

【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 07 D 487/04 (2006.01)
 C 07 D 519/00 (2006.01)
 A 61 K 31/519 (2006.01)
 A 61 K 31/5377 (2006.01)
 A 61 P 29/00 (2006.01)
 A 61 P 1/00 (2006.01)
 A 61 P 9/00 (2006.01)
 A 61 P 25/00 (2006.01)
 A 61 P 43/00 (2006.01)

10

【F I】

C 07 D 487/04 1 4 3
 C 07 D 487/04 C S P
 C 07 D 519/00 3 1 1
 C 07 D 519/00 3 0 1
 A 61 K 31/519
 A 61 K 31/5377
 A 61 P 29/00
 A 61 P 1/00
 A 61 P 9/00
 A 61 P 25/00
 A 61 P 43/00 1 1 1

20

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】

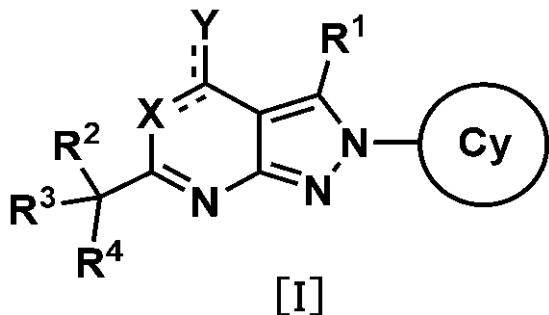
【請求項1】

式[I]の化合物又はその製薬上許容される塩。

40

50

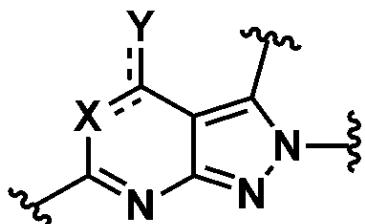
【化1】



10

{式中、
部分構造：

【化2】

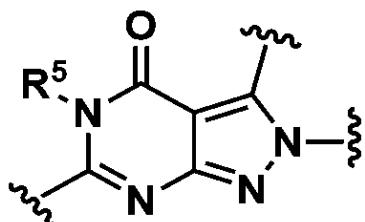


20

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、

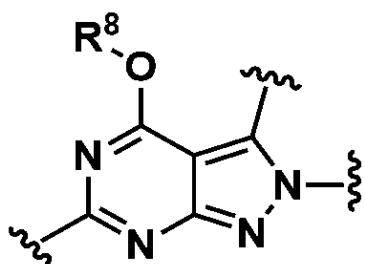
(a)カルボキシ、

(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)

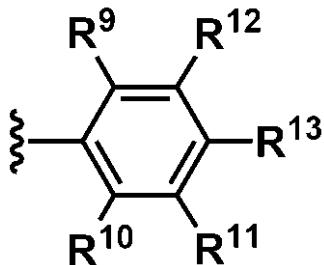
で示される構造であり、

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になって、

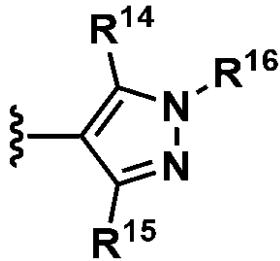
(a) C₅ - 6 シクロアルケン、又は

(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】



30

(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

R¹~R⁶は、C₁~C₆アルキル又はC₃~C₆シクロアルキルである)

で示される基、であり、

R¹は、

(1) 水素、

(2) シアノ、

(3) C₁~C₄アルキル(ここで、該アルキルは、ヒドロキシ又はC₁~C₄アルコキシで置換されてもよい)、

(4) C₁~C₄ハロアルキル、又は

(5) -CO-C₁~C₄アルキル、であり、

R²、R³及びR⁴は各々独立して、

10

(1) 水素、

(2) ヒドロキシ、

(3) C₁~C₆アルキル{ここで、該アルキルは、

(a) ヒドロキシ、

(b) C₁~C₄アルコキシ、及び

(c) -SO₂-C₁~C₄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) C₁~C₆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

20

(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) C₁~C₄ハロアルキル(ここで、該ハロアルキルは、ヒドロキシ又はC₁~C₄アルコキシで置換されてもよい)、

(7) -O-C₁~C₄ハロアルキル、

(8) -OR¹⁷(ここで、R¹⁷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)、

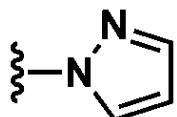
(9) C₃~C₆シクロアルキル、

(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

30

(11) 式:

