

【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8月12日(2022.8.12)

【国際公開番号】WO2020/033359  
 【公表番号】特表2021-534099(P2021-534099A)  
 【公表日】令和3年12月9日(2021.12.9)  
 【出願番号】特願2021-506624(P2021-506624)  
 【国際特許分類】

C 0 7 D 2 3 5 / 1 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 ) 10  
 A 6 1 P 2 5 / 2 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 2 1 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 2 5 / 1 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 2 5 / 1 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 2 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 2 5 / 0 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 C 0 7 D 4 0 1 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 K 3 1 / 4 1 8 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 K 3 1 / 4 3 7 ( 2 0 0 6 . 0 1 ) 20  
 A 6 1 P 4 3 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

【 F I 】

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

【 手続補正書 】

【 提出日 】 令和4年8月3日(2022.8.3)

【 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

40

【 補正方法 】 変更

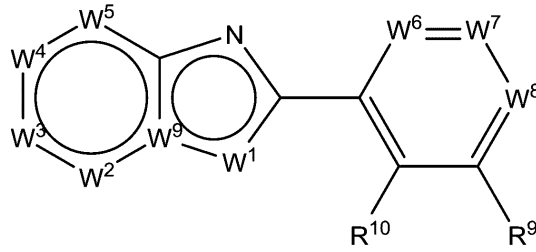
【 補正の内容 】

【 特許請求の範囲 】

【 請求項 1 】

式 ( I I I ) :

## 【化1】



III

10

の化合物を含む、神経変性疾患治療用、又は老齢化に関連する認知障害及び神経炎症の治療用医薬組成物であって、

上記式中、

$W_1$  は、O、S、及びN  $R_1$  から選択されるか、又は、 $W_9$  がNである場合に  $W_1$  はさらにC  $R_{50}$  であってよく；

$W_2$  はN又はC  $R_2$  であり；

$W_3$  はN又はC  $R_3$  であり；

$W_4$  はN又はC  $R_4$  であり；

$W_5$  はN又はC  $R_5$  であり；

$W_6$  はN又はC  $R_6$  であり；

$W_7$  はN又はC  $R_7$  であり；

$W_8$  はN又はC  $R_8$  であり；

$W_9$  はCであるか、又は、 $W_1$  がC  $R_{50}$  である場合に  $W_9$  はNであってよく；

上記式中、

$R_1$  は、H、(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル、 $CH_2OC(=O)R_{30}$ 、 $CH_2OP(=O)OR_{40}$ 、 $OR_{41}$ 、 $C(=O)OR_{42}$ 、及び  $C(=O)R_{43}$  から選択され；

上記式中、

$R_{30}$  は、(C<sub>1</sub>—C<sub>10</sub>)ヒドロカルビル、アミノで置換された(C<sub>1</sub>—C<sub>10</sub>)ヒドロカルビル、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニルで置換された(C<sub>1</sub>—C<sub>10</sub>)ヒドロカルビル、カルボキシルで置換された(C<sub>1</sub>—C<sub>10</sub>)ヒドロカルビル、カルボキシ、(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル、(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニルアミノ、メチルチオ、ヘテロシクリル、(C<sub>1</sub>—C<sub>10</sub>)オキサアルキル、 $CHR_{44}NHR_{45}$ 、及びグアニジノから選択され；

上記式中、

$R_{44}$  は任意の天然に存在するアミノ酸側鎖から選択され；

$R_{45}$  はH、メチル、及び(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニルから選択され；

$R_{40}$  及び  $R_{41}$  は、水素及び(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)ヒドロカルビルから独立に選択され；

$R_{42}$  は(C<sub>1</sub>—C<sub>5</sub>)アルキルであり；

$R_{43}$  は(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキルであり；

$R_{50}$  は、H又は(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキルであり；

$R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$  及び  $R_5$  は、水素、重水素、ハロゲン、ペルフルオロ(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルコキシ、ペルフルオロ(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アシル、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルキル、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニルアミノ[ $HNC(=O)O$ アルキル]、カルボキサミド[ $C(=O)NH_2$ ]、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルキルアミノカルボニル[ $C(=O)NH$ アルキル]、シアノ、アセトキシ、ニトロ、アミノ、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルキルアミノ、メルカプト、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルキルチオ、アミノスルホニル、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルキルスルホニル、及び(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アシルアミノから独立に

