

【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3年2月4日(2021.2.4)

【公表番号】特表2019-509337(P2019-509337A)

【公表日】平成31年4月4日(2019.4.4)

【年通号数】公開・登録公報2019-013

【出願番号】特願2018-562713(P2018-562713)

【国際特許分類】

C 07 D 417/10 (2006.01)

A 61 K 31/54 (2006.01)

A 61 P 33/06 (2006.01)

【F I】

C 07 D 417/10 C S P

A 61 K 31/54

A 61 P 33/06

【誤訳訂正書】

【提出日】令和2年11月13日(2020.11.13)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0131

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0131】

例1

(5R)-5-[3-(6-クロロ-2-メチル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-1-イル)-2-フルオロフェニル]-3-イミノ-2,5-ジメチル-1,2,4-チアジアジナン-1,1-ジオキシド

DCM(6mL)中の中間体9(0.14g、0.27mmol)の溶液に、0でTFA(0.4mL)を添加した。反応混合物を室温で5時間攪拌し、次に減圧濃縮した。粗残留物をジエチルエーテル(50mL)で洗浄し、次に凍結乾燥させ、真空下で乾燥させて、淡褐色固体として表題化合物、TFA塩(0.07g、59%)を得た。<sup>1</sup>H(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) 1.85 (d, J 2.80 Hz, 1H), 2.34 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.94 (d, J 4.00 Hz, 3H), 4.54-4.59 (m, 1H), 4.74-4.80 (m, 1H), 5.30-5.50 (m, 2H), 7.28 (d, J 8.80 Hz, 1H), 7.51-7.60 (m, 1H), 7.67 (d, J 8.80 Hz, 1H), 7.73-7.78 (m, 1H), 10.66 (d, J 9.60 Hz, 1H)。LCMS(方法1, ES+) 436 [M+1]<sup>+</sup>, 1.80分。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0132

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0132】

例2

(5R)-5-[3-[6-クロロ-2-メチル-7-(トリフルオロメチル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-1-イル]-2-フルオロ-フェニル]-3-イミノ-2,5-ジメチル-1,2,4-チアジアジナン-1,1-ジオキシド

DCM(3mL)中の中間体13(0.030g、0.049mmol)の溶液に、0でTFA(0.1mL)を添加した。反応混合物を室温で5時間攪拌し、次に減圧濃縮した。残留物をジエーテル(50mL)で洗浄し、次に凍結乾燥させ、真空下で乾燥させ

て、純度 77 % で表題化合物、TFA 塩（25 mg、粗製物）を得た。LCMS（方法1、ES+）504 [M+1]<sup>+</sup>、2.20分。

【誤訛訂正3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0133

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0133】

例3

6 - クロロ - 1 - { 2 - フルオロ - 3 - [ ( 5 R ) - 3 - イミノ - 2 , 5 - ジメチル - 1 , 1 - ジオキソ - 1 , 2 , 4 - チアジアジナン - 5 - イル ] - フェニル } - 2 - メチルイ  
ンドール - 3 - カルボニトリル

DCM (6 mL) 中の中間体 14 (0.32 g、0.69 mmol) の溶液に、0 で DCM (2 mL) 中の [ビス(トロフルオロアセトキシ)インド]ベンゼン (0.33 g、0.77 mmol) の溶液を滴下した。反応混合物を室温で 16 時間攪拌し、次に減圧濃縮した。粗残留物をカラムクロマトグラフィー(シリカ、100~200 メッシュ、DCM 中 5% MeOH) 及び分取 HPLC により精製して、オフホワイト固体として表題化合物 (0.058 g、16%、アトロブ異性体の混合物)を得た。LCMS (方法1、ESI) 46.00 [M+1]<sup>+</sup>、2.40分。

