

【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29年5月18日(2017.5.18)

【公表番号】特表2016-500115(P2016-500115A)

【公表日】平成28年1月7日(2016.1.7)

【年通号数】公開・登録公報2016-001

【出願番号】特願2015-544335(P2015-544335)

【国際特許分類】

C 0 7 D 293/06 (2006.01)

C 0 7 D 421/10 (2006.01)

C 0 7 D 421/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/41 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/4365 (2006.01)

A 6 1 P 19/06 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 293/06 C S P

C 0 7 D 421/10

C 0 7 D 421/12

A 6 1 K 31/41

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/4365

A 6 1 P 19/06

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 495/04 1 0 5 A

A 6 1 K 31/4439

【誤訳訂正書】

【提出日】平成29年3月29日(2017.3.29)

【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

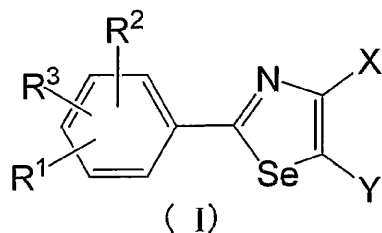
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)で示す2-アリールセレナゾール化合物又はその薬学的に許容可能な塩：

【化 1】



ただし、

Xは、 C_{1-2} アルキル基又は C_{1-2} 置換アルキル基から選ばれたものであり、

Yは、 $-COOR^a$ 又は $-CONHR^a$ から選ばれたものであり、

R^1 は、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-2} アルキル基、 C_{1-2} 置換アルキル基、 C_{1-3} アルコキシ基又は C_{1-3} 置換アルコキシ基から選ばれたものであり、

R^2 は、存在しないか、D、ハロゲン、 C_{1-2} アルキル基、 C_{1-2} 置換アルキル基、 C_{1-3} アルコキシ基又は C_{1-3} 置換アルコキシ基から選ばれたものであり、

R^3 は、 $-(CH_2)_n-O-R^b$ 、 $-(CH_2)_n-S-R^b$ 、 $-C(O)R^b$ 、 $-NR^cR^d$ 、 $-S(O)CHR^cR^d$ 、 $-S(O)_2CHR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR^cR^d$ 、アリール基、置換アリール基、複素環基、又は置換複素環基から選ばれたものであり、

nは0-2であり、

R^a は、H、 C_{1-6} アルキル基又は C_{1-6} 置換アルキル基から選ばれたものであり、

R^b は、H、メチル、エチル、プロピル、2-プロピル、n-ブチル、t-ブチル、ペンチル、 C_{1-8} 置換アルキル基、アリール基、置換アリール基、複素環基、置換複素環基、ヘテロアリール又は置換ヘテロアリールから選ばれたものであり、

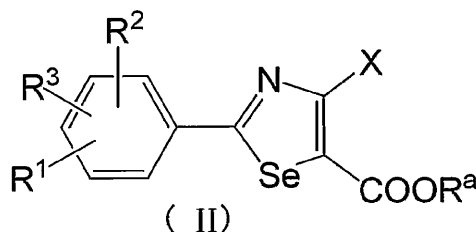
R^c と R^d はそれぞれ独立に、H、 C_{1-8} アルキル基又は C_{1-8} 置換アルキル基から選ばれたものであり、又は R^c と R^d を環化してシクロアルキル基、置換シクロアルキル基、複素環基又は置換複素環基を形成し、

X、Y、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^a 、 R^b 、 R^c 又は R^d での置換基は、D、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、アシル基、アミド基、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} 重水素化アルキル基、 C_{1-2} アルコキシ基又は C_{1-2} アルキルアミノ基の中の1種又は数種から選ばれたものである化合物。

【請求項 2】

該化合物は、式(II)で示す化合物又はその薬学的に許容可能な塩：

【化 2】



である請求項1に記載の化合物。

【請求項 3】

Xは、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 又は $-CF_3$ である請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項 4】

R^a はH、 C_{1-3} アルキル基又は C_{1-3} 置換アルキル基である請求項3に記載の化合物。

【請求項 5】

R^1 は、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCHF_2$ 又は $-OCF_3$ から選ばれたものである請求項4に記載の化合物。

