

【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 6 月 26 日 (2023.6.26)

【公開番号】特開 2023-36695 (P2023-36695A)

【公開日】令和 5 年 3 月 14 日 (2023.3.14)

【年通号数】公開公報 (特許) 2023-048

【出願番号】特願 2022-198455 (P2022-198455)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/438 (2006.01)

10

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

C 0 7 K 14/47 (2006.01)

C 0 7 K 7/06 (2006.01)

【F I】

20

A 6 1 K 31/438

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 25/00 Z N A

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 25/28

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/20

A 6 1 P 31/04

C 0 7 K 14/47

C 0 7 K 7/06

30

【手続補正書】

【提出日】令和 5 年 6 月 16 日 (2023.6.16)

【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

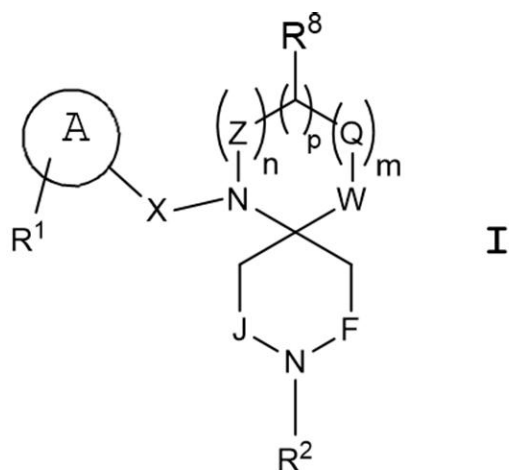
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

40

インシュリン耐性を阻害する方法であって、認識されるインシュリン耐性の阻害を必要とするインシュリン受容体を含む細胞に、系列 C - 2 の化合物の下記の式 I で示される化合物又はその薬学的に許容可能な塩の有効量を投与することを含み、前記投与が、 μ オピオイド受容体 (MOR) 結合有効量の別個の MOR アゴニスト又はアンタゴニストが存在しない状態で行われるものであることを特徴とする方法。



10

式中、

Qは、 CHR^9 又は $\text{C}(\text{O})$ であり、Zは、 CHR^{10} 又は $\text{C}(\text{O})$ であり、かつQ及びZのうち1つだけが $\text{C}(\text{O})$ であり；

m及びn及びpは、それぞれ、0又は1であり、かつ $m+n+p$ の合計は、2であり；

Wは、 NR^7 であり、ここで、 R^7 及び R^2 は、同じあるか異なっていて、 H 、 $\text{C}(\text{H})_v(\text{D})_h$ （式中、 v 及び h は、それぞれ、0、1、2、又は3であり、かつ $v+h=3$ である）、 $\text{C}(\text{H})_q(\text{D})_r$ -脂肪族 C_1-C_{11} ヒドロカルビル（式中、 q 及び r は、それぞれ、0、1、又は2であり、かつ $q+r=0$ 、1、又は2である）、脂肪族 C_1-C_{12} ヒドロカルビルスルホニル、又は脂肪族 C_1-C_{12} ヒドロカルボイル（アシル）、及び以下で定義されるX-環A- R^1 であり；

