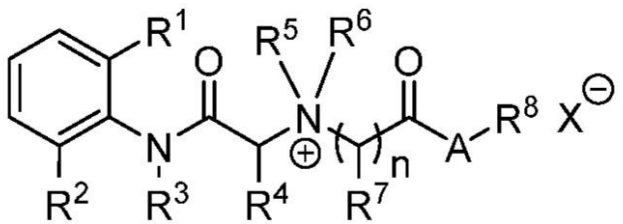
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和5年11月8日(2023.11.8)

【国際公開番号】WO2021/087113
【公表番号】特表2023-500682(P2023-500682A)
【公表日】令和5年1月10日(2023.1.10)
【年通号数】公開公報(特許)2023-004
【出願番号】特願2022-525711(P2022-525711)
【国際特許分類】
C07D295/037(2006.01)
A61P 25/02(2006.01)
A61K 31/452(2006.01)
A61K 31/221(2006.01)
C07C237/04(2006.01)
【ＦＩ】
C07D295/037 CSP
A61P 25/02 101
A61K 31/452
A61K 31/221
A61P 25/02
C07C237/04 Z

【手続補正書】
【提出日】令和5年10月30日(2023.10.30)
【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】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
式(II):
【化１】

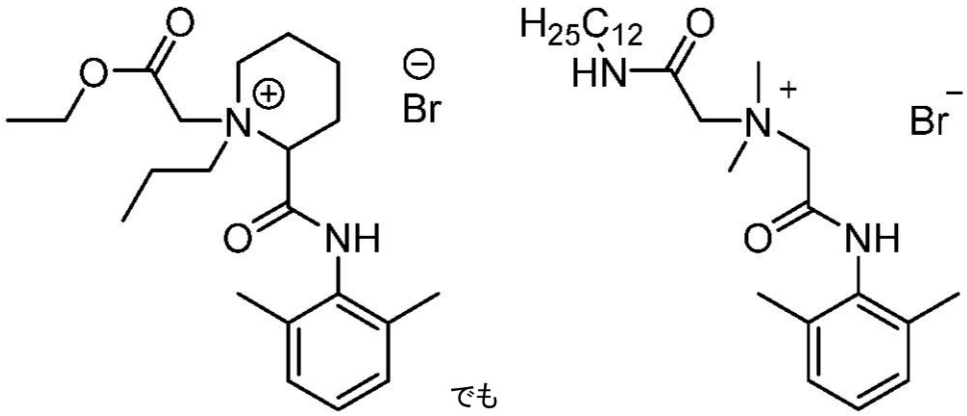


(II)

で表される化合物であり、式中:
R^1は、置換または非置換のアルキルである;
R^2は、置換または非置換のアルキルである;
R^3は、水素、または置換もしくは非置換のアルキルである;
R^4は、水素、置換もしくは非置換のアルキルであるか、またはR^5もしくはR^6と結び合わさることで、ヘテロシクリル環を形成している;

R^5は、置換もしくは非置換のアルキルであるか、またはR^4と結び合わさることで、ヘテロシクリル環を形成している;
R^6は、置換もしくは非置換のアルキルであるか、またはR^4と結び合わさることで、ヘテロシクリル環を形成している;
R^7は、水素、置換もしくは非置換のアルキル、またはハロゲンである;
R^8は、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のカルボシクリル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のヘテロアリール、または置換もしくは非置換のアリールである;
Aは、O、S、またはNR^Aである;
R^Aは、水素、または置換もしくは非置換のアルキルである;
X^-は、対イオンである;および
nは、1、2、3、4、5、または6である;
ただし、Aが、NR^Aであるなら、その場合R^3は、Hである;R^8は、置換のアリールでも非置換のアリールでもない;および化合物は、以下:

【化２】



でも表されない、前記化合物。

【請求項２】
式中:R^1が、非置換のアルキルである;および
R^2が、非置換のアルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項３】
式中:R^3が、水素である、請求項1～2のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項４】
式中:R^4が、水素であるか、またはR^5もしくはR^6と結び合わさることで、ヘテロシクリル環を形成している、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項５】
式中:R^4が、R^5またはR^6と結び合わさることで、ヘテロシクリル環を形成している、請求項1～4のいずれか一項に記載の化合物。

