

【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

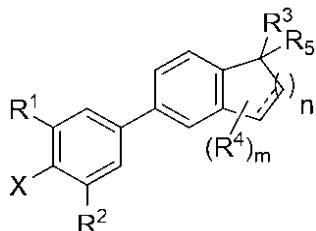
【補正方法】変更

【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；R₁およびR₂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；R₃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；R₄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；R₅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】

R₁およびR₂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】

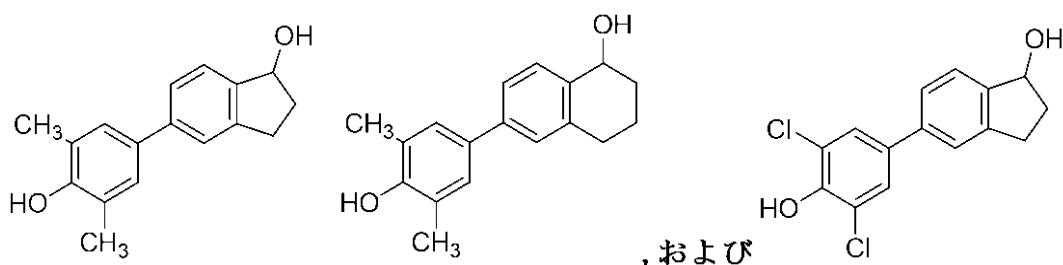
R₁およびR₂が、独立して、H、メチル、エチル、クロロ、-CH₂OHおよび-CH₂OMeから選択される、請求項1記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 4】

R₃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。

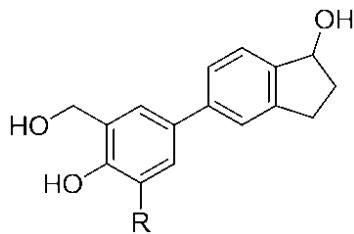
【請求項 5】

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：



【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

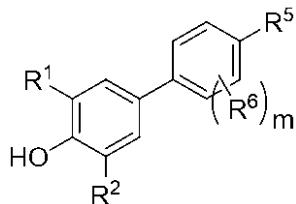


(iii)

(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、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；
R₂は、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；
R₅は、H、ヒドロキシまたはC_{1～4}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C_{1～4}アルキルであり；
C_{1～4}アルキルまたはC_{1～4}アルコキシがハロ、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8】

R₁およびR₂の少なくとも一方がC_{1～4}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】

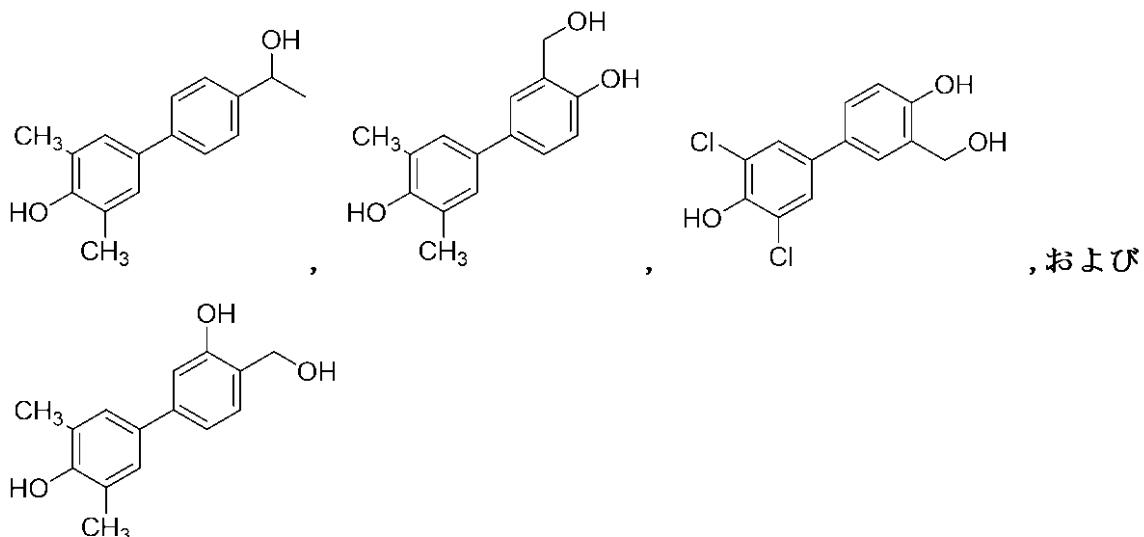
R₅が-CH(OH)(CH₃)である、請求項7または8記載の化合物または医薬的に許容されるその塩。

