合物。

30

【請求項 4】

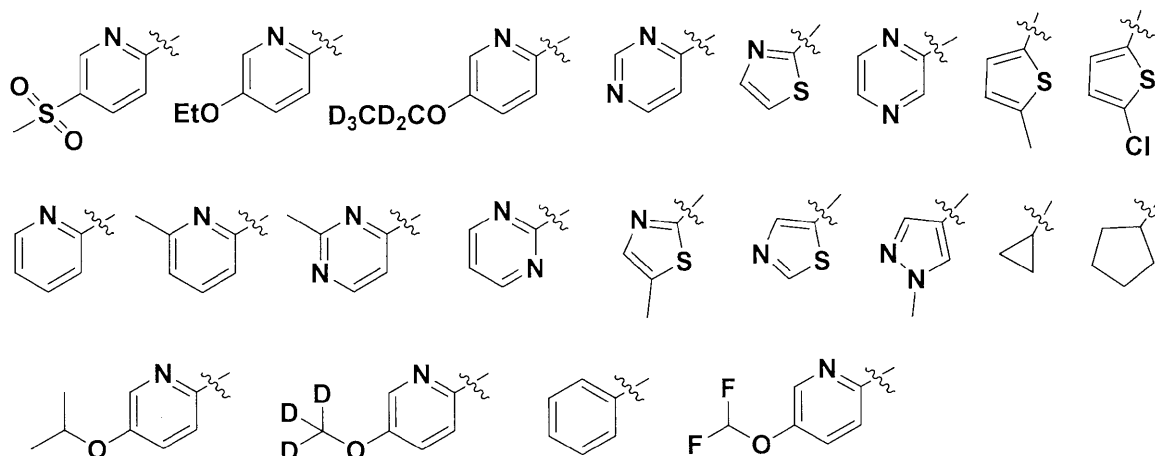
X が、ピリジン (例えば、2 - ピリジン)、ピリミジン (例えば、2 - または 4 - ピリミジン)、ピロール (例えば、2 - または 3 - ピロール)、ピラジン (例えば、2 - ピラジン)、チアゾール (例えば、2 - または 5 - チアゾール)、ピラゾール (例えば、4 - ピラゾール)、イミダゾール (例えば、2 - 、4 - 、または 5 - イミダゾール)、およびチオフェン (例えば、2 - チオフェン) のうちのいずれかの基から選択される、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

X が、以下の基のうちのいずれかから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

40

【化 2 3 4】



10

【請求項 6】

Y が、任意に置換されたアリールまたはヘテロアリール基である、先行する請求項のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

Y が、C₁-3 アルキル（例えば、メチルまたはエチル）、C₁-3 アルコキシ（例えば、メトキシまたはエトキシ）、C₁-3 ハロアルキル（例えば、-CF₃）、およびハロゲン（例えば、F または Cl）からなる群から選択される 1 つまたは 2 つの置換基によって（例えば、1 つの置換基によって）任意に置換されたフェニル基である、請求項 6 に記載の化合物。

