

【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 3 年 1 月 28 日 (2021.1.28)

【公表番号】特表 2020-514270 (P2020-514270A)

【公表日】令和 2 年 5 月 21 日 (2020.5.21)

【年通号数】公開・登録公報 2020-020

【出願番号】特願 2019-533585 (P2019-533585)

【国際特許分類】

C 0 7 F 7/18 (2006.01)

C 0 7 C 321/14 (2006.01)

C 0 7 C 271/10 (2006.01)

C 0 7 C 259/06 (2006.01)

C 0 7 C 235/42 (2006.01)

A 6 1 K 31/223 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

C 0 7 D 317/30 (2006.01)

A 6 1 K 31/357 (2006.01)

A 6 1 K 31/166 (2006.01)

C 0 7 D 295/155 (2006.01)

A 6 1 K 31/5375 (2006.01)

A 6 1 K 31/451 (2006.01)

A 6 1 K 31/495 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/472 (2006.01)

C 0 7 D 213/74 (2006.01)

C 0 7 D 217/18 (2006.01)

A 6 1 K 31/54 (2006.01)

C 0 7 D 211/14 (2006.01)

C 0 7 D 265/30 (2006.01)

C 0 7 D 307/52 (2006.01)

A 6 1 K 31/341 (2006.01)

C 0 7 D 333/36 (2006.01)

A 6 1 K 31/381 (2006.01)

A 6 1 K 31/4168 (2006.01)

C 0 7 D 233/88 (2006.01)

C 0 7 D 267/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

A 6 1 K 31/426 (2006.01)

C 0 7 D 277/30 (2006.01)

C 0 7 D 411/06 (2006.01)

C 0 7 D 409/06 (2006.01)

C 0 7 D 213/54 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 F 7/18 C S P L

C 0 7 C 321/14

C 0 7 C 271/10

C 0 7 C 259/06

C 0 7 C 235/42

A 6 1 K 31/223  
 A 6 1 P 31/04 1 7 1  
 A 6 1 P 11/00  
 C 0 7 D 317/30  
 A 6 1 K 31/357  
 A 6 1 K 31/166  
 C 0 7 D 295/155  
 A 6 1 K 31/5375  
 A 6 1 K 31/451  
 A 6 1 K 31/495  
 A 6 1 K 31/496  
 A 6 1 K 31/472  
 C 0 7 D 213/74  
 C 0 7 D 217/18  
 A 6 1 K 31/54  
 C 0 7 D 211/14  
 C 0 7 D 265/30  
 C 0 7 D 307/52  
 A 6 1 K 31/341  
 C 0 7 D 333/36  
 A 6 1 K 31/381  
 A 6 1 K 31/4168  
 C 0 7 D 233/88  
 C 0 7 D 267/10  
 A 6 1 K 31/553  
 A 6 1 K 31/426  
 C 0 7 D 277/30  
 C 0 7 D 411/06  
 C 0 7 D 409/06  
 C 0 7 D 213/54

## 【手続補正書】

【提出日】令和2年12月14日(2020.12.14)

## 【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

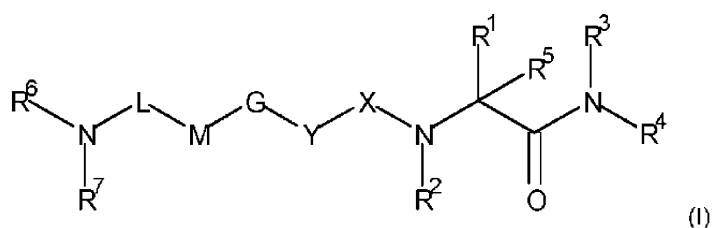
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



〔式中、

$R^{11}$  は、H、 $C(R^{11}R^{12}R^{13})$ 、 $C(=O)R^{11}$  及び  $-C(=NR^{14})R^{11}$  からなる群から選択され；

$R^{11}$  は、H 及び  $C_{1-6}$ -アルキルからなる群から選択され；

$R^{12}$  は、H、 $C_{1-6}$ -アルキル及び  $C_{1-6}$ -アルキル（ここで、該アルキルは、 $-SR^8$ 、 $-OR^9$ 、 $-C(=O)OR^9$ 、 $-NR^9R^{10}$ 、 $-SO_2NR^9R^{10}$  及び  $-SO_2R^8$  からなる群から選択される置換基で置換されている）からなる群から選択され；

