

【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4年5月19日(2022.5.19)

【公開番号】特開2022-65035(P2022-65035A)  
 【公開日】令和4年4月26日(2022.4.26)  
 【年通号数】公開公報(特許)2022-075  
 【出願番号】特願2022-17827(P2022-17827)  
 【国際特許分類】

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 ) 10  
 A 6 1 K 3 1 / 5 5 1 7 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 K 3 1 / 6 9 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 4 3 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 2 5 / 2 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 2 5 / 1 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 2 5 / 2 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 2 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 C 0 7 F 7 / 1 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 C 0 7 B 6 1 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

【 F I 】 20

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 5 3  
 A 6 1 K 3 1 / 5 5 1 7  
 A 6 1 K 3 1 / 6 9 5  
 A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1  
 A 6 1 P 2 5 / 2 4  
 A 6 1 P 2 5 / 1 8  
 A 6 1 P 2 5 / 2 8  
 A 6 1 P 2 5 / 0 0  
 C 0 7 F 7 / 1 0 V C S P  
 C 0 7 F 7 / 1 0 A 30  
 C 0 7 B 6 1 / 0 0 3 0 0

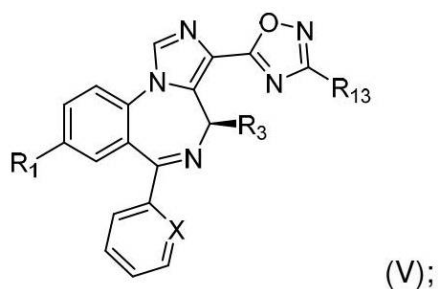
【手続補正書】  
 【提出日】令和4年5月11日(2022.5.11)

【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】 40  
 【請求項1】

式(V)は、

## 【化 1】



10

(式中、

Xは、N、C-F、およびC-Clからなる群から選択され；

R1は、-C(CH3)3であり；

R3は、-CH3であり；

R13は、-CH3、-CH2CH3、およびシクロアルキルからなる群から選択される)

の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 2】

XがNである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 3】

XがCFである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

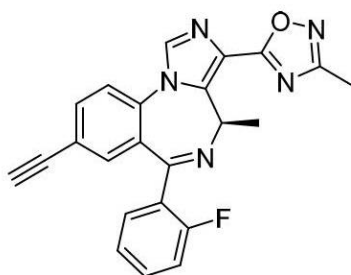
R13が-CH3である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

R13が-CH2CH3である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 6】

## 【化 2】

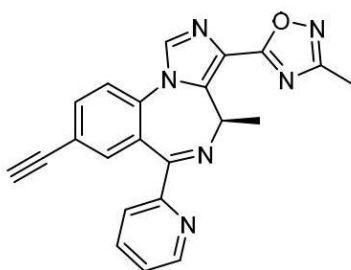


30

である請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 7】

## 【化 3】



40

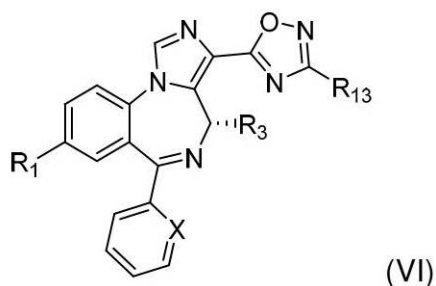
である請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 8】

50

式 (VI) :

【化 4】



10

(式中、

X は、C - F および C - Cl からなる群から選択され；

R 1 は、- C H であり；

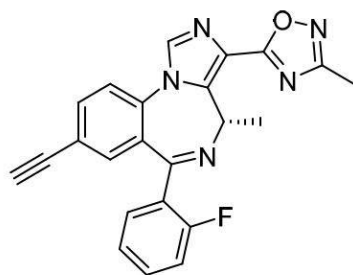
R 3 は、- C H 3 であり；

R 1 3 は、- C H 3 である)

の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 9】

【化 5】



20

である請求項 8 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

30

【請求項 10】

請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物および薬学的に許容される賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 11】

請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物または請求項 10 に記載の組成物の、認知および / または気分症状の治療のための医薬の製造における使用。

【請求項 12】

前記認知および / または気分症状がうつ病および神経障害に起因する、請求項 11 に記載の使用。

【請求項 13】

前記神経障害が神経精神障害または神経変性障害である、請求項 12 に記載の使用。

40

【請求項 14】

前記神経障害が神経精神障害であり、前記神経精神障害が、大うつ病、双極性うつ病、または統合失調症である、請求項 13 に記載の使用。

【請求項 15】

前記神経障害が神経変性障害であり、前記神経変性障害がアルツハイマー病である、請求項 13 に記載の使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0246

50

【補正方法】変更

【補正の内容】

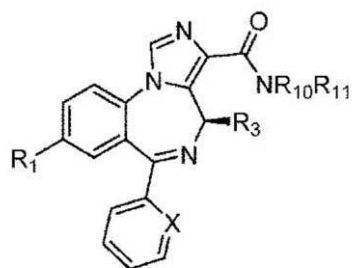
【0246】

[00236] 本開示の様々な特徴および利点は、添付の特許請求の範囲に記載される。  
国際出願時の特許請求の範囲

〔項1〕

式(II)または(III)：

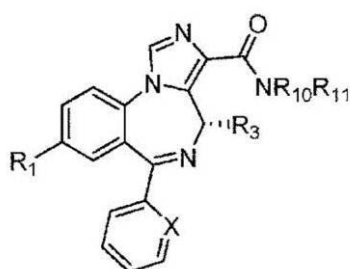
【化1a】



(II)

