

【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 5 月 27 日 (2021.5.27)

【公表番号】特表 2020-518621 (P2020-518621A)

【公表日】令和 2 年 6 月 25 日 (2020.6.25)

【年通号数】公開・登録公報 2020-025

【出願番号】特願 2019-560254 (P2019-560254)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 401/14 C S P

A 6 1 P 11/00

A 6 1 K 31/506

C 0 7 D 403/04

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 31/12

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 4 月 16 日 (2021.4.16)

【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

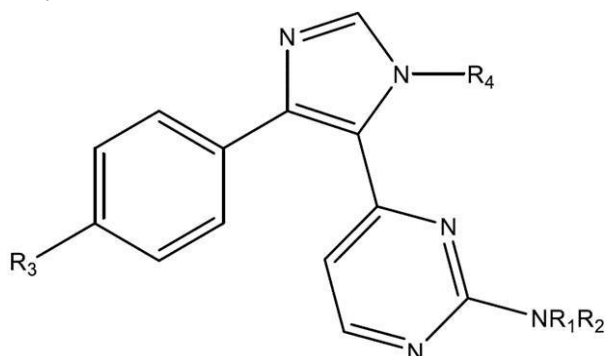
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



(I)

(式中：

R<sub>1</sub> 及び R<sub>2</sub> は

(i) H、C<sub>1</sub> ~ 12 アルキル、C<sub>2</sub> ~ 6 アルキニル、C<sub>1</sub> アルキル C<sub>6</sub> アリール、C<sub>6</sub>

アリール、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル、及び  $C_3 \sim 5$  ヘテロシクリルからなる群からそれぞれ独立に選択されるか；又は

(ii)  $R_1$  と  $R_2$  は、それらが結合している窒素原子と共に、ヘテロシクリル又はヘテロアリール基を形成し；

$R_3$  は、F、Cl、Br、I、 $CH_3$ 、 $OCH_3$ 、 $OCF_2H$ 、 $OCF_3$ 、 $CO_2H$ 、 $CO_2C_{1 \sim 10}$  アルキルからなる群から選択され；

$R_4$  は、 $C_0 \sim 3$  アルキル  $C_3 \sim 12$  シクロアルキル、 $C_{1 \sim 12}$  アルキル、 $C_{1 \sim 10}$  アルキル  $C_6$  アリール、 $C_{1 \sim 6}$  アルキル  $OC_{1 \sim 6}$  アルキル  $C_6$  アリール、 $C_0 \sim 6$  アルキルヘテロアリール、及び  $C_0 \sim 6$  アルキルヘテロシクリルからなる群から選択され；ここで、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、及び  $R_4$  のそれぞれは任意選択で置換されている) の化合物、又はその塩、溶媒和物、プロドラッグ、若しくは多形体。

【請求項 2】

図 8 中の化合物のリストから選択されない、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

$R_1$  が H でない、請求項 1 又は請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

$R_1$  が  $C_{1 \sim 6}$  アルキルである、請求項 1 ～ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

$R_1$  が  $C_{1 \sim 3}$  アルキルである、請求項 1 ～ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

$R_1$  が  $C_{2 \sim 6}$  アルキニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

$R_1$  が  $C_3 \sim 6$  シクロアルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

$R_1$  が  $C_3 \sim 5$  ヘテロシクリルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

$R_2$  が H である、請求項 1 ～ 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

$R_1$  と  $R_2$  がどちらも同じである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

$R_3$  が  $CH_3$  及びハロから選択される、請求項 1 ～ 10 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 12】

$R_3$  が F 又は Cl である、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】

$R_4$  が  $C_0 \sim 3$  アルキル  $C_3 \sim 12$  シクロアルキルである、請求項 1 ～ 12 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 14】

前記  $C_3 \sim 12$  シクロアルキル基が、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、及びシクロヘプチルから選択される、請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 15】

$R_4$  が  $C_3 \sim 12$  シクロアルキルである、請求項 1 ～ 14 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 16】

$R_4$  が  $C_{1 \sim 12}$  アルキルである、請求項 1 ～ 15 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 17】

$R_4$  が、メチル、エチル、プロピル、又はブチル基である、請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 18】

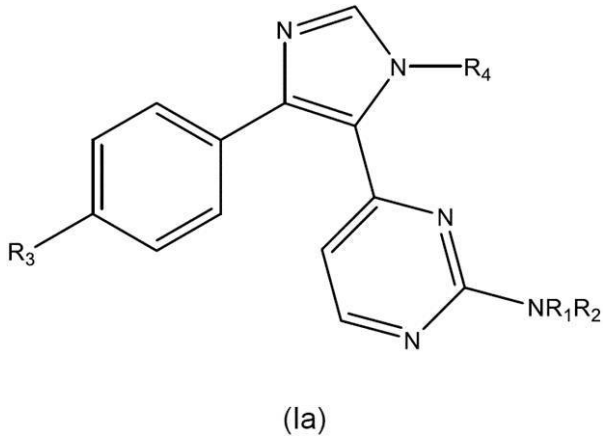
$R_4$  が  $C_0 \sim 6$  アルキルヘテロシクリルである、請求項 1 ～ 17 のいずれか一項に記載

の化合物。

【請求項 19】

式 (I a) :

【化 2】



(式中：

$R_1$  及び  $R_2$  は

(i) H、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_2 \sim 6$  アルキニル、 $C_6$  アリール、及び  $C_3 \sim 5$  ヘテロシクリルからなる群からそれぞれ独立に選択されるか；又は

(ii)  $R_1$  と  $R_2$  は、それらが結合している窒素原子と共に、ヘテロシクリル基を形成し；

$R_3$  は、F、Cl、Br、I 及び  $CH_3$  からなる群から選択され；

$R_4$  は、 $C_0 \sim 3$  アルキル  $C_3 \sim 12$  シクロアルキル、 $C_1 \sim 12$  アルキル、及び  $C_0 \sim 6$  アルキルヘテロシクリルからなる群から選択され；

ここで、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、及び  $R_4$  のそれぞれは任意選択で置換されている) の化合物である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 20】

$R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、及び  $R_4$  が、OH、 $C_1 \sim 6$  アルコキシ、ハロ、アミノ、メルカプト、及び  $C_1 \sim 6$  アルキルから選択される 1 個以上の基により任意選択で置換されている、請求項 1 ~ 19 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 21】

請求項 1 ~ 20 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物、又はその塩、溶媒和物、プロドラッグ、若しくは多形体、及び薬学的に許容できる賦形剤を含む組成物。

【請求項 22】

請求項 1 ~ 20 のいずれか一項に記載の化合物、又は請求項 21 に記載の組成物の、対象の呼吸器疾患の治療又は予防のための医薬品の調製における使用。