20

30

40

50

選択され；

R<sub>6</sub>及びR<sub>10</sub>は、水素、重水素、ハロ、(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル、ペルフルオロ(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルコキシ、ペルフルオロ(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルコキシ、及びアミノから独立に選択され；

R<sub>7</sub>及びR<sub>9</sub>は、水素、重水素、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、ハロゲン、ハロ(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルコキシ、及びハロ(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルコキシから独立に選択され；

R<sub>8</sub>は、水素、重水素、ハロゲン、ハロ(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルコキシ、シアノ、フェニル、フェノキシ、ベンジルオキシ、及びアミノから選択され；

10

ただし、R<sub>8</sub>は、

(a) W<sub>1</sub>がN R<sub>1</sub>であり；

(b) R<sub>1</sub>が水素であり；

(c) W<sub>2</sub>、W<sub>3</sub>、W<sub>4</sub>、W<sub>5</sub>、W<sub>6</sub>、及びW<sub>7</sub>がC Hであり；

(d) W<sub>8</sub>がC R<sub>8</sub>であり；

(e) W<sub>9</sub>がCであり；かつ

(f) R<sub>9</sub>及びR<sub>10</sub>が水素である

場合に、水素又は(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルキルでない、医薬組成物。

【請求項2】

前記神経変性疾患は、筋萎縮性側索硬化症(A L S)、アルツハイマー病、パーキンソン病、ハンチントン舞踏病、前頭側頭型変性症、レビー小体型認知症、運動ニューロン疾患、及び脱髄疾患からなる群から選択される、請求項1に記載の医薬組成物。

20

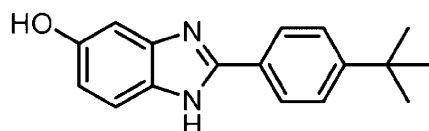
【請求項3】

老齢化に関連する認知障害及び神経炎症の治療用である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項4】

前記式(I I I)の化合物が下記式：

【化2】



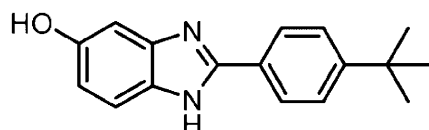
30

の化合物である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項5】

薬学的に許容可能な担体、及び下記式：

【化3】



40

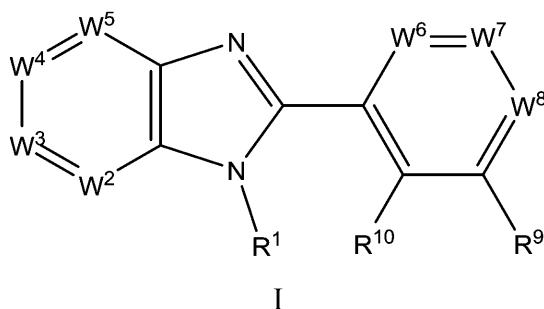
の化合物又は薬学的に許容可能な塩を含む、医薬組成物。

【請求項6】

式(I)：

50

## 【化 4】



10

の化合物であって、上記式中、

W<sub>2</sub> は N 又は C R<sub>2</sub> であり；

W<sub>3</sub> は N 又は C R<sub>3</sub> であり；

W<sub>4</sub> は N 又は C R<sub>4</sub> であり；

W<sub>5</sub> は N 又は C R<sub>5</sub> であり；

W<sub>6</sub> は N 又は C R<sub>6</sub> であり；

W<sub>7</sub> は N 又は C R<sub>7</sub> であり；

W<sub>8</sub> は N 又は C R<sub>8</sub> であり；

上記式中、

R<sub>1</sub> は、CH<sub>2</sub>OC(=O)R<sub>30</sub>、CH<sub>2</sub>OP(=O)OR<sub>40</sub>OR<sub>41</sub>、C(=O)OR<sub>42</sub>、及び C(=O)R<sub>43</sub> から選択され；

