

【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 3 月 24 日 (2011.3.24)

【公表番号】特表 2002-541259 (P2002-541259A)

【公表日】平成 14 年 12 月 3 日 (2002.12.3)

【出願番号】特願 2000-610857 (P2000-610857)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 5/06 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 487/04 1 4 0

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 5/06

A 6 1 P 15/00

C 0 7 D 495/04 1 0 5 Z

【誤訳訂正書】

【提出日】平成 23 年 2 月 2 日 (2011.2.2)

【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

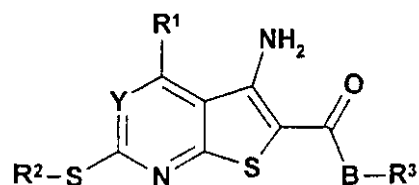
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 式 I I :

【化 1】



式 II

(式 I I 中、

R¹ は、(6 - 14 C) アリール、又は (4 - 13 C) ヘテロアリールであり

(ここで、前記アリール及びヘテロアリールは、R⁸、(6 - 14 C) アリール、(4 - 13 C) ヘテロアリール、(2 - 7 C) ヘテロシクロアルキル、(3 - 8 C) シクロアルキル、NHR⁸、OR⁸、および SR⁸、から選択される一以上の置換基で、オルト位および / 又はメタ位において置換されていてもよく、

(ここで、前記 R⁸ は、(6 - 14 C) アリール、(4 - 13 C) ヘテロアリール、(1 - 8 C) アルキルカルボニル、(6 - 14 C) アリールカルボニル、(1 - 8 C) アルキル、(2 - 8 C) アルケニル、又は (2 - 8 C) アルキニル、であり、

(R⁸ が、(1 - 8 C) アルキルカルボニル、又は (1 - 8 C) アルキルであるとき、前記アルキルは、ヒドロキシル、(1 - 8 C) アルコキシ、(2 - 7 C) ヘテロシクロアルキル ((1 - 8 C) アルコ) キシ、(3 - 8 C) シクロアルキル ((1 - 8 C) アルコ) キシ、(6 - 14 C) アリール ((1 - 8 C) アルコ) キシ、(4 - 13 C) ヘテロア

リール ((1 - 8 C) アルコ) キシ、 (2 - 7 C) ヘテロシクロアルキル、 (3 - 8 C) シクロアルキル、 (6 - 1 4 C) アリール、 (4 - 1 3 C) ヘテロアリール、 (1 - 8 C) アルコキシカルボニル、 (6 - 1 4 C) アリールオキシカルボニル、 (1 - 8 C) アルキルカルボニルオキシ、 (6 - 1 4 C) アリールカルボニルオキシ、 (1 - 8 C) アルキルカルボニル、 (6 - 1 4 C) アリールカルボニル、アミン、 (1 - 8 C) アルキルアミノカルボニル、 (6 - 1 4 C) アリールアミノカルボニル、 (1 - 8 C) アルキルカルボニルアミノ、 (6 - 1 4 C) アリールカルボニルアミノ、 (6 - 1 4 C) (ジ) アリールアミノ、および (1 - 8 C) (ジ) アルキルアミノ、から選択される一以上の置換基で置換されていてもよい。))) ;

R^2 は、 (1 - 8 C) アルキル、 (2 - 8 C) アルケニル、 (2 - 8 C) アルキニル、又は (6 - 1 4 C) アリール若しくは (4 - 1 3 C) ヘテロアリールであり

(ここで、 R^2 が、 (1 - 8 C) アルキル、 (2 - 8 C) アルケニル、又は (2 - 8 C) アルキニルであるとき、前記アルキル、アルケニル、およびアルキニルは、 (6 - 1 4 C) アリール、 (4 - 1 3 C) ヘテロアリール、 (1 - 8 C) アルキルカルボニル、 (6 - 1 4 C) アリールカルボニル、 (1 - 8 C) アルキルカルボニルオキシ、 (6 - 1 4 C) アリールカルボニルオキシ、 (6 - 1 4 C) アリールオキシカルボニル、および (1 - 8 C) アルコキシカルボニルから選択される一以上の置換基で置換されていてもよく、又は、

