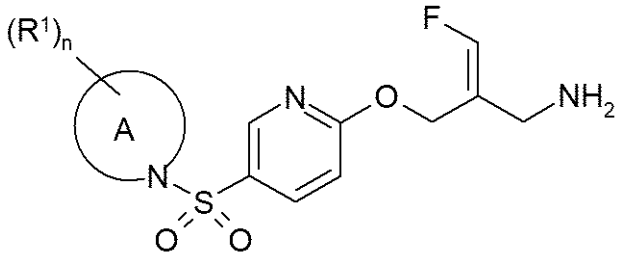
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和４年１０月５日(２０２２.１０.５)

【国際公開番号】ＷＯ２０２０/０８９０２５
【公表番号】特表２０２２-５０６０５９(Ｐ２０２２-５０６０５９Ａ)
【公表日】令和４年１月１７日(２０２２.１.１７)
【年通号数】公開公報(特許)２０２２-００７
【出願番号】特願２０２１-５２３２１４(Ｐ２０２１-５２３２１４)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ４０１/１２(２００６.０１)
Ａ６１Ｋ ３１/４４４(２００６.０１)
Ｃ０７Ｄ４０１/１４(２００６.０１)
Ａ６１Ｋ ３１/４４３９(２００６.０１)
Ａ６１Ｋ ４５/００(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ４３/００(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ３５/００(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ３/０６(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ １/１６(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ １１/００(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ２７/０２(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ １３/１２(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ９/００(２００６.０１)
Ａ６１Ｋ ３１/５３７７(２００６.０１)
Ｃ０７Ｄ４０７/１４(２００６.０１)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ４０１/１２ ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ ３１/４４４
Ｃ０７Ｄ４０１/１４
Ａ６１Ｋ ３１/４４３９
Ａ６１Ｋ ４５/００
Ａ６１Ｐ ４３/００ １２１
Ａ６１Ｐ ３５/００
Ａ６１Ｐ ３/０６
Ａ６１Ｐ １/１６
Ａ６１Ｐ １１/００
Ａ６１Ｐ ２７/０２
Ａ６１Ｐ １３/１２
Ａ６１Ｐ ９/００
Ａ６１Ｐ ４３/００ １１１
Ａ６１Ｋ ３１/５３７７
Ｃ０７Ｄ４０７/１４

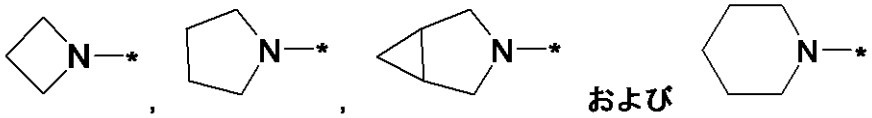
【手続補正書】
【提出日】令和４年９月２６日(２０２２.９.２６)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】

【特許請求の範囲】
【請求項１】
式（Ｉ）の化合物またはその塩。
【化１】



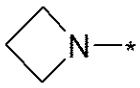
Ｉ

（式中、
環Ａは、
【化２】



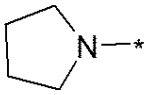
からなる群から選択され、
Ｒ^{1}は、Ｈ、Ｆ、Ｃｌ、Ｂｒ、ＣＮ、－ＯＨ、Ｃ$_{1-4}$－アルキル、－Ｏ－（Ｃ$_{1-4}$－アルキル）、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－ＣＯＯＨ、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－（Ｃ$_{1-4}$－アルキル）、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－Ｃ（＝Ｏ）－ヘテロシクリル、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－（Ｃ$_{1-4}$－アルキル）、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-4}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{3-6}$－シクロアルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－ヘテロシクリル、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－（Ｃ$_{1-4}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－（Ｃ$_{1-4}$－アルキル）、ヘテロシクリル、およびフェニル、からなる群から選択され、
ここで、各アルキル基またはアルキルサブ基は、１つもしくは複数のＦ原子で、または１つのＯＨもしくは－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）基で置換されていてもよく；
ここで、各ヘテロシクリルは、アゼチジニル、イミダゾリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、モルホリニルからなる群から選択されており、ＯＨ基、オキソ基、Ｃ$_{1-3}$－アルキル基、－Ｃ（＝Ｏ）－ＣＨ$_{3}$基、および－Ｃ（＝Ｏ）－シクロプロピル基、からなる群から独立して選択される１つまたは２つの基で置換されていてもよく；
ここで、ｎが２である場合、複数のＲ^{1}は同一でも異なっていてもよく；
ｎは、１および２から選択される整数であり；
ｍは、０、１、および２から選択される整数であり；
ここで、上記のいずれの定義においても、他に特定されない限り、任意のアルキル基またはアルキルサブ基は、直鎖または分岐鎖であってもよく、１つまたは複数のＦ原子で置換されていてもよい）
【請求項２】
Ｒ^{1}が、Ｈ、Ｆ、－ＯＨ、Ｃ$_{1-2}$－アルキル、－Ｏ－（Ｃ$_{1-2}$－アルキル）、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－ＣＯＯＨ、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－（Ｃ$_{1-2}$－アルキル）、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－Ｃ（＝Ｏ）－ヘテロシクリル、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－（Ｃ$_{1-4}$－アルキル）、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-2}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－シクロプロピル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－ヘテロシクリル、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－（Ｃ$_{1-2}$－アルキル）および－ヘテロシクリル

