

【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27年8月13日(2015.8.13)

【公表番号】特表2013-521337(P2013-521337A)

【公表日】平成25年6月10日(2013.6.10)

【年通号数】公開・登録公報2013-029

【出願番号】特願2012-557128(P2012-557128)

【国際特許分類】

C 0 7 F 9/14 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/661 (2006.01)

【F I】

C 0 7 F 9/14 C S P

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 13/12

A 6 1 K 31/661

【誤訳訂正書】

【提出日】平成27年6月22日(2015.6.22)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0056

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0056】

(Pr<sup>1</sup>及びPr<sup>2</sup>は、保護基である)

の化合物からPr<sup>2</sup>の存在下にPr<sup>1</sup>を除いて、式I-2:

【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

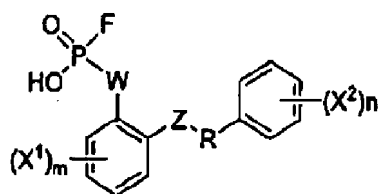
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I:

【化1】



I

[式中、

RはC<sub>2-4</sub>アルキルであり;

Wは、NR<sup>A</sup>、O及びSから選択され；  
 Zは、単結合、-C(O)-、NR<sup>A</sup>、O及びSから選択され；  
 X<sup>1</sup>及びX<sup>2</sup>は各々独立に-OH、-NHR<sup>A</sup>及び-C(O)OHから選択され；  
 R<sup>A</sup>は、H又はC<sub>1-3</sub>アルキルであり；  
 mは、1、2、3又は4であり；そして、  
 nは、1、2、3又は4である。]

で表される化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

Rが-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-又は-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-である、請求項 1 記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 3】

WがNR<sup>A</sup>及びOから選択される、請求項 1 又は 2 記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 4】

WがOである、請求項 3 記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 5】

Zが単結合及び-C(O)-から選択される、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 6】

Zが-C(O)-ある、請求項 5 記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 7】

X<sup>1</sup>及びX<sup>2</sup>が各々独立にOH及びNH<sub>2</sub>から選択される、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 8】

X<sup>1</sup>及びX<sup>2</sup>がいずれもOHである、請求項 7 記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 9】

n及びmが独立に1又は2である、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

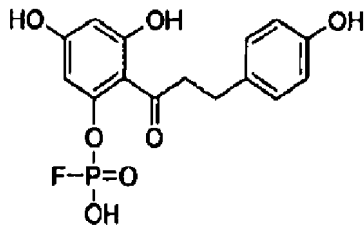
【請求項 10】

mが2で、nが1である、請求項 9 記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 11】

下記式：

【化 2】



で表される化合物である、請求項 1 記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 12】

請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項記載の化合物又はその薬学的に許容される塩、及び少なくとも 1 つの薬学的に許容される担体を含む、医薬組成物。

【請求項 13】

医薬としての請求項 12 記載の医薬組成物。

【請求項 14】

哺乳動物対象における高血圧症を治療するための請求項 13 記載の医薬組成物。

## 【請求項 15】

哺乳動物対象における高い血中リン酸塩レベルによって起こる又はそれに関連する疾患を治療するための請求項 12 記載の医薬組成物であって、血中リン酸塩レベルの減少が望ましい対象が同定され、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項記載の化合物又はその薬学的に許容される塩の治療上有効量が当該対象に投与される、医薬組成物。

## 【請求項 16】

高い血中リン酸塩レベルによって起こる又はそれに関連する疾患の治療を必要とする患者における当該疾患を治療するための請求項 12 記載の医薬組成物であって、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項記載の化合物又はその薬学的に許容される塩の治療上有効量が当該患者に投与される、医薬組成物。

