

【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2年11月12日(2020.11.12)

【公表番号】特表2019-532938(P2019-532938A)

【公表日】令和1年11月14日(2019.11.14)

【年通号数】公開・登録公報2019-046

【出願番号】特願2019-516193(P2019-516193)

【国際特許分類】

C 07 D 207/09 (2006.01)
A 61 P 25/00 (2006.01)
A 61 P 35/00 (2006.01)
A 61 P 35/02 (2006.01)
A 61 P 25/14 (2006.01)
A 61 P 25/28 (2006.01)
A 61 P 9/04 (2006.01)
A 61 P 3/10 (2006.01)
A 61 P 25/18 (2006.01)
A 61 P 43/00 (2006.01)
A 61 K 31/4025 (2006.01)
A 61 K 31/428 (2006.01)
A 61 K 31/40 (2006.01)
A 61 K 31/4439 (2006.01)
A 61 K 31/422 (2006.01)
A 61 K 31/423 (2006.01)
A 61 K 31/437 (2006.01)
A 61 K 31/4709 (2006.01)
A 61 K 31/427 (2006.01)
A 61 K 31/4155 (2006.01)
A 61 K 31/433 (2006.01)
A 61 K 31/4245 (2006.01)
C 07 D 403/06 (2006.01)
C 07 D 417/12 (2006.01)
C 07 D 401/12 (2006.01)
C 07 D 413/12 (2006.01)
C 07 D 401/14 (2006.01)
C 07 D 471/04 (2006.01)
A 61 P 25/16 (2006.01)
A 61 P 9/10 (2006.01)
A 61 P 13/12 (2006.01)
C 07 D 403/14 (2006.01)
A 61 P 25/02 (2006.01)
A 61 P 3/00 (2006.01)
A 61 P 3/08 (2006.01)
A 61 P 21/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 207/09 C S P
A 61 P 25/00
A 61 P 35/00
A 61 P 35/02

A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	9/04	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	25/18	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 K	31/4025	
A 6 1 K	31/428	
A 6 1 K	31/40	
A 6 1 K	31/4439	
A 6 1 K	31/422	
A 6 1 K	31/423	
A 6 1 K	31/437	
A 6 1 K	31/4709	
A 6 1 K	31/427	
A 6 1 K	31/4155	
A 6 1 K	31/433	
A 6 1 K	31/4245	
C 0 7 D	403/06	
C 0 7 D	417/12	
C 0 7 D	401/12	
C 0 7 D	413/12	
C 0 7 D	401/14	
C 0 7 D	471/04	1 0 8 Q
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	43/00	1 0 5
C 0 7 D	471/04	1 0 6 A
C 0 7 D	403/14	
A 6 1 P	25/02	1 0 1
A 6 1 P	25/02	
A 6 1 P	3/00	
A 6 1 P	3/08	
A 6 1 P	21/00	

【手続補正書】

【提出日】令和2年9月25日(2020.9.25)

【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

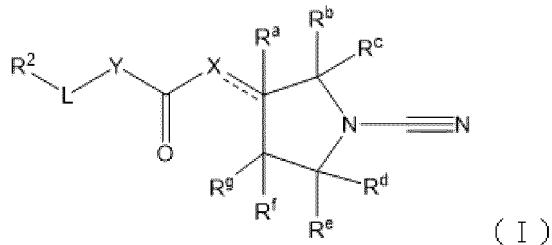
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物：

【化 1】



その互変異性体、又は前記化合物若しくは前記互変異性体の薬学的に許容される塩（式中

【化 2】

は、単結合又は二重結合を表し、

【化 3】

が二重結合である場合、 R^a は存在せず、

【化 4】

が二重結合である場合、 X は $C(R^X)$ を表し、

【化 5】

が単結合である場合、 X は $C(R^x)(R^y)$ を表し、

R^x 及び R^y は、各自独立して、水素及び $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択され、又は

R^x 及び R^y は一緒にになって、 $C_1 \sim C_6$ シクロアルキル環を形成し、

R^aは、水素、フルオロ、シアノ、C₁～C₃アルキル、及びC₁～C₃アルコキシから選択され.