【誤訛訂正4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0134

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0134】

例4

6 - クロロ - 1 - { 2 - フルオロ - 3 - [ ( 5 R ) - 3 - イミノ - 2 , 5 - ジメチル - 1 , 1 - ジオキソ - 1 , 2 , 4 - チアジアジナン - 5 - イル ] - フェニル } - N , N - ジメチルベンズイミダゾール - 2 - アミン

DCM (8 mL) 中の中間体 15 (0.14 g、0.24 mmol) の溶液に、0 で TFA (0.4 mL) を添加した。反応混合物を室温で 4 時間攪拌し、次に減圧濃縮した。粗残留物をジエチルエーテル (20 mL) 及びヘキサン (20 mL) で洗浄して、オフホワイト固体として表題化合物 (TFA 塩) (0.10 g、87%、アトロブ異性体の混合物)を得た。<sup>1</sup>H (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) 1.86 (s, 3H), 2.85 (s, 3H), 2.86 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 4.72 (d, J 14.8 Hz, 1H), 4.84 (d, J 14.8 Hz, 1H), 6.80 (s, 1H), 6.93 (s, 1H), 7.20-7.28 (m, 1H), 7.42 (d, J 8.40 Hz, 1H), 7.51-7.58 (m, 1H), 7.72-7.82 (m, 1H), 8.91 (s, 1H), 10.80 (s, 1H)。LCMS (方法1、ESI) 465.00 [M+1]<sup>+</sup>、1.48分。

【誤訛訂正5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0135

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0135】

例5

( 5 R ) - 5 - { 3 - [ 6 - クロロ - 2 - ( ピロリジン - 1 - イル ) ベンズイミダゾール - 1 - イル ] - 2 - フルオロフェニル } - 2 , 5 - ジメチル - 1 , 1 - ジオキソ - 1 , 2 , 4 - チアジアジナン - 3 - イミン

イソプロパノール (5 mL) 中の中間体 17 (0.40 g、0.87 mmol) の溶液に、ピロリジン (0.62 g、8.79 mmol) を添加した。反応混合物を 16 時間 9

0 度加熱し、次に減圧濃縮した。粗残留物を分取 HPLC により精製して、オフホワイト固体として表題化合物 (0.025 g、6%、アトロブ異性体の混合物) を得た。LCMS (方法1, ESI) 491.00 [M+1]<sup>+</sup>, 2.21分。

【誤訳訂正 6】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0136

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0136】

例 6

(5R)-5-{3-[6-クロロ-2-(モルホリン-4-イル)ベンズイミダゾール-1-イル]-2-フルオロフェニル}-2,5-ジメチル-1,1-ジオキソ-1,2,4-チアジアジナン-3-イミン

DCM (10 mL) 中の中間体 18 (0.20 g、0.32 mmol) の溶液に、0 度 TFA (0.18 g、1.65 mmol) を加えた。反応混合物を室温で 3 時間攪拌し、次に減圧濃縮した。粗残留物を分取 HPLC により精製して、オフホワイト固体として表題化合物 (TFA 塩) (0.135 g、66%、アトロブ異性体の混合物) を得た。LCMS (方法1, ESI) 507.00 [M+1]<sup>+</sup>, 2.38分。

【誤訳訂正 7】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0137

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0137】

例 7

(5R)-5-{2-フルオロ-3-[6-フルオロ-2-メチル-7-(トリフルオロメチル)ベンズイミダゾール-1-イル]フェニル}-2,5-ジメチル-1,1-ジオキソ-1,2,4-チアジアジナン-3-イミン

DCM (12 mL) 中の中間体 21 (0.13 g、0.22 mmol) の溶液に、0 度 TFA (0.6 mL) を加えた。反応混合物を室温で 6 時間攪拌し、次に減圧濃縮した。粗残留物をジエチルエーテル：ヘキサン (2:8、40 mL) で洗浄して褐色固体として表題化合物 (TFA 塩) (0.09 g、84%、アトロブ異性体の混合物) を得た。LCMS (方法 1, ESI) 488.00 [M+1]<sup>+</sup>, 2.40 and 2.41 分。