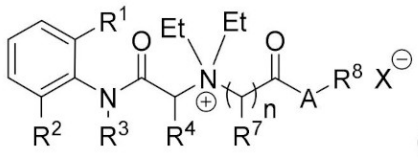
【請求項６】
式中:R^5が、非置換のアルキルであるか、またはR^4と結び合わさることで、ヘテロシクリル環を形成している;および
R^6が、非置換のアルキルであるか、またはR^4と結び合わさることで、ヘテロシクリル環を形成している、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項７】
式中:R^5が、非置換のアルキルである;および
R^6が、非置換のアルキルである、請求項1～4または6のいずれか一項に記載の化合物。

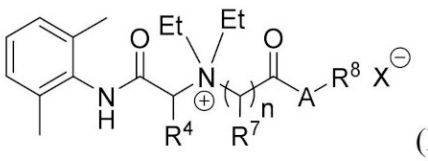
【請求項８】

式中:R^5が、非置換のアルキルである;および
R^6が、R^4と結び合わさることで、ヘテロシクリル環を形成している、請求項1～4または6のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項９】
式中:R^7が、水素である、請求項1～8のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１０】
式中:R^8が、置換または非置換のアルキルである、請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１１】
式中:R^8が、非置換の$C_{1～4}$アルキルである、請求項1～１０のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１２】
式中:Aが、OまたはSである、請求項1～１１のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１３】
式中:nが、1である、請求項1～１２のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１４】
式中:X^-が、ハロゲン化物イオンである、請求項1～１３のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１５】
化合物が、式：

