

【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7月13日(2022.7.13)

【国際公開番号】WO2020/010309

【公表番号】特表2021-530560(P2021-530560A)

【公表日】令和3年11月11日(2021.11.11)

【出願番号】特願2021-521945(P2021-521945)

【国際特許分類】

C 0 7 D 2 4 9 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

10

C 0 7 D 4 0 3 / 1 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

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

C 0 7 D 4 0 9 / 1 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

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

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

C 0 7 D 4 1 3 / 1 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

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

A 6 1 K 3 1 / 4 1 9 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

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

A 6 1 K 3 1 / 4 2 7 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

20

A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 9 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 7 2 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 3 7 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 0 6 ( 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 4 3 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

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

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

【 F I 】

C 0 7 D 2 4 9 / 0 4 5 0 6

30

C 0 7 D 4 0 3 / 1 2 C S P

C 0 7 D 4 0 1 / 1 2

C 0 7 D 4 0 9 / 1 2

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

C 0 7 D 4 0 7 / 1 2

C 0 7 D 4 1 3 / 1 2

C 0 7 D 4 1 7 / 1 2

A 6 1 K 3 1 / 4 1 9 2

A 6 1 K 3 1 / 4 2 2

A 6 1 K 3 1 / 4 2 7

40

A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 9

A 6 1 K 3 1 / 4 7 2 5

A 6 1 K 3 1 / 4 3 7

A 6 1 K 3 1 / 5 0 6

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7

A 6 1 P 4 3 / 0 0

A 6 1 P 3 / 0 0

A 6 1 P 1 3 / 1 2

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

50

【手続補正書】

【提出日】令和4年7月5日(2022.7.5)

【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】

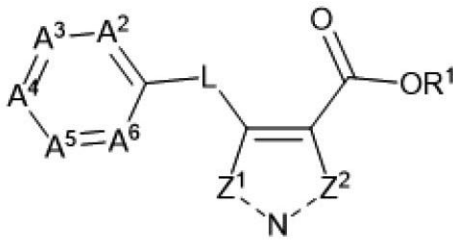
【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iにより表される化合物：

10

【化1】



(I)

20

またはその薬学上許容される塩

〔式中、

LはOおよびSから成る群より選択され；

A<sup>2</sup>はC<sup>R2</sup>およびNから成る群より選択され；

A<sup>3</sup>はC<sup>R3</sup>およびNから成る群より選択され；

A<sup>4</sup>はC<sup>R4</sup>およびNから成る群より選択され；

A<sup>5</sup>とA<sup>6</sup>は独立にCHおよびNから成る群より選択され；

Z<sup>1</sup>に結合した破線は単結合であり、Z<sup>1</sup>はN<sup>R5</sup>であり、Z<sup>2</sup>に結合した破線は二重結合であり、そしてZ<sup>2</sup>はNであるか、あるいは

Z<sup>1</sup>に結合した破線は二重結合であり、Z<sup>1</sup>はNであり、Z<sup>2</sup>に結合した破線は単結合であり、そしてZ<sup>2</sup>はN<sup>R5</sup>であり；

30

R<sup>1</sup>はH、未置換のC<sub>1-6</sub>アルキル、置換されたC<sub>1-6</sub>アルキル、-(C<sub>1-6</sub>アルキレン)-O C(O)-(C<sub>1-6</sub>アルキル)、および-(C<sub>1-6</sub>アルキレン)-O C(O)-(C<sub>1-6</sub>アルコキシ)から選択され；

R<sup>2</sup>はHおよびハロゲンから成る群より選択され；

R<sup>3</sup>はH、ハロゲン、C<sub>1-12</sub>アルキル、C<sub>1-12</sub>アルコキシ、C<sub>6-12</sub>アリーール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、および5~12員のヘテロアリーールから成る群より選択され；

R<sup>3</sup>は非置換であるか、またはR<sup>3</sup>は1つ以上のR<sup>3a</sup>で置換されており；

各R<sup>3a</sup>は独立に、C<sub>1-12</sub>アルキル、C<sub>1-12</sub>アルコキシ、C<sub>1-12</sub>ハロアルキル、C<sub>1-12</sub>ハロアルコキシ、ハロゲン、-OH、-CO<sub>2</sub>H、-SO<sub>3</sub>、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、C<sub>2-12</sub>アルケニル、C<sub>2-12</sub>アルキニル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>3-8</sub>ハロシクロアルキル、(C<sub>6-12</sub>アリーール)-M-、3~12員のヘテロシクリル、5~12員のヘテロアリーール、-N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>、-C(O)N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>、-OC(O)N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>、-OC(O)N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>a</sup>C(O)R<sup>b</sup>、-C(O)R<sup>b</sup>、および-OC(O)R<sup>b</sup>から成る群より選択され；

