

【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7月29日(2021.7.29)

【公表番号】特表2019-501910(P2019-501910A)

【公表日】平成31年1月24日(2019.1.24)

【年通号数】公開・登録公報2019-003

【出願番号】特願2018-533630(P2018-533630)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 209/34 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 487/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/404 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

A 6 1 K 31/397 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

A 6 1 K 31/4995 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/08 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/04 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

C 0 7 C 205/57 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 209/34 C S P

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 487/08

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/5377  
A 6 1 K 31/553  
A 6 1 K 31/397  
A 6 1 K 31/541  
A 6 1 K 31/4995  
A 6 1 P 11/00  
A 6 1 P 29/00  
A 6 1 P 35/00  
A 6 1 P 17/00  
A 6 1 P 1/16  
A 6 1 P 31/12  
A 6 1 P 11/06  
A 6 1 P 37/08  
A 6 1 P 11/02  
A 6 1 P 11/08  
A 6 1 P 29/00 1 0 1  
A 6 1 P 19/02  
A 6 1 P 19/04  
A 6 1 P 37/02  
A 6 1 P 9/12  
A 6 1 P 17/02  
A 6 1 P 27/02  
A 6 1 P 27/06  
A 6 1 P 3/10  
C 0 7 C 205/57

【誤訳訂正書】

【提出日】令和3年6月7日(2021.6.7)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

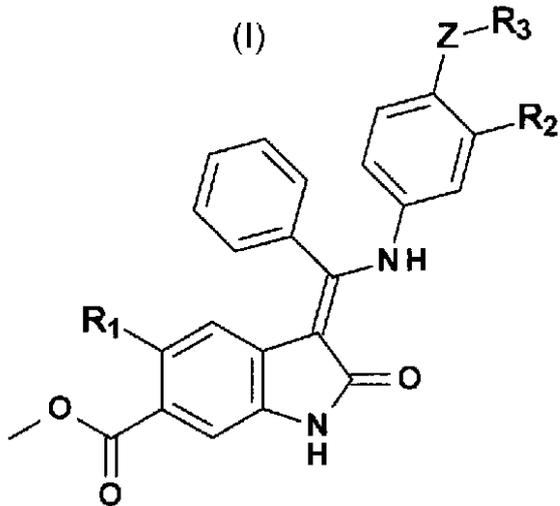
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物：

【化70】



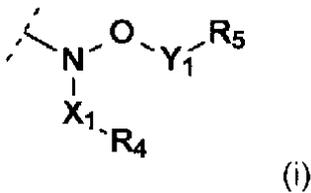
(式中、

$R_1$  は、H、Me、Et、 $CH=CH_2$ 、 $C-C-H$ または $C-C-Me$ を表し；

$R_2$  は、H、 $C_1-C_6$ アルキル、 $C_1-C_6$ アルコキシ、 $C_3-C_8$ シクロアルキル、 $-CH_2-$ ( $C_3-C_8$ シクロアルキル)、ハロゲンまたはシアノを表し；

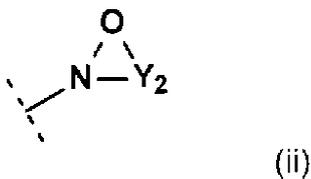
$R_3$  は、式(i)

【化71】



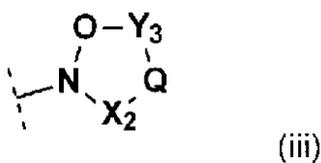
または式(ii)

【化72】



または式(iii)

【化73】



を表し；

Qは、O、NおよびSから選択されるヘテロ原子を表し、Nの場合には、 $C_1-C_4$ アルキルで場合により置換されていてもよく；

Zは、COまたは $SO_2$ を表し；

$Y_1$ は、 $(CH_2)_n$ を表し、nが0を表す場合を除いて、Meで場合により置換されていてもよく；

$X_1$ は、 $(CH_2)_m$ を表し、mが0を表す場合を除いて、Meで場合により置換されていてもよく；

nおよびmは独立して、0、1、2、3、4または5を表し；

$Y_2$  は、 $(CH_2)_s$  を表し、Me で場合により置換されていてもよく；

s は、2、3、4、5 または 6 を表し；

$Y_3$  は、 $(CH_2)_t$  を表し、Me で場合により置換されていてもよく；

$X_2$  は、 $(CH_2)_v$  を表し、Me で場合により置換されていてもよく；

t および v は独立して、2 または 3 を表していて、 $t + v = 4$  または 5 であり；

$R_4$  は、H、OH、 $NR_6R_7$ 、または O、N および S から選択される 1 個もしくはそれを超えるヘテロ原子を含有する脂肪族 4 ~ 8 員複素環を表していて、 $R_4$  が OH または  $NR_6R_7$  であるとき m は 2、3、4 または 5 であり；

