

【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 519/00
 A 6 1 K 31/496
 A 6 1 K 31/7052
 C 0 7 H 17/00

【手続補正書】

【提出日】令和5年1月11日(2023.1.11)

【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

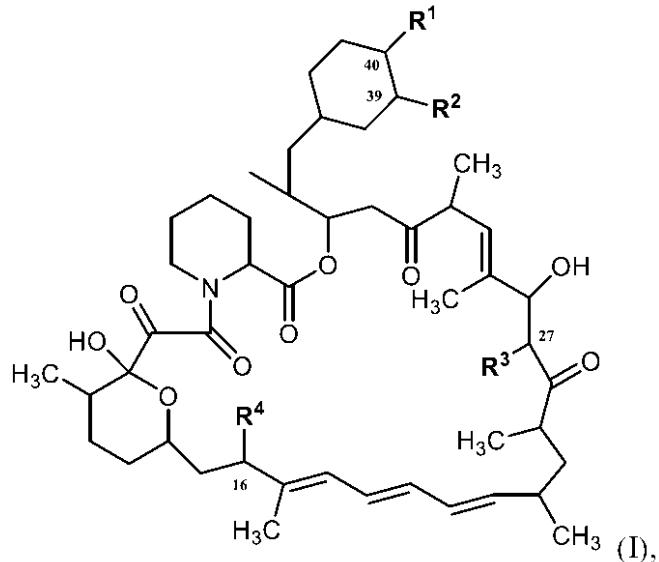
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



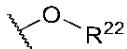
20

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、

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

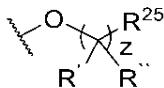
40

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、

R⁴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、ならびにハロゲンおよび-OR³⁻¹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C₁～₃アルキルから選択され、

R²⁵は、-OR³⁻¹から選択され、

R³⁻¹は、独立して、出現するごとに、水素、-Si(C₁～C₆アルキル)₃；ならびにそのそれぞれが、ハロゲン、-OSi(C₁～C₆アルキル)₃、-CN、-NO₂、-NH₂、=O、=S、-C₁～₁₀ハロアルキル、C₂～₁₀アルケニル、C₂～₁₀アルキニル、C₃～₁₂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C₁～₁₀アルキル、C₂～₁₀アルケニル、C₂～₁₀アルキニル、C₃～₁₂炭素環、および3から12員複素環から選択され、

20

R²²は、

ハロゲン、-OR³⁻⁰、-N(R³⁻⁰)₂、-(O-CH₂-(CH₂)_p)_n-W、-SR³⁻⁰、-C(O)R³⁻⁰、-C(O)N(R³⁻⁰)₂、-N(R³⁻⁰)C(O)R³⁻⁰、-C(O)OR³⁻⁰、-OC(O)R³⁻⁰、-OC(O)R³⁻⁰、-S(O)R³⁻⁰、-S(O)₂R³⁻⁰、-P(O)(OR³⁻⁰)₂、-OP(O)(OR³⁻⁰)₂、-NO₂、=O、=S、=N(R³⁻⁰)、および-CN；

そのそれぞれが、ハロゲン、-OR³⁻⁰、-SR³⁻⁰、-N(R³⁻⁰)₂、-C(O)R³⁻⁰、-C(O)N(R³⁻⁰)₂、-N(R³⁻⁰)C(O)R³⁻⁰、-C(O)OR³⁻⁰、-OC(O)R³⁻⁰、-S(O)R³⁻⁰、-S(O)₂R³⁻⁰、-P(O)(OR³⁻⁰)₂、-OP(O)(OR³⁻⁰)₂、-NO₂、=O、=S、=N(R³⁻⁰)、-CN、C₃～₁₀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C₂～₁₀アルケニル、C₂～₁₀アルキニル；

ハロゲン、-OR³⁻⁰、-SR³⁻⁰、-N(R³⁻⁰)₂、-C(O)R³⁻⁰、-C(O)N(R³⁻⁰)₂、-N(R³⁻⁰)C(O)R³⁻⁰、-C(O)OR³⁻⁰、-OC(O)R³⁻⁰、-S(O)R³⁻⁰、-S(O)₂R³⁻⁰、-P(O)(OR³⁻⁰)₂、-OP(O)(OR³⁻⁰)₂、-NO₂、=O、=S、=N(R³⁻⁰)、-CN、C₁～₆アルキル-R³⁻⁰、C₂～₆アルケニル、およびC₂～₆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C₃～₁₀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C₃～₆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-CH₃から選択され、