20

【請求項 8】

Y が、任意に置換されたヘテロアリール基である、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 9】

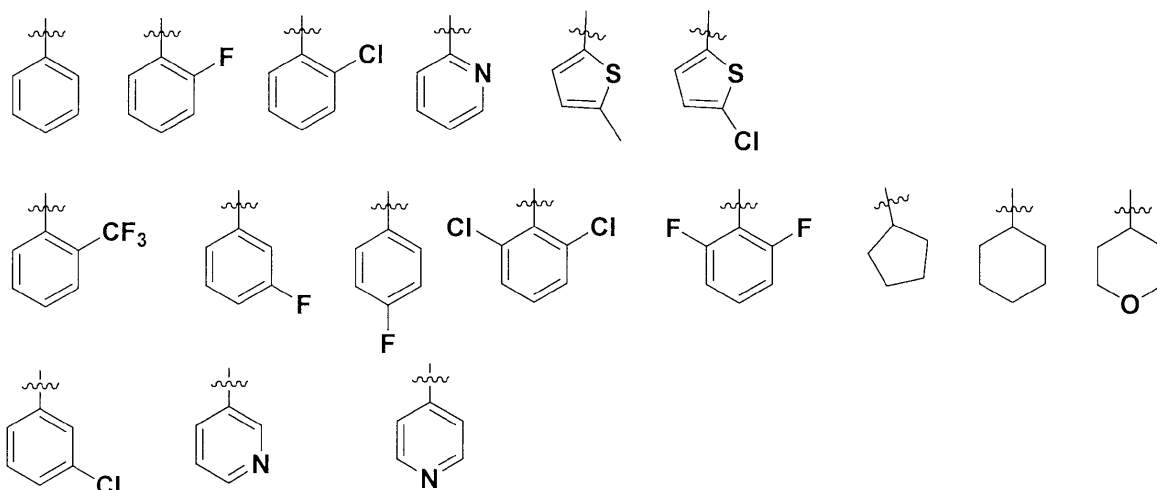
Y が、C₁-3 アルキル（例えば、メチルまたはエチル）、C₁-3 アルコキシ（例えば、メトキシまたはエトキシ）、C₁-3 ハロアルキル（例えば、-CF₃）、およびハロゲン（例えば、F または Cl）からなる群から選択される 1 つまたは 2 つの置換基によって（例えば、1 つの置換基によって）任意に置換されたピリジンまたはチオフェン環（例えば、2-ピリジンまたは 2-チオフェン）である、請求項 8 に記載の化合物。

30

【請求項 10】

Y が、以下の基のうちのいずれかから選択される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【化 2 3 5】



40

50

【請求項 1 1】

Z が、任意に置換されたアリール基を表す、先行する請求項のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 2】

Z が、C₁-3 アルキル（例えば、メチルまたはエチル）、C₁-3 アルコキシ（例えば、メトキシまたはエトキシ）、C₁-3 ハロアルキル（例えば、-CF₃）、およびハロゲン（例えば、F または Cl）から独立して選択される 1 つまたは 2 つの置換基によって（例えば、1 つの置換基によって）任意に置換されたフェニル基である、請求項 1 1 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

Z が、任意に置換された不飽和 5 ~ 10 員の単環式または二環式複素環基である、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物。

