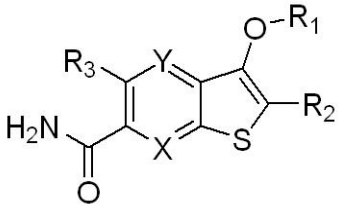
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和3年6月10日(2021.6.10)

【公表番号】特表2020-519596(P2020-519596A)
【公表日】令和2年7月2日(2020.7.2)
【年通号数】公開・登録公報2020-026
【出願番号】特願2019-561740(P2019-561740)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 495/04 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 409/12 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4365 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4015 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/5377 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 29/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 5/14 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 13/12 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 31/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/06 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 495/04 １０５Ａ
Ｃ０７Ｄ 409/12 ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ 31/4365
Ａ６１Ｋ 31/4015
Ａ６１Ｋ 31/5377
Ａ６１Ｐ 29/00
Ａ６１Ｐ 37/00
Ａ６１Ｐ 35/00
Ａ６１Ｐ 1/04
Ａ６１Ｐ 11/06
Ａ６１Ｐ 37/06
Ａ６１Ｐ 11/00
Ａ６１Ｐ 5/14
Ａ６１Ｐ 19/02
Ａ６１Ｐ 17/00
Ａ６１Ｐ 13/12
Ａ６１Ｐ 17/06
Ａ６１Ｐ 31/04
Ａ６１Ｐ 19/06

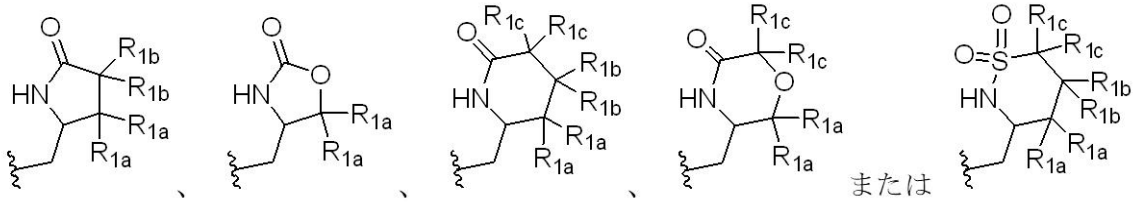
【手続補正書】

【提出日】令和3年4月23日(2021.4.23)
【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)：
【化１】



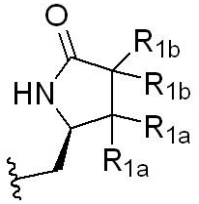
(I)

[式中、
Ｘは、ＣＲ$_4$またはＮであり；
Ｙは、ＣＲ$_5$またはＮであるが；ただし、ＸおよびＹの１つのみが、Ｎであり；
Ｒ$_1$は：
【化２】



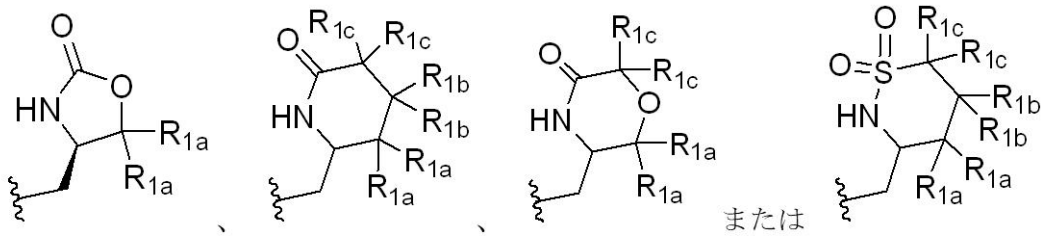
であり；
各々Ｒ$_{1a}$は、独立して、Ｈ、－ＯＨ、Ｆ、Ｃ$_{1-3}$アルキル、Ｃ$_{1-3}$フルオロアルキル、Ｃ$_{1-3}$アルコキシ、Ｃ$_{1-3}$フルオロアルコキシまたはＣ$_{3-6}$シクロアルキルであるか；あるいは、２つのＲ$_{1a}$は、それらに結合している炭素原子と一緒になって、３～４員スピロシクロアルキル環を形成できる；
各々Ｒ$_{1b}$は、独立して、Ｈ、－ＯＨ、Ｆ、Ｃ$_{1-3}$アルキル、Ｃ$_{1-3}$フルオロアルキル、Ｃ$_{1-3}$アルコキシ、Ｃ$_{1-3}$フルオロアルコキシまたはＣ$_{3-6}$シクロアルキルであるか；あるいは、２つのＲ$_{1b}$は、それらに結合している炭素原子と一緒になって、３～４員スピロシクロアルキル環を形成できる；
各々Ｒ$_{1c}$は、独立して、Ｈ、－ＯＨ、Ｆ、Ｃ$_{1-3}$アルキル、Ｃ$_{1-3}$フルオロアルキル、Ｃ$_{1-3}$アルコキシ、Ｃ$_{1-3}$フルオロアルコキシまたはＣ$_{3-6}$シクロアルキルであるか；あるいは、２つのＲ$_{1c}$は、それらに結合している炭素原子と一緒になって、３～４員スピロシクロアルキル環を形成できる；
Ｒ$_{1a}$およびＲ$_{1b}$は、それらに結合している炭素原子と一緒になって、３～４員シクロアルキル環を形成でき；
Ｒ$_{1b}$およびＲ$_{1c}$は、それらに結合している炭素原子と一緒になって、３～４員シクロアルキル環を形成できる；
Ｒ$_2$は、Ｈ、ハロ、Ｃ$_{1-3}$アルキルまたはＣ$_{3-6}$シクロアルキルであり；
Ｒ$_3$は、Ｃ$_{1-4}$アルコキシ、Ｃ$_{1-4}$フルオロアルコキシまたはＣ$_{3-6}$シクロアルコキシであり；