、からなる群から選択され、
ここで、各アルキル基またはアルキルサブ基は、１つもしくは複数のＦ原子で、または１つのＯＨもしくは－Ｏ－（$Ｃ_{1-2}$－アルキル）基で置換されていてもよく；
ここで、各ヘテロシクリルは、アゼチジニル、イミダゾリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、およびモルホリニルからなる群から選択されており、ＯＨ、オキソ、$Ｃ_{1-2}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－$ＣＨ_3$、および－Ｃ（＝Ｏ）－シクロプロピル、からなる群から独立して選択される１つまたは２つの基で置換されていてもよく；
ここで、ｍは、０または１であり；
ここで、ｎが２である場合、複数の$Ｒ^1$は同一でも異なっていてもよい、
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物またはその塩。
【請求項３】
$Ｒ^1$が、Ｈ、－ＯＨ、－$ＣＨ_3$、$ＣＦ_3$、－Ｏ－$ＣＨ_3$、－$（ＣＨ_2）_m$－ＣＯＯＨ、－$（ＣＨ_2）_m$－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－$（ＣＨ_3）$、－$（ＣＨ_2）_m$－Ｃ（＝Ｏ）－ヘテロシクリル、－$（ＣＨ_2）_m$－Ｃ（＝Ｏ）－$ＮＨ_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－$（Ｃ_{1-4}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ$（ＣＨ_3）_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－シクロプロピル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－テトラヒドロピラニル、－$（ＣＨ_2）_m$－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－$（Ｃ_{1-2}$－アルキル）、および３－メチル－２－オキソ－イミダゾリジン－１－イル、からなる群から選択されここで、各アルキル基またはアルキルサブ基は、１～３個のＦ原子、または１つのＯＨもしくは－Ｏ－$ＣＨ_3$基で置換されていてもよく；
ここで、各ヘテロシクリルは、アゼチジニル、およびモルホリニルからなる群から選択されており、１つのＯＨ基で置換されていてもよく；
ここで、ｍは、０または１であり；
ここで、ｎが２である場合、複数の$Ｒ^1$は同一でも異なっていてもよく、第２の$Ｒ^1$基は、$ＣＨ_3$および$ＣＦ_3$からなる群から選択される、
請求項２に記載の式（Ｉ）の化合物またはその塩。
【請求項４】
環Ａが、
【化３】

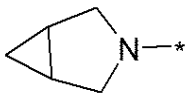


であり、
$Ｒ^1$が、Ｈ、Ｆ、－ＯＨ、$Ｃ_{1-4}$－アルキル、－Ｏ－$（Ｃ_{1-3}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－$ＮＨ_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－$（Ｃ_{1-4}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ$（Ｃ_{1-4}$－アルキル$）_2$、およびヘテロシクリル、からなる群から選択され、
ここで、各アルキル基またはアルキルサブ基は、１つもしくは複数のＦ原子で、または１つのＯＨもしくは－Ｏ－$（Ｃ_{1-3}$－アルキル）基で置換されていてもよく；
ここで、各ヘテロシクリルは、アゼチジニルおよびピペリジニルからなる群から選択されており、１つの$Ｃ_{1-3}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－$ＣＨ_3$、または－Ｃ（＝Ｏ）－シクロプロピル基で置換されていてもよく；
ここで、ｎが２である場合、複数の$Ｒ^1$は同一でも異なっていてもよく、第２の$Ｒ^1$基は$ＣＨ_3$であり；
ｎが、１および２から選択される整数である、
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物またはその塩。
【請求項５】
環Ａが、

