

【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22年8月5日 (2010.8.5)

【公表番号】特表2006-503857(P2006-503857A)

【公表日】平成18年2月2日 (2006.2.2)

【年通号数】公開・登録公報2006-005

【出願番号】特願2004-540809(P2004-540809)

【国際特許分類】

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 5/24 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/08 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 403/14 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 409/14 C S P

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/497

A 6 1 K 31/506

A 6 1 P 5/24

A 6 1 P 15/00 1 7 1

A 6 1 P 15/08

A 6 1 P 43/00 1 0 7

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 403/14

C 0 7 D 471/04 1 0 3 M

C 0 7 M 7:00

【誤訳訂正書】

【提出日】平成22年6月15日 (2010.6.15)

【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

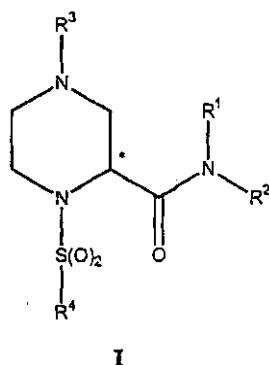
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I に係る化合物：

## 【化 1】



{ 式中、

$R^1$  は水素；

$R^2$  はアリール、ヘテロアリール、3 - 8 員環のシクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから選定され；

$R^3$  は  $C_1 - C_{16}$  - アルキル、 $C_2 - C_{16}$  - アルケニル、 $C_2 - C_{16}$  - アルキニル、単環式アリール、単環式ヘテロアリール、3 - 8 員環の単環式シクロアルキル、単環式ヘテロシクロアルキル、アシル、 $C_1 - C_{16}$  - アルキルアリール、 $C_1 - C_{16}$  - アルキルヘテロアリール、 $C_2 - C_{16}$  - アルケニルアリール、 $C_2 - C_{16}$  - アルケニルヘテロアリール、 $C_2 - C_{16}$  - アルキニルアリール、 $C_2 - C_{16}$  - アルキニルヘテロアリール、 $C_1 - C_{16}$  - アルキルシクロアルキル、 $C_1 - C_{16}$  - アルキルヘテロシクロアルキル、 $C_2 - C_{16}$  - アルケニルシクロアルキル、 $C_2 - C_{16}$  - アルケニルヘテロシクロアルキル、 $C_2 - C_{16}$  - アルキニルシクロアルキル、 $C_2 - C_{16}$  - アルキニルヘテロシクロアルキル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 $C_1 - C_{16}$  - アルキルカルボキシ、 $C_1 - C_{16}$  - アルキルアシル、アリールアシル、ヘテロアリールアシル、 $C_3 - C_8$  - (ヘテロ)シクロアルキルアシル、 $C_1 - C_{16}$  - アルキルアシルオキシ、 $C_1 - C_{16}$  - アルキルアルコキシ、 $C_1 - C_{16}$  - アルキルアルコキシカルボニル、 $C_1 - C_{16}$  - アルキルアミノカルボニル、 $C_1 - C_{16}$  - アルキルアシルアミノ、アシルアミノ、 $C_1 - C_{16}$  - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_{16}$  - アルキルスルファニル、 $C_1 - C_{16}$  - アルキルウレイド、 $C_1 - C_{16}$  - アルキルカルバメート、 $C_1 - C_{16}$  - アルキルアミノ及び  $C_1 - C_{16}$  - アルキルアンモニウムから選定され；

$R^4$  は  $C_1 - C_{12}$  - アルキル、 $C_2 - C_{12}$  - アルケニル、 $C_2 - C_{12}$  - アルキニル、アリール、ヘテロアリール、3 - 8 員環のシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、及びアミノから選定される}；

又はそれらの医薬的に許容され得る塩。

## 【請求項 2】

前記  $R^2$  がアリール又はヘテロアリールである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 3】

前記  $R^4$  が  $C_1 - C_6$  - アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、3 - 8 員環のシクロアルキル、及びヘテロシクロアルキルから選定される、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

