

【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 1 年 8 月 15 日 (2019.8.15)

【公表番号】特表 2017-526705 (P2017-526705A)

【公表日】平成 29 年 9 月 14 日 (2017.9.14)

【年通号数】公開・登録公報 2017-035

【出願番号】特願 2017-513162 (P2017-513162)

【国際特許分類】

C 07D 213/79 (2006.01)

A 61P 35/00 (2006.01)

A 61P 19/02 (2006.01)

A 61P 37/08 (2006.01)

A 61P 17/06 (2006.01)

A 61P 11/00 (2006.01)

A 61P 17/00 (2006.01)

A 61P 43/00 (2006.01)

A 61P 1/16 (2006.01)

A 61K 31/4418 (2006.01)

A 61K 31/443 (2006.01)

A 61P 29/00 (2006.01)

A 61P 9/10 (2006.01)

C 07D 405/04 (2006.01)

C 07D 213/803 (2006.01)

A 61K 31/44 (2006.01)

【FI】

C 07D 213/79 C S P

A 61P 35/00

A 61P 19/02

A 61P 37/08

A 61P 17/06

A 61P 11/00

A 61P 17/00

A 61P 43/00 1 0 5

A 61P 1/16

A 61K 31/4418

A 61K 31/443

A 61P 29/00 1 0 1

A 61P 9/10 1 0 1

C 07D 405/04

C 07D 213/803

A 61K 31/44

【誤訳訂正書】

【提出日】令和 1 年 7 月 5 日 (2019.7.5)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0030

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 3 0 】

用語「ヘテロアリアル」は、単独で又は他の基と組み合わせられて、N、O、及びS、特にN及びOから個々に選択される1、2又は3個のヘテロ原子を含有する、単一の4～8員環又は6～14個、好ましくは6～10個の環原子を含む複数の縮合環を有する芳香族炭素環基（その基において、一つ以上の複素環は、芳香族である）を指す。「ヘテロアリアル」の例は、ベンゾフリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾキサジニル、ベンゾチアジニル、ベンゾチアゾイル、ベンゾチエニル、ベンゾチアゾイル、フリル、イミダゾリル、インダゾリル、インドリル、イソキノリニル、イソチアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、ピラジニル、ピラゾリル（ピラジル）、ピラゾロ[1,5-a]ピリジニル、ピリダジニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピロリル、キノリニル、テトラゾリル、チアゾリル、チエニル、トリアゾリル等を含む。好ましくは、1H-ピラゾリル、フリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、ピラジニル、ピラゾリル、ピリダジニル、ピリジニル、ピリジニル-N-オキシド、及びピリミジニルである。更に好ましいヘテロアリアルは、ピリジニル、ピラゾリル、ピラジニル及びピリミジニルである。

【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

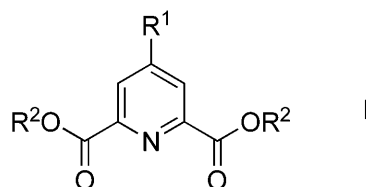
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I：

【化22】



[式中、

R¹ は、C₁ - C₁₈ - アルキル、C₃ - C₁₈ - シクロアルキル、アリール、C₃ - C₁₈ - ヘテロシクロアルキル又はヘテロアリアルであり、C₁ - C₁₈ - アルキル、C₂ - C₁₈ - アルケニル、C₂ - C₁₈ - アルキニル、C₁ - C₁₈ - アルコキシ、ニトロ、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシル、カルボキシル、C₁ - C₁₈ - ハロアルキル、C₁ - C₁₈ - ハロアルコキシ及びフェニルからなる群より選択される一つ以上の置換基によって場合により置換されており；そして

R² は、C₁ - C₁₈ - アルキル又はベンジルである] の化合物、又はそのラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、それらの混合物、又はそれらの薬学的に許容され得る塩、

但し、

ジメチル 4 - メチルピリジン 2, 6 - ジカルボキシラート、
 ジメチル 4 - (ヒドロキシメチル) - ピリジン 2, 6 - ジカルボキシラート、
 ジメチル 4 - エチルピリジン 2, 6 - ジカルボキシラート、
 ジメチル 4 - イソプロピルピリジン 2, 6 - ジカルボキシラート、
 ジメチル 4 - (ヒドロキシエチル) - ピリジン 2, 6 - ジカルボキシラート、
 ジメチル 4 - (クロロメチル)ピリジン 2, 6 - ジカルボキシラート、
 ジメチル 4 - (イオドメチル)ピリジン 2, 6 - ジカルボキシラート、
 ジメチル 4 - (プロモメチル)ピリジン 2, 6 - ジカルボキシラート、
 ジメチル 4 - (ジメトキシメチル)ピリジン 2, 6 - ジカルボキシラート、

