

【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 5 年 1 月 20 日(2023.1.20)

【公開番号】特開 2022-137237(P2022-137237A)

【公開日】令和 4 年 9 月 21 日(2022.9.21)

【年通号数】公開公報(特許)2022-174

【出願番号】特願 2022-113736(P2022-113736)

【国際特許分類】

C 07 D 498/18(2006.01)

10

A 61 K 31/436(2006.01)

A 61 P 25/28(2006.01)

A 61 P 43/00(2006.01)

A 61 P 17/00(2006.01)

A 61 P 25/08(2006.01)

A 61 P 25/00(2006.01)

A 61 P 37/06(2006.01)

A 61 P 3/00(2006.01)

A 61 P 35/00(2006.01)

A 61 P 31/00(2006.01)

20

A 61 P 9/00(2006.01)

A 61 P 21/00(2006.01)

A 61 P 29/00(2006.01)

A 61 P 27/02(2006.01)

A 61 P 1/04(2006.01)

A 61 K 31/4427(2006.01)

A 61 K 31/5377(2006.01)

C 07 D 519/00(2006.01)

A 61 K 31/496(2006.01)

A 61 K 31/7052(2006.01)

30

C 07 H 17/00(2006.01)

【F I】

C 07 D 498/18 C S P

A 61 K 31/436

A 61 P 25/28

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 17/00

A 61 P 25/08

A 61 P 25/00

A 61 P 37/06

40

A 61 P 3/00

A 61 P 35/00

A 61 P 31/00

A 61 P 9/00

A 61 P 21/00

A 61 P 29/00

A 61 P 27/02

A 61 P 1/04

A 61 K 31/4427

A 61 K 31/5377

50

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0
 A 6 1 K 3 1 / 4 9 6
 A 6 1 K 3 1 / 7 0 5 2
 C 0 7 H 1 7 / 0 0

【 手 続 補 正 書 】

【 提 出 日 】 令 和 5 年 1 月 1 1 日 (2 0 2 3 . 1 . 1 1)

【 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

10

【 補 正 方 法 】 変 更

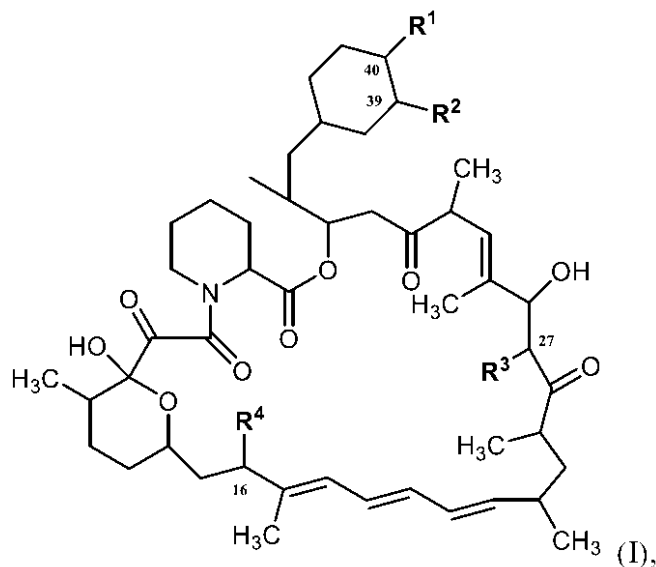
【 補 正 の 内 容 】

【 特 許 請 求 の 範 囲 】

【 請 求 項 1 】

式 (I) :

【 化 1 】



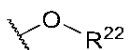
20

30

(式 中 :

R¹ は、

【 化 2 】



か ら 選 択 さ れ、

R² は、水素、および必要に応じて置換された C₁ ~ C₆ アルコキシ基から選択され、
 ここで、置換基は、独立して、出現するごとに、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、
 C₂ ~ C₆ アルコキシ基、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、およびヘテロ
 シクロアルキルから選択され、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキル、およ
 びヘテロアリールはそれぞれ、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、ハロ
 アルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、およびアルコキシアルキルから独立して選
 択される 1 つまたは複数の置換基で必要に応じて置換され、

