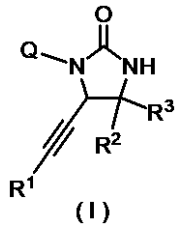
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和6年1月24日(2024.1.24)

【国際公開番号】WO2021/153665
【出願番号】特願2021-574104(P2021-574104)
【国際特許分類】
C07D513/04(2006.01)
C07D513/14(2006.01)
A61K 31/429(2006.01)
A61K 45/00(2006.01)
A61P 7/06(2006.01)
A61P 25/28(2006.01)
A61P 25/16(2006.01)
A61P 25/24(2006.01)
A61P 35/00(2006.01)
A61P 19/10(2006.01)
A61P 13/12(2006.01)
A61P 19/08(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ５１３/０４ ３０１
Ｃ０７Ｄ５１３/０４ ３５１
Ｃ０７Ｄ５１３/０４ ３２５
Ｃ０７Ｄ５１３/０４ ３４３
Ｃ０７Ｄ５１３/０４ ３２１
Ｃ０７Ｄ５１３/１４ ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ ３１/４２９
Ａ６１Ｋ ４５/００
Ａ６１Ｐ ７/０６
Ａ６１Ｐ ２５/２８
Ａ６１Ｐ ２５/１６
Ａ６１Ｐ ２５/２４
Ａ６１Ｐ ３５/００
Ａ６１Ｐ １９/１０
Ａ６１Ｐ １３/１２
Ａ６１Ｐ １９/０８

【手続補正書】
【提出日】令和6年1月16日(2024.1.16)
【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】
下式（Ｉ）：

【化１】



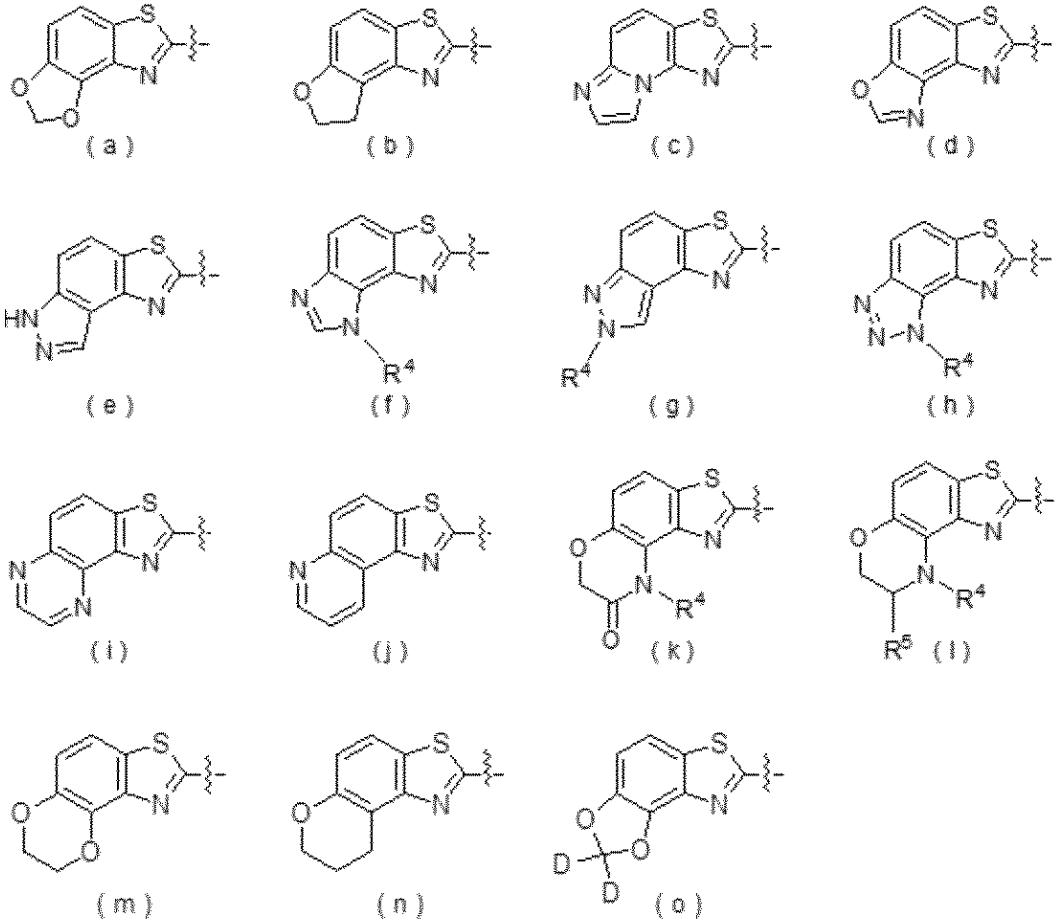
(I)

