

【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】令和4年1月21日(2022.1.21)

【国際公開番号】WO2018/077246

【公表番号】特表2019-537588(P2019-537588A)

【公表日】令和1年12月26日(2019.12.26)

【出願番号】特願2019-522962(P2019-522962)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 4 3 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 3 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 1 9 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

10

【 F I 】

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 4 2

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 C S P

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 K 3 1 / 5 1 9

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7

20

【誤訳訂正書】

【提出日】令和4年1月12日(2022.1.12)

【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】

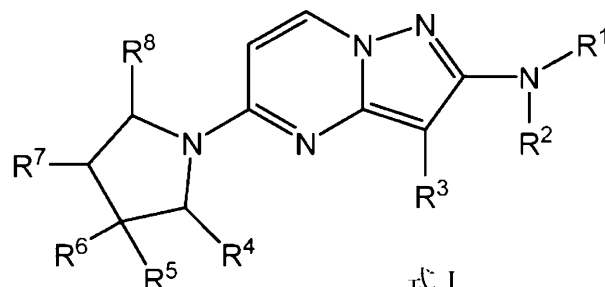
【特許請求の範囲】

30

【請求項1】

式 I :

【化1】



40

[ 式中、

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、独立して水素、C<sub>1</sub>-10アルキル、-C(=O)R<sup>9</sup>、-C(=O)NHR<sup>9</sup> および -S(=O)<sub>2</sub>R<sup>9</sup> からなる群から選ばれ、ここで前記C<sub>1</sub>-10アルキルは、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1</sub>-6アルキル、C<sub>1</sub>-6アルコキシ、任意に置換された3~6員のシクロアルキル、任意に置換された3~6員の脂肪族ヘテロシクリル、任意に置換された6~10員のアリール、および任意に置換された5~10員の芳香族ヘテロシクリルからなる群から独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

50

R<sup>3</sup>は、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、-C(=O)R<sup>10</sup>、-C(=O)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-C(=S)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、6～10員のアリール、および5～10員の芳香族ヘテロシクリルからなる群から選ばれ、ここで前記6～10員のアリールおよび5～10員の芳香族ヘテロシクリルは、それぞれ独立してC<sub>1</sub>-6アルキル、C<sub>1</sub>-6アルコキシカルボニル、任意に置換されたピロリジニル、任意に置換されたモルホリニル、および任意に置換されたピロリジニルカルボニルからなる群から独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

R<sup>4</sup>およびR<sup>7</sup>は、独立して水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、およびシアノからなる群から選ばれ、

R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>は、独立して水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、およびシアノからなる群から選ばれ、あるいはR<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>は一緒にオキソを構成し、

R<sup>8</sup>は、5～10員の芳香族ヘテロシクリル、および6～10員のアリールからなる群から選ばれ、ここで前記5～10員の芳香族ヘテロシクリルおよび6～10員のアリールは、それぞれ独立してハロゲン、ニトロ、酸素、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1</sub>-6アルキルおよびC<sub>1</sub>-6アルコキシからなる群から独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

R<sup>9</sup>は、C<sub>1</sub>-10アルキルおよびフェニルからなる群から選ばれ、ここで前記C<sub>1</sub>-10アルキルおよびフェニルは、それぞれ独立してハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1</sub>-6アルキル、およびC<sub>1</sub>-6アルコキシからなる群から独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

R<sup>10</sup>およびR<sup>11</sup>は、水素、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>-6アルキル、C<sub>1</sub>-6アルコキシ、3～6員のシクロアルキル、および6～10員のアリールからなる群から独立して選ばれ、ここで前記C<sub>1</sub>-6アルキル、C<sub>1</sub>-6アルコキシ、3～6員のシクロアルキル、および6～10員のアリールは、それぞれ独立してハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、C<sub>1</sub>-4アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub>-6アルキル)、2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル、およびN,N-ジ(C<sub>1</sub>-4アルキル)アミノからなる群から独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

あるいは

R<sup>10</sup>およびR<sup>11</sup>は、それらが結合しているNと一緒にあって5～10員の脂肪族ヘテロシクリルを構成し、ここで前記5～10員の脂肪族ヘテロシクリルは、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、およびシアノからなる群から任意に独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で置換されている。]で表される

化合物、またはその薬学的に許容される塩。

#### 【請求項2】

請求項1に記載の化合物であって、

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は、水素、C<sub>1</sub>-6アルキル、-C(=O)R<sup>9</sup>、-C(=O)NHR<sup>9</sup>、および-S(=O)<sub>2</sub>R<sup>9</sup>からなる群から独立して選ばれ、ここで前記C<sub>1</sub>-6アルキルは、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1</sub>-4アルキル、C<sub>1</sub>-4アルコキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、テトラヒドロフランニル、ジヒドロフランニル、ピロリジニル、N-メチルピロリジニル、ピラゾリジニル、ペペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、テトラヒドロチオフェニル、フェニル、4-メチルフェニル、4-メトキシフェニル、フリル、ピロリル、およびピラジニルからなる群から任意に独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で置換されており、