R^2 が、 (6 - 1 4 C) アリール、又は (4 - 1 3 C) ヘテロアリールであるとき、前記アリールおよびヘテロアリールは、 (1 - 8 C) アルキル、 (1 - 8 C) アルキルチオ、 (1 - 8 C) (ジ) アルキルアミノ、 (1 - 8 C) アルコキシ、 (2 - 8 C) アルケニル、および (2 - 8 C) アルキニルから選択される一以上の置換基で置換されていてもよい。)) ;

R^3 は、 (1 - 8 C) アルキル、 (2 - 8 C) アルケニル、 (2 - 8 C) アルキニル、 (3 - 8 C) シクロアルキル、 (2 - 7 C) ヘテロシクロアルキル、又は (6 - 1 4 C) アリール若しくは (4 - 1 3 C) ヘテロアリールであり

(ここで、 R^3 が、 (1 - 8 C) アルキル、 (2 - 8 C) アルケニル、 (2 - 8 C) アルキニル、 (3 - 8 C) シクロアルキル、又は (2 - 7 C) ヘテロシクロアルキルであるとき、前記アルキル、アルケニル、およびアルキニルは、ヒドロキシル、 (1 - 8 C) アルコキシ、 (6 - 1 4 C) アリールオキシ、 (3 - 8 C) シクロアルキル ((1 - 8 C) アルコ) キシ、 (2 - 7 C) ヘテロシクロアルキル ((1 - 8 C) アルコ) キシ、 (6 - 1 4 C) アリール ((1 - 8 C) アルコ) キシ、 (4 - 1 3 C) ヘテロアリール ((1 - 8 C) アルコ) キシ、 (2 - 7 C) ヘテロシクロアルキル、 (6 - 1 4 C) アリール、 (4 - 1 3 C) ヘテロアリール、 (1 - 8 C) アルコキシカルボニル、 (6 - 1 4 C) アリールオキシカルボニル、 (1 - 8 C) アルキルカルボニルオキシ、 (6 - 1 4 C) アリールカルボニルオキシ、 (1 - 8 C) アルキルカルボニル、 (6 - 1 4 C) アリールカルボニル、アミン、 (1 - 8 C) アルキルアミノカルボニル、 (6 - 1 4 C) アリールアミノカルボニル、 (1 - 8 C) アルキルカルボニルアミノ、 (6 - 1 4 C) アリールカルボニルアミノ、 (6 - 1 4 C) (ジ) アリールアミノ、および (1 - 8 C) (ジ) アルキルアミノから選択される一以上の置換基で置換されていてもよく、

R^3 が、 (6 - 1 4 C) アリール又は (4 - 1 3 C) ヘテロアリールであるとき、前記アリール、およびヘテロアリールは、 (1 - 8 C) アルキル、 (1 - 8 C) (ジ) アルキルアミノ、および (1 - 8 C) アルコキシから選択される一以上の置換基で置換されていてもよい。)) ;

B は、N (H)、O、又は結合手であり ; および、

Y = CH 又は N である。)

の二環式ヘテロ芳香族誘導体化合物、あるいは製薬的に許容可能な塩

(但し、前記化合物は、

エチル 5 - アミノ - 4 - フェニル - 2 - エトキシカルボニルメチルチオ - チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 6 - カルボキシラート、