40

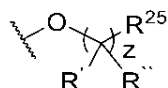
R³ は、水素、および必要に応じて置換された C₁ ~ C₆ アルコキシ基から選択され、
 ここで、置換基は、独立して、出現するごとに、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、
 C₂ ~ C₆ アルコキシ基、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、およびヘテロ
 シクロアルキルから選択され、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキル、およ

50

びヘテロアリールは、それぞれ、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、ハロアルキル、ヒドロシアルキル、アルコキシ、およびアルコシアルキルから独立して選択される1つまたは複数の置換基で必要に応じて置換され、

R^4 は、

【化3】



から選択され、

10

z は、2、3、4または5であり、

R' および R'' のそれぞれが、独立して、水素、ハロゲン、 $-OR^{31}$ 、ならびにハロゲンおよび $-OR^{31}$ から独立して選択される1つまたは複数の置換基で必要に応じて置換された $C_1 \sim 3$ アルキルから選択され、

R^{25} は、 $-OR^{31}$ から選択され、

R^{31} は、独立して、出現するごとに、水素、 $-Si(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})_3$ ；ならびにそのそれぞれが、ハロゲン、 $-OSi(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NH_2$ 、 $=O$ 、 $=S$ 、 $-C_1 \sim 10$ ハロアルキル、 $C_2 \sim 10$ アルケニル、 $C_2 \sim 10$ アルキニル、 $C_3 \sim 12$ 炭素環、および3から12員複素環から独立して選択される1つまたは複数の置換基で必要に応じて置換されている $C_1 \sim 10$ アルキル、 $C_2 \sim 10$ アルケニル、 $C_2 \sim 10$ アルキニル、 $C_3 \sim 12$ 炭素環、および3から12員複素環から選択され

20

R^{22} は、

ハロゲン、 $-OR^{30}$ 、 $-N(R^{30})_2$ 、 $-(O-CH_2-(CH_2)_p)_n-W$ 、 $-SR^{30}$ 、 $-C(O)R^{30}$ 、 $-C(O)N(R^{30})_2$ 、 $-N(R^{30})C(O)R^{30}$ 、 $-C(O)OR^{30}$ 、 $-OC(O)R^{30}$ 、 $-S(O)R^{30}$ 、 $-S(O)_2R^{30}$ 、 $-P(O)(OR^{30})_2$ 、 $-OP(O)(OR^{30})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=N(R^{30})$ 、および $-CN$ ；

そのそれぞれが、ハロゲン、 $-OR^{30}$ 、 $-SR^{30}$ 、 $-N(R^{30})_2$ 、 $-C(O)R^{30}$ 、 $-C(O)N(R^{30})_2$ 、 $-N(R^{30})C(O)R^{30}$ 、 $-C(O)OR^{30}$ 、 $-OC(O)R^{30}$ 、 $-S(O)R^{30}$ 、 $-S(O)_2R^{30}$ 、 $-P(O)(OR^{30})_2$ 、 $-OP(O)(OR^{30})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=N(R^{30})$ 、 $-CN$ 、 $C_3 \sim 10$ 炭素環、および3から10員複素環から独立して選択される1つまたは複数の置換基で必要に応じて置換された $C_2 \sim 10$ アルケニル、 $C_2 \sim 10$ アルキニル；

30

ハロゲン、 $-OR^{30}$ 、 $-SR^{30}$ 、 $-N(R^{30})_2$ 、 $-C(O)R^{30}$ 、 $-C(O)N(R^{30})_2$ 、 $-N(R^{30})C(O)R^{30}$ 、 $-C(O)OR^{30}$ 、 $-OC(O)R^{30}$ 、 $-S(O)R^{30}$ 、 $-S(O)_2R^{30}$ 、 $-P(O)(OR^{30})_2$ 、 $-OP(O)(OR^{30})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=N(R^{30})$ 、 $-CN$ 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルキル- R^{30} 、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、および $C_2 \sim 6$ アルキニルから独立して選択される1つまたは複数の置換基で必要に応じて置換された $C_3 \sim 10$ 炭素環

