

【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12月4日(2014.12.4)

【公表番号】特表2013-544797(P2013-544797A)

【公表日】平成25年12月19日(2013.12.19)

【年通号数】公開・登録公報2013-068

【出願番号】特願2013-534982(P2013-534982)

【国際特許分類】

C 07 D 277/60	(2006.01)
C 07 D 513/04	(2006.01)
C 07 D 417/12	(2006.01)
C 07 D 417/14	(2006.01)
A 61 K 31/437	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 K 31/428	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
A 61 K 31/454	(2006.01)
A 61 K 31/45	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 9/12	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 9/04	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 15/10	(2006.01)
A 61 P 13/12	(2006.01)
A 61 P 11/06	(2006.01)
A 61 P 27/06	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 19/02	(2006.01)
A 61 P 17/06	(2006.01)
A 61 P 1/00	(2006.01)
A 61 P 21/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 277/60	C S P
C 07 D 513/04	3 4 3
C 07 D 417/12	
C 07 D 417/14	
A 61 K 31/437	
A 61 K 31/5377	
A 61 K 31/428	
A 61 K 31/496	
A 61 K 31/454	
A 61 K 31/45	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 9/12	
A 61 P 9/10	1 0 1

A 6 1 P 9/10  
 A 6 1 P 9/04  
 A 6 1 P 9/00  
 A 6 1 P 15/10  
 A 6 1 P 13/12  
 A 6 1 P 43/00 1 0 1  
 A 6 1 P 11/06  
 A 6 1 P 27/06  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 25/28  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 25/00 1 0 1  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 29/00 1 0 1  
 A 6 1 P 19/02  
 A 6 1 P 17/06  
 A 6 1 P 1/00  
 A 6 1 P 21/00

## 【手続補正書】

【提出日】平成26年10月17日(2014.10.17)

## 【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

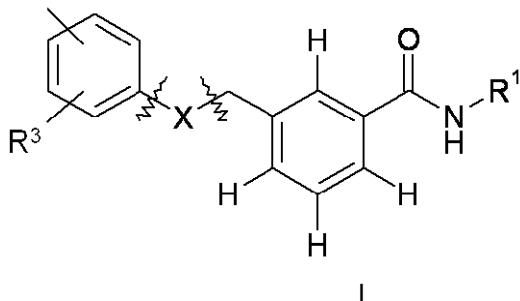
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

下記式I

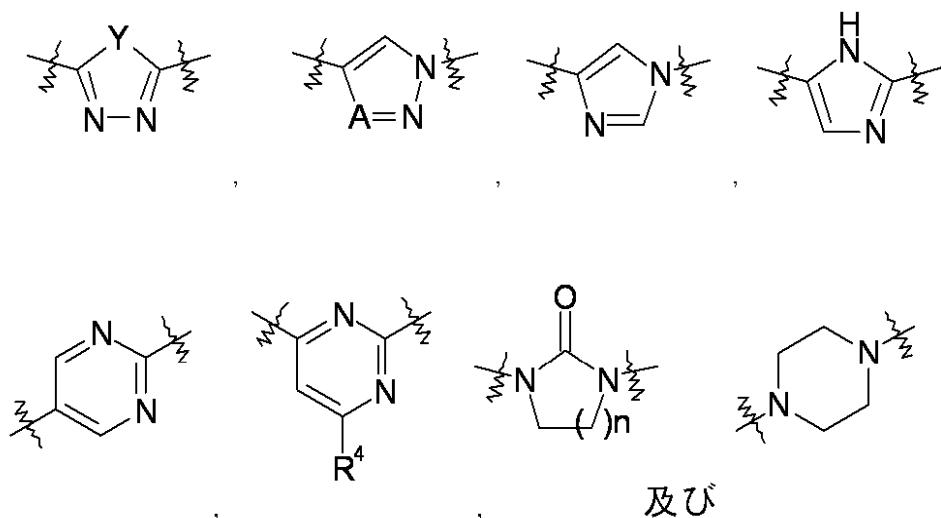
## 【化1】

 $R^2$ 

(式中:

Xは下記

## 【化2】



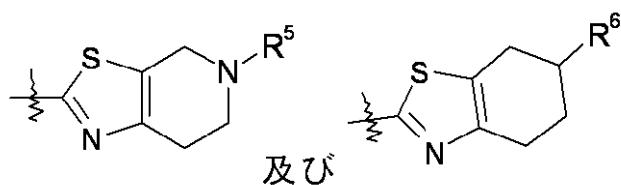
から成る群X<sup>a</sup>より選択され；

AはC又はNであり；

YはO又はSであり；

R<sup>1</sup>は下記

## 【化3】



から成る群R<sup>1a</sup>より選択され；

R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>は、H、-CH<sub>3</sub>、-OCH<sub>3</sub>、-F、-Cl、-C(O)NH<sub>2</sub>、及び-CNから独立に選択され（但し、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が両方Hではない）；

R<sup>4</sup>はH又は-CH<sub>3</sub>であり；

R<sup>5</sup>はC<sub>1-6</sub>アルキルであり；

R<sup>6</sup>は、ピペリジニル、ピペラジニル、モルフォリニル、2,3-ジヒドロインドリル及びピロリジニルから選択されるヘテロシクリル基、並びに  
-N(R<sup>7</sup>)(R<sup>8</sup>)

から選択され

（ここで、前記ヘテロシクリル基は、ハロゲン、オキソ、C<sub>1-3</sub>アルキル及びC<sub>3-6</sub>シクロアルキルから選択される1~3個の基で置換されていてもよい）；

R<sup>7</sup>及びR<sup>8</sup>は、H、C<sub>1-3</sub>アルキル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル及びCO<sub>2</sub>C<sub>1-4</sub>アルキルから独立に選択され（ここで、前記C<sub>1-3</sub>アルキル及びC<sub>3-6</sub>シクロアルキルは任意に-OCH<sub>3</sub>、-CF<sub>3</sub>、-CHF<sub>2</sub>又は-CNで置換されていてもよい）；かつ

nは1又は2である）

の化合物

又はその塩。

## 【請求項2】

R<sup>2</sup>は3-CN及び4-CNから選択され；

R<sup>3</sup>はHであり；かつ

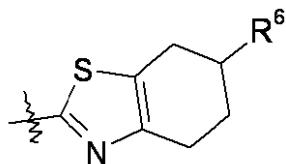
R<sup>5</sup>は-CH<sub>3</sub>である、請求項1に記載の化合物

