

【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 07D 207/09 (2006.01)

A 61P 25/00 (2006.01)

A 61P 35/00 (2006.01)

A 61P 35/02 (2006.01)

A 61P 25/14 (2006.01)

A 61P 25/28 (2006.01)

A 61P 9/04 (2006.01)

A 61P 3/10 (2006.01)

A 61P 25/18 (2006.01)

A 61P 43/00 (2006.01)

A 61K 31/4025 (2006.01)

A 61K 31/428 (2006.01)

A 61K 31/40 (2006.01)

A 61K 31/4439 (2006.01)

A 61K 31/422 (2006.01)

A 61K 31/423 (2006.01)

A 61K 31/437 (2006.01)

A 61K 31/4709 (2006.01)

A 61K 31/427 (2006.01)

A 61K 31/4155 (2006.01)

A 61K 31/433 (2006.01)

A 61K 31/4245 (2006.01)

C 07D 403/06 (2006.01)

C 07D 417/12 (2006.01)

C 07D 401/12 (2006.01)

C 07D 413/12 (2006.01)

C 07D 401/14 (2006.01)

C 07D 471/04 (2006.01)

A 61P 25/16 (2006.01)

A 61P 9/10 (2006.01)

A 61P 13/12 (2006.01)

C 07D 403/14 (2006.01)

A 61P 25/02 (2006.01)

A 61P 3/00 (2006.01)

A 61P 3/08 (2006.01)

A 61P 21/00 (2006.01)

【F I】

C 07D 207/09 C S P

A 61P 25/00

A 61P 35/00

A 61P 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

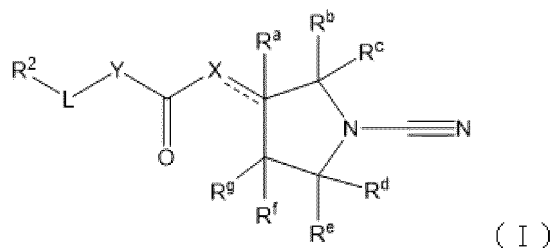
【補正の内容】

【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、 $\text{R}^a$ は存在せず、

## 【化 4】



が二重結合である場合、 $\text{X}$ は $\text{C}(\text{R}^x)$ を表し、

## 【化 5】



が単結合である場合、 $\text{X}$ は $\text{C}(\text{R}^x)(\text{R}^y)$ を表し、

$\text{R}^x$ 及び $\text{R}^y$ は、各々独立して、水素及び $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルキルから選択され、又は

$\text{R}^x$ 及び $\text{R}^y$ は一緒になって、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル環を形成し、

$\text{R}^a$ は、水素、フルオロ、シアノ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルキル、及び $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシから選択され、

又は $\text{R}^a$ は、 $\text{R}^b$ 又は $\text{R}^g$ のいずれかと結合して、 $\text{C}_3\sim\text{C}_4$ シクロアルキル環を形成し、

$\text{R}^b$ 、 $\text{R}^c$ 、 $\text{R}^d$ 及び $\text{R}^e$ は、各々独立して、水素、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルキル、1個以上のスピロ環基（ここで、 $\text{R}^b$ は $\text{R}^c$ と結合し、又は $\text{R}^d$ は $\text{R}^e$ と結合する）を表し、又は $\text{R}^b$ は $\text{R}^a$ と結合して、 $\text{C}_3\sim\text{C}_4$ シクロアルキル環を形成し、又は $\text{R}^e$ は $\text{R}^f$ と結合して、 $\text{C}_3\sim\text{C}_4$ シクロアルキル環を形成し、

$\text{R}^f$ 及び $\text{R}^g$ は、各々独立して、水素、フルオロ、シアノ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ 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 $\text{R}^f$ は $\text{R}^g$ と結合して、 $\text{C}_3\sim\text{C}_4$ シクロアルキル環を形成し、

又は $\text{R}^g$ は $\text{R}^a$ と結合して、 $\text{C}_3\sim\text{C}_4$ シクロアルキル環を形成し、

又は $\text{R}^g$ 及び $\text{R}^f$ は一緒になって、スピロ環基を形成し、

$\text{Y}$ は、 $\text{N}(\text{R}^1)$ 、 $\text{N}(\text{R}^1)$ アゼチジニル、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、 $C_1 \sim C_3$ アルキル及び $C_1 \sim C_3$ 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 $C_1 \sim C_3$ アルキレンから選択され、但し、YがN( $R^1$ )を表す場合、Lは酸素原子であることはできず、

$R^1$ は、水素及び $C_1 \sim C_3$ アルキルから選択され、

$R^2$ 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 $Q^1$ ( $R^3$ )<sub>n</sub>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、 $Q^1$ は $Q^{1a}$ を表し、

