

【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 07D 487/14 (2006.01)

A 61P 25/16 (2006.01)

A 61P 25/00 (2006.01)

A 61P 25/14 (2006.01)

A 61P 25/28 (2006.01)

A 61P 25/24 (2006.01)

A 61P 25/22 (2006.01)

A 61P 25/20 (2006.01)

A 61P 25/30 (2006.01)

A 61P 9/00 (2006.01)

A 61P 9/12 (2006.01)

A 61P 15/00 (2006.01)

A 61P 11/06 (2006.01)

A 61P 11/00 (2006.01)

A 61P 11/02 (2006.01)

A 61P 37/08 (2006.01)

A 61P 37/06 (2006.01)

A 61P 29/00 (2006.01)

A 61P 19/10 (2006.01)

A 61P 13/08 (2006.01)

A 61P 35/00 (2006.01)

A 61P 43/00 (2006.01)

A 61P 27/06 (2006.01)

A 61P 27/02 (2006.01)

A 61P 25/18 (2006.01)

A 61K 31/5575 (2006.01)

A 61K 31/519 (2006.01)

【F I】

C 07D 487/14 C S P

A 61P 25/16

A 61P 25/00

A 61P 25/14

A 61P 25/28

A 61P 25/24

A 61P 25/22

A 61P 25/20

A 61P 25/30

A 61P 9/00

A 61P 9/12

A 61P 15/00

A 61P 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

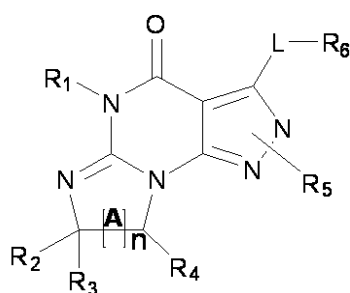
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

遊離形または塩形態の、式 I I :

【化 1】



式 II

[式中、

(i) L は、 - S - 、 - S O - または - S O ₂ - であり；

(i i) R ₁ は、H または C ₁ - 4 アルキルであり；

(i i i) R ₄ は、H または C ₁ - 6 アルキルであり、そして R ₂ および R ₃ 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 ₁ - 6 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 ₁ - 6 アルキルであるか、または R ₂ および R ₃ は、一体となって、3 ないし 6 員環を形成するか；

または

R ₂ は H であり、そして R ₃ および R ₄ 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 ₃ および R ₄ は、一体となって c i s 配置であっても

よい。) ;

(i v) R₅ は、

a) - D - E - F

[式中、

D は、C₁ - 4 アルキレンであり ;

E は、単結合、C₂ - 4 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 C₁ - 4 アルキル、

- C (O) - R₁₅、

- N (R₁₆) (R₁₇)、

- S (O)₂ R₂₁、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

C₃ - 7 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、

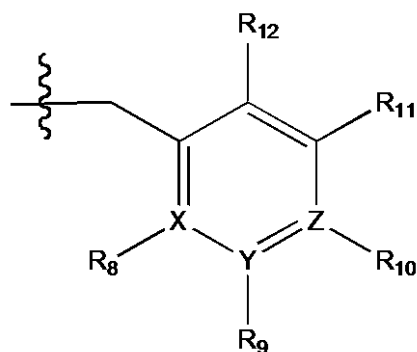
C₁ - 4 アルキル、または

ハロ C₁ - 4 アルキル

で置換されていてよい ; 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 R₈、R₉、R₁₁ お

よび R₁₂ は、独立して、H またはハロゲンであり、そして R₁₀ は、

ハロゲン、

C₁ - 4 アルキル、

C₃ - 7 シクロアルキル、

ヘテロ C₃ - 7 シクロアルキル、

C₁ - 4 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_8 、 R_9 または R_{10} は、それぞれ存在しない。

で示される部分であり；

(v) R_6 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_{18}) (R_{19}) 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_{13} R_{14}) - (式中、 R_{13} および R_{14} 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_{13} または R_{14} は、 R_2 または R_4 と架橋形成してよい。) であり；