20

上記式中、

R<sub>30</sub> は、(C<sub>1</sub> C<sub>10</sub>) ヒドロカルビル、アミノで置換された (C<sub>1</sub> C<sub>10</sub>) ヒドロカルビル、(C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルコシカルボニルで置換された (C<sub>1</sub> C<sub>10</sub>) ヒドロカルビル、カルボキシルで置換された (C<sub>1</sub> C<sub>10</sub>) ヒドロカルビル、カルボキシ、(C<sub>1</sub> C<sub>6</sub>) アルコシカルボニル、(C<sub>1</sub> C<sub>6</sub>) アルコシカルボニルアミノ、メチルチオ、ヘテロシクリル、(C<sub>1</sub> C<sub>10</sub>) オキサアルキル、CHR<sub>44</sub>NHR<sub>45</sub>、及びゲアニジノから選択され；

上記式中、

R<sub>44</sub> は任意の天然に存在するアミノ酸側鎖から選択され；

30

R<sub>45</sub> は H、メチル、及び (C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルコシカルボニルから選択され；

R<sub>40</sub> 及び R<sub>41</sub> は、水素及び (C<sub>1</sub> C<sub>6</sub>) ヒドロカルビルから独立に選択され；

R<sub>42</sub> は (C<sub>1</sub> C<sub>5</sub>) アルキルであり；

R<sub>43</sub> は (C<sub>1</sub> C<sub>3</sub>) アルキルであり；

R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> 及び R<sub>5</sub> は、水素、重水素、ハロゲン、ペルフルオロ (C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルコキシ、ペルフルオロ (C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アシル、(C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルキル、ヒドロキシ (C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルキル、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルコシカルボニルアミノ [ HNC(=O)O アルキル ]、カルボキサミド [ C(=O)NH<sub>2</sub> ]、(C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルキルアミノカルボニル [ C(=O)NH アルキル ]、シアノ、アセトキシ、ニトロ、アミノ、(C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルキルアミノ、ジ (C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルキルアミノ、メルカプト、(C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルキルチオ、アミノスルホニル、(C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルキルスルホニル、及び (C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アシルアミノから独立に選択され；

40

R<sub>6</sub> 及び R<sub>10</sub> は、水素、重水素、ハロ、(C<sub>1</sub> C<sub>3</sub>) アルキル、ペルフルオロ (C<sub>1</sub> C<sub>3</sub>) アルキル、ヒドロキシ、(C<sub>1</sub> C<sub>3</sub>) アルコキシ、ペルフルオロ (C<sub>1</sub> C<sub>3</sub>) アルコキシ、及びアミノから独立に選択され；

R<sub>7</sub> 及び R<sub>9</sub> は、水素、重水素、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、ハロゲン、ハロ (C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルコキシ、及びハロ (C<sub>1</sub> C<sub>4</sub>) アルコキシから独立に選択され；

50

R<sup>8</sup>は、水素、重水素、ハロゲン、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、シアノ、フェニル、フェノキシ、ベンジルオキシ、及びアミノから選択される、化合物。

【請求項7】

W<sup>6</sup>はC - Hであり；W<sup>8</sup>はC - R<sup>8</sup>であり；

R<sup>9</sup>及びR<sup>10</sup>は水素であり；

R<sup>7</sup>はH又は(C<sub>3</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルであり；かつ

R<sup>8</sup>は、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、アミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、及びヒドロキシから選択される、請求項6に記載の化合物。

【請求項8】

W<sup>2</sup>及びW<sup>5</sup>はそれぞれC - R<sup>2</sup>及びC - R<sup>5</sup>であり；

R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、及びR<sup>5</sup>は、H、ハロ、及びペルフルオロ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキルから独立に選択され；

かつ

R<sup>1</sup>は -CH<sub>2</sub>OP(=O)OR<sup>40</sup>OR<sup>41</sup>である、請求項7に記載の化合物。

【請求項9】

W<sup>2</sup>及びW<sup>5</sup>はそれぞれC - R<sup>2</sup>及びC - R<sup>5</sup>であり；

R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、及びR<sup>5</sup>は、H、ハロ、及びペルフルオロ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキルから独立に選択され；

R<sup>1</sup>は -CH<sub>2</sub>OC(=O)R<sup>30</sup>であり；かつ

R<sup>30</sup>は、

(a) (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル；

(b) (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルアミノで置換されたフェニル；

(c) 天然アミノ酸のデスカルボキシ残基；

(d) カルボキシルで置換された(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)ヒドロカルビル；

(e) (C<sub>1</sub> - C<sub>5</sub>)オキサアルキル；及び

(d)ピリジル

から選択される、請求項7に記載の化合物。

【請求項10】

R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>のうちの一つがペルフルオロ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、ペルフルオロ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、アミノ、ヒドロキシ、ニトリル、ハロ又はカルボキサミドであり、かつ残りは水素である、請求項6に記載の化合物。