$R^{13}$  は、H、 $C_{1-6}$ -アルキル、アリーール、 $-SR^8$ 、 $-OR^9$ 、 $-NR^9R^{10}$ 、 $-SO_2R^8$ 、ニトロ、 $-C(=O)NR^9R^{10}$  及び  $C_{1-6}$ -アルキル（ここで、該アルキルは、 $-SR^8$ 、 $-C(=O)NR^9R^{10}$ 、 $-SO_2NR^9R^{10}$ 、 $-SO_2R^8$ 、ニトロ、シアノ、 $-OR^9$ 、 $-C(=O)OR^9$  及び  $-NR^9C(=NR^{14})NR^9R^{10}$  からなる群から選択される置換基で置換されている）からなる群から選択され；

又は、

$R^{13}$  と  $R^2$  は、 $R^2$  が結合している N 原子と一緒にあって、3～6 個の環原子を有する飽和又は不飽和のヘテロ環 [ここで、1 個の環原子は N であり、及び、0 個、1 個又は 2 個のさらなる環原子は、N、S 及び O から選択され、残りの環原子は、C である] を形成し；

ここで、 $R^{13}$  が OH 又は  $NH_2$  であり且つ  $R^{12}$  がメチルである場合、 $R^{11}$  は H であることはできず、及び、 $R^{13}$  が  $NH_2$  であり且つ  $R^{12}$  がメチルである場合、 $R^{11}$  はメチルであることはできず；

$R^{14}$  は、H、 $C_{1-6}$ -アルキル及び  $-OR^9$  からなる群から選択され；

$R^2$ 、 $R^3$  は、H 及び  $C_{1-6}$ -アルキルからなる群から選択され；

$R^4$  は、H、 $C_{1-6}$ -アルキル、 $-OR^8$ 、 $C(=O)OR^8$ 、及び  $C(=O)R^8$  からなる群から選択され；

$R^5$  は、H 及び  $C_{1-6}$ -アルキルからなる群から選択され；

$R^6$ 、 $R^7$  は、独立して、H、 $C_{1-6}$ -アルキル、 $C_{2-6}$ -アルケニル、 $C_{3-10}$ -シクロアルキル、 $C_{1-6}$ -アルキルオキシ- $C_{1-6}$ -アルキル、アリーールで置換されている  $C_1-C_6$ -アルキル、ヘテロアリーールで置換されている  $C_1-C_6$ -アルキルからなる群から選択されるか、又は、 $NR^6R^7$  は、 $NO_2$  であり；又は、

$R^6$ 、 $R^7$  は、それらが結合している N 原子と一緒にあって、3～12 個の環原子を有する飽和又は不飽和のヘテロ環式環 [ここで、1 個の環原子は N であり、及び、0 個、1 個、2 個又は 3 個のさらなる環原子は、N、S 及び O から選択される] を形成し；

ここで、該アルキル、アルケニル、シクロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、アルキルオキシ、又は、 $R^6$ 、 $R^7$  がそれらが結合している N 原子と一緒にあって形成するヘテロ環式環は、 $C_{1-6}$ -アルキル、 $C_{3-8}$ -シクロアルキル、 $C_{1-6}$ -アルキルオキシ、 $-NR^9R^{10}$ 、カルボニル、 $-C(=O)OR^9$ 、ハロゲン原子、ハロで置換されている  $C_{1-6}$ -アルキル、 $C_{1-6}$ -アルキルオキシ- $C_{1-6}$ -アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、アリーールで置換されている  $C_1-C_6$ -アルキル、シアノ、ヒドロキシル、 $-SR^8$ 、 $-SO_2R^8$ 、 $-SO_2NR^9R^{10}$ 、 $-C(=O)NR^9R^{10}$ 、ヒドロキシルで置換されている  $C_{1-6}$ -アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていてもよく；

$R^8$  は、H 及び  $C_{1-6}$ -アルキルからなる群から選択され；

$R^9$ 、 $R^{10}$  は、独立して、H 及び  $C_{1-6}$ -アルキルからなる群から選択され；

L は、存在しないか、又は、 $C_{1-6}$ -アルキル、 $C_{2-6}$ -アルケニル、 $C_{2-6}$ -アルキニル、 $C_{3-10}$ -シクロアルキル及び  $-NR^L$  からなる群から選択され；  
ここで、