(viii) R_{15} は、 C_{1-4} アルキル、ハロ C_{1-4} アルキル、-OH または -O C_{1-4} アルキルであり、

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

(x) R_{18} および R_{19} 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、

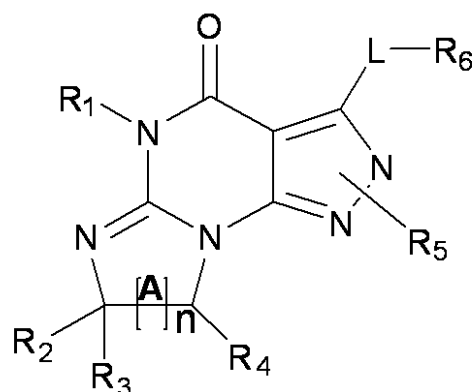
(xi) R_{21} は、 C_{1-6} アルキルである。]

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 $-SO_2-$ であり；

(ii) R_1 は、H または C_{1-4} アルキルであり；

(iii) R_4 は、H または C_{1-6} アルキルであり、そして R_2 および R_3 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_{1-6} 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_{1-6} アルキルであるか；

または、

R_2 は H であり、そして R_3 および R_4 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_3 および R_4 は、一体となって、c i s 配置であって もよい。) ；

(iv) R_5 は、

a) $-D-E-F$

[式中、

D は、 C_{1-4} アルキレンであり；

E は、単結合、 C_{2-4} 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；

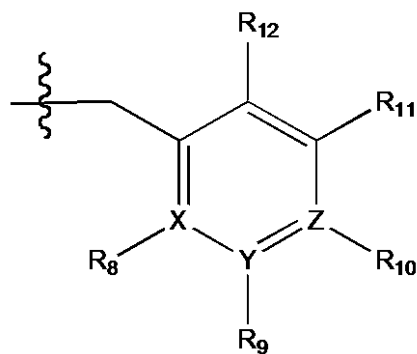
F は、H、アリール、ヘテロアリール、ハロ、ハロ C_{1-4} アルキル、 $-C(O)-R_{15}$ 、 $-N(R_{16})(R_{17})$ 、 $-S(O)_2R_{21}$ 、または所望により N もしくは O からなる群から選択される少なくとも 1 個の原子を含んでいてよい C_{3-7} シクロアルキルであり；

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_{1-4} アルキル、ハロ C_{1-4} 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R₈、R₉、R₁₁およびR₁₂は、独立して、Hまたはハロゲンであり、そしてR₁₀は、ハロゲン、C₁-₄アルキル、C₃-₇シクロアルキル、C₁-₄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、R₈、R₉またはR₁₀は、それぞれ存在しない。〕

で示される部分であり；

(v) R₆は、

H、

C₁-₄アルキル、

C₃-₇シクロアルキル、

アリール、

ヘテロアリール、

アリールC₁-₄アルキル、

アリールアミノ、

ヘテロアリールアミノ、

N,N-ジC₁-₄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C₁-₄アルキル)アミノ、または

-N(R₁₈)(R₁₉)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C₁-₆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(R₁₃R₁₄)- (式中、R₁₃およびR₁₄は、独立して、HまたはC₁-₄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C₁-₄アルコキシ、または(所望により、ヘテロ)アリールC₁-₄アルキルであり；

(viii) R₁₅は、C₁-₄アルキル、ハロC₁-₄アルキル、-OHまたは-OC₁-₄アルキルであり、

(ix) R₁₆およびR₁₇は、独立して、HまたはC₁-₄アルキルであり；

(x) R₁₈およびR₁₉は、独立して、H、C₁-₄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く、

(xi) R₂₁は、C₁-₆アルキルである。〕

で示される化合物。

【請求項 3】

R₆ が
H、
C₁₋₄ アルキル、
C₃₋₇ 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 C₁₋₄ 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 C₁₋₆ 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】

R₂ が H であり、そして R₃ および R₄ 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】

R₆ が C₁₋₄ 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 C₁₋₆ 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】

R₅ 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】

R₄ が H または C₁₋₆ アルキルであり、そして R₂ および R₃ 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】

R₆ が C₁₋₄ 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 C₁₋₆ 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】

