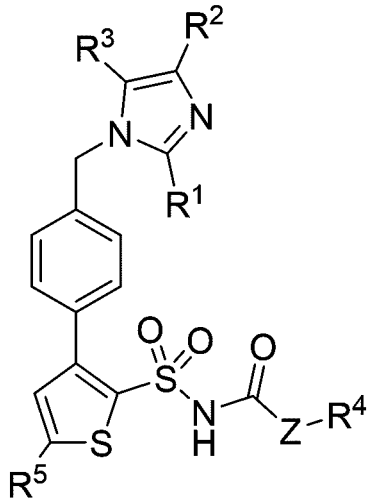
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和6年3月28日(2024.3.28)

【国際公開番号】WO2021/186180
【公表番号】特表2023-518474(P2023-518474A)
【公表日】令和5年5月1日(2023.5.1)
【年通号数】公開公報(特許)2023-081
【出願番号】特願2022-556583(P2022-556583)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ 31/4178(2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00(2006.01)
Ａ６１Ｋ 45/00(2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/00(2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/02(2006.01)
Ａ６１Ｐ 13/12(2006.01)
Ａ６１Ｐ 31/12(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/00(2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/02(2006.01)
Ａ６１Ｐ 29/00(2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/10(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/12(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/10(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4418(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ 31/4178
Ａ６１Ｐ 43/00 １１１
Ａ６１Ｋ 45/00
Ａ６１Ｐ 11/00
Ａ６１Ｐ 37/02
Ａ６１Ｐ 13/12
Ａ６１Ｐ 31/12
Ａ６１Ｐ 9/00
Ａ６１Ｐ 19/02
Ａ６１Ｐ 29/00 １０１
Ａ６１Ｐ 3/10
Ａ６１Ｐ 9/12
Ａ６１Ｐ 9/10
Ａ６１Ｋ 31/4418

【手続補正書】
【提出日】令和6年3月15日(2024.3.15)
【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】
ＡＴ２受容体の活性化が、望まれるか、または必要とされるが、ＣＹＰの阻害が望まれ

ない疾患または状態の治療における使用のための、式Ｉの化合物であって、
【化１】

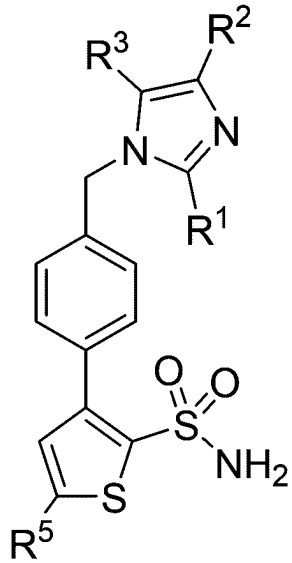


Ｉ

式中、
Ｚが、－Ｏ－もしくは直接結合を表し、
Ｒ^{1}が、１個以上のハロゲン原子によって置換されていてもよい、Ｃ$_{1-3}$アルキルを表し、
Ｒ^{2}およびＲ^{3}が、各々独立して、Ｈ、または１個以上のハロゲン原子によって置換されていてもよい、Ｃ$_{1-3}$アルキルを表し、
Ｒ^{4}が、各々が１個以上のハロゲン原子で置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルもしくはＣ$_{1-6}$アルコキシを表すか、または
Ｒ^{4}が、各々がハロゲン、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＯＣＦ$_{3}$、Ｃ$_{1-6}$アルキル、およびＣ$_{1-6}$アルコキシから選択される１つ以上の置換基によって置換されていてもよい、アリール、Ｃ$_{1-6}$アルキルアリール、ヘテロアリール、もしくはＣ$_{1-6}$アルキルヘテロアリールを表し、
Ｒ^{5}が、各々が１個以上のハロゲン原子によって任意に置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキル、Ｃ$_{1-6}$アルコキシ、またはＣ$_{1-6}$アルコキシ－Ｃ$_{1-6}$アルキルを表す、化合物、
またはその薬学的に許容される塩。
【請求項２】
Ｚが、－Ｏ－を表す、請求項１に記載の使用のための化合物。
【請求項３】
Ｒ^{1}が、メチルまたはエチルを表す、請求項１または２に記載の使用のための化合物。
【請求項４】
Ｒ^{2}およびＲ^{3}が、独立して、Ｈ、メチル、またはエチルを表す、請求項１～３のいずれか一項に記載の使用のための化合物。
【請求項５】
Ｒ^{4}が、最大３個のフッ素原子によって置換もしくは終端されていてもよい、Ｃ$_{1-4}$アルキル基、フェニル、Ｃ$_{1-3}$アルキルアリール、またはＣ$_{1-3}$アルキルヘテロアリールを表す、請求項１～４のいずれか一項に記載の使用のための化合物。
【請求項６】
Ｒ^{5}が、最大３個のフッ素原子によって置換または終端されていてもよい、Ｃ$_{1-4}$アルキル基を表す、請求項１～５のいずれか一項に記載の使用のための化合物。
【請求項７】
ブチル（５－イソブチル－３－（４－（（２－メチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）メチル）フェニル）チオフェン－２－イル）スルホニル－カルバメート、
ブチル（３－（４－（（２－エチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）メチル）フェニ