R³⁻⁰は、独立して、出現するごとに、水素、-Si(C₁～C₆アルキル)₃；ならびにそのそれぞれが、ハロゲン、-OH、-OSi(C₁～C₆アルキル)₃、-CN、-NO₂、-NH₂、=O、=S、C₁～₁₀アルキル、-C₁～₁₀ハロアルキル、-OC₁～₁₀アルキル、C₂～₁₀アルケニル、C₂～₁₀アルキニル、C₃～₁₂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C₁～₁₀アルキル、C₂～₁₀アルケニル、C₂～₁₀アルキニル、C₃～₁₂炭素環、および3から12員複素環から選択され、

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】

R₂²が、ハロゲン、-OR³₀、-N(R³₀)₂、-(O-CH₂-(CH₂)_p)-n-W、-SR³₀、-C(O)R³₀、-C(O)N(R³₀)₂、-N(R³₀)C(O)R³₀、-C(O)OR³₀、-OC(O)R³₀、-S(O)R³₀、-S(O)₂R³₀、-P(O)(OR³₀)₂、-OP(O)(OR³₀)₂、-NO₂、=O、=S、=N(R³₀)、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C₃~C₆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 3】

R₂²が、ハロゲン、-OR³₀、-N(R³₀)₂、-SR³₀、-S(O)R³₀、-S(O)₂R³₀、-NO₂、=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C₃~C₆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R³₀が、水素およびC₁~C₁₀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】

R²²が、置換されたC₃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C₃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。