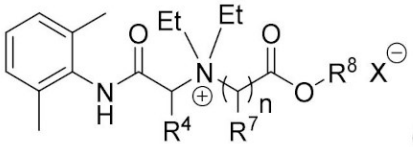
【化３】



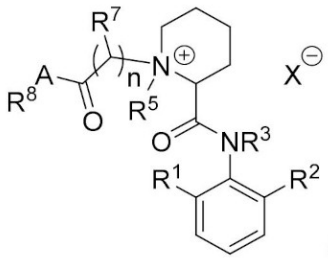
(II-b),



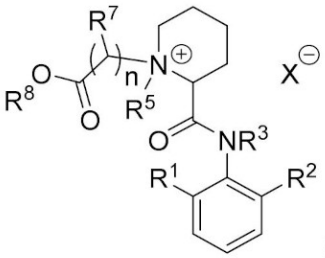
(II-c),



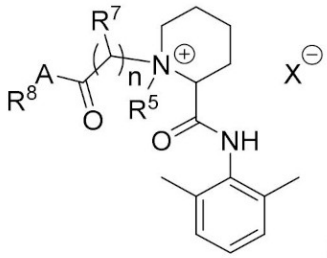
(II-d),



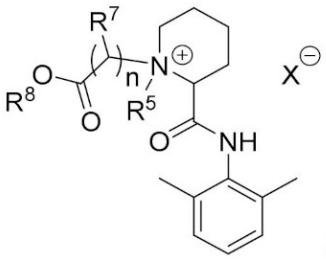
(II-e),



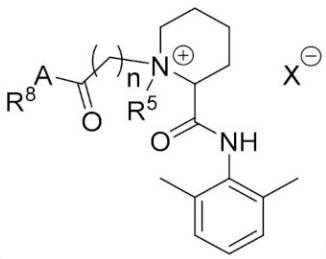
(II-f),



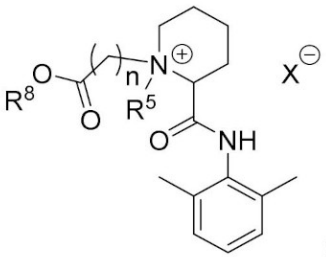
(II-g),



(II-h),



(II-i), または



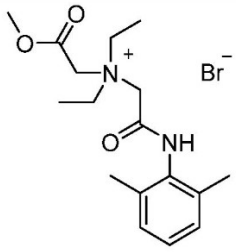
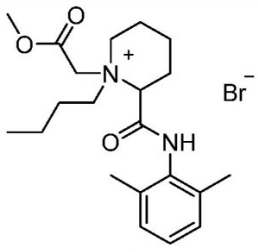
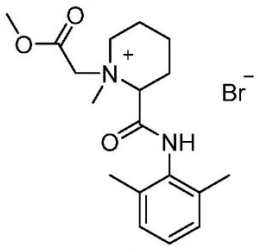
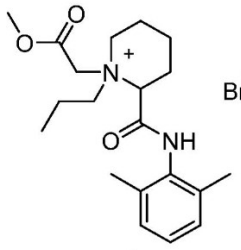
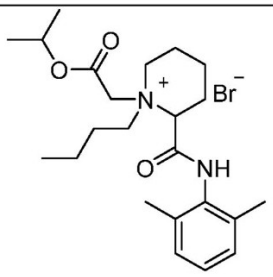
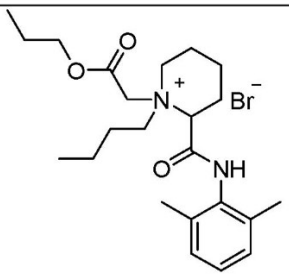
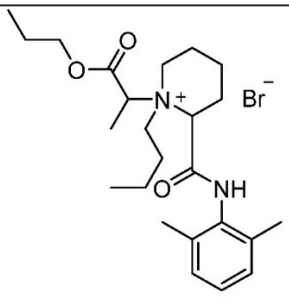
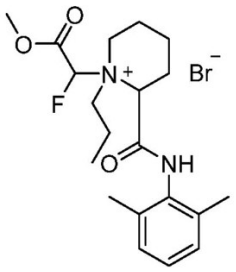
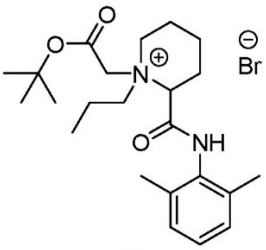
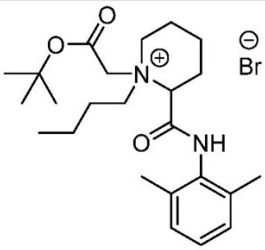
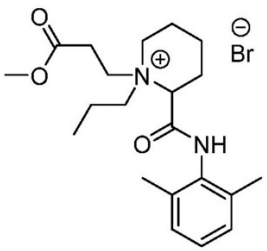
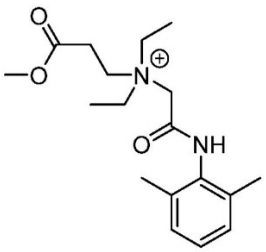
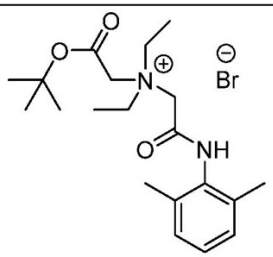
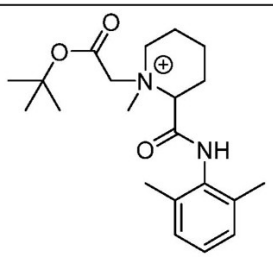
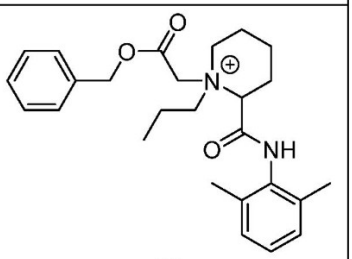
(II-j)

