

【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21年1月22日(2009.1.22)

【公表番号】特表2008-523146(P2008-523146A)

【公表日】平成20年7月3日(2008.7.3)

【年通号数】公開・登録公報2008-026

【出願番号】特願2007-546799(P2007-546799)

【国際特許分類】

A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/4439	(2006.01)
A 6 1 K	31/429	(2006.01)
A 6 1 K	31/404	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	45/00	
A 6 1 K	31/4439	
A 6 1 K	31/429	
A 6 1 K	31/404	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/08	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	17/02	

【手続補正書】

【提出日】平成20年11月25日(2008.11.25)

【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】

神経変性障害の処置を必要とする患者における、神経変性障害の処置のための組成物であって、該組成物は、治療有効量の5-ヒドロキシトリプタミン-6アゴニストを含む、組成物。

【請求項2】

前記5-ヒドロキシトリプタミン-6アゴニストが、1-スルホニルトリプタミン誘導体である、請求項1に記載の組成物。

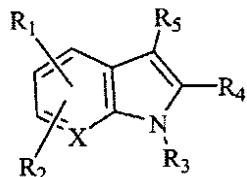
【請求項3】

前記5-ヒドロキシトリプタミン-6アゴニストが、1-アミノアルキル-3-スルホニルアザインドール誘導体である、請求項1に記載の組成物。

【請求項4】

前記5-ヒドロキシトリプタミン-6アゴニストが、式Iの化合物

【化1】



(I)

、またはその立体異性体あるいはその薬学的に受容可能な塩である、請求項1に記載の方法であって、式Iにおいて、

Xは、CHまたはNであり；

R₁およびR₂は、各々独立して、H、ハロゲン、CN、OCO₂R₁₂、CO₂R₁₃、CONR₁₄R₁₅、CNR₁₆NR₁₇R₁₈、SO_mR₁₉、NR₂₀R₂₁、OR₂₂、COR₂₃、または各々が必要に応じて置換される、C₁～C₆アルキル基、C₂～C₆アルケニル基、C₂～C₆アルキニル基、C₃～C₆シクロアルキル基、シクロヘテロアルキル基、アリール基もしくはヘテロアリール基であり；

R₃は、XがCHである場合、SO₂R₈であり、またはXがNである場合、(CH₂)_nNR₆R₇であり；

R₄は、H、ハロゲン、または各々が必要に応じて置換される、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシ基、アリール基もしくはヘテロアリール基であり；

R₅は、XがCHである場合、(CH₂)_nNR₆R₇であり、またはXがNである場合、SO₂R₈であり；

nは、2または3の整数であり；

R₆およびR₇は、各々独立して、H、または各々が必要に応じて置換される、C₁～C₆アルキル基、C₂～C₆アルケニル基、C₂～C₆アルキニル基、C₃～C₆シクロアルキル基、シクロヘテロアルキル基、アリール基もしくはヘテロアリール基であるか、あるいはR₆およびR₇は、これらが結合している原子と一緒にになって、必要に応じて置換された5～7員環を形成し得、該5～7員環は、必要に応じて、O、NまたはSから選択されるさらなるヘテロ原子を含有し；

R₈は、必要に応じて置換された、アリール、ヘテロアリールまたは8～13員の二環式環系もしくは三環式環系であり、該二環式環系もしくは三環式環系は、橋頭に1個のN原子を有し、そして必要に応じて、N、OもしくはSから選択される1個、2個もしくは3個のさらなるヘテロ原子を含み；

mは、0であるか、または1もしくは2の整数であり；

R₁₂、R₁₃、R₁₉およびR₂₃は、各々独立して、H、または各々が必要に応じて置換された、C₁～C₆アルキル基、C₂～C₆アルケニル基、C₂～C₆アルキニル基、C₃～C₆シクロアルキル基、シクロヘテロアルキル基、アリール基もしくはヘテロアリール基であり；

R₁₄、R₁₅およびR₂₂は、各々独立して、H、または必要に応じて置換されたC₁～C₆アルキル基であり；そして

R₁₆、R₁₇、R₁₈、R₂₀およびR₂₁は、各々独立して、H、または必要に応じて置換されたC₁～C₄アルキル基であるか；あるいはR₂₀およびR₂₁は、これらが結合している原子と一緒にになって、5～7員環を形成し得、該5～7員環は、必要に応じて、O、NまたはSから選択される別のヘテロ原子を含有する、

組成物。

【請求項 5】

式 I の化合物において、X が、C H であり；n が、2 であり；そして R₈ が、各々が独立して置換されたフェニル基またはイミダゾ [2, 1 - b] [1, 3] チアゾリル基である、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 6】

式 I の化合物において、X が、N であり；n が、2 であり；そして R₈ が、各々が必要に応じて置換されたフェニル基またはイミダゾ [2, 1 - b] [1, 3] チアゾリル基である、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 7】

式 I の化合物が、以下：

2 - { 1 - [6 - クロロイミダゾ [2, 1 - b] [1, 3] チアゾール - 5 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 3 - イル } エタンアミン；

(2 - { 3 - [(2 , 5 - ジメトキシフェニル) スルホニル] - 1 H - ピロロ [2 , 3 - b] ピリジン - 1 - イル } エチル) アミン；

N - (2 - { 3 - [(3 - フルオロフェニル) スルホニル] - 1 H - ピロロ [2 , 3 - b] ピリジン - 1 - イル } エチル) - N , N - ジメチルアミン；

2 - { [1 - (フェニルスルホニル) - 1 H - インドール - 3 - イル] エチル } - N , N - ジメチルアミン；

これらの薬学的に受容可能な塩；および

これらの立体異性体、

からなる群より選択される、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 8】

前記障害が、急性神経変性障害である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 9】

前記障害が、慢性神経変性障害である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 10】

前記障害が、脳卒中；頭部外傷；脊椎外傷；仮死、アルツハイマー病；ハンティングトン病；パーキンソン病；てんかん；筋萎縮性側索硬化症；エイズ痴呆および網膜疾患から選択される、請求項 8 または 9 に記載の組成物。

【請求項 11】

薬学的に受容可能なキャリアと、有効量の 5 - HT 6 アゴニストまたは請求項 2 ~ 8 のいずれか 1 項において定義される 5 - HT 6 アゴニストとを含有する、神経変性障害を処置するための薬学的組成物。

【請求項 12】

神経変性障害を処置するための医薬の調製における、5 - HT 6 アゴニストまたは請求項 2 ~ 8 のいずれか 1 項において定義される 5 - HT 6 アゴニストの使用。

【請求項 13】

前記障害が、脳卒中；頭部外傷；脊椎外傷；仮死、アルツハイマー病；ハンティングトン病；パーキンソン病；てんかん；筋萎縮性側索硬化症；エイズ痴呆および網膜疾患から選択される、請求項 12 に記載の使用。