

【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28年9月8日(2016.9.8)

【公表番号】特表2015-530362(P2015-530362A)

【公表日】平成27年10月15日(2015.10.15)

【年通号数】公開・登録公報2015-064

【出願番号】特願2015-522082(P2015-522082)

【国際特許分類】

C 0 7 D 221/20 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

C 0 7 D 409/06 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 265/34 (2006.01)

C 0 7 D 471/10 (2006.01)

C 0 7 D 491/107 (2006.01)

C 0 7 D 471/20 (2006.01)

A 6 1 K 31/438 (2006.01)

A 6 1 K 31/4545 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/5386 (2006.01)

A 6 1 K 31/16 (2006.01)

A 6 1 P 7/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 221/20 C S P

C 0 7 D 401/04

C 0 7 D 401/06

C 0 7 D 409/06

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 265/34

C 0 7 D 471/10 1 0 1

C 0 7 D 491/107

C 0 7 D 471/20

A 6 1 K 31/438

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/5386

A 6 1 K 31/16

A 6 1 P 7/04

【手続補正書】

【提出日】平成28年7月15日(2016.7.15)

【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

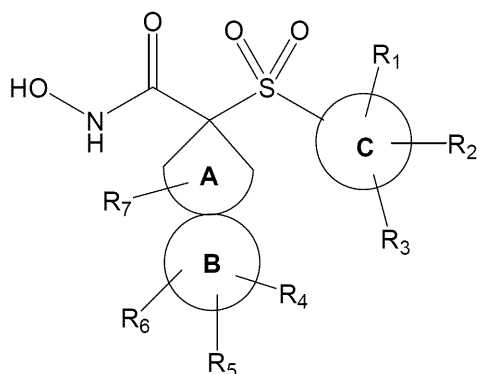
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)



(I)

〔上式中、

A 及び B は、A と B とを連結するスピロ原子が炭素原子であるスピロ環式環系を形成し、ここで

A は、飽和した又は部分的に不飽和の、既知の炭素環式又は複素環式の単環式 3 ～ 8 員環であるか；又は代替的に

A は、飽和した、部分的に不飽和の、又は部分的に芳香族の、既知の炭素環式又は複素環式が多環式 6 ～ 18 員環系であり；

B は、飽和した又は部分的に不飽和の、既知の炭素環式又は複素環式の単環式 4 ～ 7 員環であり；

C は、フェニル、又は既知の 5 ～ 6 員芳香族複素環であり；

$R_1 \sim R_3$ は、独立に、H、ハロゲン、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 R^a 、 $-\text{OR}^a$ 、 $-\text{OC}(Y)R^a$ 、 $-\text{OC}(Y)\text{OR}^a$ 、 $-\text{OC}(Y)\text{NR}^b R^a$ 、 $-\text{OSO}_2\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^b R^a$ 、 $-\text{NR}^b \text{C}(Y)R^a$ 、 $-\text{NR}^b \text{C}(Y)\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^b \text{C}(Y)\text{NR}^b R^a$ 、 $-\text{NR}^b \text{S}(\text{O})_2 R^a$ 、 $-\text{NR}^b \text{SO}_2 \text{NR}^b R^a$ 、 $-\text{SR}^a$ 、 $-\text{S}(\text{O})R^a$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{SO}_2 R^a$ 、 $-\text{SO}_2(\text{OR}^a)$ 、 $-\text{SO}_2 \text{NR}^b R^a$ 、 $-\text{SC}(Y)\text{NR}^b R^a$ 、 $-\text{C}(Y)R^a$ 、 $-\text{C}(Y)\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(Y)\text{NR}^b R^a$ 、 $-\text{C}(Y)\text{NR}^b \text{OR}^a$ 、及び $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^b \text{SO}_2 R^a$ から選択され；

