【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2年4月23日(2020.4.23)

【公表番号】特表2019-508447(P2019-508447A)
【公表日】平成31年3月28日(2019.3.28)
【年通号数】公開・登録公報2019-012
【出願番号】特願2018-548205(P2018-548205)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 401/14 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4439 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 405/14 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 471/04 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/437 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4545 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 401/14 ＣＳＰ
Ａ６１Ｐ 35/00
Ａ６１Ｐ 43/00 １１１
Ａ６１Ｋ 31/4439
Ｃ０７Ｄ 405/14
Ｃ０７Ｄ 471/04 １０１
Ａ６１Ｋ 31/437
Ａ６１Ｋ 31/4545

【手続補正書】
【提出日】令和2年3月10日(2020.3.10)
【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（Ｉｃ）の構造を有する化合物、
【化１】



(Ic)

またはその薬学的に許容可能な塩であって、
ここで、
Ｒ^{1}は、水素、ハロゲン、－ＯＨ、－ＯＲ^{5}、－Ｎ（Ｒ^{5}）$_{2}$、アルキル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、カルボシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルキル、アラルキル、またはヘテロアリールアルキルであり、
Ｒ^{2}は、アルキル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、カル

ボシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルキル、アラルキル、またはヘテロアリールアルキルであり、
R^3は水素であり、
R^4は、水素、C_1－C_4アルキル、C_1－C_4アルケン、C_1－C_4アルキン、ハロゲン、または－ＣＮであり、および、
R^5はそれぞれ独立して、水素、アルキル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、カルボシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルキル、アラルキル、またはヘテロアリールアルキルである、化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。
【請求項２】
R^2はアルキルである、請求項１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３】
R^2はメチルである、請求項２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４】
R^2はカルボシクリルまたはカルボシクリルアルキルである、請求項１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５】
R^2はカルボシクリルであり、カルボシクリルは、ハロゲン、ヒドロキシ、－ＣＮ、アルキル、アルコキシ、アルキルアミノ、アリール、カルボシクリル、ヘテロシクリル、カルボシクリルアルキル、または、ヘテロシクリルアルキルの少なくとも１つで随意に置換された１，２，３，４－テトラヒドロナフチルである、請求項４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６】
R^2は－（C_1－C_6アルキレン）カルボシクリルである、請求項４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７】
（C_1－C_6アルキレン）はC_1アルキレンまたはC_2アルキレンである、請求項６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８】
R^2はヘテロシクリルまたはヘテロシクリルアルキルである、請求項１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】
R^2はヘテロアリールまたはヘテロアリールアルキルである、請求項１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１０】
R^2はアリールまたはアラルキルである、請求項１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１１】
アラルキルは－（C_1－C_6アルキレン）アリールである、請求項１０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１２】
（C_1－C_6アルキレン）はC_1アルキレンまたはC_2アルキレンである、請求項１１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１３】
アリールはフェニルまたはナフチルであり、前記フェニルまたはナフチルは、ハロゲン、ヒドロキシ、－ＣＮ、アルキル、アルコキシ、アルキルアミノ、アリール、カルボシクリル、ヘテロシクリル、カルボシクリルアルキル、またはヘテロシクリルアルキルの少なくとも１つで随意に置換される、請求項１０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１４】
R^1は水素またはアリールである、請求項１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１５】
Ｒ^{1}はアリールであり、アリールは、ハロゲン、ヒドロキシ、－ＣＮ、アルキル、アルコキシ、－Ｏ－（シクロアルキルアルキル）、アルキルアミノ、アリール、カルボシクリル、ヘテロシクリル、カルボシクリルアルキル、およびヘテロシクリルアルキルの少なくとも１つで随意に置換されたフェニルである、請求項１４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１６】
Ｒ^{4}はＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$アルキルであり、アルキルは、少なくとも１つのフルオロで置換される、請求項１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１７】
Ｒ^{4}はＣＨ$_{2}$Ｆ、ＣＨＦ$_{2}$、またはＣＦ$_{3}$である、請求項１６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１８】
前記化合物は、
２－｛１－［２－（２－クロロフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（１，２，３，４－テトラヒドロナフタレン－１－イル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［２－（２－エトキシフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］－２－（１－｛２－［２－（トリフルオロメチル）フェニル］エチル｝－１Ｈ－イミダゾール－４－イル）ピリジン，
２－｛１－［（４－フルオロフェニル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（４－フルオロフェニル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（４－クロロフェニル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（２－クロロフェニル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（４－メチルフェニル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（２－メチルフェニル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（４－メトキシフェニル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（２，４－ジフルオロフェニル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］

