

【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 07 D 207/333(2006.01)

10

A 61 P 43/00(2006.01)

C 07 D 401/06(2006.01)

A 61 K 31/454(2006.01)

A 61 K 31/505(2006.01)

C 07 D 403/12(2006.01)

【F I】

C 07 D 207/333 C S P

A 61 P 43/00 105

C 07 D 401/06

20

A 61 K 31/454

A 61 K 31/505

C 07 D 403/12

【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

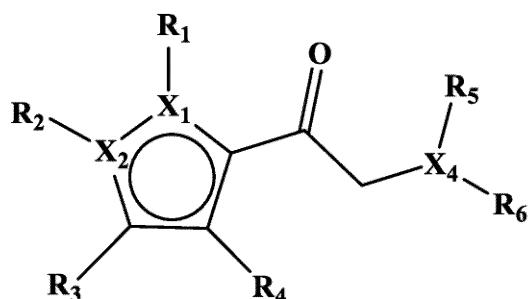
【補正の内容】

30

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(VIII)の構造を有する化合物：



40

(VIII)

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>~<sub>8</sub>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<sub>2</sub>は、水素又はC<sub>1</sub>～4アルキルであり；

各R<sub>3</sub>及びR<sub>4</sub>は、水素、C<sub>1</sub>～4アルキル、及びC<sub>3</sub>～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<sub>5</sub>及びR<sub>6</sub>は、水素、任意に置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、任意に置換されたC<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニル、任意に置換されたC<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニル、任意に置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシ、任意に置換されたC<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>シクロアルキル、任意に置換されたC<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>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<sub>5</sub>及びR<sub>6</sub>は、X<sub>4</sub>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、

R<sub>7</sub>は、水素又はC<sub>1</sub>～4アルキルであり；

ここで、任意に置換されたR<sub>1</sub>、R<sub>5</sub>、及びR<sub>6</sub>の置換基は、OR<sub>c</sub>又はNR<sub>d</sub>R<sub>d</sub>で任意に置換されたC<sub>1</sub>～4アルキル；CN；ハロ；C<sub>1</sub>～4ハロアルキル；C<sub>2</sub>～4アルケニル；C<sub>4</sub>～6シクロアルキル；C<sub>1</sub>～4アルキルで任意に置換された5員ヘテロ環；OR<sub>c</sub>；COR<sub>c</sub>；COOR<sub>c</sub>；NR<sub>d</sub>R<sub>d</sub>；CONR<sub>d</sub>R<sub>d</sub>；OCNR<sub>d</sub>R<sub>d</sub>；S(O)<sub>n</sub>R<sub>c</sub>；及び、S(O)<sub>n</sub>NR<sub>d</sub>R<sub>d</sub>からなる群からそれぞれ独立して選択され；

ここで、各R<sub>c</sub>は、水素、フェニル又はCONR<sub>d</sub>R<sub>d</sub>で任意に置換されたC<sub>1</sub>～4アルキル；C<sub>1</sub>～4ハロアルキル；フェニル、及び-CH<sub>3</sub>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<sub>d</sub>は、水素、C<sub>1</sub>～4アルキル、COOC<sub>1</sub>～4アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>シクロアルキル、及び-OCH<sub>1</sub>～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；

又は、2つのR<sub>d</sub>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<sub>1</sub>及びX<sub>4</sub>がそれぞれ窒素であり、X<sub>2</sub>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<sub>1</sub>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。

#### 【請求項4】

前記フェニルが、少なくとも1つのC<sub>1</sub>～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<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、及びR<sub>4</sub>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<sub>5</sub>及びR<sub>6</sub>が、X<sub>4</sub>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。