20

J及びFは、同じであるか異なっていて、 CH_2 、 CHD 、又は CD_2 である（式中、Dは、重水素である）；

Xは、 SO_2 、 $\text{C}(\text{O})$ 、 CH_2 であり、

環Aは、芳香環系又はヘテロ芳香環系であり、この環系は、単環又は縮合した2つの環を含み；

30

R^1 は、 H であるか、又は上限3個までの置換基、 R^{1a} 、 R^{1b} 、及び R^{1c} 、を表し、上限3個までの置換基自身は、同じであっても異なってもよく、これら3つの基、 R^{1a-c} は、それぞれ、個別に、 H 、 C_1-C_6 ヒドロカルビル、 C_1-C_6 ヒドロカルビルオキシ、 C_1-C_6 ヒドロカルビルオキシカルボニル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 C_1-C_7 ヒドロカルボイル、ヒドロキシ置換、トリフルオロメチル置換、もしくはハロゲン置換の C_1-C_7 ヒドロカルボイル、 C_1-C_6 ヒドロカルビルスルホニル、 C_1-C_6 ヒドロカルビルオキシスルホニル、ハロゲン、ニトロ、フェニル、シアノ、カルボキシル、 C_1-C_7 ヒドロカルビルカルボキシラート、カルボキサミドもしくはスルホンアミド（いずれのアミド基中のアミド窒素は、式 NR^3R^4 を有し、ここで、 R^3 及び R^4 は、同じであるか異なっていて、 H 、 C_1-C_4 ヒドロカルビルであるか、又は R^3 と R^4 は、該示されている窒素と一緒に五員～七員環を形成し、形成された環は随意に1又は2個の追加のヘテロ原子を含有し、追加のヘテロ原子はそれぞれ独立して窒素、酸素、又は硫黄である）、 MAR （式中、Mは、 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{O}-$ 、又は $-\text{N}=\text{N}-$ であり、かつArは、単環のアリール又はヘテロアリール基である）、及び NR^5R^6 （式中、 R^5 及び R^6 は、同じであるか異なっていて、 H 、 C_1-C_4 ヒドロカルビル、 C_1-C_4 アシル、 C_1-C_4 ヒドロカルビルスルホニルであるか、又は R^5 と R^6 は、該示されている窒素と一緒に五員～七員環を形成し、形成された環は随意に1又は2個の追加のヘテロ原子を含有し、追加のヘテロ原子はそれぞれ独立して窒素、酸素、又は硫黄である）からなる群より選択され；

40

R^8 、 R^9 、及び R^{10} は、それぞれ H であるか、又は R^8 、 R^9 、及び R^{10} のうち2つが H であり、1つが C_1-C_8 ヒドロカルビル基であって、この C_1-C_8 ヒドロカルビル基

50

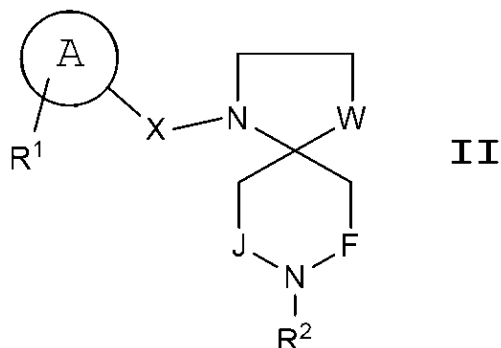
は、無置換であるか、又は上限 3 個までの原子で置換され、該原子は、同じであるか異なっていて、酸素又は窒素原子である。

【請求項 2】

前記化合物又はその薬学的に許容可能な塩が、投与されるときには、薬学的組成物として薬学的に許容可能な希釈剤に溶解又は分散して存在する、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

