

【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7年3月24日(2025.3.24)

【国際公開番号】WO2022/197763

【公表番号】特表2024-512497(P2024-512497A)

【公表日】令和6年3月19日(2024.3.19)

【年通号数】公開公報(特許)2024-051

【出願番号】特願2023-557369(P2023-557369)

【国際特許分類】

10

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

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

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

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

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

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

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

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

20

C 0 7 D 4 9 5 / 0 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 5 1 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

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

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

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

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

A 6 1 P 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

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

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

30

A 6 1 K 3 1 / 4 1 5 5 (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 1 9 (2 0 0 6 . 0 1)

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

A 6 1 K 3 1 / 5 0 2 5 (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 K 3 1 / 4 9 6 (2 0 0 6 . 0 1)

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

【 F I 】

C 0 7 D 2 3 1 / 3 8 Z

40

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

C 0 7 D 4 1 7 / 1 2

C 0 7 D 4 0 3 / 1 2

C 0 7 D 4 0 3 / 1 4

C 0 7 D 4 0 3 / 1 0

C 0 7 D 4 0 1 / 1 2

C 0 7 D 4 0 1 / 1 0

C 0 7 D 4 0 1 / 0 6

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 4 4

C 0 7 D 4 9 5 / 0 4 1 0 5 A

50

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 1
 C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 4 5
 C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 3 1 1
 C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 6 A
 C 0 7 D 4 0 3 / 0 4
 C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 4 2
 A 6 1 K 3 1 / 5 0 1
 A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1
 A 6 1 P 7 / 1 0
 A 6 1 P 9 / 0 0
 A 6 1 P 2 7 / 0 2
 A 6 1 K 3 1 / 4 1 7 8
 A 6 1 K 3 1 / 4 1 5 5
 A 6 1 K 3 1 / 5 0 6
 A 6 1 K 3 1 / 5 1 9
 A 6 1 K 3 1 / 4 4 4
 A 6 1 K 3 1 / 5 0 2 5
 A 6 1 K 3 1 / 4 7 0 9
 A 6 1 K 3 1 / 4 9 6
 A 6 1 K 3 1 / 5 3

10

20

【手続補正書】

【提出日】令和7年3月13日(2025.3.13)

【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】

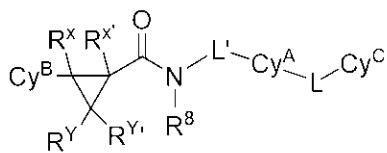
【特許請求の範囲】

【請求項1】

30

式(I)：

【化1】



(I)

40

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：

Cy^Aは、フェニレン、または酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される1～3個のヘテロ原子を有する5員もしくは6員単環式ヘテロアリーレン、または酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される1～4個のヘテロ原子を有する7～12員二環式ヘテロアリーレンであり、式中、Cy^Aは、0～4個の-R^A基で置換されていて、

各R^Aは、オキソ、ハロゲン、-CN、-C(O)R、-C(O)₂R、-C(O)N(R)₂、-NO₂、-N(R)₂、-N(R)C(O)R、-N(R)C(O)₂R、-N(R)S(O)₂R、-OR、-OC(O)R、-OC(O)N(R)₂、-SR、-S(O)R、-S(O)₂R、-S(O)N(R)₂、-S(O)₂N(R)₂、並びに

50

$C_1 \sim 6$ 脂肪族と、フェニルと、3 ~ 7 員飽和または部分不飽和単環式カルボシクリルと、酸素、窒素、及び硫黄から選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 7 員飽和または部分不飽和単環式ヘテロシクリルとから選択される任意に置換された基から独立して選択され、

各 R は、独立して水素または任意に置換された $C_1 \sim 6$ 脂肪族基であり、

各 R^Y 及び $R^{Y'}$ は、水素、ハロゲン、及び任意に置換された $C_1 \sim 6$ 脂肪族基から独立して選択され、

各 R^X 及び $R^{X'}$ は、水素、ハロゲン、または $-CN$ から独立して選択され、

C_y^B は、フェニルと、8 ~ 10 員二環式アリールと、酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 6 員ヘテロアリールと、酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 7 ~ 10 員ヘテロアリールとから選択され、式中、 C_y^B は、0 ~ 4 個の $-R^B$ 基で置換されているか、または C_y^B 及び R^X が、それらの介在する原子と共に、酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される 0 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 6 ~ 12 員スピロ環式環系を形成し、 C_y^B 及び R^X によって形成される環 (複数可) は、0 ~ 4 個の $-R^B$ 基で置換されている場合があり、

各 R^B は、オキソ、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)_2R$ 、 $-C(O)N(R)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R)_2$ 、 $-N(R)C(O)R$ 、 $-N(R)C(O)_2R$ 、 $-N(R)S(O)_2R$ 、 $-OR$ 、 $-OC(O)R$ 、 $-OC(O)N(R)_2$ 、 $-SR$ 、 $-S(O)R$ 、 $-S(O)_2R$ 、 $-S(O)N(R)_2$ 、 $-S(O)_2N(R)_2$ 、並びに $C_1 \sim 6$ 脂肪族と、酸素、窒素、及び硫黄から選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 7 員飽和または部分不飽和単環式ヘテロシクリルと、酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 5 員または 6 員ヘテロアリールとから選択される任意に置換された基から独立して選択され、

L は、任意に置換された $C_1 \sim 3$ 炭化水素鎖であり、1 ~ 3 個のメチレン単位が任意に、かつ独立して $-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^Z-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、任意に置換されたシクロプロピレン、または酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、任意に置換された 5 ~ 6 員飽和もしくは部分不飽和ヘテロシクリンで置換されていて、

各 R^Z は、水素、 $-(CH_2)_{0 \sim 3}OR$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 3}C(O)OR$ 、または任意に置換された $C_1 \sim 6$ 脂肪族基から独立して選択され、

L' は、共有結合または任意に置換された $C_1 \sim 3$ 炭化水素鎖であり、1 ~ 3 個のメチレン単位が任意に、かつ独立して $-O-$ 、 $-NR^Z-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、または SO_2- で置換されていて、

C_y^C は、酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 6 員ヘテロアリールと、フェニルと、8 ~ 10 員二環式アリールと、酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 7 ~ 10 員ヘテロアリールと、酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 6 ~ 12 員飽和または部分不飽和縮合二環式ヘテロシクリルとから選択され、式中、 C_y^C は、0 ~ 6 個の $-L^C - R^C$ 基で置換されていて、

各 L^C は、共有結合及び任意に置換された $C_1 \sim 6$ 炭化水素鎖から独立して選択され、1 ~ 3 個のメチレン単位が任意に、かつ独立して $-O-$ または $-NR-$ で置換されていて、

各 R^C は、オキソ、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)_2R$ 、 $-C(O)N(R)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R)_2$ 、 $-N(R)C(O)R$ 、 $-N(R)C(O)_2R$ 、 $-N(R)S(O)_2R$ 、 $-OR$ 、 $-OC(O)R$ 、 $-OC(O)N(R)_2$ 、 $-SR$ 、 $-S(O)R$ 、 $-S(O)_2R$ 、 $-S(O)N(R)_2$ 、 $-S(O)_2N(R)_2$ 、並びに $C_1 \sim 6$ 脂肪族と、フェニルと、3 ~ 7 員飽和または部分不飽和単環式カルボシクリルと、酸素、窒素、及び硫黄から選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する 5 員または 6 員ヘテロアリールと、酸素、窒素、及び硫黄から選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 7 員飽和または部分不飽和単環式ヘテロシクリルと、酸素、窒素、及び硫黄から選択さ

10

20

30

40

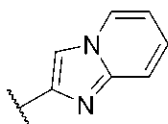
50

れる 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 6 ~ 12 員飽和または不飽和二環式ヘテロシクリルとから選択される任意に置換された基から独立して選択され、
 R^8 は、水素、-OR、及び任意に置換された C_{1-6} 脂肪族基から選択される、
 前記化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

Cy^C が 0 ~ 6 個の $-L^C - R^C$ 基で置換されている

【化 2】



10

ではないことを条件とする、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

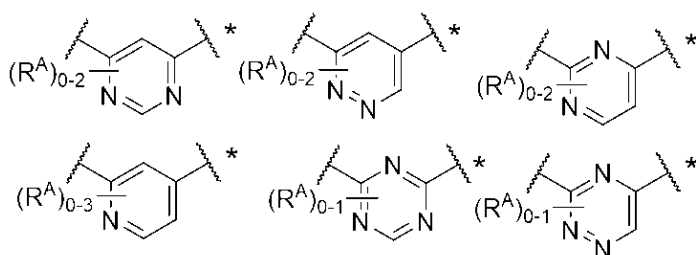
Cy^A が、酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 5 員もしくは 6 員単環式ヘテロアリーレン、または酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 7 ~ 12 員二環式ヘテロアリーレンであり、式中、 Cy^A は、0 ~ 4 個の $-R^A$ 基で置換されている、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