40

から選択される1つまたは複数の置換基で置換された $C_3 \sim C_6$ アルキルから選択され、

各 p は、1または2から選択され、

n は、1～4から選択され、

W は、 $-OH$ および $-CH_3$ から選択され、

R^{30} は、独立して、出現するごとに、水素、 $-Si(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})_3$ ；ならびにそのそれぞれが、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-OSi(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NH_2$ 、 $=O$ 、 $=S$ 、 $C_1 \sim 10$ アルキル、 $-C_1 \sim 10$ ハロアルキル、 $-O-C_1 \sim 10$ アルキル、 $C_2 \sim 10$ アルケニル、 $C_2 \sim 10$ アルキニル、 $C_3 \sim 12$ 炭素環、および3から12員複素環から独立して選択される1つまたは複数の置換基で必要に応じて置換された $C_1 \sim 10$ アルキル、 $C_2 \sim 10$ アルケニル、 $C_2 \sim 10$ アルキニル、 $C_3 \sim$

50

1 2 炭素環、および 3 から 1 2 員複素環から選択される)
の構造によって表される化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

$R^{2,2}$ が、ハロゲン、 $-OR^{3,0}$ 、 $-N(R^{3,0})_2$ 、 $-(O-CH_2-(CH_2)_p)_n$ 、 $-W$ 、 $-SR^{3,0}$ 、 $-C(O)R^{3,0}$ 、 $-C(O)N(R^{3,0})_2$ 、 $-N(R^{3,0})C(O)R^{3,0}$ 、 $-C(O)OR^{3,0}$ 、 $-OC(O)R^{3,0}$ 、 $-S(O)R^{3,0}$ 、 $-S(O)_2R^{3,0}$ 、 $-P(O)(OR^{3,0})_2$ 、 $-OP(O)(OR^{3,0})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=N(R^{3,0})$ 、および $-CN$ から選択される 1 つまたは複数の置換基で置換された $C_3 \sim C_6$ アルキルから選択される、請求項 1 に記載の化合物または塩。

10

【請求項 3】

$R^{2,2}$ が、ハロゲン、 $-OR^{3,0}$ 、 $-N(R^{3,0})_2$ 、 $-SR^{3,0}$ 、 $-S(O)R^{3,0}$ 、 $-S(O)_2R^{3,0}$ 、 $-NO_2$ 、 $=O$ 、および $-CN$ から選択される 1 つまたは複数の置換基で必要に応じて置換された $C_3 \sim C_6$ アルキルから選択される、請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 4】

各 $R^{3,0}$ が、水素および $C_1 \sim C_{10}$ アルキルから選択される、請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 5】

$R^{2,2}$ が、置換された C_3 アルキルから選択される、請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 6】

R' および R'' のそれぞれが、独立して、水素、および C_3 アルキルから選択される、請求項 1 に記載の化合物または塩。

20

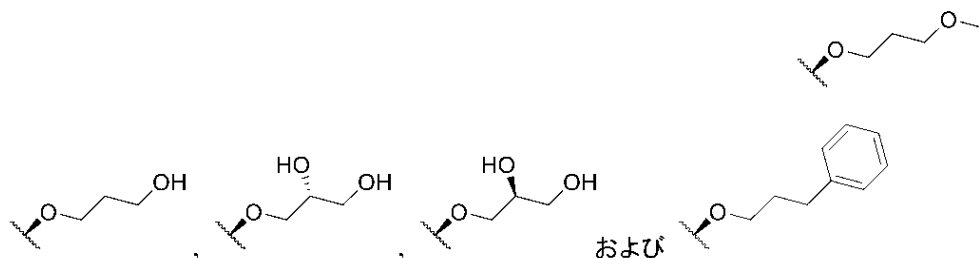
【請求項 7】

各 $R^{3,1}$ が、水素および $C_1 \sim C_{10}$ アルキルから選択される、請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 8】

