

【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27年12月3日(2015.12.3)

【公表番号】特表2014-530813(P2014-530813A)

【公表日】平成26年11月20日(2014.11.20)

【年通号数】公開・登録公報2014-064

【出願番号】特願2014-535037(P2014-535037)

【国際特許分類】

C 0 7 C 279/18 (2006.01)

C 0 7 C 277/08 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 13/10 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 5/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/155 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 279/18 C S P

C 0 7 C 277/08

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 1/18

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 13/10

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 5/00

A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 K 45/00
 A 6 1 K 31/155
 A 6 1 K 31/505

【手続補正書】

【提出日】平成27年10月8日(2015.10.8)

【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

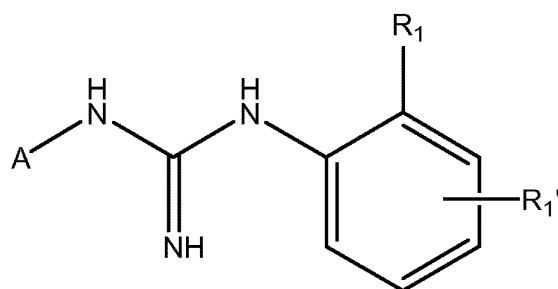
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

R h o - G T P アーゼ細胞タンパク質により媒介される状態の治療に使用するための、
 式 (I)



(I)

の化合物もしくはその塩、又はその立体異性型の何れか又はこれらの混合物

(式中、

R₁ 及び R₁ ' は独立に、H、(C₁ ~ C₄) アルキル、CF₃、F、Cl、Br、I、
 -CN、OH、NH₂、-OCH₃ 及び NO₂ からなる群から選択され；但し、R₁ 及
 び R₁ ' の少なくとも一つはH以外であり；

A は直鎖もしくは分枝 (C₁ ~ C₆) アルキル又は1 ~ 2 個の環を有する既知の炭素環
 もしくは複素環系の一つから選択される基であり、前記環系を形成する前記環の各々は、

5 ~ 7 員を有し、各員は独立に、C、N、O、S、CH、CH₂、NH から選択され

、

飽和、部分不飽和又は芳香族であり；

A はH、ハロゲン、ニトロ、シアノ、直鎖もしくは分枝 (C₁ ~ C₆) アルキル、ハロ
 - (C₁ ~ C₆) アルキル、直鎖もしくは分枝 (C₂ ~ C₆) アルケニル、-OR₂、-
 COR₂、-COOR₂、-OC(O)R₂、-C(O)NR₃R₄、-NR₃R₄、-
 R₅NHR₆、-SR₂、-SO-R₂、-SO₂-R₂ 及び -SO₂NR₃R₄ からな
 る群から選択される一又は複数の基で置換されており；

