

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成26年7月31日(2014.7.31)

【公表番号】特表2012-510993(P2012-510993A)

【公表日】平成24年5月17日(2012.5.17)

【年通号数】公開・登録公報2012-019

【出願番号】特願2011-539520(P2011-539520)

【国際特許分類】

C 07 D 487/14	(2006.01)
A 61 P 25/16	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 25/14	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 25/24	(2006.01)
A 61 P 25/22	(2006.01)
A 61 P 25/20	(2006.01)
A 61 P 25/30	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 9/12	(2006.01)
A 61 P 15/00	(2006.01)
A 61 P 11/06	(2006.01)
A 61 P 11/00	(2006.01)
A 61 P 11/02	(2006.01)
A 61 P 37/08	(2006.01)
A 61 P 37/06	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 19/10	(2006.01)
A 61 P 13/08	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 27/06	(2006.01)
A 61 P 27/02	(2006.01)
A 61 P 25/18	(2006.01)
A 61 K 31/5575	(2006.01)
A 61 K 31/519	(2006.01)

【F I】

C 07 D 487/14	C S P
A 61 P 25/16	
A 61 P 25/00	
A 61 P 25/14	
A 61 P 25/28	
A 61 P 25/24	
A 61 P 25/22	
A 61 P 25/20	
A 61 P 25/30	
A 61 P 9/00	
A 61 P 9/12	
A 61 P 15/00	
A 61 P 11/06	

A 6 1 P 11/00  
 A 6 1 P 11/02  
 A 6 1 P 37/08  
 A 6 1 P 37/06  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 19/10  
 A 6 1 P 13/08  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1  
 A 6 1 P 27/06  
 A 6 1 P 27/02  
 A 6 1 P 25/18  
 A 6 1 K 31/5575  
 A 6 1 K 31/519

## 【誤訳訂正書】

【提出日】平成26年6月11日(2014.6.11)

## 【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

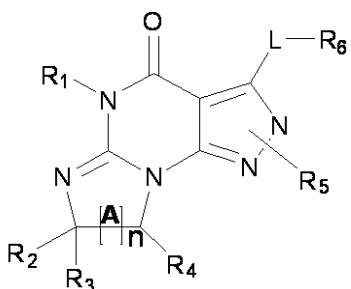
## 【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

遊離形または塩形態の、式II：

## 【化1】



## 式II

[式中、

(i) Lは、-S-、-SO-または-SO<sub>2</sub>-であり；(ii) R<sub>1</sub>は、HまたはC<sub>1-4</sub>アルキルであり；

(iii) R<sub>4</sub>は、HまたはC<sub>1-6</sub>アルキルであり、そしてR<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>は、独立して、H、または所望によりハロもしくはヒドロキシで置換されていてよいC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、(所望によりヘテロ)アリールアルコキシ、(所望によりヘテロ)アリールC<sub>1-6</sub>アルキルであるか、またはR<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>は、一体となって、3ないし6員環を形成するか；

または

R<sub>2</sub>はHであり、そしてR<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、一体となって、ジ-、トリ-またはテトラメチレン架橋を形成し(ここで、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、一体となってc i s配置であっても

よい。) ;

( i v ) R<sub>5</sub> は、

a ) - D - E - F

[ 式中、

D は、 C<sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキレンであり；

E は、 単結合、 C<sub>2</sub> - <sub>4</sub> アルキニレン、 アリーレンまたはヘテロアリーレンであり；

F は、

H、

アリール、

ヘテロアリール、

ハロ、

ハロ C<sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、

- C(O) - R<sub>1</sub> - <sub>5</sub>、

- N(R<sub>1</sub> - <sub>6</sub>) (R<sub>1</sub> - <sub>7</sub>)、

- S(O)<sub>2</sub> R<sub>2</sub> - <sub>1</sub>、または

所望により N または O からなる群から選択される少なくとも 1 個の原子を含んでいてよい

C<sub>3</sub> - <sub>7</sub> シクロアルキル

であり；

ここで、 D、 E および F は、 独立して、 かつ所望により、 1 個以上のハロ、

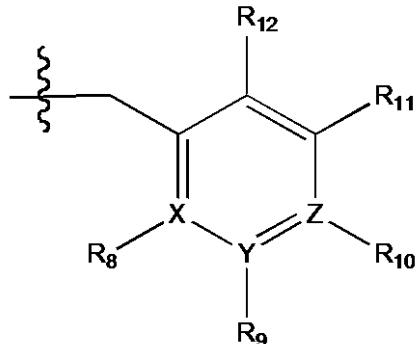
C<sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、 または

