

【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5年1月24日(2023.1.24)

【国際公開番号】WO2022/138987

【出願番号】特願2022-571730(P2022-571730)

【国際特許分類】

- C 0 7 D 4 0 1 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 5 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 5 3 (2 0 0 6 . 0 1) 10
- A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 5 3 8 3 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 5 5 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 P 3 1 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 2 5 1 / 4 6 (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 1 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 0 3 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 0 3 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1) 20
- C 0 7 D 4 0 5 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 0 7 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 0 9 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 1 3 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 1 3 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 1 7 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 1 7 / 1 2 (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 7 1 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1) 30
- C 0 7 D 4 9 1 / 0 4 8 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 9 1 / 0 8 (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 5 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 9 8 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 5 1 3 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

【 F I 】

- C 0 7 D 4 0 1 / 0 6
- A 6 1 K 3 1 / 5 0 6
- A 6 1 K 3 1 / 5 3 40
- A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7
- A 6 1 K 3 1 / 5 3 8 3
- A 6 1 K 3 1 / 5 5
- A 6 1 P 3 1 / 1 4
- A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1
- C 0 7 D 2 5 1 / 4 6 C C S P
- C 0 7 D 4 0 1 / 0 4
- C 0 7 D 4 0 1 / 1 4
- C 0 7 D 4 0 3 / 0 6
- C 0 7 D 4 0 3 / 1 4 50

C 0 7 D 4 0 5 / 1 4
 C 0 7 D 4 0 7 / 1 4
 C 0 7 D 4 0 9 / 1 4
 C 0 7 D 4 1 3 / 0 6
 C 0 7 D 4 1 3 / 1 4
 C 0 7 D 4 1 7 / 0 6
 C 0 7 D 4 1 7 / 1 2
 C 0 7 D 4 1 7 / 1 4
 C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 1
 C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 4 Z
 C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 6 A
 C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 6 C
 C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 6 H
 C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 8 E
 C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 8 Q
 C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 1 3
 C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 1 4 A
 C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 3 6
 C 0 7 D 4 9 1 / 0 4 8
 C 0 7 D 4 9 1 / 0 8
 C 0 7 D 4 9 1 / 1 0 7
 C 0 7 D 4 9 5 / 0 4 1 0 5 A
 C 0 7 D 4 9 8 / 0 4 1 1 1
 C 0 7 D 4 9 8 / 0 4 1 1 2 Q
 C 0 7 D 5 1 3 / 0 4 3 0 1
 C 0 7 D 5 1 3 / 0 4 3 4 3

10

20

【手続補正書】

【提出日】令和4年10月6日(2022.10.6)

【手続補正1】

30

【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

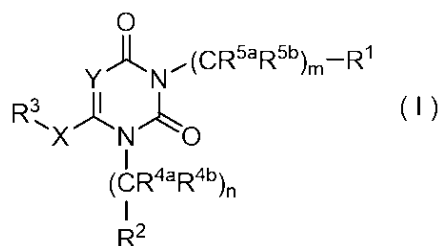
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



40

(式中、Yは、NまたはCR⁷であり；R⁷は、水素原子または置換もしくは非置換のアルキルであり；R¹は、置換もしくは非置換の芳香族複素環式基、置換もしくは非置換の非芳香族複素環式基、置換もしくは非置換のカルバモイルまたは置換もしくは非置換のアミノであり；

50

R²は、置換もしくは非置換の芳香族炭素環式基（ただし、パラモノフルオロフェニル、パラモノクロロフェニルおよびパラモノメチルフェニルを除く）、置換もしくは非置換の非芳香族炭素環式基、置換もしくは非置換の芳香族複素環式基または置換もしくは非置換の非芳香族複素環式基であり；

R³は、置換もしくは非置換の芳香族炭素環式基、置換もしくは非置換の非芳香族炭素環式基、置換もしくは非置換の芳香族複素環式基、置換もしくは非置換の非芳香族複素環式基または置換もしくは非置換のアルキルであり；

