

【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28年11月10日(2016.11.10)

【公表番号】特表2015-524828(P2015-524828A)

【公表日】平成27年8月27日(2015.8.27)

【年通号数】公開・登録公報2015-054

【出願番号】特願2015-526856(P2015-526856)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

C 0 7 D 487/10 (2006.01)

C 0 7 D 471/10 (2006.01)

C 0 7 D 498/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/5386 (2006.01)

C 0 7 D 487/08 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 403/04 C S P

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/55

C 0 7 D 487/10

C 0 7 D 471/10 1 0 1

C 0 7 D 498/08

A 6 1 K 31/5386

C 0 7 D 487/08

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 13/02

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 15/10

A 6 1 P 13/08

C 0 7 D 401/04

【誤訳訂正書】

【提出日】平成28年9月13日(2016.9.13)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0015

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0015】

式中、 $R^1$  は、6～7員飽和N含有縮合ヘテロシクリル、7～12員N含有スピロヘテロシクリル及び7～12員N含有架橋ヘテロシクリルからなる群から選択され、これらはそれぞれ窒素を介してピリミジン環に結合されており、ハロゲン原子、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、ヒドロキシル $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシル、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル及び $C_{1-6}$ アルコキシルカルボニルからなる群から選択される置換基で任意に置換されていてもよく、前記置換基数が1～4であり；

$R^2$  は、水素、ヒドロキシル及びメチルからなる群から選択され；

$R^3$  は、水素及び - M -  $R^7$  から選択され、

Mは、単結合及び $C_{1-4}$ アルキレンから選択され、

$R^7$  は、置換基 $L_2$ でそれぞれ任意に置換されていてもよい、フェニル、4～7員シクロアルキル、7～10員スピロシクリル、5～7員単環ヘテロシクリル、5～8員ヘテロアリール、8～9員縮合ヘテロシクリル、6～14員縮合ヘテロアリール、及び7～10員スピロヘテロシクリルからなる群から選択され、

$R^4$  は、水素であり、

或いは、 $R^3$  及び $R^4$  は $R^3$  及び $R^4$  に結合した窒素と共に、置換基 $L_3$ で任意に置換されていてもよい5～6員N含有ヘテロシクリルを形成し、

前記置換基 $L_2$  及び $L_3$  は、ハロゲン原子、ヒドロキシル、アミノ、オキソ、 $C_{1-6}$ アルキル、及びハロ $C_{1-6}$ アルキルからなる群から選択され、前記置換基の数が1～4であり；

$R^5$  は、 - Q -  $R^8$  であり、

Qは、単結合及び $C_{1-4}$ アルキレンから選択され、

$R^8$  は、フェニル、8～9員縮合シクリル及び8～9員縮合ヘテロシクリルからなる群から選択され、これらはそれぞれ置換基 $L_5$ で任意に置換されていてもよく、

前記置換基 $L_5$  は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、カルボキシル $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシル、ハロ $C_{1-6}$ アルコキシル及びジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノからなる群から選択され、前記置換基の数が1～4であり；

$R^6$  は、水素である。

【誤訳訂正2】

【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

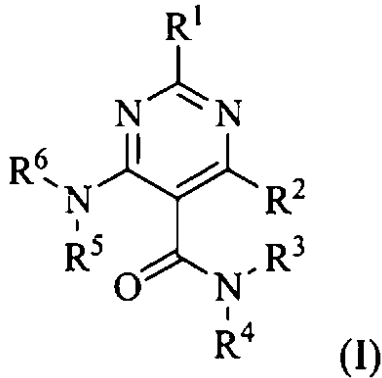
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I：

## 【化 1】



(式中、 $R^1$  は、6～7員飽和N含有縮合ヘテロシクリル、7～12員N含有スピロヘテロシクリル及び7～12員N含有架橋ヘテロシクリルからなる群から選択され、これらはそれぞれ窒素を介してピリミジン環に結合されており、ハロゲン原子、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、ヒドロキシル $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシル、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル及び $C_{1-6}$ アルコキシルカルボニルからなる群から選択される置換基で任意に置換されていてもよく、前記置換基数が1～4であり；

$R^2$  は、水素、ヒドロキシル及びメチルからなる群から選択され；

$R^3$  は、水素及び - M -  $R^7$  から選択され、

M は、単結合及び $C_{1-4}$ アルキレンから選択され、

$R^7$  は、置換基 $L_2$ でそれぞれ任意に置換されていてもよい、フェニル、4～7員シクロアルキル、7～10員スピロシクリル、5～7員単環ヘテロシクリル、5～8員ヘテロアリール、8～9員縮合ヘテロシクリル、6～14員縮合ヘテロアリール、及び7～10員スピロヘテロシクリルからなる群から選択され、

$R^4$  は、水素であり、

或いは、 $R^3$  及び $R^4$  は $R^3$  及び $R^4$  に結合した窒素と共に、置換基 $L_3$ で任意に置換されていてもよい5～6員N含有ヘテロシクリルを形成し、

前記置換基 $L_2$  及び $L_3$  は、ハロゲン原子、ヒドロキシル、アミノ、オキソ、 $C_{1-6}$ アルキル、及びハロ $C_{1-6}$ アルキルからなる群から選択され、前記置換基の数が1～4であり；

$R^5$  は、- Q -  $R^8$  であり、

Q は、単結合及び $C_{1-4}$ アルキレンから選択され、

$R^8$  は、フェニル、8～9員縮合シクリル及び8～9員縮合ヘテロシクリルからなる群から選択され、これらはそれぞれ置換基 $L_5$ で任意に置換されていてもよく、

前記置換基 $L_5$  は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、カルボキシル $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシル、ハロ $C_{1-6}$ アルコキシル及びジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノからなる群から選択され、前記置換基の数が1～4であり；

$R^6$  は、水素である。)の化合物、又はその薬学的に許容される塩若しくは立体異性体

## 【請求項 2】

$R^1$  が、6～7員飽和N含有縮合ヘテロシクリル、7～10員N含有スピロヘテロシクリル及び7～8員N含有架橋ヘテロシクリルからなる群から選択され、これらはそれぞれ窒素を介してピリミジン環に結合されており、ハロゲン原子、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、ヒドロキシル $C_{1-6}$ アルキル及び $C_{1-6}$ アルコキシルからなる群から選択される置換基で任意に置換されていてもよく、前記置換基の数が1～4であり；

$R^3$  が - M -  $R^7$  であり、

M は、単結合及び $C_{1-4}$ アルキレンから選択され、

$R^7$  は、置換基  $L_2$  でそれぞれ任意に置換されていてもよい、フェニル、5～7員単環ヘテロシクリル、4～7員シクロアルキル、5～8員ヘテロアリール、7～10員スピロシクリル及び7～10員スピロヘテロシクリルからなる群から選択され、

