

【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17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2005-510456(P2005-510456A)

【公表日】平成17年4月21日(2005.4.21)

【年通号数】公開・登録公報2005-016

【出願番号】特願2002-591456(P2002-591456)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 211/58

A 6 1 K 31/4468

A 6 1 K 31/4525

A 6 1 K 31/4535

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/12

A 6 1 P 1/14

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 13/02

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 23/00

A 6 1 P 25/02

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/30

A 6 1 P 25/32

A 6 1 P 25/34

A 6 1 P 25/36

A 6 1 P 29/00

C 0 7 D 401/06

C 0 7 D 405/06

C 0 7 D 409/06

C 0 7 D 417/06

【F I】

C 0 7 D 211/58

A 6 1 K 31/4468

A 6 1 K 31/4525

A 6 1 K 31/4535

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/12

A 6 1 P 1/14

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 13/02  
 A 6 1 P 19/08  
 A 6 1 P 23/00  
 A 6 1 P 25/02  
 A 6 1 P 25/16  
 A 6 1 P 25/18  
 A 6 1 P 25/22  
 A 6 1 P 25/30  
 A 6 1 P 25/32  
 A 6 1 P 25/34  
 A 6 1 P 25/36  
 A 6 1 P 29/00  
 C 0 7 D 401/06  
 C 0 7 D 405/06  
 C 0 7 D 409/06  
 C 0 7 D 417/06

## 【手続補正書】

【提出日】平成17年5月11日(2005.5.11)

## 【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

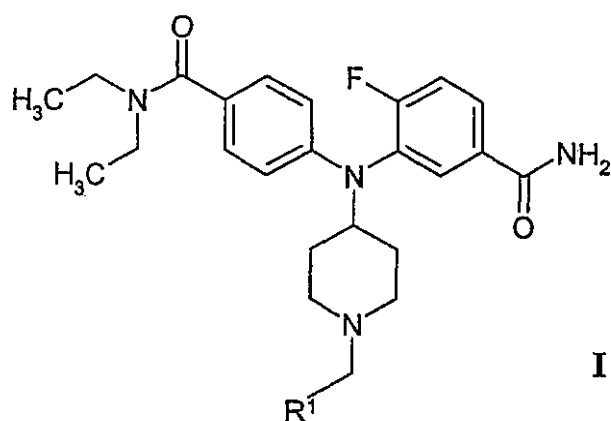
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I

【化1】

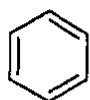


の化合物又はその塩。

式 I 中、R<sup>1</sup>は、

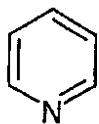
(i) フェニル

【化2】



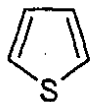
(ii) ピリジニル

【化 3】



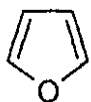
(iii) チエニル

【化 4】



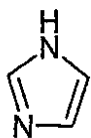
(iv) フラニル

【化 5】



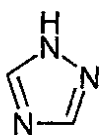
(v) イミダゾリル

【化 6】



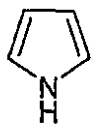
(vi) トリアゾリル

【化 7】



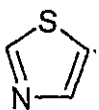
(vii) ピロリル

【化 8】



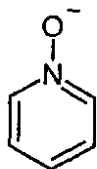
(viii) チアゾリル

【化 9】



(ix) ピリジル - N - オキシド

## 【化 10】



のいずれか一つから選ばれ、その際、 $R^1$ フェニル環及び $R^1$ 複素芳香族環は、それぞれ独立して、直鎖及び分枝  $C_1 - C_6$ アルキル、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、クロロ、フルオロ、ブromo及びヨードから独立して選ばれる 1、2 又は 3 個の置換基によってさらに置換されていてもよい。

## 【請求項 2】

$R^1$ フェニル環及び $R^1$ 複素芳香族環がそれぞれ独立してメチル、 $CF_3$ 、クロロ、フルオロ、ブromo及びヨードから独立して選ばれる 1、2 又は 3 個の置換基によってさらに置換されていてもよい請求項 1 記載の化合物。

## 【請求項 3】

$R^1$ フェニル環及び $R^1$ 複素芳香族環は、それぞれ独立してメチル基によってさらに置換されていてもよい請求項 1 記載の化合物。

## 【請求項 4】

$R^1$ がピリジニル、ピロリル、チエニル又はフラニルである請求項 1 記載の化合物。

## 【請求項 5】

[(1 - ベンジル - ピペリジン - 4 - イル) - (4 - ジエチル - カルバモイル - フェニル) - アミノ] - フルオロ - ベンズアミド、

[(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - (1 - ピリジン - 2 - イルメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミノ] - フルオロ - ベンズアミド、

[(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - (1 - チオフェン - 3 - イルメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミノ] - フルオロ - ベンズアミド、

[(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - (1 - フラン - 3 - イルメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミノ] - フルオロ - ベンズアミド、

[(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - (1 - チオフェン - 2 - イルメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミノ] - フルオロ - ベンズアミド、

[[1 - (2, 4 - ジクロロ - ベンジル) - ピペリジン - 4 - イル] - (4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - アミノ] - フルオロ - ベンズアミド、

[(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - (1 - チアゾール - 2 - イルメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミノ] - フルオロ - ベンズアミド、

[[1 - (4 - ブromo - ベンジル) - ピペリジン - 4 - イル] - (4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - アミノ] - フルオロ - ベンズアミド、