R_4は、H、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{1-4}フルオロアルキルまたはC_{3-6}シクロアルキルであり；および
R_5は、H、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{1-4}フルオロアルキルまたはC_{3-6}シクロアルキルである]
の化合物、あるいはその塩またはプロドラッグ。
【請求項２】
各々R_{1a}が、独立して、H、－OH、F、C_{1-3}アルキル、C_{1-2}フルオロアルキル、C_{1-2}アルコキシ、C_{1-2}フルオロアルコキシまたはC_{3-6}シクロアルキルであるか；あるいは、２つのR_{1a}が、それらに結合している炭素原子と一緒になって、３～４員スピロシクロアルキル環を形成できる；
各々R_{1b}が、独立して、H、－OH、F、C_{1-2}アルキル、C_{1-2}フルオロアルキル、C_{1-2}アルコキシ、C_{1-2}フルオロアルコキシまたはC_{3-6}シクロアルキルであるか；あるいは、２つのR_{1b}が、それらに結合している炭素原子と一緒になって、３～４員スピロシクロアルキル環を形成できる；
各々R_{1c}が、独立して、H、F、C_{1-2}アルキル、C_{1-2}フルオロアルキルまたはC_{3-6}シクロアルキルであるか；あるいは、２つのR_{1c}が、それらに結合している炭素原子と一緒になって、３～４員スピロシクロアルキル環を形成できる；
R_2が、H、F、Cl、C_{1-2}アルキルまたはC_{3-6}シクロアルキルであり；
R_3が、C_{1-3}アルコキシ、C_{1-2}フルオロアルコキシまたはC_{3-6}シクロアルコキシであり；
R_4が、H、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{1-4}フルオロアルキルまたはC_{3-6}シクロアルキルであり；および
R_5が、H、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{1-4}フルオロアルキルまたはC_{3-6}シクロアルキルである、
請求項１記載の化合物、あるいはその塩またはプロドラッグ。
【請求項３】
各々R_{1a}が、独立して、HまたはC_{1-2}アルキルであり；
各々R_{1b}が、独立して、H、F、－CH_3、－CHF_2またはシクロプロピルであるか；あるいは、２つのR_{1b}が、それらに結合している炭素原子と一緒になって、３員スピロシクロアルキル環を形成でき；
各々R_{1c}が、Hであり；
R_2が、Hまたは－CH_3であり；
R_3が、－OCH_3、－$OCH(CH_3)_2$または－O(シクロプロピル)であり；
R_4が、Hであり；および
R_5が、Hである、
請求項１～２のいずれかに記載の化合物、あるいはその塩またはプロドラッグ。
【請求項４】
R_1が、
【化３】



である、
請求項１～３のいずれかに記載の化合物、あるいはその塩またはプロドラッグ。
【請求項５】
各々R_{1a}が、独立して、HまたはC_{1-2}アルキルであり；および
各々R_{1b}が、独立して、H、F、－CH_3、－CHF_2またはシクロプロピルである

か；あるいは、２つのＲ１ｂが、それらに結合している炭素原子と一緒になって、３員スピロシクロアルキル環を形成している、
請求項１～２および４のいずれかに記載の化合物、あるいはその塩またはプロドラッグ。
【請求項６】
Ｒ１が、
【化４】



