

【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2年11月26日(2020.11.26)

【公表番号】特表2020-530023(P2020-530023A)

【公表日】令和2年10月15日(2020.10.15)

【年通号数】公開・登録公報2020-042

【出願番号】特願2020-506974(P2020-506974)

【国際特許分類】

C 07 D 491/147 (2006.01)

A 61 K 31/4985 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

C 07 D 487/04 (2006.01)

【F I】

C 07 D 491/147 C S P

A 61 K 31/4985

A 61 P 13/12

A 61 P 3/10

A 61 P 43/00 1 1 1

C 07 D 487/04 1 4 0

【手続補正書】

【提出日】令和2年2月7日(2020.2.7)

【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

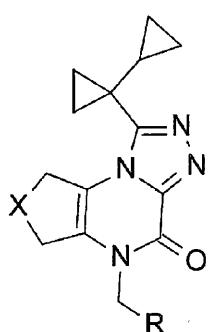
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式:

【化1】



[式中、

XがCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>、またはCH<sub>2</sub>Oであり、

Rがエチル、n-プロピル、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

ただし、XがCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>であるとき、Rがシクロプロピル以外である]

の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項2】

X が  $\text{OCH}_2$  である、請求項 1 に記載の化合物または塩。

**【請求項 3】**

X が  $\text{CH}_2\text{O}$  である、請求項 1 に記載の化合物または塩。

**【請求項 4】**

R がシクロプロピルである、請求項 1 に記載の化合物または塩。

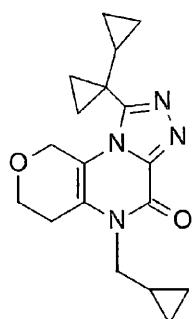
**【請求項 5】**

R が n - プロピルである、請求項 1 に記載の化合物または塩。

**【請求項 6】**

式：

**【化 2】**



である、請求項 1 に記載の化合物または塩。

**【請求項 7】**

式：

**【化 3】**

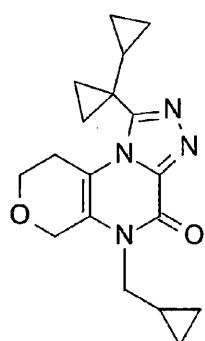


である、請求項 6 に記載の化合物。

**【請求項 8】**

式：

**【化 4】**

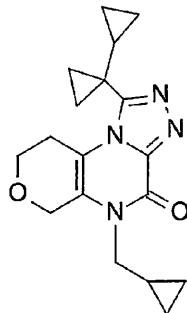


である、請求項 1 に記載の化合物または塩。

**【請求項 9】**

式：

**【化 5】**



である、請求項 8 に記載の化合物。

**【請求項 10】**

患者における慢性腎疾患を治療するための薬学的組成物であって、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含む、薬学的組成物。

**【請求項 11】**

患者における糖尿病性腎疾患を治療するための薬学的組成物であって、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含む、薬学的組成物。

**【請求項 12】**

療法において使用するための、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

**【請求項 13】**

慢性腎疾患の治療に使用するための、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

**【請求項 14】**

糖尿病性腎疾患の治療に使用するための、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

**【請求項 15】**

請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を、1 つ以上の薬学的に許容される担体、希釈剤、または賦形剤とともに含む、薬学的組成物。

**【請求項 16】**

請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を、1 つ以上の薬学的に許容される担体、希釈剤、または賦形剤と混合することを含む、薬学的組成物を調製するためのプロセス。

**【手続補正 2】**

**【補正対象書類名】**明細書

**【補正対象項目名】**0 2 3 3

**【補正方法】**変更

**【補正の内容】**

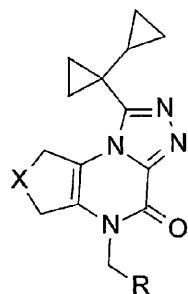
**【0 2 3 3】**

表 1、2、および 3 のデータは、実施例 1 ~ 8 の化合物が、インビトロでヒト PDE3A、PDE4D、および PDE6AB と比較して、ヒト PDE1A、PDE1B、および PDE1C の選択的阻害剤であることを実証している。

本発明は以下の態様を含みうる。

[1] 式：

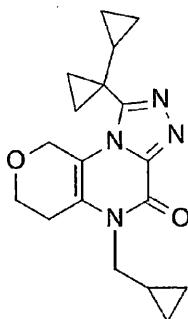
## 【化59-1】



[式中、

XがCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>またはCH<sub>2</sub>Oであり、Rがエチル、n-プロピル、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、ただし、XがCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>のとき、Rがシクロプロピル以外である】  
の化合物またはその薬学的に許容される塩。[2] XがOCH<sub>2</sub>である、上記[1]に記載の化合物または塩。[3] XがCH<sub>2</sub>Oである、上記[1]に記載の化合物または塩。[4] Rがシクロプロピルである、上記[1]に記載の化合物または塩。[5] Rがn-プロピルである、上記[1]に記載の化合物または塩。[6] 式：

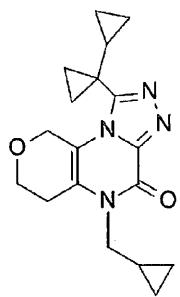
## 【化59-2】



である、上記[1]に記載の化合物または塩。

[7] 式：

## 【化59-3】



である、上記[6]に記載の化合物。

[8] 式：

## 【化59-4】



である、上記〔1〕に記載の化合物または塩。

〔9〕式：

## 【化59-5】



である、上記〔8〕に記載の化合物。

〔10〕患者における慢性腎疾患を治療する方法であって、それを必要とする患者に、有効量の、上記〔1〕～〔9〕のいずれか1項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を投与することを含む、方法。

〔11〕患者における糖尿病性腎疾患を治療する方法であって、それを必要とする患者に、有効量の、上記〔1〕～〔9〕のいずれか1項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を投与することを含む、方法。

〔12〕療法において使用するための、上記〔1〕～〔9〕のいずれか1項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

〔13〕慢性腎疾患の治療に使用するための、上記〔1〕～〔9〕のいずれか1項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

〔14〕糖尿病性腎疾患の治療に使用するための、上記〔1〕～〔9〕のいずれか1項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

〔15〕上記〔1〕～〔9〕のいずれか1項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を、1つ以上の薬学的に許容される担体、希釈剤、または賦形剤とともに含む、薬学的組成物。

〔16〕上記〔1〕～〔9〕のいずれか1項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を、1つ以上の薬学的に許容される担体、希釈剤、または賦形剤と混合することを含む、薬学的組成物を調製するためのプロセス。