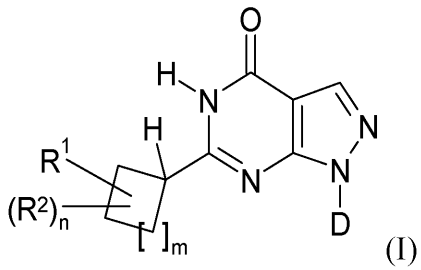
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成26年9月25日(2014.9.25)

【公表番号】特表2013-533302(P2013-533302A)
【公表日】平成25年8月22日(2013.8.22)
【年通号数】公開・登録公報2013-045
【出願番号】特願2013-523596(P2013-523596)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 487/04　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/519　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 45/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/28　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/16　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 21/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/14　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/02　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 31/18　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/08　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/18　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/20　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/06　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 15/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/00　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 487/04　１４３
Ｃ０７Ｄ 487/04　ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ 31/519
Ａ６１Ｐ 43/00　１１１
Ａ６１Ｋ 45/00
Ａ６１Ｐ 25/28
Ａ６１Ｐ 25/00
Ａ６１Ｐ 25/16
Ａ６１Ｐ 21/00
Ａ６１Ｐ 25/14
Ａ６１Ｐ 27/02
Ａ６１Ｐ 31/18
Ａ６１Ｐ 25/08
Ａ６１Ｐ 25/18
Ａ６１Ｐ 25/20
Ａ６１Ｐ 3/04
Ａ６１Ｐ 3/10
Ａ６１Ｐ 3/06

Ａ６１Ｐ　15/00
Ａ６１Ｐ　 1/00
Ａ６１Ｐ　 9/00
Ａ６１Ｐ　11/00
Ａ６１Ｐ　 3/00

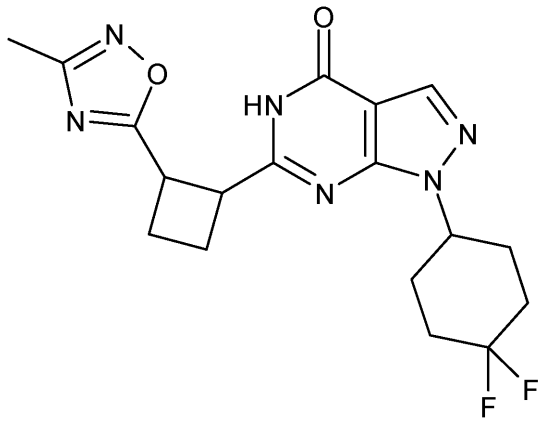
【手続補正書】
【提出日】平成26年8月8日(2014.8.8)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
式（Ｉ）：
【化５９】



(I)

［式中、
R^1は、５又は６員ヘテロアリール基（ここで、環原子の１、２、３又は４個が、Ｎ、Ｏ又はＳより互いに独立に選択されるヘテロ原子である）であり、
ここで、該５又は６員ヘテロアリール基は、場合により、１、２、３又は４個の置換基で置換され得、ここで、該置換基は、フッ素、塩素、臭素、ＨＯ－、ＮＣ－、F_3C－、HF_2C－、FH_2C－、メチル、H_2N－及び$(CH_3)_2N$－からなる群より互いに独立に選択され得；
R^2は、フッ素、ＮＣ－、F_3C－、HF_2C－、FH_2C－及びメチルからなる群より選択され；
Ｄは、シクロペンチル、シクロヘキシル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、２－、３－及び４－ピリジルからなる群より選択され、
ここで、シクロペンチル及びシクロヘキシルは、場合により、１又は２個の置換基で置換され得、ここで、該置換基は、フッ素、ＮＣ－、F_3C－、HF_2C－及びFH_2C－からなる群より互いに独立に選択され得；
ここで、テトラヒドロフラニル及びテトラヒドロピラニルは、場合により、１又は２個の置換基で置換され得、ここで、該置換基は、フッ素、ＮＣ－、F_3C－、HF_2C－及びFH_2C－からなる群より互いに独立に選択され得；
ここで、ピリジルは、場合により、１、２、３又は４個の置換基で置換され得、ここで、該置換基は、フッ素、塩素、臭素、ＮＣ－、F_3C－、HF_2C－、FH_2C－、F_3C-CH_2－、C_{1-6}－アルキル－及びC_{3-7}－シクロアルキルからなる群より互いに独立に選択され得；
ｍは、１又は２より選択され；
ｎは、０、１又は２より選択され、
ここで、ｎ＝２の場合、これら２個の基R^2は、互いに独立に選択される］で示さ

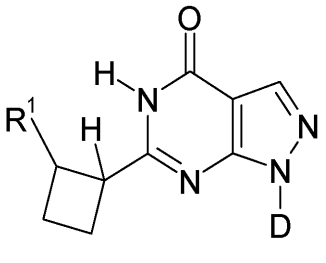
れる化合物又はその塩、
但し、該化合物は、任意の可能な立体異性体の形態又はそのすべてのもしくは一部の混合物における、下記：
【化６０】



で示されるものではない。
【請求項２】
R^1が、５又は６員ヘテロアリール基（ここで、環原子の１、２、３又は４個は、Ｎ、Ｏ又はＳより互いに独立に選択されるヘテロ原子である）であり、
ここで、該５又は６員ヘテロアリール基は、場合により、１、２、３又は４個の置換基で置換され得、ここで、該置換基は、フッ素、塩素、臭素、ＮＣ－、F_3C－、HF_2C－、FH_2C－、メチル、H_2N－及び$(CH_3)_2N$－からなる群より互いに独立に選択され得；
R^2が、フッ素、ＮＣ－、F_3C－、HF_2C－、FH_2C－及びメチルからなる群より選択され；
Ｄが、シクロペンチル、シクロヘキシル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、２－、３－及び４－ピリジルからなる群より選択され、
ここで、シクロペンチル及びシクロヘキシルは、場合により、１又は２個の置換基で置換され得、ここで、該置換基は、フッ素、F_3C－、HF_2C－及びFH_2C－からなる群より互いに独立に選択され得；
ここで、テトラヒドロフラニル及びテトラヒドロピラニルは、場合により、１又は２個の置換基で置換され得、ここで、該置換基は、フッ素、F_3C－、HF_2C－及びFH_2C－からなる群より互いに独立に選択され得；
ここで、ピリジルは、場合により、１、２、３又は４個の置換基で置換され得、ここで、該置換基は、フッ素、塩素、臭素、ＮＣ－、F_3C－、HF_2C－、FH_2C－、F_3C－CH_2－、C_{1-6}－アルキル－及びC_{3-7}－シクロアルキルからなる群より互いに独立に選択され得；
ｍが、１又は２より選択され；
ｎが、０、１又は２より選択され、
ここで、ｎ＝２の場合、これら２個の基R^2は、互いに独立に選択される、
請求項１記載の化合物。
【請求項３】
R^1が、チアジアゾリル、オキサジアゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、オキサゾリル、ピリジル及びピリミジニルからなる群より選択されるヘテロアリール基であり、
ここで、該ヘテロアリール基は、場合により、１、２、３又は４個の置換基で置換され得、ここで、該置換基は、フッ素、塩素、臭素、ＮＣ－、F_3C－、HF_2C－、FH_2C－、メチル、H_2N－及び$(CH_3)_2N$－からなる群より互いに独立に選択され得る、