- X - は、- NR⁶ -、- CR⁶R^{6'} -、- O -、- S - または単結合であり；

R⁶およびR^{6'}はそれぞれ独立して、水素原子または置換もしくは非置換のアルキルであり；

mは、0、1または2であり；

R^{5a}はそれぞれ独立して、水素原子または置換もしくは非置換のアルキルであり；

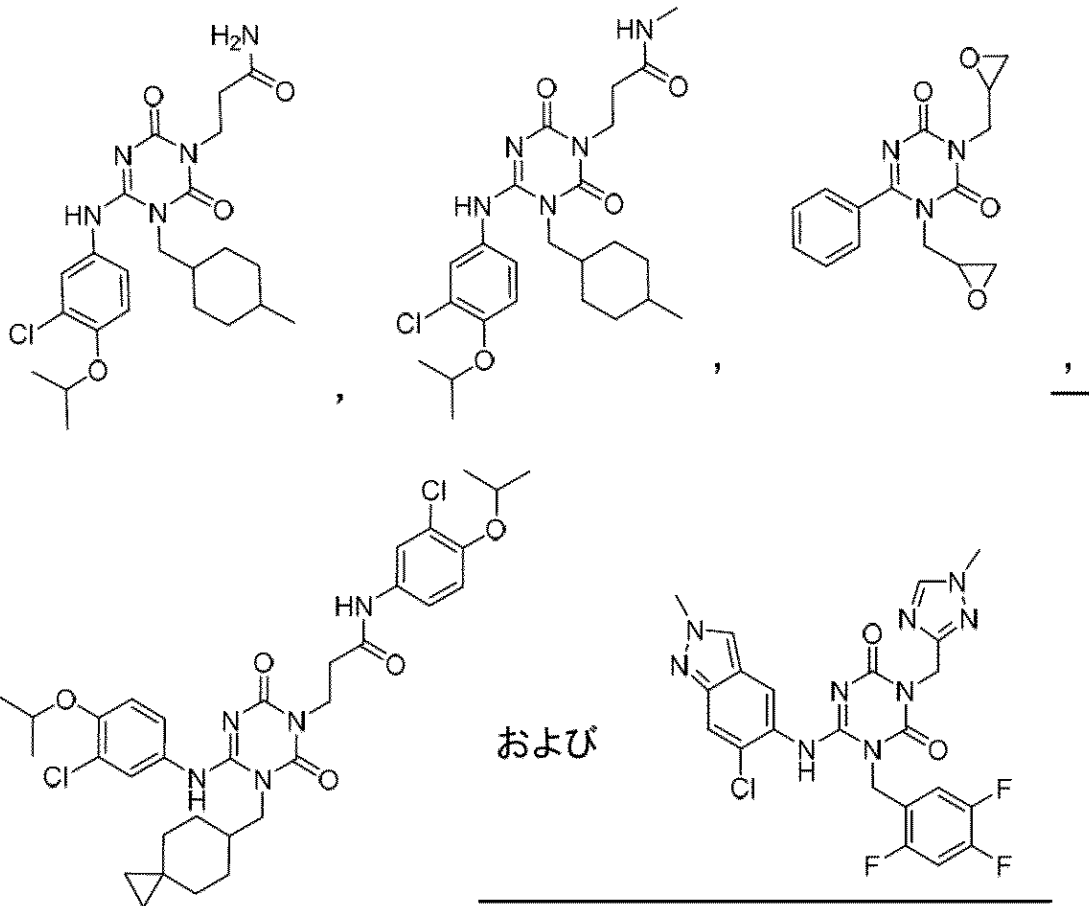
R^{5b}はそれぞれ独立して、水素原子または置換もしくは非置換のアルキルであり；

nは、0、1または2であり；

R^{4a}はそれぞれ独立して、水素原子または置換もしくは非置換のアルキルであり；

R^{4b}はそれぞれ独立して、水素原子または置換もしくは非置換のアルキルである）で示される化合物（ただし、以下の化合物：

【化2】



を除く）、またはその製薬上許容される塩。

【請求項2】

YがNである、請求項1記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項3】

- X - が - NH - である、請求項1または2記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項4】

10

20

30

40

50

R^2 が、置換もしくは非置換の 6 ~ 14 員芳香族炭素環式基、置換もしくは非置換の 5 ~ 10 員非芳香族炭素環式基、置換もしくは非置換の 5 ~ 10 員芳香族複素環式基または置換もしくは非置換の 5 ~ 10 員非芳香族複素環式基である、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項 5】