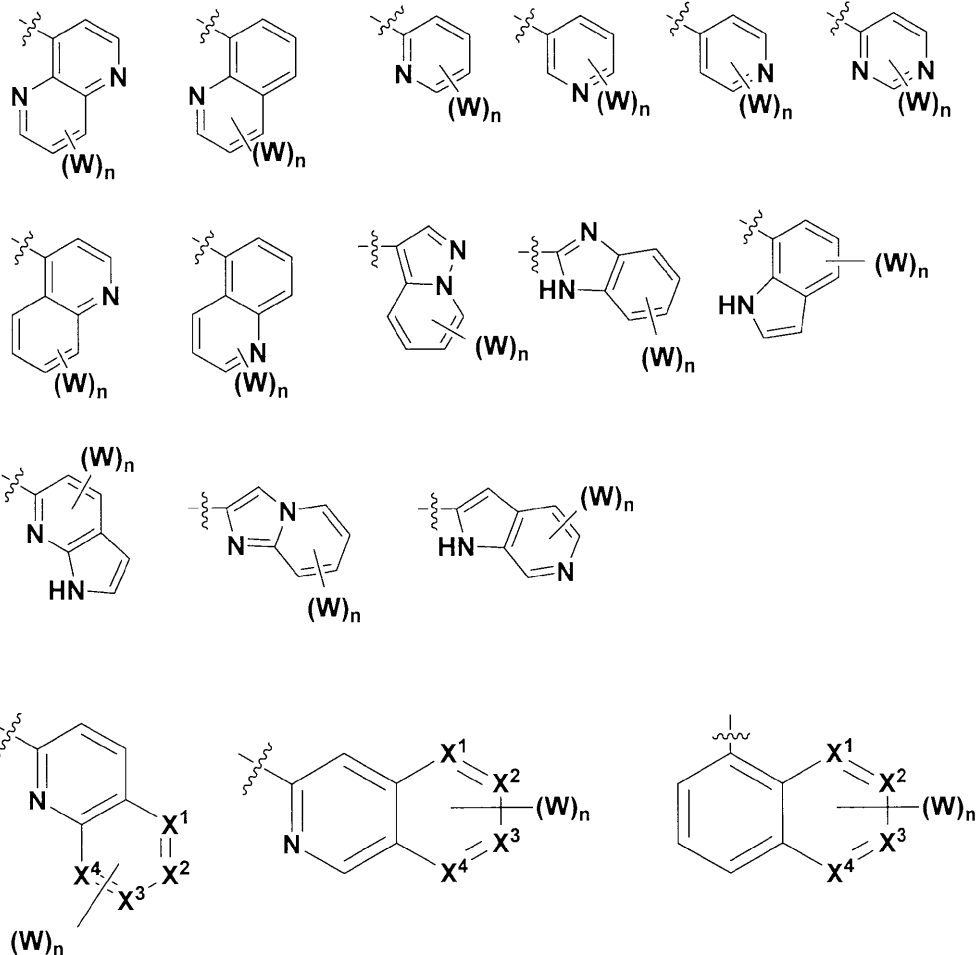
【請求項 1 4】

Z が、1 個、2 個、または 3 個のヘテロ原子、例えば、1 個、2 個、または 3 個の窒素原子、好ましくは 1 個または 2 個の窒素原子を含有する、6 員、5-5 縮合、5-6 縮合、または 6-6 縮合不飽和複素環である、請求項 1 3 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

Z が、以下の基のうちのいずれかから選択され、

【化 2 3 6】



式中、n が、0、1、または 2、好ましくは 0 または 1 であり、

W が、ハロゲン（すなわち、F、Cl、Br、I）、C₁-6 アルキル（例えば、C₁-3 アルキル）、C₁-6 ハロアルキル（例えば、C₁-3 ハロアルキル）、C₁-6 アルコキシ（例えば、C₁-3 アルコキシ）、-CN、-NO₂、-N(R)₂、および -S

10

20

30

40

50

O₂R (式中、各Rが独立して、HまたはC₁-6アルキル、例えば、HまたはC₁-3アルキルである)から選択される置換基であり、
X₁、X₂、X₃、およびX₄が、各CHであるか、または
X₁、X₂、X₃、およびX₄のうちの1つがNであり、X₁、X₂、X₃、およびX₄のうちの残りの3つがCHであるか、または
X₁、X₂、X₃、およびX₄のうちの2つがNであり、X₁、X₂、X₃、およびX₄のうちの残りの2つがCHである、請求項14に記載の化合物。

【請求項16】

nが、0である、請求項15に記載の化合物。

【請求項17】

nが、1または2であり、各Wが、独立して、ハロゲン(例えば、FまたはCl)、C₁-3アルキル、C₁-3アルコキシ、および-CNから選択され得る、請求項15に記載の化合物。

10

【請求項18】

Zが、任意に置換されたフェニル、ピリジン(例えば、2-、3-、または4-ピリジン、好ましくは2-、または3-ピリジン)、ピリミジン(例えば、2-または4-ピリミジン、好ましくは4-ピリミジン)、キノリン(例えば、4-、5-、または8-キノリン)、1,5-ナフチリジン(例えば、4-(1,5-ナフチリジン))、ベンズイミダゾール(例えば、2-ベンズイミダゾール)、ピラゾロ[1,5-a]ピリジン(例えば、3-(ピラゾロ[1,5-a]ピリジン))、およびベンゾジアジン(例えば、1,4-ジアザナфтаレン)から選択される、請求項1~10のいずれか一項に記載の化合物。