各 R₂ は独立に、H 又は直鎖もしくは分枝 (C₁ ~ C₄) アルキルを表し、

各 R₃ は独立に、H 又は直鎖もしくは分枝 (C₁ ~ C₄) アルキルを表し、

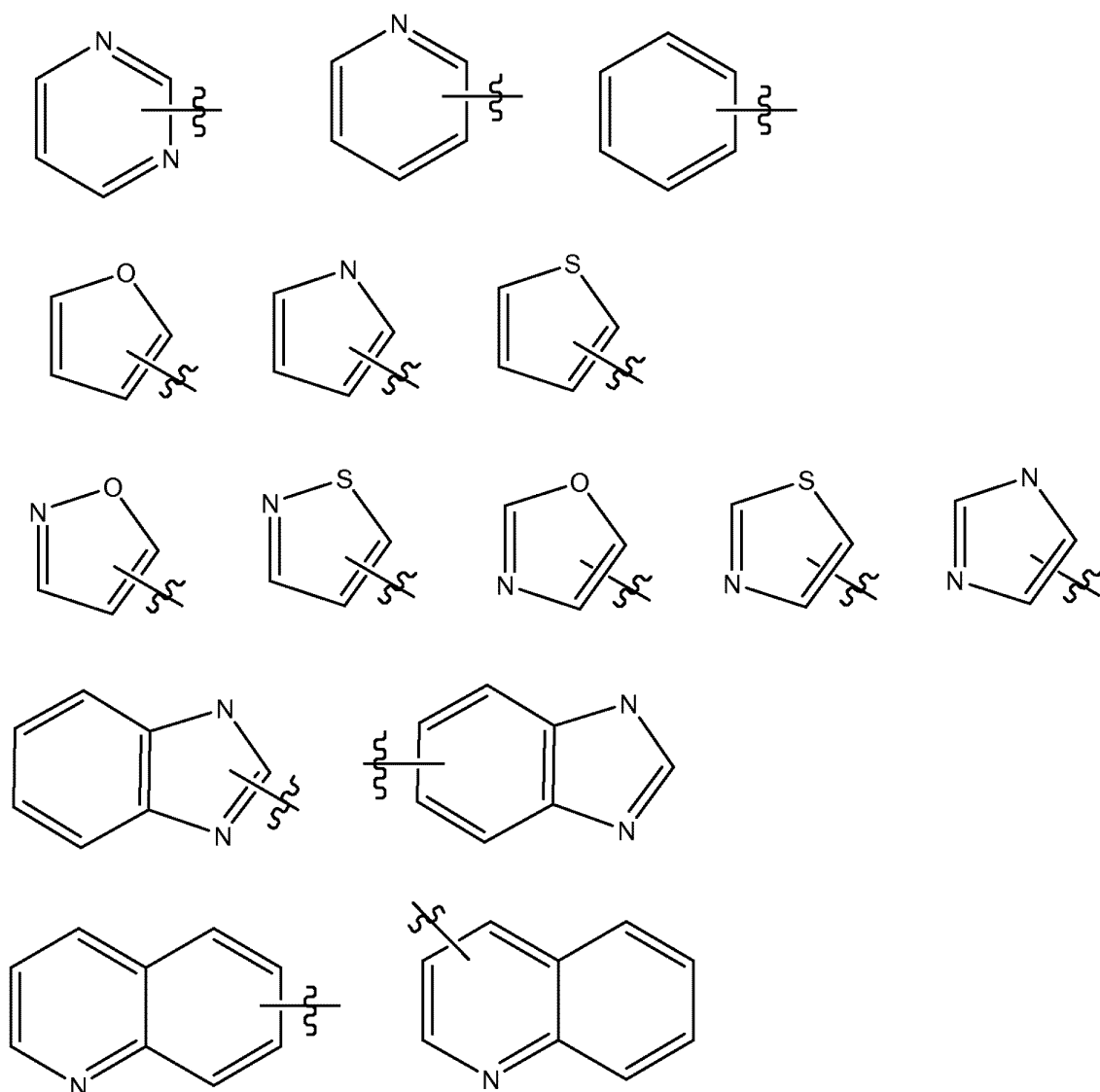
各 R₄ は独立に、H、直鎖もしくは分枝 (C₁ ~ C₆) アルキル、フェニル、ピリジ
 ン又はキノリンを表し；フェニル、ピリジン及びキノリン環系は、H、直鎖もしくは分枝
 (C₁ ~ C₄) アルキル、及び NH₂ から選択される一又は複数の基で置換されており；

R₅ 及び R₆ は独立に、H、直鎖もしくは分枝 (C₁ ~ C₄) アルキルから選択され

る)であって、R h o - G T Pアーゼ細胞タンパク質がR a c 1であり、疾患が、胃腸又は結腸直腸管、肝臓、膵臓、腎臓、膀胱、前立腺、子宮内膜、卵巣、精巣の前癌状態；異形成；化生；癌、メラノーマ、異形成口腔粘膜、浸潤性口腔癌、小細胞及び非小細胞肺癌、ホルモン依存性乳癌、ホルモン非依存性乳癌、移行扁平上皮細胞癌、神経芽細胞腫、神経膠腫、神経膠芽腫、星状細胞腫を含む神経悪性腫瘍、骨肉種、軟部肉腫、血管腫、内分泌腫瘍、白血病、リンパ腫及び他の骨髓増殖性及びリンパ増殖性疾患を含む血液系新形成、上皮内癌、過形成病変、腺腫、線維腫、組織球増殖症、慢性炎症性増殖性疾患、血管増殖性疾患及びウイルス誘発増殖性疾患、ケラチノサイト及び／又はT細胞の過剰増殖を特徴とする皮膚疾患からなる群から選択される増殖性疾患である、化合物もしくはその塩、又はその立体異性型の何れか又はこれらの混合物。

