

【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 1 月 7 日(2025.1.7)

【公開番号】特開 2024-112835(P2024-112835A)  
【公開日】令和 6 年 8 月 21 日(2024.8.21)  
【年通号数】公開公報(特許)2024-156  
【出願番号】特願 2024-76047(P2024-76047)  
【国際特許分類】

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

10

【 F I 】

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

20

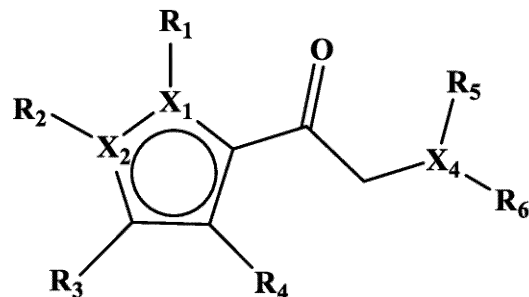
【手続補正書】  
【提出日】令和 6 年 12 月 17 日(2024.12.17)  
【手続補正 1】  
【補正対象書類名】特許請求の範囲  
【補正対象項目名】全文  
【補正方法】変更  
【補正の内容】

30

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 ( V I I I ) の構造を有する化合物：



40

( V I I I )

又はその薬学的に許容される塩であって、式中：

X<sub>1</sub> 及び X<sub>2</sub> は、独立して炭素又は窒素であり、ここで、X<sub>1</sub> 及び X<sub>2</sub> のうち 1 つは窒素であり；

X<sub>4</sub> は、N 又は C ( R<sub>7</sub> ) であり；

R<sub>1</sub> は、置換された C<sub>3</sub> ~ 8 シクロアルキル及び少なくとも 1 つのハロゲンで置換されたフェニルからなる群から選択され；

50

$R_2$  は、水素又は  $C_1 \sim 4$  アルキルであり；

各  $R_3$  及び  $R_4$  は、水素、 $C_1 \sim 4$  アルキル、及び  $C_3 \sim 8$  シクロアルキルからなる群から独立して選択され；

各  $R_5$  及び  $R_6$  は、水素、任意に置換された  $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、任意に置換された  $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、任意に置換された  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、任意に置換された  $C_1 \sim C_{10}$  アルコキシ、任意に置換された  $C_3 \sim C_{12}$  シクロアルキル、任意に置換された  $C_3 \sim C_{12}$  シクロアルケニル、任意に置換されたヘテロ環、任意に置換されたアリール、及び任意に置換されたヘテロアリールからなる群から独立して選択され；

又は、 $R_5$  及び  $R_6$  は、 $X_4$  と結合して、任意に置換された 5 ～ 6 員ヘテロ環、又は任意に置換された 5 ～ 6 員ヘテロアリールを形成し；並びに、

10

$R_7$  は、水素又は  $C_1 \sim 4$  アルキルであり；

ここで、任意に置換された  $R_1$ 、 $R_5$ 、及び  $R_6$  の置換基は、 $OR_c$  又は  $NR_dR_d$  で任意に置換された  $C_1 \sim 4$  アルキル； $CN$ ；ハロ； $C_1 \sim 4$  ハロアルキル； $C_2 \sim 4$  アルキニル； $C_4 \sim 6$  シクロアルキル； $C_1 \sim 4$  アルキルで任意に置換された 5 員ヘテロ環； $OR_c$ ； $COR_c$ ； $COOR_c$ ； $NR_dR_d$ ； $CONR_dR_d$ ； $OCOR_dR_d$ ； $S(O)_nR_c$ ；及び、 $S(O)_nNR_dR_d$  からなる群からそれぞれ独立して選択され；

ここで、各  $R_c$  は、水素、フェニル又は  $CONR_dR_d$  で任意に置換された  $C_1 \sim 4$  アルキル； $C_1 \sim 4$  ハロアルキル；フェニル、及び  $-CH_3$  又はフェニルで任意に置換されたヘテロアリールからなる群から独立して選択され；並びに、

各  $R_d$  は、水素、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $COOC_1 \sim 4$  アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$  シクロアルキル、及び  $-OC_1 \sim 4$  アルキルで任意に置換されたヘテロアリールからなる群から独立して選択され；

