

【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23年12月15日 (2011.12.15)

【公表番号】特表2003-525933(P2003-525933A)

【公表日】平成15年9月2日 (2003.9.2)

【出願番号】特願2001-565349(P2001-565349)

【国際特許分類】

C 0 7 D 281/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/554 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 281/10 C

A 6 1 K 31/554

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 417/12

【誤訳訂正書】

【提出日】平成23年10月26日 (2011.10.26)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】特許請求の範囲

【訂正方法】変更

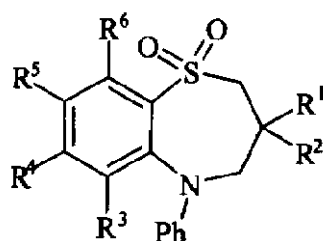
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 ( I ) :

【化 1】



(I)

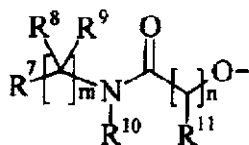
の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグ:

[ 式中 :

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、独立してC<sub>1-6</sub>アルキルから選択され ;

R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>の一方は、式 ( I A ) :

【化 2】



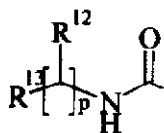
(IA)

の基であり、

$R^3$ 及び $R^6$ と $R^4$ 及び $R^5$ の他方は、独立して、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{2-4}$ アルケニル、 $C_{2-4}$ アルキニル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ アルカノイル、 $C_{1-4}$ アルカノイルオキシ、 $N-(C_{1-4}$ アルキル)アミノ、 $N,N-(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ アミノ、 $C_{1-4}$ アルカノイルアミノ、 $N-(C_{1-4}$ アルキル)カルバモイル、 $N,N-(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ カルバモイル、 $C_{1-4}$ アルキル $S(O)_a$  (ここで $a$ は0~2である)、 $C_{1-4}$ アルコシカルボニル、 $N-(C_{1-4}$ アルキル)スルファモイル及び $N,N-(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ スルファモイルから選択され；ここで $R^3$ 及び $R^6$ と $R^4$ 及び $R^5$ の他方は、場合により1つ又はそれ以上の $R^{14}$ により炭素上で置換される場合があり；

$R^7$ は、カルボキシ、スルホ、スルフィノ、ホスホノ、 $-P(O)(OR^a)(OR^b)$ 、 $P(O)(OH)(OR^a)$ 、 $-P(O)(OH)(R^a)$ 又は $P(O)(OR^a)(R^b)$ である (ここで $R^a$ 及び $R^b$ は、独立して $C_{1-6}$ アルキルから選択される) か；又は $R^7$ は、式 (IB)：

【化3】



(IB)

の基であり；

$R^8$ 及び $R^9$ は、独立して、水素、 $C_{1-4}$ アルキル又は飽和環式基であるか、又は $R^8$ 及び $R^9$ は、一緒に $C_{2-6}$ アルキレンを形成し；ここで $R^8$ 及び $R^9$ 、又は一緒に $R^8$ 及び $R^9$ は、独立して、場合により $R^{15}$ から選択される1つ又はそれ以上の置換基により炭素上で置換される場合があり；そしてここで前記飽和環式基が $-NH-$ 部分を含む場合、その窒素は、場合により1つ又はそれ以上の $R^{20}$ により置換される場合があり；

$R^{10}$ は、水素又は $C_{1-4}$ アルキルであり；ここで $R^{10}$ は、場合により $R^{24}$ から選択される1つ又はそれ以上の置換基により炭素上で置換され；

$R^{11}$ は、水素、 $C_{1-4}$ アルキル、カルボシクリル又はヘテロシクリルであり；ここで $R^{11}$ は、場合により $R^{16}$ から選択される1つ又はそれ以上の置換基により炭素上で置換され；そしてここで前記ヘテロシクリルが $-NH-$ 部分を含む場合、その窒素は、場合により1つ又はそれ以上の $R^{21}$ により置換される場合があり；

$R^{12}$ は、水素又は $C_{1-4}$ アルキル、カルボシクリル又はヘテロシクリルであり；ここで $R^{12}$ は、場合により $R^{17}$ から選択される1つ又はそれ以上の置換基により炭素上で置換され；そしてここで前記ヘテロシクリルが $-NH-$ 部分を含む場合、その窒素は、場合により1つ又はそれ以上の $R^{22}$ により置換される場合があり；