R^2 が、1 個のハロゲンまたはシアノで置換され、さらに置換基群 G から選択される 1、2、3 もしくは 4 個の置換基で置換された 6 員芳香族炭素環式基、または、1 個のハロゲンまたはシアノで置換され、さらに置換基群 G から選択される 1 もしくは 2 個の置換基で置換された 6 員芳香族複素環式基であり；

置換基群 G が、ハロゲン、シアノ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルキルオキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシおよびハロアルキルオキシからなる群である、請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

10

【請求項 6】

m が 0 または 1 である、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項 7】

n が 0 または 1 である、請求項 1 ~ 6 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項 8】

R^{4a} がそれぞれ独立して水素原子または非置換アルキルであり、 R^{4b} がそれぞれ独立して水素原子である、請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

20

【請求項 9】

R^{5a} がそれぞれ独立して水素原子であり、 R^{5b} がそれぞれ独立して水素原子である、請求項 1 ~ 8 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項 10】

R^1 が、置換もしくは非置換の芳香族複素環式基である、請求項 1 ~ 9 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項 11】

R^1 が置換もしくは非置換の芳香族複素環式基であり、m が 1 であり、 R^{5a} が水素原子であり、 R^{5b} が水素原子である、請求項 1 ~ 9 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

30

【請求項 12】

R^1 が置換もしくは非置換の芳香族複素環式基であり、m が 0 である、請求項 1 ~ 9 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項 13】

R^3 が、置換もしくは非置換の 6 員芳香族炭素環式基、置換もしくは非置換の 3 ~ 10 員非芳香族炭素環式基、置換もしくは非置換の 5 ~ 6 員芳香族複素環式基、置換もしくは非置換の 9 ~ 10 員芳香族複素環式基、置換もしくは非置換の 13 ~ 15 員芳香族複素環式基または置換もしくは非置換の 3 ~ 20 員非芳香族複素環式基である、請求項 1 ~ 12 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

40

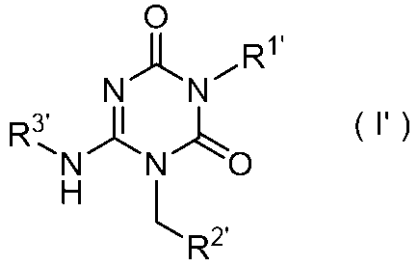
【請求項 14】

R^3 が、置換もしくは非置換の 6 員芳香族炭素環式基、置換もしくは非置換の 9 ~ 10 員芳香族複素環式基または置換もしくは非置換の 9 ~ 13 員非芳香族複素環式基である、請求項 1 ~ 12 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

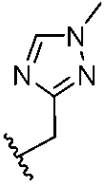
【請求項 15】

式 (I) が、
式 (I') :