（式中、R^1は水素原子、ハロゲン原子、トリメチルシリル基、置換されていてもよいアリール基、置換されていてもよいヘテロアリール基、置換されていてもよい低級アルキル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表し、

R^2およびR^3は夫々独立して水素原子、ハロゲン原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいアリール基、置換されていてもよいヘテロアリール基、置換されていてもよい飽和複素環基、置換されていてもよい複素環式縮合環、置換されていてもよいアルコキシ基、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいアルキニル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいアルキルカルボニル基、カルボキシ基、アルコキシカルボニル基、アジド基、ニトリル基、置換されていてもよいカルバモイル基、置換されていてもよいチオエーテル基、置換されていてもよいアルキルスルホニル基、置換されていてもよいスルホンアミド基、ニトロ基、またはホルミル基を表し、

Qは以下の構造（ａ）～（ｏ）から選択される構造を示し、

【化２】



(a) (b) (c) (d)

(e) (f) (g) (h)

(i) (j) (k) (l)

(m) (n) (o)

R^4は水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいアルキルカルボニル基、置換されていてもよいアルキルスルホニル基、または置換されていてもよい飽和複素環基を表し、

Ｒ^{5}は水素原子または置換されていてもよい低級アルキル基を表す。）
で示されるアルキン誘導体またはその薬学的に許容される塩。
【請求項２】
式（Ｉ）において、Ｑが構造（ａ）～（ｄ）または（ｍ）から選択される、請求項１に記載のアルキン誘導体またはその薬学的に許容される塩。
【請求項３】
式（Ｉ）において、Ｑが構造（ａ）である、請求項２に記載のアルキン誘導体またはその薬学的に許容される塩。
【請求項４】
式（Ｉ）において、Ｑが構造（ｂ）である、請求項２に記載のアルキン誘導体またはその薬学的に許容される塩。
【請求項５】
式（Ｉ）において、Ｑが構造（ｃ）である、請求項２に記載のアルキン誘導体またはその薬学的に許容される塩。
【請求項６】
式（Ｉ）において、Ｑが構造（ｄ）である、請求項２に記載のアルキン誘導体またはその薬学的に許容される塩。
【請求項７】
式（Ｉ）において、Ｑが構造（ｍ）である、請求項２に記載のアルキン誘導体またはその薬学的に許容される塩。
【請求項８】
実施例１～８４に記載されたアルキン誘導体またはその薬学的に許容される塩。
【請求項９】
以下の化合物からなる群から選択される、請求項１に記載のアルキン誘導体またはその薬学的に許容される塩。
（Ｒ）－１－（［１，３］ジオキソロ［４’，５’：５，６］ベンゾ［１，２－ｄ］チアゾール－７－イル）－５－（１－プロピン－１－イル）イミダゾリジン－２－オン(実施例２)；
（４Ｓ，５Ｒ）－１－（７，８－ジヒドロベンゾフロ［４，５－ｄ］チアゾール－２－イル）－４－メチル－５－（プロパ－１－イン－１－イル）イミダゾリジン－２－オン（実施例５）；
１－（７，８－ジヒドロベンゾフロ［４，５－ｄ］チアゾール－２－イル）－５－（プロパ－１－イン－１－イル）イミダゾリジン－２－オン（実施例９）；
（４Ｓ，５Ｒ）－１－（［１，３］ジオキソロ［４’，５’：５，６］ベンゾ［１，２－ｄ］チアゾール－７－イル）－４－メチル－５－（プロパ－１－イン－１－イル）イミダゾリジン－２－オン（実施例２３）；
（４Ｓ，５Ｒ）－１－（７，８－ジヒドロ－［１，４］ジオキシノ［２’，３’：５，６］ベンゾ［１，２－ｄ］チアゾール－２－イル）－４－メチル－５－（プロパ－１－イン－１－イル）イミダゾリジン－２－オン（実施例５６）；
（４Ｓ，５Ｒ）－１－（８，９－ジヒドロ－７Ｈ－クロメノ［５，６－ｄ］チアゾール－２－イル）－４－メチル－５－（プロパ－１－イン－１－イル）イミダゾリジン－２－オン（実施例５７）；
１－（７，８－ジヒドロ－［１，４］ジオキシノ［２’，３’：５，６］ベンゾ［１，２－ｄ］チアゾール－２－イル）－５－（プロパ－１－イン－１－イル）イミダゾリジン－２－オン（実施例５８）；
（Ｒ）－１－（［１，３］ジオキソロ［４’，５’：５，６］ベンゾ［１，２－ｄ］チアゾール－７－イル－２，２－ｄ２）－５－（プロパ－１－イン－１－イル）イミダゾリジン－２－オン（実施例６２）；
ｃｉｓ－１－（７，８－ジヒドロ－［１，４］ジオキシノ［２’，３’：５，６］ベンゾ［１，２－ｄ］チアゾール－２－イル）－４－（ヒドロキシメチル）－５－（プロパ－１－

