

【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 3 年 1 月 7 日 (2021.1.7)

【公表番号】特表 2019-535761 (P2019-535761A)

【公表日】令和 1 年 12 月 12 日 (2019.12.12)

【年通号数】公開・登録公報 2019-050

【出願番号】特願 2019-527497 (P2019-527497)

【国際特許分類】

C 07D 471/04 (2006.01)

A 61P 11/00 (2006.01)

A 61P 43/00 (2006.01)

A 61P 29/00 (2006.01)

A 61P 17/00 (2006.01)

A 61P 27/16 (2006.01)

A 61P 1/00 (2006.01)

A 61P 13/02 (2006.01)

A 61P 19/02 (2006.01)

A 61P 11/14 (2006.01)

A 61P 11/06 (2006.01)

A 61P 1/04 (2006.01)

C 07D 473/30 (2006.01)

C 07D 487/04 (2006.01)

C 07D 513/04 (2006.01)

C 07D 498/04 (2006.01)

A 61K 31/522 (2006.01)

A 61K 31/519 (2006.01)

A 61K 31/53 (2006.01)

A 61K 31/5025 (2006.01)

【F I】

C 07D 471/04 1 1 7 N

A 61P 11/00

A 61P 43/00 1 1 1

A 61P 29/00

A 61P 17/00

A 61P 27/16

A 61P 1/00

A 61P 13/02

A 61P 19/02

A 61P 11/14

A 61P 11/06

A 61P 1/04

C 07D 473/30 C S P

C 07D 471/04 1 1 8 Z

C 07D 487/04 1 4 4

C 07D 487/04 1 4 2

C 07D 487/04 1 4 7

C 07D 513/04 3 5 5

C 07D 487/04 1 4 0

C 07D 471/04 1 1 7 A

C 0 7 D	487/04	1 4 6
C 0 7 D	498/04	1 0 5
A 6 1 K	31/522	
A 6 1 K	31/519	
A 6 1 K	31/53	
A 6 1 K	31/5025	
C 0 7 D	487/04	1 4 8
C 0 7 D	471/04	1 1 9

【手続補正書】

【提出日】令和2年11月20日(2020.11.20)

【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

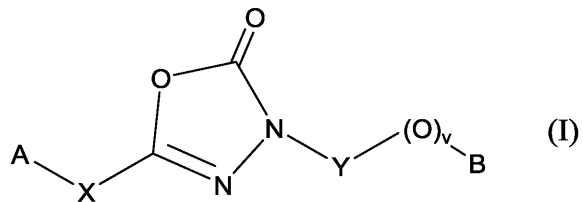
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

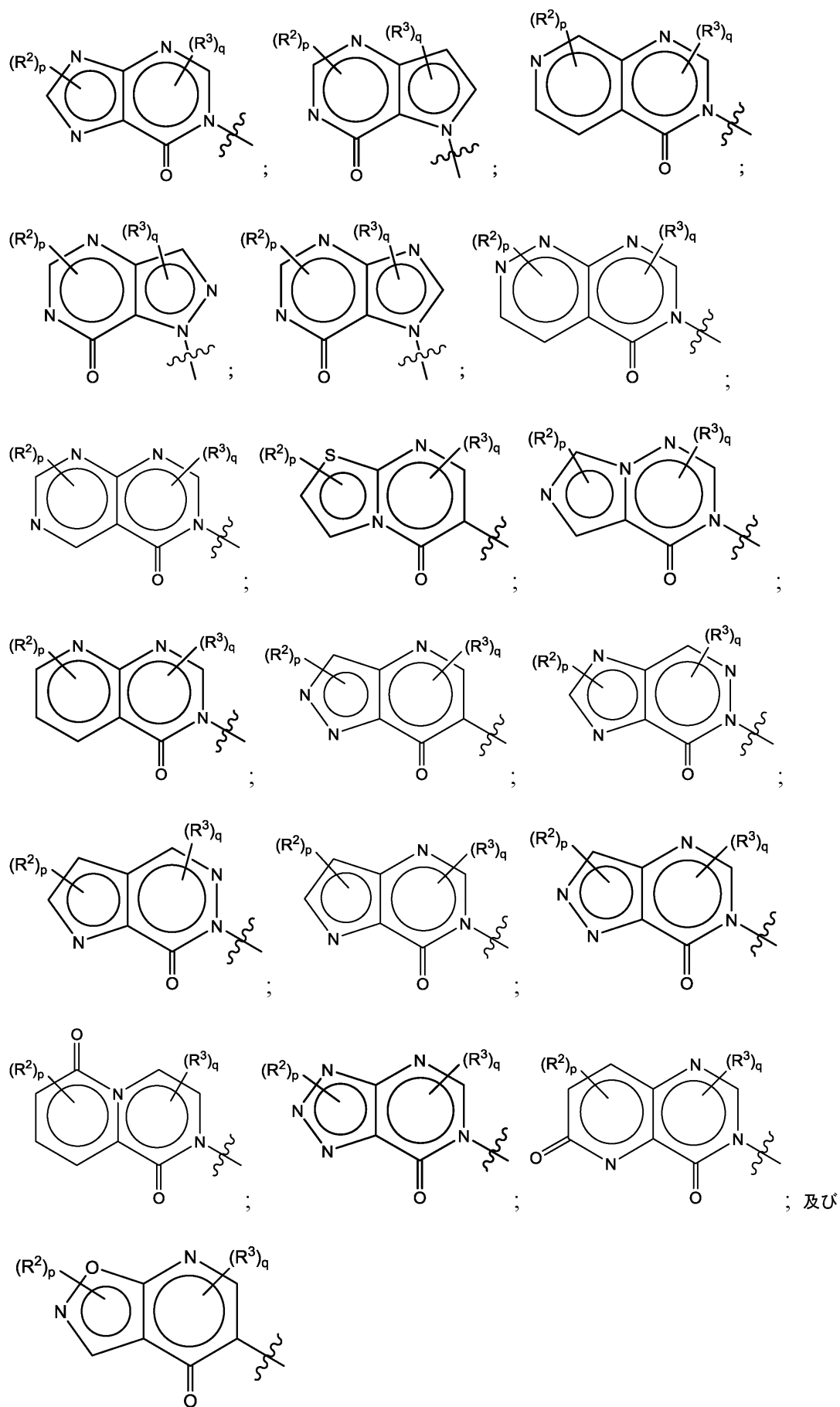
【化1】



[ 式中、

A は、以下：

【化 2】



[ 式中、

各  $R^2$  は、 $-C_{1-4}$  アルキル、 $-ハロC_{1-4}$  アルキル、 $-CN$ 、ハロ、 $-C(O)CH_3$ 、ジウテリウム、及び  $-ジウテリオ-C_{1-4}$  アルキル から独立に選択され、 $p$  は、0、1 又は 2 であり；

$R^3$  は、 $-C_{1-4}$  アルキル、 $-ハロC_{1-4}$  アルキル、 $-CN$ 、ハロ、ジウテリウム、及び  $-ジウテリオ-C_{1-4}$  アルキル から選択され；そして

$q$  は、0 又は 1 である]