ハロ C<sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル

で置換されていてよいか； または

b ) 式 I I のピラゾロ部分上の窒素の 1 つに結合し、 式 A

【化 2】



式A

[ 式中、 X、 Y および Z は、 独立して、 N または C であり、 そして R<sub>8</sub>、 R<sub>9</sub>、 R<sub>1</sub> - <sub>1</sub> および R<sub>1</sub> - <sub>2</sub> は、 独立して、 H またはハロゲンであり、 そして R<sub>1</sub> - <sub>0</sub> は、

ハロゲン、

C<sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、

C<sub>3</sub> - <sub>7</sub> シクロアルキル、

ヘテロ C<sub>3</sub> - <sub>7</sub> シクロアルキル、

C<sub>1</sub> - <sub>4</sub> ハロアルキル、

アリール、

ヘテロアリール、

アリールカルボニル、

アルキルスルホニル、

ヘテロアリールカルボニル、 または

アルコキシカルボニルであり、

ここで、該アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルまたはヘテロシクロアルキルは、所望により1個以上のハロ、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ ハロアルキル、または-SHで置換されていてよい。

ただし、X、YまたはZが窒素のとき、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>またはR<sub>10</sub>は、それぞれ存在しない。]

で示される部分であり；

(v) R<sub>6</sub>は、

H、

$C_{1-4}$ アルキル、

$C_{3-7}$ シクロアルキル、

アリール、

ヘテロアリール、

アリール $C_{1-4}$ アルキル、

アリールアミノ、

ヘテロアリールアミノ、

N,N-ジ $C_{1-4}$ アルキルアミノ、

N,N-ジアリールアミノ、

N-アリール-N-(アリール $C_{1-4}$ アルキル)アミノ、または

-N(R<sub>18</sub>)(R<sub>19</sub>)であり；

ここで、該アリールまたはヘテロアリールは、所望により1個以上のハロ、ヒドロキシまたは $C_{1-6}$ アルコキシで置換されていてよく、

(vi)n=0または1であり；

(vii)n=1のとき、Aは、-C(R<sub>13</sub>R<sub>14</sub>)-（式中、R<sub>13</sub>およびR<sub>14</sub>は、独立して、Hまたは $C_{1-4}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、（所望により、ヘテロ）アリール $C_{1-4}$ アルコキシ、または（所望により、ヘテロ）アリール $C_{1-4}$ アルキルであるか、またはR<sub>13</sub>またはR<sub>14</sub>は、R<sub>2</sub>またはR<sub>4</sub>と架橋形成してよい。）であり；

(viii)R<sub>15</sub>は、 $C_{1-4}$ アルキル、ハロ $C_{1-4}$ アルキル、-OHまたは-OCH<sub>1-4</sub>アルキルであり、

(ix)R<sub>16</sub>およびR<sub>17</sub>は、独立して、Hまたは $C_{1-4}$ アルキルであり；

(x)R<sub>18</sub>およびR<sub>19</sub>は、独立して、H、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、ヘテロ $C_{3-8}$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、ここで、該アリールまたはヘテロアリールは、所望により1個以上のハロ、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、または $C_{3-8}$ シクロアルキルで置換されていてよく、

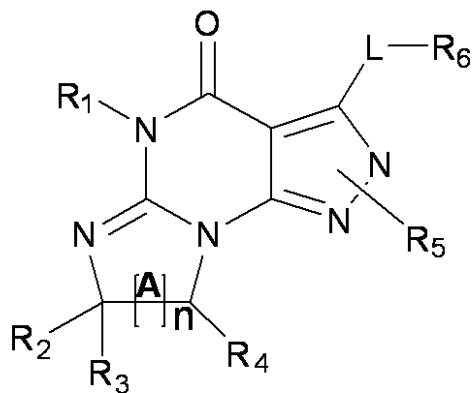
(xi)R<sub>21</sub>は、 $C_{1-6}$ アルキルである。]