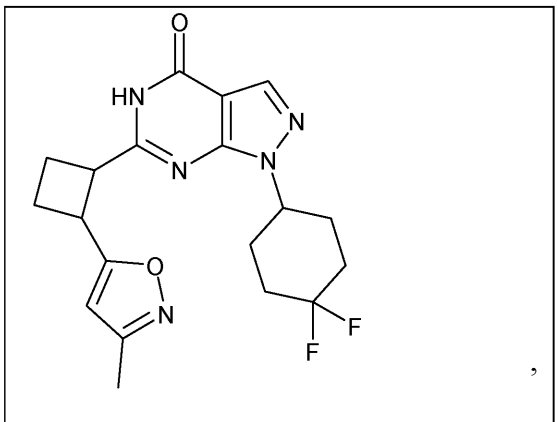
請求項２記載の化合物。
【請求項４】
Ｒ^{1}が、チアジアゾリル、１，２，３－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，５－オキサジアゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、オキサゾリル、ピリジル及びピリミジニルからなる群より選択される、ヘテロアリール基であり、
ここで、該ヘテロアリール基は、場合により、１、２、３又は４個の置換基で置換され得、ここで、該置換基は、フッ素、塩素、臭素、ＮＣ－、Ｆ$_{3}$Ｃ－、ＨＦ$_{2}$Ｃ－、ＦＨ$_{2}$Ｃ－、メチル、Ｈ$_{2}$Ｎ－及び（ＣＨ$_{3}$）$_{2}$Ｎ－からなる群より互いに独立に選択され得；
Ｒ^{2}が、フッ素、ＮＣ－、Ｆ$_{3}$Ｃ－、ＨＦ$_{2}$Ｃ－、ＦＨ$_{2}$Ｃ－及びメチルからなる群より選択され；
Ｄが、シクロペンチル、シクロヘキシル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、２－、３－及び４－ピリジルからなる群より選択され、
ここで、シクロペンチル及びシクロヘキシルは、場合により、１又は２個の置換基で置換され得、ここで、該置換基は、フッ素、Ｆ$_{3}$Ｃ－、ＨＦ$_{2}$Ｃ－及びＦＨ$_{2}$Ｃ－からなる群より互いに独立に選択され得；
ここで、テトラヒドロフラニル及びテトラヒドロピラニルは、場合により、１又は２個の置換基で置換され得、ここで、該置換基は、フッ素、Ｆ$_{3}$Ｃ－、ＨＦ$_{2}$Ｃ－及びＦＨ$_{2}$Ｃ－からなる群より互いに独立に選択され得；
ここで、ピリジルは、場合により、１、２、３又は４個の置換基で置換され得、ここで、該置換基は、フッ素、塩素、臭素、ＮＣ－、Ｆ$_{3}$Ｃ－、ＨＦ$_{2}$Ｃ－、ＦＨ$_{2}$Ｃ－、Ｆ$_{3}$Ｃ－ＣＨ$_{2}$－、Ｃ$_{1-6}$－アルキル－及びＣ$_{3-7}$－シクロアルキルからなる群より互いに独立に選択され得；
ｍが、１又は２より選択され；
ｎが、０、１又は２より選択され、
ここで、ｎ＝２の場合、これら２個の基Ｒ^{2}は、互いに独立に選択される、
請求項１記載の化合物。
【請求項５】
Ｒ^{1}が、オキサジアゾリル（非置換又は置換されているのどちらでもない）ではない、請求項１～４のいずれかに記載の化合物。
【請求項６】
Ｒ^{1}が、［１，３，４］チアジアゾール－２－イル、イソオキサゾール－５－イル、チアゾール－５－イル－、オキサゾール－２－イル、ピリジン－２－イル及びピリミジン－２－イルからなる群より選択されるヘテロアリール基であり、
ここで、該ヘテロアリール基は、場合により、１又は２個の置換基で置換され得、ここで、該置換基は、フッ素、塩素、臭素、ＣＮ－、メチル及びＨ$_{2}$Ｎ－からなる群より互いに独立に選択され得；
Ｒ^{2}が、フッ素、ＮＣ－、Ｆ$_{3}$Ｃ－、ＨＦ$_{2}$Ｃ－、ＦＨ$_{2}$Ｃ－及びメチルからなる群より選択され；
Ｄが、シクロペンチル、シクロヘキシル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、２－、３－及び４－ピリジルからなる群より選択され、
ここで、シクロペンチル及びシクロヘキシルは、場合により、１又は２個の置換基で置換され得、ここで、該置換基は、フッ素、Ｆ$_{3}$Ｃ－、ＨＦ$_{2}$Ｃ－及びＦＨ$_{2}$Ｃ－からなる群より互いに独立に選択され得；
ここで、テトラヒドロフラニル及びテトラヒドロピラニルは、場合により、１又は２個の置換基で置換され得、ここで、該置換基は、フッ素、Ｆ$_{3}$Ｃ－、ＨＦ$_{2}$Ｃ－及びＦＨ$_{2}$Ｃ－　からなる群より互いに独立に選択され得；
ここで、ピリジルは、場合により、１、２、３又は４個の置換基で置換され得、ここで、該置換基は、フッ素、塩素、臭素、ＮＣ－、Ｆ$_{3}$Ｃ－、ＨＦ$_{2}$Ｃ－、ＦＨ$_{2}$Ｃ－、Ｆ$_{3}$Ｃ－ＣＨ$_{2}$－及びメチルからなる群より互いに独立に選択され得；

ｍが、１又は２より選択され；
ｎが、０、１又は２より選択され、
ここで、ｎ＝２の場合、これら２個の基Ｒ^{2}は、互いに独立に選択される、請求項４記載の化合物。
【請求項７】
式（ＩＩ）：
【化６２】

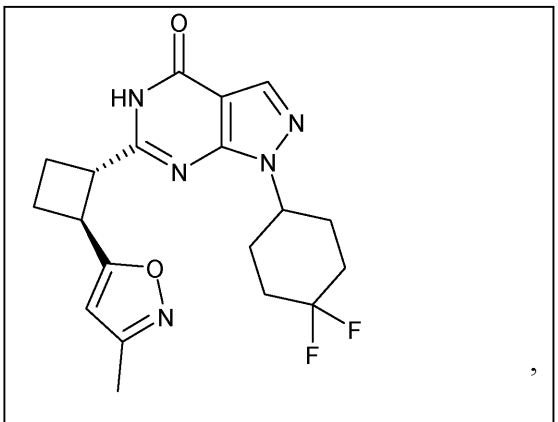


(II)

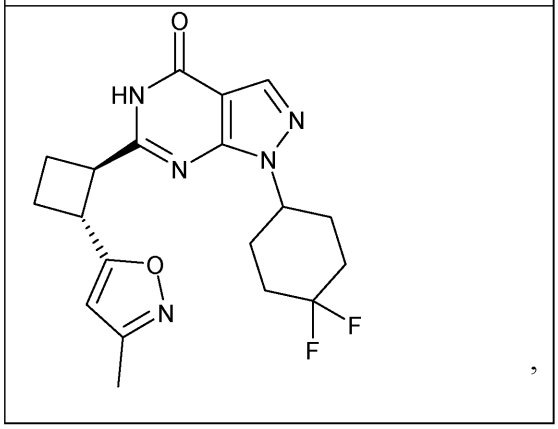
［式中、
Ｒ^{1}は：請求項１、２、３、４、５又は６のいずれかで定義されたとおりであり；
Ｄは：４，４－ジフルオロシクロヘキシル、テトラヒドロピラン－４－イル及び４－メチル－３－ピリジルからなる群より選択され、ここで、４，４－ジフルオロシクロヘキシル又はテトラヒドロピラン－４－イルのどちらも、更なる置換基を有さない］で示される化合物であることを特徴とする、請求項１、２、３、４、５又は６記載の化合物。
【請求項８】
式（ＩＩ）の化合物が、下記：
【表２０】