で表される、請求項1に記載の化合物。

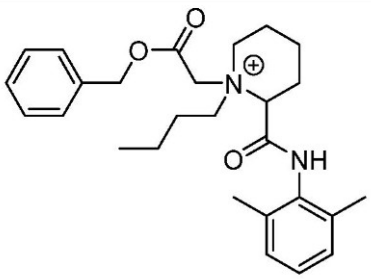
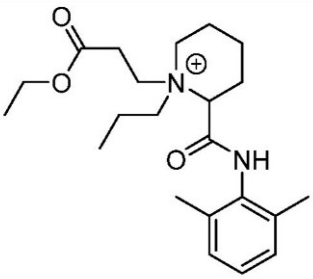
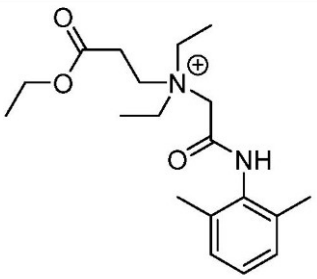
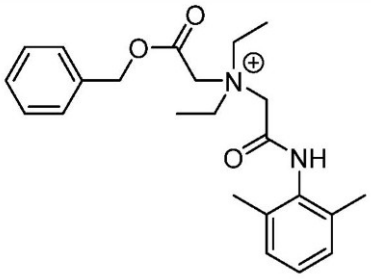
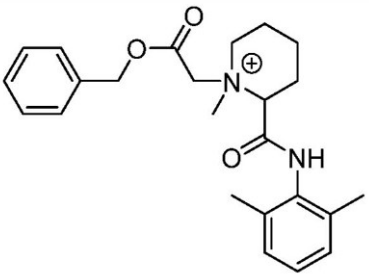
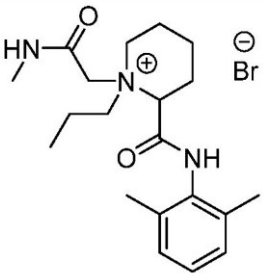
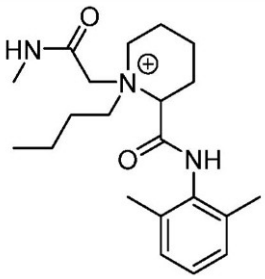
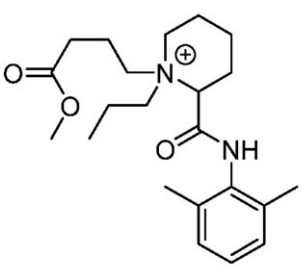
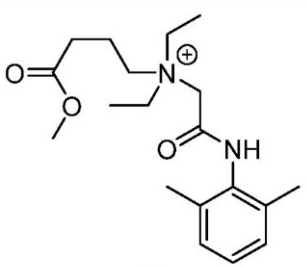
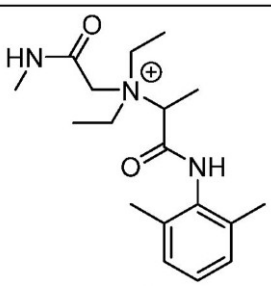
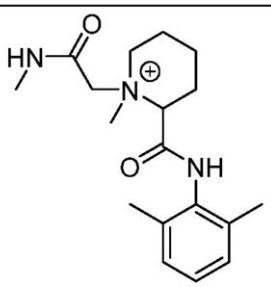
【請求項１６】

化合物が、式:

【表１】

 1	 2	 3
 4	 5	 6
 7	 8	 14
 15	 16	 17
 18	 19	 20

【表２】

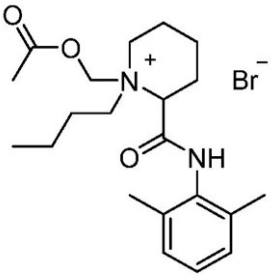
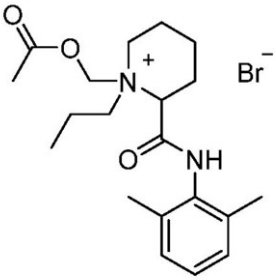
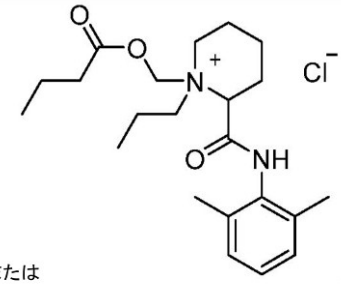
 21	 22	 23
 24	 25	 26
 27	 28	 29
 30	 31	