$R^L$  は、H、 $C_{1-6}$ -アルキル、ハロ- $C_{1-6}$ -アルキル、アリーールで置換されている  $C_1-C_6$ -アルキル、ヘテロアリーールで置換されている  $C_1-C_6$ -アルキル、ヘテロシクリルで置換されている  $C_1-C_6$ -アルキルからなる群から選択され；

Mは、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル及びヘテロアリールからなる群から選択され；

ここで、各シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル又はヘテロアリールは、 $C_{1-6}$ -アルキル、 $C_{3-8}$ -シクロアルキル、 $C_{1-6}$ -アルキルオキシ、 $NR^{M2}R^{M3}$ 、カルボニル、 $-C(=O)OR^{M2}$ 、ハロ、ハロ- $C_{1-6}$ -アルキル、 $C_{1-6}$ -アルキルオキシ- $C_{1-6}$ -アルキル、アリール、ヘテロアリール、アリールで置換されている $C_{1-6}$ -アルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $-SR^{M2}$ 、 $-SO_2R^{M4}$ 、 $-OSO_2R^{M4}$ 、 $-SO_2NR^{M2}R^{M3}$ 、 $-C(=O)NR^{M2}R^{M3}$ 、及びヒドロキシ- $C_{1-6}$ -アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていてもよく；

ここで、 $R^{M1}$ は、H、 $C_{1-6}$ -アルキル、ハロ、ヒドロキシル及びアミノからなる群から選択され；

ここで、 $R^{M2}$ 、 $R^{M3}$ は、独立して、H及び $C_{1-6}$ -アルキルからなる群から選択され；

ここで、 $R^{M4}$ は、H、 $C_{1-6}$ -アルキル及びアミノからなる群から選択され；

Gは、 $-CR^{G2}=CR^{G2}-$ 、 $-C-C-$ 、 $-C-C-C-$ 、 $-C-C-C(=O)-$ からなる群から選択され；

ここで、

$R^{G2}$ は、H、ハロゲン原子又は $C_{1-6}$ -アルキルからなる群から選択され；

Yは、アリール又はヘテロアリールからなる群から選択され

ここで、各アリール又はヘテロアリールは、 $C_{1-6}$ -アルキル、 $C_{3-8}$ -シクロアルキル、 $C_{1-6}$ -アルキルオキシ、 $NR^{Y1}R^{Y2}$ 、カルボニル、 $-C(=O)-OR^{Y1}$ 、ハロ、ハロ- $C_{1-6}$ -アルキル、 $C_{1-6}$ -アルキルオキシ- $C_{1-6}$ -アルキル、アリール、ヘテロアリール、アリールで置換されている $C_{1-6}$ -アルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $-SR^{Y2}$ 、 $-SO_2R^{Y3}$ 、 $-OSO_2R^{Y3}$ 、 $-SO_2NR^{Y1}R^{Y2}$ 、 $-C(=O)NR^{M2}R^{M3}$ 、ヒドロキシ- $C_{1-6}$ -アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていてもよく；

ここで、 $R^{Y1}$ 、 $R^{Y2}$ は、独立して、H及び $C_{1-6}$ -アルキルからなる群から選択され；

ここで、 $R^{Y3}$ は、H、 $C_{1-6}$ -アルキル及びアミノからなる群から選択され；

Xは、 $-C(=O)-$ 、 $-C_{1-6}$ -アルキル- $C(=O)-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-SO_2-$ からなる群から選択される；

で表される化合物又はその立体異性体、薬学的に許容されるその塩、エステル、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

#### 【請求項2】

$R^6$ 、 $R^7$ は、独立して、H、 $C_{1-6}$ -アルキル、 $C_{2-6}$ -アルケニル、 $C_{3-10}$ -シクロアルキル、 $C_{1-6}$ -アルキルオキシ- $C_{1-6}$ -アルキル、アリールで置換されている $C_{1-6}$ -アルキル、ヘテロアリールで置換されている $C_{1-6}$ -アルキルからなる群から選択されるか、又は、 $NR^6R^7$ は、 $NO_2$ であり；又は、

$R^6$ 、 $R^7$ は、それらが結合しているN原子と一緒に、3～12個の環原子を有する飽和又は不飽和のヘテロ環式環〔ここで、1個の環原子はNであり、及び、ここで、0個、1個、2個又は3個のさらなる環原子は、N、S及びOから選択される〕を形成することができる；