R^1 が、

【化 4】



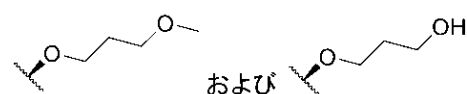
30

から選択される、請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 9】

R^1 が、

【化 5】



40

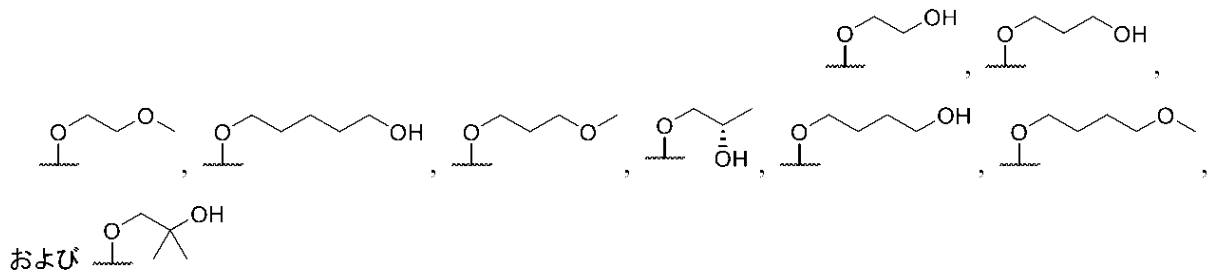
から選択される、請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 10】

R^4 が、

50

【化 6】



から選択される、請求項 1 に記載の化合物または塩。

10

【請求項 1 1】

前記化合物が、

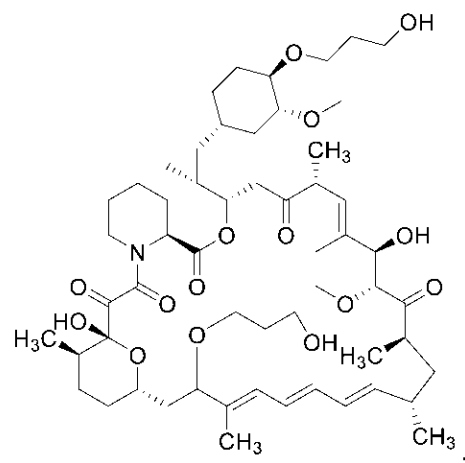
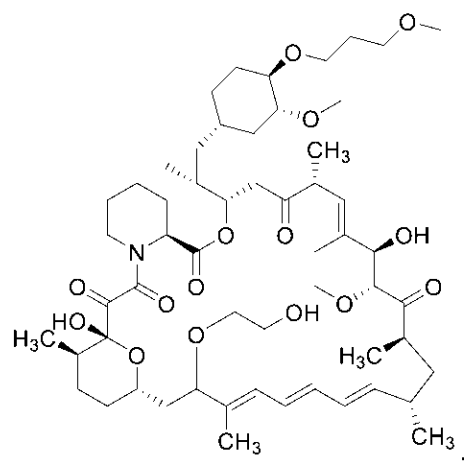
20

30

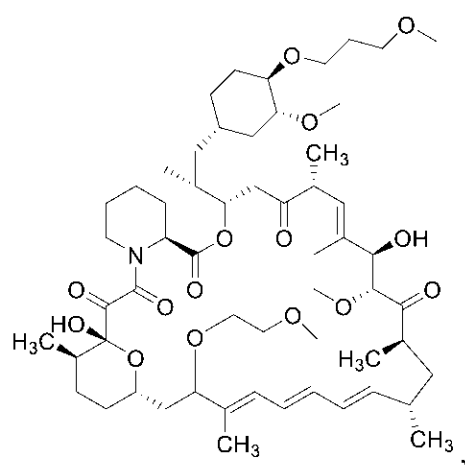
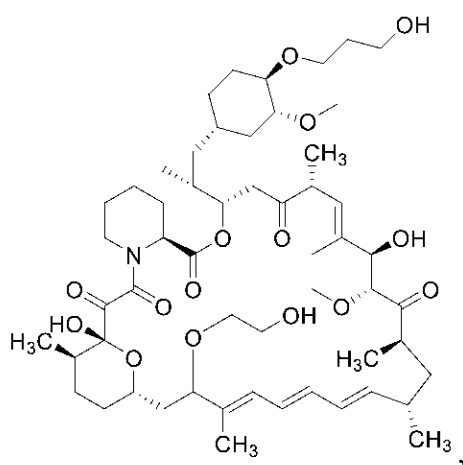
40

