

【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7年4月7日(2025.4.7)

【国際公開番号】WO2021/091967
 【公表番号】特表2022-553857(P2022-553857A)
 【公表日】令和4年12月26日(2022.12.26)
 【年通号数】公開公報(特許)2022-238
 【出願番号】特願2022-526198(P2022-526198)
 【国際特許分類】

10

C 0 7 D 4 9 8 / 1 8 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 3 1 / 5 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 4 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 C 0 7 D 5 1 3 / 1 8 (2 0 0 6 . 0 1)
 C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

【 F I 】

C 0 7 D 4 9 8 / 1 8 C S P
 A 6 1 K 3 1 / 5 0 4
 A 6 1 K 4 5 / 0 0
 A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 2 1
 A 6 1 P 3 5 / 0 0
 C 0 7 D 5 1 3 / 1 8
 C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 3 0 1

20

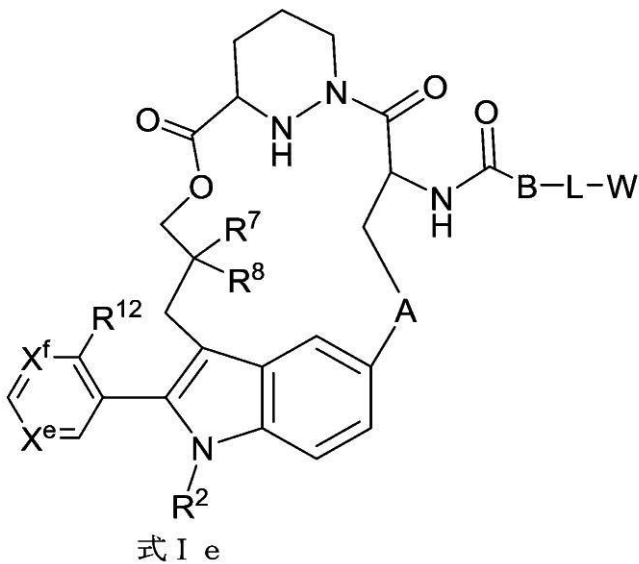
【誤訳訂正書】
 【提出日】令和7年3月28日(2025.3.28)
 【誤訳訂正1】
 【訂正対象書類名】特許請求の範囲
 【訂正対象項目名】全文
 【訂正方法】変更
 【訂正の内容】
 【特許請求の範囲】
 【請求項1】
 式I e の構造：

30

40

50

【化 1】



10

を有する化合物、またはその薬学的に許容される塩であって、

式中、Aは - N (H または C H ₃) C (O) - (C H ₂) - [式中、アミノ窒素は、 - C H (R ¹⁰) - の炭素原子に結合するもの]、または任意に置換された6員のアリーレンであり、

20

Bは、 - C H (R ⁹) - [式中、炭素は、 - N H C (O) - のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された3～6員のシクロアルキレン、任意に置換された3～6員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された6員のアリーレン、または5～6員のヘテロアリーレンであり、

Lは存在しないか、または、式 I I の構造：

A¹ - (B¹)_f - (C¹)_g - (B²)_h - (D¹) - (B³)_i - (C²)_j - (B⁴)_k - A²

式 I I

30

を有するリンカーであり、式中、A¹は、リンカーとBとの間の結合であり；A²は、Wとリンカーとの間の結合であり；B¹、B²、B³、及びB⁴はそれぞれ独立して、任意に置換されたC₁-C₂アルキレン、任意に置換されたC₁-C₃ヘテロアルキレン、O、S、及びN R^Nから選択され；R^Nは、水素、任意に置換されたC₁-C₄アルキル、任意に置換されたC₂-C₄アルケニル、任意に置換されたC₂-C₄アルキニル、任意に置換された3～14員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された6～10員のアリール、または、任意に置換されたC₁-C₇ヘテロアルキルであり；C¹及びC²はそれぞれ独立して、カルボニル、チオカルボニル、スルホニル、またはホスホリルから選択され；f、g、h、i、j、及びkはそれぞれ独立して、0または1であり；D¹は、任意に置換されたC₁-C₁₀アルキレン、任意に置換されたC₂-C₁₀アルケニレン、任意に置換されたC₂-C₁₀アルキニレン、任意に置換された3～14員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された5～10員のヘテロアリーレン、任意に置換された3～8員のシクロアルキレン、任意に置換された6～10員のアリーレン、任意に置換されたC₂-C₁₀ポリエチレングリコレン、もしくは、任意に置換されたC₁-C₁₀ヘテロアルキレン、または、A¹ - (B¹)_f - (C¹)_g - (B²)_h - を - (B³)_i - (C²)_j - (B⁴)_k - A²に結合させる化学結合であり、

40

Wは、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N - エトキシカルボニル - 2 - エトキシ - 1, 2 - ジヒドロキノリン (E E D Q)、イソ E E D Q もしくは他の E E D Q

50

誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリコールを含む架橋基であり、

R^2 は、 $C_1 - C_6$ アルキルまたは 3 ~ 6 員のシクロアルキルであり、

R^7 は、 $C_1 - C_3$ アルキルであり、

R^8 は、 $C_1 - C_3$ アルキルであり、かつ、

R^9 は、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであり、

X^e 及び X^f は独立して、 N または CH であり、かつ、

R^{12} は、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキルもしくは任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルである、
 化合物、またはその薬学的に許容される塩。

10

【請求項 2】

A が、任意に置換された 6 員のアリーレンである、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 3】

B が $-CHR^9-$ 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される塩。

【請求項 4】

R^9 が、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、または任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキルである、請求項 3 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

20

【請求項 5】

B が、任意に置換された 6 員のアリーレンである、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される塩。

【請求項 6】

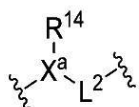
前記リンカーが非環式である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 7】

前記リンカーが式 I I a の構造：

【化 2】

30



式 I I a

[式中、 X^a は存在しないか、または N であり、

R^{14} は存在しないか、水素、または、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキルであり、
 かつ、

L^2 は存在しないか、 $-SO_2-$ 、任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキレン、または任意に置換された $C_1 - C_4$ ヘテロアルキレンであり、

40

X^a 、 R^{14} 、または L^2 のうちの少なくとも 1 つが存在する。]

を有する、請求項 6 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 8】

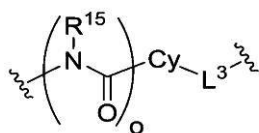
前記リンカーが環状基であるか、環状基を含む、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 9】

前記リンカーが式 I I b の構造：

50

【化 3】



式 I I b

[式中、o は 0 または 1 であり、

R¹⁵ は、水素または任意に置換された C₁ - C₆ アルキルであり、

Cy は、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 8 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリーレン、または任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリーレンであり、かつ、

L³ は存在しないか、-SO₂-、任意に置換された C₁ - C₄ アルキレン、または任意に置換された C₁ - C₄ ヘテロアルキレンである。]

を有する、請求項 1 ~ 5、または 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

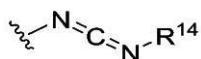
【請求項 10】

W がカルボジイミドを含む、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 11】

W が式 I I I a の構造：

【化 4】



式 I I I a

[式中、R¹⁴ は任意に置換された C₁ - C₆ アルキル、任意に置換された C₁ - C₆ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリール、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、または、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリールである。]

を有する、請求項 10 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

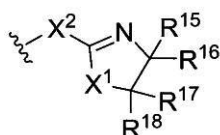
【請求項 12】

W が、オキサゾリンまたはチアゾリンを含む、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 13】

W が式 I I I b の構造：

【化 5】



式 I I b

[式中、X¹ は、O または S であり、

10

20

30

40

50

X^2 は存在しないか、または NR^{19} であり、

R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、及び R^{18} は独立して、水素または任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキルであり、かつ、

R^{19} は、水素、 $C(O)$ (任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル)、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリール、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、または任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリールである。]

を有する、請求項 12 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 14】

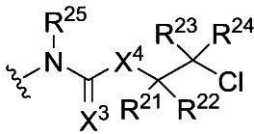
W がクロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、またはクロロエチルチオカルバメートを含む、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

10

【請求項 15】

W が式 III c の構造：

【化 6】



20

式 III c

[式中、 X^3 は、O または S であり、

X^4 は、O、S、または NR^{26} であり、

R^{21} 、 R^{22} 、 R^{23} 、 R^{24} 、及び R^{26} は独立して、水素または任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキルであり、かつ、

R^{25} は、水素、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリール、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、または任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリールである。]

30

を有する、請求項 14 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

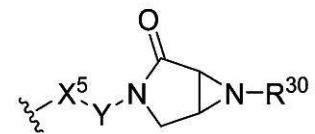
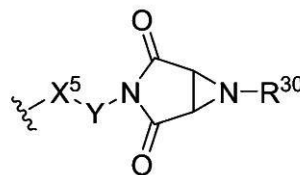
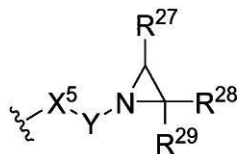
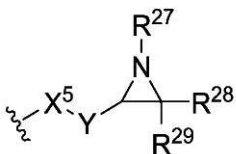
【請求項 16】

W がアジリジンを含む、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 17】

W が式 III d 1、式 III d 2、式 III d 3、または式 III d 4 の構造：

【化 7】



40

式 III d 1

式 III d 2

式 III d 3

式 III d 4

[式中、 X^5 は存在しないか、または NR^{30} であり、

Y は存在しないか、または $C(O)$ 、 $C(S)$ 、 $S(O)$ 、 SO_2 、もしくは任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキレンであり、

R^{27} は、水素、 $-C(O)R^{32}$ 、 $-C(O)OR^{32}$ 、 $-SO_2R^{33}$ 、 $-SOR^{33}$

50

³、任意に置換された C₁ - C₆アルキル、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリール、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、または任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリールであり、

R²⁸ 及び R²⁹ は独立して、水素、CN、C(O)R³¹、CO₂R³¹、C(O)R³¹R³¹、任意に置換された C₁ - C₆アルキル、任意に置換された 3 ~ 10 員のシクロアルキル、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリール、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、または、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリールであり、

各 R³¹ は独立して、水素、任意に置換された C₁ - C₆アルキル、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリール、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、または任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリールであり、

R³⁰ は、水素または任意に置換された C₁ - C₆アルキルであり、かつ、

R³² 及び R³³ は独立して、水素、任意に置換された C₁ - C₆アルキル、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリール、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、または任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリールである。]

