

【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

D C M ( 6 m L ) 中の中間体 9 ( 0 . 14 g、0 . 27 m m o l ) の溶液に、0 で T F A ( 0 . 4 m L ) 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 ( 50 m L ) 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、T F A 塩 ( 0 . 07 g、59 % ) を得た。  $^1\text{H}$  ( 400 MHz, DMSO- $d_6$  ) 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+] $^+$ , 1.80 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

D C M ( 3 m L ) 中の中間体 13 ( 0 . 030 g、0 . 049 m m o l ) の溶液に、0 で T F A ( 0 . 1 m L ) 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 ( 50 m L ) 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。

【誤訳訂正 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%、アトロプ異性体の混合物) を得た。LCMS (方法1, ESI) 460.00 [M+1]<sup>+</sup>, 2.40分。

【誤訳訂正 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%、アトロプ異性体の混合物) 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。

【誤訳訂正 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 で加熱し、次に減圧濃縮した。粗残留物を分取 H P L C により精製して、オフホワイト固体として表題化合物 ( 0 . 0 2 5 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】0 1 3 6

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 1 3 6】

#### 例 6

( 5 R ) - 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

D C M ( 1 0 m L ) 中の中間体 1 8 ( 0 . 2 0 g 、 0 . 3 2 m m o l ) の溶液に、0 で T F A ( 0 . 1 8 g 、 1 . 6 5 m m o l ) 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 H P L C により精製して、オフホワイト固体として表題化合物 ( T F A 塩 ) ( 0 . 1 3 5 g 、 6 6 % 、 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】0 1 3 7

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 1 3 7】

#### 例 7

( 5 R ) - 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

D C M ( 1 2 m L ) 中の中間体 2 1 ( 0 . 1 3 g 、 0 . 2 2 m m o l ) の溶液に、0 で T F A ( 0 . 6 m L ) 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 、 4 0 m L ) で洗浄して褐色固体として表題化合物 ( T F A 塩 ) ( 0 . 0 9 g 、 8 4 % 、 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。