

【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】平成27年4月30日 (2015.4.30)

【公表番号】特表2014-508170(P2014-508170A)

【公表日】平成26年4月3日 (2014.4.3)

【年通号数】公開・登録公報2014-017

【出願番号】特願2013-558126(P2013-558126)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/12 C S P

A 6 1 K 31/454

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 29/00

【手続補正書】

【提出日】平成27年3月12日 (2015.3.12)

【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

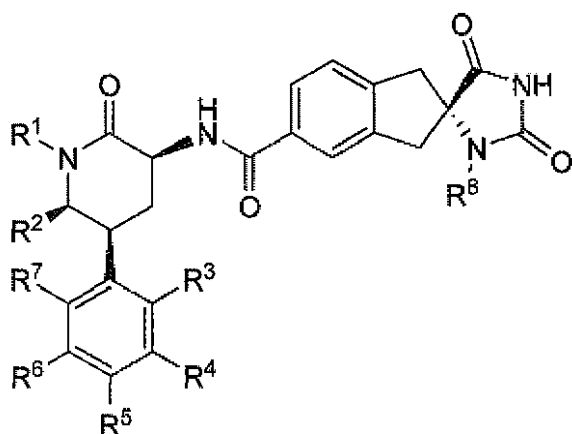
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物：

【化 1】



I

またはその製薬上許容される塩、

〔式中、

R<sup>1</sup> は、C<sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチルおよび [ 1 - (トリフルオロメチル)シクロプロピル ] メチルからなる群から選択され、その各々は、ヒドロキシルおよび F からなる群から独立して選択される、価数によって許容される 1 ~ 4 個の置換基で置換されていてもよく；

R<sup>2</sup> は、水素またはメチルであり；

R<sup>2</sup> が水素である場合、

R<sup>3</sup> は、水素、F または C<sub>1</sub> から選択され；

R<sup>4</sup> は、水素、F または C<sub>1</sub> から選択され；

R<sup>5</sup> は、水素であり；

R<sup>6</sup> は、水素または F から選択され；そして

R<sup>7</sup> は、水素、F または C<sub>1</sub> から選択され；

R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> のうちの少なくとも 2 つは F または C<sub>1</sub> でなければならず、但し、R<sup>3</sup> が F であれば、その場合 R<sup>4</sup>、R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> は全て水素であってよく；そして、R<sup>4</sup> が C<sub>1</sub> である場合、R<sup>7</sup> は C<sub>1</sub> ではあり得ず；

R<sup>2</sup> がメチルである場合、

R<sup>3</sup> は、水素、メチル、F、C<sub>1</sub>、または Br から選択され；

R<sup>4</sup> は、水素、メチル、F または C<sub>1</sub> から選択され；

R<sup>5</sup> は、水素または F から選択され；

R<sup>6</sup> は、水素または F から選択され；そして

R<sup>7</sup> は、水素、メチル、F または C<sub>1</sub> から選択され；

但し、R<sup>5</sup> が F である場合、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> のうちの少なくとも 3 つは F でなければならず；そして、R<sup>4</sup> がメチルまたは C<sub>1</sub> である場合、R<sup>7</sup> はメチルまたは C<sub>1</sub> ではあり得ず；そして

R<sup>8</sup> は、水素、C<sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、シクロプロピルメチル、およびシクロブチルメチルからなる群から選択され、その各々は、価数によって許容される 1 ~ 3 個のフルオロ置換基で置換されていてもよい）。

【請求項 2】

R<sup>1</sup> が、ヒドロキシルおよび F からなる群から独立して選択される、価数によって許容される 1 ~ 4 個の置換基で置換されていてもよい C<sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキルである、請求項 1 に記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項 3】

R<sup>1</sup> が、イソプロピル、2, 2, 2 - トリフルオロエチルおよび 2 - メチルプロピルから選択される、請求項 2 に記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項 4】

R<sup>1</sup> が、2, 2, 2 - トリフルオロエチルである、請求項 3 に記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項 5】

R<sup>2</sup> が水素である、請求項 1 に記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項 6】

R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> のうちの少なくとも 2 つが F または C<sub>1</sub> であり、但し、R<sup>4</sup> が C<sub>1</sub> である場合は、R<sup>7</sup> は、C<sub>1</sub> ではあり得ない、請求項 5 に記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項 7】

R<sup>3</sup> が F であり、R<sup>4</sup>、R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> が水素である、請求項 5 に記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項 8】

R<sup>2</sup> がメチルである、請求項 1 に記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項 9】

R<sup>5</sup> が F であり、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> のうちの少なくとも 3 つが F である、請求項 8 に記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

## 【請求項 10】

R<sup>5</sup> が水素であり、そして R<sup>4</sup> がメチルまたは C<sub>1</sub> である場合には、R<sup>7</sup> はメチルまたは C<sub>1</sub> ではあり得ない、請求項 8 に記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

## 【請求項 11】

R<sup>3</sup> が、水素、メチルまたは F から選択され；R<sup>4</sup> が、水素、メチルまたは F から選択され；R<sup>5</sup> が水素であり；R<sup>6</sup> が、水素または F から選択され；そして、R<sup>7</sup> が、水素、メチルまたは F から選択され；但し、R<sup>4</sup> がメチルである場合には、R<sup>7</sup> はメチルではあり得ない、請求項 8 に記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

## 【請求項 12】

R<sup>3</sup> が水素または F であり、R<sup>4</sup> が水素または F であり、R<sup>6</sup> が水素または F であり、そして、R<sup>7</sup> が水素または F である、請求項 11 に記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

## 【請求項 13】

R<sup>8</sup> が C<sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキルである、請求項 1 または 8 に記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

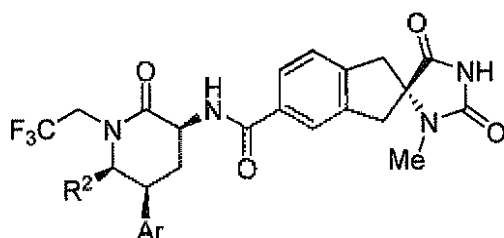
## 【請求項 14】

R<sup>8</sup> がメチルである、請求項 13 に記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

## 【請求項 15】

以下、

## 【化 2】



【表 1】

R <sup>2</sup>	Ar
Me	2,3,5-トリフルオロフェニル
Me	2,3,6-トリフルオロフェニル
Me	フェニル
Me	2,3,5,6-テトラフルオロフェニル
Me	2-メチルフェニル
Me	3-メチルフェニル
Me	3-フルオロ-2-メチルフェニル

から選択される、請求項 1 に記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

## 【請求項 16】

不活性担体、および請求項 1 に記載の化合物またはその製薬上許容される塩を含む医薬組成物。

## 【請求項 17】

治療上有効な量の請求項 1 に記載の化合物またはその製薬上許容される塩を含む、頭痛の治療用の医薬組成物。

## 【請求項 18】

頭痛が片頭痛である、請求項 17 に記載の 医薬組成物。

【請求項 19】

頭痛の治療用の医薬の製造のための、請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の化合物またはその製薬上許容される塩、および製薬上許容される担体の使用。

【請求項 20】

頭痛が片頭痛である、請求項 19 に記載の使用。