

【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 0 7 D 401/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/12 C S P

A 6 1 K 31/497

A 6 1 K 31/444

C 0 7 D 413/12

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 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】

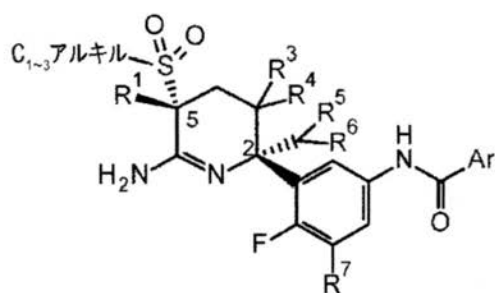
式 (I)

(I)

【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。

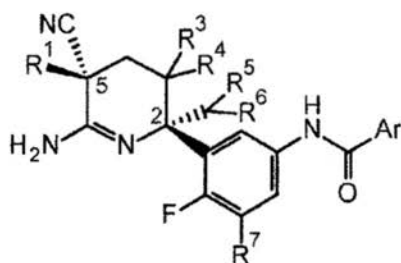
【請求項 5】

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^{II})

【化 3】

(I^{II})

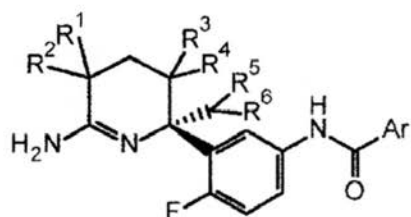
(式中、R¹ および R³ ~ R⁷ および Ar は、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項で定義されたとおりである)

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 C₁ ~ C₂ アルキルもしくはフルオロであり、

R² は -SO₂C₁ ~ C₃ アルキル、-SO₂シクロプロピル、-CN、-OC₁ ~ C₃ 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、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 HC(C₂H₅)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、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 HC(C₂H₅)O -、

R³、R⁴、R⁵ および R⁶ 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。

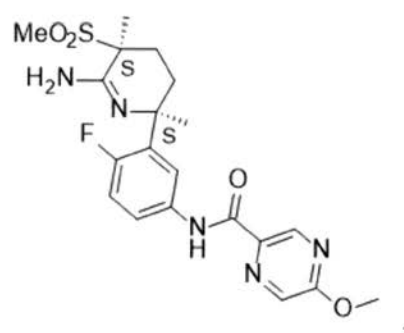
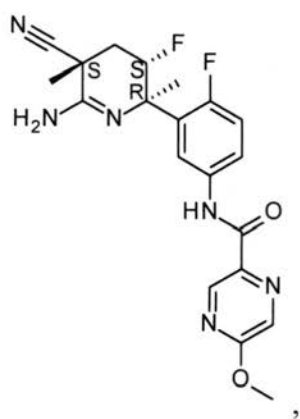
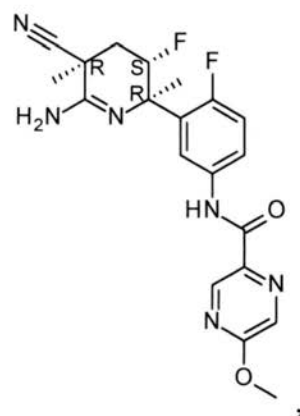
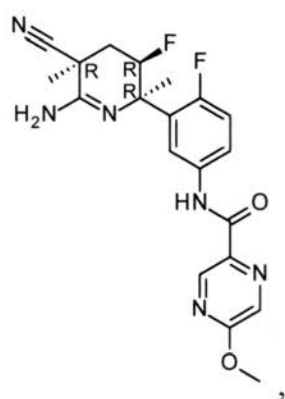
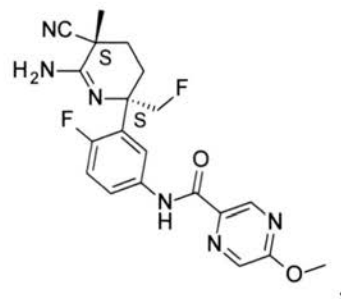
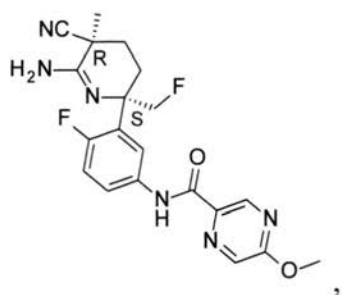
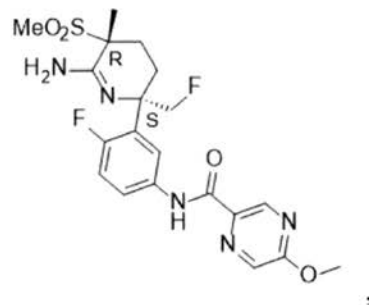
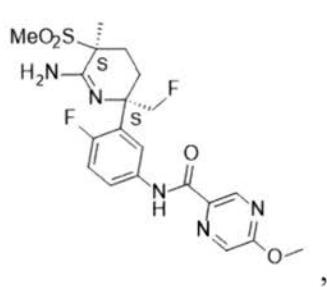
【請求項8】

