

【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 61K 31/438(2006.01)

10

A 61P 43/00(2006.01)

A 61P 25/00(2006.01)

A 61P 29/00(2006.01)

A 61P 25/28(2006.01)

A 61K 9/08(2006.01)

A 61K 9/20(2006.01)

A 61P 31/04(2006.01)

C 07K 14/47(2006.01)

C 07K 7/06(2006.01)

【F I】

20

A 61K 31/438

A 61P 43/00 1 1 1

A 61P 25/00 Z N A

A 61P 29/00

A 61P 25/28

A 61K 9/08

A 61K 9/20

A 61P 31/04

C 07K 14/47

C 07K 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】

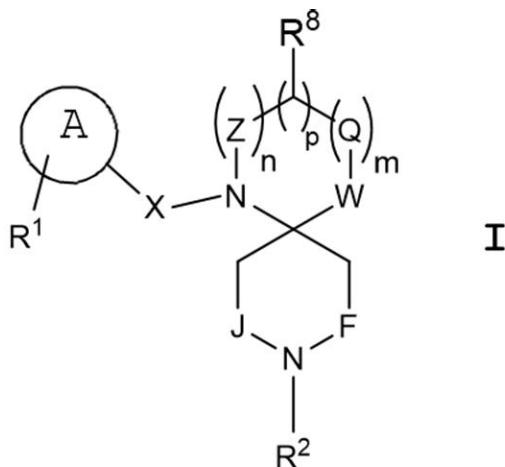
【特許請求の範囲】

【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有する細胞に、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。

50



10

式中、

Q は、 $C H R^9$ 又は $C(O)$ であり、 Z は、 $C H R^{10}$ 又は $C(O)$ であり、 かつ Q 及び Z のうち 1 つだけが $C(O)$ 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、 $N R^7$ 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 、 $C(H)$ $v(D)_h$ (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)、 $C(H)_q(D)_r$ - 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 $q + r = 0, 1, \text{ 又は } 2$ 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；

J 及び F は、 同じであるか異なっていて、 $C H_2$ 、 $C H D$ 、 又は $C D_2$ である (式中、 D は、 重水素である)；

X は、 $S O_2$ 、 $C(O)$ 、 $C H_2$ 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；

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いてもよく、 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カルボニル、 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 $N R^3 R^4$ 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になって五員～七員環を形成し、 形成された環は隨意に 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)、 $M Ar$ (式中、 M は、 $-C H_2-$ 、 $-O-$ 、 又は $-N=N-$ であり、 かつ $A r$ は、 単環のアリール又はヘテロアリール基である)、 及び $N R^5 R^6$ (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になって五員～七員環を形成し、 形成された環は隨意に 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；

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

20

30

40

50

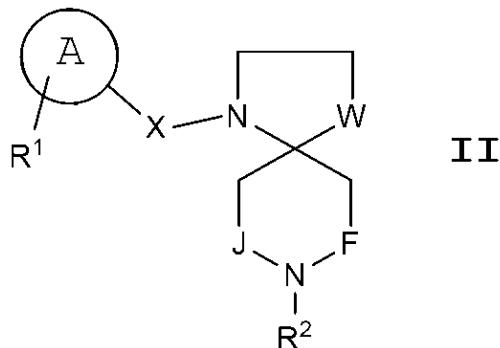
は、無置換であるか、又は上限 3 個までの原子で置換され、該原子は、同じであるか異なっていて、酸素又は窒素原子である。

【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 II 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。