メチル 5 - アミノ - 4 - フェニル - 2 - メチルチオ - チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン
 - 6 - カルボキシラート、
 エチル 5 - アミノ - 4 - フェニル - 2 - メチルチオ - チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン
 - 6 - カルボキシラート、
 6 - アセチル - 5 - アミノ - 4 - フェニル - 2 - (2 - オキソプロピルチオ) - チエノ
 [2 , 3 - d] ピリミジン、
 5 - アミノ - 6 - ベンゾイル - 4 - フェニル - 2 - フェニルカルボニルメチルチオ - チ
 エノ [2 , 3 - d] ピリミジン、
 5 - アミノ - 6 - (4 - クロロベンゾイル) - 4 - フェニル - 2 - [(4 - クロロフェ
 ニル) カルボニルメチルチオ] - チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン、
 メチル 5 - アミノ - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - メチルチオ - チエノ [2 , 3
 - d] ピリミジン - 6 - カルボキシラート、
 エチル 5 - アミノ - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - メトキシチオ - チエノ [2 ,
 3 - d] ピリミジン - 6 - カルボキシラート、
 メチル 5 - アミノ - 4 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチルチオ - チエノ [2 , 3 -
 d] ピリミジン - 6 - カルボキシラート、
 エチル 5 - アミノ - 4 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチルチオ - チエノ [2 , 3 -
 d] ピリミジン - 6 - カルボキシラート、
 5 - アミノ - 6 - (4 - メチルベンゾイル) - 4 - フェニル - 2 - [(4 - メチルフェ
 ニル) カルボニルメチルチオ] - チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン、又は、
 エチル 5 - アミノ - 2 - エトキシカルボニルメチルチオ - 4 - (ピリジン - 4 - イル)
 - チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 6 - カルボキシラート
 ではない。) 。

【請求項 2】 B は、N (H) 又は O である請求項 1 記載による誘導体化合物。

【請求項 3】 B は、N (H) である請求項 1 あるいは 2 記載による化合物。

【請求項 4】 R¹ が、(6 - 1 4 C) アリール又は (4 - 1 3 C) ヘテロアリールであ
り、前記アリールおよびヘテロアリールが、NHR⁸、およびOR⁸から選択される置換
基で置換されている請求項 1 ~ 3 記載による化合物。

【請求項 5】 R⁸ が、(1 - 8 C) アルキルカルボニル、(6 - 1 4 C) アリールカル
ボニル、又は (1 - 8 C) アルキルである請求項 1 ~ 4 記載による化合物。

【請求項 6】 R⁸ が、(1 - 8 C) アルキルカルボニル、又は (1 - 8 C) アルキルで
あり、前記アルキルが、(2 - 7 C) ヘテロシクロアルキル、(1 - 6 C) (ジ) アルキ
ルアミノ、およびアミンから選択される置換基で置換されている請求項 1 ~ 5 記載による
化合物。

【請求項 7】 R³ が、(1 - 8 C) アルキルである請求項 1 ~ 6 記載による化合物。

【請求項 8】 R³ が、(1 - 4 C) アルキルである請求項 7 記載による化合物。

【請求項 9】 R³ が、イソプロピル又は t e r t - ブチルである請求項 8 記載による化
合物。

【請求項 1 0】 Y = N である請求項 1 ~ 9 記載による化合物。

【請求項 1 1】 R² = (1 - 4 C) アルキルである請求項 1 ~ 1 0 記載による化合物。

【請求項 1 2】 請求項 1 ~ 1 1 記載による二環式ヘテロ芳香族誘導体化合物または製薬
的に許容可能な塩あるいは溶媒和化合物を製薬的に許容可能な補助剤と共に含む製薬的組成
物。

【請求項 1 3】 生殖能の調整のための薬物の製造のための請求項 1 ~ 1 1 記載のいずれ
かによる二環式ヘテロ芳香族誘導体化合物又は製薬的に許容可能な塩あるいは溶媒和化合
物の使用。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

