

【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27年8月13日 (2015.8.13)

【公表番号】特表2014-520876(P2014-520876A)

【公表日】平成26年8月25日 (2014.8.25)

【年通号数】公開・登録公報2014-045

【出願番号】特願2014-520667(P2014-520667)

【国際特許分類】

C 0 7 D 211/56 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/04 (2006.01)

A 6 1 P 15/18 (2006.01)

A 6 1 P 15/16 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 211/56 C S P

C 0 7 D 401/04

C 0 7 D 401/06

A 6 1 K 31/445

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 7/04

A 6 1 P 15/18

A 6 1 P 15/16

A 6 1 P 3/06

A 6 1 K 31/454

【手続補正書】

【提出日】平成27年6月24日 (2015.6.24)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

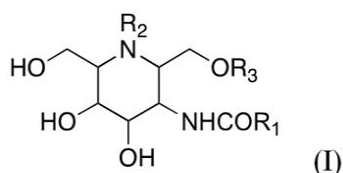
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 ( I ) :

## 【化 1】



[ 式中、

$R_1$  は、( $C_1 \sim C_{10}$ )アルキル基、( $C_2 \sim C_{10}$ )アルケニル基、( $C_2 \sim C_{10}$ )アルキニル基、( $C_3 \sim C_{10}$ )シクロアルキル基、( $C_3 \sim C_{18}$ )複素環基、( $C_6 \sim C_{18}$ )アリール基、またはアリールアルキル基を表し；

$R_2$  は、水素原子、( $C_1 \sim C_{10}$ )アルキル基、( $C_2 \sim C_{10}$ )アルケニル基、( $C_2 \sim C_{10}$ )アルキニル基、( $C_3 \sim C_{10}$ )シクロアルキル基、( $C_3 \sim C_{18}$ )複素環基、( $C_6 \sim C_{18}$ )アリール基、アリールアルキル基、または( $C_4 \sim C_{16}$ )ヘテロアリール基を表し；

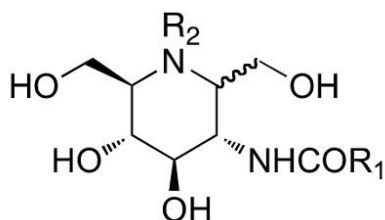
$R_3$  は、水素原子、( $C_1 \sim C_{10}$ )アルキル基、( $C_2 \sim C_{10}$ )アルケニル基、( $C_2 \sim C_{10}$ )アルキニル基、( $C_3 \sim C_{10}$ )シクロアルキル基、( $C_3 \sim C_{18}$ )複素環基、( $C_6 \sim C_{18}$ )アリール基、またはアリールアルキル基を表す]

で示される化合物またはその幾何異性体もしくは光学異性体。

## 【請求項 2】

化合物が、下記式：

## 【化 2】

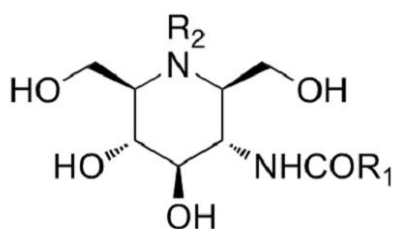
[ 式中、 $R_1$  および  $R_2$  は、請求項 1 における定義と同じである ]

で示されるものである、請求項 1 記載の化合物。

## 【請求項 3】

化合物が、下記式：

## 【化 3】

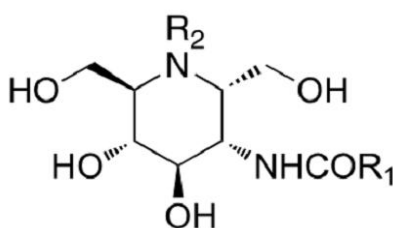
[ 式中、 $R_1$  および  $R_2$  は、請求項 1 における定義と同じである ]

で示されるものである、請求項 1 記載の化合物。

## 【請求項 4】

化合物が、下記式：

## 【化 4】



[ 式中、 $R_1$ および $R_2$ は、請求項 1 における定義と同じである ]  
 で示されるものである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 5】

$R_2$ が、水素原子、( $C_1 \sim C_8$ )アルキル基、( $C_3 \sim C_{10}$ )シクロアルキル基、または少なくとも 1 つの複素環および / または ( $C_3 \sim C_{10}$ )シクロアルキル基および / またはアルコキシ基で置換されている ( $C_8 \sim C_{10}$ )アルキル基であり、好ましくは、 $R_2$ が水素原子である、請求項 1 ~ 4 いずれか 1 項記載の化合物。