【化7】



で示される基であるか、あるいは、

R²、R³及びR⁴は、これらが結合する炭素原子と一緒にになって、-CR²R³R⁴基が、

40

(a) シアノ、

(b) C₃~C₆シクロアルキル{ここで、該シクロアルキルは、

(1) シアノ、

(2) C₁~C₄アルキル(ここで、該アルキルは、ヒドロキシ又はC₁~C₄アルコキシで置換されてもよい)、

(3) C₁~C₄アルコキシ、

(4) ハロゲン、及び

(5) -CO-NR¹⁸R¹⁹(ここで、R¹⁸及びR¹⁹は各々独立して、水素又はC₁~C₄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

50

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か、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〕、

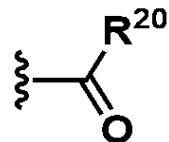
(f) 窒素及び酸素原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を1又は2個含有する、5から8員の架橋ヘテロシクロアルキル〔ここで、該架橋ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシで置換されてもよいC₁-4アルキル、で置換されてもよい〕、

(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) -N R²¹ R²²〔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

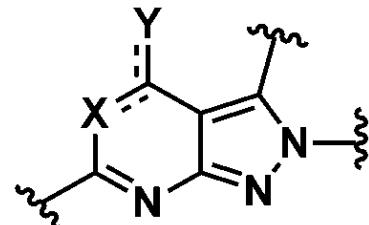
(d) 窒素及び酸素原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を1又は2個含有する、4から6員のヘテロシクロアルキル、である〕、である〕

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

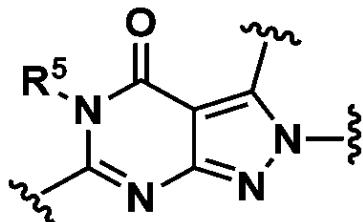
20

30

40

50

【化10】



(式中、R⁵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】

R¹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】

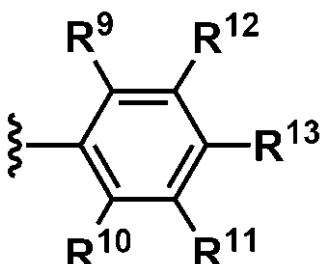
R⁵が水素である、請求項1に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

【請求項5】

環基C_yが、

(1)式：

【化11】



20

(式中、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²及びR¹³は請求項1と同義である)

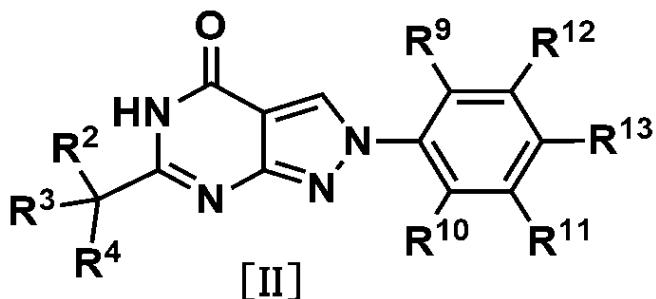
で示される基である、請求項1に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

【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12】



40

(式中、R²、R³、R⁴、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²及びR¹³は請求項1と同義である)

【請求項7】

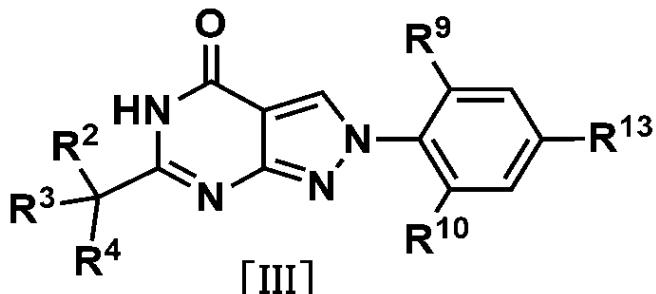
R¹¹及びR¹²が水素である、請求項1に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

【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13】



10

(式中、R²、R³、R⁴、R⁹、R¹⁰及びR¹³は請求項1と同義である)

【請求項9】

R⁹及びR¹⁰のうち少なくとも1つが

(1) 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)、

(2) C₁-4アルコキシ、

(3) ハロゲン、

(4) C₁-4ハロアルキル、又は

(5) -O-C₁-4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】

R²、R³及びR⁴は各々独立して、

(1) 水素、

(2) ヒドロキシ、

(3) C₁-6アルキル(ここで、該アルキルは、

(a) ヒドロキシ、

(b) C₁-4アルコキシ、及び

(c) -SO₂-C₁-4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) C₁-6アルコキシ(ここで、該アルコキシは、