20

【請求項 4】

Cy^A が、以下：

【化 3】



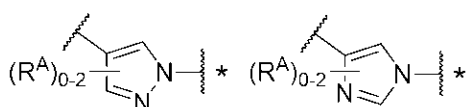
30

からなる群から選択され、式中、* は、L との結合点を表す、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 5】

Cy^A が、以下：

【化 4】



40

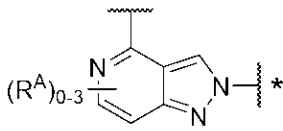
からなる群から選択され、式中、* は、L との結合点を表す、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6】

Cy^A が

50

【化 5】



であり、式中、*は、Lとの結合点を表す、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項7】

各 R^A が、ハロゲン、 $-OR$ 、及び任意に置換された C_{1-6} 脂肪族から独立して選択される、請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物。

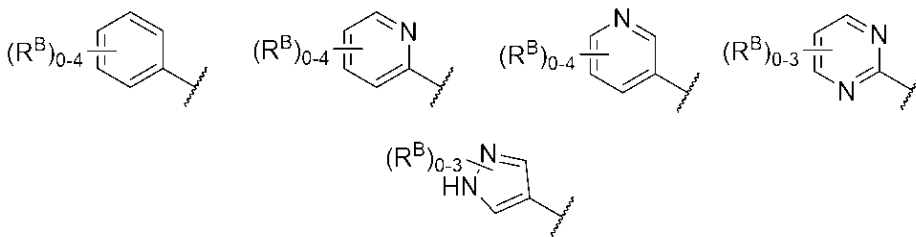
【請求項8】

Cy^B が、フェニルと、酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される1～3個のヘテロ原子を有する5～6員ヘテロアリアルと、酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される1～4個のヘテロ原子を有する7～10員ヘテロアリアルとから選択され、式中、 Cy^B は、0～4個の $-R^B$ 基で置換されている、請求項1～7のいずれかに記載の化合物。

【請求項9】

Cy^B が、以下：

【化 6】



からなる群から選択される、請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物。

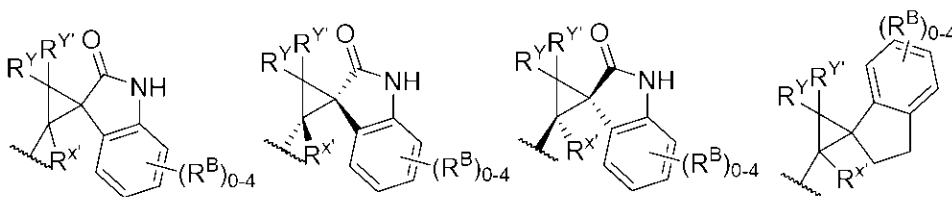
【請求項10】

Cy^B 及び R^X が、それらの介在する原子と共に、酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される0～4個のヘテロ原子を有する6～12員スピロ環式環系を形成し、 Cy^B 及び R^X によって形成される環(複数可)は、0～4個の $-R^B$ 基で置換されている場合がある、請求項1～7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項11】

Cy^B 及び R^X が、それらの介在する原子と共に、

【化 7】



から選択される6～12員スピロ環式環系を形成する、請求項1～7または10のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項12】

各 R^B が、オキソ、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-N(R)_2$ 、及び任意に置換された C_{1-6}

10

20

30

40

50

脂肪族から独立して選択される、請求項 1 ~ 1 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 3】

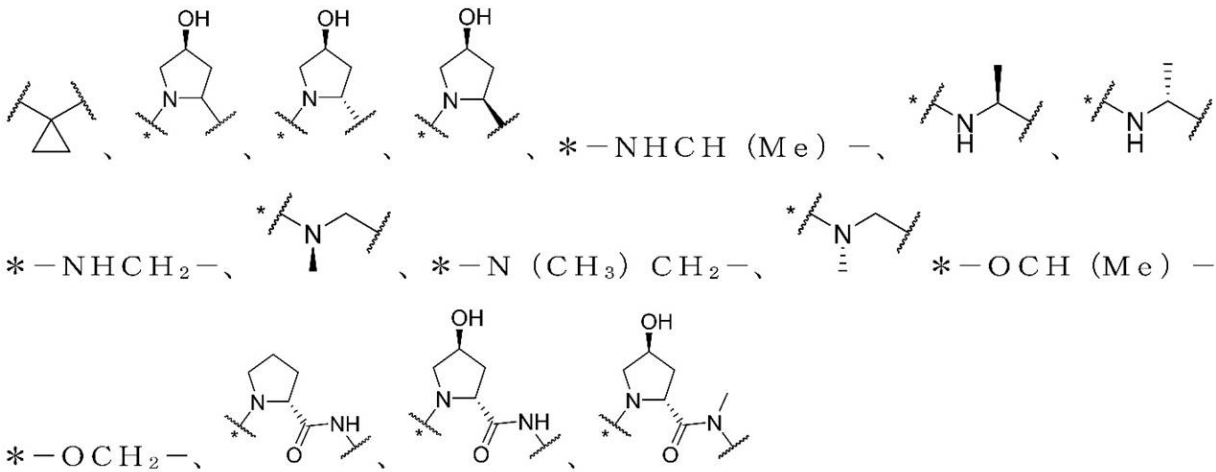
L が、任意に置換された C₁ ~ 3 炭化水素鎖であり、1 ~ 3 個のメチレン単位が任意に、かつ独立して - C (O) - 、 - O - 、 - N R^Z - 、任意に置換されたシクロプロピレン、または酸素、窒素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、任意に置換された 5 員もしくは 6 員飽和もしくは部分不飽和ヘテロシクレンで置換されている、請求項 1 ~ 1 2 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 1 4】

L が、

【化 8】

10



20

から選択され、式中、*は、C y^Aとの結合点を表す、請求項 1 ~ 1 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 5】

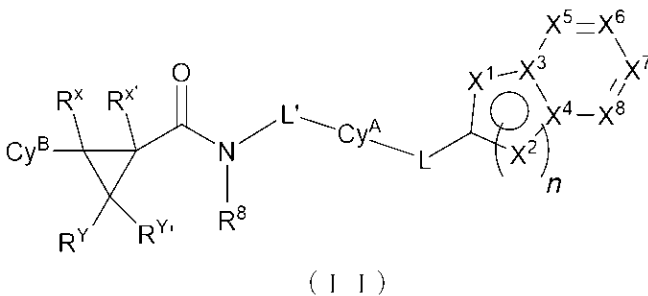
L' が共有結合である、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 6】

前記化合物が、式 (I I) :

【化 9】

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、

X¹ は、N、CH、または C - L^C - R^C であり、

各 X² は、N、CH、及び C - L^C - R^C から独立して選択され、

X³ 及び X⁴ は、独立して N または C であり、X³ または X⁴ のうち少なくとも 1 つは C であり、

X⁵、X⁶、X⁷、及び X⁸ の各々は、N、CH、及び C - L^C - R^C から独立して選択され、

n は、1 または 2 である、

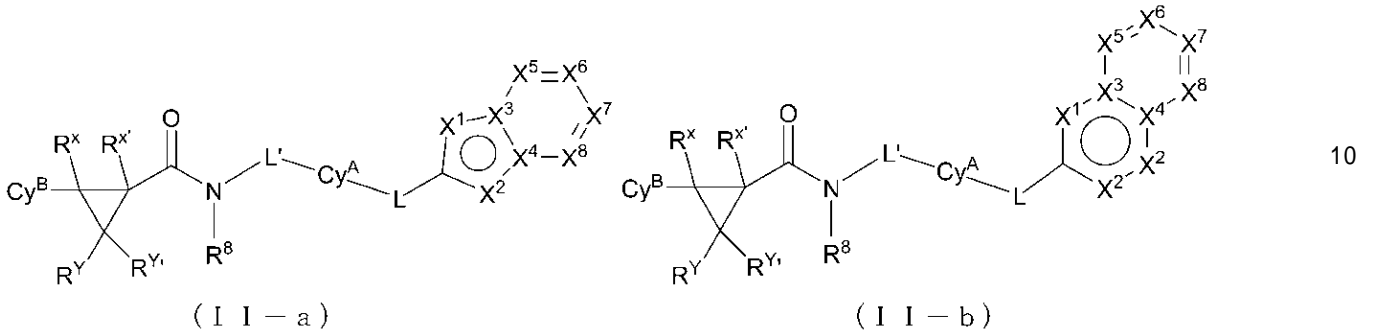
50

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 17】

前記化合物が、式 (II-a) もしくは (II-b) :