R<sup>3</sup>は、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、-C(=O)R<sup>10</sup>、-C(=O)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-C(=S)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、フェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、およびピラゾリルからなる群から選ばれ、ここで前記フェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、およびピラゾリルは、それぞれ独立してC<sub>1</sub>-4アルキル、C<sub>1</sub>-4アルコキシカルボニル、ピロリジン-1-イル、3-ヒドロキシピロリジン-1-イル、モルホリン-4-イル、および3-ヒドロキシピロリジン-

1 - イルカルボニルからなる群から独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

R<sup>4</sup> および R<sup>7</sup> は、水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、およびシアノからなる群から独立して選ばれ、

R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は、水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、およびシアノからなる群から独立して選ばれ、あるいは R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は一緒にオキソを構成し、

R<sup>8</sup> は、フェニル、フリル、ピロリル、チエニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、ピリジル、ピリジニル、およびピラジニルからなる群から選ばれ、ここで前記フェニル、フリル、ピロリル、チエニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、ピリジル、ピリジニル、およびピラジニルは、それぞれ独立してハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1</sub> - 4 アルキル、および C<sub>1</sub> - 4 アルコキシからなる群から独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

R<sup>9</sup> は、C<sub>1</sub> - 6 アルキルおよびフェニルからなる群から選ばれ、ここで前記 C<sub>1</sub> - 6 アルキルおよびフェニルは、それぞれ独立してハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1</sub> - 4 アルキル、および C<sub>1</sub> - 4 アルコキシからなる群から独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

R<sup>10</sup> および R<sup>11</sup> は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、n - プロポキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、およびフェニルからなる群から独立して選ばれ、ここで前記メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、n - プロポキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、およびフェニルは、それぞれ独立してハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、ヒドロキシメチル、2 - ヒドロキシエチル、3 - ヒドロキシ n - プロピル、2, 2 - ジメチル - 1, 3 - ジオキソラン - 4 - イル、N, N - ジメチルアミノ、および N, N - ジエチルアミノからなる群から独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

あるいは

R<sup>10</sup> および R<sup>11</sup> は、それらが結合している N と一緒になってピロリジン - 1 - イルを構成し、ここで前記ピロリジン - 1 - イルは、ハロゲンおよびヒドロキシからなる群から任意に独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で置換されている、化合物。

### 【請求項 3】

請求項 2 に記載の化合物であって、

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、水素、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、- C(=O)R<sup>9</sup>、- C(=O)NHR<sup>9</sup>、および - S(=O)<sub>2</sub>R<sup>9</sup> からなる群から独立して選ばれ、ここで前記メチル、エチル、n - プロピル、およびイソプロピルは、それぞれ独立してフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、テトラヒドロフランニル、ジヒドロフランニル、ピロリジニル、N - メチルピロリジニル、ピラゾリジニル、ペペリジニル、ペペラジニル、モルホリン - 4 - イル、チオモルホリン - 4 - イル、テトラヒドロチオフェニル、フェニル、4 - メチルフェニル、4 - メトキシフェニル、フリル、ピロリル、およびピラジニルからなる群から独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

R<sup>3</sup> は、水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、- C(=O)R<sup>10</sup>、- C(=O)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、- C(=S)NH<sub>2</sub>、フェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、およびピラゾリルからなる群から選ばれ、ここで前記フェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、およびピラゾリルは、それぞれ独立してメチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ピロリジン - 1 - イル、3 - ヒドロキシピロリジン - 1 - イル、モ

10

20

30

40

50

ルホリン - 4 - イル、および 3 - ヒドロキシピロリジン - 1 - イルカルボニルからなる群から独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

R<sup>4</sup> および R<sup>7</sup> は、水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、およびヒドロキシからなる群から独立して選ばれ、

R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は、水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、およびヒドロキシからなる群から独立して選ばれ、あるいは R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は一緒にオキソを構成し、

R<sup>8</sup> は、フェニル、ピリジル、ピリジニル、およびピラジニルからなる群から選ばれ、ここで前記フェニル、ピリジル、ピリジニル、およびピラジニルは、それぞれ独立してフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ヒドロキシ、メトキシ、およびエトキシからなる群から独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

R<sup>9</sup> は、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、およびフェニルからなる群から選ばれ、ここで前記メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、およびフェニルは、それぞれ独立してフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、メチル、エチル、メトキシ、およびエトキシからなる群から独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

R<sup>10</sup> および R<sup>11</sup> は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、シクロプロピル、シクロヘキシル、およびフェニルからなる群から独立して選ばれ、ここで前記メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、シクロプロピル、シクロヘキシル、およびフェニルは、それぞれ独立してフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ヒドロキシ、メチル、エチル、ヒドロキシメチル、2 - ヒドロキシエチル、2, 2 - ジメチル - 1, 3 -ジオキソラン - 4 - イル、N, N - ジメチルアミノ、および N, N - ジエチルアミノからなる群から独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

あるいは

R<sup>10</sup> および R<sup>11</sup> は、それらが結合している N と一緒になってピロリジン - 1 - イルを構成し、ここで前記ピロリジン - 1 - イルは、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、およびヒドロキシからなる群から任意に独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で置換されている、