或いは、 $R^3$  及び  $R^4$  は  $R^3$  及び  $R^4$  に結合した窒素と共に、置換基  $L_3$  で任意に置換されていてもよい5～6員N含有ヘテロシクリルを形成し、

前記置換基  $L_2$  及び  $L_3$  は、ハロゲン原子、ヒドロキシル、アミノ、オキソ、 $C_{1-6}$  アルキル及びハロ  $C_{1-6}$  アルキルからなる群から選択され、前記置換基の数が1～4であり；

$R^5$  が - Q -  $R^8$  であり、

Q が、メチレン及びエチレンから選択され、

$R^8$  が、フェニル、8～9員縮合シクリル及び8～9員縮合ヘテロシクリルからなる群から選択され、これらはそれぞれ置換基  $L_5$  で任意に置換されていてもよく、

前記置換基  $L_5$  は、フルオロ、クロロ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシル、エトキシル、トリフルオロメトキシル、ジメチルアミノ及びカルボキシメチルからなる群から選択され、前記置換基の数が1～4であり；

$R^2$  が水素であり；

$R^4$  が水素であり；

$R^6$  が水素である、請求項1に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩若しくは立体異性体。

#### 【請求項3】

$R^7$  が、置換基  $L_2$  でそれぞれ任意に置換されていてもよい、フェニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロピロリル、イミダゾリジニル、ピラゾリジニル、ペペリジニル、モルホリニル、ペペラジニル、2-オキソ-アザシクロヘプタニル、2-オキソ-ペペラジニルフラニル、ジヒドロチエニル、ジヒドロピロリル、ジヒドロオキサゾリル、ジヒドロピラゾリル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、チアゾリル、ピラゾリル、ピリミジル、ピリジル、ピラジニル、オキサゾリル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、インドリル、ベンズイミダゾリル、2,3-ジヒドロベンズフラニル、キノリニル、ベンゾ[d][1,3]-メタ-ジオキサシクロペンテニル、7～10員スピロシクリル及び7～10員スピロヘテロシクリルからなる群から選択され、

或いは、 $R^3$  及び  $R^4$  が  $R^3$  及び  $R^4$  に結合した窒素と共に、置換基  $L_3$  で任意に置換されていてもよい5～6員N含有ヘテロシクリルを形成し、

前記置換基  $L_2$  及び  $L_3$  が、ハロゲン原子、ヒドロキシル、アミノ、オキソ、 $C_{1-6}$  アルキル及びハロ  $C_{1-6}$  アルキルからなる群から選択され、前記置換基の数が1～4であり；

$R^8$  が、フェニル、8～9員縮合シクリル及び8～9員縮合ヘテロシクリルからなる群から選択され、これらはそれぞれ置換基  $L_5$  で任意に置換されていてもよく、

前記置換基  $L_5$  は、フルオロ、クロロ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシル、エトキシル、トリフルオロメトキシル、ジメチルアミノ及びカルボキシメチルからなる群から選択され、前記置換基の数が1～4である、請求項2に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩若しくは立体異性体。

#### 【請求項4】

$R^1$  が、6～7員飽和N含有縮合ヘテロシクリル、7～10員N含有スピロヘテロシクリル及び7～8員N含有架橋ヘテロシクリルからなる群から選択され、これらはそれぞれ窒素を介してピリミジン環に結合されており、フルオロ、クロロ、アミノ、ヒドロキシル、 $C_{1-6}$  アルキル及びヒドロキシル  $C_{1-6}$  アルキルからなる群から選択される置換基で任意に置換されていてもよく、前記置換基の数が1～2であり；

$R^3$  が - M -  $R^7$  であり、

M は、単結合、メチレン及びエチレンからなる群から選択され、

$R^7$  は、置換基  $L_2$  でそれぞれ任意に置換されていてもよい、シクロペンチル、シク

ロヘキシル及びシクロヘブチルからなる群から選択され、

前記置換基  $L_2$  は、フルオロ、クロロ、ヒドロキシル、アミノ、メチル及びエチルからなる群から選択され、前記置換基の数が 1 ~ 2 であり；

$R^5$  が - Q -  $R^8$  であり、

Q が、メチレン及びエチレンから選択され、

$R^8$  が、置換基  $L_5$  で任意に置換されていてもよいフェニルであり、

前記置換基  $L_5$  は、フルオロ、クロロ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシル、エトキシル及びトリフルオロメトキシルからなる群から選択され、前記置換基の数が 1 ~ 4 である、請求項 3 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩若しくは立体異性体。

【請求項 5】

$R^1$  が、6 ~ 7 員飽和 N 含有縮合ヘテロシクリル及び 7 ~ 10 員 N 含有スピロヘテロシクリルからなる群から選択され、これらはそれぞれ窒素を介してピリミジン環に結合されており、フルオロ、クロロ、アミノ、ヒドロキシル、 $C_{1-6}$  アルキル及びヒドロキシル  $C_{1-6}$  アルキルからなる群から選択される置換基で任意に置換されていてもよく、前記置換基の数が 1 ~ 2 であり；

$R^3$  が - M -  $R^7$  であり、

M は、単結合、メチレン及びエチレンからなる群から選択され、

$R^7$  は、置換基  $L_2$  でそれぞれ任意に置換されていてもよい、ピペリジニル、モルホリニル、ピペラジニル、2 - オキソ - アザシクロヘブタニル、2 - オキソ - ピペラジニルフラニル及び 7 ~ 10 員スピロシクリルからなる群から選択され、

或いは、 $R^3$  及び  $R^4$  が  $R^3$  及び  $R^4$  に結合した窒素と共に、置換基  $L_3$  でそれぞれ任意に置換されていてもよい、ピペリジニル、ピペラジニル又はモルホリニルを形成し、

前記置換基  $L_2$  及び  $L_3$  は、フルオロ、クロロ、ヒドロキシル、アミノ、オキソ、トリフルオロメチル、メチル及びエチルからなる群から選択され、前記置換基の数が 1 ~ 2 であり；

$R^5$  が - Q -  $R^8$  であり、

Q が、メチレン及びエチレンから選択され、

$R^8$  が、置換基  $L_5$  で任意に置換されていてもよいフェニルであり、

前記置換基  $L_5$  は、フルオロ、クロロ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシル、エトキシル及びトリフルオロメトキシルからなる群から選択され、前記置換基の数が 1 ~ 4 である、請求項 3 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩若しくは立体異性体。

【請求項 6】

$R^1$  が、6 ~ 7 員飽和 N 含有縮合ヘテロシクリル、7 ~ 10 員 N 含有スピロヘテロシクリル及び 7 ~ 8 員 N 含有架橋ヘテロシクリルからなる群から選択され、これらはそれぞれ窒素を介してピリミジン環に結合されており、フルオロ、クロロ、アミノ、ヒドロキシル、 $C_{1-6}$  アルキル及びヒドロキシル  $C_{1-6}$  アルキルからなる群から選択される置換基で任意に置換されていてもよく、前記置換基の数が 1 ~ 2 であり；