【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。

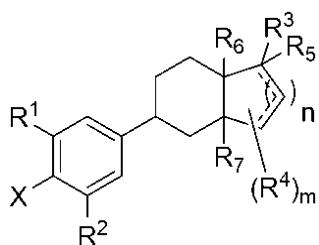
【請求項11】

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；R₁およびR₂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；R₃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R₄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；R₅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；R₆およびR₇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 1 3】

R₁およびR₂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】

R₁およびR₂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】

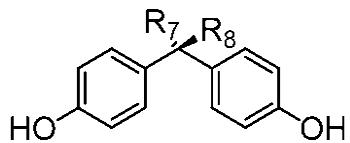
R₃が、H、OH、オキソ、クロロ、シアノまたはメトキシから選択され、mが0である、請求項1 2, 1 3または1 4記載の化合物。

【請求項 1 6】

R₆がメチルであり、R₇がHである、請求項12, 13、14または15記載の化合物。

【請求項17】

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；



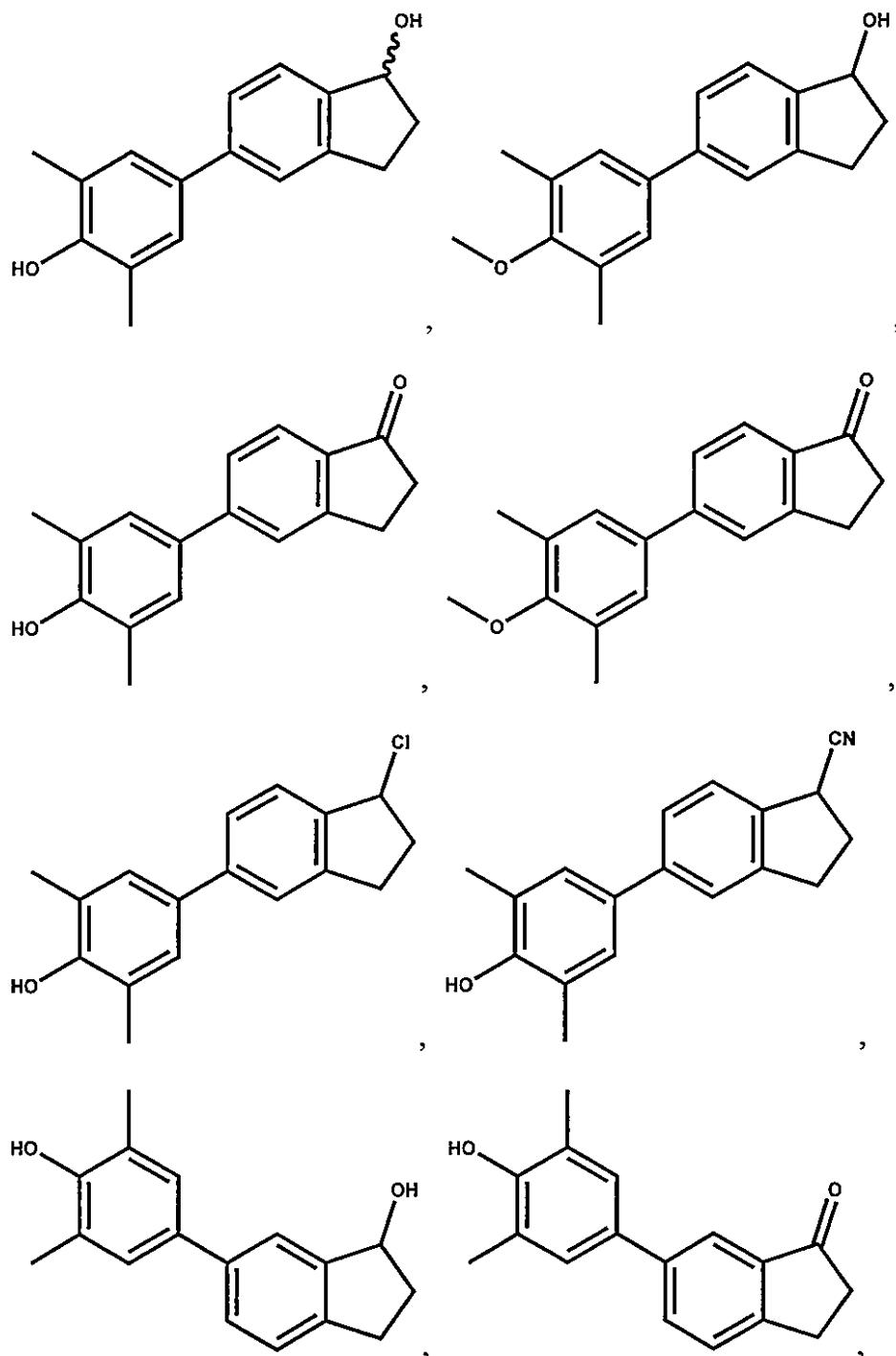
(vii)