20

【請求項19】

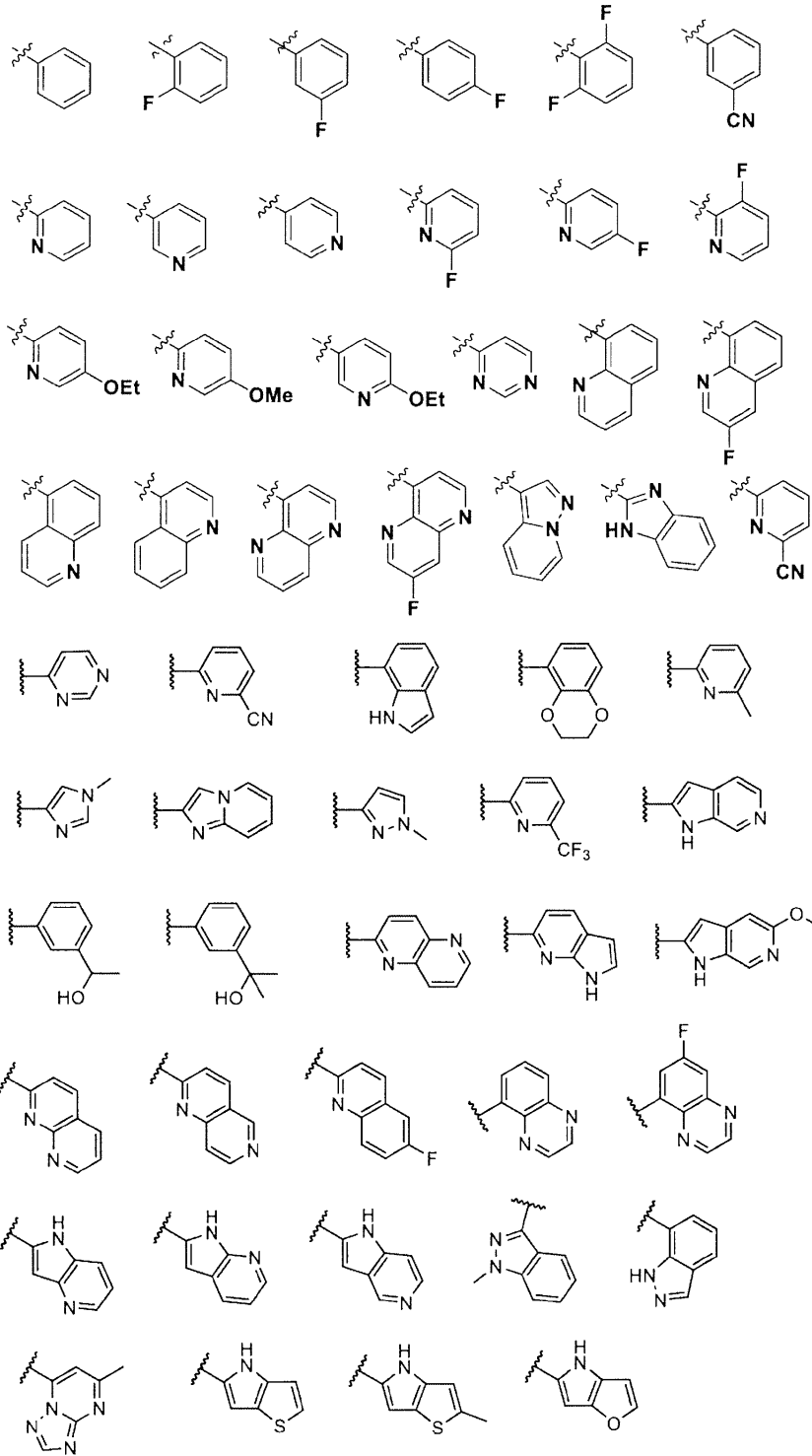
Zが、以下の基のうちのいずれかから選択される、請求項1~10のいずれか一項に記載の化合物。

30

40

50

【化 2 3 7】



10

20

30

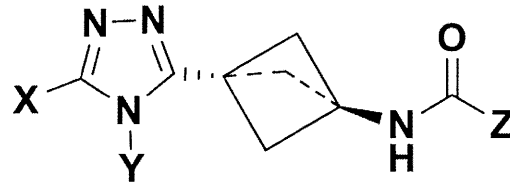
40

【請求項 20】

一般式 (I a) を有する、

50

【化 2 3 8】



(Ia)

(式中、X、Y、およびZが、請求項1～19のいずれか一項に定義される通りである)
請求項1に記載の化合物、またはその互変異性体、立体異性体、薬学的に許容される塩、
もしくはプロドラッグ。