$R^3$  が - M -  $R^7$  であり、

M は、単結合、メチレン及びエチレンからなる群から選択され、

$R^7$  は、置換基  $L_2$  でそれぞれ任意に置換されていてもよい、フェニル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、チアゾリル、ピラゾリル、ピリミジル、ピリジル、ピラジニル、オキサゾリル、インドリル及びキノリニルからなる群から選択され、

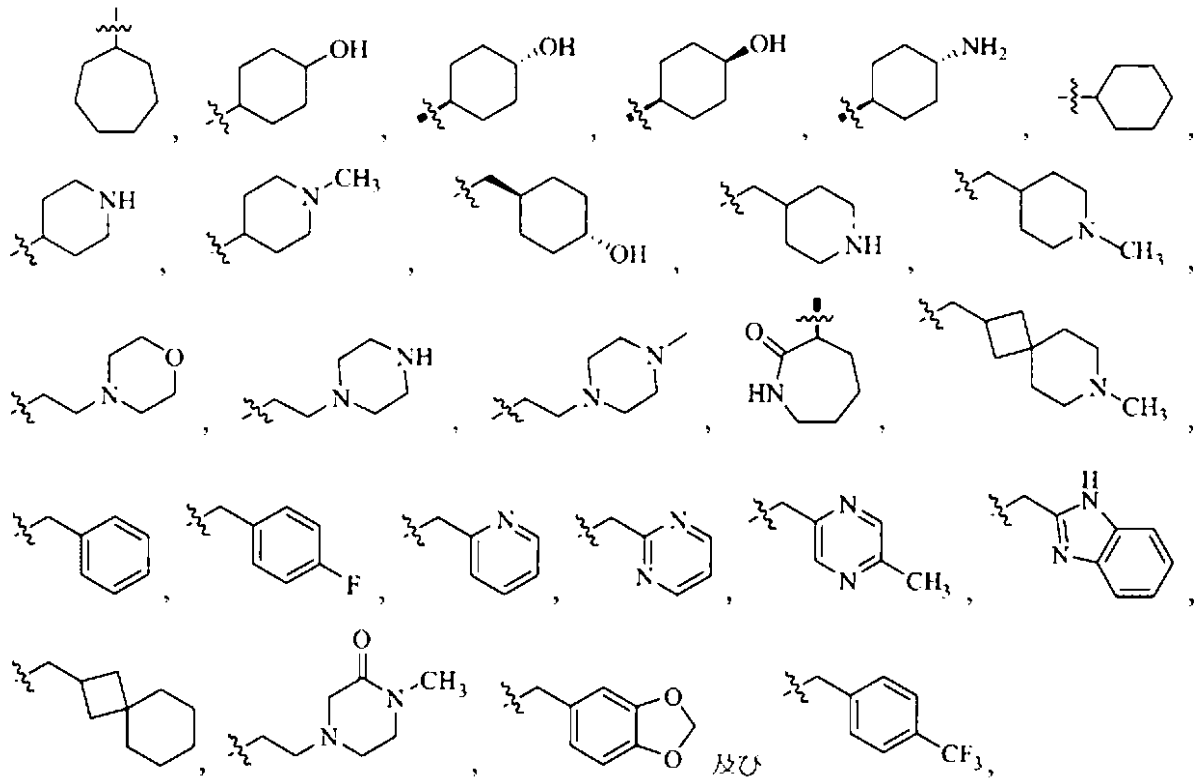
或いは、 $R^3$  及び  $R^4$  が  $R^3$  及び  $R^4$  に結合した窒素と共に、置換基  $L_3$  でそれぞれ任意に置換されていてもよい、ピペリジニル、ピペラジニル又はモルホリニルを形成し、

前記置換基  $L_2$  及び  $L_3$  は、フルオロ、クロロ、ヒドロキシル、アミノ、オキソ、トリフルオロメチル、メチル及びエチルからなる群から選択され、前記置換基の数が 1 ~ 2 であり；