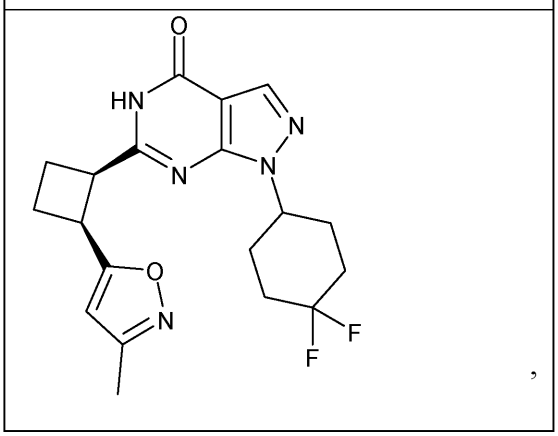
,



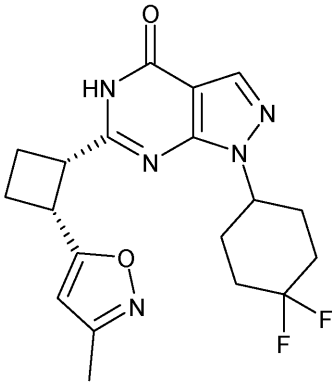
,

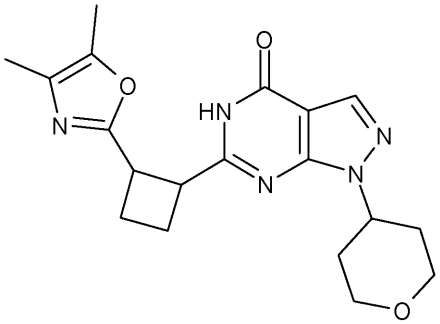


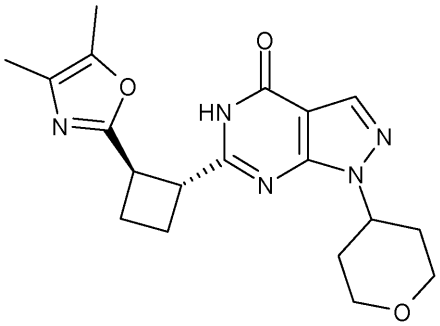
,

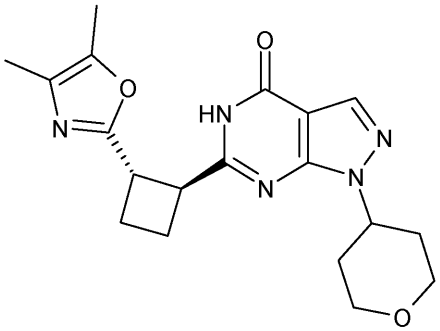


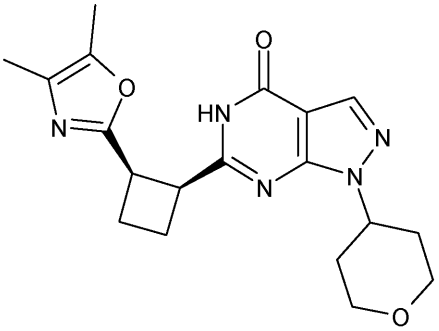
,

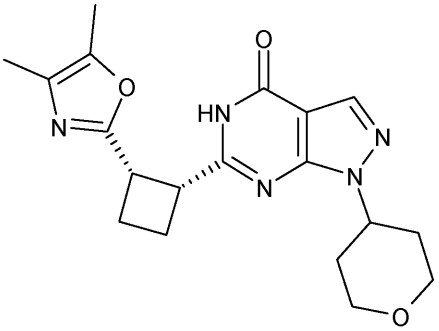

,

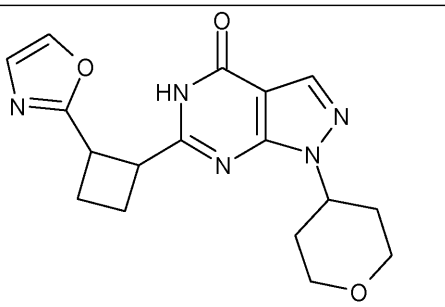

,

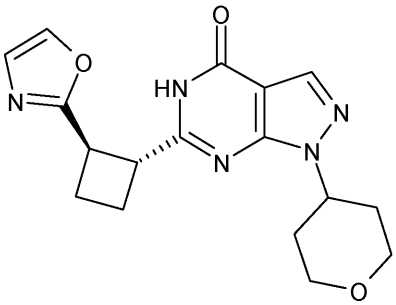

,

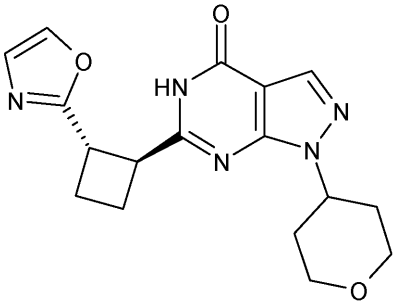

,

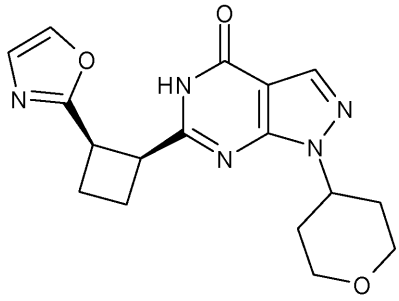

,

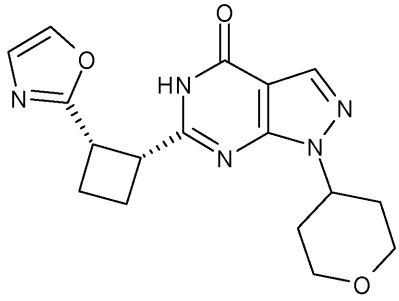

,

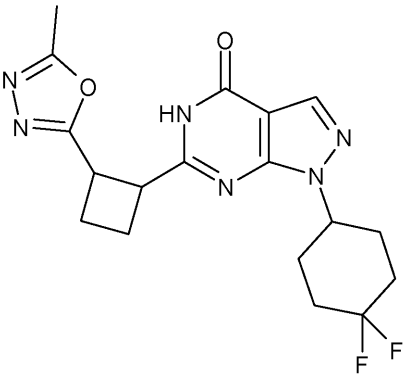

,

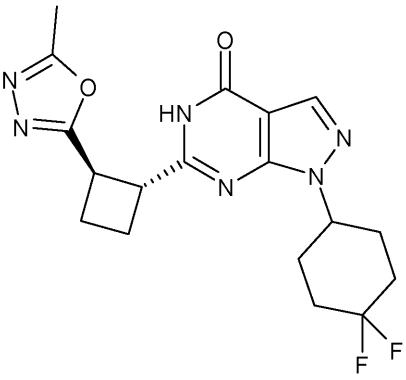

,

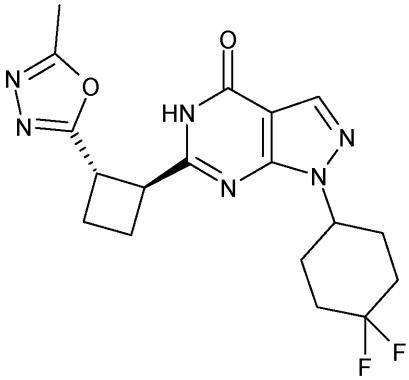

,

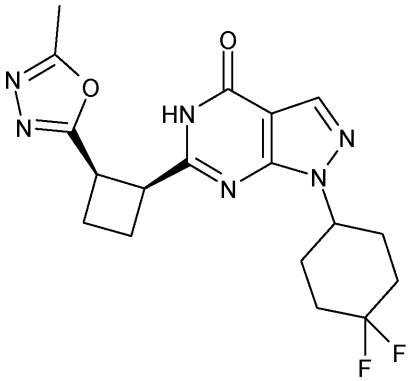

,

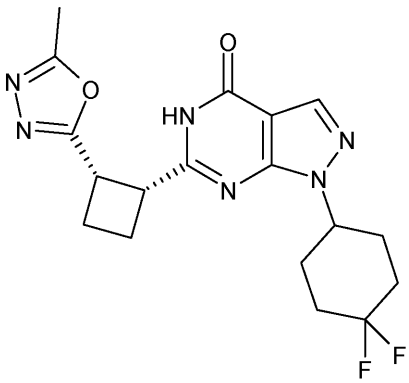

,

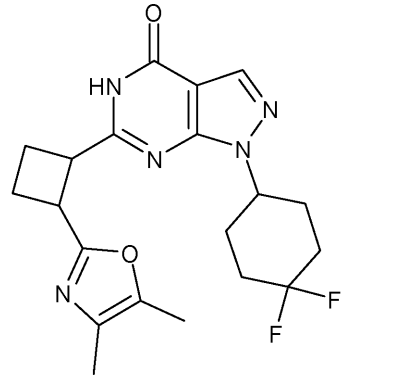

,

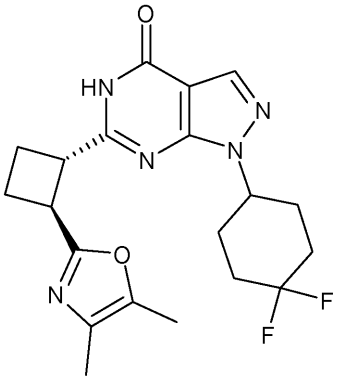

,

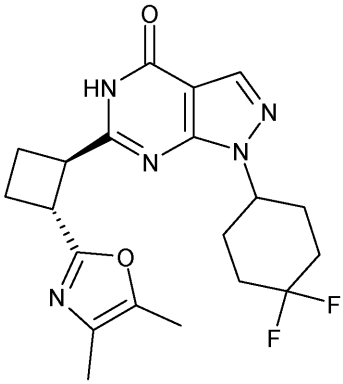

,

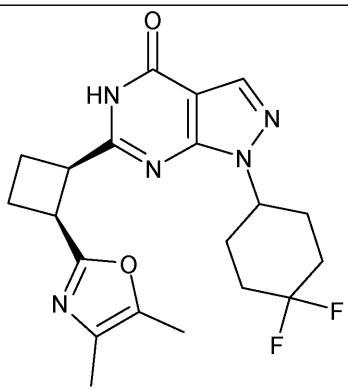

,

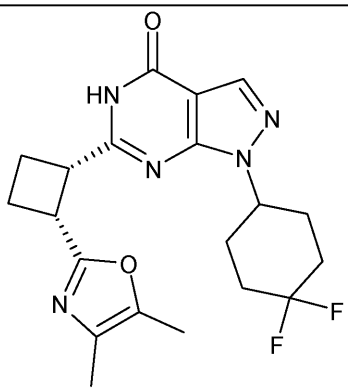

,

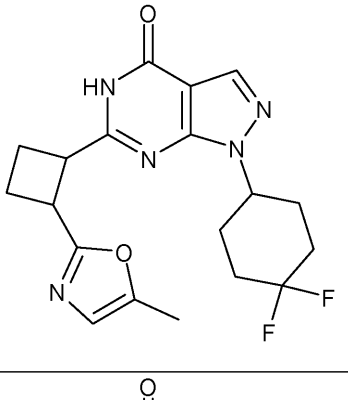

,

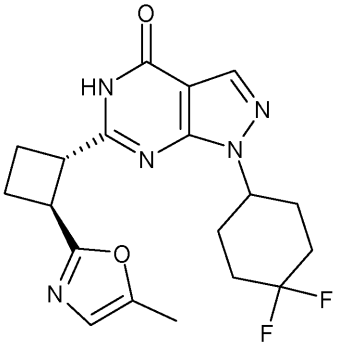