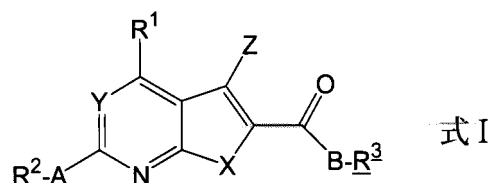
【訂正対象項目名】0 0 0 8

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 0 8 】

【 化 3 】



R^1 は NR^5R^6 , OR^5 , SR^5 又は R^7 であり、好ましくは R^1 は R^7 であり、
 R^5 および R^6 は H, (1 - 8 C) アルキル, (2 - 8 C) アルケニル, (2 - 8 C) アルキニル, (3 - 8 C) シクロアルキル, (2 - 7 C) ヘテロシクロアルキル, (1 - 8 C) アルキルカルボニル, (6 - 14 C) アリールカルボニル, (6 - 14 C) アリール又は (4 - 13 C) ヘテロアリールから独立して選択されるかあるいは R^5 および R^6 が共に (2 - 7 C) ヘテロシクロアルキル環で結合され、

R^7 は (3 - 8 C) シクロアルキル, (2 - 7 C) ヘテロシクロアルキル, (6 - 14 C) アリール又は (4 - 13 C) ヘテロアリールであり、好ましくは R^7 は (6 - 14 C) アリール又は (4 - 13 C) ヘテロアリールであり、

R^2 は (1 - 8 C) アルキル, (2 - 8 C) アルケニル, (2 - 8 C) アルキニル, 又は (6 - 14 C) アリール若しくは (4 - 13 C) ヘテロアリールであり、前記 (6 - 14 C) アリールおよび (4 - 13 C) ヘテロアリールは、 (1 - 8 C) アルキル, (1 - 8 C) アルキルチオ, (1 - 8 C) (ジ) アルキルアミノ, (1 - 8 C) アルコキシ, (2 - 8 C) アルケニル, 又は (2 - 8 C) アルキニルから選択される 1 あるいは 1 以上の置換基で任意に置換され、

R^3 は (1 - 8 C) アルキル, (2 - 8 C) アルケニル, (2 - 8 C) アルキニル, (3 - 8 C) シクロアルキル, (2 - 7 C) ヘテロシクロアルキル, 又は (6 - 14 C) アリール若しくは (4 - 13 C) ヘテロアリールであり、前記 (6 - 14 C) アリールおよび (4 - 13 C) ヘテロアリールは、 (1 - 8 C) アルキル, (1 - 8 C) (ジ) アルキルアミノ又は (1 - 8 C) アルコキシから選択される 1 あるいは 1 以上の置換基で任意に置換され、好ましくは R^3 は (1 - 8 C) アルキルであり、さらに好ましくは (1 - 4 C) アルキルであり、さらに一層好ましくは R^3 はイソプロピル又は *tert*-ブチルであり、

X は S, O, 又は $N(R^4)$ であり、

R^4 は H, (1 - 8 C) アルキル, (1 - 8 C) アルキルカルボニル, (6 - 14 C) アリールカルボニル又は (6 - 14 C) アリール (1 - 8 C) アルキルであり、

Y は CH または N であり、好ましくは Y は N であり、

Z は NH_2 または OH であり、

A は S, $N(H)$, $N(R^9)$, O 又は結合手であり、および

R^9 は R^2 として表わした同基から選択可能であり、

B は $N(H)$, O 又は結合手である。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0010

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 1 0 】

R^7 が (6 - 14 C) アリール又は (4 - 13 C) ヘテロアリールであるならば、前記 (6 - 14 C) アリール及び (4 - 13 C) ヘテロアリールは、 R^8 , (6 - 14 C) アリール, (4 - 13 C) ヘテロアリール, (2 - 7 C) ヘテロシクロアルキル, (3 - 8

C) シクロアルキル, NHR^8 , OR^8 および / 又は SR^8 から選択される一つあるいは一つ以上の置換基でオルト位および / 又はメタ位で任意に置換してもよい。