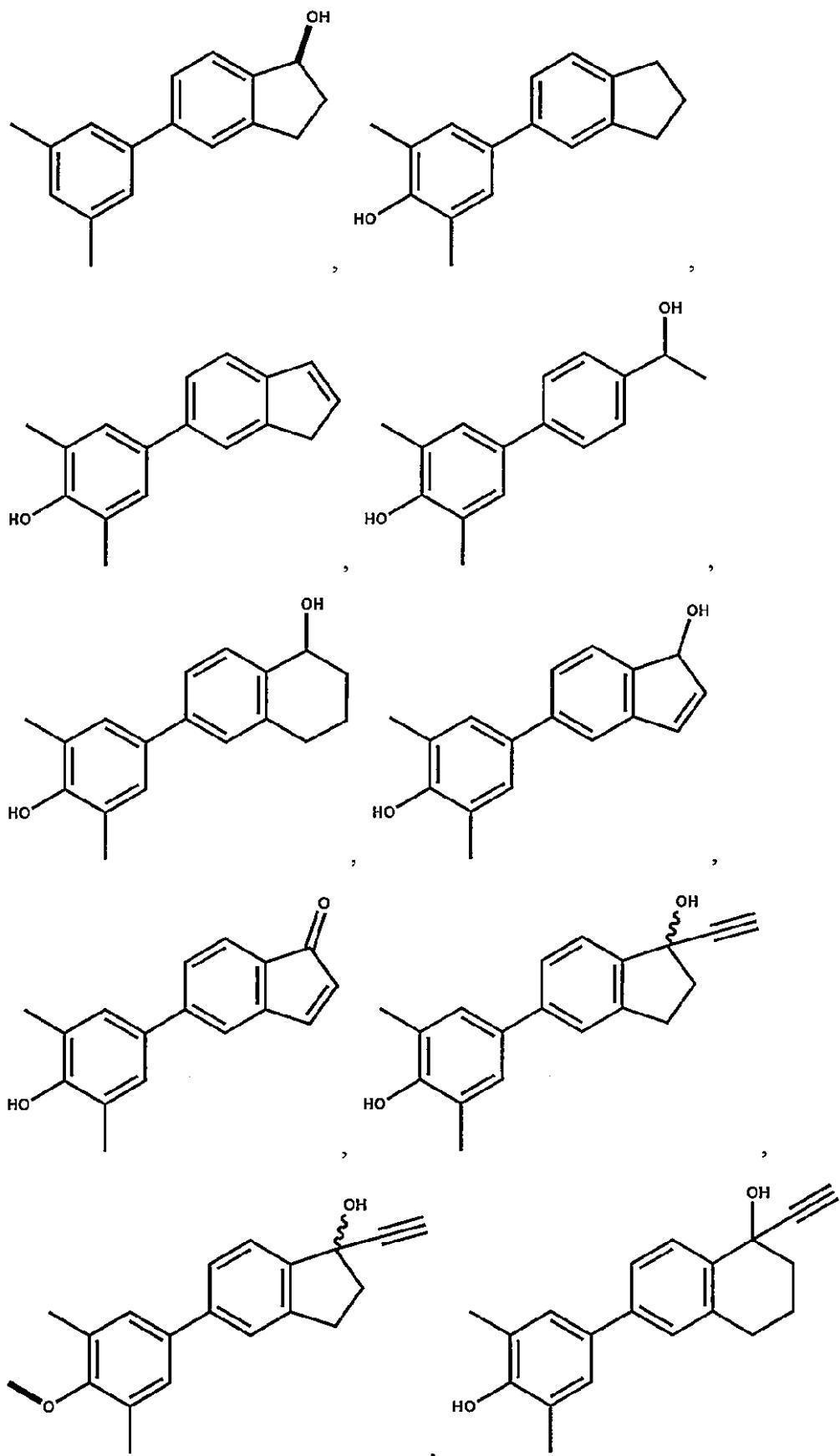
(式中、

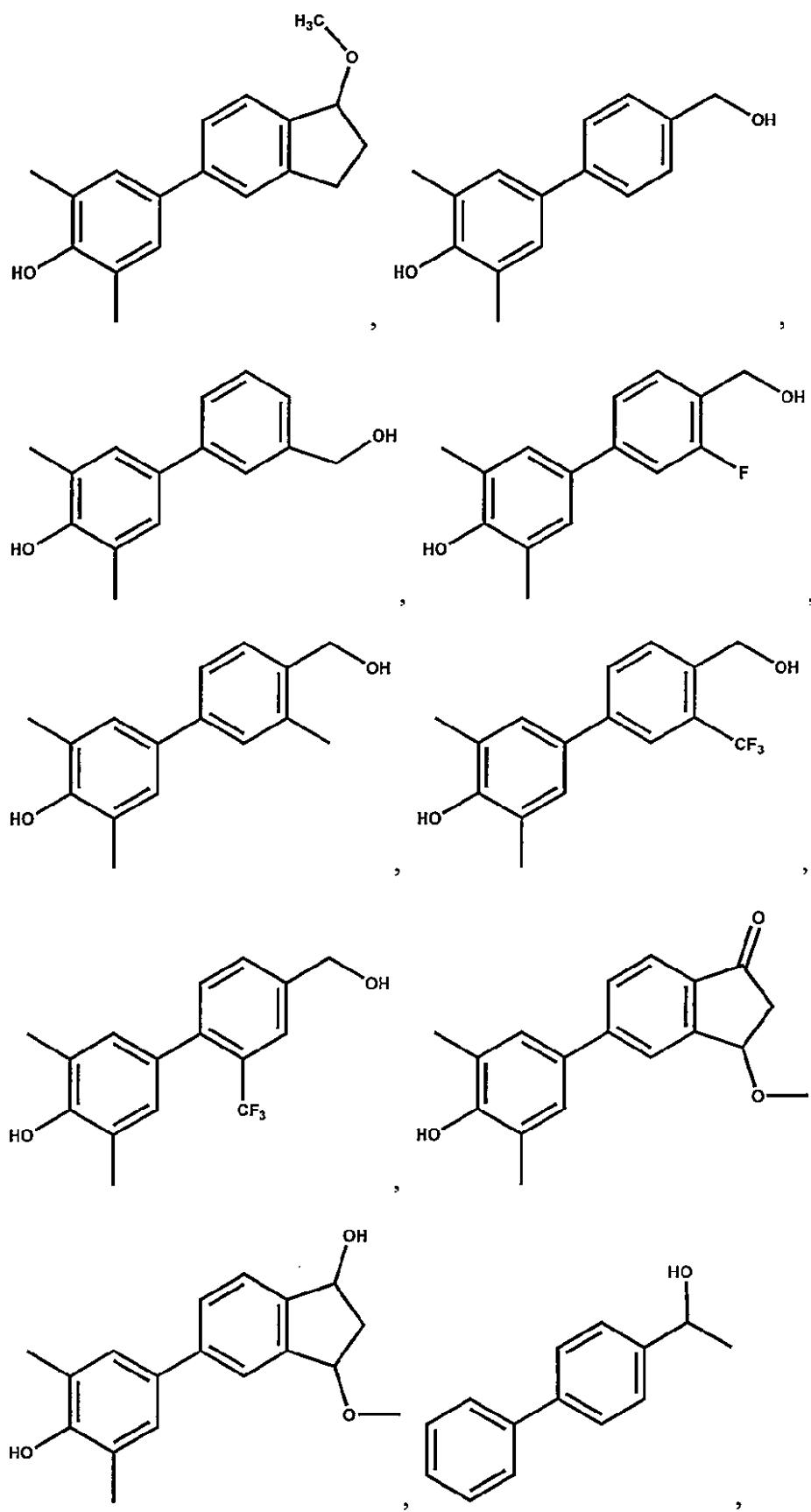
R₇およびR₈は、独立して、H、C₁₋₅アルキル、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、アミド、環状C₃₋₈アルキルまたはヘテロシクリルである)。