10

【請求項21】

以下の化合物のうちのいずれかから選択される、請求項1に記載の化合物、またはその互
変異性体、立体異性体、薬学的に許容される塩、もしくはプロドラッグ。

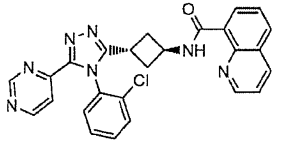
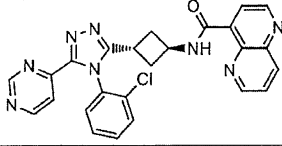
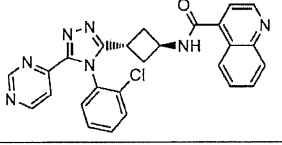
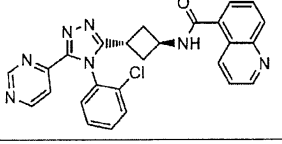
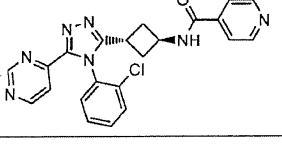
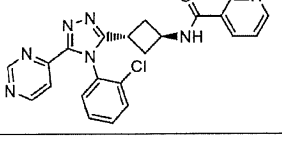
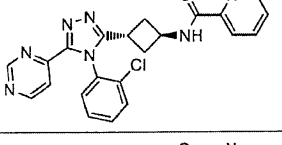
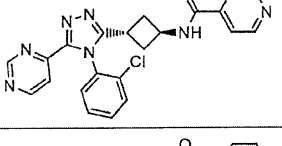
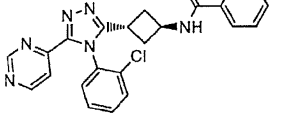
20

30

40

50

【表 2 4】

実施例番号(該当する 場合)	構造
4	
5	
6	
7	
8	
9	
10	
11	
12	

10

20

30

40

50

【表 2 5】

13	
14	
15	
16	
17	
18	
19	
21	
22	

10

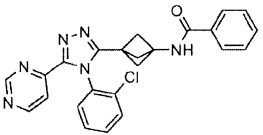
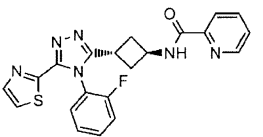
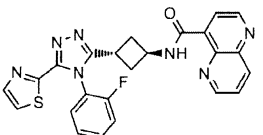
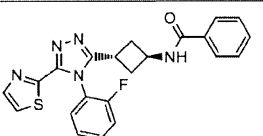
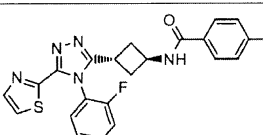
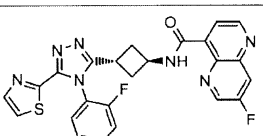
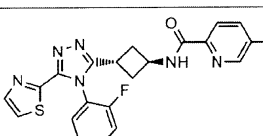
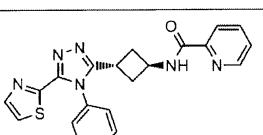
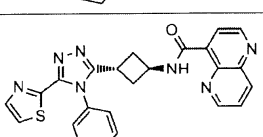
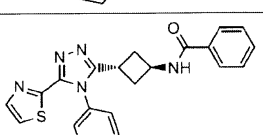
20

30

40

50

【表 2 6】

23	
25	
26	
27	
28	
29	
30	
32	
33	
34	

10

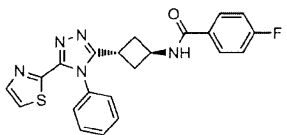
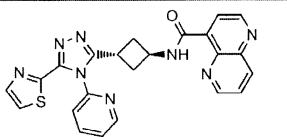
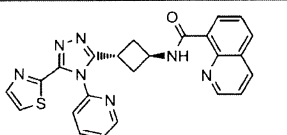
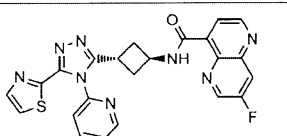
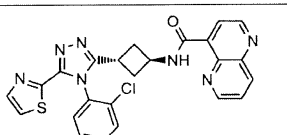
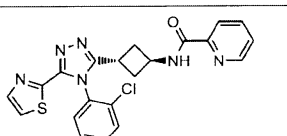
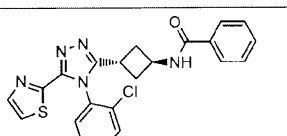
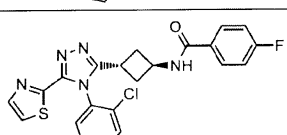
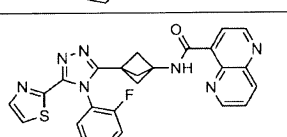
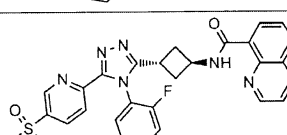
20