$R^{13}$ は、カルボキシ、スルホ、スルフィノ、ホスホノ、 $-P(O)(OR^c)(OR^d)$ 、 $P(O)(OH)(OR^c)$ 、 $-P(O)(OH)(R^c)$ 又は $P(O)(OR^c)(R^d)$ であり (ここで $R^c$ 及び $R^d$ は、独立して $C_{1-6}$ アルキルから選択される)；

$m$ は1~3であり；ここで $R^8$ 及び $R^9$ の適合基は同じであるか又は異なる場合があり；

$n$ は1~3であり；ここで $R^{11}$ の適合基は同じであるか又は異なる場合があり；

$p$ は1~3であり；ここで $R^{12}$ の適合基は同じであるか又は異なる場合があり；

$R^{14}$ 及び $R^{16}$ は、独立して、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{2-4}$ アルケニル、 $C_{2-4}$ アルキニル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ アルカノイル、 $C_{1-4}$ アルカノイルオキシ、 $N - (C_{1-4}$ アルキル)アミノ、 $N, N - (C_{1-4}$ アルキル) $_2$ アミノ、 $C_{1-4}$ アルカノイルアミノ、 $N - (C_{1-4}$ アルキル)カルバモイル、 $N, N - (C_{1-4}$ アルキル) $_2$ カルバモイル、 $C_{1-4}$ アルキル $S(O)_a$ (ここで $a$ は0~2である)、 $C_{1-4}$ アルコキシカルボニル、 $N - (C_{1-4}$ アルキル)スルファモイル及び $N, N - (C_{1-4}$ アルキル) $_2$ スルファモイルから選択され；ここで $R^{14}$ 及び $R^{16}$ は、独立して、場合により1つ又はそれ以上の $R^{18}$ により炭素上で置換される場合があり；

$R^{15}$ 及び $R^{17}$ は、独立して、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{2-4}$ アルケニル、 $C_{2-4}$ アルキニル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ アルカノイル、 $C_{1-4}$ アルカノイルオキシ、 $N - (C_{1-4}$ アルキル)アミノ、 $N, N - (C_{1-4}$ アルキル) $_2$ アミノ、 $C_{1-4}$ アルカノイルアミノ、 $N - (C_{1-4}$ アルキル)カルバモイル、 $N, N - (C_{1-4}$ アルキル) $_2$ カルバモイル、 $C_{1-4}$ アルキル $S(O)_a$ (ここで $a$ は0~2である)、 $C_{1-4}$ アルコキシカルボニル、 $N - (C_{1-4}$ アルキル)スルファモイル及び $N, N - (C_{1-4}$ アルキル) $_2$ スルファモイル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、スルホ、スルフィノ、アミジノ、ホスホノ、 $-P(O)(OR^e)(OR^f)$ 、 $-P(O)(OH)(OR^e)$ 、 $-P(O)(OH)(R^e)$ 又は $P(O)(OR^e)(R^f)$ (ここで $R^e$ 及び $R^f$ は、独立して $C_{1-6}$ アルキルから選択される)から選択され；ここで $R^{15}$ 及び $R^{17}$ は、場合により1つ又はそれ以上の $R^{19}$ により炭素上で置換される場合があり；そしてここで前記ヘテロシクリルが $-NH-$ 部分を含む場合、その窒素は、場合により1つ又はそれ以上の $R^{23}$ により置換される場合があり；

$R^{18}$ 、 $R^{19}$ 及び $R^{25}$ は、独立して、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、カルバモイル、ウレイド、アミノ、ニトロ、カルボキシ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、ビニル、アリル、エチニル、メトキシカルボニル、ホルミル、アセチル、ホルムアミド、アセチルアミノ、アセトキシ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、 $N -$ メチルカルバモイル、 $N, N -$ ジメチルカルバモイル、メチルチオ、メチルスルフィニル、メシル、 $N -$ メチルスルファモイル及び $N, N -$ ジメチルスルファモイルから選択され；

$R^{20}$ 、 $R^{21}$ 、 $R^{22}$ 、 $R^{23}$ 及び $R^{26}$ は、独立して、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルカノイル、 $C_{1-4}$ アルキルスルホニル、スルファモイル、 $N - (C_{1-4}$ アルキル)スルファモイル、 $N, N - (C_{1-4}$ アルキル) $_2$ スルファモイル、 $C_{1-4}$ アルコキシカルボニル、カルバモイル、 $N - (C_{1-4}$ アルキル)カルバモイル、 $N, N - (C_{1-4}$ アルキル) $_2$ カルバモイル、ベンジル、フェネチル、ベンゾイル、フェニルスルホニル、及びフェニルであり；

