

【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30年8月16日 (2018.8.16)

【公表番号】特表2017-500295(P2017-500295A)

【公表日】平成29年1月5日 (2017.1.5)

【年通号数】公開・登録公報2017-001

【出願番号】特願2016-533648(P2016-533648)

【国際特許分類】

C 07 D 417/04 (2006.01)

A 61 P 7/00 (2006.01)

A 61 P 39/02 (2006.01)

A 61 P 39/06 (2006.01)

A 61 P 7/06 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 1/16 (2006.01)

A 61 P 9/00 (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 27/02 (2006.01)

A 61 P 1/00 (2006.01)

A 61 P 31/00 (2006.01)

A 61 K 31/4436 (2006.01)

A 61 K 31/426 (2006.01)

【F I】

C 07 D 417/04 C S P

A 61 P 7/00

A 61 P 39/02

A 61 P 39/06

A 61 P 7/06

A 61 P 3/10

A 61 P 1/16

A 61 P 9/00

A 61 P 35/00

A 61 P 25/28

A 61 P 25/00

A 61 P 27/02

A 61 P 1/00

A 61 P 31/00

A 61 K 31/4436

A 61 K 31/426

【手続補正書】

【提出日】平成30年7月3日 (2018.7.3)

【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

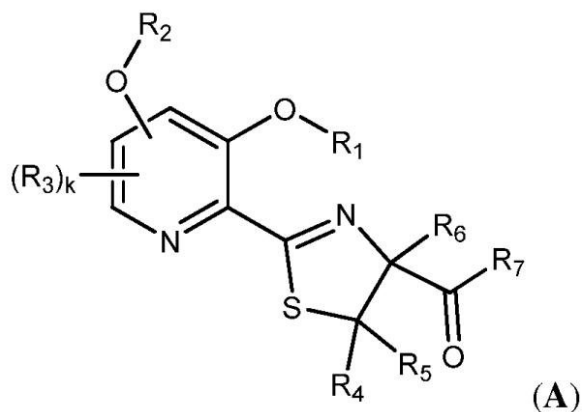
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (A) :

【化 1】



式中、

R₁ は、水素、アルキル、アシル、または酸素保護基であり；R₂ は、水素、アルキル、アシル、酸素保護基、 $-[(CH_2)_n - O]_x - [(CH_2)_n - O]_y - R''$ 、または $-[(CH_2)_n - O]_x - [(CH_2)_n - O]_y - (CH_2)_n - NR_{10} - C(=O)O - R''$ であり；各 R₃ の出現は、独立して、アルキル、アリールアルキル、または $-OR_8$ であり；R₄、R₅ および R₆ は、各々独立して、水素またはアルキルであり；R₇ は、 $-OR_9$ または $-SR_9$ であり；R₈ は、水素、アルキル、アシル、または酸素保護基であり；R₉ は、水素、アルキル、酸素保護基（酸素原子に付いている場合）、または硫黄保護基（硫黄原子に付いている場合）であり；R₁₀ は、水素、アルキル、アシル、または窒素保護基であり；

