

【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11月13日(2024.11.13)

【公開番号】特開2024-109765(P2024-109765A)  
【公開日】令和6年8月14日(2024.8.14)  
【年通号数】公開公報(特許)2024-151  
【出願番号】特願2024-83009(P2024-83009)  
【国際特許分類】

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

10

A 6 1 P 1 3 / 0 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 3 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

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

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

A 6 1 K 3 1 / 4 9 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 9 9 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 4 8 7 / 0 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

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

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

A 6 1 P 5 / 2 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

20

【 F I 】

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

A 6 1 P 1 3 / 0 8

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 K 3 1 / 4 9 6

C 0 7 D 4 0 1 / 1 2

A 6 1 K 3 1 / 4 9 8

A 6 1 K 3 1 / 4 9 9 5

C 0 7 D 4 8 7 / 0 8

A 6 1 K 3 1 / 5 5

C 0 7 D 4 9 1 / 1 0 7

A 6 1 P 5 / 2 8

30

【手続補正書】

【提出日】令和6年11月5日(2024.11.5)

【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】

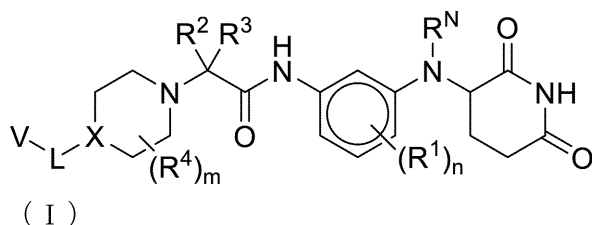
40

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物：

## 【化 1】



またはその医薬的に許容される塩、互変異性体、アイソトポログ、もしくは立体異性体  
(式中、

10

$R^N$  が H であり、

各  $R^1$  が独立的に、ハロゲン、CN、及び  $C_1 \sim 3$  アルキルから選択され、

$R^2$  及び  $R^3$  が、各々独立的に、H 及び  $C_1 \sim 3$  アルキルから選択されるか、または  $R^2$  及び  $R^3$  ならびにこれらが結合している炭素が、置換もしくは非置換の  $C_3 \sim 6$  シクロアルキルを形成し、

各  $R^4$  が独立的に、置換もしくは非置換  $C_1 \sim 3$  アルキルであるか、または 2 つの  $R^4$  基が、これらが結合している同じ炭素原子もしくは隣接する炭素原子と共に、置換もしくは非置換の  $C_3 \sim 6$  シクロアルキルを形成するか、または 2 つの  $R^4$  基が、これらが結合している隣接していない炭素原子と共に、置換もしくは非置換 4 ～ 7 員ヘテロシクリルを形成し、

20

X が N であり、

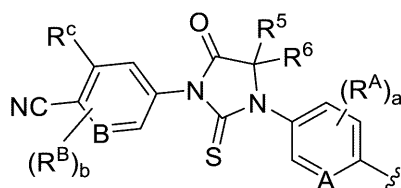
L が、 $-O(C_1 \sim 6 \text{ アルキル})-$  または  $-(C_1 \sim 9 \text{ アルキル})-$  であり、

n が 0 ～ 4 であり、

m が 0 ～ 8 であり、

V が

## 【化 2】



30

であり、

式中、

A が、N、CH、または  $CR^A$  であり、

B が、N、CH、または  $CR^B$  であり、

各  $R^A$  が独立的に、ハロゲン、置換または非置換の  $C_1 \sim 6$  アルキル、及び置換または非置換の  $C_3 \sim 6$  シクロアルキルから選択され、

40

各  $R^B$  が独立的に、ハロゲン及び置換または非置換の  $C_1 \sim 6$  アルキルから選択され、

$R^C$  が、ハロゲンまたは  $CF_3$  であり、

$R^5$  及び  $R^6$  が  $C_1 \sim 3$  アルキルであるか、または  $R^5$  及び  $R^6$  が、これらが結合している炭素原子と共に、置換もしくは非置換の  $C_3 \sim 6$  シクロアルキルもしくは 3 ～ 6 員ヘテロシクリルを形成し、

a が 0 ～ 3 であり、かつ

b が 0 ～ 2 である。)。

## 【請求項 2】

L が、 $-O(CH_2)_p-$  または  $-(CH_2)_p-$  であり、p が 1 ～ 3 である、請求項 1 に記載の化合物。

50

## 【請求項 3】

各  $R^1$  が独立的に、Cl、F、Br、CN、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、及びイソプロピルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