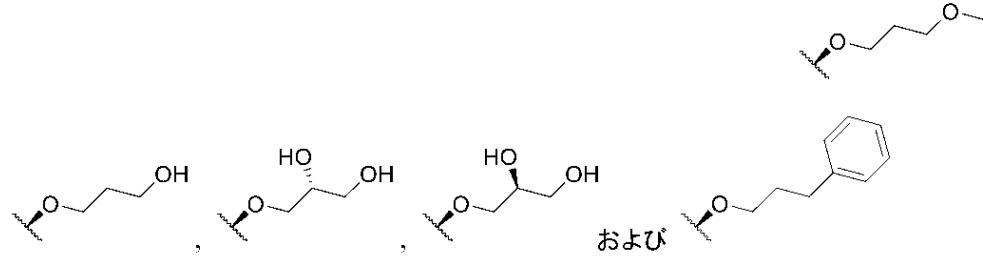
【請求項 7】

各R³₁が、水素およびC₁~C₁₀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】

R¹が、

【化4】

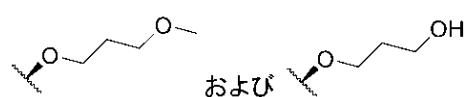


から選択される、請求項1に記載の化合物または塩。

【請求項 9】

R¹が、

【化5】



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】

R⁴が、

10

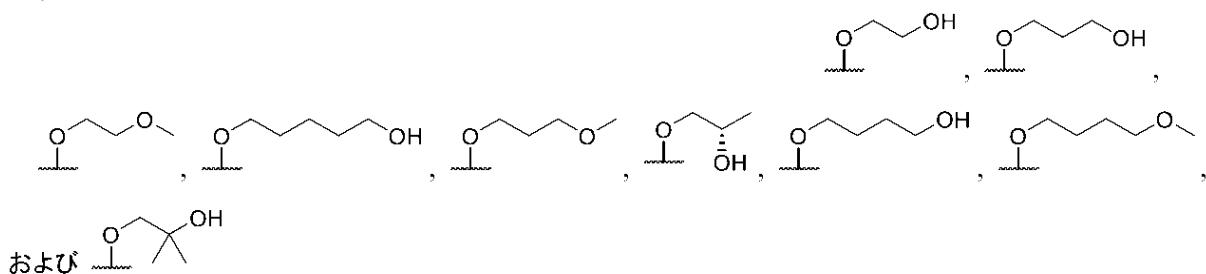
20

30

40

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11】
前記化合物が、