【化 3】

(式中、R^{1'}は、式：

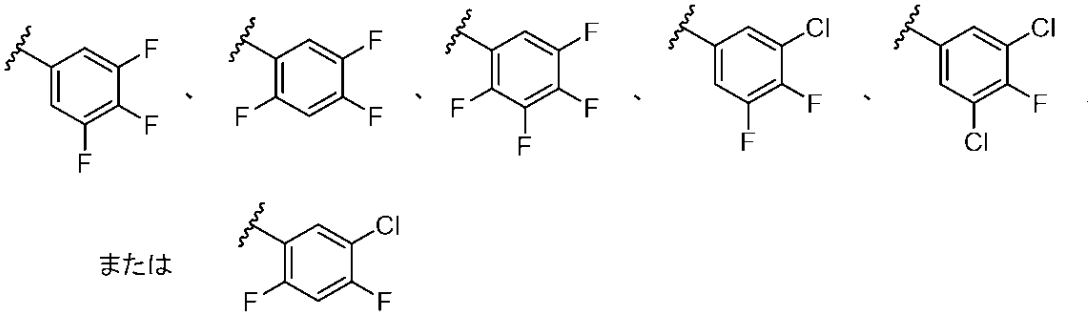
【化 4】



で示される基であり；

R^{2'}は、式：

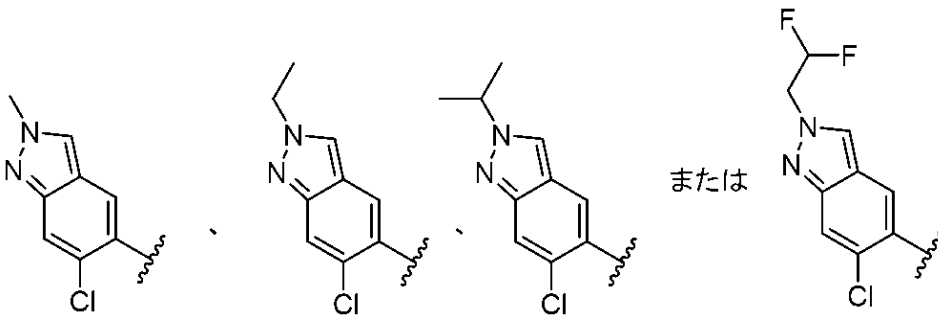
【化 5】



で示される基であり；

R^{3'}は、式：

【化 6】



で示される基である)である、請求項 1 記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項 1 6】

式 (I) が、
式 (I') :