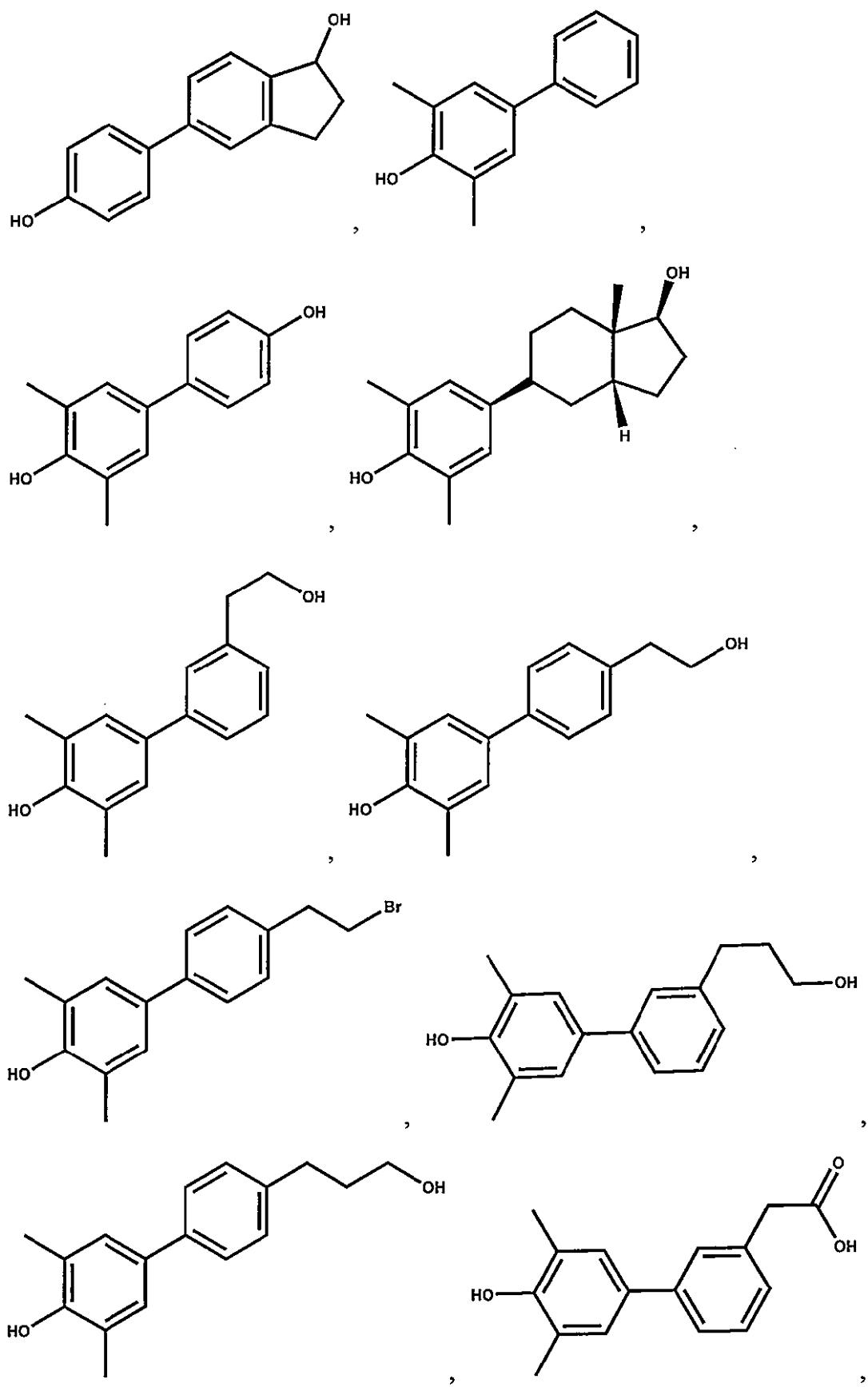
【請求項18】