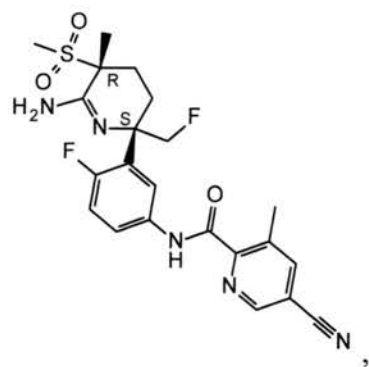
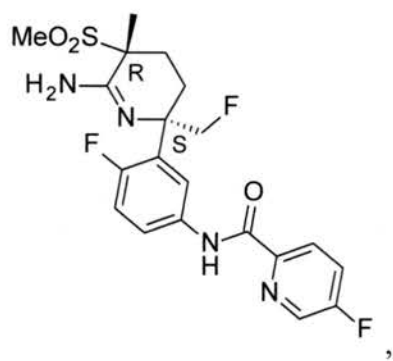
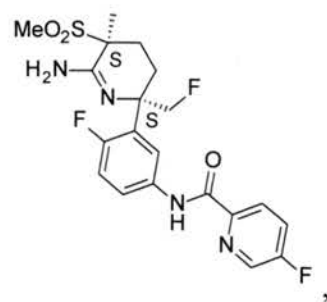
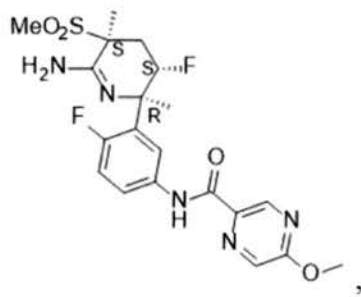
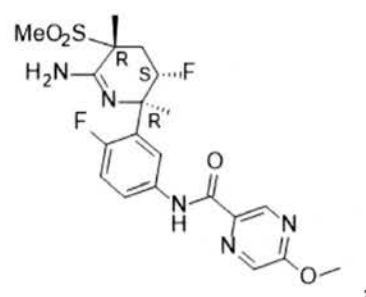
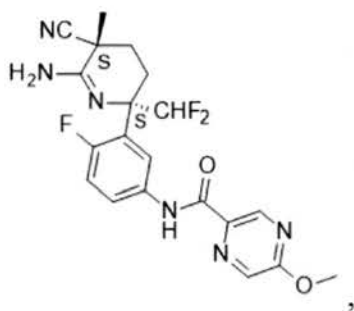
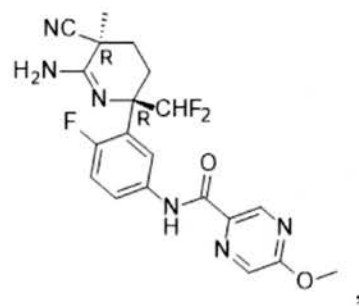
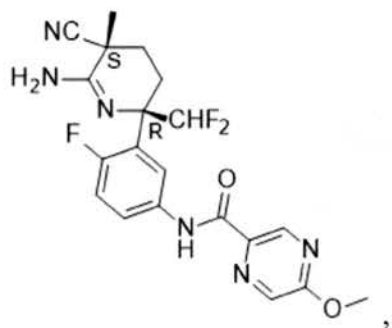
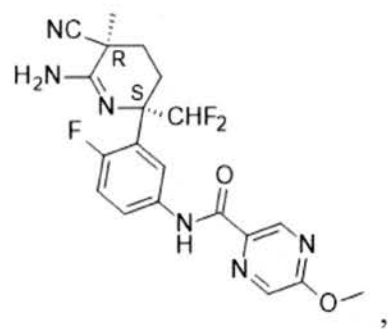
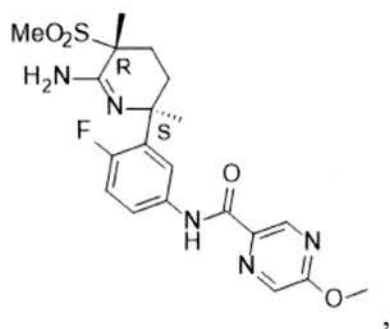
R¹ は CH₃ である、請求項1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