、 、 または

である、
請求項１記載の化合物、あるいはその塩またはプロドラッグ。
【請求項７】
各々Ｒ１ａが、独立して、ＨまたはＣ１－２アルキルであり；
各々Ｒ１ｂが、独立して、Ｈ、Ｆ、－ＣＨ３、－ＣＨＦ２またはシクロプロピルであり；および
各々Ｒ１ｃが、Ｈである、
請求項１～６のいずれかに記載の化合物、あるいはその塩またはプロドラッグ。
【請求項８】
化合物が、
３－(((２Ｓ，３Ｓ)－３－エチル－４，４－ジフルオロ－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)－５－メトキシチエノ[３，２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(１)；
３－(((２Ｓ，３Ｓ，４Ｓ)－３－エチル－４－フルオロ－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)－５－メトキシチエノ[３，２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(２)；
(Ｓ)－５－メトキシ－３－((５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)チエノ[２，３－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(３)；
３－(((２Ｓ，３Ｓ，４Ｓ)－３－エチル－４－フルオロ－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)－５－メトキシベンゾ[ｂ]チオフェン－６－カルボキサミド(４)；
(Ｓ)－５－メトキシ－３－((５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)チエノ[３，２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(５)；
３－(((２Ｓ，３Ｒ)－３－エチル－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)－５－メトキシチエノ[３，２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(６)；
５－メトキシ－３－((５－オキソモルホリン－３－イル)メトキシ)チエノ[３，２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(７)；
３－(((２Ｓ，３Ｓ，４Ｒ)－３－エチル－４－フルオロ－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)－５－メトキシチエノ[３，２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(８)；
３－(((６Ｓ，７Ｒ)－７－エチル－４－オキソ－５－アザスピロ[２．４]ヘプタン－６－イル)メトキシ)－５－メトキシチエノ[３，２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(９)；
３－(((２Ｓ，３Ｒ)－３－エチル－４，４－ジメチル－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)－５－メトキシチエノ[３，２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(１０)；
３－(((２Ｓ，４Ｒ)－４－フルオロ－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)－５－メトキシチエノ[３，２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(１１)；
３－(((２Ｓ，３Ｒ)－３－(ジフルオロメチル)－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)－５－メトキシチエノ[３，２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(１２)；
５－メトキシ－３－(((２Ｓ)－４－メチル－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)チエノ[３，２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(１３－１４)；

３－(((２Ｓ)－４－エチル－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)－５－メトキシチエノ[３,２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(１５－１６)；
５－メトキシ－３－(((２Ｓ,３Ｒ)－３－メチル－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)チエノ[３,２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(１７)；
３－(((２Ｓ,３Ｓ,４Ｒ)－３－シクロプロピル－４－フルオロ－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)－５－メトキシチエノ[３,２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(１８)；
３－(((２Ｓ,３Ｒ)－３－エチル－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)－５－メトキシ－２－メチルチエノ[３,２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(１９)；
５－シクロプロポキシ－３－(((２Ｓ,３Ｒ)－３－エチル－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)チエノ[３,２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(２０)；
３－(((２Ｓ,３Ｓ)－４,４－ジフルオロ－３－メチル－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)－５－メトキシチエノ[３,２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(２１)；
３－(((２Ｓ,３Ｓ,４Ｓ)－３－エチル－４－フルオロ－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)－５－メトキシ－２－メチルチエノ[３,２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(２２)；
３－(((２Ｓ,３Ｓ,４Ｓ)－３－エチル－４－フルオロ－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)－５－イソプロポキシチエノ[３,２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(２３)；
５－シクロプロポキシ－３－(((２Ｓ,３Ｓ,４Ｓ)－３－エチル－４－フルオロ－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)チエノ[３,２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(２４)；
(Ｓ)－５－メトキシ－２－メチル－３－((５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)チエノ[３,２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(２５)；
３－(((４Ｒ,５Ｓ)－５－エチル－２－オキソオキサゾリジン－４－イル)メトキシ)－５－メトキシチエノ[３,２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(２６)；
３－(((２Ｓ,３Ｓ,４Ｒ)－４－フルオロ－３－メチル－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)－５－メトキシチエノ[３,２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(２７)；
３－(((２Ｓ,３Ｓ,４Ｓ)－４－フルオロ－３－メチル－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)－５－メトキシチエノ[３,２－ｂ]ピリジン－６－カルボキサミド(２８)；および
３－(((２Ｓ,３Ｒ)－３－エチル－５－オキソピロリジン－２－イル)メトキシ)－５－メトキシベンゾ[ｂ]チオフェン－６－カルボキサミド(２９)、
から選択される、請求項１記載の化合物またはその塩。

【請求項９】
請求項１～８のいずれか一項記載の１または複数の化合物と、医薬的に許容される担体または希釈剤を含む、医薬組成物。

【請求項１０】
治療に用いるための請求項９記載の医薬組成物。

【請求項１１】
炎症疾患、自己免疫性疾患またはがんの治療に用いるための請求項９記載の医薬組成物。

【請求項１２】
疾患が、クローン病、潰瘍性大腸炎、喘息、移植片対宿主病、同種移植の拒絶反応、慢性閉塞性肺疾患、グレーブス病、関節リウマチ、全身性紅斑性狼瘡、ループス腎炎、皮膚ループス、乾癬、クリオピリン関連周期性症候群、ＴＮＦ受容体関連周期性症候群、家族性地中海熱、成人発症型スチル病、全身性発症若年性突発性関節炎、多発性硬化症、神経因性疼痛、痛風または痛風性関節炎より選択される、請求項１１記載の医薬組成物。