

【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11月30日(2022.11.30)

【国際公開番号】WO2020/116660
 【公表番号】特表2022-510736(P2022-510736A)
 【公表日】令和4年1月27日(2022.1.27)
 【年通号数】公開公報(特許)2022-015
 【出願番号】特願2021-554804(P2021-554804)
 【国際特許分類】

10

C 0 7 D 4 7 1 / 1 8 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 1 / 1 6 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 1 1 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 1 3 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 2 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 7 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 2 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 3 1 / 4 7 4 8 (2 0 0 6 . 0 1)
 C 0 7 D 4 9 8 / 1 8 (2 0 0 6 . 0 1)
 C 0 7 D 4 9 1 / 2 2 (2 0 0 6 . 0 1)
 C 0 7 D 4 9 8 / 2 2 (2 0 0 6 . 0 1)

20

【 F I 】

C 0 7 D 4 7 1 / 1 8 C S P
 A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1
 A 6 1 P 1 / 1 6
 A 6 1 P 9 / 0 0
 A 6 1 P 1 1 / 0 0
 A 6 1 P 1 3 / 1 2
 A 6 1 P 2 5 / 0 0
 A 6 1 P 3 5 / 0 0
 A 6 1 P 7 / 0 6
 A 6 1 P 2 9 / 0 0
 A 6 1 K 3 1 / 4 7 4 8
 C 0 7 D 4 9 8 / 1 8
 C 0 7 D 4 9 1 / 2 2
 C 0 7 D 4 9 8 / 2 2

30

【手続補正書】

【提出日】令和4年11月21日(2022.11.21)

【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】

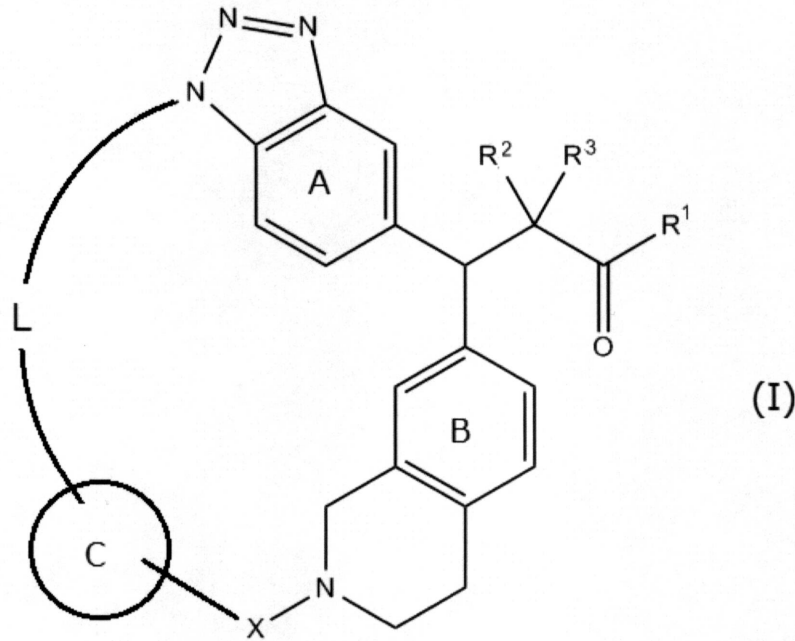
【請求項1】

下記式(I)：

40

50

【化 2 6 7】



10

20

30

40

50

(式中、

 R^1 : OH、OR_y、またはNHR_y ; R_y : 置換されていてもよいC₁-6アルキル基、または置換されていてもよい環状基 ; R^2 , R^3 : 同一または異なって水素原子、置換されていてもよいC₁-6アルキル基、
または R^2 および R^3 が一体となってC₃-6シクロアルキル基 ; X : C(=O)、SO₂、またはCR^{x1}R^{x2} ; R^{x1} , R^{x2} : 同一または異なって水素原子、または置換されていてもよいC₁-6アルキル基 ;

環A : さらに置換されていてもよいベンゼン環 ;

環B : さらに置換されていてもよいベンゼン環 ;

環C : 置換されていてもよく、環中にヘテロ原子を有していてもよい5または6員芳香族環 ; および

L : 置換されていてもよく、ヘテロ原子が挿入されていてもよい、飽和または不飽和の直鎖C₄-8アルキレン)

