

【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1年11月14日(2019.11.14)

【公表番号】特表2018-527387(P2018-527387A)

【公表日】平成30年9月20日(2018.9.20)

【年通号数】公開・登録公報2018-036

【出願番号】特願2018-514794(P2018-514794)

【国際特許分類】

C 07 D 401/12 (2006.01)

A 61 K 31/497 (2006.01)

A 61 K 31/444 (2006.01)

C 07 D 413/12 (2006.01)

A 61 K 31/506 (2006.01)

A 61 K 31/4439 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 401/12 C S P

A 61 K 31/497

A 61 K 31/444

C 07 D 413/12

A 61 K 31/506

A 61 K 31/4439

A 61 P 25/28

A 61 P 25/16

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 9/00

【手続補正書】

【提出日】令和1年9月24日(2019.9.24)

【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

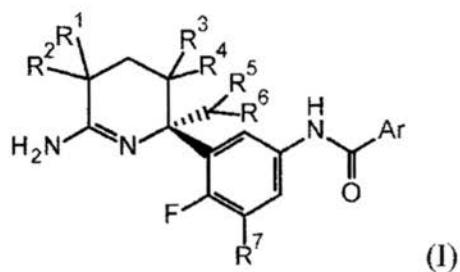
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



(式中、

R¹ は、 - C₁ ~ ₃ アルキル、 - C₁ ~ ₃ アルキル - F およびフルオロからなる群から選択され、

R² は、 - SO₂ C₁ ~ ₃ アルキル、 - SO₂ シクロプロピル、 - CN、 - OC₁ ~ ₃ アルキル、 CF₃ および - SO(NCH₃)CH₃ からなる群から選択され、

Ar はホモアリールもしくはヘテロアリールであり、

ここで、ホモアリールは、フェニル、もしくは以下からなる群からそれぞれ独立して選択される 1 つ、 2 つもしくは 3 つの置換基で置換されているフェニルであり：ハロ、シアノ、C₁ ~ ₃ アルキル、シクロプロピル、C₁ ~ ₃ アルキルオキシ、シクロプロピルオキシ、(シクロプロピル)C₁ ~ ₃ アルキルオキシ、モノハロ - C₁ ~ ₃ アルキル、ポリハロ - C₁ ~ ₃ アルキル、モノハロ - シクロプロピル、ポリハロ - シクロプロピル、モノハロ - C₁ ~ ₃ アルキルオキシ、ポリハロ - C₁ ~ ₃ アルキルオキシ、モノハロ - シクロプロピルオキシ、ポリハロ - シクロプロピルオキシ、(C₁ ~ ₃ アルキルオキシ)C₁ ~ ₃ アルキルオキシ、(シクロプロピルオキシ)C₁ ~ ₃ アルキルオキシおよびHC₂O。

ヘテロアリールは以下からなる群から選択され：ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、フラニル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、チアジアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリルおよびオキサジアゾリル（それぞれ、以下からなる群からそれぞれ独立して選択される 1 つ、 2 つもしくは 3 つの置換基で任意選択的に置換されている：ハロ、シアノ、C₁ ~ ₃ アルキル、シクロプロピル、C₂ ~ ₃ アルキニル、C₁ ~ ₃ アルキルオキシ、シクロプロピルオキシ、(シクロプロピル)C₁ ~ ₃ アルキルオキシ、モノハロ - C₁ ~ ₃ アルキル、ポリハロ - C₁ ~ ₃ アルキル、モノハロ - シクロプロピル、ポリハロ - シクロプロピル、モノハロ - C₁ ~ ₃ アルキルオキシ、ポリハロ - C₁ ~ ₃ アルキルオキシ、モノハロ - シクロプロピルオキシ、ポリハロ - シクロプロピルオキシ、(C₁ ~ ₃ アルキルオキシ)C₁ ~ ₃ アルキルオキシ、(シクロプロピルオキシ)C₁ ~ ₃ アルキルオキシおよびHC₂O。

R³、R⁴、R⁵ および R⁶ はそれぞれ独立して、H、フルオロ、メチルおよびメトキシからなる群から選択され、

R⁷ は水素もしくはフルオロである)

