

【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31年3月14日 (2019.3.14)

【公表番号】特表2018-504411(P2018-504411A)

【公表日】平成30年2月15日 (2018.2.15)

【年通号数】公開・登録公報2018-006

【出願番号】特願2017-538575(P2017-538575)

【国際特許分類】

C 0 7 D 495/18 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/16 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/46 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/7036 (2006.01)

A 6 1 K 33/24 (2019.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/282 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 495/18 C S P

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 27/16

A 6 1 P 13/12

A 6 1 K 31/46

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/7036

A 6 1 K 33/24

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 31/282

【手続補正書】

【提出日】平成31年1月28日 (2019.1.28)

【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

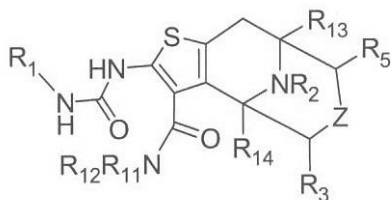
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の構造を有する化合物、または、その薬学的に許容可能な塩、薬学的に許容可能な溶媒和物あるいは水和物、薬学的に許容可能な塩水和物、あるいは薬学的に許容可能なプロドラッグであって、

【化 1】



式 (I)

式中、

Z は単結合、二重結合、 $-CH_2-$ 、または $-O-$ であり、

R_1 はアリールまたはヘテロアリールであり、ここで、アリールとヘテロアリールは 1 つ以上の R_4 で随意に置換され、

R_2 は、H、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル $-OR_6$ 、 $C_1 - C_6$ アルキル $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル $C_2 - C_7$ ヘテロシクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル $-CO_2R_6$ 、随意に置換された $C_1 - C_6$ アルキルアリール、または随意に置換された $C_1 - C_6$ アルキルヘテロアリールであり、

R_3 と R_5 は各々独立して、H または $C_1 - C_6$ アルキルであり、

あるいは、 R_3 と R_5 はともに、随意に置換された $C_3 - C_6$ シクロアルキル環、随意に置換された $C_2 - C_7$ ヘテロシクロアルキル環、随意に置換されたアリール環、または随意に置換されたヘテロアリール環を形成し、

R_4 はそれぞれ、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OR_9$ 、 $-OCF_3$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-C(O)R_{10}$ 、 $-CO_2R_9$ 、 $-C(O)NR_8R_9$ 、 $-N(R_8)C(O)R_{10}$ 、 $-N(R_8)CO_2R_{10}$ 、 $-NHS(O)_2R_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_8R_9$ 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_2 - C_7$ ヘテロシクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールから独立して選択され、

R_6 は H または $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R_8 は H または $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R_9 は、H、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_2 - C_7$ ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_1 - C_6$ アルキルアリール、または $C_1 - C_6$ アルキルヘテロアリールであり、

R_{10} は、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_2 - C_7$ ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_1 - C_6$ アルキルアリール、または $C_1 - C_6$ アルキルヘテロアリールであり、

R_{11} は、H、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_2 - C_7$ ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_1 - C_6$ アルキル $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルキルアリール、または $C_1 - C_6$ アルキルヘテロアリールであり、

R_{12} は、H、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_2 - C_7$ ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_1 - C_6$ アルキル $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルキルアリール、または $C_1 - C_6$ アルキルヘテロアリールであり、

あるいは、 R_{11} と R_{12} はそれらが結合している窒素と一体となって、随意に置換された $C_2 - C_7$ ヘテロシクロアルキル環を形成し、および、

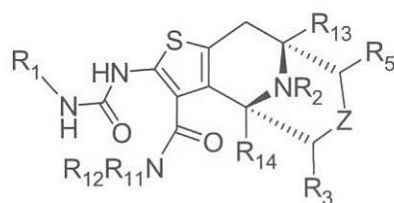
R_{13} と R_{14} は各々独立して、H または $C_1 - C_6$ アルキルである、化合物、または、その薬学的に許容可能な塩、薬学的に許容可能な溶媒和物あるいは水和物、薬学的に許容可能な塩水和物、あるいは薬学的に許容可能なプロドラッグ。

【請求項 2】

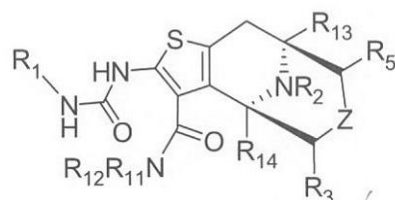
式 (I a) または式 (I b) の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬

学的に許容可能な塩、薬学的に許容可能な溶媒和物あるいは水和物、薬学的に許容可能な塩水和物、あるいは薬学的に許容可能なプロドラッグ。

【化 2】



式 (Ia)