R' は、水素または酸素保護基であり；

R'' は、水素、アルキル、アシル、または酸素保護基であり；

各 n の出現は、独立して 1 ~ 8 の整数であり；

k は、0 ~ 2 の整数であり；

x は、1 ~ 8 の整数であり；および

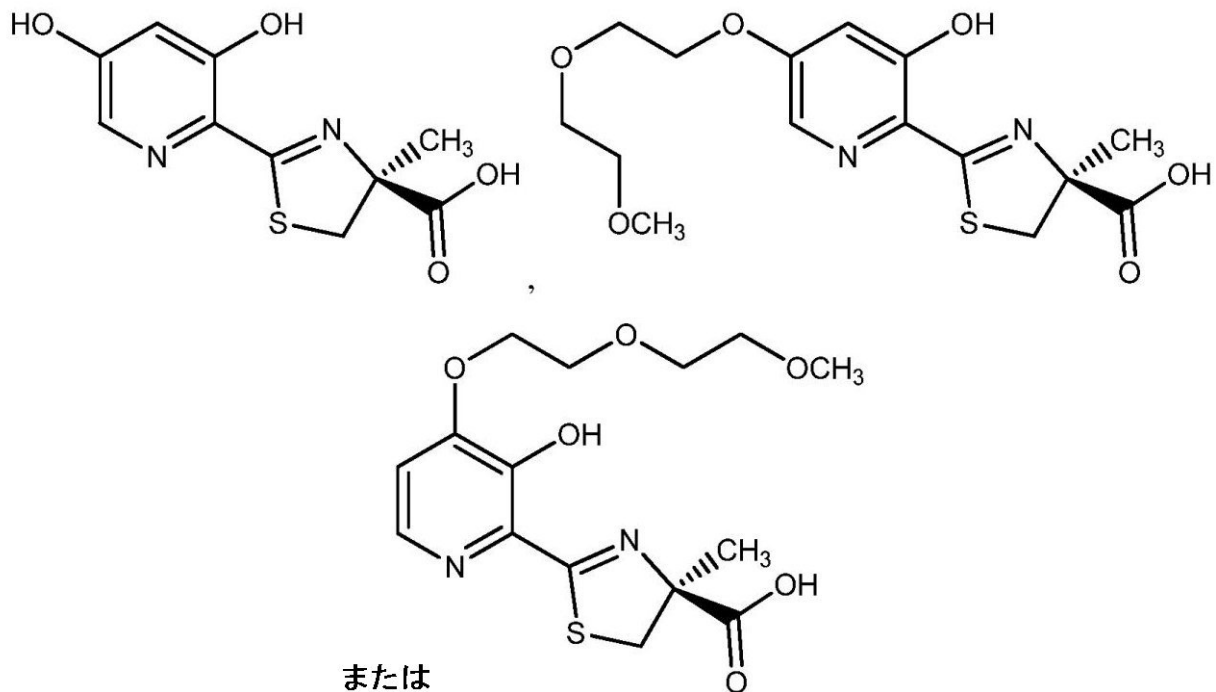
y は、0 ~ 8 の整数である；

で表される化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 2】

化合物が、式

【化 2】

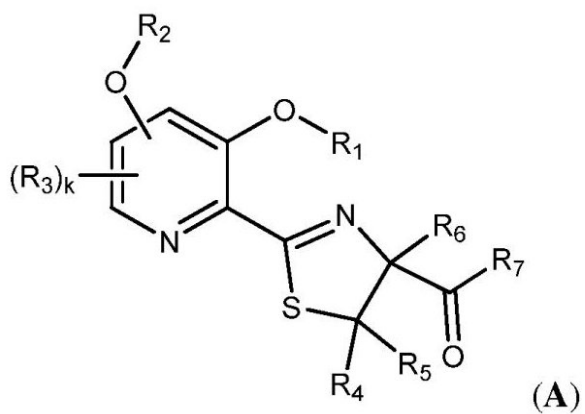


で表されるものではない、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 3】

式 (A) :

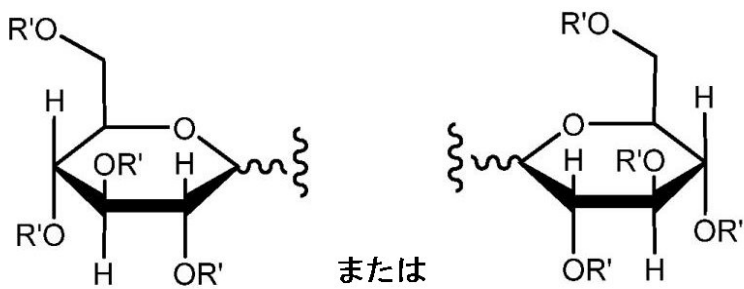
【化 3】



式中、

R₁ は、水素、アルキル、アシル、酸素保護基、

【化 4】



であり；

R_2 は、水素、アルキル、アシル、酸素保護基、 $-[(CH_2)_n - O]_x - [(CH_2)_n - O]_y - R''$ 、または $-[(CH_2)_n - O]_x - [(CH_2)_n - O]_y - (CH_2)_n - NR_{10} - C(=O)O - R''$ であり；

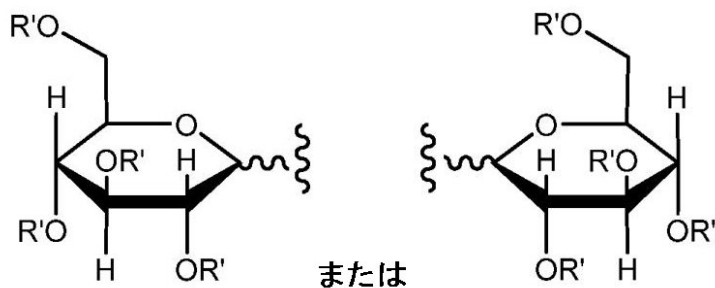
各 R_3 の出現は、独立して、アルキル、アリールアルキル、または $-OR_8$ であり；

R_4 、 R_5 および R_6 は、各々独立して、水素またはアルキルであり；

R_7 は、 $-OR_9$ または $-SR_9$ であり；

R_8 は、水素、アルキル、アシル、酸素保護基、

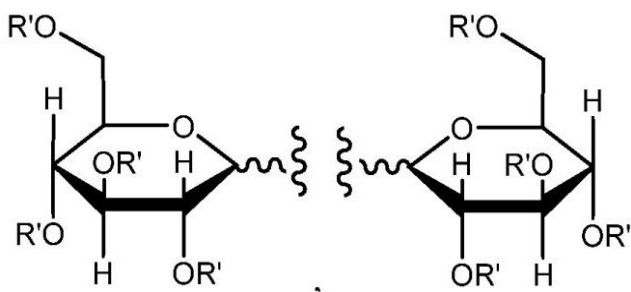
【化 5】



であり；

R_9 は、水素、アルキル、

【化 6】



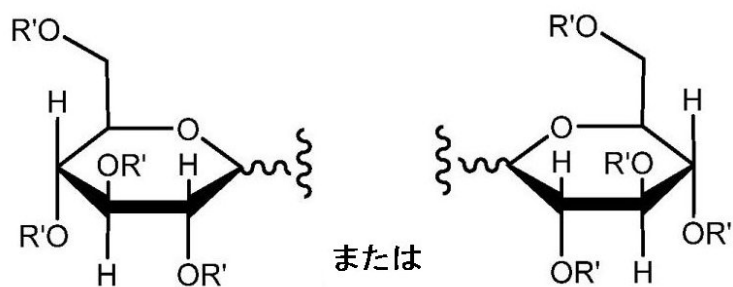
、酸素保護基（酸素原子に付いている場合）、または硫黄保護基（硫黄原子に付いている場合）であり；