で示される化合物。

【請求項2】

遊離形または塩形態の、式I

【化3】



式I

〔式中、

(i) Lは、単結合、-S-、-SO-または-SO<sub>2</sub>-であり；(ii) R<sub>1</sub>は、HまたはC<sub>1-4</sub>アルキルであり；(iii) R<sub>4</sub>は、HまたはC<sub>1-6</sub>アルキルであり、そしてR<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>は、独立して、H、または所望によりハロもしくはヒドロキシで置換されていてよいC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、(所望によりヘテロ)アリールアルコキシ、または(所望によりヘテロ)アリールC<sub>1-6</sub>アルキルであるか；

または、

R<sub>2</sub>はHであり、そしてR<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、一体となって、ジ-、トリ-またはテトラメチレン架橋を形成し(ここで、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、一体となって、c i s配置であつてもよい。)；(iv) R<sub>5</sub>は、

a) -D-E-F

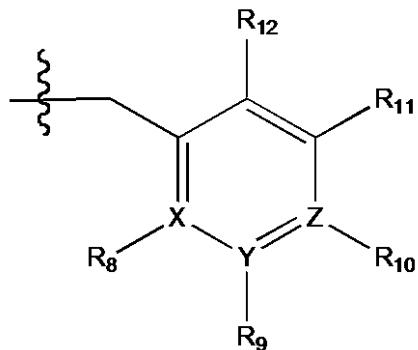
〔式中、

Dは、C<sub>1-4</sub>アルキレンであり；Eは、単結合、C<sub>2-4</sub>アルキニレン、アリーレンまたはヘテロアリーレンであり；Fは、H、アリール、ヘテロアリール、ハロ、ハロC<sub>1-4</sub>アルキル、-C(O)-R<sub>1-5</sub>、-N(R<sub>1-6</sub>)(R<sub>1-7</sub>)、-S(O)<sub>2</sub>R<sub>2-1</sub>、または所望によりNもしくはOからなる群から選択される少なくとも1個の原子を含んでいてよいC<sub>3-7</sub>シクロアルキルであり；ここで、D、EおよびFは、独立して、かつ所望により、1個以上のハロ、C<sub>1-4</sub>アルキル、ハロC<sub>1-4</sub>アルキルで置換されていてよい。〕

であるか；または

b) 式Iのピラゾロ部分上の窒素の1つに結合し、式A

【化4】



式A

[式中、X、YおよびZは、独立して、NまたはCであり、そしてR<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>11</sub>およびR<sub>12</sub>は、独立して、Hまたはハロゲンであり、そしてR<sub>10</sub>は、ハロゲン、C<sub>1</sub>-<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-<sub>7</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>-<sub>4</sub>ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アリールカルボニル、アルキルスルホニル、ヘテロアリールカルボニル、またはアルコキシカルボニルである。

ただし、X、YまたはZが窒素のとき、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>またはR<sub>10</sub>は、それぞれ存在しない。]

で示される部分であり；

(v) R<sub>6</sub>は、

H、

C<sub>1</sub>-<sub>4</sub>アルキル、

C<sub>3</sub>-<sub>7</sub>シクロアルキル、

アリール、

ヘテロアリール、

アリールC<sub>1</sub>-<sub>4</sub>アルキル、

アリールアミノ、

ヘテロアリールアミノ、

N,N-ジC<sub>1</sub>-<sub>4</sub>アルキルアミノ、

N,N-ジアリールアミノ、

N-アリール-N-(アリールC<sub>1</sub>-<sub>4</sub>アルキル)アミノ、または  
-N(R<sub>18</sub>)(R<sub>19</sub>)であり；

ここで、該アリールまたはヘテロアリールは、所望により1個以上のハロ、ヒドロキシまたはC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルコキシで置換されていてよい、

(vi)n=0または1であり；

(vii)n=1のとき、Aは、-C(R<sub>13</sub>R<sub>14</sub>)-（式中、R<sub>13</sub>およびR<sub>14</sub>は、独立して、HまたはC<sub>1</sub>-<sub>4</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、（所望により、ヘテロ）アリールC<sub>1</sub>-<sub>4</sub>アルコキシ、または（所望により、ヘテロ）アリールC<sub>1</sub>-<sub>4</sub>アルキルであり；

