

【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7年3月31日(2025.3.31)

【国際公開番号】WO2022/200785  
 【公表番号】特表2024-511453(P2024-511453A)  
 【公表日】令和6年3月13日(2024.3.13)  
 【年通号数】公開公報(特許)2024-047  
 【出願番号】特願2023-558500(P2023-558500)

【国際特許分類】

10

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

20

【F I】

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

30

40

【手続補正書】

【提出日】令和7年3月21日(2025.3.21)

【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】

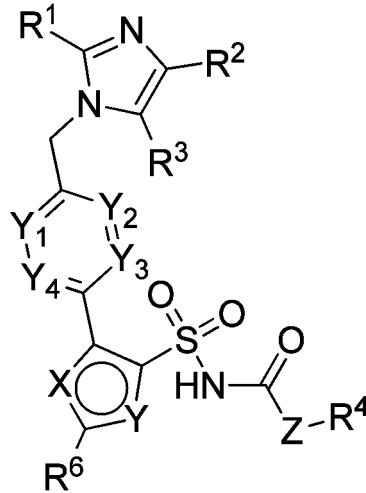
50

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

式 I の化合物であって、

## 【化 1】



I

10

式中、

R<sup>1</sup> が、1つ以上のフッ素原子によって、及び/若しくはOR<sup>7</sup>で任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>-4アルキルを表し、

20

R<sup>2</sup> 及びR<sup>3</sup> が、各々独立して、Hを表すか、若しくは1つ以上のハロゲン原子によって任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>-6アルキルを表し、

Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>、Y<sup>3</sup>、及びY<sup>4</sup> が、独立して、-CH-若しくは-CF-を表し、

Z が、-O-、-N(R<sup>5</sup>)-、若しくは直接結合を表し、

R<sup>4</sup> が、C<sub>1</sub>-6アルキル、C<sub>1</sub>-6アルコキシ、C<sub>1</sub>-6アルコキシ-C<sub>1</sub>-6アルキルを表し、これらの各々のアルキル部分が、-OH及びハロゲンから選択される1つ以上の置換基によって任意選択的に置換されるか、あるいは

R<sup>4</sup> が、アリール、C<sub>1</sub>-6アルキルアリール、C<sub>1</sub>-3アルケニルアリール、ヘテロアリール、C<sub>1</sub>-6アルキルヘテロアリール、若しくは

30

C<sub>1</sub>-3アルケニルヘテロアリールを表し、これらの各々が、ハロゲン、-CF<sub>3</sub>、-CF<sub>3</sub>O、C<sub>1</sub>-6アルキル、及びC<sub>1</sub>-6アルコキシから選択される1つ以上の置換基によって任意選択的に置換され、

R<sup>5</sup> が、Hを表すか、若しくは1つ以上のハロゲン原子によって任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>-6アルキルを表し、

X が、CH=CH、CH、N、NH、O、若しくはSを表し、

Y が、CH=CH、CH、N、NH、O、若しくはSを表し、

但し、

(a) X及びYが、同じではなく、

(b) XがCH=CHを表す場合、Yは、CHのみを表し得、

40

(c) YがCH=CHを表す場合、Xは、CHのみを表し得、

(d) YがO若しくはSを表す場合、Xは、CH若しくはCH=CHを表さないことを条件とし、

R<sup>6</sup> が、C<sub>1</sub>-6アルキル、C<sub>1</sub>-6アルコキシ、C<sub>1</sub>-6アルコキシ-C<sub>1</sub>-6アルキルを表し、これらの各々が、1つの以上のハロゲン原子によって任意選択的に置換され、R<sup>7</sup> が、Hを表すか、若しくは1つ以上のフッ素原子によって任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>-3アルキルを表す、化合物、

又はその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 2】

Z が、-O-又は-N(R<sup>5</sup>)-を表す、請求項 1 に記載の化合物。

50

## 【請求項 3】

R<sup>1</sup>が、最大3つのフッ素原子によって任意選択的に置換された、メチル、エチル、イソ-プロピル、若しくはtert-ブチルを表すか、又はR<sup>1</sup>が、OR<sup>7</sup>を表す、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 4】

R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>が、独立して、H又はメチルを表す、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 5】

R<sup>4</sup>が、1つ以上の-OH基及び/若しくはフッ素原子によって任意選択的に置換されたC<sub>1-4</sub>アルキル；フェニル；ベンジル；2-メチルピリジニル、2-メチルチオフェニル、又は2-メチルフラニルを表す、請求項1～4のいずれか一項に記載の化合物。

10

## 【請求項 6】

R<sup>5</sup>が、H、メチル、エチル、n-プロピル、n-ブチル、又はイソブチルを表す、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 7】

Xが、CHを表し、Yが、CH=CHを表すか、又はXが、Nを表し、Yが、Sを表す、請求項1～6のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 8】

