

【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22年10月21日(2010.10.21)

【公表番号】特表2010-502664(P2010-502664A)

【公表日】平成22年1月28日(2010.1.28)

【年通号数】公開・登録公報2010-004

【出願番号】特願2009-527065(P2009-527065)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 K 31/455 (2006.01)

A 6 1 K 31/4545 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

A 6 1 K 31/501 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/18

A 6 1 K 31/455

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/541

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/553

A 6 1 K 31/501

【手続補正書】

【提出日】平成22年9月3日(2010.9.3)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0050

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0050】

N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - 4 - ジメチルアミノ - ベンズアミド

1 H - ピロール - 3 - カルボン酸 [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - アミド

N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - 4 - メチル - ベンズアミド

N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - 4 - メチル - ベンズアミド

N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - 3 - フルオロ - ベンズアミド

N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - 2 - エチル - プチルアミド

N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - 4 - (2 , 5 - ジメトキシ - フェニル) - 4 - オキソ - プチルアミド

2 - (2 - ベンジルオキシ - エトキシ) - N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - アセトアミド

N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - 2 - フェニル - アセトアミド

N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - 3 - (1 H - インドール - 4 - イル) - プロピオンアミド

2 - ベンゾ [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル - N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - アセトアミド

N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - 2 - フェノキシ - プロピオンアミド

N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - 2 - (2 - フルオロ - フェニル) - アセトアミド

5 - ヒドロキシ - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸 [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - アミド

1 - メチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸 [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - アミド

N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - テレフタルアミド酸メチルエステル

N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - 2 - (2 - トリフルオロメトキシ - フェニル) - アセトアミド

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0077

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0077】

1 H - ピロール - 3 - カルボン酸 [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - アミド

N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シク

□ヘキシル] - 4 - メチル - ベンズアミド
 N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シク
 □ヘキシル] - 4 - メチル - ベンズアミド
 N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シク
 □ヘキシル] - 3 - フルオロ - ベンズアミド
 N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シク
 □ヘキシル] - 2 - エチル - プチルアミド
 N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シク
 □ヘキシル] - 4 - (2 , 5 - ジメトキシ - フェニル) - 4 - オキソ - プチルアミド
 2 - (2 - ベンジルオキシ - エトキシ) - N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フ
 ェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - アセトアミド
 N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シク
 □ヘキシル] - 2 - フェニル - アセトアミド
 N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シク
 □ヘキシル] - 3 - (1 H - インドール - 4 - イル) - プロピオンアミド
 2 - ベンゾ [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル - N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロ
 ロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - アセトアミド
 N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シク
 □ヘキシル] - 2 - フェノキシ - プロピオンアミド
 N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シク
 □ヘキシル] - 2 - (2 - フルオロ - フェニル) - アセトアミド
 5 - ヒドロキシ - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸 [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロ
 ロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - アミド
 1 - メチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸 [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フ
 ェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシル] - アミド
 N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シク
 □ヘキシル] - テレフタルアミド酸メチルエステル
 N - [(1 S , 3 S) - 3 - (3 - クロロ - フェニルエチニル) - 3 - ヒドロキシ - シク
 □ヘキシル] - 2 - (2 - トリフルオロメトキシ - フェニル) - アセトアミド

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0084

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0084】

本発明の化合物は、認知機能障害の処置、予防または進行の遅延に有用である。認知機
 能障害には注意および覚醒状態、実行機能および記憶（例えば作業記憶およびエピソード
 記憶）の欠損および異常が含まれる。認知機能障害に関連した他の障害には、睡眠関連呼
 吸障害（SRBD）、行動障害、情報処理不全および加齢性障害が含まれる。

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0113

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0113】

実施例 2 . 1 1 : [5 - クロロ - 6 - (6 - メチル - ピリジン - 3 - イルアミノ) - ピ
 リジン - 3 - イル] - ピペリジン - 1 - イル - メタノン

無色結晶、HPLC: $t_R = 4.3$ 分(システム1); ESI+ MS: $m/z = 331.1$ (MH⁺).

実施例 2 . 1 2 : アゼパン - 1 - イル - [5 - クロロ - 6 - (6 - メチル - ピリジン -
 3 - イルアミノ) - ピリジン - 3 - イル] - メタノン

無色結晶、HPLC: $t_R = 4.3$ 分(システム1); ESI+ MS: $m/z = 345.1$ (MH^+).

実施例 2.13: rac - (2 - アザ - ビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) -
[5 - クロロ - 6 - (6 - メチル - ピリジン - 3 - イルアミノ) - ピリジン - 3 - イル]
- メタノン

ベージュ色粉末、HPLC: $t_R = 4.1$ 分(システム1); ESI+ MS: $m/z = 343.1$ (MH^+).

実施例 2.14: [5 - クロロ - 6 - (6 - メチル - ピリジン - 3 - イルアミノ) - ピ
リジン - 3 - イル] - チアゾリジン - 3 - イル - メタノン

ベージュ色粉末、HPLC: $t_R = 4.1$ 分(システム1); ESI+ MS: $m/z = 335.0$ (MH^+).

実施例 2.15: [5 - クロロ - 6 - (6 - メチル - ピリジン - 3 - イルアミノ) - ピ
リジン - 3 - イル] - チオモルホリン - 4 - イル - メタノン

ベージュ色粉末、HPLC: $t_R = 3.9$ 分(システム1); ESI+ MS: $m/z = 349.0$ (MH^+).