10

または



(III)

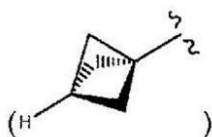
20

(式中、

Xは、N、C-H、C-F、C-Cl、C-Br、C-IおよびC-NO<sub>2</sub>からなる群から選択され；

R<sub>1</sub>は、-Br、-CH<sub>3</sub>、-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、-シクロプロピルおよびビスシクル[1.1.1]ペンタン 30

【化2a】



からなる群から選択され；

R<sub>3</sub>は、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-CD<sub>3</sub>、-OH、-F、-Cl、-CF<sub>3</sub>および-CCl<sub>3</sub>からなる群から選択され； 40

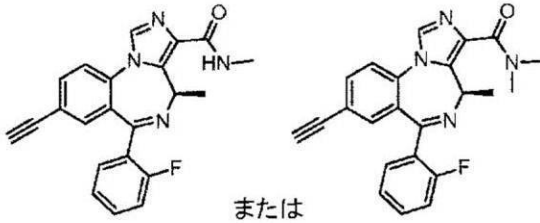
R<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>は、-H、C<sub>1</sub>~6アルキル、シクロアルキルから独立して選択されるか、または一緒にシクロアルキル環を形成してもよい)

のいずれか1つに従う化合物であって、

ただし、前記化合物は、

50

## 【化 3 a】



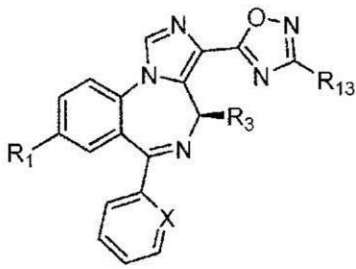
でない化合物、またはその薬学的に許容される塩。

10

〔項 2〕

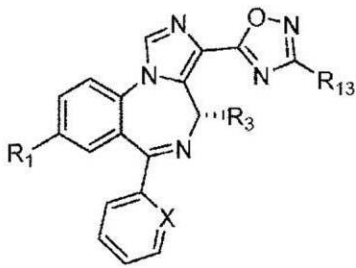
式 (V) または (VI) :

## 【化 4 a】



20

または



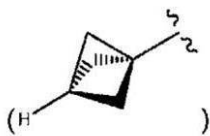
30

(式中、

X は、N、C - H、C - F、C - Cl、C - Br、C - I および C - NO<sub>2</sub> からなる群から選択され；

R<sub>1</sub> は、- Br、- C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、- Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、- シクロプロピル および ビシクル [1.1.1] ペンタン

## 【化 5 a】



40

からなる群から選択され；

R<sub>3</sub> は、- CH<sub>3</sub>、- CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、- CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、- CD<sub>3</sub>、- OH、- F、- Cl、- CF<sub>3</sub> および - CCl<sub>3</sub> からなる群から選択され；

R<sub>13</sub> は、- H、- CD<sub>3</sub>、C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル および シクロアルキル からなる群から選択される)

のいずれか 1 つに従う化合物、またはその薬学的に許容される塩。

〔項 3〕

X が N である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

〔項 4〕

50

X が C F である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

[ 項 5 ]

R 1 が B r である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

[ 項 6 ]

R 1 が - C C H である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

[ 項 7 ]

R 3 が - C H 3 である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

[ 項 8 ]

R 3 が - C H 2 C H 3 である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

[ 項 9 ]

R 3 が - C H ( C H 3 ) 2 である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

10

[ 項 1 0 ]

R 1 3 が - C H 3 である、請求項 2 に記載の化合物。

[ 項 1 1 ]

R 1 3 が - C H 2 C H 3 である、請求項 2 に記載の化合物。

[ 項 1 2 ]

R 1 3 が - C H ( C H 3 ) 2 である、請求項 2 に記載の化合物。

[ 項 1 3 ]

R 1 が B r である、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

20

[ 項 1 4 ]

R 1 が - C C H である、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

[ 項 1 5 ]

R 3 が - C H 3 である、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

[ 項 1 6 ]

R 3 が - C H 2 C H 3 である、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

[ 項 1 7 ]

R 3 が - C H ( C H 3 ) 2 である、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

[ 項 1 8 ]

R 1 3 が - C H 3 である、請求項 2 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物。

30

[ 項 1 9 ]

R 1 3 が - C H 2 C H 3 である、請求項 2 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物。

[ 項 2 0 ]

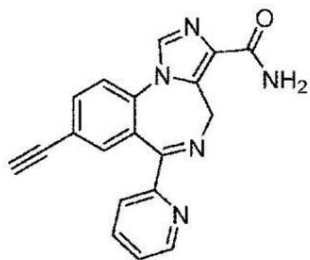
R 1 3 が - C H ( C H 3 ) 2 である、請求項 2 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物。

[ 項 2 1 ]

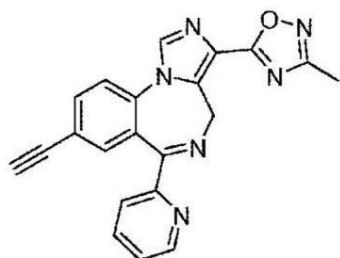
40

50

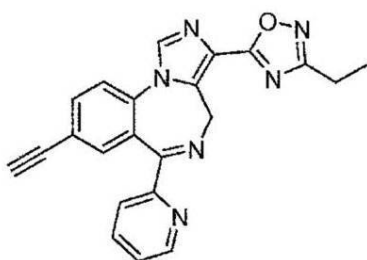
## 【化 6 a】



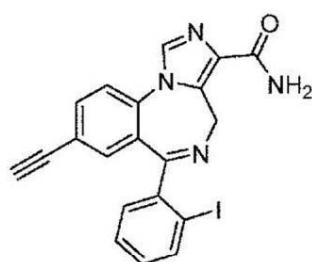
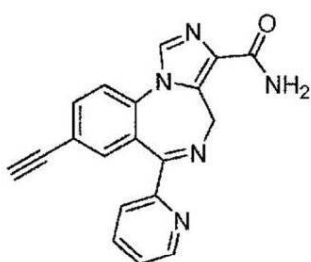
10