で表される化合物、またはその塩。

【請求項2】

式(1)において、

Lが、 $(CR^4R^5)_n - Y^1 - (CR^6R^7)_m - Y^2 - *$

(式中、*は環Cに結合することを意味する ;

 n : 2以上4以下の整数 ; m : 1以上4以下の整数 ; R^4 、 R^5 : R^4 および R^5 は、互いに同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、OH、置換されていてもよいC₁-6アルキル基、もしくは、置換されていてもよいC₁-6アルコキシ基、または、 R^4 と R^5 が一体となって置換されていてもよいC₃-6シクロアルキル基であり、複数の R^4 、または複数の R^5 は、それぞれ互いに同一または異なっていてもよく、隣接する R^4 または R^5 と一体となって二重結合を形成してもよい ; R^6 、 R^7 : R^6 および R^7 は互いに同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、OH、置換されていてもよいC₁-6アルキル基、もしくは、置換されていてもよいC₁-6アルコキシ基、または、 R^6 と R^7 が一体となって置換されていてもよいC₃-6シクロアルキル基であり、 m が2以上の場合、複数の R^6 、または複数の R^7 は、それぞれ互い

に同一または異なっているとしてもよく、隣接する R^6 または R^7 と一体となって二重結合を形成してもよい；

Y^1 、 Y^2 ：同一または異なって結合、酸素原子、硫黄原子、 SO 、 SO_2 または、 NR^8 、ただし、 Y^1 が結合するとき、 m は 1 または 4 である；および、

R^8 ：水素原子、置換基を有しているとしてもよい C_{1-6} アルキル基。なお、 R^8 が複数存在するときには、複数の R^8 は、それぞれ互いに同一または異なっているとしてもよい。) である、

請求項 1 記載の化合物またはその塩。

【請求項 3】

式 (I) において、

10

L が、下記式からなる群

- $CR^4R^5 - CR^4R^5 - CR^6R^7 - CR^6R^7 - CR^6R^7 - CR^6R^7 - *$
- $CR^4R^5 - CR^4R^5 - CR^4R^5 - CR^4R^5 - CR^6R^7 - *$ 、
- $CR^4R^5 - CR^4R^5 - CR^4R^5 - CR^6R^7 - O - *$ 、
- $CR^4R^5 - CR^4R^5 - CR^4R^5 - O - CR^6R^7 - *$ 、および
- $CR^4R^5 - CR^4R^5 - O - CR^6R^7 - CR^6R^7 - *$ 、

から選択される、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 4】

式 (I) において、

20

R^1 ：OH または OR^y ；

R^y ： C_{1-6} アルキル基；

R^2 および R^3 ：同一または異なって、水素原子または C_{1-3} アルキル基；

X： $C(=O)$ ；

環 A：さらに、フッ素原子、塩素原子、1-3 個の置換基（ハロゲン原子、 C_{1-3} アルコキシ基から選ばれる）で置換されていてもよい C_{1-3} アルキル基、または、1-3 個の置換基（ハロゲン原子、 C_{1-3} アルコキシ基から選ばれる）で置換されていてもよい C_{1-3} アルコキシ基で、置換されていてもよいベンゼン環；

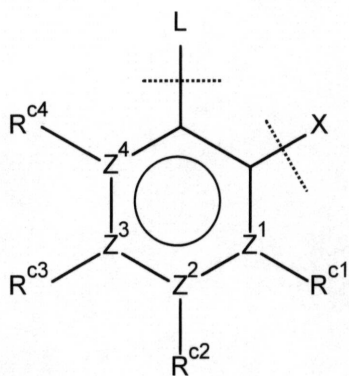
環 B：さらに、フッ素原子、塩素原子、シアノ基、1-3 個の置換基（ハロゲン原子、 C_{1-3} アルコキシ基から選ばれる）で置換されていてもよい C_{1-3} アルキル基、または、1-3 個の置換基（ハロゲン原子、 C_{1-3} アルコキシ基から選ばれる）で置換されて

30

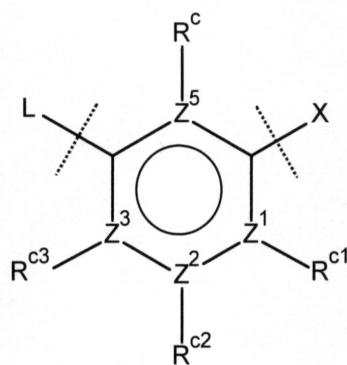
いてもよい C_{1-3} アルコキシ基で、置換されていてもよいベンゼン環；および