10

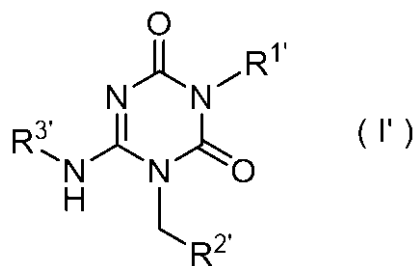
20

30

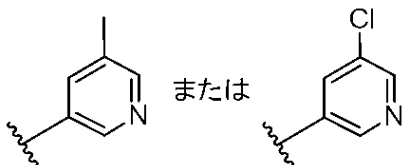
40

50

【化7】

(式中、R^{1'}は、式：

【化8】

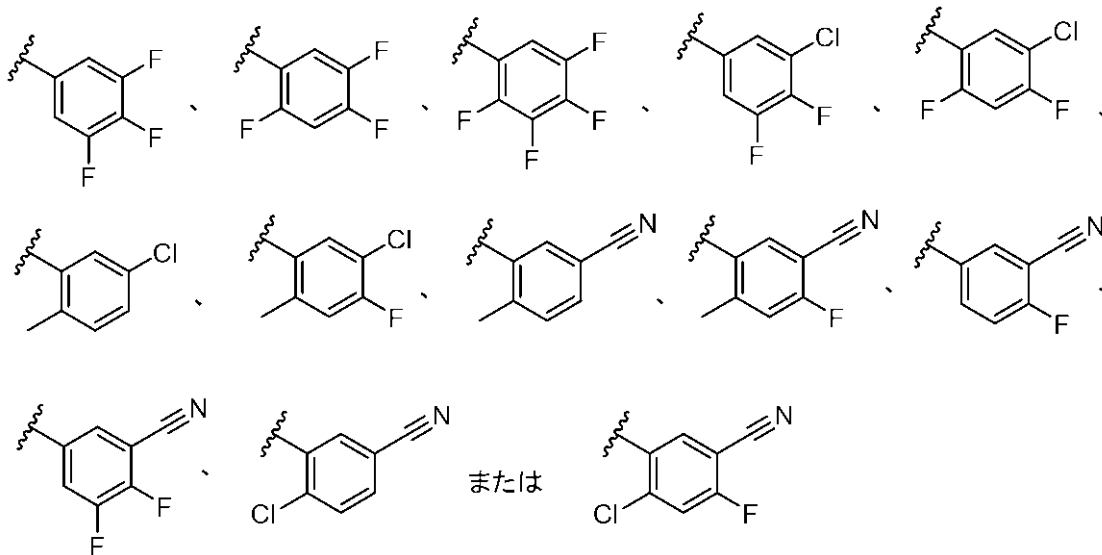


10

で示される基であり；

R^{2'}は、式：

【化9】



20

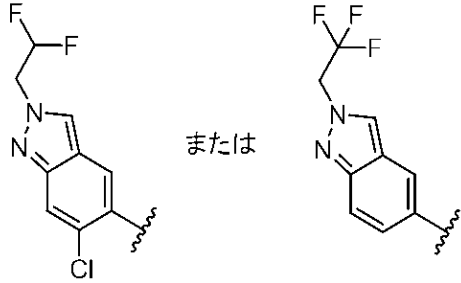
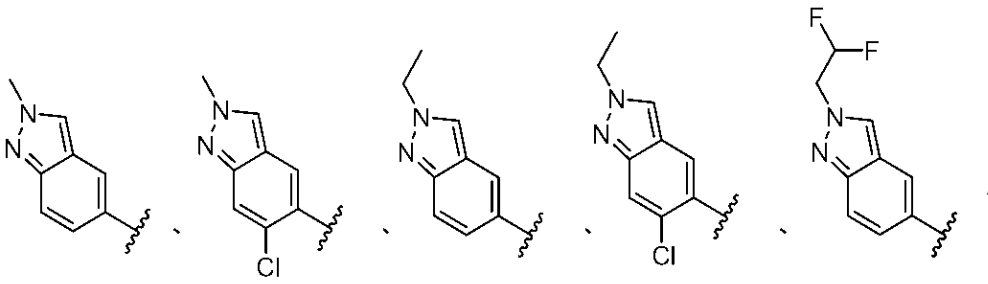
で示される基であり；