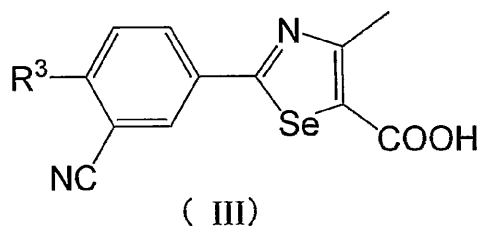
【請求項 6】

R^2 は、存在しないか又はDから選ばれたものである請求項5に記載の化合物。

【請求項 7】

該化合物は、式(III)で示す化合物又はその薬学的に許容可能な塩：

【化 3】



である請求項6に記載の化合物。

【請求項 8】

R^3 は、 $-OR^b$ 、 $-SR^b$ 、 $-C(O)R^b$ 、 $-NR^cR^d$ 、 $-S(O)CHR^cR^d$ 、 $-S(O)_2CHR^cR^d$ 、 $-C(O)NR^cR^d$ 、フェニル、置換フェニル、ピリジル基、置換ピリジル基、ナフチル基、置換ナフチル基、フェノキシ、置換フェノキシ、フェニルチオ基、置換フェニルチオ基、モルホリノ、置換モルホリノ、N-エチルモルホリン、置換N-エチルモルホリン、ピペラジニル基、置換ピペラジニル基、テトラヒドロチオフェンピリジル基、ベンジルスルホン基又は置換ベンジルスルホン基から選ばれたものであり、

R^b はメチル、エチル、プロピル、2-プロピル、n-ブチル、t-ブチル、ペンチル、 C_{1-8} 置換アルキル基、フェニル又は置換フェニルであり、 R^c 又は R^d はそれぞれ独立には、H、 C_{1-8} アルキル基又は C_{1-8} 置換アルキル基から選ばれたものであり、又は R^c と R^d を環化してシクロアルキル基、置換シクロアルキル基、複素環基又は置換複素環基を形成し、

前記置換基は、D、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、アシル基、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} 重水素化アルキル基又は C_{1-2} アルコキシ基中の1種又は数種から選ばれたものである請求項4、5、6又は7に記載の化合物。

【請求項 9】

R^3 は、 $-OR^b$ 、 $-SR^b$ 、 $-C(O)R^b$ 、 $-NR^cR^d$ 、 $-S(O)_2CHR^cR^d$ 、 $-C(O)NR^cR^d$ 、フェニル、置換フェニル、ピリジル基、置換ピリジル基、ナフチル基、置換ナフチル基、フェニルチオ基、置換フェニルチオ基、フェノキシ、置換フェノキシ、モルホリノ、ピペラジニル基、置換ピペラジニル基又はテトラヒドロチオフェンピリジル基から選ばれたものであり、

R^b はメチル、エチル、プロピル、2-プロピル、n-ブチル、t-ブチル、ペンチル、 C_{1-8} 置換アルキル基、フェニル又は置換フェニルであり、 R^c 又は R^d はそれぞれ独立には、H、 C_{1-8} アルキル基又は C_{1-8} 置換アルキル基から選ばれたものであり、又は R^c と R^d を環化してシクロアルキル基、置換シクロアルキル基、複素環基又は置換複素環基を形成し、

前記置換基は、D、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CHDCH_2D$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCH_3$ 又は $-OCH_2CH_3$ の中の1種又は数種から選ばれたものである請求項8に記載の化合物。

【請求項 10】

以下の化合物又はその薬学的に許容可能な塩：

- 2-(3-シアノ-4-エトキシフェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
- 2-(3-シアノ-4-イソプロポキシフェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
- 2-[3-シアノ-4-(3-メチル-ブトキシ)フェニル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
- 2-[3-シアノ-4-(シクロヘキシルメトキシ)フェニル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
- 、
- 2-[3-シアノ-4-(フェニルメトキシ)フェニル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
- 2-[3-シアノ-4-(シクロプロピルメトキシ)フェニル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸
- 、
- 2-(2-シアノ-ジフェニル-4-イル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、