R_{10} は、水素、アルキル、アシル、または窒素保護基であり；

R' は、水素または酸素保護基であり；

R'' は、水素、アルキル、アシル、酸素保護基、

【化 7】



であり；

各 n の出現は、独立して 1 ~ 8 の整数であり；

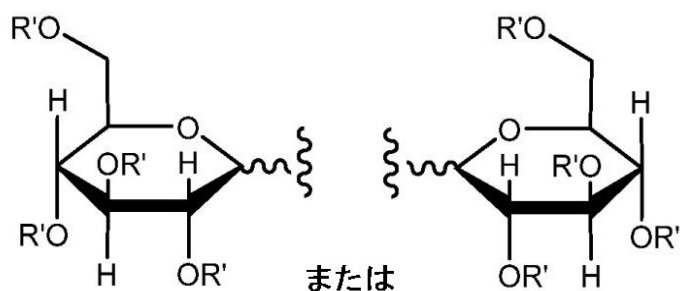
k は、0 ~ 2 の整数であり；

x は、1 ~ 8 の整数であり；および

y は、0 ~ 8 の整数であり；

ただし、 R_1 および R_9 の少なくとも一方が

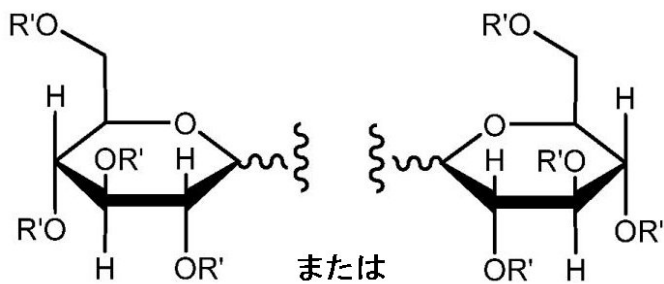
【化 8】



であるか；あるいは、

R_2 が $-[(CH_2)_n - O]_x - [(CH_2)_n - O]_y - R''$ または $-[(CH_2)_n - O]_x - [(CH_2)_n - O]_y - (CH_2)_n - NR_{10} - C(=O)O - R''$ であり、かつ、 R'' が