【化 10】

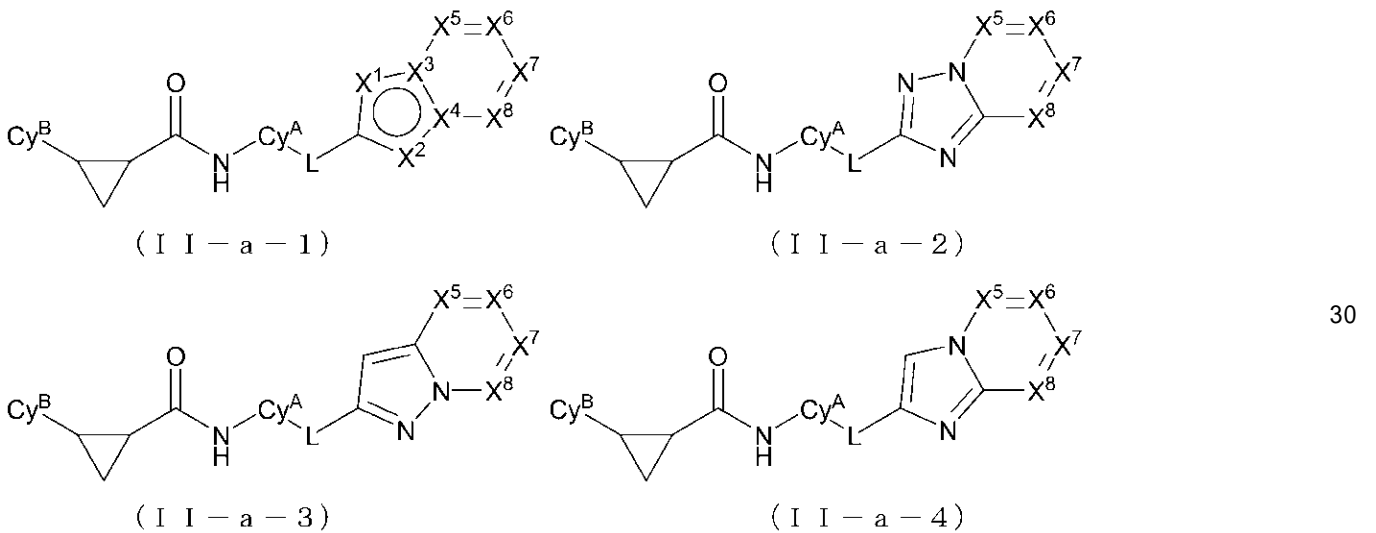


の化合物またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 18】

前記化合物が、式 (II-a-1)、(II-a-2)、(II-a-3)、もしくは (II-a-4) :

【化 11】



の化合物またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

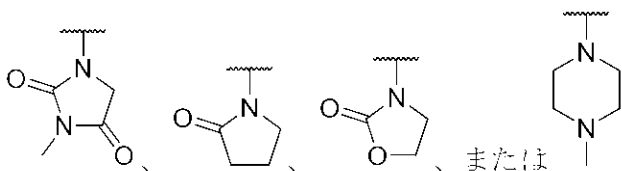
【請求項 19】

X^6 が $C-L^C-R^C$ であり、 L^C が共有結合であり、 R^C がシクロプロピルである、請求項 16 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 20】

X^8 が $C-L^C-R^C$ であり、 L^C が共有結合であり、 R^C が、

【化 12】



10

20

30

40

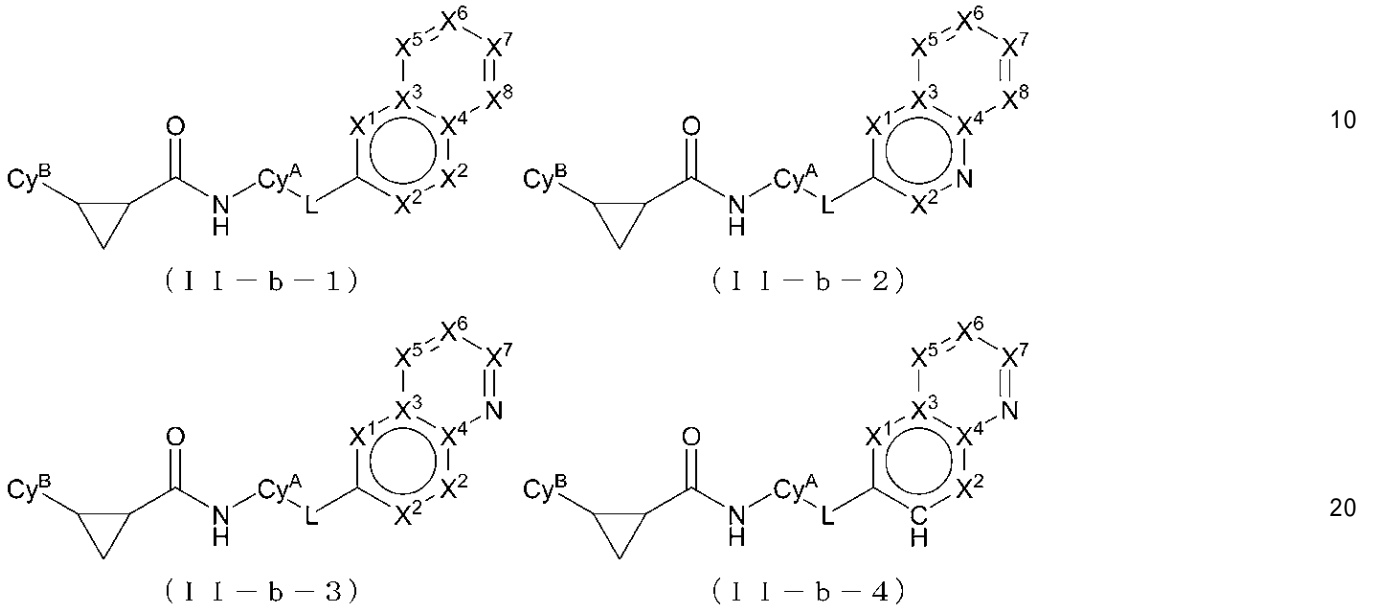
50

である、請求項 16 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 1】

前記化合物が、式 (I I - b - 1)、(I I - b - 2)、(I I - b - 3)、もしくは (I I - b - 4) :

【化 1 3】



の化合物またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

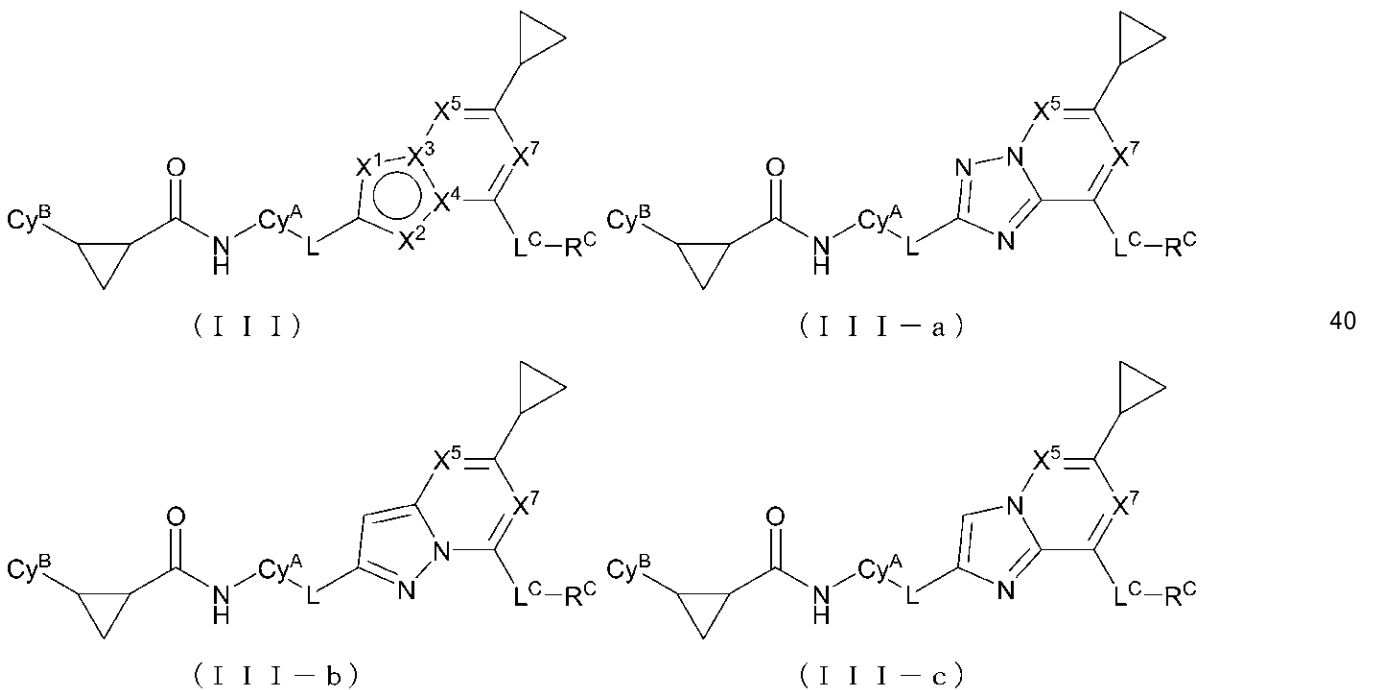
【請求項 2 2】

X¹、X³、X⁴、X⁵、及び X⁷ が C H である、請求項 2 1 に記載の化合物。

【請求項 2 3】

前記化合物が、式 (I I I)、式 (I I I - a)、式 (I I I - b)、もしくは式 (I I I - c) :