## 【請求項 17】

前記疾患が慢性腎不全である、請求項 16 記載の医薬組成物。

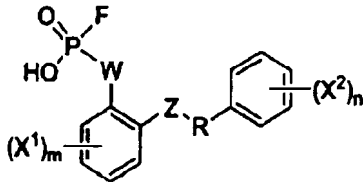
## 【請求項 18】

前記慢性腎不全が、高リン酸塩血症、二次性副甲状腺機能亢進症、腎性骨ジストロフィー、高血圧症、代謝性アシドーシス又は心臓病に関連し及び/又はそれを伴う、請求項 17 記載の医薬組成物。

## 【請求項 19】

式 I :

## 【化 3】



I

[ 式中、

RはC<sub>2-4</sub>アルキルであり；

Wは、NR<sup>A</sup>、O及びSから選択され；

Zは、単結合、-C(O)-、NR<sup>A</sup>、O及びSから選択され；

X<sup>1</sup>及びX<sup>2</sup>は各々独立に-OH、-NHR<sup>A</sup>及び-C(O)OHから選択され；

R<sup>A</sup>は、H又はC<sub>1-3</sub>アルキルであり；

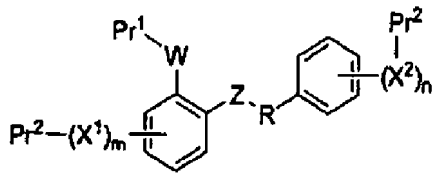
mは、1、2、3又は4であり；そして、

nは、1、2、3又は4である。]

の化合物又はその薬学的に許容される塩の製造法であって、以下：

a) 式 I-1:

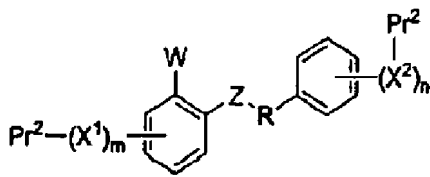
【化4】



I-1

(Pr<sup>1</sup>及びPr<sup>2</sup>は、保護基である)  
 の化合物からPr<sup>1</sup>を選択的に除いて、式I-2:

【化5】

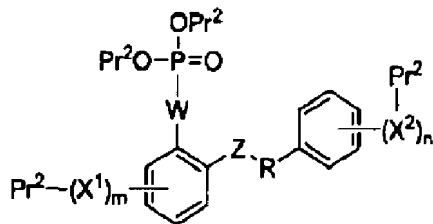


I-2

の化合物を製造し、

b) 式I-2の化合物をリン酸化剤と反応させて、式I-3:

【化6】

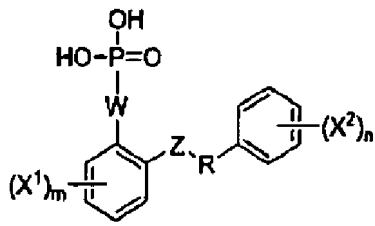


I-3

の化合物を製造し、

c) 還元剤を用いて式I-3の化合物からPr<sup>2</sup>を除いて、式I-4:

【化 7】



I-4

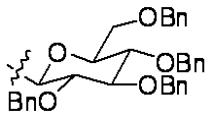
の化合物を製造し、

d) 式 I-4 の化合物をフッ素化剤と反応させて、式 I の化合物を製造すること、を含む、方法。

【請求項 20】

Pr<sup>1</sup>が、

【化 8】



であり、Pr<sup>2</sup>がベンジルである、請求項 19 記載の方法。

【請求項 21】

前記ホスホリル化剤が亜リン酸エステル又はホスホン酸であり、前記亜リン酸エステルがジベンジル亜リン酸エステルであり、前記ホスホン酸がフルオロホスホン酸である、請求項 19 又は 20 記載の方法。

【請求項 22】

前記還元剤が、水素ガス又は遷移金属である、請求項 19 ~ 21 のいずれか 1 項記載の方法。

【請求項 23】

前記フッ素化剤がジニトロフルオロベンゼン又はフッ化水素酸である、請求項 19 ~ 22 のいずれか 1 項記載の方法。