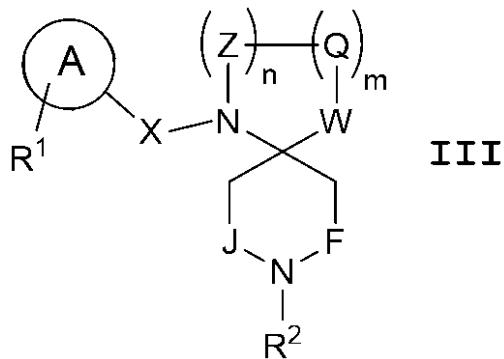


10

式中、J 及び F は、同じであるか異なっていて、CH₂、CHD、又はCD₂である（式中、D は、重水素である）。

【請求項 4】

前記化合物が、以下の式 III 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。



30

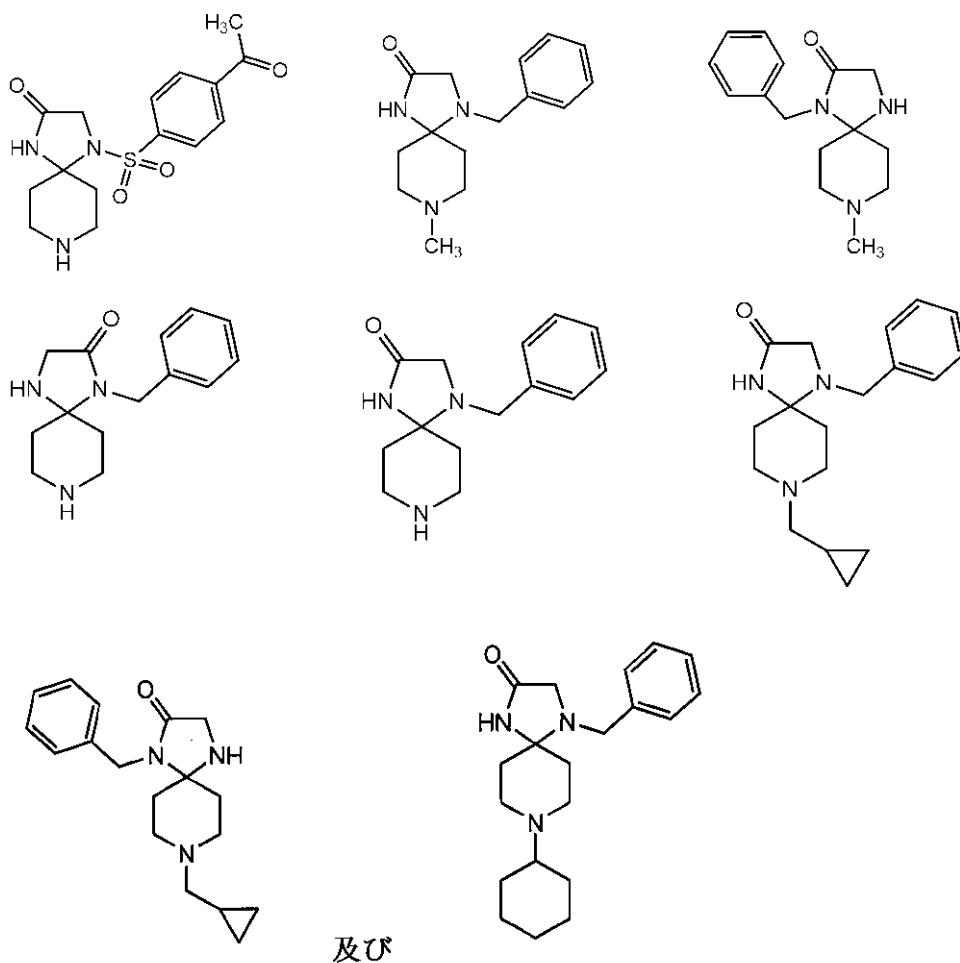
式中、J 及び F は、同じであるか異なっていて、CH₂、CHD、又はCD₂であり（式中、D は、重水素である）、かつ m 及び n は、それぞれ、1 である。

【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

50

**【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。

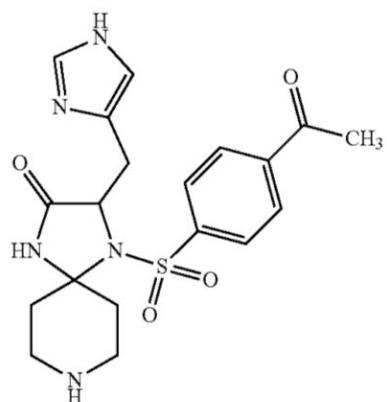
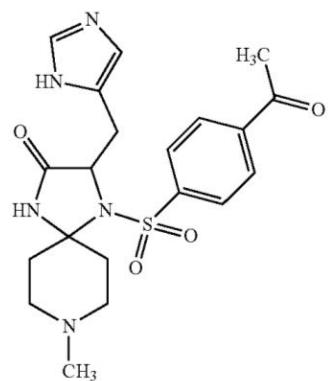
【請求項 10】

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】

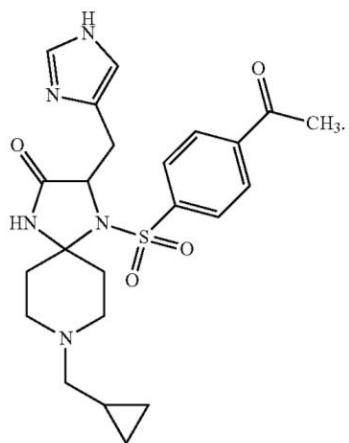
40

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