ジメチル 4 - (ヒドロキシエチル) ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - フェニル - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - (3 - ブロモプロピル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - (トリフルオロメチル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - (3 - メチルフェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - シクロヘキシル - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - (4 - メチルフェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - (4 - ヒドロキシフェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - (2 - メチルフェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - (3 - クロロフェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - ナフタレニル - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - (4 - メトキシルフェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - (4 - フルオロフェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - (4 - ニトロフェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - (4 - ヒドロキシ - 2 - メトキシルフェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - (2 , 4 - ジメトキシルフェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - [(4 - オクチロキシル) フェニル] - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - ベンゾ [b] チエ - 2 - イル - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - [(4 - オクタデシロキシル) フェニル] - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - (1 - メチル - 1 H - インドール - 2 - イル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - (1 - ピロリジニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - (2 - メチル - 1 - ピペリジニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジメチル 4 - (4 - モルホリニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジエチル 4 - メチルピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジエチル 4 - (ヒドロキシメチル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジエチル 4 - エチルピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジエチル 4 - tert - ブチルピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジエチル 4 - (2 - カルボキシエチル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジエチル 4 - (2 - フラニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジエチル 4 - (4 - メトキシフェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジエチル 4 - (4 - シアノフェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジエチル 4 - (4 - クロロフェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジエチル 4 - (2 - チエニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジエチル 4 - (3 - チエニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジエチル 4 - [4 - (1 , 1 - ジメチルエチル) フェニル] - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジエチル 4 - (1 - ピペラジニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジエチル 4 - (4 - モルホリニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジエチル 4 - (1 - ピペラジニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジエチル 4 - (9 - アントラセニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジエチル 4 - (5 - クロロ - 2 - メトキシフェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
ジエチル 4 - (5 - クロロ - 2 - エトキシフェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、

ジエチル 4 - (2 , 4 , 6 - トリメトキシフェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
 ジエチル 4 - (3 - ブロモ - 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
 ジエチル 4 - (3 - ヘキシル - 2 - チエニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
 ジ - tert - ブチル 4 - (ブロモメチル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
 ジ - tert - ブチル 4 - (ピリジン - 4 - イル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
 ジメチル 4 - (4 - ヒドロキシ - 2 , 6 ジメトキシフェニル) ピリジン - 2 , 6 - ジカルボキシラート、
 ジメチル 4 - (3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル) ピリジン - 2 , 6 - ジカルボキシラート、
 ジメチル 4 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
 ジメチル 4 - (3 - ヒドロキシプロピル) ピリジン - 2 , 6 - ジカルボキシラート、
 ジエチル 4 - フェニル - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
 ジエチル 4 - (4 - エチルフェニル) - ピリジン 2 , 6 - ジカルボキシラート、
 ジメチル 4 - (4 - フェニル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル) ピリジン - 2 , 6 - ジカルボキシラート、
2 - (2 , 6 - ビス (メトキシカルボニル) ピリジン - 4 - イル) 酢酸、
ジメチル 4 - [4 - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル] ピリジン - 2 , 6 - ジカルボキシラート、及び
ジメチル 4 - [4 - (2 - ブロモエチル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル] ピリジン - 2 , 6 - ジカルボキシラート

を除く。

【請求項 2】

R¹ が、C₁ - C₈ - アルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル、フェニル、ナフチル、又は窒素、酸素及び硫黄より選択される一つ以上のヘテロ原子を含む 5 員又は 6 員環ヘテロアリールであり、C₁ - C₈ - アルキル、C₂ - C₈ - アルケニル、C₂ - C₈ - アルキニル、C₁ - C₈ - アルコキシ、ニトロ、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシル、カルボキシル、C₁ - C₈ - ハロアルキル、C₁ - C₈ - ハロアルコキシ及びフェニルからなる群より選択される一つ以上の置換基によって場合により置換されており；そして