【請求項 2】

A が

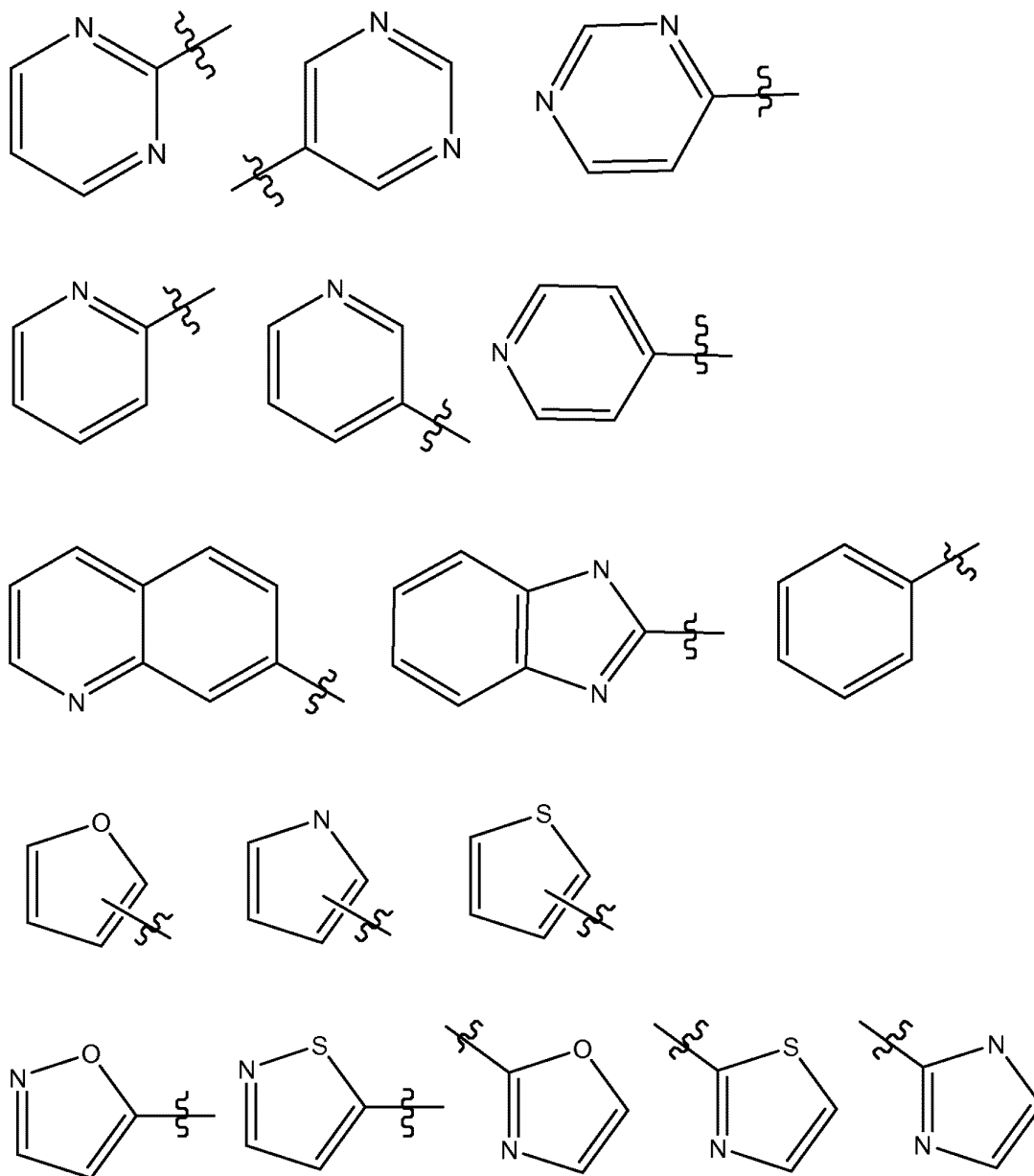


から選択される環系であり、

A が請求項 1 に記載される一又は複数の基で置換されており、波線が環と隣接窒素の結合の点を意味する、請求項 1 に記載の使用のための化合物。

【請求項 3】

A が



から選択される環系であり、

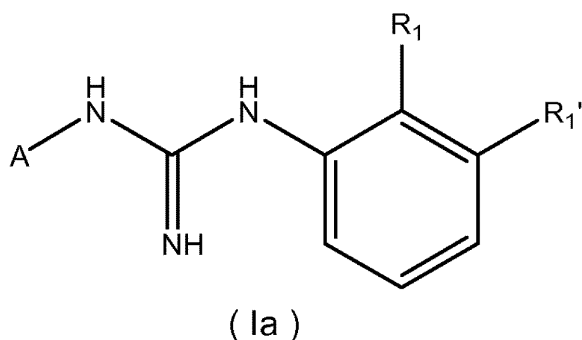
Aが請求項1に記載される一又は複数の基で置換されており、波線が環と隣接窒素の結合の点を意味する、請求項1～2の何れかに記載の使用のための化合物。

【請求項4】

Aの前記環系がH、F、Cl、Br、I、ニトロ、シアノ、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、t-ブチル、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、直鎖もしくは分枝($\text{C}_2 \sim \text{C}_6$)アルケニル、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{COH}$ 、 $-\text{COCH}_3$ 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{COOCH}_3$ 、 $-\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHCH}_3$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{NHCH}_3$ 、 $-\text{SH}_2$ 、 $-\text{SO}-\text{CH}_3$ 、 $-\text{SO}_2-\text{CH}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{SO}_2\text{NHCH}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{NHCH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$ 及び $-\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)_2)_2$ からなる群から選択される一又は複数の基で置換されている、請求項1～3の何れかに記載の使用のための化合物。