又は R^a は、 R^b 又は R^g のいずれかと結合して、 C_3 ~ C_4 シクロアルキル環を形成し、 R^b 、 R^c 、 R^d 及び R^e は、 各々独立して、 水素、 C_1 ~ C_3 アルキル、 1 個以上のスピロ環基（ここで、 R^b は R^c と結合し、 又は R^d は R^e と結合する）を表し、 又は R^b は R^a と結合して、 C_3 ~ C_4 シクロアルキル環を形成し、 又は R^e は R^f と結合して、 C_3 ~ C_4 シクロアルキル環を形成し、

R^f 及び R^g は、各々独立して、水素、フルオロ、シアノ、C₁ ~ C₃アルキル、C₁ ~ C₃アルコキシ、及び 3 ~ 6 員のシクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール又はヘテロアリール環から選択され。

又は R^f は R^e と結合して $C_1 \sim C_4$ シクロアルキル環を形成し

又は R^g は R^a と結合して、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル環を形成し、

又は R^g 及び R^f は一緒にになってスピロ環基を形成し、

Y は $N(B^1)$ $- N(B^1)$ アザモジニル 及び

【化6】

から選択され、ここで、

【化7】



は、4～10員の単環式又は二環式ヘテロシクリル環であり、前記環は、ハロ、オキソ、シアノ、C₁～C₃アルキル及びC₁～C₃アルコキシから独立して選択される1個以上の置換基で任意選択的に置換されてもよく、ここで、前記アルキル及びアルコキシは、ハロで任意選択的に置換されてもよく、

Lは、共有結合、酸素原子及びC₁～C₃アルキレンから選択され、但し、YがN(R¹)を表す場合、Lは酸素原子であることはできず、

R¹は、水素及びC₁～C₃アルキルから選択され、

R²は、非置換であってもよいし又は1個以上の同じでも若しくは異なってもよいQ¹(R³)_nで置換されてもよい、5～10員の単環式若しくは二環式アリール又はヘテロアリール環であり、

nは、0又は1であり、

nが0である場合、Q¹はQ^{1a}を表し、

nが1である場合、Q¹はQ^{1b}を表し、

Q^{1a}は、ハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、SR⁴、NR⁴R⁵、CONR⁴R⁵、C₀～C₃-アルキレン-NR⁴COR⁵、NR⁴CONR⁵R⁶、COR⁴、C(O)OR⁴、SO₂R⁴、SO₂NR⁴R⁵、NR⁴SO₂R⁵、NR⁴SO₂NR⁵R⁶、NR⁴C(O)OR⁵、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルコキシ、ハロ(C₁～C₆アルキル)、ハロ(C₁～C₆アルコキシ)及びC₂～C₆アルケニルから選択され、ここで、前記アルキル、アルコキシ及びアルケニルは、非置換であってもよいし、又はC₁～C₆アルコキシ、ハロ、ヒドロキシル、チオール、シアノ、アミノ及びニトロから選択される基で置換されてもよく、

Q^{1b}は、共有結合、酸素原子、硫黄原子、OR⁷、SO、SO₂、CO、C(O)O、C₀～C₃-アルキレン-C(O)NR⁴-C₀～C₃アルキレン、C₀～C₃-アルキレン-NR⁴-C₀～C₃アルキレン、C₀～C₃-アルキレン-NR⁴C(O)-C₀～C₃アルキレン、NR⁴CONR⁵、SO₂NR⁴、NR⁴SO₂、NR⁴SO₂NR⁵、NR⁴C(O)O、NR⁴C(O)OR⁷、C₁～C₆アルキレン及びC₂～C₆アルケニレンから選択され、

