

【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2月13日(2020.2.13)

【公表番号】特表2019-507116(P2019-507116A)

【公表日】平成31年3月14日(2019.3.14)

【年通号数】公開・登録公報2019-010

【出願番号】特願2018-536179(P2018-536179)

【国際特許分類】

C 0 7 C 39/17 (2006.01)

C 0 7 C 39/15 (2006.01)

A 6 1 K 31/05 (2006.01)

A 6 1 K 31/165 (2006.01)

A 6 1 K 31/122 (2006.01)

A 6 1 K 31/075 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 5/24 (2006.01)

A 6 1 K 31/277 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 39/17

C 0 7 C 39/15

A 6 1 K 31/05

A 6 1 K 31/165

A 6 1 K 31/122

A 6 1 K 31/075

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 19/00

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 5/24

A 6 1 K 31/277

【手続補正書】

【提出日】令和1年12月26日(2019.12.26)

【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

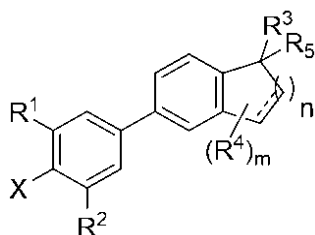
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(i)の化合物またはその立体異性体若しくは医薬的に許容される塩：



(i)

(式中、

n は、0～4の整数であり；

m は、0～4の整数であり；

X は、ヒドロキシまたは C_{1-4} アルコキシであり；

R_1 および R_2 は、独立して、H、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、アミノ、 $-S-C_{1-4}$ アルキルまたはハロであり；

R_3 は、H、ヒドロキシ、シアノ、ハロ、 C_{1-4} アルキルまたは C_{1-4} アルコキシであり；

R_4 は、各々独立して、水素、ヒドロキシ、オキソ、ハロ、 C_{1-4} アルキルまたは C_{1-4} アルコキシであり；

R_5 は、Hまたは C_{1-4} アルキニルであり、

---は、二重結合であってもよく；

C_{1-4} アルキルまたは C_{1-4} アルコキシはハロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシおよび C_{1-4} アルコキシの1つ以上で置換されていてもよい。

【請求項 2】

R_1 および R_2 の少なくとも1つが C_{1-4} アルキルである、請求項1記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 3】

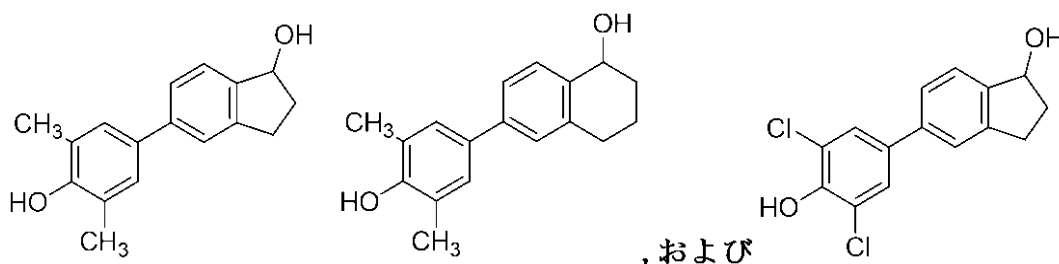
R_1 および R_2 が、独立して、H、メチル、エチル、クロロ、 $-CH_2OH$ および $-CH_2OMe$ から選択される、請求項1記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 4】

R_3 が、H、OH、オキソ、クロロ、シアノまたはメトキシから選択される、請求項1、2または3記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 5】

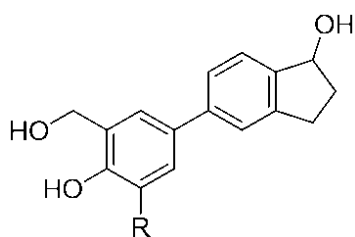
下記からなる群から選択される、請求項1記載の化合物またはその医薬的に許容される塩：



,および

【請求項 6】

式(ii)の請求項1記載の化合物またはその立体異性体若しくは医薬的に許容される塩

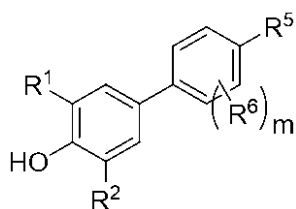


(ii)

(式中、

Rは、Hまたはメチルである)。

【請求項 7】

式(iii)に従う化合物またはその立体異性体若しくは医薬的に許容される塩

(iii)

(式中、

mは、0～3の整数であり；

R₁は、H、ヒドロキシ、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、アミノ、-S-C₁₋₄アルキルまたはハロであり；R₂は、ヒドロキシ、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、アミノ、-S-C₁₋₄アルキルまたはハロであり；R₅は、H、ヒドロキシまたはC₁₋₄アルキルであり；R₆は、各々独立して、H、ヒドロキシ、ハロまたはC₁₋₄アルキルであり；C₁₋₄アルキルまたはC₁₋₄アルコキシがハロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシおよびC₁₋₄アルコキシの1つ以上で置換されていてもよい)。