nが1である場合、 $Q^1$ は $Q^{1b}$ を表し、

$Q^{1a}$ は、ハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、 $SR^4$ 、 $NR^4R^5$ 、 $CONR^4R^5$ 、 $C_0 \sim C_3$ -アルキレン- $NR^4COR^5$ 、 $NR^4CONR^5R^6$ 、 $COR^4$ 、 $C(O)OR^4$ 、 $SO_2R^4$ 、 $SO_2NR^4R^5$ 、 $NR^4SO_2R^5$ 、 $NR^4SO_2NR^5R^6$ 、 $NR^4C(O)OR^5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)、ハロ( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ)及び $C_2 \sim C_6$ 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 $C_1 \sim C_6$ 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、 $OR^7$ 、 $SO$ 、 $SO_2$ 、 $CO$ 、 $C(O)O$ 、 $C_0 \sim C_3$ -アルキレン- $C(O)NR^4$ 、 $C_0 \sim C_3$ アルキレン、 $C_0 \sim C_3$ -アルキレン- $NR^4$ 、 $C_0 \sim C_3$ アルキレン、 $C_0 \sim C_3$ -アルキレン- $NR^4C(O)$ 、 $C_0 \sim C_3$ アルキレン、 $NR^4CONR^5$ 、 $SO_2NR^4$ 、 $NR^4SO_2$ 、 $NR^4SO_2NR^5$ 、 $NR^4C(O)O$ 、 $NR^4C(O)OR^7$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキレン及び $C_2 \sim C_6$ アルケニルから選択され、

$R^3$ 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、シクロアルキル又はアリール環であり、

$R^4$ 、 $R^5$ 及び $R^6$ は、各々独立して、水素及び $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択され、

$R^7$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキレンであり、

$R^3$ 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、 $SR^8$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)、ハロ( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ)、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $Q^{2a}-R^{11}$ 、 $Q^{2a}-O-Q^{2b}-R^{11}$ 、 $Q^{2a}-S-Q^{2b}-R^{11}$ 、 $Q^{2a}-SO-Q^{2b}-R^{11}$ 、 $Q^{2a}-NR^8CONR^9R^{10}$ 、 $Q^{2a}-NR^8CONR^9-Q^{2a}-R^{11}$ 、 $Q^{2a}-NR^8R^9$ 、 $Q^{2a}-NR^8-Q^{2b}-R^{11}$ 、 $Q^{2a}-COR^8$ 、 $Q^{2a}-CO-Q^{2b}-R^{11}$ 、 $Q^{2a}-NR^8COR^9$ 、 $Q^{2a}-NR^8CO-Q^{2b}-R^{11}$ 、 $Q^{2a}-NR^8C(O)OR^9$ 、 $Q^{2a}-NR^8C(O)O-Q^{2b}-R^{11}$ 、 $Q^{2a}-SO_2R^8$ 、 $Q^{2a}-SO_2-Q^{2b}-R^{11}$ 、 $Q^{2a}-CONR^8R^9$ 、 $Q^{2a}-CONR^8-Q^{2b}-R^{11}$ 、 $Q^{2a}-CO_2R^8$ 、 $Q^{2a}-CO_2-Q^{2b}-R^{11}$ 、 $Q^{2a}-SO_2NR^8R^9$ 、 $Q^{2a}-SO_2NR^8$

$-Q^{2b}-R^{11}$ 、 $Q^{2a}-NR^8SO_2R^9$ 、 $Q^{2a}-NR^8SO_2-Q^{2b}-R^{11}$ 、 $Q^{2a}-NR^8SO_2NR^9R^{10}$ 、及び $Q^{2a}-NR^8SO_2NR^9-Q^{2b}-R^{11}$ 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、 $C_1\sim C_6$ アルキレン及び $C_2\sim C_6$ 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 $C_1\sim C_6$ 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 $Q^1(R^3)_n$ 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、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、ハロ( $C_1\sim C_6$ アルキル)、及びハロ( $C_1\sim C_6$ アルコキシ)、 $C_1\sim C_3$ アルコキシ- $C_1\sim C_3$ アルキル及び $C_1\sim C_3$ アルコキシ- $C_1\sim C_3$ 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、 $C_1\sim C_3$ アルキル、 $C_1\sim C_3$ アルコキシ、ハロ( $C_1\sim C_3$ アルキル)及び $C_1\sim C_3$ アルコキシ- $C_1\sim C_3$ 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、 $SR^8$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、ハロ( $C_1\sim C_6$ アルキル)、ハロ( $C_1\sim C_6$ アルコキシ)、 $C_2\sim C_6$ アルケニル及び $C_2\sim C_6$ 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、N(H)アゼチジニル、N(H)及びN(CH<sub>3</sub>)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、

N-(3-クロロフェニル)-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-(6-メトキシベンゾ[d]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 - ( 3 - ( 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 - ( 4 - ( 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 ) プロペンアミド、

( 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 ) プロペンアミド、

( 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 - イソプロボキシピリジン - 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 13】

医薬として使用するための、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。

#### 【請求項 14】

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 ~ 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、CNS 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；パース症候群；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 10 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；C P T I 欠損症；C P T I I 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 C o A デヒドロゲナーゼ欠損症；  
リー病又は症候群；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 C  
o A デヒドロゲナーゼ欠損症；ミオクロヌステんかん症候群・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 D N A 枯渇  
症候群；筋神経胃腸障害及び脳症；ピアソン症候群；ビルビン酸デヒドロゲナーゼ欠損症  
；ビルビン酸カルボキシラーゼ欠損症；P O L G 変異；中ノ短鎖 3 - ヒドロキシアシル -  
C o A デヒドロゲナーゼ欠損症；極長鎖アシル C o A 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 1 5】

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；         - シヌクレイ  
ン、パーキン及び P I N K 1 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 1 4 に記載の医薬  
組成物。

【請求項 1 6】

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  
発性骨髄腫、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 B C L  
- 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 ~ 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。

【請求項 1 7】

請求項 1 ~ 1 2 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。