各  $R^1$  が独立的に、Cl、F、CN、及び $-CH_3$ から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

n が 0 である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 6】

n が 1 または 2 である、請求項 1 に記載の化合物。

10

## 【請求項 7】

$R^2$  及び  $R^3$  が、各々独立的に、H、置換もしくは非置換のメチル及びエチルから選択されるか、または  $R^2$  及び  $R^3$  ならびにこれらが結合している炭素が、置換もしくは非置換のシクロプロピル、シクロブチル、もしくはシクロペンチルを形成する、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 8】

$R^2$  及び  $R^3$  が、各々独立的に、H 及びメチルから選択されるか、または  $R^2$  及び  $R^3$  ならびにこれらが結合している炭素が非置換のシクロプロピルを形成する、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 9】

$R^2$  及び  $R^3$  が、いずれも H もしくはメチルであるか、または  $R^2$  及び  $R^3$  ならびにこれらが結合している炭素が非置換のシクロプロピルを形成する、請求項 1 に記載の化合物。

20

## 【請求項 10】

各  $R^4$  が独立的に、置換もしくは非置換のメチル及びエチルから選択されるか、または 2 つの  $R^4$  基が、これらが結合している同じ炭素原子と共に、置換もしくは非置換のシクロプロピルもしくはシクロブチルを形成する、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 11】

各  $R^4$  が独立的に、置換もしくは非置換のメチルから選択されるか、または 2 つの  $R^4$  基が、これらが結合している同じ炭素原子と共に、非置換のシクロプロピルを形成する、請求項 1 に記載の化合物。

30

## 【請求項 12】

各  $R^4$  が独立的に、メチル、 $CF_3$ 、及び  $CH_2OH$  から選択されるか、または 2 つの  $R^4$  基が、これらが結合している同じ炭素原子と共に、非置換のシクロプロピルを形成する、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 13】

m が、0、1、2、3 または 4 である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 14】

m が、0、1、または 2 である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 15】

2 つの  $R^4$  基が、これらが結合している隣接していない炭素原子と共に、非置換の 4 ～ 7 員ヘテロシクリルを形成する、請求項 1 に記載の化合物。

40

## 【請求項 16】

L が、 $O(CH_2)(CH_2)-$ 、 $-O(CH_2)(CH(CH_3))-$ 、 $-O(CH_2)(C(CH_3)_2)-$ 、 $-O(CH(CH_3))(CH_2)-$ 、 $-O(C(CH_3)_2)(CH_2)-$ 、 $-O(CH(CH_3))(CH(CH_3))-$ 、 $-O(CH(CH_3))(C(CH_3)_2)-$ 、 $-O(C(CH_3)_2)(CH(CH_3))-$ 、 $-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)(CH_2)(CH_2)-$ 、 $-(C(CH_3)_2)(C(CH_3)_2)-$ 、 $-(CH(CH_3))-$ 、 $-(C(CH_3)_2)-$ 、 $-(CH(CH_3))(CH(CH_3))-$ 、 $-(CH(CH_3))(C(CH_3)_2)-$ 、

50

$-(C(CH_3)_2)(CH(CH_3))-$ 、 $-(C(CH_3)_2)(C(CH_3)_2)-$ 、 $-(CH_3)(CH_3)(CH(CH_3))-$ 、 $-(CH_2)(CH(CH_3))(CH_2)-$ 、 $-(CH(CH_3))(CH_2)(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)(CH_2)(C(CH_2)_2)-$ 、 $-(CH_2)(C(CH_2)_2)(CH_2)-$ 、 $-(C(CH_2)_2)(CH_2)(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)(CH(CH_3))(CH(CH_3))-$ 、 $-(CH(CH_3))(CH(CH_3))(CH(CH_3))-$ 、 $-(CH(CH_3))(CH(CH_3))(CH_2)-$ 、 $-(CH(CH_3))(CH_2)(CH(CH_3))-$ 、 $-(CH_2)(CH(CH_3))(C(CH_3)_2)-$ 、 $-(CH(CH_3))(CH_2)(C(CH_2)_2)-$ 、 $-(C(CH_3)_2)(CH_2)(C(CH_3)_2)-$ 、 $-(CH_2)(C(CH_3)_2)(C(CH_3)_2)-$ 、 $-(CH_2)(C(CH_3)_2)(CH(CH_3))-$ 、 $-(CH(CH_3)(C(CH_3)_2)(CH_2)-$ 、 $-(C(CH_3)_2)(CH_2)(CH(CH_3))-$ 、 $-(C(CH_3)_2)(CH(CH_3))(CH_2)-$ 、 $-(C(CH_3)_2)(C(CH_3)_2)(CH_2)-$ 、 $-(CH(CH_3))(CH(CH_3))(C(CH_3)_2)-$ 、 $-(C(CH_3)_2)(CH(CH_3))(C(CH_3)_2)-$ 、 $-(C(CH_3)_2)(CH(CH_3))(C(CH_3)_2)-$ 、 $-(CH(CH_3))(C(CH_3)_2)(CH(CH_3))-$ 、 $-(C(CH_3)_2)(C(CH_3)_2)(CH(CH_3))-$ 、 $-(C(CH_3)_2)(CH(CH_3))(CH(CH_3))-$ 、及び $-(C(CH_3)_2)(C(CH_3)_2)(C(CH_3)_2)-$ である、請求項 1 に記載の化合物。