$R^{24}$ は、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{2-4}$ アルケニル、 $C_{2-4}$ アルキニル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ アルカノイル、 $C_{1-4}$ アルカノイルオキシ、 $N - (C_{1-4}$ アルキル)アミノ、 $N, N - (C_{1-4}$ アルキル) $_2$ アミノ、 $C_{1-4}$ アルカノイルアミノ、 $N - (C_{1-4}$ アルキル)カルバモイル、 $N, N - (C_{1-4}$ アルキル) $_2$ カルバモイル、 $C_{1-4}$ アルキル $S(O)_a$ (ここで $a$ は0~2である)、 $C_{1-4}$ アルコキシカルボニル、 $N - (C_{1-4}$ アルキル)スルファモイル及び $N, N - (C_{1-4}$ アルキル) $_2$ スルファモイル、カルボシクリル、ヘテロシクリルから選択され；ここで $R^{24}$ は、独立して、場合により1つ又はそれ以上の $R^{25}$ により炭素上で置換される場合があり；そしてここで前記ヘテロシクリルが $-NH-$ 部分を含む場合、その窒素は、場合により1つ又はそれ以上の $R^{26}$ により置換される場合があり；

ここで、プロドラッグは、

式(1)の化合物に存在するカルボキシ基が、 $C_{1-6}$ アルコキシメチルエステル、 $C_{1-6}$ アルカノイルオキシメチルエステル、フタリジルエステル、 $C_{3-8}$ シクロアルコキシカルボニルオキシ $C_{1-6}$ アルキルエステル、1, 3 - ジオキソレン - 2 - オニルメチルエステル、5 - メチル - 1, 3 - ジオキソレン - 2 - オニルメチルエステル、 $C_{1-6}$ アルコキシ

カルボニルオキシエチルエステル、N - C<sub>1-6</sub>アルキルアミド、またはN, N - ジ - C<sub>1-6</sub>アルキルアミドに；および／または

式(Ⅰ)の化合物に存在するヒドロキシ基が、ホスホノオキシ、-アシルオキシアルコキシ、アルカノイルオキシ、ベンゾイルオキシ、フェニルアセチルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、ジアルキルカルバモイルオキシ、N - (ジアルキルアミノエチル) - N - アルキルカルバモイルオキシ、ジアルキルアミノアセチルオキシ、またはカルボキシアセチルオキシ

に変換された化合物であり、ここで前記ベンゾイルオキシは、ベンゾイル環の3位または4位にメチレン基を介して環窒素原子から連結したモルホリノまたはピペラジノにより置換されている。】。

#### 【請求項2】

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、独立して、エチル又はブチルから選択される、請求項1に記載の式(Ⅰ)の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグ。

#### 【請求項3】

R<sup>3</sup>が水素である、請求項1又は2のいずれか1項に記載の式(Ⅰ)の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグ。

#### 【請求項4】

R<sup>5</sup>が式(ⅠA)の基であり、R<sup>4</sup>がプロモ、メトキシ又はメチルチオである、請求項1～3のいずれか1項に記載の式(Ⅰ)の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグ。