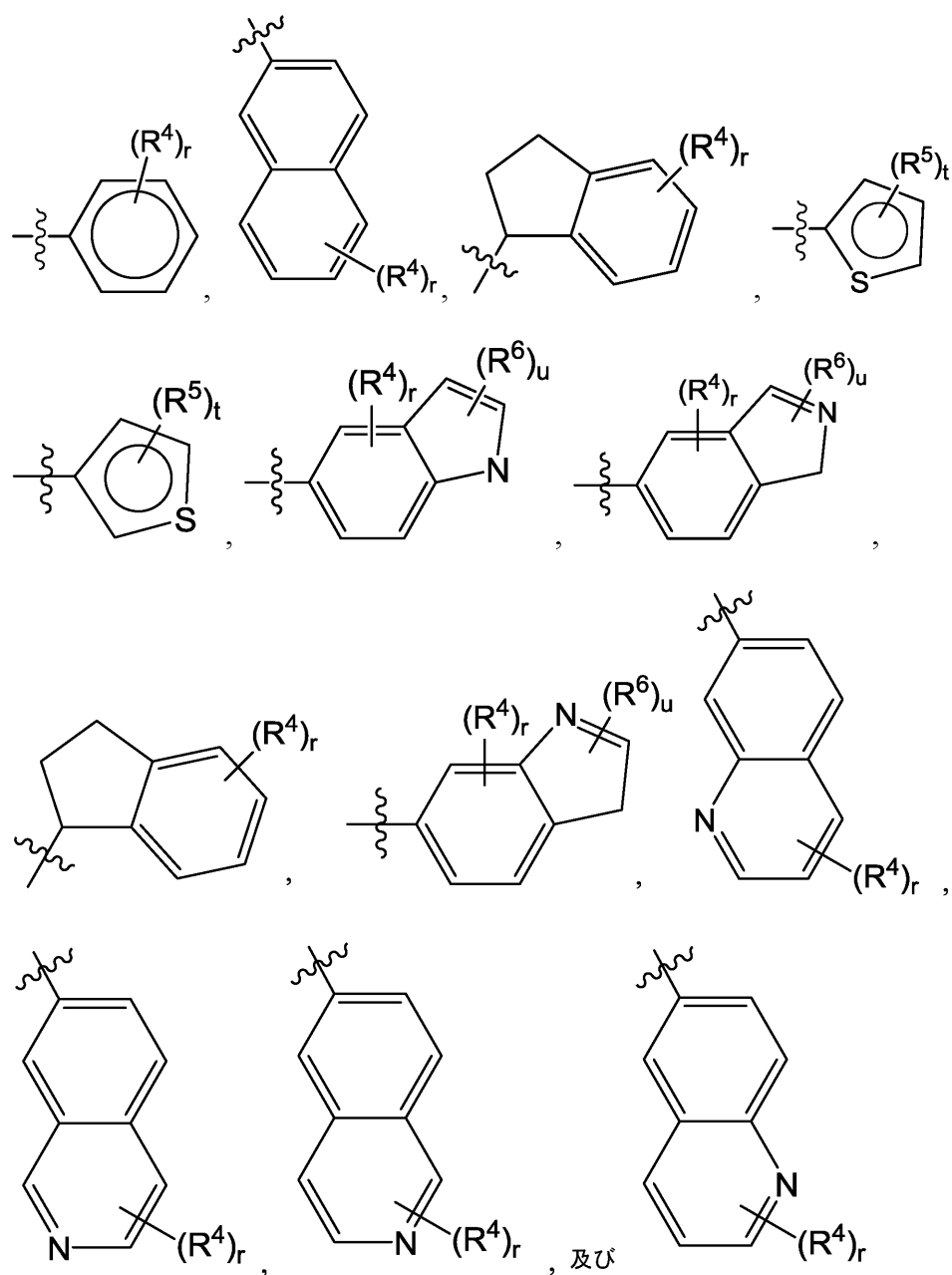
から選択され；

$X$  は、 $-CH_2-$  であり；

$Y$  は、置換及び非置換の  $C_{1-4}$  アルキレン、 $C_{2-4}$  アルケニレン及び  $C_{3-6}$  シクロアルキレン から選択され、ここで、置換  $C_{1-4}$  アルキレン、置換  $C_{2-4}$  アルケニレン及び置換  $C_{3-6}$  シクロアルキレンは、ハロ、 $-C_{1-4}$  アルキル、 $-OH$  及び  $-C_{3-4}$  シクロアルキルのうちの 1 個で置換されている、 $C_{1-4}$  アルキレン、 $C_{2-4}$  アルケニレン及び  $C_{3-6}$  シクロアルキレン であり；

$B$  は、以下：

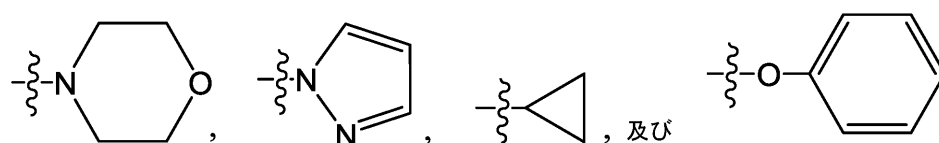
## 【化 3】



[ 式中、

$r$  は、0、1 及び 2 から独立に選択され、 $R^4$  は、 $C_{1-4}$  アルキル、ハロ  $C_{1-4}$  アルキル、ハロゲン、 $-OCHF_2$ 、 $-CN$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-OCH_3$ 、 $-フェニル$ 、

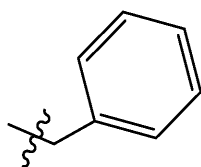
【化 4】



から選択され；

$t$  は、0 及び 1 から選択され、 $R^5$  は、ハロゲンであり；そして

u は、0 及び 1 から選択され、 $R^6$  は、 $C_{1-4}$  アルキル；及び  
【化 5】



から選択される]

から選択され；そして

v は、0 又は 1 である]

で示される化合物、又は薬学的に許容し得るその塩。

【請求項 2】

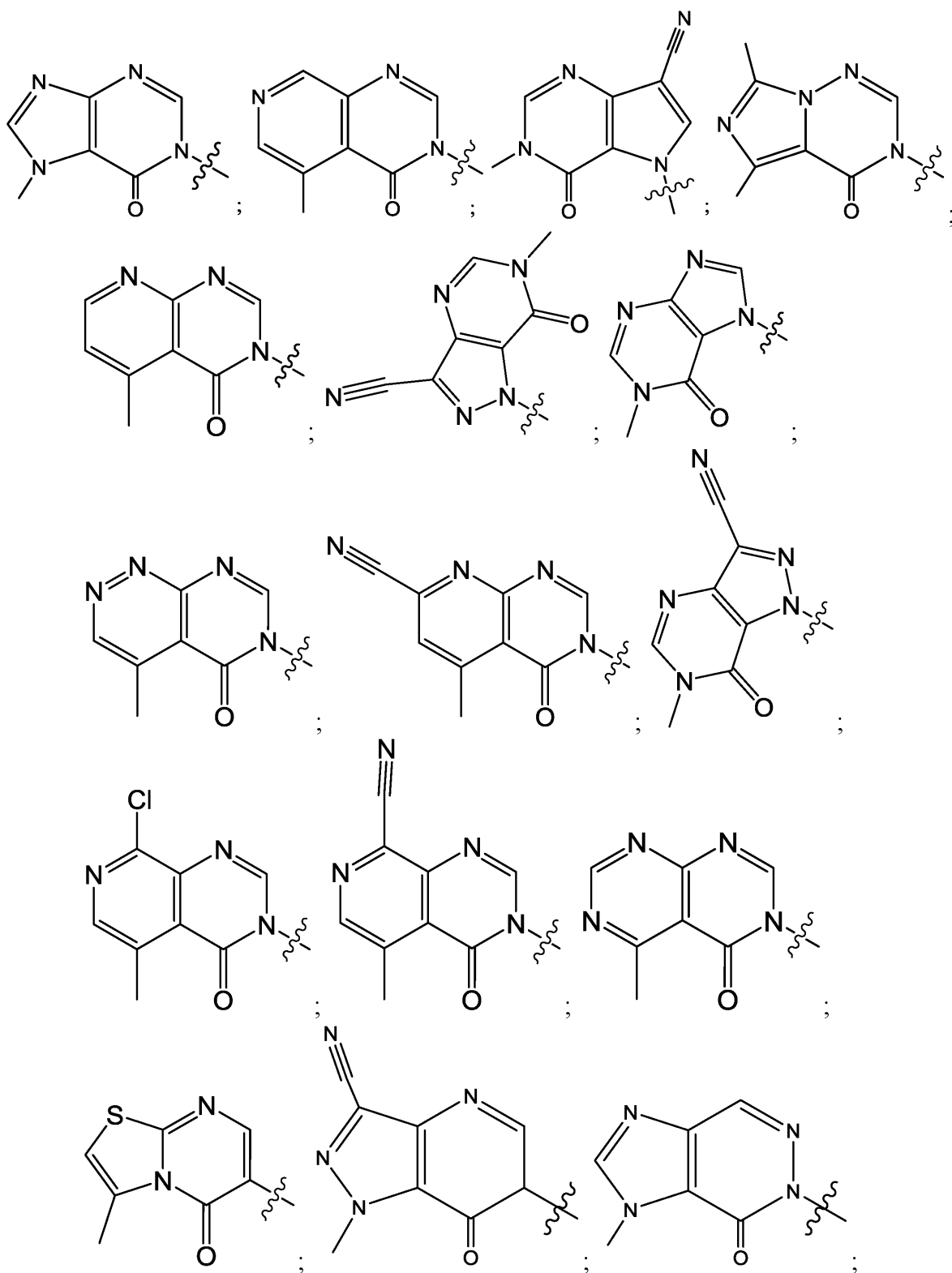
各  $R^2$  が、ジウテリウム、 $-CH_3$ 、 $-CD_3$ 、 $-C(O)CH_3$ 、 $-CN$ 、 $-Cl$ 、及び F から独立に選択され；そして