の化合物またはその互変異性体もしくは立体異性体型、またはそれらの薬学的に許容される付加塩もしくは溶媒和物。

【請求項 2】

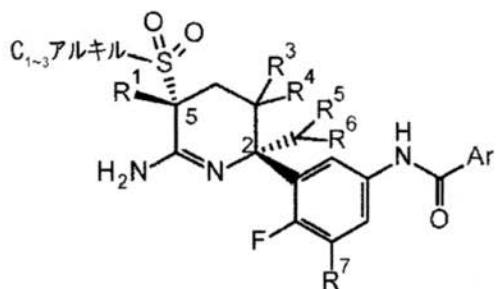
R² は - SO₂ C₁ ~ ₃ アルキル、 - SO₂ シクロプロピルまたは - CN である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

> CR³ R⁴ は > CH₂、> CHF、> CF₂ または > C(CH₃)F であり、- CH R⁵ R⁶ は - CH₃、- CH₂F または - CHF₂ である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

式 (I^I)
【化 2】

(I^I)

(式中、R¹ および R³ ~ R⁷ および Ar は、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項で定義されたとおりである)

を有する請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

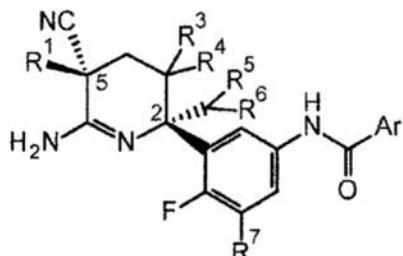
【請求項 5】

R² は - SO₂CH₃、- SO₂CH₂CH₃ または - SO₂CH(CH₃)₂ である
、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項の化合物。

【請求項 6】

式 (I^I I^I)

【化 3】

(I^{II})

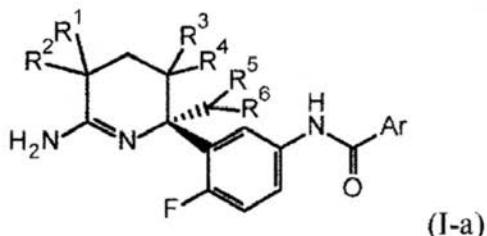
(式中、R¹ および R³ ~ R⁷ および Ar は、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項で定義されたとおりである)

を有する請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

式 (I - a)

【化 4】



(I-a)

(式中、

R¹ は C_{1~2} アルキルもしくはフルオロであり、R² は - SO₂C_{1~3} アルキル、- SO₂シクロプロピル、- CN、- OC_{1~3} アルキル、CF₃ もしくは - SO(NCH₃)CH₃ であり、

A_r はホモアリールもしくはヘテロアリールであり、

ここで、ホモアリールは、フェニル、もしくは以下からなる群からそれぞれ独立して選択される 1 つ、2 つもしくは 3 つの置換基で置換されているフェニルであり：ハロ、シアノ、 $C_{1 \sim 3}$ アルキル、シクロプロピル、 $C_{1 \sim 3}$ アルキルオキシ、シクロプロピルオキシ、(シクロプロピル) $C_{1 \sim 3}$ アルキルオキシ、モノハロ- $C_{1 \sim 3}$ アルキル、ポリハロ- $C_{1 \sim 3}$ アルキル、モノハロ-シクロプロピル、ポリハロ-シクロプロピル、モノハロ- $C_{1 \sim 3}$ アルキルオキシ-、ポリハロ- $C_{1 \sim 3}$ アルキルオキシ、モノハロ-シクロプロピルオキシ、ポリハロ-シクロプロピルオキシ、($C_{1 \sim 3}$ アルキルオキシ) $C_{1 \sim 3}$ アルキルオキシ、(シクロプロピルオキシ) $C_{1 \sim 3}$ アルキルオキシおよび $H C C H_2 O -$ 、

