

【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 5 月 26 日(2025.5.26)

【公開番号】特開 2024-120882(P2024-120882A)
【公開日】令和 6 年 9 月 5 日(2024.9.5)
【年通号数】公開公報(特許)2024-167
【出願番号】特願 2024-25063(P2024-25063)
【国際特許分類】

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

10

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 (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 / 5 3 7 7 (2 0 0 6 . 0 1)

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

A 6 1 P 1 / 0 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 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

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

【 F I 】

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 4 3

20

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 C S P

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 3 1 1

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 3 0 1

A 6 1 K 3 1 / 5 1 9

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7

A 6 1 P 2 9 / 0 0

A 6 1 P 1 / 0 0

A 6 1 P 9 / 0 0

A 6 1 P 2 5 / 0 0

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1

30

【手続補正書】

【提出日】令和 7 年 5 月 16 日(2025.5.16)

【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】

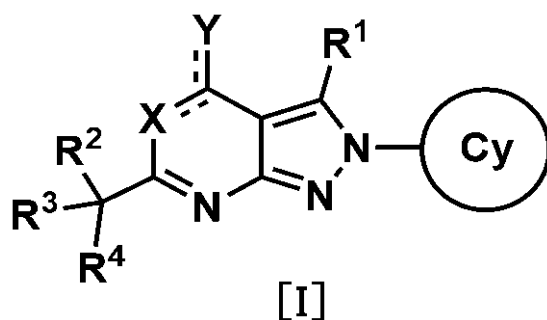
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

40

式 [I] の化合物又はその製薬上許容される塩。

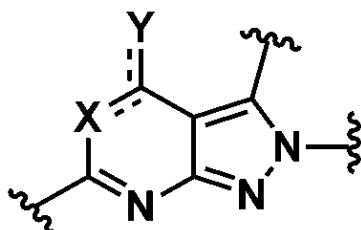
【化 1】



10

{ 式中、
部分構造：

【化 2】

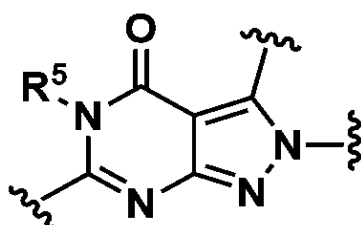


20

は、

(1) 式：

【化 3】



30

{ 式中、

R⁵ は、水素又は C₁ - 4 アルキル { ここで、該アルキルは、

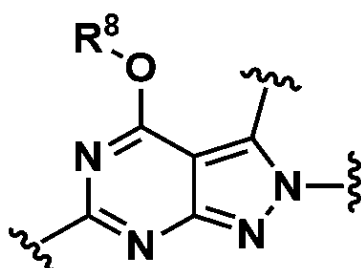
(a) カルボキシ、

(b) - CO - C₁ - 4 アルコキシ、又は(c) - CO - NR⁶R⁷ (ここで、R⁶ 及び R⁷ は各々独立して、水素又は C₁ - 4 アルキルである)、で置換されてもよい } である]

で示される構造、又は

(2) 式：

【化 4】



40

(式中、

R⁸ は、C₁ - 4 アルキルである)