20

又は、2つの  $R_d$  は、それらが結合している窒素原子と共に、3 ～ 6 員ヘテロ環を形成し；

各  $n$  は、独立して、0、1、又は2である、化合物、又はその薬学的に許容される塩。

#### 【請求項 2】

$X_1$  及び  $X_4$  がそれぞれ窒素であり、 $X_2$  が炭素である、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

#### 【請求項 3】

$R_1$  が、少なくとも1つのハロゲンで置換されたフェニルである、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

30

#### 【請求項 4】

前記フェニルが、少なくとも1つの  $C_1 \sim 4$  アルキル及び少なくとも1つのハロゲンで置換されている、請求項 3 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

#### 【請求項 5】

$R_2$ 、 $R_3$ 、及び  $R_4$  が、それぞれ水素である、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

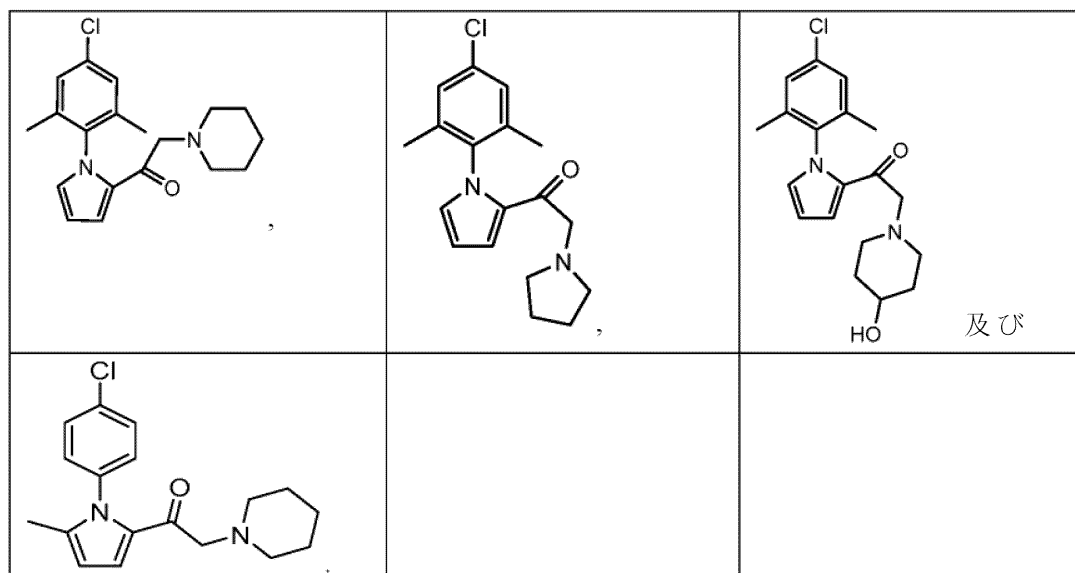
#### 【請求項 6】

$R_5$  及び  $R_6$  が、 $X_4$  と結合して、任意に置換された 5 ～ 6 員ヘテロ環又は任意に置換された 5 ～ 6 員ヘテロアリールを形成する、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

40

#### 【請求項 7】

前記化合物が、



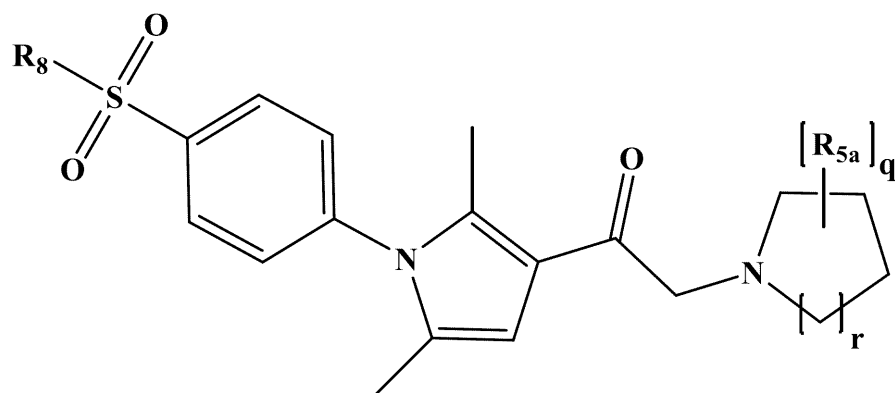
10

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 8】

式 (IX) の構造を有する化合物：

20



(IX)