R<sup>6</sup>が、n-プロピル、n-ブチル、又はイソブチルを表す、請求項1～7のいずれか一項に記載の化合物。

20

## 【請求項 9】

R<sup>7</sup>が、H又はメチルを表す、請求項1～8のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 10】

Xが、CHを表し、Yが、Sを表す、請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 11】

4-(4-(2-(tert-ブチル)-1H-イミダゾール-1-イル)メチル)フェニル)-2-イソブチル-N-((チオフェン-2-イルメチル)カルバモイル)チアゾール-5-スルホンアミド、

4'-(2-(tert-ブチル)-1H-イミダゾール-1-イル)メチル)-5-イソブチル-N-((ピリジン-2-イルメチル)カルバモイル)-[1,1'-ピフェニル]-2-スルホンアミド、

30

4'-(2-(tert-ブチル)-1H-イミダゾール-1-イル)メチル)-5-イソブチル-N-((チオフェン-2-イルメチル)カルバモイル)-[1,1'-ピフェニル]-2-スルホンアミド、又は

3-(3'-フルオロ-5-イソブチル-4'-{[2-(tert-ブチル)-1H-イミダゾール-1-イル]メチル}-2-ピフェニル)スルホニル)-1-[(2-ピリジル)メチル]尿素、

((4'-(2-(tert-ブチル)-1H-イミダゾール-1-イル)メチル)-3'-フルオロ-5-イソブチル-[1,1'-ピフェニル]-2-イル)スルホニル)カルバミン酸エチル、

40

((3'-フルオロ-5-イソブチル-4'-(2-イソプロピル-1H-イミダゾール-1-イル)メチル)-[1,1'-ピフェニル]-2-イル)スルホニル)カルバミン酸ブチル、

((3'-フルオロ-5-イソブチル-4'-(2-イソプロピル-1H-イミダゾール-1-イル)メチル)-[1,1'-ピフェニル]-2-イル)スルホニル)カルバミン酸エチル、

((3'-フルオロ-5-イソブチル-4'-(2-イソプロピル-1H-イミダゾール-1-イル)メチル)-[1,1'-ピフェニル]-2-イル)スルホニル)カルバミン酸メチル、

((3'-フルオロ-5-イソブチル-4'-(2-メチル-1H-イミダゾール-1-

50

- イル)メチル) - [ 1 , 1' - ビフェニル ] - 2 - イル)スルホニル)カルバミン酸ブチル、
- ( ( 4' - ( ( 2 - エチル - 1 H - イミダゾール - 1 - イル)メチル) - 3' - フルオロ - 5 - イソブチル - [ 1 , 1' - ビフェニル ] - 2 - イル)スルホニル)カルバミン酸ブチル、
- ( ( 3' - フルオロ - 5 - イソブチル - 4' - ( ( 2 - メチル - 1 H - イミダゾール - 1 - イル)メチル) - [ 1 , 1' - ビフェニル ] - 2 - イル)スルホニル)カルバミン酸エチル、
- ( ( 3' - フルオロ - 5 - イソブチル - 4' - ( ( 2 - メチル - 1 H - イミダゾール - 1 - イル)メチル) - [ 1 , 1' - ビフェニル ] - 2 - イル)スルホニル)カルバミン酸メチル、 10
- ( ( 4' - ( ( 2 - エチル - 1 H - イミダゾール - 1 - イル)メチル) - 3' - フルオロ - 5 - イソブチル - [ 1 , 1' - ビフェニル ] - 2 - イル)スルホニル)カルバミン酸エチル、
- ( ( 4' - ( ( 2 - エチル - 1 H - イミダゾール - 1 - イル)メチル) - 3' - フルオロ - 5 - イソブチル - [ 1 , 1' - ビフェニル ] - 2 - イル)スルホニル)カルバミン酸メチル、
- ( 4' - ( ( 2 - ( tert - ブチル) - 1 H - イミダゾール - 1 - イル)メチル) - 5 - イソブチル - [ 1 , 1' - ビフェニル ] - 2 - イル)スルホニルカルバミン酸 2 - ヒドロキシエチル、 20
- ( 4' - ( ( 2 - ( tert - ブチル) - 1 H - イミダゾール - 1 - イル)メチル) - 3' - フルオロ - 5 - イソブチル - [ 1 , 1' - ビフェニル ] - 2 - イル)スルホニルカルバミン酸 2 - ヒドロキシエチル、
- ( 5 - イソブチル - 4' - ( ( 2 - メチル - 1 H - イミダゾール - 1 - イル)メチル) - [ 1 , 1' - ビフェニル ] - 2 - イル)スルホニルカルバミン酸メチルである、請求項 1 に記載の化合物。
- 【請求項 1 2】
- 医薬品としての使用のための、請求項 1 ~ 1.1 のいずれか一項に記載の化合物。
- 【請求項 1 3】
- 薬学的に許容されるアジュバント、希釈剤、又は担体との混和物における、請求項 1 ~ 1.1 のいずれか一項に記載の化合物を含む、薬学的製剤。 30
- 【請求項 1 4】
- 自己免疫疾患、ウイルス性気道感染症及び/若しくはその結果としての肺炎、線維性疾患、慢性腎臓疾患、肺高血圧症、心不全、並びに/又は心筋梗塞の治療用の、請求項 1 ~ 1.1 のいずれか一項に記載の化合物を含む薬学的組成物。
- 【請求項 1 5】
- 自己免疫疾患、ウイルス性気道感染症及び/若しくはその結果としての肺炎、線維性疾患、慢性腎臓疾患、肺高血圧症、心不全、並びに/又は心筋梗塞の治療のための薬剤の製造のための、請求項 1 ~ 1.1 のいずれか一項に記載の化合物の使用。
- 【請求項 1 6】 40
- 前記疾患が、間質性肺疾患である、請求項 1.4 に記載の薬学的組成物、又は請求項 1.5 に記載の使用。
- 【請求項 1 7】
- 前記間質性肺疾患が、特発性肺線維症又はサルコイドーシスである、請求項 1.6 に記載の薬学的組成物、又は使用。
- 【請求項 1 8】
- 前記自己免疫疾患が、関節リウマチ又は全身性硬化症である、請求項 1.4 に記載の薬学的組成物、又は請求項 1.5 に記載の使用。
- 【請求項 1 9】
- 前記慢性腎臓疾患が、糖尿病性腎症である、請求項 1.4 に記載の薬学的組成物、又は請 50