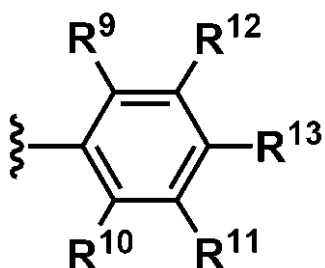
で示される構造であり、

50

環基 C_y は、

(1) 式：

【化5】



10

(式中、

R⁹ 及び R¹⁰ は各々独立して、

(a) 水素、

(b) C₁ - 4 アルキル (ここで、該アルキルは、C₁ - 4 アルコキシで置換されてもよい)、

(c) C₁ - 4 アルコキシ、

(d) ハロゲン、

(e) C₁ - 4 ハロアルキル、又は

(f) - O - C₁ - 4 ハロアルキル、であり、

R¹¹ 及び R¹² は各々独立して、

(a) 水素、

(b) C₁ - 4 アルキル、又は

(c) C₁ - 4 ハロアルキル、であり、

R¹³ は、

(a) 水素、

(b) C₁ - 4 アルキル、

(c) C₁ - 4 アルコキシ、

(d) ハロゲン、

(e) C₁ - 6 ハロアルキル、

(f) - O - C₁ - 4 ハロアルキル、又は

(g) C₃ - 6 シクロアルキル (ここで、該シクロアルキルは、1 又は 2 個のハロゲンで置換されてもよい)、であるか、あるいは

R¹³ は R¹¹ 又は R¹²、及びこれらが結合する炭素原子と一緒にあって、

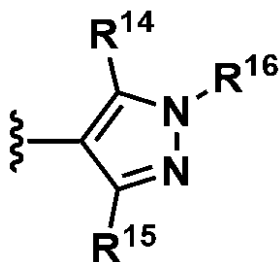
(a) C₅ - 6 シクロアルケン、又は

(b) 酸素原子を 1 又は 2 個含有する、5 から 7 員のヘテロシクロアルケンを形成してもよい)

で示される基、又は

(2) 式：

【化6】



40

(式中、

R¹⁴ 及び R¹⁵ は各々独立して、C₁ - 4 アルキル又は C₁ - 4 ハロアルキルであり、

50

R^{16} は、 C_{1-6} アルキル又は C_{3-6} シクロアルキルである)
で示される基、であり、

R^1 は、

- (1) 水素、
- (2) シアノ、
- (3) C_{1-4} アルキル (ここで、該アルキルは、ヒドロキシ又は C_{1-4} アルコキシで置換されてもよい)、
- (4) C_{1-4} ハロアルキル、又は
- (5) $-CO-C_{1-4}$ アルキル、であり、

R^2 、 R^3 及び R^4 は各々独立して、

- (1) 水素、
- (2) ヒドロキシ、
- (3) C_{1-6} アルキル { ここで、該アルキルは、
 - (a) ヒドロキシ、
 - (b) C_{1-4} アルコキシ、及び
 - (c) $-SO_2-C_{1-4}$ アルキル、からなる群から独立して選択される 1 又は 2 個の置換基で置換されてもよい }、

(4) C_{1-6} アルコキシ { ここで、該アルコキシは、

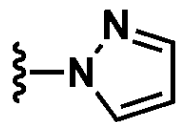
- (a) ヒドロキシ、
- (b) フェニル、又は
- (c) 窒素及び酸素原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を 1 又は 2 個含有する、4 から 6 員のヘテロシクロアルキル、で置換されてもよい }、

- (5) ハロゲン、
- (6) C_{1-4} ハロアルキル (ここで、該ハロアルキルは、ヒドロキシ又は C_{1-4} アルコキシで置換されてもよい)、
- (7) $-O-C_{1-4}$ ハロアルキル、
- (8) $-OR^{17}$ (ここで、 R^{17} は、窒素及び酸素原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を 1 又は 2 個含有する、4 から 6 員のヘテロシクロアルキルである)、
- (9) C_{3-6} シクロアルキル、

(10) 窒素及び酸素原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を 1 又は 2 個含有する、4 から 6 員のヘテロシクロアルキル (ここで、該ヘテロシクロアルキルは、オキソで置換されてもよい)、又は

(11) 式：

【化 7】



で示される基であるか、あるいは、

R^2 、 R^3 及び R^4 は、これらが結合する炭素原子と一緒にあって、 $-CR^2R^3R^4$ 基が、

- (a) シアノ、
- (b) C_{3-6} シクロアルキル { ここで、該シクロアルキルは、
 - (1) シアノ、
 - (2) C_{1-4} アルキル (ここで、該アルキルは、ヒドロキシ又は C_{1-4} アルコキシで置換されてもよい)、
 - (3) C_{1-4} アルコキシ、
 - (4) ハロゲン、及び

(5) $-CO-NR^{18}R^{19}$ (ここで、 R^{18} 及び R^{19} は各々独立して、水素又は C_{1-4} アルキルである)、からなる群から独立して選択される 1 から 3 個の置換基で置

換されてもよい}、

(c) 窒素、酸素及び硫黄原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を 1 又は 2 個含有する、4 から 7 員のヘテロシクロアルキル〔ここで、該ヘテロシクロアルキルは、