10

20

【請求項 17】

$L$  が、 $-O(CH_2)(CH_2)-$ 、 $-O(CH_2)(CH(CH_3))-$ 、 $-O(CH_2)(C(CH_3)_2)-$ 、 $-O(CH(CH_3))(CH_2)-$ 、 $-O(C(CH_3)_2)(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)(CH_2)-$ 、または $-(CH_2)(CH_2)(CH_2)-$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 18】

$L$  が、 $-O(CH_2)(CH_2)-$ 、 $-O(CH_2)(CH(CH_3))-$ 、 $-O(CH(CH_3))(CH_2)-$ 、または $-(CH_2)(CH_2)(CH_2)-$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 19】

$A$  が  $CH$  である、請求項 1 に記載の化合物。

30

【請求項 20】

$B$  が  $CH$  である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 21】

$B$  が  $N$  である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 22】

$a$  が、0、1、または 2 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 23】

各  $R^A$  が独立的に、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $F$ 、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、イソプロピル、 $n$ -ブチル、イソブチル、 $sec$ -ブチル、 $tert$ -ブチル、 $n$ -ペンチル、 $CH_2CH_2CH(CH_3)_2$ 、 $CH(CH_3)CH(CH_3)_2$ 、 $CF_3$ 、 $CF_2CH_3$ 、 $CH_2CH_2F$ 、 $CH_2CHF_2$ 、 $CH_2CF_3$ 、 $CH_2OH$ 、 $CH(CH_3)OH$ 、 $CH_2CH_2OH$ 、 $CH(CH_3)CH_2OH$ 、 $CH_2CH(CH_3)OH$ 、シクロプロピル、シクロブチル、及びシクロペンチルから選択される、請求項 19 に記載の化合物。

40

【請求項 24】

各  $R^A$  が独立的に、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $F$ 、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、イソプロピル、イソブチル、 $sec$ -ブチル、 $CF_3$ 、 $CF_2CH_3$ 、 $CH_2CH_2F$ 、 $CH_2CHF_2$ 、 $CH_2OH$ 、 $CH(CH_3)OH$ 、シクロプロピル、シクロブチル、及びシクロペンチルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 25】

各  $R^A$  が独立的に、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $F$ 、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、イソプロピル、

50

イソブチル、sec-ブチル、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{CF}_2\text{CH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHF}_2$ 、シクロプロピル、シクロブチル、及びシクロペンチルから選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項26】

各 $\text{R}^A$ が独立的に、Cl、F、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、sec-ブチル、 $\text{CF}_2\text{CH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHF}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{OH}$ 、シクロプロピル、及びシクロブチルから選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項27】

bが0または1である、請求項1に記載の化合物。

【請求項28】

$\text{R}^B$ がメチルである、請求項1に記載の化合物。

10

【請求項29】

$\text{R}^C$ が $\text{CF}_3$ またはClである、請求項1に記載の化合物。

【請求項30】

$\text{R}^5$ 及び $\text{R}^6$ がメチルであるか、または $\text{R}^5$ 及び $\text{R}^6$ が、これらが結合している炭素原子と共に、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、テトラヒドロフラニル、もしくはテトラヒドロピラニルを形成する、請求項1に記載の化合物。

【請求項31】

$\text{R}^5$ 及び $\text{R}^6$ がメチルであるか、または $\text{R}^5$ 及び $\text{R}^6$ が、これらが結合している炭素原子と共に、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、もしくはテトラヒドロフラニルを形成する、請求項1に記載の化合物。

20

【請求項32】

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、互変異性体、アイソトポログ、もしくは立体異性体を含む、医薬組成物。

【請求項33】

アンドロゲン受容体媒介疾患の治療のための、請求項32に記載の医薬組成物であって、該アンドロゲン媒介疾患が前立腺癌である、前記医薬組成物。

30

40

50