【請求項11】

W<sup>2</sup>、W<sup>3</sup>、W<sup>4</sup>、W<sup>5</sup>、W<sup>6</sup>、及びW<sup>7</sup>はC - Hである、請求項6に記載の化合物。

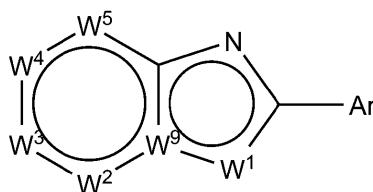
【請求項12】

R<sup>8</sup>はt - ブチルである、請求項6~11のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項13】

式(II)：

【化5】



II

の化合物であって、上記式中、

Arは

10

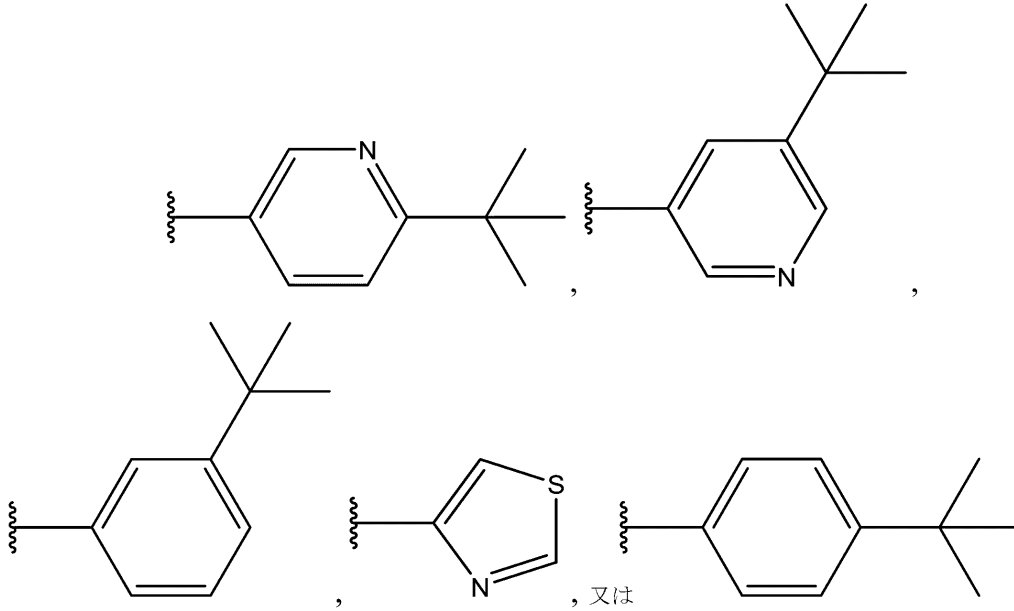
20

30

40

50

## 【化6】



10

であり；

W<sup>1</sup>は、O、S、及びN、R<sup>1</sup>から選択されるか、又は、W<sup>9</sup>がNである場合にW<sup>1</sup>はさ  
らにC、R<sup>50</sup>であってよく；

W<sup>2</sup>はN又はC、R<sup>2</sup>であり；

W<sup>3</sup>はN又はC、R<sup>3</sup>であり；

W<sup>4</sup>はN又はC、R<sup>4</sup>であり；

W<sup>5</sup>はN又はC、R<sup>5</sup>であり；

W<sup>9</sup>はCであるか、又は、W<sup>1</sup>がC、R<sup>50</sup>である場合にW<sup>9</sup>はNであってよく；

上記式中、

R<sup>1</sup>は、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキル、CH<sub>2</sub>OC(=O)R<sup>30</sup>、-CH<sub>2</sub>OP(=O)OR<sup>40</sup>OR<sup>41</sup>、C(=O)OR<sup>42</sup>、及びC(=O)R<sup>43</sup>から選択され  
；

30

上記式中、

R<sup>30</sup>は、(C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)ヒドロカルビル、アミノで置換された(C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)  
ヒドロカルビル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコシカルボニルで置換された(C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)ヒ  
ドロカルビル、カルボキシルで置換された(C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)ヒドロカルビル、カルボキシ  
、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコシカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコシカルボニルアミノ、  
メチルチオ、ヘテロシクリル、(C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)オキサアルキル、CHR<sup>44</sup>NHR<sup>45</sup>  
、及びグアニジノから選択され；