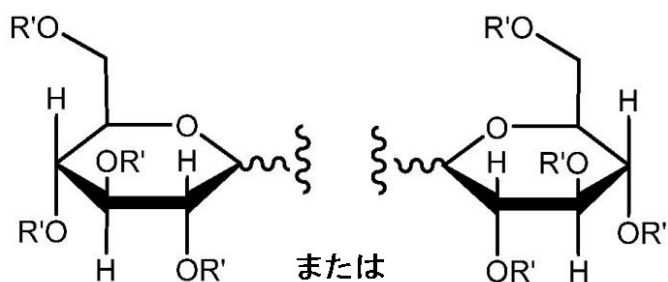
【化 9】



であるか；あるいは、

R_3 が $-OR_8$ であり、 R_8 が

【化 1 0】



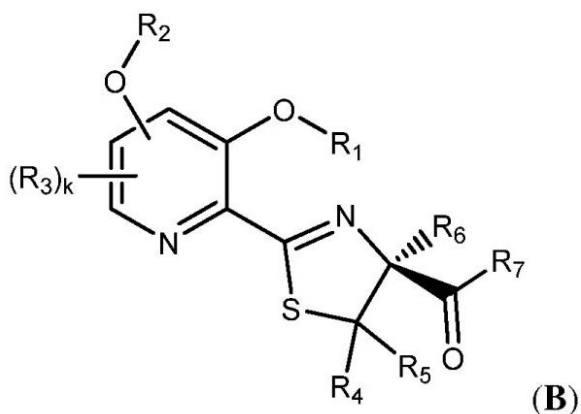
であり、かつ、 k が 1 または 2 である；

で表される化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 4】

化合物が、式 (B)：

【化 1 1】

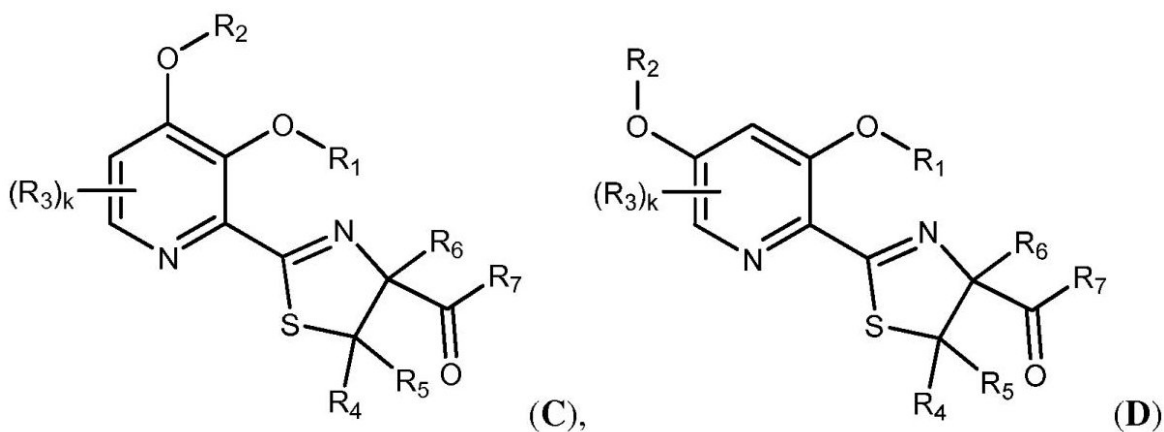


で表される、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 5】

化合物が、式：

【化 1 2】

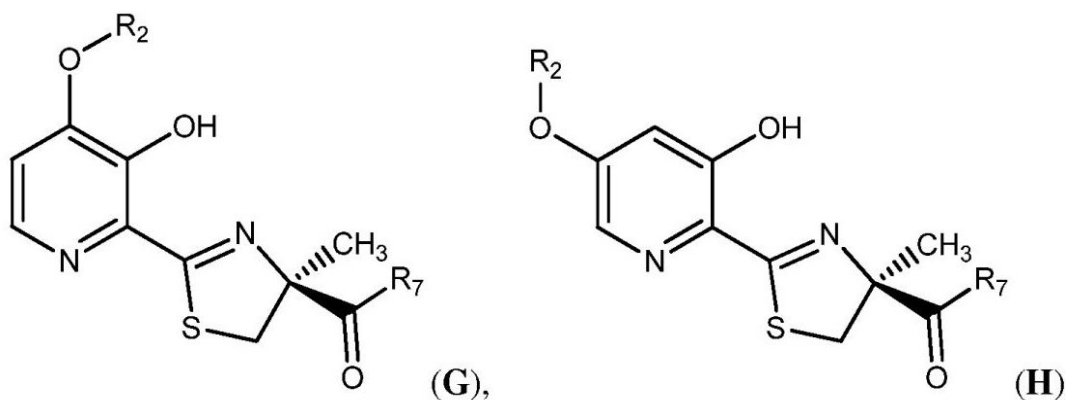


で表される、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 6】

化合物が、式：

【化 1 3】

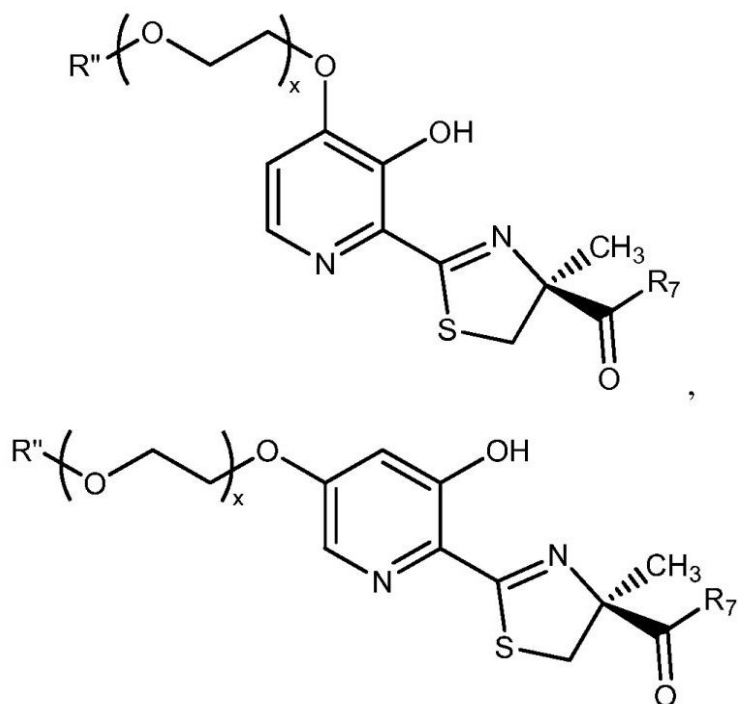


で表される、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 7】

化合物が、式：

【化 1 4】

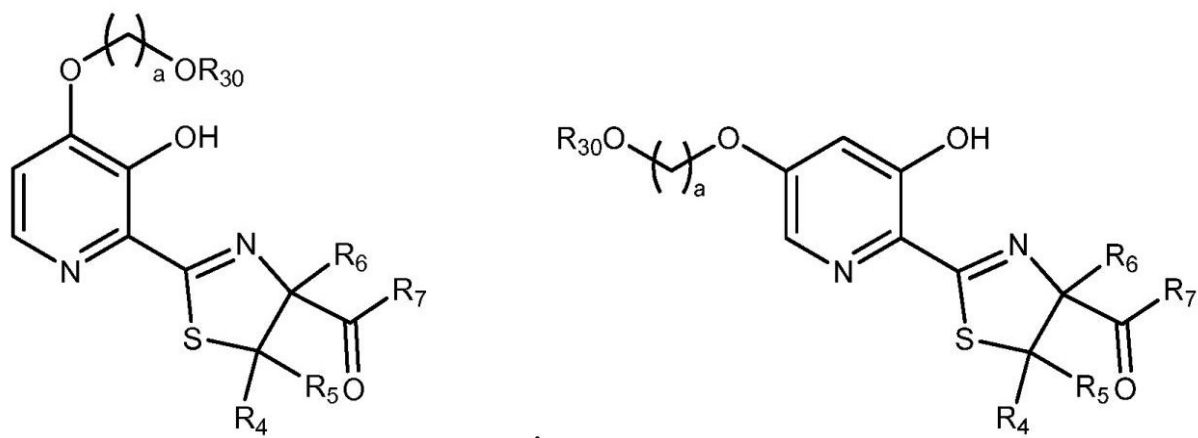


で表される、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 8】

化合物が、式：

【化 1 5】



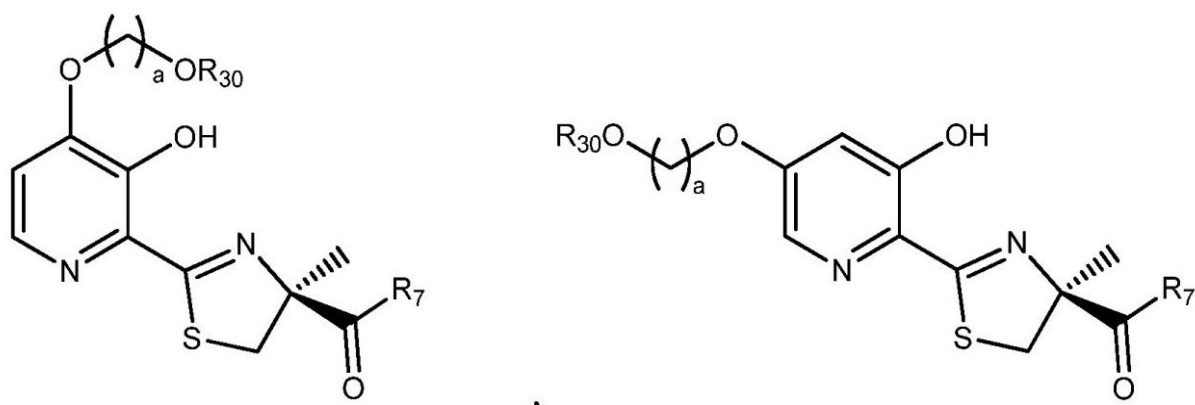
で表され、

式中、R₃₀が、H、置換されたもしくは非置換のC₁ - 6 アルキルまたは酸素保護基であり；aが、2、3、4、5、6、7、8、9、または10である、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 9】