$R^5$  が - Q -  $R^8$  であり、



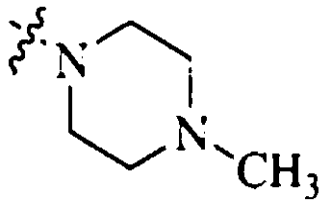
## 【化3】



からなる群から選択され、

或いは  $R^3$  及び  $R^4$  が、 $R^3$  及び  $R^4$  に結合した窒素と共に、下記式を形成し、

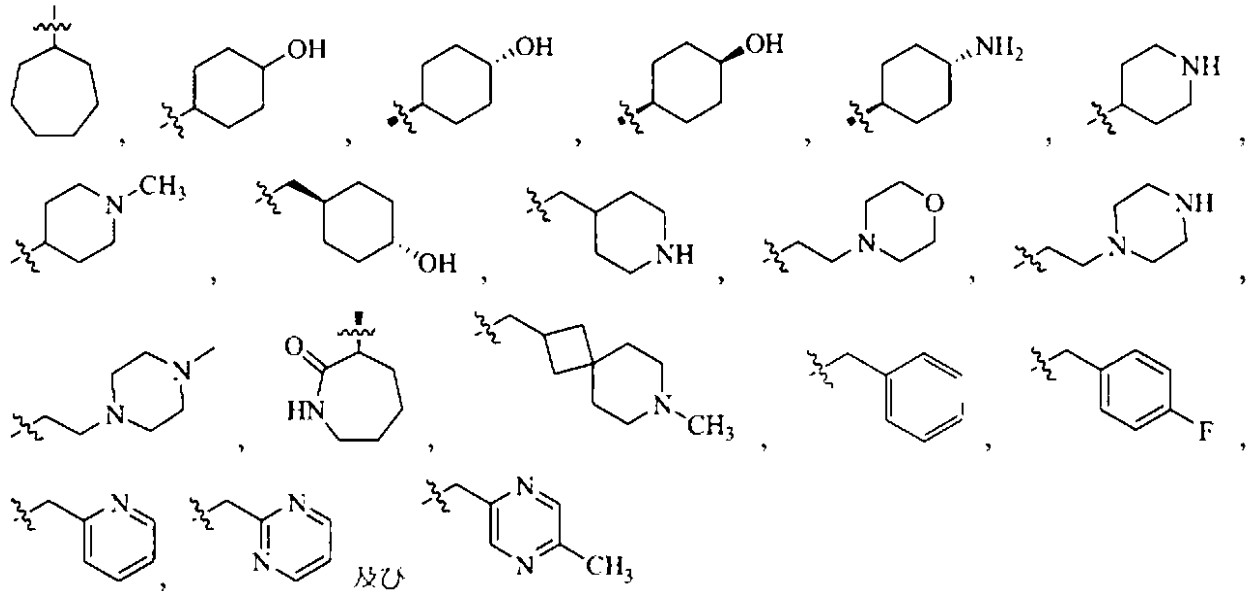
## 【化4】



$R^5$  が、



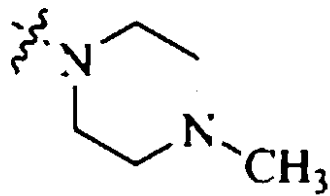
## 【化7】



からなる群から選択され、

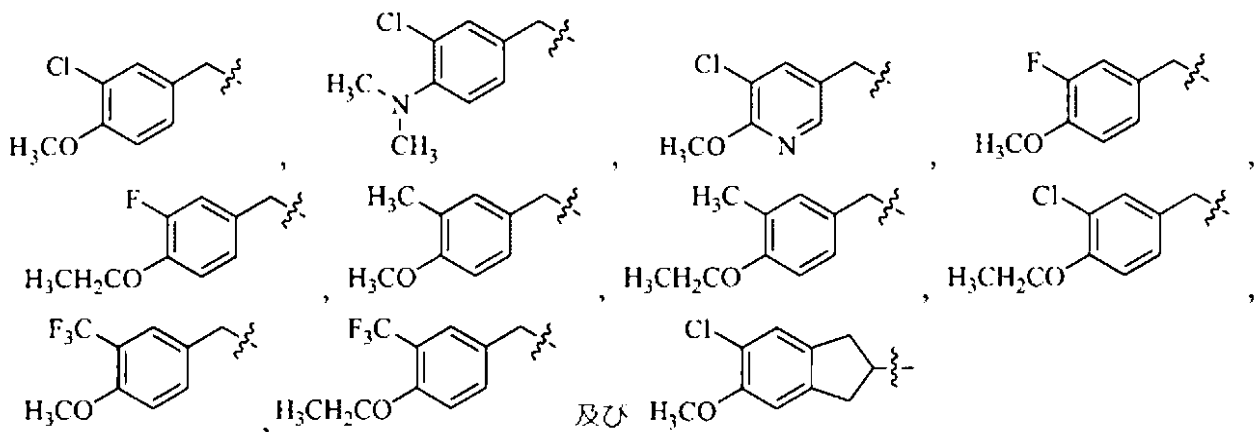
R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> が、R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> に結合した窒素と共に、下記式を形成し、

## 【化8】



R<sup>5</sup> が、

## 【化9】

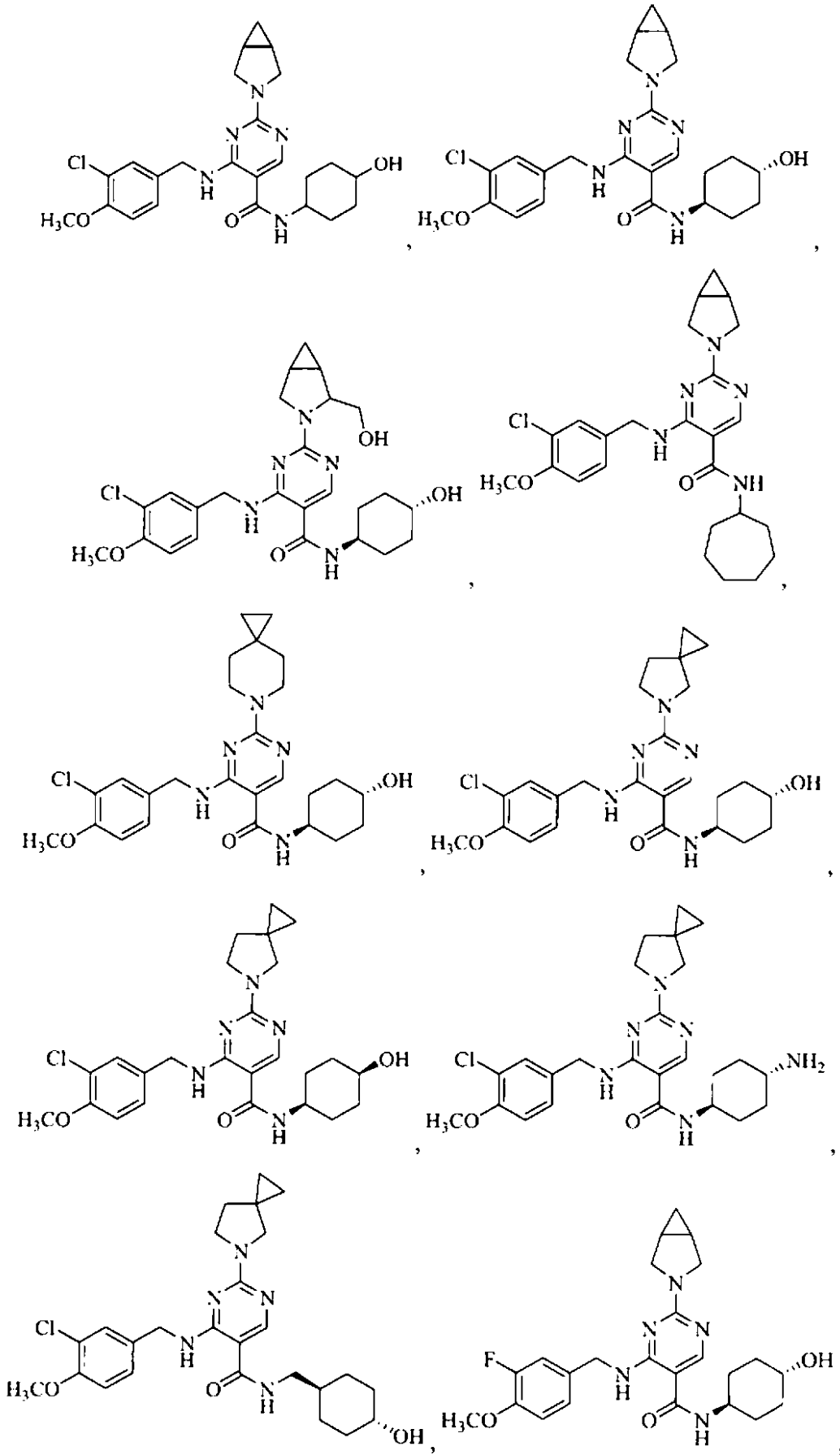


からなる群から選択される、請求項7に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩若しくは立体異性体。