を有する、請求項 16 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

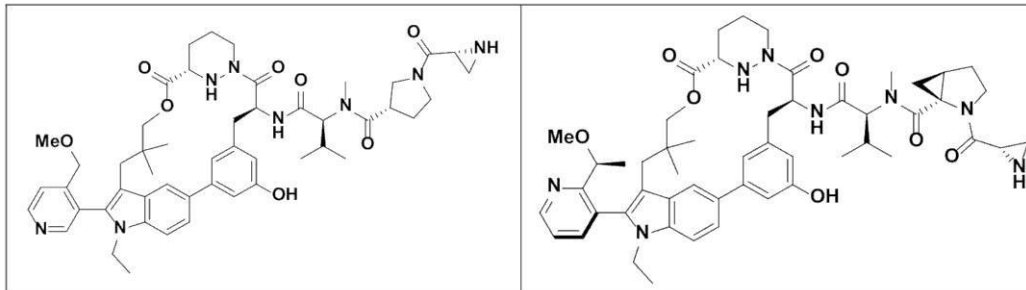
【請求項 18】

W がエポキシドを含む、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 19】

前記化合物が、下記：

【化 8 - 1】



10

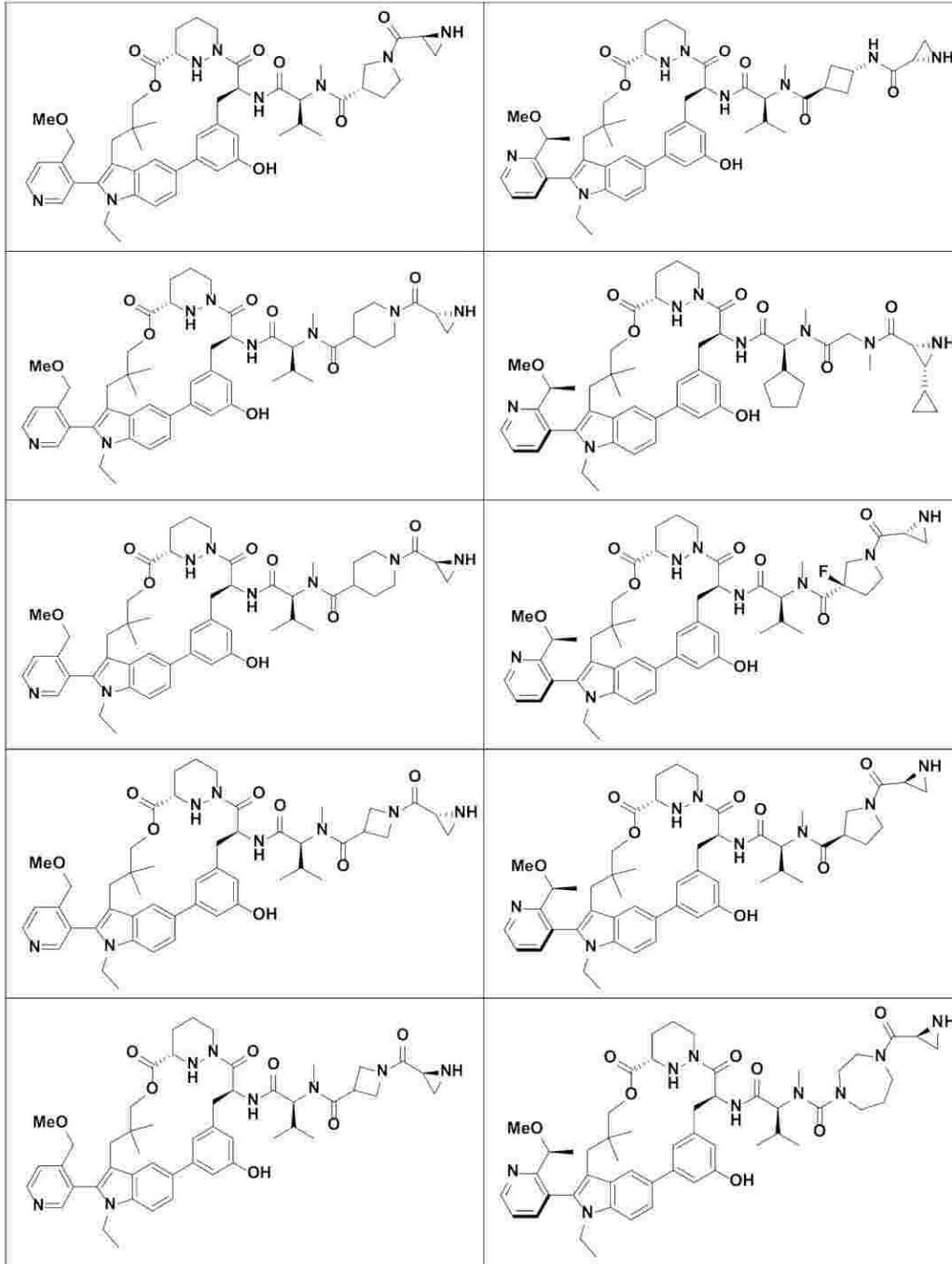
20

30

40

50

【化 8 - 2】



10

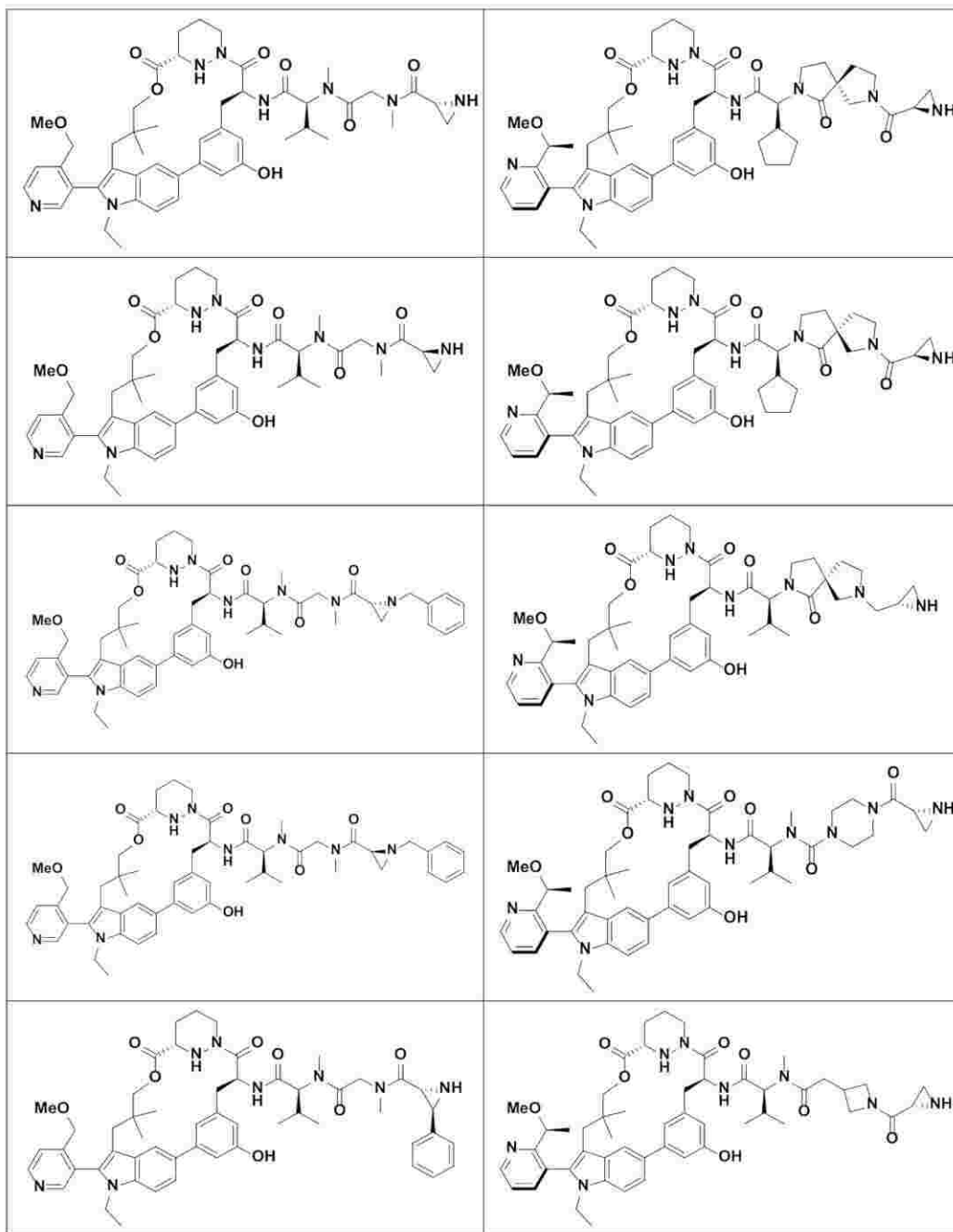
20

30

40

50

【化 8 - 3】



10

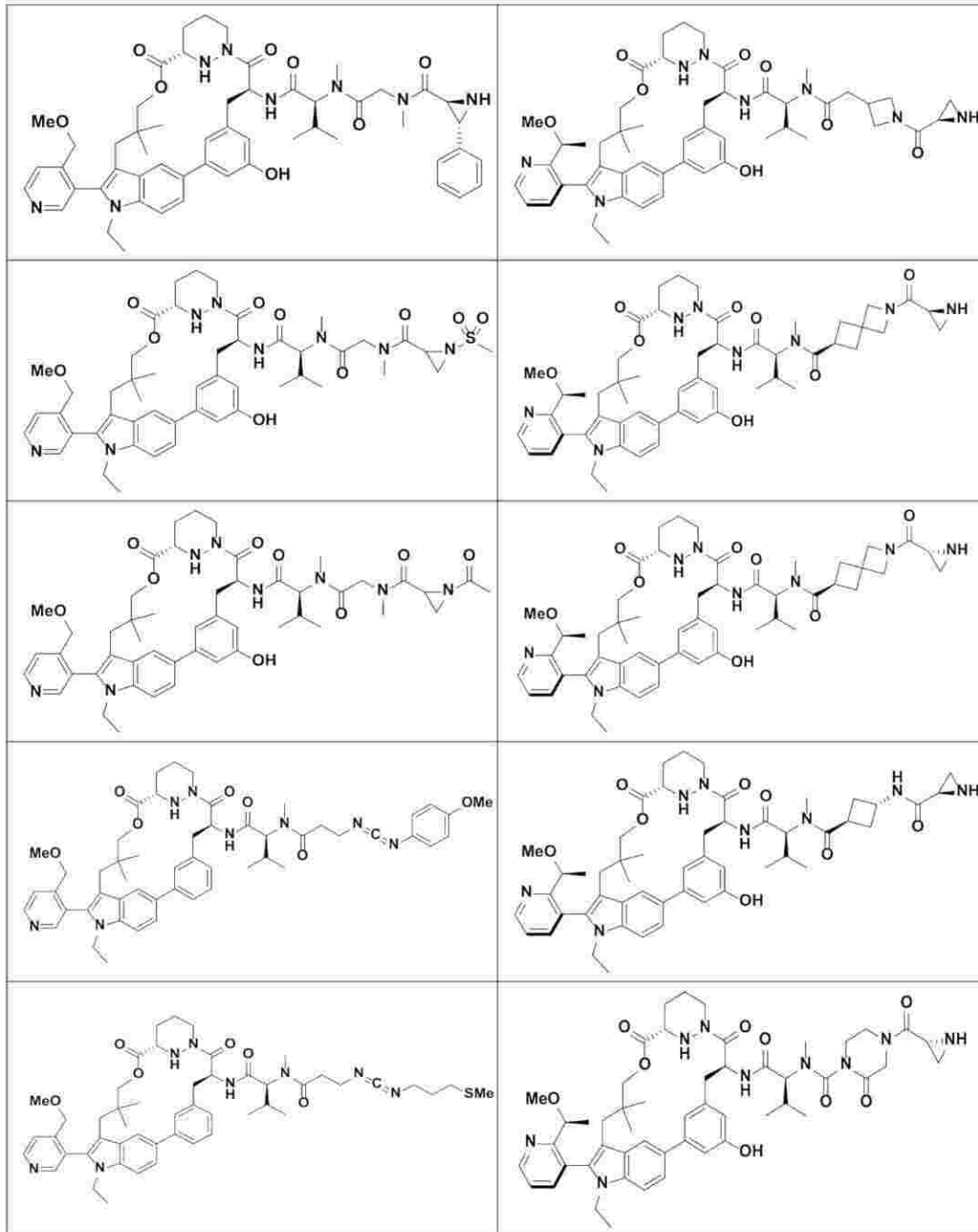
20

30

40

50

【化 8 - 4】



10

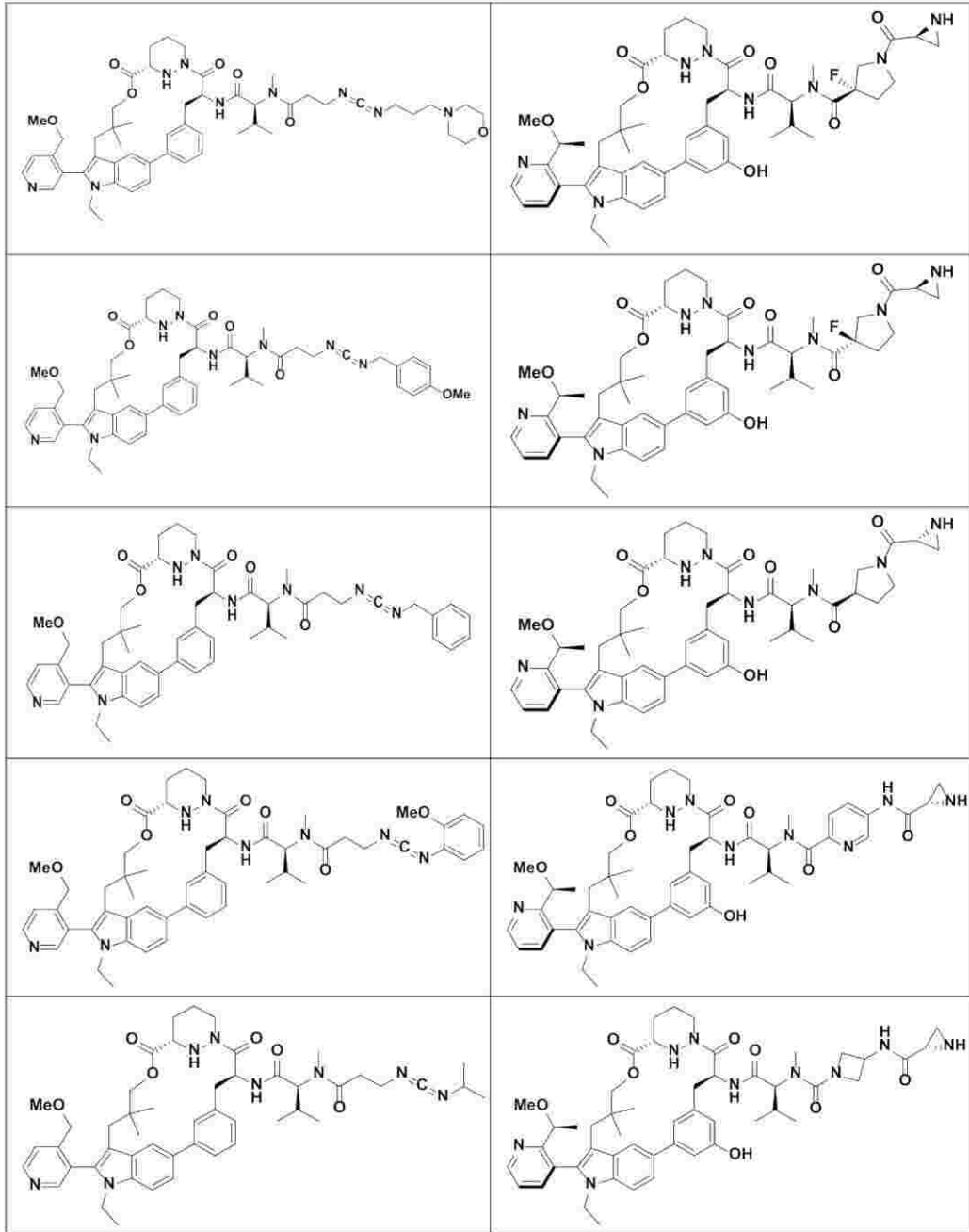
20

30

40

50

【化 8 - 5】



10

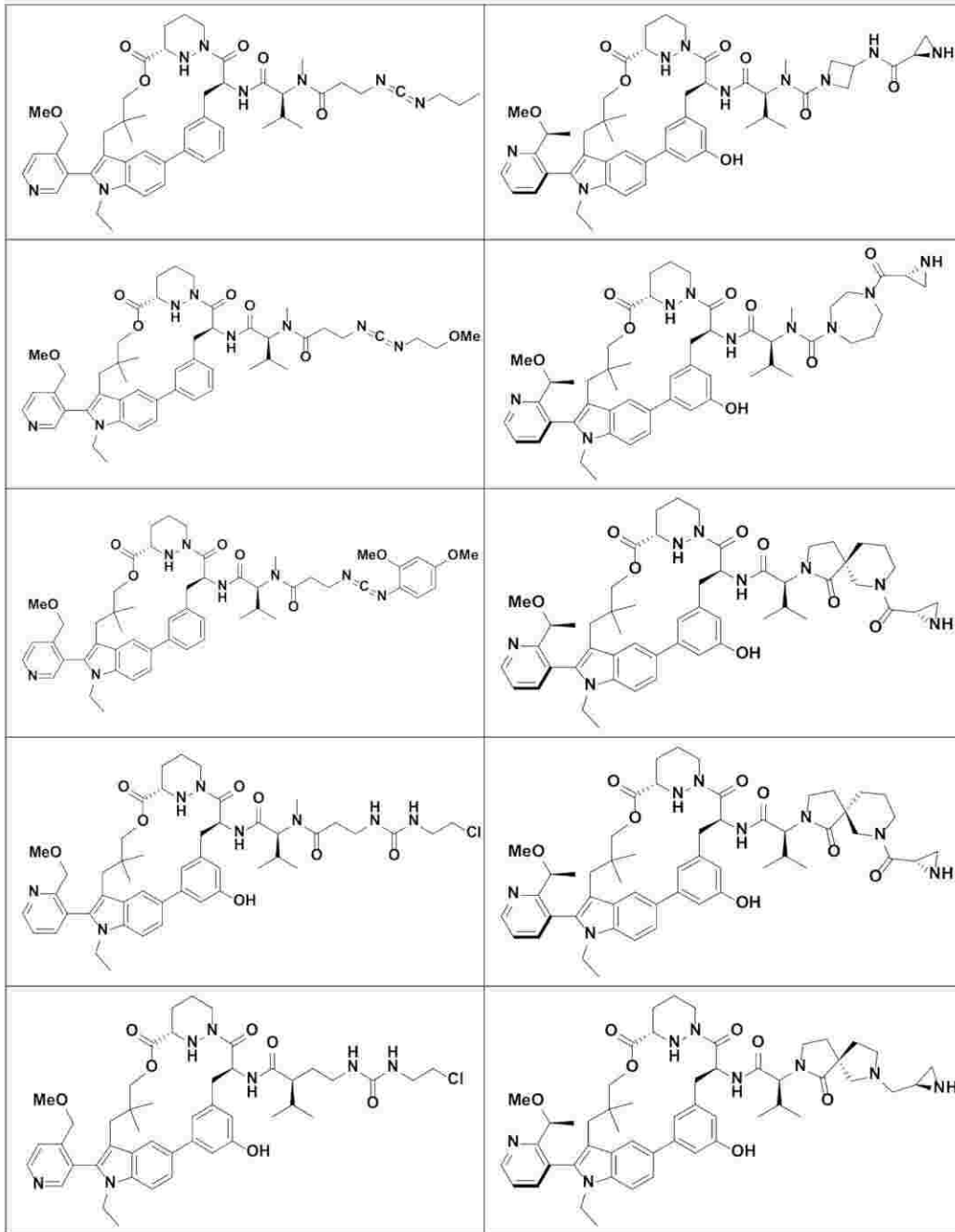
20

30

40

50

【化 8 - 6】



10

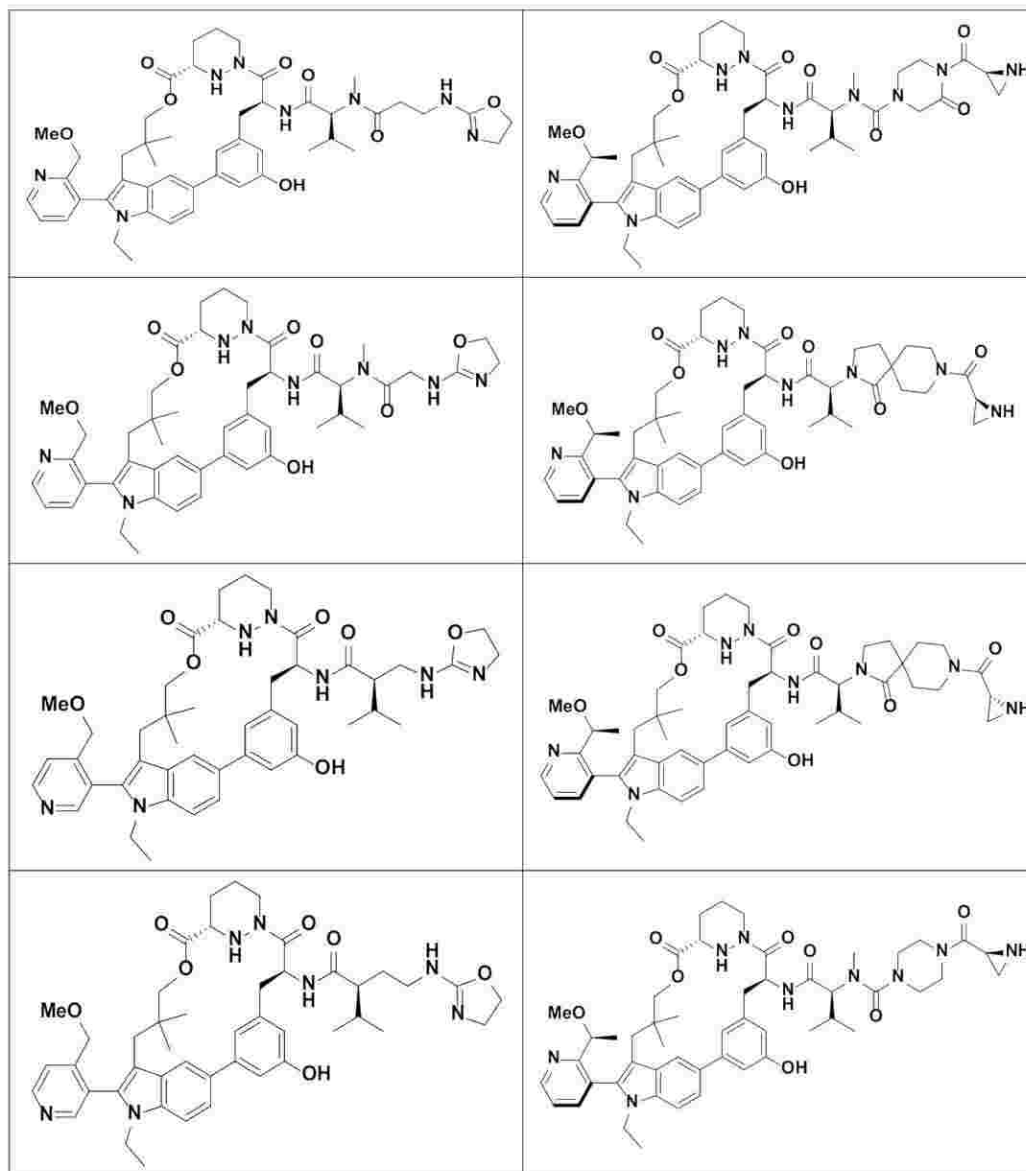
20

30

40

50

【化 8 - 7】



10

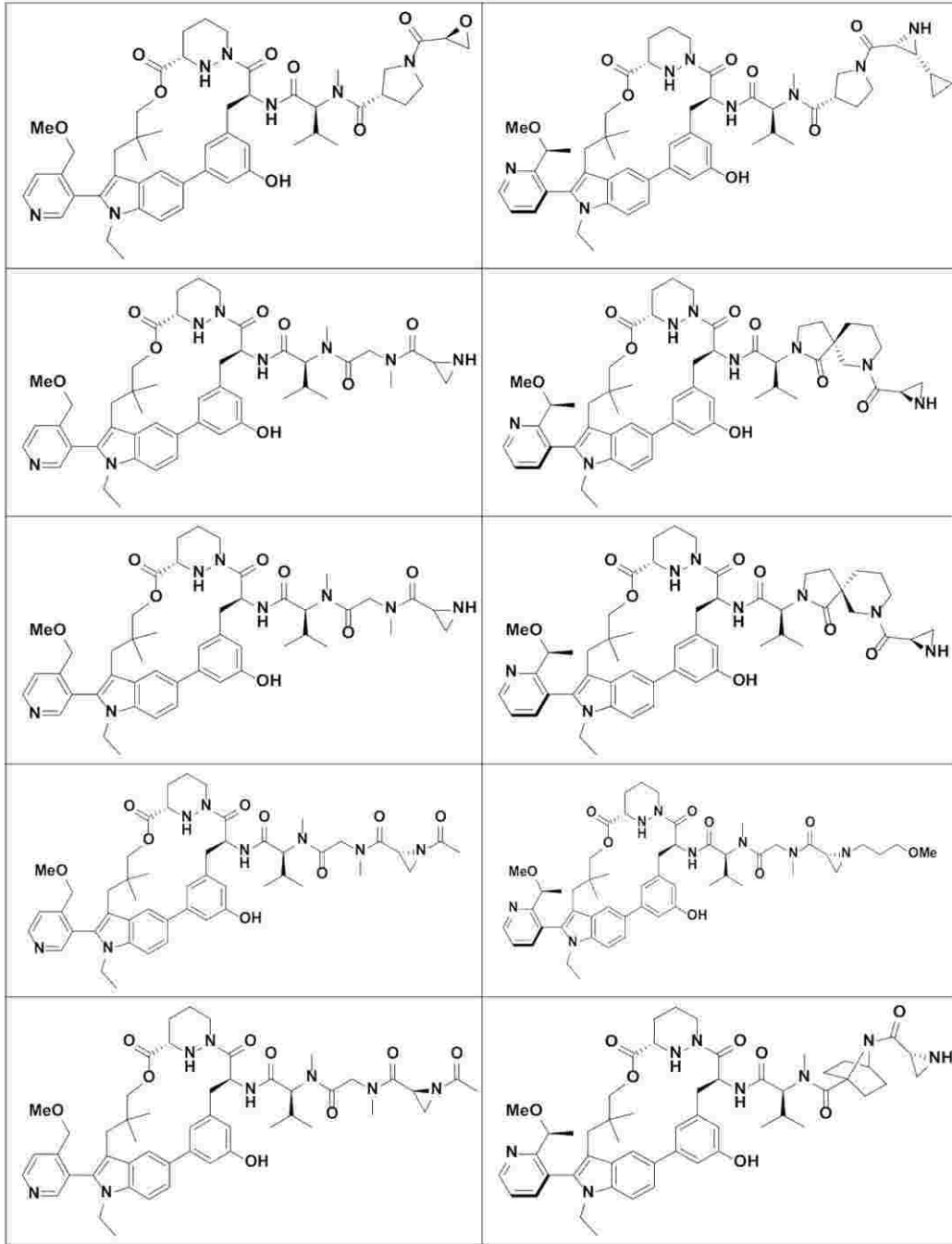
20

30

40

50

【化 8 - 8】



10

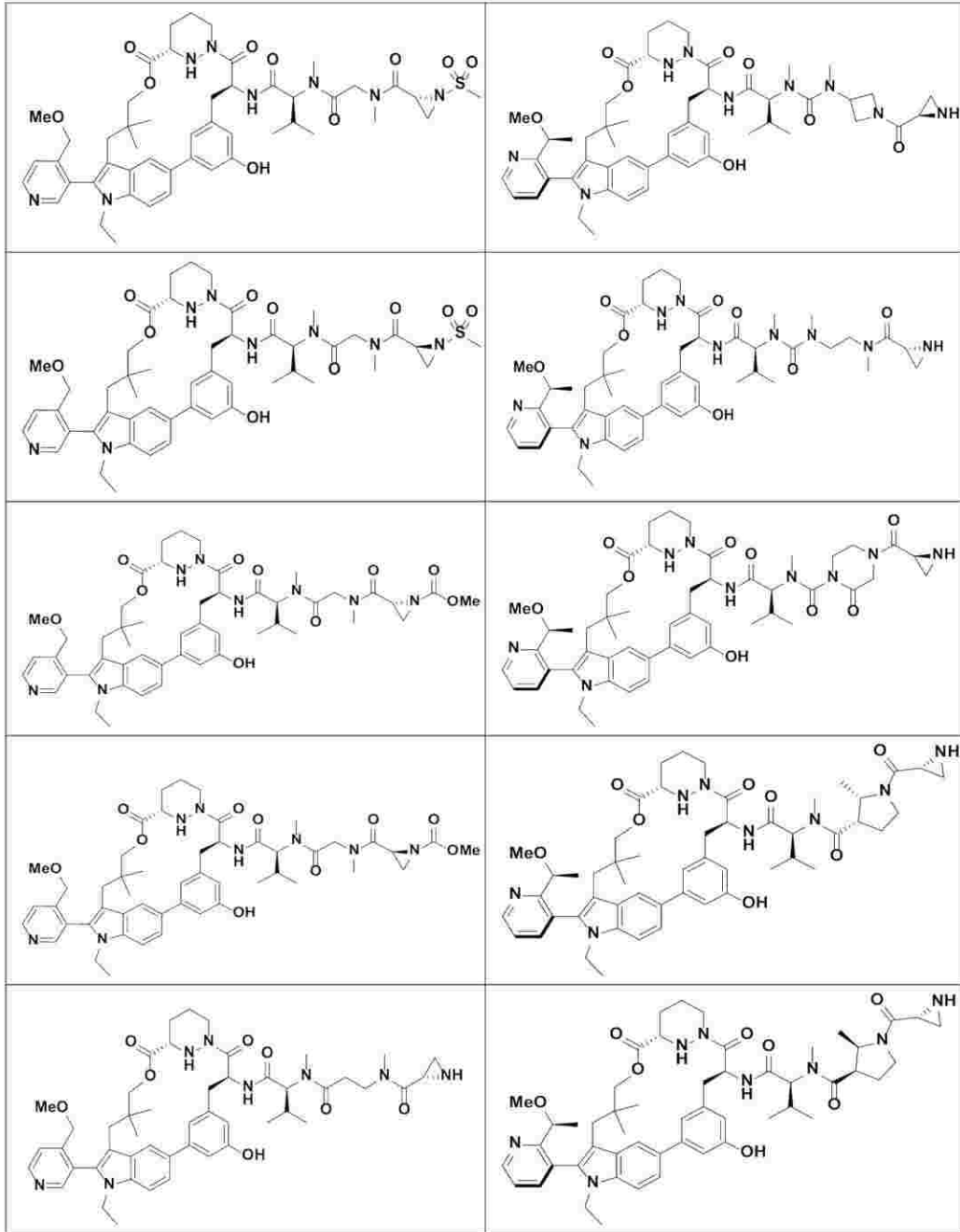
20

30

40

50

【化 8 - 9】



10

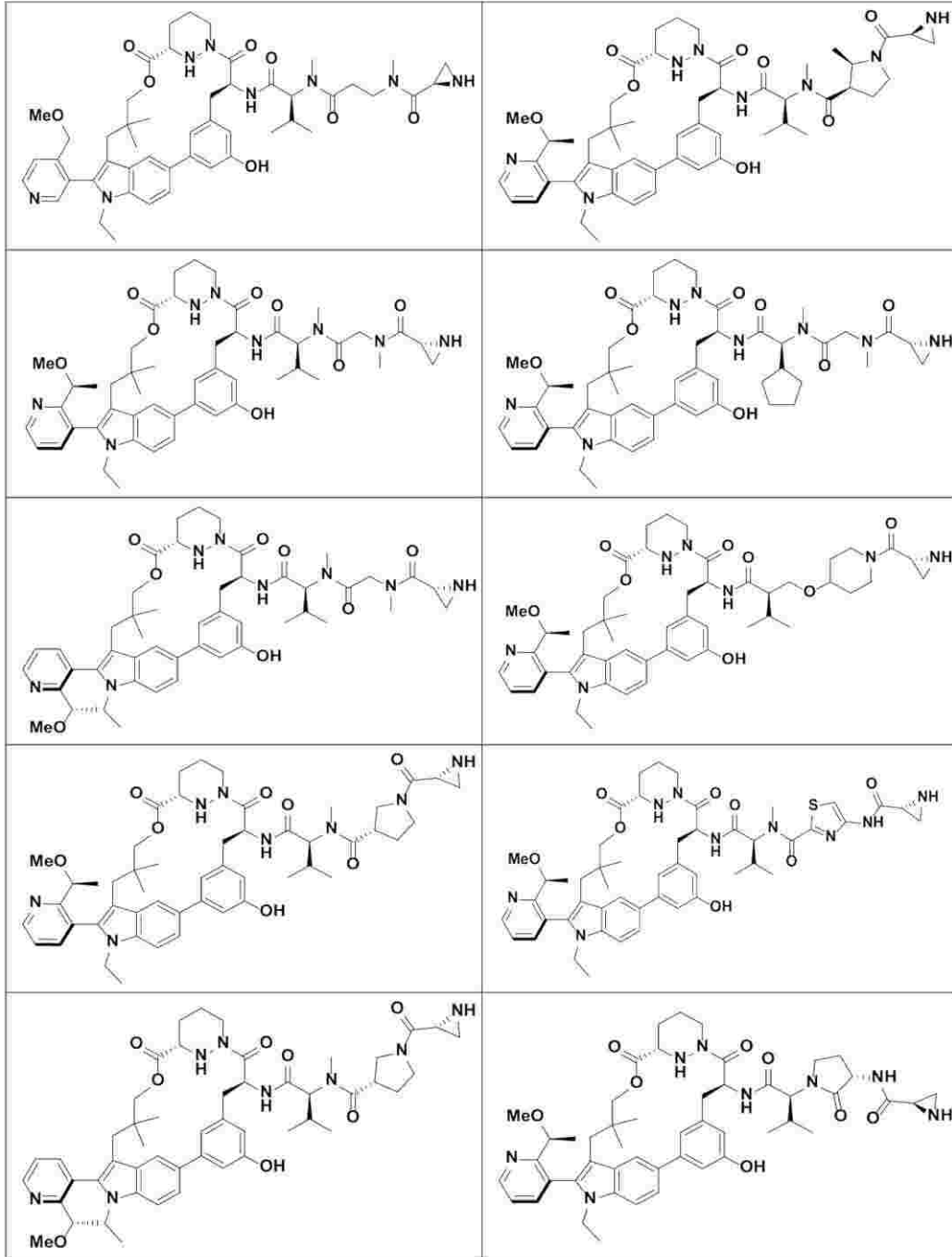
20

30

40

50

【化 8 - 1 0】



10

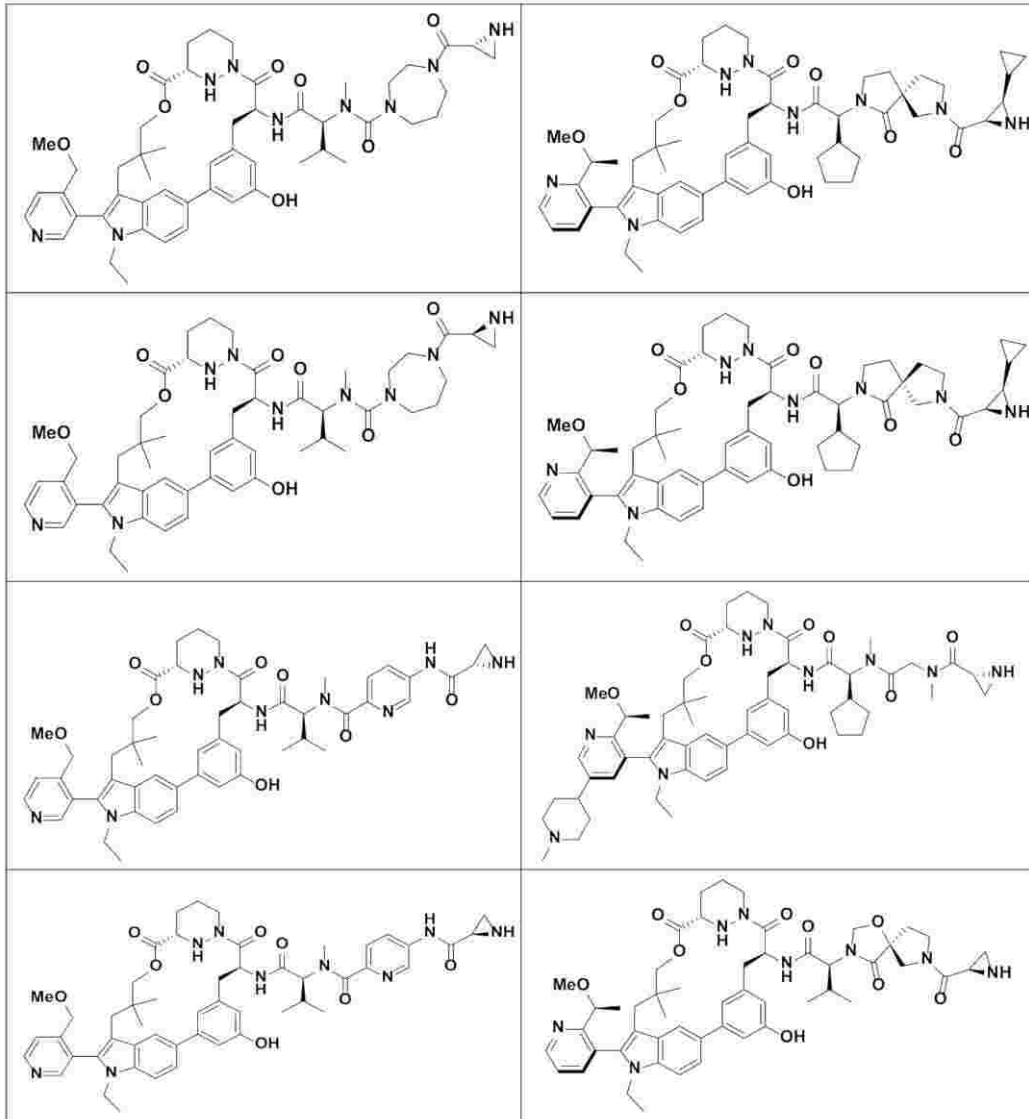
20

30

40

50

【化 8 - 1 1】



10

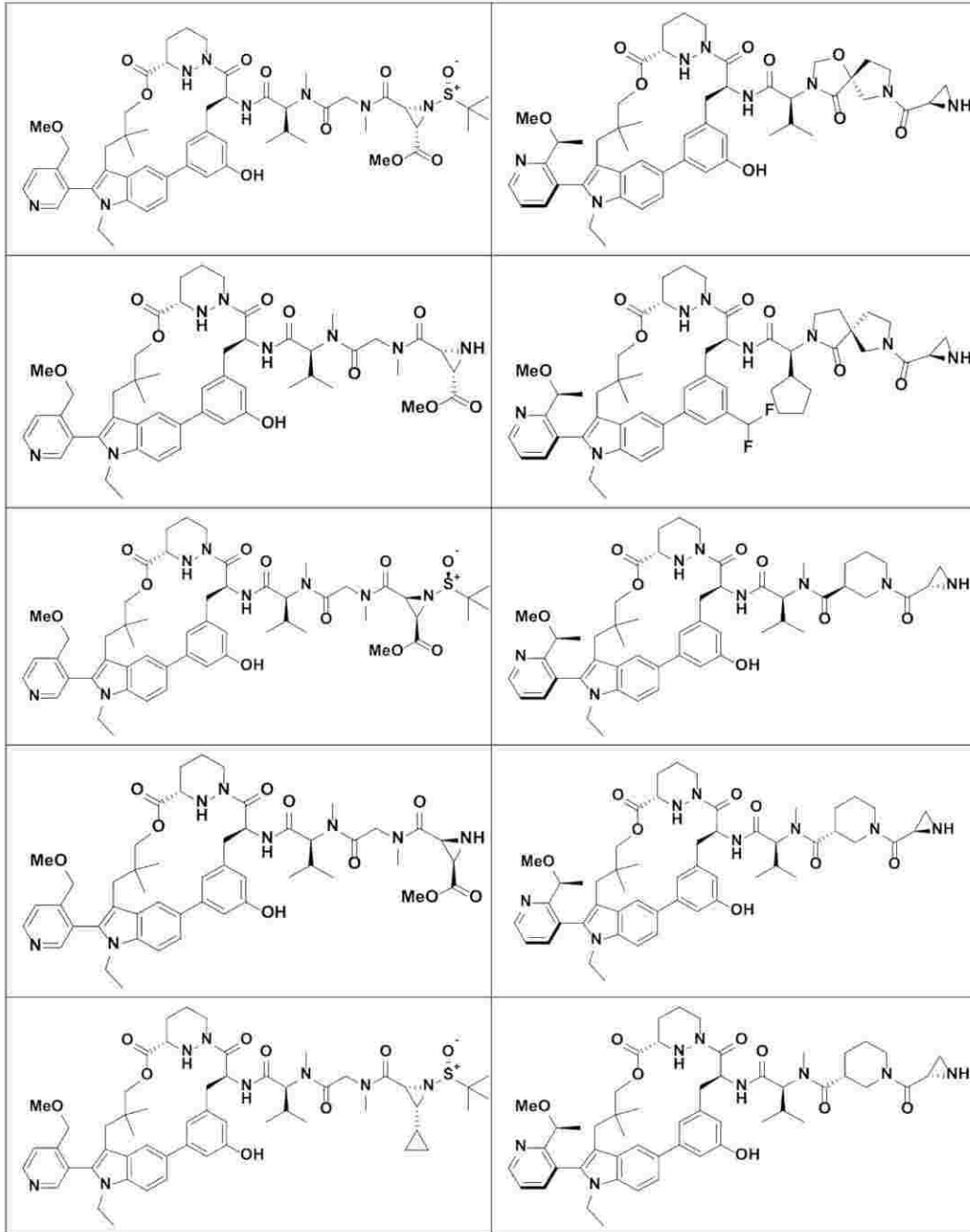
20

30

40

50

【化 8 - 1 2】



10

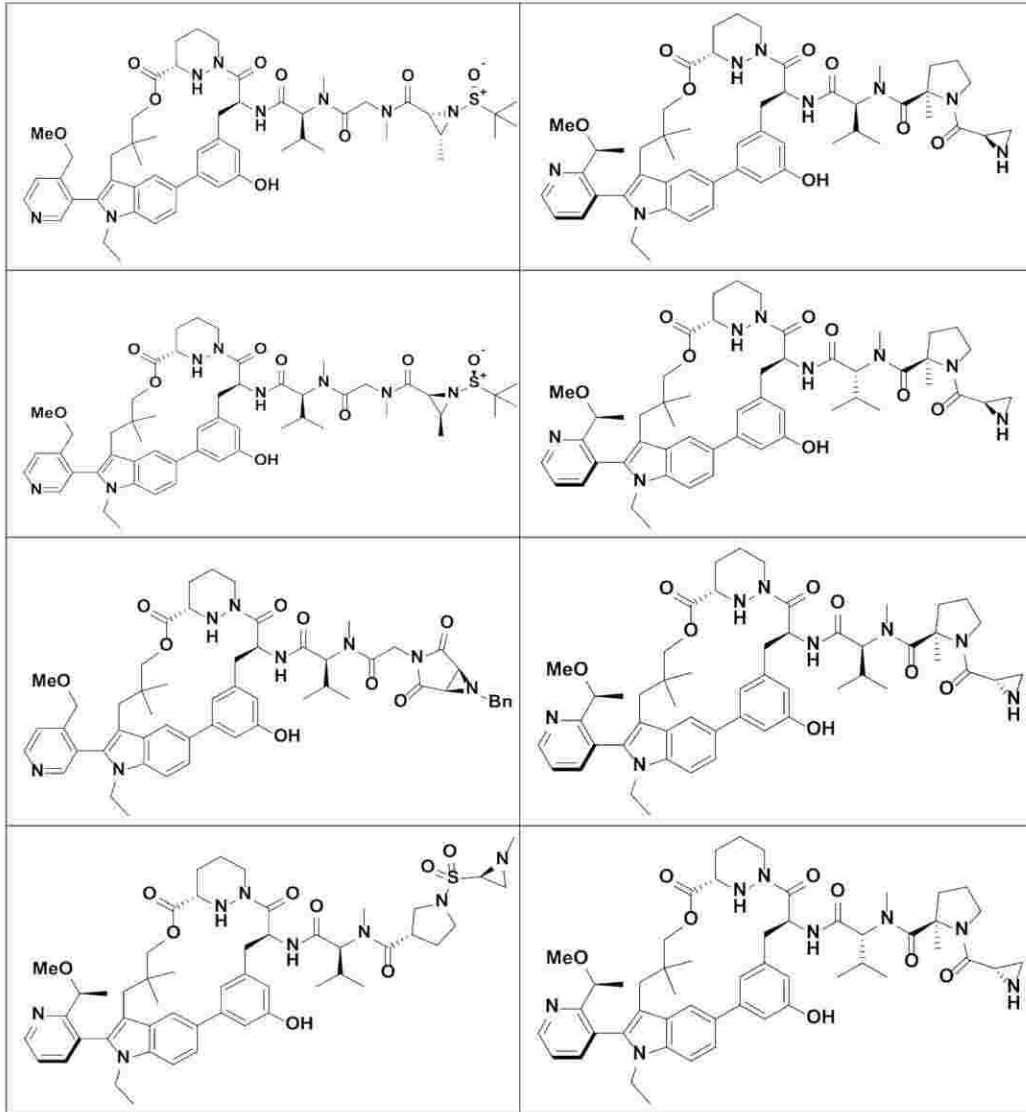
20

30

40

50

【化 8 - 1 3】



10

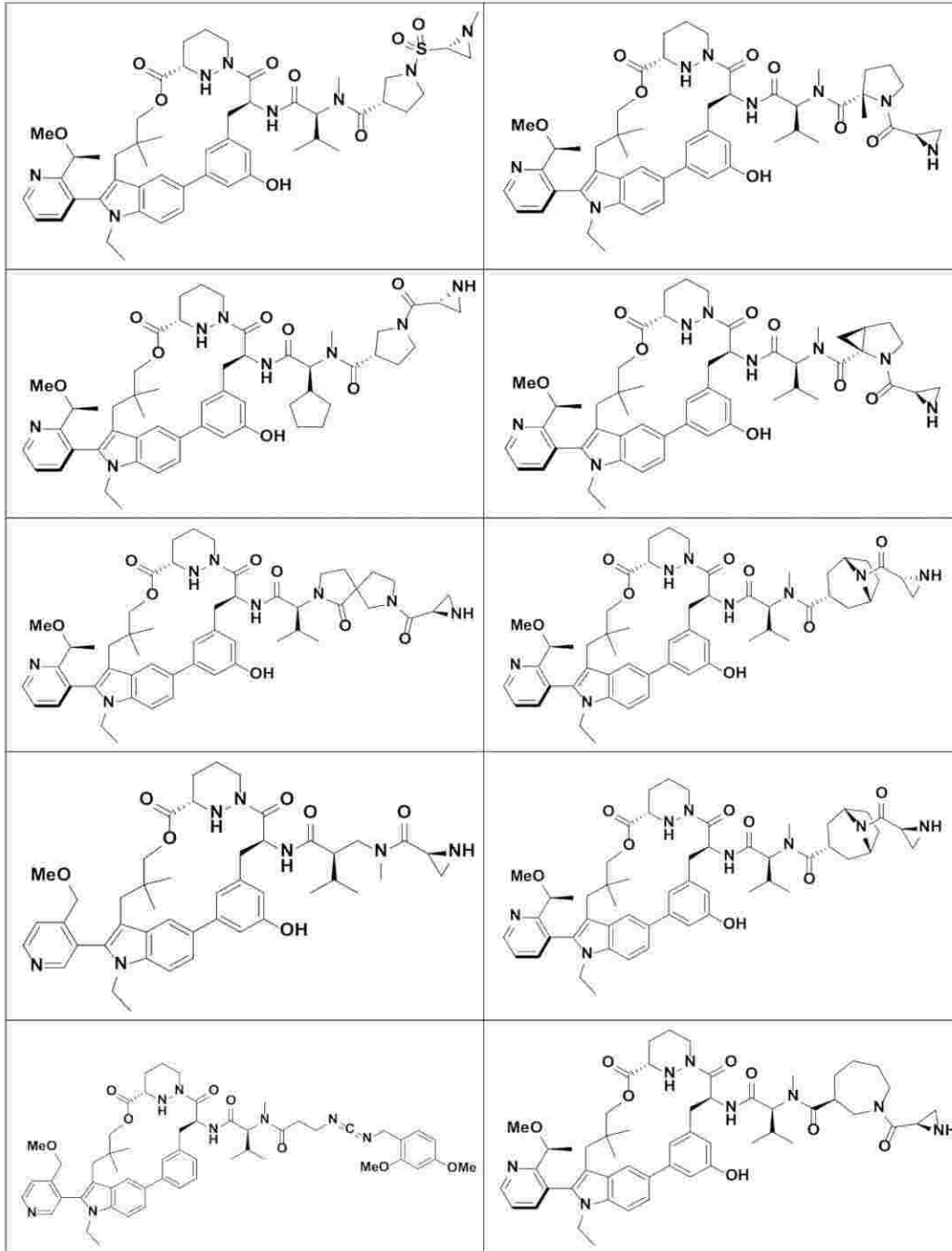
20

30

40

50

【化 8 - 1 4】



10

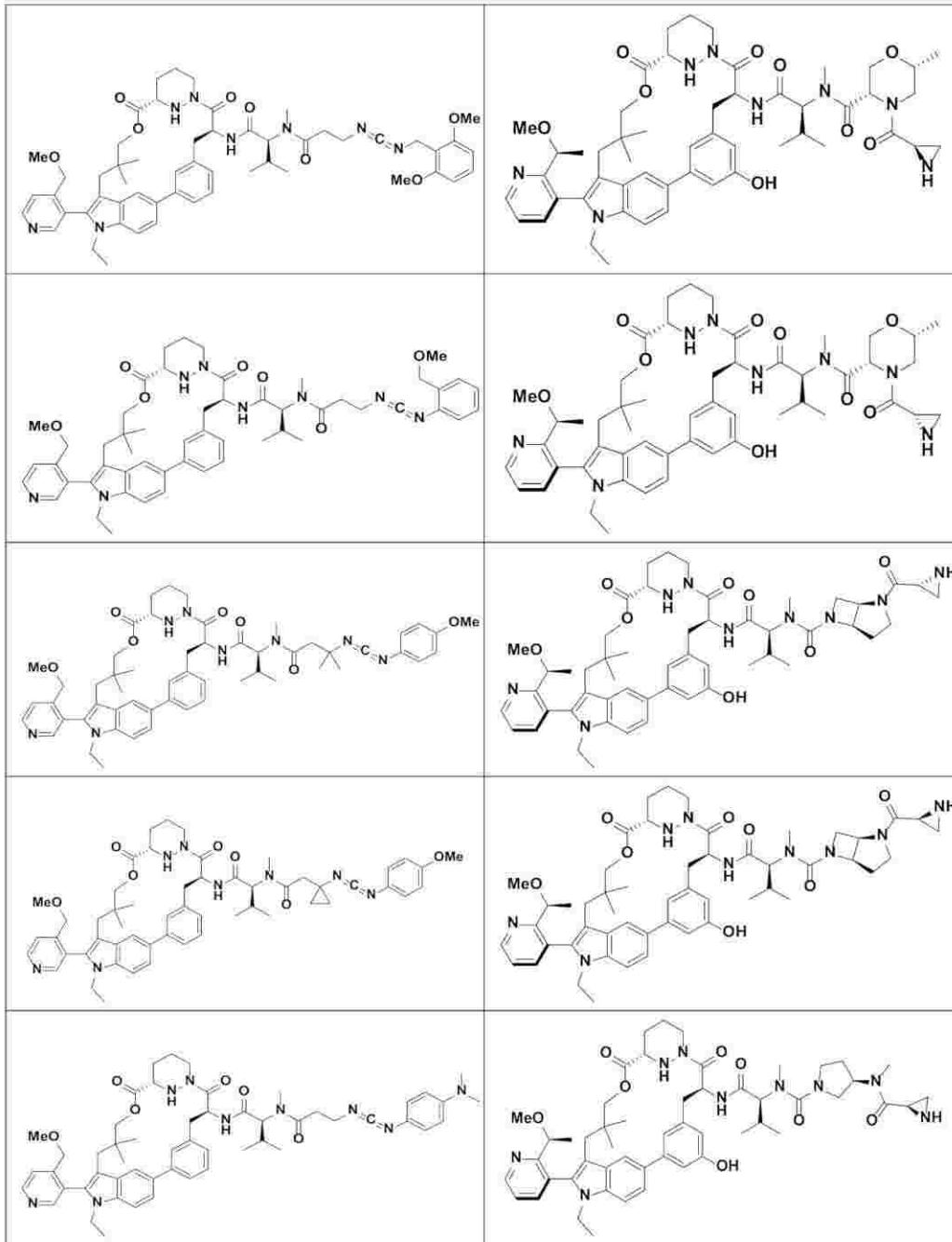
20

30

40

50

【化 8 - 1 5】



10

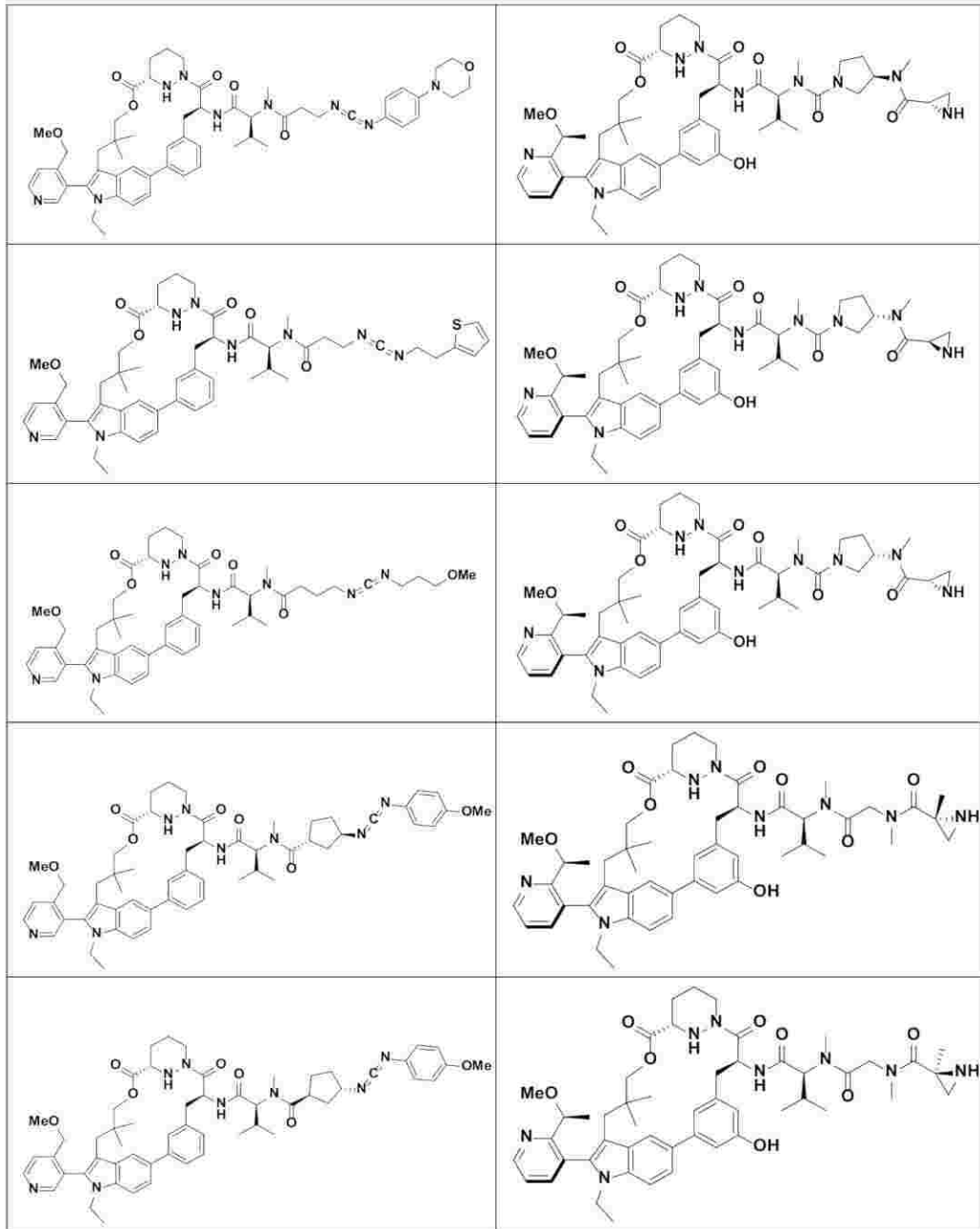
20

30

40

50

【化 8 - 1 6】



10

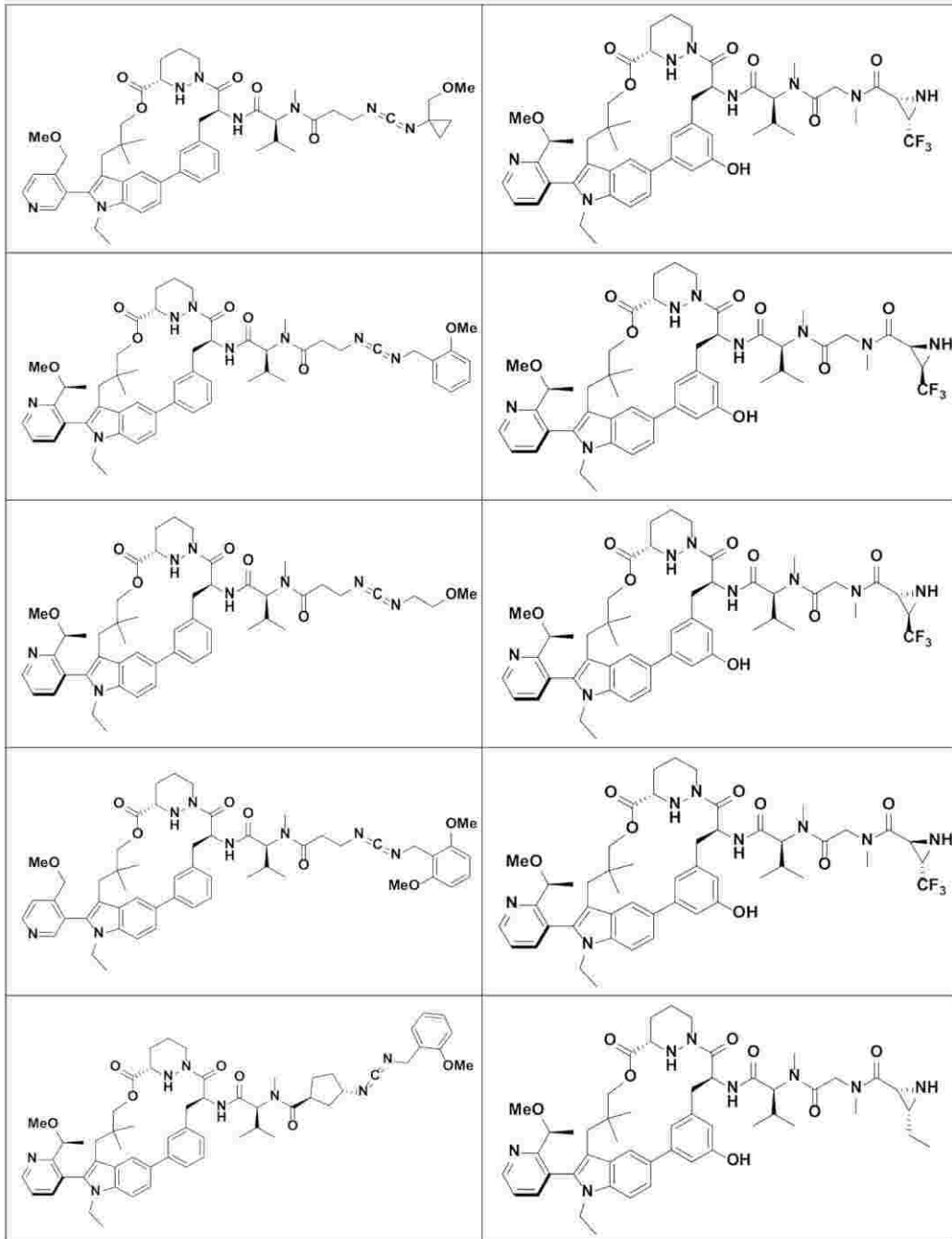
20

30

40

50

【化 8 - 1 7】



10

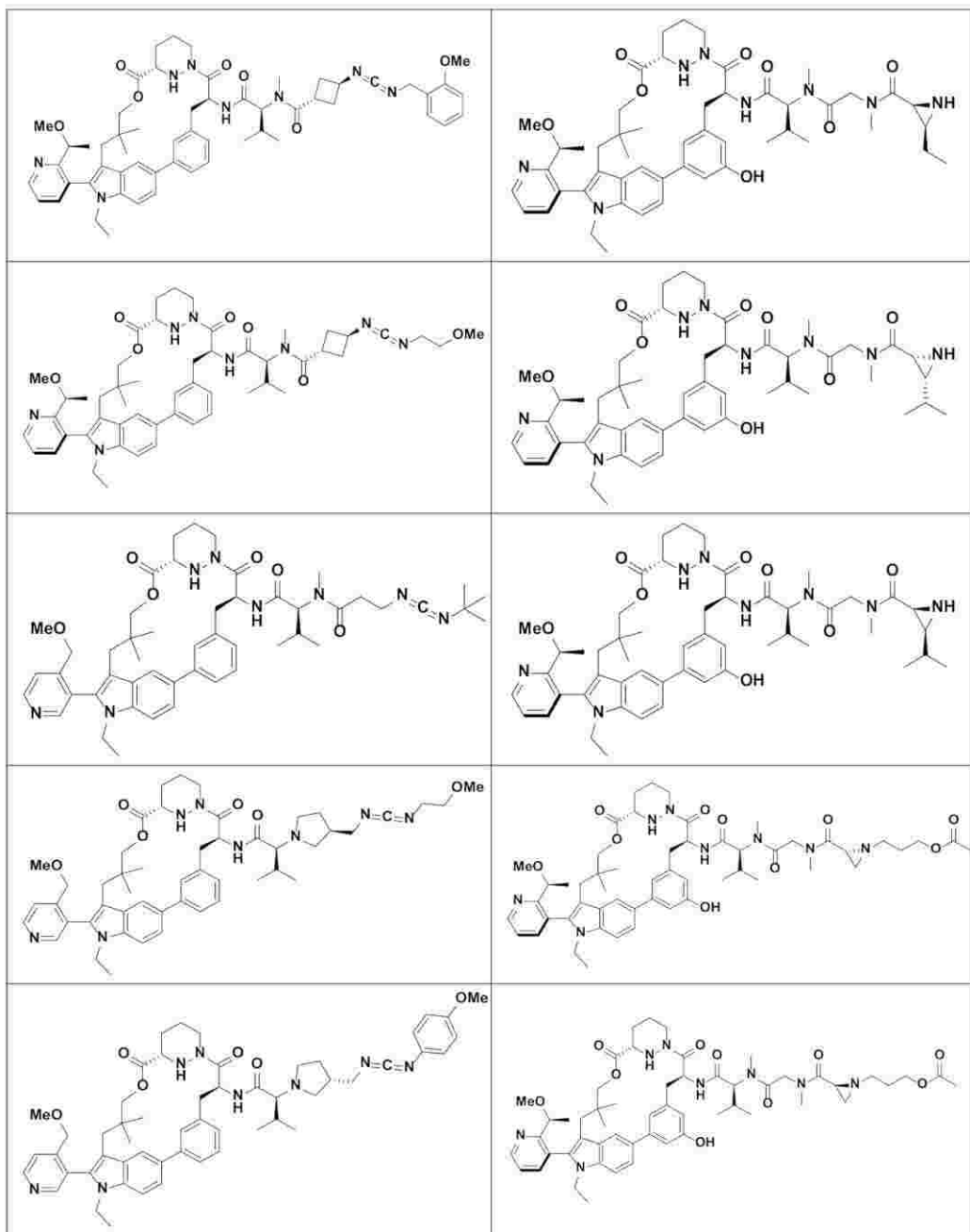
20

30

40

50

【化 8 - 1 8】



10

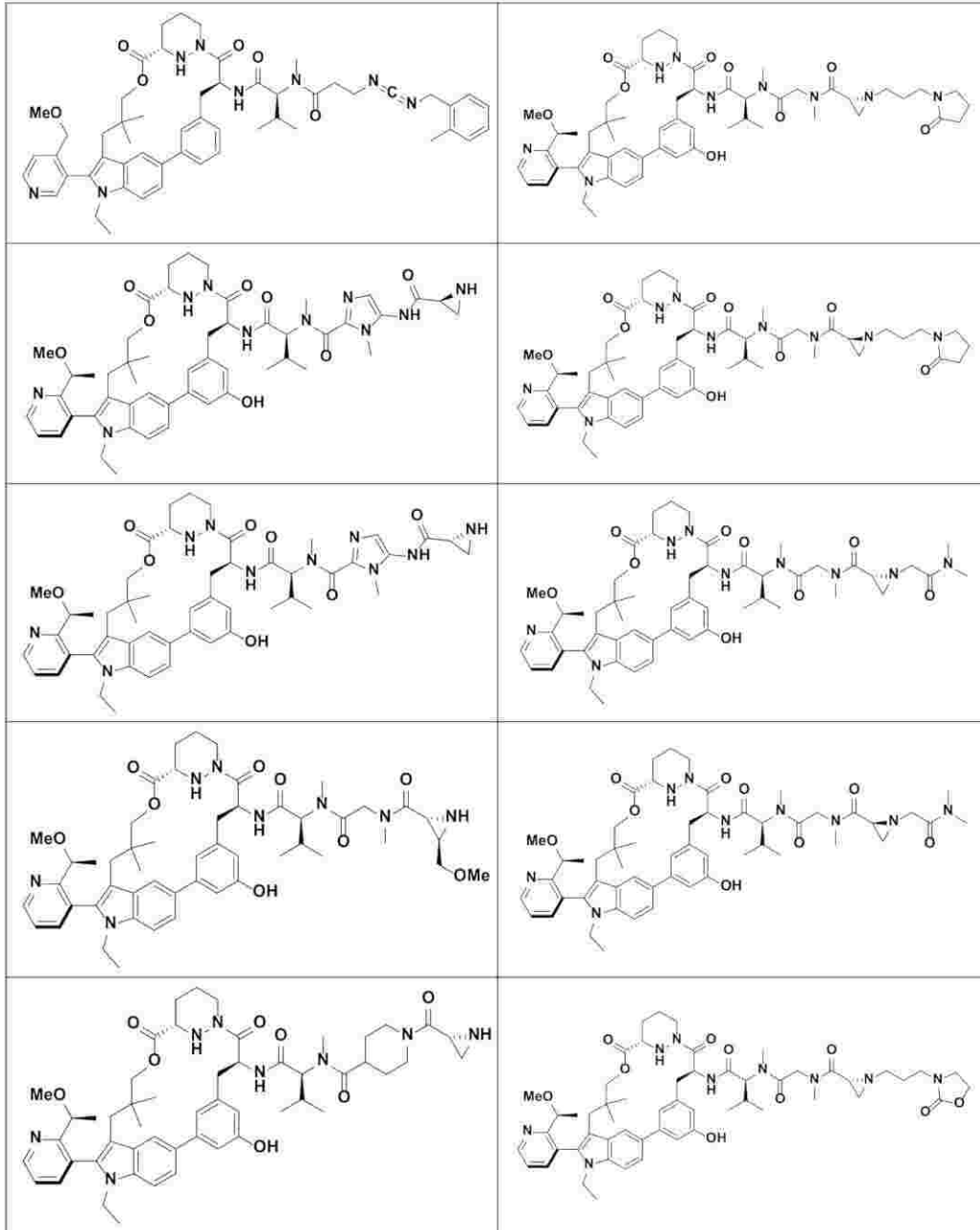
20

30

40

50

【化 8 - 1 9】



10

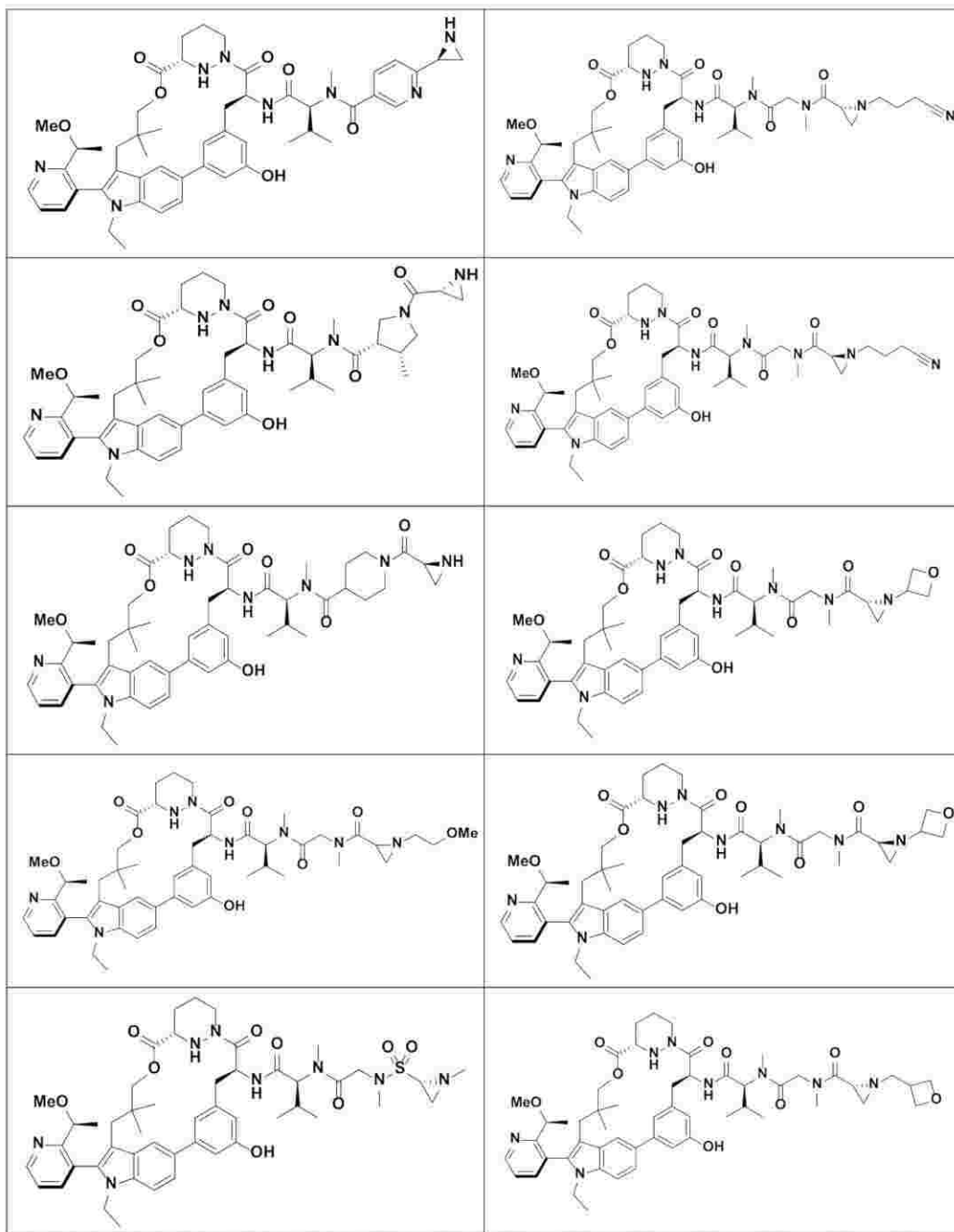
20

30

40

50

【化 8 - 2 0】



10

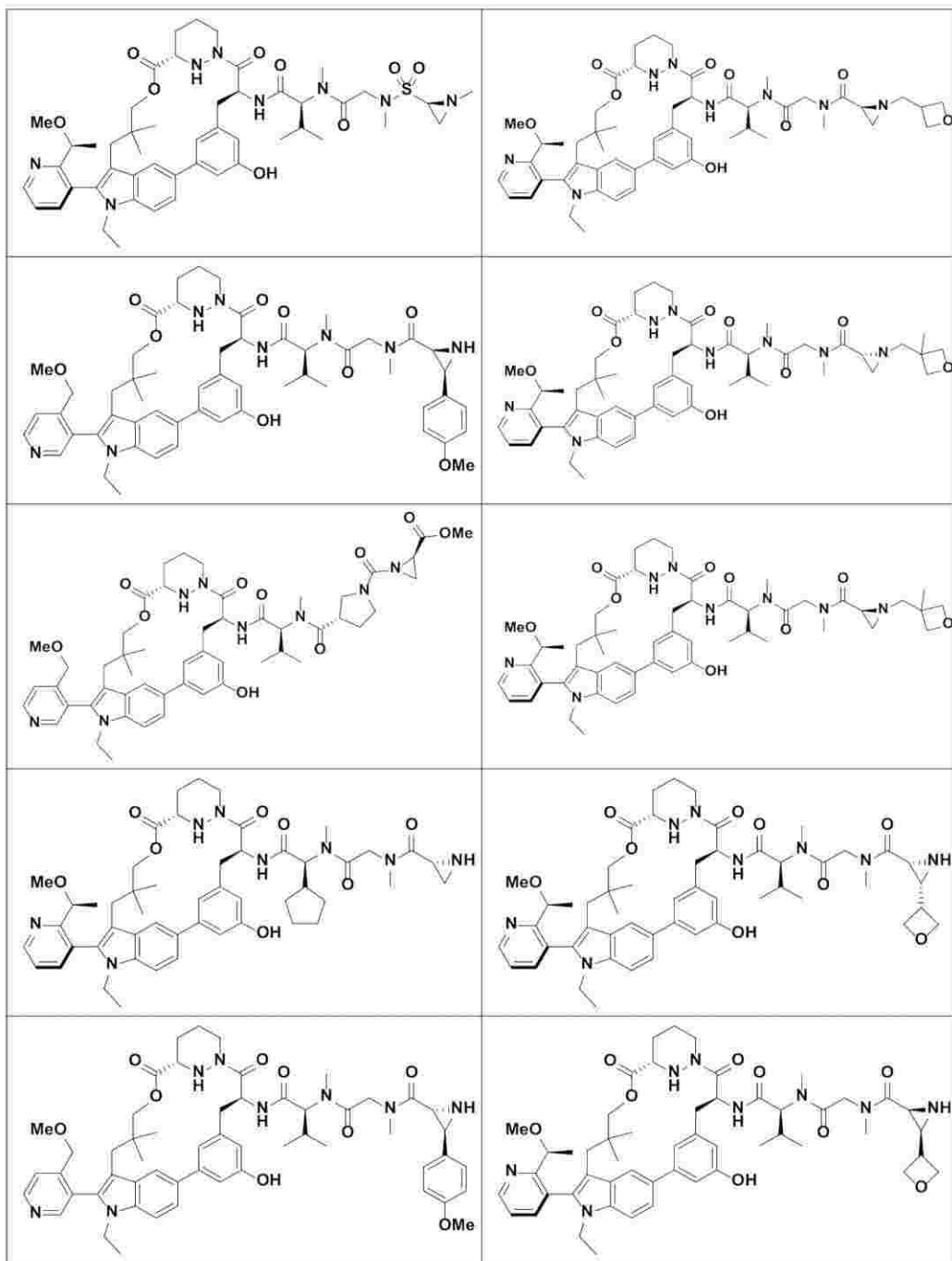
20

30

40

50

【化 8 - 2 1】



10

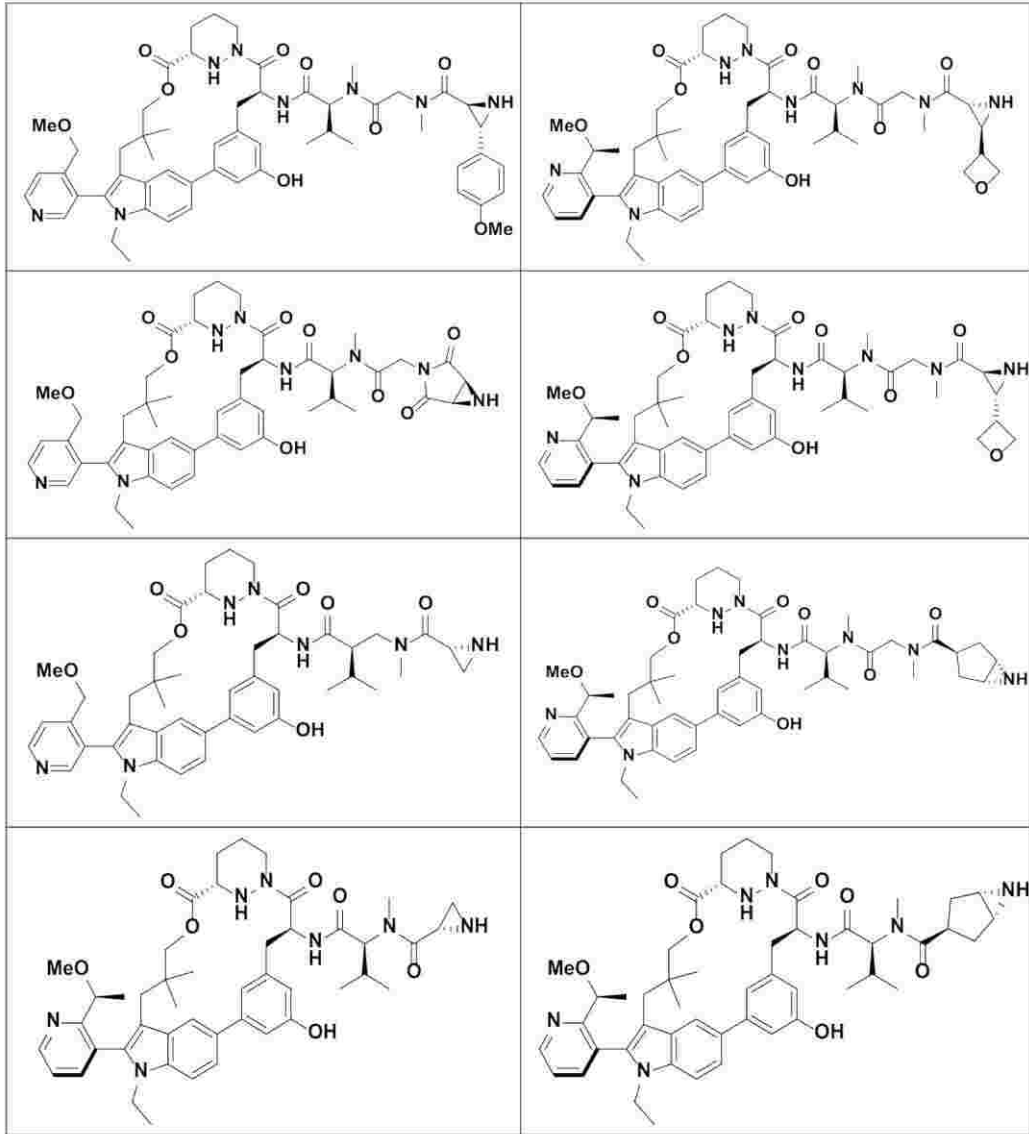
20

30

40

50

【化 8 - 2 2】



10

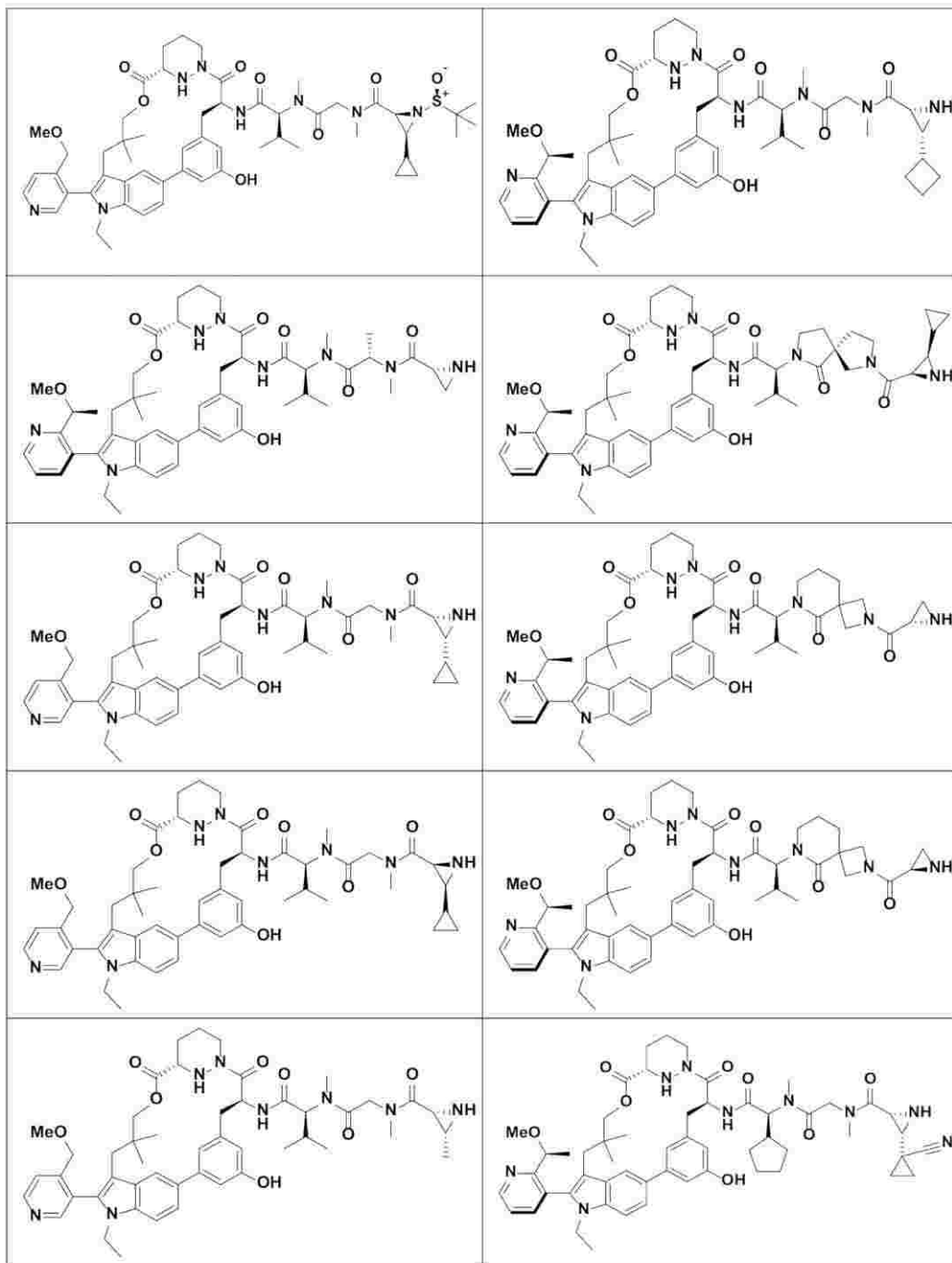
20

30

40

50

【化 8 - 2 3】



10

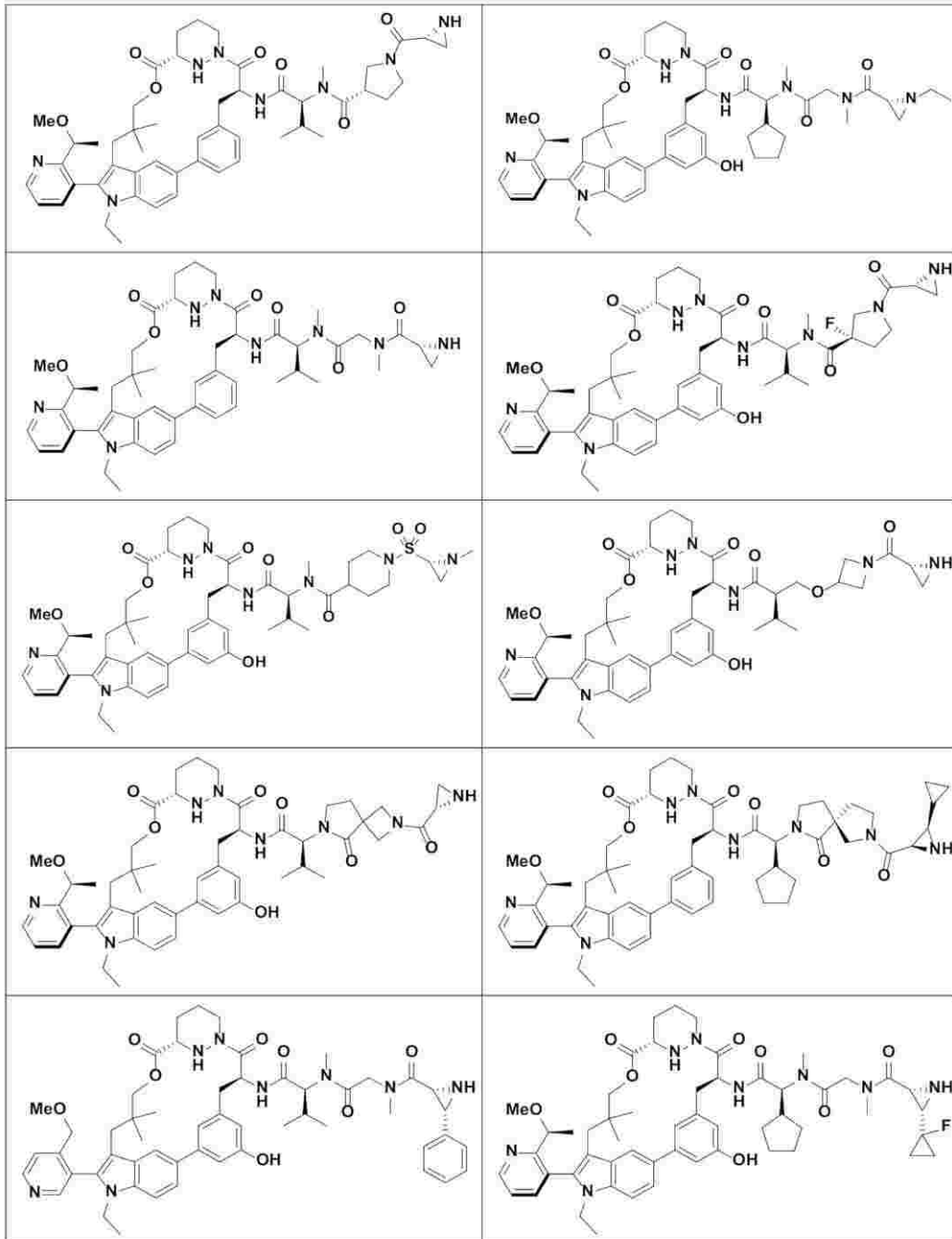
20

30

40

50

【化 8 - 2 4】



10

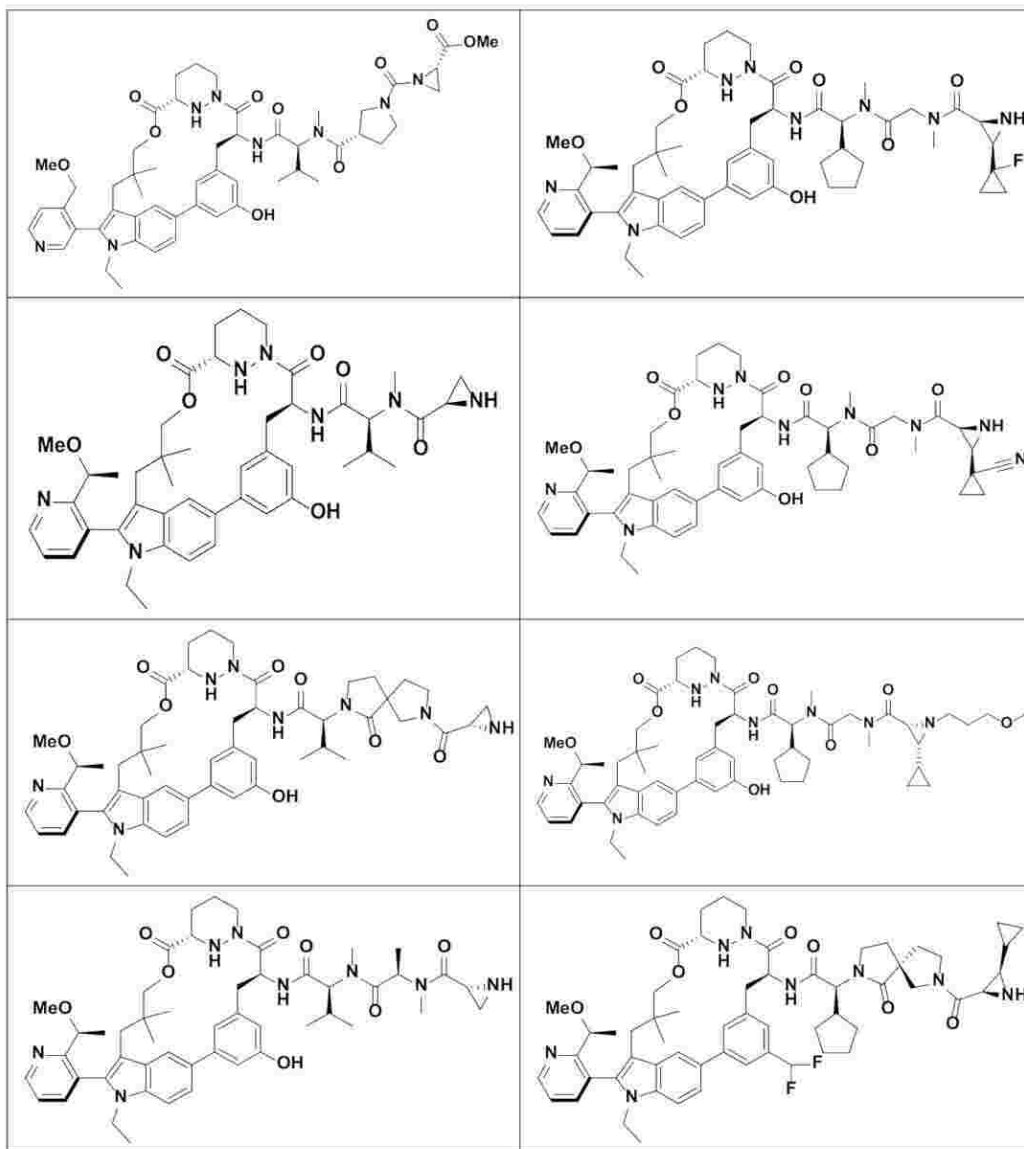
20

30

40

50

【化 8 - 2 5】



10

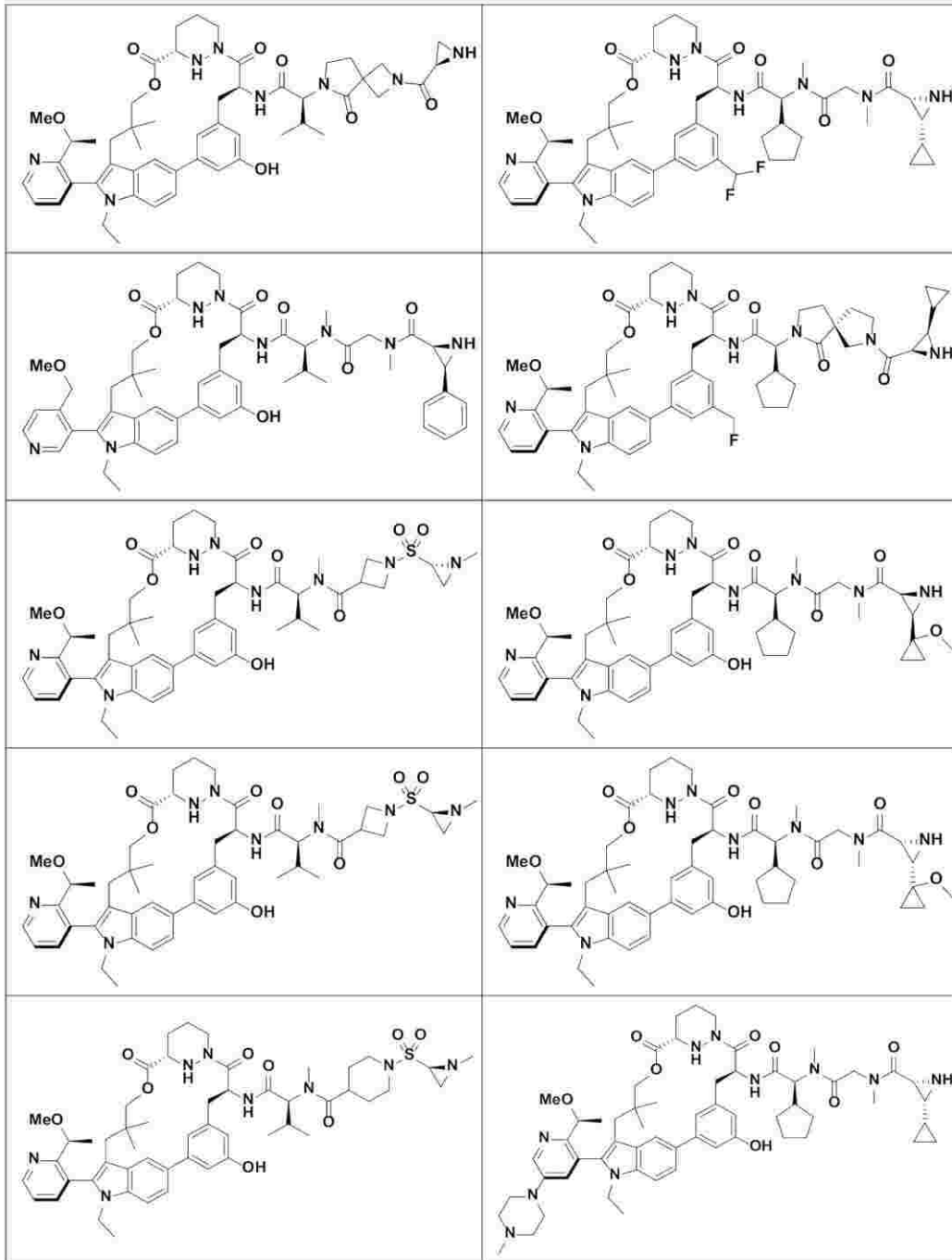
20

30

40

50

【化 8 - 2 6】



10

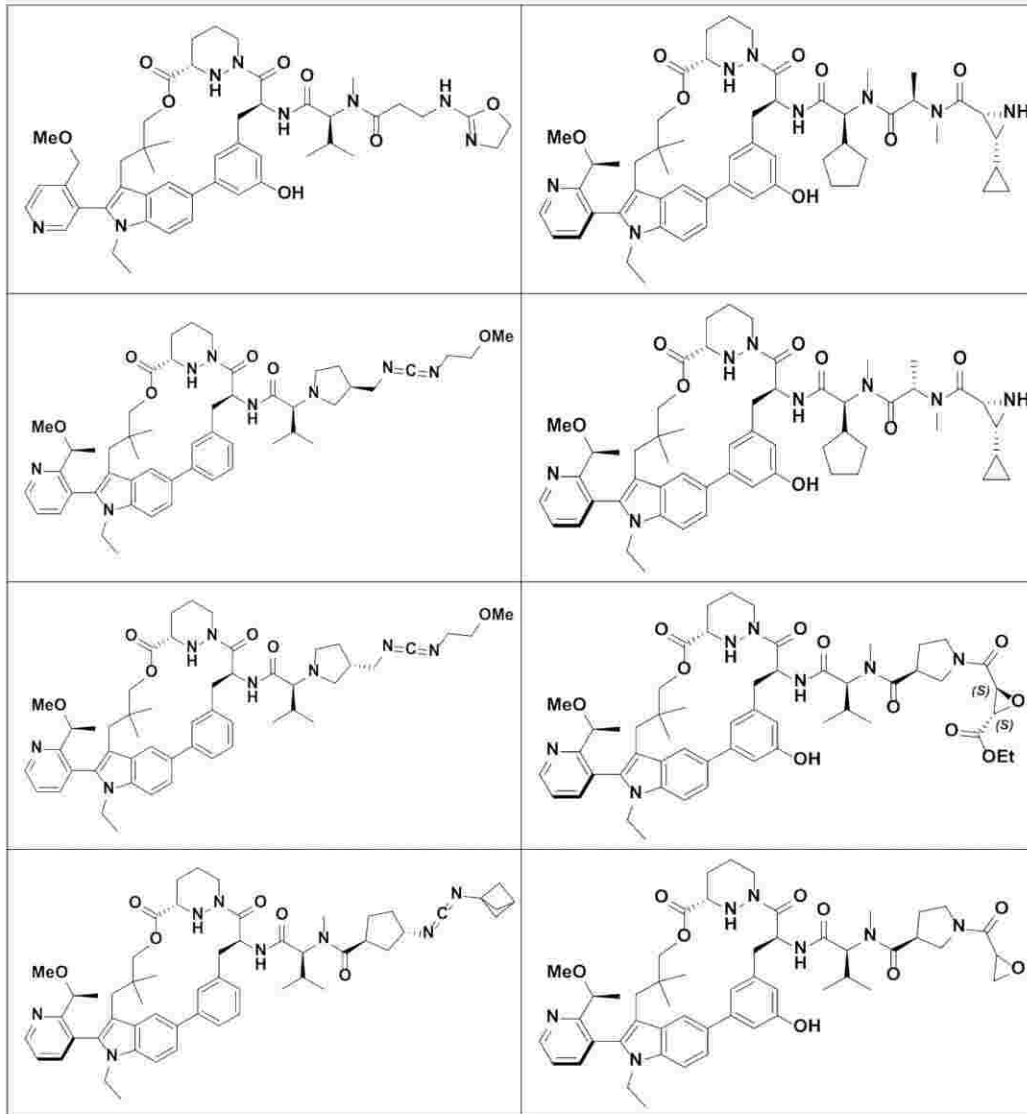
20

30

40

50

【化 8 - 2 7】



10

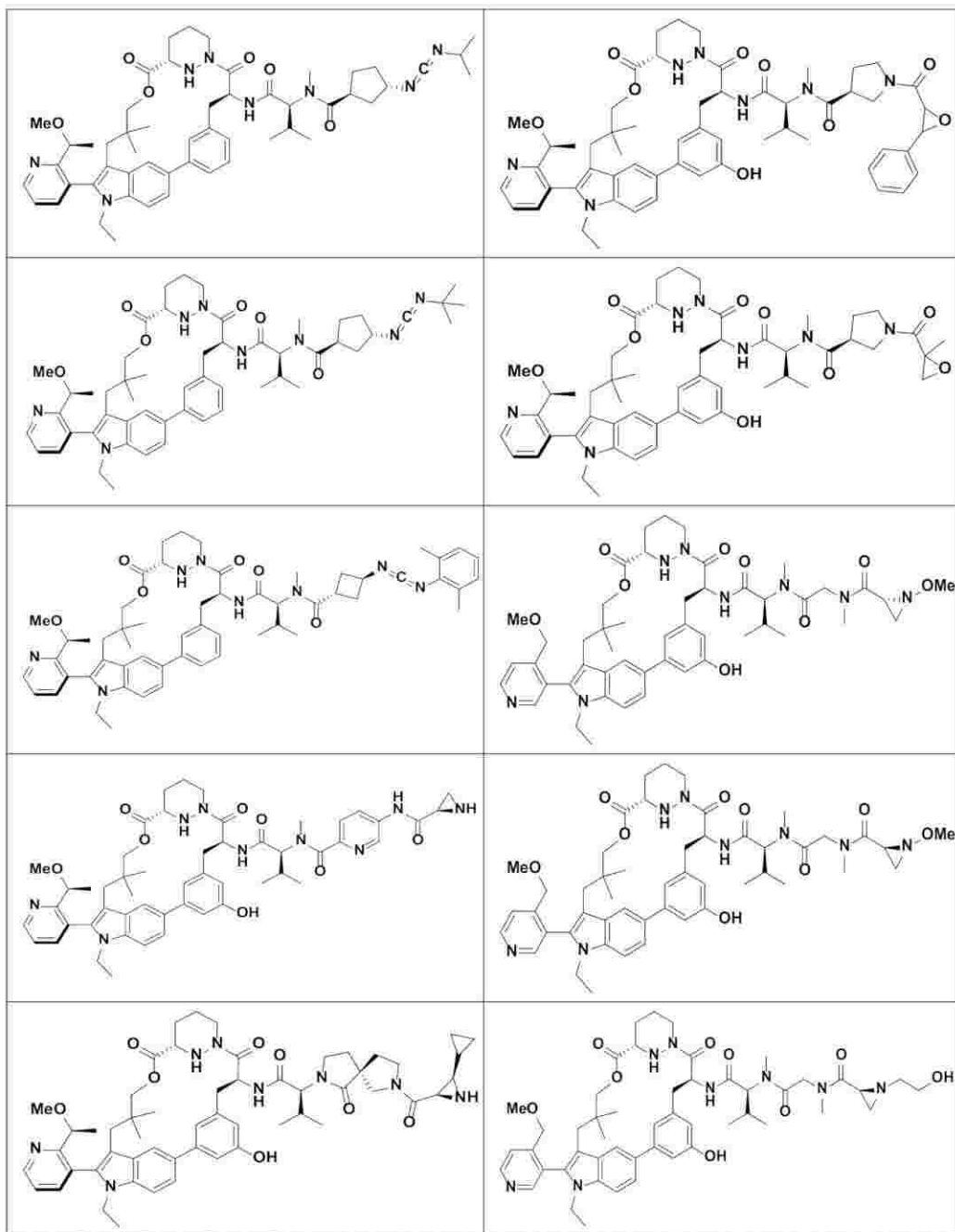
20

30

40

50

【化 8 - 2 8】



10

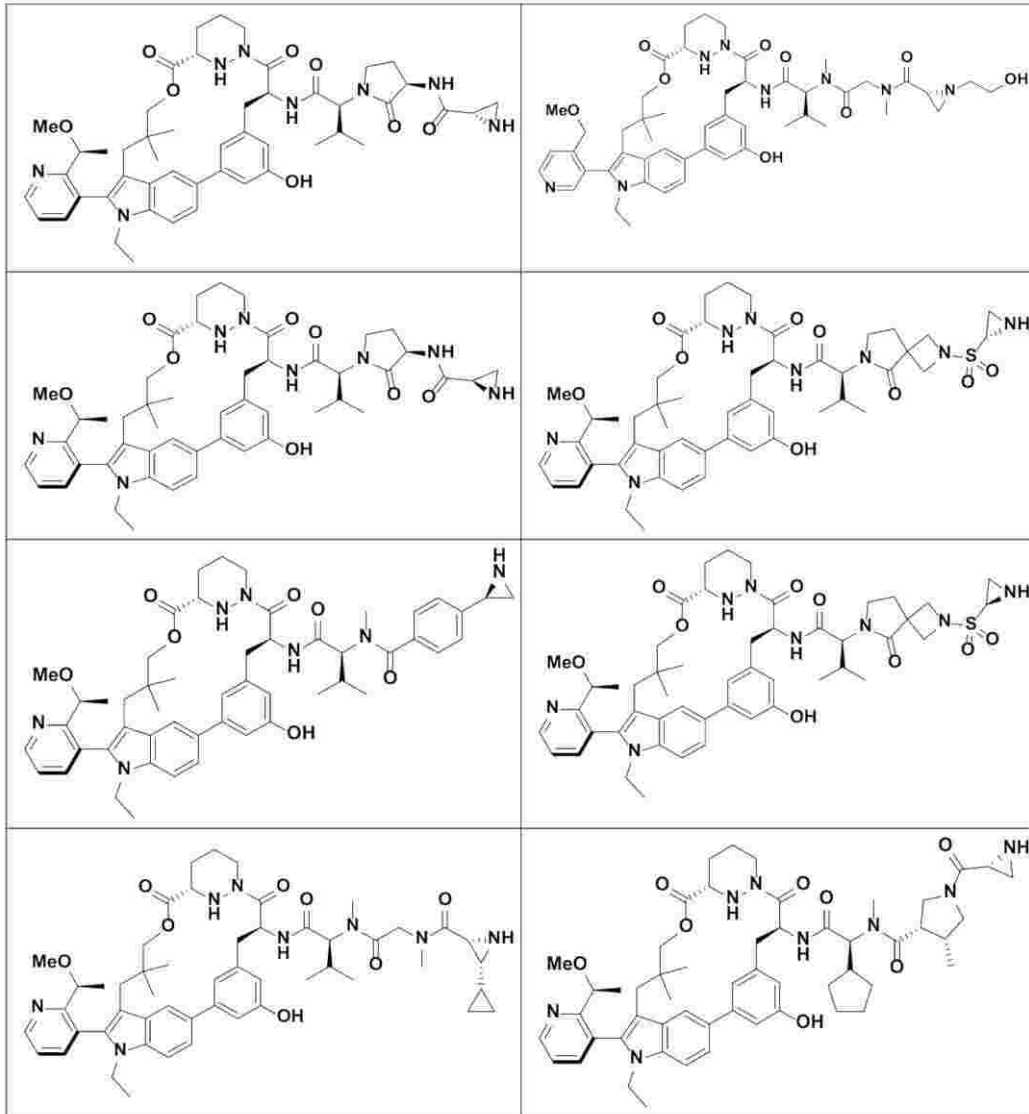
20

30

40

50

【化 8 - 2 9】



10

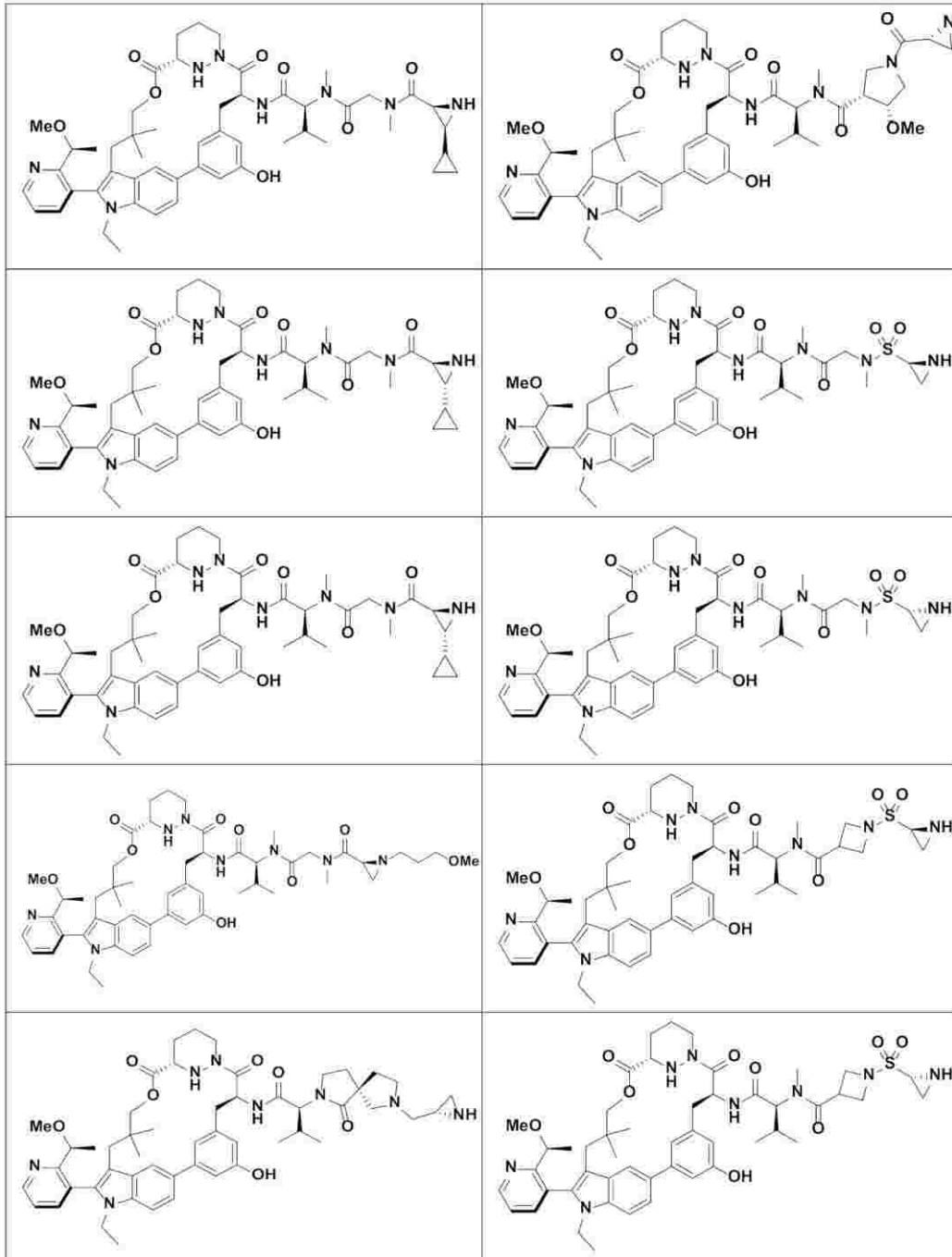
20

30

40

50

【化 8 - 3 0】



10

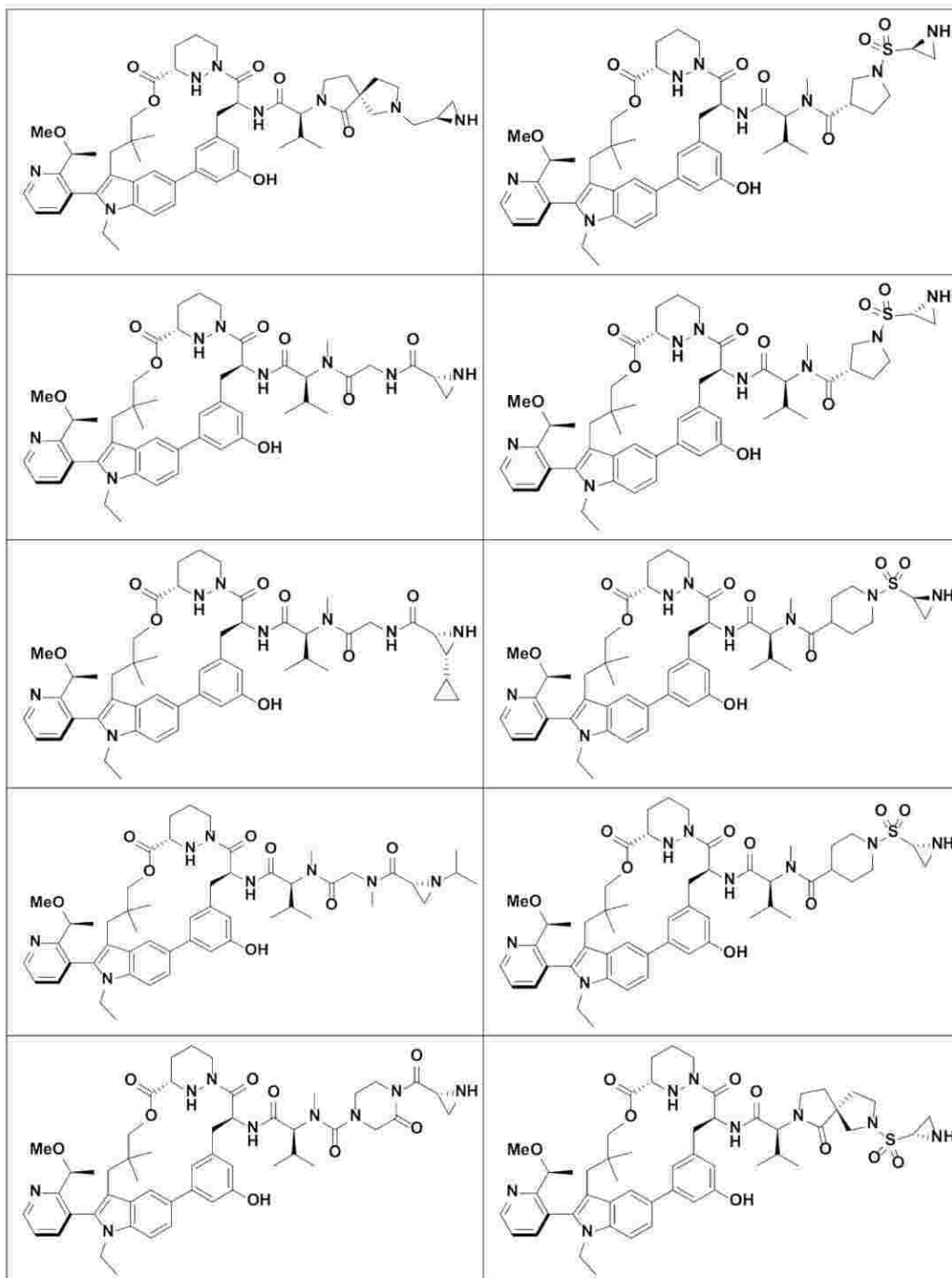
20

30

40

50

【化 8 - 3 1】



10

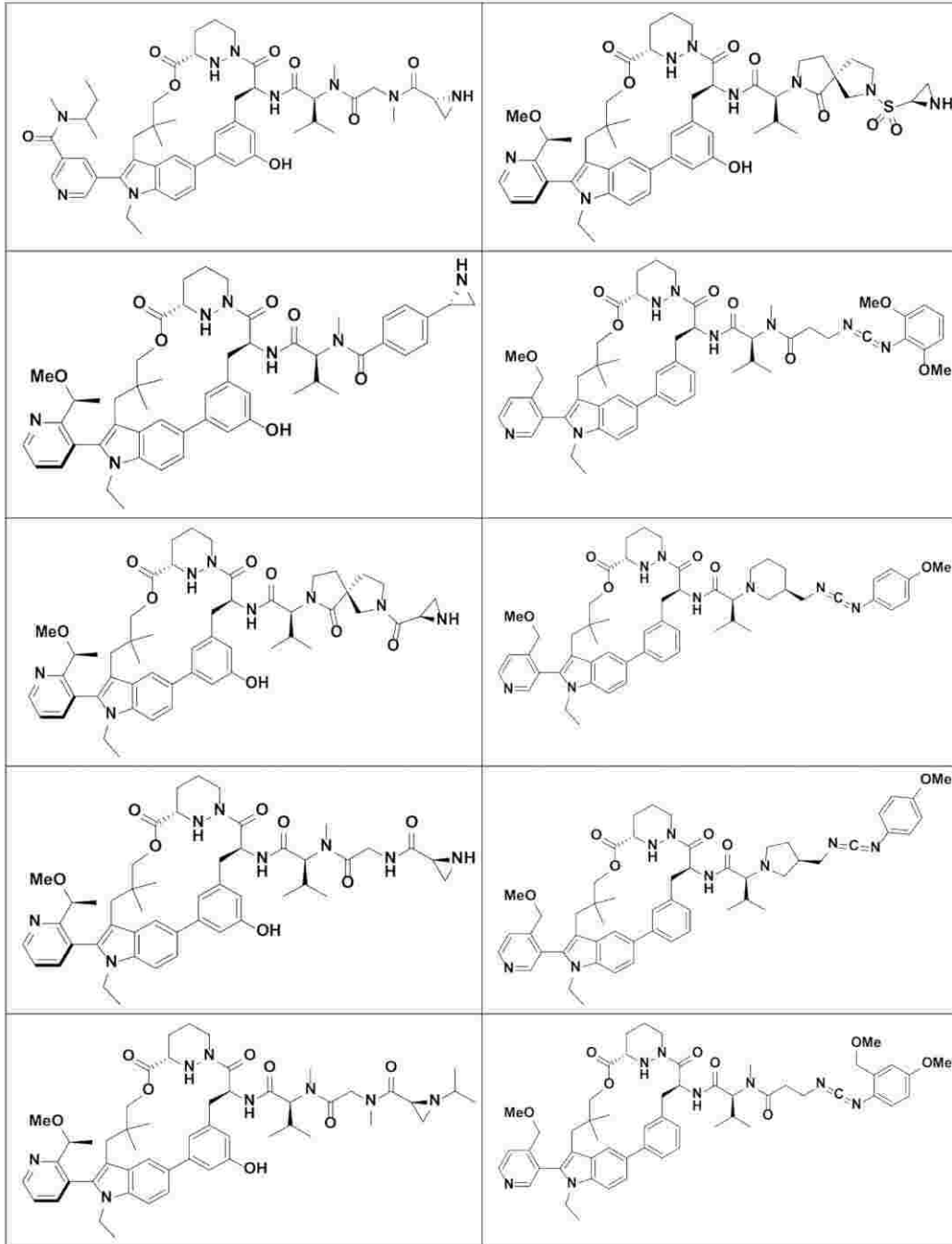
20

30

40

50

【化 8 - 3 2】