R₅ 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。

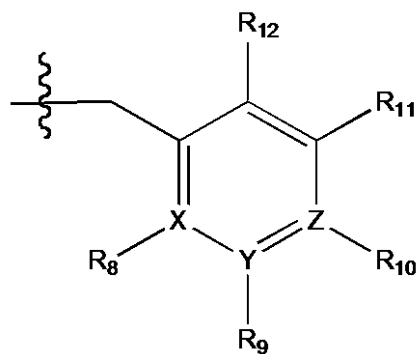
【請求項 10】

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】

R₅ が、式 I I 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R₈、R₉、R₁₁およびR₁₂は、独立して、Hまたはハロゲンであり、そしてR₁₀は、
ヘテロC₃₋₇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、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄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、R₈、R₉またはR₁₀は、それぞれ存在しない。〕

で示される部分であり；

R₆が、

H、

C₁₋₄アルキル、

アリール、または

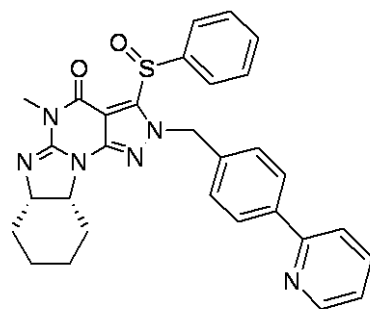
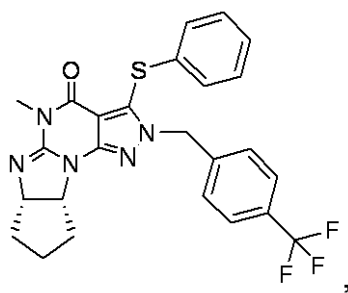
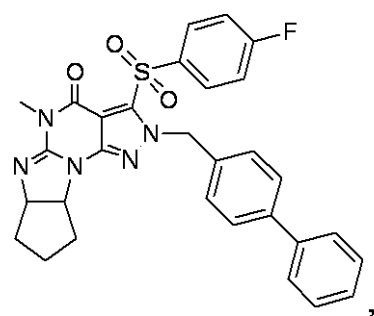
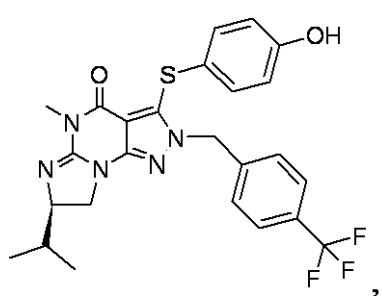
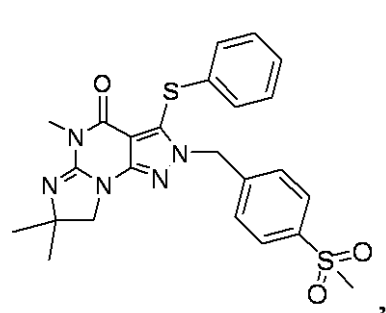
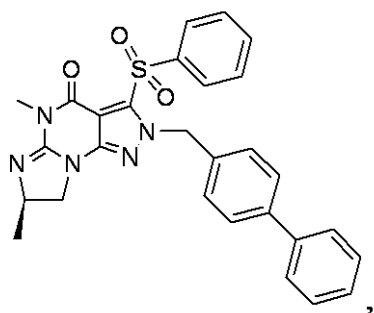
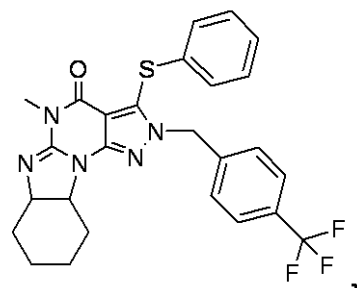
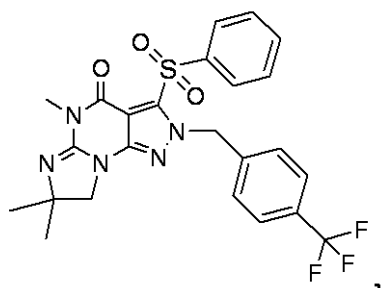
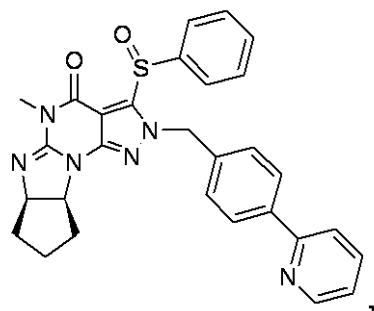
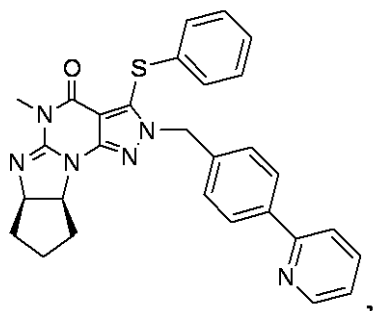
ヘテロアリールであり；

