

【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24年12月27日 (2012.12.27)

【公表番号】特表2012-508726(P2012-508726A)

【公表日】平成24年4月12日 (2012.4.12)

【年通号数】公開・登録公報2012-015

【出願番号】特願2011-536026(P2011-536026)

【国際特許分類】

C 07 D 401/10 (2006.01)

A 61 P 25/22 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 25/18 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 25/14 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 25/04 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 25/06 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 3/06 (2006.01)

A 61 P 37/06 (2006.01)

A 61 P 25/08 (2006.01)

A 61 K 31/4439 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

C 07 D 403/10 (2006.01)

A 61 K 31/506 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 401/10 C S P

A 61 P 25/22

A 61 P 25/24

A 61 P 25/18

A 61 P 25/28

A 61 P 25/16

A 61 P 25/14

A 61 P 9/10

A 61 P 25/04

A 61 P 19/02

A 61 P 25/06

A 61 P 3/10

A 61 P 3/06

A 61 P 37/06

A 61 P 25/08

A 61 K 31/4439

A 61 P 3/04

C 07 D 403/10

A 61 K 31/506

【手続補正書】

【提出日】平成24年11月9日(2012.11.9)

【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

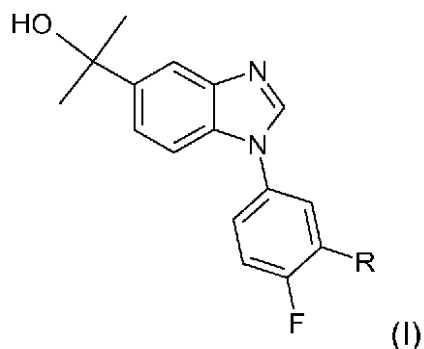
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式Iの化合物：

【化1】



又はそのN - オキシド、その立体異性体のいずれか若しくはその立体異性体のいずれかの混合物又はその薬学的に許容される塩〔式中、

R は、ピリジル又はピリミジル基を表し、

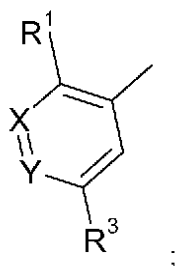
このピリジル又はピリミジル基は、

ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、ニトロ、アルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル及びアルコキシからなる群から独立して選択される1つ又は複数の置換基で場合により置換されている〕。

【請求項2】

R が、

【化2】



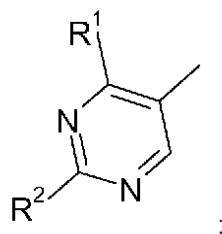
を表し、

ここで、X及びYの一方が、Nを表し、X及びYの他方が、CR²を表し、R¹、R²及びR³が、互いに独立して、水素、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、ニトロ、アルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル又はアルコキシを表す、請求項1に記載の化合物、そのN - オキシド、その立体異性体のいずれか若しくはその立体異性体のいずれかの混合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項3】

R が、

【化 3】



を表し、

ここで、 R^1 及び R^2 が、互いに独立して、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、ニトロ、アルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル又はアルコキシを表す、

請求項 1 に記載の化合物、その N - オキシド、その立体異性体のいずれか若しくはその立体異性体のいずれかの混合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 4】

2 - { 1 - [4 - フルオロ - 3 - (2 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル) - フェニル] - 1 H - ベンゾイミダゾール - 5 - イル } - プロパン - 2 - オール ;

2 - { 1 - [3 - (2 - クロロ - ピリジン - 3 - イル) - 4 - フルオロ - フェニル] - 1 H - ベンゾイミダゾール - 5 - イル } - プロパン - 2 - オール ;

2 - { 1 - [3 - (3 - クロロ - ピリジン - 4 - イル) - 4 - フルオロ - フェニル] - 1 H - ベンゾイミダゾール - 5 - イル } - プロパン - 2 - オール ;

2 - { 1 - [4 - フルオロ - 3 - (2 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル) - フェニル] - 1 H - ベンゾイミダゾール - 5 - イル } - プロパン - 2 - オール ;

2 - { 1 - [4 - フルオロ - 3 - (3 - フルオロ - ピリジン - 4 - イル) - フェニル] - 1 H - ベンゾイミダゾール - 5 - イル } - プロパン - 2 - オール ;

2 - { 1 - [3 - (2 - クロロ - 3 - フルオロ - ピリジン - 4 - イル) - 4 - フルオロ - フェニル] - 1 H - ベンゾイミダゾール - 5 - イル } - プロパン - 2 - オール ;