で表される、請求項1に記載の化合物。

【請求項１７】

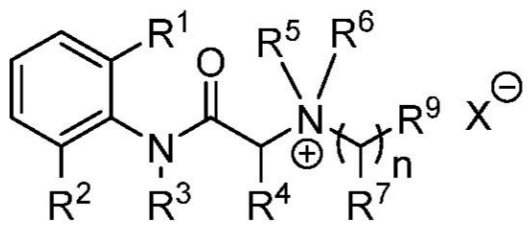
式:

【表３】

 9	 10	 または 11

で表される、化合物。

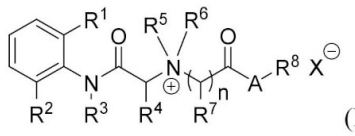
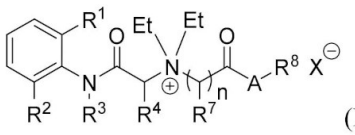
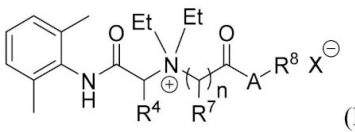
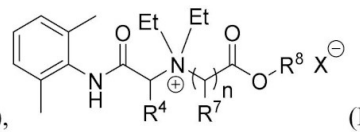
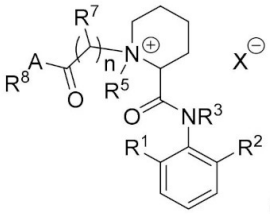
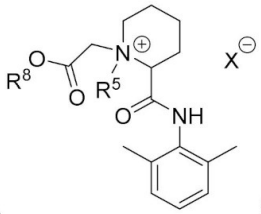
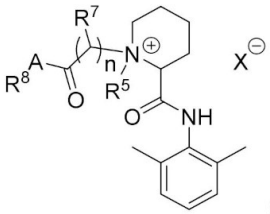
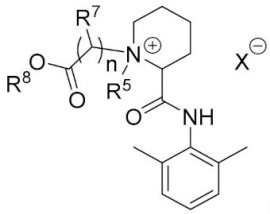
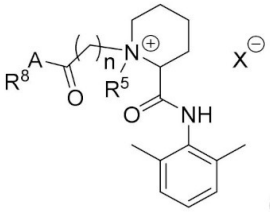
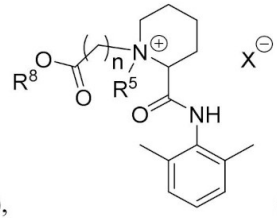
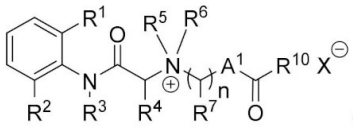
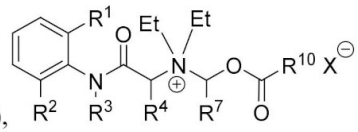
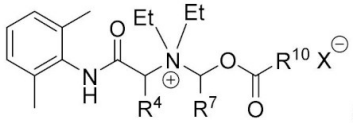
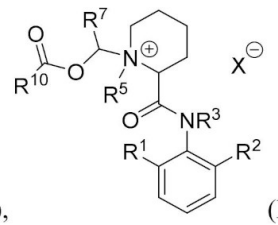
【請求項１８】
請求項1～17のいずれか一項に記載の化合物および薬学的に許容し得る賦形剤を含む、医薬組成物。
【請求項１９】
必要とする対象における選択的な感覚神経の遮断を誘導する方法における使用のための医薬組成物であって、医薬組成物が、式(I):
【化４】



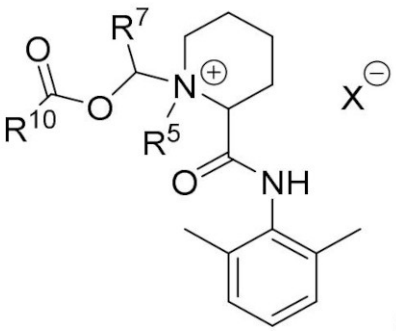
(I)