10

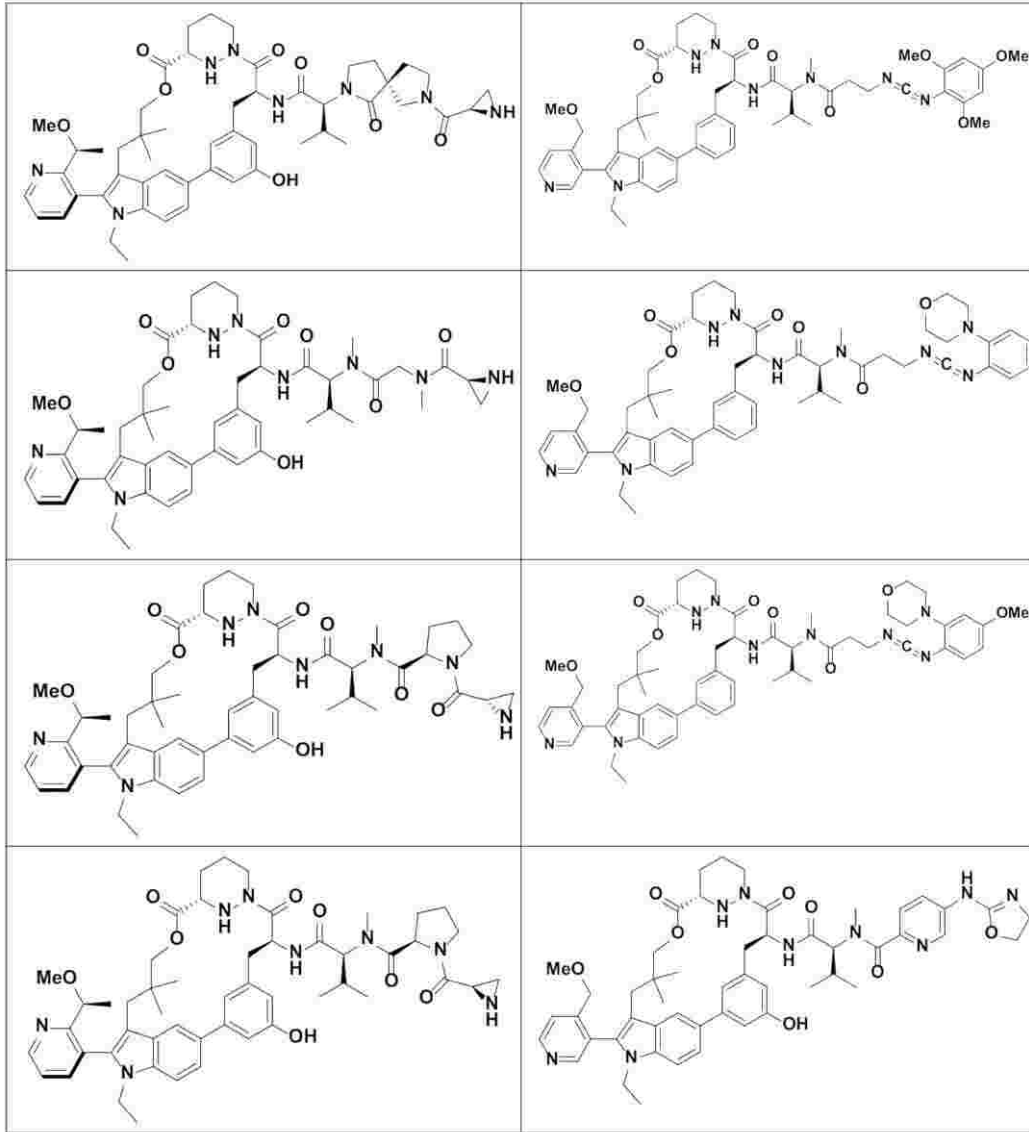
20

30

40

50

【化 8 - 3 3】



10

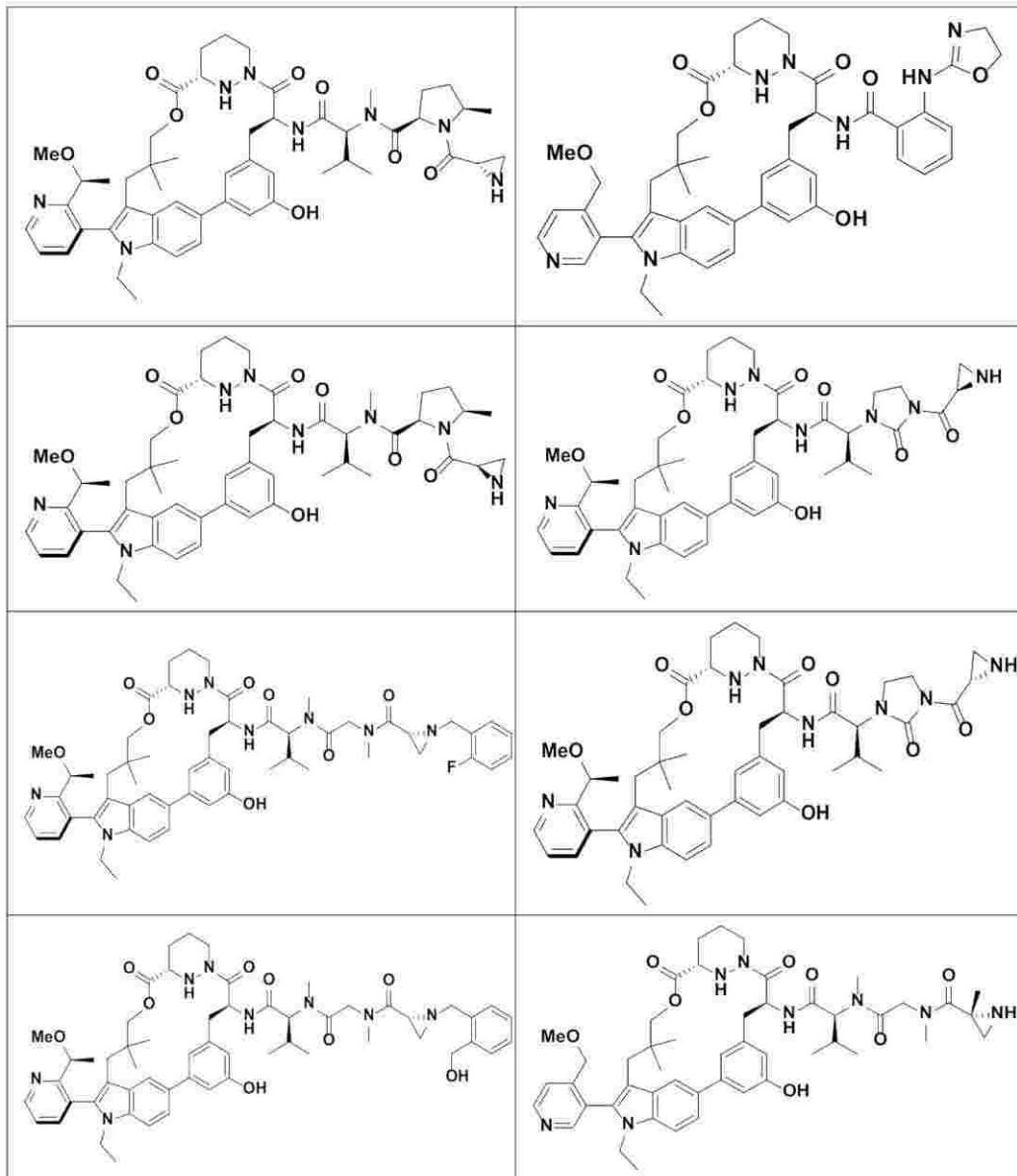
20

30

40

50

【化 8 - 3 4】



10

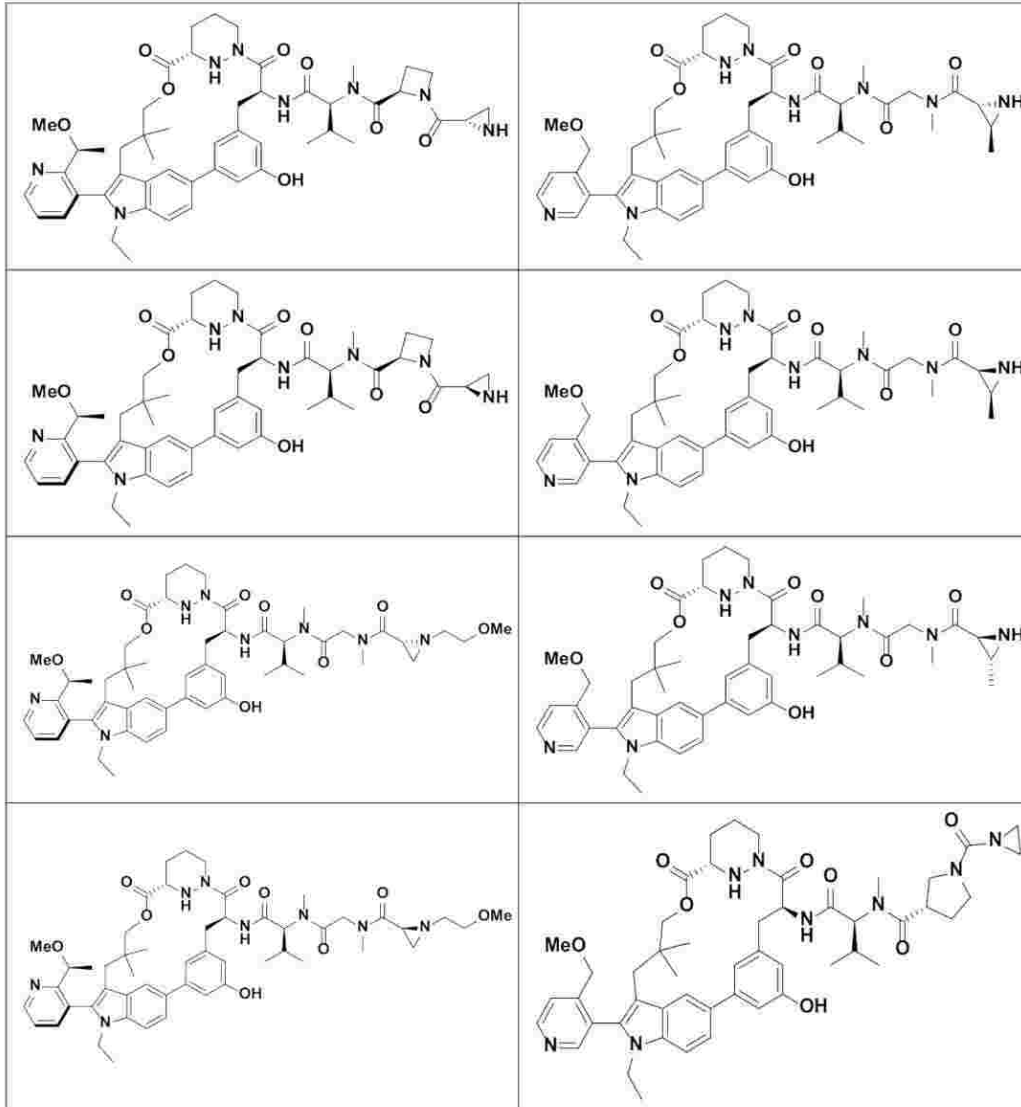
20

30

40

50

【化 8 - 3 5】



10

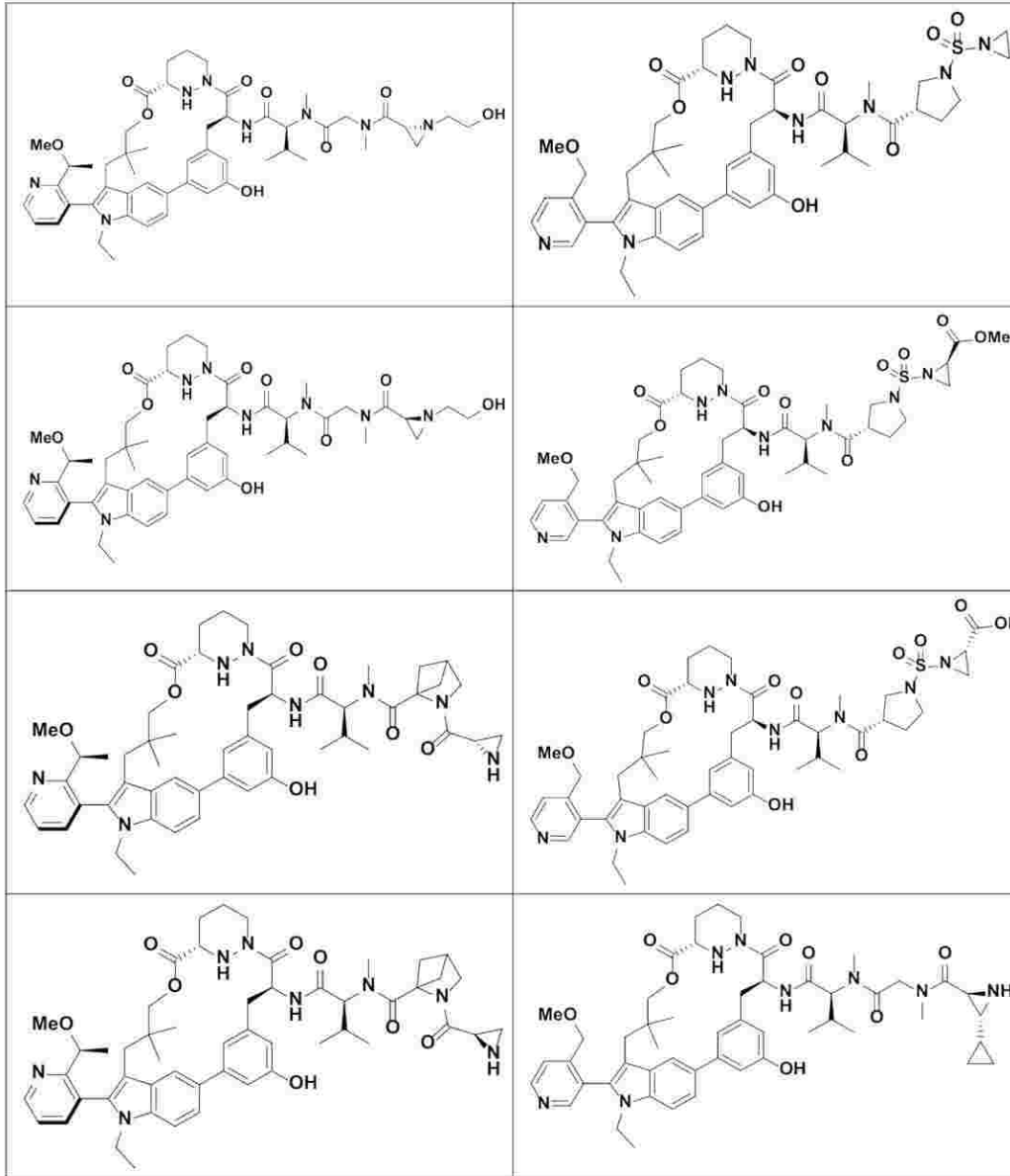
20

30

40

50

【化 8 - 3 6】



10

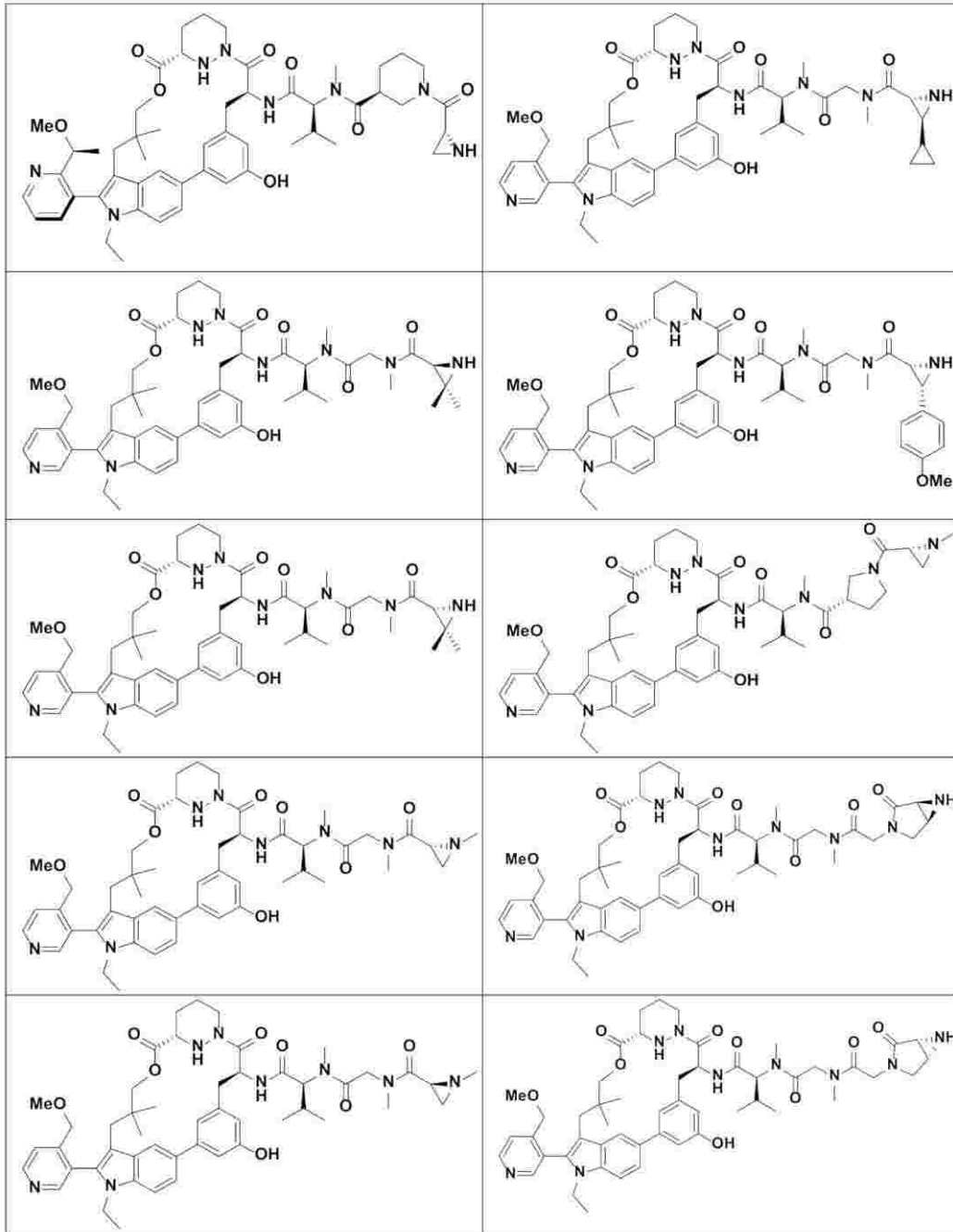
20

30

40

50

【化 8 - 3 7】



10

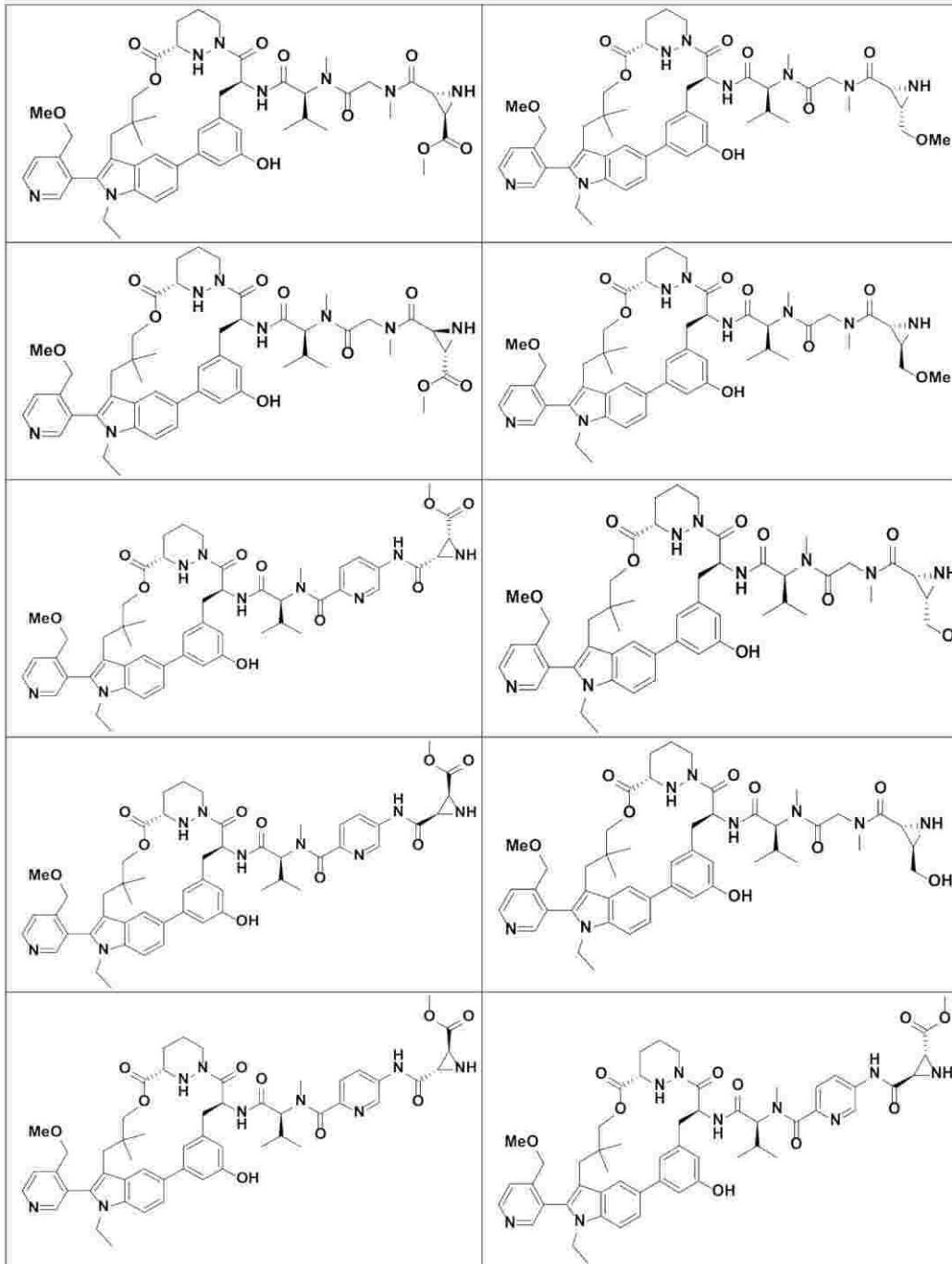
20

30

40

50

【化 8 - 3 8】

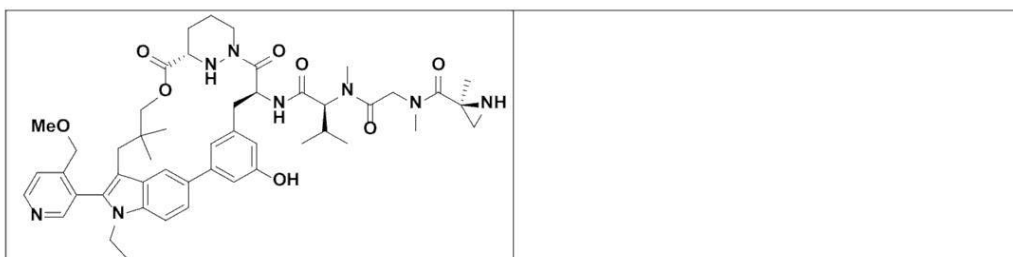


10

20

30

【化 8 - 3 9】



40

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 2 0】

50

請求項 1 ~ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、及び、薬学的に許容される賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 21】

がんの治療に使用するための、請求項 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

前記がんが膵癌、非小細胞肺癌、結腸直腸癌、または子宮体癌である、請求項 21 に記載の医薬組成物。

【請求項 23】

前記がんが R a s 変異を含む、請求項 21 または 22 に記載の医薬組成物。

【請求項 24】

前記 R a s 変異が K - R a s G 1 2 D または K - R a s G 1 3 D である、請求項 23 に記載の医薬組成物。

10

【請求項 25】

R a s タンパク質関連疾患の治療に使用するための、請求項 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 26】

前記医薬組成物が、追加の抗がん治療法と組み合わせて使用される、請求項 21 ~ 25 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 27】

前記追加の抗がん治療法が、E G F R 阻害剤、第 2 の R a s 阻害剤、S H P 2 阻害剤、S O S 1 阻害剤、R a f 阻害剤、M E K 阻害剤、E R K 阻害剤、P I 3 K 阻害剤、P T E N 阻害剤、A K T 阻害剤、m T O R C 1 阻害剤、B R A F 阻害剤、P D - L 1 阻害剤、P D - 1 阻害剤、C D K 4 / 6 阻害剤、H E R 2 阻害剤、またはこれらの組み合わせである、請求項 26 に記載の医薬組成物。

20

【請求項 28】

前記追加の抗がん治療法が S H P 2 阻害剤である、請求項 26 または 27 に記載の医薬組成物。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0006

【訂正方法】変更

30

【訂正の内容】

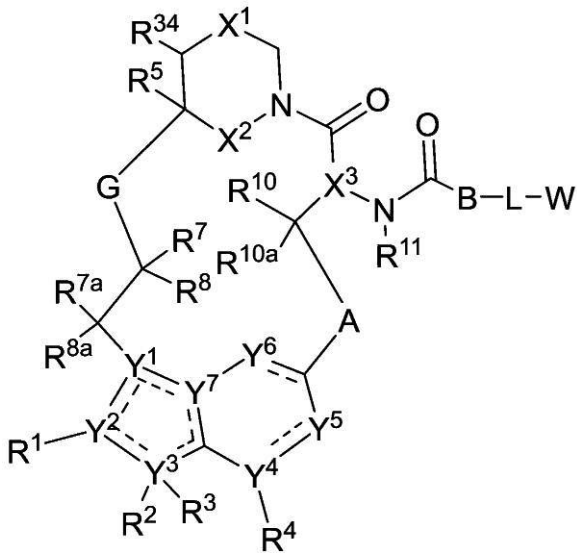
【0006】

そのため、いくつかの実施形態では、本開示は、構造式 I の化合物、またはその薬学的に許容される塩を特徴とする：

40

50

【化 1】



10

式 I

20

[式中、点線は 0、1、2、3、または 4 個の非隣接二重結合を示し、

A は - N (H または C H ₃) C (O) - (C H ₂) - [式中、アミノ窒素は、 - C H (R ¹⁰) - の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリーレンであり、

B は、 - C H (R ⁹) - または > C = C R ⁹ R ^{9'} [式中、炭素は、 - N (R ¹¹) C (O) - のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

G は、任意に置換された C ₁ - C ₄ アルキレン、任意に置換された C ₁ - C ₄ アルケニレン、任意に置換された C ₁ - C ₄ ヘテロアルキレン、 - C (O) O - C H (R ⁶) - [式中、2 番目の C は - C (R ⁷ R ⁸) - に結合している。]、 - C (O) N H - C H (R ⁶) - [式中、2 番目の C は - C (R ⁷ R ⁸) - に結合している。]、任意に置換された C ₁ - C ₄ ヘテロアルキレン、または 3 ~ 8 員のヘテロアリーレンであり、

30

L は存在しないか、またはリンカーであり、

W は、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N - エトキシカルボニル - 2 - エトキシ - 1, 2 - ジヒドロキノリン (E E D Q)、イソ E E D Q もしくは他の E E D Q 誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカルを含む架橋基であり、

40