環 C：下記式で表される基：

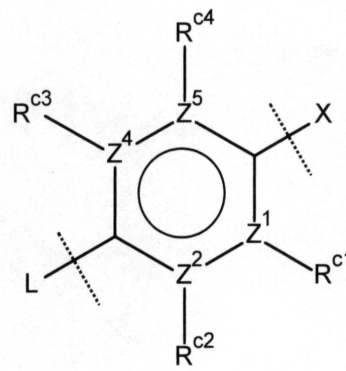
【化 268】



(C-3)



(C-4)



(C-5)

40

(式中、 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 Z^4 、および Z^5 は、同一または異なって炭素原子、窒素原子を意味する。

50

R^c は、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、ヒドロキシ基、ハロゲン化されていてもよい C_{1-6} アルキル基、ハロゲン化されていてもよい C_{1-6} アルコキシ基、または C_{3-10} シクロアルキル基を意味する。

R^{c1} 、 R^{c2} 、 R^{c3} または R^{c4} は、同一または異なって、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、ヒドロキシ基、ハロゲン化されていてもよい C_{1-6} アルキル基、ハロゲン化されていてもよい C_{1-6} アルコキシ基、または C_{3-10} シクロアルキル基を意味し、または、隣接する 2 つの R^{c1} 、 R^{c2} 、 R^{c3} または R^{c4} が一体となって、置換されていてもよい環を形成してもよい。

なお、 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 Z^4 、または Z^5 が窒素原子のときは、 R^c 、 R^{c1} 、 R^{c2} 、 R^{c3} または R^{c4} は存在しない。) である、

10

請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 5】

式 (I) において、

R^1 : OH ;

R^2 および R^3 : 同一または異なって、水素原子または C_{1-3} アルキル基 ;

X : C (= O) ;

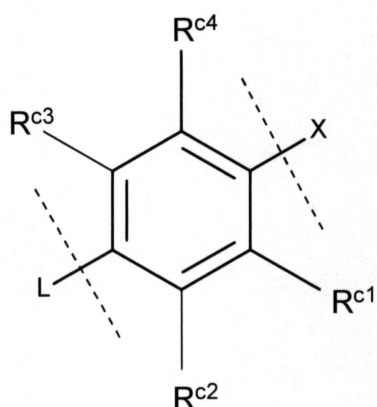
環 A : さらに C_{1-3} アルキル基で置換されていてもよいベンゼン環 ;

環 B : さらなる置換基を有さないベンゼン環 ; および

環 C : 下記式で表される基 :

【化 269】

20



30

(式中、

R^{c1} および R^{c4} は、同一または異なって、水素原子、ハロゲン化されていてもよい C_{1-6} アルキル基、ハロゲン化されていてもよい C_{1-6} アルコキシ基、塩素原子、またはフッ素原子であり、 R^{c2} および R^{c3} は水素原子) であり、

L : $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-*$ 、

$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-O-*$ 、

$-CH_2-CH_2-CH_2-O-CH_2-*$ 、または、

$-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-*$ 、である、

40

請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 6】

式 (I) において、

R^1 : OH ;

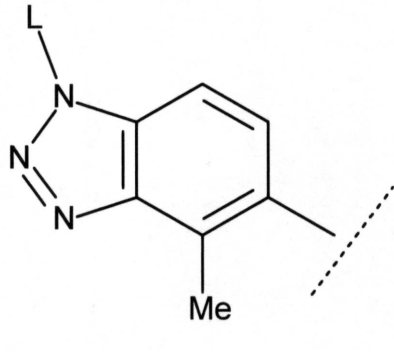
R^2 および R^3 : 同一または異なって、水素原子またはメチル基 ;

X : C (= O) ;

環 A : 下記式で表される部分構造 :

50

【化 2 7 0】

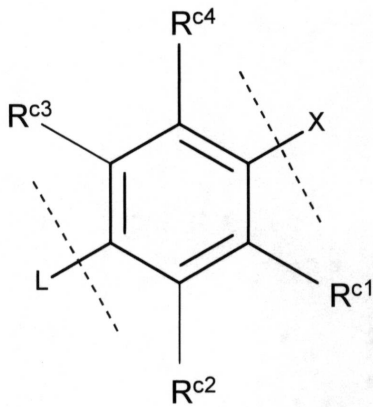


10

環 B : さらなる置換基を有さないベンゼン環 ;