ピリジン，
２－｛１－［（２，６－ジフルオロフェニル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（４－フルオロ－２－メチルフェニル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（２－フルオロ－４－メチルフェニル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－（１－ベンジル－１Ｈ－イミダゾール－４－イル）－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－［１－（１－フェニルエチル）－１Ｈ－イミダゾール－４－イル］－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－［１－（１－フェニルプロピル）－１Ｈ－イミダゾール－４－イル］－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－［１－（２－メチル－１－フェニルプロピル）－１Ｈ－イミダゾール－４－イル］－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－（１－｛［２－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）フェニル］メチル｝－１Ｈ－イミダゾール－４－イル）－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［２－（４－フルオロフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［２－（３－フルオロフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［２－（２，３－ジフルオロフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［２－（２－クロロ－６－フルオロフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］－２－｛１－［２－（２，４，５－トリフルオロフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール４－イル｝ピリジン，
４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］－２－｛１－［２－（２，４，６－トリフルオロフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール４－イル｝ピリジン，
２－｛１－［（２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－１－イル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［２－（２－フルオロフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－［１－（６－フルオロ－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－１－イル）－１Ｈ－イミダゾール－４－イル］－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［２－（２，４－ジフルオロフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－

イル}－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［２－（２，６－ジフルオロフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［２－（２，５－ジフルオロフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（３Ｒ）－１－ベンゾイルピペリジン－３－イル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（３Ｓ）－１－ベンゾイルピペリジン－３－イル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［２－（４－メチルフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［２－（４－クロロフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［２－（４－メトキシフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］－２－（１－｛２－［４－（トリフルオロメチル）フェニル］エチル｝－１Ｈ－イミダゾール－４－イル）ピリジン，
２－｛１－［２－（４－エチルフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［２－（４－ｔｅｒｔ－ブチルフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－［５－（４－フルオロフェニル）－１－メチル－１Ｈ－イミダゾール－４－イル］－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（３，４－ジヒドロ－２Ｈ－１－ベンゾピラン－４－イル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（５－フルオロ－１，２，３，４－テトラヒドロナフタレン－１－イル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（６－フルオロ－１，２，３，４－テトラヒドロナフタレン－１－イル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（７－フルオロ－１，２，３，４－テトラヒドロナフタレン－１－イル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（６－メチル－１，２，３，４－テトラヒドロナフタレン－１－イル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，

２－｛１－［（７－メチル－１，２，３，４－テトラヒドロナフタレン－１－イル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（５－メトキシ－１，２，３，４－テトラヒドロナフタレン－１－イル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（６－メトキシ－１，２，３，４－テトラヒドロナフタレン－１－イル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
２－｛１－［（７－メトキシ－１，２，３，４－テトラヒドロナフタレン－１－イル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，　２－｛１－［（８－メトキシ－１，２，３，４－テトラヒドロナフタレン－１－イル）メチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝－４－［５－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル］ピリジン，
４－（５－フルオロ－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル）－２－｛１－［２－（４－フルオロフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝ピリジン、および、
４－（５－クロロ－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル）－２－｛１－［２－（４－フルオロフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝ピリジン
からなる群から選択される、請求項１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１９】
前記化合物は、４－（５－フルオロ－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル）－２－｛１－［２－（４－フルオロフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝ピリジン、および、４－（５－クロロ－１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル）－２－｛１－［２－（４－フルオロフェニル）エチル］－１Ｈ－イミダゾール－４－イル｝ピリジンからなる群から選択される、請求項１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２０】
請求項１の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩を含む医薬組成物。

【請求項２１】
ヒストンデメチラーゼ酵素を請求項１の化合物に接触させる工程を含む、ヒストンデメチラーゼ酵素を阻害する方法。

【請求項２２】
被験体の癌を処置するための薬剤の製造における、請求項１の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩の使用。