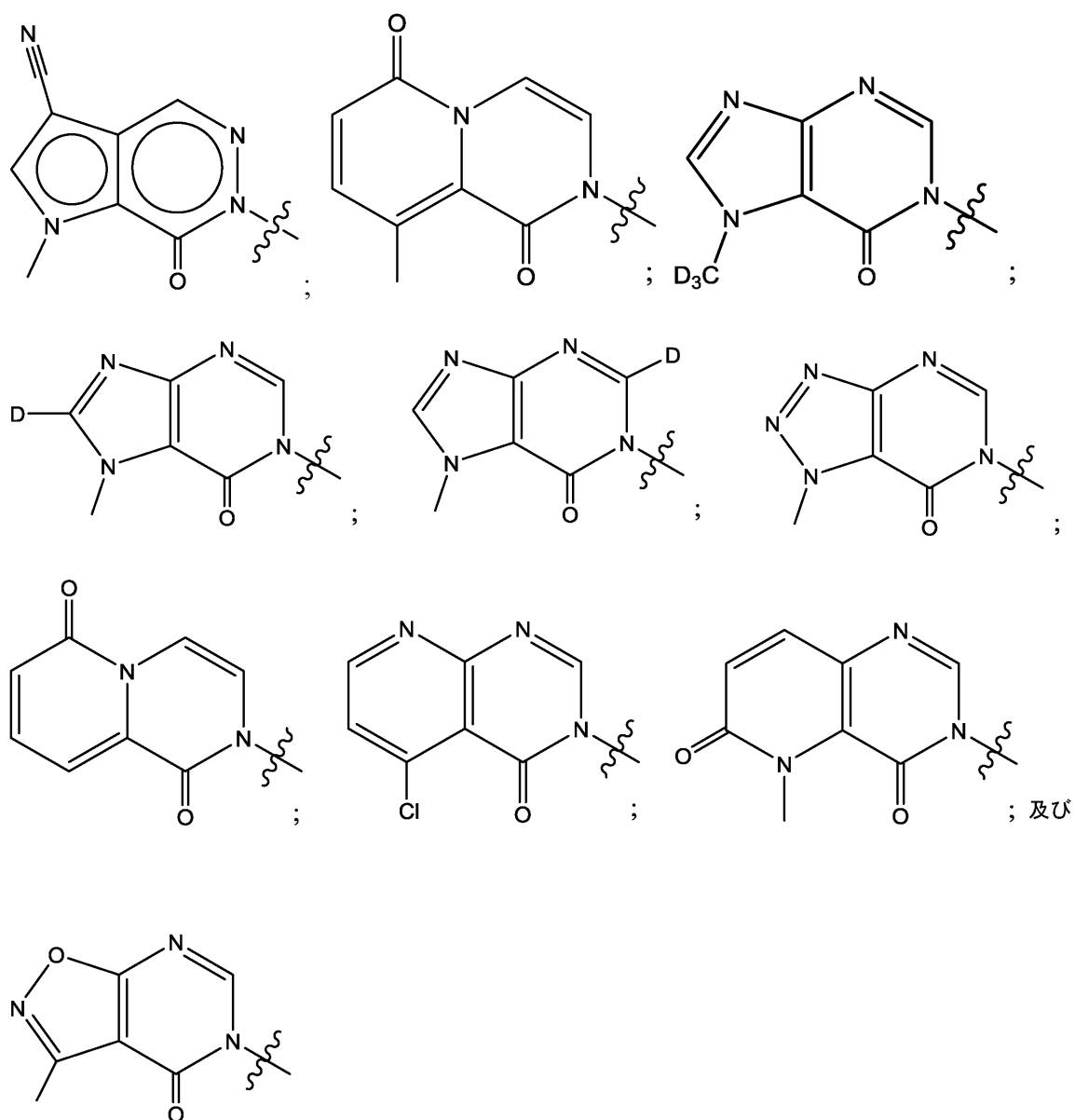
$R^3$  が、ジウテリウム及び  $-CN$  から選択される、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

A が、以下：

## 【化 6】





から選択される、請求項 1 又は 2 のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 4】

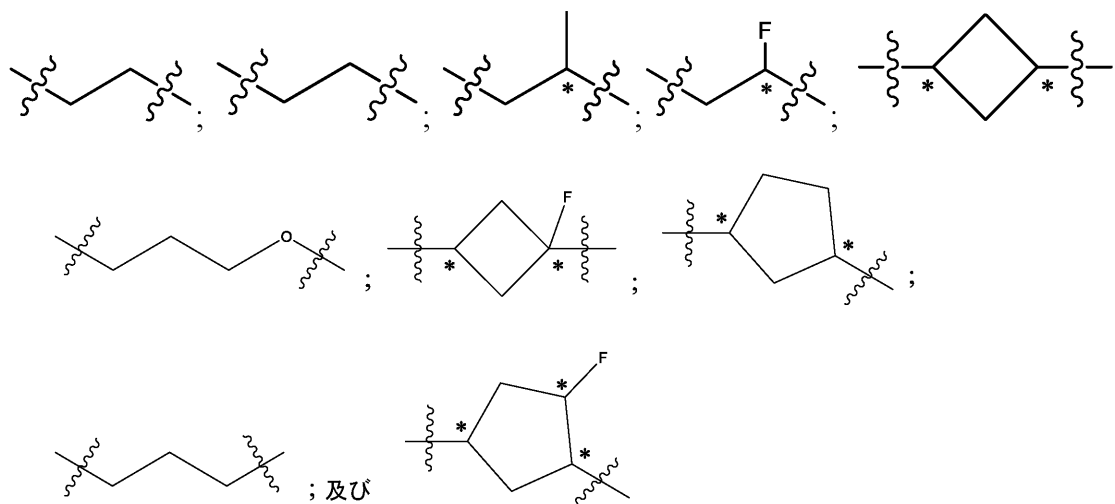
Y が、F、 $-CH_3$ 、 $-OH$  又は  $-シクロプロピル$  で置換されている、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 5】

Y が、以下：



## 【化 7】



[ 式中、\* は、キラル中心であって、( i ) R 立体配置若しくは S 立体配置の、又は ( ii ) 複数の式 ( I ) で示される化合物について R 及び S 立体配置の混合物の、キラル中心を意味する ]

