

【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11月13日(2014.11.13)

【公開番号】特開2014-167027(P2014-167027A)

【公開日】平成26年9月11日(2014.9.11)

【年通号数】公開・登録公報2014-049

【出願番号】特願2014-121362(P2014-121362)

【国際特許分類】

C 0 7 C 237/36 (2006.01)

C 0 7 C 237/34 (2006.01)

C 0 7 C 237/10 (2006.01)

C 0 7 C 239/18 (2006.01)

C 0 7 C 251/48 (2006.01)

C 0 7 C 251/52 (2006.01)

C 0 7 C 271/22 (2006.01)

C 0 7 C 237/26 (2006.01)

C 0 7 C 251/38 (2006.01)

C 0 7 C 259/10 (2006.01)

C 0 7 C 237/30 (2006.01)

C 0 7 C 255/59 (2006.01)

C 0 7 C 243/28 (2006.01)

C 0 7 C 281/06 (2006.01)

C 0 7 C 271/28 (2006.01)

C 0 7 D 261/02 (2006.01)

C 0 7 D 261/04 (2006.01)

C 0 7 D 265/02 (2006.01)

C 0 7 D 207/50 (2006.01)

C 0 7 D 239/26 (2006.01)

C 0 7 D 211/14 (2006.01)

C 0 7 D 241/12 (2006.01)

C 0 7 D 263/32 (2006.01)

C 0 7 D 277/20 (2006.01)

C 0 7 D 277/30 (2006.01)

C 0 7 D 207/337 (2006.01)

C 0 7 D 307/54 (2006.01)

C 0 7 D 295/16 (2006.01)

C 0 7 D 261/08 (2006.01)

C 0 7 D 231/12 (2006.01)

C 0 7 D 213/56 (2006.01)

C 0 7 D 233/64 (2006.01)

C 0 7 D 309/22 (2006.01)

C 0 7 D 271/06 (2006.01)

C 0 7 D 215/14 (2006.01)

C 0 7 D 213/64 (2006.01)

C 0 7 D 295/12 (2006.01)

C 0 7 D 209/44 (2006.01)

C 0 7 D 207/20 (2006.01)

C 0 7 D 211/70 (2006.01)

C 0 7 D 211/38 (2006.01)

C 0 7 D 211/18 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/65 (2006.01)  
 A 6 1 P 31/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 33/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 17/10 (2006.01)  
 A 6 1 P 11/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 C 237/36	C S P
C 0 7 C 237/34	
C 0 7 C 237/10	
C 0 7 C 239/18	
C 0 7 C 251/48	
C 0 7 C 251/52	
C 0 7 C 271/22	
C 0 7 C 237/26	
C 0 7 C 251/38	
C 0 7 C 259/10	
C 0 7 C 237/30	
C 0 7 C 255/59	
C 0 7 C 243/28	
C 0 7 C 281/06	
C 0 7 C 271/28	
C 0 7 D 261/02	
C 0 7 D 261/04	
C 0 7 D 265/02	
C 0 7 D 207/50	
C 0 7 D 239/26	
C 0 7 D 211/14	
C 0 7 D 241/12	
C 0 7 D 263/32	
C 0 7 D 277/30	
C 0 7 D 207/337	
C 0 7 D 307/54	
C 0 7 D 295/16	Z
C 0 7 D 261/08	
C 0 7 D 231/12	E
C 0 7 D 213/56	
C 0 7 D 233/64	1 0 6
C 0 7 D 309/22	
C 0 7 D 271/06	
C 0 7 D 295/16	A
C 0 7 D 215/14	
C 0 7 D 213/64	
C 0 7 D 295/12	Z
C 0 7 D 209/44	
C 0 7 D 207/20	
C 0 7 D 211/70	
C 0 7 D 211/38	

C 0 7 D 211/18  
 A 6 1 K 31/65  
 A 6 1 P 31/04  
 A 6 1 P 33/06  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 17/10  
 A 6 1 P 11/02  
 A 6 1 P 25/00

【手続補正書】

【提出日】平成26年9月26日(2014.9.26)

【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

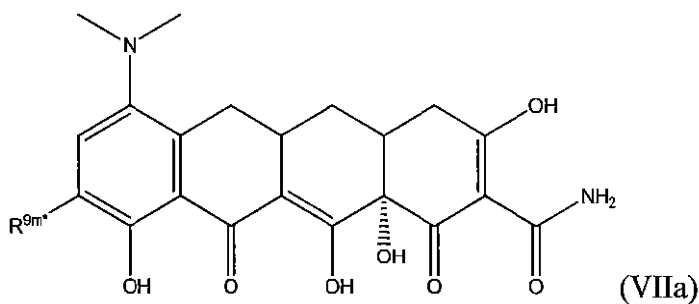
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式：

