

【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 26 年 5 月 8 日 (2014.5.8)

【公表番号】特表 2012-528813 (P2012-528813A)

【公表日】平成 24 年 11 月 15 日 (2012.11.15)

【年通号数】公開・登録公報 2012-048

【出願番号】特願 2012-513512 (P2012-513512)

【国際特許分類】

C 07 C 323/22 (2006.01)

C 07 C 49/227 (2006.01)

A 61 K 31/121 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

【F I】

C 07 C 323/22 C S P

C 07 C 49/227

A 61 K 31/121

A 61 P 13/12

【手続補正書】

【提出日】平成 26 年 3 月 24 日 (2014.3.24)

【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】

糸球体腎炎、ループス腎炎、または糖尿病性腎症の治療のための、式 (I) の化合物またはその塩を含む組成物。

R - L - CO - X (I)

(式中、R は、場合によっては S、O、N、SO、SO₂ から選ばれる 1 個以上のヘテロ原子またはヘテロ原子の群によって割り込まれていてもよい C₁₀₋₂₄ 不飽和炭化水素基であり、当該炭化水素基は、少なくとも 4 個の非共役二重結合を含み；

L は、R 基と前記カルボニル CO との間に原子を 1 ~ 5 個有する橋状結合を形成する連結基であり；

X は、電子求引基である。)

【請求項 2】

前記炭化水素基が、二重結合を 5 ~ 7 個有する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

二重結合が前記カルボニル基と共役していない、請求項 1 または 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

二重結合がいずれもシス配置である、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 5】

前記カルボニル基に最も近い二重結合を除く、すべての二重結合がシス配置である、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 6】

R 基が炭素原子を 17 ~ 19 個含む、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 7】

連結基 L が、-CH₂-、-CH(C₁₋₆アルキル)-、-N(C₁₋₆アルキル)-、-

NH -、- S -、- O -、- CH=CH -、- CO -、- SO -、または- SO₂ -を含み、これらは、（化学的に意味のある）任意の順番で互いに組み合わせられて連結基を形成していてもよい、請求項 1 ～ 6 のいずれか一項に記載の組成物。

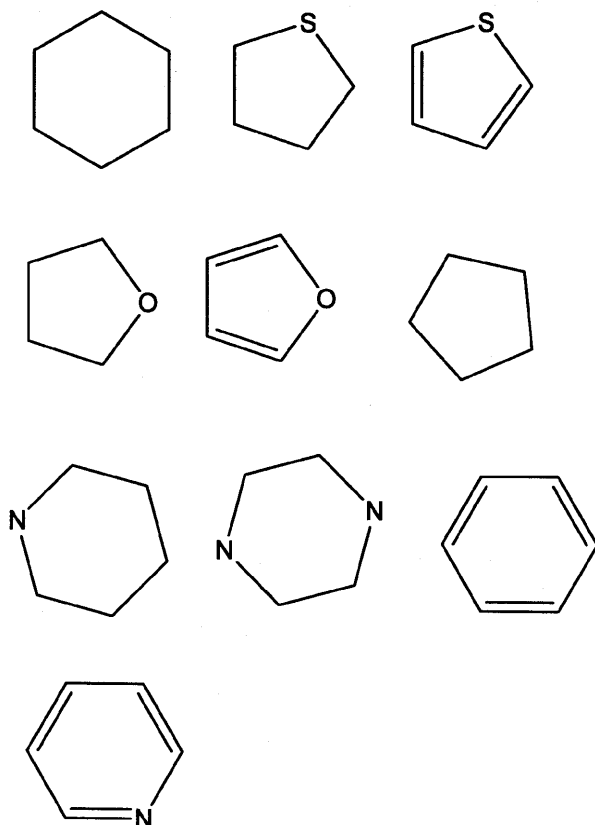
【請求項 8】

L が、少なくとも 1 つの O、S、N、または SO を含む、請求項 1 ～ 7 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 9】

L 基が、下記の環のひとつを含む、請求項 1 ～ 6 のいずれか一項に記載の組成物。

【化 1 1】



【請求項 10】

L が、- NH₂CH₂ -、- NH(Me)CH₂ -、- SCH₂ -、- SOCH₂ -、- COCH₂ -、- CH(Me) -、- CH(Me)CH₂ -、- CH(Me) - CH(Me) -、2,4 - チオフェン、または 2,5 - チオフェンである、請求項 1 ～ 9 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 11】

X が、O - C₁₋₆アルキル、CN、OCO₂ - C₁₋₆アルキル、フェニル、CHa l₃、CHa l₂H、またはCHa l H₂であり、Hal が、ハロゲンを表す、請求項 1 ～ 10 のいずれかに記載の組成物。