R³は、3～10員の単環式若しくは二環式ヘテロシクリル、ヘテロアリール、シクロアリキル又はアリール環であり、

R⁴、R⁵及びR⁶は、各々独立して、水素及びC₁～C₆アルキルから選択され、

R⁷は、C₁～C₆アルキレンであり、

R³は、非置換であってもよいし、又はハロ、シアノ、オキソ、ニトロ、ヒドロキシル、SR⁸、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルコキシ、ハロ(C₁～C₆アルキル)、ハロ(C₁～C₆アルコキシ)、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、Q^{2a}-R¹¹、Q^{2a}-O-Q^{2b}-R¹¹、Q^{2a}-S-Q^{2b}-R¹¹、Q^{2a}-SO-Q^{2b}-R¹¹、Q^{2a}-NR⁸CONR⁹R¹⁰、Q^{2a}-NR⁸CONR⁹-Q^{2a}-R¹¹、Q^{2a}-NR⁸R⁹、Q^{2a}-NR⁸-Q^{2b}-R¹¹、Q^{2a}-COR⁸、Q^{2a}-CO-Q^{2b}-R¹¹、Q^{2a}-NR⁸COR⁹、Q^{2a}-NR⁸CO-Q^{2b}-R¹¹、Q^{2a}-NR⁸C(O)OR⁹、Q^{2a}-NR⁸C(O)O-Q^{2b}-R¹¹、Q^{2a}-S-O₂R⁸、Q^{2a}-SO₂-Q^{2b}-R¹¹、Q^{2a}-CONR⁸R⁹、Q^{2a}-CONR⁸-Q^{2b}-R¹¹、Q^{2a}-CO₂R⁸、Q^{2a}-CO₂-Q^{2b}-R¹¹、Q^{2a}-SO₂NR⁸R⁹、Q^{2a}-SO₂NR⁸

$-\text{Q}^{2b}-\text{R}^{11}$ 、 $\text{Q}^{2a}-\text{N}\text{R}^8\text{SO}_2\text{R}^9$ 、 $\text{Q}^{2a}-\text{N}\text{R}^8\text{SO}_2-\text{Q}^{2b}-\text{R}^{11}$ 、 $\text{Q}^{2a}-\text{N}\text{R}^8\text{SO}_2\text{N}\text{R}^9\text{R}^{10}$ 、及び $\text{Q}^{2a}-\text{N}\text{R}^8\text{SO}_2\text{N}\text{R}^9-\text{Q}^{2b}-\text{R}^{11}$ から選択される1個以上の置換基で置換されてもよく、

Q^{2a} 及び Q^{2b} は、各々独立して、共有結合、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキレン及び $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニレンから選択され、

R^8 、 R^9 及び R^{10} は、各々独立して、水素及び $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルから選択され、 R^{11} は、3～10員のヘテロシクリル、ヘテロアリール、アリール又はシクロアルキル環である)。

【請求項2】

R^2 は、チアゾリル、イミダゾピリジニル、フェニル、ピリジニル、ベンゾチアゾリル、イソオキサゾリル、ベンゾオキサゾリル、キノリニル、ピラゾリル、チアジアゾリル、オキサジアゾリル及びピラゾロピリジンから選択され、これらの各々は、非置換であってもよいし、又は1個以上の同じでも若しくは異なってもよい $\text{Q}^1(\text{R}^3)_n$ で置換されてもよい、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

Q^{1a} は、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、ハロ($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル)、及びハロ($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ)、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ- $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル及び $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ- $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシから選択される、請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項4】

Q^{1a} は、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ、ハロ($\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル)及び $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ- $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシから選択される、請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

Q^{1b} は、共有結合及び酸素原子から選択される、請求項1～4の何れか一項に記載の化合物。

【請求項6】

R^3 は、フェニル、イソオキサゾリル、ピリジニル、ピロリジニル及びピラゾリルから選択される、請求項1～5の何れか一項に記載の化合物。

【請求項7】

R^3 は、非置換であるか、又はハロ、シアノ、オキソ、ニトロ、ヒドロキシル、 SR^8 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、ハロ($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル)、ハロ($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ)、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル及び $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニルから各々独立して選択される1、2又は3個の置換基で置換された、請求項1～6の何れか一項に記載の化合物。