30

40

50

【表 2 7】

35	
37	
38	
39	
41	
42	
43	
44	
46	
48	

10

20

30

40

50

【表 2 8】

49	
50	
52	
53	
54	
55	
56	
57	
58	
59	

10

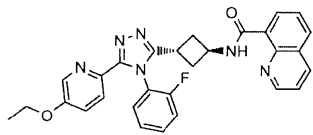
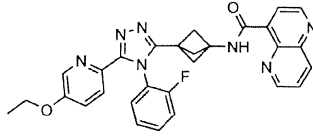
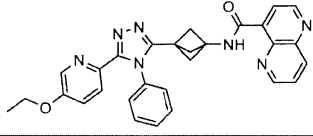
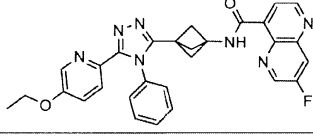
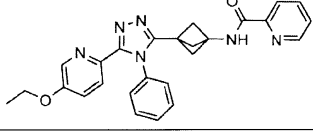
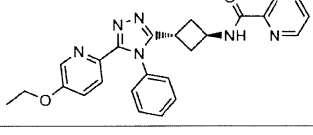
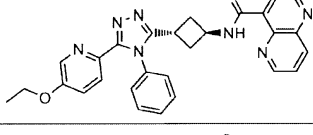
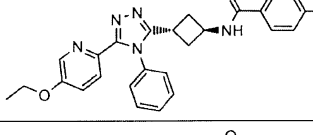
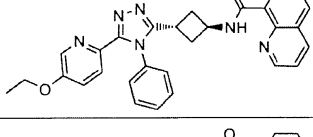
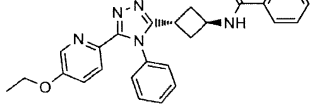
20

30

40

50

【表 2 9】

60	
62	
64	
65	
66	
68	
69	
70	
71	
72	

10

20

30

40

50

【表 30】

73	
75	
76	
78	
79	
81	
82	
83	
84	
86	

10

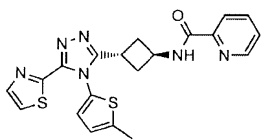
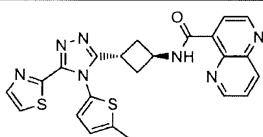
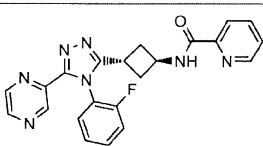
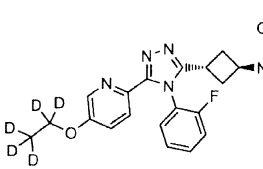
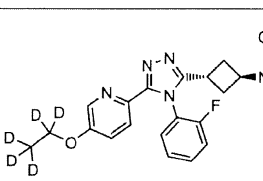
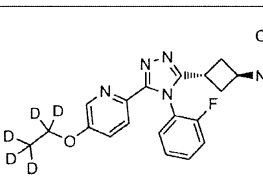
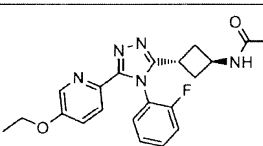
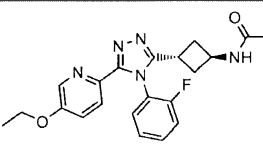
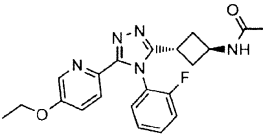
20

