

【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 1 年 9 月 26 日 (2019.9.26)

【公表番号】特表 2017-521482 (P2017-521482A)

【公表日】平成 29 年 8 月 3 日 (2017.8.3)

【年通号数】公開・登録公報 2017-029

【出願番号】特願 2017-514763 (P2017-514763)

【国際特許分類】

C 07 C 211/38 (2006.01)

C 07 C 209/62 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 21/02 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 27/06 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 P 25/08 (2006.01)

A 61 P 25/14 (2006.01)

A 61 P 9/14 (2006.01)

A 61 P 7/02 (2006.01)

A 61 P 3/06 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 1/18 (2006.01)

A 61 P 1/16 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

A 61 K 31/21 (2006.01)

【 F I 】

C 07 C 211/38 C S P

C 07 C 209/62

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 9/10

A 61 P 25/16

A 61 P 25/28

A 61 P 21/02

A 61 P 9/00

A 61 P 25/00

A 61 P 27/06

A 61 P 27/02

A 61 P 25/08

A 61 P 25/14

A 61 P 9/14

A 61 P 7/02

A 61 P 9/10 1 0 1

A 61 P 3/06

A 61 P 11/00

A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 1/18
 A 6 1 P 1/16
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 K 31/21

【誤訳訂正書】

【提出日】令和1年8月6日(2019.8.6)

【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

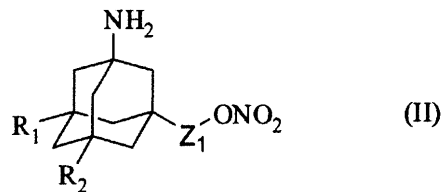
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式(II)の構造を有するアマンタジン硝酸エステル化合物又はその薬学的に許容される塩。

【化 1】



その中：

R2は水素、R1は直鎖或いは分鎖アルキルである、

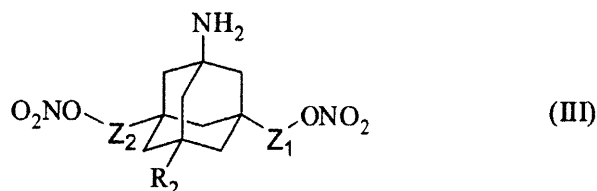
Z1は硝酸エステル基を連続する直鎖或いは分枝のある炭素鎖官能基であり、

Z1及びR1がもつ炭素原子数の和は3以上である。

【請求項 2】

一般式(III)の構造を有するアマンタジン硝酸エステル化合物又はその薬学的に許容される塩。

【化 2】



その中：

R2は水素、炭素数10以下の直鎖或いは分枝アルキル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、単環芳香族官能基、或いは、単環ヘテロ芳香族官能基であり、硝酸エステル基を有することができる；

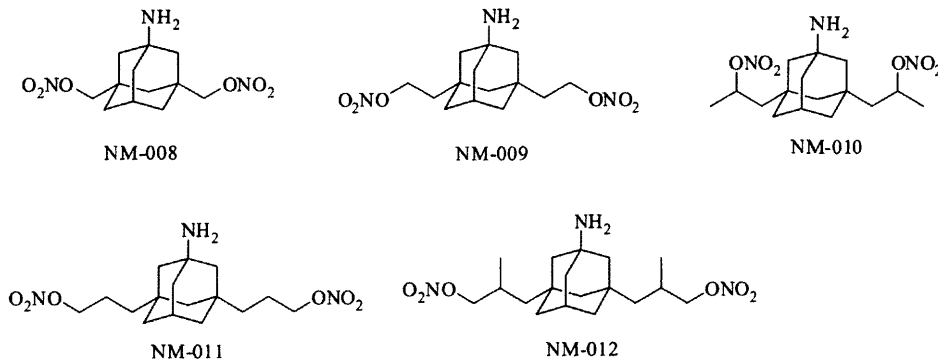
Z1とZ2は同一もしくは異なって、それぞれ硝酸エステル基を連続する直鎖或いは分枝のある炭素鎖官能基で、且つZ1とZ2の炭素原子数は同一もしくは異なって、1-6である；