R² が、C₁ - C₈ - アルキル又はベンジルである、

請求項 1 記載の式 I の化合物、又はそのラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、それらの混合物、又はそれらの薬学的に許容され得る塩。

【請求項 3】

R¹ が、C₁ - C₈ - アルキルであり、C₂ - C₈ - アルケニル、C₂ - C₈ - アルキニル、C₁ - C₈ - アルコキシ、ニトロ、シアノ、ハロゲン、カルボキシル、C₁ - C₈ - ハロアルキル、C₁ - C₈ - ハロアルコキシ及びフェニルからなる群より選択される一つ以上の置換基によって場合により置換されており；そして

R² が、C₁ - C₄ - アルキル又はベンジルである、

請求項 1 又は 2 に記載の式 I の化合物、又はそのラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、それらの混合物、又はそれらの薬学的に許容され得る塩。

【請求項 4】

R¹ が、C₃ - C₈ - シクロアルキルであり、C₂ - C₈ - アルケニル、C₂ - C₈ - アルキニル、C₁ - C₈ - アルコキシ、ニトロ、シアノ、ハロゲン、カルボキシル、C₁ - C₈ - ハロアルキル、C₁ - C₈ - ハロアルコキシ及びフェニル、からなる群より選択される一つ以上の置換基によって場合により置換されており；そして

R² が、C₁ - C₄ - アルキル、又はベンジルである、

請求項 1 又は 2 に記載の式 I の化合物、又はそのラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、それらの混合物、又はそれらの薬学的に許容され得る塩。

【請求項 5】

R^1 が、フェニルであり、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、エテニル、2-プロペニル、エチニル、プロパルギル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ヒドロキシル、カルボキシル、ニトロからなる群より選択される一つ以上の置換基によって場合により置換されており；そして

R^2 が、 $C_1 - C_4$ - アルキル又はベンジルである、

請求項 1 又は 2 に記載の式 I の化合物、又はそのラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、それらの混合物、又はそれらの薬学的に許容され得る塩。

【請求項 6】

R^1 が、窒素、酸素及び硫黄より選択される一つ以上のヘテロ原子を含む 5 員又は 6 員環ヘテロアリールであり、 $C_2 - C_8$ - アルケニル、 $C_2 - C_8$ - アルキニル、 $C_1 - C_8$ - アルコキシ、ニトロ、シアノ、ハロゲン、カルボキシル、 $C_1 - C_8$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_8$ - ハロアルコキシ及びフェニルからなる群より選択される一つ以上の置換基によって場合により置換されており；そして

R^2 が、 $C_1 - C_4$ - アルキル又はベンジルである。

請求項 1 又は 2 に記載の式 I の化合物、又はそのラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、それらの混合物、又はそれらの薬学的に許容され得る塩。

【請求項 7】

R^1 が、窒素、酸素及び硫黄より選択される一つ以上のヘテロ原子を含む 5 員又は 6 員環ヘテロシクリルであり、 $C_2 - C_8$ - アルケニル、 $C_2 - C_8$ - アルキニル、 $C_1 - C_8$ - アルコキシ、ニトロ、シアノ、ハロゲン、カルボキシル、 $C_1 - C_8$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_8$ - ハロアルコキシ及びフェニルからなる群より選択される一つ以上の置換基によって場合により置換されており；そして

R^2 が、 $C_1 - C_4$ - アルキル又はベンジルである、

請求項 1 又は 2 に記載の式 I の化合物、又はそのラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、それらの混合物、又はそれらの薬学的に許容され得る塩。