請求項 1.5 に記載の使用。

【請求項 2.0】

前記肺高血圧症が、肺動脈性肺高血圧症である、請求項 1.4 に記載の薬学的組成物、又は請求項 1.5 に記載の使用。

【請求項 2.1】

前記心不全が、駆出率が維持された状態である、請求項 1.4 に記載の薬学的組成物、又は請求項 1.5 に記載の使用。

【請求項 2.2】

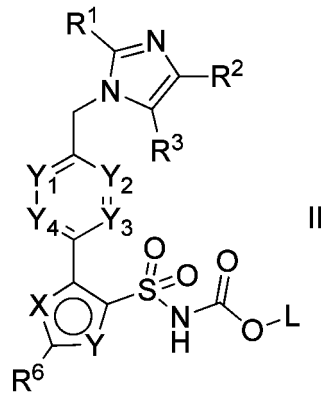
前記ウイルス性気道感染症が、ウイルス誘発性肺炎をもたらす、請求項 1.4 に記載の薬学的組成物、又は請求項 1.5 に記載の使用。

【請求項 2.3】

請求項 1 ~ 1.1 のいずれか一項に定義される式 I の化合物の調製のためのプロセスであって、前記プロセスが、

(i) 式 I I の化合物であって、

【化 2】



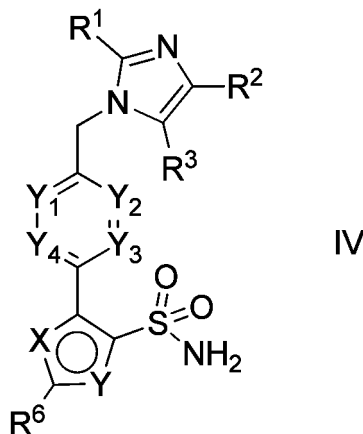
式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、 $Y^1$ 、 $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$ 、 $X$ 、及び $Y$ が、請求項 1 ~ 1.0 のいずれか一項に定義されるとおりであり、 $L$ が、 $C_{1-6}$ アルキル又はアリールを表す、式 I I の化合物と、式 I I I の化合物であって、



式中、 $R^4$  及び  $R^5$  が、請求項 1 ~ 1.0 のいずれか一項に定義されるとおりである、式 I I I の化合物との反応、又は

(ii)  $Z$  が、 $-N(R^5)-$  を表し、 $R^5$  が、 $H$  を表す式 I の化合物では、式 I V の化合物であって、

【化 3】



式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、 $Y^1$ 、 $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$ 、 $X$ 、及び $Z$ が、請求項 1 ~ 1.0

10

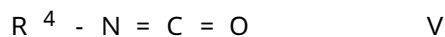
20

30

40

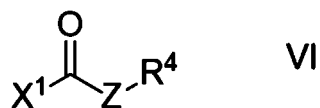
50

のいずれか一項に定義されるとおりである、式 I V の化合物と、式 V の化合物、



若しくは式 V I の化合物であって、

【化 4】



10

式中、 $X^1$  が、好適な脱離基であり、各場合において、 $R^4$  が、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に定義されるとおりである、式 V I の化合物との反応、

( i i i ) Z が、- O - を表す式 I の化合物では、定義されるとおりの式 I I の化合物と、式 V I I の化合物であって、



式中、 $R^4$  が、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に定義されるとおりである、式 V I I の化合物との反応、を含む、プロセス。

20

30

40

50