

【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に役していない、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)-、-

N H -、- S -、- O -、- C H = C H -、- C O -、- S O -、または- S O₂ -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さ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。

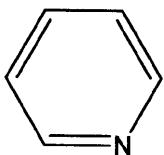
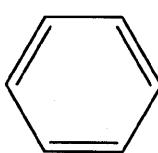
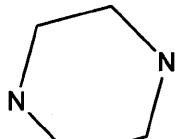
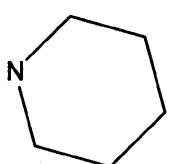
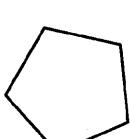
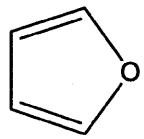
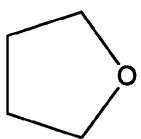
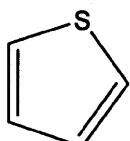
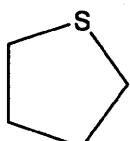
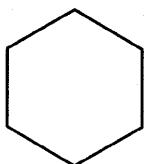
【請求項8】

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11】



【請求項10】

Lが、-N H₂ C H₂ -、- N H (M e) C H₂ -、- S C H₂ -、- S O C H₂ -、- C O C H₂ -、- C H (M e) -、- C H (M e) C H₂ -、- C H (M e) - C H (M e) -、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、C N、O C O₂-C₁₋₆アルキル、フェニル、C H a l₃、C H a l₂H、またはC H a l H₂であり、H a l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。

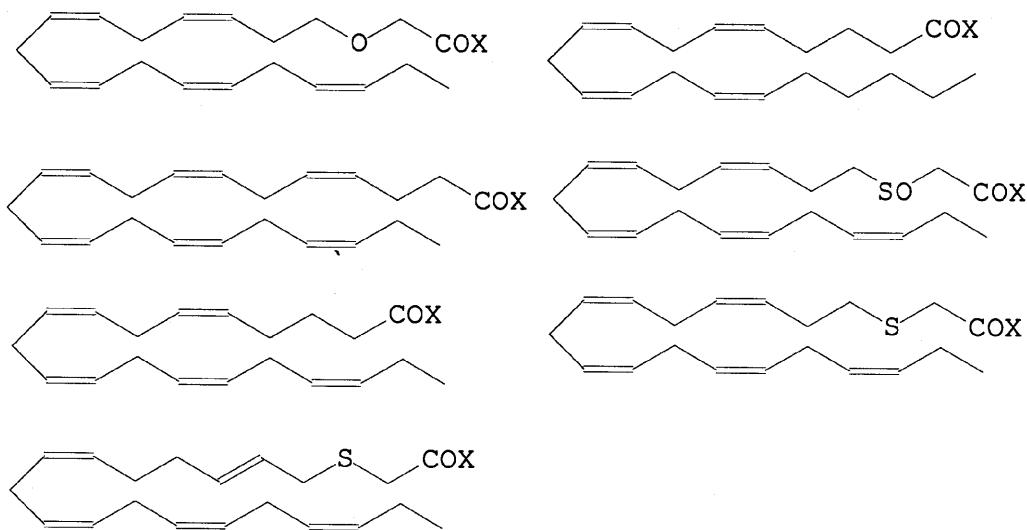
【請求項12】

XがC H a 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12】



【請求項14】

前記化合物が、式(I')

$R - Y_1 - Y_2 - CO - X$

(式中、RおよびXは、上に定義のとおりであり；

Y_1 は、O、S、NH、N(C_{1-6} -アルキル)、SO、または SO_2 から選ばれ、 Y_2 は、 $(CH_2)_n$ または $CH(C_{1-6}$ アルキル)であるか；あるいは、

Y_1 および Y_2 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、

Y_1 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、 Y_2 は $(CH_2)_n$ 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15】

式(I'')の化合物。

$R - Y_1 - Y_2 - CO - X$ (I'')

(式中、RおよびXは、請求項1に定義のとおりであり；

Y_1 および Y_2 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

Y_1 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、 Y_2 は $(CH_2)_n$ であり；

ここでnは、1～3である)

【請求項16】

式(II)の化合物

$RN(C_{1-6}$ アルキル) $(CH_2)_nCOX$ (II)

(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17】

式(III)の化合物。

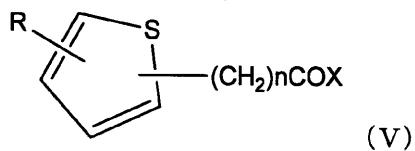
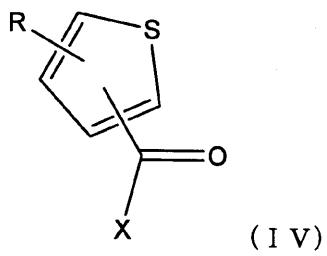
$R - L' - CO - X$ (III)

(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18】

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)

$RS(C_{1-6}\text{アルキル})CH_2-COX^+Z^-$

(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。