から選択される、請求項 1 ～ 4 のいずれか一項記載の化合物。

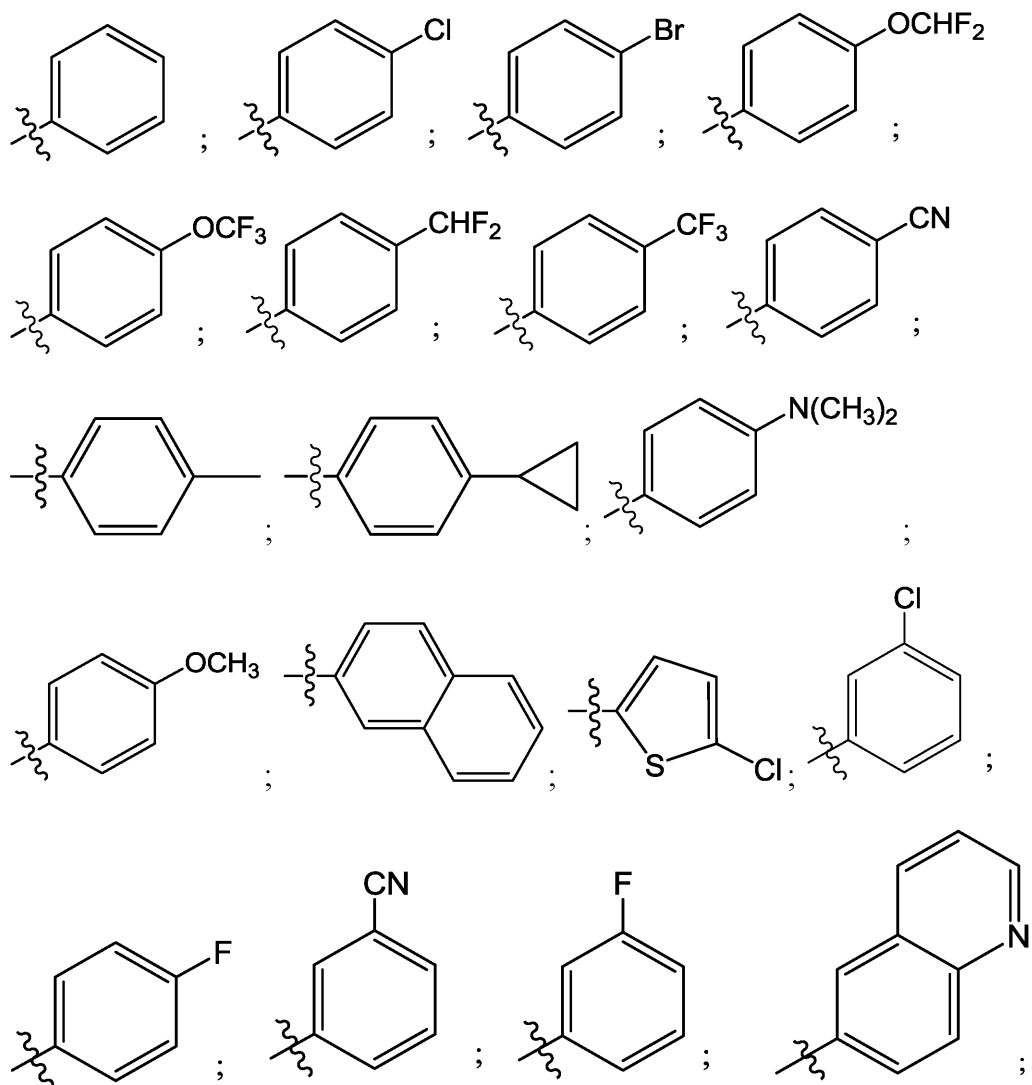
## 【請求項 6】

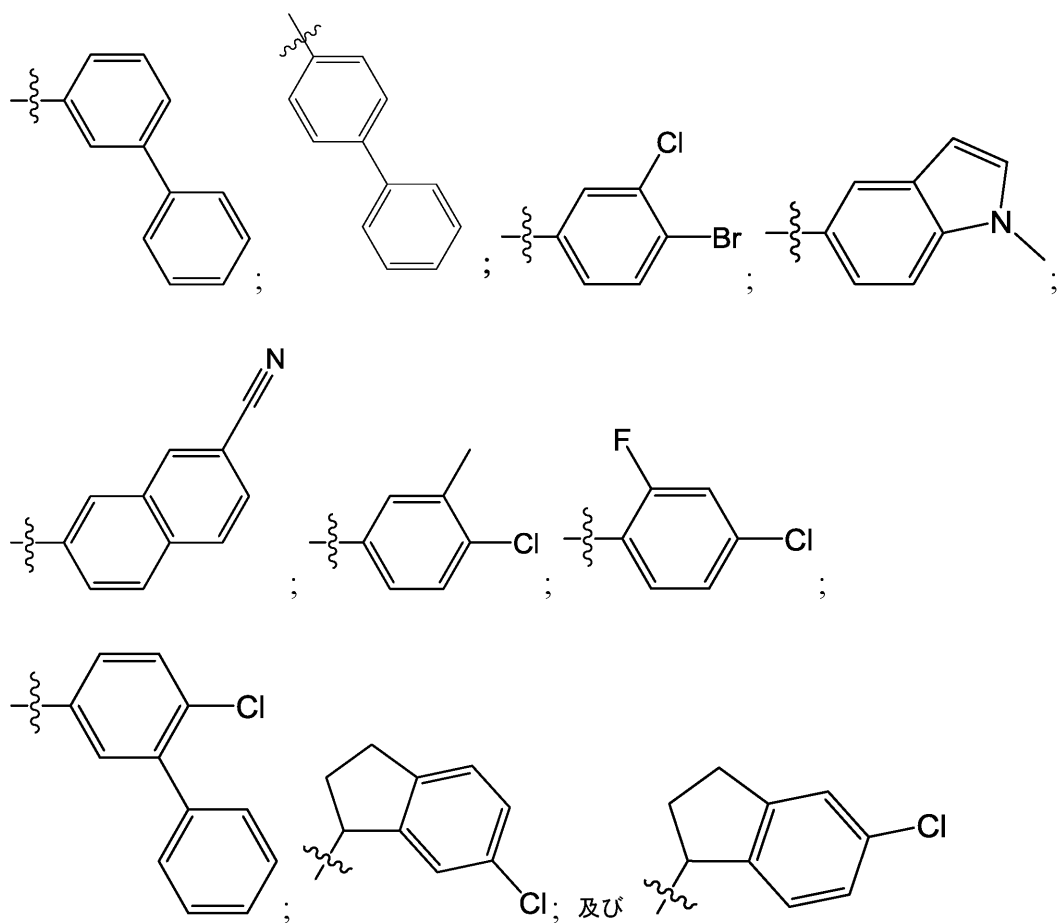
ハロ C<sub>1</sub> - 4 アルキルが、- C H F<sub>2</sub> 及び - C F<sub>3</sub> から選択され；そして C<sub>1</sub> - 4 アルコキシが、- O C H<sub>3</sub> である、請求項 1 ～ 5 のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 7】