化合物が、式：

【化 1 6】

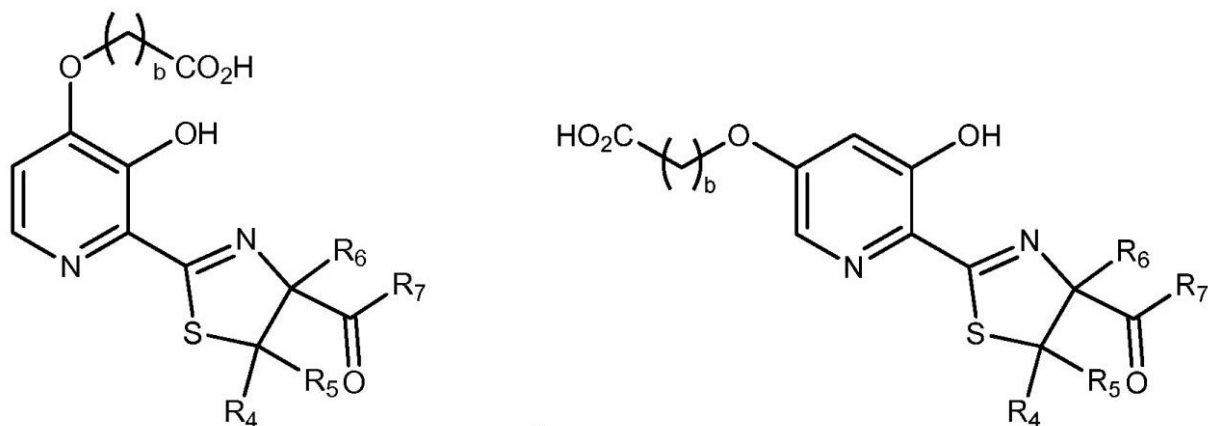


で表される、請求項8に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 10】

化合物が、式：

【化 17】



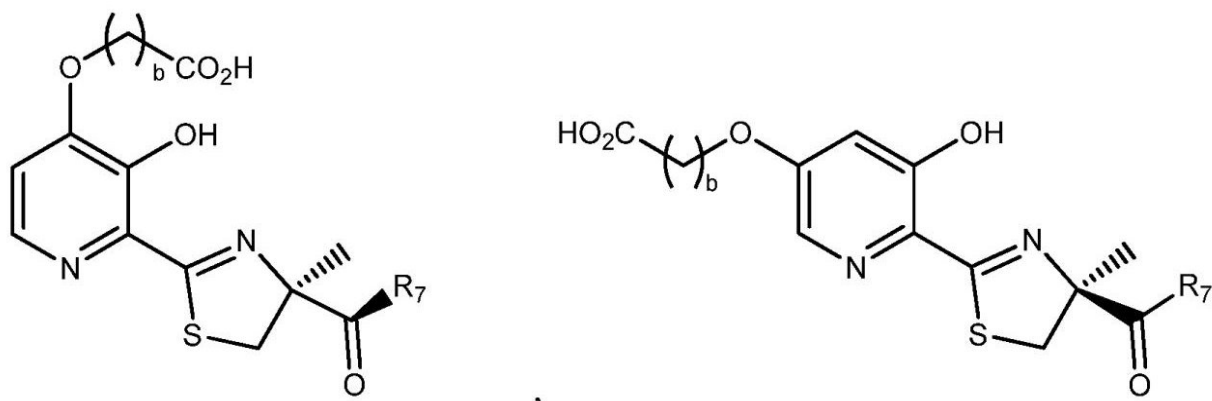
で表され、

式中、 b が、1、2、3、4、5、6、7、8、9、または10である、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 11】

化合物が、式：

【化 18】



で表される、請求項10に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

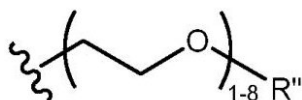
【請求項 12】

R_1 が水素である、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 13】

R_2 が

【化 19】

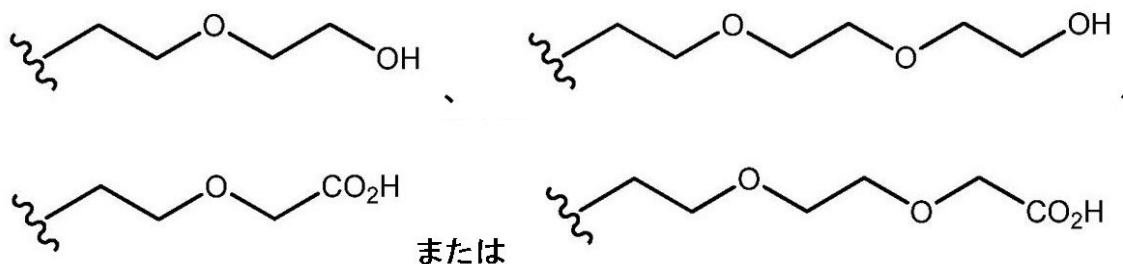


である、請求項1～6、および12のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 14】

R_2 が

【化 20】



である、請求項 13 に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 15】

R_2 が、任意に 1 以上の置換基で置換されていてもよい C_{1-12} アルキルであって、当該置換基は、独立して、ヒドロキシ基、アルキルオキシ基、および $-CO_2H$ からなる群から選択されたものである、請求項 1～6、および 12 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 16】