【請求項8】

Y は、アゼチジニル、 $\text{N}(\text{H})$ アゼチジニル、 $\text{N}(\text{H})$ 及び $\text{N}(\text{CH}_3)$ から選択される、請求項1～7の何れか一項に記載の化合物。

【請求項9】

R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e 、 R^f 及び R^g 、 R^x 並びに R^y は、各々独立して、水素及びメチルから選択される、請求項1～8の何れか一項に記載の化合物。

【請求項10】

R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e 、 R^f 及び R^g は水素である、請求項9に記載の化合物。

【請求項11】

R^x 及び R^y は水素である、請求項9又は10に記載の化合物。

【請求項12】

3-(2-(3-(4-メトキシフェニル)アゼチジン-1-イル)-2-オキソエチル)ピロリジン-1-カルボニトリル、

$\text{N}-(3-\text{クロロフェニル})-2-(1-\text{シアノピロリジン}-3-\text{イル})\text{アセトアミド}$ 、

2-(1-シアノピロリジン-3-イル)- $\text{N}-(6-\text{メトキシベンゾ}[\text{d}]\text{チアゾー}$

ル - 2 - イル) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) - N - (6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル) アセトアミド、
N - (6 - クロロベンゾ [d] チアゾール - 2 - イル) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) - N - (3 - フェニルイソオキサゾール - 5 - イル) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) - N - (5 - フェニルピリジン - 2 - イル) アセトアミド、
N - (5 - クロロベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) - N - (3 , 4 - ジクロロフェニル) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) - N - (5 - フェニルチアゾール - 2 - イル) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) - N - フェネチルアセトアミド、
3 - (2 - オキソ - 2 - (3 - フェノキシアゼチジン - 1 - イル) エチル) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、
3 - (2 - (3 - (3 - メトキシフェニル) アゼチジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、
3 - (2 - (3 - (3 , 4 - ジフルオロフェニル) アゼチジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、
3 - (2 - (3 - (2 - メチルピリジン - 4 - イル) アゼチジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) - N - (6 - (3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 2 - イル) アセトアミド、
3 - (2 - (3 - (4 - メトキシフェニル) アゼチジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチリデン) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、
3 - (2 - オキソ - 2 - (3 - フェニルアゼチジン - 1 - イル) エチリデン) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、
N - (3 - クロロ - 4 - メチルフェニル) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イリデン) アセトアミド、
N - (4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イリデン) アセトアミド、
N - (ベンゾ [d] チアゾール - 6 - イル) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イリデン) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イリデン) - N - (4 - フェノキシフェニル) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イリデン) - N - (キノリン - 3 - イル) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イリデン) - N - メチル - N - (キノリン - 6 - イルメチル) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イリデン) - N - メチル - N - ((5 - フェニルイソオキサゾール - 3 - イル) メチル) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イリデン) - N - メチル - N - ((ピリジン - 4 - イル) ベンジル) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イリデン) - N - メチル - N - ((3 - フェニルイソオキサゾール - 5 - イル) メチル) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イリデン) - N - メチル - N - ((ピロリジン - 1 - イル) ベンジル) アセトアミド、