(1) ヒドロキシ、

(2) C₁₋₄ アルキル、

(3) C₁₋₄ アルコキシ、及び

(4) ハロゲン、からなる群から独立して選択される 1 又は 2 個の置換基で置換されてもよい、あるいは該ヘテロシクロアルキルの環構成原子の内 1 つが 1 又は 2 個のオキソで置換されてもよい}、

(d) 窒素及び酸素原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を 1 又は 2 個含有する、7 から 9 員の飽和縮合ヘテロ環基〔ここで、該縮合ヘテロ環基は、1 又は 2 個のハロゲンで置換されてもよい}、

(e) 5 から 8 員の架橋シクロアルキル〔ここで、該架橋シクロアルキルは、ハロゲンで置換されてもよい}、

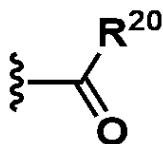
(f) 窒素及び酸素原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を 1 又は 2 個含有する、5 から 8 員の架橋ヘテロシクロアルキル〔ここで、該架橋ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシで置換されてもよい C₁₋₄ アルキル、で置換されてもよい}、

(g) C₅₋₆ シクロアルケニル、

(h) 窒素及び酸素原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を 1 又は 2 個含有する、5 又は 6 員のヘテロシクロアルケニル、又は

(i) 式：

【化 8】



{ 式中、R²⁰ は、

(1) C₁₋₄ アルキル、又は

(2) -NR²¹R²² (ここで、R²¹ 及び R²² は各々独立して、

(a) 水素、

(b) C₁₋₄ アルキル、

(c) C₁₋₄ ハロアルキル、又は

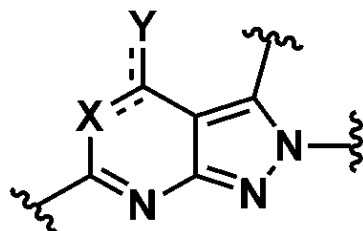
(d) 窒素及び酸素原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を 1 又は 2 個含有する、4 から 6 員のヘテロシクロアルキル、である)、である}

で示される基を形成してもよい}

【請求項 2】

部分構造：

【化 9】



が、

(1) 式：

10

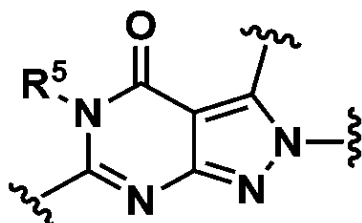
20

30

40

50

【化 1 0】

(式中、 R^5 は請求項 1 と同義である)

で示される構造である、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

10

【請求項 3】

 R^1 が水素である、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

【請求項 4】

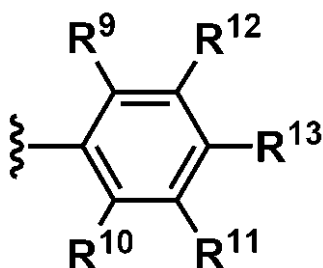
 R^5 が水素である、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

【請求項 5】

環基 Cy が、

(1) 式：

【化 1 1】



20

(式中、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 及び R^{13} は請求項 1 と同義である)

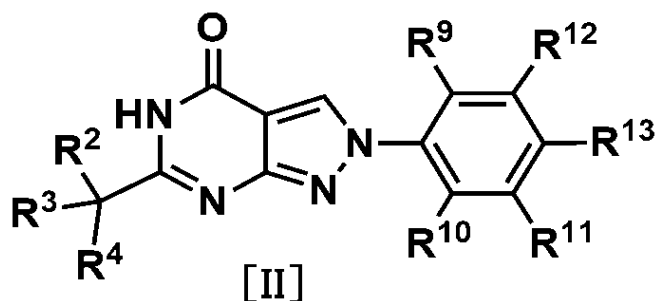
で示される基である、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

【請求項 6】

式 [I I] で示される、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

30

【化 1 2】



40

(式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 及び R^{13} は請求項 1 と同義である)