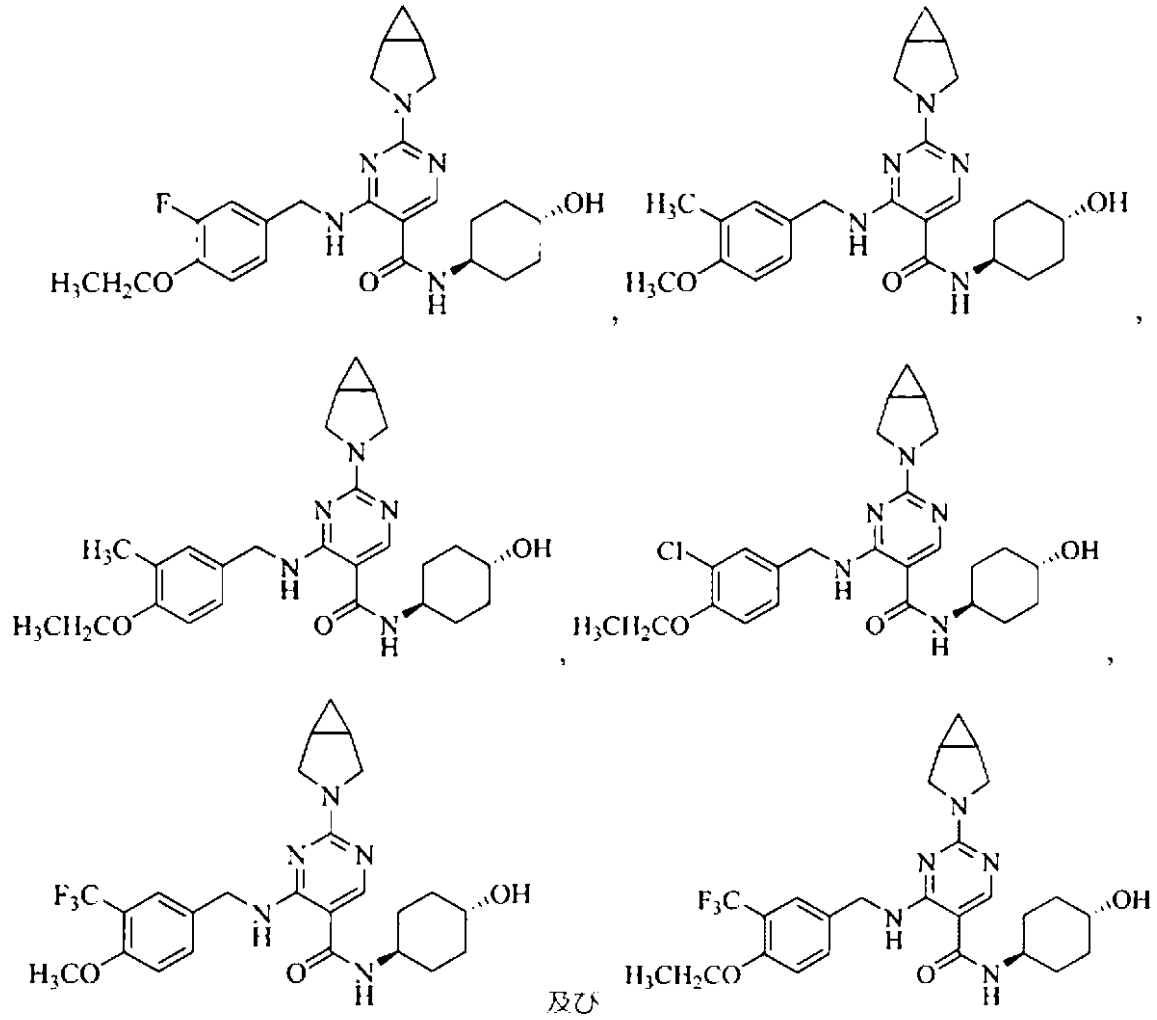
## 【請求項9】

前記化合物が、

【化 10】



## 【化 1 1】

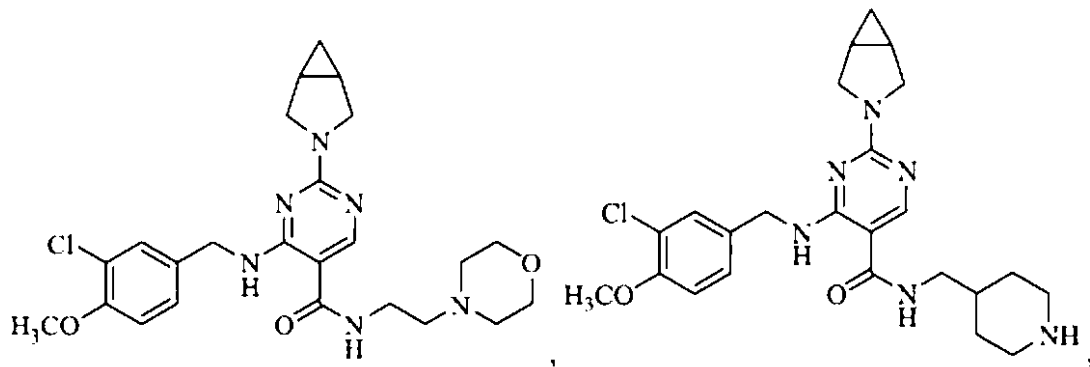


から選択される、請求項 4 若しくは 8 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩若しくは立体異性体。