ヘテロアリールは以下からなる群から選択され：ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、フラニル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、チアジアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリルおよびオキサジアゾリル(それぞれ、以下からなる群からそれぞれ独立して選択される 1 つ、2 つもしくは 3 つの置換基で任意選択的に置換されている：ハロ、シアノ、 $C_{1 \sim 3}$ アルキル、シクロプロピル、 $C_{2 \sim 3}$ アルキニル、 $C_{1 \sim 3}$ アルキルオキシ、シクロプロピルオキシ、(シクロプロピル) $C_{1 \sim 3}$ アルキルオキシ、モノハロ- $C_{1 \sim 3}$ アルキル、ポリハロ- $C_{1 \sim 3}$ アルキル、モノハロ-シクロプロピル、ポリハロ-シクロプロピル、モノハロ- $C_{1 \sim 3}$ アルキルオキシ、ポリハロ- $C_{1 \sim 3}$ アルキルオキシ、モノハロ-シクロプロピルオキシ、ポリハロ-シクロプロピルオキシ、($C_{1 \sim 3}$ アルキルオキシ) $C_{1 \sim 3}$ アルキルオキシ、(シクロプロピルオキシ) $C_{1 \sim 3}$ アルキルオキシおよび $H C C C H_2 O -$ 、

R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 はそれぞれ独立して、H、フルオロおよびメチルから選択される)