(viii)R<sub>15</sub>は、C<sub>1</sub>-<sub>4</sub>アルキル、ハロC<sub>1</sub>-<sub>4</sub>アルキル、-OHまたは-OCH<sub>1</sub>-<sub>4</sub>アルキルであり、

(ix)R<sub>16</sub>およびR<sub>17</sub>は、独立して、HまたはC<sub>1</sub>-<sub>4</sub>アルキルであり；

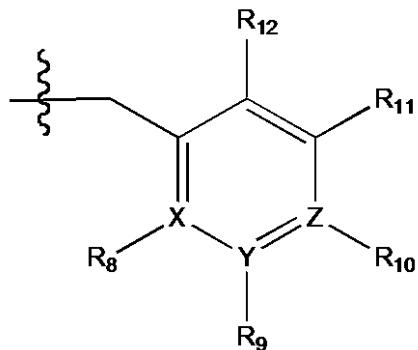
(x)R<sub>18</sub>およびR<sub>19</sub>は、独立して、H、C<sub>1</sub>-<sub>4</sub>アルキルまたはアリールであり、ここで、該アリールは、所望により1個以上のハロまたはヒドロキシで置換されていてよい、

(xi)R<sub>21</sub>は、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルである。]

で示される化合物。

**【請求項3】**R<sub>6</sub> がH、C<sub>1</sub> - 4 アルキル、C<sub>3</sub> - 7 シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、またはアリール C<sub>1</sub> - 4 アルキルであり；ここで、該アリールまたはヘテロアリールが、所望により1個以上のハロ、ヒドロキシまたはC<sub>1</sub> - 6 アルコキシで置換されていてよい、請求項1または2記載の遊離形または塩形態の化合物。**【請求項4】**R<sub>2</sub> が H であり、そして R<sub>3</sub> および R<sub>4</sub> が、一体となって、ジ-、トリ- または テトラメチレン架橋を形成する、請求項1～3のいずれか一項記載の遊離形または塩形態の化合物。**【請求項5】**R<sub>6</sub> が C<sub>1</sub> - 4 アルキル、ピリジルまたはアリールであり；ここで、該アリールが、所望により1個以上のハロ、ヒドロキシまたはC<sub>1</sub> - 6 アルコキシで置換されていてよい、  
請求項1～4のいずれか一項記載の遊離形または塩形態の化合物。**【請求項6】**R<sub>5</sub> が -D-E-F であり、D がメチレンであり、E がフェニレンであり、F が 6 - フルオロピリド - 2 - イル、5 - フルオロピリド - 2 - イル、4 - フルオロピリド - 2 - イルおよび 3 - フルオロピリド - 2 - イルから選択される、請求項1～5のいずれか一項記載の遊離形または塩形態の化合物。**【請求項7】**R<sub>4</sub> が H または C<sub>1</sub> - 6 アルキルであり、そして R<sub>2</sub> および R<sub>3</sub> がどちらもメチルである、  
請求項1～3のいずれか一項記載の遊離形または塩形態の化合物。**【請求項8】**R<sub>6</sub> が C<sub>1</sub> - 4 アルキル、ピリジルまたはアリールであり；ここで、該アリールが、所望により1個以上のハロ、ヒドロキシまたはC<sub>1</sub> - 6 アルコキシで置換されていてよい、  
請求項1～3および7のいずれか一項記載の遊離形または塩形態の化合物。**【請求項9】**R<sub>5</sub> が -D-E-F であり、D がメチレンであり、E がフェニレンであり、F が 6 - フルオロピリド - 2 - イル、5 - フルオロピリド - 2 - イル、4 - フルオロピリド - 2 - イルおよび 3 - フルオロピリド - 2 - イルから選択される、請求項1～3、7および8のいずれか一項記載の遊離形または塩形態の化合物。**【請求項10】**L が -S- である、  
請求項1～9のいずれか一項記載の遊離形または塩形態の化合物。**【請求項11】**R<sub>5</sub> が、式IIのピラゾロ部分上の窒素の1つに結合し、式A