【請求項 7】

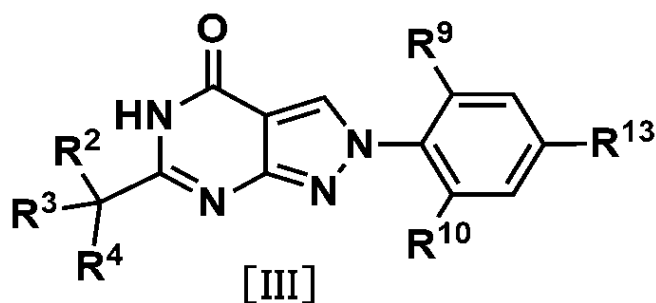
 R^{11} 及び R^{12} が水素である、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

【請求項 8】

式 [I I I] で示される、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

50

【化 1 3】



10

(式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^9 、 R^{10} 及び R^{13} は請求項1と同義である)

【請求項9】

R^9 及び R^{10} のうち少なくとも1つが

(1) C_{1-4} アルキル(ここで、該アルキルは、 C_{1-4} アルコキシで置換されてもよい)、

(2) C_{1-4} アルコキシ、

(3) ハロゲン、

(4) C_{1-4} ハロアルキル、又は

(5) $-O-C_{1-4}$ ハロアルキルである、請求項1に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

20

【請求項10】

R^2 、 R^3 及び R^4 は各々独立して、

(1) 水素、

(2) ヒドロキシ、

(3) C_{1-6} アルキル{ここで、該アルキルは、

(a) ヒドロキシ、

(b) C_{1-4} アルコキシ、及び

(c) $-SO_2-C_{1-4}$ アルキル、からなる群から独立して選択される1又は2個の置換基で置換されてもよい}、

(4) C_{1-6} アルコキシ{ここで、該アルコキシは、

(a) ヒドロキシ、

(b) フェニル、又は

(c) 窒素及び酸素原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を1又は2個含有する、4から6員のヘテロシクロアルキル、で置換されてもよい}、

(5) C_{1-4} ハロアルキル(ここで、該ハロアルキルは、ヒドロキシ又は C_{1-4} アルコキシで置換されてもよい)、

(6) $-O-C_{1-4}$ ハロアルキル、又は

(7) C_{3-6} シクロアルキル、であるか、あるいは、

R^2 、 R^3 及び R^4 は、これらが結合する炭素原子と一緒に、 $-CR^2R^3R^4$ 基が、

30

40

(a) C_{3-6} シクロアルキル{ここで、該シクロアルキルは、

(1) シアノ、

(2) C_{1-4} アルキル(ここで、該アルキルは、ヒドロキシ又は C_{1-4} アルコキシで置換されてもよい)、

(3) C_{1-4} アルコキシ、

(4) ハロゲン、及び

(5) $-CO-NR^{18}R^{19}$ (ここで、 R^{18} 及び R^{19} は各々独立して、水素又は C_{1-4} アルキルである)、からなる群から独立して選択される1から3個の置換基で置換されてもよい}、

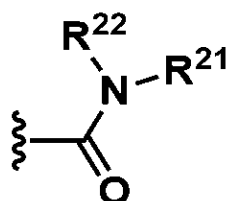
(b) 窒素、酸素及び硫黄原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を1又は2

50

個含有する、4 から 7 員のヘテロシクロアルキル〔ここで、該ヘテロシクロアルキルは、
 (1) ヒドロキシ、
 (2) C_{1-4} アルキル、
 (3) C_{1-4} アルコキシ、及び
 (4) ハロゲン、からなる群から独立して選択される 1 又は 2 個の置換基で置換されてもよい、あるいは該ヘテロシクロアルキルの環構成原子の内 1 つが 1 又は 2 個のオキソで置換されてもよい〕、
 (c) 5 から 8 員の架橋シクロアルキル (ここで、該架橋シクロアルキルは、ハロゲンで置換されてもよい)、
 (d) 窒素及び酸素原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を 1 又は 2 個含有する、5 から 8 員の架橋ヘテロシクロアルキル (ここで、該架橋ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシで置換されてもよい C_{1-4} アルキル、で置換されてもよい)、
 (e) 窒素及び酸素原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を 1 又は 2 個含有する、5 又は 6 員のヘテロシクロアルケニル、又は
 (f) 式：
 【化 1 4】

10

20



{ 式中、 R^{21} 及び R^{22} は各々独立して、

(1) 水素、
 (2) C_{1-4} アルキル、
 (3) C_{1-4} ハロアルキル、又は
 (4) 窒素及び酸素原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を 1 又は 2 個含有する、4 から 6 員のヘテロシクロアルキル、である }
 で示される基を形成してもよい、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