ここで、前記 R^8 は、(6 - 14C) アリール, (4 - 13C) ヘテロアリール, (1 - 8C) アルキルカルボニル, (6 - 14C) アリールカルボニル, (1 - 8C) アルキル, (2 - 8C) アルケニル, (2 - 8C) アルケニルであり、前記 (1 - 8C) アルキルカルボニル及び (1 - 8C) アルキルのアルキル基は、ヒドロキシル, (1 - 8C) アルコキシ, (2 - 7C) ヘテロシクロアルキル ((1 - 8C) アルコ) キシ, (3 - 8C) シクロアルキル ((1 - 8C) アルコ) キシ, (6 - 14C) アリール ((1 - 8C) アルコ) キシ, (4 - 13C) ヘテロアリール ((1 - 8C) アルコ) キシ, (2 - 7C) ヘテロシクロアルキル, (3 - 8C) シクロアルキル, (6 - 14C) アリール, (4 - 13C) ヘテロアリール, (1 - 8C) アルコキシカルボニル, (6 - 14C) アリールオキシカルボニル, (1 - 8C) アルキルカルボニルオキシ, (6 - 14C) アリールカルボニルオキシ, (1 - 8C) アルキルカルボニル, (6 - 14C) アリールカルボニル, アミン, (1 - 8C) アルキルアミノカルボニル, (6 - 14C) アリールアミノカルボニル, (1 - 8C) アルキルカルボニルアミノ, (6 - 14C) アリールカルボニルアミノ, (6 - 14C) (ジ) アリールアミノおよび / 又は (1 - 8C) (ジ) アルキルアミノから選択された一つあるいは一つ以上の置換基で任意に置換されていてもよい。

好ましくは R^7 にあるアリールの置換基は、 NHR^8 又は OR^8 から選択される。 R^8 は好ましくは (1 - 8C) アルキルカルボニル, (6 - 14C) アリールカルボニル, (1 - 8C) アルキルである。アルキル基におけるさらに好ましい置換基は (2 - 7C) ヘテロシクロアルキル, (1 - 6C) (ジ) アルキルアミノおよびアミンである。

【誤訳訂正 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0014

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0014】

本発明の非常に好ましい化合物は一般式 I を有する二環式ヘテロ芳香族誘導体化合物であって、式中、

R^1 は (6 - 14C) アリール又は (4 - 13C) ヘテロアリール、

R^2 は (1 - 8C) アルキル, (2 - 8C) アルケニル, (2 - 8C) アルキニル, 又は (6 - 14C) アリール若しくは (4 - 13C) ヘテロアリールであり、前記 (6 - 14C) アリールおよび (4 - 13C) ヘテロアリール (1 - 8C) アルキルは、(1 - 8C) アルキルチオ, (1 - 8C) アルコキシ, (2 - 8C) アルケニル, 又は (2 - 8C) アルキニルから選択された一つあるいは一つ以上の置換基で任意に置換され、

R^3 は (1 - 8C) アルキル, (2 - 8C) アルケニル, (2 - 8C) アルキニル, (3 - 8C) シクロアルキル, (2 - 7C) ヘテロシクロアルキル, 又は (6 - 14C) アリール若しくは (4 - 13C) ヘテロアリールであり、前記 (6 - 14C) アリールおよび (4 - 13C) ヘテロアリール (1 - 8C) アルキルは、(1 - 8C) (ジ) アルキルアミノ又は (1 - 8C) アルコキシから選択された一つあるいは一つ以上の置換基で任意に置換され、

X は S、Z は NH_2 、A は S、および B は N(H), O, 又は結合手である。

【誤訳訂正 5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0017

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0017】

最も好ましい化合物は一般式 I の化合物であり、さらに好ましくは B が N(H) 又は O の化合物 II であり、B が N(H) である化合物 II が最も好ましい。 R^2 および / 又は

R³ は好ましくは (1 - 8 C) アルキルであり、さらに好ましくは (1 - 4 C) アルキルであり、Y は好ましくはNである。