#### 【請求項5】

R<sup>5</sup>が、N - (カルボキシメチル)カルバモイルメトキシ、N - (2 - スルホエチル)カルバモイルメトキシ、N - (1, 3 - ジカルボキシプロピル)カルバモイルメトキシ、N - (3 - スルホプロピル)カルバモイルメトキシ、N - [N - (2 - スルホエチル)カルバモイルメチル]カルバモイルメトキシ、N - [1 - カルボキシ - 2 - (4 - ヒドロキシフェニル)エチル]カルバモイルメトキシ、N - (1 - カルボキシ - 2 - フェニルエチル)カルバモイルメトキシ、N - (1 - カルボキシ - 3 - メチルブチル)カルバモイルメトキシ、N - (1 - カルボキシ - 2 - インドル - 3 - イルエチル)カルバモイルメトキシ、N - (1 - カルボキシ - 2 - ピリド - 3 - イルエチル)カルバモイルメトキシ、N - (カルボキシメチル) - N - (ベンジル)カルバモイルメトキシ、N - (1 - カルボキシエチル)カルバモイルメトキシ、1 - [N - (カルボキシメチル)カルバモイル]エトキシ、N - (1 - カルボキシ - 2 - ヒドロキシエチル)カルバモイルメトキシ、N - (1 - カルボキシシクロプロプ - 1 - イル)カルバモイルメトキシ、N - (1 - カルボキシ - 1 - メチルエチル)カルバモイルメトキシ、N - (1 - カルボキシ - 2 - シクロヘキシルエチル)カルバモイルメトキシ、N - (1 - カルボキシ - 2 - メチルプロピル)カルバモイルメトキシ、N - (1 - カルボキシ - 2 - イミダゾル - 4 - イルエチル)カルバモイルメトキシ、N - [1 - カルボキシ - 2 - (1 - メチルイミダゾル - 4 - イル)エチル]カルバモイルメトキシ、N - (1 - カルボキシ - 2 - t - ブトキシプロピル)カルバモイルメトキシ、N - (1 - カルボキシ - 3 - メチルチオプロピル)カルバモイルメトキシ、N - (1 - カルボキシ - 2 - メチルブチル)カルバモイルメトキシ、N - (1 - カルボキシ - 2 - メチルプロピル)カルバモイルメトキシ、N - (1 - カルボキシ - 1 - メチル - 2 - インドル - 3 - イルエチル)カルバモイルメトキシ、N - (1 - カルボキシ - 2 - ヒドロキシプロピル)カルバモイルメトキシ、及びN - (1 - カルボキシ - 1 - シクロヘキシルメチル)カルバモイルメトキシであり、R<sup>4</sup>がプロモ、メトキシ又はメチルチオである、請求項1～4のいずれか1項に記載の式(Ⅰ)の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグ。

#### 【請求項6】

R<sup>6</sup>が水素である、請求項1～5のいずれか1項に記載の式(Ⅰ)の

化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグ。

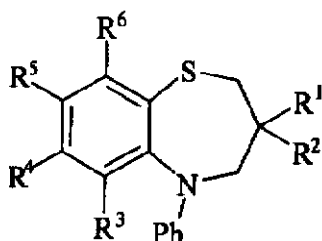
【請求項 7】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物を製造する方法であって：

方法 1)：

式 (II)：

【化 4】



(II)

のベンゾチアゼピンを酸化する工程、そして、その後必要であるか又は望まれるならば：

i) 式 (I) のある化合物を式 (I) の別の化合物へ変換する工程；

ii) 保護基を除去する工程；

iii) 製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグを形成させる工程を含む、前記方法。

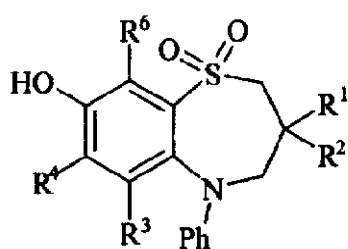
【請求項 8】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物を製造する方法であって：

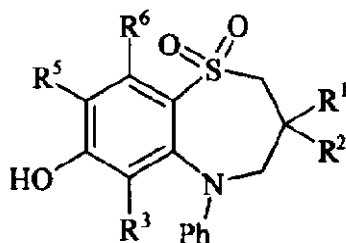
方法 2)：

式 (IIIa) 若しくは (IIIb)：

【化 5】



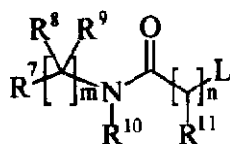
(IIIa)



(IIIb)

のアルコールを、式 (IV)：

【化 6】



(IV)

(式中、L は、ハロゲンまたはスルホニルオキシから選択される置換可能基である) の化合物と反応させる工程、そして、その後必要であるか又は望まれるならば：

i) 式 (I) のある化合物を式 (I) の別の化合物へ変換する工程；

ii) 保護基を除去する工程；

iii) 製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグを形成させる工程を含む、前記方法。

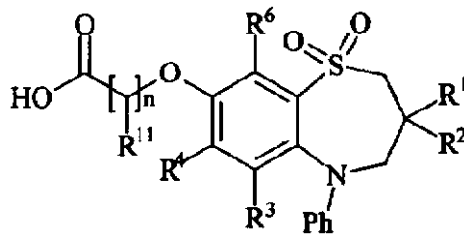
## 【請求項 9】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物を製造する方法であって：

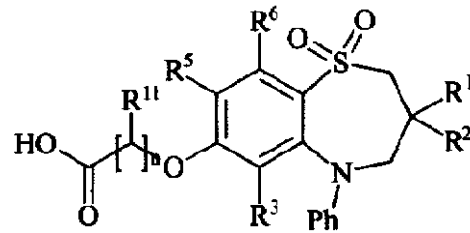
方法 3 )：

式 (Va) 若しくは (Vb)：

【化 7】



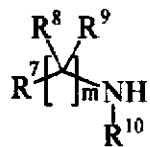
(Va)