イン－１－イル）イミダゾリジン－２－オン（実施例６４）；
ｃｉｓ－１－（７，８－ジヒドロベンゾフロ［４，５－ｄ］チアゾール－２－イル）－４－エチル－５－（プロパ－１－イン－１－イル）イミダゾリジン－２－オン（実施例７３）；
ｃｉｓ－１－（７，８－ジヒドロベンゾフロ［４，５－ｄ］チアゾール－２－イル）－４－（メトキシメチル）－５－（プロパ－１－イン－１－イル）イミダゾリジン－２－オン（実施例７４）；
（４Ｒ，５Ｒ）－１－（７，８－ジヒドロベンゾフロ［４，５－ｄ］チアゾール－２－イル）－４－（（Ｒ）－１－ヒドロキシエチル）－５－（プロパ－１－イン－１－イル）イミダゾリジン－２－オン（実施例８２）；および
（４Ｒ，５Ｒ）－１－（７，８－ジヒドロベンゾフロ［４，５－ｄ］チアゾール－２－イル）－４－（（Ｓ）－１－ヒドロキシエチル）－５－（プロパ－１－イン－１－イル）イミダゾリジン－２－オン（実施例８４）。

【請求項１０】
請求項１から９のいずれか一項に記載のアルキン誘導体またはその薬学的に許容される塩を有効成分として含有する医薬。

【請求項１１】
請求項１から９のいずれか一項に記載のアルキン誘導体またはその薬学的に許容される塩を有効成分として含有する医薬組成物。

【請求項１２】
請求項１から９のいずれか一項に記載のアルキン誘導体またはその薬学的に許容される塩を有効成分として含有する、ＤＹＲＫが関与する疾患の治療剤及び／又は予防剤。

【請求項１３】
ＤＹＲＫが関与する疾患が、前頭側頭型認知症、進行性核上性麻痺、大脳皮質基底核変性症、レビー小体型認知症、血管性認知症、外傷性脳損傷、慢性外傷性脳症、脳卒中、アルツハイマー病、パーキンソン病、ダウン症、鬱病ならびにこれらに伴う精神遅滞、記憶障害、記憶喪失、学習障害、知的障害、認知機能障害、軽度認知障害、認知症症状進行の治療または認知症発症の予防あるいは脳腫瘍、膵臓がん、卵巣がん、骨肉腫、大腸がん、肺がん、骨吸収疾患、骨粗鬆症鎌状赤血球貧血または慢性腎疾患骨吸収疾患である、請求項１２に記載の治療剤及び／又は予防剤。

【請求項１４】
ＤＹＲＫが関与する疾患の治療剤及び／又は予防剤を製造するための、請求項１から９のいずれか一項に記載のアルキン誘導体またはその薬学的に許容される塩の使用。

【請求項１５】
請求項１０に記載の医薬と、抗がん剤、抗精神病薬、抗認知症薬、抗てんかん薬、抗うつ薬、胃腸薬、甲状腺ホルモン薬又は抗甲状腺薬に分類される薬剤から選択される少なくとも１種以上の薬剤とを組み合わせてなる医薬。

【請求項１６】
抗がん剤、抗精神病薬、抗認知症薬、抗てんかん薬、抗うつ薬、胃腸薬、甲状腺ホルモン薬又は抗甲状腺薬に分類される薬剤から選択される少なくとも１種以上の薬剤と併用して前頭側頭型認知症、進行性核上性麻痺、大脳皮質基底核変性症、レビー小体型認知症、血管性認知症、外傷性脳損傷、慢性外傷性脳症、脳卒中、アルツハイマー病、パーキンソン病、ダウン症、鬱病ならびにこれらに伴う合併症、精神遅滞、記憶障害、記憶喪失、学習障害、知的障害、認知機能障害、軽度認知障害、認知症症状進行の治療又は認知症発症の予防あるいは脳腫瘍、膵臓がん、卵巣がん、骨肉腫、大腸がん、肺がん、骨吸収疾患、骨粗鬆症、鎌状赤血球貧血又は慢性腎疾患骨吸収疾患を治療するための、請求項１５に記載の医薬。