【化 1 4】

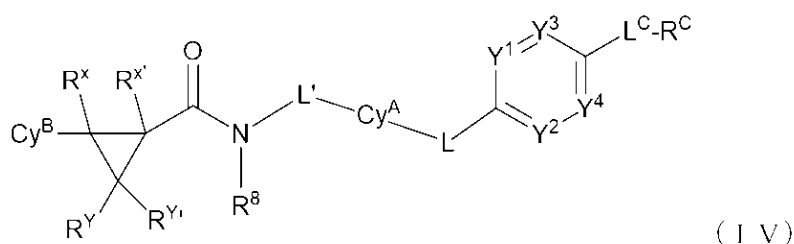


の化合物またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

前記化合物が、式 (I V) :

【化 1 5】



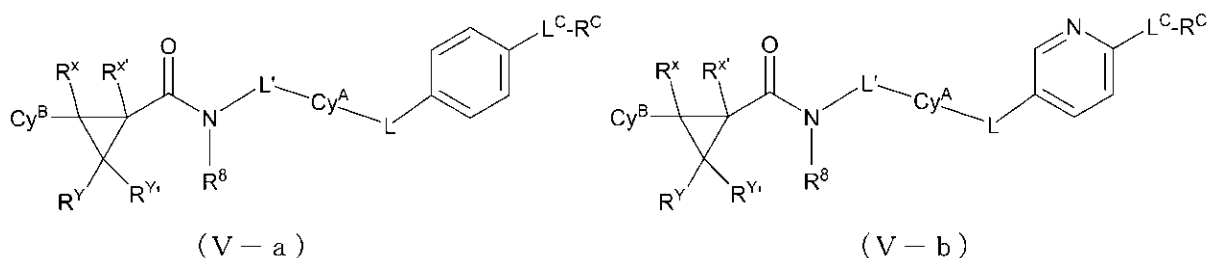
10

の化合物またはその薬学的に許容される塩であり、式中、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及び Y^4 の各々は、N、CH、及びC - L^C - R^C から独立して選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

前記化合物が、式 (V - a) もしくは式 (V - b) :

【化 1 6】



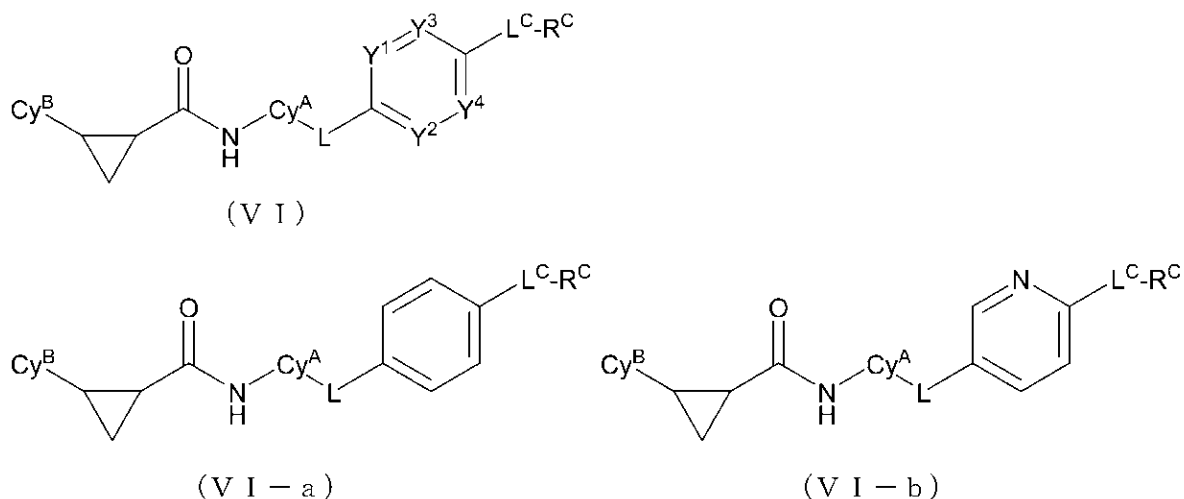
20

の化合物またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 または 2 4 に記載の化合物。

【請求項 2 6】

前記化合物が、式 (V I)、式 (V I - a)、もしくは式 (V I - b) :

【化 1 7】



40

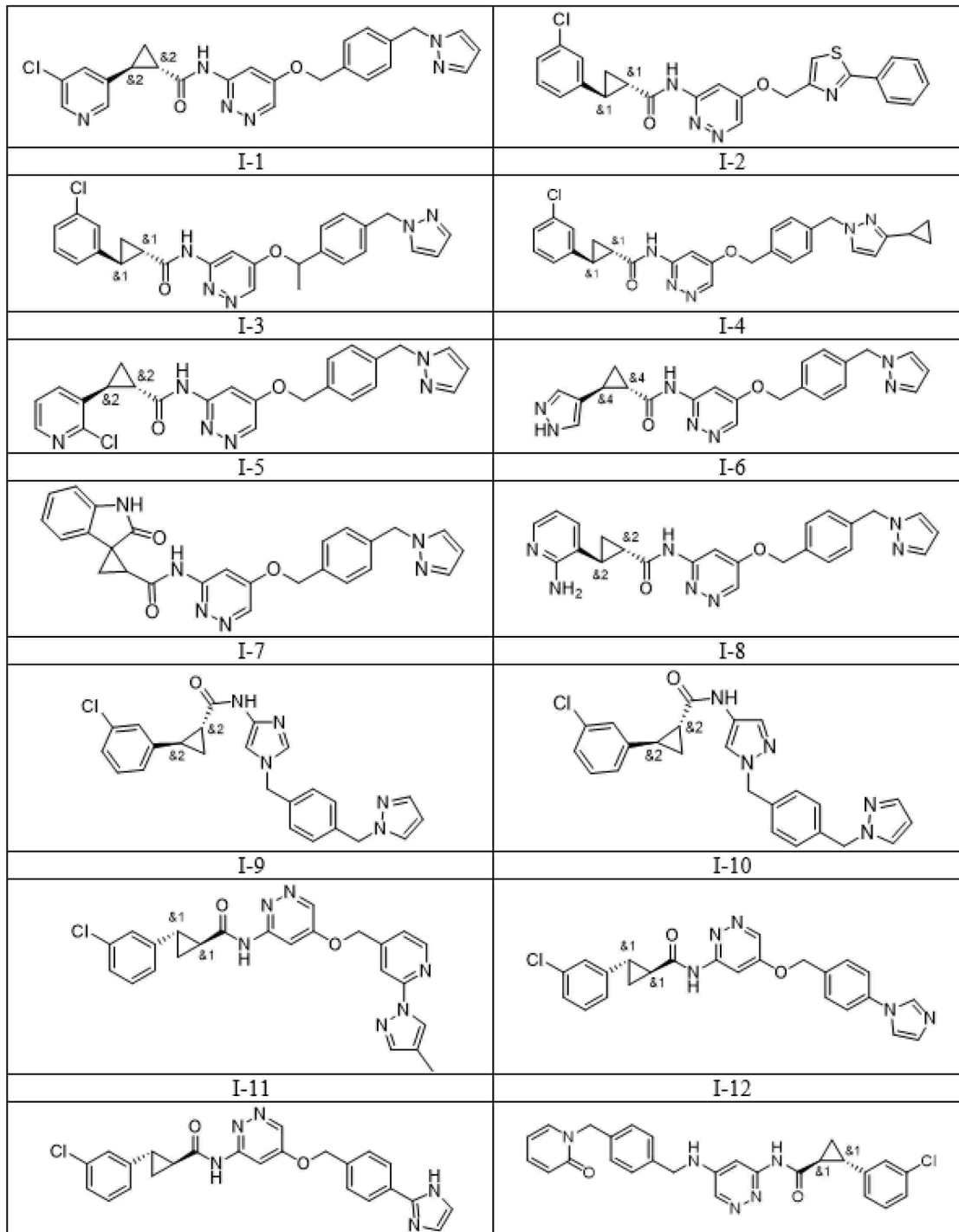
の化合物またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 または 2 4 ~ 2 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 7】