前記単環芳香族官能基及び単環ヘテロ芳香族官能基は、 $-N(CH_3)_2$ 、F、Cl、Br、I、 $-OCH_3$ 、 $-CO_2CH_3$ 、 $-CN$ 、単環芳香族官能基或いは単環ヘテロ芳香族官能基からなる置換基にて水素が置換されていても良い。

【請求項 3】

以下の構造の一つを備えることを特徴とする請求項2に記載のアマンタジン硝酸エステル化合物又はその薬学的に許容される塩。

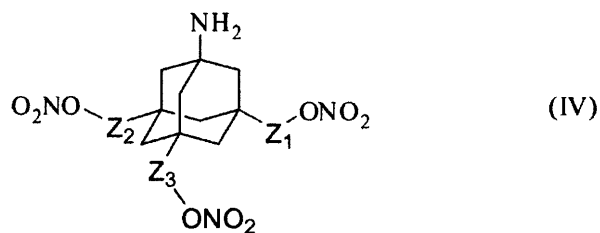
【化 3】



【請求項 4】

R2は硝酸エステル基、即ち一般式(IV)の構造があることを特徴とする請求項 2 に記載のアマンタジン硝酸エステル化合物又はその薬学的に許容される塩。

【化 4】



その中：

Z1、Z2とZ3は同一もしくは異なって、それぞれ前記硝酸エステル基を連続する直鎖或いは分枝のある炭素鎖官能基で、その中Z1、Z2とZ3は同一もしくは異なって、炭素数が1-6である。

【請求項 5】

NMDA受容体、細胞内カルシウム過剰、NO発生、又は活性酸素過剰に由来する神経変性疾患である、疾患を予防又は治療し、

前記疾患は、脳虚血、パーキンソン病、老人性痴呆症、筋萎縮性側索硬化症、運動失調毛細管拡張症、牛海綿状脳症、クロイツフェルト・ヤコブ病、ハンチントン病、小脳萎縮症、多発性硬化症、原発性側索硬化症、尺骨神経管症候群、緑内障と加齢性黄斑変性症、

脳卒中、脳外傷、癲癇、パーキンソン病、ハンチントン病、筋萎縮性側索硬化症、老人性痴呆症、酸欠虚血性脳損傷、脳溢血、痴呆症、虚血性心疾患、血栓、粥状動脈硬化症、高コレステロール血症、肺気腫、糖尿病、急性膵炎、アルコールで発生する肝臓疾患と腎臓傷害、

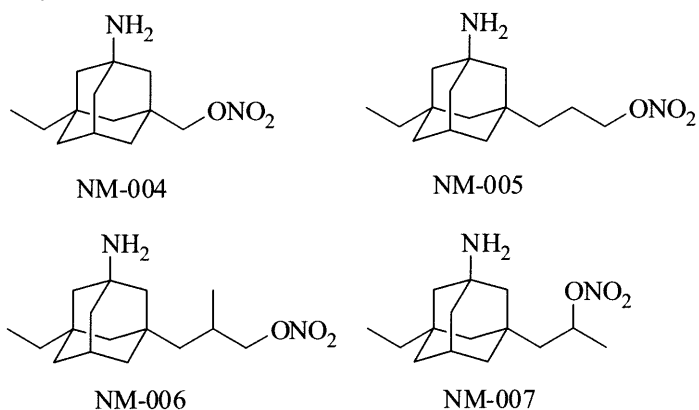
脳虚血、パーキンソン病、アルツハイマー病、筋萎縮性側索硬化症、運動失調毛細管拡張症、牛海綿状脳症、クロイツフェルト・ヤコブ病、ハンチントン病、小脳萎縮症、多発性硬化症、原発性側索硬化症と尺骨神経管症候群を含む、

請求項1- 4 のいずれか一項に記載のアマンタジン硝酸エステル化合物又はその薬学的に許容される塩を含む薬剤。

【請求項 6】

前記式(II)の化合物は下記NM-004、NM-005、NM-006、及びNM-007のうちの何れかである請求項 1 に記載のアマンタジン硝酸エステル化合物又はその薬学的に許容される塩。