X ¹ は、任意に置換された C ₁ - C ₂ アルキレン、N R、O、または S (O) _n であり、

X ² は O または N H であり、

X ³ は N または C H であり、

n は、0、1、または 2 であり、

R は、水素、シアノ、任意に置換された C ₁ - C ₄ アルキル、任意に置換された C ₂ - C ₄ アルケニル、任意に置換された C ₂ - C ₄ アルキニル、C (O) R '、C (O) O R '、C (O) N (R ') ₂、S (O) R '、S (O) ₂ R '、または S (O) ₂ N (R ') ₂ であり、

各 R ' は独立して、H または任意に置換された C ₁ - C ₄ アルキルであり、

50

Y^1 は、C、CH、またはNであり、

Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、及び Y^7 は独立して、CまたはNであり、

Y^5 は、CH、 CH_2 、またはNであり、

Y^6 は、C(O)、CH、 CH_2 、またはNであり、

R^1 は、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、任意に置換された3～6員のシクロアルケニル、任意に置換された3～6員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された6～10員のアリール、または、任意に置換された5～10員のヘテロアリールであるか、あるいは、

R^1 及び R^2 は、それらが結合する原子と共に組み合わせり、任意に置換された3～10員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^2 は、存在しないか、水素、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された6員のアリール、任意に置換された5または6員のヘテロアリールであり、 R^3 は存在しないか、あるいは、

R^2 及び R^3 は、それらが結合する原子と組み合わせり、任意に置換された3～8員のシクロアルキルまたは任意に置換された3～14員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^4 は存在しないか、水素、ハロゲン、シアノ、または、1～3個のハロゲンで任意に置換されたメチルであり、

R^5 は、水素、ハロゲンで任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、シアノ、ヒドロキシ、または $C_1 - C_4$ アルコキシ、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

R^6 は水素またはメチルであり、 R^7 は水素、ハロゲン、または、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、あるいは、

R^6 及び R^7 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、または任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^8 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された3～8員のシクロアルキル、任意に置換された3～14員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された5～10員のヘテロアリール、または、任意に置換された6～10員のアリールであるか、あるいは、

R^7 及び R^8 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、 $C = CR^7$ 、 R^8 、 $C = N(OH)$ 、 $C = N(O - C_1 - C_3$ アルキル)、 $C = O$ 、 $C = S$ 、 $C = NH$ 、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、または任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^{7a} 及び R^{8a} は独立して、水素、ハロ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、または、それらが結合する炭素と組み合わせり、カルボニルを形成し、

$R^{7'}$ は、水素、ハロゲン、または任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであり、 $R^{8'}$ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された3～8員のシクロアルキル、任意に置換された3～14員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された5～10員のヘテロアリール、または、任意に置換された6～10員のアリールであるか、あるいは、

$R^{7'}$ 及び $R^{8'}$ は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、または任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^9 は、水素、F、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、または、任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキルであるか、あるいは、