【化 2 6 3】



の置換テトラサイクリン化合物、またはその医薬的に許容しうる塩：

(式中、

$R^{9m*}$  は、オキサゾリル、オキサジアゾリル、イソキサゾリル、ピラゾリル、チアゾリル、メチルイミダゾリル、または  $-CONR^{9ma}R^{9mb}$  であり；

$R^{9ma}$  および  $R^{9mb}$  は、それぞれ独立して、水素、ヒドロキシル、アルキル、ヒドロキシアルキル、アリール、またはアルコキシであり；

該オキサゾリル、オキサジアゾリル、イソキサゾリル、ピラゾリル、およびチアゾリルは、非置換であり得るか、あるいは 1 個以上の環位置において、ハロゲン、ヒドロキシル、アルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、アリールカルボニルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アリールオキシカルボニルオキシ、カルボキシレート、アルキルカルボニル、アルキルアミノカルボニル、アリールアルキルアミノカルボニル、アルケニルアミノカルボニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリールアルキルカルボニル、アルケニルカルボニル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルチオカルボニル、ホスフェート、ホスホナート、ホスフィナート、シアノ、アミノ（アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ジアリールアミノおよびアルキルアリールアミノを含む）、アシルアミノ（アルキルカルボニルアミノ、アリールカルボニルアミノ、カルバモイルおよびウレイドを含む）、アミジノ、イミノ、スルフヒドリル、アルキルチオ、アリールチオ、チオカルボキシレート、スルフェート、アルキルスルフィニル、スルホナート、スルファモイル、スルホンアミド、ニトロ、トリフルオロメチル、シアノ、アジド、ヘテロシクリル、アルキルアリール、あるいは芳香族またはヘテロ芳香族部分で置換され得る）。

## 【請求項 2】

$R^{9m*}$  が、オキサゾリルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 3】

$R^{9m*}$  が、オキサジアゾリルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

$R^{9m*}$  が、イソキサゾリルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

$R^{9m*}$  が、ピラゾリルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 6】

$R^{9m*}$  が、チアゾリルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 7】

$R^{9m*}$  が、メチルイミダゾリルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 8】

$R^{9m*}$  が、 $-CONR^{9ma}R^{9mb}$  であり、 $R^{9ma}$  が水素であり、 $R^{9mb}$  がヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、フェニル、またはアルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

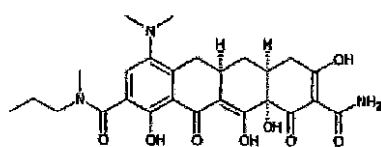
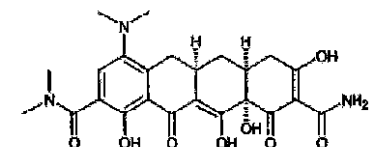
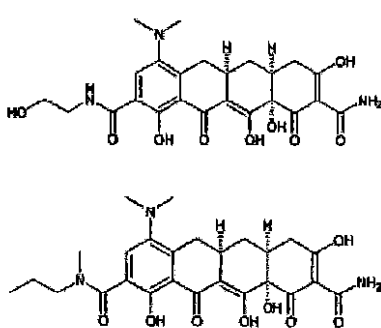
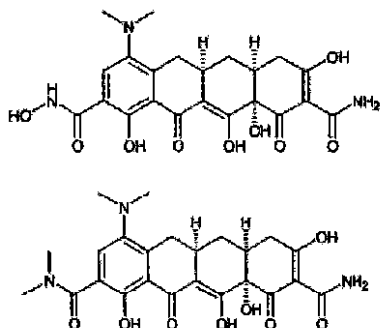
## 【請求項 9】