又はその塩。

## 【請求項3】

R<sup>1</sup>は

## 【化4】

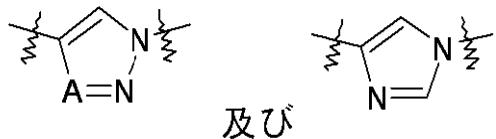


である、請求項1に記載の化合物  
又はその塩。

## 【請求項4】

Xは下記

## 【化5】

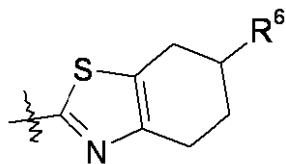


から成る群X<sup>b</sup>より選択される、請求項1に記載の化合物  
又はその塩。

## 【請求項5】

R<sup>1</sup>は

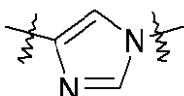
## 【化6】



であり；かつ

Xは

## 【化7】

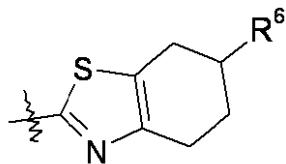


である、請求項2に記載の化合物  
又はその塩。

## 【請求項6】

R<sup>1</sup>は

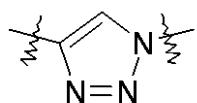
## 【化8】



であり；かつ

Xは

## 【化9】

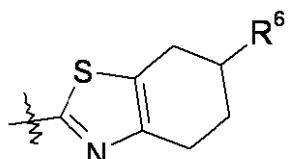


である、請求項2に記載の化合物  
又はその塩。

## 【請求項7】

R<sup>1</sup>は

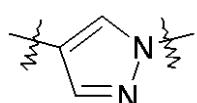
## 【化10】



であり；かつ

Xは

## 【化11】

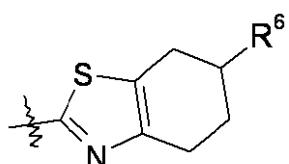


である、請求項2に記載の化合物  
又はその塩。

## 【請求項8】

R<sup>1</sup>は

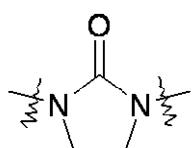
## 【化12】



であり；かつ

Xは

## 【化13】

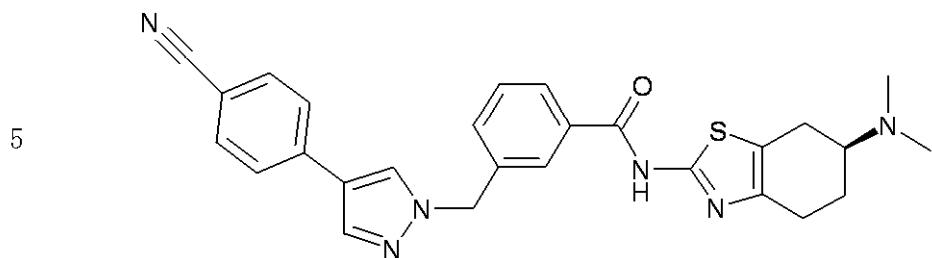
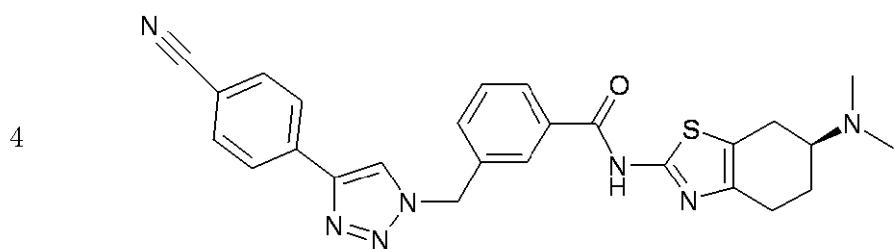
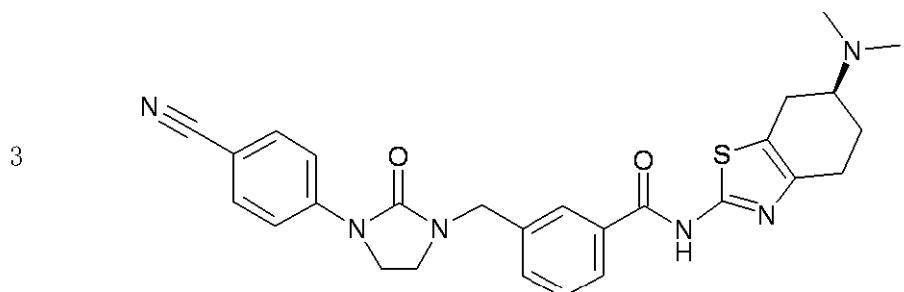
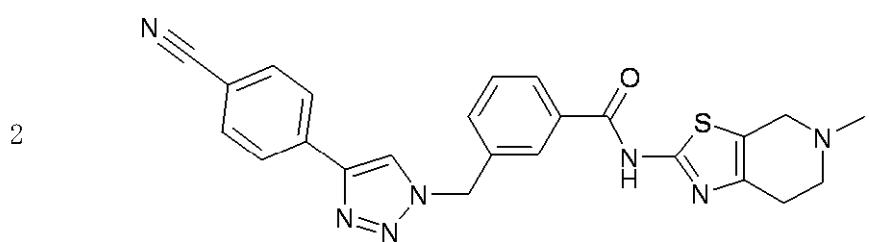
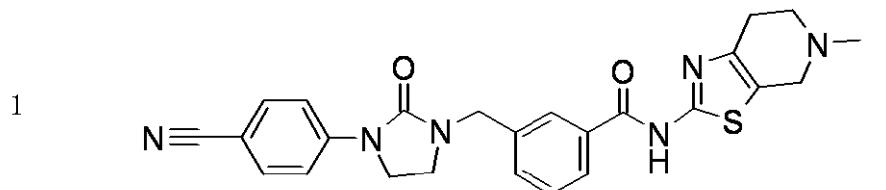


