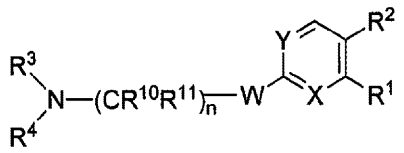
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成28年6月23日(2016.6.23)

【公表番号】特表2015-516432(P2015-516432A)
【公表日】平成27年6月11日(2015.6.11)
【年通号数】公開・登録公報2015-038
【出願番号】特願2015-511676(P2015-511676)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 215/24 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 471/04 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 401/12 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 495/04 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 513/04 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 487/04 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 401/14 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 401/04 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 519/00 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 231/56 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/496 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4725 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4709 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/519 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4985 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4375 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/551 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/16 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/14 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/18 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/28 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/24 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/30 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/22 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/20 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 215/24 ＣＳＰ
Ｃ０７Ｄ 471/04 １０６Ｃ
Ｃ０７Ｄ 401/12
Ｃ０７Ｄ 495/04 １０５Ａ
Ｃ０７Ｄ 471/04 １１７Ｎ
Ｃ０７Ｄ 471/04 １０６Ｈ
Ｃ０７Ｄ 471/04 １２０
Ｃ０７Ｄ 513/04 ３４３
Ｃ０７Ｄ 471/04 １１７Ｚ
Ｃ０７Ｄ 487/04 １４４
Ｃ０７Ｄ 401/14
Ｃ０７Ｄ 401/04
Ｃ０７Ｄ 471/04 １１４Ａ

Ｃ０７Ｄ	519/00	３０１
Ｃ０７Ｄ	519/00	３１１
Ｃ０７Ｄ	471/04	１２１
Ｃ０７Ｄ	231/56	Ｚ
Ａ６１Ｋ	31/496	
Ａ６１Ｋ	31/4725	
Ａ６１Ｋ	31/4709	
Ａ６１Ｋ	31/519	
Ａ６１Ｋ	31/4985	
Ａ６１Ｋ	31/4375	
Ａ６１Ｋ	31/551	
Ａ６１Ｐ	25/00	
Ａ６１Ｐ	25/16	
Ａ６１Ｐ	25/14	
Ａ６１Ｐ	25/18	
Ａ６１Ｐ	25/28	
Ａ６１Ｐ	25/24	
Ａ６１Ｐ	25/30	
Ａ６１Ｐ	25/22	
Ａ６１Ｐ	25/06	
Ａ６１Ｐ	25/20	

【手続補正書】
【提出日】平成28年5月2日(2016.5.2)
【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)の化合物、又はその医薬として許容し得る塩もしくは立体異性体:
【化１】



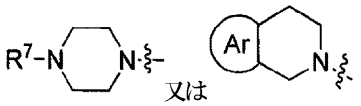
(I),

(式中、
nは、2、3、又は4であり;
Wは、O、NR^5、又はCH_2であり;
Xは、N又はCHであり;
Yは、N又はCHであり;
各々のR^{10}及び各々のR^{11}は、独立に、H、F、OH、又は(C_1-C_4)アルキルであり;
(i)R^1は、アミド、スルホンアミド、任意に置換されたイミダゾリル、もしくは任意に置換されたピラゾリルであり;かつR^2は、H、ハロゲン、CN、(C_1-C_4)アルキル、もしくは(C_1-C_3)アルコキシルであるか;又は(ii)R^1及びR^2は、それらが結合している炭素原子と一緒に、その各々が1～3個のR^6で任意に置換されている、5、6、もしくは7員アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、もしくはヘテロシクリル環を形成し;

R^3及びR^4は、それらが結合している窒素原子と一緒に、任意に置換されたヘテロシクリルQを形成し;

Qは、

【化２】



であり;

R^5は、H又は$(C_1\text{-}C_3)$アルキルであり;

各々のR^6は、独立に、OH、ケト、ハロゲン、CN、$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、又は$(C_1\text{-}C_3)$アルコキシルであり;