$R_5$  は、H、OH、 $NR_8R_9$ 、または O、N および S から選択される 1 個もしくはそれを超えるヘテロ原子を含有する脂肪族 4 ~ 8 員複素環を表していて、 $R_5$  が OH または  $NR_8R_9$  であるとき n は 2、3、4 または 5 であり；

ここで、 $R_4$  および  $R_5$  が表し得る前記脂肪族 4 ~ 8 員複素環基は、カルボニルまたはスルホン基を場合により含有していてもよく、 $-C_1-C_4$  アルキル、 $C_1-C_4$  ヒドロキシアルキル、 $-C_1-C_4$  アルコキシ ( $C_1-C_4$ ) アルキル、 $-C_1-C_4$  アルキレン  $CONR_{10}R_{11}$ 、CN、OH および  $NR_{12}R_{13}$  から選択される 1 つまたはそれを超える基で場合により置換されていてもよく；

$R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$  は独立して、H を表すか、または OH、オキソ、 $NR_{14}R_{15}$  もしくは  $-C_1-C_4$  アルコキシで場合により置換されている  $C_1-C_4$  アルキルを表し；ならびに

$R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$ 、 $R_{13}$ 、 $R_{14}$  および  $R_{15}$  は独立して、H または  $C_1-C_4$  アルキルを表す)

またはその薬学的に許容され得る塩。

#### 【請求項 2】

1 つまたはそれを超える薬学的に許容され得る希釈剤または担体と組み合わせて、請求項 1 に記載の化合物を含む、医薬組成物。

#### 【請求項 3】

IPF、巨細胞間質性肺炎、サルコイドーシス、嚢胞性線維症、呼吸窮迫症候群、薬物誘導性肺線維症、肉芽腫症、珪肺症、石綿症 および全身性強皮症から選択される線維性疾患 もしくは 間質性肺疾患；C 型肝炎誘導性肝硬変から選択されるウイルス誘導性肝硬変；もしくは、強皮症、サルコイドーシスおよび全身性エリテマトーデスから選択される線維性成分を有する皮膚の疾患の処置のための、または がんおよび肺がんから選択される細胞の過剰増殖を特徴とする疾患の処置のための、または

COPD、慢性気管支炎、気腫、喘息、小児喘息、アレルギー性鼻炎、鼻炎 および副鼻腔炎から選択される呼吸器障害の処置のための

医薬を製造するための、請求項 1 に記載の化合物または請求項 2 に記載の組成物の使用。

#### 【請求項 4】

関節リウマチに関連する肺線維症、呼吸窮迫症候群、急性呼吸窮迫症候群、急性肺傷害、放射線誘導性肺線維症または肺炎、慢性過敏性肺炎、全身性硬化症、シェーグレン症候群、間質性肺疾患および肺動脈性高血圧症 (PAH) から選択される線維性疾患、；または肥厚性癭痕およびケロイドから選択される線維性成分を有する皮膚の疾患；または 緑内障、加齢性黄斑変性症、糖尿病性黄斑浮腫、ドライアイ疾患および糖尿病性網膜症から選択される線維症が構成要素である眼疾患；または

炎症性腸疾患に場合により関連する腸の線維症

の処置のための医薬を製造するための、請求項 1 に記載の化合物または請求項 2 に記載の組成物の使用。

#### 【請求項 5】

IPF、巨細胞間質性肺炎、サルコイドーシス、嚢胞性線維症、呼吸窮迫症候群、薬物誘導性肺線維症、肉芽腫症、珪肺症、石綿症 および全身性強皮症、ならびに C 型肝炎誘導性肝硬変から選択されるウイルス誘導性肝硬変から選択される線維性疾患 もしくは 間質性肺

疾患、もしくは、強皮症、サルコイドーシスおよび全身性エリテマトーデスから選択される線維性成分を有する皮膚の疾患を処置するための組成物；または  
がんおよび肺がんから選択される細胞の過剰増殖を特徴とする疾患を処置するための組成物；または