である、請求項2に記載の化合物  
又はその塩。

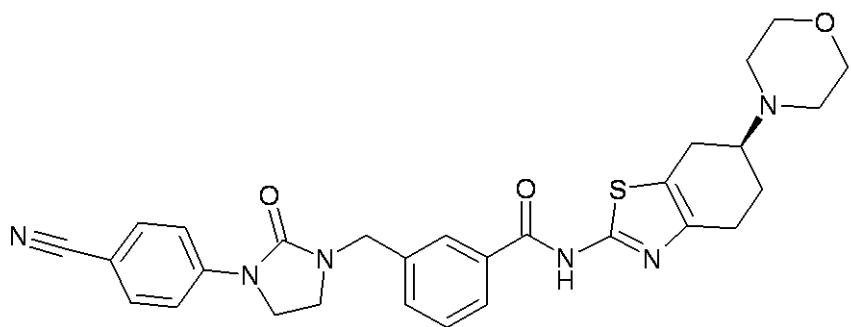
## 【請求項9】

下記化合物

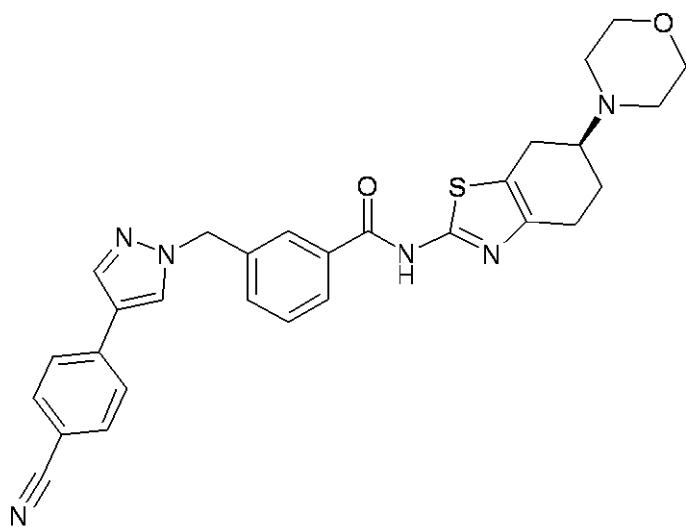
【化 14】



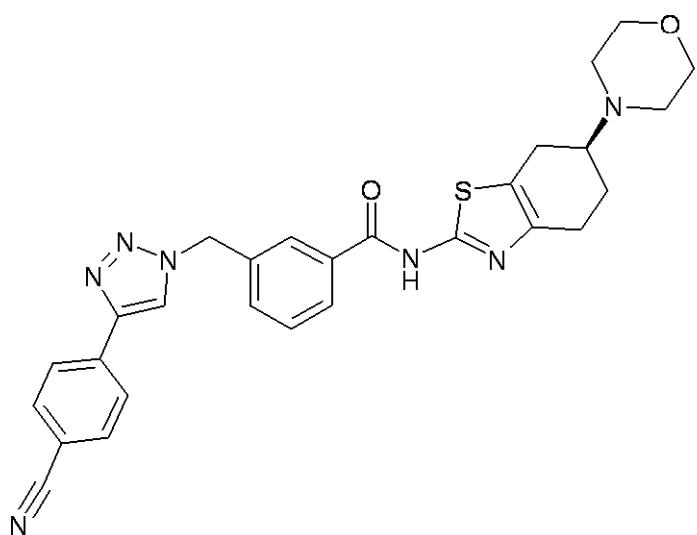
6



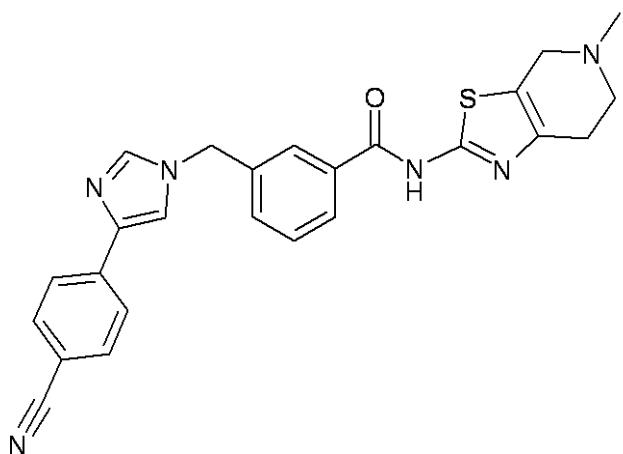
7



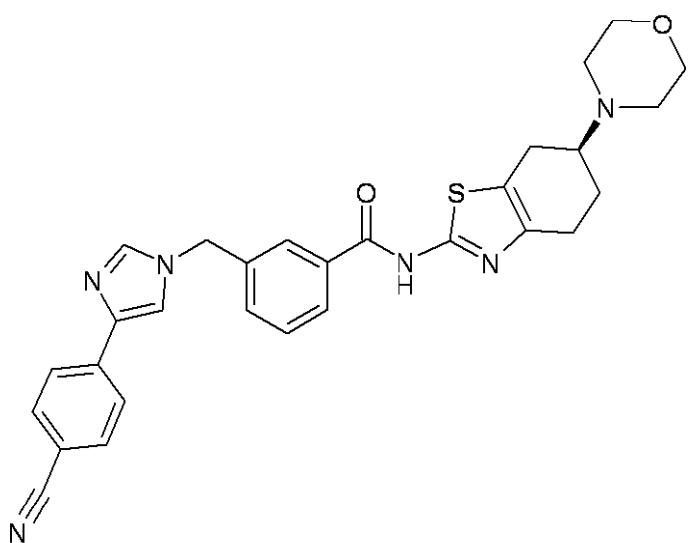
8



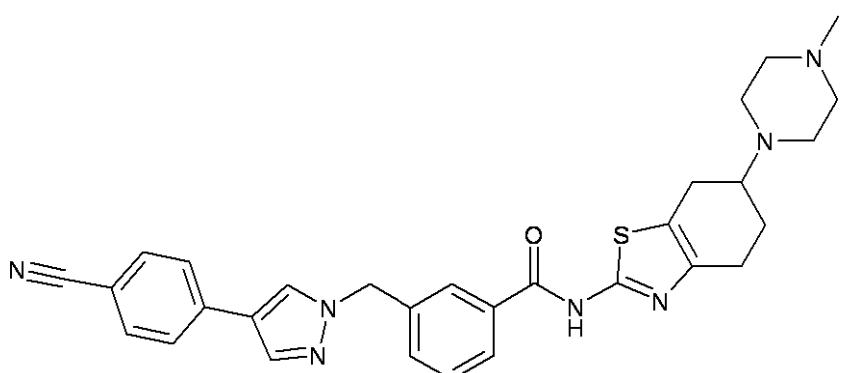
9



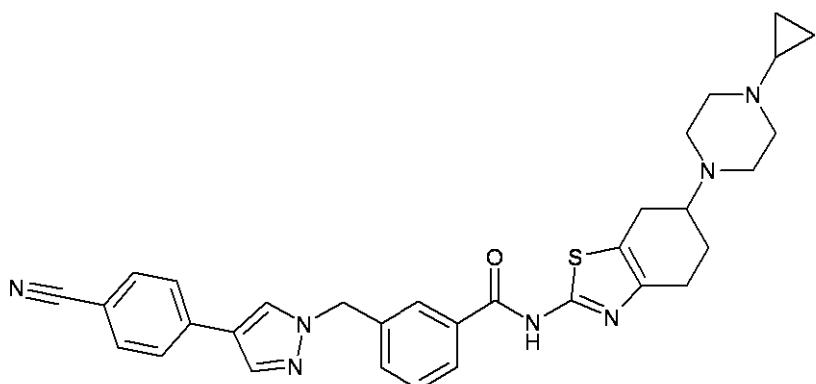
10



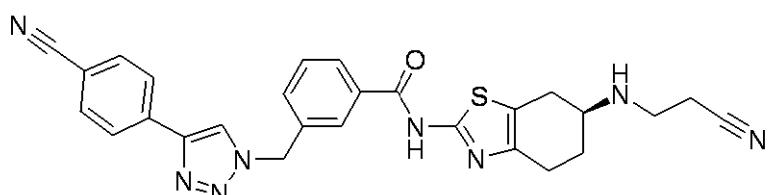
11



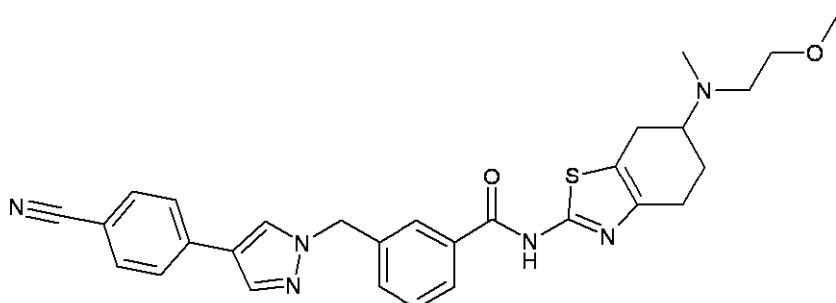
12



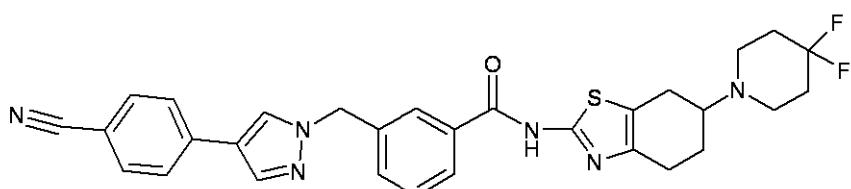
