

【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。

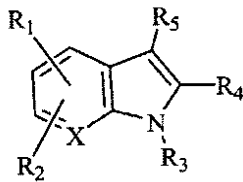
## 【請求項 3】

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；

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は、各々独立して、H、ハロゲン、CN、OCO<sub>2</sub>R<sub>12</sub>、CO<sub>2</sub>R<sub>13</sub>、CONR<sub>14</sub>R<sub>15</sub>、CNR<sub>16</sub>NR<sub>17</sub>R<sub>18</sub>、SO<sub>m</sub>R<sub>19</sub>、NR<sub>20</sub>R<sub>21</sub>、OR<sub>22</sub>、COR<sub>23</sub>、または各々が必要に応じて置換される、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル基、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル基、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル基、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> 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；

R<sub>3</sub> は、X が CH である場合、SO<sub>2</sub>R<sub>8</sub> であり、または X が N である場合、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub> であり；

R<sub>4</sub> は、H、ハロゲン、または各々が必要に応じて置換される、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル基、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> 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；

R<sub>5</sub> は、X が CH である場合、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub> であり、または X が N である場合、SO<sub>2</sub>R<sub>8</sub> であり；

n は、2 または 3 の整数であり；

R<sub>6</sub> および R<sub>7</sub> 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、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル基、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル基、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル基、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> 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 R<sub>6</sub> および R<sub>7</sub> は、これらが結合している原子と一緒に、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；

R<sub>8</sub> 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；

R<sub>12</sub>、R<sub>13</sub>、R<sub>19</sub> および R<sub>23</sub> 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、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル基、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル基、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル基、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> 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；

R<sub>14</sub>、R<sub>15</sub> および R<sub>22</sub> は、各々独立して、H、または必要に応じて置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル基であり；そして

R<sub>16</sub>、R<sub>17</sub>、R<sub>18</sub>、R<sub>20</sub> および R<sub>21</sub> は、各々独立して、H、または必要に応じて置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基であるか；あるいは R<sub>20</sub> および R<sub>21</sub> は、これらが結合している原子と一緒に、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、CH であり；n が、2 であり；そして R<sub>8</sub> 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 R<sub>8</sub> 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<sub>6</sub> 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<sub>6</sub> 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<sub>6</sub> 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<sub>6</sub> 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。