50

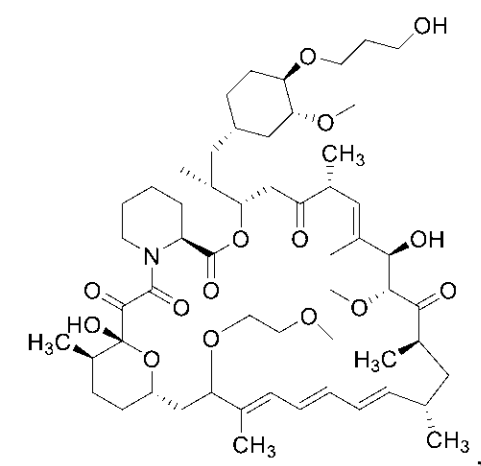
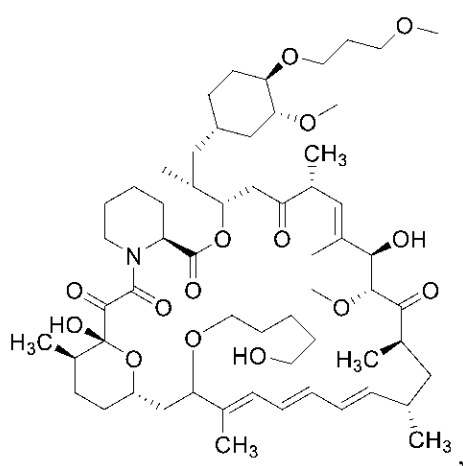
【化 7 - 1】



10



20

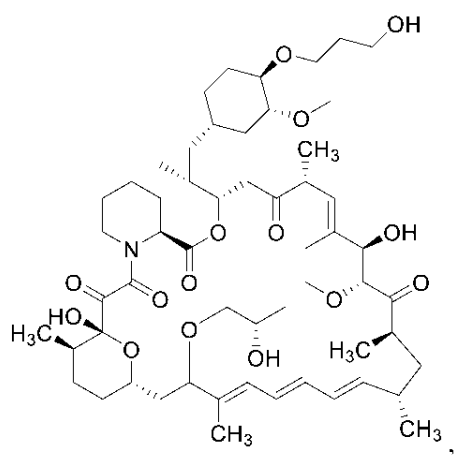
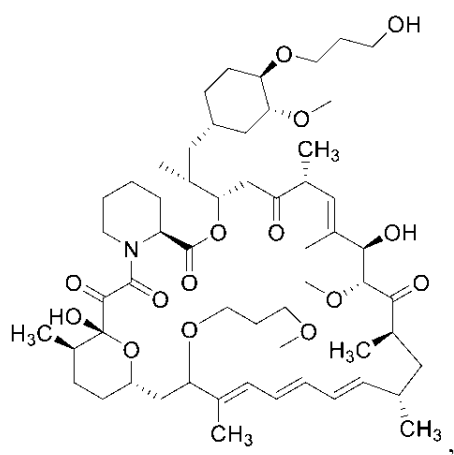


30

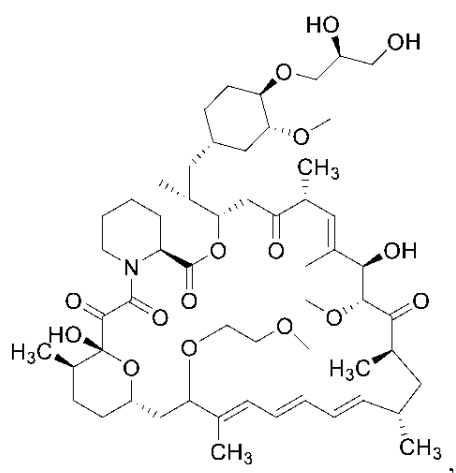
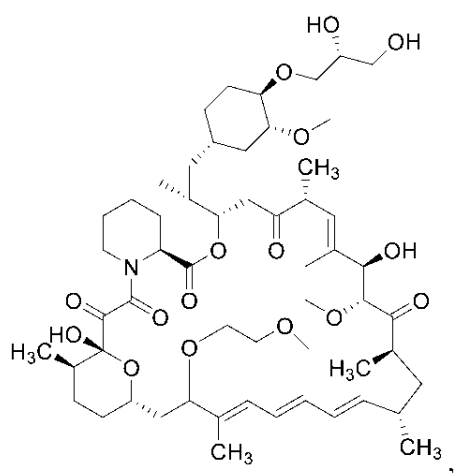
40