30

又はその薬学的に許容される塩であって、式中：

$R_8$  は、 $NR_{8a}R_{8b}$  であり、ここで、 $R_{8a}$  は、 $-OC_{1-4}$  アルキルで任意に置換された、 $C_{5-6}$  アリール及び 5 ~ 6 員ヘテロアリールからなる群から選択され、 $R_{8b}$  は水素であり；

各  $R_{5a}$  は、水素、 $OR_c$  又は  $NR_dR_d$  で任意に置換された  $C_{1-4}$  アルキル、ハロ、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、 $OR_c$ 、 $COOR_c$ 、 $NR_dR_d$ 、 $CONR_dR_d$ 、 $OCOR_dR_d$ 、及び  $S(O)_nR_c$  からなる群から独立して選択され；

40

各  $R_c$  は、水素、フェニル又は  $CONR_dR_d$  で任意に置換された  $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、フェニル、及び  $-CH_3$  又はフェニルで任意に置換されたヘテロアリールからなる群から独立して選択され；

各  $R_d$  は、水素、 $C_{1-4}$  アルキル、 $COOC_{1-4}$  アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$  シクロアルキル、及び  $-OCH_3$  で任意に置換されたヘテロアリールからなる群から独立して選択され；

又は、2つの  $R_d$  は共にヘテロ環を形成し；

各  $n$  は、独立して、0、1、又は2であり；

$q$  は、0、1、又は2であり；並びに、

$r$  は、1又は2である、化合物、又はその薬学的に許容される塩。

50

## 【請求項 9】

R<sub>8a</sub> が、ピリミジニルである、請求項 8 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 10】

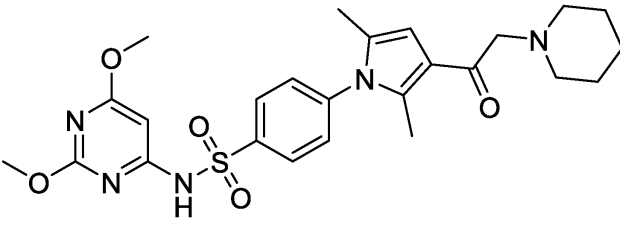
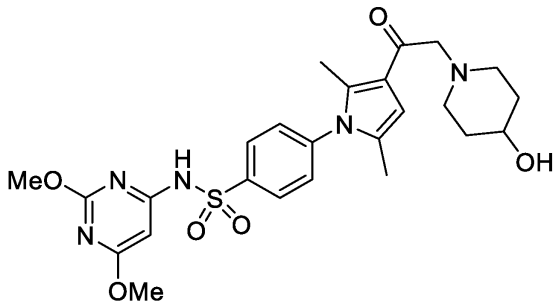
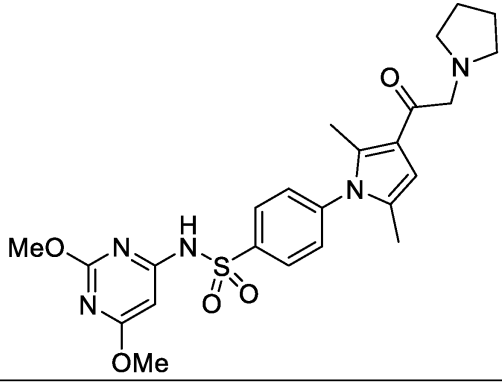
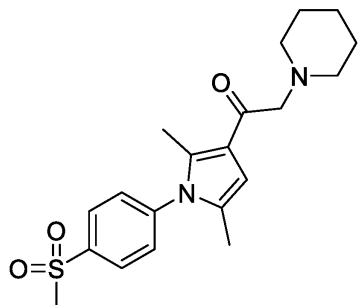
R<sub>8a</sub> が、メトキシで置換されている、請求項 9 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 11】