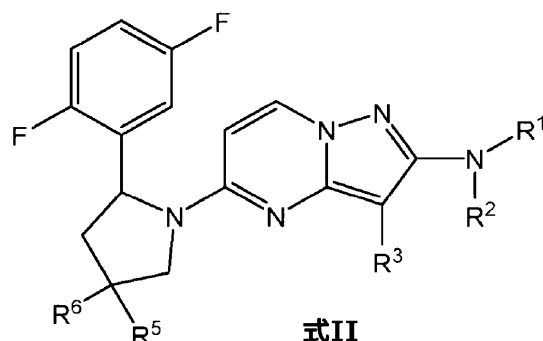
化合物。

【請求項 4】

請求項 1 に記載の化合物であって、

前記式 I の化合物は、次の式 II :

【化 2】



[ 式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は、請求項 1 に定義の通りである。 ] で表される構造を有する、化合物。

【請求項 5】

請求項 4 に記載の化合物であって、

前記式 II の化合物は、次の式 III :

10

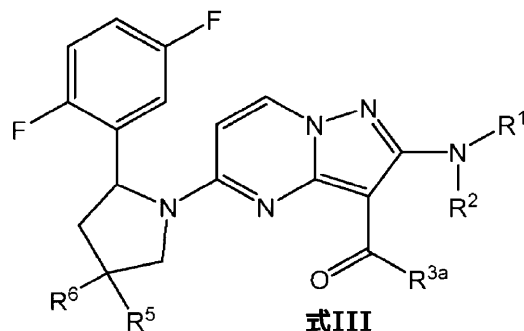
20

30

40

50

## 【化 3】



10

[ 式中、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>は、請求項4に定義の通りであり、R<sup>3a</sup>は、R<sup>7a</sup>およびNR<sup>7a</sup>R<sup>8a</sup>からなる群から選ばれ、

R<sup>7a</sup>およびR<sup>8a</sup>は、水素、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>-6アルキル、C<sub>1</sub>-6アルコキシ、3~6員のシクロアルキル、および6~10員のアリールからなる群から独立して選ばれ、ここで前記C<sub>1</sub>-6アルキル、C<sub>1</sub>-6アルコキシ、3~6員のシクロアルキル、および6~10員のアリールは、それぞれ独立してハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、C<sub>1</sub>-4アルキル、ヒドロキシで置換されたC<sub>1</sub>-6アルキル、2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル、および-N-(C<sub>1</sub>-4アルキル)<sub>2</sub>からなる群から独立して

20

あられる1つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

あるいは  
R<sup>7a</sup>およびR<sup>8a</sup>は、それらが結合しているNと一緒に5~10員の脂肪族ヘテロシクリルを構成し、ここで前記5~10員の脂肪族ヘテロシクリルは、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、およびシアノからなる群から任意に独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で置換されている。]で表される構造を有する、化合物。

## 【請求項6】

請求項5記載の化合物であって、

R<sup>7a</sup>およびR<sup>8a</sup>は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、およびフェニルからなる群から独立して選ばれ、ここで前記メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、およびフェニルは、それぞれ独立してハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル、3-ヒドロキシn-プロピル、2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル、N,N-ジメチルアミノ、およびN,N-ジエチルアミノからなる群から独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

30

あるいは

R<sup>7a</sup>およびR<sup>8a</sup>は、それらが結合しているNと一緒にピロリジン-1-イルを構成し、ここで前記ピロリジン-1-イルは、ハロゲンおよびヒドロキシからなる群から任意に独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で置換されている、化合物。

40

## 【請求項7】

請求項6記載の化合物であって、

R<sup>7a</sup>およびR<sup>8a</sup>は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、シクロプロピル、シクロヘキシル、およびフェニルからなる群から独立して選ばれ、ここで前記メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、シクロプロピル、シクロヘキシル、およびフェニルは、それぞれ独立してフルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、ヒドロキシ、メチル、エ

50

チル、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル、2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル、N,N-ジメチルアミノ、およびN,N-ジエチルアミノからなる群から独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

あるいは

R<sup>7a</sup>およびR<sup>8a</sup>は、それらが結合しているNと一緒にピロリジン-1-イルを構成し、ここで前記ピロリジン-1-イルは、フルオロ、クロロ、ブromo、ヨード、およびヒドロキシからなる群から任意に独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で置換されている、

化合物。

【請求項8】

10

請求項7記載の化合物であって、

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は、水素、メチル、エチル、-C(=O)R<sup>6a</sup>、-C(=O)NHR<sup>6a</sup>、および-S(=O)<sub>2</sub>R<sup>6a</sup>からなる群から独立して選ばれ、ここで前記メチルおよびエチルは、それぞれ独立してピロリジン-1-イル、ピペリジン-1-イル、ピペリジン-4-イル、モルホリン-4-イル、チオモルホリン-4-イル、フェニル、4-メチルフェニル、および4-メトキシフェニルからなる群から独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

R<sup>3a</sup>は、R<sup>7a</sup>およびNR<sup>7a</sup>R<sup>8a</sup>からなる群から選ばれ、

R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>は、水素、フルオロ、およびヒドロキシからなる群から独立して選ばれ、