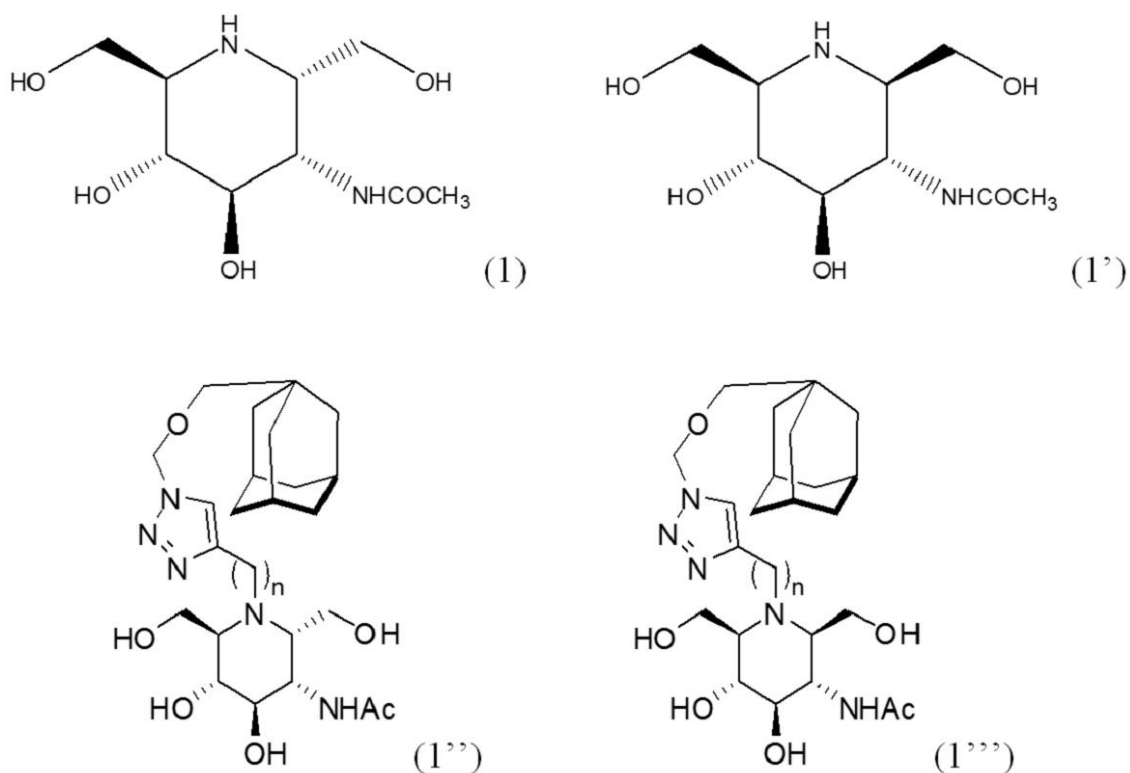
【請求項 6】

$R_1$ が、( $C_1 \sim C_8$ )アルキル基、好ましくはメチルもしくはトリフルオロメチル、( $C_3 \sim C_{10}$ )シクロアルキル基、好ましくはアダマンチル、または ( $C_3 \sim C_{18}$ )複素環基を表し、好ましくは、 $R_1$ がメチル基である、請求項 1 ~ 5 いずれか 1 項記載の化合物。