環 C : 下記式で表される基 :

【化 2 7 1】



20

(式中、

R^{c1} および R^{c4} は、同一または異なって、水素原子、塩素原子、またはメチル基であり、 R^{c2} および R^{c3} は水素原子である) ; および、

30

L : $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-*$ 、
 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-O-*$ 、
 $-CH_2-CH_2-CH_2-O-CH_2-*$ 、または、
 $-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-*$ 、

である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 7】

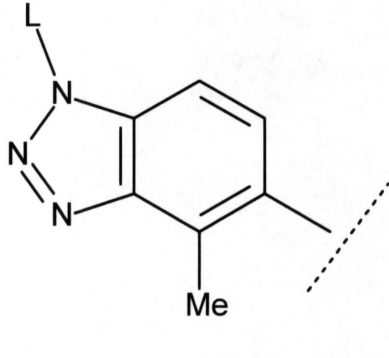
式 (I) において、 R^1 : OH ; R^2 および R^3 : 同一または異なって、水素原子またはメチル基 ;X : C (= O) ;

40

環 A : 下記式で表される部分構造 :

50

【化 2 7 0】

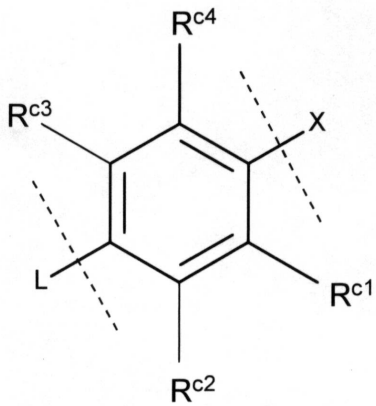


10

環 B : さらなる置換基を有さないベンゼン環 ;

環 C : 下記式で表される基 ;

【化 2 7 1】



20

(式中、

R^{c1}およびR^{c4}は、同一または異なって、水素原子またはメチル基であり、R^{c2}およびR^{c3}は水素原子である) ; および、

30

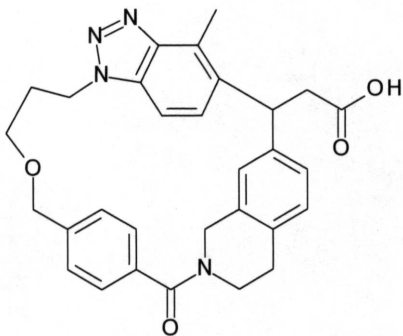
L : -CH₂-CH₂-CH₂-O-CH₂-*である、

請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 8】

下記化合物 ;

【化 2 7 3】



40

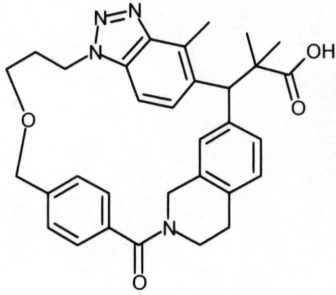
またはその塩。

【請求項 9】

下記化合物 ;

50

【化 2 7 4】



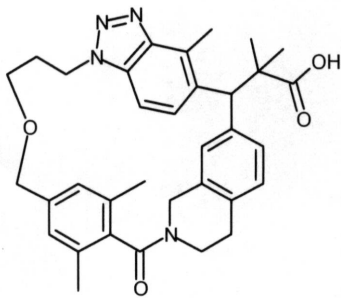
10

またはその塩。

【請求項 1 0】

下記化合物：

【化 2 7 5】



20

またはその塩。

【請求項 1 1】

請求項 1 ~ 1 0 のいずれか一項に記載の化合物またはその塩を含有してなる医薬。

【請求項 1 2】

NRF2 活性化剤である、請求項 1 1 記載の医薬。

30

【請求項 1 3】

肝・胆管疾患、心血管性疾患、肺疾患、腎疾患、中枢神経系疾患、癌、鎌状赤血球症、ミトコンドリア病、または、炎症性疾患の予防または治療剤である、請求項 1 1 記載の医薬。

【請求項 1 4】

肝・胆管疾患、心血管性疾患、肺疾患、腎疾患、中枢神経系疾患、癌、鎌状赤血球症、ミトコンドリア病、または、炎症性疾患の予防または治療に使用するための、請求項 1 ~ 1 0 のいずれか一項に記載の化合物または薬学的に許容される塩を含む医薬組成物。

40

50