,

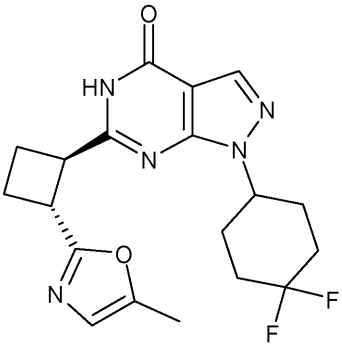

,

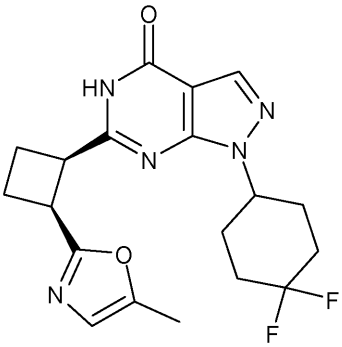

,

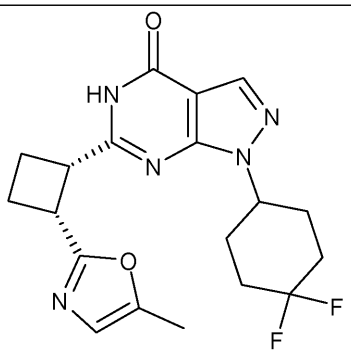

,

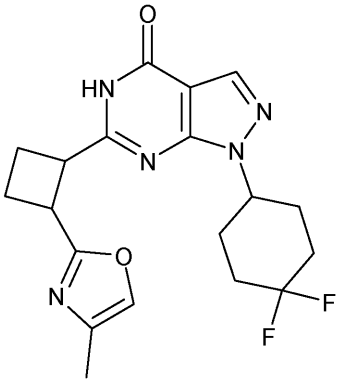

,

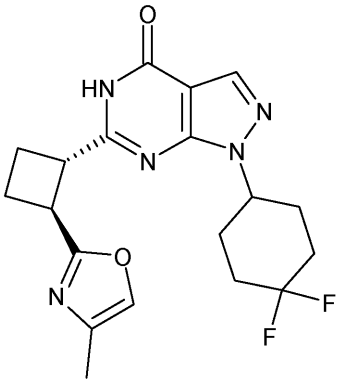

,

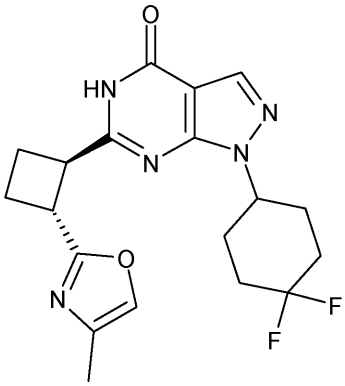

,

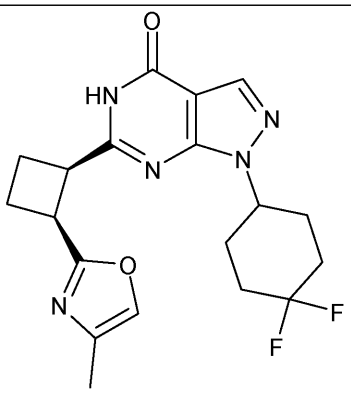

,

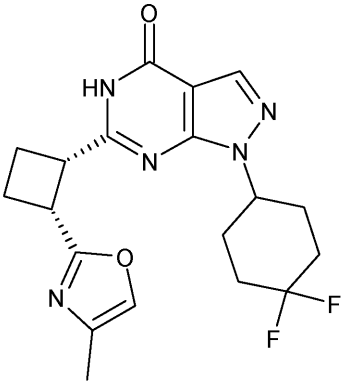

,

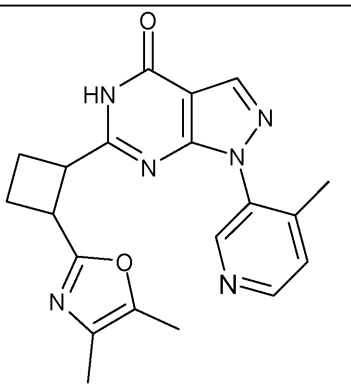

,

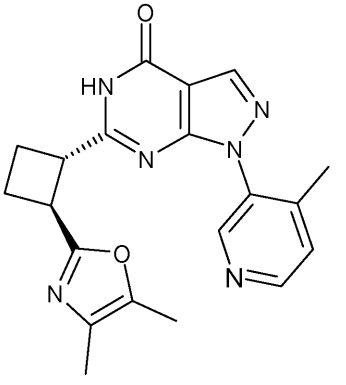

,

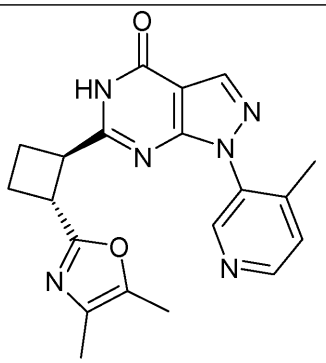

,

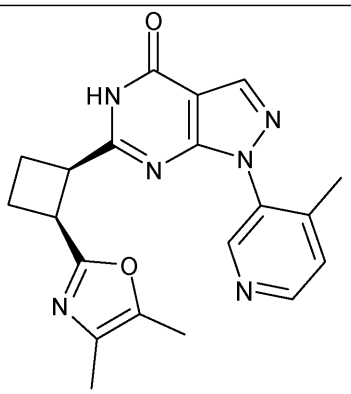

,

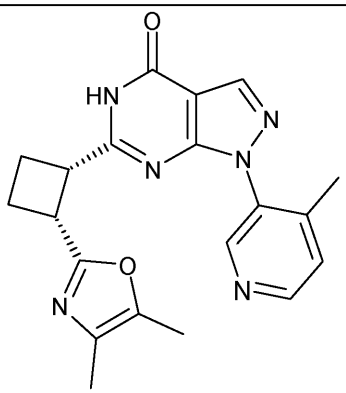

,

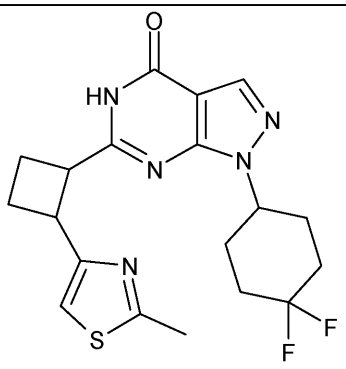

,

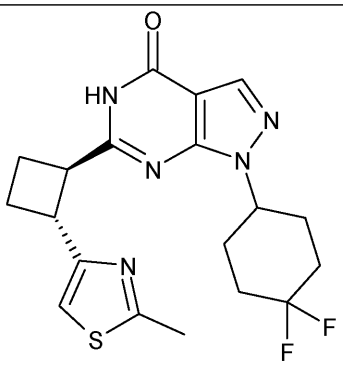

,

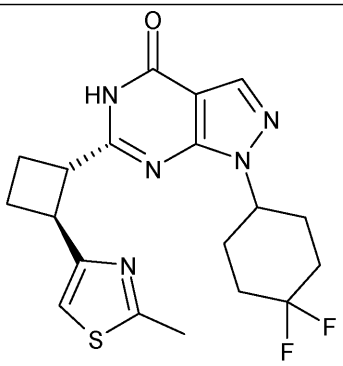

,

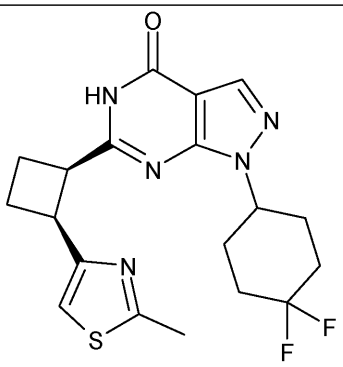

,

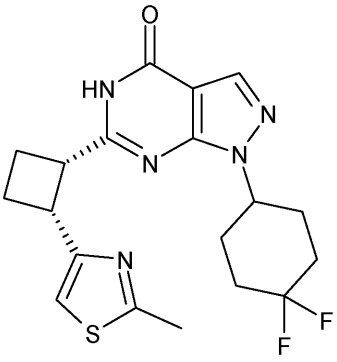

,

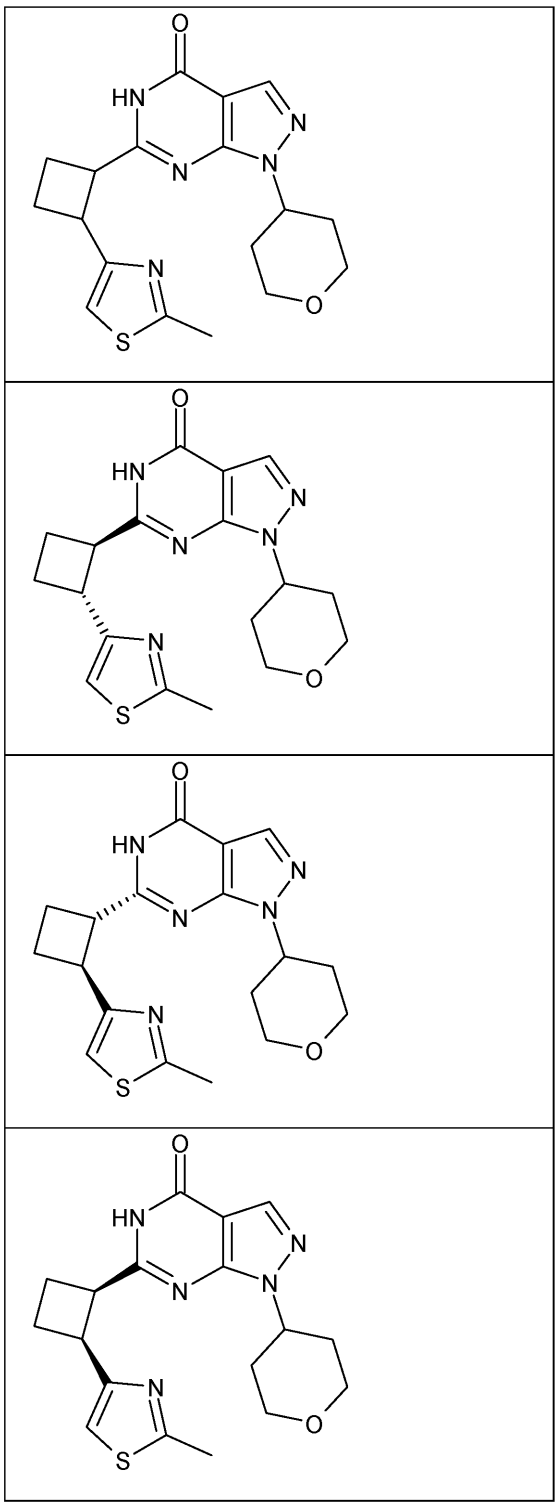

,

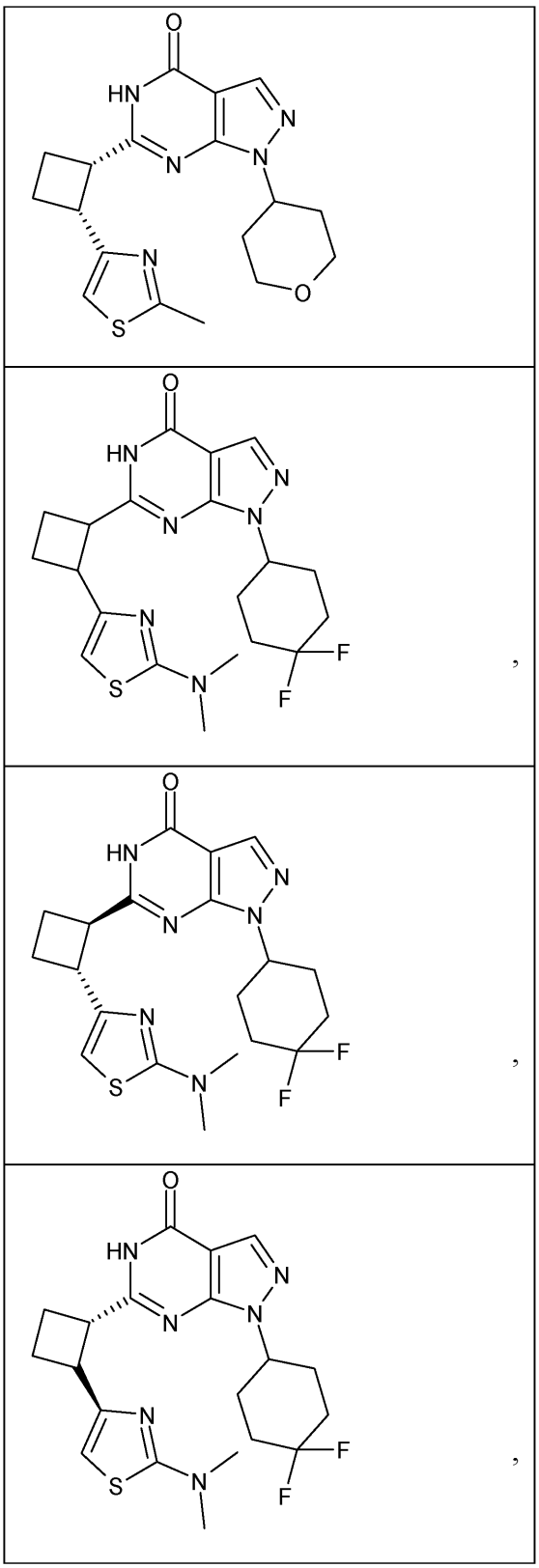

,

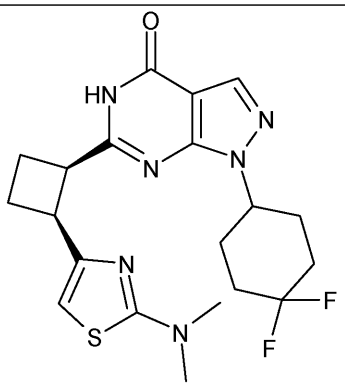

,

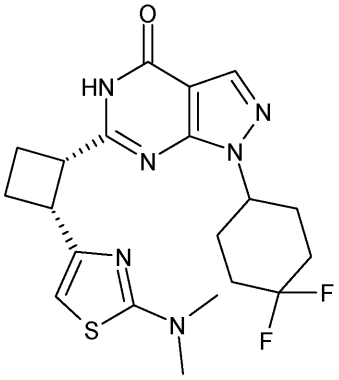

,

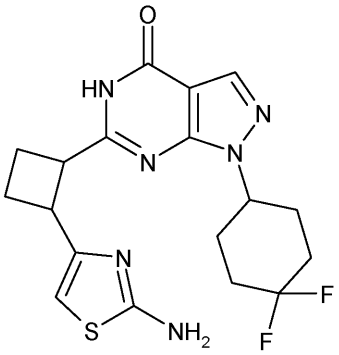

,