(Vb)

の酸又はその活性化誘導体を、式 (VI)：

【化 8】



(VI)

のアミンと反応させる工程、そして、その後必要であるか又は望まれるならば：

i) 式 (I) のある化合物を式 (I) の別の化合物へ変換する工程；

i i) 保護基を除去する工程；

i i i) 製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグを形成させる工程を含む、前記方法。

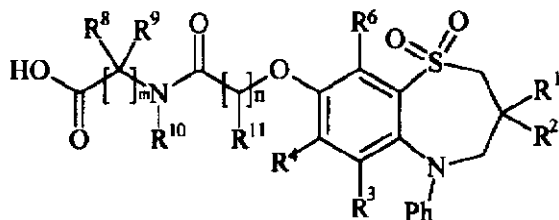
## 【請求項 10】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物を製造する方法であって：

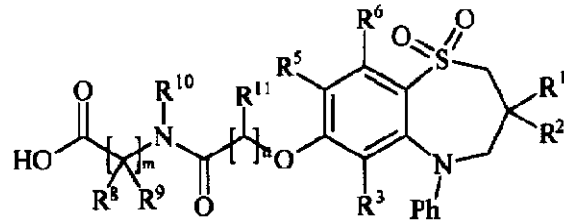
方法 4 )：

R<sup>7</sup>が式 (IB) の基である式 (I) の化合物では；式 (VIIa) 若しくは (VIIb) )：

【化 9】



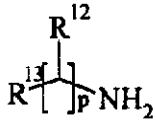
(VIIa)



(VIIb)

の酸又はその活性化誘導体を、式 (IX)：

【化 10】



のアミンと反応させる工程、そして、その後必要であるか又は望まれるならば：

- i) 式 (I) のある化合物を式 (I) の別の化合物へ変換する工程；
- ii) 保護基を除去する工程；
- iii) 製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグを形成させる工程を含む、前記方法。

【請求項 1 1】

医薬品として使用される、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグ。

【請求項 1 2】

ヒトのような温血動物の予防的若しくは治療的処置の方法において使用される、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグ。

【請求項 1 3】

請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグの、ヒトのような温血動物における回腸胆汁酸輸送阻害効果を生じさせるために使用される医薬品の製造における使用。

【請求項 1 4】

ヒトのような温血動物において回腸胆汁酸輸送阻害効果の産生に使用されるための、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、又はそのような塩の溶媒和物を含む医薬組成物。

【請求項 1 5】

請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグを、製剤的に許容される希釈剤若しくは担体と一緒に含む、医薬組成物。

【請求項 1 6】

請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグと、HMG CoA レダクターゼ阻害剤、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグとを、製剤的に許容される希釈剤若しくは担体と一緒に含む、医薬組成物。

【請求項 1 7】

請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグと、胆汁酸結合剤とを、製剤的に許容される希釈剤若しくは担体と一緒に含む、医薬組成物。

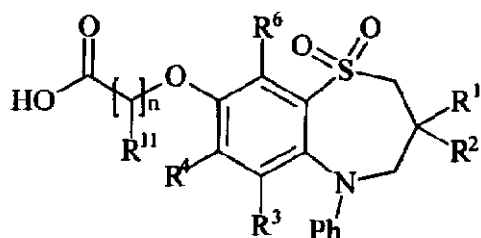
【請求項 1 8】

請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグと、HMG CoA レダクターゼ阻害剤、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグと、胆汁酸結合剤とを、製剤的に許容される希釈剤若しくは担体と一緒に含む、医薬組成物。