B が、以下：

## 【化 8】



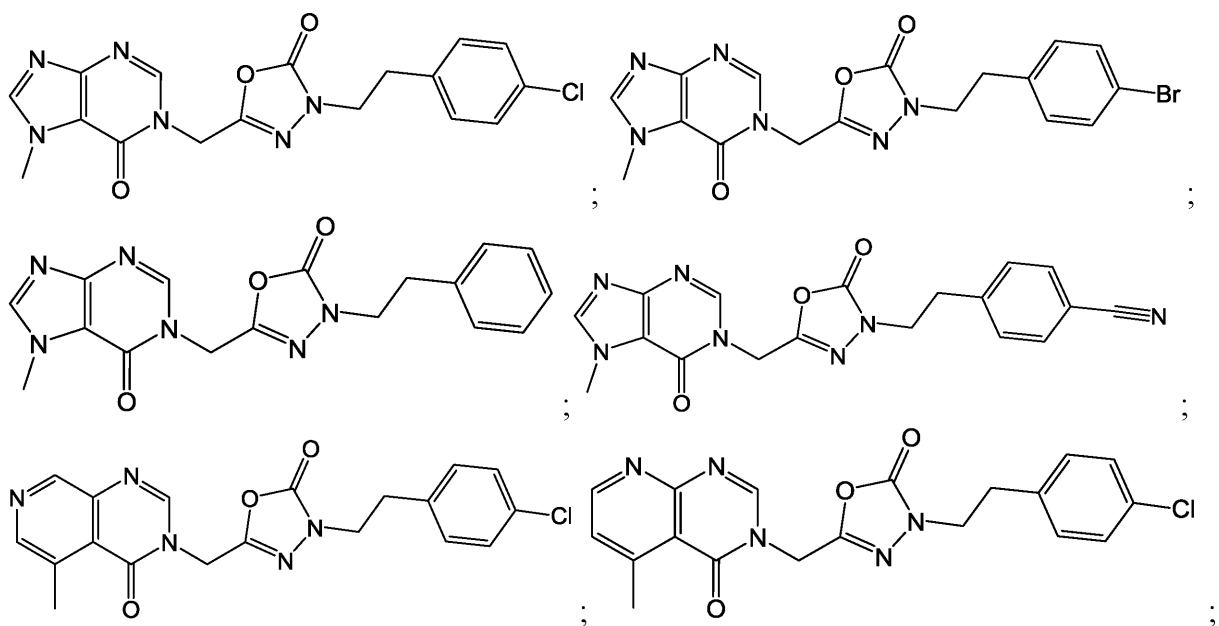


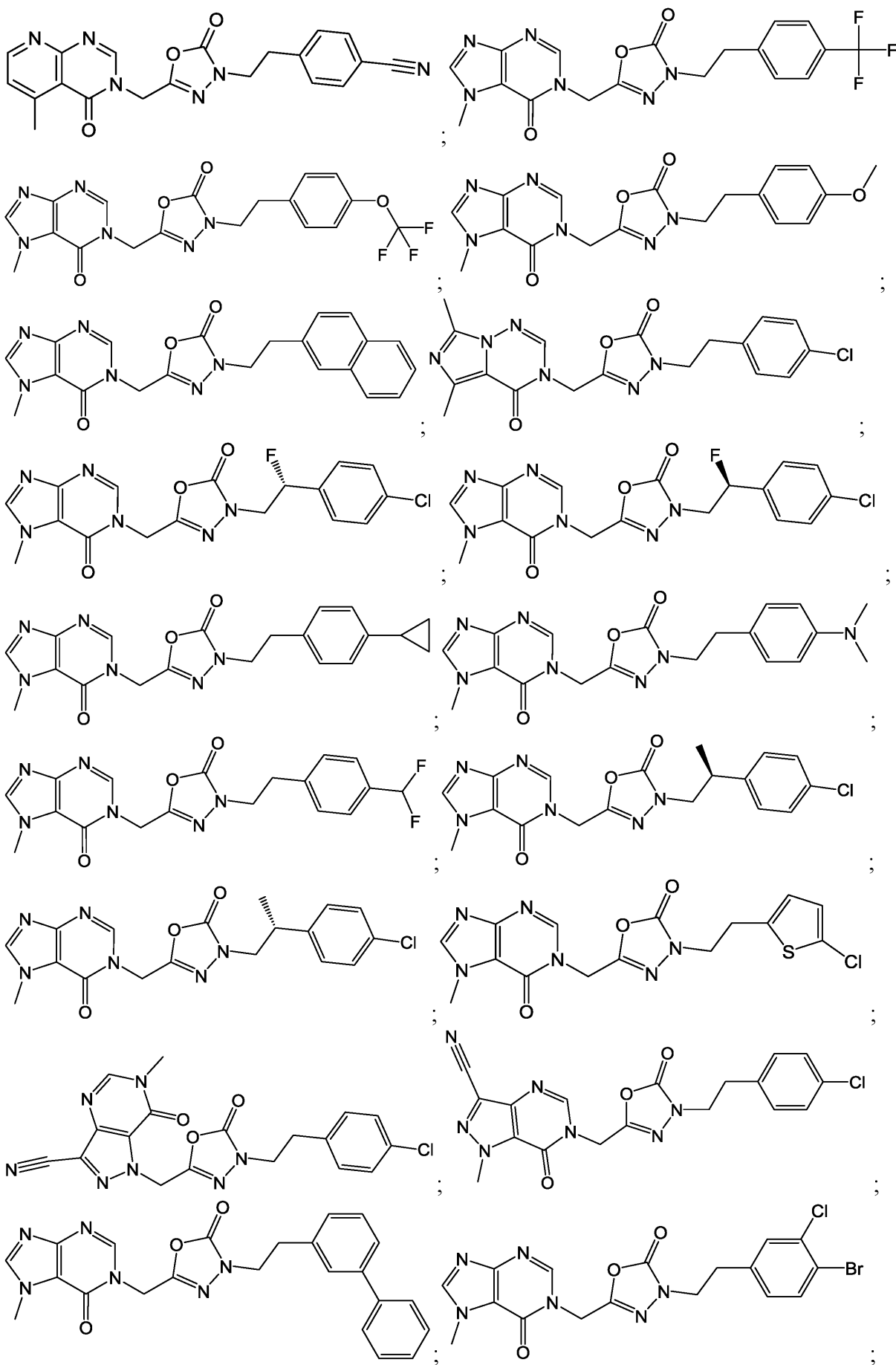
から選択される、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項記載の化合物。