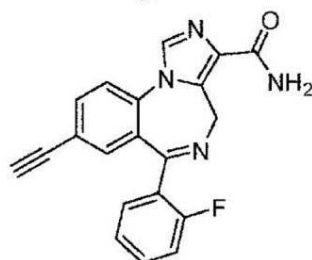
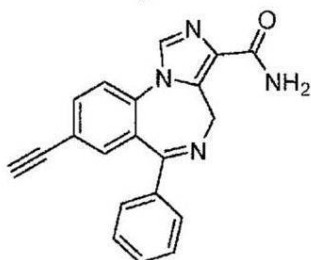
20



30

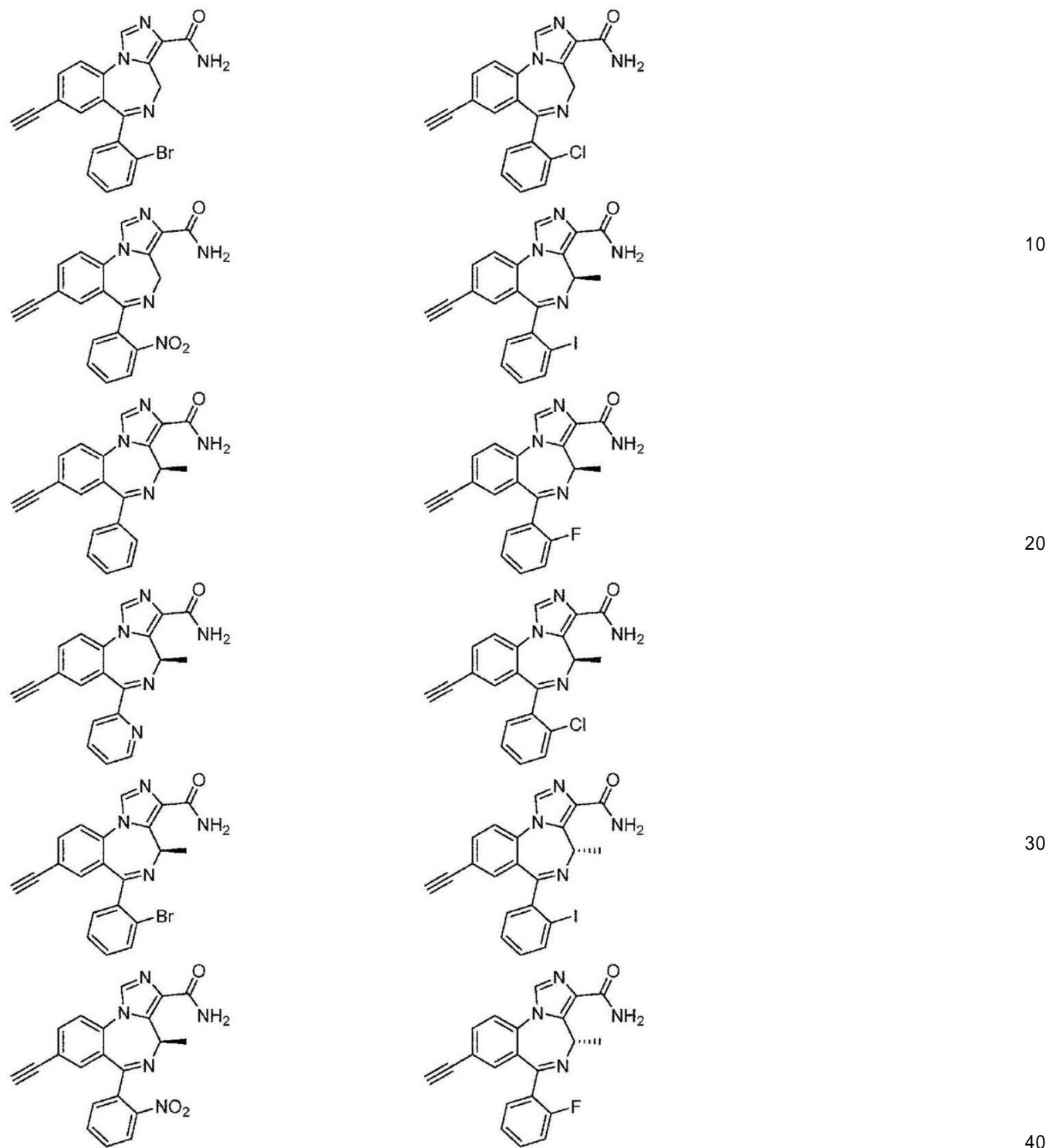


40

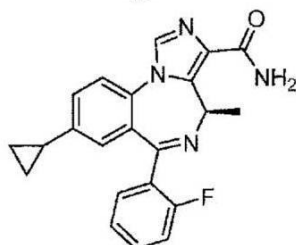
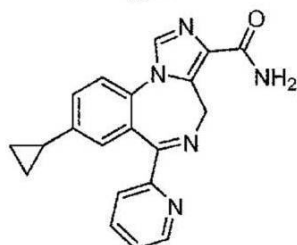
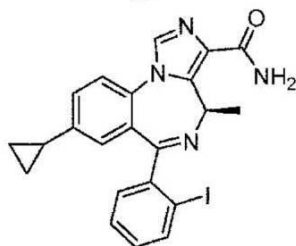
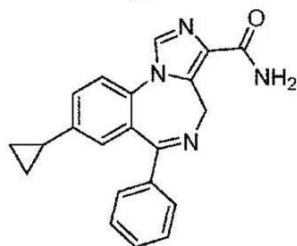
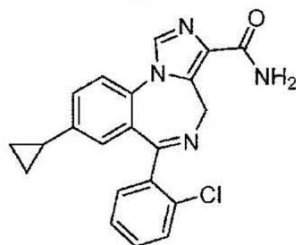
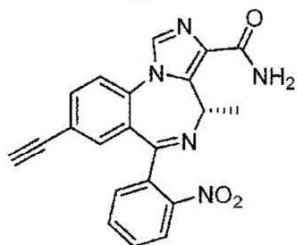
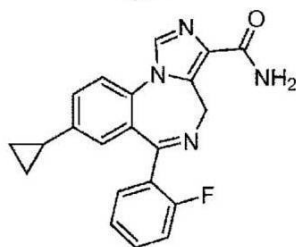
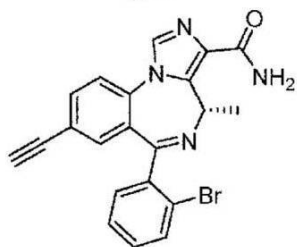
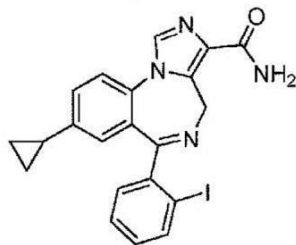
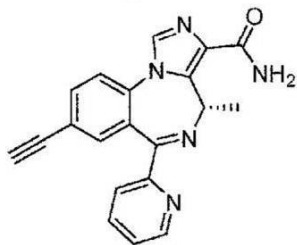
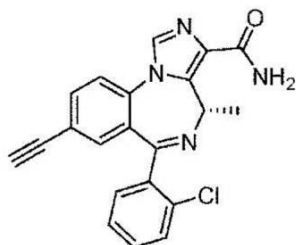