COPD、慢性気管支炎、気腫、喘息、小児喘息、アレルギー性鼻炎、鼻炎および副鼻腔炎から選択される呼吸器障害を処置するための組成物であって、  
 請求項 1 に記載の化合物または請求項 2 に記載の医薬組成物を含む、前記組成物。

【請求項 6】

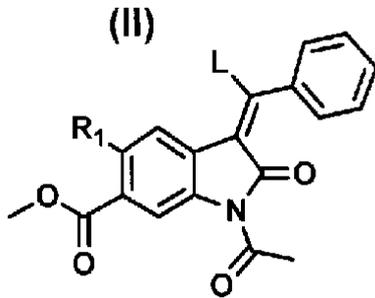
関節リウマチに関連する肺線維症、呼吸窮迫症候群（急性呼吸窮迫症候群を含む）、急性肺傷害、放射線誘導性肺線維症または肺炎、慢性過敏性肺炎、全身性硬化症、シェーグレン症候群、間質性肺疾患および肺動脈性高血圧症（PAH）から選択される線維性疾患；  
 または

肥厚性癬痕およびケロイドから選択される線維性成分を有する皮膚の疾患；または  
緑内障、加齢性黄斑変性症、糖尿病性黄斑浮腫、ドライアイ疾患および糖尿病性網膜症から選択される線維症が構成要素である眼疾患；または  
炎症性腸疾患に場合により関連する腸の線維症  
 を処置するための組成物であって、請求項 1 に記載の化合物または請求項 2 に記載の医薬組成物を含む、前記組成物。

【請求項 7】

式 (II) の化合物：

【化 7 4】



(式中、

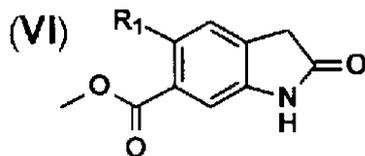
R<sub>1</sub> は、Me、Et、CH=CH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>C<sub>2</sub>-H または C<sub>1</sub>C<sub>2</sub>-Me を表し；および  
 L は、-OC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキルを表す)

またはその塩。

【請求項 8】

式 (VI) の化合物：

【化 7 5】



(式中、

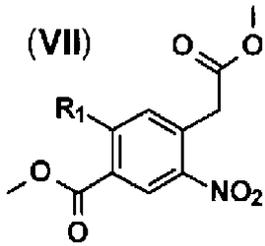
R<sub>1</sub> は、Et、CH=CH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>C<sub>2</sub>-H または C<sub>1</sub>C<sub>2</sub>-Me を表す)

またはその塩。

【請求項 9】

式 (VII) の化合物：

【化 7 6】



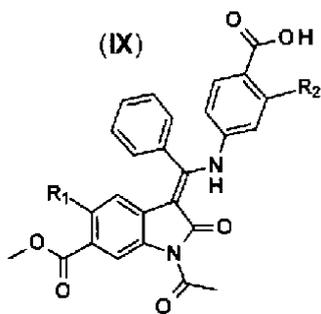
(式中、

$R_1$  は、Me、Et、 $CH=CH_2$ 、 $C-C-H$ または $C-C-Me$ を表す)  
 またはその塩。

【請求項 10】

式 (IX) の化合物：

【化 7 7】



(式中、

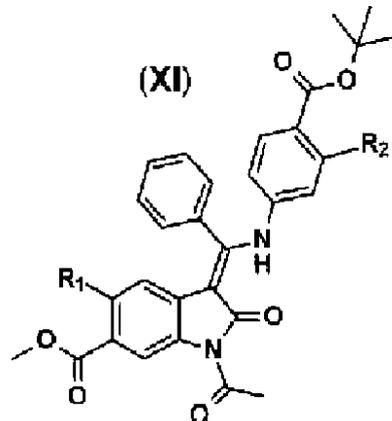
$R_1$  は、Me、Et、 $CH=CH_2$ 、 $C-C-H$ または $C-C-Me$ を表し；および  
 $R_2$  は、H、 $C_1-C_6$ アルキル、 $C_1-C_6$ アルコキシ、 $C_3-C_8$ シクロアルキル、 $-CH_2-$ ( $C_3-C_8$ シクロアルキル)、ハロゲンまたはシアノを表す)