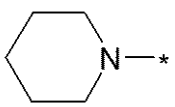
【化４】



であり、
Ｒ[1]が、Ｈ、Ｆ、－ＯＨ、－Ｏ－（Ｃ$_{1-2}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－ヘテロシクリル、－（ＣＨ$_2$）$_m$－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－（ＣＨ$_2$）$_m$－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－（Ｃ$_{1-4}$－アルキル）、－（ＣＨ$_2$）$_m$－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-4}$－アルキル）$_2$、－（ＣＨ$_2$）$_m$－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）、および－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－（Ｃ$_{1-4}$－アルキル）、からなる群から選択され、
ここで、各アルキル基またはアルキルサブ基は、１つもしくは複数のＦ原子で、または１つのＯＨもしくは－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）基で置換されていてもよく；
ここで、各ヘテロシクリルは、アゼチジニル、イミダゾリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニルおよびモルホリニルからなる群から選択されており、１つのＣＨ$_3$基で置換されていてもよく；
ｎが、１であり；
ｍが、０および１から選択される整数である、
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物またはその塩。
【請求項６】
環Ａが、
【化５】



であり、
Ｒ[1]が、Ｈ、－（ＣＨ$_2$）$_m$－ＣＯＯＨ、－（ＣＨ$_2$）$_m$－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－ヘテロシクリル、－（ＣＨ$_2$）$_m$－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－（ＣＨ$_2$）$_m$－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）、および－（ＣＨ$_2$）$_m$－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$アルキル）$_2$、からなる群から選択され、
ここで、各アルキル基またはアルキルサブ基は、１つもしくは複数のＦ原子で、または１つのＯＨもしくは－Ｏ－ＣＨ$_3$基で置換されていてもよく；
ここで、各ヘテロシクリルは、アゼチジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニルおよびモルホリニルからなる群から選択されており、１つのＣＨ$_3$基で置換されていてもよく；
ｎが、１であり；
ｍが、０および１から選択される整数であり；
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物またはその塩。
【請求項７】
環Ａが、
【化６】



であり、
Ｒ[1]が、Ｈ、－ＯＨ、Ｃ$_{1-2}$－アルキル、－Ｏ－（Ｃ$_{1-2}$－アルキル）、－（ＣＨ$_2$）$_m$－ＣＯＯＨ、－（ＣＨ$_2$）$_m$－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－（Ｃ$_{1-2}$－アルキル）、－（ＣＨ$_2$）$_m$－Ｃ（＝Ｏ）－ヘテロシクリル、－（ＣＨ$_2$）$_m$－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－（ＣＨ$_2$）$_m$－Ｃ

（＝Ｏ）－ＮＨ－（Ｃ$_{1-4}$－アルキル）、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-2}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－シクロプロピル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－ヘテロシクリル、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－（Ｃ$_{1-2}$－アルキル）、およびヘテロシクリル、からなる群から選択され、

ここで、各アルキル基またはアルキルサブ基は、１つもしくは複数のＦ原子で、または１つのＯＨもしくは－Ｏ－ＣＨ$_{3}$基で置換されていてもよく；

ここで、各ヘテロシクリルは、アゼチジニル、イミダゾリジニル、テトラヒドロピラニル、およびモルホリニルからなる群から選択されており、ＯＨ、オキソ、Ｃ$_{1-2}$－アルキル、および－Ｃ（＝Ｏ）－ＣＨ$_{3}$、からなる群から独立して選択される１つまたは２つの基で置換されていてもよく；

ここで、ｎが２である場合、複数のＲ^{1}は同一でも異なっていてもよく；

ｎが、１および２から選択される整数であり；

ｍが、０および１から選択される整数である、

請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物またはその塩。

【請求項８】

Ｒ^{1}が、Ｈ、－ＯＨ、ＣＨ$_{3}$、－Ｏ－ＣＨ$_{3}$、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－ＣＯＯＨ、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－ＣＨ$_{3}$、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－Ｃ（＝Ｏ）－ヘテロシクリル、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（ＣＨ$_{3}$）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－シクロプロピル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－ヘテロシクリル、－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＣＨ$_{3}$および－ヘテロシクリル、からなる群から選択され、

ここで、各アルキル基またはアルキルサブ基は、１～３個のＦ原子、または１つのＯＨもしくは－Ｏ－ＣＨ$_{3}$基で置換されていてもよく；

ここで、各ヘテロシクリルは、アゼチジニル、イミダゾリジニル、およびテトラヒドロピラニルからなる群から選択されており、ＯＨ、オキソ、ＣＨ$_{3}$、および－Ｃ（＝Ｏ）－ＣＨ$_{3}$からなる群から独立して選択される１つまたは２つの基で置換されていてもよく；