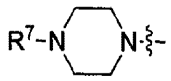
R^7は、1～3個の置換基で各々任意に置換された、5～10員アリール又はヘテロアリールであり;かつ

環Arは、1～3個の置換基で各々任意に置換された、ベンゾ、ピラゾロ、ピリド、チエノ、ピリミド、ピラジノ、フラノ、ピリダジノ、チアゾロ、又はイミダゾロ環であり;

但し:

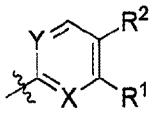
(i)Qが

【化３】



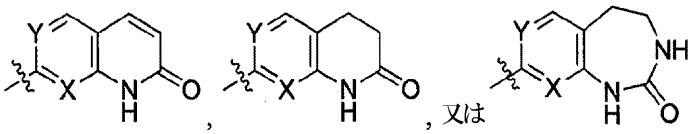
である場合、

【化４】



は、

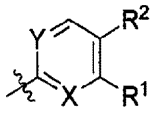
【化５】



ではなく;かつ

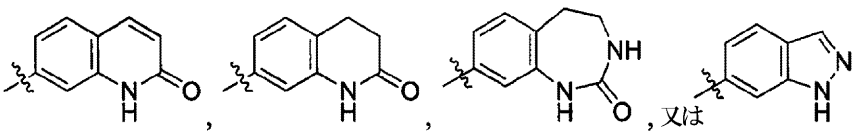
(ii)Arが、任意に置換されたベンゾ環である場合、

【化６】



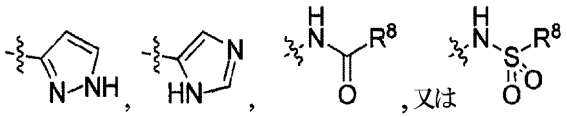
は、

【化７】

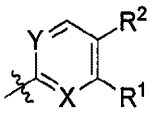


ではない)。

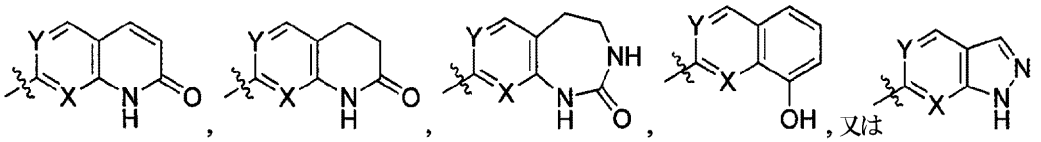
【請求項２】
nが4である、請求項1記載の化合物。
【請求項３】
Wが0である、請求項1又は2記載の化合物。
【請求項４】
R^{10}及びR^{11}がHである、請求項1～3のいずれか一項記載の化合物。
【請求項５】
R^1が、
【化８】



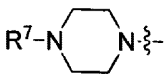
であり;ここで、R^8が、$(C_1\text{-}C_5)$アルキル又は任意に置換されたフェニルである、請求項1～4のいずれか一項記載の化合物。
【請求項６】
【化９】



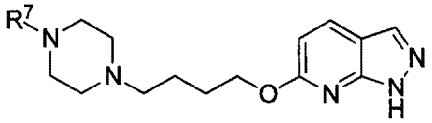
が、
【化１０】



である、請求項1～4のいずれか一項記載の化合物。
【請求項７】
Qが、
【化１１】



である、請求項1～6のいずれか一項記載の化合物。
【請求項８】
式(III-a)を有する、請求項1記載の化合物:
【化１２】



(III-a)

