

【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28年3月31日(2016.3.31)

【公開番号】特開2016-26151(P2016-26151A)

【公開日】平成28年2月12日(2016.2.12)

【年通号数】公開・登録公報2016-010

【出願番号】特願2015-154042(P2015-154042)

【国際特許分類】

|        |         |           |
|--------|---------|-----------|
| C 07 D | 471/10  | (2006.01) |
| A 61 K | 31/497  | (2006.01) |
| A 61 P | 11/00   | (2006.01) |
| A 61 P | 43/00   | (2006.01) |
| A 61 K | 45/00   | (2006.01) |
| A 61 K | 31/7048 | (2006.01) |
| A 61 P | 31/04   | (2006.01) |

【F I】

|        |         |       |
|--------|---------|-------|
| C 07 D | 471/10  | 1 0 3 |
| C 07 D | 471/10  | C S P |
| A 61 K | 31/497  |       |
| A 61 P | 11/00   |       |
| A 61 P | 43/00   | 1 1 1 |
| A 61 K | 45/00   |       |
| A 61 K | 31/7048 |       |
| A 61 P | 31/04   |       |

【手続補正書】

【提出日】平成28年2月10日(2016.2.10)

【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】

次のものから選択される化合物：

[4-(3-{2-[(E)-3,5-ジアミノ-6-クロロ-ピラジン-2-カルボニルイミノ]-1,3,8-トリアザ-スピロ[4.5]デク-8-イル}-3-オキソ-プロピル)-フェノキシ]-酢酸シクロヘキシリオキシカルボニルメチルエステル；  
 3-(3-{2-[(E)-3,5-ジアミノ-6-クロロ-ピラジン-2-カルボニルイミノ]-1,3,8-トリアザ-スピロ[4.5]デカン-8-カルボニル}-ベンゼンスルホニルアミノ)-プロピオン酸シクロヘキシリオキシカルボニルメチルエステル；  
 [4-(3-{2-[(E)-3,5-ジアミノ-6-クロロ-ピラジン-2-カルボニルイミノ]-1,3,8-トリアザ-スピロ[4.5]デク-8-イル}-3-オキソ-プロピル)-フェノキシ]-酢酸ジプロピルカルバモイルメチルエステル；  
 [4-(3-{2-[(E)-3,5-ジアミノ-6-クロロ-ピラジン-2-カルボニルイミノ]-1,3,8-トリアザ-スピロ[4.5]デク-8-イル}-3-オキソ-プロピル)-フェノキシ]-酢酸tert-ブトキシカルボニルメチルエステル；  
 [2-クロロ-4-(3-{2-[(E)-3,5-ジアミノ-6-クロロ-ピラジン-2-カルボニルイミノ]-1,3,8-トリアザ-スピロ[4.5]デク-8-イル}-3-オキソ-

プロピル) - フェノキシ] - 酢酸 2 - (2 - オキソ - ピペリジン - 1 - イル) - エチルエステル；

[4 - (3 - {2 - [(E) - 3, 5 - ジアミノ - 6 - クロロ - ピラジン - 2 - カルボニルイミノ] - 1, 3, 8 - トリアザ - スピロ[4.5]デク - 8 - イル} - 3 - オキソ - プロピル) - フェノキシ] - 酢酸 2 - モルホリン - 4 - イル - 2 - オキソ - エチルエステル；

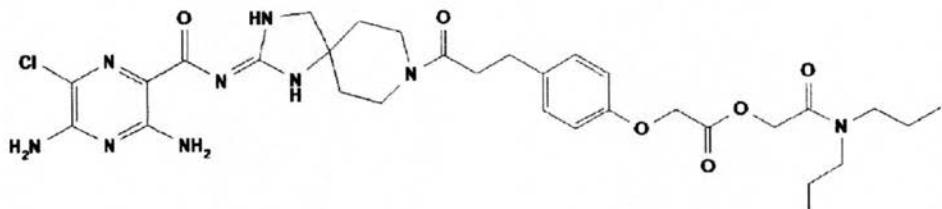
1 - [(3 - {2 - [(E) - 3, 5 - ジアミノ - 6 - クロロ - ピラジン - 2 - カルボニルイミノ] - 1, 3, 8 - トリアザ - スピロ[4.5]デカン - 8 - カルボニル} - ベンゼンスルホニルアミノ) - メチル] - シクロブタンカルボン酸ジプロピルカルバモイルメチルエステル；  
および