#### 【請求項7】

前記化合物が、

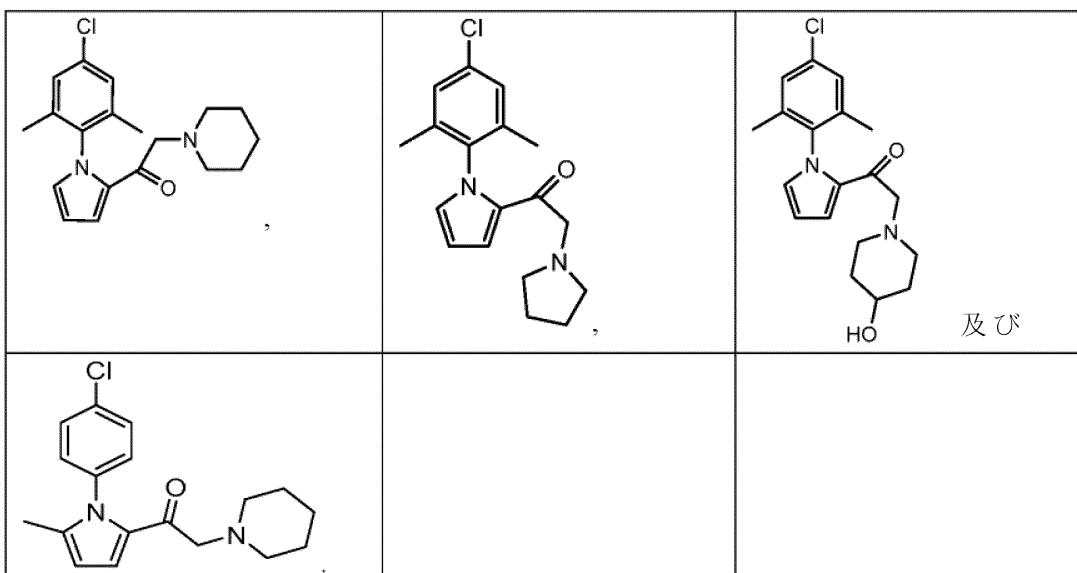
10

20

30

40

50



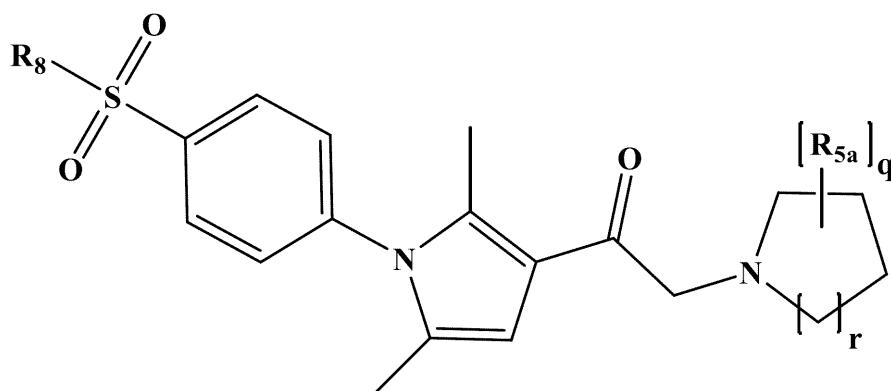
10

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



30

(IX)

又はその薬学的に許容される塩であつて、式中：

R<sub>8</sub> は、N R<sub>8a</sub> R<sub>8b</sub> であり、ここで、R<sub>8a</sub> は、-O C<sub>1~4</sub> アルキルで任意に置換された、C<sub>5~6</sub> 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<sub>8b</sub> は水素であり；

各 R<sub>5a</sub> は、水素、O R<sub>c</sub> 又はN R<sub>d</sub> R<sub>d</sub> で任意に置換されたC<sub>1~4</sub> アルキル、ハロ、C<sub>1~4</sub> ハロアルキル、O R<sub>c</sub>、C O O R<sub>c</sub>、N R<sub>d</sub> R<sub>d</sub>、C O N R<sub>d</sub> R<sub>d</sub>、O C O N R<sub>d</sub> R<sub>d</sub>、及びS (O)<sub>n</sub> R<sub>c</sub> からなる群から独立して選択され；

各 R<sub>c</sub> は、水素、フェニル又はC O N R<sub>d</sub> R<sub>d</sub> で任意に置換されたC<sub>1~4</sub> アルキル、C<sub>1~4</sub> ハロアルキル、フェニル、及び-C H<sub>3</sub> 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<sub>d</sub> は、水素、C<sub>1~4</sub> アルキル、C O O C<sub>1~4</sub> アルキル、C<sub>3~C12</sub> シクロアルキル、及び-O C H<sub>3</sub> 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<sub>d</sub> 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。