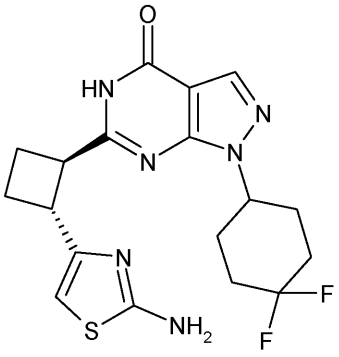


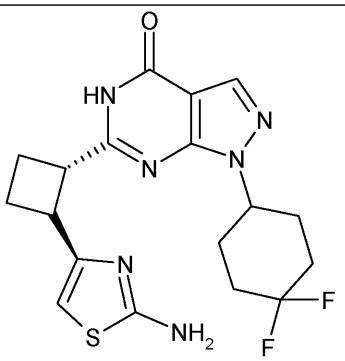


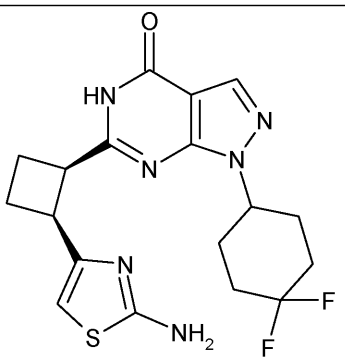

,

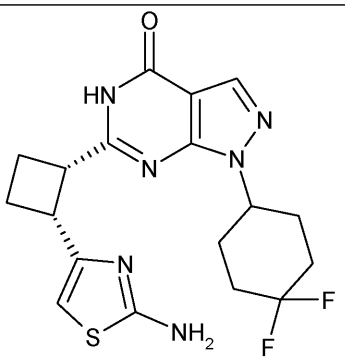

,

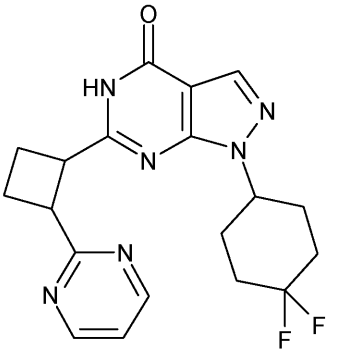

,

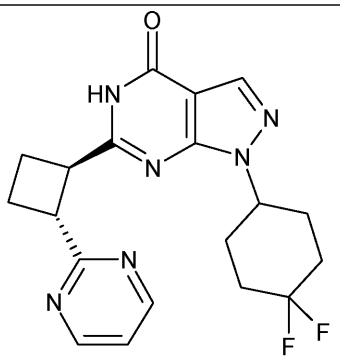

,

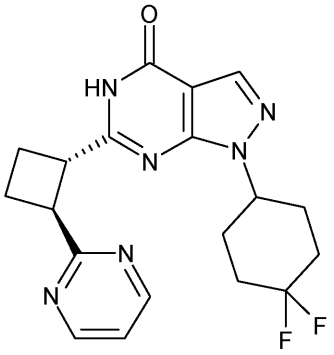

,

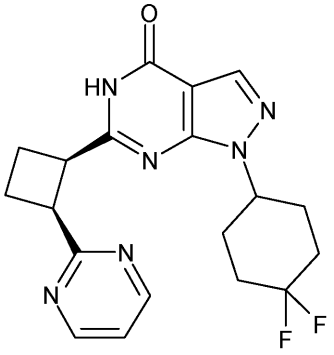

,

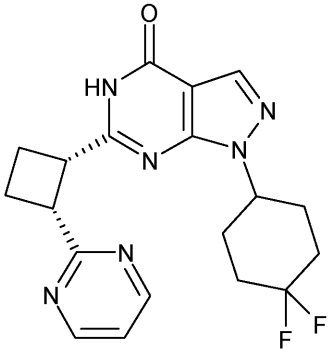

,

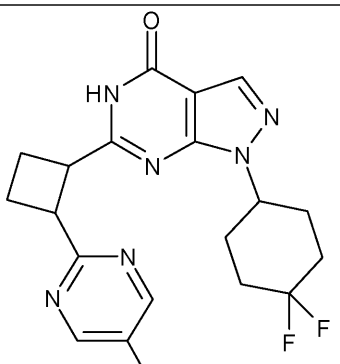

,

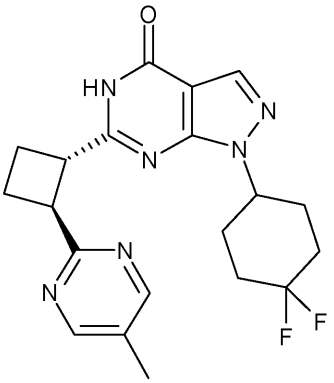

,

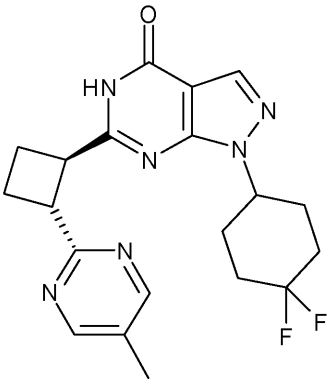

,

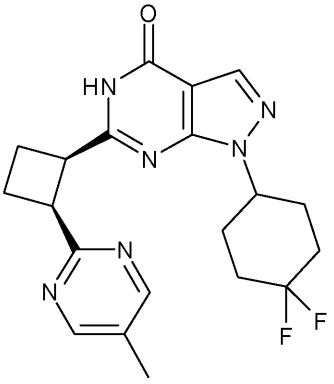

,

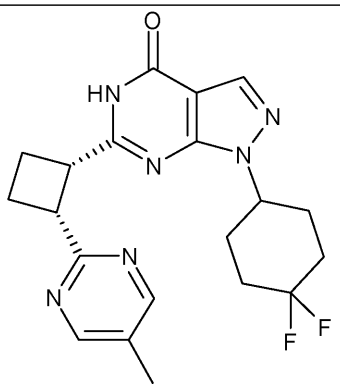

,

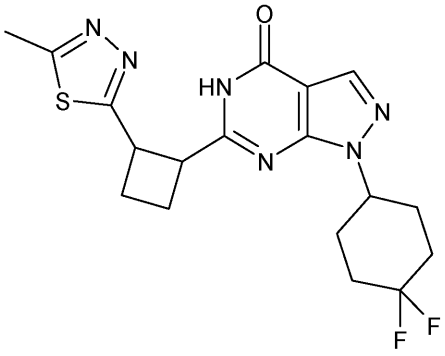

,

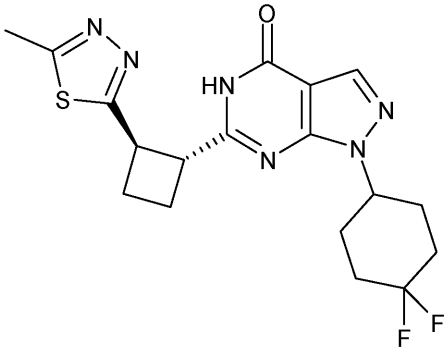

,

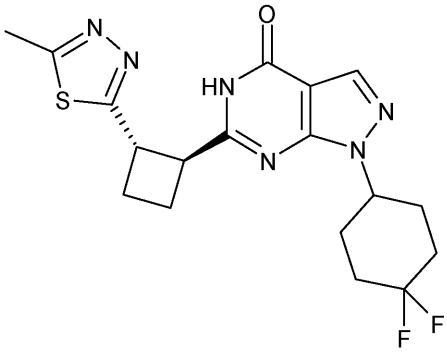

,

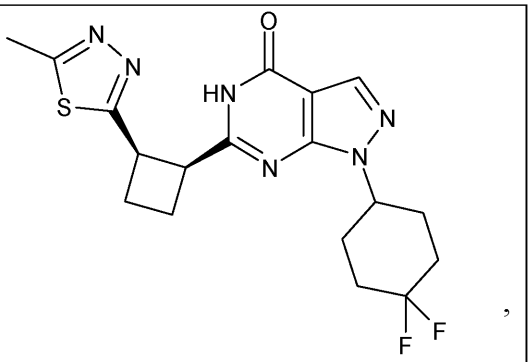

,

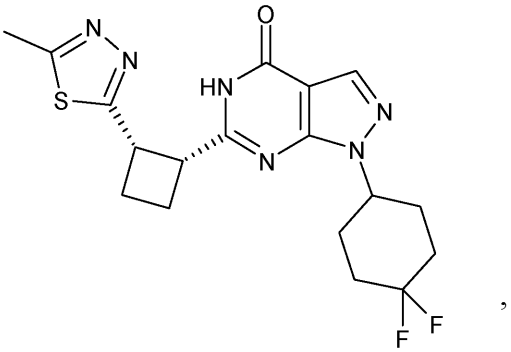

,

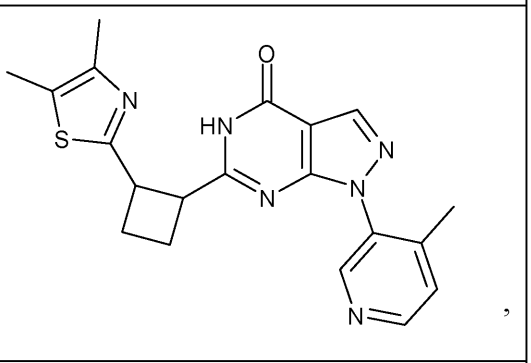

,

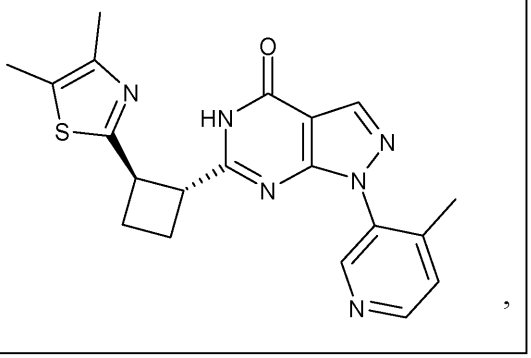

,

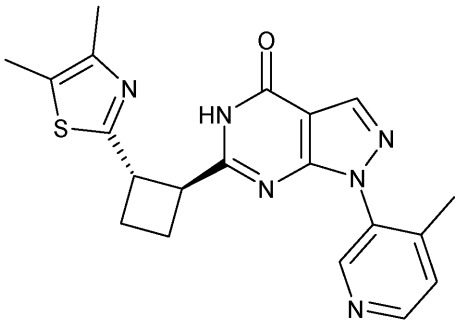

,

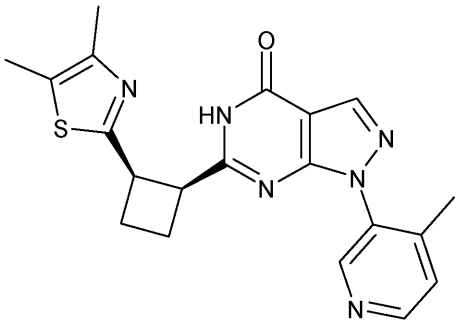

,

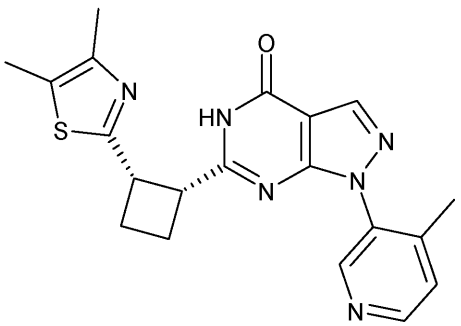

,