式 (Ib)

【請求項 3】

R_1 は 1 つ以上の R_4 で随意に置換されたフェニルである、請求項 1 または 2 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、薬学的に許容可能な溶媒和物あるいは水和物、薬学的に許容可能な塩水和物、あるいは薬学的に許容可能なプロドラッグ。

【請求項 4】

R_1 は 1 つの R_4 で置換されたフェニルであり、 R_4 はそれぞれ独立して、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OR_9$ 、 $-OCF_3$ 、 $-C(O)R_{10}$ 、 $-CO_2R_9$ 、および $C_1 - C_6$ アルキルから選択される、請求項 3 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、薬学的に許容可能な溶媒和物あるいは水和物、薬学的に許容可能な塩水和物、あるいは薬学的に許容可能なプロドラッグ。

【請求項 5】

R_1 は 4 - クロロフェニルである、請求項 4 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、薬学的に許容可能な溶媒和物あるいは水和物、薬学的に許容可能な塩水和物、あるいは薬学的に許容可能なプロドラッグ。

【請求項 6】

R_{11} と R_{12} はそれぞれ H である、請求項 3 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、薬学的に許容可能な溶媒和物あるいは水和物、薬学的に許容可能な塩水和物、あるいは薬学的に許容可能なプロドラッグ。

【請求項 7】

R_2 は H である、請求項 3 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、薬学的に許容可能な溶媒和物あるいは水和物、薬学的に許容可能な塩水和物、あるいは薬学的に許容可能なプロドラッグ。

【請求項 8】

R_2 は $-CH_3$ である、請求項 3 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、薬学的に許容可能な溶媒和物あるいは水和物、薬学的に許容可能な塩水和物、あるいは薬学的に許容可能なプロドラッグ。

【請求項 9】

R_3 、 R_5 、 R_{13} 、および R_{14} はそれぞれ H である、請求項 3 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、薬学的に許容可能な溶媒和物あるいは水和物、薬学的に許容可能な塩水和物、あるいは薬学的に許容可能なプロドラッグ。

【請求項 10】

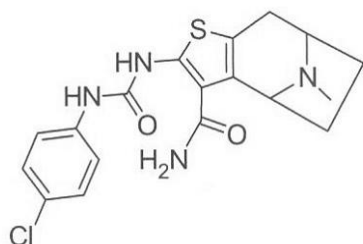
Z は単結合である、請求項 3 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、薬学

的に許容可能な溶媒和物あるいは水和物、薬学的に許容可能な塩水和物、あるいは薬学的に許容可能なプロドラッグ。

【請求項 1 1】

以下の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、薬学的に許容可能な溶媒和物あるいは水和物、薬学的に許容可能な塩水和物、あるいは薬学的に許容可能なプロドラッグ。

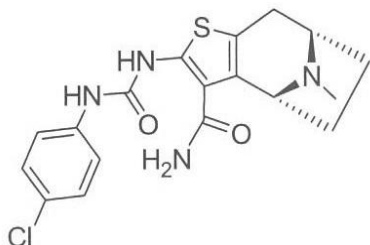
【化 3】



【請求項 1 2】

以下の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、薬学的に許容可能な溶媒和物あるいは水和物、薬学的に許容可能な塩水和物、あるいは薬学的に許容可能なプロドラッグ。

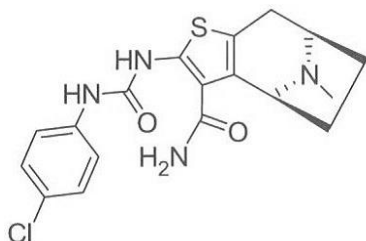
【化 4】



【請求項 1 3】

以下の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、薬学的に許容可能な溶媒和物あるいは水和物、薬学的に許容可能な塩水和物、あるいは薬学的に許容可能なプロドラッグ。

【化 5】



【請求項 1 4】

治療上有効な量の請求項 1 - 1 3 のいずれか 1 つの化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、薬学的に許容可能な溶媒和物または水和物、薬学的に許容可能な塩水和物あるいは薬学的に許容可能なプロドラッグ、および薬学的に許容可能な賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 1 5】

アミノグリコシド系抗生物質を受け取る個体の腎臓障害の予防、聴力損失の予防または処置、あるいは感覚有毛細胞の死の予防または処置に使用するための、請求項 1 - 1 3 のいずれか 1 つの化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、薬学的に許容可能な溶媒和物または水和物、薬学的に許容可能な塩水和物または薬学的に許容可能なプロドラッグ。