20

あるいは

R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>は一緒にオキソを構成し、

R<sup>6a</sup>は、メチル、エチル、および4-メチルフェニルからなる群から選ばれ、

R<sup>7a</sup>およびR<sup>8a</sup>は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、シクロプロピル、シクロヘキシル、およびフェニルからなる群から独立して選ばれ、ここで前記メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、シクロプロピル、シクロヘキシル、およびフェニルは、それぞれ独立してフルオロ、ヒドロキシ、メチル、ヒドロキシメチル、2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル、N,N-ジメチルアミノ、およびN,N-ジエチルアミノからなる群から独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

あるいは

30

R<sup>7a</sup>およびR<sup>8a</sup>は、それらが結合しているNと一緒にピロリジン-1-イルを構成し、ここで前記ピロリジン-1-イルは1つまたは複数のヒドロキシで任意に置換されている、

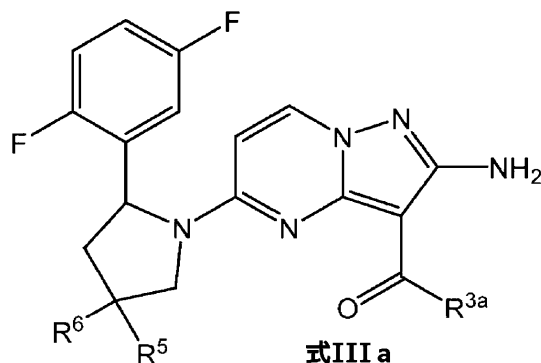
化合物。

【請求項9】

請求項5記載の化合物であって、

前記式III化合物は、次の式IIIa:

【化4】



40

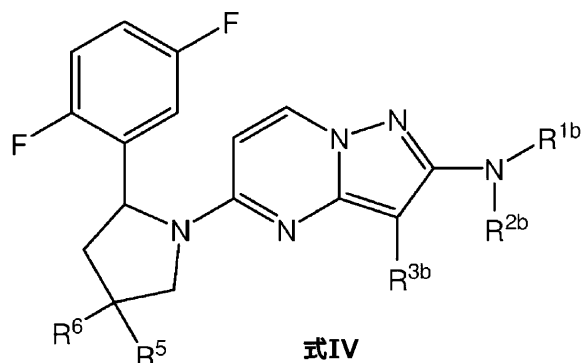
[式中、R<sup>3a</sup>、R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>は、請求項5に定義の通りである。]で表される構造を有する、化合物。

50

## 【請求項10】

請求項4に記載の化合物であって、  
前記式IIの化合物は、次の式IV：

## 【化5】



10

[式中、R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>は請求項4に定義の通りであり、  
R<sup>1b</sup>およびR<sup>2b</sup>は、水素またはC<sub>1</sub>-10アルキルからなる群から独立して選ばれ、  
ここで前記C<sub>1</sub>-10アルキルは、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1</sub>-6アルキル、  
C<sub>1</sub>-6アルコキシ、任意に置換された3~6員のシクロアルキル、任意に置換  
された3~6員の脂肪族ヘテロシクリル、任意に置換された6~10員のアリール、およ  
び任意に置換された5~10員の芳香族ヘテロシクリルからなる群から独立して選ばれる  
1つまたは複数の置換基で任意に置換されており、  
R<sup>3b</sup>は、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、-C(=S)NH<sub>2</sub>、6~1  
0員のアリール、および5~10員の芳香族ヘテロシクリルからなる群から選ばれ、こ  
で前記6~10員のアリールおよび5~10員の芳香族ヘテロシクリルは、それぞれ独立  
してC<sub>1</sub>-6アルキル、C<sub>1</sub>-6アルコキシカルボニル、任意に置換されたピロリジニル、  
任意に置換されたモルホリニル、および任意に置換されたピロリジニルカルボニルから  
なる群から独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で任意に置換されている。]で表さ  
れる構造を有する、  
化合物。

20

30

## 【請求項11】

請求項10に記載の化合物であって、

R<sup>1b</sup>およびR<sup>2b</sup>は、水素およびC<sub>1</sub>-6アルキルからなる群から独立して選ばれ、こ  
で前記C<sub>1</sub>-6アルキルは、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1</sub>-4アルキ  
ル、C<sub>1</sub>-4アルコキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキ  
シル、テトラヒドロフランニル、ジヒドロフランニル、ピロリジニル、N-メチルピロリジ  
ニル、ピラゾリジニル、ペリリジニル、ペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、  
テトラヒドロチオフェニル、フェニル、4-メチルフェニル、4-メトキシフェニル、フリ  
リル、ピロリル、およびピラジニルからなる群から任意に独立して選ばれる1つまたは複  
数の置換基で置換されており、  
R<sup>3b</sup>は、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、-C(=S)NH<sub>2</sub>、フェニ  
ル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、およびピラゾリルからなる群から選  
ばれ、ここで前記フェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、およびピラ  
ゾリルは、それぞれ独立してC<sub>1</sub>-4アルキル、C<sub>1</sub>-4アルコキシカルボニル、ピロリ  
ジン-1-イル、3-ヒドロキシピロリジン-1-イル、モルホリン-4-イル、および  
3-ヒドロキシピロリジン-1-イルカルボニルからなる群から独立して選ばれる1つま  
たは複数の置換基で任意に置換されている、  
化合物。