40

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】

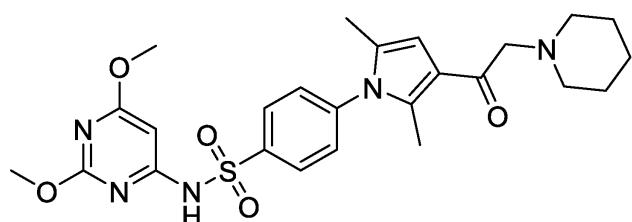
rが、2である、請求項8に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 12】

以下：

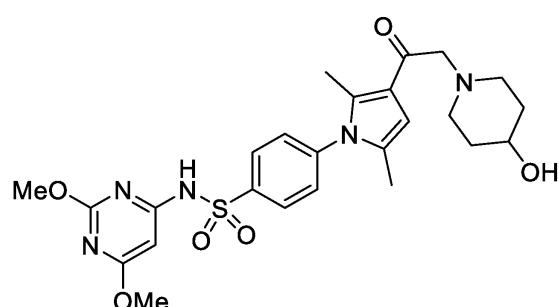
10

1



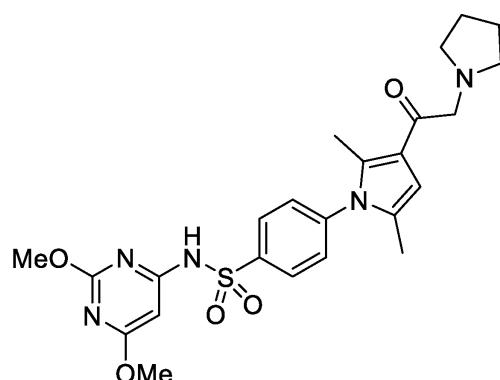
20

2



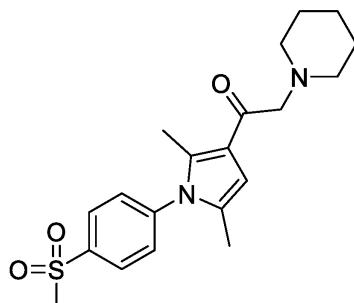
30

4



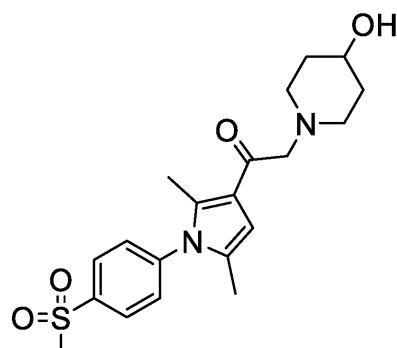
40

12



50

13

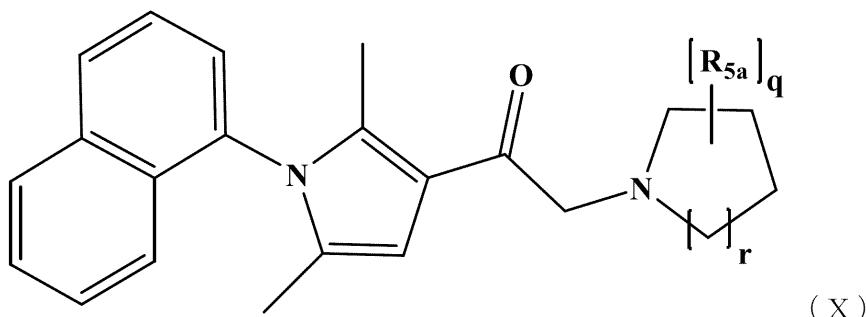


10

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：



20

又はその薬学的に許容される塩であつて、式中：

各  $R_{5a}$  は、水素、 $OR_c$  又は  $NR_dR_d$  で任意に置換された  $C_{1~4}$  アルキル、ハロ、  
 $C_{1~4}$  ハロアルキル、 $OR_c$ 、 $COOR_c$ 、 $NR_dR_d$ 、 $CNR_dR_d$ 、 $OCONR_d$   
 $R_d$ 、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  $CNR_dR_d$  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；

30

各  $R_d$  は、水素、 $C_{1~4}$  アルキル、 $COOC_{1~4}$  アルキル、 $C_{3~C_{12}}$  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。