【請求項 8】

R₁およびR₂の少なくとも一方がC₁₋₄アルキルである、請求項7記載の化合物または医薬的に許容されるその塩。

【請求項 9】

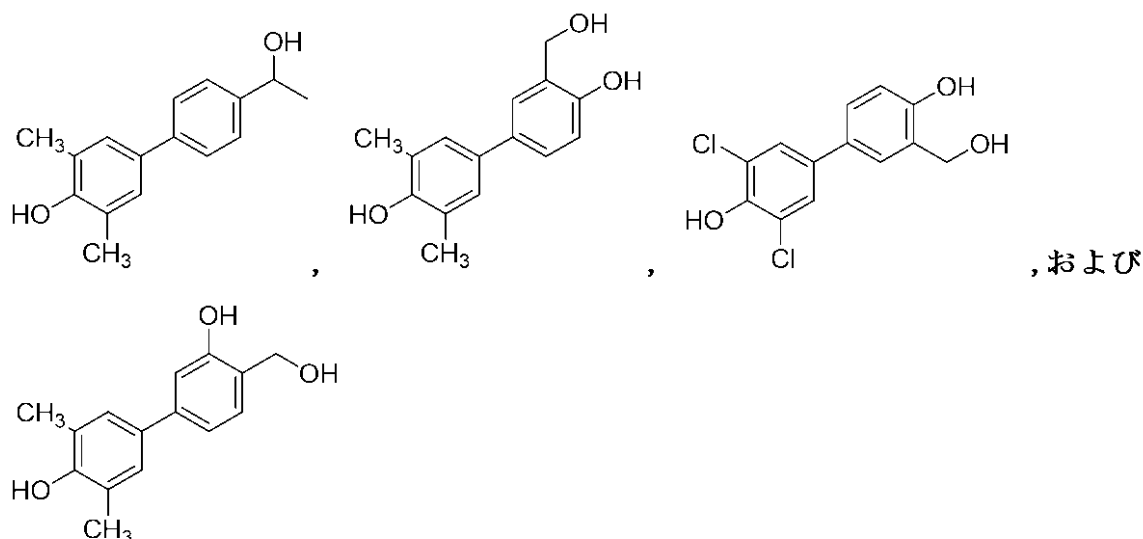
R₅が-CH(OH)(CH₃)である、請求項7または8記載の化合物または医薬的に許容されるその塩。

【請求項 10】

R₆が-CH₂OHである、請求項7、8または9記載の化合物または医薬的に許容されるその塩。

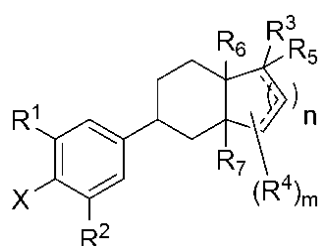
【請求項 11】

下記からなる群から選択される請求項7記載の化合物または医薬的に許容されるその塩：



【請求項 1 2】

式 (vi) に従う化合物 またはその立体異性体若しくは医薬的に許容される塩；



(vi)

(式中、

n は、0～4の整数であり；

m は、0～4の整数であり；

X は、H、ヒドロキシまたは C_{1-4} アルコキシであり；

R_1 および R_2 は、独立して、H、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、アミノ、-S- C_{1-4} アルキルまたはハロであり；

R_3 は、H、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、ハロ、 C_{1-4} アルキルまたは C_{1-4} アルコキシであり；

各 R_4 は、独立して、水素、ヒドロキシ、オキソ、ハロ、 C_{1-4} アルキルまたは C_{1-4} アルコキシであり；

R_5 は、H、アルキニルであるか、または二重結合が存在する場合には存在せず；

R_6 および R_7 は、独立して、 C_{1-4} アルキルおよびHから選択され；

--- は、二重結合であつてもよく；

C_{1-4} アルキルまたは C_{1-4} アルコキシは、ハロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシおよび C_{1-4} アルコキシの1つ以上で置換されていてもよい。

【請求項 1 3】

R_1 および R_2 の少なくとも一方が C_{1-4} アルキルである、請求項 1 2 記載の化合物。

【請求項 1 4】

R_1 および R_2 が、独立して、H、メチル、エチル、クロロ、-CH₂OH および -CH₂OMe から選択される、請求項 1 2 記載の化合物。

【請求項 1 5】

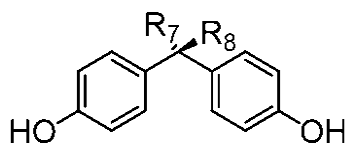
R_3 が、H、OH、オキソ、クロロ、シアノまたはメトキシから選択され、 m が 0 である、請求項 1 2 , 1 3 または 1 4 記載の化合物。