前記  $R^2$  がアリールであり； $R^3$  が  $C_1 - C_8$  - アルキル、 $C_1 - C_8$  - アシルアミノ、及び  $C_1 - C_8$  - アルキルアシルから選定され、並びに  $R^4$  が  $C_1 - C_6$  - アルキル、アミノ、アリール及びヘテロアリールから選定される、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

前記  $R^2$  が融合フェニルである、請求項 1 に記載の化合物。

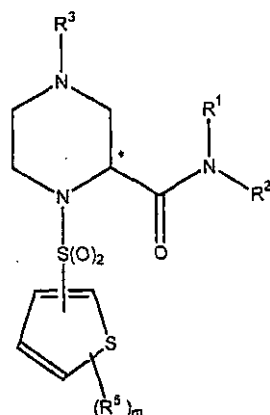
【請求項 6】

前記  $R^4$  がチエニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

以下の式 II :

【化 2】



II

{ 式中、

$R^5$  は独立してハロゲン、又はヒドロキシであり；

$m$  が 0 ~ 3 の整数である }

を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

前記  $R^2$  が、カルバゾリル、テトラヒドロ - - カルボリニル、又はベンゾイミダゾリル部位を含む、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

以下の群：

- 4-ヘキシル-1-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジニル-3-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-アミド)；
- 4-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン-1,3-ジカルボン酸 3-[(9-エチル-9H-カルバゾール-3-イル)アミド]-1-ペンチルアミド；
- 4-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン-1,3-ジカルボン酸 1-エチルアミド 3-[(9-エチル-9H-カルバゾール-3-イル)アミド]；
- 4-ペンタノイル-1-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(9-エチル-9H-カルバゾール-3-イル)アミド；
- 4-ヘキシル-1-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(9-エチル-9H-カルバゾール-3-イル)アミド；
- 4-ジメチルスルファモイル-ピペラジン-1,3-ジカルボン酸 3-[(9-エチル-9H-カルバゾール-3-イル)アミド]1-ペンチルアミド；
- 4-(1-メチル-1H-イミダゾール-4-スルホニル)-ピペラジン-1,3-ジカルボン酸 3-[(9-エチル-9H-カルバゾール-3-イル)-アミド]1-ペンチルアミド；
- 4-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン-1,3-ジカルボン酸 1-ペンチルアミド 3-[(3-ピリジン-4-イル-フェニル)-アミド]；
- 4-ヘキシル-1-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-オキソ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H- -カルボリン-6-イル)-アミド；
- 4-ヘプチル-1-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジ

ン-3-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-アミド；  
 4-ペンチル-1-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-オキソ-2,3,4,9-  
 テトラヒドロ-1H- -カルボリン-6-イル) アミド；  
 4-ヘプチル-1-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-オキソ-2,3,4,9-  
 テトラヒドロ-1H- -カルボリン-6-イル)アミド；  
 4-(3-メチルスルファニル-プロピル)-1-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カル  
 ボン酸 (9-エチル-9H-カルバゾール-3-イル)-アミド；  
 4-(4-エチル-フラン-3-イルメチル)-1-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボ  
 ン酸(9-エチル-9H-カルバゾール-3-イル)-アミド；  
 3-(9-エチル-9H-カルバゾール-3-イルカルバモイル)-4-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペ  
 ラジン-1-イル] 酢酸エチルエステル；  
 1-ベンゼンスルホニル-4-ヘキシル-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジン-3-イ  
 ル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 4-ペンチル-1-チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジ  
 ン-3-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 4-ヘキシル-1-チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジ  
 ン-3-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 1-(4-フルオロ-ベンゼンスルホニル)-4-ヘキシル-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-  
 ピリジン-3-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 1-(2-フルオロ-ベンゼンスルホニル)-4-ヘキシル-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-  
 ピリジン-3-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 4-オクチル-1-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジ  
 ン-4-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 4-ヘプチル-1-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジ  
 ン-4-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 1-ジメチルスルファモイル-4-ヘキシル-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジン-  
 3-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 1-(ブタン-1-スルホニル)-4-ヘキシル-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジン-3-  
 -イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 4-ヘキシル-1-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジ  
 ン-4-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 4-(3-メチルスルファニル-プロピル)-1-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン- 2-カル  
 ボン酸(1-エチル-2-ピリジン-4-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 4-オクチル-1-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジ  
 ン-3-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 から選定される、請求項 1 に記載の化合物；又は医薬として許容される塩。

