

【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7月28日(2016.7.28)

【公表番号】特表2015-519402(P2015-519402A)

【公表日】平成27年7月9日(2015.7.9)

【年通号数】公開・登録公報2015-044

【出願番号】特願2015-517445(P2015-517445)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/14 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/14 C S P

C 0 7 D 403/14

C 0 7 D 471/04 1 1 3

A 6 1 K 31/497

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 25/22

A 6 1 K 31/517

【手続補正書】

【提出日】平成28年6月6日(2016.6.6)

【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

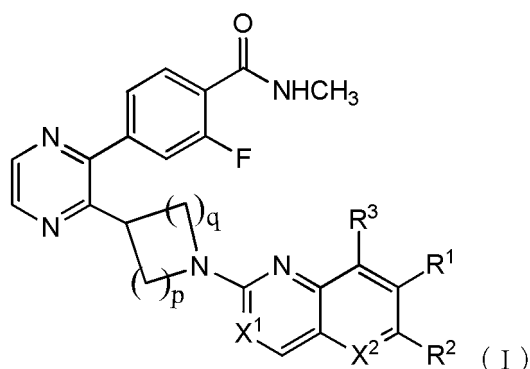
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物

【化 1】



またはその薬学的に許容される塩であって、式中、

X^1 は、N または CR^4 であり、

X^2 は、N または CR^5 であり、

ここで、 X^1 および X^2 の 0 ~ 1 つは、N であり、

p および q のそれぞれは、独立して、1 または 2 であり、ここで、 p および q の和は、2 または 4 であり、

各 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、および R^5 は、独立して、水素またはハロゲンである、化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

X^1 は N であり、 X^2 は CH 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 3】

X^1 は CH であり、 X^2 は N 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 4】

X^1 は CH であり、 X^2 は CH 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 5】

p および q の和は、4 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 6】

p および q の和は、2 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】

R^2 はフルオロである、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 8】

R^1 、 R^2 、および R^3 のうちの 1 つは、水素である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 9】

R^1 、 R^2 、および R^3 のうちの 2 つが、水素である、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 10】

R^1 、 R^2 、および R^3 は、水素である、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 11】

R^1 および R^2 のうちの 1 つが、フルオロである、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 12】

R^1 および R^2 のうちの 1 つが、クロロである、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 13】

R^1 は、フルオロまたはクロロである、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 14】

R^1 は水素であり、 R^2 はクロロまたはフルオロである、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

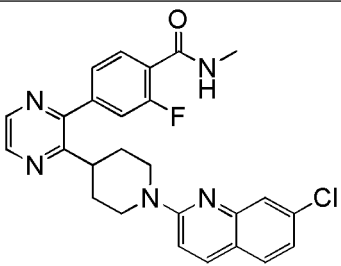
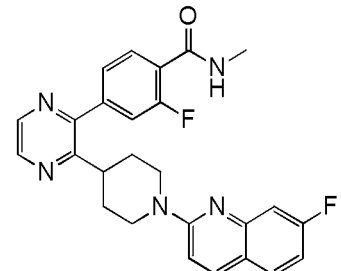
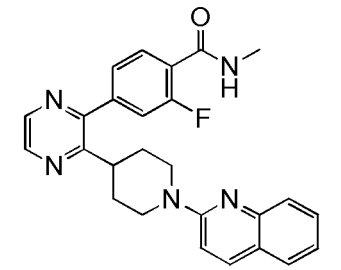
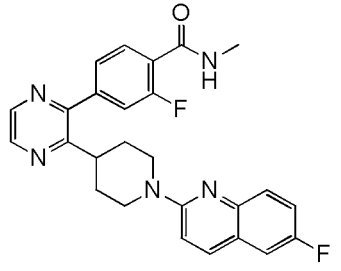
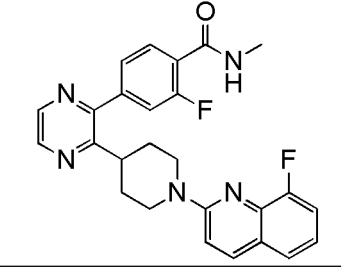
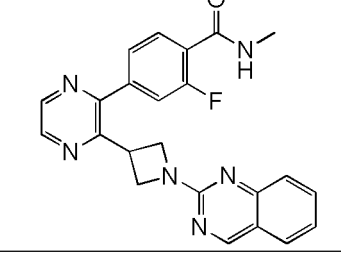
【請求項 15】