【請求項 5】

以下の一般式 I a



(式中、 R_1 及び R_1' が独立に、H、 CF_3 、 NH_2 、メチル、エチル、F、Cl、Br、I 及び OH から選択される；但し、 R_1 が H である場合、 R_1' は H と異なり、逆もまた同様であり；

A が請求項 1～4 の何れか一項に記載される通りである)

を有することを特徴とする、請求項 1～4 の何れかに記載の 使用のための 化合物もしくはその塩、又はその立体異性型の何れか又はこれらの混合物。

【請求項 6】

A が 1～2 個の環を有する既知の複素環系の一つの基であり、

前記環系を形成する前記環の各々が、

5～7 員を有し、各員は独立に、C、N、O、S、CH、 CH_2 、NH から選択され

、

飽和、部分不飽和又は芳香族であり；

A が H、F、Cl、Br、I、ニトロ、シアノ、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*t*-ブチル、 $-CF_3$ 、 $-CH_2CF_3$ 、直鎖もしくは分枝 ($C_2 \sim C_6$) アルケニル、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-COH$ 、 $-COCH_3$ 、 $-COOH$ 、 $-COOCH_3$ 、 $-COOCH_2CH_3$ 、 $-OC(O)H$ 、 $-OC(O)CH_3$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-NHCH_3$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-CH_2NH_2$ 、 $-CH_2NHCH_3$ 、 $-SH_2$ 、 $-SO-CH_3$ 、 $-SO_2-CH_3$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHCH_3$ 、 $-SO_2NHCH_2CH_3$ 、 $-SO_2N(CH_3)_2$ 、 $-SO_2N(CH_2CH_3)_2$ 、 $-SO_2N(CH_2CH_2CH_3)_2$ 、 $-SO_2N(CH_2CH_2CH_3)_2$ 及び $-SO_2N(CH_2CH_2(CH_3)_2)_2$ からなる群から選択される一又は複数の基で置換されている、請求項 5 に記載の 使用のための 化合物。