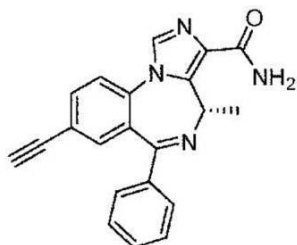


50

## 【化 7 a】



## 【化 8 a】



10

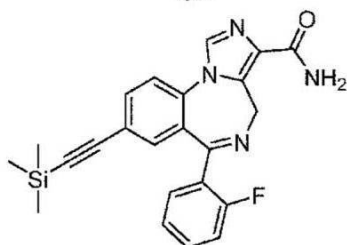
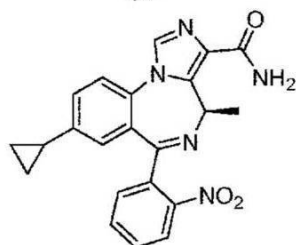
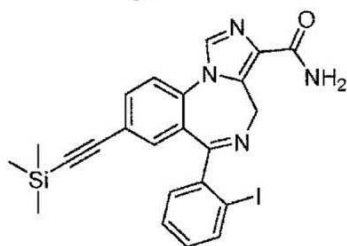
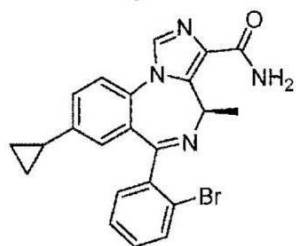
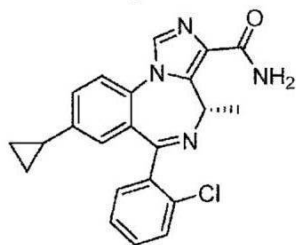
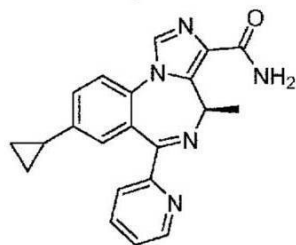
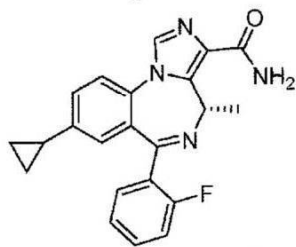
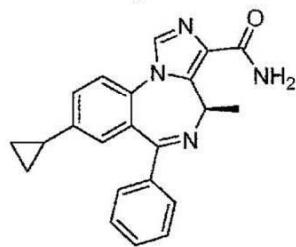
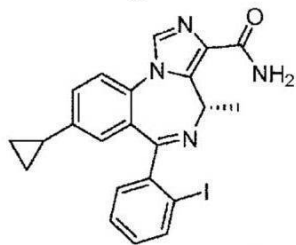
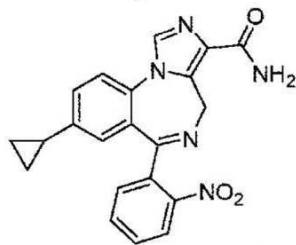
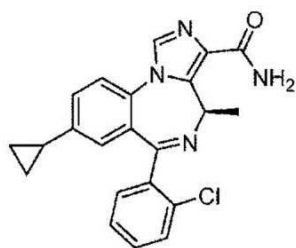
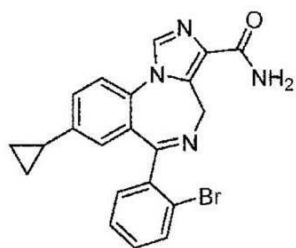
20