$R_4 \sim R_7$ は、独立に、ハロゲン、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 R^c 、 $-\text{OR}^c$ 、 $-\text{NR}^d R^c$ 、 $-\text{NR}^d \text{C}(Y)R^c$ 、 $-\text{NR}^d \text{C}(Y)\text{OR}^c$ 、 $-\text{NR}^d \text{C}(Y)\text{NR}^d R^c$ 、 $-\text{NR}^d \text{S}(\text{O})_2 R^c$ 、 $-\text{NR}^d \text{SO}_2 \text{NR}^d R^c$ 、 $-\text{SR}^c$ 、 $-\text{S}(\text{O})R^c$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{OR}^c$ 、 $-\text{SO}_2 R^c$ 、 $-\text{SO}_2 \text{R}(\text{OR}^c)$ 、 $-\text{SO}_2 \text{NR}^d R^c$ 、 $-\text{SC}(Y)\text{NR}^d R^c$ 、 $-\text{C}(Y)R^c$ 、 $-\text{C}(Y)\text{OR}^c$ 、 $-\text{C}(Y)\text{NR}^d R^c$ 、 $-\text{C}(Y)\text{NR}^d \text{OR}^c$ 、及び $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^d \text{SO}_2 R^c$ から選択され；

R^a は、一又は複数の置換基 R^e 及び／又は一の C_{y^1} で置換されていてもよい飽和又は不飽和 (C_{1-12}) アルキルであるか；又は代替的に、 R^a は C_{y^2} であり；

ここで、 C_{y^1} 及び C_{y^2} は、独立に：一の C_{y^3} 、及び／又は、一又は複数の置換基 R^e 、及び／又は、一又は複数の置換基 R^e 及び／又は一の C_{y^3} で置換されていてもよい、一又は複数の飽和又は不飽和 (C_{1-6}) アルキル基であり；且つ

任意の Cy^3 は、 R^e 、及び、一又は複数の置換基 R^e で置換されていてもよい飽和又は不飽和 ($C_1 - C_6$) アルキルから独立に選択される、一又は複数の置換基で置換されていてもよく；

各 R^a 及び R^b は、独立に、H又は R^a であり；

R^c 及び各 R^d は、独立に、H、 Cy^4 、及び、一又は複数の置換基 R^h 及び／又は一の Cy^5 で置換されていてもよい飽和又は不飽和 ($C_1 - C_6$) アルキルから選択され；

ここで、 Cy^4 は、 R^h 、及び、一又は複数の置換基 R^h で置換されていてもよい飽和又は不飽和 ($C_1 - C_6$) アルキルから独立に選択される、一又は複数の置換基で置換されていてもよく；且つ

Cy^5 は、 R^h 、及び、一又は複数の置換基 R^h で置換されていてもよい飽和又は不飽和 ($C_1 - C_6$) アルキルから独立に選択される、一又は複数の置換基で置換されていてもよく；

各 R^e は、独立に、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^f$ 、 $-OC(Y)R^f$ 、 $-OC(Y)OR^f$ 、 $-OC(Y)NR^gR^f$ 、 $-NR^gR^f$ 、 $-NR^gC(Y)R^f$ 、 $-NR^gC(Y)OR^f$ 、 $-NR^gC(Y)NR^gR^f$ 、 $-NR^gS(O)_2R^f$ 、 $-NR^gSO_2NR^gR^f$ 、 $-SR^f$ 、 $-S(O)R^f$ 、 $-S(O)OR^f$ 、 $-SO_2R^f$ 、 $-SO_2(OR^f)$ 、 $-SO_2NR^gR^f$ 、 $-SC(Y)NR^gR^f$ 、 $-C(Y)R^f$ 、 $-C(Y)OR^f$ 、 $-C(Y)NR^gR^f$ 、 $-C(Y)NR^gOR^f$ 及び $-C(O)NR^gSO_2R^f$ から選択され；

R^f 及び各 R^g は、独立に、H、 Cy^6 、及び、一又は複数の置換基 R^h 及び／又は一の Cy^7 で置換されていてもよい飽和又は不飽和 ($C_1 - C_6$) アルキルから選択され；

ここで、 Cy^6 は：一の Cy^7 、及び／又は、一又は複数の置換基 R^h 、及び／又は、一又は複数の置換基 R^h 及び／又は Cy^7 で置換されていてもよい一又は複数の飽和又は不飽和 ($C_1 - C_6$) アルキル基で置換されていてもよく；且つ

任意の Cy^7 は、 R^h 、及び、一又は複数の置換基 R^h で置換されていてもよい ($C_1 - C_4$) アルキルから独立に選択される、一又は複数の置換基で置換されていてもよく；