を有する式(I)の請求項 1 に記載の化合物またはその互変異性体もしくは立体異性体型、またはそれらの薬学的に許容される付加塩もしくは溶媒和物。

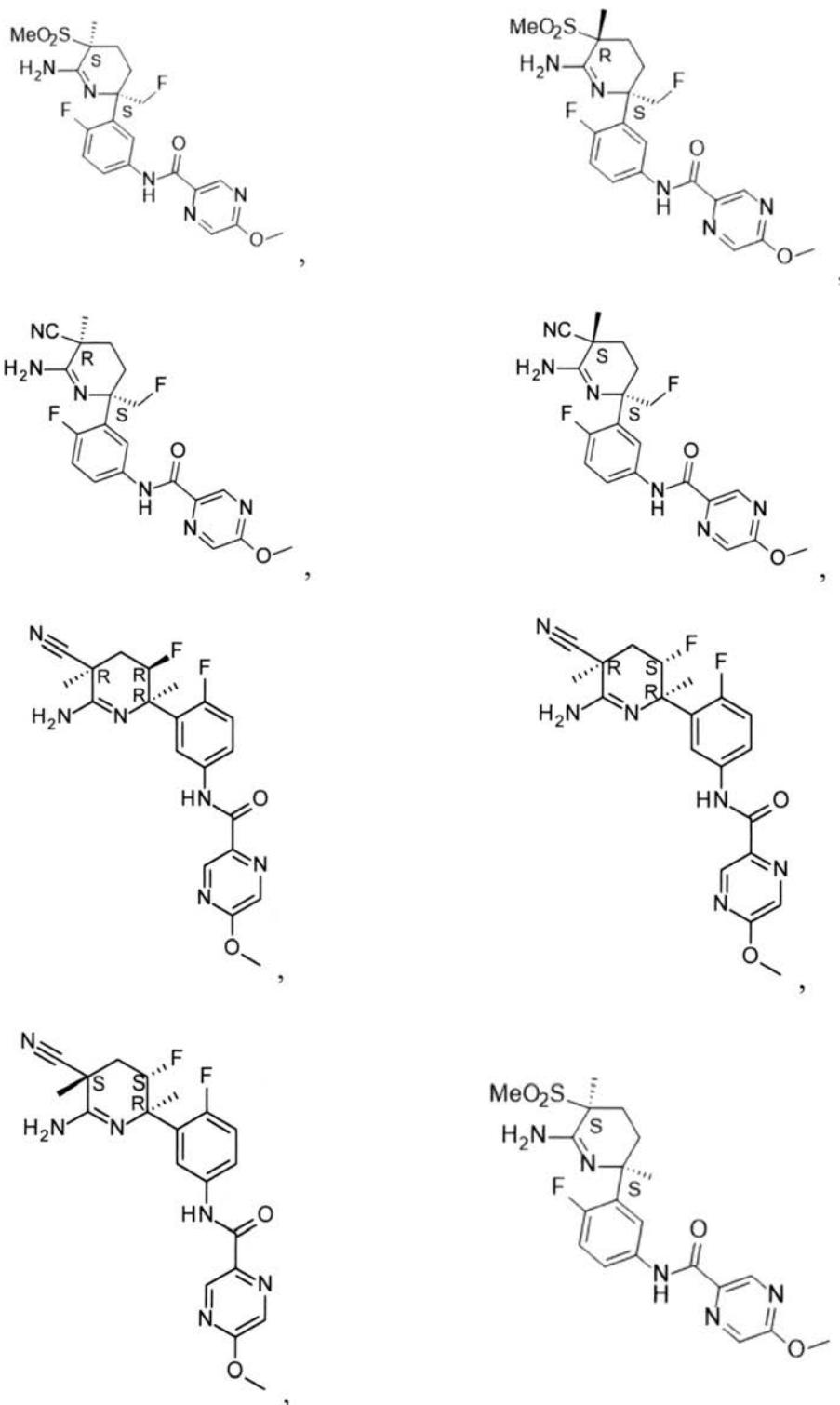
【請求項 8】

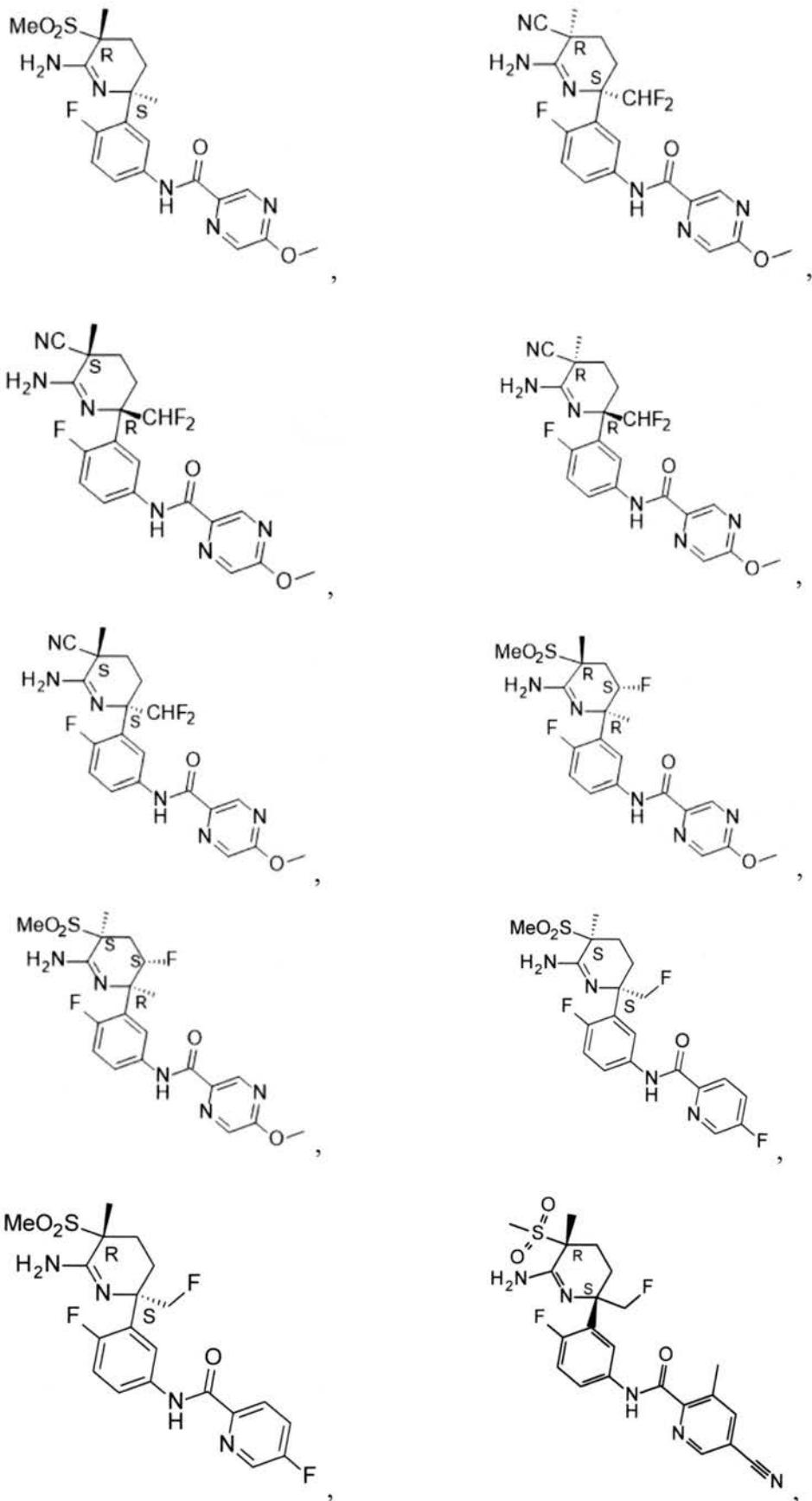
R^1 は $C H_3$ である、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