【請求項 1 6】

R_6 がメチルであり、 R_7 がHである、請求項 1 2 , 1 3、1 4 または 1 5 記載の化合物。

【請求項 1 7】

式(vii)に従う化合物またはその立体異性体若しくは医薬的に許容される塩；



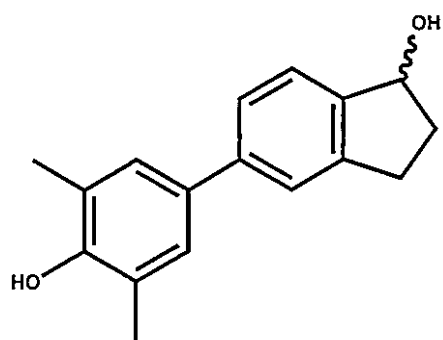
(vii)

(式中、

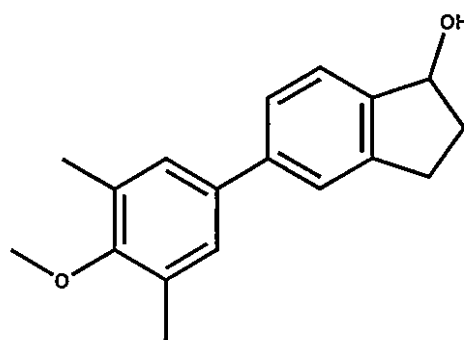
R_7 および R_8 は、独立して、H、 C_{1-5} アルキル、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、アミド、環状 C_{3-8} アルキルまたはヘテロシクリルである)。

【請求項 1 8】

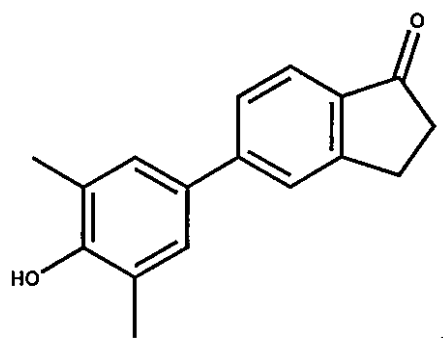
下記からなる群から選択される化合物またはその立体異性体若しくは医薬的に許容される塩：