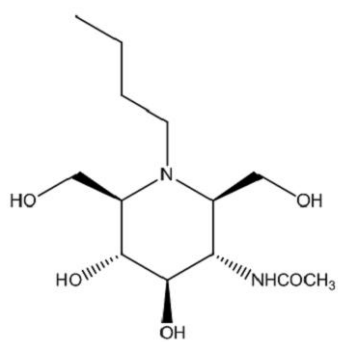
【請求項 7】

化合物が、下記式：

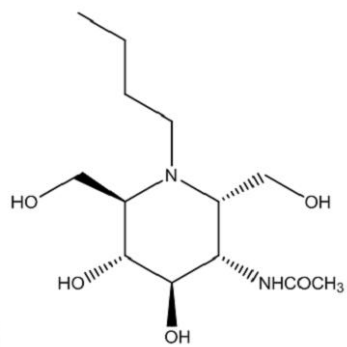
【化 5】



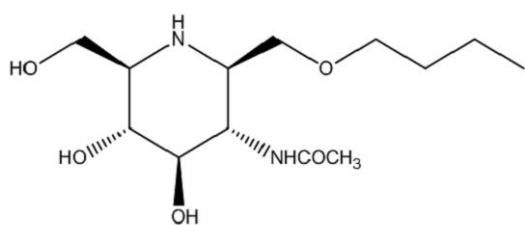
## 【化 6】



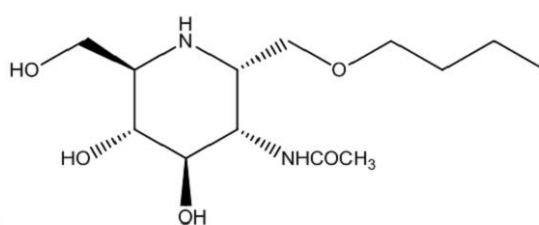
(2)



(2')

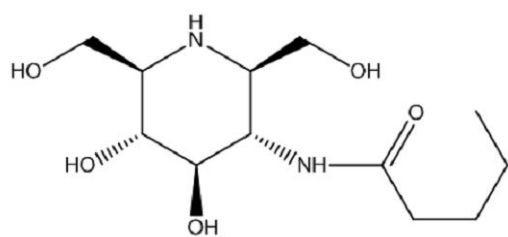


(3)

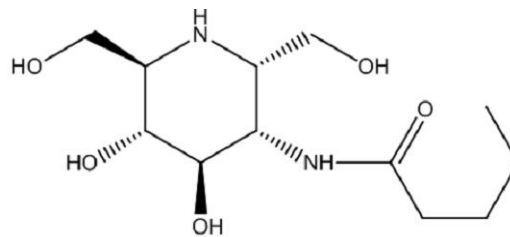


(3')

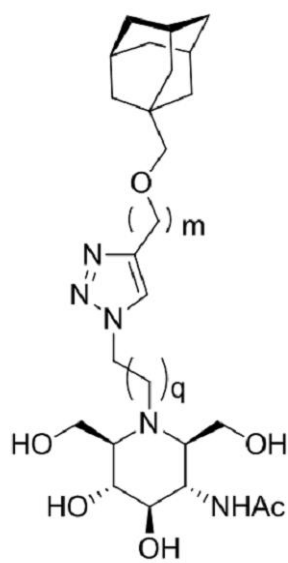
## 【化 7】



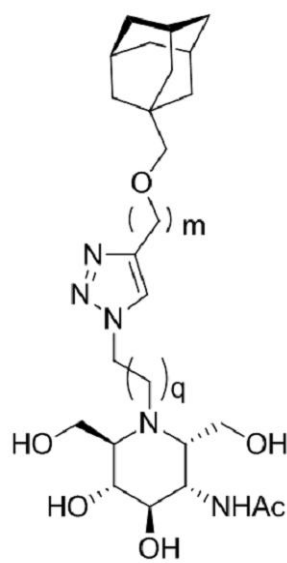
(4)



(4')

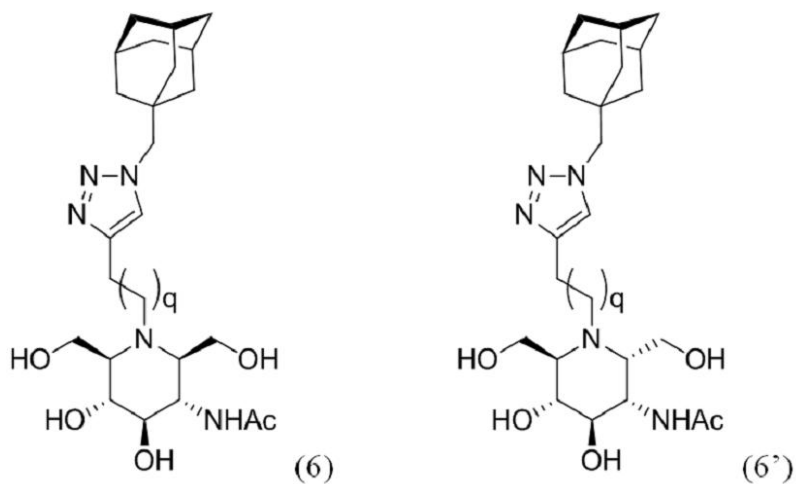


(5)



(5')