13



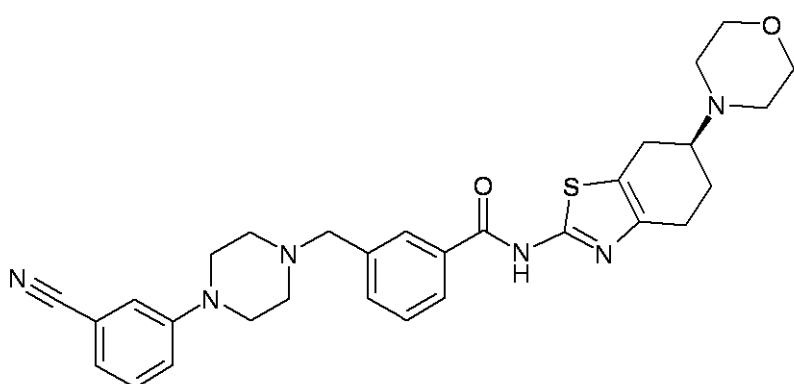
14



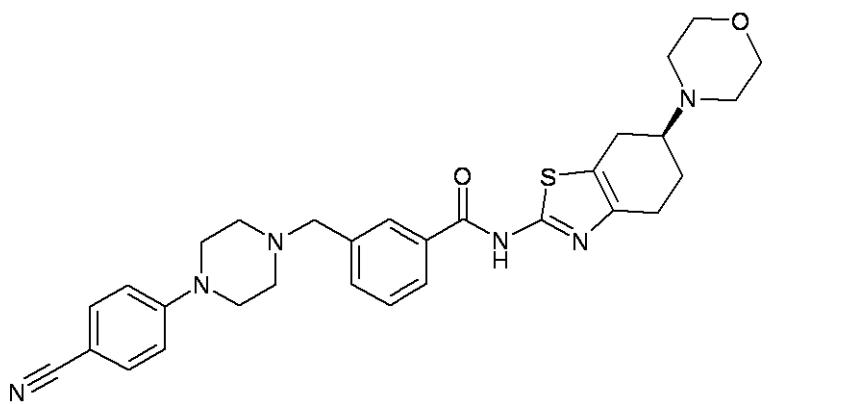
15



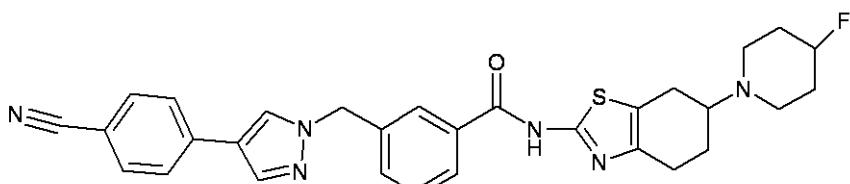
16



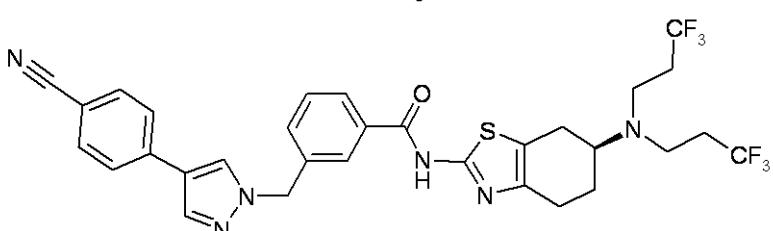
17



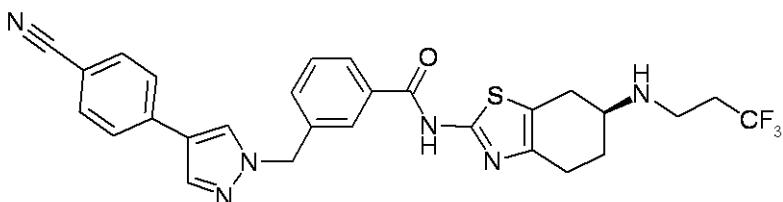
18



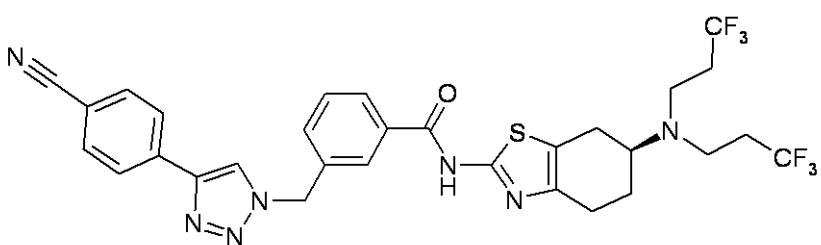
19



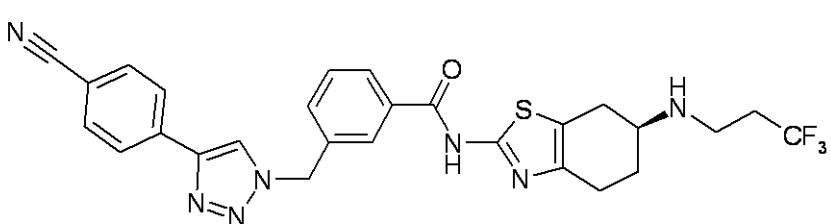
20



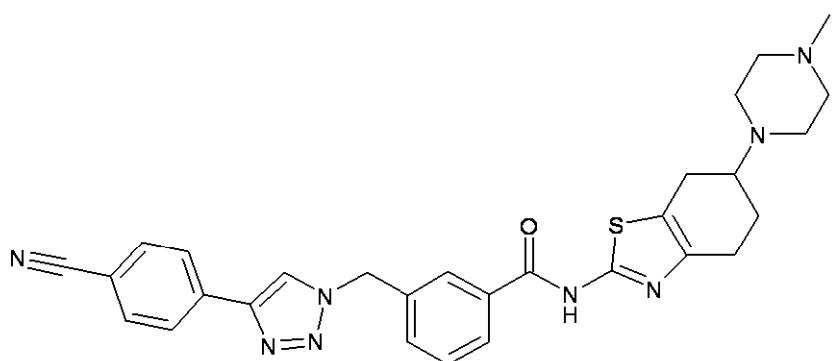
21



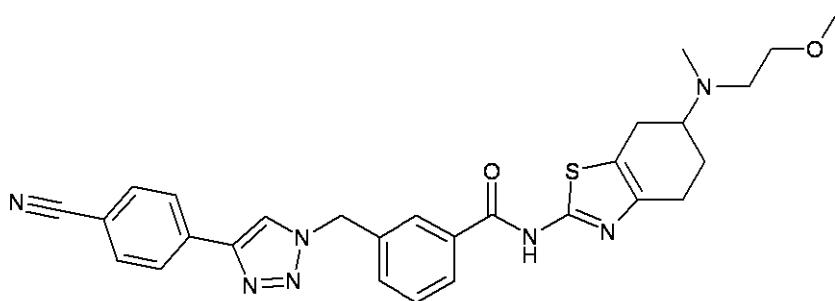
22



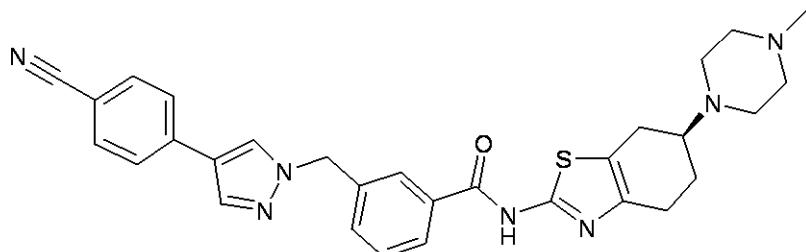
23



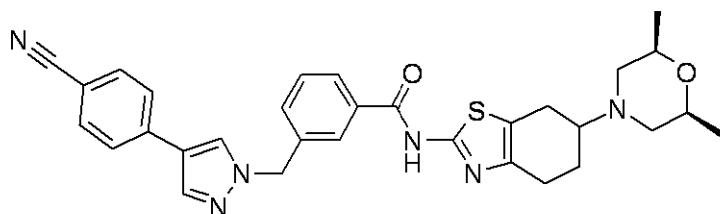