5 - { 2 - フルオロ - 5 - [5 - (1 - ヒドロキシ - 1 - メチル - エチル) - ベンゾイミダゾール - 1 - イル] - フェニル } - ニコチノニトリル ;

2 - { 1 - [3 - (2 , 4 - ジメトキシ - ピリミジン - 5 - イル) - 4 - フルオロ - フェニル] - 1 H - ベンゾイミダゾール - 5 - イル } - プロパン - 2 - オール ;

4 - { 2 - フルオロ - 5 - [5 - (1 - ヒドロキシ - 1 - メチル - エチル) - ベンゾイミダゾール - 1 - イル] - フェニル } - ニコチノニトリル ;

又はその N - オキシド、その立体異性体のいずれか若しくはその立体異性体のいずれかの混合物又はその薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

請求項 1 から 4 までのいずれか一項に記載の化合物又はその N - オキシド、その立体異性体のいずれか若しくはその立体異性体のいずれかの混合物又はその薬学的に許容される塩の治療有効量を、少なくとも 1 つの薬学的に許容される担体、賦形剤又は希釈剤と一緒に含む医薬組成物。

【請求項 6】

請求項 1 から 4 までのいずれか一項に記載の化合物又はその N - オキシド、その立体異性体のいずれか若しくはその立体異性体のいずれかの混合物又はその薬学的に許容される塩を含む、ヒトを含む哺乳動物の疾患又は障害又は状態（その疾患、障害又は状態は G A B A_A レセプター複合体の調節に反応性がある）を治療、予防又は緩和するための医薬組成物。

【請求項 7】

疾患、障害又は状態が、不安障害、広場恐怖症のある又はないパニック障害、パニック

障害の病歴のない広場恐怖症、恐怖症、動物恐怖症、社会恐怖症、強迫性障害（OCD）、全般性不安障害、物質誘発性不安障害、ストレス障害、外傷後ストレス障害、分離不安障害、急性ストレス障害、睡眠障害、記憶障害、神経症、痙攣性障害、てんかん、発作、痙攣、小児の熱性痙攣、気分障害、抑うつ障害、双極性障害、抑うつ、大うつ病性障害、一回発症大うつ病性障害、再発性大うつ病性障害、気分変調性障害、双極性障害、躁病、双極Ⅰ型躁病、双極ⅠⅡ型躁病、気分循環性障害、精神病性障害、統合失調症、認知障害、学習障害、記憶障害及び機能障害、認知症、注意欠陥、注意欠陥多動障害（ADHD）、ダウン症候群、トゥレット症候群、アルツハイマー病、パーキンソン病、ハンチントン病、ピック病、クロイツフェルトヤコブ病、認知機能障害、統合失調症における認知障害、抜毛癖、吃音症、全身性チック障害、筋肉緊張性障害、脳虚血、卒中、頭部外傷、脳虚血により生じる神経変性、急性疼痛、慢性疼痛、軽度の疼痛、中程度の疼痛又は激痛からなる疼痛、術後疼痛、神経因性疼痛、中枢神経障害性疼痛、糖尿病性神経障害に関連する、帯状疱疹後神経痛に関連する、末梢神経損傷に関連する、幻肢痛に関連する、線維筋痛症に関連する、慢性局所性疼痛症候群に関連する疼痛、体性痛、内臓痛又は皮膚痛、炎症又は感染により引き起こされる疼痛、骨関節症に関連する疼痛、リウマチ様関節炎、神経興奮性亢進障害、末梢神経興奮性亢進、慢性頭痛、片頭痛、片頭痛関連障害、緊張型頭痛、侵害受容性嘔吐、急性、遅発性及び先行性嘔吐、化学療法又は放射線により誘発される特定の嘔吐、乗物酔い、術後悪心、嘔吐、摂食障害、栄養補給障害、肥満症、体重増加、神経性食欲不振、神経性過食症、神経性オルトレキシア、むちゃ食い障害（BED）、月経前症候群、神経痛、三叉神経痛、筋痙攣、例えば対麻痺患者における痙攣、物質乱用又は依存の影響、アルコール離脱、耳鳴、日周期リズムの障害、時差ぼけ又は交代勤務の影響に苦しめられている対象における日周期リズムの障害、1型糖尿病、2型糖尿病、高インスリン血症、異脂肪血症、高脂血症、炎症性疾患又は自己免疫性障害である、請求項6に記載の医薬組成物。