3 - [3 - (3 - {2 - [(E) - 3, 5 - ジアミノ - 6 - クロロ - ピラジン - 2 - カルボニルイミノ] - 1, 3, 8 - トリアザ - スピロ[4.5]デカン - 8 - カルボニル} - フェニル) - ウレイド] - プロピオン酸ジプロピルカルバモイルメチルエステル；またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

#### 【請求項 2】

下記構造：

#### 【化 4】

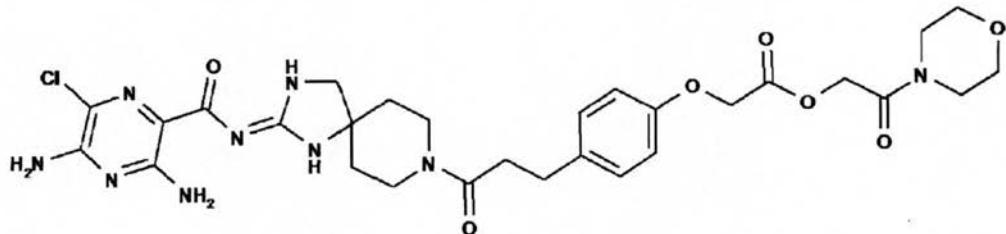


を有する、[4 - (3 - {2 - [(E) - 3, 5 - ジアミノ - 6 - クロロ - ピラジン - 2 - カルボニルイミノ] - 1, 3, 8 - トリアザ - スピロ[4.5]デク - 8 - イル} - 3 - オキソ - プロピル) - フェノキシ] - 酢酸ジプロピルカルバモイルメチルエステルである、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

#### 【請求項 3】

下記構造：

#### 【化 6】

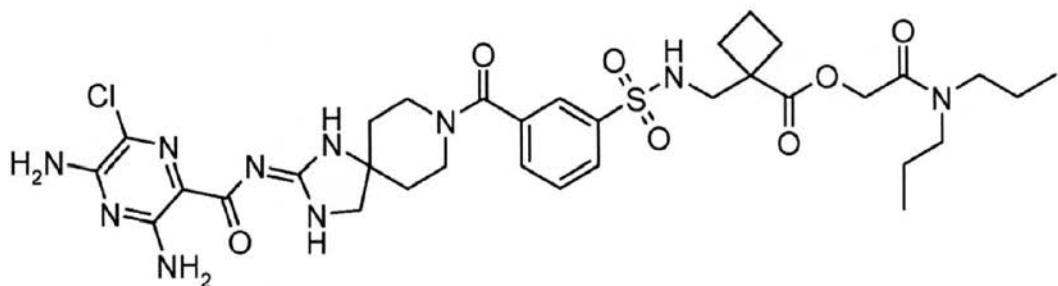


を有する、[4 - (3 - {2 - [(E) - 3, 5 - ジアミノ - 6 - クロロ - ピラジン - 2 - カルボニルイミノ] - 1, 3, 8 - トリアザ - スピロ[4.5]デク - 8 - イル} - 3 - オキソ - プロピル) - フェノキシ] - 酢酸 2 - モルホリン - 4 - イル - 2 - オキソ - エチルエステルである、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

#### 【請求項 4】

下記構造：

## 【化7】



を有する、1 - [(3 - {2 - [(E) - 3, 5 - ジアミノ - 6 - クロロ - ピラジン - 2 - カルボニルイミノ] - 1, 3, 8 - トリアザ - スピロ[4.5]デカン - 8 - カルボニル} - ベンゼンスルホニルアミノ) - メチル] - シクロブタンカルボン酸ジプロピルカルバモイルメチルエステルである、請求項1に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

## 【請求項5】

請求項1～4のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、および1種以上の薬学的に許容される添加物、希釈剤および／または担体を含む、医薬組成物。

## 【請求項6】

C F T R 機能修飾剤およびマクロライド抗生物質から選択される、1種以上の他の治療剤と組み合わせた、請求項5に記載の医薬組成物。

## 【請求項7】

医薬として使用するための、請求項1～4のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

## 【請求項8】

上皮性ナトリウムチャネルの遮断が仲介する疾患または状態の処置または予防に使用するための、請求項1～4のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

## 【請求項9】

囊胞性線維症、原発性線毛機能不全、および慢性閉塞性肺疾患から選択される、疾患または状態の処置または予防に使用するための、請求項1～4のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。