【請求項 7】

A が H、F、Cl、Br、I、ニトロ、シアノ、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*t*-ブチル、 $-CF_3$ 、 $-CH_2CF_3$ 、直鎖もしくは分枝 ($C_2 \sim C_6$) アルケニル、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-COH$ 、 $-COCH_3$ 、 $-COOH$ 、 $-COOCH_3$ 、 $-COOCH_2CH_3$ 、 $-OC(O)H$ 、 $-OC(O)CH_3$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-NHCH_3$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-CH_2NH_2$ 、 $-CH_2NHCH_3$ 、 $-SH_2$ 、 $-SO-CH_3$ 、 $-SO_2-CH_3$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHCH_3$ 、 $-SO_2NHCH_2CH_3$ 、 $-SO_2N(CH_3)_2$ 、 $-SO_2N(CH_2CH_3)_2$ 、 $-SO_2N(CH_2CH_2CH_3)_2$ 、 $-SO_2N(CH_2CH_2CH_3)_2$ 及び $-SO_2N(CH_2CH_2(CH_3)_2)_2$ からなる群から選択される一又は複数の基で置換されているフェニル基である、請求項 5 に記載の 使用のための 化合物。

【請求項 8】

R_1 が CF_3 であり、 R_1' が H である、請求項 1～7 の何れかに記載の 使用のための 化合物。

【請求項 9】

N-ピリミジン-2-イル-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(1) ;

N-(4-エチル-6-メチルピリミジン-2-イル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(2) ;

N-(4-メチル-6-プロピルピリミジン-2-イル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(3) ;

N-(4-イソプロピル-6-メチルピリミジン-2-イル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(4) ;

N-(4-ブチル-6-メチルピリミジン-2-イル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(5) ;

N-(4-tert-ブチル-6-メチルピリミジン-2-イル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(6) ;

N-(4,6-ジアミノピリミジン-2-イル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(7) ;

N-(4,6-ジクロロピリミジン-2-イル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(8) ;

N-(4,6-ジフルオロピリミジン-2-イル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(9) ;

N-[4-メチル-6-(トリフルオロメチル)ピリミジン-2-イル]-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(10) ;

N-(4-シアノ-6-メチルピリミジン-2-イル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(11) ;

N-(5-メチルピリミジン-2-イル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(12) ;

N-(4-クロロ-6-メチルピリミジン-2-イル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(13) ;

N-(4-フルオロ-6-メチルピリミジン-2-イル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(14) ;

N-(4-フルオロピリミジン-2-イル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(15) ;

N-(5-フルオロピリミジン-2-イル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(16) ;

N-[4,6-ビス(トリフルオロメチル)ピリミジン-2-イル]-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(17) ;

N-(4,6-ジシアノピリミジン-2-イル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(18) ;

N-ピリジン-2-イル-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(19) ;

N-ピリジン-3-イル-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(20) ;

N-ピリジン-4-イル-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(21) ;

N-ピリミジン-4-イル-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(22) ;

N-ピリミジン-5-イル-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(23) ;

N-(4,6-ジメチルピリジン-2-イル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(24) ;

N-(3,5-ジメチルフェニル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン(25) ;

N- (2, 6-ジメチルピリジン-4-イル) -N' - [2- (トリフルオロメチル) フェニル] グアニジン (26) ;

N-フェニル-N' - [2- (トリフルオロメチル) フェニル] グアニジン (27) ;
2- [(イミノ { [2- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ } メチル) アミノ]
-N, N-ジメチルベンゼンスルホンアミド (28) ;

2- [(イミノ { [2- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ } メチル) アミノ]
-N, N-ジエチルベンゼンスルホンアミド (29) ;

2- [(イミノ { [2- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ } メチル) アミノ]
-N, N-ジプロピルベンゼンスルホンアミド (30) ;

2- [(イミノ { [2- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ } メチル) アミノ]
-N, N-ジブチルベンゼンスルホンアミド (31) ;

3- [(イミノ { [2- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ } メチル) アミノ]
-N, N-ジメチルベンゼンスルホンアミド (32) ;

3- [(イミノ { [2- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ } メチル) アミノ]
-N, N-ジエチルベンゼンスルホンアミド (33) ;

3- [(イミノ { [2- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ } メチル) アミノ]
-N, N-ジプロピルベンゼンスルホンアミド (34) ;

3- [(イミノ { [2- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ } メチル) アミノ]
-N, N-ジブチルベンゼンスルホンアミド (35) ;

4- [(イミノ { [2- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ } メチル) アミノ]
-N, N-ジメチルベンゼンスルホンアミド (36) ;