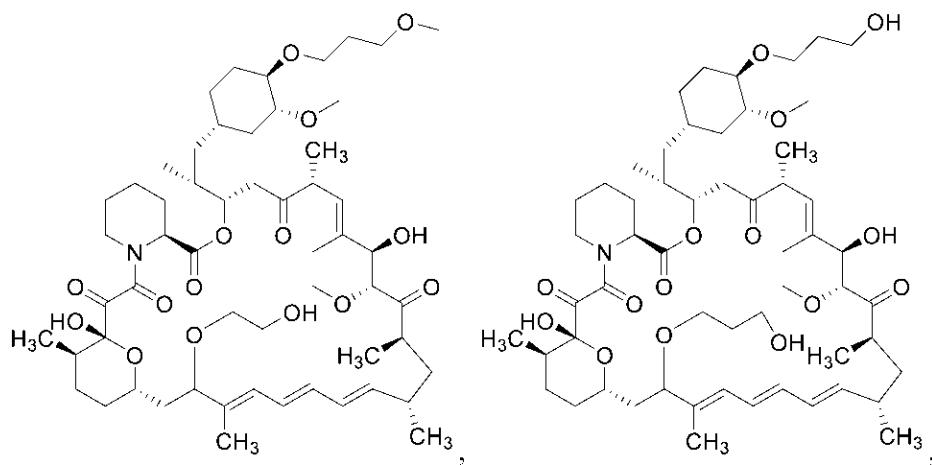
20

30

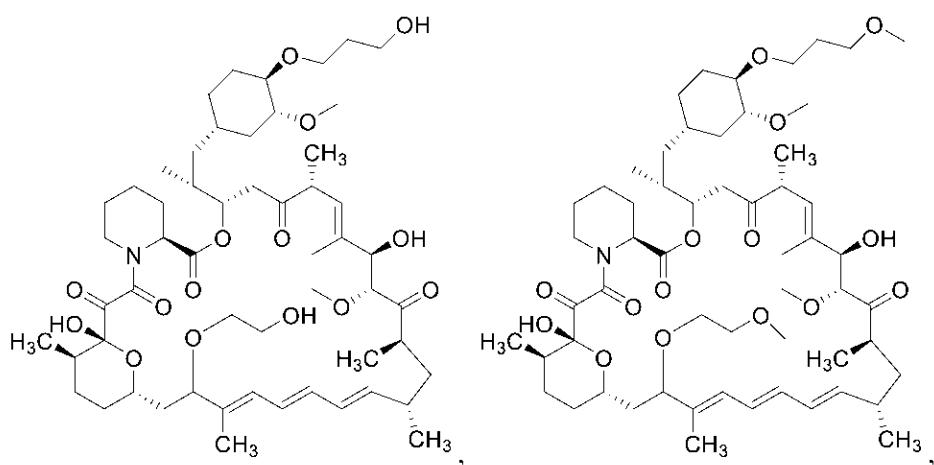
40

50

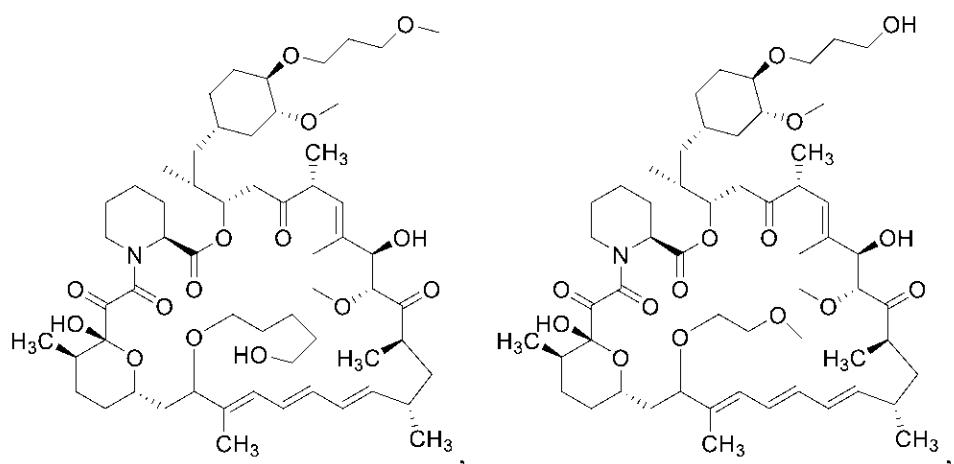
【化 7 - 1】



10



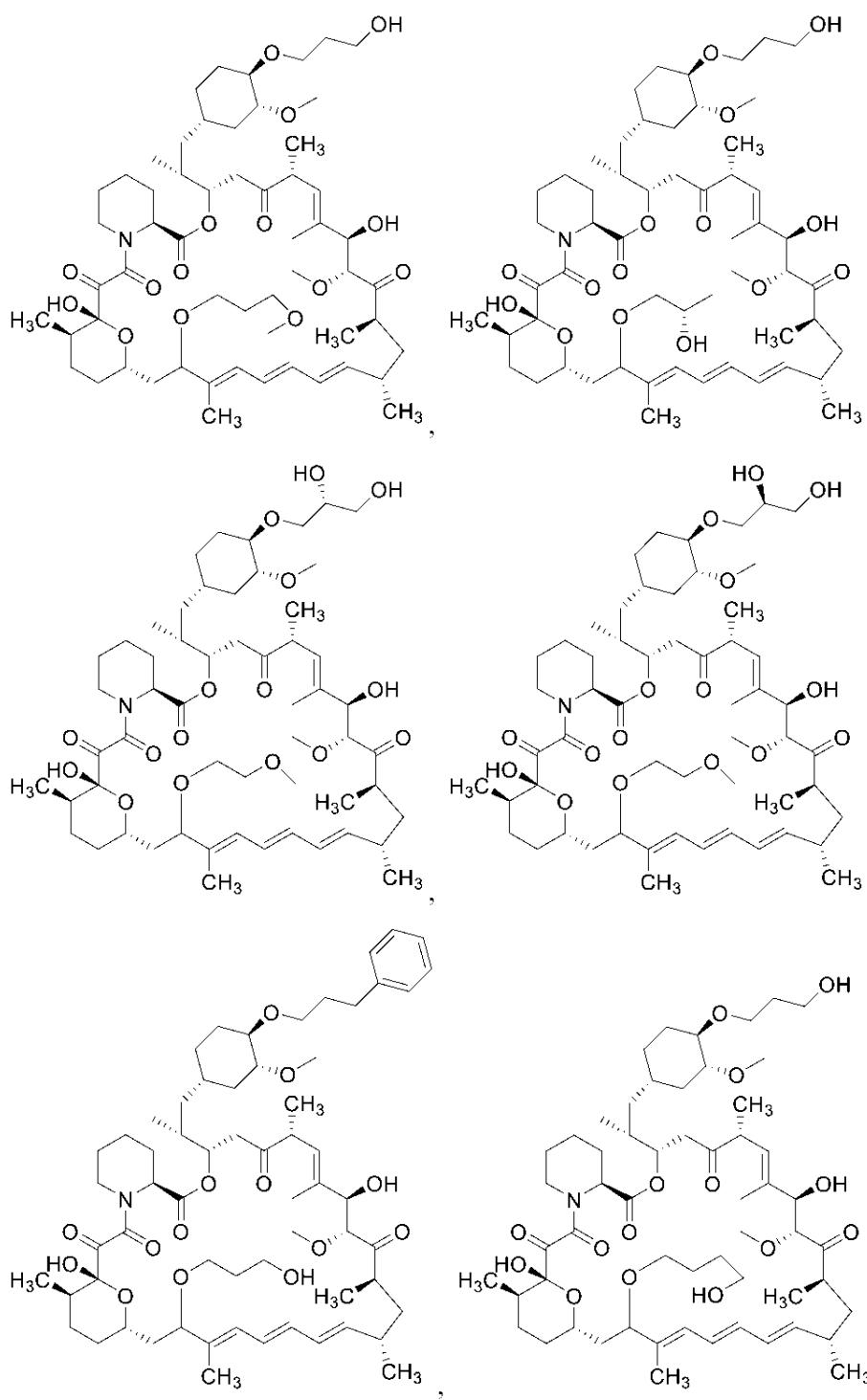
20



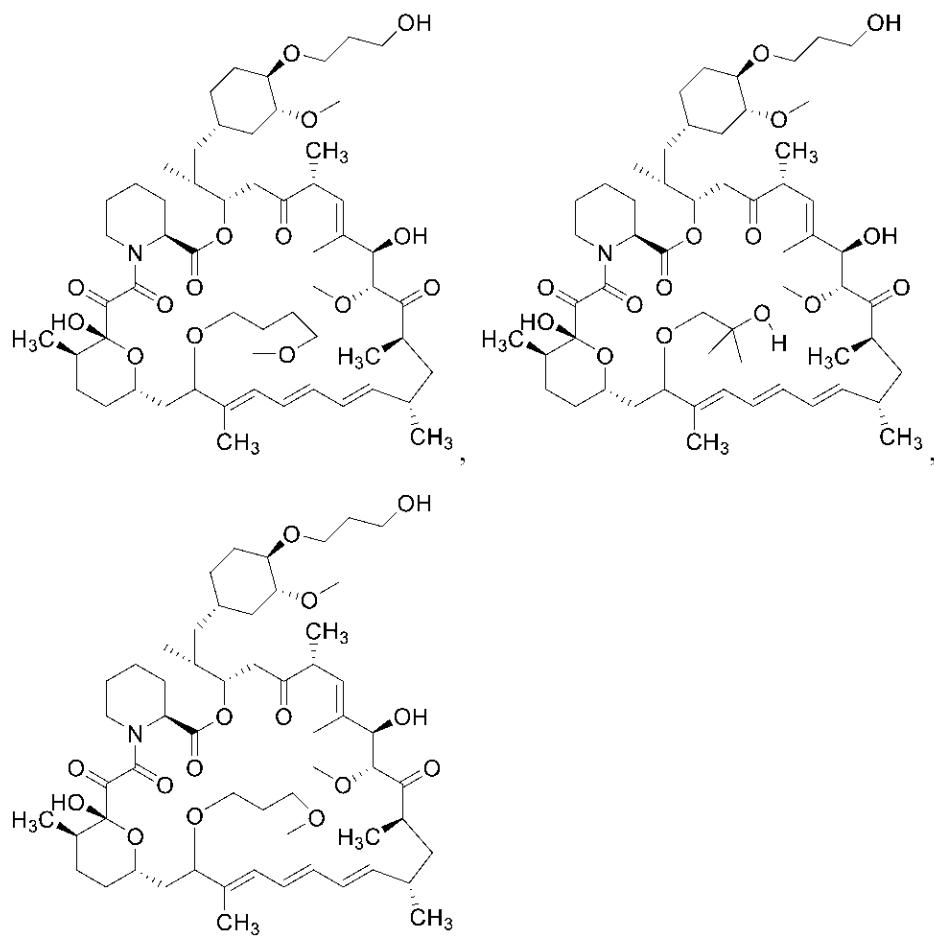
30

40

【化 7 - 2】



【化7-3】



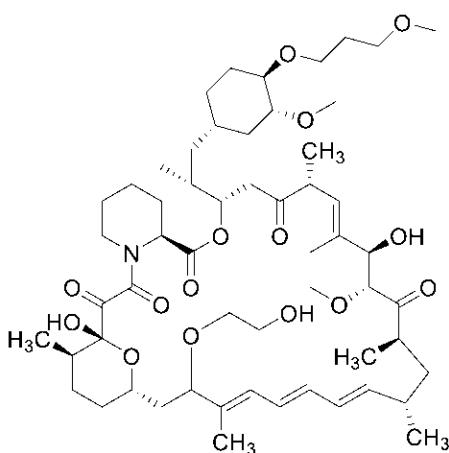
またはそのいずれか1つの塩から選択される、請求項1に記載の化合物または塩。

【請求項12】

30

前記化合物が、

【化8】



40

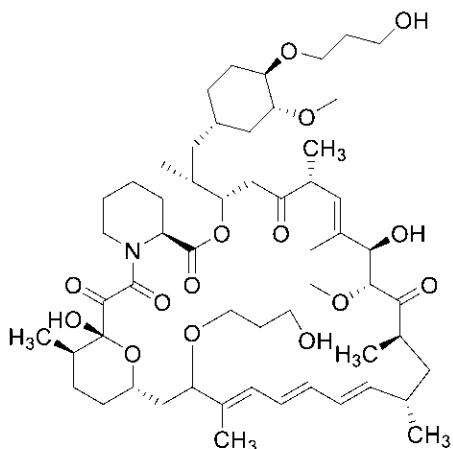
