

【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3年11月4日(2021.11.4)

【公表番号】特表2020-535172(P2020-535172A)

【公表日】令和2年12月3日(2020.12.3)

【年通号数】公開・登録公報2020-049

【出願番号】特願2020-517549(P2020-517549)

【国際特許分類】

C 07 D 401/12 (2006.01)  
C 07 D 405/14 (2006.01)  
C 07 D 471/10 (2006.01)  
A 61 K 31/4545 (2006.01)  
A 61 K 45/00 (2006.01)  
A 61 K 31/453 (2006.01)  
A 61 K 31/55 (2006.01)  
A 61 K 31/4025 (2006.01)  
A 61 K 31/4439 (2006.01)  
A 61 K 31/454 (2006.01)  
A 61 K 31/5377 (2006.01)  
A 61 K 31/438 (2006.01)  
A 61 P 27/02 (2006.01)  
A 61 P 35/00 (2006.01)  
A 61 P 25/28 (2006.01)  
A 61 P 25/04 (2006.01)

【F I】

C 07 D 401/12 C S P  
C 07 D 405/14  
C 07 D 471/10 1 0 1  
A 61 K 31/4545  
A 61 K 45/00  
A 61 K 31/453  
A 61 K 31/55  
A 61 K 31/4025  
A 61 K 31/4439  
A 61 K 31/454  
A 61 K 31/5377  
A 61 K 31/438  
A 61 P 27/02  
A 61 P 35/00  
A 61 P 25/28  
A 61 P 25/04

【誤訳訂正書】

【提出日】令和3年9月24日(2021.9.24)

【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

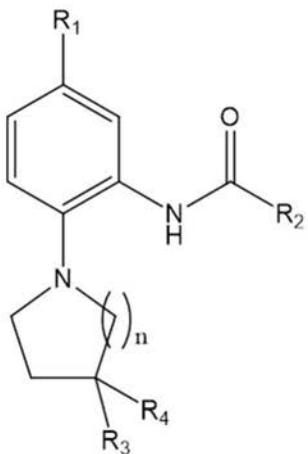
【訂正の内容】

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

式(I)の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、水和物、またはプロドラッグ。

## 【化 2】



(I)

この際、

$n = 1, 2, \text{ または } 3$  であり；

$R_1$  は、ハロゲン、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、シクロプロピル、メチル、メトキシまたはトリフルオロメトキシであり；

$R_2$  は、フラニルまたは2-ピリジルであり；

$R_3$  は、ヒドロキシリル、ヒドロキシメチル、メトキシ、 $C_1 - C_3$  アルキル、カルボキシ、アミノ、 $-C(O)NR_5R_6$  または  $CH_2NR_5R_6$  であり；

$R_4$  は、水素、メチル、エチル、シクロプロピル、フェニル、ベンジルまたはシクロプロピルメチルであり；または

$R_3$  および  $R_4$  は、隣接する炭素原子と一緒に結合して、3員から6員までの炭素環または複素環を形成する；そして

$R_5$  および  $R_6$  は、独立して水素、メチル、エチルまたはプロピルから選択され；または

$R_5$  および  $R_6$  は、一緒に結合して窒素含有複素環を形成する。

## 【請求項 2】

$R_2$  が、4-テトラヒドロピラニルまたは4-ピリジルで置換されたフラニルである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 3】

$R_3$  は、ヒドロキシリル、ヒドロキシメチル、メトキシ、メチル、カルボキシ、 $-C(O)NR_5R_6$  または  $CH_2NR_5R_6$  であり；そして

$R_4$  は、メチル、エチル、シクロプロピル、フェニル、ベンジルまたはシクロプロピルメチルであり；そして

$R_5$  および  $R_6$  は、独立して水素、メチル、エチルまたはプロピルから選択され；または

$R_5$  および  $R_6$  は、一緒に結合して窒素含有複素環を形成する、請求項1または2に記載の化合物。

## 【請求項 4】

$R_3$  は、ヒドロキシリルであり；そして

$R_4$  は、メチル、エチル、シクロプロピル、フェニル、ベンジルまたはシクロプロピルメチルである、

請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 5】**

R<sub>3</sub> は、 - C(O)NR<sub>5</sub>R<sub>6</sub> または CH<sub>2</sub>NR<sub>5</sub>R<sub>6</sub> であり；