30

(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) C₁-4ハロアルキル(ここで、該ハロアルキルは、ヒドロキシ又はC₁-4アルコキシで置換されてもよい)、

(6) -O-C₁-4ハロアルキル、又は

(7) C₃-6シクロアルキル、であるか、あるいは、

R²、R³及びR⁴は、これらが結合する炭素原子と一緒にになって、-CR²R³R⁴基が、

40

(a) C₃-6シクロアルキル(ここで、該シクロアルキルは、

(1) シアノ、

(2) C₁-4アルキル(ここで、該アルキルは、ヒドロキシ又はC₁-4アルコキシで置換されてもよい)、

(3) C₁-4アルコキシ、

(4) ハロゲン、及び

(5) -CO-NR¹₈R¹₉(ここで、R¹₈及びR¹₉は各々独立して、水素又はC₁-4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) 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か、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〕、

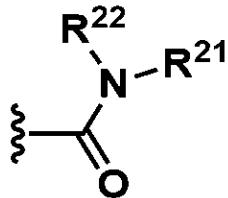
(c) 5から8員の架橋シクロアルキル〔ここで、該架橋シクロアルキルは、ハロゲンで置換されてもよい〕、

(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C₁-4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14】



10

20

30

40

50

{式中、R²¹及びR²²は各々独立して、

- (1) 水素、
- (2) C₁-4アルキル、
- (3) C₁-4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。

【請求項11】

R²、R³及びR⁴は各々独立して、

- (1) 水素、
- (2) ヒドロキシ、
- (3) C₁-6アルキル〔ここで、該アルキルは、
 - (a) ヒドロキシ、
 - (b) C₁-4アルコキシ、及び
- (c) -SO₂-C₁-4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) C₁-6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) C₁-4ハロアルキル〔ここで、該ハロアルキルは、ヒドロキシ又はC₁-4アルコキシで置換されてもよい〕、であるか、あるいは、

R²、R³及びR⁴は、これらが結合する炭素原子と一緒にになって、-CR²R³R⁴基が、

(a) C₃-6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) C₁ - 4 アルキル(ここで、該アルキルは、ヒドロキシ又はC₁ - 4 アルコキシで置換されてもよい)、

(3) C₁ - 4 アルコキシ、

(4) ハロゲン、及び

(5) -CO-NR¹₈R¹₉(ここで、R¹₈及びR¹₉は各々独立して、水素又はC₁ - 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) 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か、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

20

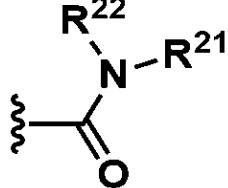
30

40

50

(c) 式:

【化15】



{式中、R²₁及びR²₂は各々独立して、

(1) 水素、

(2) C₁ - 4 アルキル、

(3) C₁ - 4 ハロアルキル、又は

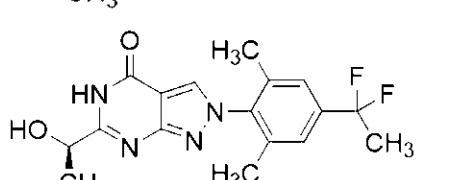
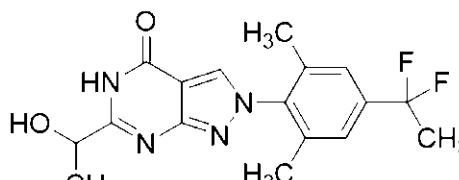
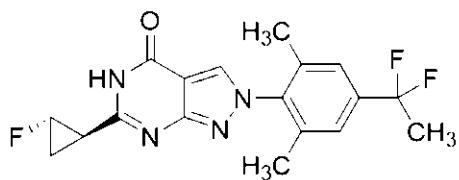
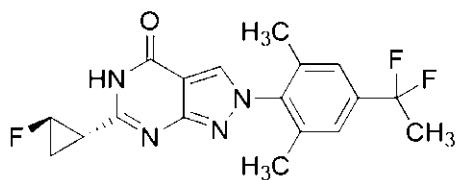
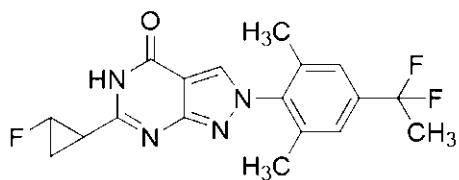
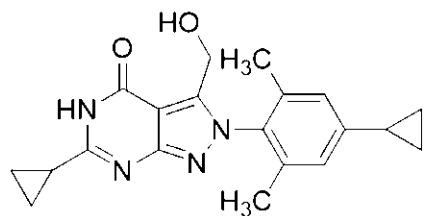
(4) 窒素及び酸素原子からなる群から独立して選択されるヘテロ原子を1又は2個含有する、4から6員のヘテロシクロアルキル、である} 30