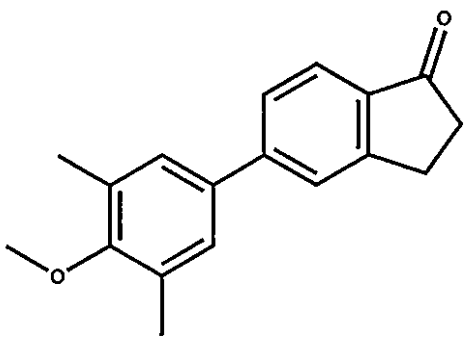
,



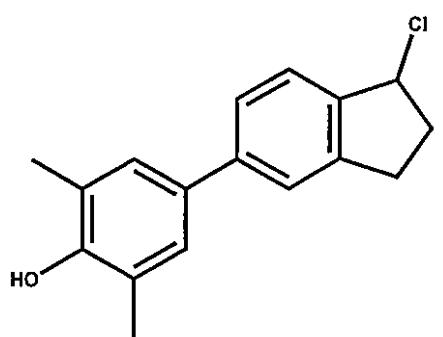
,



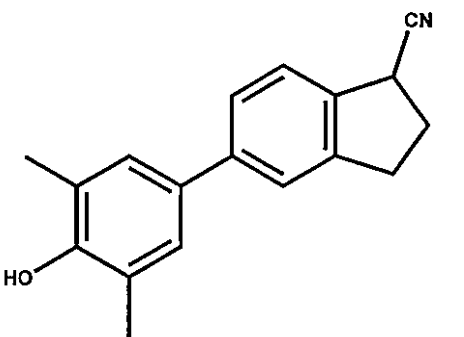
,



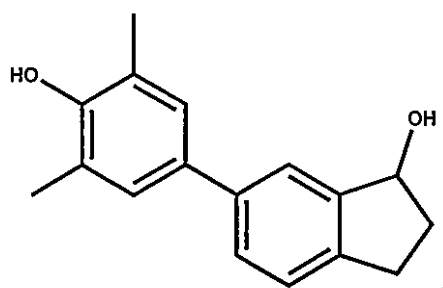
,



