

【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 10 月 3 日 (2019.10.3)

【公表番号】特表 2018-525426 (P2018-525426A)

【公表日】平成 30 年 9 月 6 日 (2018.9.6)

【年通号数】公開・登録公報 2018-034

【出願番号】特願 2018-510980 (P2018-510980)

【国際特許分類】

C 07D 471/04 (2006.01)

A 61P 43/00 (2006.01)

A 61K 9/20 (2006.01)

A 61K 9/48 (2006.01)

A 61K 9/06 (2006.01)

A 61K 9/12 (2006.01)

A 61K 9/08 (2006.01)

A 61K 9/70 (2006.01)

A 61P 31/12 (2006.01)

A 61P 31/22 (2006.01)

A 61P 31/16 (2006.01)

A 61P 31/14 (2006.01)

A 61P 31/20 (2006.01)

A 61P 31/18 (2006.01)

A 61P 35/00 (2006.01)

A 61P 35/02 (2006.01)

A 61P 17/00 (2006.01)

A 61P 17/04 (2006.01)

A 61P 17/02 (2006.01)

A 61P 11/06 (2006.01)

A 61P 37/08 (2006.01)

A 61P 11/02 (2006.01)

A 61P 33/00 (2006.01)

A 61P 33/06 (2006.01)

A 61K 39/39 (2006.01)

A 61K 31/437 (2006.01)

C 07D 471/14 (2006.01)

A 61K 31/4375 (2006.01)

【F I】

C 07D 471/04 1 0 5 C

C 07D 471/04 C S P

A 61P 43/00 1 1 1

A 61K 9/20

A 61K 9/48

A 61K 9/06

A 61K 9/12

A 61K 9/08

A 61K 9/70 4 0 1

A 61P 31/12

A 61P 31/22

A 61P 31/16

A 6 1 P 31/14  
 A 6 1 P 31/20  
 A 6 1 P 31/18  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 35/02  
 A 6 1 P 17/00  
 A 6 1 P 17/04  
 A 6 1 P 17/02  
 A 6 1 P 11/06  
 A 6 1 P 37/08  
 A 6 1 P 11/02  
 A 6 1 P 33/00  
 A 6 1 P 33/06  
 A 6 1 K 39/39  
 A 6 1 K 31/437  
 C 0 7 D 471/14 1 0 2  
 A 6 1 K 31/4375

## 【手続補正書】

【提出日】令和1年8月23日(2019.8.23)

## 【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

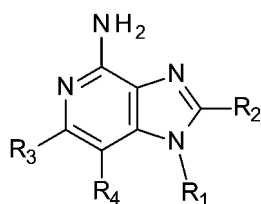
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 ( I ) :

【化 1】



式 I

〔式中、

$R_3$  及び  $R_4$  は、一緒になって縮合ベンゼン環、縮合ピリジン環、縮合シクロヘキセン環、又は縮合テトラヒドロピリジン環を形成し、前記縮合ベンゼン環、縮合ピリジン環、縮合シクロヘキセン環、又は縮合テトラヒドロピリジン環は、非置換であるか、1又は複数の R 基で置換されているかのいずれかであり、

R は、ハロゲン、ヒドロキシル、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、 $-C(O)-O-$ アルキル、 $-C(O)-OCH_2Ph$ 、 $-C(O)-O-$ アリール、アミノ、アルキルアミノ、及びジアルキルアミノ、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アリールアルキレンオキシ、アリールオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、ヘテロアリールアルキレンオキシ、及びヘテロアリールオキシからなる群から選択され、前記アルキル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アリールアルキレンオキシ、アリール

R<sub>1</sub> は、 $-W-X-N(R_5)-C(=NH)-NH_2$ 、  
 $-W-Z-N(R_5)-C(=NH)-NH_2$ 、及び

$$\text{—W—X—} \begin{array}{c} | \\ \diagdown \\ \text{Q} \end{array} \quad \text{N(R}_5\text{)—C(=NH)—NH}_2$$

【請求項 5】

Z が、 $-C_{1 \sim 5}$  アルキレン - アリーレン -  $-C_{1 \sim 5}$  アルキレン - 又は  $-C_{1 \sim 5}$  アルキレン - ヘテロアリーレン -  $-C_{1 \sim 5}$  アルキレン - である、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

