

【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28年6月16日 (2016.6.16)

【公表番号】特表2015-531746(P2015-531746A)

【公表日】平成27年11月5日 (2015.11.5)

【年通号数】公開・登録公報2015-068

【出願番号】特願2015-517189(P2015-517189)

【国際特許分類】

C 0 7 D 317/18 (2006.01)

C 0 7 D 317/72 (2006.01)

C 0 7 D 317/20 (2006.01)

A 6 1 K 31/357 (2006.01)

A 6 1 P 21/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

C 0 7 D 317/36 (2006.01)

C 0 7 D 317/32 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 317/18

C 0 7 D 317/72 C S P

C 0 7 D 317/20

A 6 1 K 31/357

A 6 1 P 21/02

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/02

C 0 7 D 317/36

C 0 7 D 317/32

【誤訳訂正書】

【提出日】平成28年4月20日 (2016.4.20)

【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

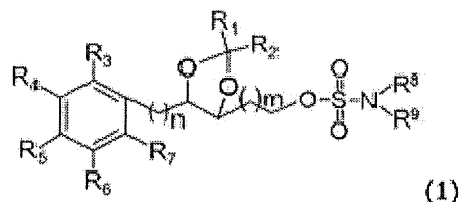
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記化学式 (1) で示される化合物又はその薬学的に許容可能な塩：

【化 1】



上記式において、 R_1 及び R_2 は、それぞれ独立的に水素、 $C_1 - C_5$ アルキル基及び $C_6 - C_{10}$ アリール基からなる群より選ばれるか、 R_1 及び R_2 は、炭素原子と結合して $C_5 - C_6$ シクロアルキル基を形成し；

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 及び R_7 は、それぞれ独立的に水素、ハロゲン、 $C_1 - C_5$ アルキル基、ニトロ基及び置換されていないか、又は $C_1 - C_3$ アルキル - 置換されたアミン基からなる群より選ばれる；

R_8 及び R_9 は、それぞれ独立的には水素又は $C_1 - C_3$ アルキル基であり；

n 及び m は、それぞれ独立的に 0 ~ 2 の整数である。

【請求項 2】

R_1 及び R_2 は、それぞれ独立的に水素、 $C_1 - C_3$ アルキル基及びフェニル基からなる群より選ばれるか、 R_1 及び R_2 は、炭素原子と結合して $C_5 - C_6$ シクロアルキル基を形成し、 R_1 及び R_2 は両方とも水素ではない、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 3】

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 及び R_7 は、それぞれ独立的に水素、塩素、フッ素、ヨウ素、 $C_1 - C_3$ アルキル基、ニトロ基及び置換されていないか又はメチル - 置換されたアミン基からなる群より選ばれる、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4】

R_8 及び R_9 は水素である、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5】

n 及び m はそれぞれ独立的に 0 又は 1 の整数である、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6】

上記化合物は、

- (1) (5 - (2 - クロロフェニル) - 2, 2 - ジメチル - 1, 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート；
- (2) (5 - (2 - クロロフェニル) - 2 - メチル - 1, 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート；
- (3) (5 - (2 - クロロフェニル) - 2, 2 - ジエチル - 1, 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート；
- (4) (3 - (2 - クロロフェニル) - 1, 4 - ジオキサスピロ [4, 4] ノナン - 2 - イル) メチルスルファメート；
- (5) (3 - (2 - クロロフェニル) - 1, 4 - ジオキサスピロ [4, 5] デカン - 2 - イル) メチルスルファメート；
- (6) (5 - (2 - クロロフェニル) - 2 - フェニル - 1, 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート；
- (7) (5 - (2 - フルオロフェニル) - 2, 2 - ジメチル - 1, 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート；
- (8) (5 - (2 - フルオロフェニル) - 2 - メチル - 1, 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート；
- (9) (5 - (2 - フルオロフェニル) - 2, 2 - ジエチル - 1, 3 - ジオキソラン - 4