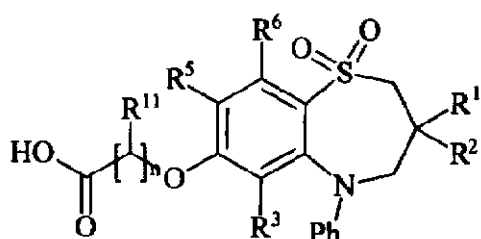
【請求項 1 9】

式 (Va)、(Vb)、(VIIa) 又は (VIIb)：

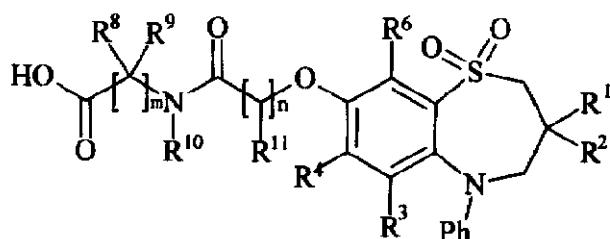
【化 1 1】



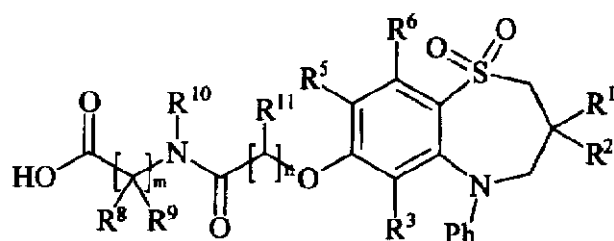
(Va)



(Vb)



(VIIa)



(VIIb)

の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグ（ここで、プロドラッグは、

式 (Va)、(Vb)、(VIIa) 又は (VIIb) の化合物に存在するカルボキシ基が、C<sub>1-6</sub>アルコキシメチルエステル、C<sub>1-6</sub>アルカノイルオキシメチルエステル、フタリジルエステル、C<sub>3-8</sub>シクロアルコキシカルボニルオキシC<sub>1-6</sub>アルキルエステル、1, 3 - ジオキソレン - 2 - オニルメチルエステル、5 - メチル - 1, 3 - ジオキソレン - 2 - オニルメチルエステル、C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニルオキシエチルエステル、N - C<sub>1-6</sub>アルキルアミド、またはN, N - ジ - C<sub>1-6</sub>アルキルアミドに；および/または

式 (Va)、(Vb)、(VIIa) 又は (VIIb) の化合物に存在するヒドロキシ基が、ホスホノオキシ、- アシルオキシアルコキシ、アルカノイルオキシ、ベンゾイルオキシ、フェニルアセチルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、ジアルキルカルバモイルオキシ、N - (ジアルキルアミノエチル) - N - アルキルカルバモイルオキシ、ジアルキルアミノアセチルオキシ、またはカルボキシアセチルオキシ

に変換された化合物であり、ここで前記ベンゾイルオキシは、ベンゾイル環の3位または



4 位にメチレン基を介して環窒素原子から連結したモルホリノまたは生尾鯰時のにより置換されていてもよい)。

【請求項 20】

医薬品として使用される、請求項 19 に記載の式 (V I I a) 又は (V I I b) の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグ。

【請求項 21】

ヒトのような温血動物の予防的若しくは治療的処置の方法において使用される、請求項 19 に記載の式 (V I I a) 又は (V I I b) の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグ。

【請求項 22】

請求項 19 に記載の式 (V I I a) 又は (V I I b) の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグの、ヒトのような温血動物における回腸胆汁酸輸送阻害効果を生じさせるために使用される医薬品の製造における使用。

【請求項 23】

ヒトのような温血動物において回腸胆汁酸輸送阻害効果の產生に使用されるための、請求項 19 に記載の式 (V I I a) 又は (V I I b) の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグを含む医薬組成物。

【請求項 24】

請求項 19 に記載の式 (V I I a) 又は (V I I b) の化合物、又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグを、製剤的に許容される希釈剤若しくは担体と一緒に含む、医薬組成物。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0011

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0011】

の基であり；

$R^8$  及び  $R^9$  は、独立して、水素、 $C_{1-4}$  アルキル又は飽和環式基であるか、又は  $R^8$  及び  $R^9$  は、一緒に  $C_{2-6}$  アルキレンを形成し；ここで  $R^8$  及び  $R^9$ 、又は一緒に  $R^8$  及び  $R^9$  は、独立して、場合により  $R^{15}$  から選択される 1 つ又はそれ以上の置換基により炭素上で置換される場合があり；そしてここで前記飽和環式基が -NH- 部分を含有する場合、その窒素は、場合により 1 つ又はそれ以上の  $R^{20}$  により置換される場合があり；

$R^{10}$  は、水素又は  $C_{1-4}$  アルキルであり；ここで  $R^{10}$  は、場合により  $R^{24}$  から選択される 1 つ又はそれ以上の置換基により炭素上で置換され；

$R^{11}$  は、水素、 $C_{1-4}$  アルキル、カルボシクリル又はヘテロシクリルであり；ここで  $R^{11}$  は、場合により  $R^{16}$  から選択される 1 つ又はそれ以上の置換基により炭素上で置換され；そしてここで前記ヘテロシクリルが -NH- 部分を含有する場合、その窒素は、場合により 1 つ又はそれ以上の  $R^{21}$  により置換される場合があり；