## 【化 8】



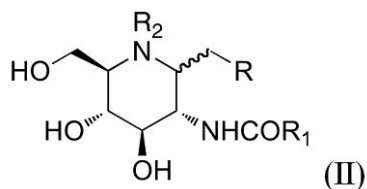
[ 式中、 $n$  は、 $1 \sim 10$  の整数であり、 $m$  は、 $1 \sim 10$  の整数であり、 $q$  は、 $0 \sim 9$  の整数である ]

のうちの 1 つで示されるものである、請求項 1 ～ 6 いずれか 1 項記載の化合物。

## 【請求項 8】

一般式 (I I) :

## 【化 9】



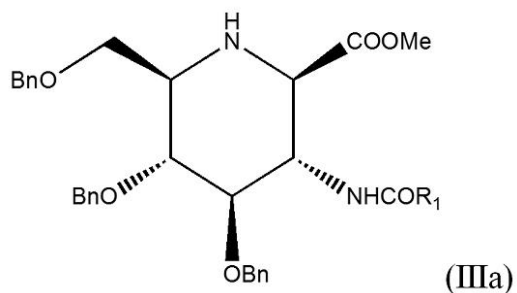
[ 式中、 $R_1$  および  $R_2$  は、請求項 1 ～ 7 いずれか 1 項における定義と同じであり、 $R$  は、ハロゲン原子、例えば、フルオロを表すか、または脂肪族および / または芳香族の基を含有する基、例えば、アルコキシ (例えば、メチルオキシ ( - OMe )、エチルオキシ ( - OEt ) )、ハロゲノアルコキシ (例えば、 - OEtBr )、ニトロフェノキシ、有機リン酸エステル、リン酸基、アミノ酸、ペプチド、炭水化物またはその誘導体を表す ]

で示される化合物。

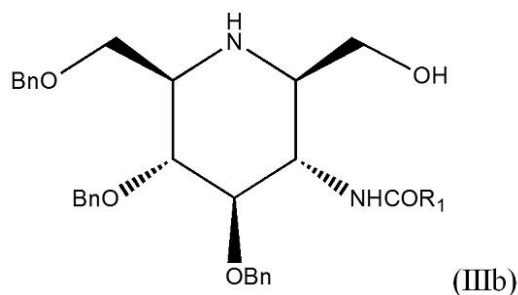
## 【請求項 9】

式 (I I I a) または (I I I b) :

## 【化 10】



## 【化 1 1】



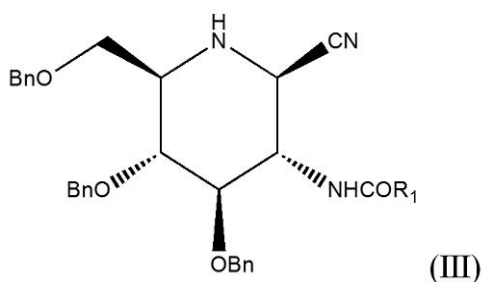
[ 式中、 $R_1$ は、請求項 1 または 6 における定義と同じである ]  
 で示される化合物。

## 【請求項 1 0】

請求項 3 ~ 6 いずれか 1 項で定義された化合物の製造方法であって、

( i ) 下記式 ( I I I ) :

## 【化 1 2】



[ 式中、 $R_1$ は、上記で定義したとおりであり、B n は、ベンジル基または他のいずれかのアルコール保護基を表す ]

で示される化合物を加水分解し、次いで、エステル化反応させてニトリル官能基をエステル基と置き換える工程、

( i i ) エステル基を還元してアルコール基を得る工程、および

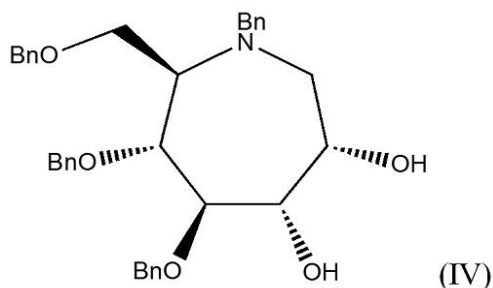
( i i i ) アルコール保護基を、好ましくは水素化分解によって、除去してもよい工程を含む方法。

## 【請求項 1 1】

請求項 4 ~ 6 いずれか 1 項で定義された化合物の製造方法であって、

( i ) 下記式 ( I V ) :

