

【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 6 月 10 日(2022.6.10)

【国際公開番号】WO2019/236884

【公表番号】特表 2021-528488(P2021-528488A)

【公表日】令和 3 年 10 月 21 日(2021.10.21)

【出願番号】特願 2021-518046(P2021-518046)

【国際特許分類】

C 07 D 231/56(2006.01)

10

A 61 P 25/00(2006.01)

C 07 D 471/04(2006.01)

A 61 K 31/437(2006.01)

C 07 D 487/04(2006.01)

A 61 K 31/4985(2006.01)

A 61 K 31/416(2006.01)

C 07 D 491/048(2006.01)

A 61 K 31/4355(2006.01)

C 07 D 235/06(2006.01)

A 61 K 31/4184(2006.01)

20

C 07 D 495/04(2006.01)

A 61 K 31/4365(2006.01)

A 61 K 31/519(2006.01)

A 61 K 31/5025(2006.01)

C 12 N 9/99(2006.01)

C 12 N 15/55(2006.01)

【F I】

C 07 D 231/56 Z C S P

A 61 P 25/00 Z N A

C 07 D 471/04 1 0 6 Z

30

A 61 K 31/437

C 07 D 487/04 1 4 5

A 61 K 31/4985

C 07 D 471/04 1 0 1

C 07 D 471/04 1 0 4 Z

A 61 K 31/416

C 07 D 491/048

A 61 K 31/4355

C 07 D 471/04 1 0 7 Z

C 07 D 235/06

40

A 61 K 31/4184

C 07 D 495/04 1 0 5 A

A 61 K 31/4365

C 07 D 487/04 1 4 2

A 61 K 31/519

C 07 D 495/04 1 0 5 Z

A 61 K 31/5025

C 07 D 487/04 1 4 0

C 12 N 9/99

C 12 N 15/55

50

【手続補正書】

【提出日】令和4年6月2日(2022.6.2)

【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】

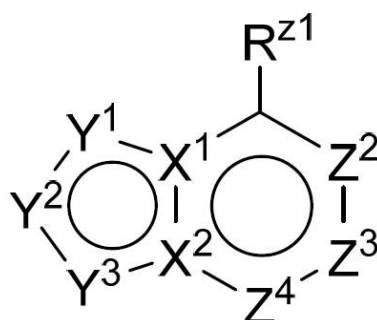
【特許請求の範囲】

【請求項1】

10

式 I :

【化1】



20

I

[式中、

X 1 および X 2 のうちの 1 つは、C および N から選択され、もう一方は、C であり；

Y 1 は、N、N - R[†]、および C - R^{Y 1} から選択され；

Y 2 は、N および C - R^{Y 2} から選択され；

Y 3 は、N、N - R[†]、O、S、および S (O)₂ から選択され；

30

Z 2 は、N および C - R^{Z 2} から選択され；

Z 3 は、N および C - R^{Z 3} から選択され；

Z 4 は、N および C - R^{Z 4} から選択され；

各 R[†] は、独立して、水素、ならびに - OR、- C (O) N (R)₂ または - C (O) O R で適宜置換されていてもよい C₁ - 6 脂肪族から選択され；

R^{Y 1}、R^{Y 2}、R^{Z 1}、R^{Z 2}、R^{Z 3}、および R^{Z 4} の各々は、独立して、水素、ハロゲン、- CN、- OR、- C (O) O R、ならびにハロゲン、- CN、- OR、- N (R)₂、- C (O) O R または - C (O) N (R)₂ で適宜置換されていてもよい C₁ - 6 脂肪族から選択され；ならびに

各 R は、独立して、水素および C₁ - 6 脂肪族から選択され；

40

あるいは R が 2 つの場合、それらが結合している原子と一緒にあって、3 ~ 6 員飽和または部分不飽和ヘテロ環を形成する]