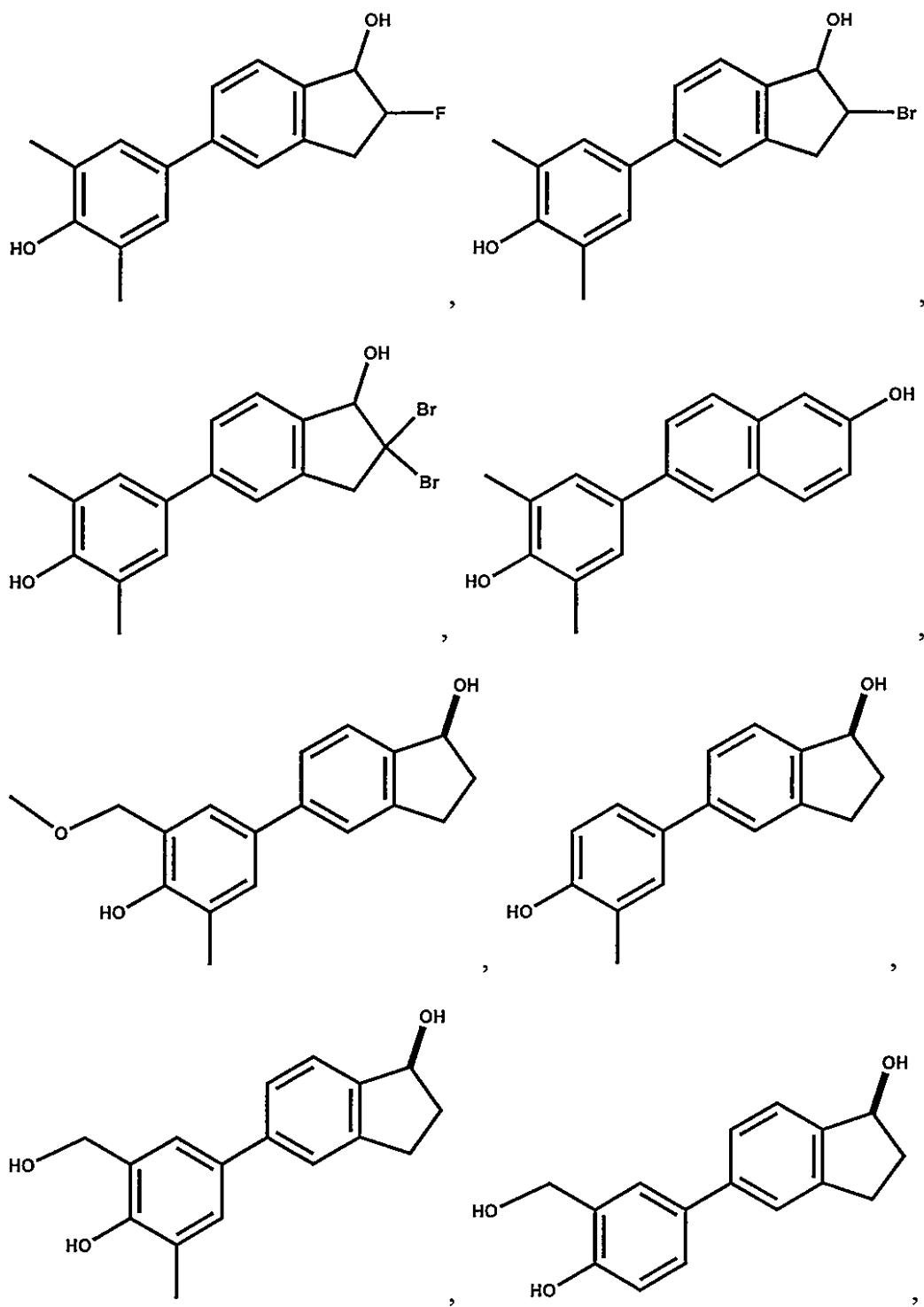
下記からなる群から選択される化合物またはその立体異性体若しくは医薬的に許容される塩：