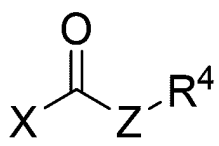
ル）－５－イソブチルチオフェン－２－イル）スルホニル－カルバメート、または
エチル（５－イソブチル－３－（４－（（２－メチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）メチル）フェニル）チオフェン－２－イル）スルホニル－カルバメートである、請求項１～６のいずれか一項に記載の使用のための化合物。
【請求項８】
Ｚが、－Ｏ－を表し、R^1が、メチルを表し、R^2およびR^3が、両方ともＨを表し、R^4が、ｎ－ブチルを表す場合、R^5が、イソブチルを表さない、請求項１～６のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。
【請求項９】
ブチル（３－（４－（（２－エチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）メチル）フェニル）－５－イソブチルチオフェン－２－イル）スルホニル－カルバメート、または
エチル（５－イソブチル－３－（４－（（２－メチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）メチル）フェニル）チオフェン－２－イル）スルホニル－カルバメートである、請求項８に記載の化合物。
【請求項１０】
医薬品としての使用のための、請求項８または９に記載の化合物。
【請求項１１】
請求項８または９に記載の化合物を、薬学的に許容されるアジュバント、希釈剤、または担体と混合して含む、薬学的製剤。
【請求項１２】
ＡＴ２受容体の活性化が、望まれるか、または必要とされるが、ＣＹＰの阻害が望まれない疾患または状態の治療における使用のための、請求項８または９に記載の化合物。
【請求項１３】
請求項１～９のいずれか一項に記載の化合物と、ＣＹＰ酵素によって代謝されることが知られている治療剤と、薬学的に許容されるアジュバント、希釈剤、または担体と、を含む、薬学的製剤。
【請求項１４】
（Ａ）薬学的に許容されるアジュバント、希釈剤、または担体と混合された、請求項１～９のいずれか一項に記載の化合物を含む薬学的製剤と、
（Ｂ）薬学的に許容されるアジュバント、希釈剤、または担体と混合された、ＣＹＰ酵素によって代謝されることが知られている治療剤を含む薬学的製剤と、を含む、キットオブパーツであって、
成分（Ａ）および（Ｂ）が、各々、他方と組み合わせた投与に好適である形態で提供される、キットオブパーツ。
【請求項１５】
前記治療剤が、群ピルフィニドン、ナプロキセン、プロプラノロール、リルゾール、チザニジン、ワルファリン、セレコキシブ、クロピドグレル、イルベサルタン、メロキシカム、ピロキシカム、トルセミド、シクロホスファミド、インドメタシン、アトルバスタチン、シロスタゾール、シクロスポリン、デフラザコート、ヒドロコルチゾン、リドカイン、セレキシパグ、シルデナフィル、シンバスタチン、およびそれらの薬剤のうちのいずれかの薬学的に許容される塩から選択される、請求項１３に記載の製剤、または請求項１４に記載のキットオブパーツ。
【請求項１６】
ＡＴ２受容体の活性化が、望まれるか、または必要とされるが、ＣＹＰの阻害が望まれない疾患または状態の前記治療における使用のための、請求項１１、１３、もしくは１５のいずれか一項に記載の製剤、または請求項１４もしくは１５に記載のキットオブパーツ。
【請求項１７】
治療される前記疾患または状態が、群：間質性肺疾患、自己免疫疾患、慢性腎臓病、肺高血圧症、閉塞性気道疾患、ウイルス性気道感染症およびその結果としての肺炎、ならび

に梗塞から選択される、請求項１～７もしくは１２のいずれか一項に記載の使用のための化合物、請求項１６に記載の使用のための製剤、または使用のためのキットオブパーツ。
【請求項１８】
前記疾患または状態が、群：関節リウマチ、糖尿病性腎症、肺動脈性肺高血圧症、慢性閉塞性気道疾患、ウイルス誘導性肺炎、および心筋梗塞から選択される、請求項１７に記載の、使用のための化合物、使用のための製剤、または使用のためのキットオブパーツ。
【請求項１９】
前記疾患が、間質性肺疾患である、請求項１７に記載の、使用のための化合物、使用のための製剤、または使用のためのキットオブパーツ。
【請求項２０】
前記間質性肺疾患が、特発性肺線維症である、請求項１９に記載の、使用のための化合物、使用のための製剤、または使用のためのキットオブパーツ。
【請求項２１】
前記間質性肺疾患が、サルコイドーシスである、請求項１９に記載の、使用のための化合物、使用のための製剤、または使用のためのキットオブパーツ。
【請求項２２】
ＣＹＰ酵素によって代謝されることが知られている治療剤が、ピルフェニドン、またはその薬学的に許容される塩である、請求項１９～２１のいずれか一項に記載の、使用のための化合物、使用のための製剤、または使用のためのキットオブパーツ。
【請求項２３】
請求項８または９に記載の式Ｉの化合物の調製のためのプロセスであって、
（ｉ）式ＩＩの化合物
【化２】



II

（式中、R^1、R^2、R^3、およびR^5は、請求項８に定義される通りである）の、式ＩＩＩの化合物
【化３】



III

（式中、R^4およびR^5は、請求項８に定義される通りであり、Ｘは、好適な脱離基を表す）との反応を含む、プロセス。