

【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】令和 1 年 10 月 3 日 (2019.10.3)

【公表番号】特表 2018-525427 (P2018-525427A)

【公表日】平成 30 年 9 月 6 日 (2018.9.6)

【年通号数】公開・登録公報 2018-034

【出願番号】特願 2018-510982 (P2018-510982)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 39/39 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 0 5 C

C 0 7 D 471/04 C S P

A 6 1 K 31/437

A 6 1 K 39/39

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 43/00 1 0 5

【手続補正書】

【提出日】令和 1 年 8 月 23 日 (2019.8.23)

【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

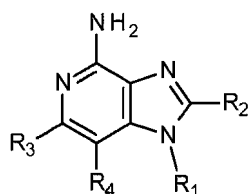
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



式 I

[式中、

R₃ 及び R₄ は、一緒になって縮合ベンゼン環、縮合ピリジン環、縮合シクロヘキセン環、又は縮合テトラヒドロピリジン環を形成し、前記縮合ベンゼン環、縮合ピリジン環、縮合シクロヘキセン環、又は縮合テトラヒドロピリジン環は、非置換であるか、1 又は複数の R 基で置換されているかのいずれかであり、

R は、ハロゲン、ヒドロキシル、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、- C (O) - O - アルキル、- C (O) - O - C H₂ P h、- C (O) - O - アリール、アミノ、アル

R₁ は、 $-W-X-N(R_7)-C(=N-R_5)-N(H)R_6$ 、
 $-W-Z-N(R_7)-C(=N-R_5)-N(H)R_6$ 、 及び

$$-W-X-\text{C}(\text{N}(\text{R}_7)-\text{C}(=\text{N}-\text{R}_5)-\text{N}(\text{H})\text{R}_6)-\text{O}-$$

- X - アリーレン - X - 、
- X - ヘテロアリーレン - X - 、
- X - アリーレン - 、及び
- X - ヘテロアリーレン - からなる群から選択され、

R₅ 及び R₆ は、水素、-C(O)-O-アルキル、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、シクロアルキルアルキレニル、アリール-(CH₂)₂₋₆-O-アルキレニル、及びベンジルオキシアルキレニルからなる群から独立して選択され、前記アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、シクロアルキルアルキレニル、アリール-(CH₂)₂₋₆-O-アルキレニル、及びベンジルオキシアルキレニル基のいずれも、非置換であるか、ハロゲン、ヒドロキシル、アルコキシ、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、ニトリル、アリール、ヘテロアリール、及びジアルキルアミノからなる群から独

立して選択される 1 又は複数の置換基によって置換されているかのいずれかであることができ、ただし、 R_5 及び R_6 は、両方とも水素ではなく、

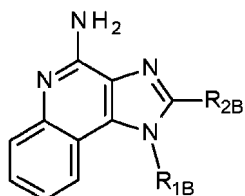
Q は、共有結合、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2-O-CH_2-$ 、及び $-OCH_2-$ からなる群から選択される。] の化合物、

又は製薬上許容されるその塩。

【請求項 2】

式 XIII :

【化 3】

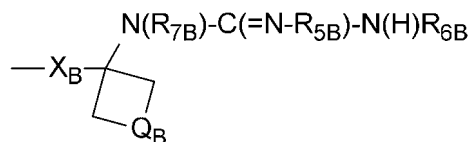


式 XIII

[式中、

R_{1B} は、 $-X_B-N(R_{7B})-C(=N-R_{5B})-N(H)R_{6B}$ 、及び
 $-Z_B-N(R_{7B})-C(=N-R_{5B})-N(H)R_{6B}$ 、及び

【化 4】



からなる群から選択され、

X_B は、アルキレン、アルケニレン、及びアルキニレンからなる群から選択され、前記アルキレン、アルケニレン、及びアルキニレン基は、1 又は複数の $-O-$ 基により任意に介在されていてもよく、

Z_B は、

- X_B - アリーレン - X_B - 、
- X_B - ヘテロアリーレン - X_B - 、
- X_B - アリーレン - 、及び
- X_B - ヘテロアリーレン - からなる群から選択され、

R_{2B} は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、 $-O-$ アルキル、ヒドロキシアルキレニル、アルコキシアルキレニル、アルキルアミノアルキレニル、ヒドロキシル、 $-CH_2-NH-O-$ アルキル、及び $-CH_2NHC(O)-$ アルキルからなる群から選択され、

R_{7B} は、水素、アルキル、アリールアルキレニル、アルコキシアルキレニル、アリーロキシアルキレニル、ベンジルオキシアルキレニル、アリール- $(CH_2)_{2-6}-O-$ アルキレニル、及びシクロアルキルアルキレニルからなる群から選択され、前記アルキル、アリールアルキレニル、アルコキシアルキレニル、アリーロキシアルキレニル、ベンジルオキシアルキレニル、アリール- $(CH_2)_{2-6}-O-$ アルキレニル、及びシクロアルキルアルキレニル基のいずれも、非置換であるか、ハロゲン、ヒドロキシル、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、及びニトリルからなる群から選択される 1 又は複数の置換基で置換されているかのいずれかであることができ、

R_{5B} 及び R_{6B} は、水素、 $-C(O)-O-$ アルキル、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキレニル、アリーロキシアルキレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリーロキシアルキレニル、シクロアルキルアルキレ

ニル、アリール - (CH₂)₂ ~ ₆ - O - アルキレニル、及びベンジルオキシアルキレニルからなる群から独立して選択され、前記シクロアルキル、アリール、アリールアルキレニル、アリーロキシアルキレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリーロキシアルキレニル、シクロアルキルアルキレニル、アリール - (CH₂)₂ ~ ₆ - O - アルキレニル、及びベンジルオキシアルキレニル基のいずれも、非置換であるか、ハロゲン、ヒドロキシル、アルコキシ、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、ニトリル、アリール、ヘテロアリール、及びジアルキルアミノからなる群から独立して選択される 1 又は複数の置換基で置換されているかのいずれかであることができ、ただし、R_{5B} 及び R_{6B} は、両方とも水素ではなく、

Q は、共有結合、-CH₂-、-CH₂CH₂-、-CH₂CH₂CH₂-、-CH₂CH₂CH₂CH₂-、-CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂-、-CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂-、-CH₂-O-CH₂-、及び -OCH₂- からなる群から選択される。] の化合物、

又は製薬上許容されるその塩。

【請求項 3】

R_{7B} が水素である、請求項 2 に記載の化合物又は塩。

【請求項 4】

X_B が、1 又は複数の -O- 基により任意に介在されていてもよいアルキレンである、請求項 2 又は 3 に記載の化合物又は塩。

【請求項 5】

Z_B が、-C₁ ~ ₅ アルキレン - アリーレン - C₁ ~ ₅ アルキレン - 又は -C₁ ~ ₅ アルキレン - ヘテロアリーレン - C₁ ~ ₅ アルキレン - である、請求項 2 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 6】

R_{2B} が、水素、アルキル、アルコキシアルキレニル、アルキルアミノアルキレニル、及びヒドロキシアルキレニルからなる群から選択される、請求項 2 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 7】

R_{5B} 及び R_{6B} が、水素、アルキル、フェニル、フェニルアルキレニルからなる群から独立して選択され、R_{5B} 及び R_{6B} は、両方とも水素ではない、請求項 2 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 8】

請求項 1 に記載の化合物又は塩の治療有効量を、製薬上許容される担体と組み合わせて含む、医薬組成物。