50

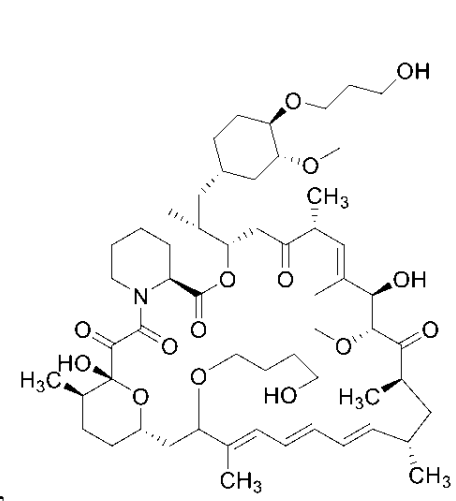
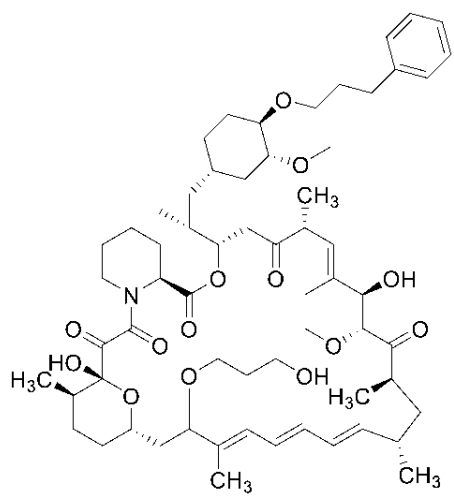
【化 7 - 2】