50

前記化合物が、以下：

【化 1 8】



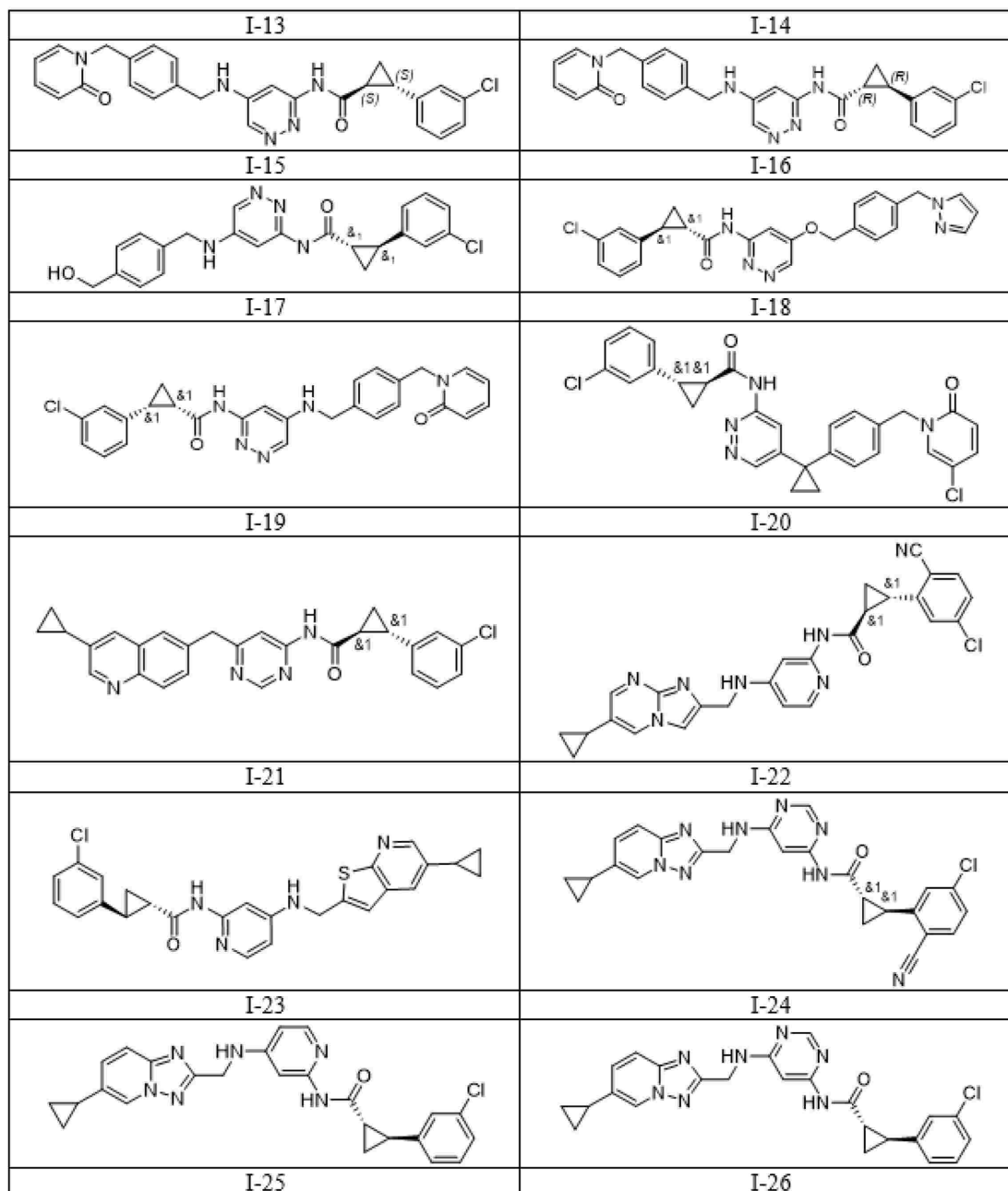
10

20

30

40

50



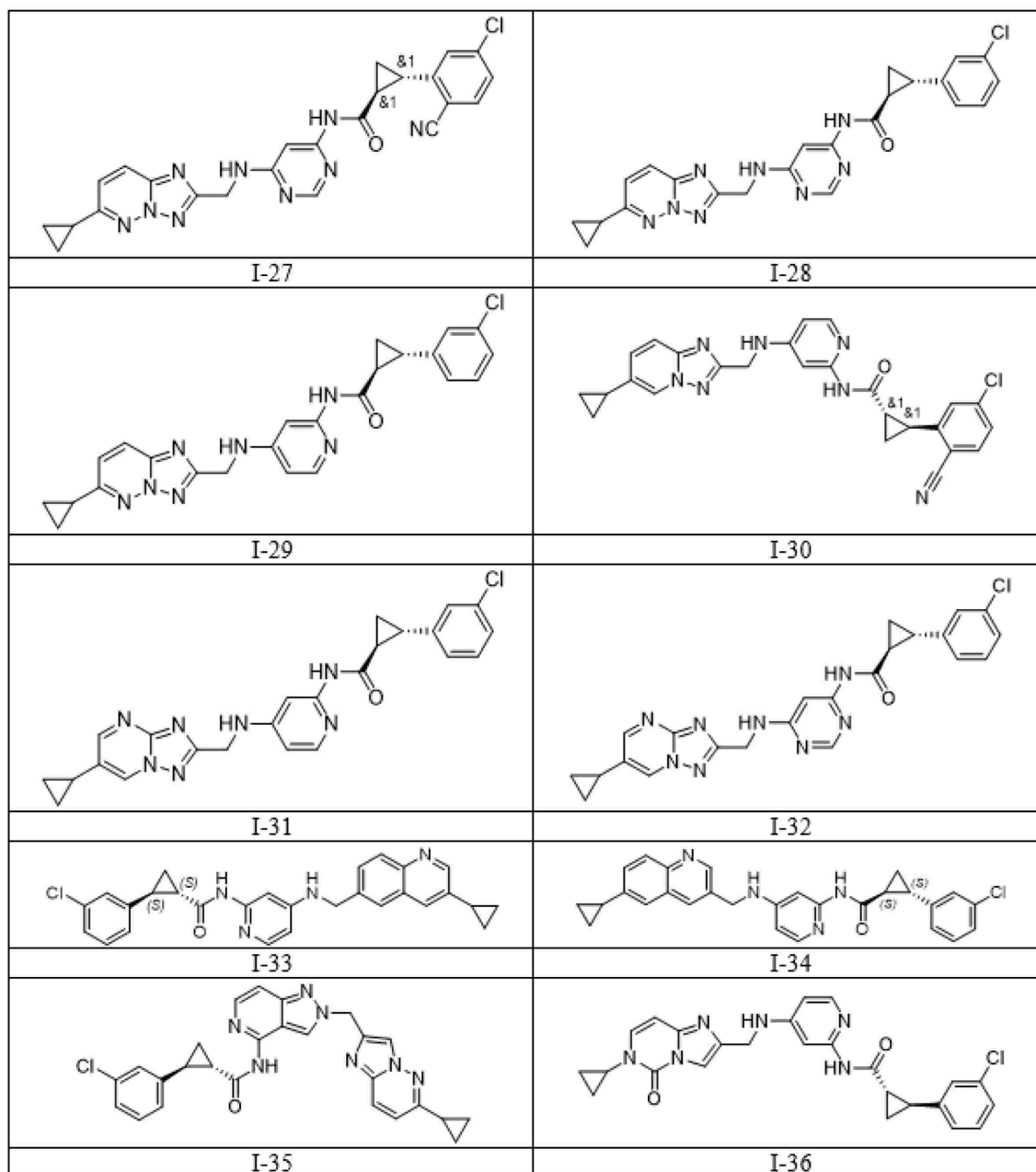
10

20

30

40

50



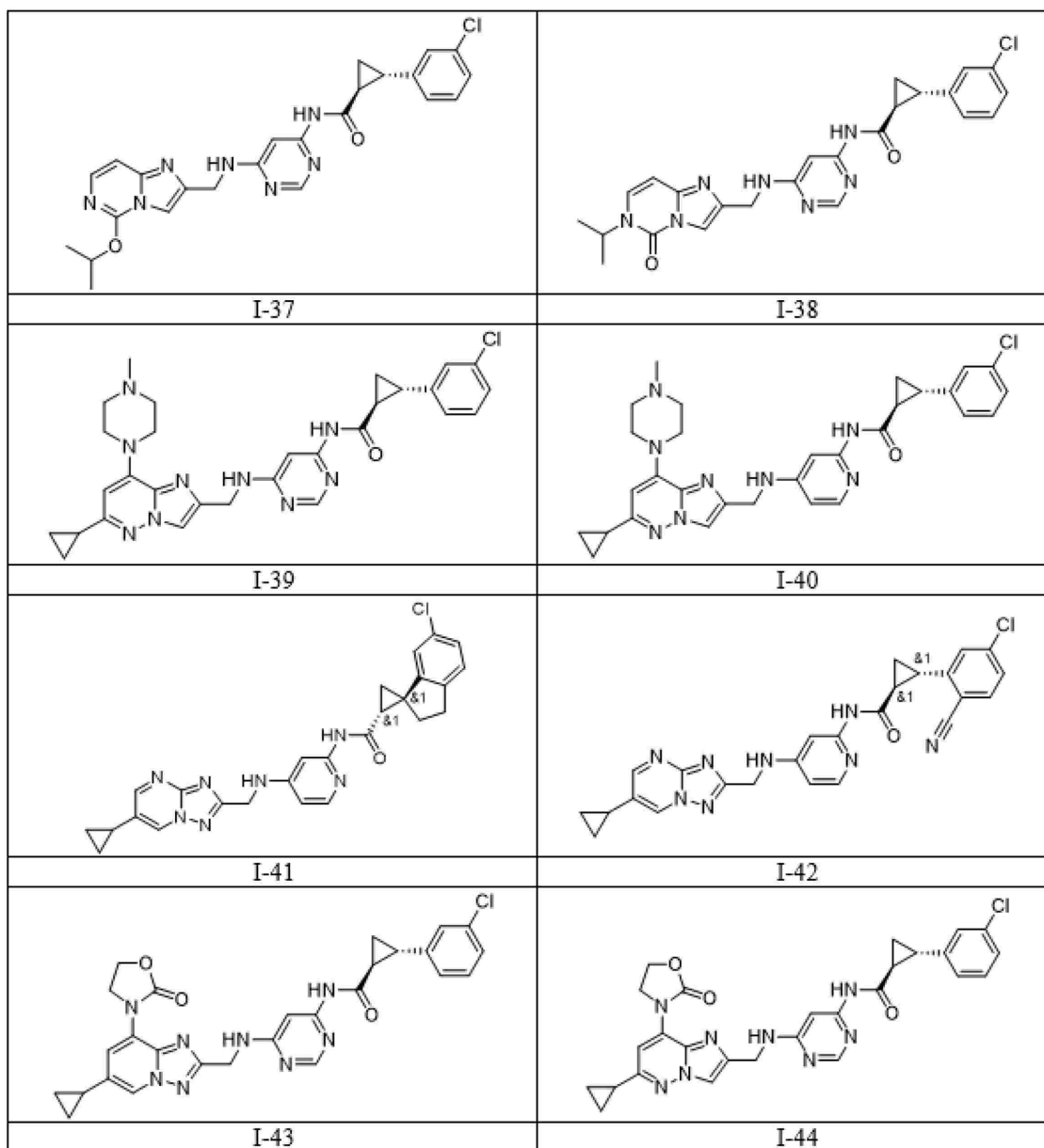
10

20

30

40

50



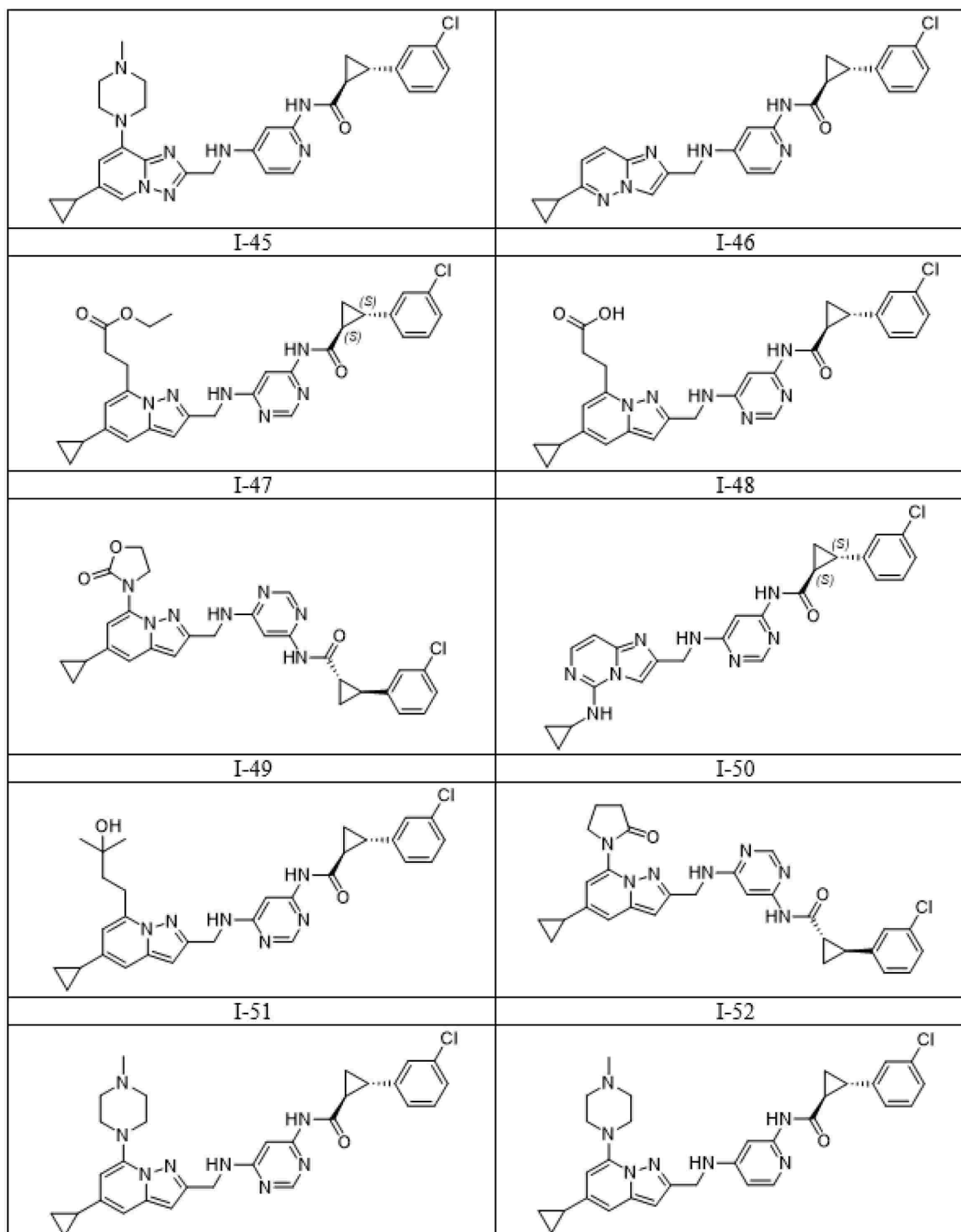
10

20

30

40

50



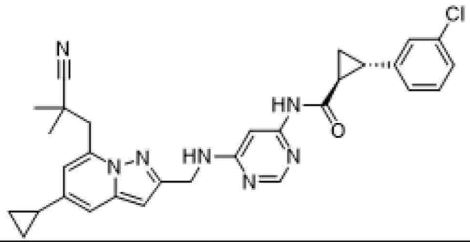
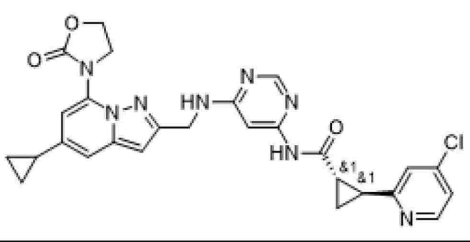
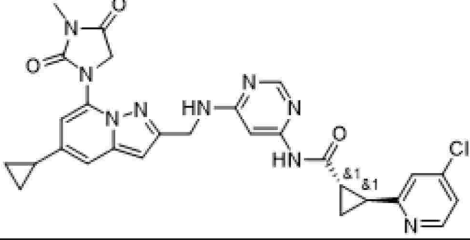
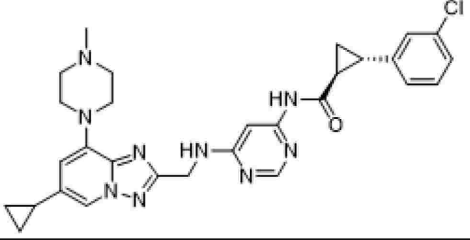
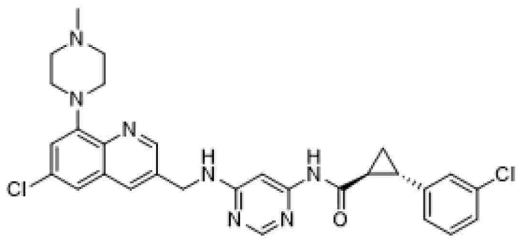
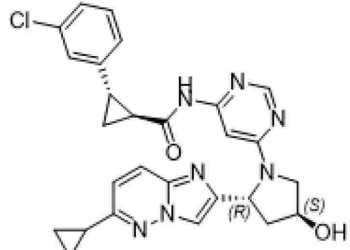
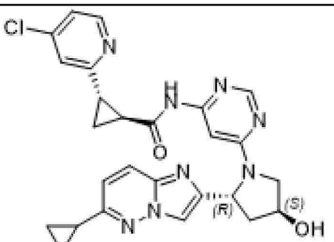
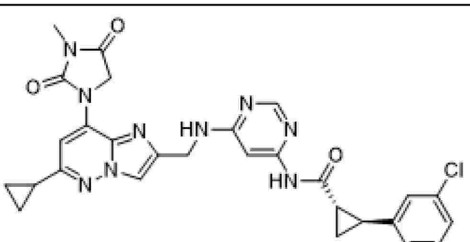
10

20

30

40

50

<p style="text-align: center;">I-53</p> 	<p style="text-align: center;">I-54</p> 
<p style="text-align: center;">I-55</p> 	<p style="text-align: center;">I-56</p> 
<p style="text-align: center;">I-57</p> 	<p style="text-align: center;">I-58</p> 
<p style="text-align: center;">I-59</p> 	<p style="text-align: center;">I-60</p> 
<p style="text-align: center;">I-61</p>	<p style="text-align: center;">I-62</p>