【請求項 10】

治療有効量の請求項 9 に記載の化合物を含む、不妊治療用の医薬組成物。

【請求項 11】

医薬として許容される担体及び請求項 9 に記載の 1 以上の化合物を含む、不妊治療用の  
医薬組成物。

【請求項 12】

前記化合物が、不妊を治療するために、前記化合物を使用するための説明書と一緒にパ  
ッケージングされている、請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

治療有効量の請求項 1 に記載の化合物を含む、不妊治療用の医薬組成物。

【請求項 14】

前記R<sup>2</sup> がアリール、又はヘテロアリールである、請求項 13 に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

前記R<sup>4</sup> がC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、3 - 8 員環シ

クロアルキル及びヘテロシクロアルキルから選定される、請求項 1 3 に記載の 医薬組成物。

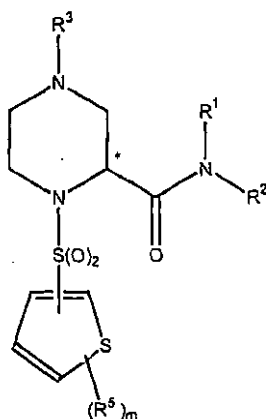
【請求項 1 6】

$R^2$  がアリールであり； $R^3$  が  $C_1$ - $C_8$ -アルキル、 $C_1$ - $C_8$ -アシル アミノ及び  $C_1$ - $C_8$ -アルキル アシルから選定され、並びに  $R^4$  が  $C_1$ - $C_6$ -アルキル、アミノ、アリール及びヘテロアリールから選定される、請求項 1 3 に記載の 医薬組成物。

【請求項 1 7】

前記化合物が、以下の式 II：

【化 3】



II

( $R^1$ 、 $R^2$ 、及び $R^3$ は、請求項 1 に定義される通りであり、そして、 $R^5$  は、独立してハロゲン、ヒドロキシであり； $m$ は 0 ~ 3 の整数である) を有する化合物、及びそれらの医薬的に許容され得る塩類である、請求項 1 3 に記載の 医薬組成物。

【請求項 1 8】

前記  $R^2$  は、カルバゾリル、テトラヒドロ - - カルボリニル、又はベンゾイミダゾリル部位を含む、請求項 1 3 に記載の 医薬組成物。

【請求項 1 9】

前記式 I の化合物が、以下の群：

- 4-ヘキシル-1-(チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジニル-3-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-アミド；
- 4-(チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-1,3-ジカルボン酸 3-[(9-エチル-9H-カルバゾール-3-イル)アミド]-1-ペンチルアミド；
- 4-(チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-1,3-ジカルボン酸 1-エチルアミド 3-[(9-エチル-9H-カルバゾール-3-イル)アミド]；
- 4-ペンタノイル-1-(チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(9-エチル-9H-カルバゾール-3-イル)アミド；
- 4-ヘキシル-1-(チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(9-エチル-9H-カルバゾール-3-イル)アミド；
- 4-ジメチルスルファモイル-ピペラジン-1,3-ジカルボン酸 3-[(9-エチル-9H-カルバゾール-3-イル)アミド] 1-ペンチルアミド；
- 4-(1-メチル-1H-イミダゾール-4-スルホニル)-ピペラジン-1,3-ジカルボン酸 3-[(9-エチル-9H-カルバゾール-3-イル)-アミド]1-ペンチルアミド；
- 4-(チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-1,3-ジカルボン酸 1-ペンチルアミド 3-[(3-ピリジン-4-イル-フェニル)-アミド]；