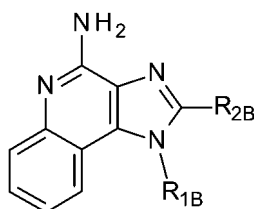
【請求項 6】

$R_2$  が、水素、アルキル、アルコキシアルキレニル、アルキルアミノアルキレニル、及びヒドロキシアルキレニルからなる群から選択される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 7】

式 X I I I :

【化 3】

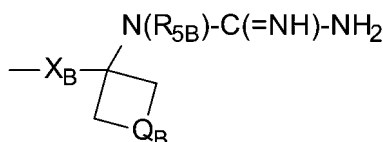


式 XIII

[ 式中、

$R_{1B}$  は、 $-X_B - N(R_{5B}) - C(=NH) - NH_2$ 、  
 $-Z_B - N(R_{5B}) - C(=NH) - NH_2$ 、及び

【化 4】



からなる群から選択され、

$X_B$  は、アルキレン、アルケニレン、及びアルキニレンからなる群から選択され、前記アルキレン、アルケニレン、及びアルキニレン基のいずれも、1 又は複数の  $-O-$  基により任意に介在されていてもよく、

$Z_B$  は、

- $X_B$  - アリーレン -  $X_B$  - 、
- $X_B$  - ヘテロアリーレン -  $X_B$  - 、
- $X_B$  - アリーレン - 、及び
- $X_B$  - ヘテロアリーレン - からなる群から選択され、

$R_{2B}$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、 $-O-$  アルキル、ヒドロキシアルキレニル、アルコキシアルキレニル、アルキルアミノアルキレニル、ヒドロキシル、 $-CH_2 - NH - O -$  アルキル、及び  $-CH_2 - NH - C(O) -$  アルキルからなる群から選択され、

$R_{5B}$  は、水素、アルキル、アリールアルキレニル、アルコキシアルキレニル、アリーロキシアルキレニル、ベンジルオキシアルキレニル、アリール -  $(CH_2)_{2 \sim 6} - O -$  アルキレニル、及びシクロアルキルアルキレニルからなる群から選択され、前記アルキル、アリールアルキレニル、アルコキシアルキレニル、アリーロキシアルキレニル、ベンジルオキシアルキレニル、アリール -  $(CH_2)_{2 \sim 6} - O -$  アルキレニル、及びシクロアルキルアルキレニル基のいずれも、非置換であるか、ハロゲン、ヒドロキシル、アルコキシ、アルキル、ハロアルキル、及びニトリルからなる群から独立して選択される 1 又は複数の置換基で置換されているかのいずれかであることができ、

$Q_B$  は、結合、 $-CH_2 -$ 、 $-CH_2CH_2 -$ 、 $-CH_2CH_2CH_2 -$ 、 $-CH_2C$

$\text{H}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、  
及び $-\text{OCH}_2-$ からなる群から選択される]の化合物、

又は製薬上許容されるその塩。

【請求項 8】

$\text{R}_{1\text{B}}$  が、 $-\text{X}_{\text{B}}-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{NH})-\text{NH}_2$ 、及び $-\text{Z}_{\text{B}}-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{NH})-\text{NH}_2$ からなる群から選択される、請求項 7 に記載の化合物又は塩。

【請求項 9】

$\text{X}_{\text{B}}$  が、1 又は複数の $-\text{O}-$ 基により任意に介在されていてもよいアルキレンであり、  
 $\text{Z}_{\text{B}}$  が、 $-\text{C}_{1\sim 5}$ アルキレン-アリーレン- $\text{C}_{1\sim 5}$ アルキレン-又は $-\text{C}_{1\sim 5}$ アルキレン-ヘテロアリーレン- $\text{C}_{1\sim 5}$ アルキレン-である、請求項 7 又は 8 に記載の化合物又は塩。

【請求項 10】

$\text{R}_{2\text{B}}$  が、水素、アルキル、アルコキシアルキレニル、アルキルアミノアルキレニル、  
及びヒドロキシアルキレニルからなる群から選択される、請求項 7 ~ 9 のいずれか一項に  
記載の化合物又は塩。

【請求項 11】

請求項 1 に記載の化合物又は塩の治療有効量を、製薬上許容される担体と組み合わせて  
含む、医薬組成物。