R^{3'}は、式：

40

50

【化 1 0】



10

で示される基である)である、請求項 1 記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項 1 7】

化合物が、以下の化合物：

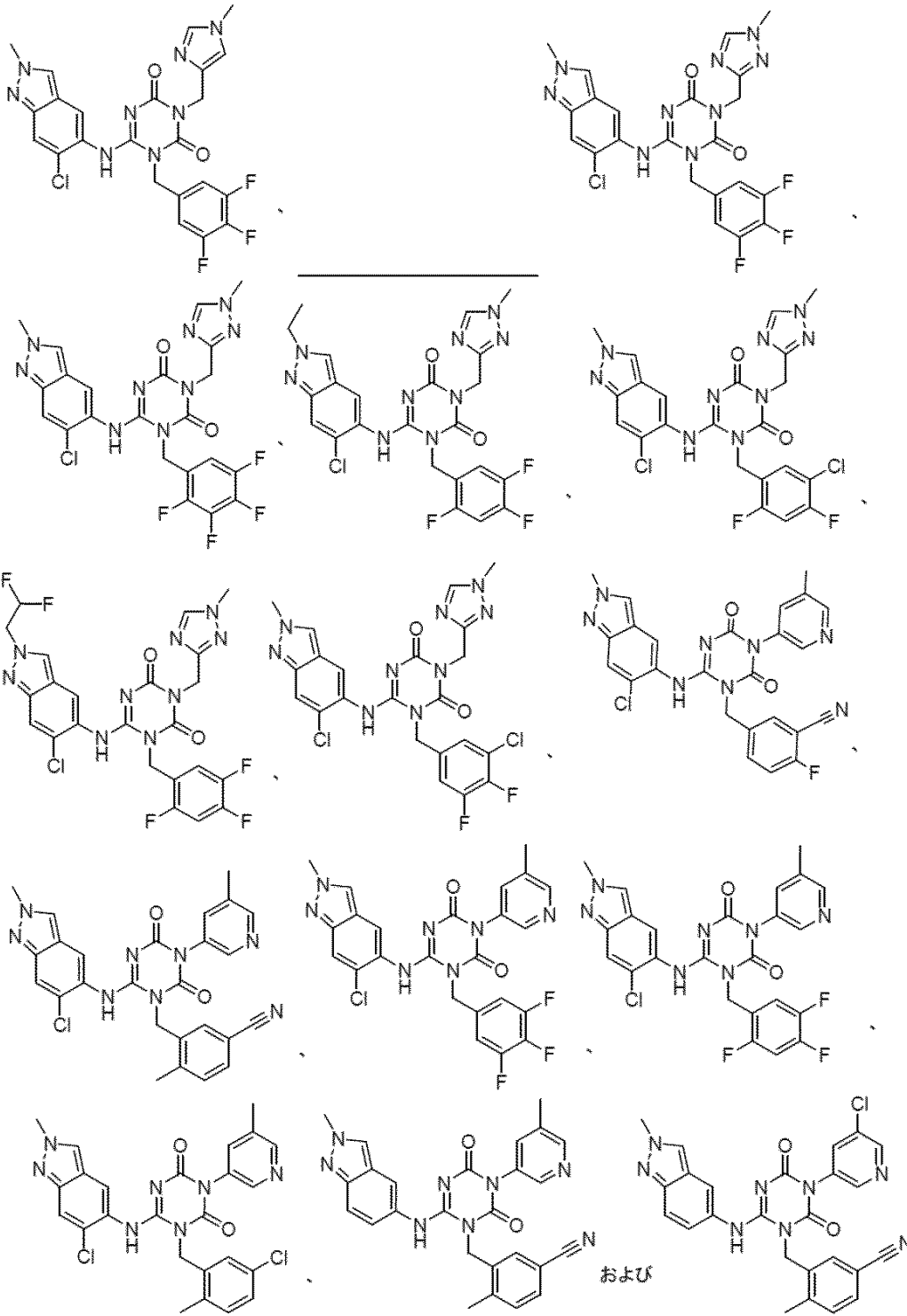
20

30

40

50

【化 1 1】



10

20

30

40

からなる群から選択される請求項 1 記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

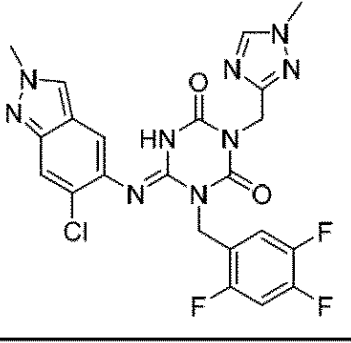
【請求項 1 8】

請求項 1 ~ 1 7 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩を含有する、医薬組成物。

【請求項 1 9】

式 (I - B) :

【化 1 2】



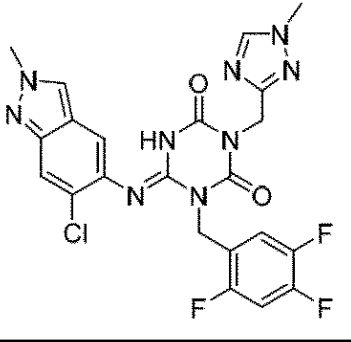
10

で示される化合物およびフマル酸が 1 : 1 のモル比で存在するフマル酸共結晶であって、粉末 X 線回折スペクトルにおいて、回折角度 (2θ) : $9.5 \pm 0.2^\circ$ 、 $10.9 \pm 0.2^\circ$ 、 $18.6 \pm 0.2^\circ$ 、 $23.5 \pm 0.2^\circ$ および $24.6 \pm 0.2^\circ$ にピークを有するフマル酸共結晶 I 形を含む医薬組成物。

【請求項 2 0】

式 (I - B) :

【化 1 3】



20

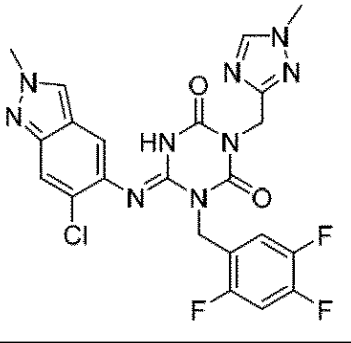
で示される化合物およびフマル酸が 1 : 1 のモル比で存在するフマル酸共結晶であって、粉末 X 線回折スペクトルにおいて、回折角度 (2θ) : $7.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $9.5 \pm 0.2^\circ$ 、 $10.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $10.9 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $14.7 \pm 0.2^\circ$ 、 $18.6 \pm 0.2^\circ$ 、 $22.6 \pm 0.2^\circ$ 、 $23.5 \pm 0.2^\circ$ および $24.6 \pm 0.2^\circ$ にピークを有するフマル酸共結晶 I 形を含む医薬組成物。

30

【請求項 2 1】

式 (I - B) :

【化 1 4】



40

で示される化合物およびフマル酸が 1 : 1 のモル比で存在するフマル酸共結晶であって、ラマンスペクトルにおいて、 $676.3 \text{ cm}^{-1} \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ 、 $748.0 \text{ cm}^{-1} \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ 、 $1029.3 \text{ cm}^{-1} \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ 、 $1374.4 \text{ cm}^{-1} \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ 、 $1515.5 \text{ cm}^{-1} \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ 、 $1665.7 \text{ cm}^{-1} \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ 、 1715.7 cm^{-1}

50

$1 \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ および $1739.1 \text{ cm}^{-1} \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ にラマンスペクトルピークを有するフマル酸共結晶 I 形を含む医薬組成物。

10

20

30

40

50