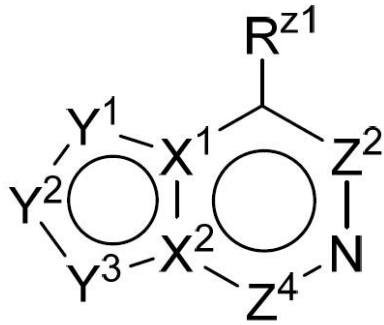
で示される化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項2】

式 I I :

50

【化 2】



I I

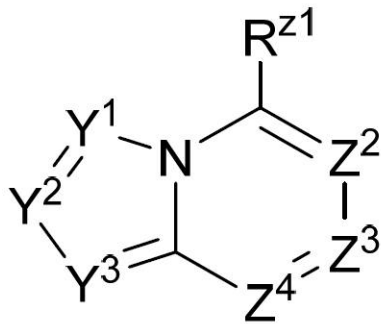
10

で示される構造を有する、請求項 1 に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 3】

式 I I I :

【化 3】



I I I

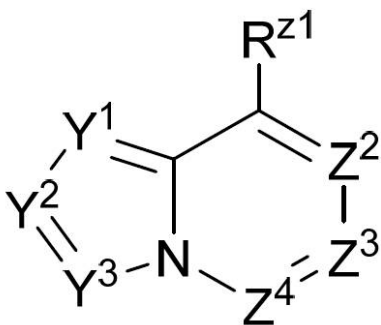
20

で示される構造を有する、請求項 1 に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 4】

式 I V :

【化 4】



I V

30

で示される構造を有する、請求項 1 に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 5】

50

10



30

請求項 1 ～ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩を含む医薬組成物であって、前記医薬組成物が、(i) 軸索変性によって特徴付けられる病気に罹っているか、または (i i) 軸索変性によって特徴付けられる病気を発症するリスクを有する対象に投与される、医薬組成物。

軸索変性の治療または予防に用いられる医薬組成物であって、請求項 1 ～ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩を含む、医薬組成物。

【 0 2 6 2 】

表 3

【表 17】

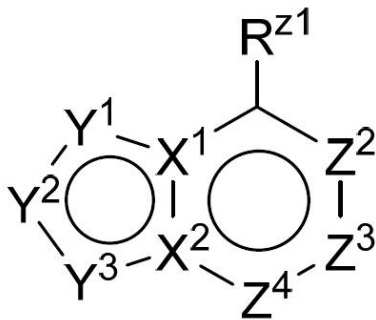
実施例	軸索変性 I C ₅₀
4	A
7	A
30	B

10

なお、本発明は以下の態様を含みうる。

[1] 式 I :

【化 19 - 1】



I

20

[式中、

X₁ および X₂ のうちの 1 つは、C および N から選択され、もう一方は、C であり；

Y₁ は、N、N - R⁺、および C - R_{Y1} から選択され；

Y₂ は、N および C - R_{Y2} から選択され；

Y₃ は、N、N - R⁺、O、S、および S(O)₂ から選択され；

Z₂ は、N および C - R_{Z2} から選択され；

Z₃ は、N および C - R_{Z3} から選択され；

Z₄ は、N および C - R_{Z4} から選択され；

各 R⁺ は、独立して、水素、ならびに - OR、- C(O)N(R)₂ または - C(O)OR で適宜置換されていてもよい C₁ - 6 脂肪族から選択され；

R_{Y1}、R_{Y2}、R_{Z1}、R_{Z2}、R_{Z3}、および R_{Z4} の各々は、独立して、水素、ハロゲン、- CN、- OR、- C(O)OR、ならびにハロゲン、- CN、- OR、- N(R)₂、- C(O)OR または - C(O)N(R)₂ で適宜置換されていてもよい C₁ - 6 脂肪族から選択され；ならびに

各 R は、独立して、水素および C₁ - 6 脂肪族から選択され；

あるいは R が 2 つの場合、それらが結合している原子と一緒にあって、3 ~ 6 員飽和または部分不飽和ヘテロ環を形成する]