## 【化5】



式A

[式中、X、YおよびZは、独立して、NまたはCであり、そしてR<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>11</sub>およびR<sub>12</sub>は、独立して、Hまたはハロゲンであり、そしてR<sub>10</sub>は、  
ヘテロC<sub>3</sub>-7シクロアルキル、

アリール、または

ヘテロアリール

であり、

ここで、該アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキルは、所望により1個以上のハロ、C<sub>1</sub>-4アルキル、C<sub>1</sub>-4アルコキシ、C<sub>1</sub>-4ハロアルキル、または-SHで置換されていてよい。

ただし、X、YまたはZが窒素のとき、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>またはR<sub>10</sub>は、それぞれ存在しない。]

で示される部分であり；

R<sub>6</sub>が、

H、

C<sub>1</sub>-4アルキル、

アリール、または

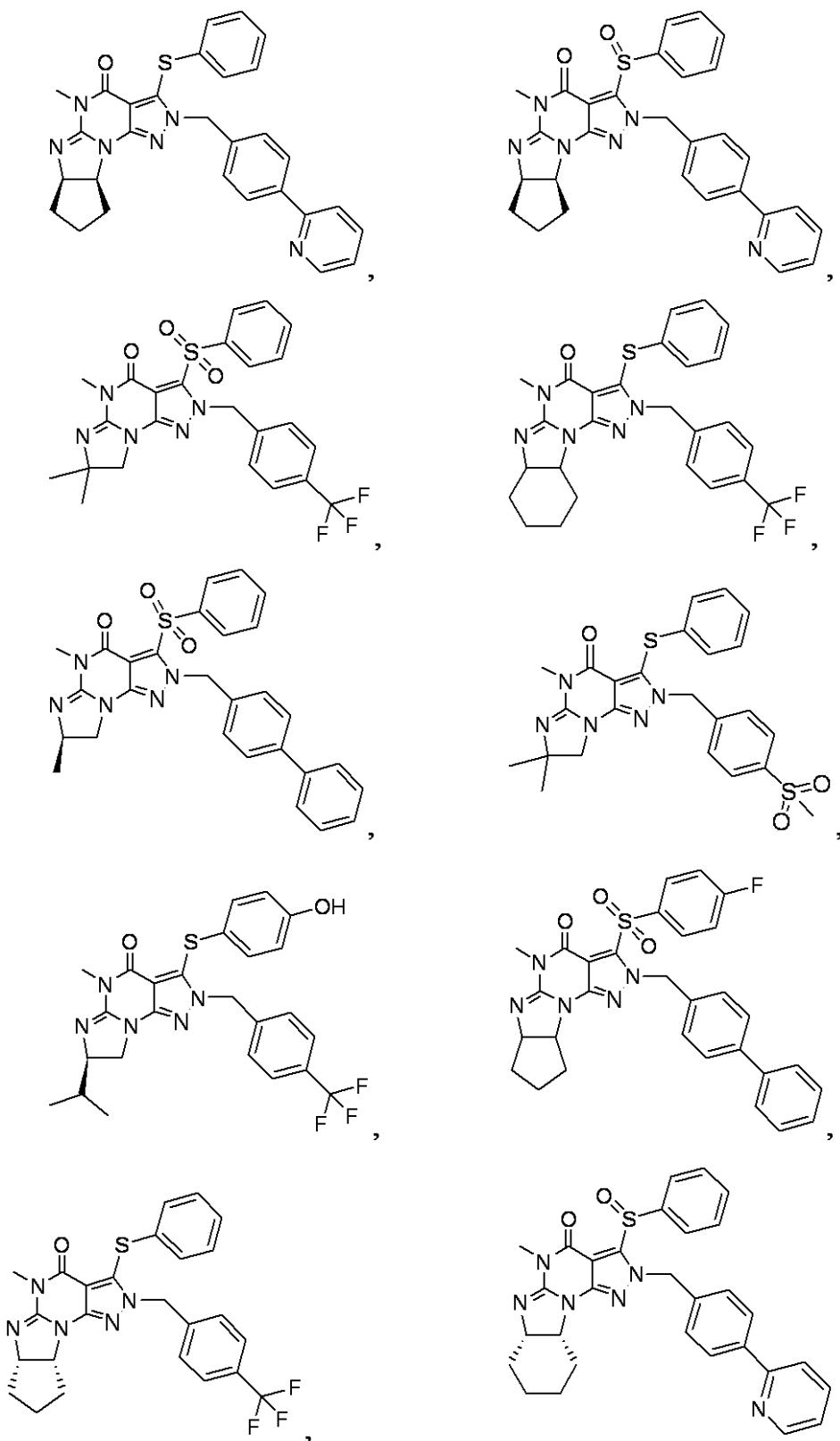
ヘテロアリールであり；

ここで、該アリールまたはヘテロアリールは、所望により1個以上のハロ、ヒドロキシまたはC<sub>1</sub>-6アルコキシで置換されていてよい、請求項1記載の遊離形または塩形態の化合物。