式中:
R^1は、置換または非置換のアルキルである;
R^2は、置換または非置換のアルキルである;
R^3は、水素、または置換もしくは非置換のアルキルである;
R^4は、水素、置換もしくは非置換のアルキルであるか、またはR^5もしくはR^6と結び合わさることで、ヘテロシクリル環を形成している;
R^5は、置換もしくは非置換のアルキルであるか、またはR^4もしくはR^6と結び合わさることで、ヘテロシクリル環を形成している;
R^6は、置換もしくは非置換のアルキルであるか、またはR^4もしくはR^5と結び合わさることで、ヘテロシクリル環を形成している;
R^7は、水素、置換もしくは非置換のアルキル、またはハロゲンである;
R^9は、-(C=O)-A-R^8または-A^1-(C=O)-R^{10}である;
R^8は、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のカルボシクリル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のヘテロアリール、または置換もしくは非置換のアリールである;
R^{10}は、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のカルボシクリル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のヘテロアリール、または置換もしくは非置換のアリールである;
Aは、O、S、またはNR^Aである;
A^1は、O、S、またはNR^Aである;
R^Aは、水素、または置換もしくは非置換のアルキルである;
X^-は、対イオンである;および
nは、1、2、3、4、5、または6である、
で表される化合物を含む、前記医薬組成物。
【請求項２０】
式(I)で表される化合物が式：

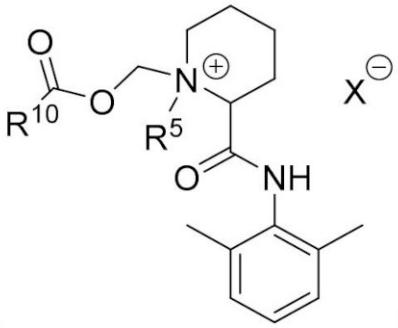
【化５】


(II),

(II-b),

(II-c),

(II-d),

(II-e),

(II-f),

(II-g),

(II-h),

(II-i),

(II-j),

(III),

(III-b)