- イル) メチルスルファメート;
- (1 0) (3 - (2 - フルオロフェニル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 4] ノナン - 2 - イル) メチルスルファメート;
- (1 1) (3 - (2 - フルオロフェニル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 5] デカン - 2 - イル) メチルスルファメート;
- (1 2) (5 - (2 - フルオロフェニル) - 2 - フェニル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (1 3) (5 - (2 - ヨードフェニル) - 2 , 2 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (1 4) (5 - (2 - ヨードフェニル) - 2 - メチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (1 5) (5 - (2 - ヨードフェニル) - 2 , 2 - ジエチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (1 6) (3 - (2 - ヨードフェニル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 4] ノナン - 2 - イル) メチルスルファメート;
- (1 7) (3 - (2 - ヨードフェニル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 5] デカン - 2 - イル) メチルスルファメート;
- (1 8) (5 - (2 - ヨードフェニル) - 2 - フェニル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (1 9) (5 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 2 , 2 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (2 0) (5 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 2 - メチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (2 1) (5 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 2 , 2 - ジエチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (2 2) (3 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 4] ノナン - 2 - イル) メチルスルファメート;
- (2 3) (3 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 5] デカン - 2 - イル) メチルスルファメート;
- (2 4) (5 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 2 - フェニル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (2 5) (5 - (2 , 6 - ジクロロフェニル) - 2 , 2 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (2 6) (5 - (2 , 6 - ジクロロフェニル) - 2 - メチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (2 7) (5 - (2 , 6 - ジクロロフェニル) - 2 , 2 - ジエチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (2 8) (3 - (2 , 6 - ジクロロフェニル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 4] ノナン - 2 - イル) メチルスルファメート;
- (2 9) (3 - (2 , 6 - ジクロロフェニル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 5] デカン - 2 - イル) メチルスルファメート;
- (3 0) (5 - (2 , 6 - ジクロロフェニル) - 2 - フェニル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (3 1) (5 - (2 - アミノフェニル) - 2 , 2 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (3 2) (5 - (2 - アミノフェニル) - 2 - メチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (3 3) (5 - (2 - アミノフェニル) - 2 , 2 - ジエチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (3 4) (3 - (2 - アミノフェニル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 4] ノナン - 2

- イル) メチルスルファメート;
- (3 5) (3 - (2 - アミノフェニル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 5] デカン - 2 - イル) メチルスルファメート;
- (3 6) (5 - (2 - アミノフェニル) - 2 - フェニル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (3 7) (5 - (2 - ニトロフェニル) - 2 , 2 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (3 8) (5 - (2 - ニトロフェニル) - 2 - メチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (3 9) (5 - (2 - ニトロフェニル) - 2 , 2 - ジエチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (4 0) (3 - (2 - ニトロフェニル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 4] ノナン - 2 - イル) メチルスルファメート;
- (4 1) (3 - (2 - ニトロフェニル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 5] デカン - 2 - イル) メチルスルファメート;
- (4 2) (5 - (2 - ニトロフェニル) - 2 - フェニル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (4 4) (5 - (2 - メチルフェニル) - 2 , 2 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (4 5) (5 - (2 - メチルフェニル) - 2 - メチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (4 6) (5 - (2 - メチルフェニル) - 2 , 2 - ジエチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (4 7) (3 - (2 - メチルフェニル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 4] ノナン - 2 - イル) メチルスルファメート;
- (4 8) (3 - (2 - メチルフェニル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 5] デカン - 2 - イル) メチルスルファメート;
- (4 9) (5 - (2 - メチルフェニル) - 2 - フェニル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (5 0) (5 - (2 - メチルアミノフェニル) - 2 , 2 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (5 1) (5 - フェニル - 2 , 2 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (5 2) (5 - フェニル - 2 , 2 - ジエチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (5 3) (3 - フェニル - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 4] ノナン - 2 - イル) メチルスルファメート;
- (5 4) (3 - フェニル - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 5] デカン - 2 - イル) メチルスルファメート;
- (5 5) 2 - (5 - ベンジル - 2 , 2 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) エチルスルファメート;
- (5 6) 2 - (5 - ベンジル - 2 , 2 - ジエチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) エチルスルファメート;
- (5 7) 2 - (3 - ベンジル - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 4] ノナン - 2 - イル) エチルスルファメート;
- (5 8) 2 - (3 - ベンジル - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 5] デカン - 2 - イル) エチルスルファメート;
- (5 9) (5 - ベンジル - 2 , 2 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート;
- (6 0) (5 - ベンジル - 2 , 2 - ジエチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチル

スルファメート；

(6 1) (3 - ベンジル - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 4] ノナン - 2 - イル) メチル
スルファメート；

(6 2) (3 - ベンジル - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 5] デカン - 2 - イル) メチル
スルファメート；

(6 3) 2 - (5 - フェニル - 2 , 2 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) エ
チルスルファメート；

(6 4) 2 - (5 - フェニル - 2 , 2 - ジエチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) エ
チルスルファメート；

(6 5) 2 - (3 - フェニル - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 4] ノナン - 2 - イル) エ
チルスルファメート；

(6 6) 2 - (3 - フェニル - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 5] デカン - 2 - イル) エ
チルスルファメート；

(6 7) 2 - (5 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 2 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン
- 4 - イル) エチルスルファメート；

(6 8) 2 - (5 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 2 - ジエチル - 1 , 3 - ジオキソラン
- 4 - イル) エチルスルファメート；

(6 9) 2 - (3 - (2 - クロロベンジル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 4] ノナン
- 2 - イル) エチルスルファメート；

(7 0) 2 - (3 - (2 - クロロベンジル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 5] デカン
- 2 - イル) エチルスルファメート；

(7 1) (5 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 2 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4
- イル) メチルスルファメート；

(7 2) (5 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 2 - ジエチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4
- イル) メチルスルファメート；

(7 3) (3 - (2 - クロロベンジル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 4] ノナン - 2
- イル) メチルスルファメート；

(7 4) (3 - (2 - クロロベンジル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 5] デカン - 2
- イル) メチルスルファメート；

(7 5) 2 - (5 - (2 - クロロフェニル) - 2 , 2 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン
- 4 - イル) エチルスルファメート；

(7 6) 2 - (5 - (2 - クロロフェニル) - 2 , 2 - ジエチル - 1 , 3 - ジオキソラン
- 4 - イル) エチルスルファメート；

(7 7) 2 - (3 - (2 - クロロフェニル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 4] ノナン
- 2 - イル) エチルスルファメート； 及び

(7 8) 2 - (3 - (2 - クロロフェニル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 5] デカン
- 2 - イル) エチルスルファメート

からなる群より選ばれる、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 7】

上記化合物は、

(1) (5 - (2 - クロロフェニル) - 2 , 2 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 -
イル) メチルスルファメート；

(2) (5 - (2 - クロロフェニル) - 2 - メチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル)
メチルスルファメート；

(3) (5 - (2 - クロロフェニル) - 2 , 2 - ジエチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 -
イル) メチルスルファメート；

(5) (3 - (2 - クロロフェニル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 5] デカン - 2 -
イル) メチルスルファメート；

(2 5) (5 - (2 , 6 - ジクロロフェニル) - 2 , 2 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラ
ン - 4 - イル) メチルスルファメート；

(4 4) (5 - (2 - メチルフェニル) - 2 , 2 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) メチルスルファメート ;

(5 4) (3 - フェニル - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 5] デカン - 2 - イル) メチルスルファメート ; 及び

(6 4) 2 - (5 - フェニル - 2 , 2 - ジエチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 4 - イル) エチルスルファメート

からなる群より選ばれる、請求項 6 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 8】

上記化合物はラセミ体、光学異性体、部分立体異性体 (diastereomer)、光学異性体の混合物、又は部分立体異性体の混合物の形態である、請求項 1 乃至 7 のうちのいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許用可能な塩。