10



20

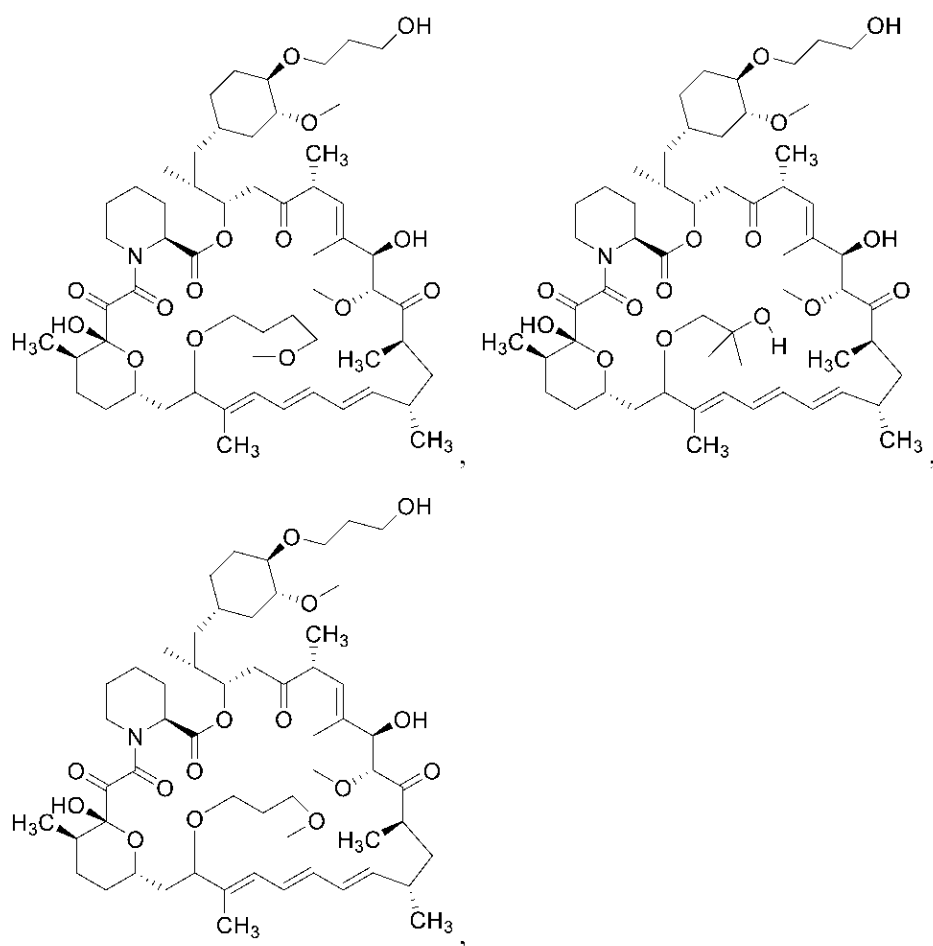


30

40

50

【化 7 - 3】



10

20

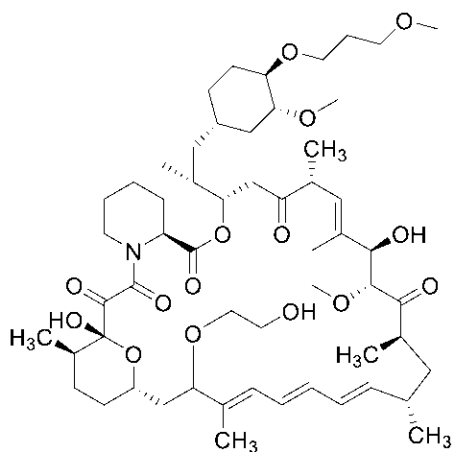
またはそのいずれか 1 つの塩から選択される、請求項 1 に記載の化合物または塩。

30

【請求項 1 2】

前記化合物が、

【化 8】



40

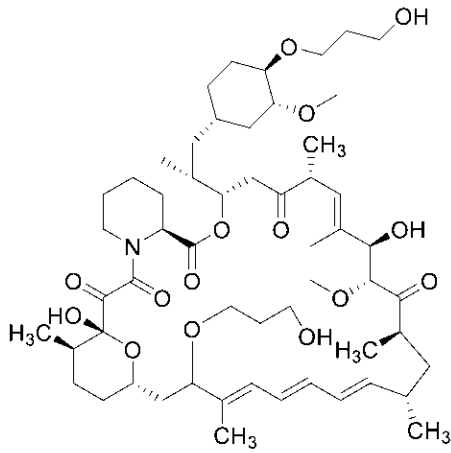
またはその塩である、請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 1 3】

前記化合物が、

50

【化 9】



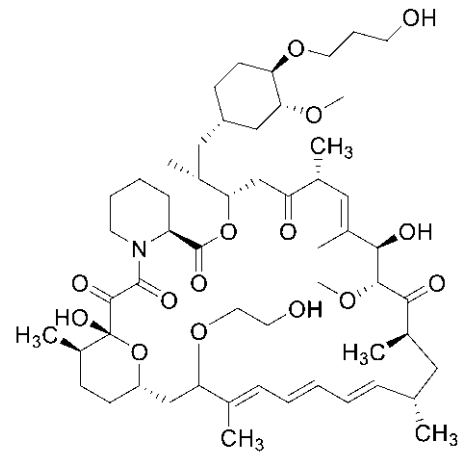
10

またはその塩である、請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 1 4】

前記化合物が、

【化 1 0】



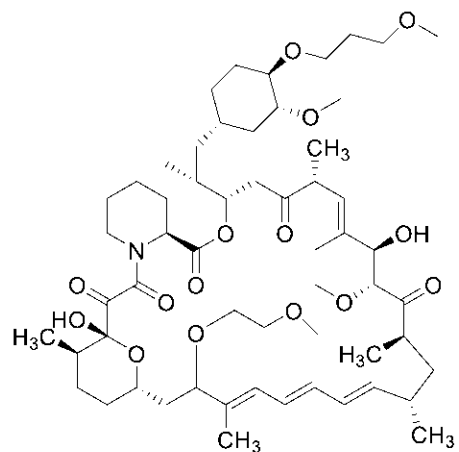
20

またはその塩である、請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 1 5】

前記化合物が、

【化 1 1】



40

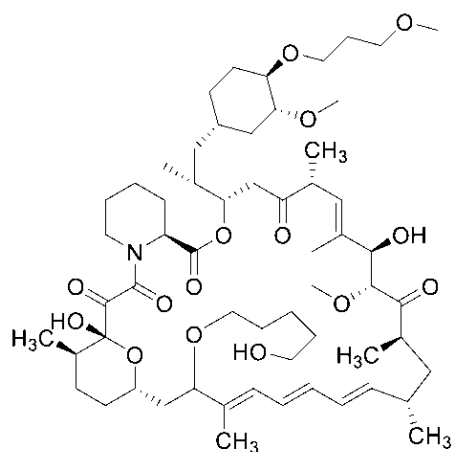
またはその塩である、請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 1 6】