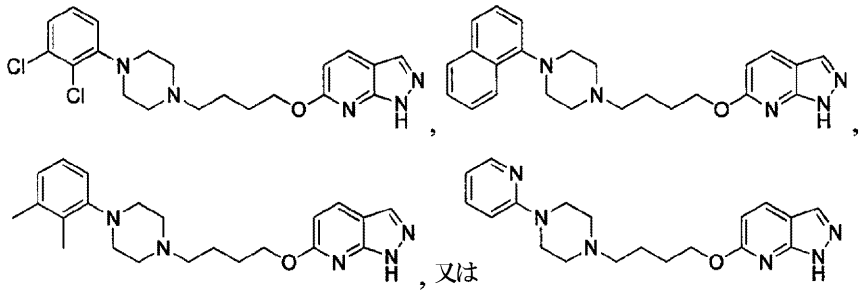
。
【請求項９】
R^7が、その各々が、ハロ、シアノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、1以上のフル

オロで任意に置換された(C_1-C_3)アルキル、及び1以上のフルオロで任意に置換された(C_1-C_3)アルコキシルから独立に選択される1～3個の置換基で任意に置換されている、フェニル、ピリジル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリミジニル、又はナフチルである、請求項8記載の化合物。

【請求項１０】

下記のものである、請求項8記載の化合物:

【化１３】



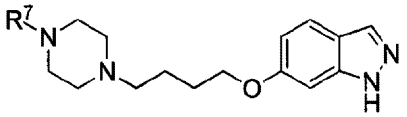
,又は

。

【請求項１１】

式(III-b)を有する、請求項1記載の化合物:

【化１４】



(III-b)

。

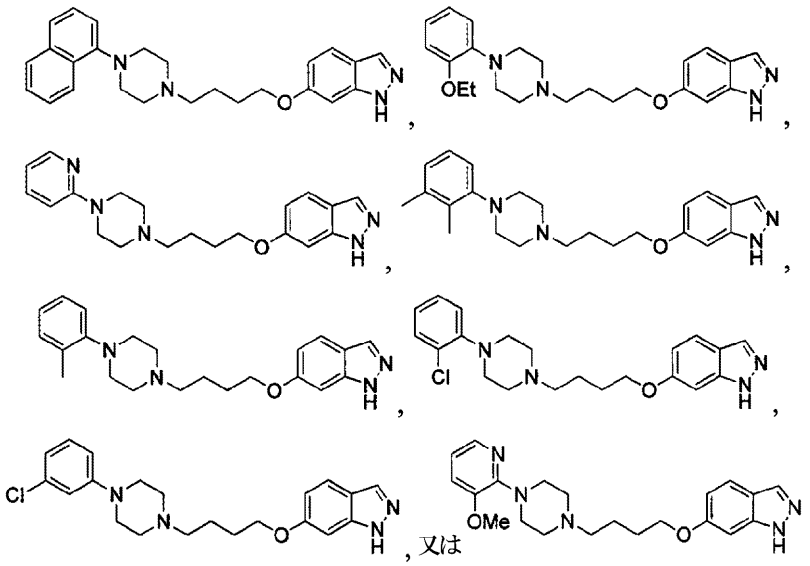
【請求項１２】

R^7が、その各々が、ハロ、シアノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、1以上のフルオロで任意に置換された(C_1-C_3)アルキル、及び1以上のフルオロで任意に置換された(C_1-C_3)アルコキシルから独立に選択される1～3個の置換基で任意に置換されている、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、又はナフチルである、請求項11記載の化合物。

【請求項１３】

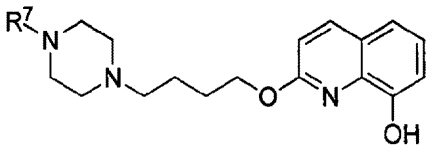
下記のものである、請求項11記載の化合物:

【化１５】



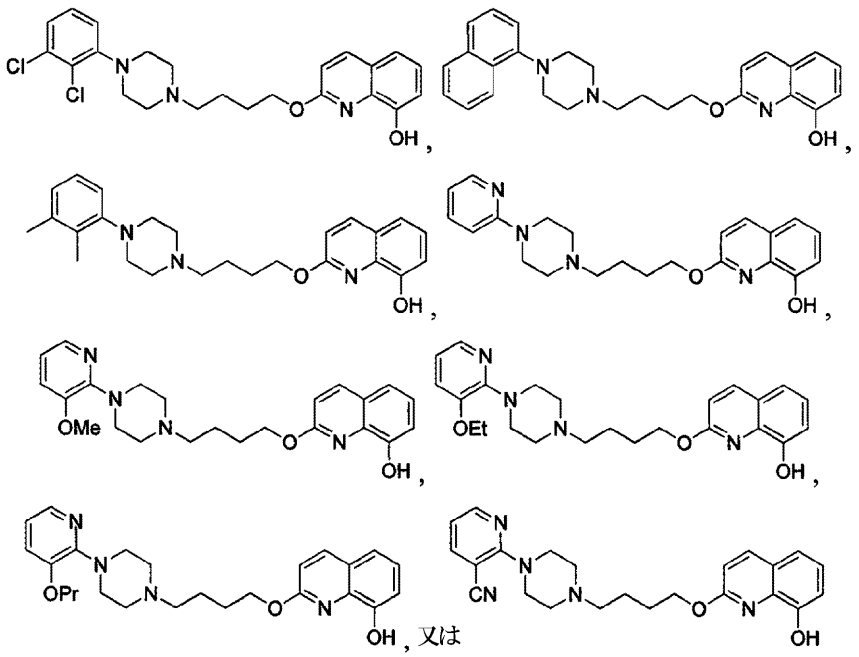
,又は

。
【請求項１４】
式(III-c)を有する、請求項1記載の化合物:
【化１６】

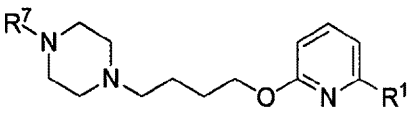


(III-c)

。
【請求項１５】
R^7が、その各々が、ハロ、シアノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、1以上のフルオロで任意に置換された$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、及び1以上のフルオロで任意に置換された$(C_1\text{-}C_3)$アルコキシルから独立に選択される1～3個の置換基で任意に置換されている、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、又はナフチルである、請求項14記載の化合物。
【請求項１６】
下記のものである、請求項14記載の化合物:
【化１７】



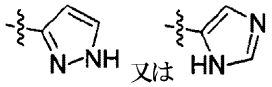
。
【請求項１７】
式(III-d)を有する、請求項1記載の化合物:
【化１８】



(III-d)

。
【請求項１８】
R^1が、

【化１９】



である、請求項17記載の化合物。

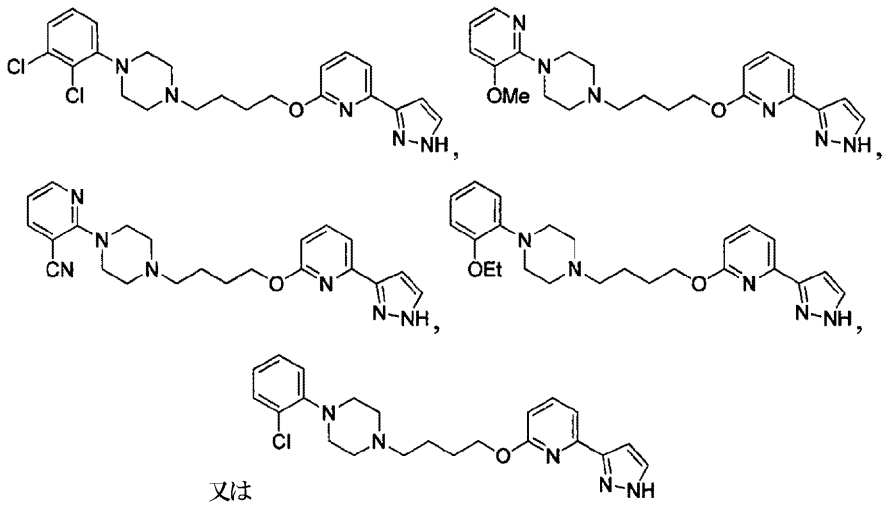
【請求項１９】

R^7が、その各々が、ハロ、シアノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、1以上のフルオロで任意に置換された$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、及び1以上のフルオロで任意に置換された$(C_1\text{-}C_3)$アルコキシルから独立に選択される1～3個の置換基で任意に置換されている、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、又はナフチルである、請求項17又は18記載の化合物。