40

R<sup>4</sup>はC<sub>6-12</sub>アリーール、および5~12員のヘテロアリーールから成る群より選択され；

R<sup>4</sup>は1つ以上のR<sup>4a</sup>で置換されており；

各R<sup>4a</sup>は独立にC<sub>3-8</sub>ハロシクロアルキルであり；

R<sup>5</sup>はH、未置換のC<sub>1-6</sub>アルキル、置換されたC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>2-7</sub>アシル、-(C<sub>1-</sub>

50

6アルキレン) - OC(O) - (C<sub>1-6</sub>アルキル)、および - (C<sub>1-6</sub>アルキレン) - OC(O) - (C<sub>1-6</sub>アルコキシ)から成る群より選択され；

各Mは独立に共有結合、NR<sup>a</sup>、O、S、C<sub>1-6</sub>アルキレン、および2～6員のヘテロアルキレンから成る群より選択され；

各R<sup>a</sup>は独立にHおよびC<sub>1-6</sub>アルキルから成る群より選択され；そして

各R<sup>b</sup>は独立にC<sub>1-6</sub>アルキルおよびC<sub>1-6</sub>アルコキシから成る群より選択される。】

【請求項2】

Z<sup>1</sup>に結合した破線が単結合であり、Z<sup>1</sup>がNR<sup>5</sup>であり、Z<sup>2</sup>に結合した破線が二重結合であり、そしてZ<sup>2</sup>がNである、請求項1に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩。

10

【請求項3】

Z<sup>1</sup>に結合した破線が二重結合であり、Z<sup>1</sup>がNであり、Z<sup>2</sup>に結合した破線が単結合であり、そしてZ<sup>2</sup>がNR<sup>5</sup>である、請求項1に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

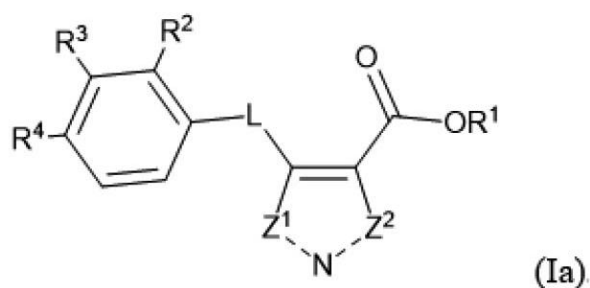
【請求項4】

R<sup>5</sup>がHである、請求項1に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩。

【請求項5】

式Iaに示される構造：

【化2】



20

を有する請求項1に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩。

【請求項6】

LがOである、請求項5に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩。

30

【請求項7】

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>がHである、請求項6に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩。

【請求項8】

R<sup>4</sup>がフェニルおよびピフェニルから成る群より選択され、その各々がC<sub>3-8</sub>ハロシクロアルキルで置換されている、請求項6に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩。

【請求項9】

R<sup>4</sup>がC<sub>3-8</sub>ハロシクロアルキルで置換されたフェニルである、請求項8に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩。

40

【請求項10】

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>がHである、請求項1に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩。

【請求項11】

R<sup>4</sup>がフェニルおよびピフェニルから成る群より選択され、その各々がC<sub>3-8</sub>ハロシクロアルキルで置換されている、請求項1に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩。

【請求項12】

R<sup>4</sup>がC<sub>3-8</sub>ハロシクロアルキルで置換されたフェニルである、請求項11に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩。

【請求項13】

50

L が S である、請求項 5 に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 14】

R<sup>1</sup> が H である、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 15】

R<sup>1</sup> が未置換の C<sub>1-6</sub>アルキルおよび置換された C<sub>1-6</sub>アルキルから成る群より選択される、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 16】

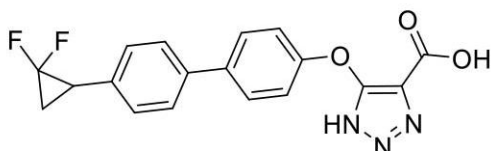
R<sup>1</sup> が - (C<sub>1-6</sub>アルキレン) - O C ( O ) - (C<sub>1-6</sub>アルキル) および - (C<sub>1-6</sub>アルキレン) - O C ( O ) - (C<sub>1-6</sub>アルコキシ) から成る群より選択される、請求項 1 に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩。