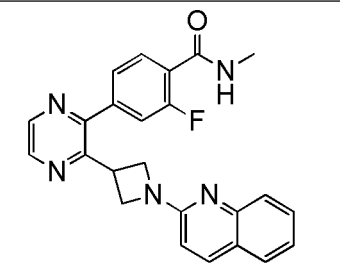
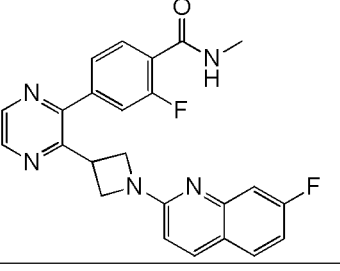
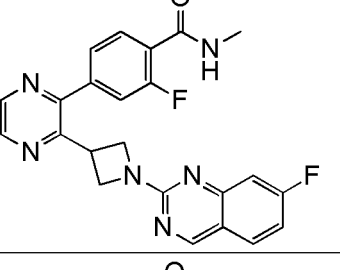
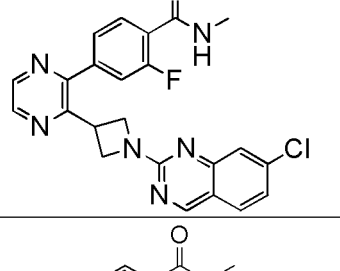
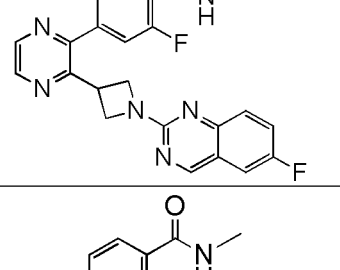
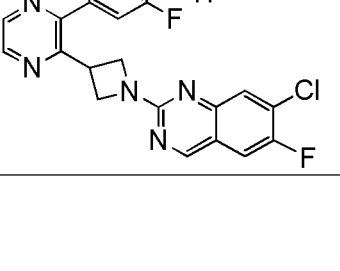
R^1 はクロロまたはフルオロであり、 R^2 は水素である、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

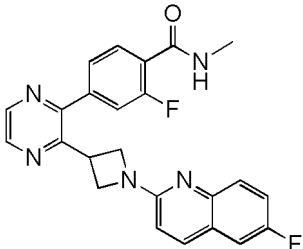
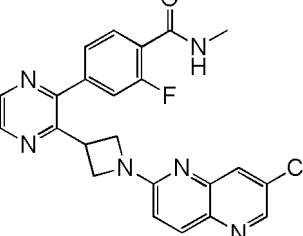
【請求項 16】

以下である、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：

【表 1】

実施例	構造
1	
2	
3	
4	
5	
6	

実施例	構造
7	
8	
9	
10	
11	
12	

実施例	構造
13	
14	

【請求項 17】

請求項 1 ～ 16 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される賦形剤とを含む、薬学的組成物。

【請求項 18】

PDE10 阻害剤により治療することができる認知障害を治療するための、請求項 17 に記載の薬学的組成物。

【請求項 19】

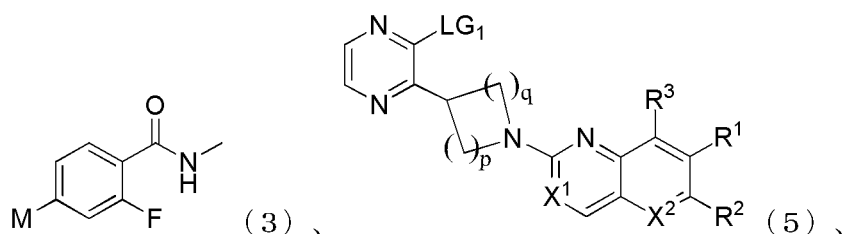
前記障害は、統合失調症、ハンチントン病、肥満、双極性障害、または強迫性障害である、請求項 18 に記載の薬学的組成物。

【請求項 20】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物を調製する方法であって、式 (I) の化合物を調製するために、

(a) 式 3 の化合物を、式 5 の化合物と反応させるステップであって、

【化 2】

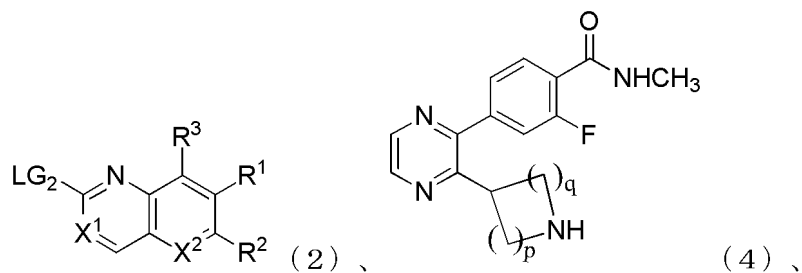


式中、 X^1 、 X^2 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 p 、および q は、式 (I) の化合物において定義される通りであり、式中、 LG_1 は、脱離基であり、 M は、金属部分であり、溶媒および触媒の存在下である、ステップ、

または

(b) 式 2 の化合物を、式 4 の化合物と反応させるステップであって、

【化 3】



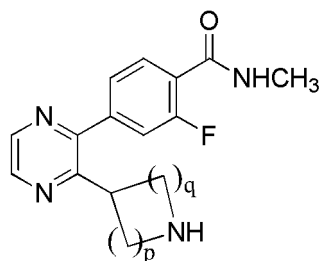
式中、 X^1 、 X^2 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 p 、および q は、式(I)の化合物において