前記化合物が、以下の式 I I の構造に一致する系列 C - 2 の化合物である、請求項 1 に記載の方法。

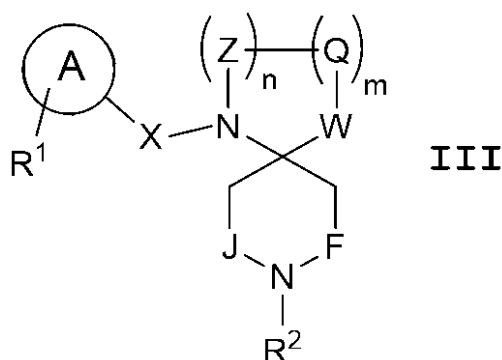


式中、J 及び F は、同じであるか異なっていて、 CH_2 、 CHD 、又は CD_2 である（式中、D は、重水素である）。

20

【請求項 4】

前記化合物が、以下の式 I I I の構造に一致する系列 C - 2 の化合物である、請求項 1 に記載の方法。

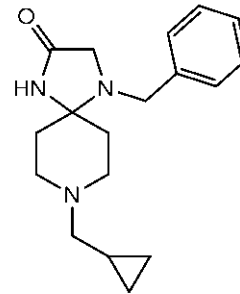
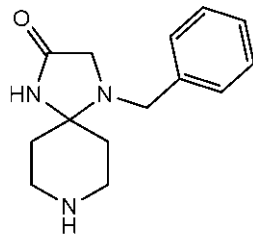
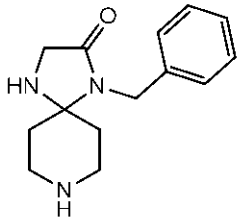
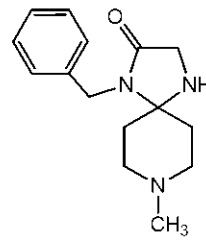
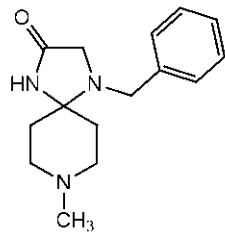
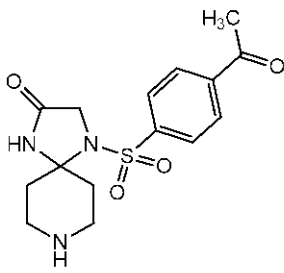


式中、J 及び F は、同じであるか異なっていて、 CH_2 、 CHD 、又は CD_2 であり（式中、D は、重水素である）、かつ m 及び n は、それぞれ、1 である。

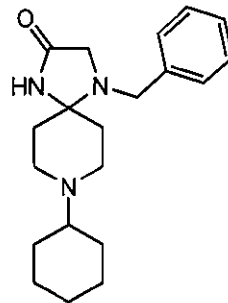
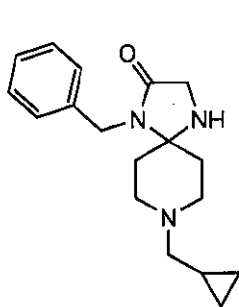
【請求項 5】

前記化合物が、以下で示される式を有する化合物と構造が一致する、請求項 4 に記載の方法。

40



10



20

及び

【請求項 6】

30

前記投与が、複数回行われる、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 7】

前記投与が、毎日行われる、請求項 6 に記載の方法

【請求項 8】

前記投与が、毎日複数回行われる、請求項 6 に記載の方法。

【請求項 9】

前記薬学的組成物が、液状である、請求項 2 に記載の方法。

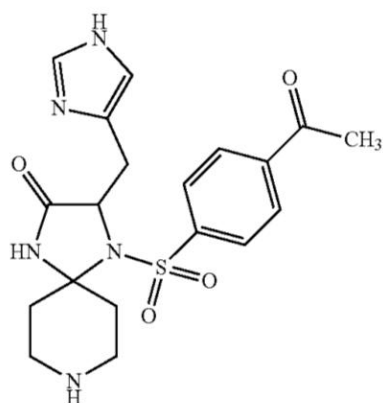
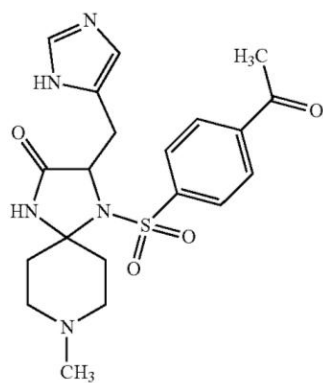
【請求項 10】

前記薬学的組成物が、固形である、請求項 2 に記載の方法。

【請求項 11】

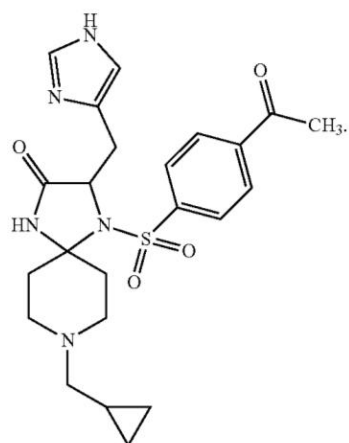
40

前記化合物が、以下で示される式と構造が一致する系列 C - 2 の化合物である、請求項 1 に記載の方法。



10

及び



20

30

40

50