10

20

30

40

50

R⁹ 及び L は、それらが結合する原子と共に組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^{9'} は、水素または任意に置換された C₁ - C₆ アルキルであり、

R¹⁰ は、水素、ハロ、ヒドロキシ、C₁ - C₃ アルコキシ、または C₁ - C₃ アルキルであり、

R^{10a} は、水素またはハロであり、

R¹¹ は、水素または C₁ - C₃ アルキルであり、かつ、

R³⁴ は、水素または C₁ - C₃ アルキル（例えば、メチル）である。]。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

10

【訂正対象項目名】0008

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0008】

式 I V の構造を含むコンジュゲート、またはその塩をさらに提供する：M - L - P

式 I V

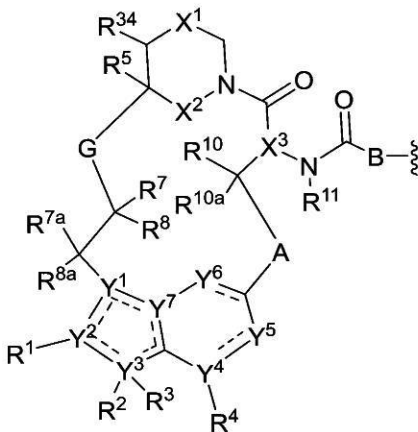
[式中、L はリンカーであり、

P は、一価の有機部分であり、

M は、式 V の構造を有する。]

【化 2】

20



30

式 V

[式中、点線は 0、1、2、3、または 4 個の非隣接二重結合を示し、

A は - N (H または C H₃) C (O) - (C H₂) - [式中、アミノ窒素は、 - C H (R¹⁰) - の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

40

B は、 - C H (R⁹) - または > C = C R⁹ R^{9'} [式中、炭素は、 - N (R¹¹) C (O) - のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

G は、任意に置換された C₁ - C₄ アルキレン、任意に置換された C₁ - C₄ アルケニレン、任意に置換された C₁ - C₄ ヘテロアルキレン、 - C (O) O - C H (R⁶) - [式中、2 番目の C は - C (R⁷ R⁸) - に結合している。]、 - C (O) N H - C H (R⁶) - [式中、2 番目の C は - C (R⁷ R⁸) - に結合している。]、任意に置換された C₁ - C₄ ヘテロアルキレン、または 3 ~ 8 員のヘテロアリーレンであり、

50

X^1 は、任意に置換された $C_1 - C_2$ アルキレン、 NR 、 O 、または $S(O)_n$ であり、

X^2 は O または NH であり、

X^3 は N または CH であり、

n は、 0 、 1 、または 2 であり、

R は、水素、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_4$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C(O)R'$ 、 $C(O)OR'$ 、 $C(O)N(R')_2$ 、 $S(O)R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、または $S(O)_2N(R')_2$ であり、

各 R' は独立して、 H または任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキルであり、

Y^1 は、 C 、 CH 、または N であり、

Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、及び Y^7 は独立して、 C または N であり、

Y^5 は、 CH 、 CH_2 、または N であり、

Y^6 は、 $C(O)$ 、 CH 、 CH_2 、または N であり、

R^1 は、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された $3 \sim 6$ 員のシクロアルキル、任意に置換された $3 \sim 6$ 員のシクロアルケニル、任意に置換された $3 \sim 6$ 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された $6 \sim 10$ 員のアリール、または、任意に置換された $5 \sim 10$ 員のヘテロアリールであるか、あるいは、

R^1 及び R^2 は、それらが結合する原子と共に組み合わせたり、任意に置換された $3 \sim 14$ 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^2 は、存在しないか、水素、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された $3 \sim 6$ 員のシクロアルキル、任意に置換された $3 \sim 7$ 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 6 員のアリール、任意に置換された 5 または 6 員のヘテロアリールであり、 R^3 は存在しないか、あるいは、

R^2 及び R^3 は、それらが結合する原子と組み合わせたり、任意に置換された $3 \sim 8$ 員のシクロアルキルまたは任意に置換された $3 \sim 14$ 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^4 は存在しないか、水素、ハロゲン、シアノ、または、 $1 \sim 3$ 個のハロゲンで任意に置換されたメチルであり、