2-(2-シアノ-3',4'-ジメトキシジフェニル-4-イル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(2-シアノ-3'-フッ素-4'-メトキシジフェニル-4-イル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(2-シアノ-3',4',5'-トリメトキシジフェニル-4-イル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(2-シアノ-4'-メトキシジフェニル-4-イル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(2-シアノ-3'-メトキシジフェニル-4-イル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(2-シアノ-3'-トリフルオロメトキシジフェニル-4-イル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(2-シアノ-4'-クロロジフェニル-4-イル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(2-シアノ-3',4'-ニフルオロジフェニル-4-イル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(2-シアノ-2',3',4',5',6'-五重水素化ジフェニル-4-イル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(2-シアノ-2'-メトキシジフェニル-4-イル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(2-シアノ-2',4'-ジメトキシジフェニル-4-イル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-[3-シアノ-4-(1-ナフチル)-フェニル]-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-[3-シアノ-4-(4-ピリジル)-ベンゼン-4-イル]-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-[3-シアノ-4-(3-ピリジル)-ベンゼン-4-イル]-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-[2-シアノ-4'-(1,2-重水素化エチル)-ジフェニル-4-イル]-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(2-シアノ-6-重水素化ジフェニル-4-イル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-シアノ-4-イソプロピルチオフェニル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-シアノ-4-イソブチルチオフェニル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-[3-シアノ-4-(4-クロロベンゼンチオ)-フェニル]-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-[3-シアノ-4-(3-トリフルオロメチルフェニルチオ)-フェニル]-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-[3-シアノ-4-(2-ピリジルチオ)-フェニル]-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-シアノ-4-ベンジルチオ-フェニル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-シアノ-4-イソプロピルスルホン-フェニル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-シアノ-4-モルホリノ-4-イル-フェニル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-[3-シアノ-4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-{3-シアノ-4-(6,7-ジヒドロ--テトラヒドロ-チオフェン[3,2-c]ピリジル)-フェニル}-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-シアノ-4-ジメチルアミノ-フェニル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-塩素-4-イソブトキシフェニル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-トリフルオロメチル-4-イソブトキシフェニル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-[3-シアノ-4-(イソプロピル硫化メチル)-フェニル]-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-[3-ブromo-4-(アニリンホルミル)-フェニル]-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(2-シアノ-4'-トリフルオロメチルジフェニル-4-イル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(2-シアノ-3'-トリフルオロメチルジフェニル-4-イル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(2-シアノ-2'-トリフルオロメチルジフェニル-4-イル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-シアノ-4-イソブトキシフェニル)-4-ヒドロキシメチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-ブromo-4-イソブトキシフェニル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-シアノ-4-イソプロピルチオフェニル)-4-メチル-セナゾール-5-ギ酸-(2-N-アセチル)エチル、

2-(3-シアノ-4-tert-ブチルチオフェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-(3-シアノ-4-シクロヘキシルチオフェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸から選ばれたもの
である請求項1に記載の化合物。

【請求項 1 1】

請求項1に記載の任意の化合物又はその薬学的に許容可能な塩を活性成分とする薬剤組成物。

【請求項 1 2】

キサンチン酸化酵素の阻害剤薬物を調製するための、請求項1に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用。

【請求項 1 3】

前記キサンチン酸化酵素の阻害剤薬物が高尿酸症、痛風、糖尿病性腎症、炎症性疾患又は神経系疾患を予防又は治療する薬物である請求項12に記載の使用。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 3 3

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 3 3】

本発明の2-アリアルセレナゾール化合物は、更に、以下の化合物又はその薬学的に許容可能な塩から選ばれたものである：

2-(3-シアノ-4-エトキシフェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-(3-シアノ-4-イソプロポキシフェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-[3-シアノ-4-(3-メチル-ブトキシ)フェニル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-[3-シアノ-4-(シクロヘキシルメトキシ基)フェニル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
、
2-[3-シアノ-4-(フェニルメトキシ)フェニル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-[3-シアノ-4-(シクロプロピルメトキシ基)フェニル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
、
2-(2-シアノ-ジフェニル-4-イル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-(2-シアノ-3',4'-ジメトキシジフェニル-4-イル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-(2-シアノ-3'-フッ素-4'-メトキシジフェニル-4-イル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-(2-シアノ-3',4',5'-トリメトキシジフェニル-4-イル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-(2-シアノ-4'-メトキシジフェニル-4-イル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-(2-シアノ-3'-メトキシジフェニル-4-イル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-(2-シアノ-3'-トリフルオロメトキシジフェニル-4-イル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-(2-シアノ-4'-クロロジフェニル-4-イル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-(2-シアノ-3',4'-二フルオロジフェニル-4-イル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-(2-シアノ-2',3',4',5',6'-五重水素化ジフェニル-4-イル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-(2-シアノ-2'-メトキシジフェニル-4-イル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-(2-シアノ-2',4'-ジメトキシジフェニル-4-イル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-[3-シアノ-4-(1-ナフチル)-フェニル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-[3-シアノ-4-(4-ピリジル)-ベンゼン-4-イル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-[3-シアノ-4-(3-ピリジル)-ベンゼン-4-イル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
2-[2-シアノ-4'-(1,2-重水素化エチル)-ジフェニル-4-イル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、