30

40

50

【表 3 1】

88	
89	
91	
93	
94	
95	
96	
97	
98	

10

20

30

40

50

【表 3 2】

99	
100	
101	
102	
103	
104	
106	
107	
109	

10

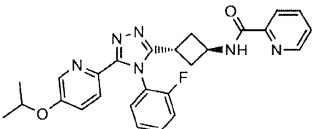
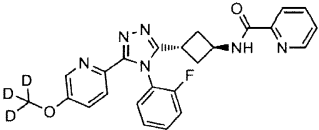
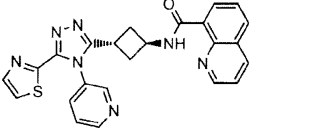
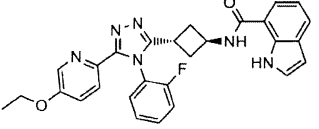
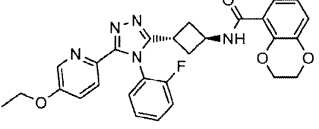
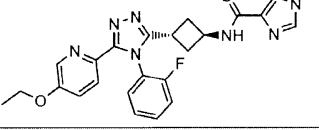
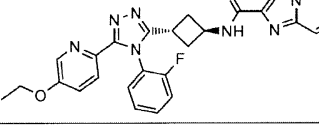
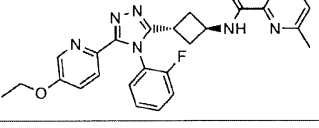
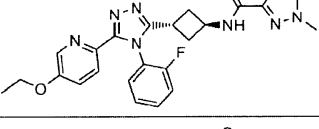
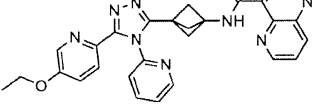
20

30

40

50

【表 3 3】

111	
113	
114	
115	
116	
117	
118	
119	
120	
122	

10

20

30

40

50

【表 3 4】

124	
125	
126	
127	
128	
129	
130	
131	
132	
134	

10

20

30

40

50

【表 3 5】

135	
136	
137	
139	
140	
141	
142	
143	
144	

10

20

30

40

50

【表 3 6】

146	
147	
148	
149	
150	
151	
152	
153	

10

20

30

40

50

【表 3 7】

154	
155	
156	
157	
158	
159	
160	
162	
163	

10

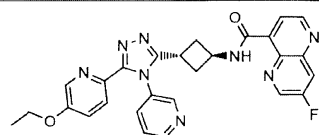
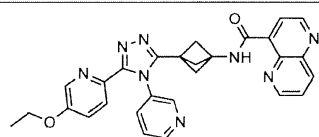
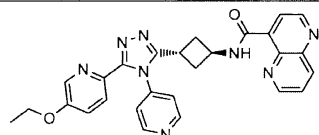
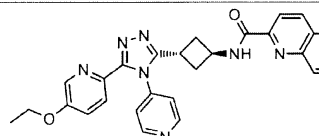
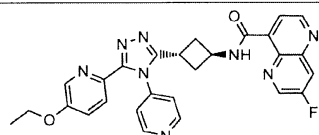
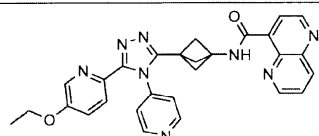
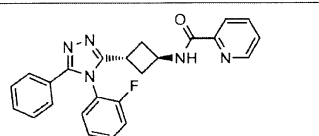
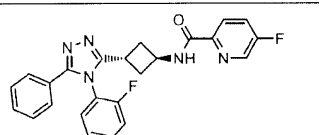
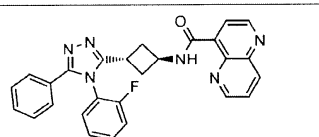
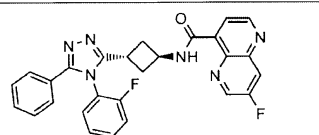
20