2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イリデン) - N - メチル - N - ((2 - フェニルチアゾール - 4 - イル) メチル) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イリデン) - N - メチル - N - ((5 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イリデン) - N - (2 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル) ベンジル) アセトアミド、
N - (ベンゾ [d] チアゾール - 2 - イル) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イリデン) - N - メチルアセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イリデン) - N - (3 , 4 - ジクロロベンジル) - N - メチルアセトアミド、
(S) - N - (3 - (4 - クロロフェニル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) アセトアミド、
(R) - N - (3 - (4 - クロロフェニル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) アセトアミド、
(R) - N - (3 - (3 - クロロフェニル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) アセトアミド、
(S) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) - N - (3 - (3 - メトキシフェニル) イソオキサゾール - 5 - イル) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) - N - (5 - フェニル - 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - イル) アセトアミド、
(S) - N - (3 - (3 - クロロフェニル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) アセトアミド、
(R) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) - N - (3 - (3 - メトキシフェニル) イソオキサゾール - 5 - イル) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) - N - (ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 2 - イル) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) - N - (4 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル) アセトアミド、
N - (5 - シアノピリジン - 2 - イル) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) アセトアミド、
2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) - N - (1 - (ピリジン - 2 - イル) アゼチジン - 3 - イル) アセトアミド、
(S) - N - (5 - (3 - クロロフェニル) - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) アセトアミド、
N - (5 - (3 - シアノフェニル) - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) アセトアミド、
(S) - N - (3 - (3 - クロロフェニル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 2 - ((S) - 1 - シアノピロリジン - 3 - イル) プロベンアミド、
(R) - N - (3 - (3 - シアノフェニル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) アセトアミド、
(S) - 3 - (2 - (3 - (4 - シアノフェニル) アゼチジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、
(R) - N - (3 - (3 - クロロフェニル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 2 - ((S) - 1 - シアノピロリジン - 3 - イル) プロベンアミド、
(R) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) - N - (3 - (3 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) イソオキサゾール - 5 - イル) アセトアミド、
(R) - N - (5 - (3 - シアノフェニル) イソオキサゾール - 3 - イル) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) アセトアミド、
(S) - 3 - (2 - (3 - (3 - シアノフェニル) アゼチジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、

(S) - 6 - (1 - (2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) アセチル) アゼチジン - 3 - イル) ニコチノニトリル、
 (S) - 3 - (2 - (3 - (4 - メトキシフェニル) アゼチジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、
 3 - (2 - (3 - (4 - ヒドロキシフェニル) アゼチジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、
 (S) - 3 - (2 - (3 - (4 - シアノ - 3 - メチルフェニル) アゼチジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、
 (S) - 4 - (1 - (2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) アセチル) アゼチジン - 3 - イル) - N , N - ジメチルベンズアミド、
 (S) - 3 - ((S) - 1 - (3 - (4 - シアノフェニル) アゼチジン - 1 - イル) - 1 - オキソプロパン - 2 - イル) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、
 (S) - 3 - ((R) - 1 - (3 - (4 - シアノフェニル) アゼチジン - 1 - イル) - 1 - オキソプロパン - 2 - イル) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、
 (R) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) - N - (5 - フェニル - 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - イル) アセトアミド、
 (S) - 2 - (1 - シアノピロリジン - 3 - イル) - N - (5 - フェニル - 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - イル) アセトアミド、
 (S) - 3 - (2 - (3 - (5 - イソプロポキシピリジン - 2 - イル) アゼチジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、
 (S) - 3 - (2 - (3 - (4 - (2 - メトキシエトキシ) フェニル) アゼチジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、
 (S) - 3 - (2 - (3 - (4 - メトキシ - 3 - (1 H - ピラゾール - 5 - イル) フェニル) アゼチジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、
 (S) - 3 - (2 - (3 - (4 - メトキシ - 3 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) フェニル) アゼチジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、
 (S) - 3 - (2 - (3 - (4 - メトキシ - 3 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) フェニル) アゼチジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、及び

(S) - 3 - (2 - (3 - (2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) アゼチジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル) ピロリジン - 1 - カルボニトリル、

