

【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 0 7 D	471/04	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 K	9/48	(2006.01)
A 6 1 K	9/06	(2006.01)
A 6 1 K	9/12	(2006.01)
A 6 1 K	9/08	(2006.01)
A 6 1 K	9/70	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	31/22	(2006.01)
A 6 1 P	31/16	(2006.01)
A 6 1 P	31/14	(2006.01)
A 6 1 P	31/20	(2006.01)
A 6 1 P	31/18	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/04	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 P	11/02	(2006.01)
A 6 1 P	33/00	(2006.01)
A 6 1 P	33/06	(2006.01)
A 6 1 K	39/39	(2006.01)
A 6 1 K	31/437	(2006.01)
C 0 7 D	471/14	(2006.01)
A 6 1 K	31/4375	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D	471/04	1 0 5 C
C 0 7 D	471/04	C S P
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 K	9/20	
A 6 1 K	9/48	
A 6 1 K	9/06	
A 6 1 K	9/12	
A 6 1 K	9/08	
A 6 1 K	9/70	4 0 1
A 6 1 P	31/12	
A 6 1 P	31/22	
A 6 1 P	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

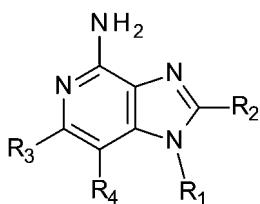
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式(I) :

## 【化1】



式I

## [式中、

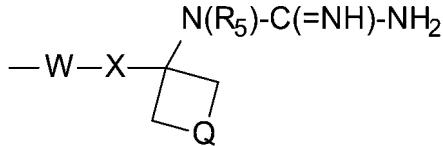
$\text{R}_3$  及び  $\text{R}_4$  は、一緒になって縮合ベンゼン環、縮合ピリジン環、縮合シクロヘキセン環、又は縮合テトラヒドロピリジン環を形成し、前記縮合ベンゼン環、縮合ピリジン環、縮合シクロヘキセン環、又は縮合テトラヒドロピリジン環は、非置換であるか、1又は複数のR基で置換されているかのいずれかであり、

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<sub>2</sub>Ph、-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、アリールオキシアリキレニル、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、アリールオキシアリキレニル、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基は、非置換であるか、アルキル、アルコキシ、ハロゲン、ハロアルキル、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキレニル、アルコキシアルキレニル、アリールアルキレンオキシ、ニトリル、アミノ、アルキルアミノ、及びジアルキルアミノからなる群から独立して選択される1又は複数の置換基によって置換されていることができ、

$R_1$  は、 $-W-X-N(R_5)-C(=NH)-NH_2$ 、  
 $-W-Z-N(R_5)-C(=NH)-NH_2$ 、及び

【化2】



からなる群から選択され、

$W$ は、共有結合、 $-O-$ 、及び $-NH-$ からなる群から選択され、

$X$ 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、

$Z$ は、

$-X-$ アリーレン $-X-$ 、  
 $-X-$ ヘテロアリーレン $-X-$ 、  
 $-X-$ アリーレン $-$ 、及び

$-X-$ ヘテロアリーレン $-$ からなる群から選択され、

$R_2$ 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 $-CH_2-NHC(O)-$ アルキルからなる群から選択され、

$R_5$ 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、アリールオキシアルキレニル、ベンジルオキシアルキレニル、アリール $-(CH_2)_{2~6}-O-$ 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、アリールオキシアルキレニル、ベンジルオキシアルキレニル、アリール $-(CH_2)_{2~6}-O-$ 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きること、

$Q$ は、結合、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-O-CH_2-$ 、及び $-OCH_2-$ 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2】

$R_1$ が、 $-W-X-N(H)-C(=NH)-NH_2$ 、及び $-W-Z-N(H)-C(=NH)-NH_2$ からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物又は塩。

【請求項3】

$W$ が、共有結合又は $-O-$ である、請求項1又は2に記載の化合物又は塩。

【請求項4】

$X$ が、1又は複数の $-O-$ 基により任意に介在されていてよいアルキレンである、請求項1~3のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項5】

$Z$  が、-  $C_{1-5}$  アルキレン - アリーレン -  $C_{1-5}$  アルキレン - 又は -  $C_{1-5}$  アルキレン - ヘテロアリーレン -  $C_{1-5}$  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。

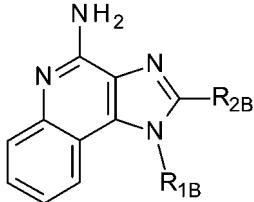
【請求項 6】

$R_2$  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】

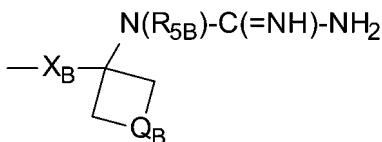


式 XIII

[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 -  $CH_2-NHC(O)$  - 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、アリールオキシアルキレニル、ベンジルオキシアルキレニル、アリール -  $(CH_2)_{2-6}-O$  - 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、アリールオキシアルキレニル、ベンジルオキシアルキレニル、アリール -  $(CH_2)_{2-6}-O$  - 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、-  $CH_2$  - 、-  $CH_2CH_2$  - 、-  $CH_2CH_2CH_2$  - 、-  $CH_2C$

$\text{H}_2\text{C}\text{H}_2\text{C}\text{H}_2-$ 、 $-\text{C}\text{H}_2\text{C}\text{H}_2\text{C}\text{H}_2\text{C}\text{H}_2\text{C}\text{H}_2-$ 、 $-\text{C}\text{H}_2-\text{O}-\text{C}\text{H}_2-$ 、  
及び $-\text{O}\text{C}\text{H}_2-$ 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、 $-\text{X}_{\text{B}}-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{N}\text{H})-\text{N}\text{H}_2$ 、及び $-\text{Z}_{\text{B}}-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{N}\text{H})-\text{N}\text{H}_2$ 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。