30

【請求項 1 1】

R^2 、 R^3 及び R^4 は各々独立して、

(1) 水素、
 (2) ヒドロキシ、
 (3) C_{1-6} アルキル { ここで、該アルキルは、
 (a) ヒドロキシ、
 (b) C_{1-4} アルコキシ、及び
 (c) $-SO_2-C_{1-4}$ アルキル、からなる群から独立して選択される 1 又は 2 個の置換基で置換されてもよい }、

40

(4) C_{1-6} アルコキシ { ここで、該アルコキシは、
 (a) ヒドロキシ、
 (b) フェニル、又は

(c) 窒素及び酸素原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を 1 又は 2 個含有する、4 から 6 員のヘテロシクロアルキル、で置換されてもよい }、又は

(5) C_{1-4} ハロアルキル (ここで、該ハロアルキルは、ヒドロキシ又は C_{1-4} アルコキシで置換されてもよい)、であるか、あるいは、
 R^2 、 R^3 及び R^4 は、これらが結合する炭素原子と一緒にあって、 $-CR^2R^3R^4$ 基が、

(a) C_{3-6} シクロアルキル { ここで、該シクロアルキルは、

(1) シアノ、

50

(2) C_{1-4} アルキル(ここで、該アルキルは、ヒドロキシ又は C_{1-4} アルコキシで置換されてもよい)、

(3) C_{1-4} アルコキシ、

(4) ハロゲン、及び

(5) $-CO-NR^{18}R^{19}$ (ここで、 R^{18} 及び R^{19} は各々独立して、水素又は C_{1-4} アルキルである)、からなる群から独立して選択される1から3個の置換基で置換されてもよい}、

(b) 窒素、酸素及び硫黄原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を1又は2個含有する、4から7員のヘテロシクロアルキル〔ここで、該ヘテロシクロアルキルは、

(1) ヒドロキシ、

(2) C_{1-4} アルキル、

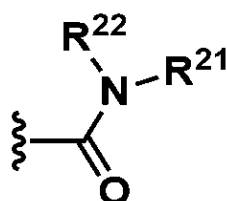
(3) C_{1-4} アルコキシ、及び

(4) ハロゲン、からなる群から独立して選択される1又は2個の置換基で置換されてもよい、あるいは該ヘテロシクロアルキルの環構成原子の内1つが1又は2個のオキソで置換されてもよい〕、又は

10

(c) 式：

【化15】



20

{式中、 R^{21} 及び R^{22} は各々独立して、

(1) 水素、

(2) C_{1-4} アルキル、

(3) C_{1-4} ハロアルキル、又は

(4) 窒素及び酸素原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を1又は2個含有する、4から6員のヘテロシクロアルキル、である}

30

で示される基を形成してもよい、請求項1に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

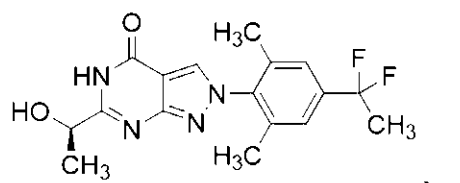
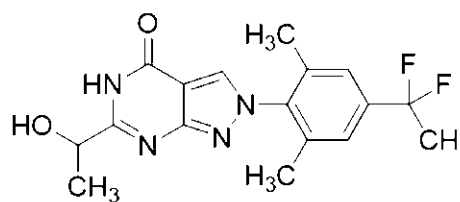
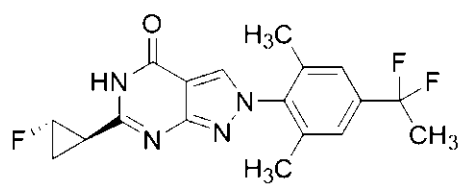
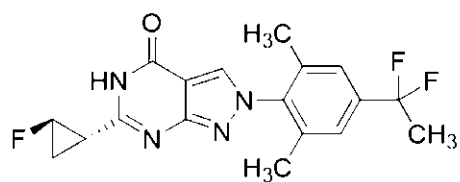
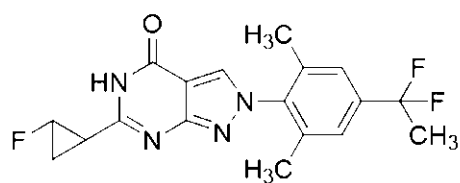
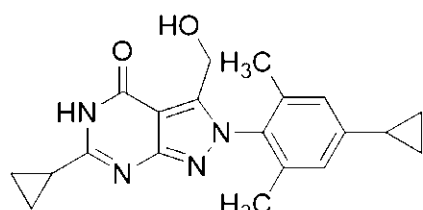
【請求項12】