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C₁₋₆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。

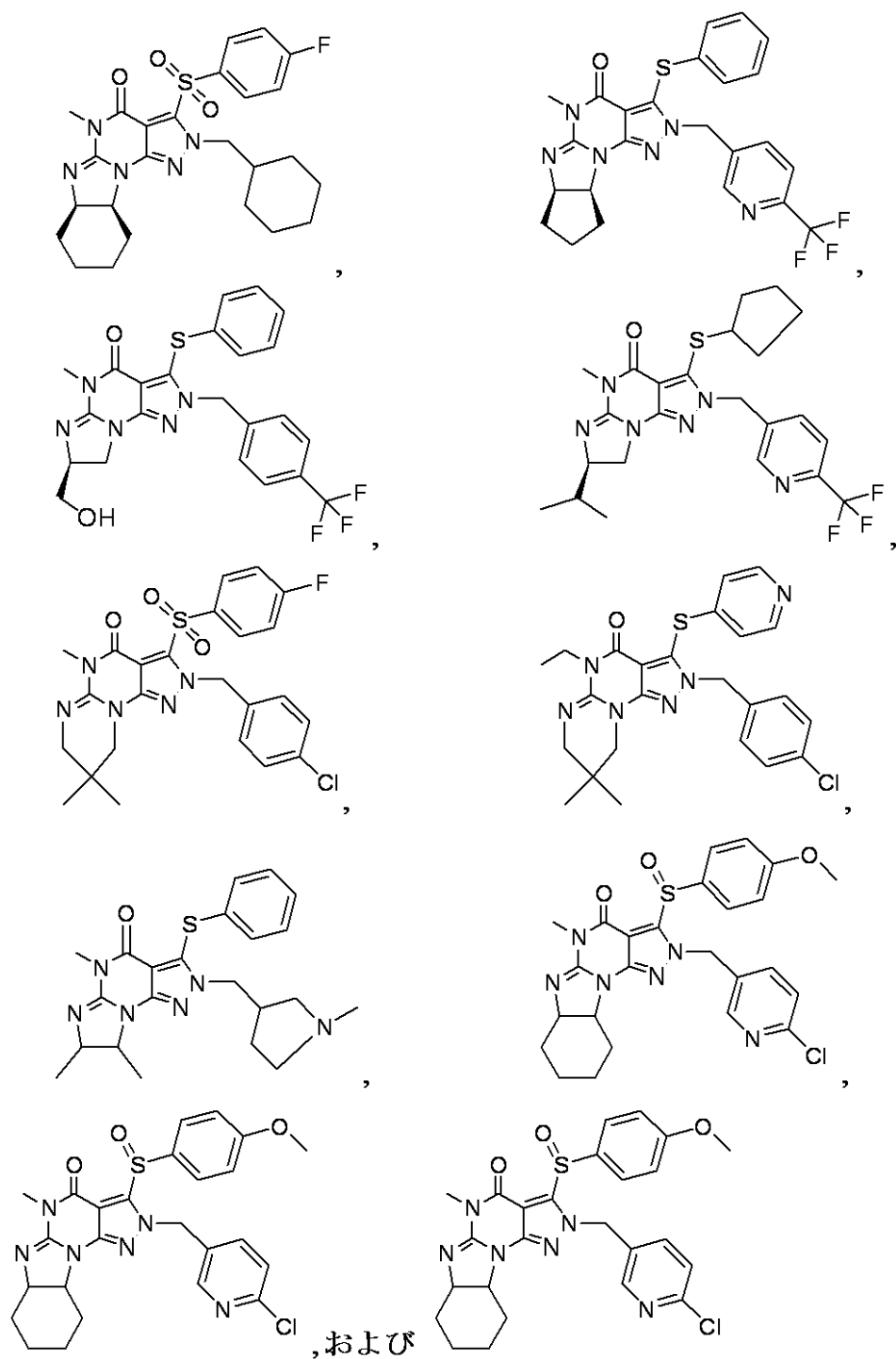
【請求項12】

遊離形または塩形態の、以下：

【化 6】



【化 7】

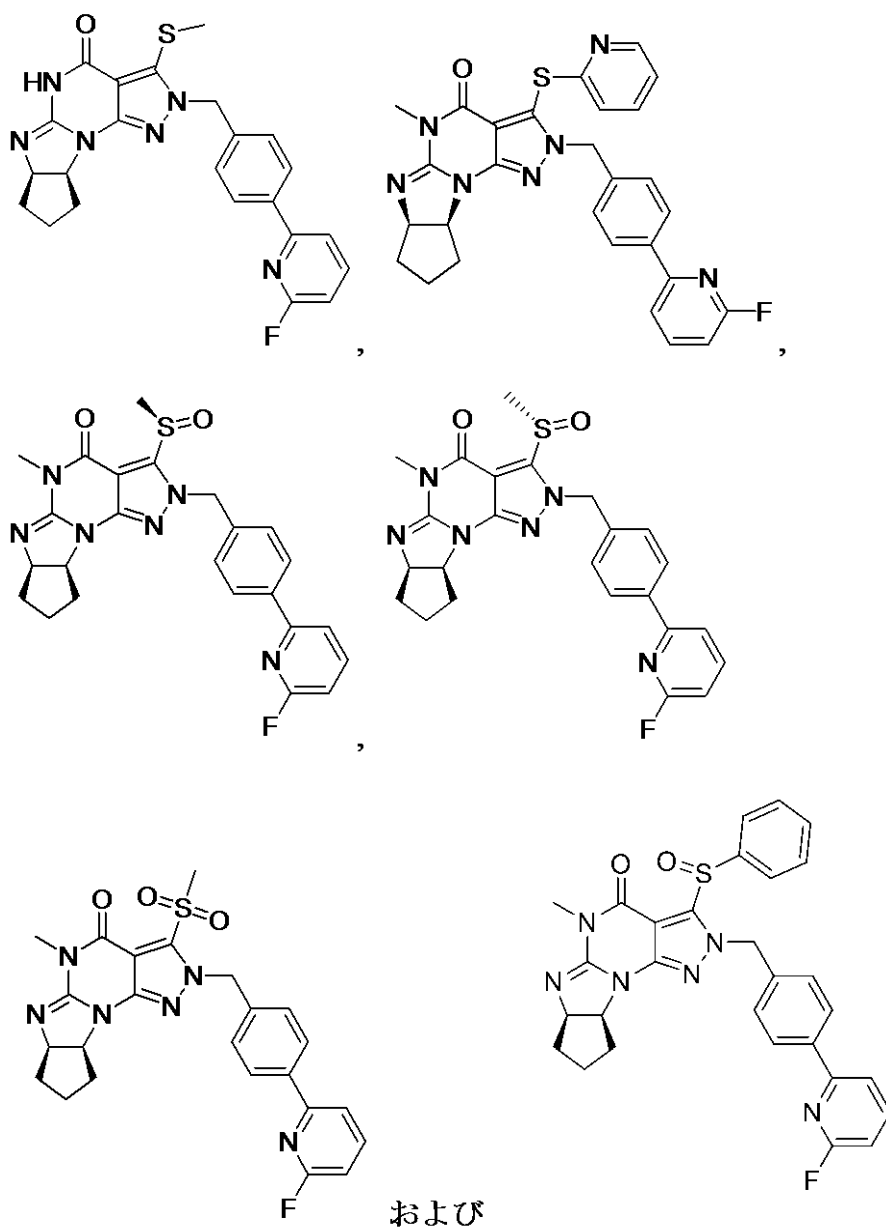