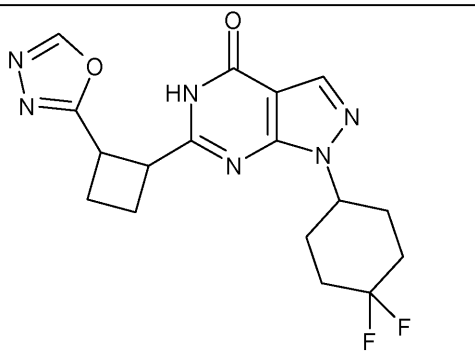

,

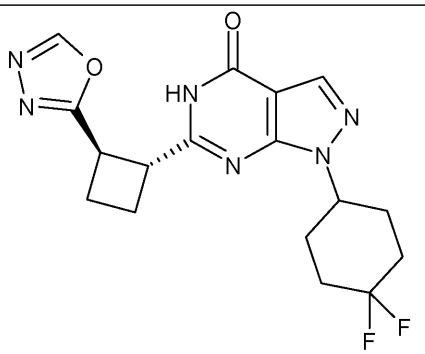

,

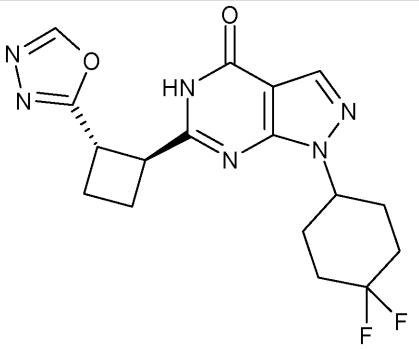

,

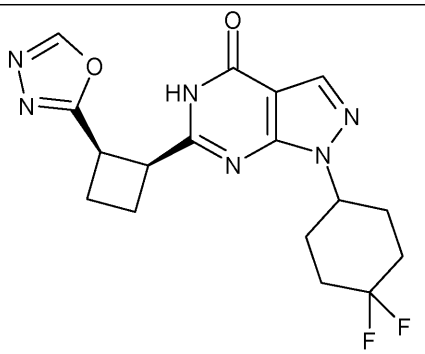

,

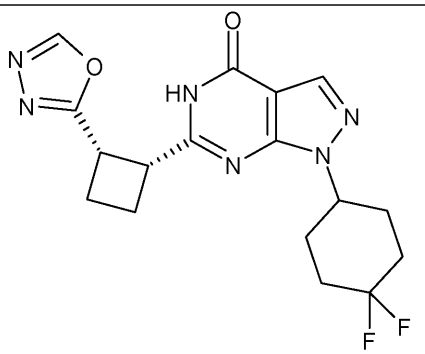

,

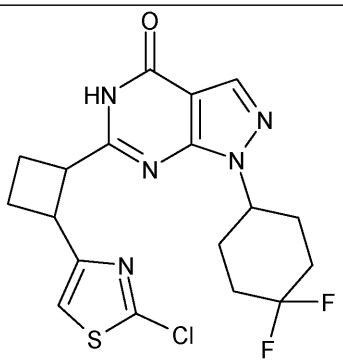

,

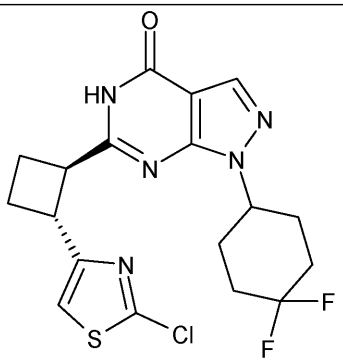

,

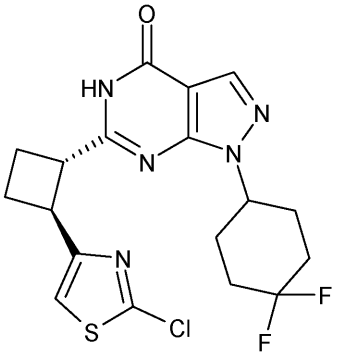

,

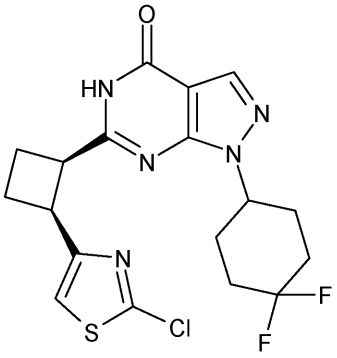

,

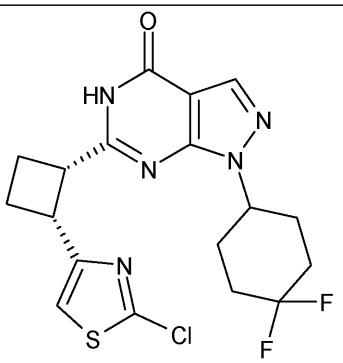

,

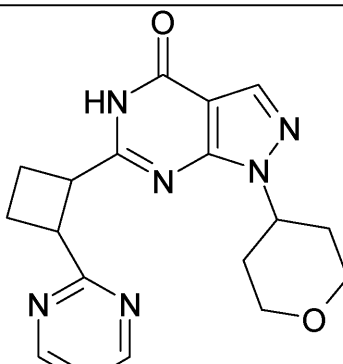

,

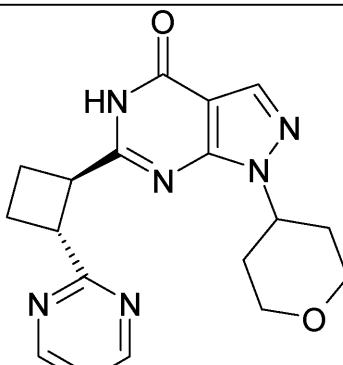

,

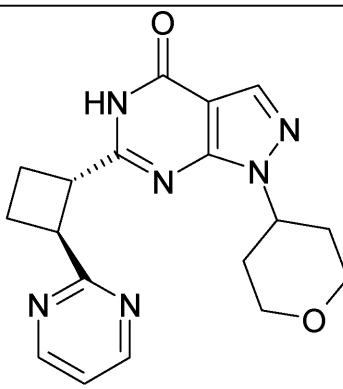

,

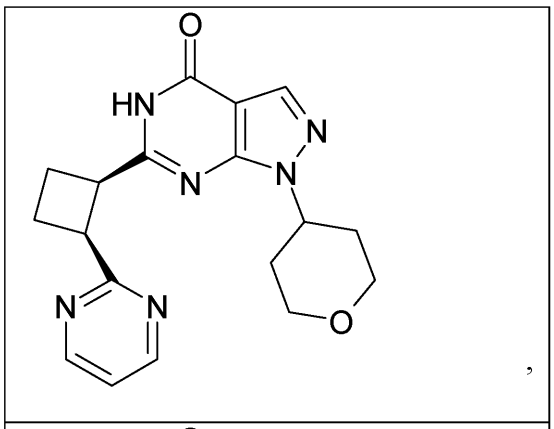

,

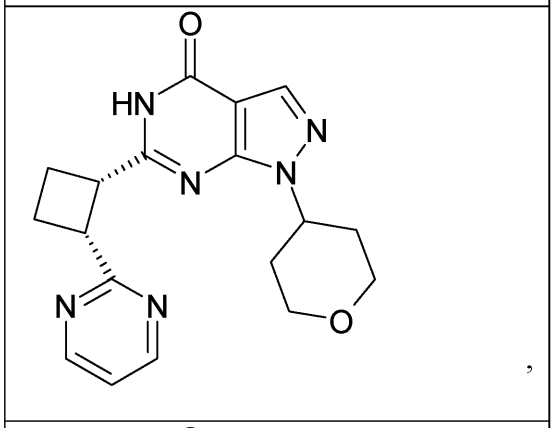

,

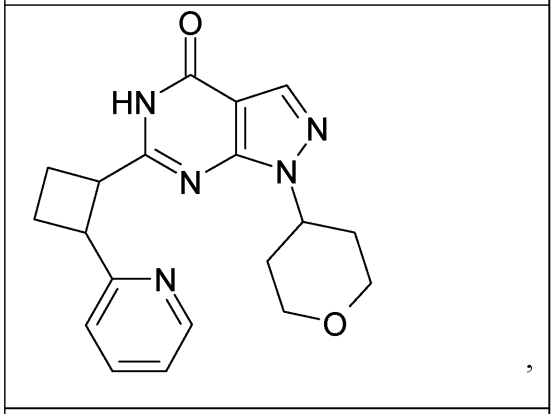

,

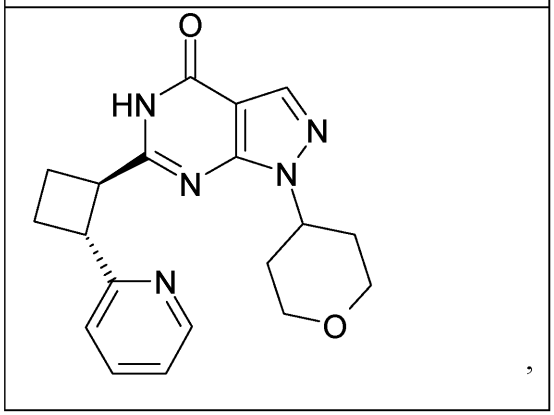

,

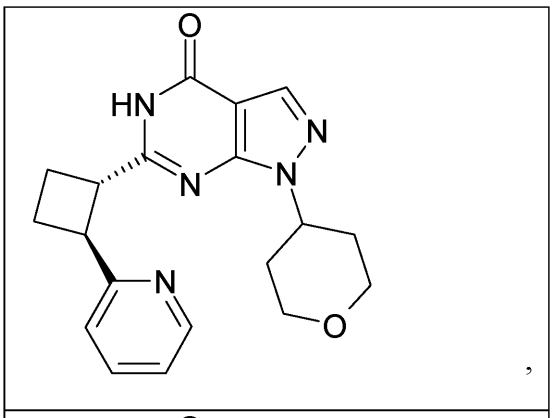

,

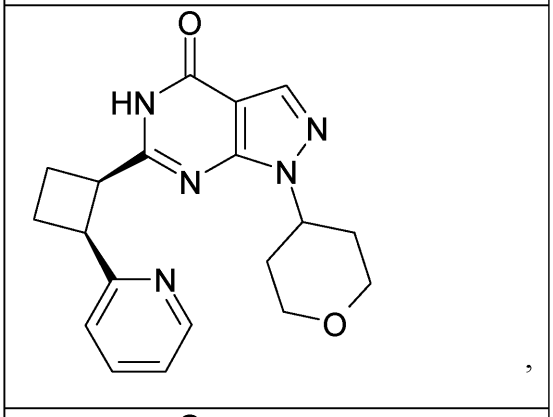

,

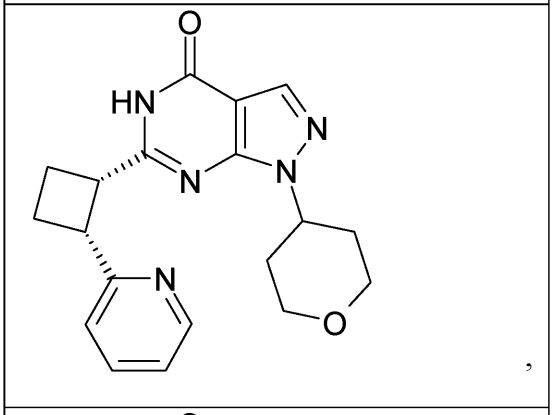

,

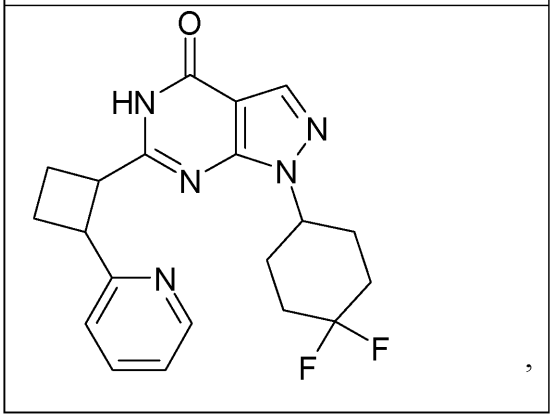

,

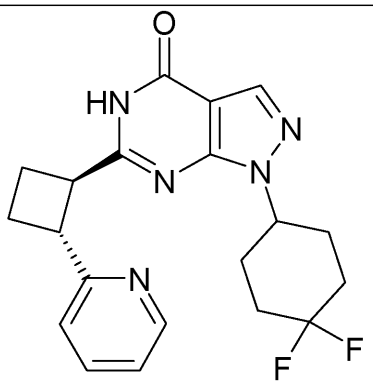

,

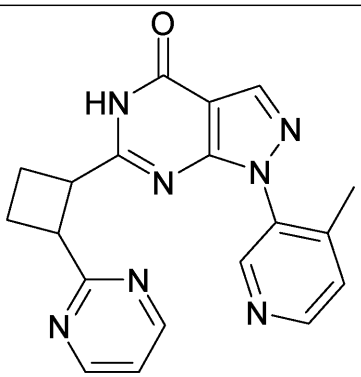

,

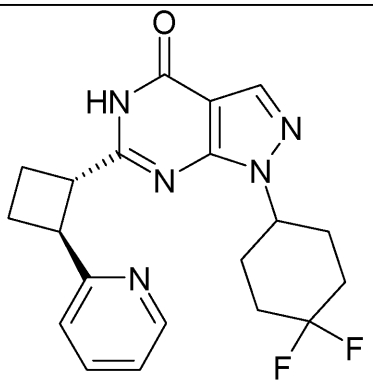