24



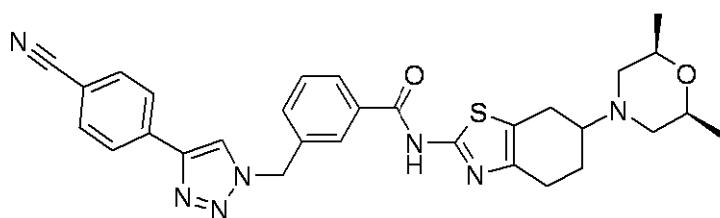
25

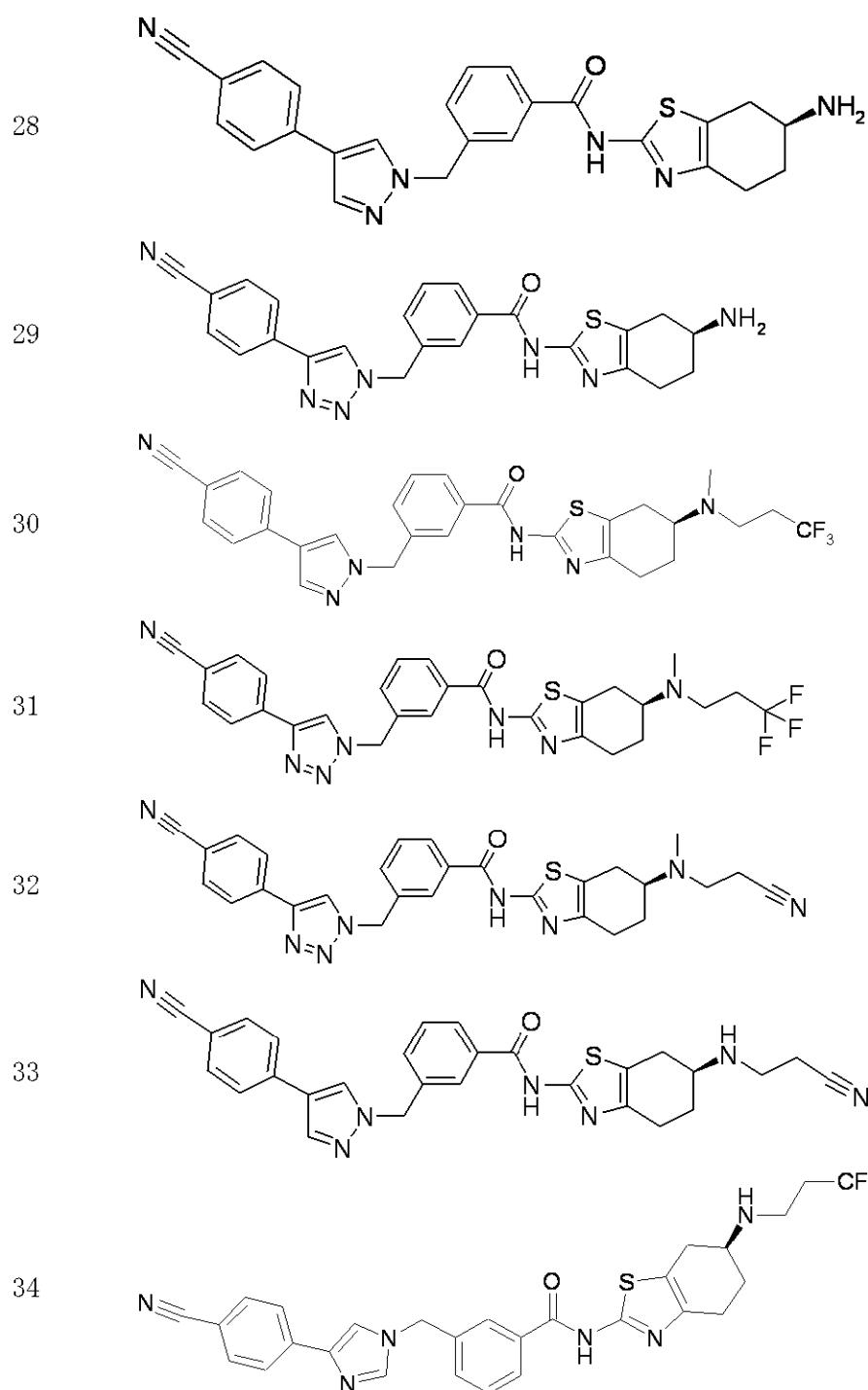


26

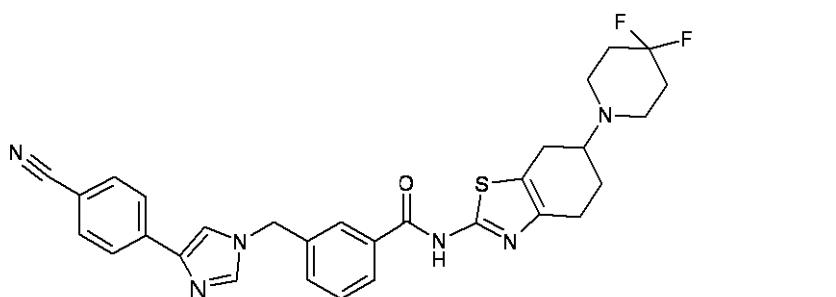


27

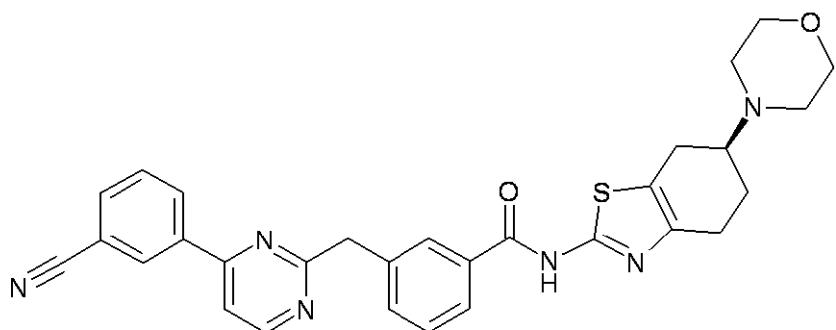




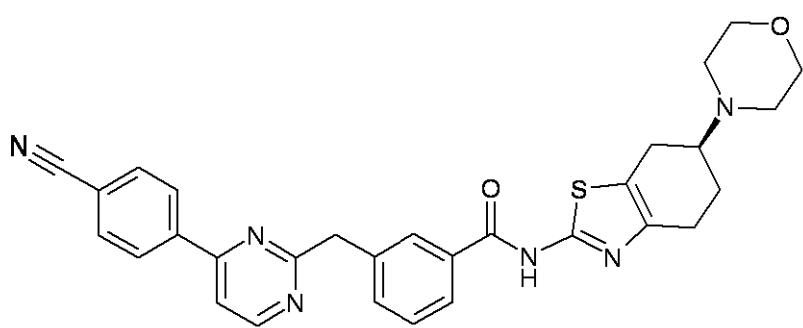
35



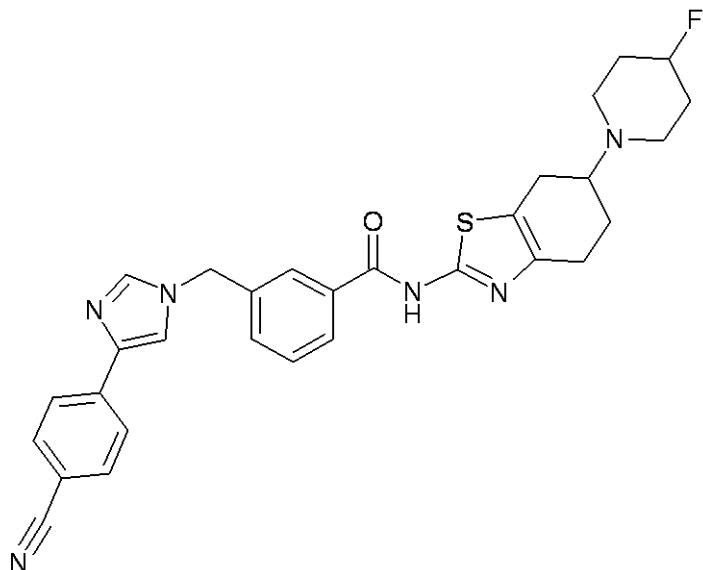
36



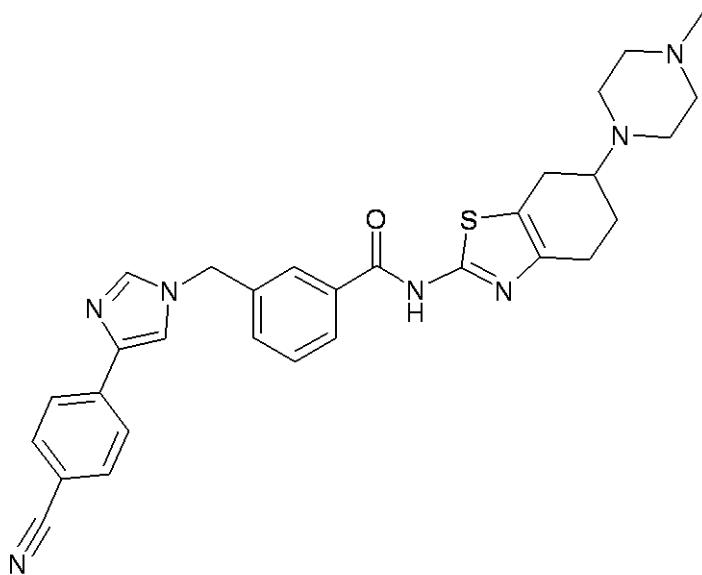
37



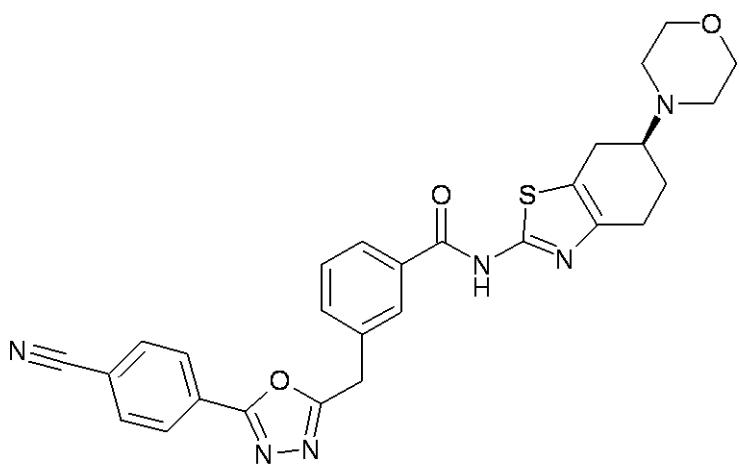
38



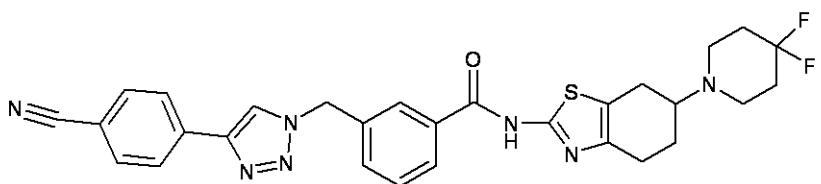
39



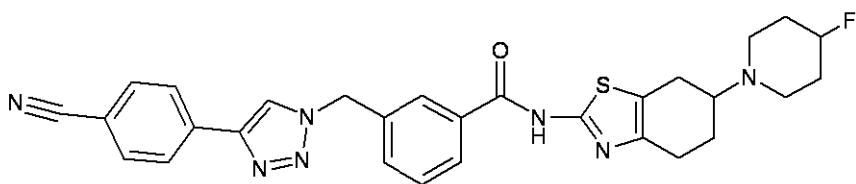
40