4-ヘキシル-1-(チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-オキソ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H- -カルボリン-6-イル)-アミド；  
 4-ヘプチル-1-(チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジン-3-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-アミド；  
 4-ペンチル-1-(チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-オキソ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H- -カルボリン-6-イル)アミド；  
 4-ヘプチル-1-(チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-オキソ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H- -カルボリン-6-イル)アミド；  
 4-(3-メチルスルファニル-プロピル)-1-(チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(9-エチル-9H-カルバゾール-3-イル)-アミド；  
 4-(4-エチル-フラン-3-イルメチル)-1-(チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(9-エチル-9H-カルバゾール-3-イル)-アミド；  
 3-(9-エチル-9H-カルバゾール-3-イルカルバモイル)-4-(チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-1-イル] 酢酸エチルエステル；  
 1-ベンゼンスルホニル-4-ヘキシル-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジン-3-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 4-ペンチル-1-チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジン-3-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 4-ヘキシル-1-チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジン-3-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 1-(4-フルオロ-ベンゼンスルホニル)-4-ヘキシル-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジン-3-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 1-(2-フルオロ-ベンゼンスルホニル)-4-ヘキシル-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジン-3-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 4-オクチル-1-(チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジン-4-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 4-ヘプチル-1-(チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジン-4-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 1-ジメチルスルファモイル-4-ヘキシル-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジン-3-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 1-(ブタン-1-スルホニル)-4-ヘキシル-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジン-3-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 4-ヘキシル-1-(チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジン-4-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 4-(3-メチルスルファニル-プロピル)-1-(チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジン-4-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 4-オクチル-1-(チオフェン-2-スルホニル)-ピペラジン-2-カルボン酸(1-エチル-2-ピリジン-3-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)アミド；  
 及びそれらの医薬的に許容され得る塩類から選定される、請求項 1 3 に記載の 医薬組成物。

【請求項 2 0】

前記哺乳動物がヒトである、請求項 1 3 に記載の 医薬組成物。

【請求項 2 1】

前記哺乳動物が雌性である、請求項 2 0 に記載の 医薬組成物。

【請求項 2 2】

前記哺乳動物が排卵障害で苦しんでいる、請求項 2 1 に記載の 医薬組成物。

【請求項 2 3】

前記哺乳動物が生殖補助処置を受けている、請求項 2 1 に記載の 医薬組成物。

【請求項 2 4】

前記哺乳動物が体外受精を行っている、請求項 2 1 に記載の 医薬組成物。

## 【請求項 25】

前記哺乳動物が雄性である、請求項 20 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 26】

前記哺乳動物が精子形成障害で苦しんでいる雄性である、請求項 25 に記載の医薬組成物。

## 【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0011

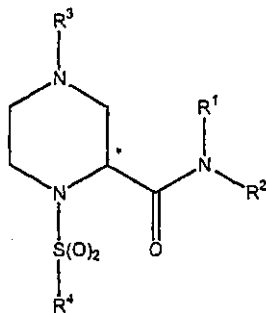
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0011】