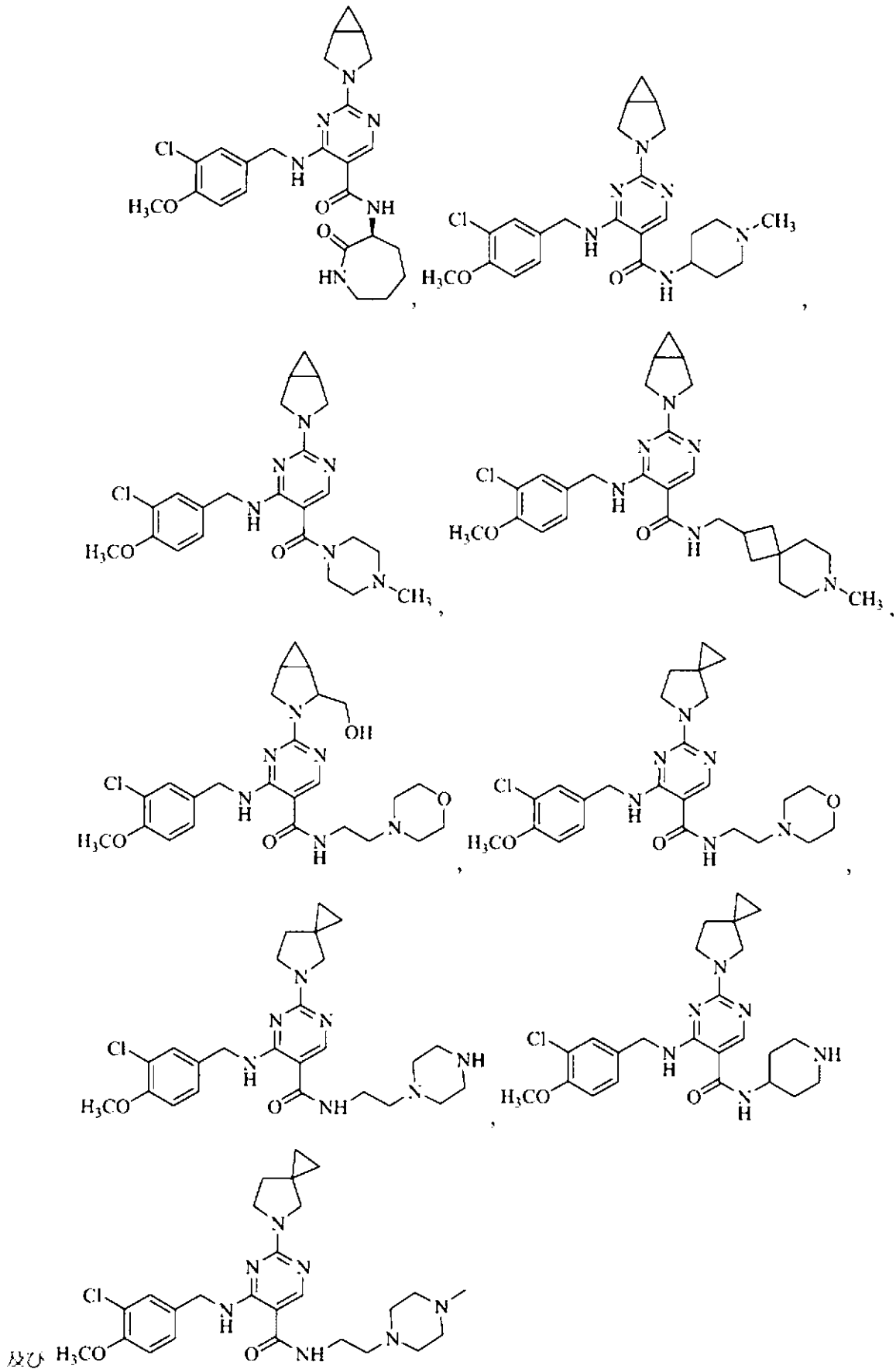
## 【請求項 10】

前記化合物が、

## 【化 1 2】

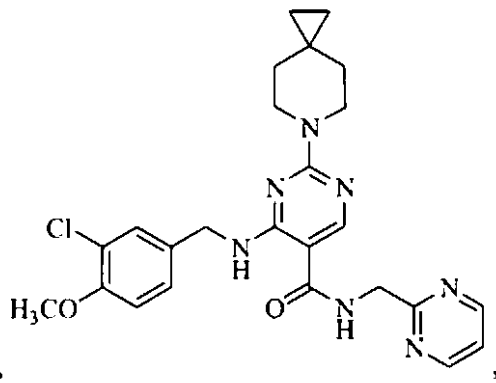
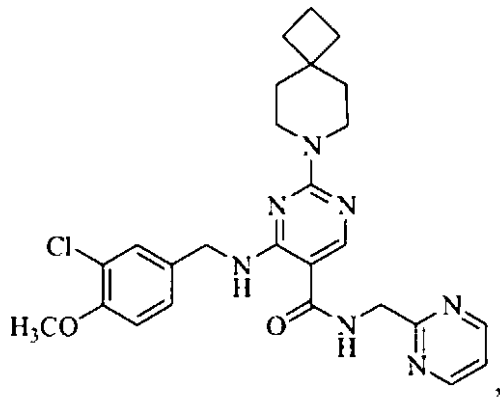
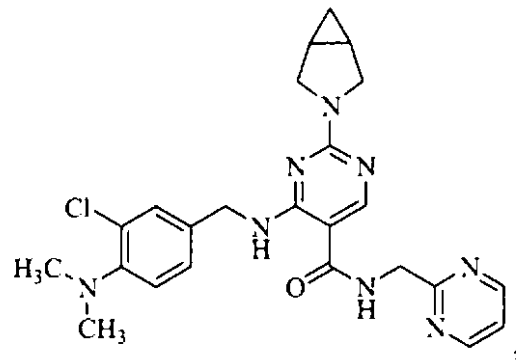
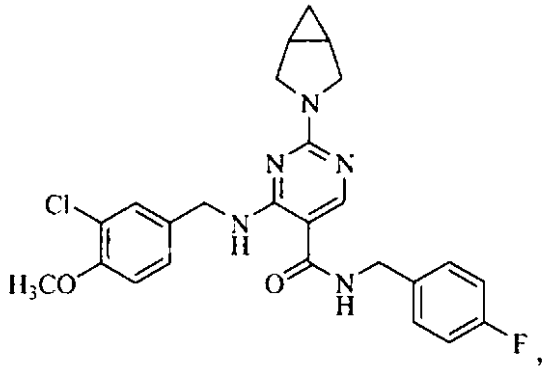
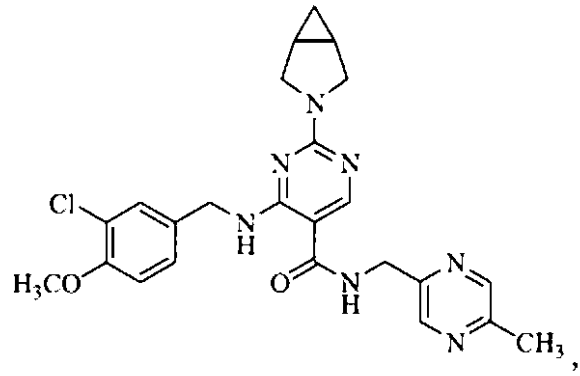
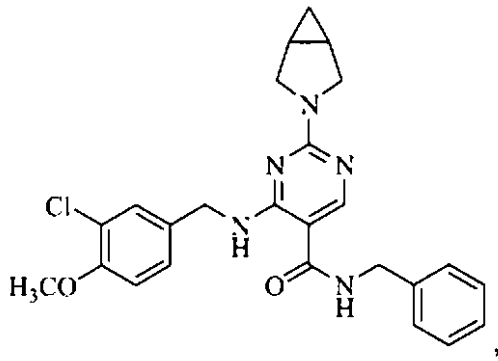
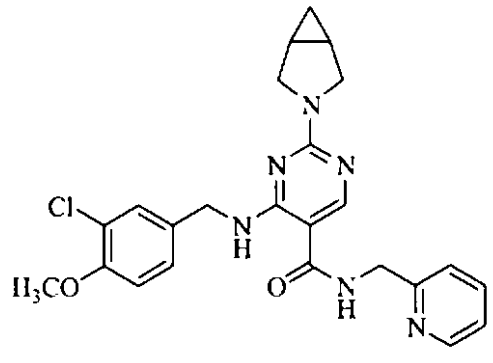
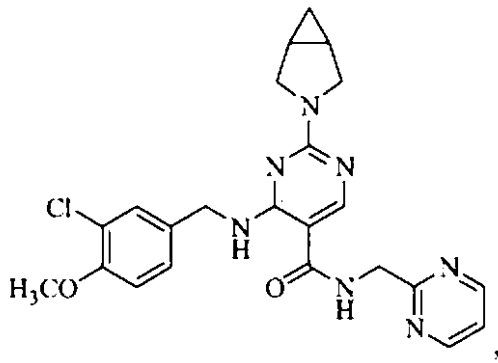