各 R^h は、独立に、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^i$ 、 $-OC(O)R^i$ 、 $-OC(O)OR^i$ 、 $-OC(O)NR^iR^i$ 、 $-NR^iR^i$ 、 $-NR^iC(O)R^i$ 、 $-NR^iC(O)OR^i$ 、 $-NR^iC(O)NR^iR^i$ 、 $-NR^iS(O)_2R^i$ 、 $-NR^iSO_2NR^iR^i$ 、 $-SR^i$ 、 $-S(O)R^i$ 、 $-SO_2R^i$ 、 $-SO_2(OR^i)$ 、 $-SO_2NR^iR^i$ 、 $-C(O)R^i$ 、 $-C(O)OR^i$ 、 $-C(O)NR^iR^i$ 、及び $-C(O)NR^iOR^i$ から選択され；

各 R^i は、独立に、H、又は一又は複数のハロゲン原子で置換されていてもよい ($C_1 - C_4$) アルキルであり；

Yは、O、S、又は NR^g であり；

Cy^1 、 Cy^2 、 Cy^4 及び Cy^6 は、独立に、飽和した又は部分的に不飽和の、炭素環式又は複素環式の単環式 3～8 員環；フェニル；5又は6員芳香族複素環；並びに飽和した、部分的に不飽和の、又は部分的に芳香族の、炭素環式又は複素環式が多環式 6～18 員環系から選択される、C又はNに結合した既知の環系であり；

Cy^3 、 Cy^5 、及び Cy^7 は、独立に、飽和した又は部分的に不飽和の、炭素環式又は複素環式の単環式 3～8 員環；フェニル；及び5又は6員芳香族複素環から選択される、C又はNに結合した既知の環系であり；

ここで、炭素環式環内ではすべての環員は炭素原子であり；複素環式及び芳香族複素環内では、一又は複数の環員はN、O、及びSから選択され；且つ飽和した又は部分的に不飽和のすべての環では、一又は二の環員は、任意選択的に、 $C(O)$ 及び／又は $C(NH)$ 及び／又は $C[N(C_1 - C_4)アルキル]$ である]

の化合物、又はその薬学的に若しくは獣医薬的に許容可能な塩、又は式 (I) の化合物又はその薬学的に若しくは獣医薬的に許容可能な塩の任意の立体異性体。

【請求項 2】

Aは、既知の炭素環式又は複素環式の単環式 3～8 員環であるか、又は既知の炭素環式

又は複素環式の二重環式 6 ～ 10 員環系である、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 3】