R_2 が、 $-(CH_2)_2-OH$ 、 $-(CH_2)_3-OH$ 、 $-(CH_2)_4-OH$ 、 $-(CH_2)_5-OH$ 、 $-(CH_2)_6-OH$ 、 $-(CH_2)_7-OH$ 、 $-(CH_2)_8-OH$ 、 $-(CH_2)_2-OCH_3$ 、 $-(CH_2)_3-OCH_3$ 、 $-(CH_2)_4-OCH_3$ 、 $-(CH_2)_5-OCH_3$ 、 $-(CH_2)_6-OCH_3$ 、 $-(CH_2)_7-OCH_3$ 、 $-(CH_2)_8-OCH_3$ 、 $-CH_2-CO_2H$ 、 $-(CH_2)_2-CO_2H$ 、 $-(CH_2)_3-CO_2H$ 、 $-(CH_2)_4-CO_2H$ 、 $-(CH_2)_5-CO_2H$ 、 $-(CH_2)_6-CO_2H$ 、または $-(CH_2)_7-CO_2H$ である、請求項 15 に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 17】

R_4 および R_5 がそれぞれ水素である、請求項 1～5、8、10、および 12～16 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 18】

R_6 が $-CH_3$ である、請求項 1～5、8、10、および 12～17 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 19】

R_7 が $-OMe$ 、 $-OEt$ 、 $-OPr$ 、または $-OBu$ である、請求項 1～18 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

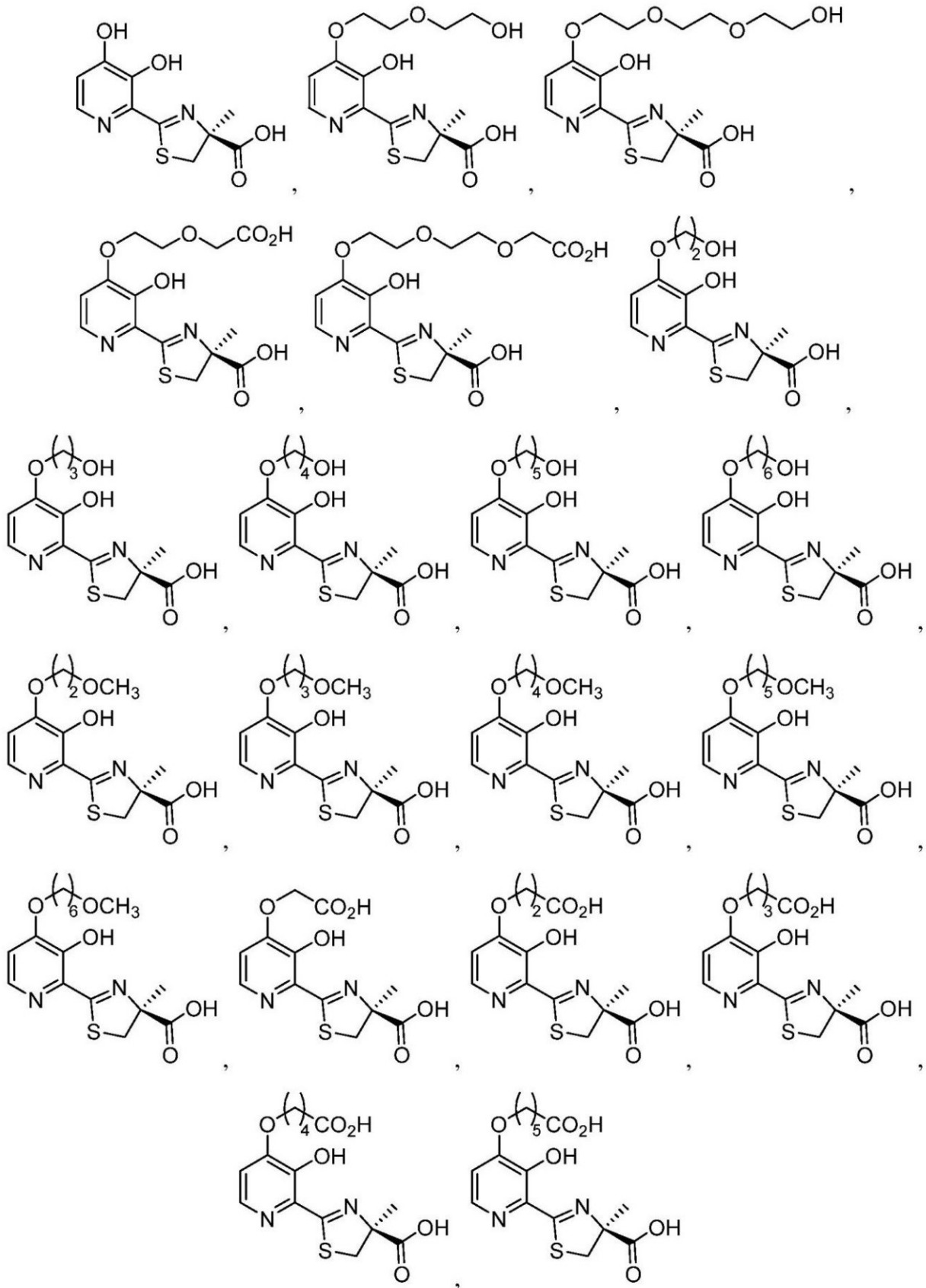
【請求項 20】

R_7 が $-OH$ である、請求項 1～18 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 21】