またはその塩である、請求項1に記載の化合物または塩。

【請求項13】

50

前記化合物が、

【化 9】



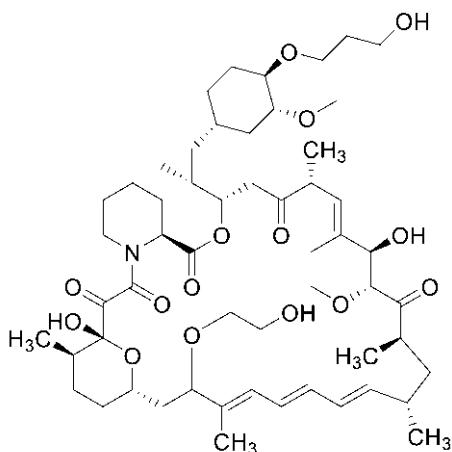
10

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

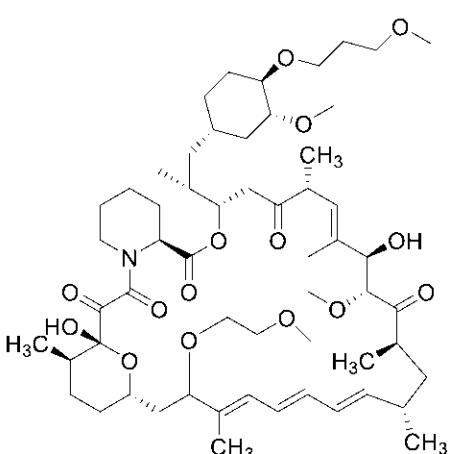
30

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 1 5】

前記化合物が、

【化 1 1】



40

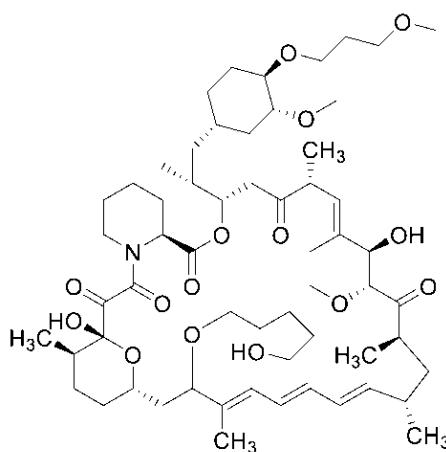
またはその塩である、請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 1 6】

50

前記化合物が、

【化12】



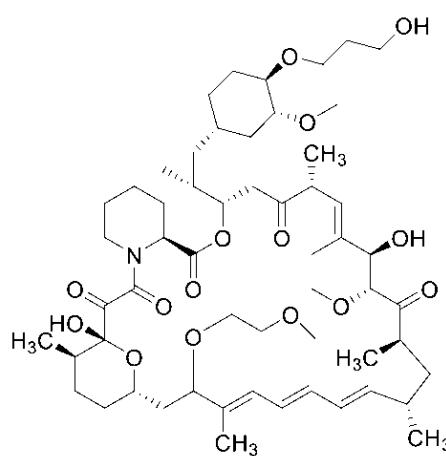