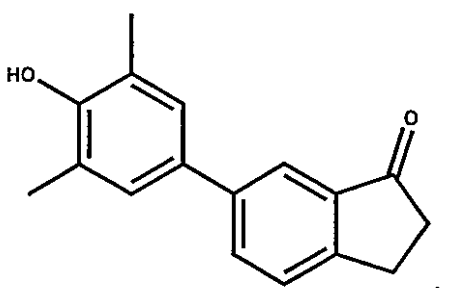
,



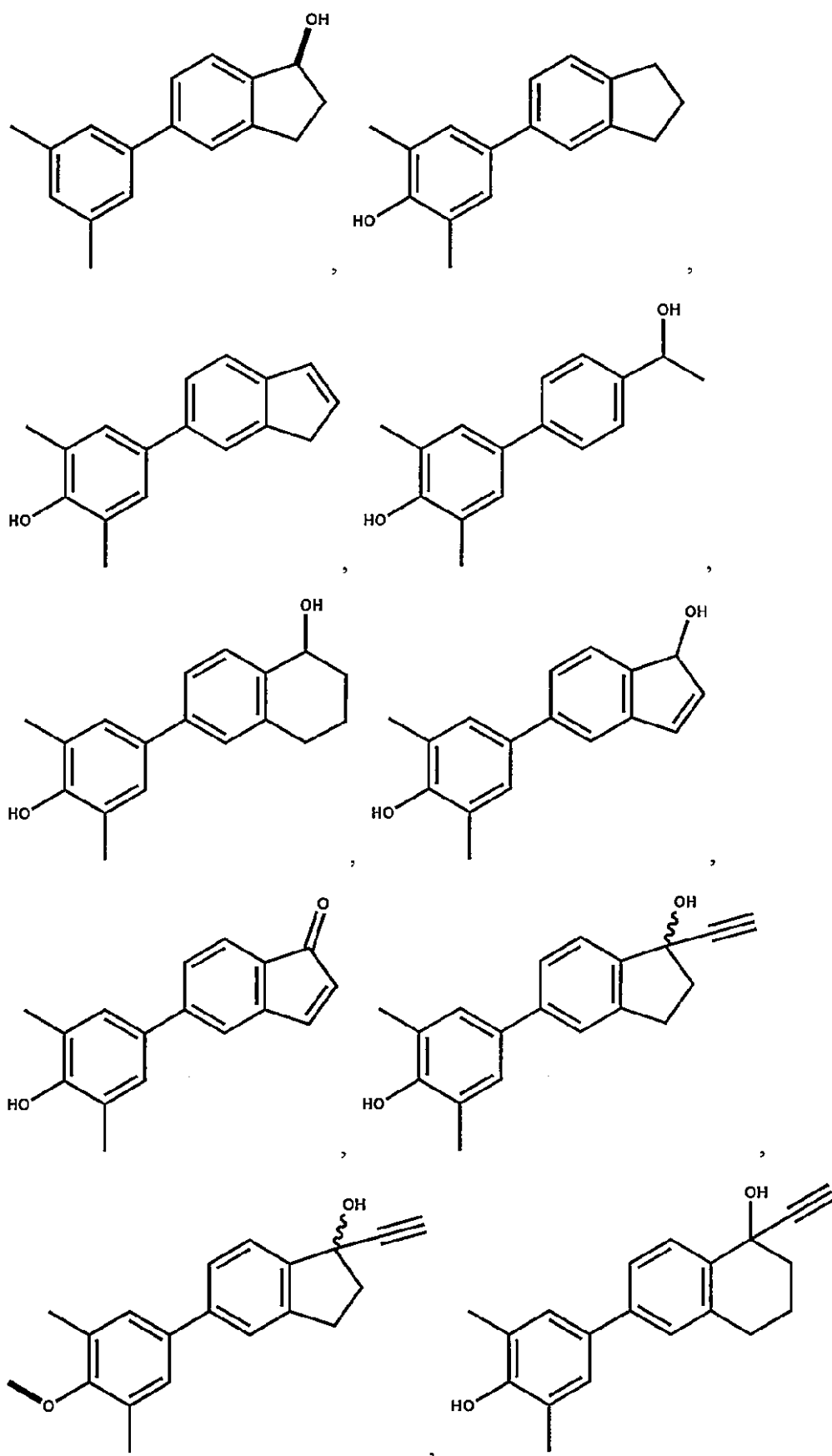
,

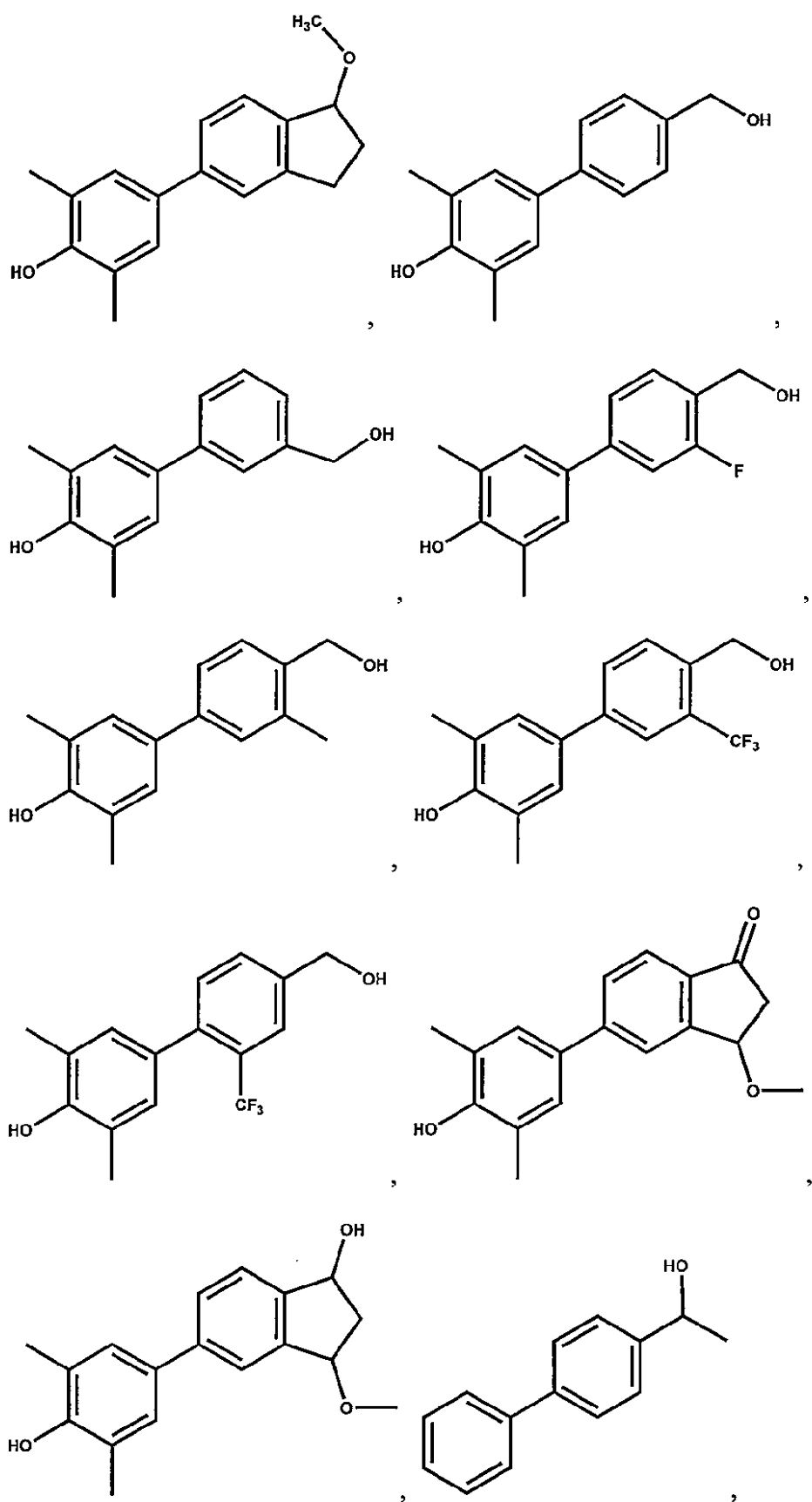


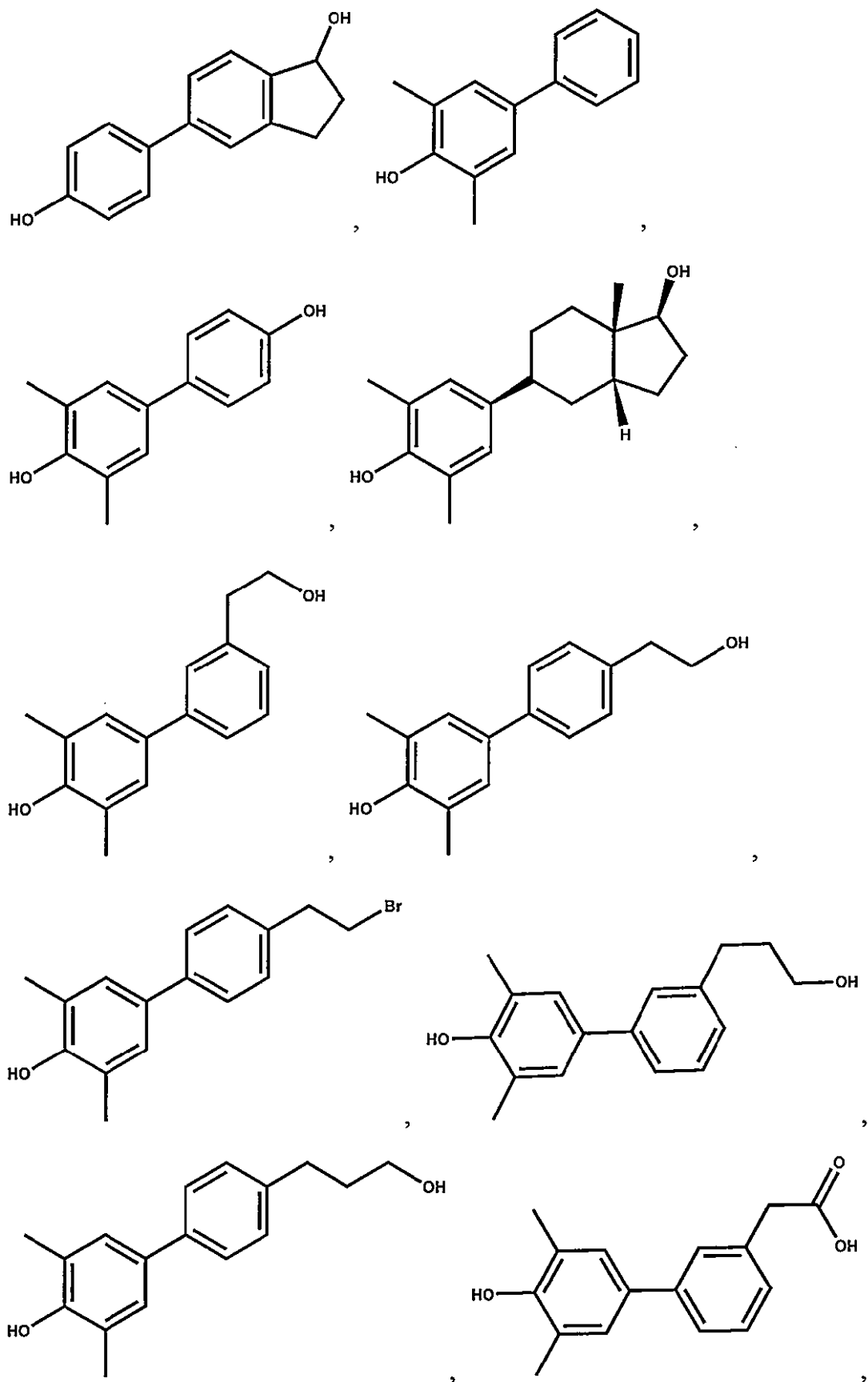
,