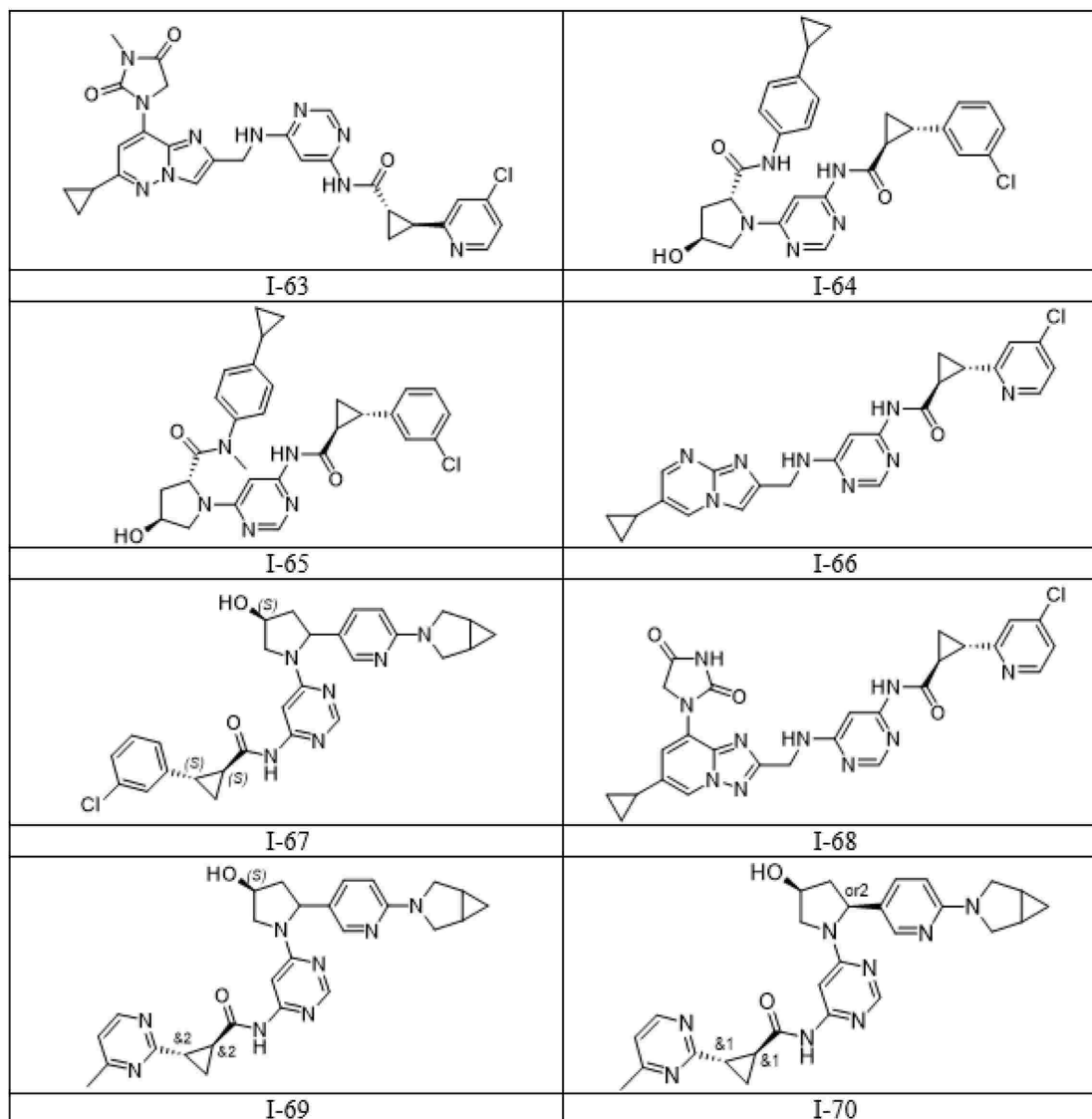
10

20

30

40

50



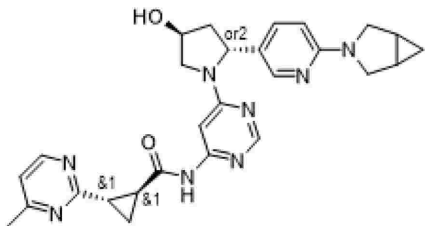
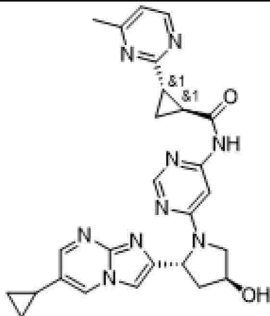
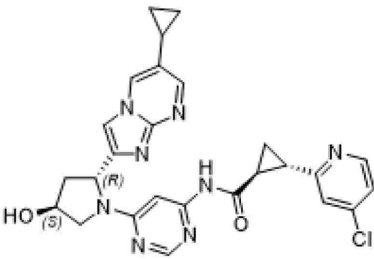
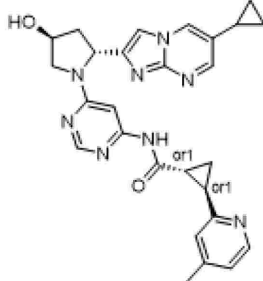
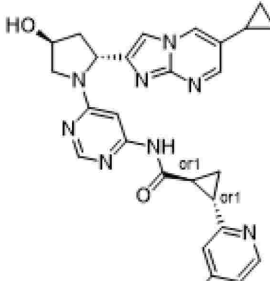
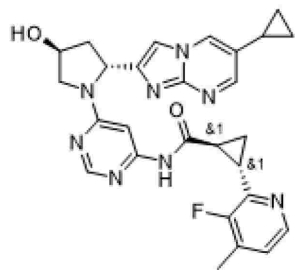
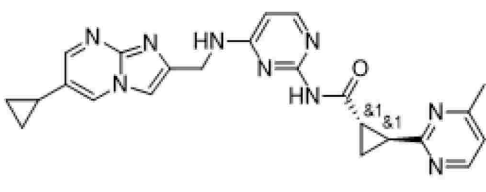
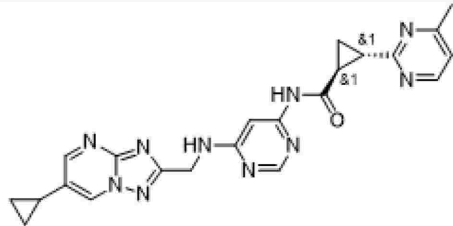
10

20

30

40

50

 <p>I-71</p>	 <p>I-72</p>
 <p>I-73</p>	 <p>I-74</p>
 <p>I-75</p>	 <p>I-76</p>
 <p>I-77</p>	 <p>I-78</p>

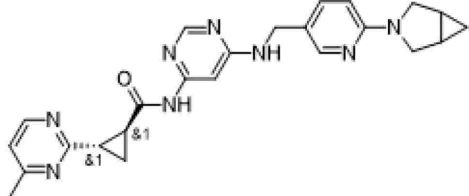
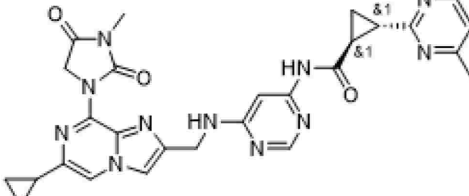
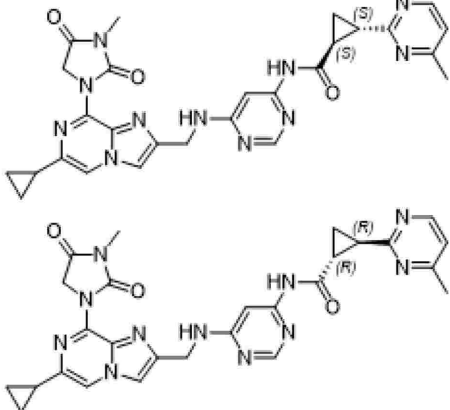
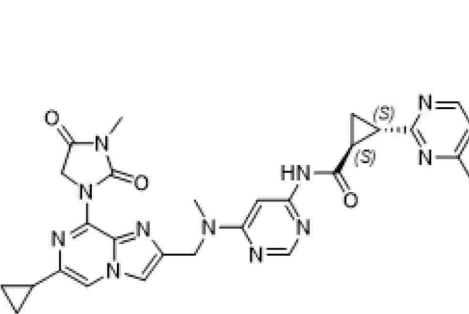
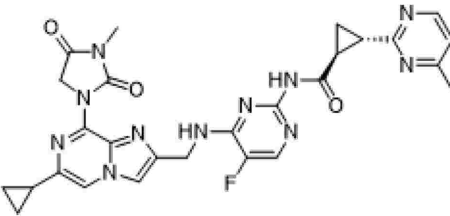
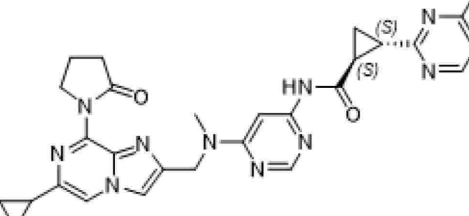
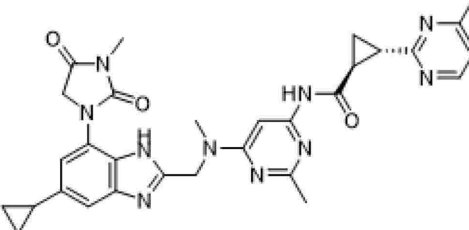
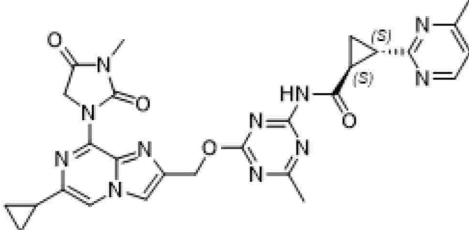
10

