

【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30年2月22日(2018.2.22)

【公表番号】特表2015-534958(P2015-534958A)

【公表日】平成27年12月7日(2015.12.7)

【年通号数】公開・登録公報2015-076

【出願番号】特願2015-537212(P2015-537212)

【国際特許分類】

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/395 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 403/06 C S P

A 6 1 K 31/395

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 35/00

【誤訳訂正書】

【提出日】平成30年1月10日(2018.1.10)

【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

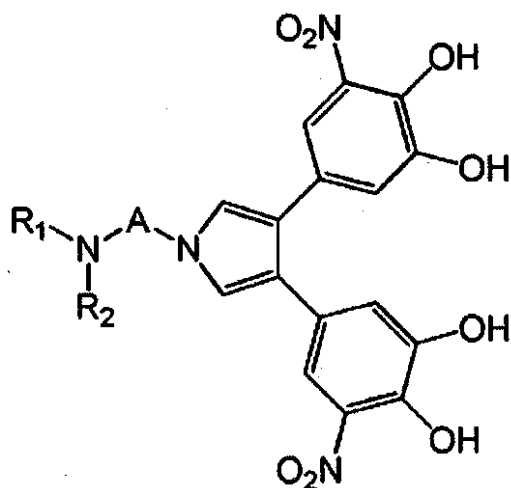
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I a)：

【化1】



(Ia)

(式中：

— Aは、飽和又は不飽和の、直鎖又は分岐した、1～10個の炭素原子を含む炭化水素鎖

であり、

- R_1 及び R_2 はそれぞれ、互いに独立して、水素原子、 $\text{CO}-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ -アルキル、 (C_1-C_6) アルキル、フェニル、又はフェニル- (C_1-C_6) -アルキル基を示すか、または、 R_1 及び R_2 は、これらと結合している窒素原子とともに、場合により (C_1-C_6) アルキル基で置換されている、5 ~ 15 員のヘテロ環を形成する)

を有する化合物であって、その立体異性体及びこれらの混合物、又はその薬学的に許容される酸塩を含む、化合物。

【請求項 2】

基 R_1 及び R_2 が、これらと結合している窒素原子とともに、 R_1 及び R_2 と結合している窒素原子以外のヘテロ原子を含まない、飽和したヘテロ環を形成することを特徴とする、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R_1 及び R_2 が、これらと結合している窒素原子とともに、10 ~ 15 員のヘテロ環を形成することを特徴とする、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R_1 及び R_2 が、これらと結合している窒素原子とともに、13 員のヘテロ環を形成することを特徴とする、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

A が、3 ~ 6 個の炭素原子を含む、飽和した直鎖炭化水素鎖であることを特徴とする、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

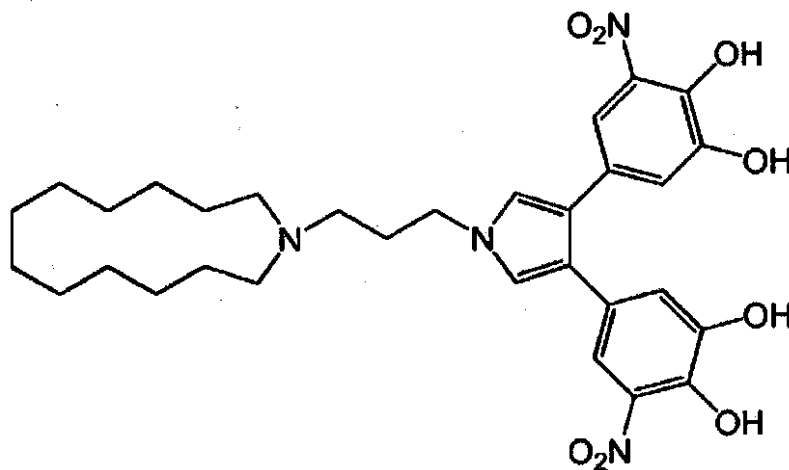
【請求項 6】

A が、3 個の炭素原子を含む、飽和した直鎖炭化水素鎖であることを特徴とする、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

以下の式 (1) ;

【化 2】



(1)

を有する、請求項 1 ~ 6 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酸塩。

【請求項 8】

前記薬学的に許容される酸塩が、塩酸塩であることを特徴とする、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