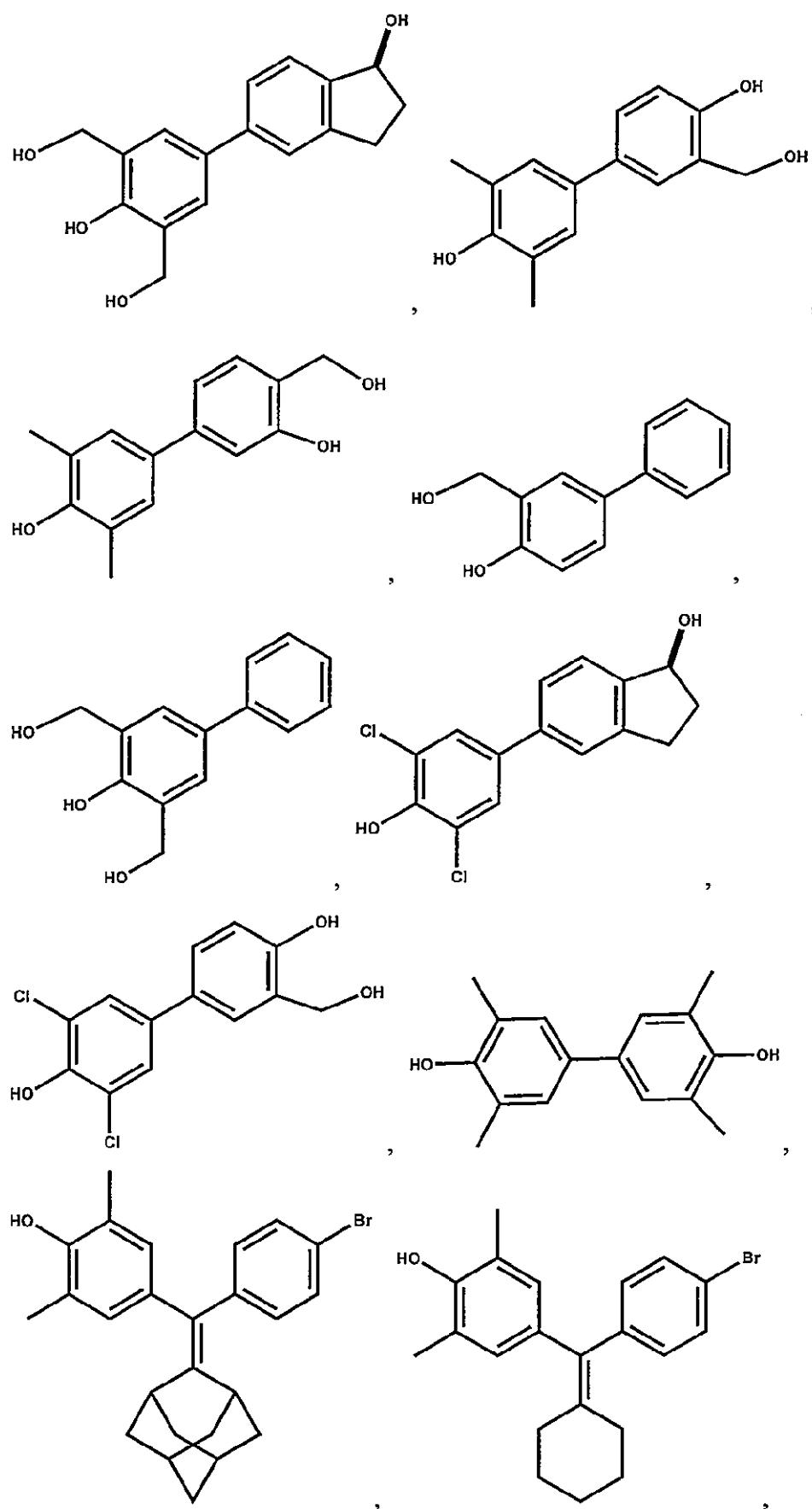


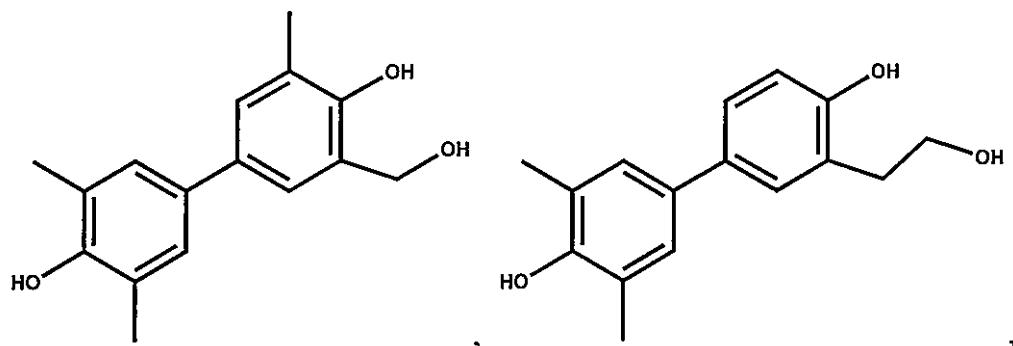




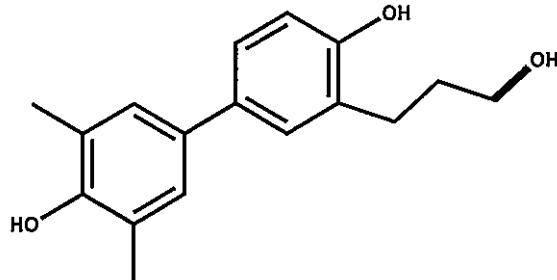




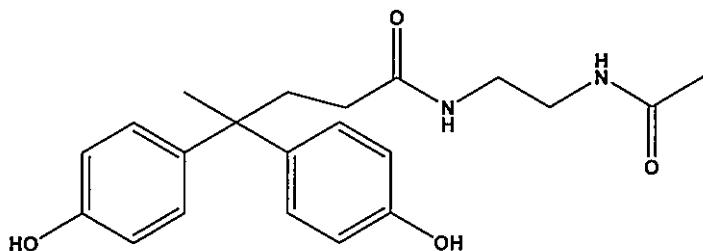




,

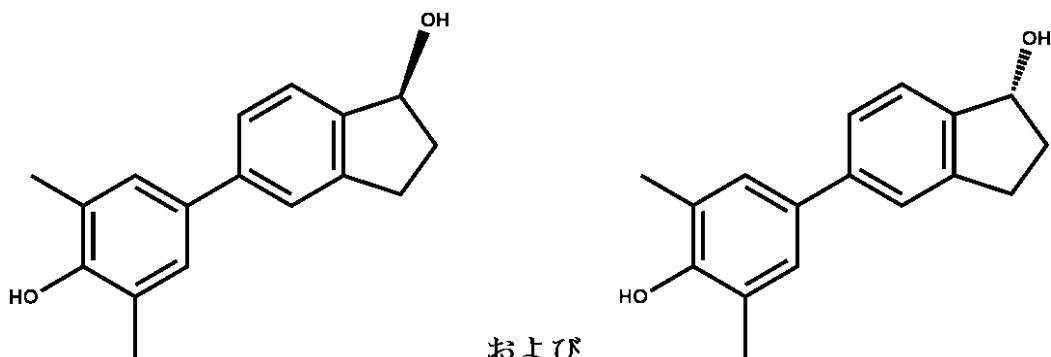


および



【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：



および

【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
。