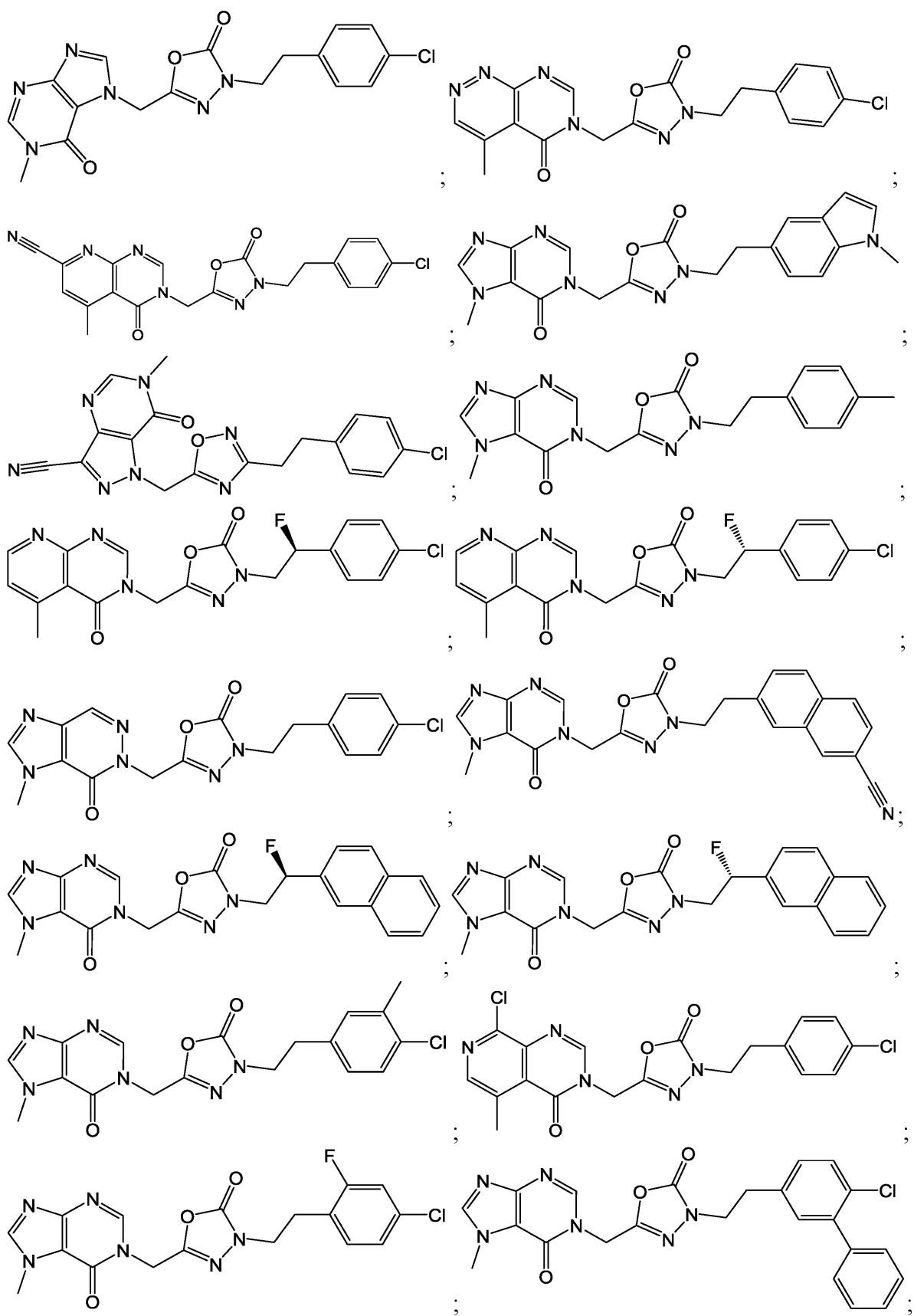
【請求項 8】

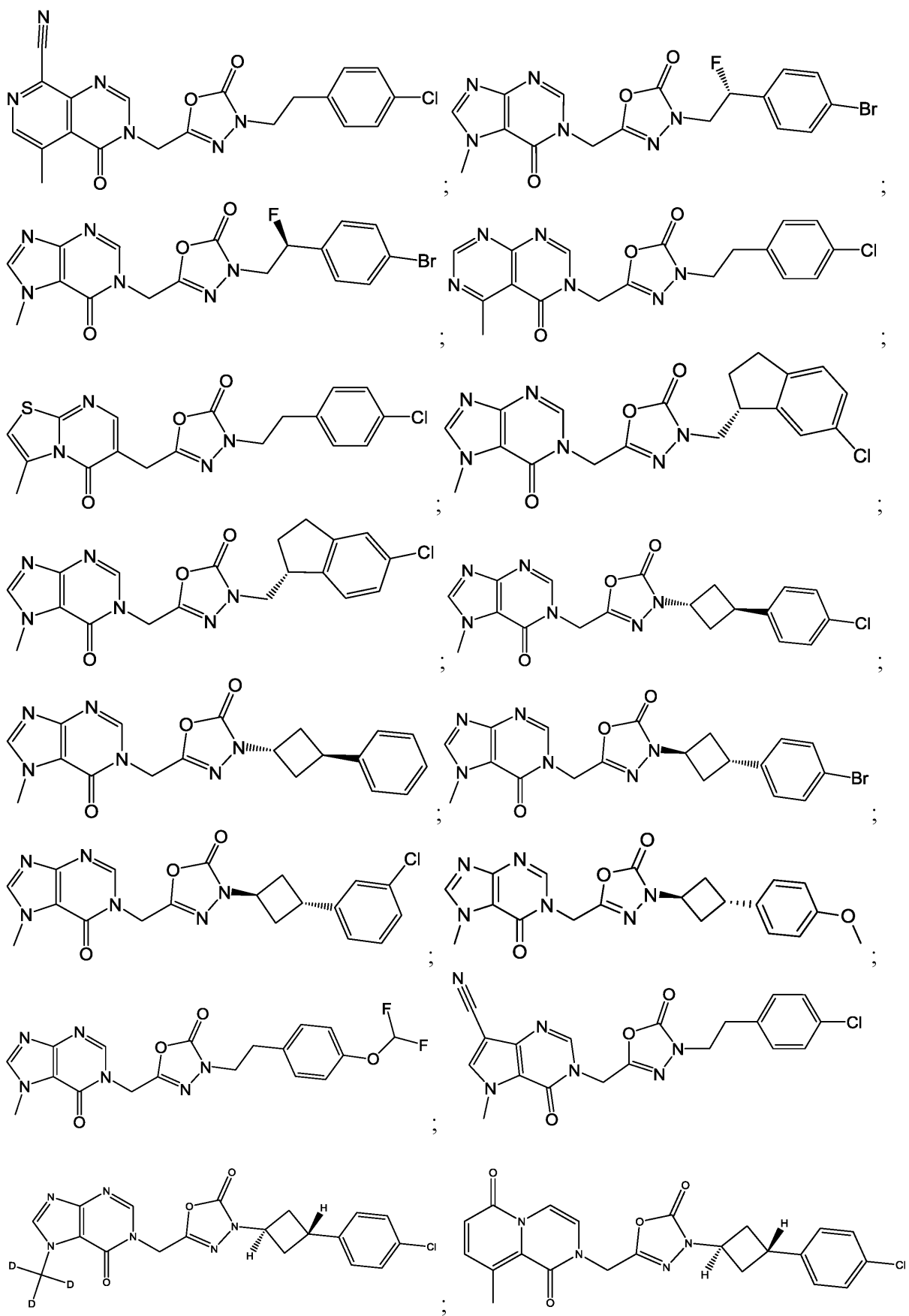
以下：

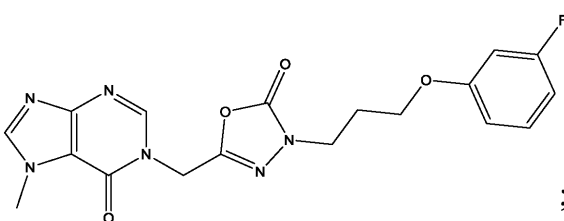
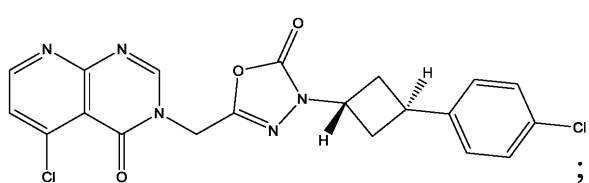
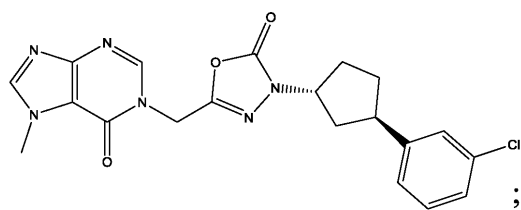
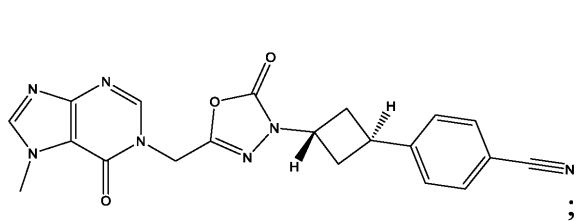
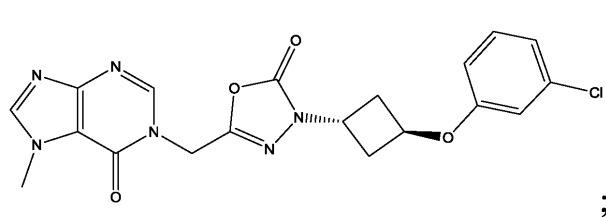
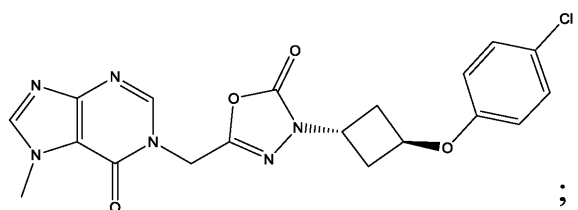
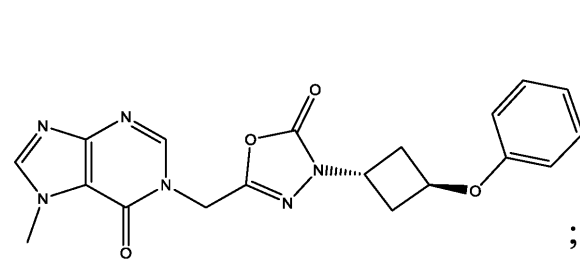
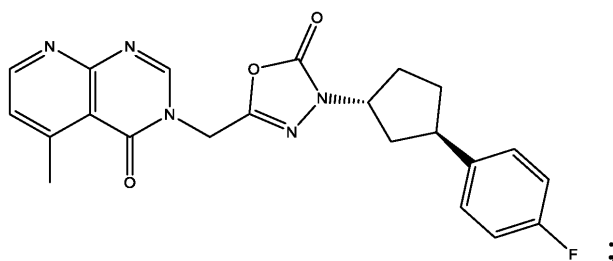
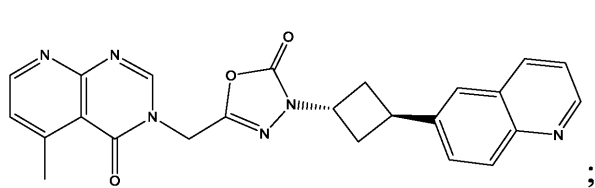
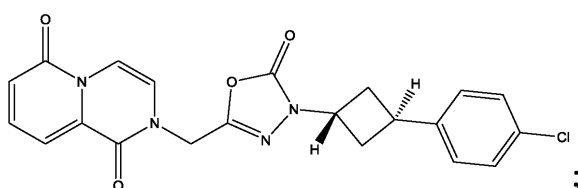
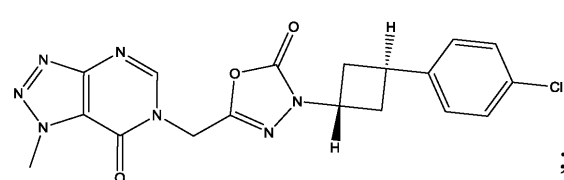
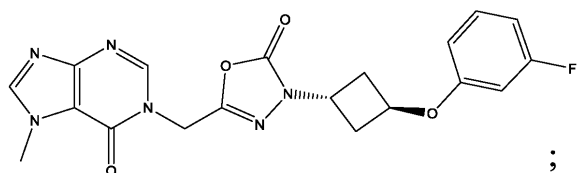
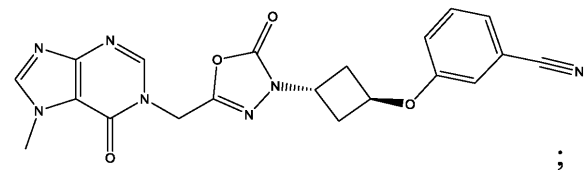
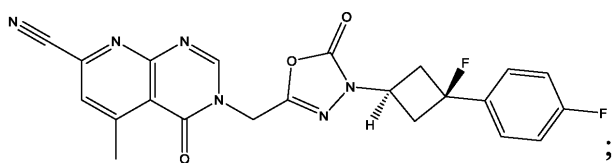
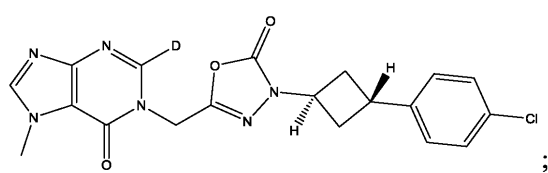
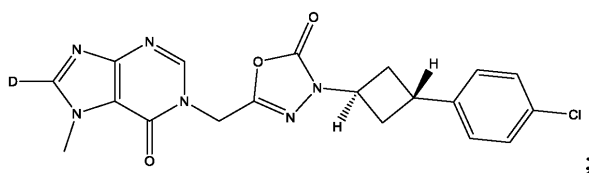
【化 9】