10

【請求項 17】

以下の式により表される、請求項 1 に記載の化合物：

【化 3】



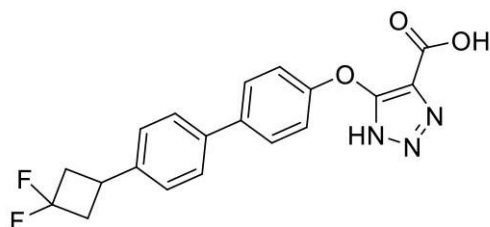
若しくはその互変異性体、および / または薬学的に許容されるその塩。

20

【請求項 18】

以下の式により表される、請求項 1 に記載の化合物：

【化 4】



30

若しくはその互変異性体、および / または薬学的に許容されるその塩。

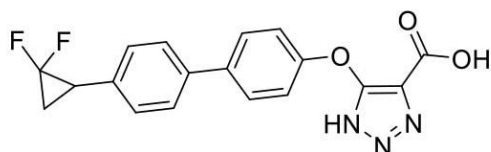
【請求項 19】

原発性高シュウ酸尿症 I 型 (PH1) を治療するための、治療有効量の請求項 1 ~ 18 のいずれか一項に記載の化合物、若しくはその互変異性体、および / または薬学的に許容されるその塩を含む医薬組成物であって、前記組成物が対象に投与される、医薬組成物。

【請求項 20】

前記化合物が以下の式により表される化合物：

【化 5】



40

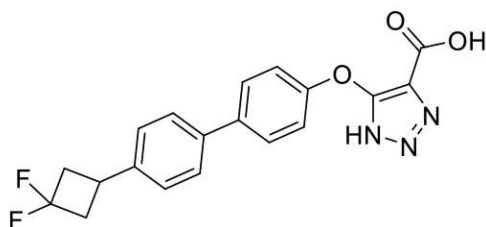
若しくはその互変異性体、および / または薬学的に許容されるその塩である、請求項 19 に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

前記化合物が以下の式により表される化合物：

50

## 【化 6】



若しくはその互変異性体、および/または薬学的に許容されるその塩である、請求項 1 9 に記載の医薬組成物。

10

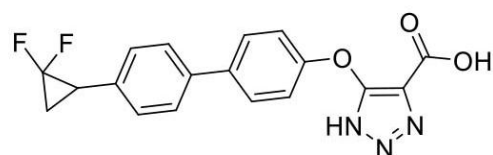
## 【請求項 2 2】

腎臓結石を治療するための、治療有効量の請求項 1 ~ 1 8 のいずれか一項に記載の化合物、若しくはその互変異性体、および/または薬学的に許容されるその塩を含む医薬組成物であって、前記組成物が対象に投与される、医薬組成物。

## 【請求項 2 3】

前記化合物が以下の式により表される化合物：

## 【化 7】



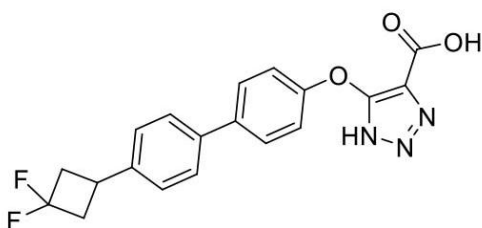
20

若しくはその互変異性体、および/または薬学的に許容されるその塩である、請求項 2 2 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 4】

前記化合物が以下の式により表される化合物：

## 【化 8】



30

若しくはその互変異性体、および/または薬学的に許容されるその塩である、請求項 2 2 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 5】

グリコール酸オキシダーゼを阻害するためのインビトロ方法であって、グリコール酸オキシダーゼを請求項 1 ~ 1 8 のいずれか一項に記載の化合物、若しくはその互変異性体、および/または薬学的に許容されるその塩の有効量と接触させることを含む方法。

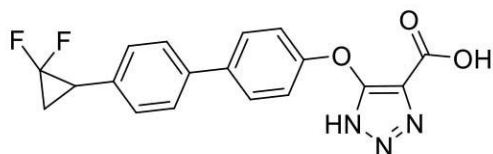
40

## 【請求項 2 6】

前記化合物が以下の式により表される化合物：

50

## 【化 9】

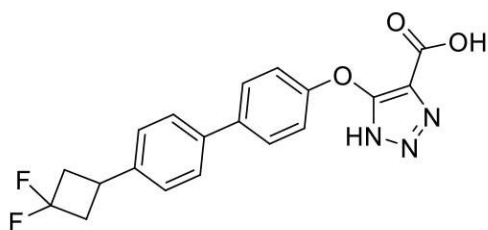


若しくはその互変異性体、および/または薬学的に許容されるその塩である、請求項 2 5 に記載のインビトロ方法。

## 【請求項 2 7】

前記化合物が以下の式により表される化合物：

## 【化 1 0】



若しくはその互変異性体、および/または薬学的に許容されるその塩である、請求項 2 5 に記載のインビトロ方法。

10

20

30

40

50