20

30

40

50

	
I-79	I-80
	
I-81 (第1 溶出異性体) 及び I-82 (第2 溶出異性体)	I-83
	
I-84	I-85
	
I-86	I-87

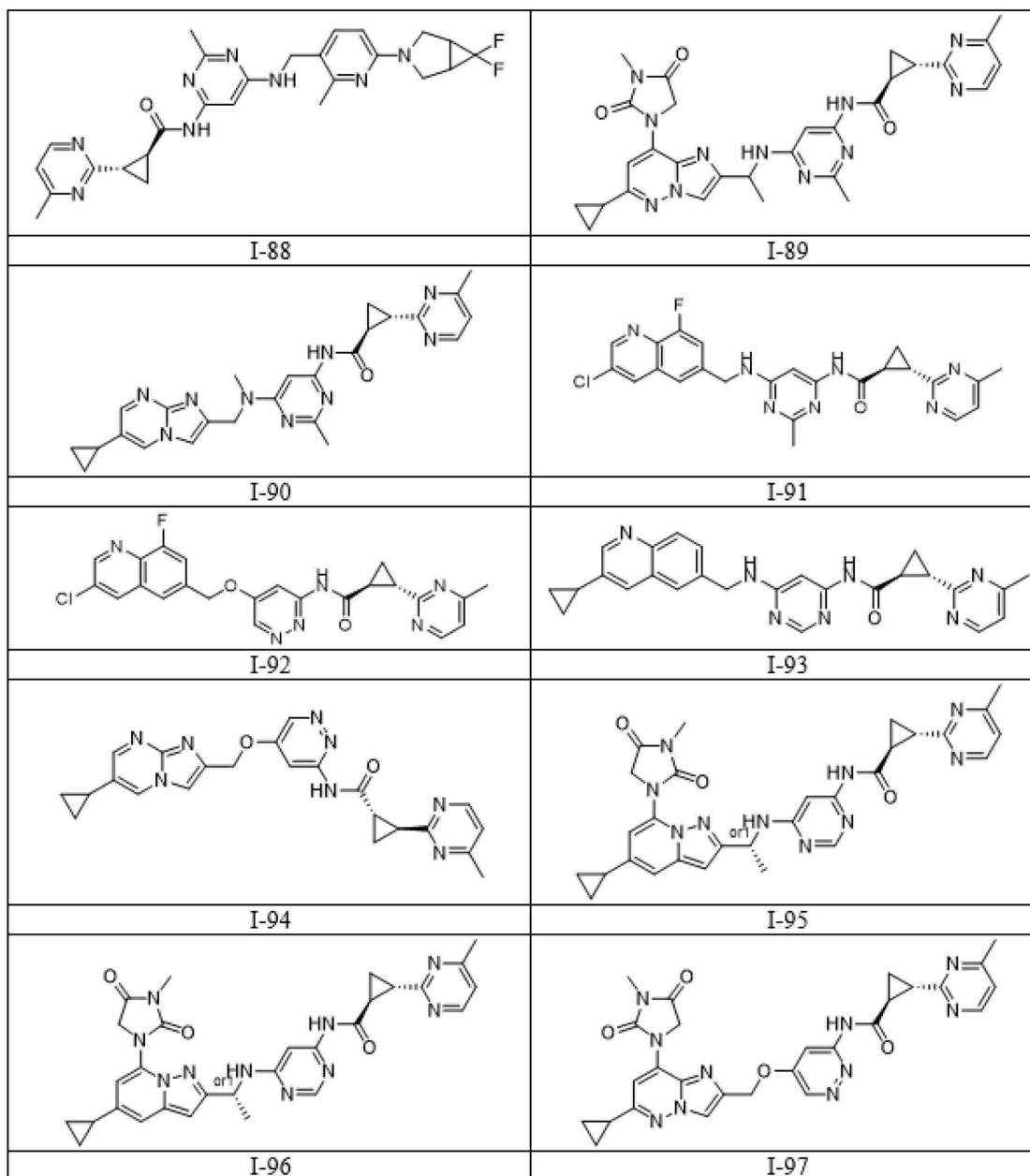
10

20

30

40

50



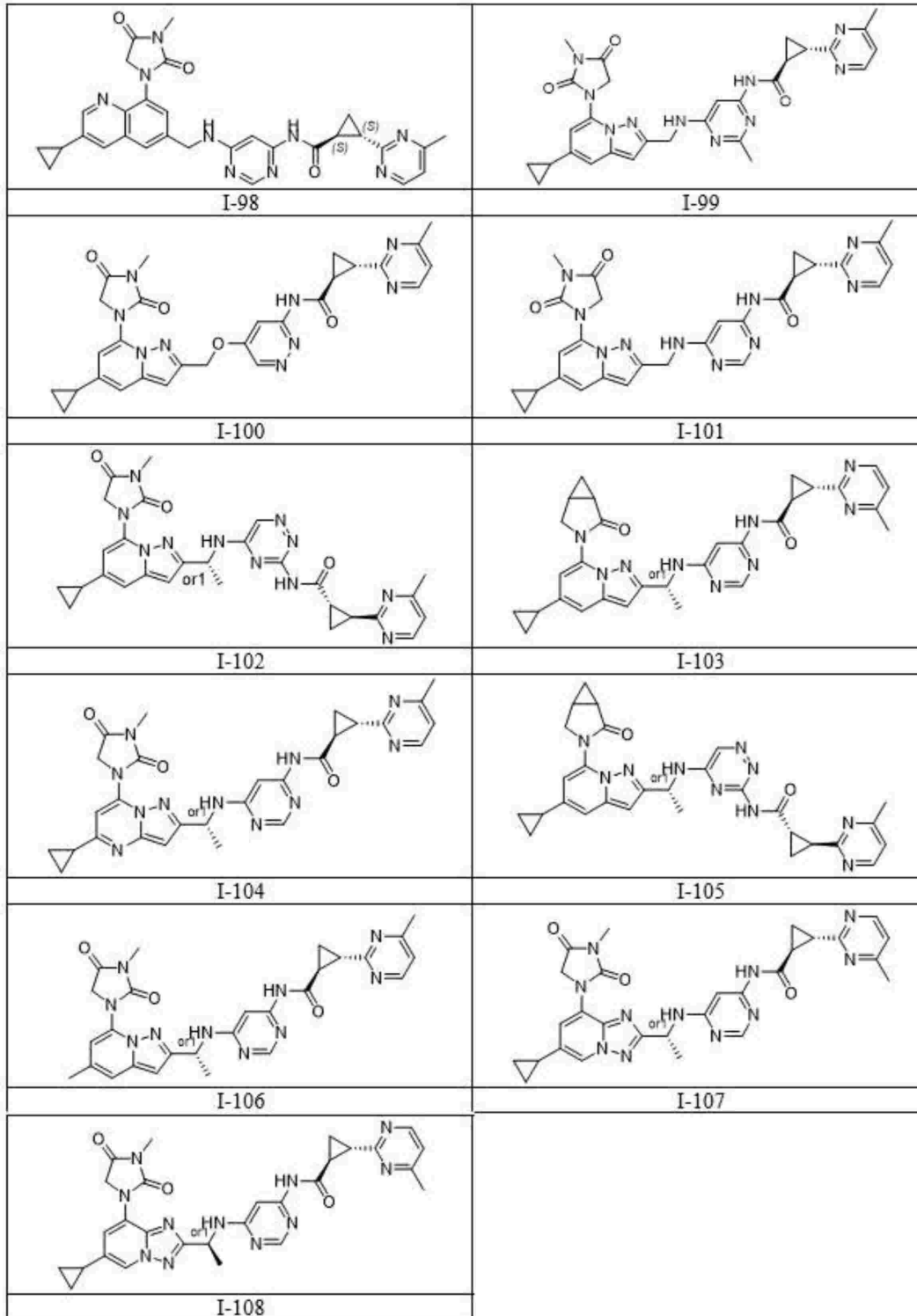
10

20

30

40

50



10

20

30

40

の化合物またはその薬学的に許容される塩から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 28】

請求項 1 ~ 27 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 29】

血漿カリクレイン媒介疾患または障害の治療に使用するための、請求項 1 ~ 28 のいずれか 1 項に記載の化合物または組成物。

【請求項 30】

前記疾患または障害が、遺伝性血管浮腫または糖尿病黄斑浮腫である、請求項 29 に記載の使用のための化合物または組成物。

50