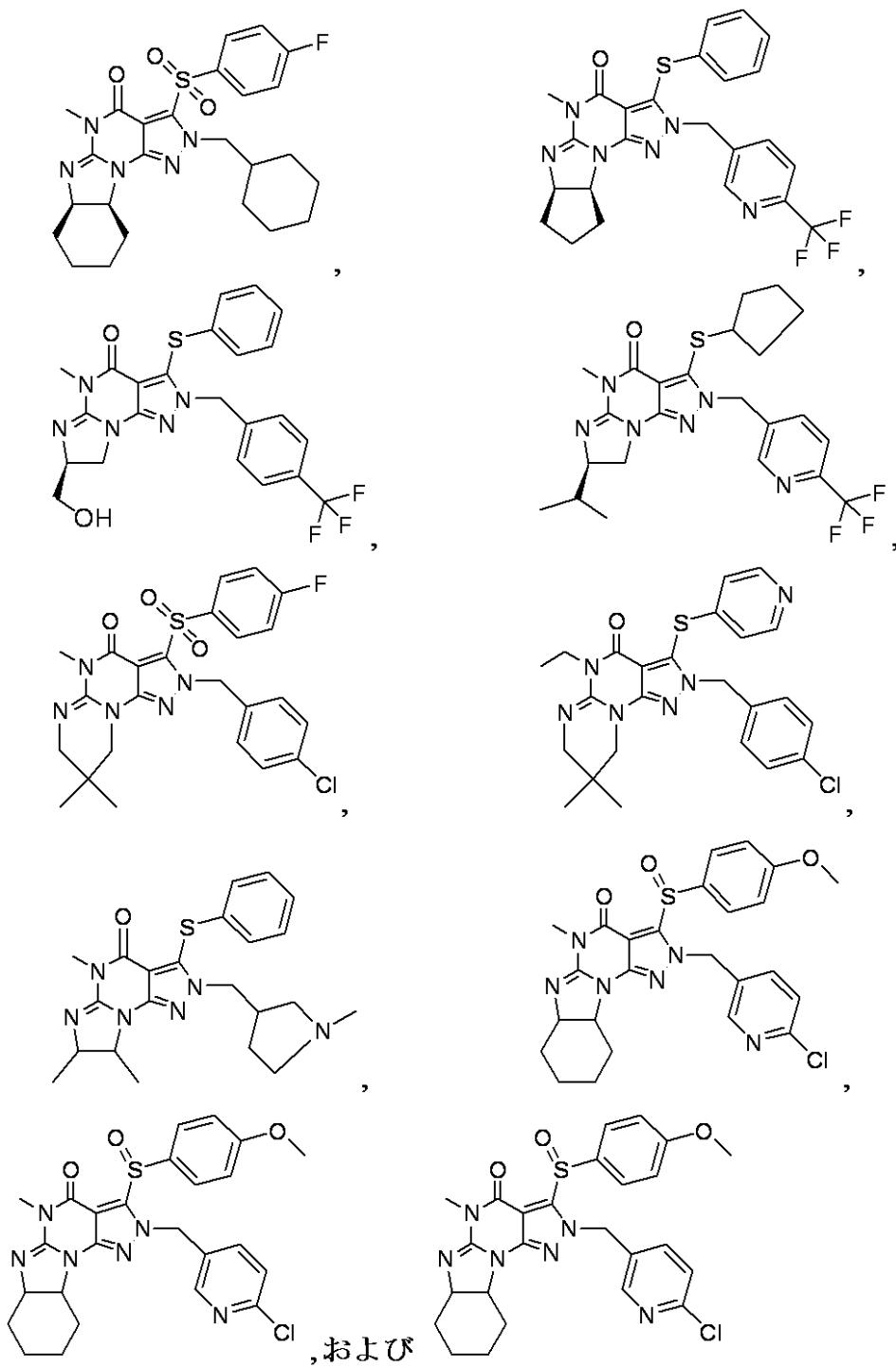
## 【請求項12】

遊離形または塩形態の、以下：

【化 6】



【化 7】

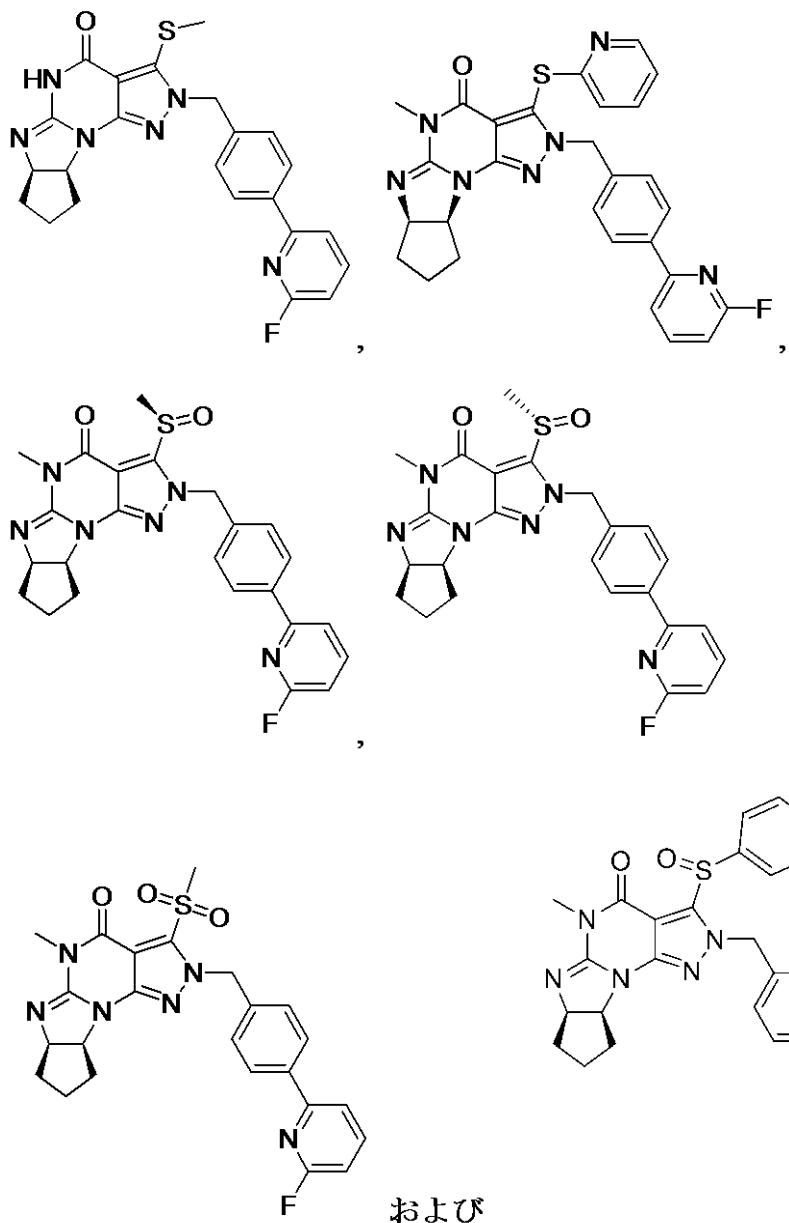


の何れかから選択される、請求項 1 または 2 記載の遊離形または塩形態の化合物。

【請求項 1 3】

遊離形または塩形態の、以下：

【化 8】

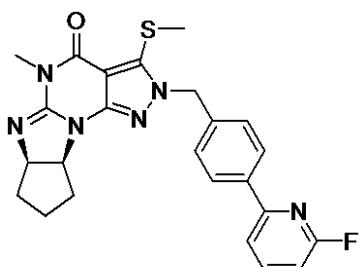
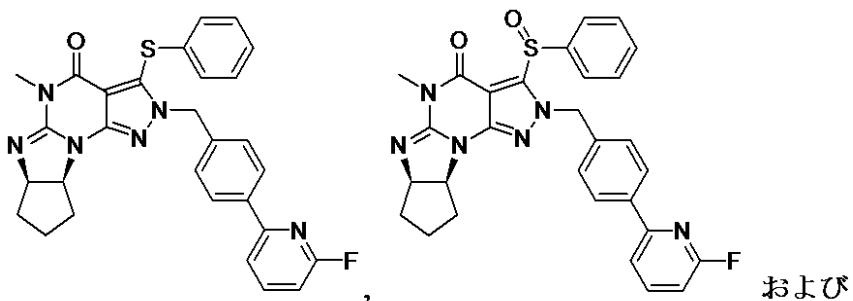