30

40

50

【表 3 8】

164	
166	
168	
169	
170	
172	
174	
175	
176	
177	

10

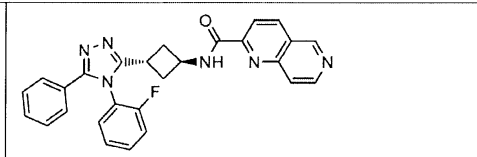
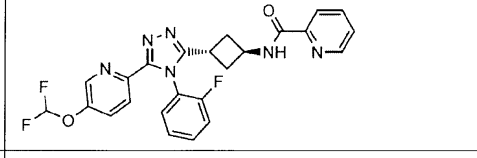
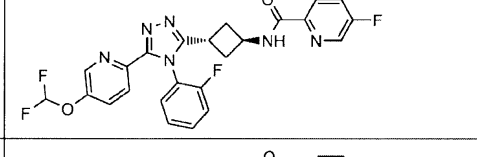
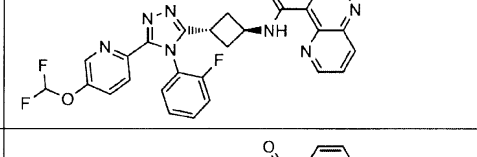
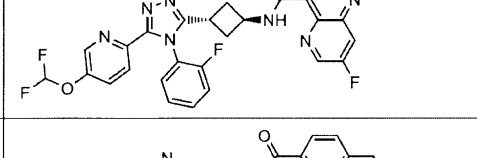
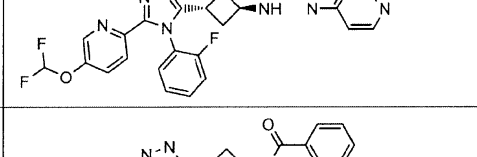
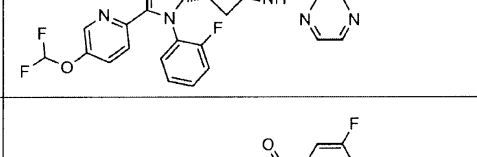
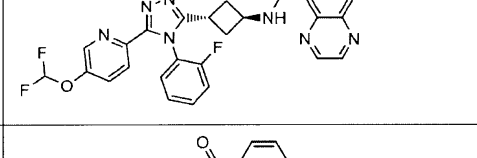
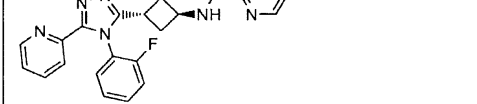
20

30

40

50

【表 3 9】

178	
180	
181	
182	
183	
184	
185	
186	
188	

10

20

30

40

50

【表 40】

189	
190	
191	
192	
193	
194	
196	
197	
198	

10

20

30

40

50

【表 4 1】

199		
200		10
201		
202		20

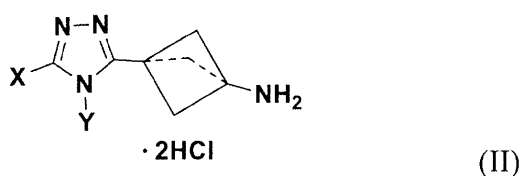
【請求項 2 2】

請求項 1 ~ 2 1 のいずれか一項に記載の式 (I) または式 (I a) の化合物の製造のための方法であって、前記方法が、

(a) 一般式 (I I) の化合物を、

30

【化 2 3 9】



一般式 (I I I) の化合物

【化 2 4 0】



40

と反応させること [式中、X、Y、および Z は、請求項 1 ~ 2 1 のいずれか一項に定義される通りである]、

(b) 所望であれば、このようにして得られた化合物をその立体異性体に分割すること、ならびに / または

(c) 所望であれば、このようにして得られた化合物を、その塩、特にその薬学的に許容される塩に変換することを含む、方法。

50

【請求項 2 3】

請求項 1 ~ 2 1 のいずれか一項に記載の化合物、またはその互変異性体、立体異性体、薬学的に許容される塩、もしくはプロドラッグ、および 1 つ以上の薬学的に許容される担体、賦形剤、または希釈剤を含む、医薬組成物。

【請求項 2 4】

治療で使用するための、請求項 1 ~ 2 1 のいずれか一項に記載の化合物、またはその互変異性体、立体異性体、薬学的に許容される塩、もしくはプロドラッグ。

【請求項 2 5】

タンキラーゼ 1 および / または 2 の阻害に応答する疾患または障害、例えば、タンキラーゼ 1 および / または 2 によって媒介される障害の治療または予防に使用するための、好ましくは癌などの障害の治療または予防に使用するための、請求項 1 ~ 2 1 のいずれか一項に記載の化合物、またはその互変異性体、立体異性体、薬学的に許容される塩、もしくはプロドラッグ。

10

【請求項 2 6】

結腸直腸組織、子宮、膵臓、皮膚、肝臓、甲状腺、前立腺、卵巣、胃、肺、リンパ節、膀胱、頸部、甲状腺、頭頸部、脳、乳房、もしくは腎臓から出現する腫瘍の治療もしくは予防、

黒色腫の治療、

非再生創傷治癒の治療、または

単純ヘルペスウイルス感染症などのウイルス感染症、肺、皮膚、腎臓、および肝臓線維症などの線維症、心筋線維症、もしくは異常な全身性グルコース代謝などの代謝状態の治療もしくは予防における、

20

請求項 2 5 に記載の使用のための化合物。

30

40

50