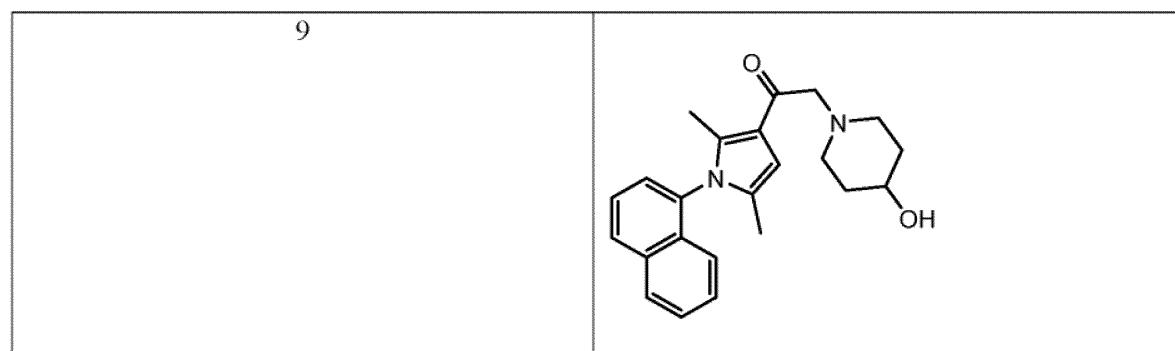
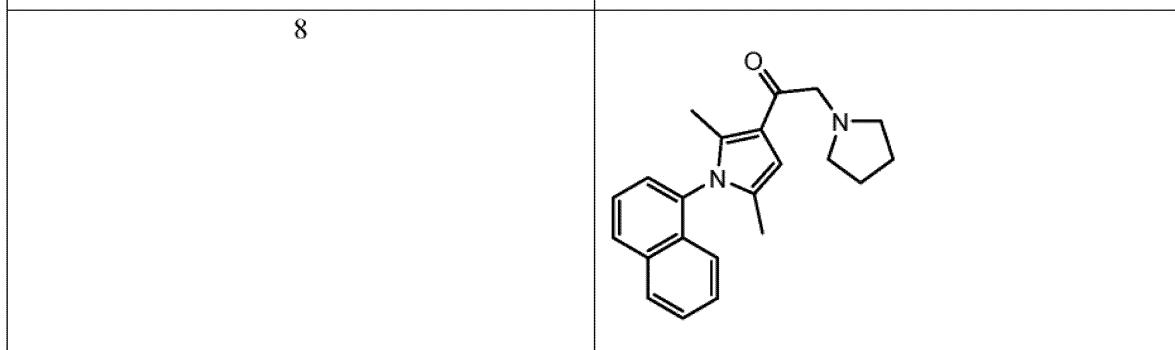
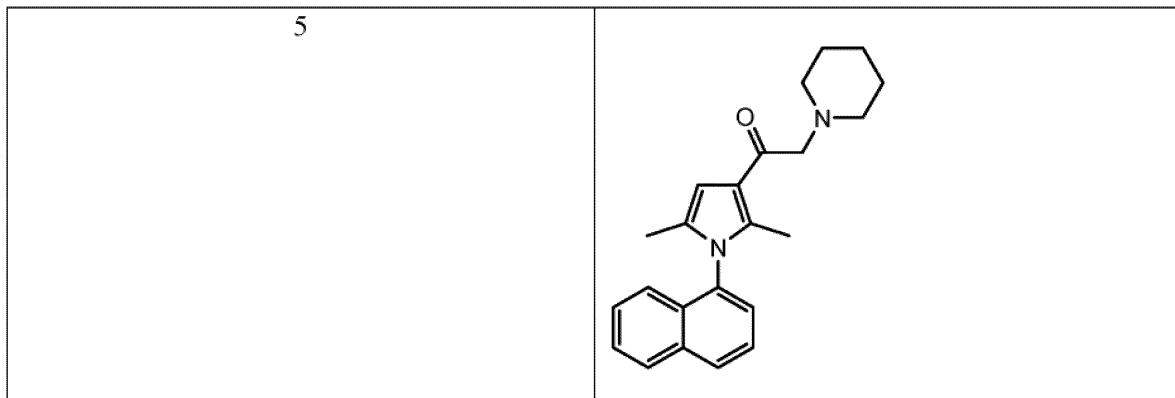
40

【請求項 14】

以下：

40

50



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

50