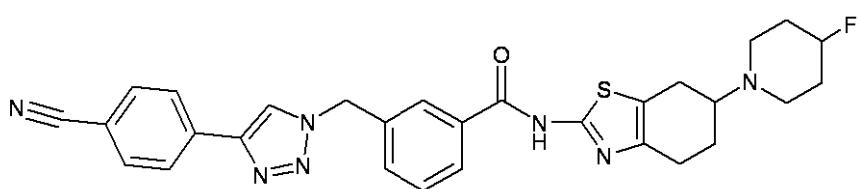
41



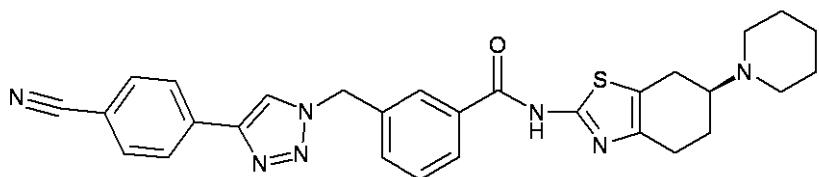
42



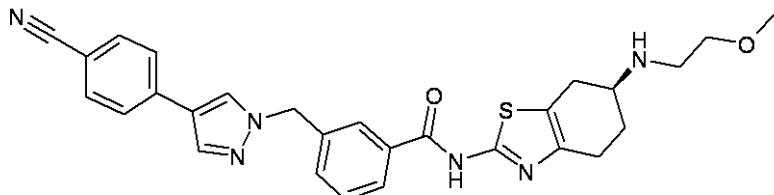
43



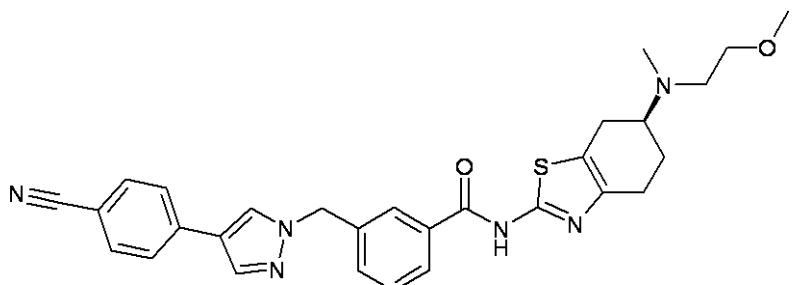
44



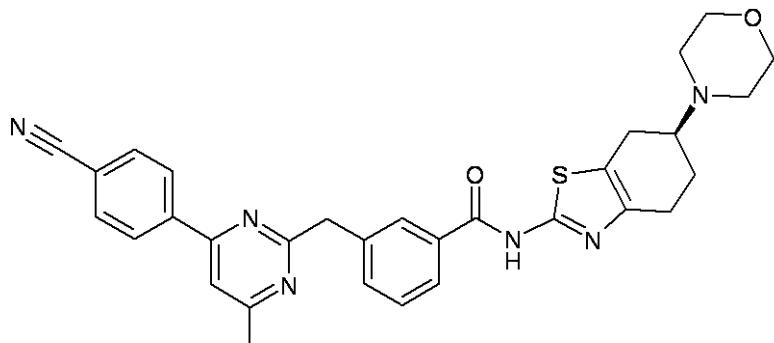
45



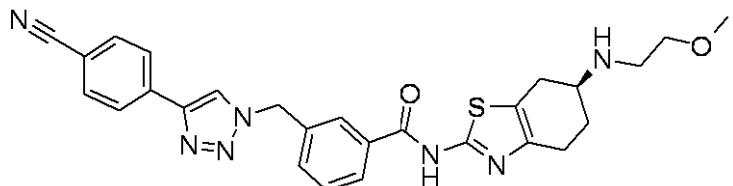
46



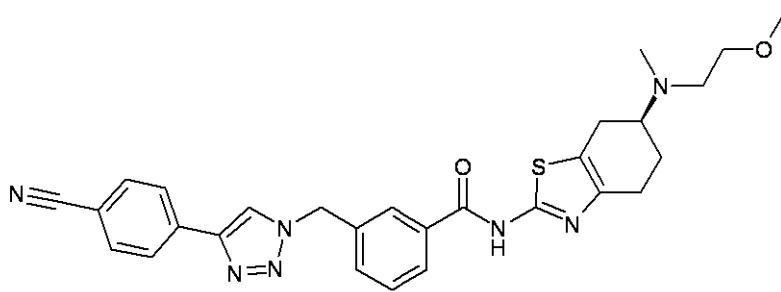
47



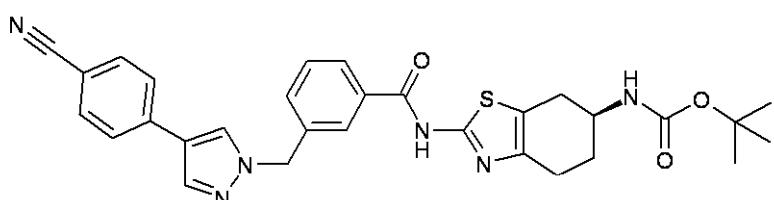
48



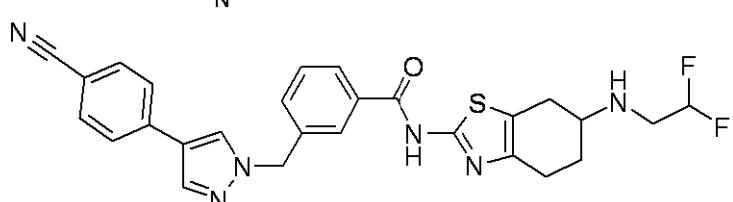
49



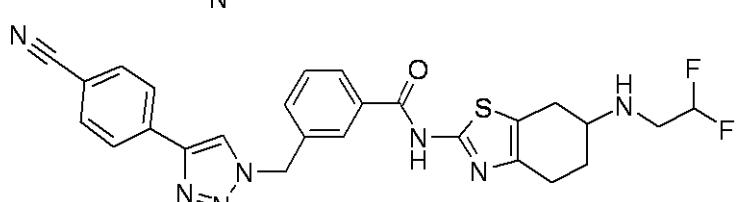
50



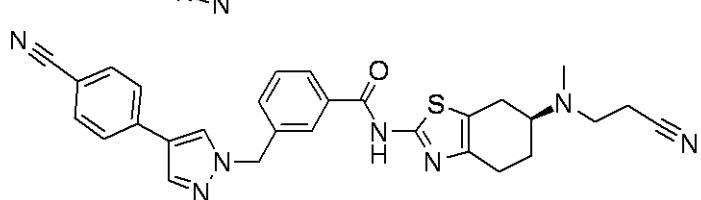
51