【化 5】



【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0008

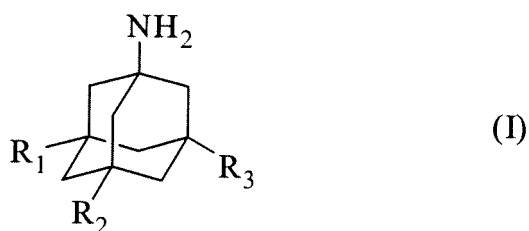
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0008】

一般式()の構造がある、本発明が提供する化合物。

【化 1】



式中：

R1, R2, R3は同一もしくは異なって、それぞれは水素、置換もしくは非置換炭化水素基、ヘテロ芳香族官能基、硝酸エステル基であり、且つR1, R2, R3では少なくとも一つは硝酸エステル基を含む。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0009

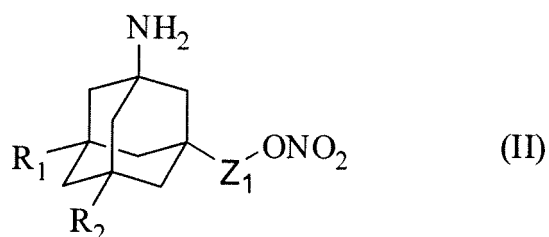
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0009】

好ましくは一般式(I)の化合物は一般式(II)の構造がある。

【化 2】



式中：

R1, R2は同一もしくは異なって、それぞれは水素、置換もしくは非置換炭化水素基、ヘテロ芳香族官能基、硝酸エステル基である；

Z1はR3硝酸エステル基を連続する直鎖或いは分枝のある炭素鎖である。式中Z1には置換

できるヘテロ原子、アルキル基、芳香族官能基 あるいはヘテロ芳香族官能基 であり、且つZ1の炭素原子数は1-6、1-5、2-5 あるいは2-4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】0012

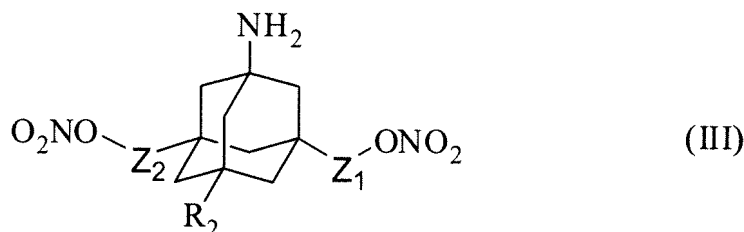
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0012】

好ましくは一般式(I)の化合物ではR1とR3は硝酸エステル基であり、即ち前記化合物は一般式(III)の構造がある。

【化3】



式中：

R2は水素、直鎖 あるいは 分岐鎖アルキル、置換もしくは非置換炭化水素基、ヘテロ芳香族官能基 である；

Z1とZ2は同一もしくは異なって、それぞれ硝酸エステル基を連続する直鎖 あるいは 分岐鎖炭素鎖で、式中Z1とZ2にはそれぞれ置換できるヘテロ原子、アルキル基、芳香族官能基 あるいはヘテロ芳香族官能基 であり、且つZ1とZ2それぞれの炭素原子数は1-6、1-5、2-5 あるいは2-4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】0014

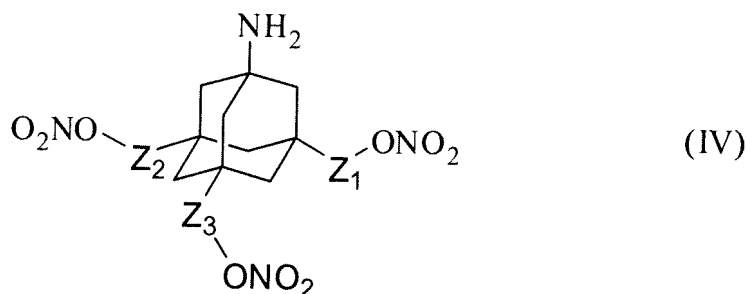
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0014】

好ましくは、R1、R2とR3は硝酸エステル基、即ち一般式(IV)の構造がある一般式(I)の化合物。

【化5】



式中：

Z1、Z2とZ3は同一もしくは異なって、それぞれ前記硝酸エステル基を連続する直鎖 あるいは 分枝のある炭素鎖で、式中Z1、Z2とZ3にはそれぞれ置換できるヘテロ原子、アルキル基、芳香族官能基 あるいはヘテロ芳香族官能基 であり、且つZ1、Z2とZ3それぞれの炭素原子数は1-6、1-5、2-5 あるいは2-4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】0020