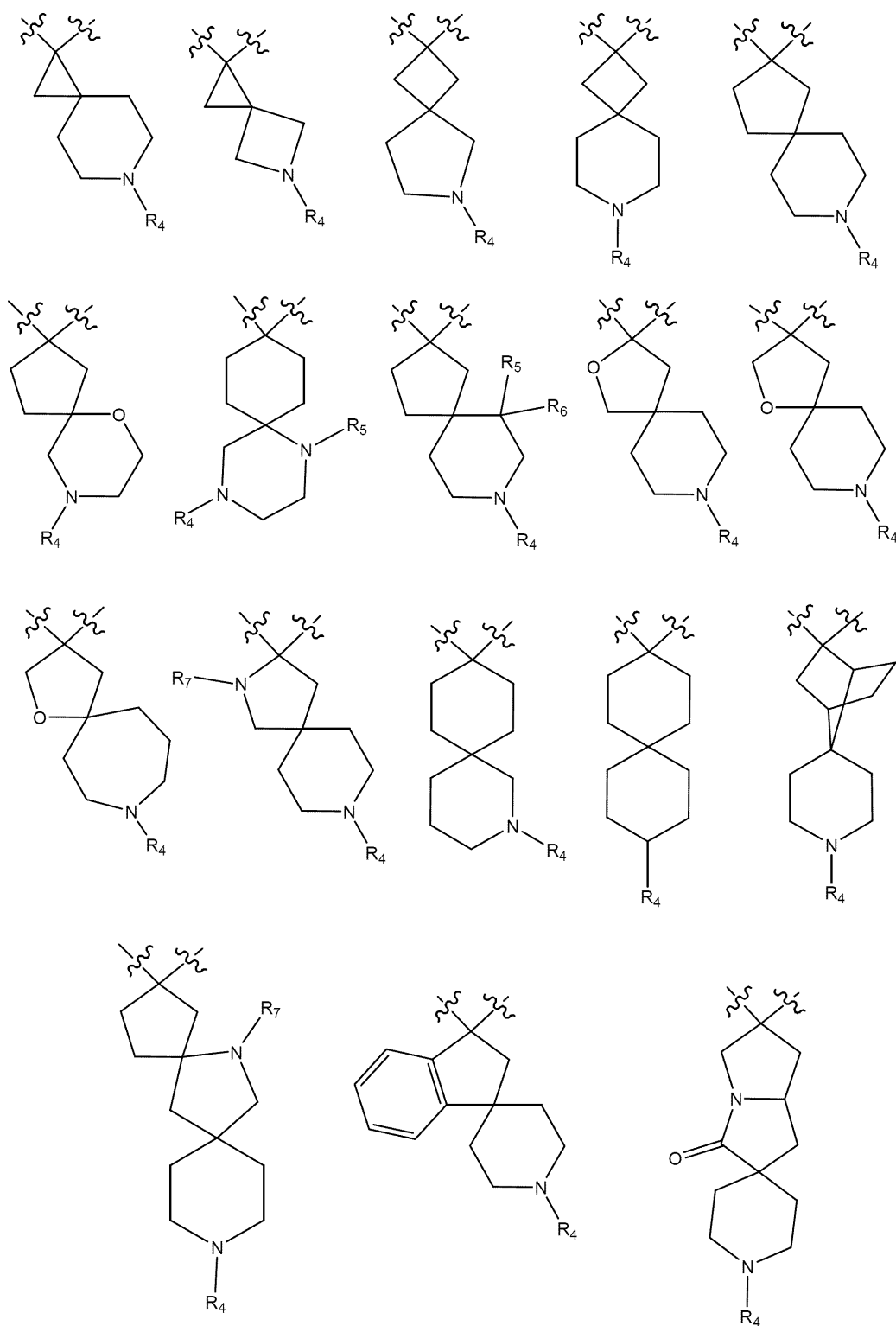
A は、炭素環式 3 ～ 6 員環及び複素環式 5 ～ 6 員環から選択される単環式環である、請求項 2 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 4】

B は、炭素環式又は複素環式の単環式 6 ～ 7 員環である、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 5】

A 及び B は、次のもの



からなる群より選択されるスピロ環式環系を形成する、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 6】

C はフェニルである、請求項 1 から 5 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 7】

$R_1 \sim R_3$ では、 R^f 及び各 R^g は、独立に、H、及び、一又は複数のフッ素原子で置換されていてもよい、飽和又は不飽和 ($C_1 - C_6$) アルキルから選択される、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 8】

$R_1 \sim R_3$ では、 Cy^1 及び Cy^2 は、独立に、 R^e 、及び置換されていてもよい飽和又は不飽和 ($C_1 - C_6$) アルキルから選択される、一又は複数の置換基で置換されていてもよく； Cy^6 は、 R^h 、及び置換されていてもよい飽和又は不飽和 ($C_1 - C_6$) アルキルから独立に選択される、一又は複数の置換基で置換されていてもよい、請求項 1 から 7 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 9】

$R_1 \sim R_3$ は、独立に、H、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 R^a 、 $-OR^{a'}$ 、 $-OC(O)R^{a'}$ 、 $-OC(O)OR^{a'}$ 、 $-OC(O)NR^bR^{a'}$ 、 $-NR^bR^{a'}$ 、 $-NR^bC(O)R^{a'}$ 、 $-NR^bC(O)OR^{a'}$ 、 $-NR^bC(O)NR^bR^{a'}$ 、 $-NR^bS(O)_2R^{a'}$ 、 $-SR^{a'}$ 、 $-S(O)R^{a'}$ 、 $-SO_2R^{a'}$ 、 $-SO_2NR^bR^{a'}$ 、 $-C(O)R^{a'}$ 、 $-C(O)OR^{a'}$ 、 $-C(O)NR^bR^{a'}$ 、及び $-C(O)NR^bOR^{a'}$ から選択される、請求項 1 から 8 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 10】