下記構造式：

40

50

【化 1 6】



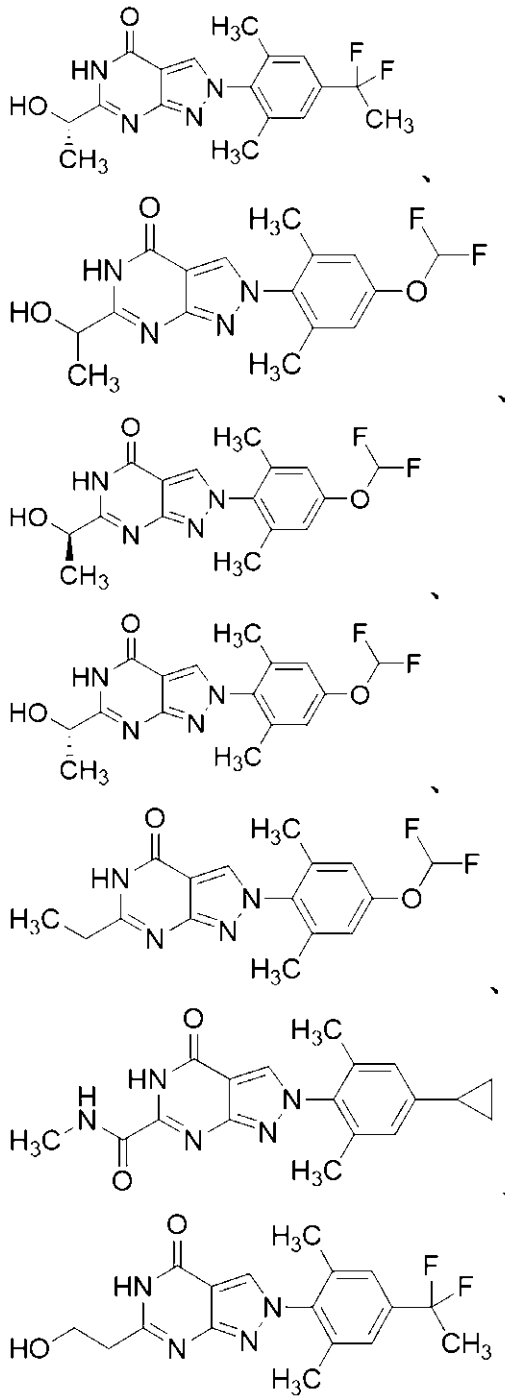
10

20

30

40

50



10

20

30

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

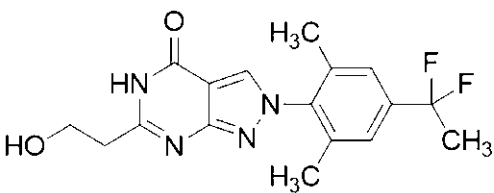
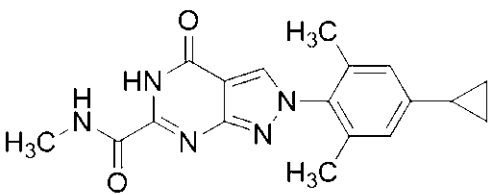
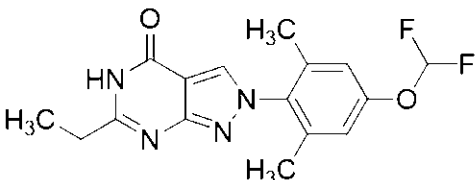
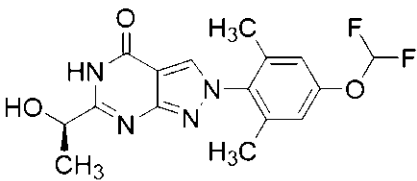
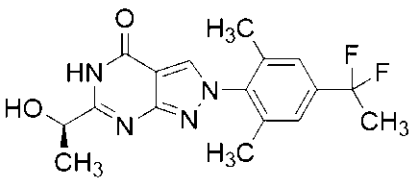
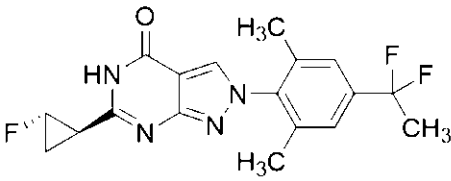
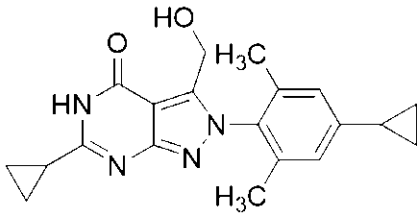
40