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:

【化 16】



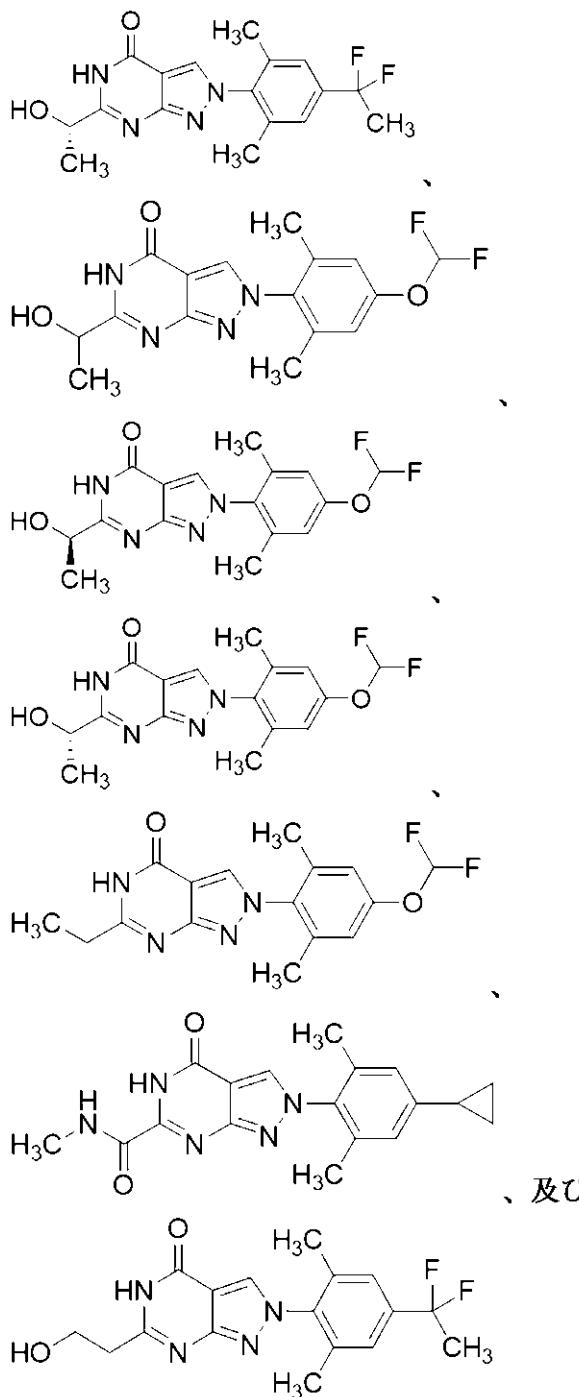
10

20

30

40

50



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。

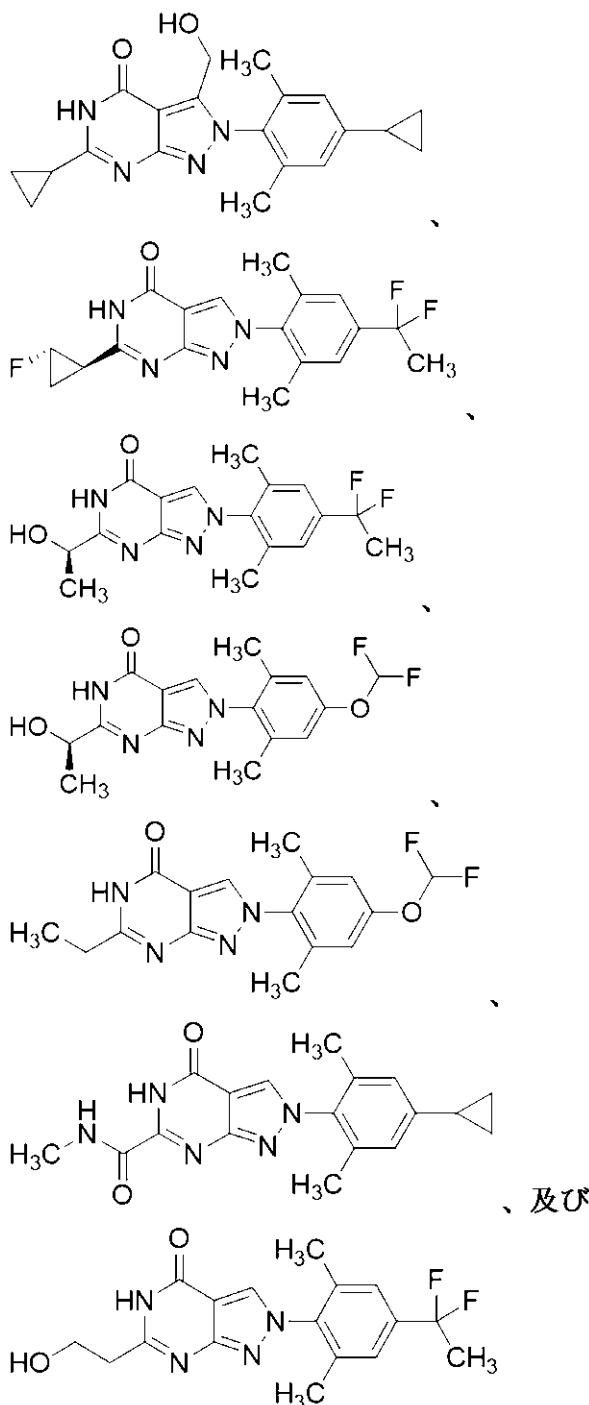
40

【請求項 1 3】

下記構造式：

50

【化17】



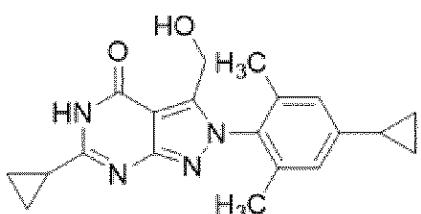
からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

40

【請求項14】

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18】

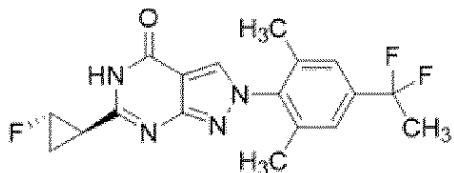


50

【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】

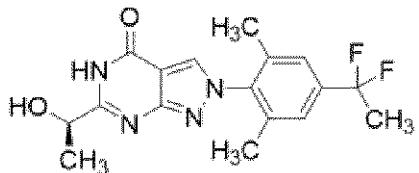


【請求項 16】

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】

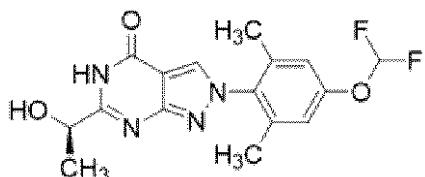


【請求項 17】

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】

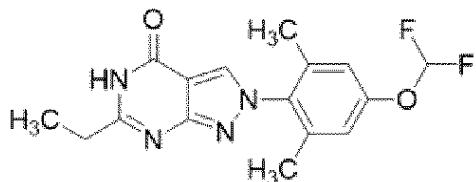


【請求項 18】

30

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】

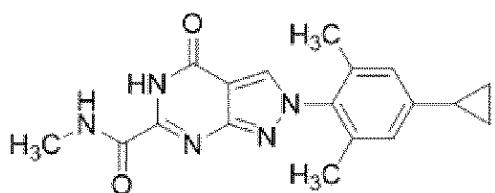


【請求項 19】

40

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】

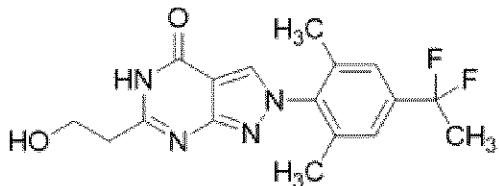


【請求項 20】

50

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24】



【請求項21】

請求項1から20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22】

請求項1から20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23】

請求項1から20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24】

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23に記載の治療剤又は予防剤。
20

【請求項25】

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、マックルウェルズ症候群、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23に記載の治療剤又は予防剤。

【請求項26】

治療上有効量の請求項1から20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27】

治療上有効量の請求項1から20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28】

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27に記載の方法。

【請求項29】

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、マックルウェルズ症候群、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27に記載の方法。
40

【請求項30】

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20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31】

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20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32】

10

20

30

40

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、マックルウェルズ症候群、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インスマーフラ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、マックルウェルズ症候群、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