

【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 07 F	7/18	(2006.01)
C 07 C	321/14	(2006.01)
C 07 C	271/10	(2006.01)
C 07 C	259/06	(2006.01)
C 07 C	235/42	(2006.01)
A 61 K	31/223	(2006.01)
A 61 P	31/04	(2006.01)
A 61 P	11/00	(2006.01)
C 07 D	317/30	(2006.01)
A 61 K	31/357	(2006.01)
A 61 K	31/166	(2006.01)
C 07 D	295/155	(2006.01)
A 61 K	31/5375	(2006.01)
A 61 K	31/451	(2006.01)
A 61 K	31/495	(2006.01)
A 61 K	31/496	(2006.01)
A 61 K	31/472	(2006.01)
C 07 D	213/74	(2006.01)
C 07 D	217/18	(2006.01)
A 61 K	31/54	(2006.01)
C 07 D	211/14	(2006.01)
C 07 D	265/30	(2006.01)
C 07 D	307/52	(2006.01)
A 61 K	31/341	(2006.01)
C 07 D	333/36	(2006.01)
A 61 K	31/381	(2006.01)
A 61 K	31/4168	(2006.01)
C 07 D	233/88	(2006.01)
C 07 D	267/10	(2006.01)
A 61 K	31/553	(2006.01)
A 61 K	31/426	(2006.01)
C 07 D	277/30	(2006.01)
C 07 D	411/06	(2006.01)
C 07 D	409/06	(2006.01)
C 07 D	213/54	(2006.01)

【F I】

C 07 F	7/18	C S P L
C 07 C	321/14	
C 07 C	271/10	
C 07 C	259/06	
C 07 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

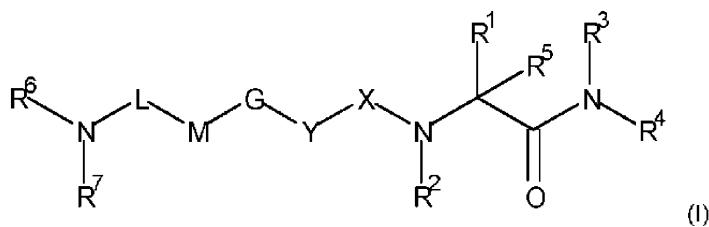
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



〔式中、

R^1 は、 H、 C ($R^{1-1} R^{1-2} R^{1-3}$)、 C (=O) R^{1-1} 及び - C (=N R^{1-4}) R^{1-1} からなる群から選択され；

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

R^{1-2} 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) OR⁹、 - NR⁹ R¹⁻⁰、 - SO₂ NR⁹ R¹⁻⁰ 及び - SO₂ R⁸ 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^{1-3} は、 H、 C_{1-6} -アルキル、アリール、 - SR⁸、 - OR⁹、 - NR⁹ R¹⁻⁰、 - SO₂ R⁸、ニトロ、 - C (=O) NR⁹ R¹⁻⁰ 及び C_{1-6} -アルキル（ここで、該アルキルは、 - SR⁸、 - C (=O) NR⁹ R¹⁻⁰、 - SO₂ NR⁹ R¹⁻⁰、 - SO₂ R⁸、ニトロ、シアノ、 - OR⁹、 - C (=O) OR⁹ 及び - NR⁹ C (=NR¹⁻⁴) NR⁹ R¹⁻⁰ 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^{1-3} と R^2 は、 R^2 が結合している N 原子と一緒にになって、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^{1-3} が OH 又は NH₂ であり且つ R^{1-2} がメチルである場合、 R^{1-1} は H であることはできず、及び、 R^{1-3} が NH₂ であり且つ R^{1-2} がメチルである場合、 R^{1-1} はメチルであることはできず；

R^{1-4} は、 H、 C_{1-6} -アルキル及び - OR⁹ 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、 - OR⁸、 C (=O) OR⁸、及び C (=O) R⁸ 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_{3-1} ₀-シクロアルキル、 C_{1-6} -アルキルオキシ - C₁₋₆-アルキル、アリールで置換されている C_{1-C₆}-アルキル、ヘテロアリールで置換されている C_{1-C₆}-アルキルからなる群から選択されるか、又は、 NR⁶ R⁷ は、 NO₂ であり；又は、

R^6 、 R^7 は、それらが結合している N 原子と一緒にになって、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、アリール、ヘテロアリール、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 原子と一緒ににな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、 - NR⁹ R¹⁻⁰ -、カルボニル、 - C (=O) OR⁹ -、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 - C₁₋₆-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-C₆}-アルキル、シアノ、ヒドロキシル、 - SR⁸ -、 - SO₂ R⁸ -、 - SO₂ NR⁹ R¹⁻⁰、 - C (=O) NR⁹ R¹⁻⁰ -、ヒドロキシルで置換されている C₁₋₆-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^{1-0} 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-3} からなる群から選択され；