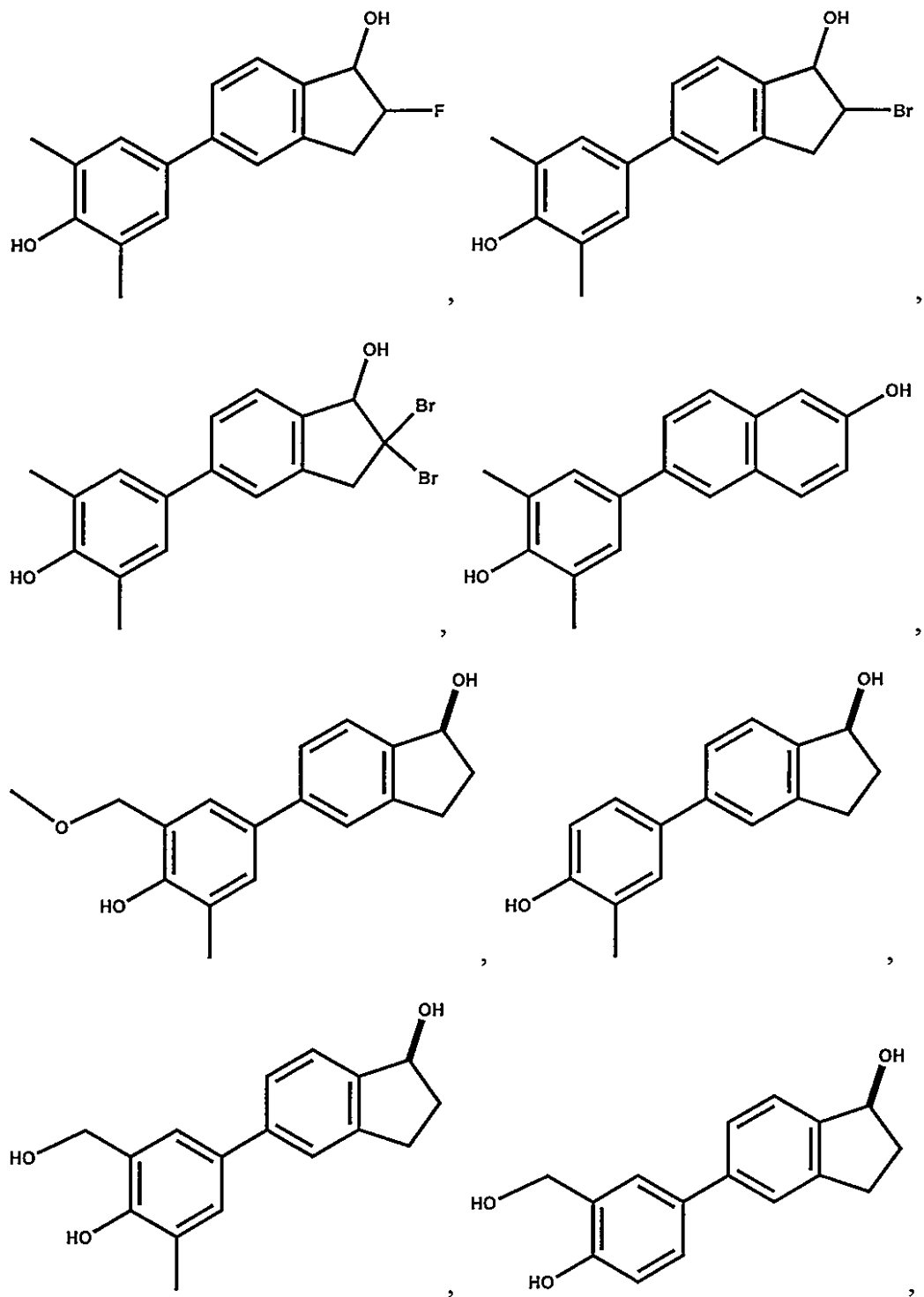


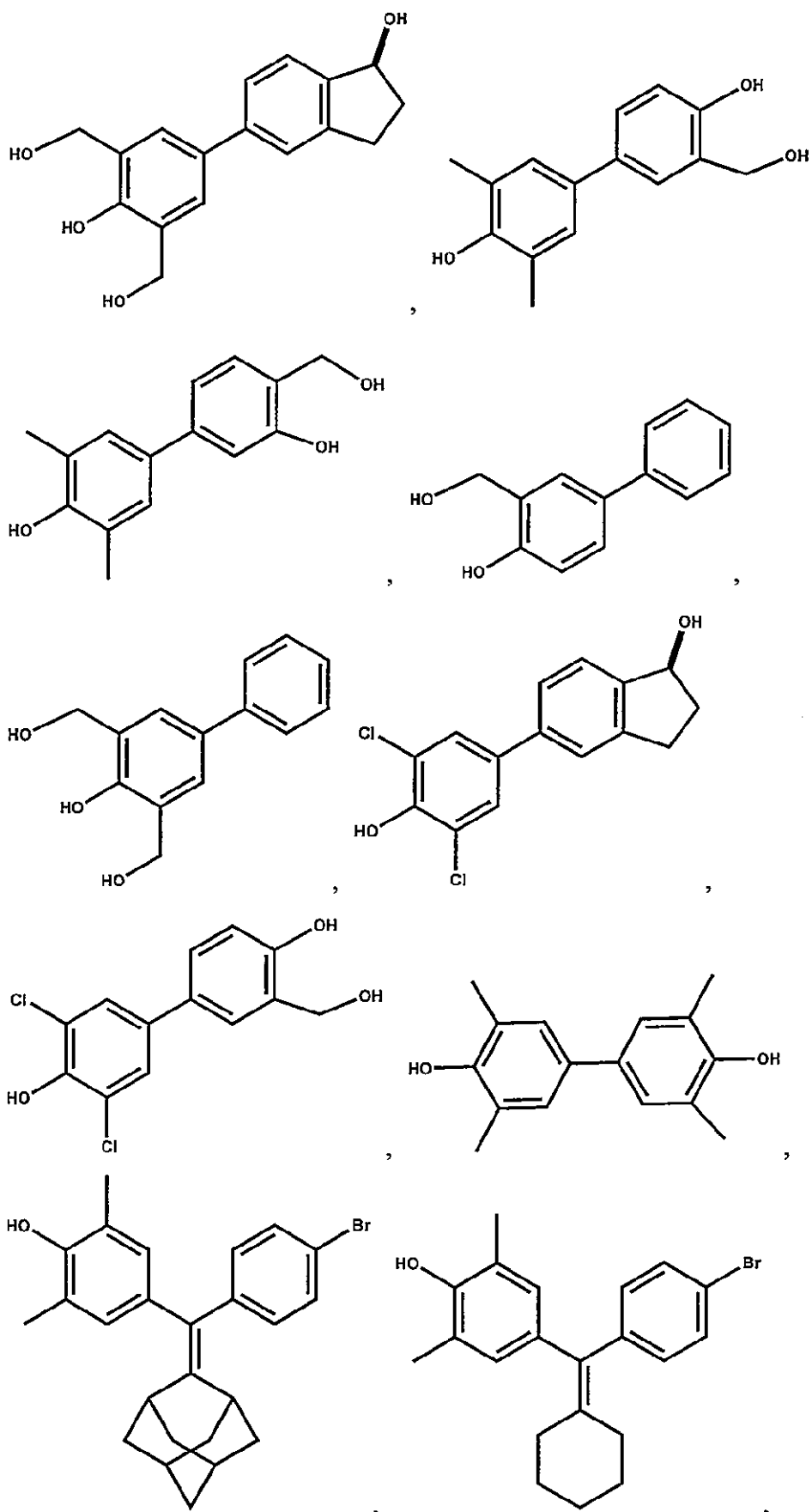
,

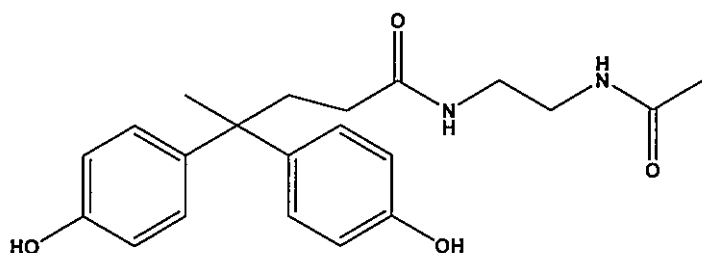
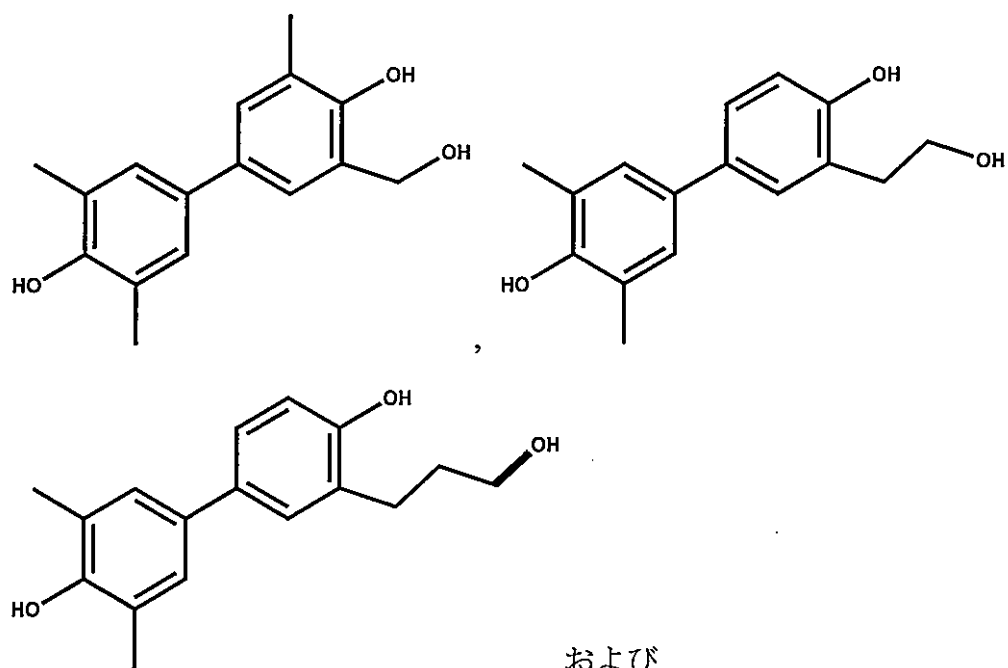