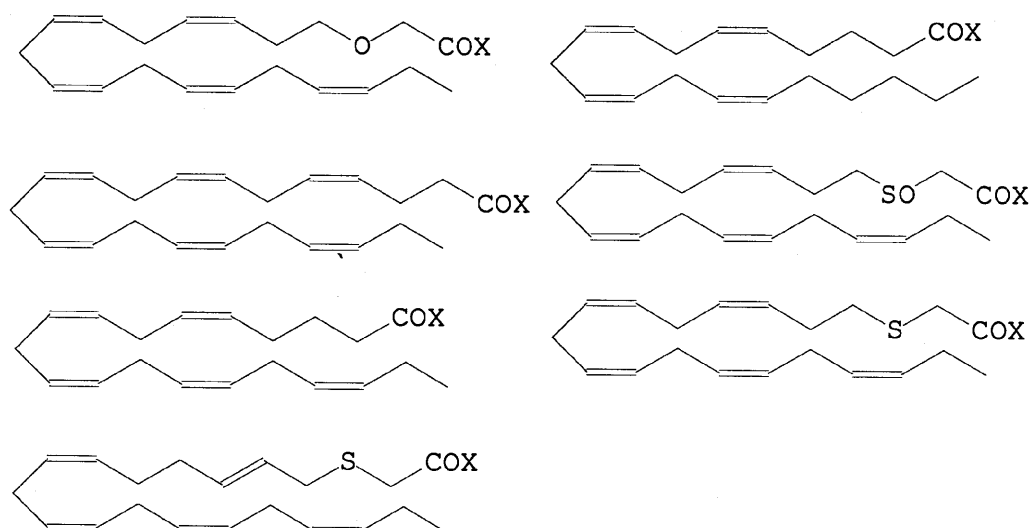
【請求項 12】

X がCHa l₃である、請求項 1 ～ 11 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 13】

前記化合物が、下記式を有する、請求項 1 に記載の組成物。

【化 1 2】



【請求項 1 4】

前記化合物が、式 (I')



(式中、RおよびXは、上に定義のとおりであり；

Y₁は、O、S、NH、N(C₁₋₆-アルキル)、SO、またはSO₂から選ばれ、Y₂は、(CH₂)_nまたはCH(C₁₋₆-アルキル)であるか；あるいは、

Y₁およびY₂は、一緒になって5員または6員の単素または複素の、場合によって不飽和または芳香性であってもよい、環を形成するか；あるいは、

Y₁は、5員または6員の単素または複素の、場合によって不飽和または芳香性であってもよい、環を形成し、Y₂は(CH₂)_nであり；

ここでnは、1～3である)

を有する、請求項1～13のいずれかに記載の組成物。

【請求項 1 5】

式 (I'') の化合物。



(式中、RおよびXは、請求項1に定義のとおりであり；

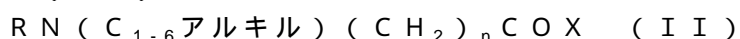
Y₁およびY₂は、一緒になって5員または6員の単素または複素の、場合によって不飽和または芳香性であってもよい、環を形成するか；あるいは

Y₁は、5員または6員の単素または複素の、場合によって不飽和または芳香性であってもよい、環を形成し、Y₂は(CH₂)_nであり；

ここでnは、1～3である)

【請求項 1 6】

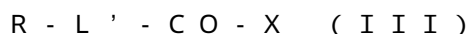
式 (II) の化合物



(式中R、n、およびXは、請求項15で定義したとおりである)。

【請求項 1 7】

式 (III) の化合物。

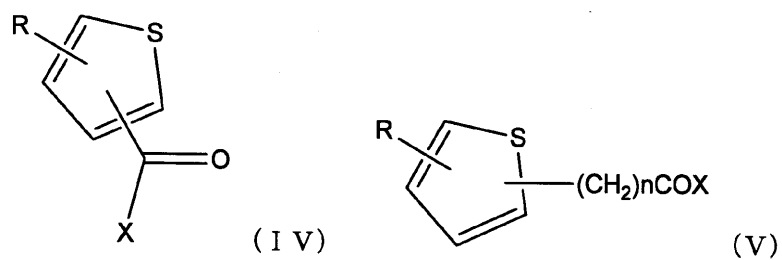


(式中、RおよびXは、請求項1に定義のとおりであり、L'は、R基と前記カルボニルCOとの間に原子を1～5個有する橋状結合を形成する連結基を表し、当該L'連結基は環構造を含む)

【請求項 1 8】

式 (IV) または (V) を有する、請求項 17 に記載の化合物。

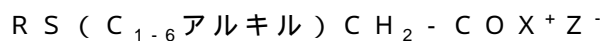
【化 13】



(式中、n は、1 ~ 3 である)

【請求項 19】

式 (VI)



(式中、R および X は、上に定義のとおりであり、Z は、対イオンである) の化合物。

【請求項 20】

少なくとも 1 種の薬学的に許容される賦形剤と組み合わせた、請求項 15 ~ 19 のいずれか一項に記載の化合物を含む医薬組成物。