の何れかから選択される、請求項 1 または 2 記載の遊離形または塩形態の化合物。

【請求項 13】

遊離形または塩形態の、以下：

【化 8】

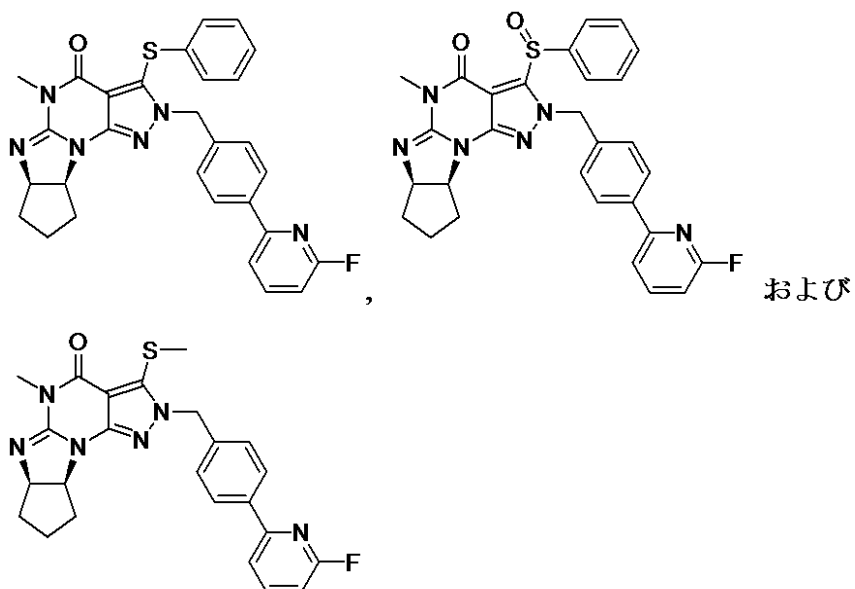


の何れかから選択される、請求項 1 または 2 記載の 遊離形または塩形態の化合物。

【請求項 1 4】

遊離形または塩形態の、以下：

【化 9】

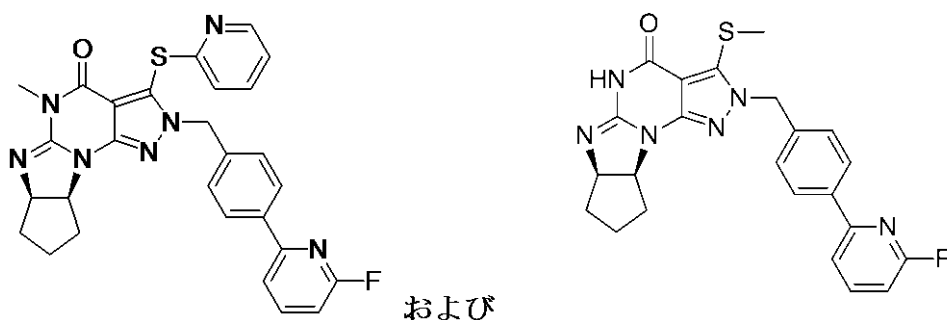


の何れかから選択される、請求項 1 または 2 記載の遊離形または塩形態の化合物。

【請求項 15】

遊離形または塩形態の、以下：

【化 10】

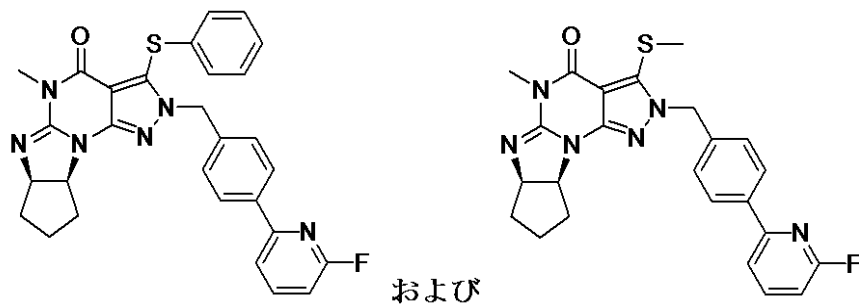


の何れかから選択される、請求項 1 または 2 記載の遊離形または塩形態の化合物。

【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】

【0066】

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。