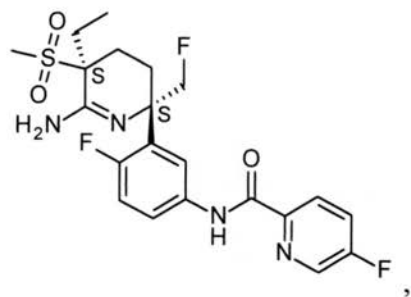
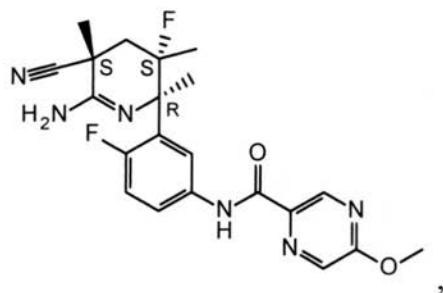
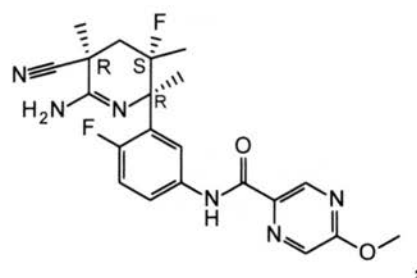
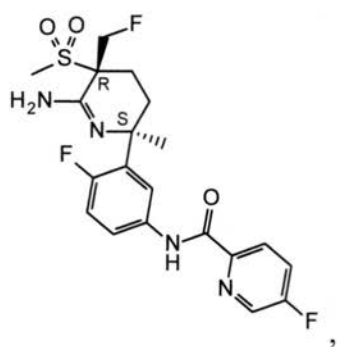
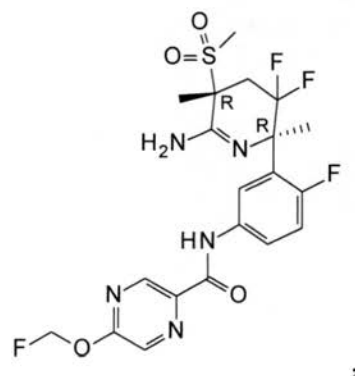
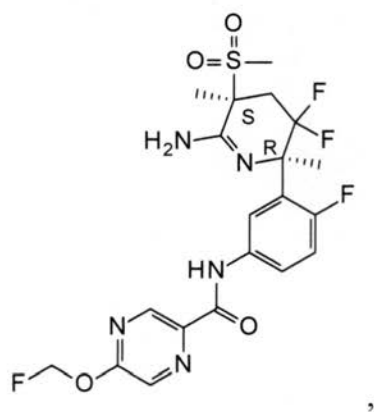
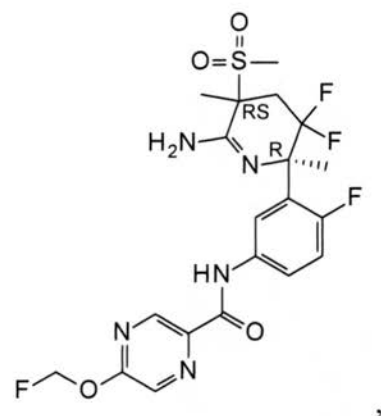
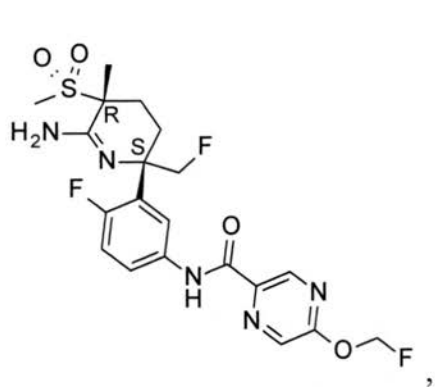
【請求項9】