【請求項 9】

薬学的に許容可能な塩は、化合物を無機酸、有機酸、アミノ酸、スルホン酸、アルカリ金属、又はアンモニウムイオンと反応させることにより生成される、請求項 1 乃至 7 のうちのいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 10】

請求項 1 乃至 7 のうちのいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩を活性成分として含む、筋攣縮関連疾病の予防又は治療用の組成物。

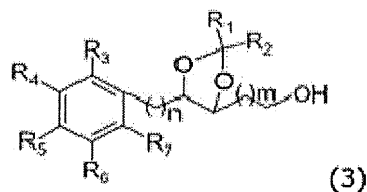
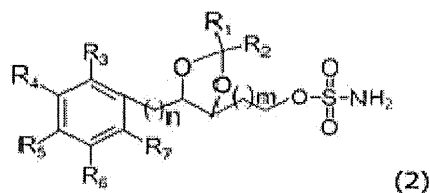
【請求項 11】

上記筋攣縮関連疾病は、椎間板ヘルニア、脊髄血管障害、痙性脊髄麻痺、頸部脊椎症、脳性麻痺、脊髄損傷後遺症、頭部損傷後遺症、及び脊髄小脳変性症からなる群より選ばれる、請求項 10 に記載の筋攣縮関連疾病の予防又は治療用の組成物。

【請求項 12】

(a) 下記化学式 (3) で表される化合物のスルファモイル化 (sulfamation) を行う段階を含む下記化学式 (2) で表される化合物の製造方法 :

【化 2】

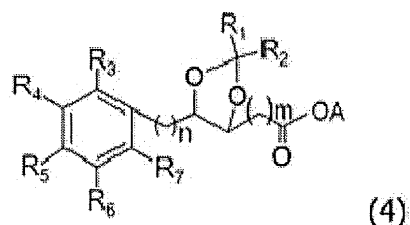


上記式において、 $R_1 \sim R_7$ 、 n 及び m は、請求項 1 で定義された通りである。

【請求項 13】

上記製造方法は、段階 (a) の前に下記化学式 (4) で表される化合物を還元剤と反応させて、化学式 (3) の化合物を形成する段階を更に含む、請求項 12 に記載の製造方法。

【化 3】

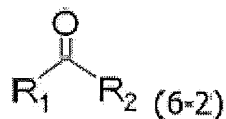
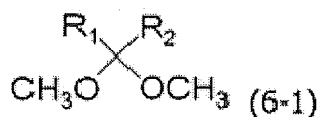
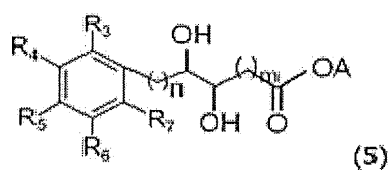


上記式において、 $R_1 \sim R_7$ 、 n 及び m は請求項 1 で定義された通り、 A は $C_1 - C_3$ アルコキシ $C_1 - C_3$ アルキルである。

【請求項 1 4】

上記製造方法は、下記化学式 (5) で表される化合物を酸及び下記化学式 (6 - 1) 又は化学式 (6 - 2) で表される化合物と反応させて、化学式 (4) の化合物を形成する段階を更に含む、請求項 1 3 に記載の製造方法：

【化 4】

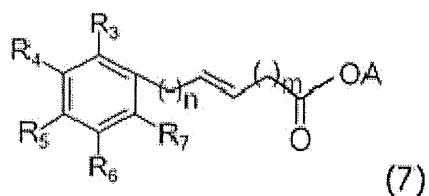


上記式において、 $R_1 \sim R_7$ 、 n 、 m 及び A は、請求項 1 6 で定義された通りである。

【請求項 1 5】

上記製造方法は、下記化学式 (7) で表される化合物のジヒドロキシル化を酸化剤により行って化学式 (5) の化合物を形成する段階を更に含む、請求項 1 4 に記載の製造方法：

【化 5】



上記式において、 $R_3 \sim R_7$ 、 n 、 m 及び A は請求項 1 6 で定義された通りである。