の何れかから選択される、請求項 1 または 2 記載の遊離形または塩形態の化合物。

【請求項 1~4】

遊離形または塩形態の、以下：

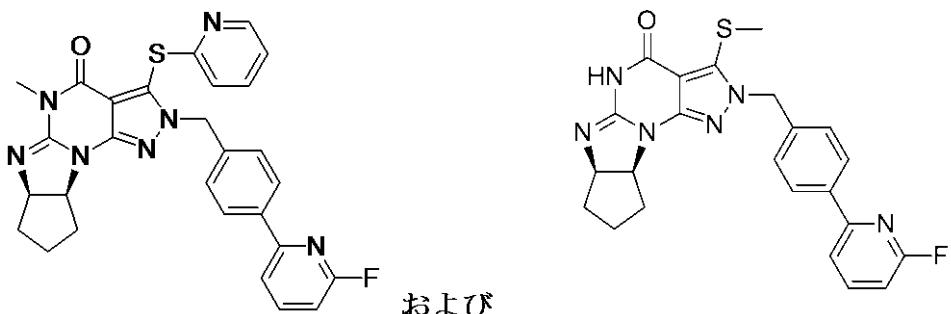
【化9】

の何れかから選択される、請求項1または2記載の遊離形または塩形態の化合物。

【請求項15】

遊離形または塩形態の、以下：

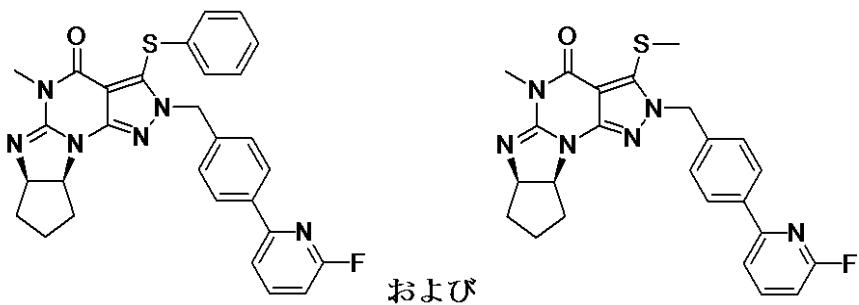
【化10】

の何れかから選択される、請求項1または2記載の遊離形または塩形態の化合物。

【請求項16】

遊離形または塩形態の、以下：

【化11】

の何れかから選択される、請求項1、2または14記載の遊離形または塩形態の化合物。

【請求項17】

請求項1～16のいずれか一項記載の化合物を、薬学的に許容される希釈剤または担体と混合して含む、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】 0066

## 【訂正方法】変更

## 【訂正の内容】

〔 0 0 6 6 〕

本発明のチオ化合物、例えば、式 I または II (式中、L は -S- である)、または化合物 (I) - B は、化合物 (IVf) を、例えば、ジスルフィドおよびリチウムビス(トリメチルシリル)アザニド (LiHMDS) と反応させて製造され得る。