50

前記化合物が、

【化 1 2】



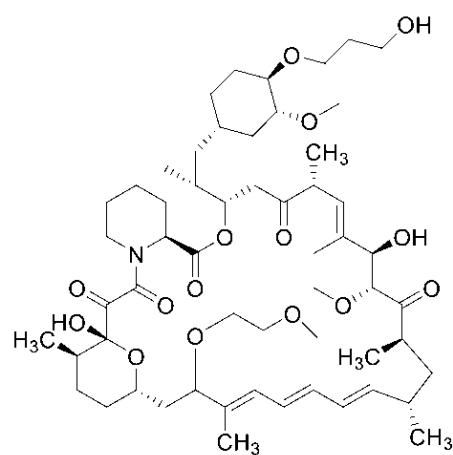
10

またはその塩である、請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 1 7】

前記化合物が、

【化 1 3】



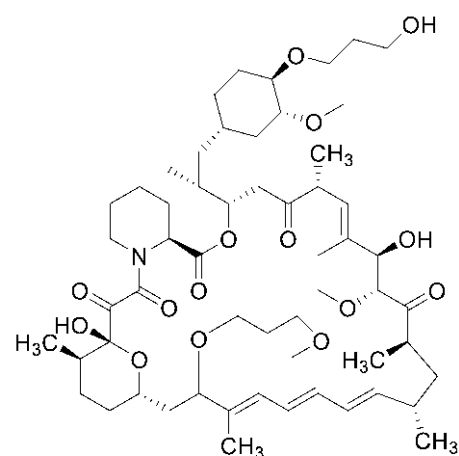
20

またはその塩である、請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 1 8】

前記化合物が、

【化 1 4】



40

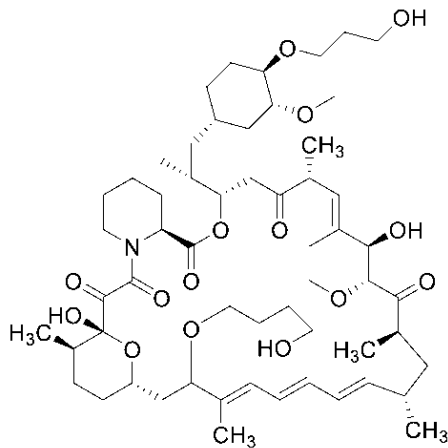
またはその塩である、請求項 1 に記載の化合物または塩。

50

【請求項 19】

前記化合物が、

【化 15】



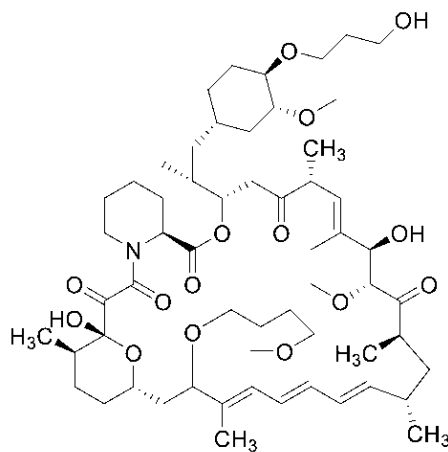
10

またはその塩である、請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 20】

前記化合物が、

【化 16】



20

30

またはその塩である、請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 21】

請求項 1 に記載の化合物または塩および薬学的に許容される賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 22】

対象に請求項 21 に記載の医薬組成物を投与するステップを含む、慢性疾患を有する前記対象の処置のための請求項 21 に記載の医薬組成物であって、前記対象は m T O R C 1 の活性の阻害から利益を得る対象である、医薬組成物。

40

【請求項 23】

前記利益が、前記慢性疾患に関連した 1 つまたは複数の症状の改善を含む、請求項 22 に記載の医薬組成物。

【請求項 24】

前記慢性疾患が、m T O R オパチーである、請求項 23 に記載の医薬組成物。

50