【請求項２０】

下記のものである、請求項17記載の化合物:

【化２０】

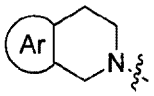


。

【請求項２１】

Qが、

【化２１】

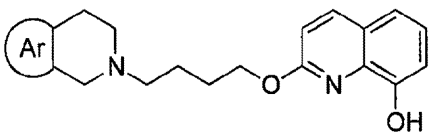


である、請求項1～6のいずれか一項記載の化合物。

【請求項２２】

式(IV-a)を有する、請求項1記載の化合物:

【化２２】



(IV-a)

。

【請求項２３】

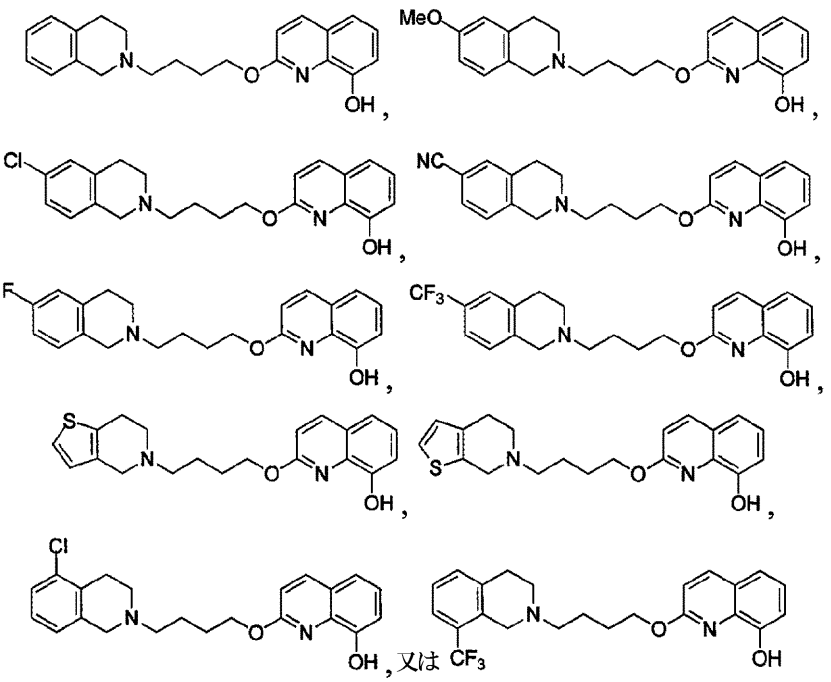
環Arが、その各々が、ハロ、シアノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、1以上のフ

ルオロで任意に置換された(C_1-C_3)アルキル、及び1以上のフルオロで任意に置換された(C_1-C_3)アルコキシルから独立に選択される1～3個の置換基で任意に置換されている、ベンゾ又はチエノ環である、請求項22記載の化合物。

【請求項２４】

下記のものである、請求項22記載の化合物:

【化２３】

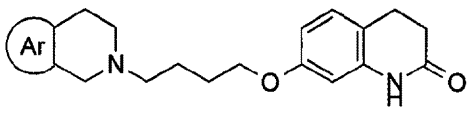


。

【請求項２５】

式(IV-b)を有する、請求項1記載の化合物:

【化２４】



(IV-b)