## 【化 1 3】

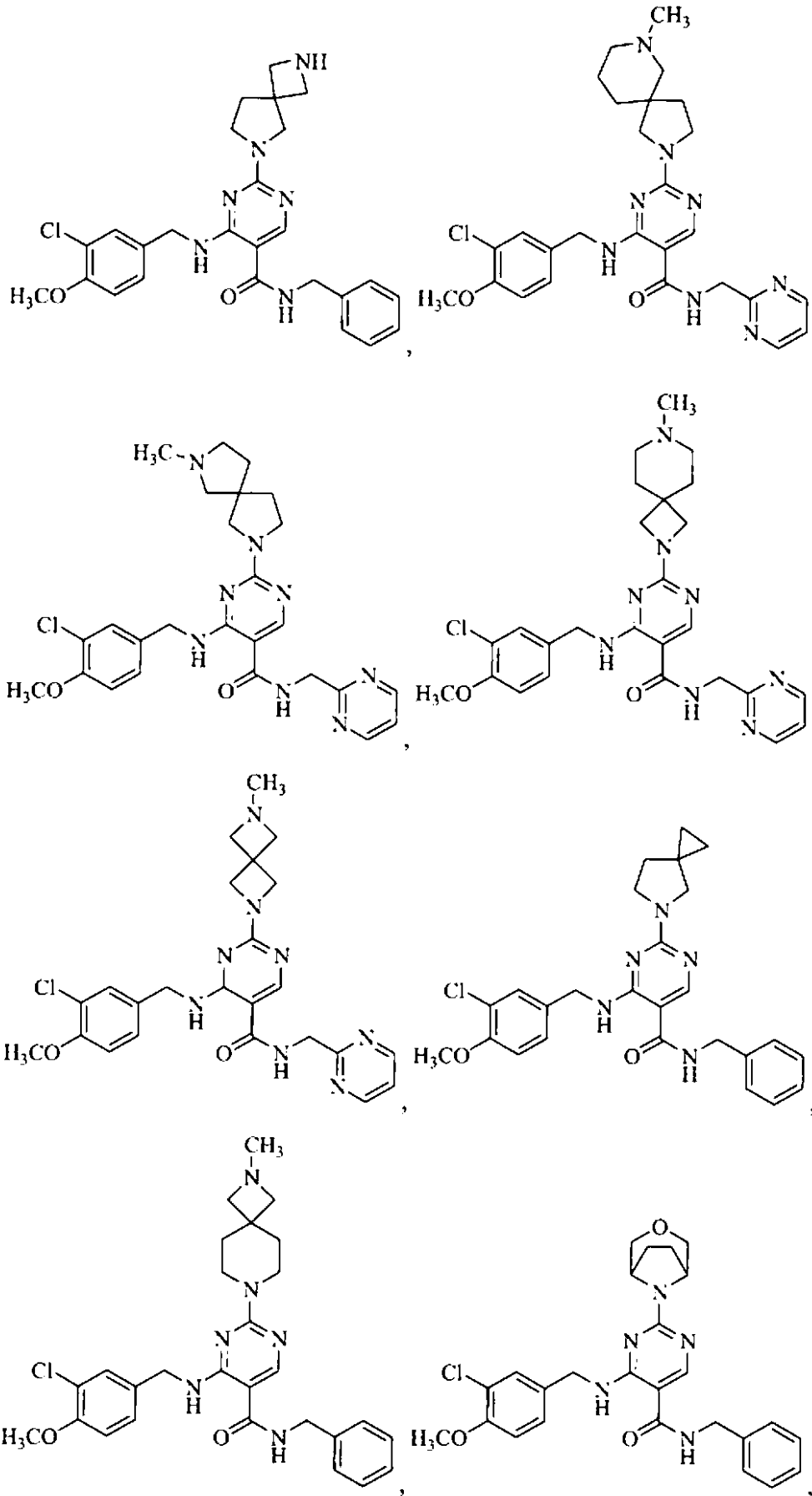


から選択される、請求項 5 若しくは 8 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩若しくは立体異性体。

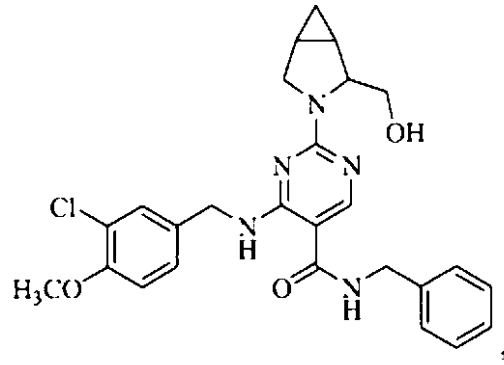
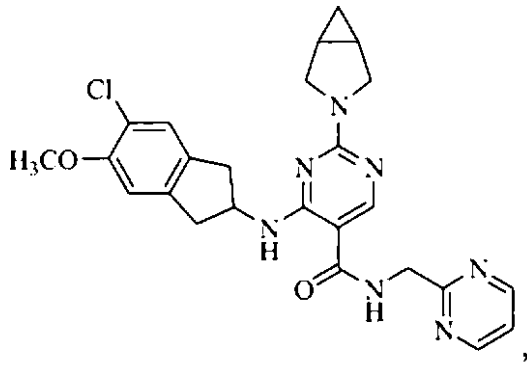
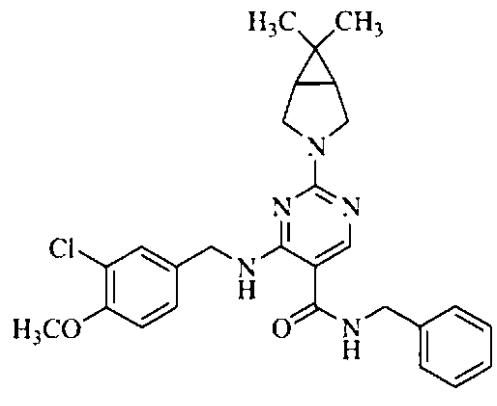
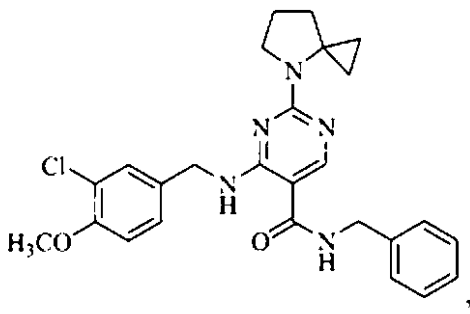
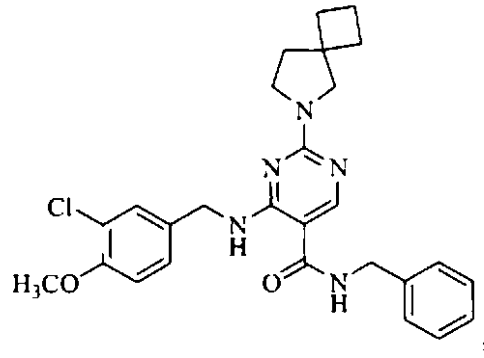
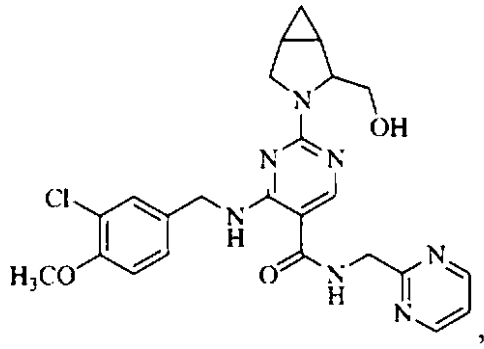
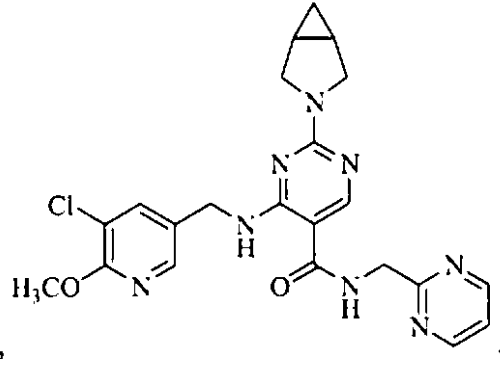
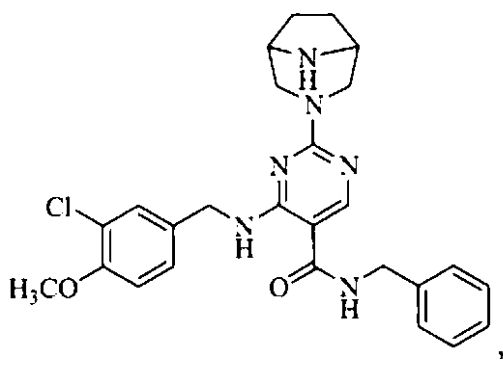
【請求項 11】  
前記化合物が、  
【化 14】