(III-c),

(III-d),

【化６】



(III-e),



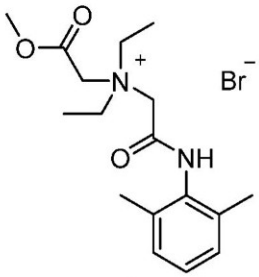
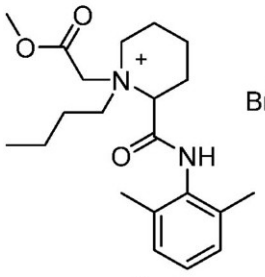
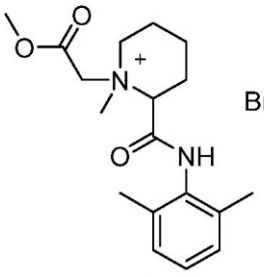
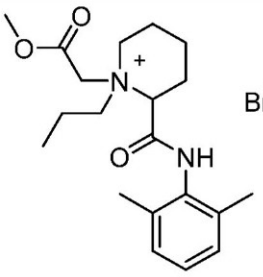
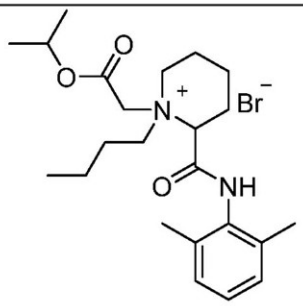
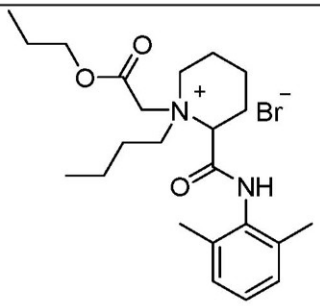
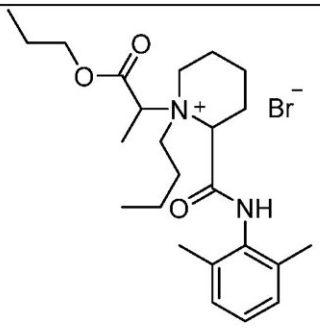
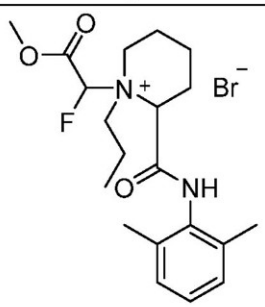
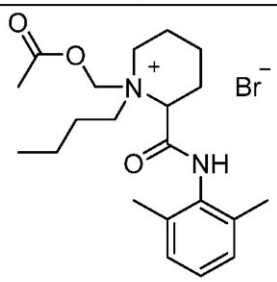
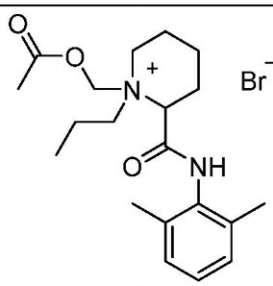
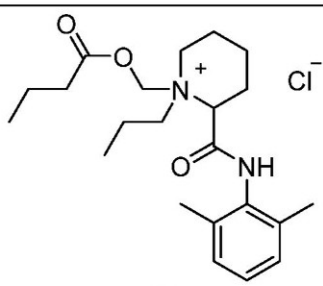
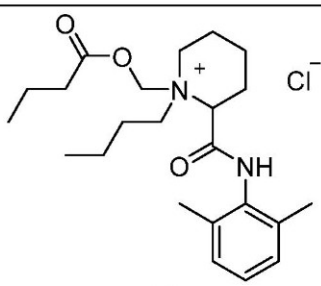
(III-f)