40

## 【請求項12】

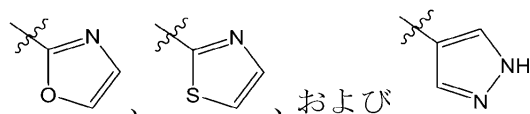
請求項10に記載の化合物であって、

50

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、水素、メチル、およびエチルからなる群から独立して選ばれ、ここで前記メチルおよびエチルは、それぞれ独立してフェニル、4 - メチルフェニル、および 4 - メトキシフェニルで任意に置換されており、

R<sup>3</sup> は、水素、フルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、シアノ、 $-C(=S)NH_2$ 、フェニル、

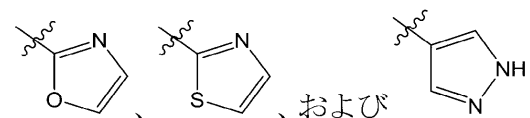
【化 6】



10

からなる群から選ばれ、ここで前記フェニル、

【化 7】



は、それぞれ独立してメチル、エチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ピロリジン - 1 - イル、モルホリン - 4 - イル、および 3 - ヒドロキシピロリジン - 1 - イルカルボニルからなる群から独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で任意に置換されている、

20

化合物。

【請求項 13】

請求項 1 に記載の化合物であって、

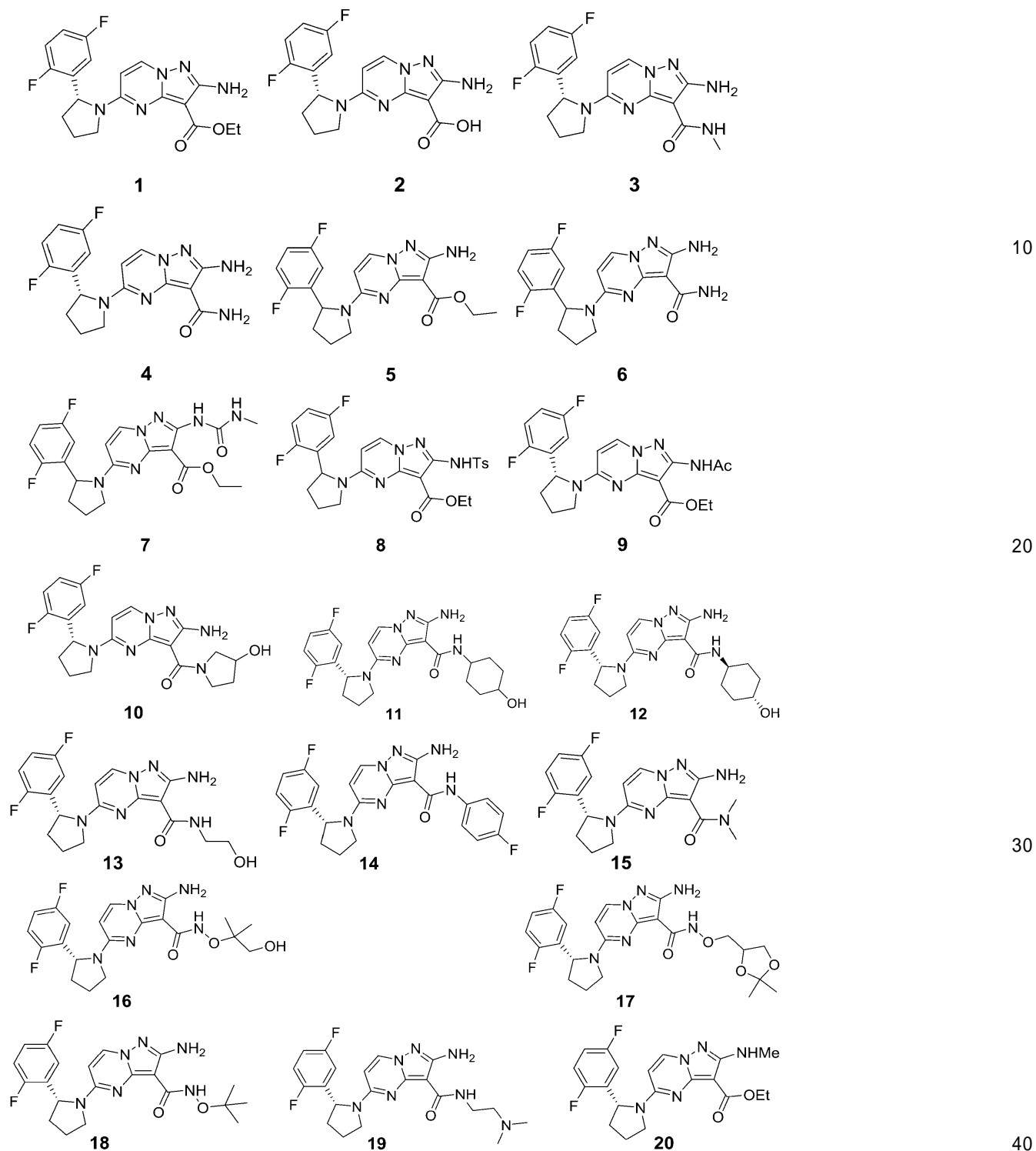
前記化合物またはその薬学的に許容される塩は、

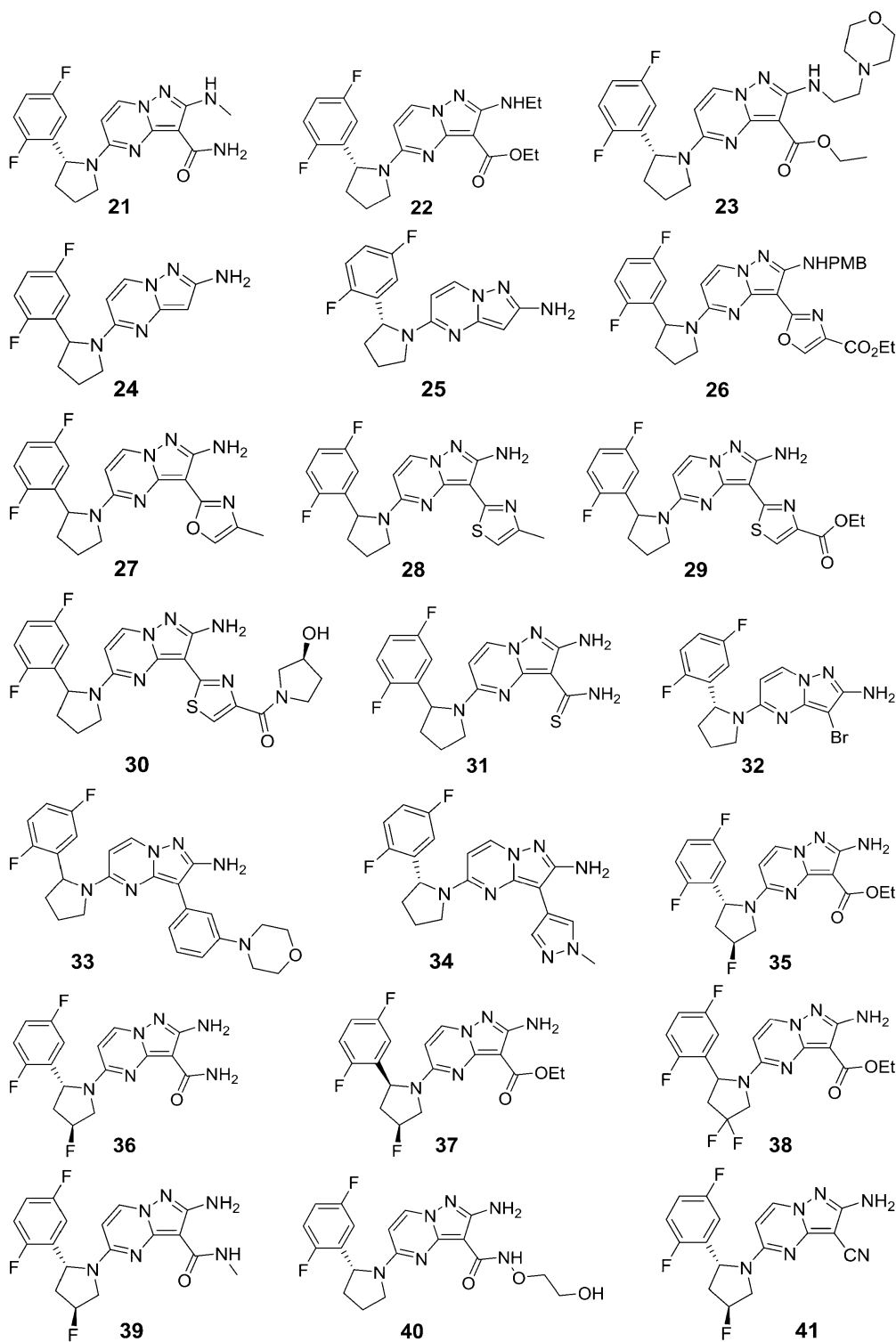
30

40

50

## 【化 8】





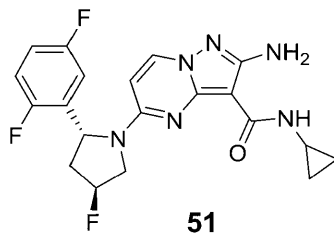
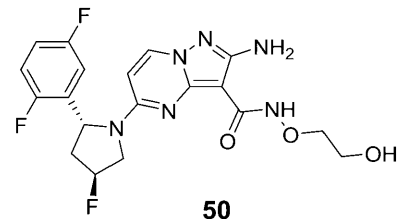
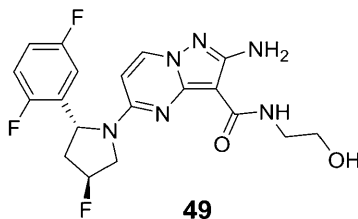
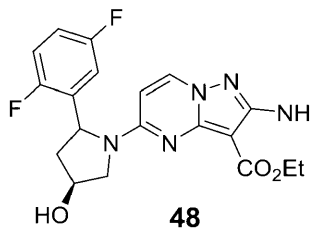
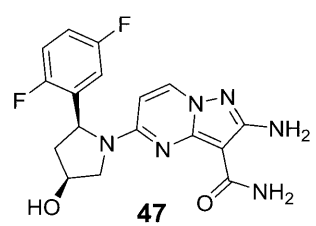
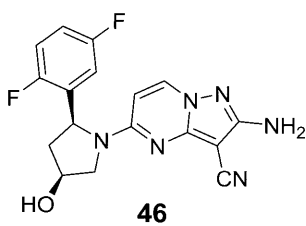
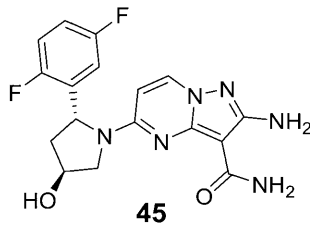
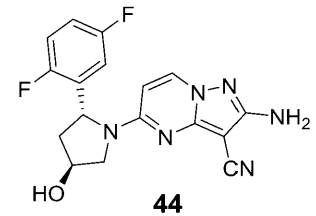
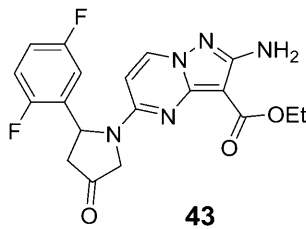
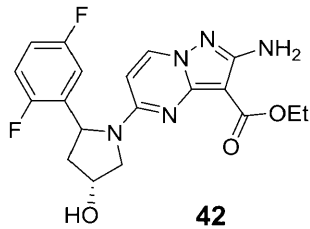
10