より詳細には、本発明の好適な観点では、本発明の 2 - カルボキサミドピペラジン化合物は以下の式 I で表される化合物、並びに医薬として許容される塩を含む：

【化 4】



式中、 $R^1$  及び  $R^2$  は、水素、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル、 $C_2 - C_{12}$  - アルケニル、 $C_2 - C_{12}$  - アルキニル（ここで前記アルキル、アルケニル、アルキニル鎖は、N、O 又は S から選定されたヘテロ原子によって中断されてよく）、アリール、ヘテロアリール、飽和もしくは不飽和した 3 - 8 員環のシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル（ここで前記シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリール基は、1 - 2 の更なるシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリール基と融合してよく）、アシル部位、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル アリール、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル ヘテロアリール、 $C_2 - C_{12}$  - アルケニル アリール、 $C_2 - C_{12}$  - アルケニル ヘテロアリール、 $C_2 - C_{12}$  - アルキニル アリール、 $C_2 - C_{12}$  - アルキニル ヘテロアリール、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル シクロアルキル、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル ヘテロシクロアルキル、 $C_2 - C_{12}$  - アルケニル シクロアルキル、 $C_2 - C_{12}$  - アルケニル ヘテロシクロアルキル、 $C_2 - C_{12}$  - アルキニル シクロアルキル、 $C_2 - C_{12}$  - アルキニル ヘテロシクロアルキル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル カルボキシ、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル アシル、アリール アシル、ヘテロアリール アシル、 $C_3 - C_8$  - (ヘテロ)シクロアルキル アシル、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル アシルオキシ、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル アルコキシ、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル アミノカルボニル、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル アシルアミノ、アシルアミノ、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル ウレイド、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル カルバメート、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル アミノ、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル アンモニウム、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル スルホニルオキシ、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル スルホニル、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル スルフィニル、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル スルファニル、 $C_1 - C_{12}$  - アルキル スルホニルアミノ、又は  $C_1 - C_{12}$  - アルキル アミノスルホニルを含む群又は成る群から独立して選定され、並びに好適には少なくとも 1 つが独立して選定され、或いは  $R^1$  及び  $R^2$  は水素以外であり；

## 【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】 0 0 1 3

【訂正方法】 変更

【訂正の内容】

【 0 0 1 3 】

$R^4$ は $C_1$ - $C_{12}$ -アルキル、 $C_2$ - $C_{12}$ -アルケニル、 $C_2$ - $C_{12}$ -アルキニル（ここで前記アルキル、アルケニル、アルキニル鎖はN、O又はSから選定されたヘテロ原子によって中断されてよく）、アリール、ヘテロアリール、飽和又は不飽和化した3 - 8員環のシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル（ここで前記シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリール基は、更に1 - 2のシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリール基と融合してよい）或いはアミノ基である。

【誤訳訂正 4】

【訂正対象書類名】 明細書

【訂正対象項目名】 0 0 1 4

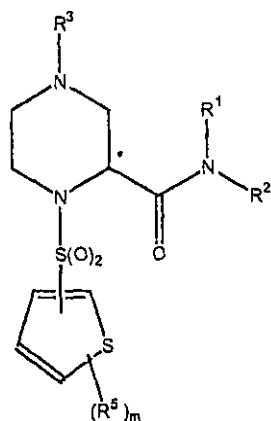
【訂正方法】 変更

【訂正の内容】

【 0 0 1 4 】

一般的に本発明の好適な化合物は、式Iの $R^4$ 置換基がヘテロアリール、詳細には硫黄環置換基であり、特に以下の式IIで表される化合物、並びにそれらの医薬的に許容され得る塩のような化合物を含む。

【化 5】



II

【誤訳訂正 5】

【訂正対象書類名】 明細書

【訂正対象項目名】 0 0 1 5

【訂正方法】 変更

【訂正の内容】

【 0 0 1 5 】

式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 及び $R^3$ は、上記式Iの定義と同一であり；

それぞれの $R^5$ は独立してハロゲン、ヒドロキシ又は $R^1$ の定義と同一であり；

$m$ は0（この場合、利用可能なチエニル環部位は水素で置換されている）から4の整数であり、そして好適には $m$ は0、1、2又は3であり、より好適には0、1又は2である。

【誤訳訂正 6】

【訂正対象書類名】 明細書

【訂正対象項目名】 0 0 1 6

【訂正方法】 変更

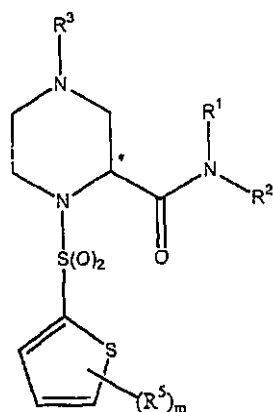


## 【訂正の内容】

【0016】

2-チエニル部位を有する式IIの化合物、即ち、以下の式IIIの化合物並びに医薬的に許容され得るそれらの塩は、典型的に好適である：

【化6】



III

式中R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>5</sup>及びmは、上記の式IIでの定義と同一である。