【請求項 1 3】

下記構造式：

50

【化 1 7】

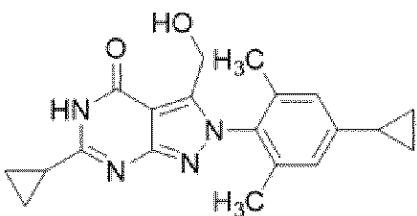


からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

【請求項 1 4】

下記構造式で示される化合物又はその製薬上許容される塩。

【化 1 8】



10

20

30

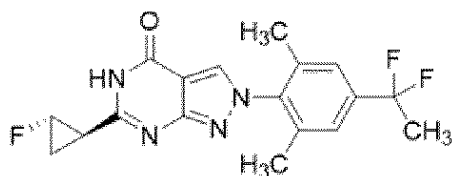
40

50

【請求項 15】

下記構造式で示される化合物又はその製薬上許容される塩。

【化 19】

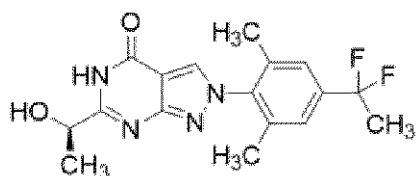


【請求項 16】

10

下記構造式で示される化合物又はその製薬上許容される塩。

【化 20】

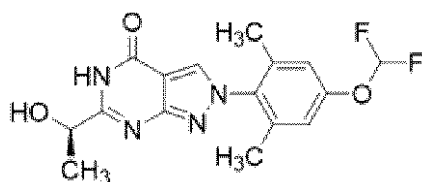


【請求項 17】

20

下記構造式で示される化合物又はその製薬上許容される塩。

【化 21】

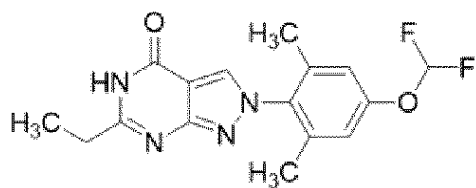


【請求項 18】

下記構造式で示される化合物又はその製薬上許容される塩。

【化 22】

30

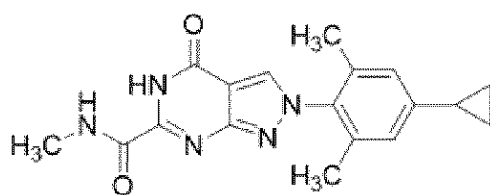


【請求項 19】

下記構造式で示される化合物又はその製薬上許容される塩。

【化 23】

40

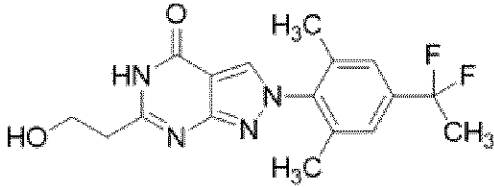


【請求項 20】

下記構造式で示される化合物又はその製薬上許容される塩。

50

【化 2 4】



【請求項 2 1】

請求項 1 から 2 0 のいずれか一項に記載の化合物又はその製薬上許容される塩と、製薬上許容される担体とを含む、医薬組成物。

10

【請求項 2 2】

請求項 1 から 2 0 のいずれか一項に記載の化合物又はその製薬上許容される塩を含む、NLRP3インフラマソーム阻害剤。

【請求項 2 3】

請求項 1 から 2 0 のいずれか一項に記載の化合物又はその製薬上許容される塩を含む、多発性硬化症、炎症性腸疾患、動脈硬化症、クリオピリン関連周期熱症候群、非アルコール性脂肪肝炎、痛風、虚血性心疾患、アルツハイマー病、パーキンソン病、筋萎縮性側索硬化症及び外傷性脳損傷からなる群より選択される疾患の治療剤又は予防剤。