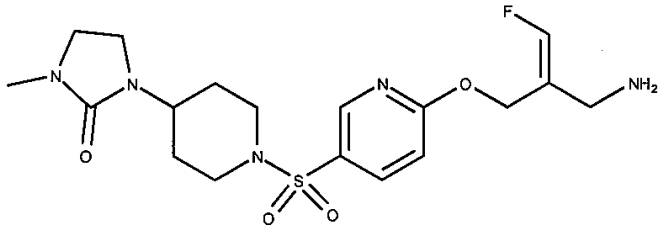
ここで、ｍは、０または１であり；

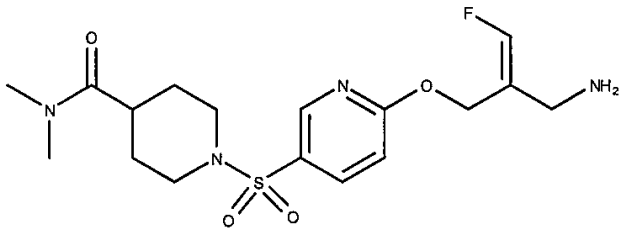
ここで、ｎが２である場合、複数のＲ^{1}は同一でも異なっていてもよく、第２のＲ^{1}基は、ＣＨ$_{3}$およびＣＦ$_{3}$からなる群から選択される、