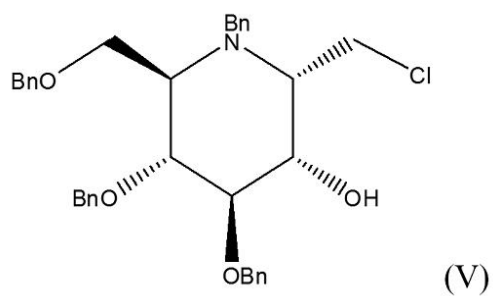
## 【化 1 3】



[ 式中、B n は、ベンジル基または他のいずれかの適切なアルコール保護基もしくはアミン保護基を表す ]

で示される化合物を反応させて、下記式 ( V ) :

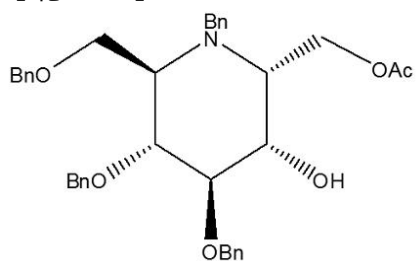
## 【化 1 4】



で示される化合物を得る工程、

( i i ) 式 ( V ) で示される化合物から式 ( V I ) :

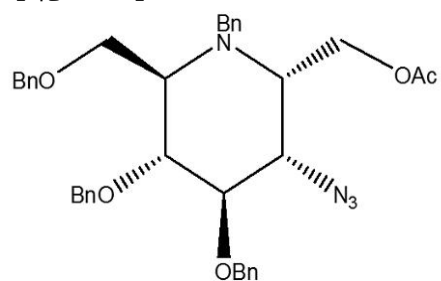
## 【化 1 5】



で示される化合物を製造する工程、

( i i i ) 式 ( V I ) で示される化合物から式 ( V I I ) :

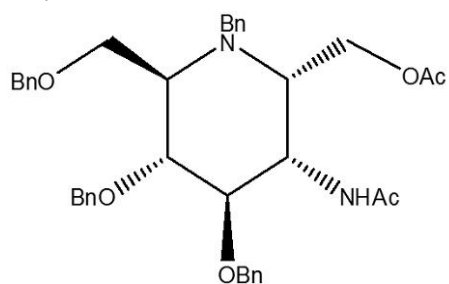
## 【化 1 6】



で示される化合物を製造する工程、

( i v ) 式 ( V I I ) で示される化合物から式 ( V I I I ) :

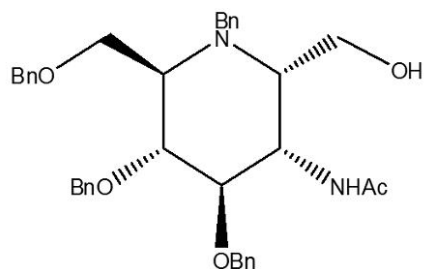
## 【化 1 7】



で示される化合物を製造する工程、

( v ) 式 ( V I I I ) で示される化合物から式 ( I X ) :

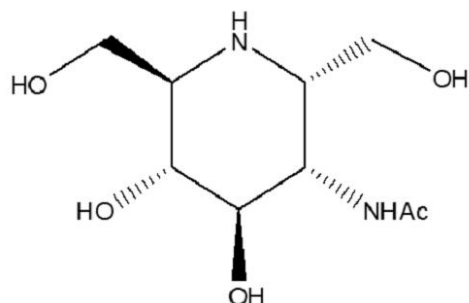
## 【化 18】



で示される化合物を製造する工程、

(vi) アルコール保護基およびアミン保護基を除去して式(1)：

## 【化 19】



で示される化合物を得てもよい工程を含む方法。

## 【請求項 12】

請求項 1～8 いずれか 1 項記載の化合物を含む医薬。

## 【請求項 13】

請求項 1～8 いずれか 1 項記載の化合物を含む、グリコシダーゼ媒介酵素加水分解反応経路およびメカニズムを評価するための生物学的ツール。

## 【請求項 14】

医薬上許容される支持体中に、請求項 1～8 いずれか 1 項で定義した少なくとも 1 種の化合物を含む、医薬組成物。

## 【請求項 15】

請求項 1～8 いずれか 1 項記載の化合物を含む、2 型糖尿病、神経変性疾患、癌、ウイルス疾患、またはリソソーム蓄積症の治療用の医薬。

## 【請求項 16】

請求項 1～8 いずれか 1 項記載の化合物を含む、脂質代謝異常の処置用、止血用または避妊用の医薬。