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0020】

「炭素鎖官能基」とは置換或いは非置換直鎖、分岐鎖或いは環状の10つまで至る炭素があるアルキル基炭素鎖を指す。直鎖アルキルはメチル基、エチル基、1-プロパノール、1-ブチル、1-ペンチル基、1-ヘキシル、1-ヘプチル基と1-オクチル等の飽和アルキルを含む同時にエチレン結合、アセチレン結合、カルボニル基、シアノ等置換基の不飽和アルキルをも含む。分岐鎖アルキルはイソプロピル、sec-ブチル基、イソブチル、tert-ブチル基、新ペンチル等を含む。環状アルキル（環アルキル）はシクロプロピル（cyclopropyl）、シクロブチル（cyclobutyl）、シクロペンチル基（cyclopentyl）とシクロヘキシル（cyclohexyl）を含む。アルキルは一つ或いは複数の疎水置換基によって置換できる。前記置換基の非限定的な例は $N(CH_3)_2$ 、F、Cl、Br、I、 OCH_3 、 CO_2CH_3 、CN、芳香族官能基とヘテロ芳香族官能基を含む。術語「アルキル基」も非置換或いは置換直鎖、分岐鎖或いは環状の10個まで至る炭素と少なくとも一つのヘテロ原子（例えば、窒素、酸素或いは硫黄）があるアルキル基炭素鎖を指す。前記直鎖アルキルは例えば $CH_2CH_2OCH_3$ 、 $CH_2CH_2N(CH_3)_2$ と $CH_2CH_2SCH_3$ を含む。分岐鎖アルキルは例えば $CH_2CH(OCH_3)CH_3$ 、 $CH_2CH(N(CH_3)_2)CH_3$ と $CH_2CH(OCH_3)CH_3$ を含む。環状アルキルは例えば六員環 $CH(CH_2CH_2)_2O$ 、 $CH(CH_2CH_2)_2NCH_3$ と $CH(CH_2CH_2)_2S$ 及びその対応する五員環等を含む。

【誤訳訂正7】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0021

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0021】

本文に使う「芳香族官能基」とは置換或いは非置換芳香族化合物、炭素環基とヘテロアリアル基を意味する。アリアル基は単環式或いは縮合多環式化合物である。アリアル基は一つ或いは複数の置換基によって置換でき、置換基の非限定的な例は $N(CH_3)_2$ 、F、Cl、Br、I、 OCH_3 、 CO_2CH_3 、CN、アリアル基とヘテロアリアル基を含む。ヘテロアリアル基は置換もしくは非置換環式或いは多環式単環式或いは多環式の原子団に関わり、環内には少なくとも一つのヘテロ原子、例えば窒素、酸素及び硫黄を含む。例を挙げると、典型的なヘテロ原子団は一つ或は多数の窒素を含む。例えば、テトラゾール基、ピロール基、ピリジル基（例えば、4-ピリジル基、3-ピリジル基、2-ピリジル基等）、ピリンダジン基、インドール基、キノリン基、（例えば、2-キノリン基、3-キノリン基等）、イミダゾール基、イソキノリン基、ピラゾール基、ペラジン基、ピリミディン基、ピリドン基或はピリンダジン基；典型的な一つの酸素原子を含むヘテロ原子団は2-フラン基、3-フラン基或はベンゾフラン基を含む。典型的な硫黄ヘテロ原子団はチオフェン基、ベンゾチオフェン基を含む。典型的な混合ヘテロ原子団はフラザニル基、オキサゾール基、イソオキサゾール基、チアゾリル基とフェノチオキシニル基（phenothioxiny基）を含む。ヘテロ環原子団は一つ或は多数の置換基に置換される。これらの置換基はO-アルキル基、NH-アルキル基、 $N(アルキル基)_2$ 、 $NHC(O)-$ アルキル基、F、Cl、Br、I、OH、 OCF_3 、 CO_2- アルキル基、CN及びアリアル基とマルチアリアル基を含む。