R^5 は、水素、ハロゲンで任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、シアノ、ヒドロキシ、または $C_1 - C_4$ アルコキシ、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

R^6 は水素またはメチルであり、 R^7 は水素、ハロゲン、または、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、あるいは、

R^6 及び R^7 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせたり、任意に置換された $3 \sim 6$ 員のシクロアルキル、または任意に置換された $3 \sim 7$ 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^8 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された $3 \sim 8$ 員のシクロアルキル、任意に置換された $3 \sim 14$ 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された $5 \sim 10$ 員のヘテロアリール、または、任意に置換された $6 \sim 10$ 員のアリールであるか、あるいは、

R^7 及び R^8 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせたり、 $C = CR^7$ 、 R^8 ； $C = N(OH)$ 、 $C = N(O - C_1 - C_3 \text{ アルキル})$ 、 $C = O$ 、 $C = S$ 、 $C = NH$ 、任意に置換された $3 \sim 6$ 員のシクロアルキル、または任意に置換された $3 \sim 7$ 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^7^a 及び R^8^a は独立して、水素、ハロ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、または、それらが結合する炭素と組み合わせたり、カルボニルを形成し、

R^7' は、水素、ハロゲン、または任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであり、 R^8' は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、

10

20

30

40

50

レン、または、任意に置換された5～10員のヘテロアリーレンであり、

Bは、 $-CH(R^9)$ - または $>C=CR^9R^9$ [式中、炭素は、 $-N(R^{11})C(O)$ - のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された3～6員のシクロアルキレン、任意に置換された3～6員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された6員のアリーレン、または5～6員のヘテロアリーレンであり、

Gは、任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキレン、任意に置換された $C_1 - C_4$ アルケニレン、任意に置換された $C_1 - C_4$ ヘテロアルキレン、 $-C(O)O-CH(R^6)$ - [式中、2番目のCは $-C(R^7R^8)$ - に結合している。]、 $-C(O)NH-CH(R^6)$ - [式中、2番目のCは $-C(R^7R^8)$ - に結合している。]、任意に置換された $C_1 - C_4$ ヘテロアルキレン、または3～8員のヘテロアリーレンであり、

10

Lは存在しないか、またはリンカーであり、

Wは、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N-エトキシカルボニル-2-エトキシ-1,2-ジヒドロキノリン(EEDQ)、イソEEDQもしくは他のEEDQ誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカールを含む架橋基であり、

X^1 は、任意に置換された $C_1 - C_2$ アルキレン、NR、O、または $S(O)_n$ であり、

X^2 はOまたはNHであり、

X^3 はNまたはCHであり、

20

nは、0、1、または2であり、

Rは、水素、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_4$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C(O)R'$ 、 $C(O)OR'$ 、 $C(O)N(R')_2$ 、 $S(O)R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、または $S(O)_2N(R')_2$ であり、

各 R' は独立して、Hまたは任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキルであり、

Y^1 は、C、CH、またはNであり、

Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、及び Y^7 は独立して、CまたはNであり、

Y^5 は、CH、 CH_2 、またはNであり、

Y^6 は、 $C(O)$ 、CH、 CH_2 、またはNであり、

30

R^1 は、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、任意に置換された3～6員のシクロアルケニル、任意に置換された3～6員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された6～10員のアリール、または、任意に置換された5～10員のヘテロアリールであるか、あるいは、

R^1 及び R^2 は、それらが結合する原子と共に組み合わせたり、任意に置換された3～14員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^2 は、存在しないか、水素、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された6員のアリール、任意に置換された5または6員のヘテロアリールであり、 R^3 は存在しないか、あるいは、

40

R^2 及び R^3 は、それらが結合する原子と組み合わせたり、任意に置換された3～8員のシクロアルキルまたは任意に置換された3～14員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^4 は存在しないか、水素、ハロゲン、シアノ、または、1～3個のハロゲンで任意に置換されたメチルであり、

R^5 は、水素、ハロゲンで任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、シアノ、ヒドロキシ、または $C_1 - C_4$ アルコキシ、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

R^6 は水素またはメチルであり、 R^7 は水素、ハロゲン、または、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、あるいは、

50

R⁶ 及び R⁷ は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R⁸ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された C₁ - C₃ アルコキシル、任意に置換された C₁ - C₃ アルキル、任意に置換された C₂ - C₆ アルケニル、任意に置換された C₂ - C₆ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R⁷ 及び R⁸ は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、C = CR^{7'}, R^{8'}; C = N(OH)、C = N(O - C₁ - C₃ アルキル)、C = O、C = S、C = NH、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^{7a} 及び R^{8a} は独立して、水素、ハロ、任意に置換された C₁ - C₃ アルキルであるか、または、それらが結合する炭素と組み合わせり、カルボニルを形成し、

R^{7'} は、水素、ハロゲン、または任意に置換された C₁ - C₃ アルキルであり、R^{8'} は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された C₁ - C₃ アルコキシル、任意に置換された C₁ - C₃ アルキル、任意に置換された C₂ - C₆ アルケニル、任意に置換された C₂ - C₆ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R^{7'} 及び R^{8'} は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R⁹ は、水素、F、任意に置換された C₁ - C₆ アルキル、任意に置換された C₁ - C₆ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであるか、あるいは、

R⁹ 及び L は、それらが結合する原子と共に組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^{9'} は、水素または任意に置換された C₁ - C₆ アルキルであり、

R¹⁰ は、水素、ハロ、ヒドロキシ、C₁ - C₃ アルコキシ、または C₁ - C₃ アルキルであり、

R^{10a} は、水素またはハロであり、かつ、

R¹¹ は、水素または C₁ - C₃ アルキルであり、かつ、

R³⁴ は、水素または C₁ - C₃ アルキル (例えば、メチル) である。]。

【誤訳訂正 5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0085

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0085】

いくつかの実施形態では、本発明の化合物は、式 I a の構造、またはその薬学的に許容される塩を有する：

10

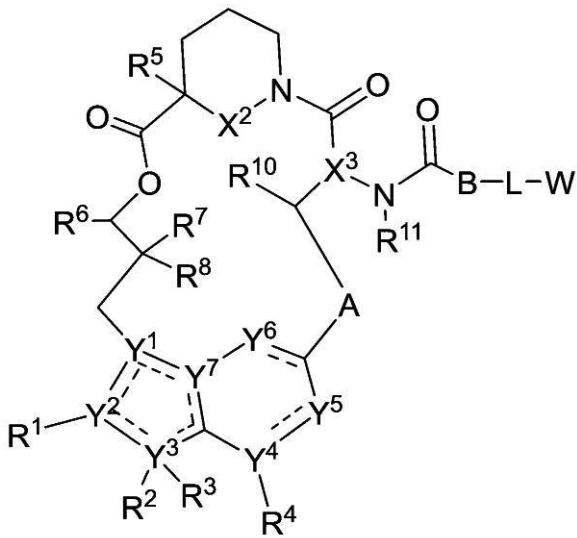
20

30

40

50

【化 7】



10

式 I a

20

[式中、点線は 0、1、2、3、または 4 個の非隣接二重結合を示し、

A は - N (H または C H ₃) C (O) - (C H ₂) - [式中、アミノ窒素は、 - C H (R ¹⁰) - の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

B は、 - C H (R ⁹) - [式中、炭素は、 - N (R ¹¹) C (O) - のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

L は存在しないか、またはリンカーであり、

30

W は、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N - エトキシカルボニル - 2 - エトキシ - 1, 2 - ジヒドロキノリン (E E D Q)、イソ E E D Q もしくは他の E E D Q 誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカールを含む架橋基であり、

X ² は O または N H であり、

X ³ は N または C H であり、

n は、0、1、または 2 であり、

R は、水素、シアノ、任意に置換された C ₁ - C ₄ アルキル、任意に置換された C ₂ - C ₄ アルケニル、任意に置換された C ₂ - C ₄ アルキニル、C (O) R '、C (O) O R '、C (O) N (R ') ₂、S (O) R '、S (O) ₂ R '、または S (O) ₂ N (R ') ₂ であり、

40

各 R ' は独立して、H または任意に置換された C ₁ - C ₄ アルキルであり、

Y ¹ は、C、C H、または N であり、

Y ²、Y ³、Y ⁴、及び Y ⁷ は独立して、C または N であり、

Y ⁵ 及び Y ⁶ は独立して、C H または N であり、

R ¹ は、シアノ、任意に置換された C ₁ - C ₆ アルキル、任意に置換された C ₁ - C ₆ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルケニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリール、または、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリールで

50

あり、

R^2 は、水素、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 6 員のアリール、任意に置換された 5 または 6 員のヘテロアリールであり、 R^3 は存在しないか、あるいは、

R^2 及び R^3 は、それらが結合する原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキルまたは任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^4 は存在しないか、水素、ハロゲン、シアノ、または、1 ~ 3 個のハロゲンで任意に置換されたメチルであり、

R^5 は、水素、ハロゲンで任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、シアノ、ヒドロキシ、または $C_1 - C_4$ アルコキシ、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

R^6 は水素またはメチルであり、 R^7 は水素、ハロゲン、または、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、あるいは、

R^6 及び R^7 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^8 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシル、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R^7 及び R^8 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、 $C = CR^7, R^8$; $C = N(OH)$ 、 $C = N(O - C_1 - C_3 \text{ アルキル})$ 、 $C = O$ 、 $C = S$ 、 $C = NH$ 、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^7 は、水素、ハロゲン、または任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであり、 R^8 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシル、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R^7 及び R^8 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^9 は、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであり、

R^{10} は、水素、ヒドロキシ、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、または $C_1 - C_3$ アルキルであり、かつ、

R^{11} は、水素または $C_1 - C_3$ アルキルである。]。

【誤訳訂正 6】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0088

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0088】

いくつかの実施形態では、本発明の化合物は、式 I b の構造、またはその薬学的に許容される塩を有する：

10

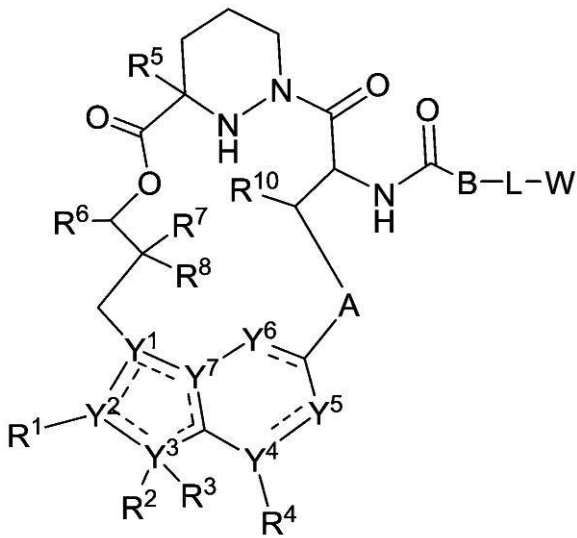
20

30

40

50

【化 8】



10

式 I b

20

[式中、点線は 0、1、2、3、または 4 個の非隣接二重結合を示し、

A は - N (H または C H ₃) C (O) - (C H ₂) - [式中、アミノ窒素は、 - C H (R ¹⁰) - の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

B は、 - C H (R ⁹) - [式中、炭素は、 - N H C (O) - のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

L は存在しないか、またはリンカーであり、

30

W は、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N - エトキシカルボニル - 2 - エトキシ - 1, 2 - ジヒドロキノリン (E E D Q)、イソ E E D Q もしくは他の E E D Q 誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカールを含む架橋基であり、

n は、0、1、または 2 であり、

R は、水素、シアノ、任意に置換された C ₁ - C ₄ アルキル、任意に置換された C ₂ - C ₄ アルケニル、任意に置換された C ₂ - C ₄ アルキニル、C (O) R '、C (O) O R '、C (O) N (R ') ₂、S (O) R '、S (O) ₂ R '、または S (O) ₂ N (R ') ₂ であり、

40

各 R ' は独立して、H または任意に置換された C ₁ - C ₄ アルキルであり、

Y ¹ は、C、C H、または N であり、

Y ²、Y ³、Y ⁴、及び Y ⁷ は独立して、C または N であり、

Y ⁵ 及び Y ⁶ は独立して、C H または N であり、

R ¹ は、シアノ、任意に置換された C ₁ - C ₆ アルキル、任意に置換された C ₁ - C ₆ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルケニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリール、または、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリールであり、

R ² は、水素、任意に置換された C ₁ - C ₆ アルキル、任意に置換された C ₂ - C ₆ ア

50

ルケニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 6 員のアリール、任意に置換された 5 または 6 員のヘテロアリールであり、 R^3 は存在しないか、あるいは、

R^2 及び R^3 は、それらが結合する原子と組み合わせたり、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキルまたは任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^4 は存在しないか、水素、ハロゲン、シアノ、または、1 ~ 3 個のハロゲンで任意に置換されたメチルであり、

R^5 は、水素、ハロゲンで任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、シアノ、ヒドロキシ、または $C_1 - C_4$ アルコキシ、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

R^6 は水素またはメチルであり、 R^7 は水素、ハロゲン、または、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、あるいは、

R^6 及び R^7 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせたり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^8 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R^7 及び R^8 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせたり、 $C = CR^7, R^8$; $C = N(OH)$ 、 $C = N(O - C_1 - C_3 \text{ アルキル})$ 、 $C = O$ 、 $C = S$ 、 $C = NH$ 、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^7 は、水素、ハロゲン、または任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであり、 R^8 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R^7 及び R^8 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせたり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^9 は、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであり、かつ、

R^{10} は、水素、ヒドロキシ、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、または $C_1 - C_3$ アルキルである。]。

【誤訳訂正 7】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0093

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0093】

いくつかの実施形態では、本発明の化合物は、式 Ic の構造、またはその薬学的に許容される塩を有する：

10

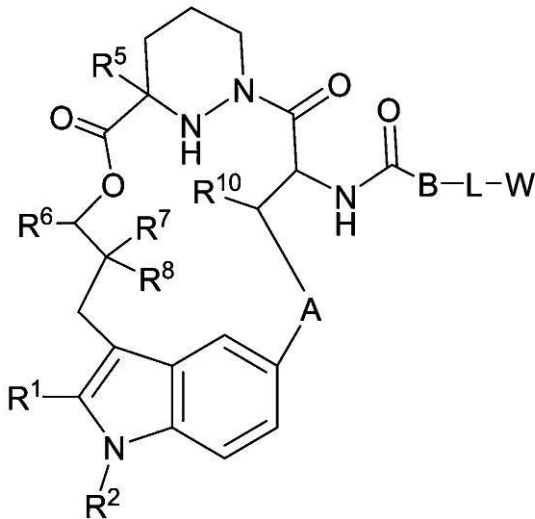
20

30

40

50

【化 9】



10

式 I c

[式中、A は - N (H または C H ₃) C (O) - (C H ₂) - [式中、アミノ窒素は、
- C H (R ¹⁰) - の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアル
キレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員
のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

20

B は、- C H (R ⁹) - [式中、炭素は、- N H C (O) - のカルボニル炭素に結合す
るもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員の
ヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロ
アリーレンであり、

L は存在しないか、またはリンカーであり、

W は、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチル
チオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、ト
リフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N - エトキシカルボニル - 2 -
エトキシ - 1 , 2 - ジヒドロキノリン (E E D Q)、イソ E E D Q もしくは他の E E D Q
誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリコールを含む架橋基であり、

30

R ¹ は、シアノ、任意に置換された C ₁ - C ₆ アルキル、任意に置換された C ₁ - C ₆
ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6
員のシクロアルケニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換
された 6 ~ 10 員のアリール、または、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリールで
あり、

R ² は、水素、任意に置換された C ₁ - C ₆ アルキル、任意に置換された C ₂ - C ₆ ア
ルケニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘ
テロシクロアルキル、任意に置換された 6 員のアリール、任意に置換された 5 または 6 員
のヘテロアリールであり、R ³ は存在しないか、あるいは、

40

R ² 及び R ³ は、それらが結合する原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 8 員の
シクロアルキルまたは任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R ⁵ は、水素、ハロゲンで任意に置換された C ₁ - C ₄ アルキル、シアノ、ヒドロキシ
、または C ₁ - C ₄ アルコキシ、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

R ⁶ は水素またはメチルであり、R ⁷ は水素、ハロゲン、または、任意に置換された C
1 - C ₃ アルキルであるか、あるいは、

R ⁶ 及び R ⁷ は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 6
員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し

50

R⁸ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された C₁ - C₃ アルコキシル、任意に置換された C₁ - C₃ アルキル、任意に置換された C₂ - C₆ アルケニル、任意に置換された C₂ - C₆ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R⁷ 及び R⁸ は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、C = C R⁷ ' R⁸ ' ; C = N (OH)、C = N (O - C₁ - C₃ アルキル)、C = O、C = S、C = NH、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

10

R⁷ ' は、水素、ハロゲン、または任意に置換された C₁ - C₃ アルキルであり、R⁸ ' は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された C₁ - C₃ アルコキシル、任意に置換された C₁ - C₃ アルキル、任意に置換された C₂ - C₆ アルケニル、任意に置換された C₂ - C₆ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R⁷ ' 及び R⁸ ' は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R⁹ は、任意に置換された C₁ - C₆ アルキル、任意に置換された C₁ - C₆ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであり、かつ、

20

R¹⁰ は、水素、ヒドロキシ、C₁ - C₃ アルコキシ、または C₁ - C₃ アルキルである。】。

【誤訳訂正 8】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0098

【訂正方法】変更

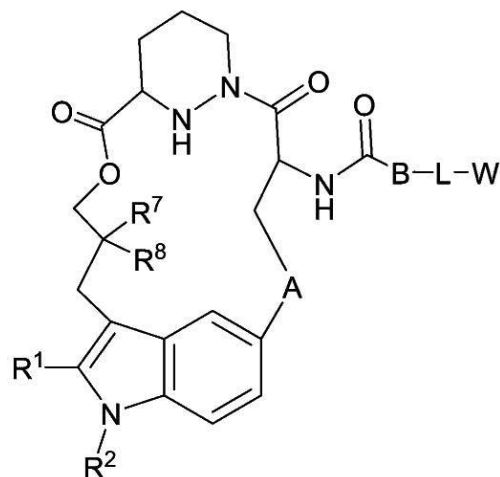
【訂正の内容】

【0098】

30

いくつかの実施形態では、本発明の化合物は、式 I d の構造、またはその薬学的に許容される塩を有する：

【化 10】



40

式 I d

50

[式中、Aは - N (H または C H ₃) C (O) - (C H ₂) - [式中、アミノ窒素は、
- C H (R ¹⁰) - の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

Bは、- C H (R ⁹) - [式中、炭素は、- N H C (O) - のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

Lは存在しないか、またはリンカーであり、

Wは、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N - エトキシカルボニル - 2 - エトキシ - 1 , 2 - ジヒドロキノリン (E E D Q)、イソ E E D Q もしくは他の E E D Q 誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカールを含む架橋基であり、

R ¹ は、シアノ、任意に置換された C ₁ - C ₆ アルキル、任意に置換された C ₁ - C ₆ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルケニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリール、または、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリールであり、

R ² は、C ₁ - C ₆ アルキルまたは 3 ~ 6 員のシクロアルキルであり、

R ⁷ は C ₁ - C ₃ アルキルであり、

R ⁸ は C ₁ - C ₃ アルキルであり、かつ、

R ⁹ は、任意に置換された C ₁ - C ₆ アルキル、任意に置換された C ₁ - C ₆ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルである。]。

【誤訳訂正 9】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0100

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0100】

いくつかの実施形態では、本発明の化合物は、式 I e の構造、またはその薬学的に許容される塩を有する：

10

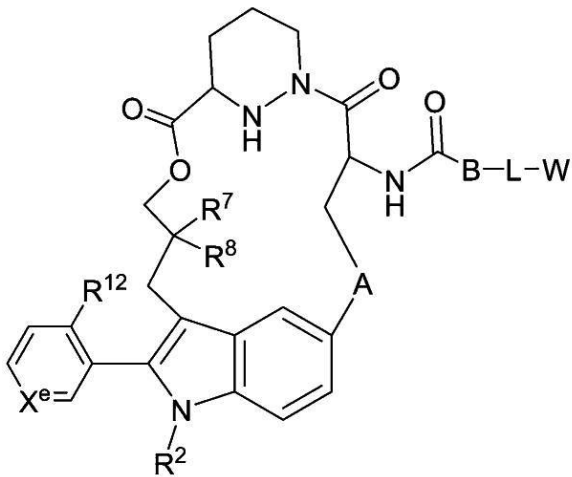
20

30

40

50

【化 1 1】



式 I e

[式中、A は - N (H または C H ₃) C (O) - (C H ₂) - [式中、アミノ窒素は、
- C H (R ¹⁰) - の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

B は、- C H (R ⁹) - [式中、炭素は、- N H C (O) - のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

L は存在しないか、またはリンカーであり、

W は、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N - エトキシカルボニル - 2 - エトキシ - 1 , 2 - ジヒドロキノリン (E E D Q)、イソ E E D Q もしくは他の E E D Q 誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカールを含む架橋基であり、

R ² は、C ₁ - C ₆ アルキルまたは 3 ~ 6 員のシクロアルキルであり、

R ⁷ は C ₁ - C ₃ アルキルであり、

R ⁸ は C ₁ - C ₃ アルキルであり、かつ、

R ⁹ は、任意に置換された C ₁ - C ₆ アルキル、任意に置換された C ₁ - C ₆ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであり、

X ^e は N または C H であり、かつ、

R ¹² は、任意に置換された C ₁ - C ₆ アルキル、または任意に置換された C ₁ - C ₆ ヘテロアルキルである。]。

【誤訳訂正 1 0】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 1 0 3

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 1 0 3】

いくつかの実施形態では、本発明の化合物は、式 I f の構造、またはその薬学的に許容される塩を有する：

10

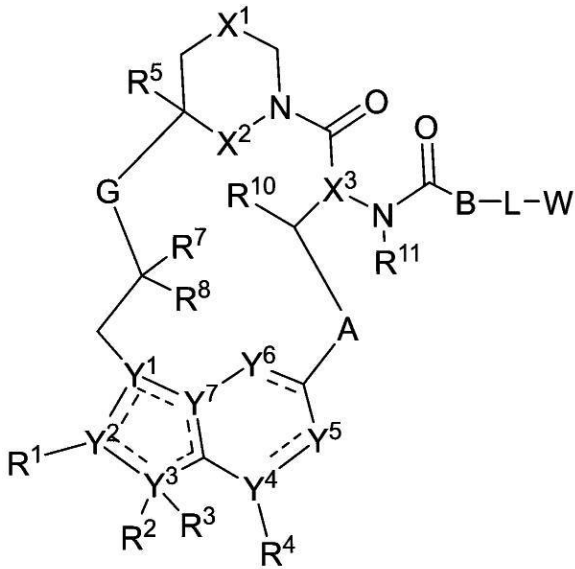
20

30

40

50

【化 1 4】



10

式 I f

20

[式中、点線は 0、1、2、3、または 4 個の非隣接二重結合を示し、

A は - N (H または CH_3) C (O) - (CH_2) - [式中、アミノ窒素は、 - CH (R^{10}) - の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

B は、 - CH (R^9) - [式中、炭素は、 - N (R^{11}) C (O) - のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

30

G は、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキレン、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルケニレン、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ヘテロアルキレン、 - C (O) O - CH (R^6) - [式中、2 番目の C は - C ($\text{R}^7 \text{R}^8$) - に結合している。]、 - C (O) NH - CH (R^6) - [式中、2 番目の C は - C ($\text{R}^7 \text{R}^8$) - に結合している。]、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ヘテロアルキレン、または 3 ~ 8 員のヘテロアリーレンであり、

L は存在しないか、またはリンカーであり、

W は、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N - エトキシカルボニル - 2 - エトキシ - 1, 2 - ジヒドロキノリン (E E D Q)、イソ E E D Q もしくは他の E E D Q 誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカールを含む架橋基であり、

40

X^1 は、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_2$ アルキレン、NR、O、または $\text{S}(\text{O})_n$ であり、

X^2 は O または NH であり、

X^3 は N または CH であり、

n は、0、1、または 2 であり、

R は、水素、シアノ、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキル、任意に置換された $\text{C}_2 - \text{C}_4$ アルケニル、任意に置換された $\text{C}_2 - \text{C}_4$ アルキニル、C (O) R' 、C (O) O R' 、C (O) N (R')₂、S (O) R' 、S (O)₂ R' 、または S (O)₂ N (R')₂ であり、

50

各 R¹ は独立して、H または任意に置換された C₁ - C₄ アルキルであり、

Y¹ は、C、CH、または N であり、

Y²、Y³、Y⁴、及び Y⁷ は独立して、C または N であり、

Y⁵ 及び Y⁶ は独立して、CH または N であり、

R¹ は、シアノ、任意に置換された C₁ - C₆ アルキル、任意に置換された C₁ - C₆ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルケニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリール、または、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリールであり、

R² は、水素、任意に置換された C₁ - C₆ アルキル、任意に置換された C₂ - C₆ アルケニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 6 員のアリール、任意に置換された 5 または 6 員のヘテロアリールであり、R³ は存在しないか、あるいは、

R² 及び R³ は、それらが結合する原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキルまたは任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R⁴ は存在しないか、水素、ハロゲン、シアノ、または、1 ~ 3 個のハロゲンで任意に置換されたメチルであり、

R⁵ は、水素、ハロゲンで任意に置換された C₁ - C₄ アルキル、シアノ、ヒドロキシ、または C₁ - C₄ アルコキシ、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

R⁶ は水素またはメチルであり、R⁷ は水素、ハロゲン、または、任意に置換された C₁ - C₃ アルキルであるか、あるいは、

R⁶ 及び R⁷ は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R⁸ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された C₁ - C₃ アルコキシ、任意に置換された C₁ - C₃ アルキル、任意に置換された C₂ - C₆ アルケニル、任意に置換された C₂ - C₆ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R⁷ 及び R⁸ は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、C = C R⁷、R⁸、; C = N(OH)、C = N(O - C₁ - C₃ アルキル)、C = O、C = S、C = NH、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R⁷ は、水素、ハロゲン、または任意に置換された C₁ - C₃ アルキルであり、R⁸ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された C₁ - C₃ アルコキシ、任意に置換された C₁ - C₃ アルキル、任意に置換された C₂ - C₆ アルケニル、任意に置換された C₂ - C₆ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R⁷ 及び R⁸ は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R⁹ は、任意に置換された C₁ - C₆ アルキル、任意に置換された C₁ - C₆ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであり、

R¹⁰ は、水素、ヒドロキシ、C₁ - C₃ アルコキシ、または C₁ - C₃ アルキルであり、かつ、

R¹¹ は、水素または C₁ - C₃ アルキルである。]。

【誤訳訂正 1 1】

【訂正対象書類名】明細書

10

20

30

40

50

【訂正対象項目名】 0 1 0 4

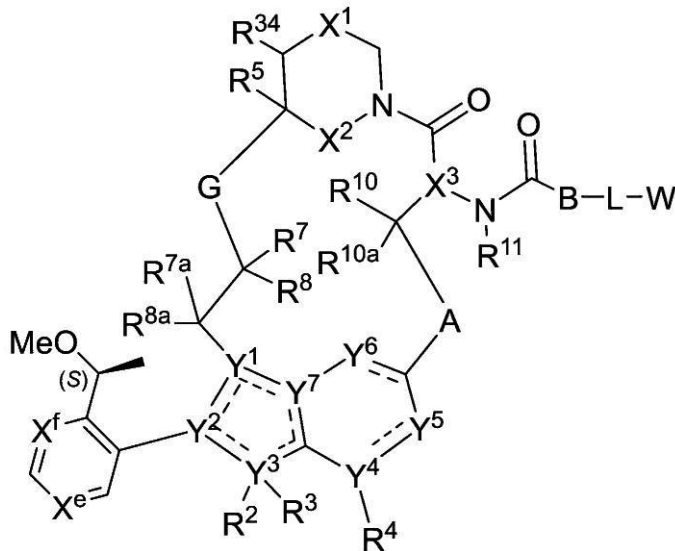
【訂正方法】 変更

【訂正の内容】

【 0 1 0 4 】

いくつかの実施形態では、本発明の化合物は、式 V I の構造、またはその薬学的に許容される塩を有する：

【化 1 5 】



式 V I

[式中、点線は 0、1、2、3、または 4 個の非隣接二重結合を示し、

A は - N (H または C H ₃) C (O) - (C H ₂) - [式中、アミノ窒素は、 - C H (R ¹⁰) - の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン (例えば、フェニルもしくはフェノール)、または、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリーレンであり、

B は、 - C H (R ⁹) - または > C = C R ⁹ R ⁹ ' [式中、炭素は、 - N (R ¹¹) C (O) - のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

G は、任意に置換された C ₁ - C ₄ アルキレン、任意に置換された C ₁ - C ₄ アルケニレン、任意に置換された C ₁ - C ₄ ヘテロアルキレン、 - C (O) O - C H (R ⁶) - [式中、2 番目の C は - C (R ⁷ R ⁸) - に結合している。]、 - C (O) N H - C H (R ⁶) - [式中、2 番目の C は - C (R ⁷ R ⁸) - に結合している。]、任意に置換された C ₁ - C ₄ ヘテロアルキレン、または 3 ~ 8 員のヘテロアリーレンであり、

L は存在しないか、またはリンカーであり、

W は、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N - エトキシカルボニル - 2 - エトキシ - 1, 2 - ジヒドロキノリン (E E D Q)、イソ E E D Q もしくは他の E E D Q 誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカルを含む架橋基であり、

X ¹ は、任意に置換された C ₁ - C ₂ アルキレン、N R、O、または S (O) _n であり、

X ² は O または N H であり、

10

20

30

40

50

X^3 は N または CH であり、

n は、0、1、または 2 であり、

R は、水素、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_4$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C(O)R'$ 、 $C(O)OR'$ 、 $C(O)N(R')_2$ 、 $S(O)R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、または $S(O)_2N(R')_2$ であり、

各 R' は独立して、H または任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキルであり、

Y^1 は、C、CH、または N であり、

Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、及び Y^7 は独立して、C または N であり、

Y^5 は、CH、 CH_2 、または N であり、

Y^6 は、 $C(O)$ 、CH、 CH_2 、または N であり、

R^2 は、存在しないか、水素、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 6 員のアリール、任意に置換された 5 または 6 員のヘテロアリールであり、 R^3 は存在しないか、あるいは、

R^2 及び R^3 は、それらが結合する原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキルまたは任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^4 は存在しないか、水素、ハロゲン、シアノ、または、1 ~ 3 個のハロゲンで任意に置換されたメチルであり、

R^5 は、水素、ハロゲンで任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、シアノ、ヒドロキシ、または $C_1 - C_4$ アルコキシ、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

R^6 は水素またはメチルであり、 R^7 は水素、ハロゲン、または、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、あるいは、

R^6 及び R^7 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^8 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R^7 及び R^8 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、 $C = CR^7$ 、 R^8 ； $C = N(OH)$ 、 $C = N(O - C_1 - C_3 \text{ アルキル})$ 、 $C = O$ 、 $C = S$ 、 $C = NH$ 、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^{7a} 及び R^{8a} は独立して、水素、ハロ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、または、それらが結合する炭素と組み合わせり、カルボニルを形成し、

$R^{7'}$ は、水素、ハロゲン、または任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであり、 $R^{8'}$ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

$R^{7'}$ 及び $R^{8'}$ は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^9 は、水素、F、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであるか、あるいは、

10

20

30

40

50

R⁹ 及び L は、それらが結合する原子と共に組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^{9'} は、水素または任意に置換された C₁ - C₆ アルキルであり、

R¹⁰ は、水素、ハロ、ヒドロキシ、C₁ - C₃ アルコキシ、または C₁ - C₃ アルキルであり、

R^{10a} は、水素またはハロであり、

R¹¹ は、水素または C₁ - C₃ アルキルであり、

R³⁴ は、水素または C₁ - C₃ アルキルであり、かつ、

X^e 及び X^f は独立して、N または CH である。]