30

40

50

## 【化 9 a】



10

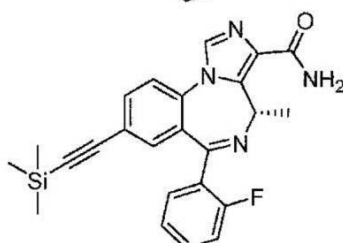
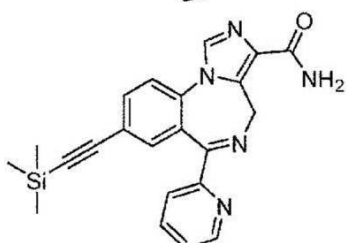
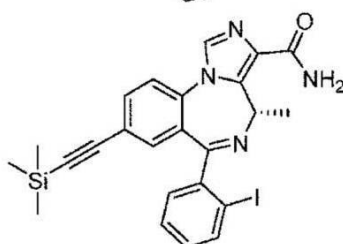
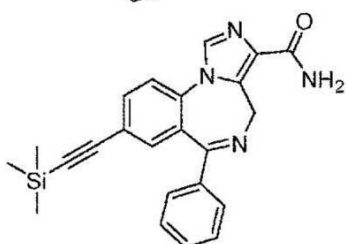
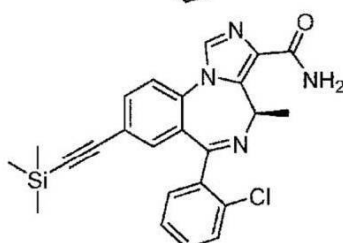
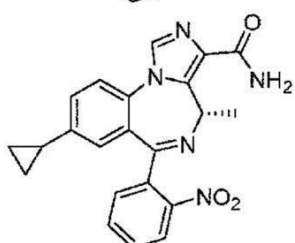
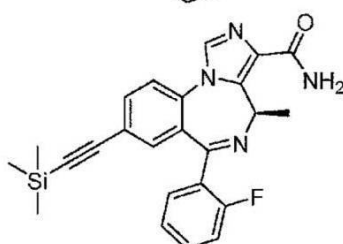
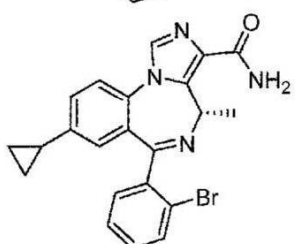
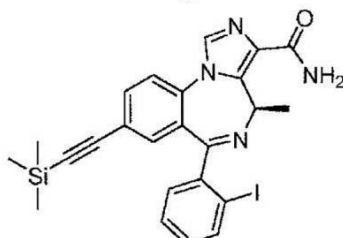
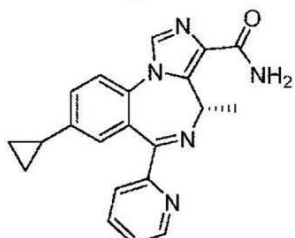
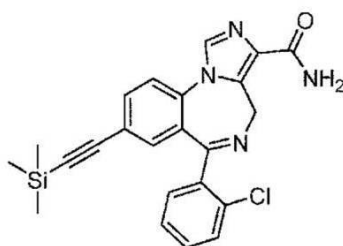
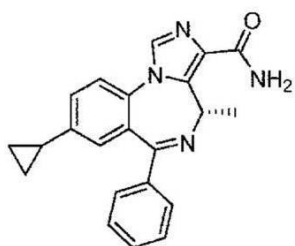
20

30

40

50

## 【化 1 0 a】



10

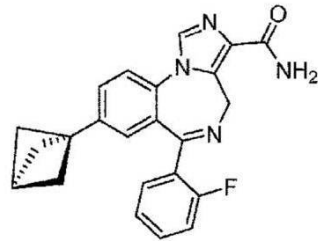
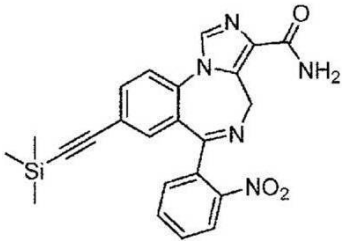
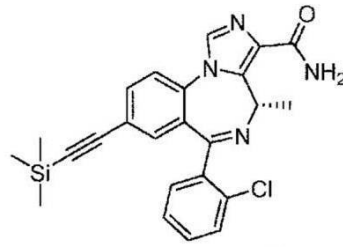
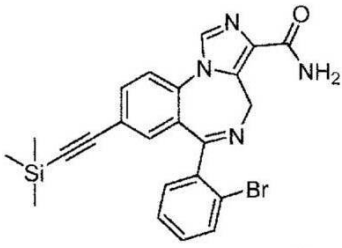
20

30

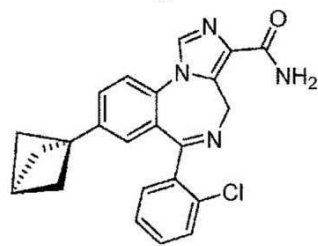
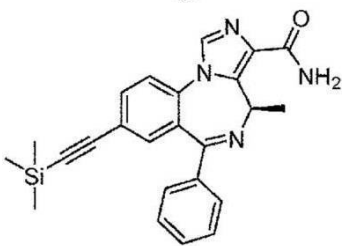
40