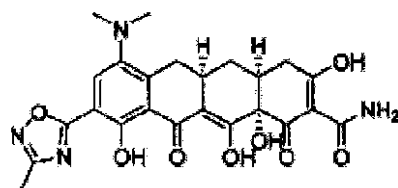
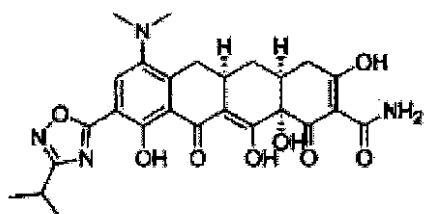
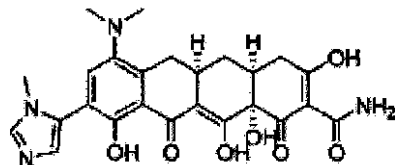
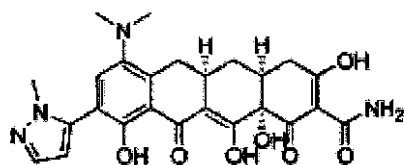
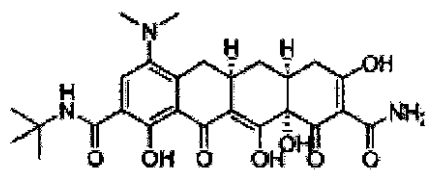
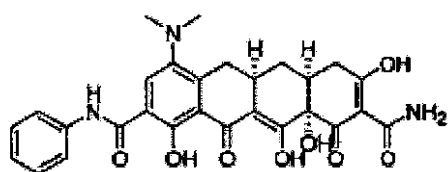
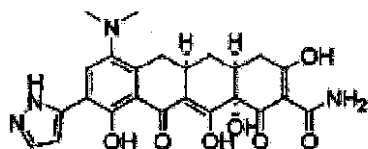
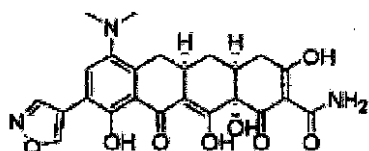
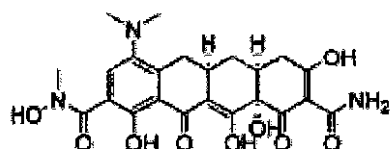
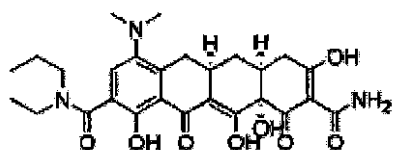
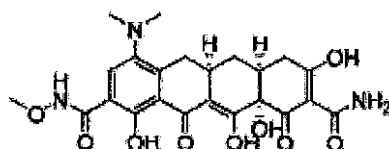
$R^{9m*}$  が、 $-CONR^{9ma}R^{9mb}$  であり、 $R^{9ma}$  がアルキルであり、 $R^{9mb}$  がアルキルまたはヒドロキシである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 10】

請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩であって、該化合物が、

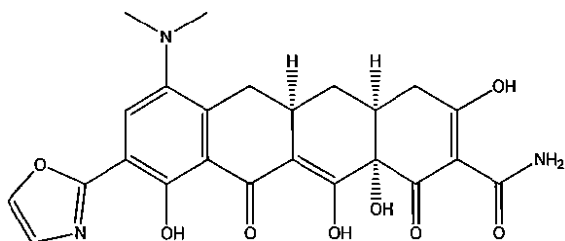
## 【化 264】



CCN(CC)C(=O)c1cc(O)c2c(c1)c(=O)c3c2c(O)c(O)c3C(=O)C(=O)N

【請求項 1 1】

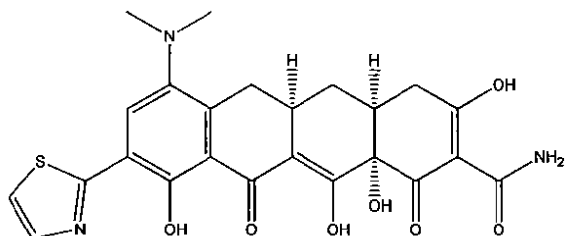
【化 2 6 6】



【請求項 1 2】

請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩であって、該化合物が、

## 【化 2 6 7】



化合物、またはその医薬的に許容しうる塩。

## 【請求項 1 3】

治療有効量の請求項 1 ～ 1 2 のいずれか一項に記載の化合物と、医薬的に許容しうる担体とを含む、医薬組成物。

## 【請求項 1 4】

対象におけるテトラサイクリン応答性状態を治療するための医薬の調製における請求項 1 ～ 1 2 のいずれか一項に記載の化合物の使用であって、該テトラサイクリン応答性状態が、細菌感染、ウイルス感染、寄生虫感染、マラリア、炎症のプロセス、ざ瘡、赤鼻、または多発性硬化症である、使用。

## 【請求項 1 5】

前記テトラサイクリン応答性状態が寄生虫感染またはマラリアである、請求項 1 4 に記載の化合物の使用。

## 【請求項 1 6】

対象におけるテトラサイクリン応答性状態を治療するための請求項 1 ～ 1 2 のいずれか一項に記載の化合物を含む組成物であって、該テトラサイクリン応答性状態が、細菌感染、ウイルス感染、寄生虫感染、マラリア、炎症のプロセス、ざ瘡、赤鼻、または多発性硬化症である、組成物。

## 【請求項 1 7】

前記テトラサイクリン応答性状態が寄生虫感染またはマラリアである、請求項 1 6 に記載の組成物。