4- [(イミノ { [2- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ } メチル) アミノ]
-N, N-ジエチルベンゼンスルホンアミド (37) ;

4- [(イミノ { [2- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ } メチル) アミノ]
-N, N-ジプロピルベンゼンスルホンアミド (38) ;

4- [(イミノ { [2- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ } メチル) アミノ]
-N, N-ジブチルベンゼンスルホンアミド (39) ;

N- (2-ニトロフェニル) -N' - [2- (トリフルオロメチル) フェニル] グアニジン (40) ;

N- (3-ニトロフェニル) -N' - [2- (トリフルオロメチル) フェニル] グアニジン (41) ;

N- (4-ニトロフェニル) -N' - [2- (トリフルオロメチル) フェニル] グアニジン (42) ;

N-2-チエニル-N' - [2- (トリフルオロメチル) フェニル] グアニジン (43) ;

N-3-チエニル-N' - [2- (トリフルオロメチル) フェニル] グアニジン (44) ;

N-1H-ピロール-2-イル-N' - [2- (トリフルオロメチル) フェニル] グアニジン (45) ;

N-1H-ピロール-3-イル-N' - [2- (トリフルオロメチル) フェニル] グアニジン (46) ;

N-2-フリル-N' - [2- (トリフルオロメチル) フェニル] グアニジン (47) ;

N-3-フリル-N' - [2- (トリフルオロメチル) フェニル] グアニジン (48) ;

N-1, 3-オキサゾール-2-イル-N' - [2- (トリフルオロメチル) フェニル] グアニジン (49) ;

N-1, 3-チアゾール-2-イル-N' - [2- (トリフルオロメチル) フェニル] グアニジン (50) ;

N-1H-イミダゾール-2-イル-N' - [2- (トリフルオロメチル) フェニル]

グアニジン (51) ;

N-イソキサゾール-5-イル-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン (52) ;

N-1H-ベンズイミダゾール-2-イル-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン (53) ;

N-(3,4-ジメチルイソキサゾール-5-イル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン (54) ;

N-(2-アミノフェニル)-N'-(4,6-ジメチルピリミジン-2-イル)グアニジン (55) ;

N-(4,6-ジメチルピリミジン-2-イル)-N'-(3-エチルフェニル)グアニジン (56) ;

1-(4-(4-アミノ-2-メチルキノリン-7-イルアミノ)ピリミジン-2-イル)-3-(2-(トリフルオロメチル)フェニル)グアニジン (57) ;

N-(4-アミノ-2-メチルキノリン-7-イル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン (58) ;

N-キノリン-7-イル-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン (59) ;

N-メチル-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン (60) ;

N-エチル-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン (61) ;

N-プロピル-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン (62) ;

N-ブチル-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン (63) ;

N-(2-メチルフェニル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン (64) ; 及び

N-[4,6-ビス(メチル)ピリミジン-2-イル]-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン (65)

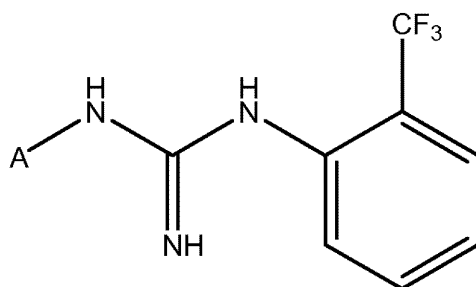
から選択される、請求項1～8の何れかに記載の使用のための化合物。

【請求項10】

N-[4,6-ビス(メチル)ピリミジン-2-イル]-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン (65)、N-(3,5-ジメチルフェニル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン (25)、N-フェニル-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン (27)、N-(3-ニトロフェニル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン (41)、N-[4-メチル-6-(トリフルオロメチル)ピリミジン-2-イル]-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン (10) 及び N-(2-メチルフェニル)-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン (64) から選択される、請求項1～9の何れかに記載の使用のための化合物。

【請求項11】

式 (II)



(II)