【誤訳訂正 1 2】

10

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 1 0 5

【訂正方法】変更

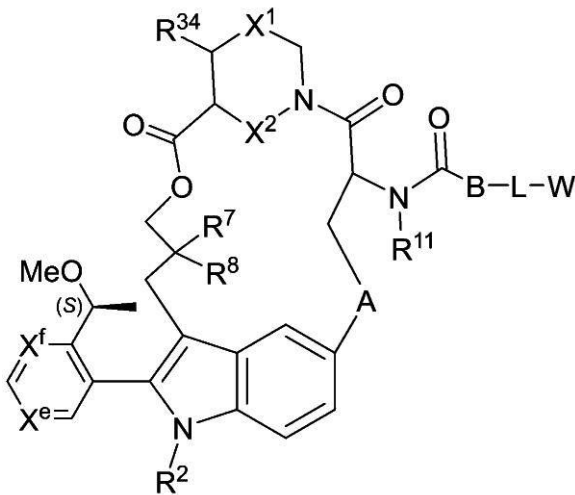
【訂正の内容】

【0 1 0 5】

いくつかの実施形態では、本発明の化合物は、式 V I a の構造、またはその薬学的に許容される塩を有する：

【化 1 6】

20



30

式 V I a

[式中、A は、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン（例えば、フェニルもしくはフェノール）、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

B は、- CH (R⁹) - [式中、炭素は、- NHC (O) - のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

40

L は存在しないか、またはリンカーであり、

W は、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N - エトキシカルボニル - 2 - エトキシ - 1 , 2 - ジヒドロキノリン (E E D Q)、イソ E E D Q もしくは他の E E D Q 誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカルを含む架橋基であり、

X¹ は、任意に置換された C₁ - C₂ アルキレン、NR、O、または S (O)_n であり

50

X^2 は O または NH であり、
 n は、0、1、または 2 であり、
 R は、水素、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_4$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C(O)R'$ 、 $C(O)OR'$ 、 $C(O)N(R')_2$ 、 $S(O)R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、または $S(O)_2N(R')_2$ であり、
 各 R' は独立して、H または任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキルであり、
 R^2 は、 $C_1 - C_6$ アルキルまたは 3 ~ 6 員のシクロアルキルであり、
 R^7 は、 $C_1 - C_3$ アルキルであり、
 R^8 は、 $C_1 - C_3$ アルキルであり、かつ、
 R^9 は、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであり、
 X^e 及び X^f は独立して、N または CH であり、
 R^{11} は、水素または $C_1 - C_3$ アルキルであり、かつ、
 R^{21} は、水素または $C_1 - C_3$ アルキルである。]。

10

【誤訳訂正 13】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0107

20

【訂正方法】変更

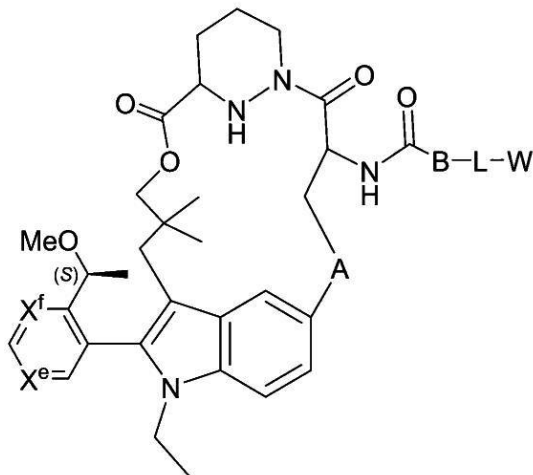
【訂正の内容】

【0107】

いくつかの実施形態では、本発明の化合物は、式 VI b の構造、またはその薬学的に許容される塩を有する：

【化 17】

30



40

式 VI b

[式中、A は、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン（例えば、フェニルもしくはフェノール）、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

B は、 $-CH(R^9)-$ [式中、炭素は、 $-NH-C(O)-$ のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

50

Lは存在しないか、またはリンカーであり、

Wは、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N-エトキシカルボニル-2-エトキシ-1,2-ジヒドロキノリン(EEDQ)、イソEEDQもしくは他のEEDQ誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカールを含む架橋基であり、

R⁹は、任意に置換されたC₁-C₆アルキル、任意に置換されたC₁-C₆ヘテロアルキル、任意に置換された3~6員のシクロアルキル、または、任意に置換された3~7員のヘテロシクロアルキルであり、

X^e及びX^fは独立して、NまたはCHである。]

10

【誤訳訂正14】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0109

【訂正方法】変更

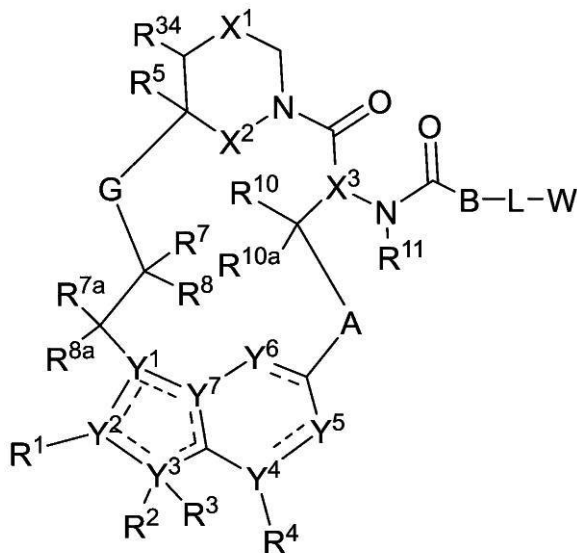
【訂正の内容】

【0109】

いくつかの実施形態では、本発明の化合物は、式VIIの構造、またはその薬学的に許容される塩を有する：

【化18】

20



30

式VII

[式中、点線は0、1、2、3、または4個の非隣接二重結合を示し、

40

Aは、-N(HまたはCH₃)C(O)-(CH₂)-[式中、アミノ窒素は、-CH(R¹⁰)-の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された3~6員のシクロアルキレン、任意に置換された3~6員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された6員のアリーレン、または、任意に置換された5~10員のヘテロアリーレンであり、

Bは、-CH(R⁹)-または>C=CR⁹R^{9'}[式中、炭素は、-N(R¹¹)C(O)-のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された3~6員のシクロアルキレン、任意に置換された3~6員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された6員のアリーレン、または5~6員のヘテロアリーレンであり、

Gは、任意に置換されたC₁-C₄アルキレン、任意に置換されたC₁-C₄アルケニレン、任意に置換されたC₁-C₄ヘテロアルキレン、-C(O)O-CH(R⁶)-[

50

式中、2番目のCは - C (R ⁷ R ⁸) - に結合している。]、 - C (O) NH - CH (R ⁶) - [式中、2番目のCは - C (R ⁷ R ⁸) - に結合している。]、任意に置換された C ₁ - C ₄ ヘテロアルキレン、または 3 ~ 8 員のヘテロアリーレンであり、

L は存在しないか、またはリンカーであり、

W は、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N - エトキシカルボニル - 2 - エトキシ - 1 , 2 - ジヒドロキノリン (E E D Q)、イソ E E D Q もしくは他の E E D Q 誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカルを含む架橋基であり、

X ¹ は、任意に置換された C ₁ - C ₂ アルキレン、NR、O、または S (O) _n であり

10

X ² は O または NH であり、

X ³ は N または CH であり、

n は、0、1、または 2 であり、

R は、水素、シアノ、任意に置換された C ₁ - C ₄ アルキル、任意に置換された C ₂ - C ₄ アルケニル、任意に置換された C ₂ - C ₄ アルキニル、C (O) R '、C (O) O R '、C (O) N (R ') ₂、S (O) R '、S (O) ₂ R '、または S (O) ₂ N (R ') ₂ であり、

各 R ' は独立して、H または任意に置換された C ₁ - C ₄ アルキルであり、

Y ¹ は、C、CH、または N であり、

20

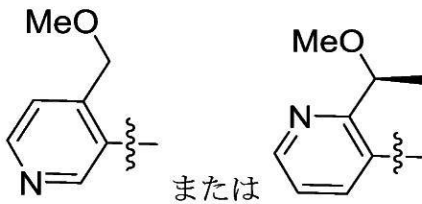
Y ²、Y ³、Y ⁴、及び Y ⁷ は独立して、C または N であり、

Y ⁵ は、CH、CH ₂、または N であり、

Y ⁶ は、C (O)、CH、CH ₂、または N であり、

R ¹ は

【化 19】



30

であり、

R ² は、存在しないか、水素、任意に置換された C ₁ - C ₆ アルキル、任意に置換された C ₂ - C ₆ アルケニル、任意に置換された C ₂ - C ₆ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 6 員のアール、任意に置換された 5 または 6 員のヘテロアールであり、R ³ は存在しないか、あるいは、

40

R ² 及び R ³ は、それらが結合する原子と組み合わせたり、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキルまたは任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R ⁴ は存在しないか、水素、ハロゲン、シアノ、または、1 ~ 3 個のハロゲンで任意に置換されたメチルであり、

R ⁵ は、水素、ハロゲンで任意に置換された C ₁ - C ₄ アルキル、シアノ、ヒドロキシ、または C ₁ - C ₄ アルコキシ、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

R ⁶ は水素またはメチルであり、R ⁷ は水素、ハロゲン、または、任意に置換された C ₁ - C ₃ アルキルであるか、あるいは、

R ⁶ 及び R ⁷ は、それらが結合する炭素原子と組み合わせたり、任意に置換された 3 ~ 6

50

員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^8 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシル、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R^7 及び R^8 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせたり、 $C = CR^7, R^8$; $C = N(OH)$ 、 $C = N(O - C_1 - C_3 \text{ アルキル})$ 、 $C = O$ 、 $C = S$ 、 $C = NH$ 、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

10

R^{7a} 及び R^{8a} は独立して、水素、ハロ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、または、それらが結合する炭素と組み合わせたり、カルボニルを形成し、

$R^{7'}$ は、水素、ハロゲン、または任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであり、 $R^{8'}$ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシル、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

$R^{7'}$ 及び $R^{8'}$ は、それらが結合する炭素原子と組み合わせたり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

20

R^9 は、水素、F、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであるか、あるいは、

R^9 及び L は、それらが結合する原子と共に組み合わせたり、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

$R^{9'}$ は、水素または任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^{10} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、または $C_1 - C_3$ アルキルであり、 R^{10a} は、水素またはハロであり、

30

R^{11} は、水素または $C_1 - C_3$ アルキルであり、かつ、 R^{34} は、水素または $C_1 - C_3$ アルキル (例えば、メチル) である。]

【誤訳訂正 15】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0127

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0127】

式 I V の構造を含むコンジュゲート、またはその塩をさらに提供する：

M - L - P

40

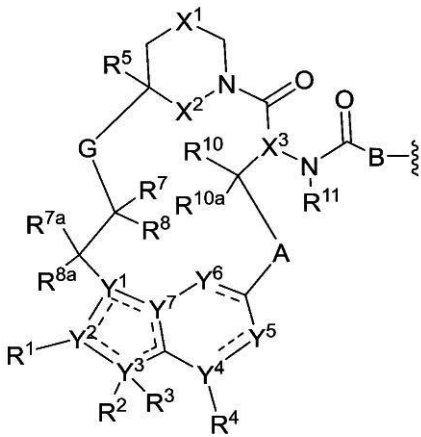
式 I V

[式中、L はリンカーであり、

P は、一価の有機部分であり、

M は、式 V a の構造を有する。]

【化 3 8】



式V a

[式中、点線は 0、1、2、3、または 4 個の非隣接二重結合を示し、

A は - N (H または CH_3) C (O) - (CH_2) - [式中、アミノ窒素は、 - CH (R^{10}) - の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

B は、 - CH (R^9) - または $> \text{C} = \text{C} \text{R}^9 \text{R}^{9'}$ [式中、炭素は、 - N (R^{11}) C (O) - のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

G は、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキレン、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルケニレン、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ヘテロアルキレン、 - C (O) O - CH (R^6) - [式中、2 番目の C は - C ($\text{R}^7 \text{R}^8$) - に結合している。]、 - C (O) NH - CH (R^6) - [式中、2 番目の C は - C ($\text{R}^7 \text{R}^8$) - に結合している。]、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ヘテロアルキレン、または 3 ~ 8 員のヘテロアリーレンであり、

X^1 は、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_2$ アルキレン、NR、O、または $\text{S}(\text{O})_n$ であり、

X^2 は O または NH であり、

X^3 は N または CH であり、

n は、0、1、または 2 であり、

R は、水素、シアノ、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキル、任意に置換された $\text{C}_2 - \text{C}_4$ アルケニル、任意に置換された $\text{C}_2 - \text{C}_4$ アルキニル、 $\text{C}(\text{O})\text{R}'$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}'$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}'$ 、 $\text{S}(\text{O})_2\text{R}'$ 、または $\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}')_2$ であり、

各 R' は独立して、H または任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルであり、

Y^1 は、C、CH、または N であり、

Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、及び Y^7 は独立して、C または N であり、

Y^5 は、CH、 CH_2 、または N であり、 Y^6 は、 $\text{C}(\text{O})$ 、CH、 CH_2 、または N であり、

R^1 は、シアノ、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルケニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリール、または、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリールであるか、あるいは、

R^1 及び R^2 は、それらが結合する原子と共に組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 1

10

20

30

40

50

4 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^2 は、存在しないか、水素、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 6 員のアリール、任意に置換された 5 または 6 員のヘテロアリールであり、 R^3 は存在しないか、あるいは、

R^2 及び R^3 は、それらが結合する原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキルまたは任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^4 は存在しないか、水素、ハロゲン、シアノ、または、1 ~ 3 個のハロゲンで任意に置換されたメチルであり、

R^5 は、水素、ハロゲンで任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、シアノ、ヒドロキシ、または $C_1 - C_4$ アルコキシ、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

R^6 は水素またはメチルであり、 R^7 は水素、ハロゲン、または、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、あるいは、

R^6 及び R^7 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^8 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R^7 及び R^8 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、 $C = CR^7, R^8$; $C = N(OH)$ 、 $C = N(O - C_1 - C_3 \text{ アルキル})$ 、 $C = O$ 、 $C = S$ 、 $C = NH$ 、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^{7a} 及び R^{8a} は独立して、水素、ハロ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、または、それらが結合する炭素と組み合わせり、カルボニルを形成し、

$R^{7'}$ は、水素、ハロゲン、または任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであり、 $R^{8'}$ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

$R^{7'}$ 及び $R^{8'}$ は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^9 は、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであるか、あるいは、

R^9 及び L は、それらが結合する原子と共に組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

$R^{9'}$ は、水素または任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^{10} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、または $C_1 - C_3$ アルキルであり、

R^{10a} は、水素またはハロであり、かつ、

R^{11} は、水素または $C_1 - C_3$ アルキルである。]。

【誤訳訂正 16】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0128

10

20

30

40

50

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0128】

いくつかの実施形態では、コンジュゲートは、式IVの構造を有する：

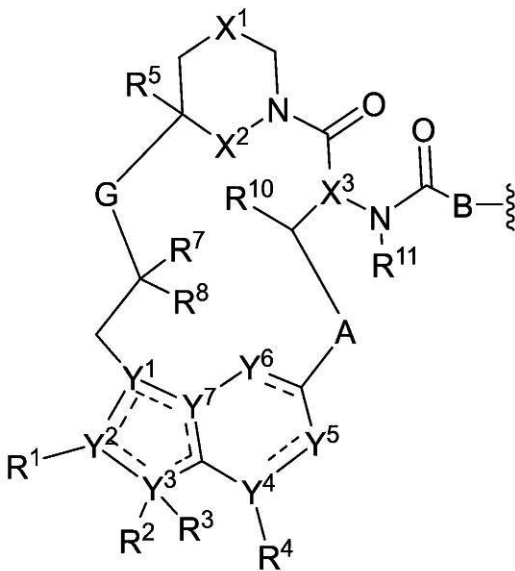
M - L - P

式IV

[式中、Lはリンカーであり、
Pは、一価の有機部分であり、
Mは、式Vbの構造を有する。]

【化39】

10



20

式Vb

[式中、点線は0、1、2、3、または4個の非隣接二重結合を示し、

30

Aは、-N(HまたはCH₃)C(O)-(CH₂)-[式中、アミノ窒素は、-CH(R¹⁰)-の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された3~6員のシクロアルキレン、任意に置換された3~6員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された6員のアリーレン、または、任意に置換された5~6員のヘテロアリーレンであり、

Bは、-CH(R⁹)-[式中、炭素は、-N(R¹¹)C(O)-のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された3~6員のシクロアルキレン、任意に置換された3~6員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された6員のアリーレン、または5~6員のヘテロアリーレンであり、

Gは、任意に置換されたC₁-C₄アルキレン、任意に置換されたC₁-C₄アルケニレン、任意に置換されたC₁-C₄ヘテロアルキレン、-C(O)O-CH(R⁶)-[式中、2番目のCは-C(R⁷R⁸)-に結合している。]、-C(O)NH-CH(R⁶)-[式中、2番目のCは-C(R⁷R⁸)-に結合している。]、任意に置換されたC₁-C₄ヘテロアルキレン、または3~8員のヘテロアリーレンであり、

40

X¹は、任意に置換されたC₁-C₂アルキレン、NR、O、またはS(O)_nであり、

X²はOまたはNHであり、

X³はNまたはCHであり、

nは、0、1、または2であり、

Rは、水素、シアノ、任意に置換されたC₁-C₄アルキル、任意に置換されたC₂-C₄アルケニル、任意に置換されたC₂-C₄アルキニル、C(O)R'、C(O)OR'、

50

、 $C(O)N(R')_2$ 、 $S(O)R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、または $S(O)_2N(R')_2$ であり、

各 R' は独立して、 H または任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキルであり、

Y^1 は、 C 、 CH 、または N であり、

Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、及び Y^7 は独立して、 C または N であり、

Y^5 及び Y^6 は独立して、 CH または N であり、

R^1 は、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、任意に置換された3～6員のシクロアルケニル、任意に置換された3～6員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された6～10員のアリール、または、任意に置換された5～10員のヘテロアリールであり、

10

R^2 は、水素、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された6員のアリール、任意に置換された5または6員のヘテロアリールであり、 R^3 は存在しないか、あるいは、

R^2 及び R^3 は、それらが結合する原子と組み合わせり、任意に置換された3～8員のシクロアルキルまたは任意に置換された3～14員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^4 は存在しないか、水素、ハロゲン、シアノ、または、1～3個のハロゲンで任意に置換されたメチルであり、

R^5 は、水素、ハロゲンで任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、シアノ、ヒドロキシ、または $C_1 - C_4$ アルコキシ、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

20

R^6 は水素またはメチルであり、 R^7 は水素、ハロゲン、または、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、あるいは、

R^6 及び R^7 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、または任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^8 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された3～8員のシクロアルキル、任意に置換された3～14員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された5～10員のヘテロアリール、または、任意に置換された6～10員のアリールであるか、あるいは、

30

R^7 及び R^8 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、 $C = CR^7'R^8'$ ； $C = N(OH)$ 、 $C = N(O - C_1 - C_3$ アルキル)、 $C = O$ 、 $C = S$ 、 $C = NH$ 、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、または任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^7' は、水素、ハロゲン、または任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであり、 R^8' は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された3～8員のシクロアルキル、任意に置換された3～14員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された5～10員のヘテロアリール、または、任意に置換された6～10員のアリールであるか、あるいは、

40

R^7' 及び R^8' は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、または任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^9 は、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、または、任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキルであり、

R^{10} は、水素、ヒドロキシ、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、または $C_1 - C_3$ アルキルであり、かつ、

R^{11} は、水素または $C_1 - C_3$ アルキルである。]。

50

【誤訳訂正 17】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0129

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0129】

いくつかの実施形態では、コンジュゲートは、式IVの構造を有する：

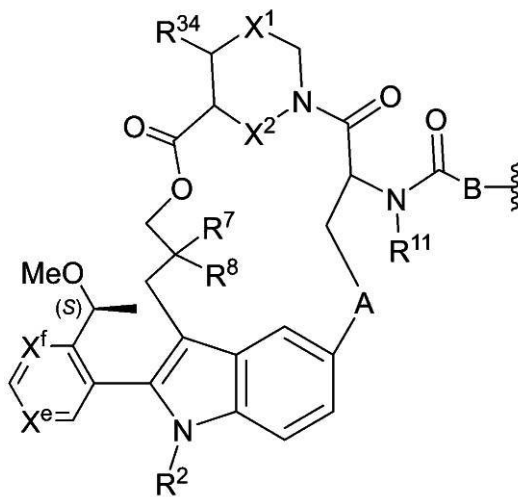
M - L - P

式IV

[式中、L はリンカーであり、
P は、一価の有機部分であり、
M は、式Vcの構造を有する。]

10

【化40】



20

式Vc

30

[式中、A は、任意に置換された3～6員のシクロアルキレン、任意に置換された3～6員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された6員のアリーレン（例えば、フェニルもしくはフェノール）、または、任意に置換された5～6員のヘテロアリーレンであり、

B は、 $-CH(R^9)-$ [式中、炭素は、 $-NHC(O)-$ のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された3～6員のシクロアルキレン、任意に置換された3～6員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された6員のアリーレン、または5～6員のヘテロアリーレンであり、

X^1 は、任意に置換された $C_1 - C_2$ アルキレン、NR、O、または $S(O)_n$ であり、

X^2 はOまたはNHであり、

n は、0、1、または2であり、

R は、水素、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_4$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C(O)R'$ 、 $C(O)OR'$ 、 $C(O)N(R')_2$ 、 $S(O)R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、または $S(O)_2N(R')_2$ であり、

40

各 R' は独立して、Hまたは任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキルであり、

X^e 及び X^f は独立して、NまたはCHであり、

R^2 は、 $C_1 - C_6$ アルキルまたは3～6員のシクロアルキルであり、

R^7 は、 $C_1 - C_3$ アルキルであり、

R^8 は、 $C_1 - C_3$ アルキルであり、かつ、

50

R⁹ は、任意に置換された C₁ - C₆ アルキル、任意に置換された C₁ - C₆ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであり、

R¹¹ は、水素または C₁ - C₃ アルキルであり、かつ、

R³⁴ は、水素または C₁ - C₃ アルキルである。]。

【誤訳訂正 18】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0131

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

10

【0131】

いくつかの実施形態では、コンジュゲートは、式 IV の構造を有する：

M - L - P

式 IV

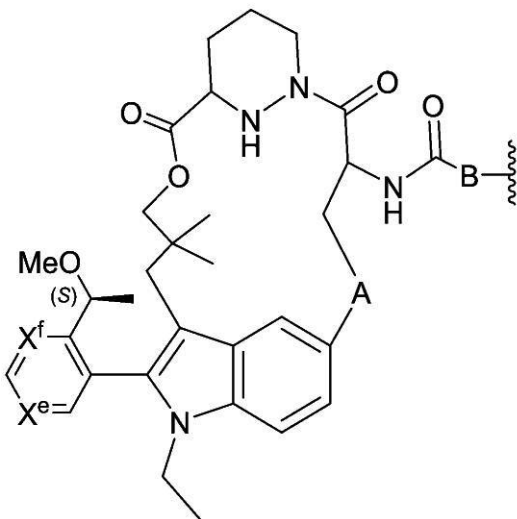
[式中、L はリンカーであり、

P は、一価の有機部分であり、

M は、式 V d の構造を有する。]

【化 41】

20



30

式 V d

[式中、A は、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン (例えば、フェニルもしくはフェノール)、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

B は、-CH(R⁹)- [式中、炭素は、-NH-C(=O)- のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

40

L は存在しないか、またはリンカーであり、

W は、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N - エトキシカルボニル - 2 - エトキシ - 1, 2 - ジヒドロキノリン (EEDQ)、イソ EEDQ もしくは他の EEDQ 誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカールを含む架橋基であり、

R⁹ は、任意に置換された C₁ - C₆ アルキル、任意に置換された C₁ - C₆ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7

50

員のヘテロシクロアルキルであり、

X^e 及び X^f は独立して、N または CH である。]。

【誤訳訂正 19】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0259

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

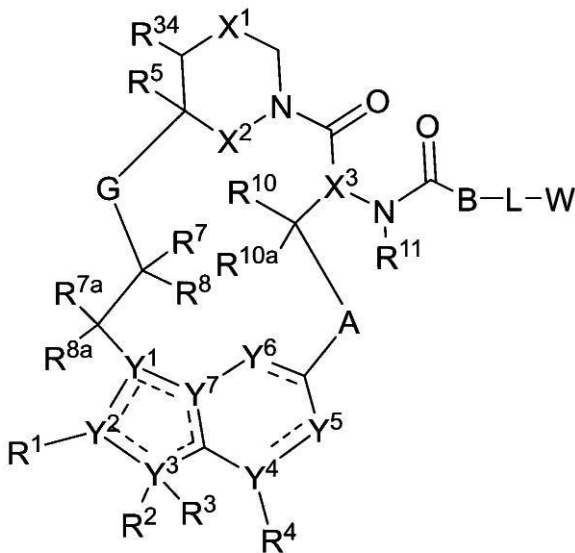
【0259】

番号付けした実施形態

[1] 式 I の構造を有する化合物、またはその薬学的に許容される塩：

10

【化 49】



20

式 I

30

[式中、点線は 0、1、2、3、または 4 個の非隣接二重結合を示し、

A は、 $-N(H \text{ または } CH_3)C(O)-(CH_2)-$ [式中、アミノ窒素は、 $-CH(R^{10})-$ の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリーレンであり、

B は、 $-CH(R^9)-$ または $>C=CR^9R^{9'}$ [式中、炭素は、 $-N(R^{11})C(O)-$ のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

G は、任意に置換された C_1-C_4 アルキレン、任意に置換された C_1-C_4 アルケニレン、任意に置換された C_1-C_4 ヘテロアルキレン、 $-C(O)O-CH(R^6)-$ [式中、2 番目の C は $-C(R^7R^8)-$ に結合している。]、 $-C(O)NH-CH(R^6)-$ [式中、2 番目の C は $-C(R^7R^8)-$ に結合している。]、任意に置換された C_1-C_4 ヘテロアルキレン、または 3 ~ 8 員のヘテロアリーレンであり、

40

L は存在しないか、またはリンカーであり、

W は、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N-エトキシカルボニル-2-エトキシ-1,2-ジヒドロキノリン (EEDQ)、イソEEDQ もしくは他の EEDQ 誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカールを含む架橋基であり、

50

X^1 は、任意に置換された $C_1 - C_2$ アルキレン、NR、O、または $S(O)_n$ であり、

X^2 はOまたはNHであり、

X^3 はNまたはCHであり、

nは、0、1、または2であり、

Rは、水素、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_4$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C(O)R'$ 、 $C(O)OR'$ 、 $C(O)N(R')_2$ 、 $S(O)R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、または $S(O)_2N(R')_2$ であり、

各 R' は独立して、Hまたは任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキルであり、

Y^1 は、C、CH、またはNであり、

Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、及び Y^7 は独立して、CまたはNであり、

Y^5 は、CH、 CH_2 、またはNであり、

Y^6 は、 $C(O)$ 、CH、 CH_2 、またはNであり、

R^1 は、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、任意に置換された3～6員のシクロアルケニル、任意に置換された3～6員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された6～10員のアリール、または、任意に置換された5～10員のヘテロアリールであるか、あるいは、

R^1 及び R^2 は、それらが結合する原子と共に組み合わせたり、任意に置換された3～14員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^2 は、存在しないか、水素、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された6員のアリール、任意に置換された5または6員のヘテロアリールであり、 R^3 は存在しないか、あるいは、

R^2 及び R^3 は、それらが結合する原子と組み合わせたり、任意に置換された3～8員のシクロアルキルまたは任意に置換された3～14員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^4 は存在しないか、水素、ハロゲン、シアノ、または、1～3個のハロゲンで任意に置換されたメチルであり、

R^5 は、水素、ハロゲンで任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、シアノ、ヒドロキシ、または $C_1 - C_4$ アルコキシ、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

R^6 は水素またはメチルであり、 R^7 は水素、ハロゲン、または、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、あるいは、

R^6 及び R^7 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせたり、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、または任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^8 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された3～8員のシクロアルキル、任意に置換された3～14員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された5～10員のヘテロアリール、または、任意に置換された6～10員のアリールであるか、あるいは、

R^7 及び R^8 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせたり、 $C = CR^7$ 、 R^8 ； $C = N(OH)$ 、 $C = N(O - C_1 - C_3$ アルキル)、 $C = O$ 、 $C = S$ 、 $C = NH$ 、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、または任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^7^a 及び R^8^a は独立して、水素、ハロ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、または、それらが結合する炭素と組み合わせたり、カルボニルを形成し、

R^7 は、水素、ハロゲン、または任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであり、 R^8 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、

10

20

30

40

50

任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R^7 ' 及び R^8 ' は、それらが結合する炭素原子と組み合わせたり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^9 は、水素、F、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであるか、あるいは、

R^9 及び L は、それらが結合する原子と共に組み合わせたり、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^9 ' は、水素または任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^{10} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、または $C_1 - C_3$ アルキルであり、

R^{10a} は、水素またはハロであり、

R^{11} は、水素または $C_1 - C_3$ アルキルであり、かつ、

R^{34} は、水素または $C_1 - C_3$ アルキルである。]。

【誤訳訂正 20】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0261

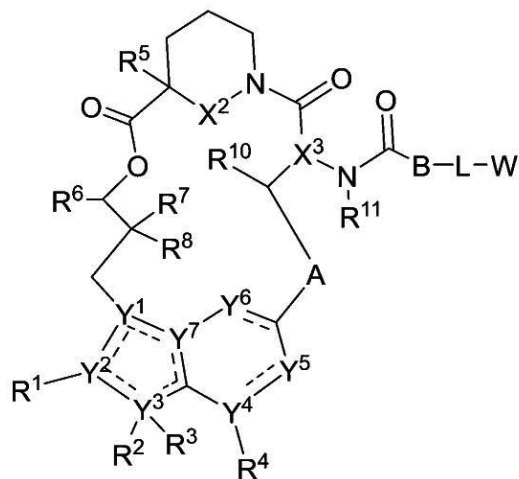
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0261】

[3] 上記化合物が式 I a の構造を有する、段落 [1] または [2] に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

【化 50】



式 I a

[式中、点線は 0、1、2、3、または 4 個の非隣接二重結合を示し、

A は、 $-N(H$ または $CH_3)C(O)-(CH_2)-$ [式中、アミノ窒素は、 $-CH(R^{10})-$ の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

B は、 $-CH(R^9)-$ [式中、炭素は、 $-N(R^{11})C(O)-$ のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3

~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

L は存在しないか、またはリンカーであり、

W は、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N - エトキシカルボニル - 2 - エトキシ - 1, 2 - ジヒドロキノリン (E E D Q)、イソ E E D Q もしくは他の E E D Q 誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカールを含む架橋基であり、

X² は O または NH であり、

X³ は N または CH であり、

n は、0、1、または 2 であり、

R は、水素、シアノ、任意に置換された C₁ - C₄ アルキル、任意に置換された C₂ - C₄ アルケニル、任意に置換された C₂ - C₄ アルキニル、C (O) R'、C (O) O R'、C (O) N (R')₂、S (O) R'、S (O)₂ R'、または S (O)₂ N (R')₂ であり、

各 R' は独立して、H または任意に置換された C₁ - C₄ アルキルであり、

Y¹ は、C、CH、または N であり、

Y²、Y³、Y⁴、及び Y⁷ は独立して、C または N であり、

Y⁵ 及び Y⁶ は独立して、CH または N であり、

R¹ は、シアノ、任意に置換された C₁ - C₆ アルキル、任意に置換された C₁ - C₆ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルケニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリール、または、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリールであり、

R² は、水素、任意に置換された C₁ - C₆ アルキル、任意に置換された C₂ - C₆ アルケニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 6 員のアリール、任意に置換された 5 または 6 員のヘテロアリールであり、R³ は存在しないか、あるいは、

R² 及び R³ は、それらが結合する原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキルまたは任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R⁴ は存在しないか、水素、ハロゲン、シアノ、または、1 ~ 3 個のハロゲンで任意に置換されたメチルであり、

R⁵ は、水素、ハロゲンで任意に置換された C₁ - C₄ アルキル、シアノ、ヒドロキシ、または C₁ - C₄ アルコキシ、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

R⁶ は水素またはメチルであり、R⁷ は水素、ハロゲン、または、任意に置換された C₁ - C₃ アルキルであるか、あるいは、

R⁶ 及び R⁷ は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R⁸ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された C₁ - C₃ アルコキシル、任意に置換された C₁ - C₃ アルキル、任意に置換された C₂ - C₆ アルケニル、任意に置換された C₂ - C₆ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R⁷ 及び R⁸ は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、C = C R⁷ ' R⁸ ' ; C = N (O H)、C = N (O - C₁ - C₃ アルキル)、C = O、C = S、C = N H、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R⁷ ' は、水素、ハロゲン、または任意に置換された C₁ - C₃ アルキルであり、R⁸ ' は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された C₁ - C₃ アルコキシル、

10

20

30

40

50

任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R^7 及び R^8 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせたり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^9 は、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであり、