から選択される請求項 1 に記載の化合物、その互変異性体、又は前記化合物若しくは前記互変異性体の薬学的に許容される塩。

【請求項 1 3】

医薬として使用するための、請求項 1 ~ 1 2 の何れか一項に記載の化合物、その互変異性体、又は前記化合物若しくは互変異性体の薬学的に許容される塩。

【請求項 1 4】

ミトコンドリア機能不全に関する障害又は状態の治療に使用するための、請求項 1 ~ 1 2 の何れか一項に記載の化合物、その互変異性体、又は前記化合物若しくは互変異性体の薬学的に許容される塩を含む医薬組成物であって、前記ミトコンドリア機能不全に関する障害又は状態が、C N S 障害；神経変性疾患；多発性硬化症；ミトコンドリア脳症・乳酸アシドーシス・脳卒中様発作症候群；レーベル遺伝性視神経症；神経性薄弱；運動失調；網膜色素変性症；母性遺伝性リー症候群；ダノン病；糖尿病；糖尿病性腎症；代謝障害；心不全；心筋梗塞を引き起こす虚血性心疾患；精神疾患；統合失調症、多発性スルファターゼ欠損症；ムコリピドーシス I I ；ムコリピドーシス I I I ；ムコリピドーシス I V ；G M I - ガングリオシドーシス；神経セロイドリポフスチン症；アルパーズ病；バース症候群；ベータ酸化欠損；カルニチン - アシル - カルニチン欠乏症；カルニチン欠乏症；クレアチン欠乏症候群；コエンザイム Q 1 0 欠損症；複合体 I 欠損症；複合体 I I 欠損症；複合体 I I I 欠損症；複合体 I V 欠損症；複合体 V 欠損症；C O X 欠損症；慢性進行性外

眼筋麻痺症候群；CPT I 欠損症；CPT II 欠損症；グルタル酸尿症 I I 型；カーンズ・セイヤー症候群；乳酸アシドーシス；長鎖アシルCoAデヒドロゲナーゼ欠損症；リーエン病又は症候群；致死性小児心筋症；ルフト病；グルタル酸尿症 I I 型；中鎖アシルCoAデヒドロゲナーゼ欠損症；ミオクローヌスてんかん症候群・赤色ぼろ線維症候群；ミトコンドリア細胞変性；ミトコンドリア劣性運動失調症候群；ミトコンドリアDNA枯渇症候群；筋神経胃腸障害及び脳症；ピアソン症候群；ピルビン酸デヒドロゲナーゼ欠損症；ピルビン酸カルボキシラーゼ欠損症；POLG変異；中／短鎖3-ヒドロキシアシル-CoAデヒドロゲナーゼ欠損症；極長鎖アシルCoAデヒドロゲナーゼ欠損症；認知機能及び筋力の年齢依存性の低下から選択される、医薬組成物。

【請求項 15】

前記神経変性疾患が、パーキンソン病、アルツハイマー病、筋萎縮性側索硬化症、ハンチントン病、虚血症、脳卒中、レビー小体型認知症、前頭側頭型認知症；-シヌクレン、パーキン及びPINK1の変異に関連するパーキンソン病、及びパーキンが変異している常染色体劣性若年性パーキンソン病の治療から選択される、請求項14に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

乳癌、卵巣癌、前立腺癌、肺癌、腎臓癌、胃癌、結腸癌、精巣癌、頭頸部癌、膵臓癌、脳腫瘍、メラノーマ、及び骨腫瘍、組織器官の癌、血液細胞の癌、リンパ腫、白血病、多発性骨髓腫、大腸癌、非小細胞肺癌、アポトーシス経路が調節不全である癌、及びBCL-2ファミリーのタンパク質が変異している又は過剰発現若しくは過少発現している癌の治療のための、請求項1～12の何れか一項に記載の化合物、その互変異性体、又は前記化合物若しくは互変異性体の薬学的に許容される塩を含む医薬組成物。

【請求項 17】

請求項1～12の何れか一項に記載の式(I)の化合物又は前記化合物若しくは前記互変異性体の薬学的に許容される塩を、薬学的に許容される希釈剤又は担体と共に含む、医薬組成物。