ここで、

R^{L-3} は、 H、 C_{1-6} -アルキル、ハロ - C₁₋₆-アルキル、アリールで置換されている C_{1-C₆}-アルキル、ヘテロアリールで置換されている C_{1-C₆}-アルキル、ヘテロシクリルで置換されている C_{1-C₆}-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、C₁-₆-アルキル、C₃-₈-シクロアルキル、C₁-₆-アルキルオキシ、NR^M₂R^M₃、カルボニル、-C(=O)OR^M₂、ハロ、ハロ-C₁-₆-アルキル、C₁-₆-アルキルオキシ-C₁-₆-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C₁-C₆-アルキル、シアノ、ヒドロキシ、-SR^M₂、-SO₂R^M₄、-OSO₂R^M₄、-SO₂NR^M₂R^M₃、-C(=O)NR^M₂R^M₃、及びヒドロキシ-C₁-₆-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、C₁-₆-アルキル、ハロ、ヒドロキシリ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C₁-₆-アルキルからなる群から選択され；

ここで、R^M₄は、H、C₁-₆-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-、-CC-、-CC-C-C-、-CC-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C₁-₆-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、C₁-₆-アルキル、C₃-₈-シクロアルキル、C₁-₆-アルキルオキシ、NR^Y₁R^Y₂、カルボニル、-C(=O)-OR^Y₁、ハロ、ハロ-C₁-₆-アルキル、C₁-₆-アルキルオキシ-C₁-₆-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C₁-C₆-アルキル、シアノ、ヒドロキシ、-SR^Y₂、-SO₂R^Y₃、-OSO₂R^Y₃、-SO₂NR^Y₁R^Y₂、-C(=O)NR^M₂R^M₃、ヒドロキシ-C₁-₆-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C₁-₆-アルキルからなる群から選択され；

ここで、R^Y₃は、H、C₁-₆-アルキル及びアミノからなる群から選択され；

Xは、-C(=O)-、-C₁-₆-アルキル-C(=O)-、-S(=O)-、-SO₂-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】

R⁶、R⁷は、独立して、H、C₁-₆-アルキル、C₂-₆-アルケニル、C₃-₁₀-シクロアルキル、C₁-₆-アルキルオキシ-C₁-₆-アルキル、アリールで置換されているC₁-C₆-アルキル、ヘテロアリールで置換されているC₁-C₆-アルキルからなる群から選択されるか、又は、NR⁶R⁷は、NO₂であり；又は、

R⁶、R⁷は、それらが結合しているN原子と一緒にになって、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、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、-CH₂-、-CH₂CH₂-、-CH₂CH₂CH₂-及び-CH₂CH₂CH₂CH₂-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、C₁-₆-アルキル、ハロ、アミノ、ハロ-C₁-₆-アルキル、C₁-₆-アルキルオ

キシ - C₁ -₆ - アルキル、アリールで置換されている C₁ - C₆ - アルキル、シアノ、ヒドロキシ、- S R^M²、- SO₂ R^M⁴、- OSO₂ R^M⁴、- SO₂ NR^M² R^M³、ヒドロキシ - C₁ -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】

R¹³ が OH であり且つ R¹² がメチルである場合、R¹¹ 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】

R¹³ が NH₂ であり且つ R¹² が H である場合、R¹¹ 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、C₁ -₆ - アルキル、NR^Y¹ R^Y²、ハロ、ハロ - C₁ -₆ - アルキル、C₁ -₆ - アルキルオキシ - C₁ -₆ - アルキル、アリールで置換されている C₁ - C₆ - アルキル、シアノ、ヒドロキシ及びヒドロキシ - C₁ -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、C₁ -₆ - アルキル、NR^Y¹ R^Y²、ハロ、ハロ - C₁ -₆ - アルキル、C₁ -₆ - アルキルオキシ - C₁ -₆ - アルキル、アリールで置換されている C₁ - C₆ - アルキル、シアノ、ヒドロキシ及びヒドロキシ - C₁ -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、パステュレラ・ムルトイダ (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 - 1 1 のいずれか 1 項に記載の化合物又は請求項 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

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 - 1 1 のいずれか 1 項に記載の化合物又は請求項 1 2 に記載の医薬組成物の使用。

【請求項 1 6】

治療を必要とする動物に有効量の請求項 1 - 1 1 のいずれか 1 項に記載の化合物を投与することを含む、パストレラ・ムルトシダ (P a s t e u r e l l a m u l t o c i d a) 、マンヘミア・ヘモリチカ (M a n n h e i m i a h a e m o l y t i c a) 及びヒストフィルス・ソムニ (H i s t o p h i l u s s o m n i) 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 - 1 1 のいずれか 1 項に記載の化合物又は請求項 1 2 に記載の医薬組成物の使用。