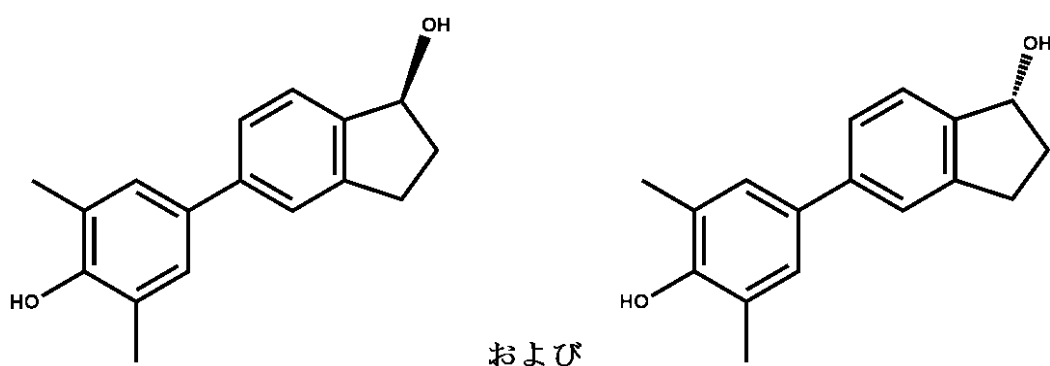






【請求項 19】

下記からなる群から選択される、請求項 18 記載の化合物 またはその医薬的に許容される塩：



【請求項 20】

請求項 1 ~ 19 のいずれか 1 項記載の化合物 またはその医薬的に許容される塩 を含む医薬組成物。

【請求項 21】

請求項 1 記載の化合物 またはその医薬的に許容される塩 の治療的有効量を投与することを含む 対象における疾患または状態を治療する方法であって、前記疾患または状態が閉経後症状、心血管疾患、脳卒中、血管疾患、骨疾患、代謝性疾患、関節炎、骨粗鬆症、肥満、血管運動性症状/のぼせ、認知低下、および癌から選択される、前記方法。

【請求項 22】

請求項 1 記載の化合物またはその医薬的に許容される塩および使用説明書を含むキット

。