R^{10} は、水素、ヒドロキシ、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、または $C_1 - C_3$ アルキルであり、かつ、

R^{11} は、水素または $C_1 - C_3$ アルキルである。]

【誤訳訂正 2 1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 2 6 7

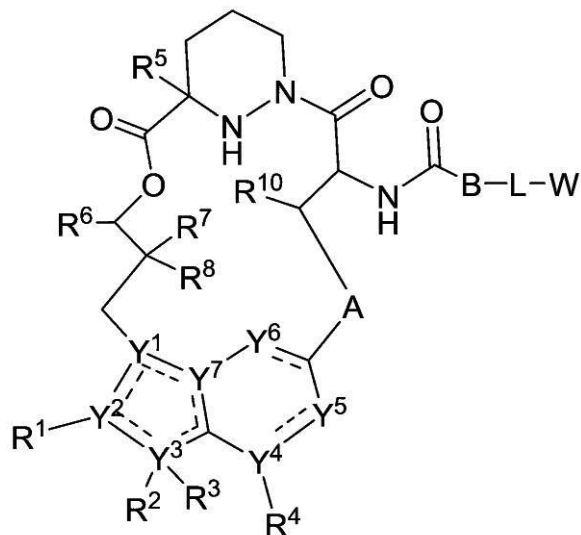
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 2 6 7】

[9] 化合物が式 I b の構造を有する、段落 [1] ~ [6] のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

【化 5 1】



式 I b

[式中、点線は 0、1、2、3、または 4 個の非隣接二重結合を示し、

A は $-N(H \text{ または } CH_3)C(O)-(CH_2)-$ [式中、アミノ窒素は、 $-CH(R^{10})-$ の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリレン、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリレンであり、

B は、 $-CH(R^9)-$ [式中、炭素は、 $-NHC(O)-$ のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリレンであり、

L は存在しないか、またはリンカーであり、

Wは、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N-エトキシカルボニル-2-エトキシ-1,2-ジヒドロキノリン(EEDQ)、イソEEDQもしくは他のEEDQ誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカールを含む架橋基であり、

nは、0、1、または2であり、

Rは、水素、シアノ、任意に置換されたC₁-C₄アルキル、任意に置換されたC₂-C₄アルケニル、任意に置換されたC₂-C₄アルキニル、C(O)R'、C(O)OR'、C(O)N(R')₂、S(O)R'、S(O)₂R'、またはS(O)₂N(R')₂であり、

10

各R'は独立して、Hまたは任意に置換されたC₁-C₄アルキルであり、

Y¹は、C、CH、またはNであり、

Y²、Y³、Y⁴、及びY⁷は独立して、CまたはNであり、

Y⁵及びY⁶は独立して、CHまたはNであり、

R¹は、シアノ、任意に置換されたC₁-C₆アルキル、任意に置換されたC₁-C₆ヘテロアルキル、任意に置換された3~6員のシクロアルキル、任意に置換された3~6員のシクロアルケニル、任意に置換された3~6員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された6~10員のアリール、または、任意に置換された5~10員のヘテロアリールであり、

R²は、水素、任意に置換されたC₁-C₆アルキル、任意に置換されたC₂-C₆アルケニル、任意に置換された3~6員のシクロアルキル、任意に置換された3~7員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された6員のアリール、任意に置換された5または6員のヘテロアリールであり、R³は存在しないか、あるいは、

20

R²及びR³は、それらが結合する原子と組み合わせり、任意に置換された3~8員のシクロアルキルまたは任意に置換された3~14員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R⁴は存在しないか、水素、ハロゲン、シアノ、または、1~3個のハロゲンで任意に置換されたメチルであり、

R⁵は、水素、ハロゲンで任意に置換されたC₁-C₄アルキル、シアノ、ヒドロキシ、またはC₁-C₄アルコキシ、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

R⁶は水素またはメチルであり、R⁷は水素、ハロゲン、または、任意に置換されたC₁-C₃アルキルであるか、あるいは、

30

R⁶及びR⁷は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された3~6員のシクロアルキル、または任意に置換された3~7員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R⁸は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換されたC₁-C₃アルコキシ、任意に置換されたC₁-C₃アルキル、任意に置換されたC₂-C₆アルケニル、任意に置換されたC₂-C₆アルキニル、任意に置換された3~8員のシクロアルキル、任意に置換された3~14員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された5~10員のヘテロアリール、または、任意に置換された6~10員のアリールであるか、あるいは、

R⁷及びR⁸は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、C=C R⁷' R⁸' ; C=N(OH)、C=N(O-C₁-C₃アルキル)、C=O、C=S、C=NH、任意に置換された3~6員のシクロアルキル、または任意に置換された3~7員のヘテロシクロアルキルを形成し、

40

R⁷'は、水素、ハロゲン、または任意に置換されたC₁-C₃アルキルであり、R⁸'は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換されたC₁-C₃アルコキシ、任意に置換されたC₁-C₃アルキル、任意に置換されたC₂-C₆アルケニル、任意に置換されたC₂-C₆アルキニル、任意に置換された3~8員のシクロアルキル、任意に置換された3~14員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された5~10員のヘテロアリール、または、任意に置換された6~10員のアリールであるか、あるいは、

R⁷'及びR⁸'は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された3~

50

6員のシクロアルキル、または任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R⁹は、任意に置換されたC₁-C₆アルキル、任意に置換されたC₁-C₆ヘテロアルキル、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、または、任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキルであり、かつ、

R¹⁰は、水素、ヒドロキシ、C₁-C₃アルコキシ、またはC₁-C₃アルキルである。]

【誤訳訂正22】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0282

10

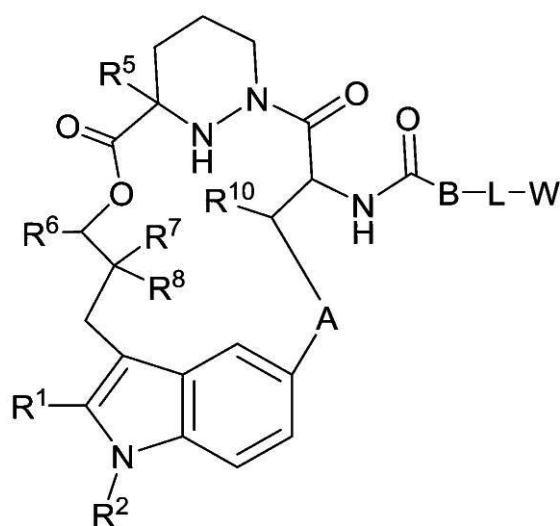
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0282】

[24]化合物が式Icの構造を有する、段落[1]～[6]、または[9]～[23]のいずれか1つに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

【化52】



20

30

式Ic

[式中、Aは-N(HまたはCH₃)-C(O)-(CH₂)-[式中、アミノ窒素は、-CH(R¹⁰)-の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された3～6員のシクロアルキレン、任意に置換された3～6員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された6員のアリーレン、または、任意に置換された5～6員のヘテロアリーレンであり、

Bは、-CH(R⁹)-[式中、炭素は、-NH-C(O)-のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された3～6員のシクロアルキレン、任意に置換された3～6員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された6員のアリーレン、または5～6員のヘテロアリーレンであり、

40

Lは存在しないか、またはリンカーであり、

Wは、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N-エトキシカルボニル-2-エトキシ-1,2-ジヒドロキノリン(EEDQ)、イソEEDQもしくは他のEEDQ誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカルを含む架橋基であり、

R¹は、シアノ、任意に置換されたC₁-C₆アルキル、任意に置換されたC₁-C₆ヘテロアルキル、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、任意に置換された3～6員のシクロアルケニル、任意に置換された3～6員のヘテロシクロアルキル、任意に置換

50

された 6 ~ 10 員のアリール、または、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリールであり、

R^2 は、水素、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 6 員のアリール、任意に置換された 5 または 6 員のヘテロアリールであり、 R^3 は存在しないか、あるいは、

R^2 及び R^3 は、それらが結合する原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキルまたは任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^5 は、水素、ハロゲンで任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、シアノ、ヒドロキシ、または $C_1 - C_4$ アルコキシ、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

R^6 は水素またはメチルであり、 R^7 は水素、ハロゲン、または、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、あるいは、

R^6 及び R^7 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^8 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R^7 及び R^8 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、 $C = CR^7, R^8$; $C = N(OH)$ 、 $C = N(O - C_1 - C_3 \text{ アルキル})$ 、 $C = O$ 、 $C = S$ 、 $C = NH$ 、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^7 は、水素、ハロゲン、または任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであり、 R^8 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R^7 及び R^8 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^9 は、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであり、かつ、

R^{10} は、水素、ヒドロキシ、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、または $C_1 - C_3$ アルキルである。】。

【誤訳訂正 2 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 2 9 1

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 2 9 1】

[3 3] 化合物が式 I d の構造を有する、段落 [1] ~ [3 2] のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

10

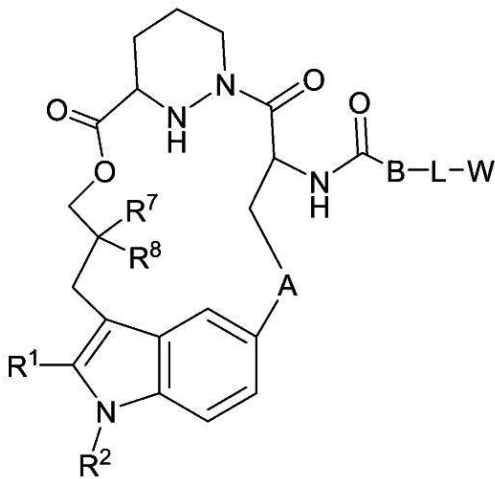
20

30

40

50

【化 5 3】



式 I d

[式中、A は - N (H または C H ₃) C (O) - (C H ₂) - [式中、アミノ窒素は、
- C H (R ¹⁰) - の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

B は、- C H (R ⁹) - [式中、炭素は、- N H C (O) - のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

L は存在しないか、またはリンカーであり、

W は、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N - エトキシカルボニル - 2 - エトキシ - 1 , 2 - ジヒドロキノリン (E E D Q)、イソ E E D Q もしくは他の E E D Q 誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカールを含む架橋基であり、

R ¹ は、シアノ、任意に置換された C ₁ - C ₆ アルキル、任意に置換された C ₁ - C ₆ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルケニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリール、または、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリールであり、

R ² は、C ₁ - C ₆ アルキルまたは 3 ~ 6 員のシクロアルキルであり、

R ⁷ は、C ₁ - C ₃ アルキルであり、

R ⁸ は、C ₁ - C ₃ アルキルであり、かつ、

R ⁹ は、任意に置換された C ₁ - C ₆ アルキル、任意に置換された C ₁ - C ₆ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルである。]。

【誤訳訂正 2 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 2 9 4

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 2 9 4】

[3 6] 化合物が式 I e の構造を有する、段落 [1] ~ [3 5] のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

10

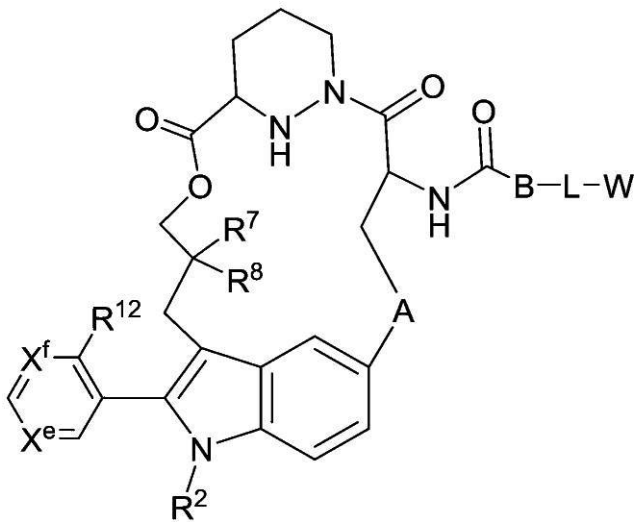
20

30

40

50

【化 5 4】



10

式 I e

[式中、A は - N (H または C H ₃) C (O) - (C H ₂) - [式中、アミノ窒素は、
 - C H (R ¹⁰) - の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアル
 キレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員
 のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

20

B は、- C H (R ⁹) - [式中、炭素は、- N H C (O) - のカルボニル炭素に結合す
 るもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員の
 ヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロ
 アリーレンであり、

L は存在しないか、またはリンカーであり、

W は、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチル
 チオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、ト
 リフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N - エトキシカルボニル - 2 -
 エトキシ - 1 , 2 - ジヒドロキノリン (E E D Q)、イソ E E D Q もしくは他の E E D Q
 誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカールを含む架橋基であり、

30

R ² は、C ₁ - C ₆ アルキルまたは 3 ~ 6 員のシクロアルキルであり、

R ⁷ は、C ₁ - C ₃ アルキルであり、

R ⁸ は、C ₁ - C ₃ アルキルであり、かつ、

R ⁹ は、任意に置換された C ₁ - C ₆ アルキル、任意に置換された C ₁ - C ₆ ヘテロア
 ルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7
 員のヘテロシクロアルキルであり、

X ^e 及び X ^f は独立して、N または C H であり、かつ、

R ¹² は、任意に置換された C ₁ - C ₆ アルキルもしくは任意に置換された C ₁ - C ₆
 ヘテロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルである。]。

40

【誤訳訂正 2 5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 2 9 9

【訂正方法】変更

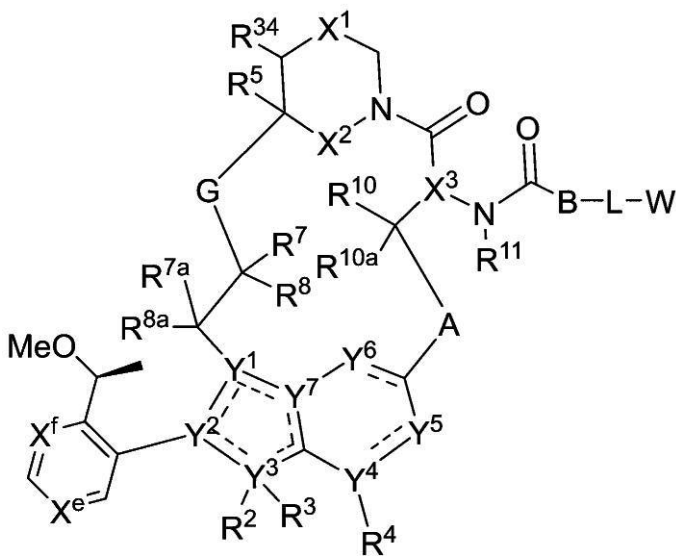
【訂正の内容】

【0 2 9 9】

[4 1] 上記化合物が式 V I の構造を有する、段落 [1] または [2] に記載の化合物
 、またはその薬学的に許容される塩：

50

【化 5 6】



10

式VI

[式中、点線は 0、1、2、3、または 4 個の非隣接二重結合を示し、

20

A は - N (H または CH_3) C (O) - (CH_2) - [式中、アミノ窒素は、 - CH (R^{10}) - の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリーレンであり、

B は、 - CH (R^9) - または $> \text{C} = \text{C} \text{R}^9 \text{R}^{9'}$ [式中、炭素は、 - N (R^{11}) C (O) - のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

G は、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキレン、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルケニレン、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ヘテロアルキレン、 - C (O) O - CH (R^6) - [式中、2 番目の C は - C ($\text{R}^7 \text{R}^8$) - に結合している。]、 - C (O) NH - CH (R^6) - [式中、2 番目の C は - C ($\text{R}^7 \text{R}^8$) - に結合している。]、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ヘテロアルキレン、または 3 ~ 8 員のヘテロアリーレンであり、

30

L は存在しないか、またはリンカーであり、

W は、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N - エトキシカルボニル - 2 - エトキシ - 1, 2 - ジヒドロキノリン (E E D Q)、イソ E E D Q もしくは他の E E D Q 誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカールを含む架橋基であり、

X^1 は、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_2$ アルキレン、NR、O、または $\text{S}(\text{O})_n$ であり

40

X^2 は O または NH であり、

X^3 は N または CH であり、

n は、0、1、または 2 であり、

R は、水素、シアノ、任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキル、任意に置換された $\text{C}_2 - \text{C}_4$ アルケニル、任意に置換された $\text{C}_2 - \text{C}_4$ アルキニル、C (O) R' 、C (O) O R' 、C (O) N (R')₂、S (O) R' 、S (O)₂ R' 、または S (O)₂ N (R')₂ であり、

各 R' は独立して、H または任意に置換された $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルであり、

Y^1 は、C、CH、または N であり、

50

Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、及び Y^7 は独立して、CまたはNであり、

Y^5 は、CH、 CH_2 、またはNであり、

Y^6 は、C(O)、CH、 CH_2 、またはNであり、

R^2 は、存在しないか、水素、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された6員のアリール、任意に置換された5または6員のヘテロアリールであり、 R^3 は存在しないか、あるいは、

R^2 及び R^3 は、それらが結合する原子と組み合わせり、任意に置換された3～8員のシクロアルキルまたは任意に置換された3～14員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^4 は存在しないか、水素、ハロゲン、シアノ、または、1～3個のハロゲンで任意に置換されたメチルであり、

R^5 は、水素、ハロゲンで任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、シアノ、ヒドロキシ、または $C_1 - C_4$ アルコキシ、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

R^6 は水素またはメチルであり、 R^7 は水素、ハロゲン、または、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、あるいは、

R^6 及び R^7 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、または任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^8 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された3～8員のシクロアルキル、任意に置換された3～14員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された5～10員のヘテロアリール、または、任意に置換された6～10員のアリールであるか、あるいは、

R^7 及び R^8 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、 $C = CR^7$ 、 R^8 、 $C = N(OH)$ 、 $C = N(O - C_1 - C_3$ アルキル)、 $C = O$ 、 $C = S$ 、 $C = NH$ 、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、または任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^{7a} 及び R^{8a} は独立して、水素、ハロ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、または、それらが結合する炭素と組み合わせり、カルボニルを形成し、

$R^{7'}$ は、水素、ハロゲン、または任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであり、 $R^{8'}$ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された3～8員のシクロアルキル、任意に置換された3～14員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された5～10員のヘテロアリール、または、任意に置換された6～10員のアリールであるか、あるいは、

$R^{7'}$ 及び $R^{8'}$ は、それらが結合する炭素原子と組み合わせり、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、または任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^9 は、水素、F、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された3～6員のシクロアルキル、または、任意に置換された3～7員のヘテロシクロアルキルであるか、あるいは、

R^9 及びLは、それらが結合する原子と共に組み合わせり、任意に置換された3～14員のヘテロシクロアルキルを形成し、

$R^{9'}$ は、水素または任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^{10} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、または $C_1 - C_3$ アルキルであり、

R^{10a} は、水素またはハロであり、

R^{11} は、水素または $C_1 - C_3$ アルキルであり、

R^{34} は、水素または $C_1 - C_3$ アルキルであり、かつ、

10

20

30

40

50

X^e 及び X^f は独立して、N または CH である。】。

【誤訳訂正 26】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0300

【訂正方法】変更

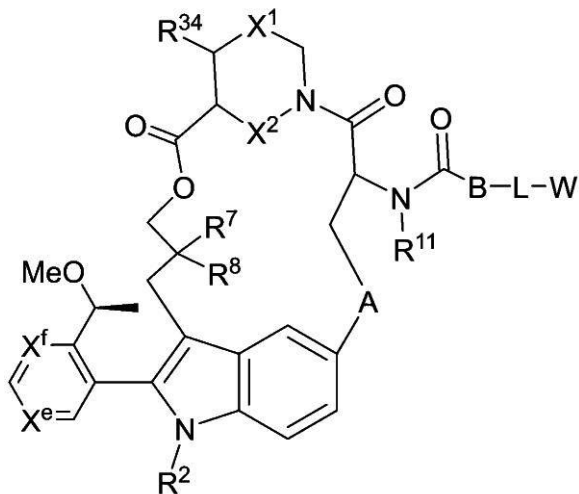
【訂正の内容】

【0300】

[42] 上記化合物が式 VI a の構造を有する、段落 [41] に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

【化 57】

10



20

式 VI a

[式中、A は、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

30

B は、 $-CH(R^9)-$ [式中、炭素は、 $-NHC(O)-$ のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

L は存在しないか、またはリンカーであり、

W は、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N-エトキシカルボニル-2-エトキシ-1,2-ジヒドロキノリン (EEDQ)、イソEEDQ もしくは他の EEDQ 誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカールを含む架橋基であり、

40

X^1 は、任意に置換された $C_1 - C_2$ アルキレン、NR、O、または $S(O)_n$ であり、

X^2 は O または NH であり、

n は、0、1、または 2 であり、

R は、水素、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_4$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C(O)R'$ 、 $C(O)OR'$ 、 $C(O)N(R')_2$ 、 $S(O)R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、または $S(O)_2N(R')_2$ であり、

各 R' は独立して、H または任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキルであり、

R^2 は、 $C_1 - C_6$ アルキルまたは 3 ~ 6 員のシクロアルキルであり、

50

R^7 は、 $C_1 - C_3$ アルキルであり、
 R^8 は、 $C_1 - C_3$ アルキルであり、かつ、
 R^9 は、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであるか、あるいは、
 X^e 及び X^f は独立して、N または CH であり、
 R^{11} は、水素または $C_1 - C_3$ アルキルであり、かつ、
 R^{21} は、水素または $C_1 - C_3$ アルキルである。]。

【誤訳訂正 27】

【訂正対象書類名】明細書

10

【訂正対象項目名】0301

【訂正方法】変更

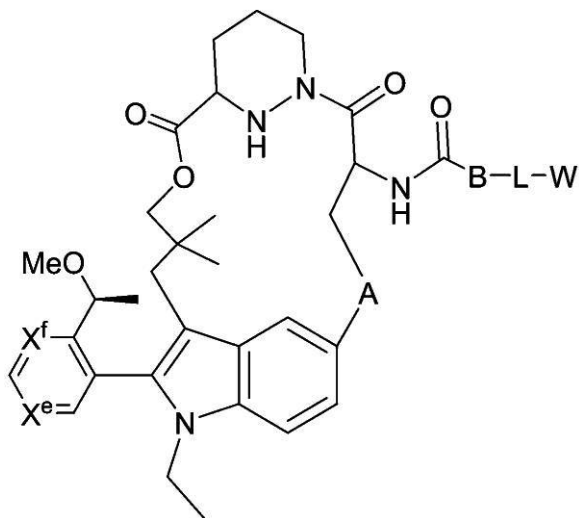
【訂正の内容】

【0301】

[43] 上記化合物が式 V I b の構造を有する、段落 [41] または [42] に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

【化 58】

20



30

式 V I b

[式中、A は、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

B は、 $-CH(R^9)-$ [式中、炭素は、 $-NHCO-$ のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

40

L は存在しないか、またはリンカーであり、

W は、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N - エトキシカルボニル - 2 - エトキシ - 1, 2 - ジヒドロキノリン (EEDQ)、イソEEDQ もしくは他の EEDQ 誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカルを含む架橋基であり、

R^9 は、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであり、

50

X^e 及び X^f は独立して、N または CH である。]。

【誤訳訂正 28】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0338

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0338】

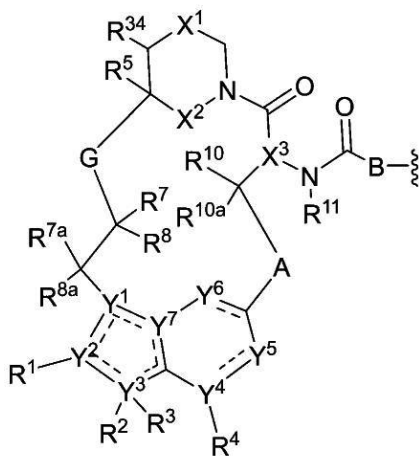
[80] 式 I V の構造を含むコンジュゲート、またはその塩：

M - L - P

式 I V

[式中、L はリンカーであり、
P は、一価の有機部分であり、
M は、式 V の構造を有する。]

【化 76】



式 V

[式中、点線は 0、1、2、3、または 4 個の非隣接二重結合を示し、

A は $-N(H \text{ または } CH_3)C(O)-(CH_2)-$ [式中、アミノ窒素は、 $-CH(R^{10})-$ の炭素原子に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

B は、 $-CH(R^9)-$ または $>C=CR^9R^{9'}$ [式中、炭素は、 $-N(R^{11})C(O)-$ のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

G は、任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキレン、任意に置換された $C_1 - C_4$ アルケニレン、任意に置換された $C_1 - C_4$ ヘテロアルキレン、 $-C(O)O-CH(R^6)-$ [式中、2 番目の C は $-C(R^7R^8)-$ に結合している。]、 $-C(O)NH-CH(R^6)-$ [式中、2 番目の C は $-C(R^7R^8)-$ に結合している。]、任意に置換された $C_1 - C_4$ ヘテロアルキレン、または 3 ~ 8 員のヘテロアリーレンであり、

X^1 は、任意に置換された $C_1 - C_2$ アルキレン、NR、O、または $S(O)_n$ であり、

X^2 は O または NH であり、

X^3 は N または CH であり、

n は、0、1、または 2 であり、

R は、水素、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、任意に置換された $C_2 -$

10

20

30

40

50

C_4 アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C(O)R'$ 、 $C(O)OR'$ 、 $C(O)N(R')_2$ 、 $S(O)R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、または $S(O)_2N(R')_2$ であり、

各 R' は独立して、 H または任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキルであり、

Y^1 は、 C 、 CH 、または N であり、

Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、及び Y^7 は独立して、 C または N であり、

Y^5 は、 CH 、 CH_2 、または N であり、

Y^6 は、 $C(O)$ 、 CH 、 CH_2 、または N であり、

R^1 は、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルケニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリール、または、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリールであるか、あるいは、

10

R^1 及び R^2 は、それらが結合する原子と共に組み合わせたり、任意に置換された 3 ~ 4 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^2 は、存在しないか、水素、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 6 員のアリール、任意に置換された 5 または 6 員のヘテロアリールであり、 R^3 は存在しないか、あるいは、

20

R^2 及び R^3 は、それらが結合する原子と組み合わせたり、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキルまたは任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

R^4 は存在しないか、水素、ハロゲン、シアノ、または、1 ~ 3 個のハロゲンで任意に置換されたメチルであり、

R^5 は、水素、ハロゲンで任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、シアノ、ヒドロキシ、または $C_1 - C_4$ アルコキシ、シクロプロピル、またはシクロブチルであり、

R^6 は水素またはメチルであり、 R^7 は水素、ハロゲン、または、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、あるいは、

R^6 及び R^7 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせたり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し

30

R^8 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R^7 及び R^8 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせたり、 $C = CR^7R^8$ 、 $C = N(OH)$ 、 $C = N(O - C_1 - C_3 \text{ アルキル})$ 、 $C = O$ 、 $C = S$ 、 $C = NH$ 、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

40

R^{7a} 及び R^{8a} は独立して、水素、ハロ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであるか、または、それらが結合する炭素と組み合わせたり、カルボニルを形成し、

R^7 は、水素、ハロゲン、または任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキルであり、 R^8 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルコキシ、任意に置換された $C_1 - C_3$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキニル、任意に置換された 3 ~ 8 員のシクロアルキル、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキル、任意に置換された 5 ~ 10 員のヘテロアリール、または、任意に置換された 6 ~ 10 員のアリールであるか、あるいは、

R^7 及び R^8 は、それらが結合する炭素原子と組み合わせたり、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成

50

し、

R^9 は、水素、F、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであるか、あるいは、

R^9 及び L は、それらが結合する原子と共に組み合わせり、任意に置換された 3 ~ 14 員のヘテロシクロアルキルを形成し、

$R^{9'}$ は、水素または任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^{10a} は、水素またはハロゲンであり、

R^{11} は、水素または $C_1 - C_3$ アルキルであり、かつ、

R^{34} は、水素または $C_1 - C_3$ アルキルである。]。

10

【誤訳訂正 29】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0339

【訂正方法】変更

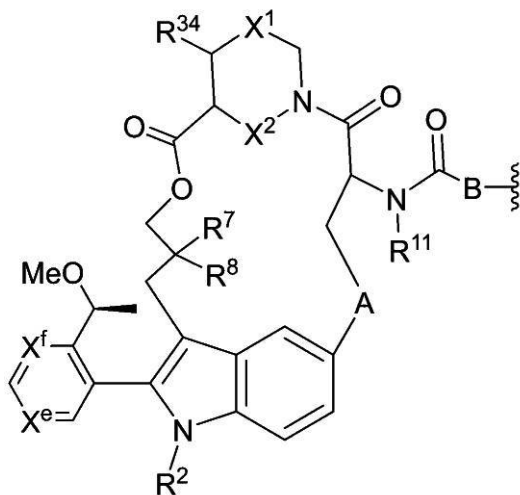
【訂正の内容】

【0339】

[81] M が式 V c の構造を有する、段落 [80] に記載のコンジュゲート、またはその塩：

【化 77】

20



30

式 V c

[式中、A は、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

B は、 $-CH(R^9)-$ [式中、炭素は、 $-NHC(O)-$ のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

40

X^1 は、任意に置換された $C_1 - C_2$ アルキレン、NR、O、または $S(O)_n$ であり、

X^2 は O または NH であり、

n は、0、1、または 2 であり、

R は、水素、シアノ、任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキル、任意に置換された $C_2 - C_4$ アルケニル、任意に置換された $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C(O)R'$ 、 $C(O)OR'$ 、 $C(O)N(R')_2$ 、 $S(O)R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、または $S(O)_2N(R')_2$ で

50

あり、

各 R^1 は独立して、H または任意に置換された $C_1 - C_4$ アルキルであり、

X^e 及び X^f は独立して、N または CH であり、

R^2 は、 $C_1 - C_6$ アルキルまたは 3 ~ 6 員のシクロアルキルであり、

R^7 は、 $C_1 - C_3$ アルキルであり、

R^8 は、 $C_1 - C_3$ アルキルであり、かつ、

R^9 は、任意に置換された $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換された $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであるか、あるいは、

R^{11} は、水素または $C_1 - C_3$ アルキルであり、かつ、

R^{34} は、水素または $C_1 - C_3$ アルキルである。]。

10

【誤訳訂正 3 0】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 3 4 1

【訂正方法】変更

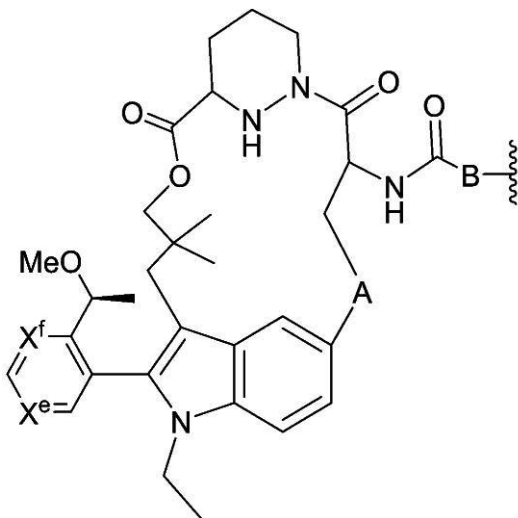
【訂正の内容】

【0 3 4 1】

[8 2] M が式 V d の構造を有する、段落 [8 0] または [8 1] に記載のコンジュゲート、またはその塩：

【化 7 8】

20



30

式 V d

[式中、A は、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または、任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

40

B は、 $-CH(R^9)-$ [式中、炭素は、 $-NHCO-$ のカルボニル炭素に結合するもの]、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキレン、任意に置換された 3 ~ 6 員のヘテロシクロアルキレン、任意に置換された 6 員のアリーレン、または 5 ~ 6 員のヘテロアリーレンであり、

L は存在しないか、またはリンカーであり、

W は、カルボジイミド、オキサゾリン、チアゾリン、クロロエチル尿素、クロロエチルチオ尿素、クロロエチルカルバメート、クロロエチルチオカルバメート、アジリジン、トリフルオロメチルケトン、ボロン酸、ボロン酸エステル、N - エトキシカルボニル - 2 - エトキシ - 1, 2 - ジヒドロキノリン (E E D Q)、イソ E E D Q もしくは他の E E D Q 誘導体、エポキシド、オキサゾリウム、またはグリカールを含む架橋基であり、

50

R⁹ は、任意に置換された C₁ - C₆ アルキル、任意に置換された C₁ - C₆ ヘテロアルキル、任意に置換された 3 ~ 6 員のシクロアルキル、または、任意に置換された 3 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルであり、

X^e 及び X^f は独立して、N または C H である。]。

10

20

30

40

50