請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項3】

Lは、存在しないか、又は、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 及び $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ からなる群から選択される；

請求項1又は2に記載の化合物。

#### 【請求項4】

Mのシクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル又はヘテロアリールが、 $C_{1-6}$ -アルキル、ハロ、アミノ、ハロ- $C_{1-6}$ -アルキル、 $C_{1-6}$ -アルキルオ

キシ -  $C_{1-6}$  - アルキル、アリールで置換されている  $C_{1-6}$  - アルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $-SR^{M2}$ 、 $-SO_2R^{M4}$ 、 $-OSO_2R^{M4}$ 、 $-SO_2NR^{M2}R^{M3}$ 、ヒドロキシ -  $C_{1-6}$  - アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていてもよい；

請求項 1 - 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】

G は、 $-C-C-$  及び  $-C-C-C-$  からなる群から選択される；

請求項 1 - 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6】

$R^{13}$  が OH であり且つ  $R^{12}$  がメチルである場合、 $R^{11}$  は、メチルであることができない；

請求項 1 - 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7】

$R^{13}$  が  $NH_2$  であり且つ  $R^{12}$  が H である場合、 $R^{11}$  は、H であることができない；

請求項 1 - 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8】

Y のアリール又はヘテロアリールが、

$C_{1-6}$  - アルキル、 $NR^{Y1}R^{Y2}$ 、ハロ、ハロ -  $C_{1-6}$  - アルキル、 $C_{1-6}$  - アルキルオキシ -  $C_{1-6}$  - アルキル、アリールで置換されている  $C_{1-6}$  - アルキル、シアノ、ヒドロキシ及びヒドロキシ -  $C_{1-6}$  - アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていてもよい；

請求項 1 - 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9】

M が、フェニル、チアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、チオフェニル、フラニル、ピロリル、イミダゾリル、オキサゾリル、ピラジニル、ピラニル、チオピラニル、オキサジニル、チアジニル、 $-C(R^{M1})=C(R^{M1})-C-C-$  及び  $-C(R^{M1})=C(R^{M1})-$  からなる群から選択される；

請求項 1 - 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 10】

Y のアリール又はヘテロアリールが、

$C_{1-6}$  - アルキル、 $NR^{Y1}R^{Y2}$ 、ハロ、ハロ -  $C_{1-6}$  - アルキル、 $C_{1-6}$  - アルキルオキシ -  $C_{1-6}$  - アルキル、アリールで置換されている  $C_{1-6}$  - アルキル、シアノ、ヒドロキシ及びヒドロキシ -  $C_{1-6}$  - アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていてもよい、

請求項 1 - 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 11】

X は、 $-C(=O)-$  及び  $-S(=O)-$  からなる群から選択される；

請求項 1 - 10 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 12】

請求項 1 - 11 のいずれか 1 項に記載の化合物及び薬学的に許容される担体を含む、医薬組成物。

【請求項 13】

ウシ呼吸器疾患又はブタ呼吸器疾患の治療において使用するための、請求項 1 - 11 のいずれか 1 項に記載の化合物又は請求項 12 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

治療を必要とする動物に有効量の請求項 1 - 11 のいずれか 1 項に記載の化合物を投与することを含む、パスツレラ・ムルトシダ (*Pasteurella multocida*)、マンヘミア・ヘモリチカ (*Mannheimia haemolytica*) 及びヒストフィルス・ソムニ (*Histophilus somni*) の群から選択される細

菌のうちの少なくとも１つの細菌に起因する動物の感染症の治療において使用するための、請求項１－１１のいずれか１項に記載の化合物又は請求項１２に記載の医薬組成物。

【請求項１５】

ウシ呼吸器疾患又はブタ呼吸器疾患の治療のための医薬の製造における、請求項１－１１のいずれか１項に記載の化合物又は請求項１２に記載の医薬組成物の使用。

【請求項１６】

治療を必要とする動物に有効量の請求項１－１１のいずれか１項に記載の化合物を投与することを含む、パスツレラ・ムルトシダ (*Pasteurella multocida*)、マンヘミア・ヘモリチカ (*Mannheimia haemolytica*) 及びヒストフィルス・ソムニ (*Histophilus somni*) の群から選択される細菌のうちの少なくとも１つの細菌に起因する動物の感染症の治療のための医薬の製造における、請求項１－１１のいずれか１項に記載の化合物又は請求項１２に記載の医薬組成物の使用。