20

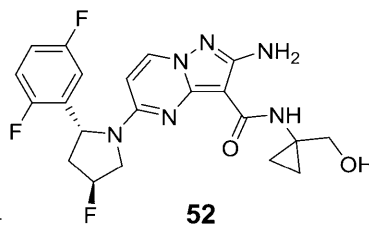
30

40

50



、または



10

20

あるいはその薬学的に許容される塩からなる群から選ばれる、化合物。

【請求項 14】

請求項 1 に記載の化合物であって、

R<sup>1</sup> は水素であり、

R<sup>2</sup> は水素、C<sub>1</sub>-6 アルキル、-C(=O)R<sup>9</sup>、-C(=O)NHR<sup>9</sup>、および -S(=O)<sub>2</sub>R<sup>9</sup> からなる群から選ばれ、ここで前記 C<sub>1</sub>-6 アルキルは、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1</sub>-4 アルキル、C<sub>1</sub>-4 アルコキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、テトラヒドロフラン、ジヒドロフラン、ピロリジニル、N-メチルピロリジニル、ピラゾリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、テトラヒドロチオフェニル、フェニル、4-メチルフェニル、4-メトキシフェニル、フリル、ピロリル、およびピラジニルからなる群から任意に独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で置換されている、

化合物。

【請求項 15】

請求項 1 に記載の化合物であって、

R<sup>3</sup> は、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、-C(=O)R<sup>10</sup>、-C(=O)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-C(=S)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、フェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、およびピラゾリルからなる群から選ばれ、ここで前記フェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、およびピラゾリルは、それぞれ独立して C<sub>1</sub>-4 アルキル、C<sub>1</sub>-4 アルコキシカルボニル、ピロリジン-1-イル、3-ヒドロキシピロリジン-1-イル、モルホリン-4-イル、および 3-ヒドロキシピロリジン-1-イルカルボニルからなる群から独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で任意に

30

40

50

置換されている、  
化合物。

【請求項 16】

請求項 1 に記載の化合物であって、

R<sup>8</sup> は、フェニル、ピリジル、ピリドニル、およびピラジニルからなる群から選ばれ、ここで前記フェニル、ピリジル、ピリドニル、およびピラジニルは、それぞれ独立してハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1</sub>-4 アルキル、および C<sub>1</sub>-4 アルコキシからなる群から独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で任意に置換されている、  
化合物。

【請求項 17】

請求項 16 に記載の化合物であって、

R<sup>8</sup> は、1 つまたは複数のフルオロで置換されたフェニルである、化合物。

【請求項 18】

請求項 17 に記載の化合物であって、

R<sup>8</sup> は、2,5-ジフルオロフェニルである、化合物。

【請求項 19】

請求項 1 ~ 18 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含む、  
医薬組成物。

【請求項 20】

Trk チロシンキナーゼ受容体によって媒介される疾患を予防または治療するための、  
請求項 19 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】0016

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0016】

本発明のいくつかの実施形態において、R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、水素、C<sub>1</sub>-6 アルキル、-C(=O)R<sup>9</sup>、-C(=O)NHR<sup>9</sup>、および -S(=O)<sub>2</sub>R<sup>9</sup> からなる群から独立して選ばれ、ここで前記 C<sub>1</sub>-6 アルキルは、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1</sub>-4 アルキル、C<sub>1</sub>-4 アルコキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、テトラヒドロフラニル、ジヒドロフラニル、ピロリジニル、N-メチルピロリジニル、ピラゾリジニル、ペペリジニル、ペペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、テトラヒドロチオフェニル、フェニル、4-メチルフェニル、4-メトキシフェニル、フリル、ピロリル、およびピラジニルからなる群から任意に独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で置換されており、