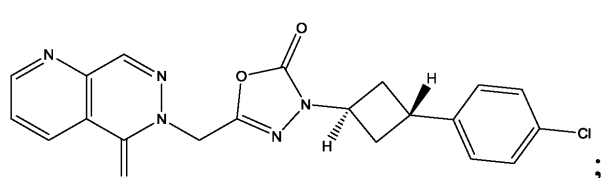
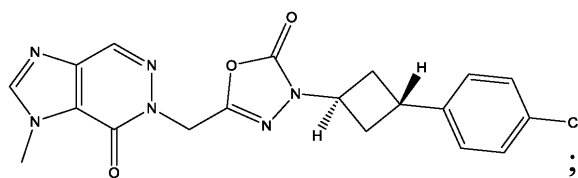
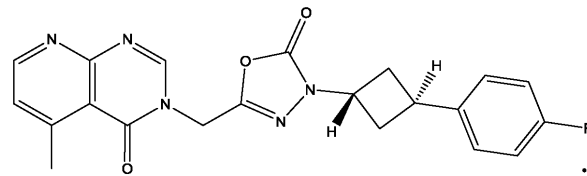
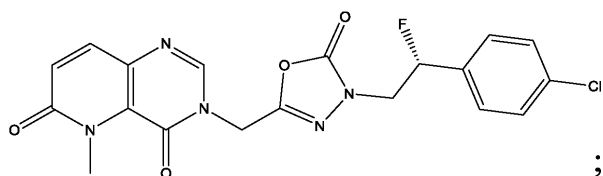
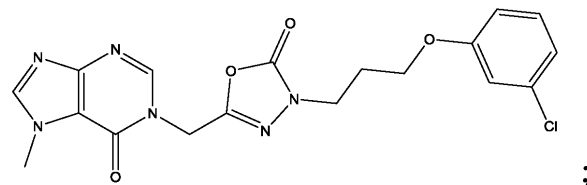
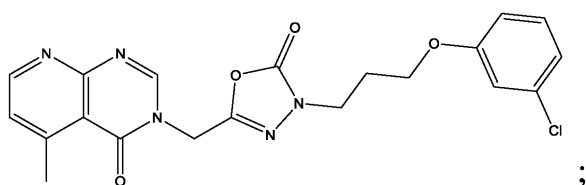
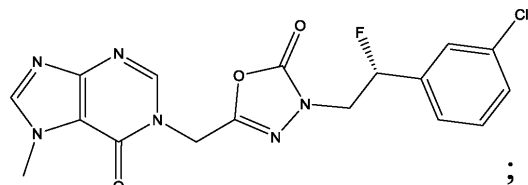
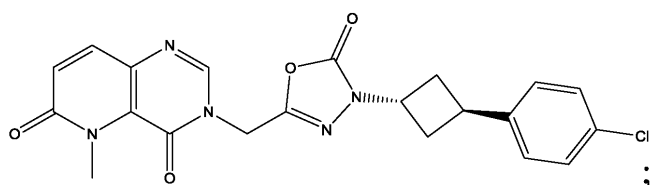
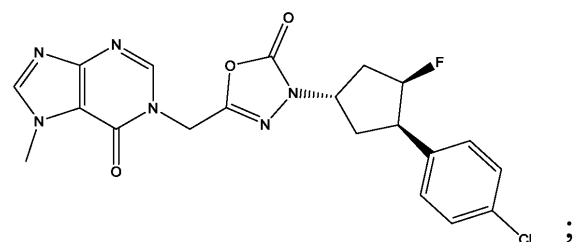
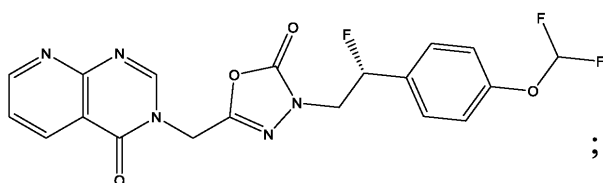
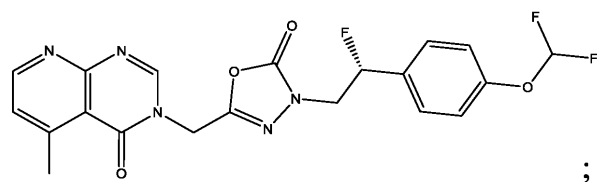
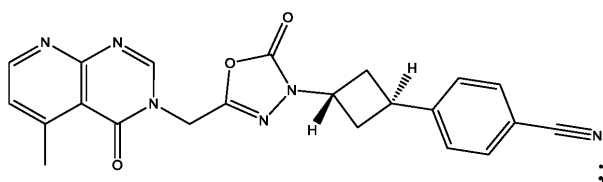
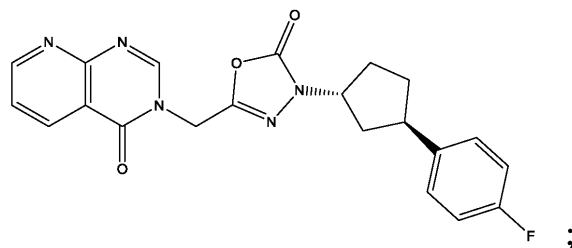
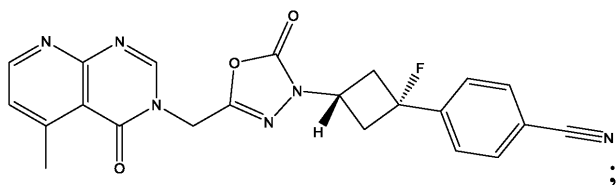
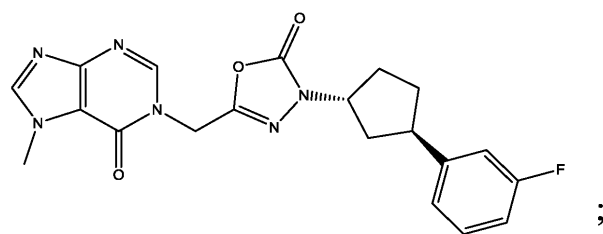
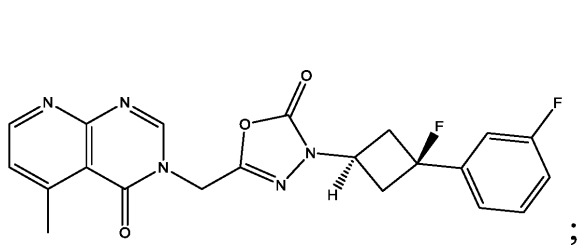