R<sub>4</sub> は、メチルであり；そして

R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> は、独立して水素とメチルから選択され；または

R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> は一緒に結合して窒素含有複素環を形成する、

請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 6】**

R<sub>3</sub> および R<sub>4</sub> は、隣接する炭素原子と一緒に結合して、3員から6員までの炭素環または複素環を形成し、この際、前記炭素環または前記複素環が5または6員飽和炭素環または複素環である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

**【請求項 7】**

n = 1 または 3 であり；そして

この際、前記化合物は鏡像異性的に純粋である、

請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 8】**

n = 1 または 3 であり；

R<sub>3</sub> は、ヒドロキシル、 - C(O)NR<sub>5</sub>R<sub>6</sub> または CH<sub>2</sub>NR<sub>5</sub>R<sub>6</sub> であり；

R<sub>4</sub> は、水素またはメチルであり；

R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> は、独立して水素とメチルから選択され；または

R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> は、一緒に結合して窒素含有複素環を形成し；そして

この際、前記化合物は R 鏡像異性体または S 鏡像異性体である、

請求項 1 または 2 に記載の化合物。

**【請求項 9】**

R<sub>1</sub> は、クロロ、トリフルオロメチルまたはシクロプロピルである、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 10】**

R<sub>3</sub> は、 - C(O)NR<sub>5</sub>R<sub>6</sub> または CH<sub>2</sub>NR<sub>5</sub>R<sub>6</sub> であり；そして、

R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> は、一緒に結合して窒素含有複素環を形成し；そして

この際、前記窒素含有複素環は、ピロリジン、ピペリジンまたはモルホリン複素環である、

請求項 1 ~ 3 および 5 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 11】**

請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物 および薬学的に許容される担体を、眼内注射、眼への局所投与または全身投与に適した形態で含む医薬組成物。

**【請求項 12】**

眼の血管新生の治療または予防における使用のための、または、加齢性黄斑変性症もしくは黄斑浮腫の治療または予防における使用のための、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に定義される式 (I) の化合物。

**【請求項 13】**

哺乳動物対象の抗血管新生治療における使用のための、または哺乳動物対象における癌の治療のための、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に定義される式 (I) の化合物。

**【請求項 14】**

小血管の透過性亢進障害の治療または予防、または VEGF<sub>xx</sub> アイソフォームの血管新生促進前透過性特性の調節、または透過性の増加なしの上皮細胞生存のサポート、または上皮濾過膜の開窓の性質の低減における使用のための、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に定義される式 (I) の化合物。

**【請求項 15】**

神経障害および神経変性障害の治療または予防における使用のための、またはインビボまたはインビトロで神経保護剤または神経再生剤として使用するための、または疼痛の治

療または予防に使用するための、または哺乳動物対象における線維症の治療または予防に使用するための、または哺乳動物対象における特発性肺線維症の予防に使用するための、請求項 1～10 のいずれか一項に定義される式（I）の化合物。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0021

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0021】

ここで

$n = 1, 2$ 、または $3$ であり；

$R_1$ は、ハロゲン、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、シクロプロピル、メチル、メトキシまたはトリフルオロメトキシであり；

$R_2$ は、任意に4-テトラヒドロピラニルまたは4-ピリジル置換基を有するフラニル、または2-ピリジルであり；

$R_3$ は、ヒドロキシル、ヒドロキシメチル、メトキシ、 $C_1 - C_3$ アルキル、カルボキシ、 $-C(O)NR_5R_6$ または $CH_2NR_5R_6$ であり；

$R_4$ は、水素、メチル、エチル、シクロプロピル、フェニル、ベンジルまたはシクロプロピルメチルであり；または

$R_3$ および $R_4$ は、隣接する炭素原子と一緒に結合して炭素環または複素環を形成し；そして

$R_5$ および $R_6$ は、独立して水素、メチル、エチルまたはプロピルから選択され；または

$R_5$ および $R_6$ は一緒に結合して窒素含有複素環を形成し；眼の血管新生の治療または予防に使用される。