

【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 12 月 12 日 (2019.12.12)

【公表番号】特表 2018-534243 (P2018-534243A)

【公表日】平成 30 年 11 月 22 日 (2018.11.22)

【年通号数】公開・登録公報 2018-045

【出願番号】特願 2018-511611 (P2018-511611)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 K 14/72 (2006.01)

C 1 2 N 15/12 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 401/06 C S P

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/00 Z N A

A 6 1 P 13/08

A 6 1 K 31/4709

C 0 7 D 401/14

C 0 7 K 14/72

C 1 2 N 15/12

【手続補正書】

【提出日】令和 1 年 10 月 29 日 (2019.10.29)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 8 8

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 8 8】

ある実施形態では、Pyrv - 24、COHP 24 は、化合物の E 異性体を指す。ある実施形態では、Pyrv - 24、COHP 24 は、化合物の Z 異性体を指す。ある実施形態では、Pyrv - 24、COHP 24 は、化合物の E 異性体と Z 異性体との混合物を指す。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 8 9

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 8 9】

ある実施形態では、Pyrv - 7、COHP 7 は、化合物の E 異性体を指す。ある実施形態では、Pyrv - 7、COHP 7 は、化合物の Z 異性体を指す。ある実施形態では、Pyrv - 7、COHP 7 は、化合物の E 異性体と Z 異性体との混合物を指す。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】 0 4 6 2

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【 0 4 6 2 】

6 - ジメチルアミノ - 1 , 2 - ジメチルキノリニウムトシレート (1 1 - 1 4 6 - 4 p p) 。 McDonald et al. (WO 2 0 0 0 6 0 7 8 7 5 4) の手順を改変して用いた : 4 m L のクロロホルム中の 6 - ジメチルアミノキナルジン (A 、 4 4 0 m g 、 2 . 3 7 m m o l) 及びメチル p - トルエンスルホネート (B 、 9 4 5 m g 、 5 . 0 8 m m o l) の溶液を 1 4 時間加熱還流した。溶媒を蒸発させ、残渣を還流酢酸エチルで 2 回粉碎し、次いで冷却し、濾過した。得られた粗橙色沈殿物 (8 5 0 m g 、 収率 9 7 %) 、融点 1 7 8 ~ 1 8 1 を、さらに精製することなく次の工程で利用した。還流酢酸エチル中で反応を行ったところ、同様の結果が得られた。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】 明細書

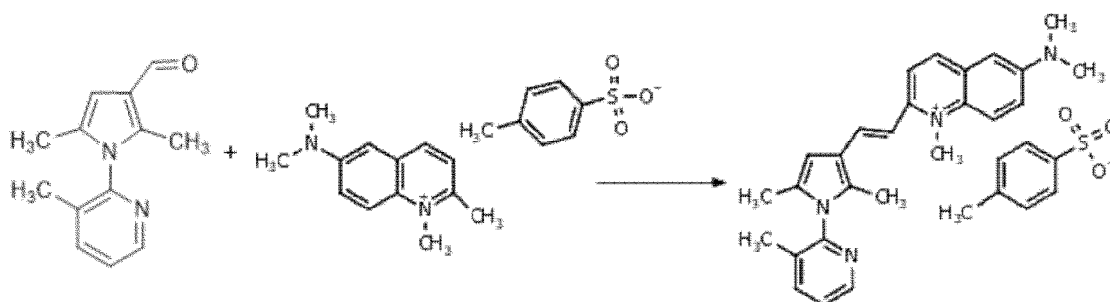
【補正対象項目名】 0 4 6 4

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【 0 4 6 4 】

【化 6 2】



【手続補正 5】

【補正対象書類名】 明細書

【補正対象項目名】 0 4 9 5

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【 0 4 9 5 】

【表 2】

薬 剤	IC ₅₀	溶 解 度 (mg/ml)					
		DMSO	アセト ニトリ ル	エタ ノー ル	緩 衝 液 B (水 性)	β シ ク ロ デ キ ス ト リ ン	γ シ ク ロ デ キ ス ト リ ン
ピロ ビニ ウム	約 50 nM	約 10	<5	<1	<1	<1	<1
P7	約 450 nM	約 10	<5	約 5	<5	約 5	約 5
P24	約 150 nM	約 10	<5	約 5	>10	50-100	約 50