またはその塩。

【請求項 11】

式 (XI) の化合物：

【化 7 8】



(式中、

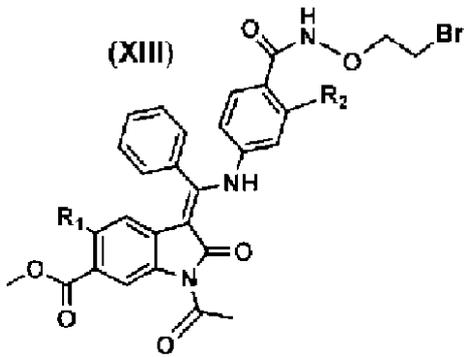
$R_1$  は、Me、Et、 $CH=CH_2$ 、 $C-C-H$ または $C-C-Me$ を表し；および  
 $R_2$  は、H、 $C_1-C_6$ アルキル、 $C_1-C_6$ アルコキシ、 $C_3-C_8$ シクロアルキル、 $-CH_2-$ ( $C_3-C_8$ シクロアルキル)、ハロゲンまたはシアノを表す)

またはその塩。

【請求項 12】

式 (XIII) の化合物：

## 【化 7 9】



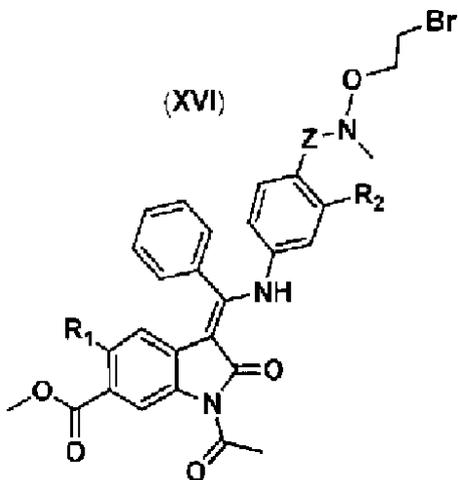
(式中、

$R_1$  は、Me、Et、 $CH=CH_2$ 、 $C-C-H$ または $C-C-Me$ を表し；および  
 $R_2$  は、H、 $C_1-C_6$ アルキル、 $C_1-C_6$ アルコキシ、 $C_3-C_8$ シクロアルキル、 $-CH_2-$ ( $C_3-C_8$ シクロアルキル)、ハロゲンまたはシアノを表す)  
 またはその塩。

## 【請求項 13】

式(XVI)の化合物：

## 【化 8 0】



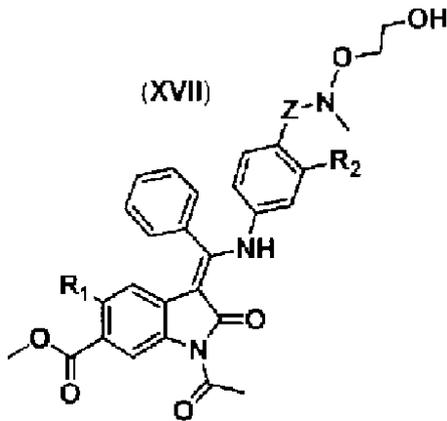
(式中、

Z は、COまたは $SO_2$ を表し；および  
 $R_1$  は、Me、Et、 $CH=CH_2$ 、 $C-C-H$ または $C-C-Me$ を表し；および  
 $R_2$  は、H、 $C_1-C_6$ アルキル、 $C_1-C_6$ アルコキシ、 $C_3-C_8$ シクロアルキル、 $-CH_2-$ ( $C_3-C_8$ シクロアルキル)、ハロゲンまたはシアノを表す)  
 またはその塩。

## 【請求項 14】

式(XVII)の化合物：

## 【化 8 1】



(式中、

Zは、COまたはSO<sub>2</sub>を表し；および

R<sub>1</sub>は、Me、Et、CH=CH<sub>2</sub>、C-C-HまたはC-C-Meを表し；および

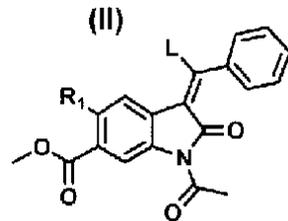
R<sub>2</sub>は、H、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>シクロアルキル、-CH<sub>2</sub>-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>シクロアルキル)、ハロゲンまたはシアノを表す)

またはその塩。

## 【請求項 15】

請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を調製するためのプロセスであって、式 (I I) の化合物：

## 【化 8 2】



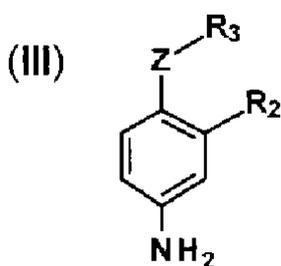
(式中、

R<sub>1</sub>は、請求項 1 で定義されるとおりであり；および

Lは、-OC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルを表す)