r が、2 である、請求項 8 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 12】

以下：

1	
2	
4	
12	

10

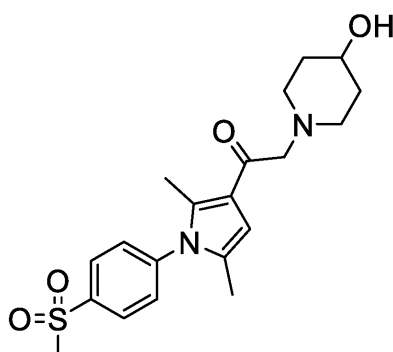
20

30

40

50

13

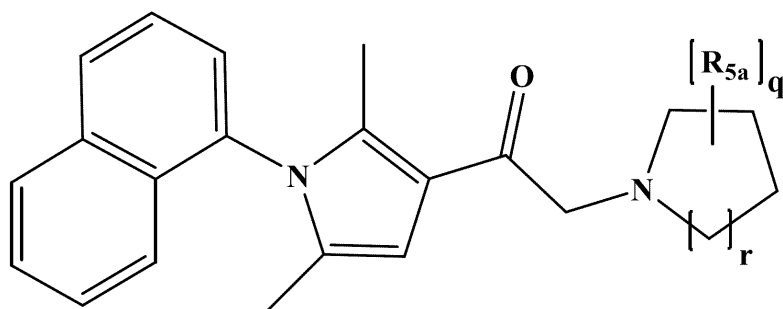


10

からなる群から選択される化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 13】

式 (X) の構造を有する化合物：



(X)

20

又はその薬学的に許容される塩であって、式中：

各  $R_{5a}$  は、水素、 $OR_c$  又は  $NR_dR_d$  で任意に置換された  $C_1 \sim 4$  アルキル、ハロ、 $C_1 \sim 4$  ハロアルキル、 $OR_c$ 、 $COOR_c$ 、 $NR_dR_d$ 、 $CONR_dR_d$ 、 $OCOR_dR_d$ 、及び  $S(O)_nR_c$  からなる群から独立して選択され；

30

各  $R_c$  は、水素、フェニル又は  $CONR_dR_d$  で任意に置換された  $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  ハロアルキル、フェニル、及び  $-CH_3$  又はフェニルで任意に置換されたヘテロアリールからなる群から独立して選択され；

各  $R_d$  は、水素、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $COOC_1 \sim 4$  アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$  シクロアルキル、及び  $-OCH_3$  で任意に置換されたヘテロアリールからなる群から独立して選択され；

又は、2つの  $R_d$  は共にヘテロ環を形成し；

各  $n$  は、独立して、0、1、又は2であり；

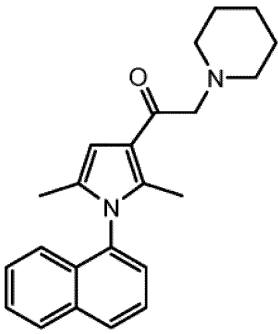
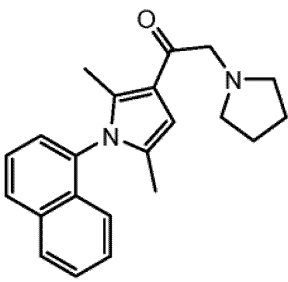
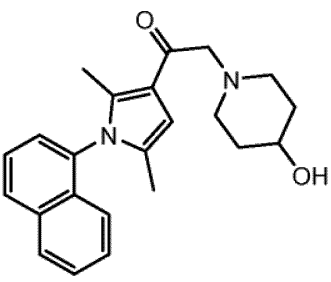
$q$  は、0、1、又は2であり；並びに、

40

$r$  は、1又は2である、化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 14】

以下：

5		10
8		20
9		30

からなる群から選択される、請求項 1 3 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 5】

請求項 1 ～ 1 4 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩、及び薬学的に許容される担体又は賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項 1 6】

有効量の請求項 1 ～ 1 4 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩を含む、タンパク質恒常性の機能不全に関連した状態を治療するための医薬。

40