【請求項 2 4】

炎症性腸疾患が潰瘍性大腸炎又はクローン病である、請求項 2 3 に記載の治療剤又は予防剤。

20

【請求項 2 5】

クリオピリン関連周期熱症候群が家族性寒冷性自己炎症性症候群、マッケルウェルズ症候群、慢性乳児神経皮膚関節症候群又は新生児期発症多臓器系炎症性疾患である、請求項 2 3 に記載の治療剤又は予防剤。

【請求項 2 6】

治療上有効量の請求項 1 から 2 0 のいずれか一項に記載の化合物又はその製薬上許容される塩を哺乳動物に投与することを含む、NLRP3インフラマソームを阻害する方法。

【請求項 2 7】

治療上有効量の請求項 1 から 2 0 のいずれか一項に記載の化合物又はその製薬上許容される塩を哺乳動物に投与することを含む、多発性硬化症、炎症性腸疾患、動脈硬化症、クリオピリン関連周期熱症候群、非アルコール性脂肪肝炎、痛風、虚血性心疾患、アルツハイマー病、パーキンソン病、筋萎縮性側索硬化症及び外傷性脳損傷からなる群より選択される疾患を治療又は予防する方法。

30

【請求項 2 8】

炎症性腸疾患が潰瘍性大腸炎又はクローン病である、請求項 2 7 に記載の方法。

【請求項 2 9】

クリオピリン関連周期熱症候群が家族性寒冷性自己炎症性症候群、マッケルウェルズ症候群、慢性乳児神経皮膚関節症候群又は新生児期発症多臓器系炎症性疾患である、請求項 2 7 に記載の方法。

40

【請求項 3 0】

NLRP3インフラマソーム阻害剤を製造するための請求項 1 から 2 0 のいずれか一項に記載の化合物又はその製薬上許容される塩の使用。

【請求項 3 1】

多発性硬化症、炎症性腸疾患、動脈硬化症、クリオピリン関連周期熱症候群、非アルコール性脂肪肝炎、痛風、虚血性心疾患、アルツハイマー病、パーキンソン病、筋萎縮性側索硬化症及び外傷性脳損傷からなる群より選択される疾患の治療剤又は予防剤を製造するための請求項 1 から 2 0 のいずれか一項に記載の化合物又はその製薬上許容される塩の使用。

【請求項 3 2】

50

炎症性腸疾患が潰瘍性大腸炎又はクローン病である、請求項 3 1 に記載の使用。

【請求項 3 3】

クリオピリン関連周期熱症候群が家族性寒冷性自己炎症性症候群、マッケルウェルズ症候群、慢性乳児神経皮膚関節症候群又は新生児期発症多臓器系炎症性疾患である、請求項 3 1 に記載の使用。

【請求項 3 4】

NLRP3インフラマソームの阻害に使用するための、請求項 1 から 2 0 のいずれか一項に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

【請求項 3 5】

多発性硬化症、炎症性腸疾患、動脈硬化症、クリオピリン関連周期熱症候群、非アルコール性脂肪肝炎、痛風、虚血性心疾患、アルツハイマー病、パーキンソン病、筋萎縮性側索硬化症及び外傷性脳損傷からなる群より選択される疾患の治療又は予防に使用するための、請求項 1 から 2 0 のいずれか一項に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

10

【請求項 3 6】

炎症性腸疾患が潰瘍性大腸炎又はクローン病である、請求項 3 5 に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

【請求項 3 7】

クリオピリン関連周期熱症候群が家族性寒冷性自己炎症性症候群、マッケルウェルズ症候群、慢性乳児神経皮膚関節症候群又は新生児期発症多臓器系炎症性疾患である、請求項 3 5 に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

20

30

40

50