,

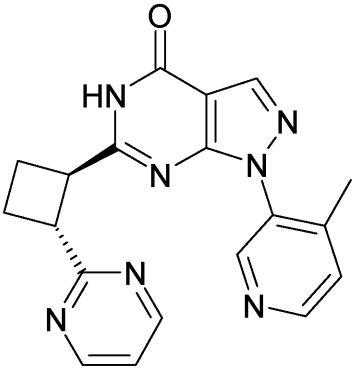

,

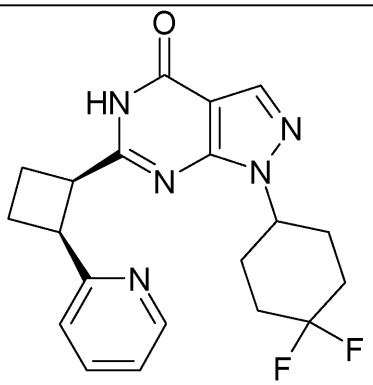

,

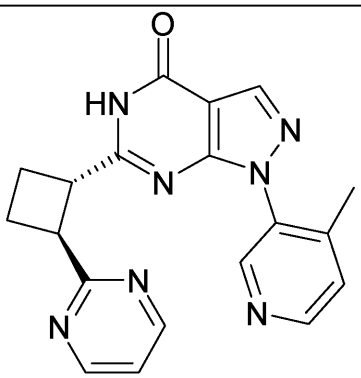

,

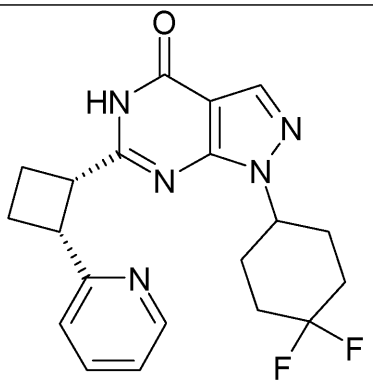

,

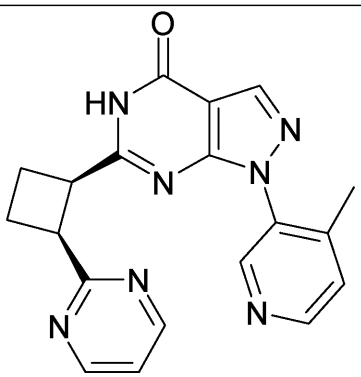

,

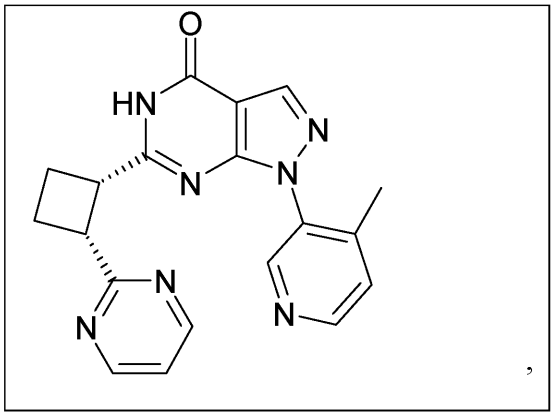

,


,


,


,


,

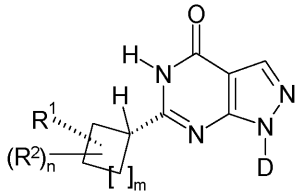


からなる群より選択される、請求項７記載の化合物。

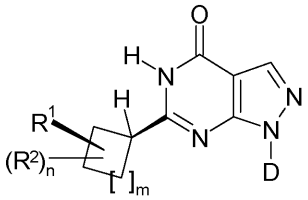
【請求項９】

式（Ｉ）の化合物が、式（Ｉａ）、式（Ｉｂ）、式（Ｉｃ）及び式（Ｉｄ）：

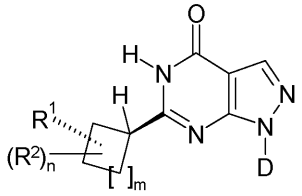
【化６３】



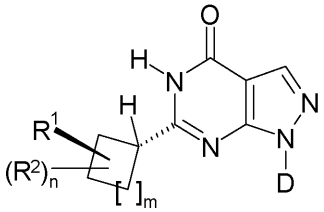
(Ia),



(Ib),



(Ic),



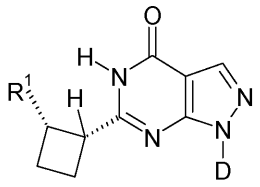
(Id)

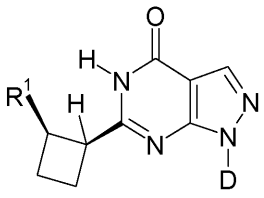
［式中、Ｒ^{1}、Ｒ^{2}、Ｄ、ｎ及びｍは、請求項１～６のいずれかで定義されたとおりである］で示される化合物の群より選択される、請求項１～６のいずれか一項記載の化合物。

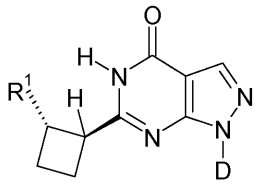
【請求項１０】

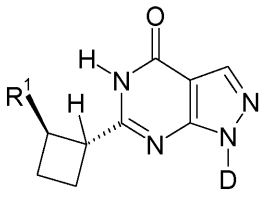
式（ＩＩ）の化合物が、式（ＩＩａ）、式（ＩＩｂ）、式（ＩＩｃ）及び式（ＩＩｄ）：

【化６４】


(IIa),


(IIb),


(IIc),


(IId)

［式中、Ｒ[1]及びＤは、請求項７～８のいずれかで定義されたとおりである］で示される化合物の群より選択される、請求項７及び８のいずれか一項記載の化合物。

【請求項１１】

医薬としての使用のための、或いは医薬中の薬学的に活性な成分としての使用のための、請求項１～１０のいずれか一項記載の化合物。