で表される、請求項19に記載の医薬組成物。

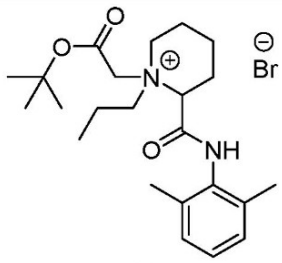
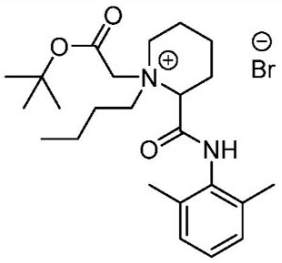
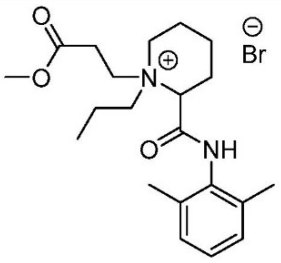
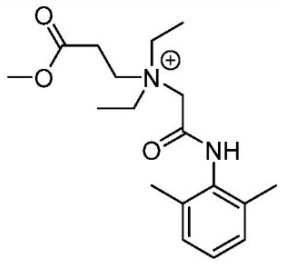
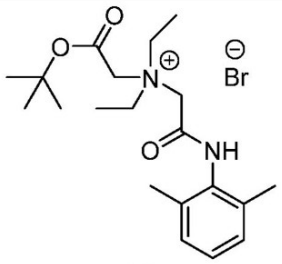
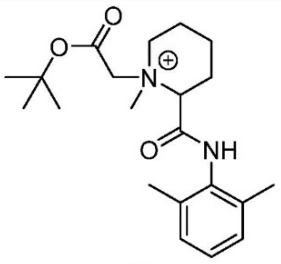
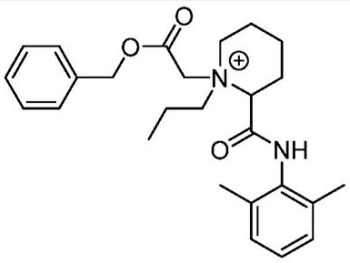
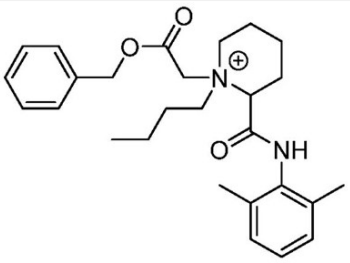
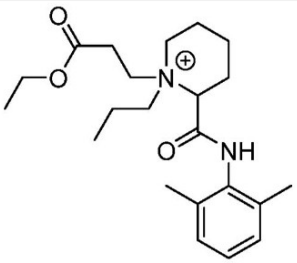
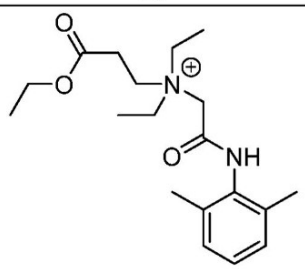
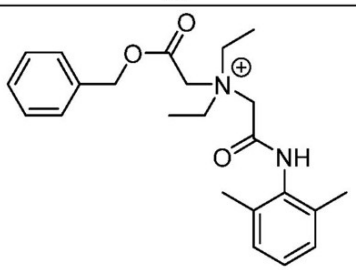
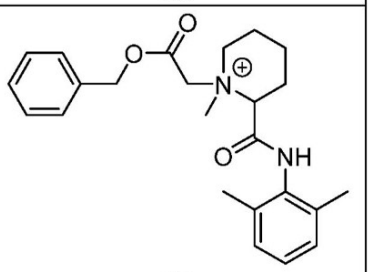
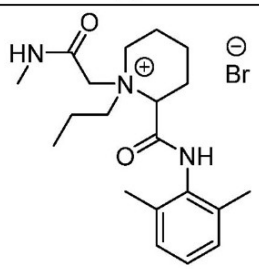
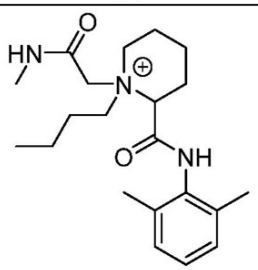
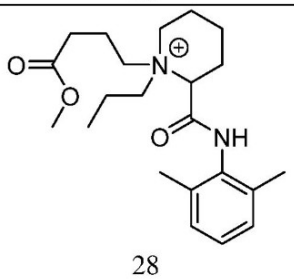
【請求項２１】

化合物が、式:

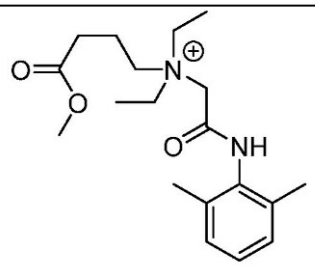
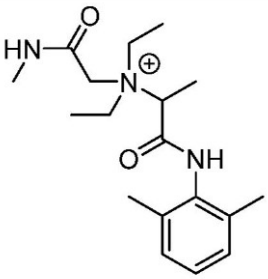
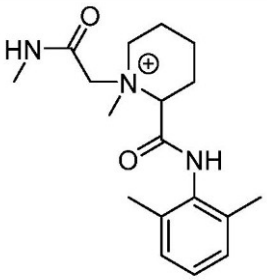
【表４】

 1	 2	 3
 4	 5	 6
 7	 8	 9
 10	 11	 12

【表５】

 14	 15	 16
 17	 18	 19
 20	 21	 22
 23	 24	 25
 26	 27	 28

【表６】

 29	 30	 31

で表される、請求項１９に記載の医薬組成物。

【請求項２２】

化合物を投与することが、運動機能遮断の持続時間より長い感覚神経遮断の持続時間を提供する、請求項１９～２１のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項２３】

化合物を投与することが、少なくとも2:1または少なくとも3:1という、感覚神経遮断の持続時間:運動機能遮断の持続時間の比率を提供する、または運動機能の遮断を何らもたらさない、請求項１９～２２のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項２４】

請求項1～１７のいずれか一項に記載の化合物、もしくはその薬学的に許容し得る塩、または請求項１８に記載の医薬組成物;および化合物または医薬組成物を対象へ投与するための指示を含む、キット。