【請求項 8】

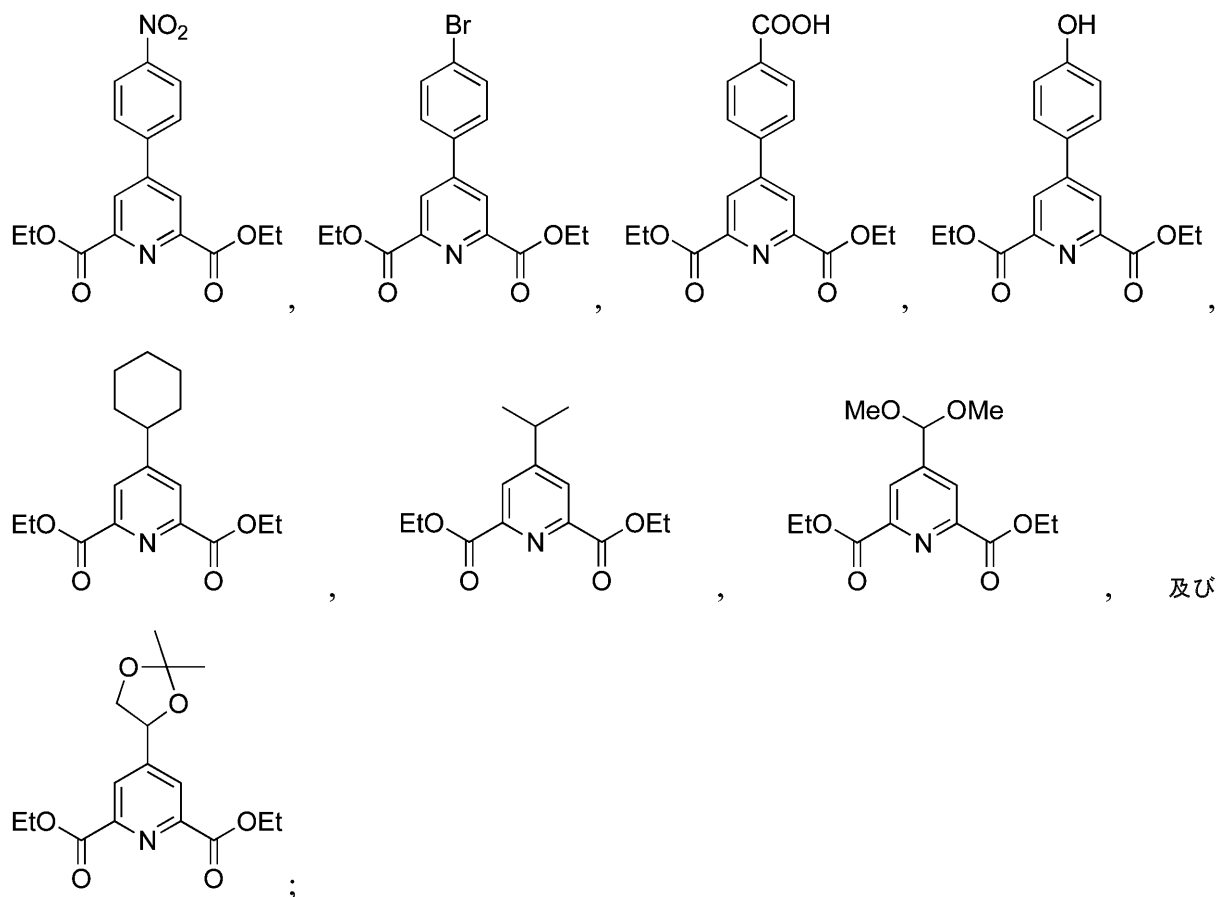
R^2 がエチル又はベンジルである、

請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の式 I の化合物、又はそのラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、それらの混合物、又はそれらの薬学的に許容され得る塩。

【請求項 9】

以下：

【化 2 3】

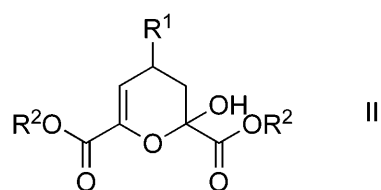


の群より選択される請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の式 I の化合物、又はそのラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、それらの混合物、又はそれらの薬学的に許容され得る塩。

【請求項 10】

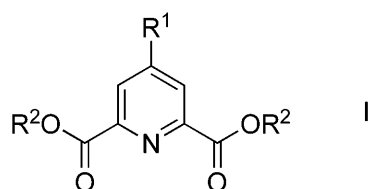
式 II :

【化 2 4】



[式中、 R^1 及び R^2 は請求項 1 と同義である] の化合物と NH_4OAc を溶媒中で反応させること含む、式 I :

【化 2 5】



[式中、 R^1 と R^2 は請求項 1 と同義である] の化合物の製造方法。

【請求項 1 1】

溶媒が CH_3CN である、請求項 1 0 に記載の式 I の化合物の製造方法。

【請求項 1 2】

請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物と薬学的に許容され得る佐剤を含む、医薬組成物。

【請求項 1 3】

増殖性疾患の治療用の請求項 1 2 に記載の医薬組成物。