【請求項１２】

（ａ）ＣＮＳ疾患の処置用、

（ｂ）ＰＤＥ９の阻害によって到達可能である疾患の処置用、

（ｃ）知覚、集中、認知、学習もしくは記憶からなる群より選択される疾患又は病状に関連する認知機能障害からなる群より選択される病状の、処置用又は寛解用又は予防用、

（ｄ）アルツハイマー病、又はアルツハイマー病に関連する認知機能障害の処置用、

（ｅ）統合失調症、又は統合失調症に関連する認知機能障害の処置用、

（ｆ）てんかん、又はてんかんに関連する認知機能障害の処置用、

（ｇ）睡眠障害、双極性障害、代謝症候群、肥満症、糖尿病、高血糖症、脂質代謝異常症、耐糖能障害、又は精巣、脳、小腸、骨格筋、心臓、肺、胸腺もしくは脾臓の疾患からなる群より選択される疾患又は病状の処置用

の治療的又は予防的方法における使用のための、請求項１～１０のいずれか一項記載の化合物。

【請求項１３】

認知機能障害の治療又は予防のための方法における使用のための、請求項１～１０のいずれか一項記載の化合物。

【請求項１４】

別の基礎疾患の症状として、知覚、集中、学習又は記憶に関連する認知機能障害の治療又は予防のための方法における使用のための、請求項１～１０のいずれか一項記載の化合物。

【請求項１５】

知覚、集中、学習又は記憶に関連する認知能力の改善のための方法における使用のための、請求項１～１０のいずれか一項記載の化合物。

【請求項１６】

請求項１～１０のいずれか一項記載の化合物及び医薬担体を含む、医薬組成物。

【請求項１７】

請求項１２～１５のいずれかに定義のとおりの疾患又は病状の処置用の、治療的又は予防的方法において使用するための、請求項１６に記載の医薬組成物。

【請求項１８】

請求項１２～１５のいずれかに定義のとおりの疾患又は病状の処置用の医薬の製造のた

めの、請求項１～１０のいずれか一項記載の化合物の使用。
【請求項１９】
請求項１～１０のいずれか一項記載の化合物と別の活性薬剤との組み合わせであって、ここで、
－該組み合わせは、請求項１２～１５のいずれかに定義のとおりの疾患又は病状の処置に有用である、或いは
－該組み合わせは、請求項１２～１５のいずれかに定義のとおりの疾患又は病状の処置用の、治療的又は予防的方法において使用するためである、或いは
－該組み合わせは、請求項１２～１５のいずれかに定義のとおりの病状又は疾患の処置用の医薬の製造のためである、
組み合わせ。