またはその塩を、式 (I I I) の化合物：

## 【化 8 3】



(式中、

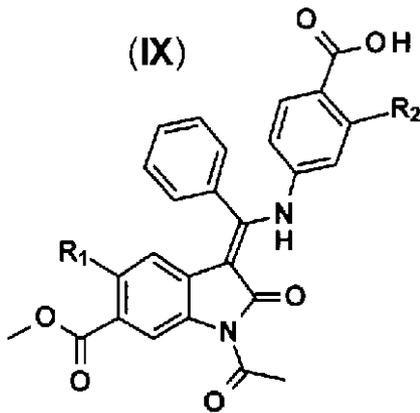
R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub> および Z は、請求項 1 で定義されるとおりである)

またはその塩と反応させることを含む、前記プロセス。

## 【請求項 16】

請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩 (式 (I) 中、Z は、CO であり、R<sub>3</sub> は、式 (i) である) を調製するためのプロセスであって、式 (I X) の化合物：

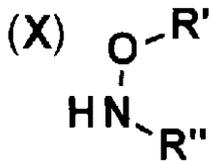
【化 8 4】



(式中、

$R_1$  および  $R_2$  は、請求項 1 で定義されるとおりである)  
 またはその塩を、式 (X) の化合物：

【化 8 5】



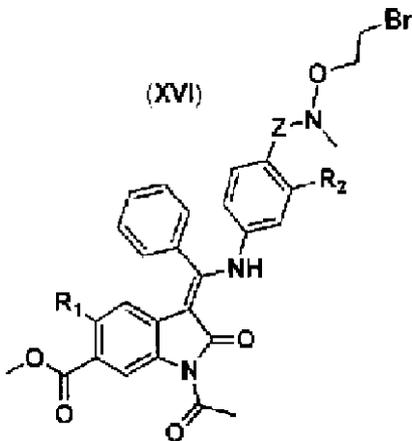
(式中、

$R'$  は、請求項 1 で定義される  $Y_1 - R_5$  を表し、  
 $R''$  は、請求項 1 で定義される  $X_1 - R_4$  を表す)  
 またはその塩と反応させることを含む、前記プロセス。

【請求項 17】

請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩 (式 (I) 中、 $R_3$  は、式 (i) であり、 $X_1 - R_4$  は、Me である) を調製するためのプロセスであって、式 (XV I) の化合物：

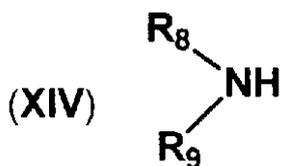
【化 8 6】



(式中、

$Z$ 、 $R_1$  および  $R_2$  は、請求項 1 で定義されるとおりである)  
 またはその塩を、式 (XIV) の化合物：

【化 8 7】



(式中、

$R_8$  および  $R_9$  は、請求項 1 で定義されるとおりであるか、または  $NR_8R_9$  は、請求項 1 で定義される O、N および S から選択される 1 個もしくはそれを超えるヘテロ原子を含有する脂肪族 4 ~ 8 員複素環を表す) またはその塩と反応させることを含む、前記プロセス。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0009

【訂正方法】変更

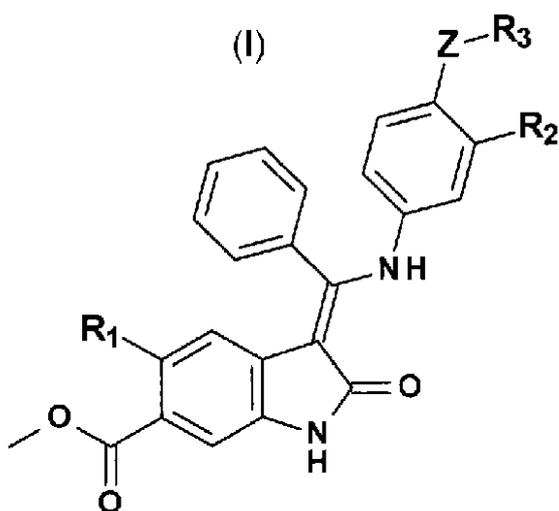
【訂正の内容】

【0009】

発明の要旨

本発明によれば、式 (I) の化合物：

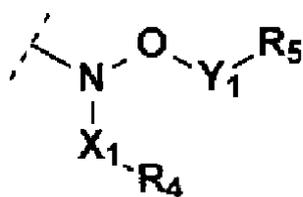
【化 1】



(式中、

 $R_1$  は、H、Me、Et、 $CH=CH_2$ 、 $C-C-H$  または  $C-C-Me$  を表し； $R_2$  は、H、 $C_1-C_6$  アルキル、 $C_1-C_6$  アルコキシ、 $C_3-C_8$  シクロアルキル、 $-CH_2-$  ( $C_3-C_8$  シクロアルキル)、ハロゲンまたはシアノを表し； $R_3$  は、式 (i)