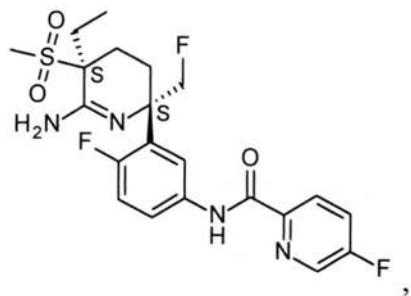
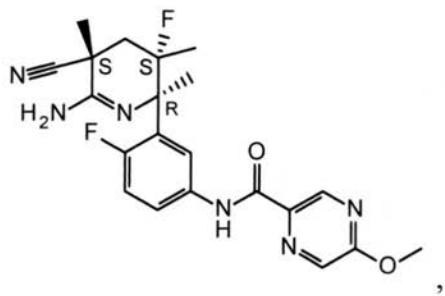
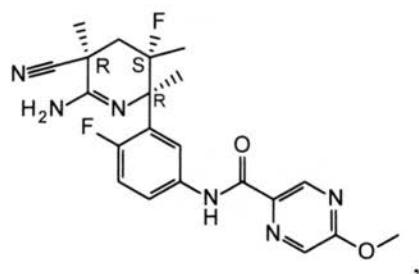
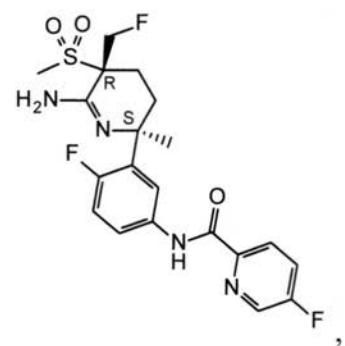
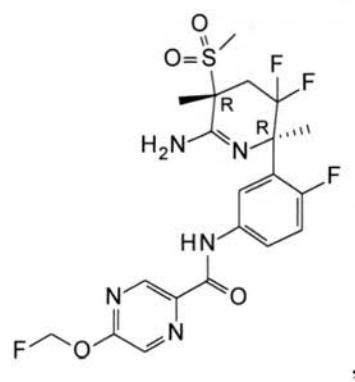
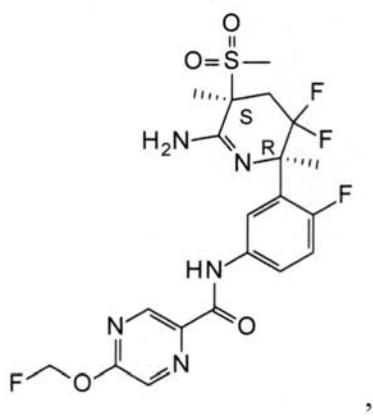
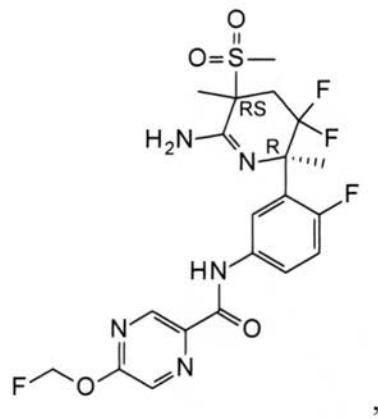
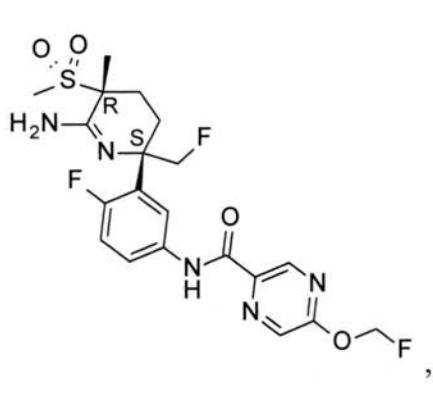
【請求項 9】