50

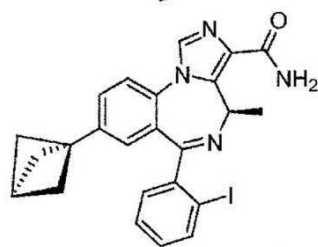
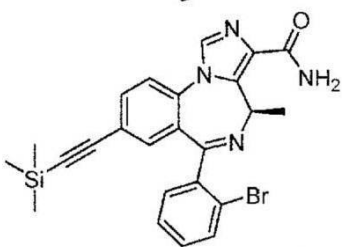
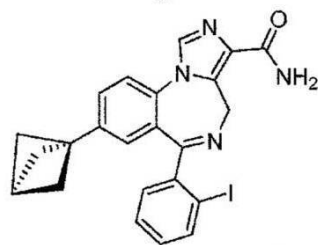
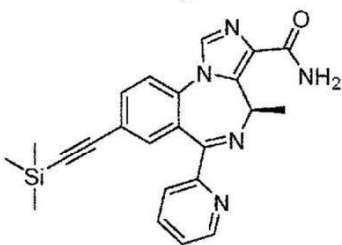
## 【化 1 1 a】



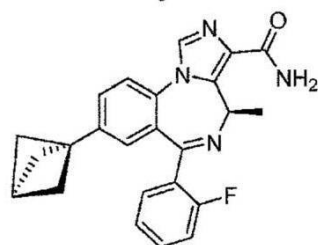
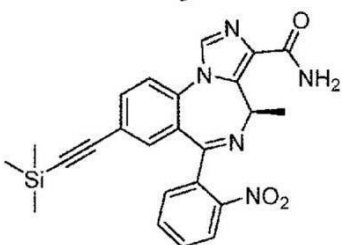
10



20



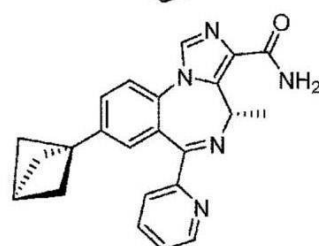
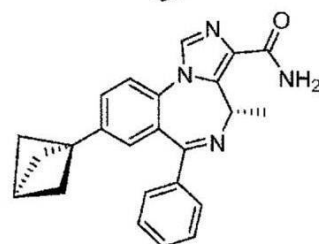
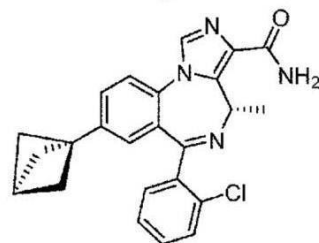
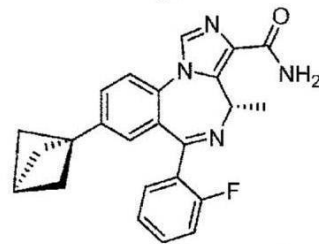
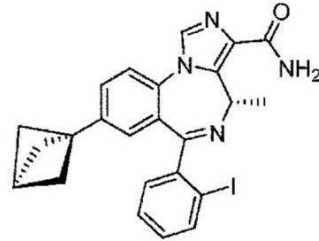
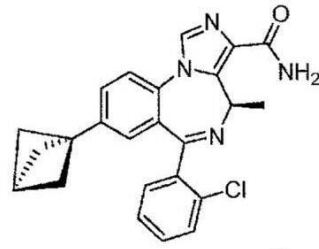
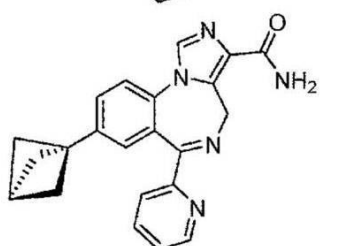
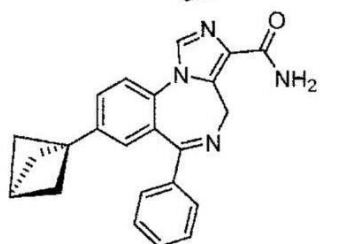
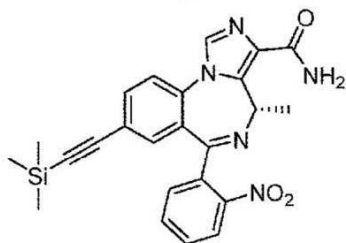
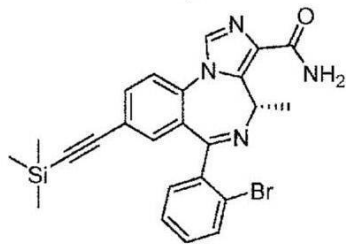
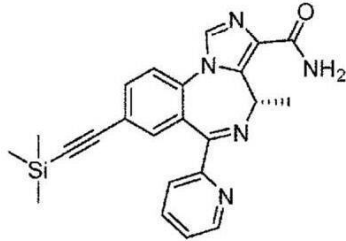
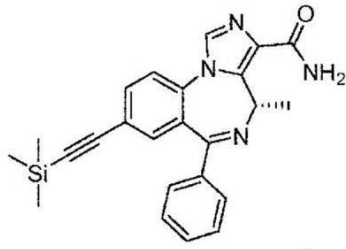
30