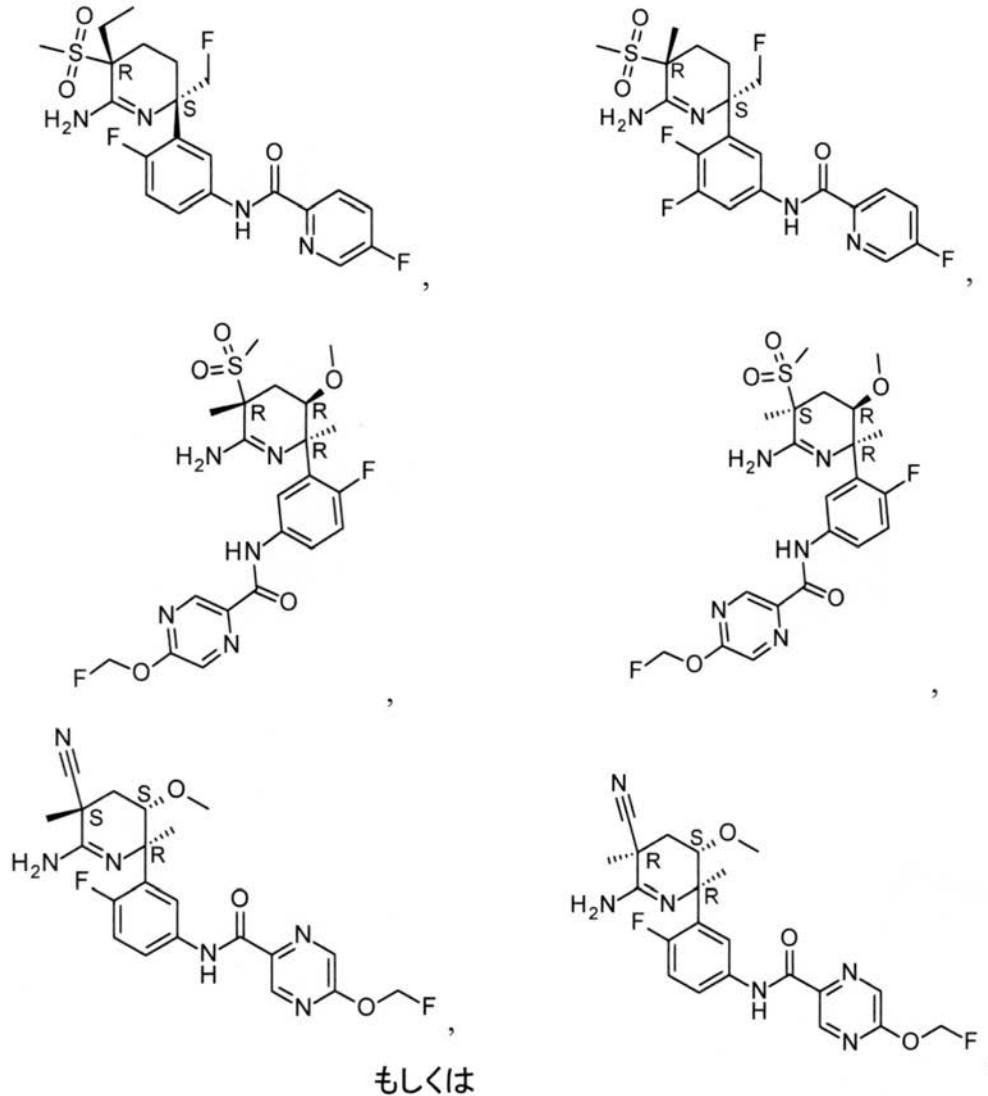
前記化合物は、

【化 5】









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 10 に記載の医薬組成物の使用。