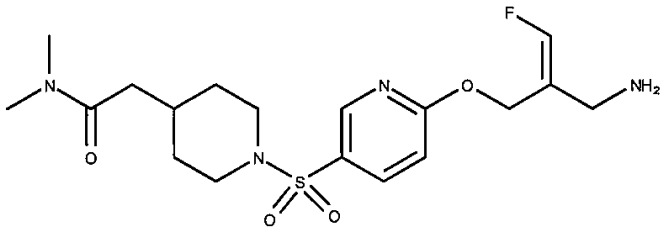
請求項７に記載の式（Ｉ）の化合物またはその塩。

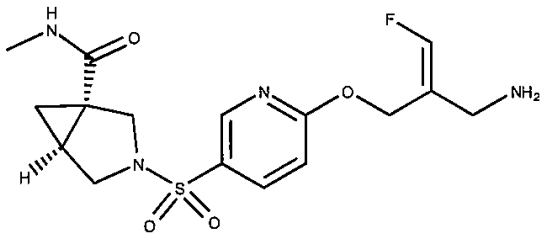
【請求項９】

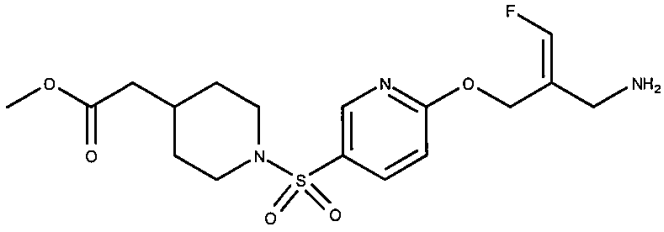
【化７－１】


,

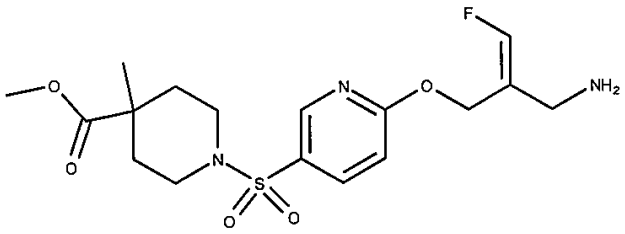

,

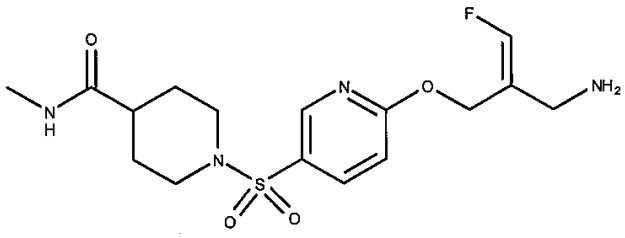

,

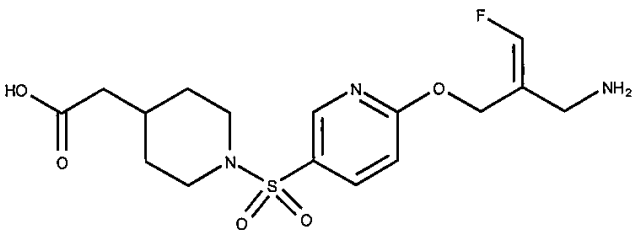

,

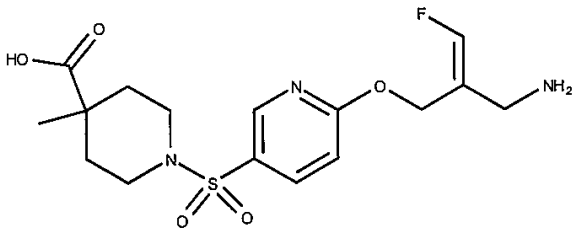

,

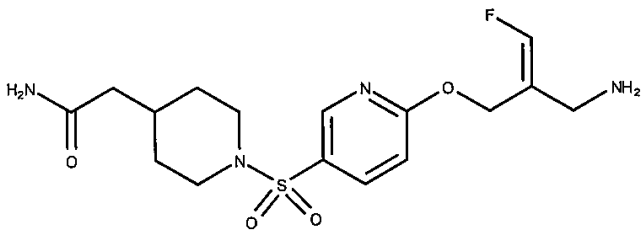
【化７－２】


,

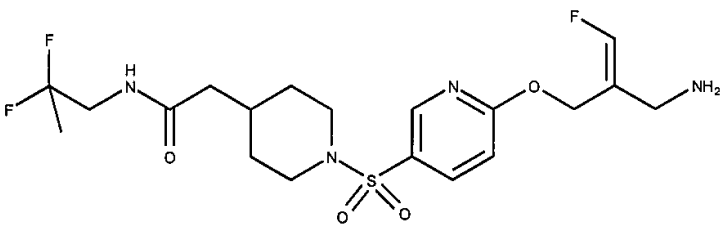

,


,

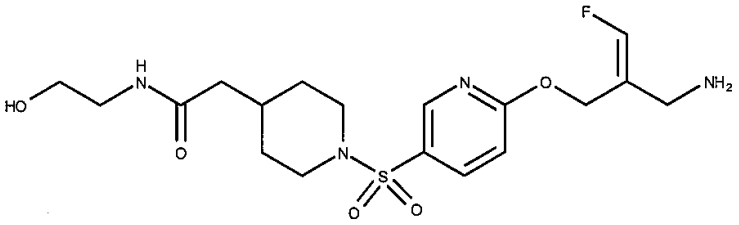

,


,

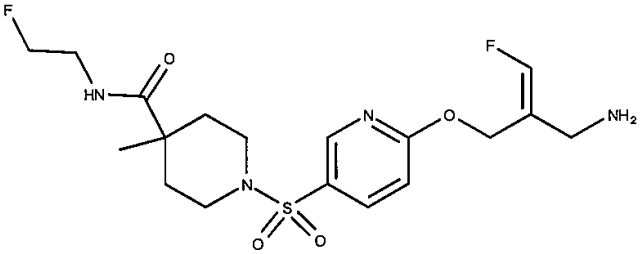
【化７－３】



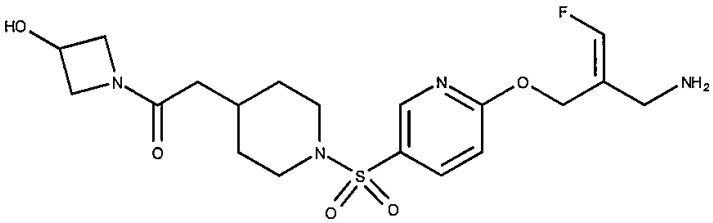
,



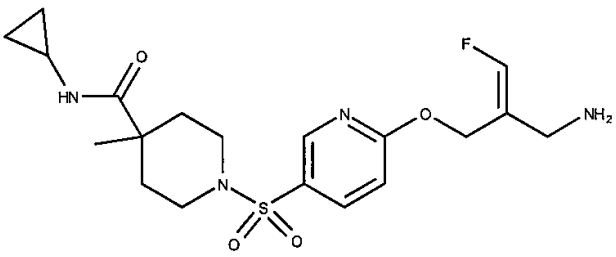
,



,



および



からなる群から選択される、請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物またはその塩。

【請求項１０】

請求項１～９のいずれか１項に記載の化合物の薬学的に許容される塩。

【請求項１１】

がん、ＮＡＳＨ（非アルコール性脂肪性肝炎）、肺線維症、網膜症、腎症、または脳卒中の処置に使用するための、請求項１～９のいずれか１項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含む、医薬組成物。

【請求項１２】

請求項１～９のいずれか１項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含み、

１つまたは複数の不活性担体および／または希釈剤を一緒に含んでもよい、医薬組成物。
【請求項１３】
請求項１～９のいずれか１項に記載の１つもしくは複数の化合物またはその薬学的に許容される塩、および１つまたは複数の追加の治療剤を含み、１つまたは複数の不活性担体および／または希釈剤を一緒に含んでもよい、医薬組成物。