定義される通りであり、 LG_2 は脱離基であり、溶媒および塩基の存在下である、ステップを含む、方法。

【請求項 2 1】

式

【化 4】



(4)の化合物、またはその薬学的に許容される塩であって、式中、 p および q のそれぞれは、独立して、1または2であり、 p および q の和は、2または4である、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 2 2】

p および q の和は、4である、請求項 2 1に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

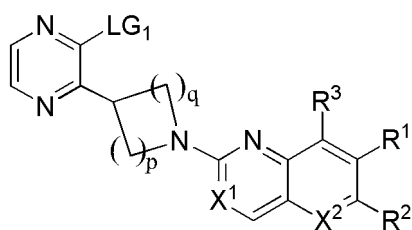
【請求項 2 3】

p および q の和は、2である、請求項 2 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 2 4】

式

【化 5】



(5)の化合物、またはその薬学的に許容される塩であって、
式中、

X^1 は、Nまたは CR^4 であり、

X^2 は、Nまたは CR^5 であり、

ここで、 X^1 および X^2 の0~1つは、Nであり、

p および q のそれぞれは、独立して、1または2であり、ここで、 p および q の和は、2または4であり、

各 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、および R^5 は、独立して、水素またはハロゲンであり、 LG_1 は脱離基である、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 25】

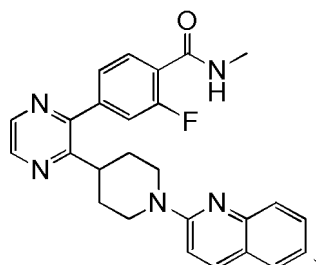
p および q の和は、4 である、請求項 24 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 26】

p および q の和は、2 である、請求項 24 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 27】

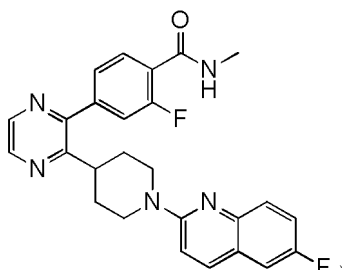
【化 6】



である、化合物、
またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 28】

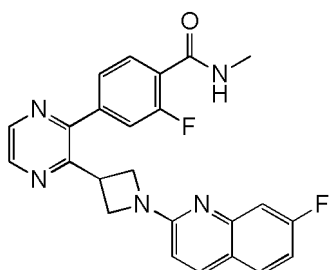
【化 7】



である、化合物、
またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 29】

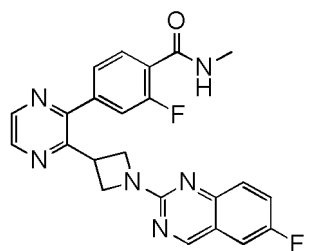
【化 8】



である、化合物、
またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 30】

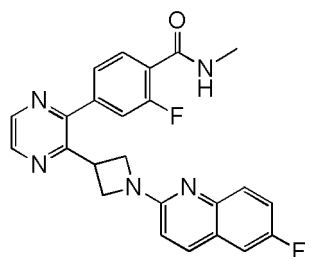
【化 9】



である、化合物、
またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 3 1】

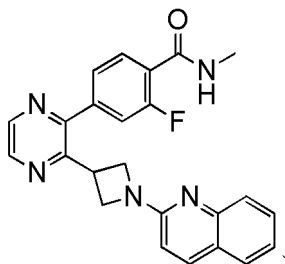
【化 1 0】



である、化合物、
またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 3 2】

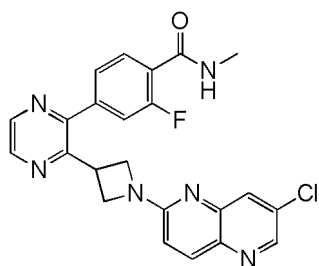
【化 1 1】



である、化合物、
またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 3 3】

【化 1 2】



である、化合物、
またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 3 4】

請求項 2 7 ~ 3 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される賦形剤と、を含む、薬学的組成物。

【請求項 3 5】

P D E 1 0 阻害剤により治療することができる認知障害を治療するための、請求項 3 4 に記載の薬学的組成物であって、前記障害は、統合失調症、ハンチントン病、肥満、双極性障害、または強迫性障害である、薬学的組成物。

【請求項 3 6】

前記状態は、統合失調症であり、前記阻害剤は好適な統合失調症薬と組み合わせられる、請求項 1 9 に記載の薬学的組成物。

【請求項 3 7】

前記状態は、統合失調症であり、前記阻害剤は好適な統合失調症薬と組み合わせられる、請求項 3 5 に記載の薬学的組成物。