で示される化合物またはその医薬的に許容される塩。

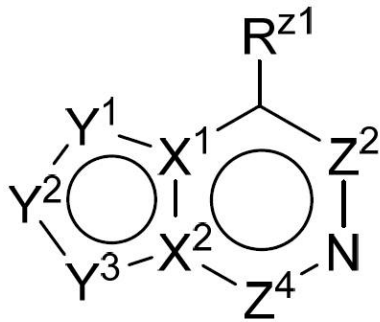
[2] 式 I I :

30

40

50

【化 19 - 2】



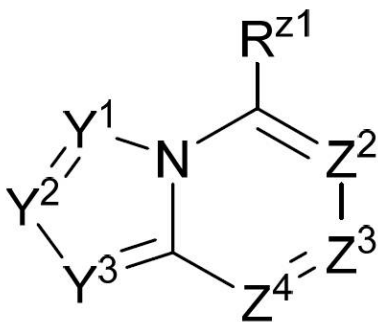
I I

10

で示される構造を有する、上記〔 1 〕に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

〔 3 〕式 I I I :

【化 19 - 3】



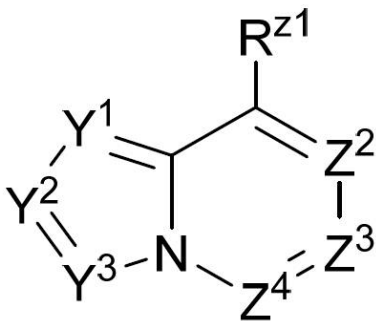
I I I

20

で示される構造を有する、上記〔 1 〕に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

〔 4 〕式 I V :

【化 19 - 4】



I V

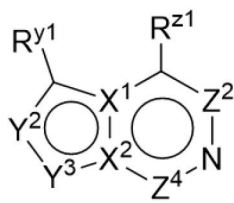
40

で示される構造を有する、上記〔 1 〕に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

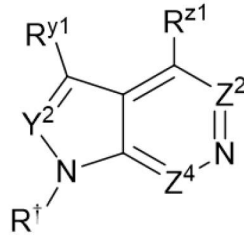
〔 5 〕

50

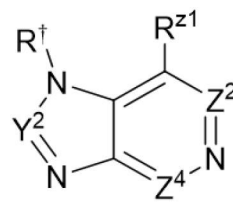
【化 1 9 - 5】



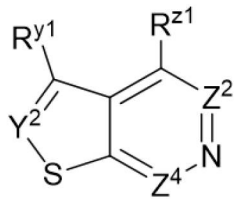
I I - a



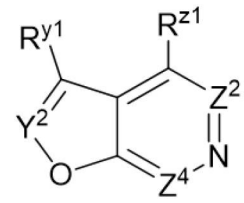
I I - b



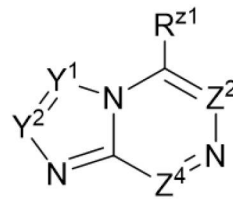
I I - c



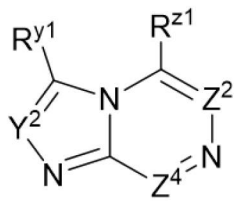
I I - d



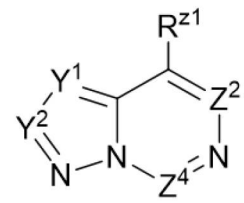
I I - e



I I I - a



I I I - b



I V - a



I V - b

10

20

から選択される、上記〔 1 〕に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

〔 6 〕上記〔 1 〕～〔 5 〕のいずれかに記載の化合物を、(i) 軸索変性によって特徴付けられる病気に罹っているか、または(i i) 軸索変性によって特徴付けられる病気を発症するリスクを有する対象に投与する工程を含む、方法。

〔 7 〕軸索変性を治療し、または予防するための方法であって、上記〔 1 〕～〔 5 〕のいずれかに記載の化合物を、それを必要とする対象に投与することを含む、前記方法。

30

40

50