少なくとも1つの請求項1~8のいずれか一項に記載の化合物と、少なくとも1つの薬学的に許容される賦形剤とを含む、医薬組成物。

【請求項10】

薬剤として使用するための、請求項1~8のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項11】

ガン治療剤として使用するための、請求項10に記載の化合物。

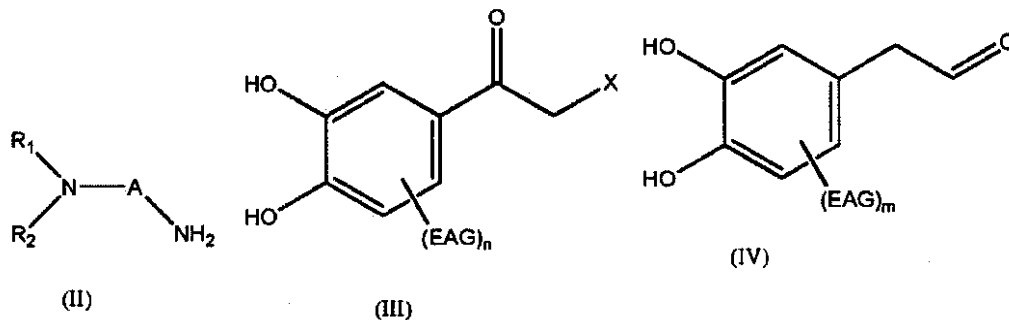
【請求項12】

ガンが、肺ガン、乳ガン、肝臓ガン、胃ガン、大腸ガン、直腸ガン、食道ガン、喉頭ガン、上咽頭ガン、膵臓ガン、前立腺ガン、腎臓ガン、膀胱ガン、十二指腸ガン、子宮内腺ガン、胸膜ガン、皮膚ガン、精巣ガン、卵巣ガン、子宮ガン、脳ガン、骨のガン、口腔ガン、眼のガン、又は、造血系のガン、例えば、白血病ガン、骨髄性白血病ガン、リンパ腫ガン、骨髄ガン、若しくは神経外胚葉起源の腫瘍、例えば膠芽腫から選択されることを特徴とする、請求項11に記載の化合物。

【請求項13】

a) 以下の式(II)を有するアミンと、以下の式(III)を有するハロゲン化物と、以下の式(IV)を有するアルデヒドを反応させて

【化3】



(式中、 n 及び m は1であり、EAGは $-NO_2$ であり、 R_1 、 R_2 、並びにAは請求項1で定義されたとおりであり、Xはハロゲンである)、請求項1に記載の式(I_a)を有する化合物を得る工程と、

b) 場合により、前の工程a)で得られた式(I_a)を有する化合物から薬学的に許容される塩を形成する工程と、

を含む、請求項1~8のいずれか一項に記載の式(I_a)を有する化合物を調製する方法。

【請求項14】

前記アルデヒド(IV)を加える前に、前記ハロゲン化物(III)及びアミン(II)を互いに最初に反応させることを特徴とする、請求項13に記載の式(I_a)を有する化合物を調製する方法。

【請求項15】

Xが塩素、臭素、又はヨウ素原子であることを特徴とする、請求項13又は14に記載の式(I_a)を有する化合物を調製する方法。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0013

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0013】

(式中:- m は、0~3、好ましくは0~2の整数であり；

- nは、0~3、好ましくは0~2の整数であり；
 - m + nは、1以上であり；
 - EAGは、ハロゲン原子、NO₂、CF₃、CCl₃、CN、CO₂H、(C=O)NR₂、CH=NR、(C=S)OR、(C=O)SR、CS₂R、SO₂R、SO₂NR₂、SO₃R、P(O)(OR)₂、P(O)(R)₂、B(OR)₂基の中から独立して選択される電子求引基であり、ここで、Rはアルキル(C₁-C₆)基、フェニル基、又は水素原子であり；
 - Aは、飽和又は不飽和の、直鎖又は分岐した、1~10個の炭素原子を含む炭化水素鎖であり；
 - R₁及びR₂はそれぞれ、互いに独立して、水素原子、CO-(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)アルキル、フェニル、又はフェニル-(C₁-C₆)-アルキル基を表すか、または、R₁及びR₂は、これらと結合している窒素原子とともに、場合によって(C₁-C₆)アルキル基で置換される5~15員ヘテロ環を形成する)
- を有する、その立体異性体及びこれらの混合物、又はこれらの薬学的に許容される酸性塩を含む、新規なN-置換3,4-ビス(カテコール)ピロール化合物、これらの調製、並びにガン(又は「癌」、「がん」)細胞に対してのこれらの抗有糸分裂活性及び作用機序に関する。