R<sup>3</sup> は、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、-C(=O)R<sup>10</sup>、-C(=O)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-C(=S)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、フェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、およびピラゾリルからなる群から選ばれ、ここで前記フェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、およびピラゾリルは、それぞれ独立して C<sub>1</sub>-4 アルキル、C<sub>1</sub>-4 アルコキシカルボニル、ピロリジン-1-イル、3-ヒドロキシピロリジン-1-イル、モルホリン-4-イル、および 3-ヒドロキシピロリジン-1-イルカルボニルからなる群から独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

R<sup>4</sup> および R<sup>7</sup> は、水素、フルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、およびシアノからなる群から独立して選ばれ、

R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は、水素、フルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、およびシアノからなる群から独立して選ばれ、あるいは R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は一緒にオキソを構成し、

R<sup>8</sup> は、フェニル、フリル、ピロリル、チエニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チ

10

20

30

40

50

アゾリル、ピリジル、ピリドニル、およびピラジニルからなる群から選ばれ、ここで前記フェニル、フリル、ピロリル、チエニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、ピリジル、ピリドニル、およびピラジニルは、それぞれ独立してハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ、 $C_{1-4}$ アルキル、および $C_{1-4}$ アルコキシからなる群から独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

$R^9$ は、 $C_{1-6}$ アルキルおよびフェニルからなる群から選ばれ、ここで前記 $C_{1-6}$ アルキルおよびフェニルは、それぞれ独立してハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ、 $C_{1-4}$ アルキル、および $C_{1-4}$ アルコキシからなる群から独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

$R^{10}$ および $R^{11}$ は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、 $n$ -プロポキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、およびフェニルからなる群から独立して選ばれ、ここで前記メチル、エチル、 $n$ -プロピル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、 $n$ -プロポキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、およびフェニルは、それぞれ独立してハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、イソプロピル、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル、3-ヒドロキシ $n$ -プロピル、2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル、 $N,N$ -ジメチルアミノ、および $N,N$ -ジエチルアミノからなる群から独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

あるいは

$R^{10}$ および $R^{11}$ は、それらが結合している $N$ と一緒になってピロリジン-1-イルを構成し、ここで前記ピロリジン-1-イルは、ハロゲンおよびヒドロキシからなる群から任意に独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で置換されている。

【誤訳訂正3】

【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】

本発明のいくつかの実施形態において、 $R^1$ および $R^2$ は、水素、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、イソプロピル、 $-C(=O)R^9$ 、 $-C(=O)NHR^9$ 、および $-S(=O)_2R^9$ からなる群から独立して選ばれ、ここで前記メチル、エチル、 $n$ -プロピル、およびイソプロピルは、それぞれ独立してフルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、テトラヒドロフラニル、ジヒドロフラニル、ピロリジニル、 $N$ -メチルピロリジニル、ピラゾリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリン-4-イル、チオモルホリン-4-イル、テトラヒドロチオフェニル、フェニル、4-メチルフェニル、4-メトキシフェニル、フリル、ピロリル、およびピラジニルからなる群から独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

$R^3$ は、水素、フルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、 $-C(=O)R^{10}$ 、 $-C(=O)NR^{10}R^{11}$ 、 $-C(=S)NH_2$ 、フェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、およびピラゾリルからなる群から選ばれ、ここで前記フェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、およびピラゾリルは、それぞれ独立してメチル、エチル、 $n$ -プロピル、イソプロピル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ピロリジン-1-イル、3-ヒドロキシピロリジン-1-イル、モルホリン-4-イル、および3-ヒドロキシピロリジン-1-イルカルボニルからなる群から独立して選ばれる1つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

$R^4$ および $R^7$ は、水素、フルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、およびヒドロキシからなる群から独立して選ばれ、

$R^5$ および $R^6$ は、水素、フルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、およびヒドロキシからな

10

20

30

40

50

る群から独立して選ばれ、あるいは R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は一緒にオキソを構成し、  
R<sup>8</sup> は、フェニル、ピリジル、ピリドニル、およびピラジニルからなる群から選ばれ、ここで前記フェニル、ピリジル、ピリドニル、およびピラジニルは、それぞれ独立してフルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、ヒドロキシ、メトキシ、およびエトキシからなる群から独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

R<sup>9</sup> は、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、およびフェニルからなる群から選ばれ、ここで前記メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、およびフェニルは、それぞれ独立してフルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、メチル、エチル、メトキシ、およびエトキシからなる群から独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

10

R<sup>10</sup> および R<sup>11</sup> は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、シクロプロピル、シクロヘキシル、およびフェニルからなる群から独立して選ばれ、ここで前記メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、シクロプロピル、シクロヘキシル、およびフェニルは、それぞれ独立してフルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、ヒドロキシ、メチル、エチル、ヒドロキシメチル、2 - ヒドロキシエチル、2, 2 - ジメチル - 1, 3 - ジオキサラン - 4 - イル、N, N - ジメチルアミノ、および N, N - ジエチルアミノからなる群から独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で任意に置換されており、

あるいは

R<sup>10</sup> および R<sup>11</sup> は、それらが結合している N と一緒になってピロリジン - 1 - イルを構成し、ここで前記ピロリジン - 1 - イルは、フルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、およびヒドロキシからなる群から任意に独立して選ばれる 1 つまたは複数の置換基で置換されている。

20

30

40

50