上記式中、

R<sup>44</sup>は任意の天然に存在するアミノ酸側鎖から選択され；

R<sup>45</sup>はH、メチル、及び(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコシカルボニルから選択され；

40

R<sup>40</sup>及びR<sup>41</sup>は、水素及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)ヒドロカルビルから独立に選択され；

R<sup>42</sup>は(C<sub>1</sub> - C<sub>5</sub>)アルキルであり；

R<sup>43</sup>は(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキルであり；

R<sup>50</sup>は、H又は(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキルであり；

R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は、水素、重水素、ハロゲン、ペルフルオロ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)  
アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、ペルフルオロ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)  
アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アシル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ア  
ルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)  
アルコシカルボニルアミノ[ HNC(=O)Oアルキル ]、カルボキサミド[ C  
(=O)NH<sub>2</sub> ]、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルアミノカルボニル[ (C(=O)NHアル  
キル ]、

50

ルキル]、シアノ、アセトキシ、ニトロ、アミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルアミノ、メルカプト、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルチオ、アミノスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルスルホニル、及び(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アシルアミノから独立に選択され；

ただし、Arは、

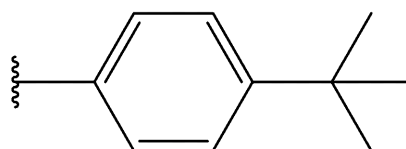
W<sup>9</sup>がCであり；

W<sup>1</sup>がN - R<sup>1</sup>であり；かつ

R<sup>1</sup>がHでも(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキルでもない

という場合に限り、

【化7】



を含む、化合物。

【請求項14】

W<sup>2</sup>及びW<sup>5</sup>はそれぞれC - R<sup>2</sup>及びC - R<sup>5</sup>であり；かつ

R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、及びR<sup>5</sup>は、H、重水素、ハロ、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルコキシ、ペルフルオロ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルコキシ、ニトリル、アミノ、ヒドロキシル、アミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキル、及びペルフルオロ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキルから独立に選択される、請求項13に記載の化合物。

【請求項15】

R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>のうちの一つがペルフルオロ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、ペルフルオロ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、アミノ、ヒドロキシ、ニトリル、ハロ又はカルボキサミドであり、かつ残りは水素である、請求項13に記載の化合物。

【請求項16】

W<sup>3</sup>又はW<sup>4</sup>のうち一方はNであり、他方はW<sup>2</sup>及びW<sup>5</sup>とともにC - Hである、請求項13に記載の化合物。

【請求項17】

W<sup>2</sup>、W<sup>3</sup>、W<sup>4</sup>、及びW<sup>5</sup>はC - Hである、請求項13に記載の化合物。

【請求項18】

薬学的に許容可能な担体と、請求項6～17のいずれか1項に記載の化合物とを含む医薬組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0022

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0022】

第5の態様では、本発明は、特に患者の老齢化に関連する認知障害及び神経炎症の治療のための、内科的治療における方法及び式I、II、若しくはIIIの上記化合物、又は、式I、II、若しくはIIIの化合物を含んでいる医薬組成物の使用に関する。上記方法は、本明細書中に記載された治療上有効な量の化合物又は医薬組成物を患者に投与することを含む。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0060

【補正方法】変更

10

20

30

40

50

## 【補正の内容】

## 【0060】

非経口投与のための調合物には、酸化防止剤、緩衝剤、静菌剤、及び意図される被投与者の血液と等張な調合物を提供する溶質を含有しうる、水性及び非水性の滅菌注射用溶液が挙げられる。非経口投与のための調合物には、懸濁化剤及び増粘剤を含有しうる、水性及び非水性の滅菌懸濁液も挙げられる。該調合物は、単位用量又は多回投与用量の容器で、例えば密封されたアンプル及びバイアルで提供されてもよく、かつ、使用直前に滅菌液体担体、例えば生理食塩水、リン酸緩衝生理食塩水（PBS）などの追加のみを要するフリーズドライ（凍結乾燥）の状態でもよい。臨時の注射用溶液及び懸濁液が、前述した種類の無菌の散剤、顆粒剤及び錠剤から調製されてもよい。

10

20

30

40

50