の化合物もしくはその塩、又はその立体異性型の何れか又はこれらの混合物
(式中、

A が 1 ～ 2 個の環を有する既知の炭素環又は複素環系の一つの基であり、
前記環系を形成する前記環の各々が、

5 ～ 7 員を有し、各員が独立に、C、N、O、S、CH、CH₂、NH から選択され

、飽和、部分不飽和又は芳香族であり；

A が H、F、Cl、Br、I、ニトロ、シアノ、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、t-ブチル、-CF₃、-CH₂CF₃、直鎖もしくは分枝 (C₂ ～ C₆) アルケニル、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-COH、-COCH₃、-COOH、-COOCH₃、-COOCH₂CH₃、-OC(O)H、-OC(O)CH₃、-C(O)NH₂、-NH₂、-NHCH₃、-N(CH₃)₂、-CH₂NH₂、-CH₂NHCH₃、-SH₂、-SO-CH₃、-SO₂-CH₃、-SO₂NH₂、-SO₂NHCH₃、-SO₂NHCH₂CH₃、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂N(CH₂CH₃)₂、-SO₂N(CH₂CH₂CH₃)₂、-SO₂N(CH₂CH₂CH₃)₂ 及び -SO₂N(CH₂CH₂(CH₃)₂)₂ からなる群から選択される一又は複数の基で置換されおり；

但し、前記化合物が N-(4-メチル-6-ヒドロキシ-ピリミジン-2-イル)-N'-(2-トリフルオロメチルフェニル)グアニジン、N-[4,6-ビス(メチル)ピリミジン-2-イル]-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン又は N-[(4-メチル)ピリミジン-2-イル]-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン以外である)。

【請求項 12】

A が H、F、Cl、Br、I、ニトロ、シアノ、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、t-ブチル、-CF₃、-CH₂CF₃、直鎖もしくは分枝 (C₂ ～ C₆) アルケニル、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-COH、-COCH₃、-COOH、-COOCH₃、-COOCH₂CH₃、-OC(O)H、-OC(O)CH₃、-C(O)NH₂、-NH₂、-NHCH₃、-N(CH₃)₂、-CH₂NH₂、-CH₂NHCH₃、-SH₂、-SO-CH₃、-SO₂-CH₃、-SO₂NH₂、-SO₂NHCH₃、-SO₂NHCH₂CH₃、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂N(CH₂CH₃)₂、-SO₂N(CH₂CH₂CH₃)₂、-SO₂N(CH₂CH₂CH₃)₂ 及び -SO₂N(CH₂CH₂(CH₃)₂)₂ からなる群から選択される一又は複数の基で置換されているフェニル基である、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】

A が 1 ～ 2 個の環を有する複素環系であり、前記環系を形成する前記環の各々が、

5 ～ 7 員を有し、各員が独立に、C、N、O、S、CH、CH₂、NH から選択され

、飽和、部分不飽和又は芳香族であり；

A が H、F、Cl、Br、I、ニトロ、シアノ、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、t-ブチル、-CF₃、-CH₂CF₃、直鎖もしくは分枝 (C₂ ～ C₆) アルケニル、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-COH、-COCH₃、-COOH、-COOCH₃、-COOCH₂CH₃、-OC(O)H、-OC(O)CH₃、-C(O)NH₂、-NH₂、-NHCH₃、-N(CH₃)₂、-CH₂NH₂、-CH₂NHCH₃、-SH₂、-SO-CH₃、-SO₂-CH₃、-SO₂NH₂、-SO₂NHCH₃、-SO₂NHCH₂CH₃、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂N(CH₂CH₃)₂、-SO₂N(CH₂CH₂CH₃)₂、-SO₂N(CH₂CH₂CH₃)₂ 及び -SO₂N(CH₂CH₂(CH₃)₂)₂ からなる群から選択される一又は複数の基で置換されおり；

但し、化合物が N-(4-メチル-6-ヒドロキシ-ピリミジン-2-イル)-N'-(2-トリフルオロメチルフェニル)グアニジン、N-[4,6-ビス(メチル)ピリミジン-2-イル]-N'-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]グアニジン又は N-

【請求項 14】

【請求項 15】

$$\text{A}-\text{NH}_2 \cdot \text{HCl} \quad \text{R}_1' \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{R}_1)(\text{NCN})$$

(式中、 A 、 R_1 及び R_1' は請求項 1 に記載される通りである)。