$R^{12}$  は、水素又は  $C_{1-4}$  アルキル、カルボシクリル又はヘテロシクリルであり；ここで  $R^{12}$  は、場合により  $R^{17}$  から選択される 1 つ又はそれ以上の置換基により炭素上で置換され；そしてここで前記ヘテロシクリルが -NH- 部分を含有する場合、その窒素は、場合により 1 つ又はそれ以上の  $R^{22}$  により置換される場合があり；

$R^{13}$  は、カルボキシ、スルホ、スルフィノ、ホスホノ、-P(O)(OR<sup>c</sup>)(OR<sup>d</sup>)、P(O)(OH)(OR<sup>c</sup>)、-P(O)(OH)(R<sup>c</sup>) 又は P(O)(OR<sup>c</sup>)(R<sup>d</sup>) であり (ここで R<sup>c</sup> 及び R<sup>d</sup> は、独立して  $C_{1-6}$  アルキルから選択される)；

m は 1 ~ 3 であり ; ここで  $R^8$  及び  $R^9$  の適合基 ( values ) は同じであるか又は異なる場合があり ;

n は 1 ~ 3 であり ; ここで  $R^{11}$  の適合基は同じであるか又は異なる場合があり ;

p は 1 ~ 3 であり ; ここで  $R^{12}$  の適合基は同じであるか又は異なる場合があり ;

$R^{14}$  及び  $R^{16}$  は、独立して、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{2-4}$  アルケニル、 $C_{2-4}$  アルキニル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $C_{1-4}$  アルカノイル、 $C_{1-4}$  アルカノイルオキシ、N - ( $C_{1-4}$  アルキル) アミノ、N, N - ( $C_{1-4}$  アルキル)<sub>2</sub> アミノ、 $C_{1-4}$  アルカノイルアミノ、N - ( $C_{1-4}$  アルキル) カルバモイル、N, N - ( $C_{1-4}$  アルキル)<sub>2</sub> カルバモイル、 $C_{1-4}$  アルキル S ( O )<sub>a</sub> ( ここで a は 0 ~ 2 である )、 $C_{1-4}$  アルコキシカルボニル、N - ( $C_{1-4}$  アルキル) スルファモイル及び N, N - ( $C_{1-4}$  アルキル)<sub>2</sub> スルファモイルから選択され ; ここで  $R^{14}$  及び  $R^{16}$  は、場合により 1 つ又はそれ以上の  $R^{18}$  により炭素上で置換される場合があり ;

$R^{15}$  及び  $R^{17}$  は、独立して、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{2-4}$  アルケニル、 $C_{2-4}$  アルキニル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $C_{1-4}$  アルカノイル、 $C_{1-4}$  アルカノイルオキシ、N - ( $C_{1-4}$  アルキル) アミノ、N, N - ( $C_{1-4}$  アルキル)<sub>2</sub> アミノ、 $C_{1-4}$  アルカノイルアミノ、N - ( $C_{1-4}$  アルキル) カルバモイル、N, N - ( $C_{1-4}$  アルキル)<sub>2</sub> カルバモイル、 $C_{1-4}$  アルキル S ( O )<sub>a</sub> ( ここで a は 0 ~ 2 である )、 $C_{1-4}$  アルコキシカルボニル、N - ( $C_{1-4}$  アルキル) スルファモイル及び N, N - ( $C_{1-4}$  アルキル)<sub>2</sub> スルファモイル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、スルホ、スルフィノ、アミジノ、ホスホノ、- P ( O ) ( OR<sup>e</sup> ) ( OR<sup>f</sup> )、- P ( O ) ( OH ) ( OR<sup>e</sup> )、- P ( O ) ( OH ) ( R<sup>e</sup> ) 又は P ( O ) ( OR<sup>e</sup> ) ( R<sup>f</sup> ) ( ここで R<sup>e</sup> 及び R<sup>f</sup> は、独立して  $C_{1-6}$  アルキル から選択される ) から選択され ; ここで  $R^{15}$  及び  $R^{17}$  は、場合により 1 つ又はそれ以上の  $R^{19}$  により炭素上で置換される場合があり ; そしてここで前記ヘテロシクリルが - NH - 部分を含有する場合、その窒素は、場合により 1 つ又はそれ以上の  $R^{23}$  により置換される場合があり ;