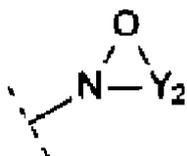
【化 2】



(i)

または式 (ii)

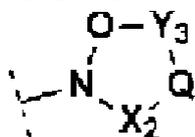
【化3】



(ii)

または式 (iii)

【化4】



(iii)

を表し；

Qは、O、NおよびSから選択されるヘテロ原子を表し、Nの場合には、 $C_1 - C_4$ アルキルで場合により置換されていてもよく；

Zは、COまたは $SO_2$ を表し；

$Y_1$ は、 $(CH_2)_n$ を表し、nが0を表す場合を除いて、Meで場合により置換されていてもよく；

$X_1$ は、 $(CH_2)_m$ を表し、mが0を表す場合を除いて、Meで場合により置換されていてもよく；

nおよびmは独立して、0、1、2、3、4または5を表し；

$Y_2$ は、 $(CH_2)_s$ を表し、Meで場合により置換されていてもよく；

sは、2、3、4、5または6を表し；

$Y_3$ は、 $(CH_2)_t$ を表し、Meで場合により置換されていてもよく；

$X_2$ は、 $(CH_2)_v$ を表し、Meで場合により置換されていてもよく；

tおよびvは独立して、2または3を表していて、 $t + v = 4$ または5であり；

$R_4$ は、H、OH、 $NR_6R_7$ 、またはO、NおよびSから選択される1個もしくはそれを超えるヘテロ原子を含有する脂肪族4～8員複素環を表していて、 $R_4$ がOHまたは $NR_6R_7$ であるときmは2、3、4または5であり；

$R_5$ は、H、OH、 $NR_8R_9$ 、またはO、NおよびSから選択される1個もしくはそれを超えるヘテロ原子を含有する脂肪族4～8員複素環を表していて、 $R_5$ がOHまたは $NR_8R_9$ であるときnは2、3、4または5であり；

ここで、 $R_4$ および $R_5$ が表し得る前記4～8員脂肪族複素環基は、カルボニルまたはスルホン基を場合により含有していてもよく、 $-C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ヒドロキシアルキル、 $-C_1 - C_4$ アルコキシ( $C_1 - C_4$ )アルキル、 $-C_1 - C_4$ アルキレンCONR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、CN、OHおよびNR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>から選択される1つまたはそれを超える基で場合により置換されていてもよく；

$R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ は独立して、Hを表すか、またはOH、オキソ、 $NR_{14}R_{15}$ もしくは $-C_1 - C_4$ アルコキシで場合により置換されている $C_1 - C_4$ アルキルを表し；ならびに

$R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$ 、 $R_{13}$ 、 $R_{14}$ および $R_{15}$ は独立して、Hまたは $C_1 - C_4$ アルキルを表す)またはその薬学的に許容され得る塩(以下、「本発明の化合物(単数または複数)」)が提供される。

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0029

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

## 【0029】

適切には、R<sub>4</sub> は、NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、または O、N および S から選択される 1 個もしくはそれを超えるヘテロ原子を含有する脂肪族 4 ~ 8 員複素環を表していて、R<sub>4</sub> が NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub> であるとき m は 2、3、4 または 5 であり、そして R<sub>5</sub> は、H または OH を表していて、R<sub>5</sub> が OH であるとき n は 2、3、4 または 5 である；または

R<sub>5</sub> は、NR<sub>8</sub>R<sub>9</sub>、または O、N および S から選択される 1 個もしくはそれを超えるヘテロ原子を含有する脂肪族 4 ~ 8 員複素環を表していて、R<sub>5</sub> が NR<sub>8</sub>R<sub>9</sub> であるとき n は 2、3、4 または 5 であり、R<sub>4</sub> は、H または OH を表していて、R<sub>4</sub> が OH であるとき m は 2、3、4 または 5 である。