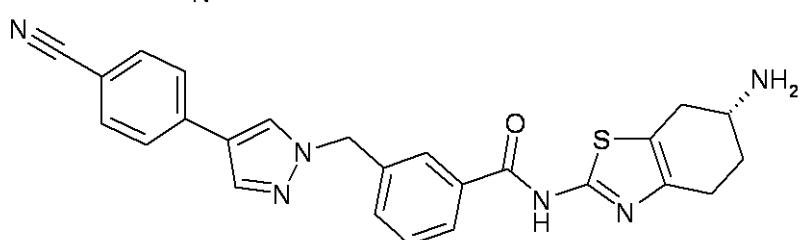
52

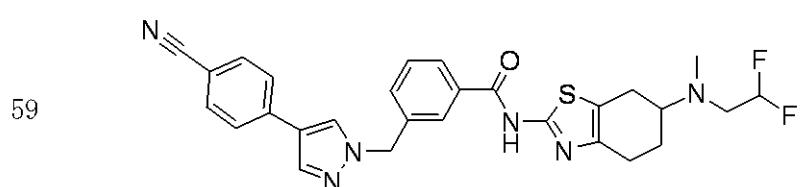
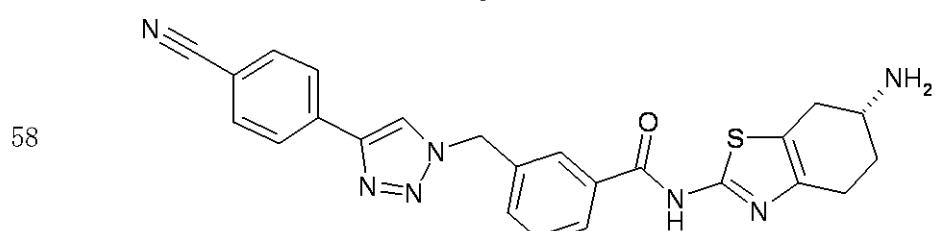
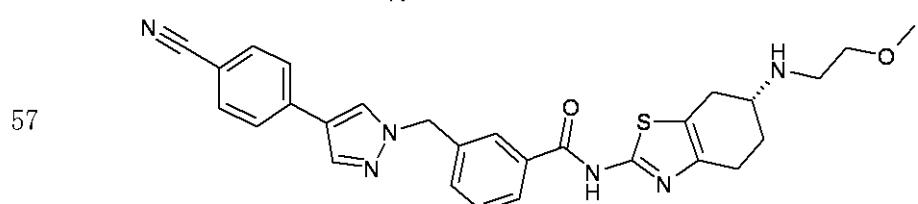
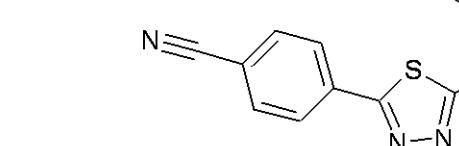
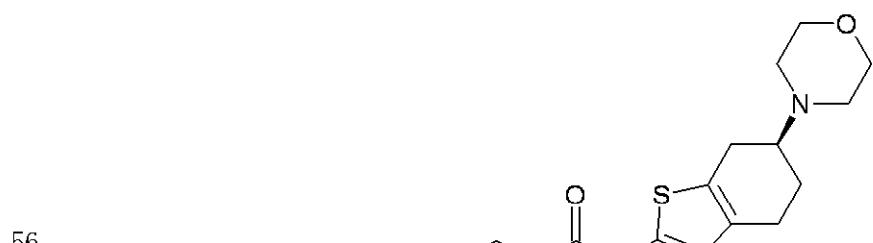
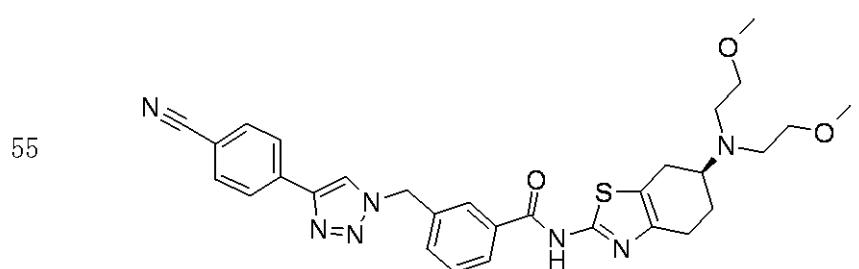


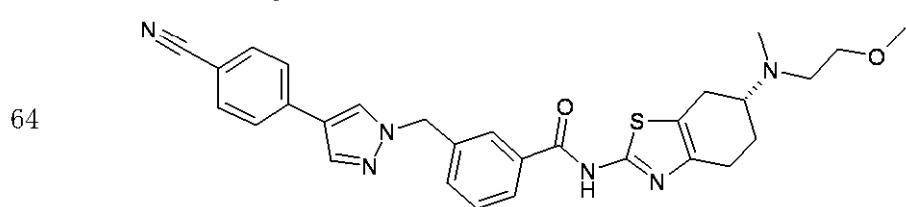
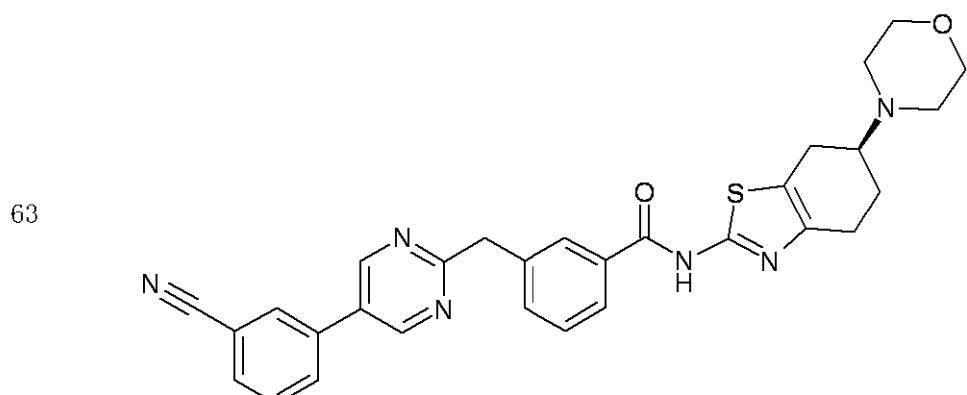
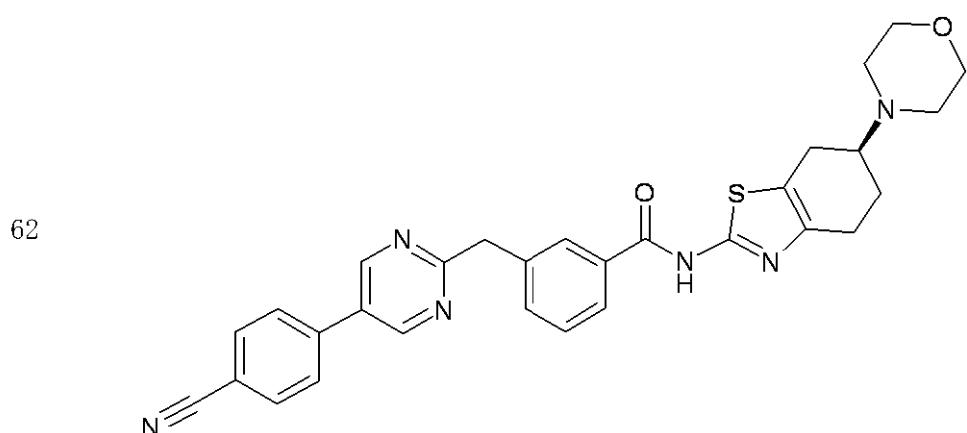
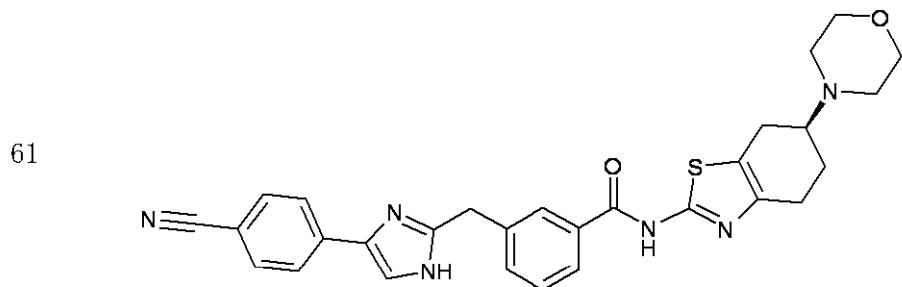
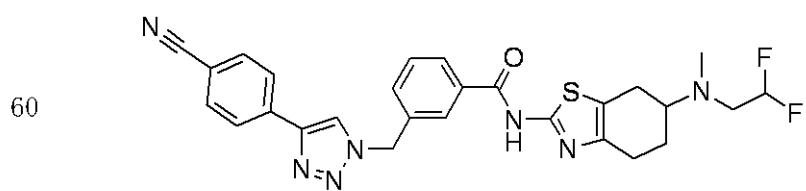
53