[(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - (1 - フラン - 2 - イルメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミノ] - フルオロ - ベンズアミド、

[(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - (1 - ピリジン - 4 - イルメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミノ] - フルオロ - ベンズアミド、

[[1 - (4 - クロロ - ベンジル) - ピペリジン - 4 - イル] - (4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - アミノ] - フルオロ - ベンズアミド、

[(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - (1 - ピリジン - 3 - イルメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミノ] - フルオロ - ベンズアミド、

{(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - [1 - (3 H - イミダゾール - 4 - イルメチル) - ピペリジン - 4 - イル] - アミノ} - フルオロ - ベンズアミド、

{(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - [1 - (1 H - イミダゾール - 2 - イルメチル) - ピペリジン - 4 - イル] - アミノ} - フルオロ - ベンズアミド、及び

{(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - [1 - (1 H - ピロール - 2 - イルメチル) - ピペリジン - 4 - イル] - アミノ} - フルオロ - ベンズアミド、

ル) - ピペリジン - 4 - イル] - アミノ} - フルオロ - ベンズアミド  
 のいずれか一つから選ばれる請求項 1 記載の化合物。

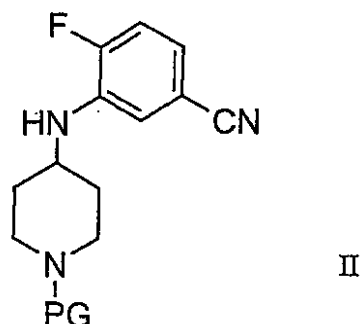
【請求項 6】

塩酸塩、二塩酸塩、硫酸塩、酒石酸塩、ジトリフルオロ酢酸塩又はクエン酸塩の形態の  
 請求項 1 ~ 5 のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 7】

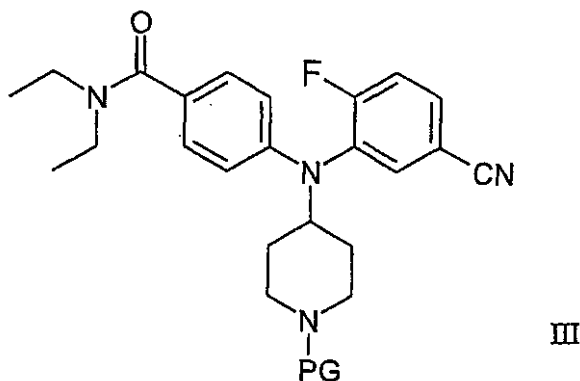
一般式 II

【化 1 1】



(式中、PGは、ウレタン保護基、又はベンジルもしくは置換されたベンジル保護基である)の化合物を、塩基の存在下で、パラジウム触媒を用いてN,N - ジエチル - 4 - ブロ  
 モベンズアミドと反応させて一般式 III

【化 1 2】



の化合物を得、その後、これを標準条件下で脱保護し、そして還元条件下で一般式 R<sup>1</sup> -  
 C H O の化合物を用いてアルキル化して一般式 I の化合物を得ることからなる式 I の化  
 合物の製造方法。

【請求項 8】

式 I の化合物又はその塩を有効成分として含有する医薬。

【請求項 9】

疼痛、不安症又は機能性胃腸障害の治療のための請求項 8 記載の医薬。

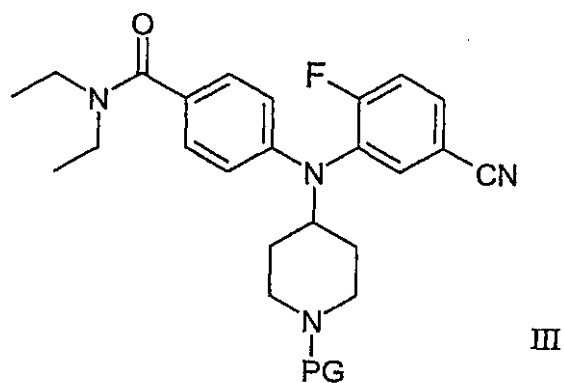
【請求項 10】

脊椎損傷の治療のための請求項 8 記載の医薬。

【請求項 11】

式 III

## 【化 1 3】

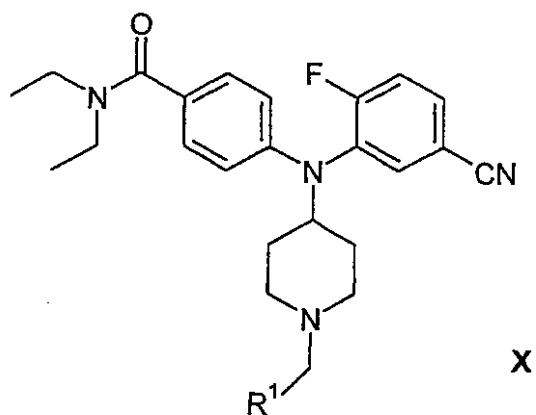


( 式中、 P G は、ウレタン保護基、又はベンジルもしくは置換されたベンジル保護基である ) の化合物。

## 【請求項 1 2】

一般式 X

## 【化 1 4】



( 式中、 R<sup>1</sup> は、フェニル、ピリジニル、チエニル、フラニル、イミダゾリル、トリアゾリル、ピロリル、チアゾリル又はピリジル - N - オキシドから選択され、 P G は、ウレタン保護基、又はベンジルもしくは置換されたベンジル保護基である ) の化合物。