2-(2-シアノ-6-重水素化ジフェニル-4-イル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-シアノ-4-イソプロピルチオフェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-シアノ-4-イソブチルチオフェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-[3-シアノ-4-(4-クロロベンゼンチオ)-フェニル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-[3-シアノ-4-(3-トリフルオロメチルフェニルチオ)-フェニル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-[3-シアノ-4-(2-ピリジルチオ)-フェニル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-シアノ-4-ベンジルチオ-フェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-シアノ-4-イソプロピルスルホン-フェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-シアノ-4-モルホリノ-4-イル-フェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-[3-シアノ-4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-{3-シアノ-4-(6,7-ジヒドロ--テトラヒドロ-チオフェン[3,2-c]ピリジル)-フェニル}-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-シアノ-4-ジメチルアミノ-フェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-塩素-4-イソブトキシフェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-トリフルオロメチル-4-イソブトキシフェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-[3-シアノ-4-(イソプロピル硫化メチル)-フェニル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-[3-ブromo-4-(アニリンホルミル)-フェニル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-(2-シアノ-4'-トリフルオロメチルジフェニル-4-イル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-(2-シアノ-3'-トリフルオロメチルジフェニル-4-イル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-(2-シアノ-2'-トリフルオロメチルジフェニル-4-イル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-シアノ-4-イソブトキシフェニル)-4-ヒドロキシメチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-ブromo-4-イソブトキシフェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-シアノ-4-イソプロピルチオフェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸-(2-N-アセチル)エチル、
 2-(3-シアノ-4-tert-ブチルチオフェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-シアノ-4-シクロヘキシルチオフェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸、
 2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸。

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0100

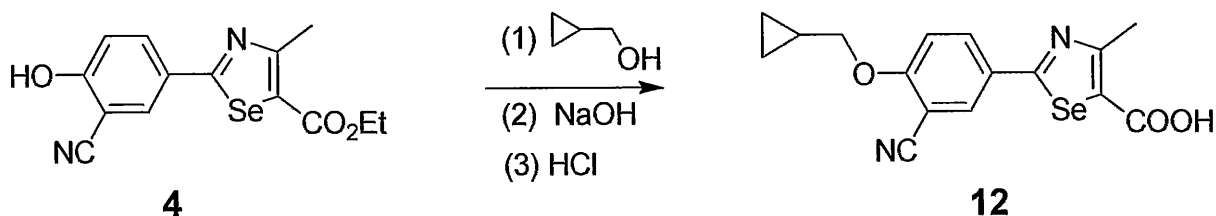
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0100】

実施例7

2-[3-シアノ-4-(シクロプロピルメトキシ基)フェニル]-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸
 (12) の合成
 【化19】



【誤訳訂正 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 1 0 1

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 1 0 1】

化合物4(100 mg、0.298 mmol)をTHF(5 mL)に溶解し、そして、シクロプロピルメタノール(35 mg、0.485 mmol)及びトリフェニルホスフィン(130 mg、0.496 mmol)を添加し、更にアゾジカルボン酸ジエチル(85 mg、0.488 mmol)を滴下添加し、得られた混合物は室温で一晩攪拌する。溶剤を減圧下で蒸発させ、得られた産物はシリカゲルカラム(200~300メッシュのシリカゲル、酢酸エチル/石油エーテル=1/20で溶出する)で精製する。更に実施例1における試験ステップFの方法に従って、加水分解し、更に酸性化した後2-(3-シアノ-4-シクロプロピルメトキシフェニル)-4-メチル-セレナゾール-5-ギ酸(12)を取得する。