10

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17】

前記化合物が、

【化13】



20

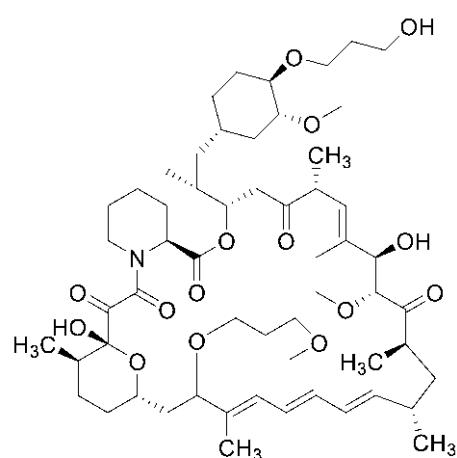
30

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18】

前記化合物が、

【化14】



40

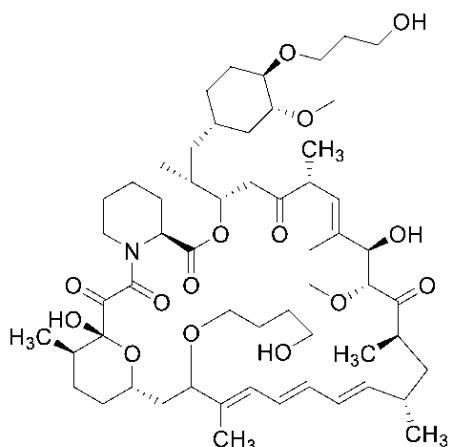
またはその塩である、請求項1に記載の化合物または塩。

50

【請求項 19】

前記化合物が、

【化 15】



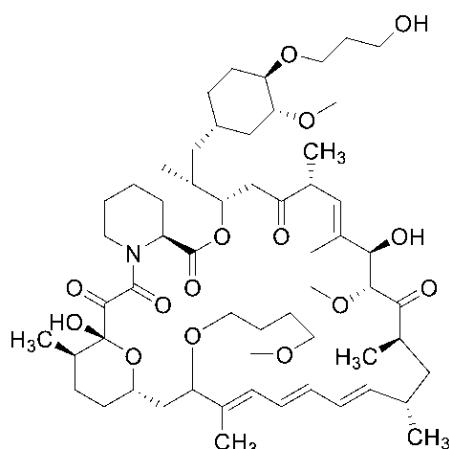
10

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