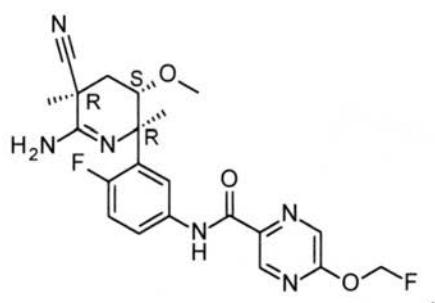
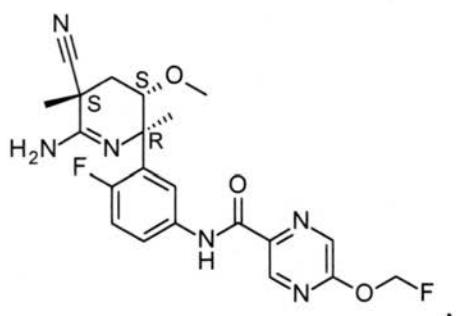
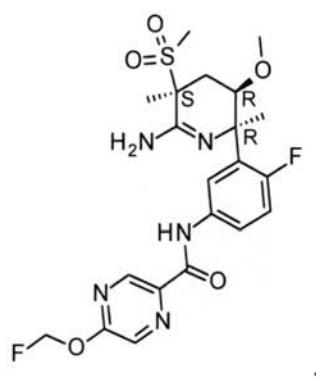
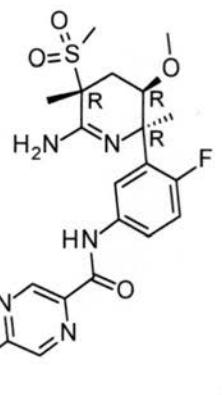
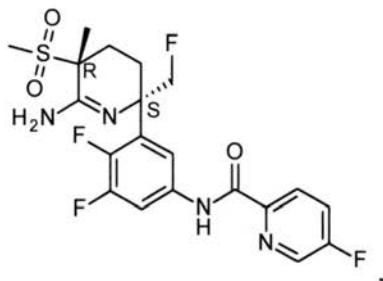
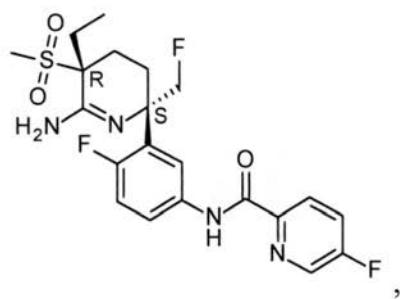
前記化合物は、

【化 5】









もしくは

またはそれらの薬学的に許容される付加塩もしくは溶媒和物である、請求項1に記載の化合物。

【請求項10】

治療有効量の請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物と、薬学的に許容される担体とを含む医薬組成物。

【請求項11】

薬学的に許容される担体と治療有効量の請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物とを混合するステップを含む、請求項10に記載の医薬組成物を調製するプロセス。

【請求項12】

薬剤として使用するための請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物または請求項10に記載の医薬組成物。

【請求項13】

アルツハイマー病(AD)、軽度認知障害、老衰、認知症、レビー小体型認知症、ダウン症候群、脳卒中に伴う認知症、パーキンソン病に伴う認知症またはアミロイドに伴う認知症の処置または予防で使用するための請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物または請求項10に記載の医薬組成物。

【請求項14】

アルツハイマー病(AD)、軽度認知障害、老衰、認知症、レビー小体型認知症、ダウン症候群、脳卒中に伴う認知症、パーキンソン病に伴う認知症またはアミロイドに伴う

認知症の処置または予防のための薬剤の製造のための、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物または請求項 1_0 に記載の医薬組成物の使用。