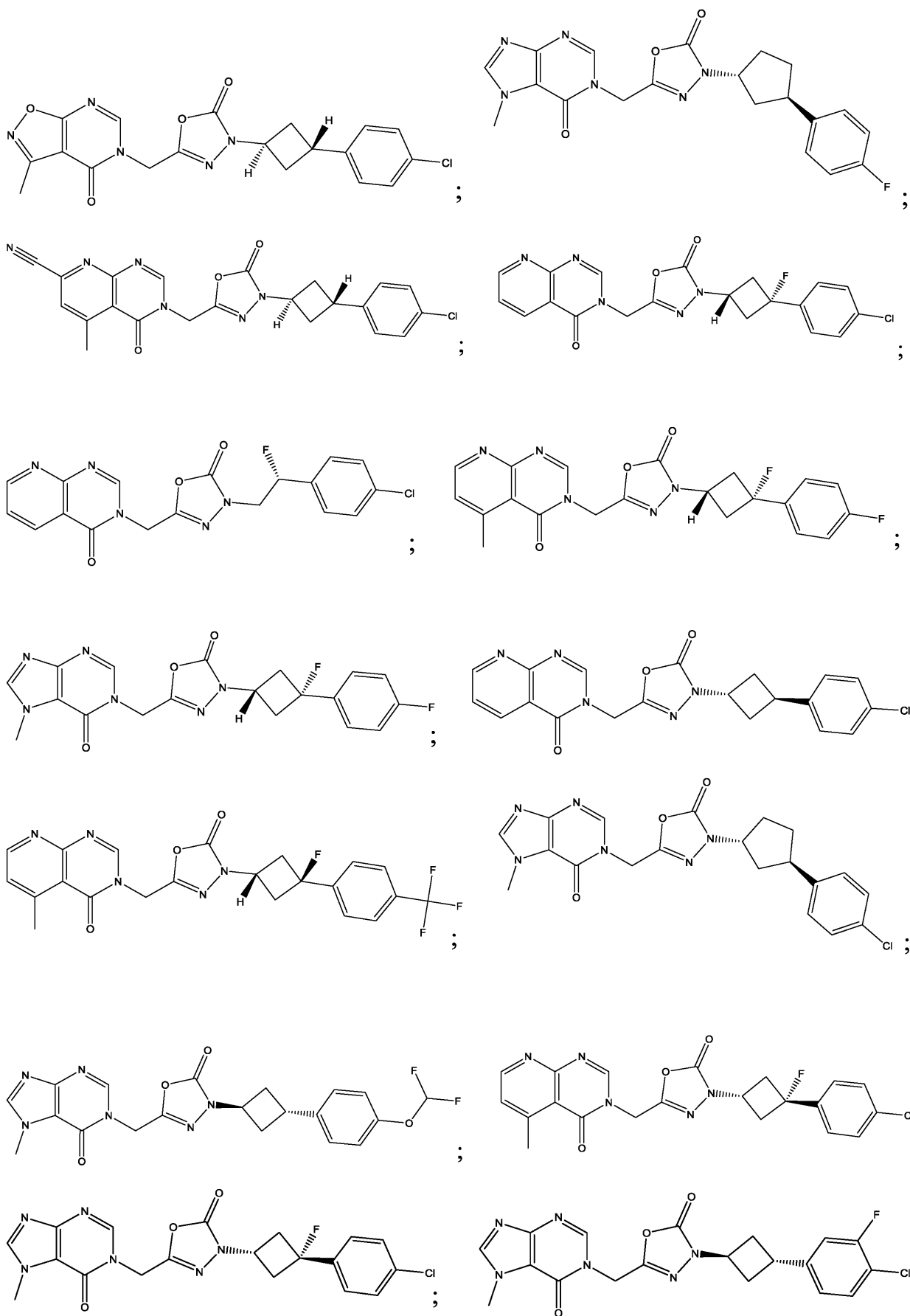














【請求項 9】

【請求項 10】

【請求項 1 1】

【請求項 1 2】

【請求項 13】

哺乳動物における呼吸器障害を処置するための方法に用いられる医薬組成物であって、請求項 1～8 のいずれか一項記載の化合物又は薬学的に許容し得るその塩を含む医薬組成物を哺乳動物に投与することを含む、方法に用いられる請求項 1～8 のいずれか一項記載の化合物又は薬学的に許容し得るその塩を有効成分として含む医薬組成物。

## 【請求項 14】

TRPA1 活性を調節するための、請求項 1～8 のいずれか一項記載の化合物又は薬学的に許容し得るその塩。

## 【請求項 15】

TRPA1 活性が介在する疾患又は症状を処置又は予防するための、請求項 1～8 のいずれか一項記載の化合物又は薬学的に許容し得るその塩。

## 【請求項 16】

疾患又は症状が、疼痛、掻痒、炎症性障害、内耳障害、発熱若しくは別の体温調節障害、気管気管支の若しくは横隔膜の機能障害、胃腸の若しくは尿路の障害、慢性閉塞性肺疾患、失禁、又は CNS への血流低下若しくは CNS の低酸素症に関連する障害である、請求項 15 記載の化合物。

## 【請求項 17】

疾患又は症状が、疼痛、関節炎、掻痒、咳、喘息、炎症性腸疾患、又は内耳障害である、請求項 16 記載の化合物。

## 【請求項 18】

TRPA1 活性が介在する疾患又は症状の処置用又は予防用の医薬を調製するための、請求項 1～8 のいずれか一項記載の化合物又は薬学的に許容し得るその塩の使用。

## 【請求項 19】

疾患又は症状が、疼痛、掻痒、炎症性障害、内耳障害、発熱若しくは別の体温調節障害、気管気管支の若しくは横隔膜の機能障害、胃腸の若しくは尿路の障害、慢性閉塞性肺疾患、失禁、又は CNS への血流低下若しくは CNS の低酸素症に関連する障害である、請求項 18 記載の使用。

## 【請求項 20】

疾患又は症状が、疼痛、関節炎、掻痒、咳、喘息、炎症性腸疾患、又は内耳障害である、請求項 19 記載の使用。

## 【請求項 21】

TRPA1 活性を調節するための方法であって、TRPA1 と請求項 1～8 のいずれか一項記載の化合物又は薬学的に許容し得るその塩とを接触させることを含む、方法。

## 【請求項 22】

哺乳動物における TRPA1 活性が介在する疾患又は症状を処置するための方法に用いられる医薬組成物であって、請求項 1～8 のいずれか一項記載の化合物又は薬学的に許容し得るその塩を含む医薬組成物を哺乳動物に投与することを含む、方法に用いられる請求項 1～8 のいずれか一項記載の化合物又は薬学的に許容し得るその塩を有効成分として含む医薬組成物。

## 【請求項 23】

疾患又は症状が、疼痛、掻痒、炎症性障害、内耳障害、発熱若しくは別の体温調節障害、気管気管支の若しくは横隔膜の機能障害、胃腸の若しくは尿路の障害、慢性閉塞性肺疾患、失禁、又は CNS への血流低下若しくは CNS の低酸素症に関連する障害である、請求項 22 記載の医薬組成物。

## 【請求項 24】

疾患又は症状が、疼痛、関節炎、掻痒、咳、喘息、炎症性腸疾患、又は内耳障害である、請求項 23 記載の医薬組成物。