$R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{25}$  は、独立して、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、カルバモイル、ウレイド、アミノ、ニトロ、カルボキシ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、ビニル、アリル、エチニル、メトキシカルボニル、ホルミル、アセチル、ホルムアミド、アセチルアミノ、アセトキシ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、N - メチルカルバモイル、N, N - ジメチルカルバモイル、メチルチオ、メチルスルフィニル、メシル、N - メチルスルファモイル及び N, N - ジメチルスルファモイルから選択され ;

$R^{20}$ 、 $R^{21}$ 、 $R^{22}$ 、 $R^{23}$  及び  $R^{26}$  は、独立して、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アルカノイル、 $C_{1-4}$  アルキルスルホニル、スルファモイル、N - ( $C_{1-4}$  アルキル) スルファモイル、N, N - ( $C_{1-4}$  アルキル)<sub>2</sub> スルファモイル、 $C_{1-4}$  アルコキシカルボニル、カルバモイル、N - ( $C_{1-4}$  アルキル) カルバモイル、N, N - ( $C_{1-4}$  アルキル)<sub>2</sub> カルバモイル、ベンジル、フェネチル、ベンゾイル、フェニルスルホニル、及びフェニルであり ;

$R^{24}$  は、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{2-4}$  アルケニル、 $C_{2-4}$  アルキニル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $C_{1-4}$  アルカノイル、 $C_{1-4}$  アルカノイルオキシ、N - ( $C_{1-4}$  アルキル) アミノ、N, N - ( $C_{1-4}$  アルキル)<sub>2</sub> アミノ、 $C_{1-4}$  アルカノイルアミノ、N - ( $C_{1-4}$  アルキル) カルバモイル、N, N - ( $C_{1-4}$  アルキル)<sub>2</sub> カルバモイル、 $C_{1-4}$  アルキル S ( O )<sub>a</sub> ( ここで a は 0 ~ 2 である )、 $C_{1-4}$  アルコキシカルボニル、N - ( $C_{1-4}$  アルキル) スルファモイル及び N, N - ( $C_{1-4}$  アルキル)<sub>2</sub> スルファモイル、カルボシクリル、ヘテロシクリルから選択され ; ここで  $R^{24}$  は、独立して、場合により 1 つ又はそれ以上の  $R^{25}$  により炭素上で置換される場合があり ; そしてここで前記ヘテロシクリルが - NH - 部分を含有する場合、その窒素は、場合により 1 つ又はそれ以上の  $R^{26}$  により置換される場合がある ] の化合物 ;

又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロ

ドラッグを提供する。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0029

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0029】

の基であり、

$R^3$ 及び $R^6$ と $R^4$ 及び $R^5$ の他方は、独立して、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、(場合によりハロにより置換される) $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{2-4}$ アルケニル、 $C_{2-4}$ アルキニル、(場合によりハロにより置換される) $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ アルカノイル、 $C_{1-4}$ アルカノイルオキシ、 $N-(C_{1-4}$ アルキル)アミノ、 $N,N-(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ アミノ、 $C_{1-4}$ アルカノイルアミノ、 $N-(C_{1-4}$ アルキル)カルバモイル、 $N,N-(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ カルバモイル、 $C_{1-4}$ アルキル $S(O)_a$ (ここで $a$ は0~2である)、 $C_{1-4}$ アルコキシカルボニル、 $N-(C_{1-4}$ アルキル)スルファモイル及び $N,N-(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ スルファモイルから選択され；

$R^7$ は、カルボキシ、スルホ、スルフィノ、ホスホノ、 $-P(O)(OR^a)(OR^b)$ 又は $P(O)(OH)(OR^c)$ であり(ここで $R^a$ 、 $R^b$ 及び $R^c$ は、独立して $C_{1-6}$ アルキルから選択される)；

$R^8$ は、水素であるか、又は1つ又はそれ以上のヒドロキシ、カルボキシ、スルホ、アミノ、アミジノ、ホスホノ、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ アルキル $S(O)_a$ (ここで $a$ は0~2である)、 $-P(O)(OR^d)(OR^e)$ 又は $-P(O)(OH)(OR^f)$ (ここで $R^d$ 、 $R^e$ 及び $R^f$ は、独立して $C_{1-6}$ アルキルから選択される)により場合により置換される $C_{1-4}$ アルキルであり；

$m$ は1~3であり；

$n$ は1~3である]の化合物；

又はその製剤的に許容される塩、溶媒和物、そのような塩の溶媒和物、又はそれらのプロドラッグが提供される。