$R_4 \sim R_7$ は、独立に、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 R^c 、 $-OR^c$ 、 $-NR^dR^c$ 、 $-NR^dC(O)R^c$ 、 $-NR^dC(O)OR^c$ 、 $-NR^dC(O)NR^dR^c$ 、 $-NR^dS(O)_2R^c$ 、 $-SR^c$ 、 $-S(O)R^c$ 、 $-SO_2R^c$ 、 $-SO_2NR^dR^c$ 、 $-C(O)R^c$ 、 $-C(O)OR^c$ 、及び $-C(O)NR^dR^c$ から選択される、請求項 1 から 9 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 11】

R_2 及び R_3 は、独立に、H、ハロゲン、 R^a 、 $-OR^{a'}$ 、及び $-NR^bR^{a'}$ から選択され； $R_5 \sim R_7$ は、独立に、H、ハロゲン、 R^c 、 $-OR^c$ 、及び $-NR^dR^c$ から選択され、ここで R^a 、 $R^{a'}$ 、 R^b 、 R^c 及び R^d は、独立に、H、及び一又は複数のフッ素原子で置換されていてもよい $(C_1 - C_4)$ アルキルから選択される、請求項 1 から 10 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 12】

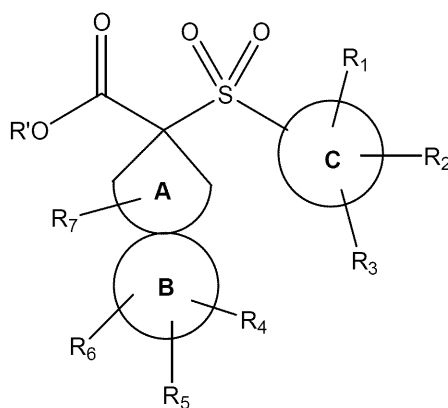
請求項 1 から 11 のいずれか一項に規定される式 (I) の化合物の有効量、又はその薬学的に若しくは獣医薬的に受容可能な塩、又は式 (I) の化合物又はその薬学的に若しくは獣医薬的に受容可能な塩の任意の立体異性体と、一又は複数の薬学的に若しくは獣医薬的に許容可能な賦形剤若しくは担体とを含む医薬組成物又は獣医薬組成物。

【請求項 13】

請求項 1 から 11 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物、又はその薬学的に若しくは獣医薬的に許容可能な塩、又は式 (I) の化合物又はその薬学的に若しくは獣医薬的に許容可能な塩の任意の立体異性体を含む抗繊維素溶解剤及び抗出血剤。

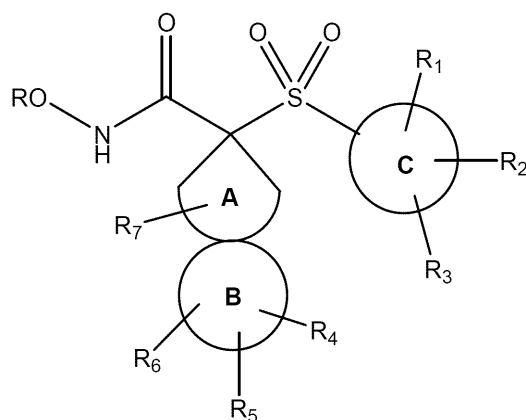
【請求項 14】

式 (I I I)



(I I I)

〔上式中、A、B、C、 $R_1 \sim R_7$ は、請求項1から11のいずれか一項に規定された通りであり、 R' は、H、又は、($C_1 - C_6$)アルキル、ベンジル、p-メトキシフェニル、トリメチルシリル、及び〔2-(トリメチルシリル)エトキシ〕メチル(SEM)からなる群より選択されるカルボキシ保護基であり、但し、化合物(III)は、7-メトキシカルボニル-7-フェニルスルホニル-2-オキサスピロ〔2.4〕ヘプタン及び($2S^*$, $4R^*$)-2-フェニルスルホニル-4-ヨードメチル-6,11-ジオキサスピロ〔4.6〕ウンデカン-2-カルボン酸メチルエステルではない〕の化合物；又は式(II)



(II)

〔上式中、A、B、C、 $R_1 \sim R_7$ は、請求項1から11のいずれか一項に規定された通りであり、Rは、テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イルオキシ(THP)、ベンジル、1-ナフチルメチル及びジメチルオキシベンジル(DMB)からなる群より選択されるヒドロキサム酸保護基である〕の化合物。