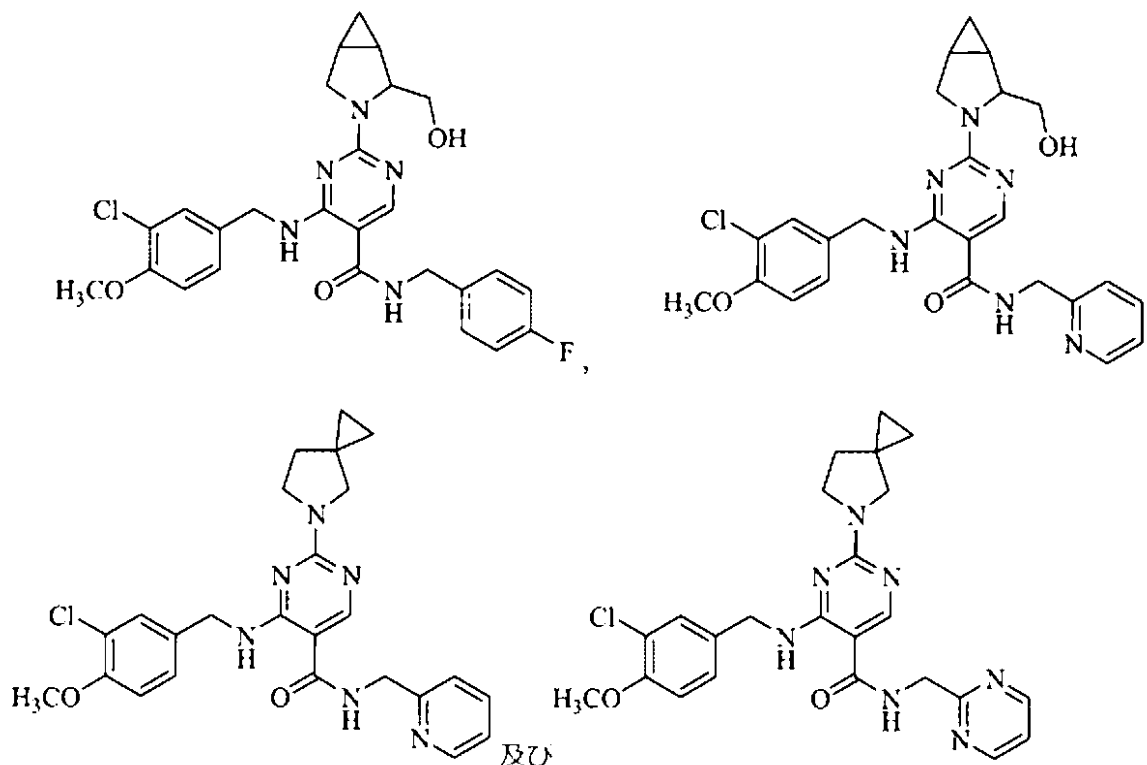
【化 15】



【化 16】



## 【化 17】



から選択される、請求項 6 若しくは 8 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩若しくは立体異性体。

## 【請求項 1 2】

請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩若しくは立体異性体と、1 種以上の薬学的な担体及び / 又は希釈剤とを含む医薬製剤。

## 【請求項 1 3】

請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩若しくは立体異性体を含む医薬組成物であって、血管拡張薬、プロスタグランジン E 1、プロスタサイクリン、 $\alpha$ -アドレナリン受容体遮断薬、混合  $\alpha$ 、 $\beta$ -遮断薬、 $\beta$ -遮断薬、5-レダクターゼ阻害剤、 $\alpha$  2-アドレナリン受容体遮断薬、ACE 阻害剤、NEP 阻害剤、中枢ドーパミン作動薬、血管作用性小腸ペプチド、カルシウムチャネル遮断薬、チアジン及びこれらの混合物からなる群から選択される 1 種以上の第 2 の治療的活性剤をさらに含むことを特徴とする医薬組成物。

## 【請求項 1 4】

医薬品の製造における請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩若しくは立体異性体の使用であって、前記医薬品が性機能不全及び下部尿路症状の疾病を治療及び / 又は予防する PDE-5 阻害剤である、前記使用。

## 【請求項 1 5】

高血圧、心不全、肺高血圧、勃起不全、過活動膀胱、前立腺肥大及び女性性機能不全からなる群から選択される疾病を治療及び / 又は治療する医薬品の製造における請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩若しくは立体異性体の使用。

## 【請求項 1 6】

前記疾病が、勃起不全、過活動膀胱及び良性前立腺肥大である、請求項 1 4 又は 1 5 に記載の使用。