

【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23年11月24日(2011.11.24)

【公表番号】特表2011-502153(P2011-502153A)

【公表日】平成23年1月20日(2011.1.20)

【年通号数】公開・登録公報2011-003

【出願番号】特願2010-532118(P2010-532118)

【国際特許分類】

C 07 C 311/18	(2006.01)
A 61 K 31/18	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 K 31/275	(2006.01)
C 07 C 311/16	(2006.01)
C 07 C 237/06	(2006.01)
C 07 C 255/50	(2006.01)
C 07 C 253/30	(2006.01)

【F I】

C 07 C 311/18	C S P
A 61 K 31/18	
A 61 P 25/28	
A 61 K 31/275	
C 07 C 311/16	
C 07 C 237/06	
C 07 C 255/50	
C 07 C 253/30	

【手続補正書】

【提出日】平成23年10月6日(2011.10.6)

【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】

(2R)-2-[[4-(クロロフェニル)スルホニル][[2-フルオロ-4-(1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)フェニル]メチル]アミノ]-5,5,5-トリフルオロペンタンアミドである化合物。

【請求項2】

治療上有効な量の(2R)-2-[[4-(クロロフェニル)スルホニル][[2-フルオロ-4-(1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)フェニル]メチル]アミノ]-5,5,5-トリフルオロペンタンアミドを、医薬的に許容されるアジュバント、担体または希釈剤とともに含有する、アルツハイマー病、脳アミロイド血管症、軽度認知機能障害および/またはダウン症候群の、治療または発症の遅延のための医薬組成物。

【請求項3】

アルツハイマー病の治療のための請求項2に記載の医薬組成物。

【請求項4】

アルツハイマー病の治療/予防/抑制もしくは寛解に用いられる1つ以上の他の薬剤をさらに含む請求項3に記載の医薬組成物であって、該他の薬剤が、コリンエステラーゼ阻害剤、NMDAアンタゴニスト、PDE4阻害剤、NSAID、コレステロール低下スタチン系薬剤、抗

アミロイドおよび抗A 免疫療法、A の凝集を阻害する化合物、A 產生もしくはプロセシングを阻害もしくは修飾する他の化合物、A 代謝回転を制御する化合物、タウのリン酸化を制御する化合物、PPAR アゴニスト、タウもしくはリン酸化タウ代謝回転またはオリゴマー形成を制御する化合物、微小管を安定化または微小管に結合する化合物、ならびにミトコンドリア機能を制御する化合物からなる群から選択される、医薬組成物。

【請求項 5】

治療上有効な量の(2R)-2-[(4-クロロフェニル)スルホニル][[2-フルオロ-4-(1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)フェニル]メチル]アミノ]-5,5,5-トリフルオロペンタンアミド、およびアルツハイマー病の治療/予防/抑制もしくは寛解に用いられる1つ以上の他の薬剤を組み合わせて含む、アルツハイマー病の治療または発症の遅延のための剤であって、該他の薬剤が、コリンエステラーゼ阻害剤、NMDAアンタゴニスト、PDE4阻害剤、NSAID、コレステロール低下スタチン系薬剤、抗アミロイドおよび抗A 免疫療法、A の凝集を阻害する化合物、A 產生もしくはプロセシングを阻害もしくは修飾する他の化合物、A 代謝回転を制御する化合物、タウのリン酸化を制御する化合物、PPAR アゴニスト、タウもしくはリン酸化タウ代謝回転またはオリゴマー形成を制御する化合物、微小管を安定化または微小管に結合する化合物、ならびにミトコンドリア機能を制御する化合物からなる群から選択される、剤。

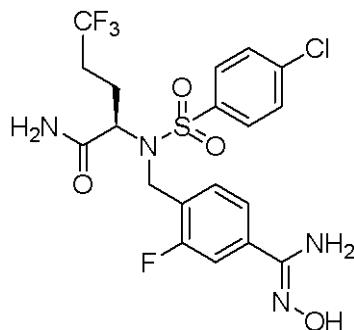
【請求項 6】

(2R)-2-[(4-クロロフェニル)スルホニル][[2-フルオロ-4-(1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)フェニル]メチル]アミノ]-5,5,5-トリフルオロペンタンアミドと同時にまたは連続して該他の薬剤を投与することを特徴とする、請求項5に記載の剤。

【請求項 7】

式；

【化1】

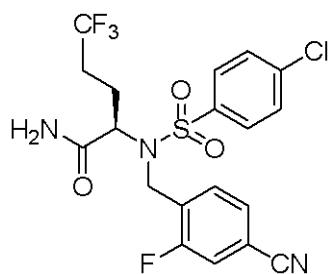


である化合物、または医薬的に許容されるその塩。

【請求項 8】

式；

【化2】

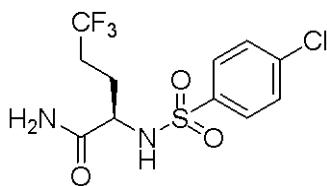


である化合物、または医薬的に許容されるその塩。

【請求項 9】

式；

## 【化3】

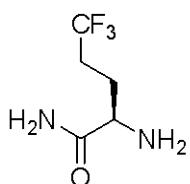


である化合物、または医薬的に許容されるその塩。

## 【請求項10】

式；

## 【化4】



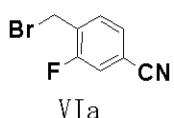
である化合物、または医薬的に許容されるその塩。

## 【請求項11】

a) ラジカル開始剤の存在下において2-フルオロ-4-シアノトルエンを臭素化剤と反応させること；および、

b) 工程a)の生成物を亜リン酸ジエチルおよび塩基で処理すること、  
を含む、化合物VIa；

## 【化5】



の製造方法。

## 【請求項12】

該臭素化剤がN-ブロモスクシンイミドである、請求項11に記載の製造方法。

## 【請求項13】

ラジカル開始剤がAIBN、UV光、またはペルカドックスから選択される、請求項11に記載の製造方法。

## 【請求項14】

ラジカル開始剤がAIBNである、請求項13に記載の製造方法。

## 【請求項15】

該塩基がジイソプロピルエチルアミンである、請求項11に記載の製造方法。