40

50

## 【化 1 2 a】



10

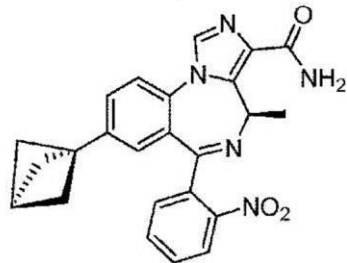
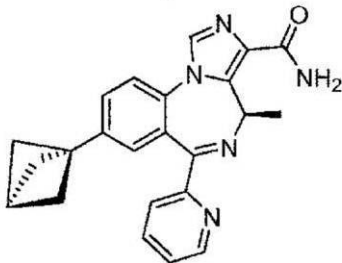
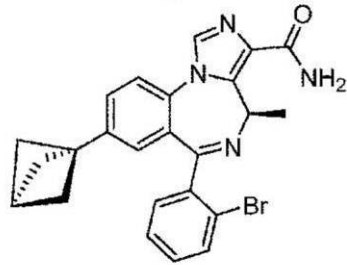
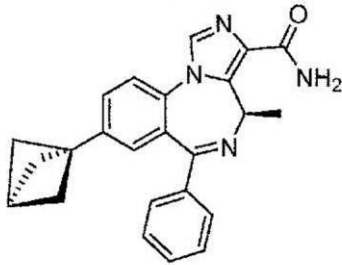
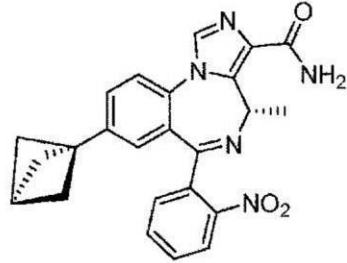
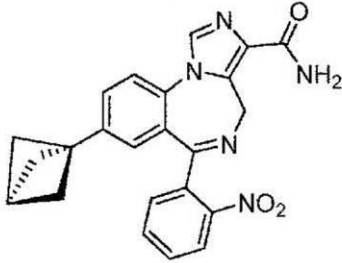
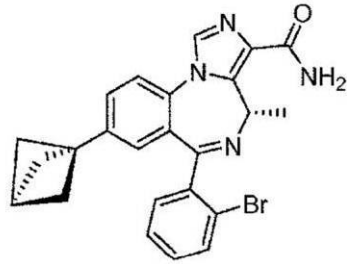
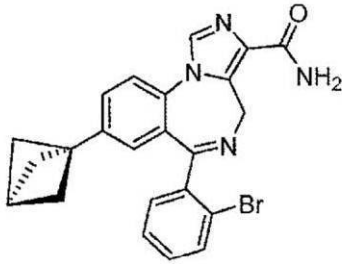
20

30

40

50

## 【化 1 3 a】



10

20

30

からなる群から選択される化合物、またはその薬学的に許容される塩。

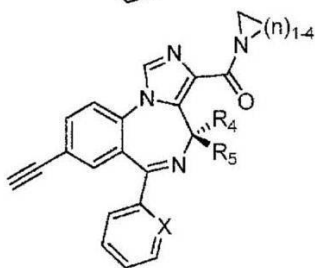
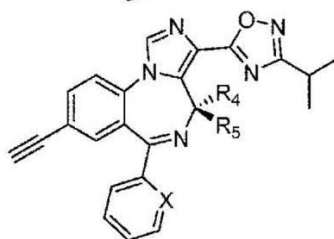
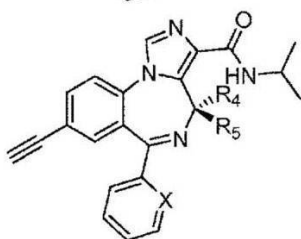
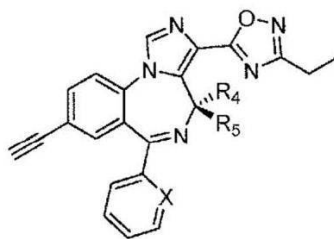
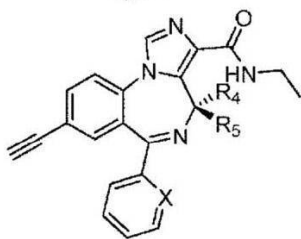
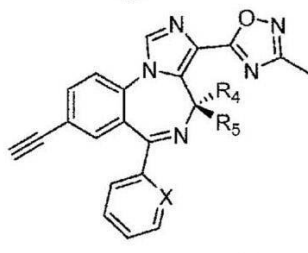
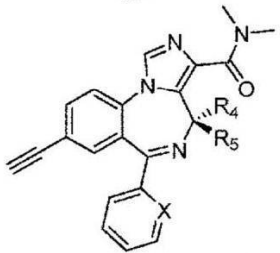
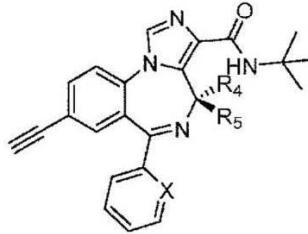
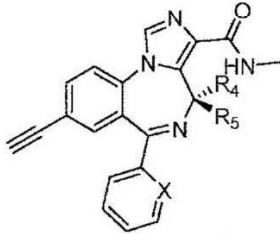
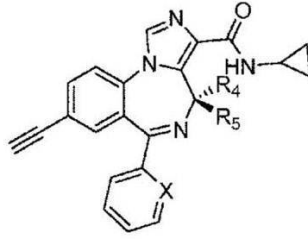
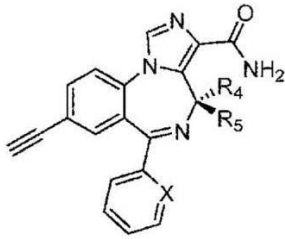
〔項 2 2〕