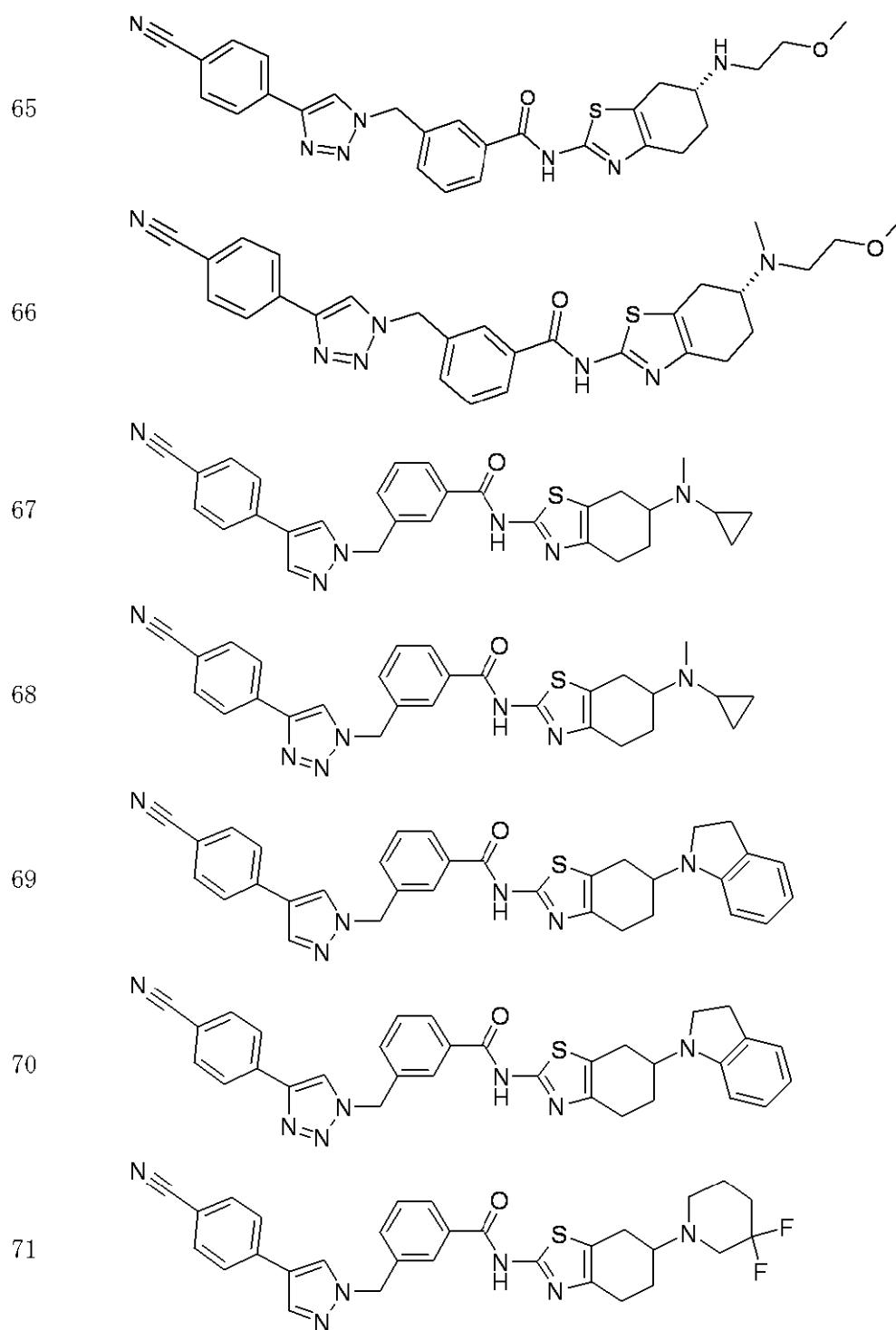


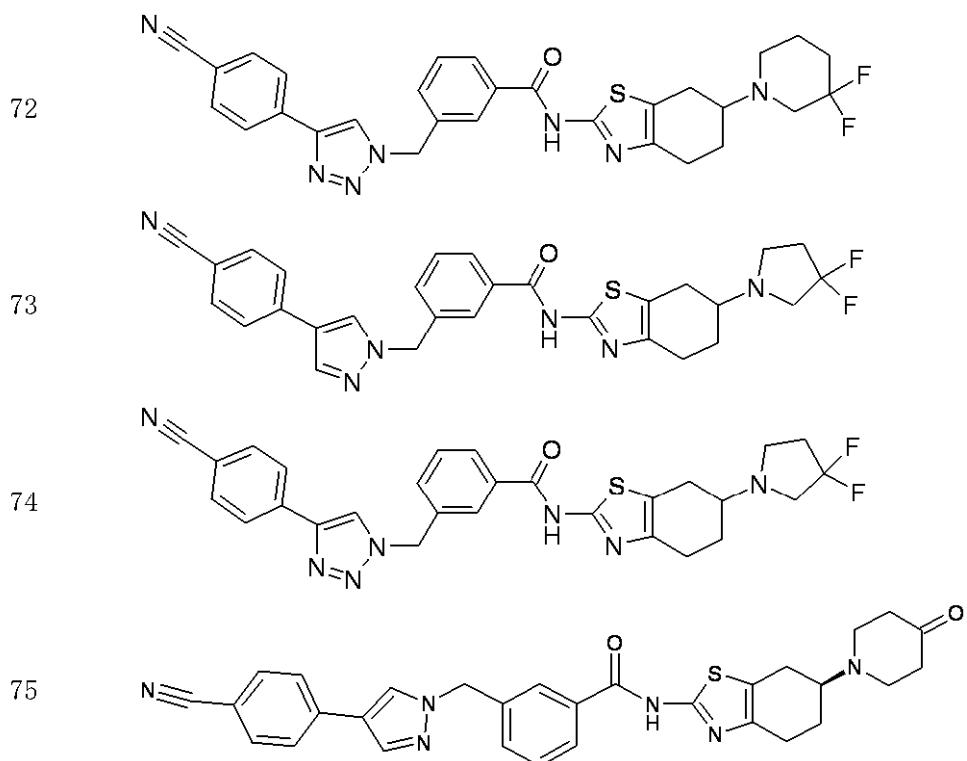
54











から成る群より選択される化合物及びその医薬的に許容できる塩。

【請求項 10】

化合物番号1～8、10、11、13～15、18、20、22～33、36、40～46、48、49、51～53、55～59、64～68、71及び73から成る群より選択される、請求項9に記載の化合物及びその医薬的に許容できる塩。

### 【請求項 11】

請求項1に記載の化合物を含む医薬組成物。

## 【請求項 1 2】

温血動物のRhoキナーゼ媒介障害の治療の為の、請求項11の医薬組成物。

【請求項 13】

前記Rhoキナーゼ媒介障害が、高血圧症、アテローム性動脈硬化症、再狭窄、脳卒中、心筋梗塞、心不全、冠動脈疾患、末梢動脈疾患、冠血管攣縮、脳血管攣縮、虚血／再灌流障害、肺高血圧症、狭心症、勃起不全、腎疾患、臓器不全、喘息、縲内障、癌、アルツハイマー病、多発性硬化症、脊髄損傷、神経障害性疼痛、関節リウマチ、乾癬、炎症性腸疾患、及び該障害の組合せである、請求項12に記載の医薬組成物。