化合物が、式：

【化 2 1】

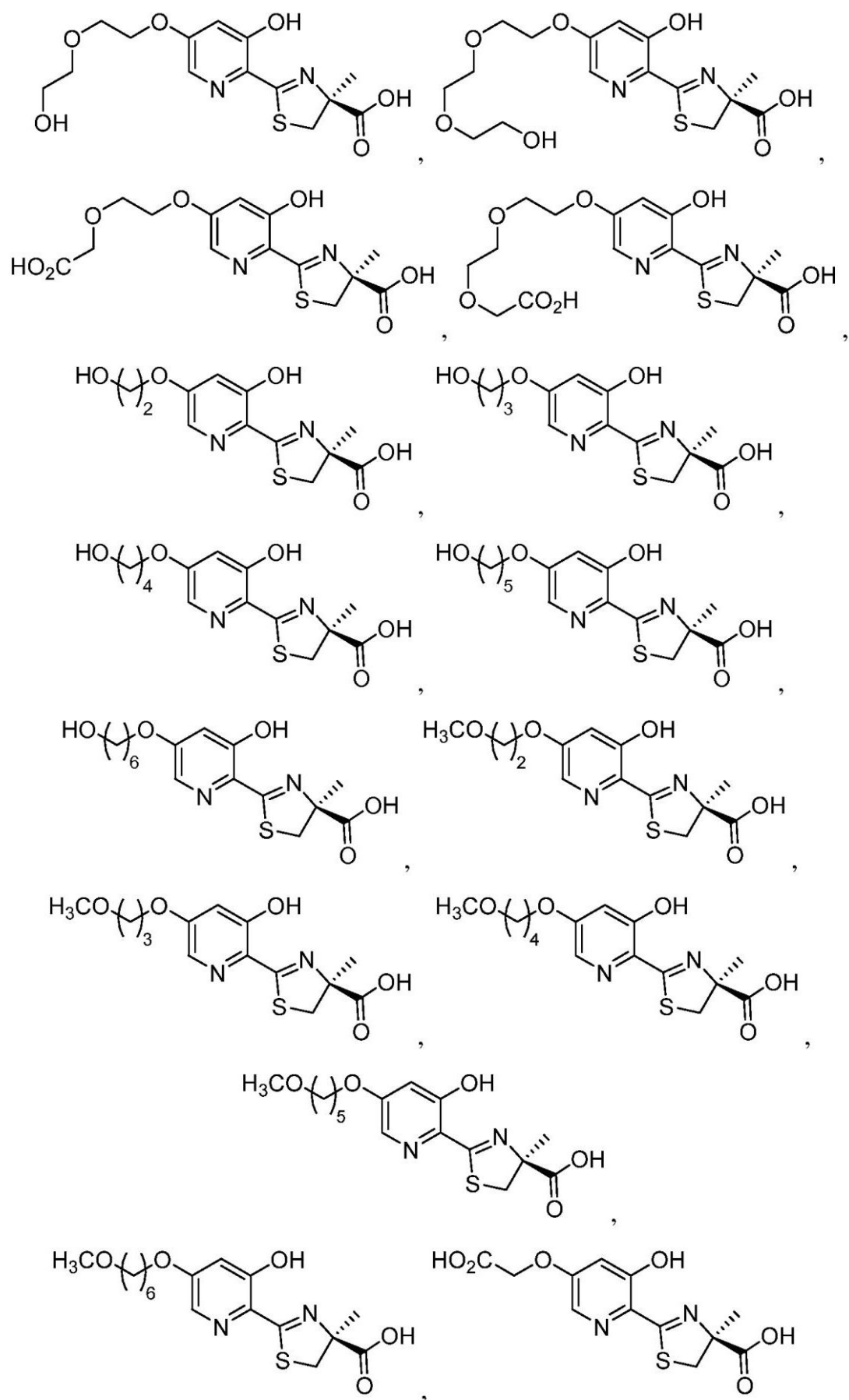


で表される、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

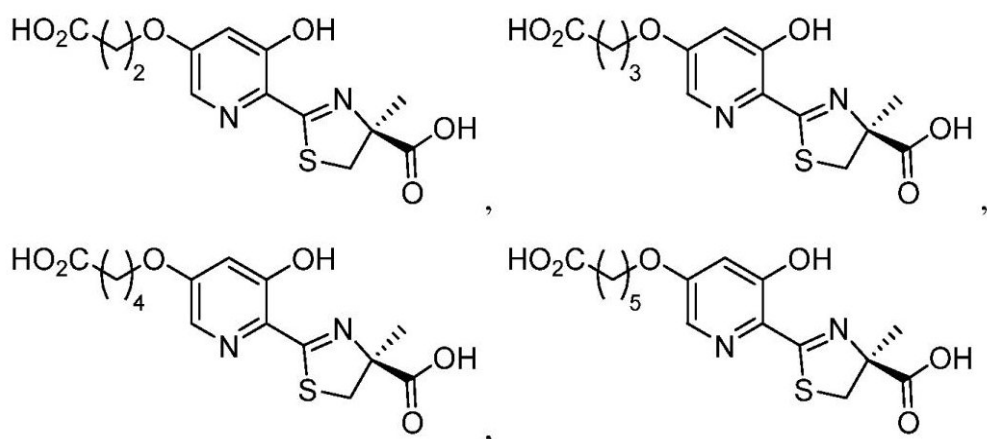
【請求項 2 2】

化合物が、式：

【化 2 2 - 1】



【化 2 2 - 2】

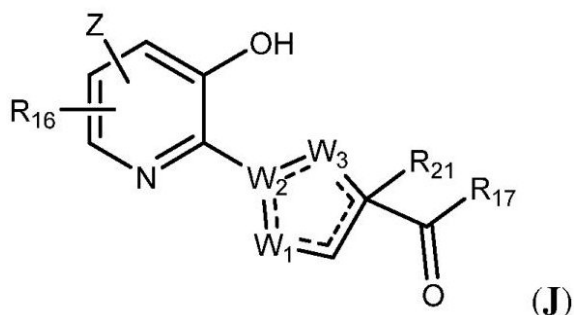


で表される、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 2 3】

式 (J) :

【化 2 3】



式中、

【化 2 4】

=====

は、単結合または二重結合を表し；

$W_1 \sim W_3$ は、独立して CR_{22} 、 NR_{23} 、酸素、または硫黄であり、ただし；

W_3 が窒素である場合、 R_{23} は空白であり、

R_{21} がメチルまたは水素である場合、 W_1 は硫黄ではなく；

Z は、 $-OR_{11}$ 、 $-NR_{12}R_{13}$ 、モルホリン、または任意に置換されてもよいピペラジニルであり；

R_{11} は、 $-[(CH_2)_p-O]_u-[(CH_2)_q-O]_v-R_{14}$ 、 $-[(CH_2)_p-NH]_u-[(CH_2)_q-NR_{14}]_v-R_{15}$ 、または $-[(CH_2)_p-O]_u-[(CH_2)_q-NR_{14}]_v-R_{15}$ であり；

R_{12} は、水素、アルキル、 $-[(CH_2)_p-O]_u-[(CH_2)_q-O]_v-R_{14}$ 、 $-[(CH_2)_p-NH]_u-[(CH_2)_q-NR_{14}]_v-R_{15}$ 、または $-[(CH_2)_p-O]_u-[(CH_2)_q-NR_{14}]_v-R_{15}$ であり；

R_{13} は、水素またはアルキルであり；

p および q は、独立して 1 ~ 8 の整数であり；

u は、0 ~ 8 の整数であり；

v は、1 ~ 8 の整数であり；

R_{14} および R_{15} は、独立して水素、アルキル、またはアシルであり；
 R_{16} は、水素、アルキル、またはアルコキシルであり；
 R_{17} は、 $-OR_{18}$ または $-N(OH)R_{19}$ であり；
 R_{18} は、水素、アルキル、またはアリールアルキルであり；
 R_{19} は、アルキルまたは $-(CH_2)_s-N(OH)C(=O)R_{20}$ であり；
 s は、1～8の整数であり；
 R_{20} は、アルキルであり；
 R_{21} は、水素またはアルキルであり；