式：

40

50

## 【化 1 4 a】



10

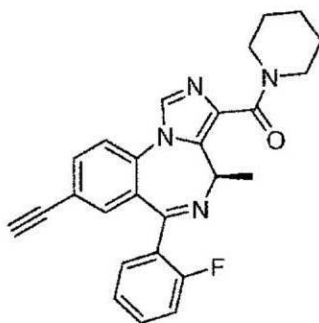
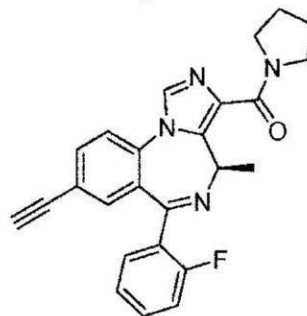
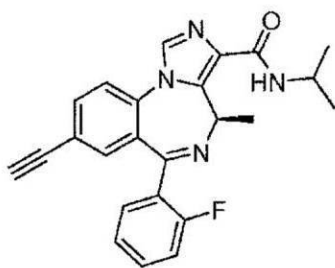
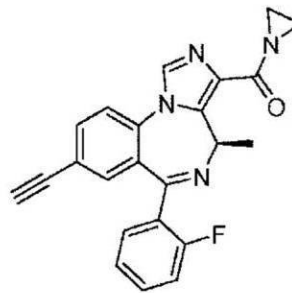
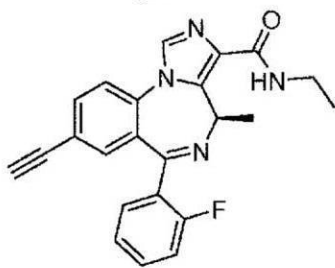
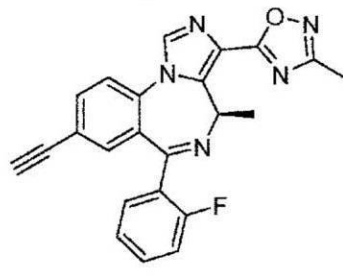
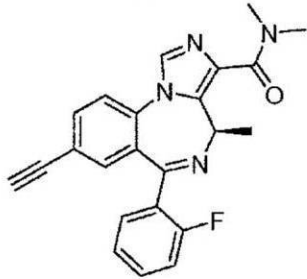
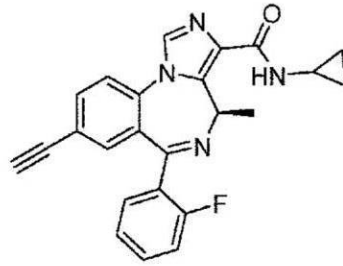
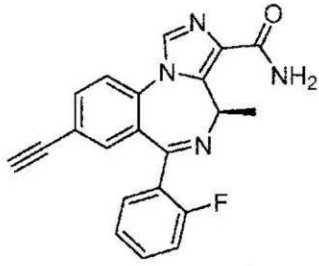
20

30

40

(式中、  
 XはCH、CF、CClまたはNであり；  
 R4はHまたはCH3であり；  
 R5はHまたはCH3である)  
 のいずれか1つに従う化合物、またはその薬学的に許容される塩。  
 [項23]

## 【化 1 5 a】



10

20

30

40

からなる群から選択される化合物、またはその薬学的に許容される塩。

〔項 2 4〕

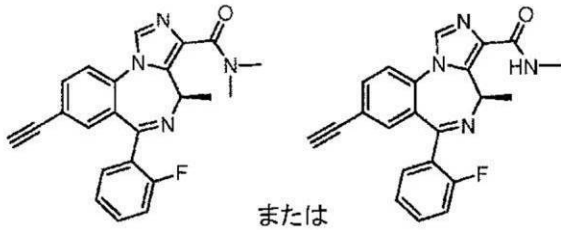
請求項 1 に記載の化合物および薬学的に許容される賦形剤を含む医薬組成物。

〔項 2 5〕

請求項 1 または請求項 2 に記載の化合物を、それを必要とする対象に投与することを含む、認知および / または気分症状の処置方法。

〔項 2 6〕

## 【化 16 a】



から選択される化合物、またはその薬学的に許容される塩を、それを必要とする対象に投与することを含む、認知症状の処置方法。 10

〔項 27〕

請求項 1 ~ 23 のいずれか一項に記載の化合物および薬学的に許容される賦形剤を含む医薬組成物。

〔項 28〕

請求項 1 ~ 23 のいずれか一項に記載の化合物または請求項 24 に記載の組成物を、それを必要とする対象に投与することを含む、認知および / または気分症状の処置方法。

〔項 29〕

前記認知および / または気分症状がうつ病および神経障害に起因する、請求項 25 または 26 に記載の方法。 20

〔項 30〕

前記神経障害が神経精神障害または神経変性障害である、請求項 29 に記載の方法。

〔項 31〕

前記神経精神障害が、大うつ病、双極性うつ病、または統合失調症である、請求項 30 に記載の方法。

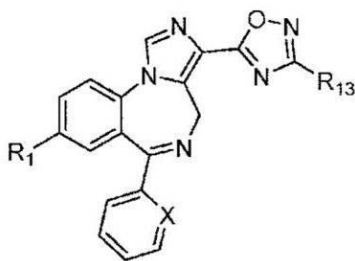
〔項 32〕

前記神経変性障害がアルツハイマー病である、請求項 30 に記載の方法。

〔項 33〕

式 (IV) :

## 【化 17 a】



(式中、 X は、N、C - H、C - F、C - Cl、C - Br、C - I および C - NO<sub>2</sub> からなる群から選択され； 40

R1 は、- Br、- C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、- シクロプロピルおよびピシクル [1.1.1] ペンタン

## 【化 18 a】