 各 R_{22} の出現は、独立して空白、水素、またはアルキルであり；
 各 R_{23} の出現は、独立して空白、水素、またはアルキルである；
 で表される化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形。

【請求項 24】

請求項 1～23 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形、および任意に薬学的に許容し得る賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項 25】

対象における、鉄過剰負荷、アルミニウム過剰負荷、ランタニド過剰負荷、アクチニド過剰負荷、酸化ストレス、輸血鉄過剰負荷、サラセミア、原発性ヘモクロマトーシス、二次性ヘモクロマトーシス、糖尿病、肝臓病、心臓病、がん、放射線損傷、神経学的または神経変性障害、フリードライヒ運動失調症 (FRDA)、黄斑変性症、閉鎖性頭部損傷、過敏性腸疾患、再灌流損傷、および感染性疾患からなる群から選択される病的状態を処置する方法における使用のための、請求項 24 に記載の医薬組成物。

【請求項 26】

対象における、鉄過剰負荷、アルミニウム過剰負荷、ランタニド過剰負荷、アクチニド過剰負荷、酸化ストレス、輸血鉄過剰負荷、サラセミア、原発性ヘモクロマトーシス、二次性ヘモクロマトーシス、糖尿病、肝臓病、心臓病、がん、放射線損傷、神経学的または神経変性障害、フリードライヒ運動失調症 (FRDA)、黄斑変性症、閉鎖性頭部損傷、過敏性腸疾患、再灌流損傷、および感染性疾患からなる群から選択される病的状態を処置する方法における使用のための混合物であって、

血液および請求項 24 に記載の医薬組成物を含む、前記混合物。

【請求項 27】

対象における、鉄過剰負荷、アルミニウム過剰負荷、ランタニド過剰負荷、アクチニド過剰負荷、酸化ストレス、輸血鉄過剰負荷、サラセミア、原発性ヘモクロマトーシス、二次性ヘモクロマトーシス、糖尿病、肝臓病、心臓病、がん、放射線損傷、神経学的または神経変性障害、フリードライヒ運動失調症 (FRDA)、黄斑変性症、閉鎖性頭部損傷、過敏性腸疾患、再灌流損傷、および感染性疾患からなる群から選択される病的状態を処置するためのキットであって、

治療有効量の請求項 1～23 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、互変異性体、立体異性体、溶媒和物、水和物、または多形または請求項 24 に記載の医薬組成物、が入っている第 1 の容器と；

病的状態を処置するために対象に該化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、または該医薬組成物を投与するための説明書と

を含むキット。