。

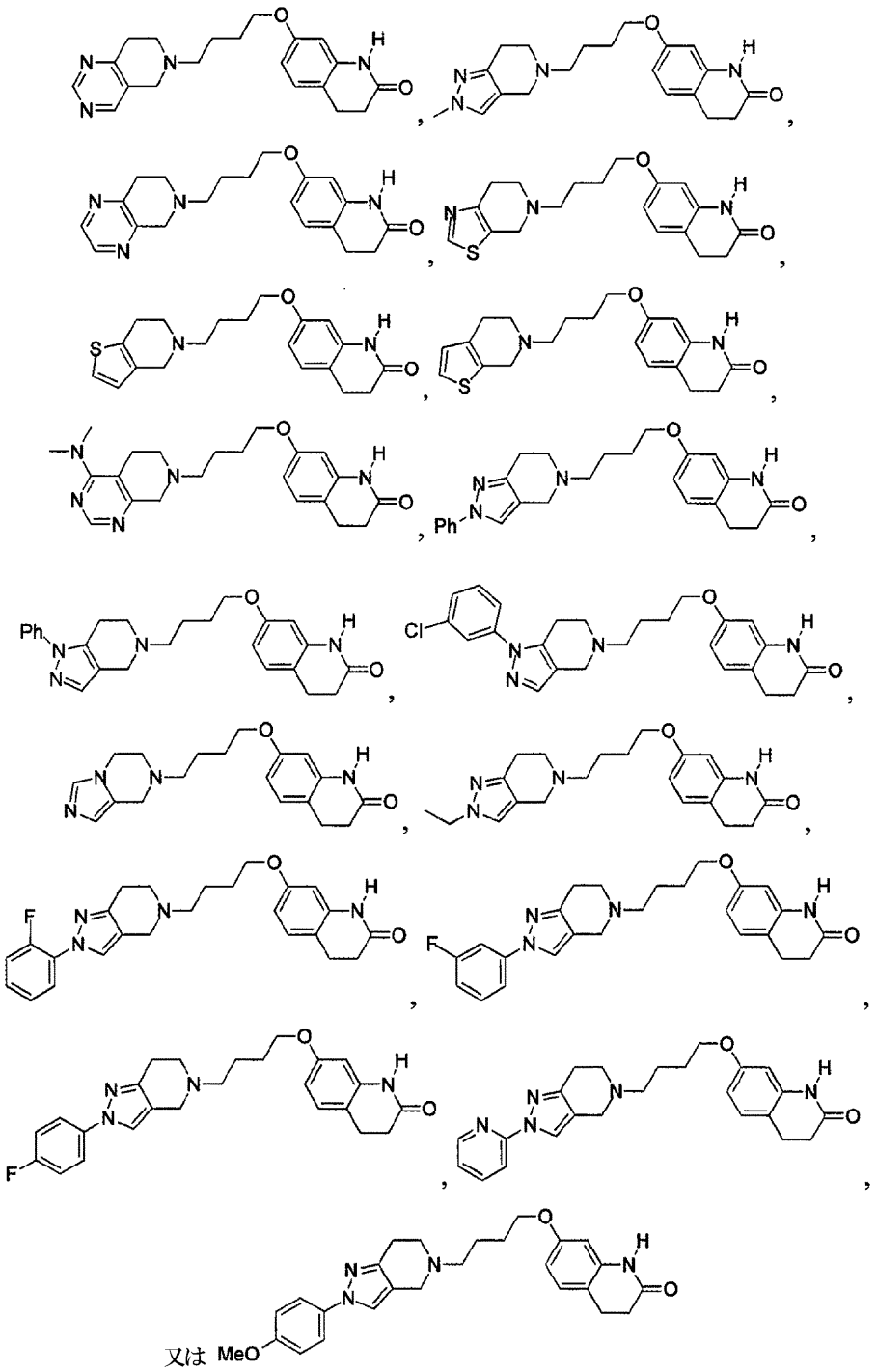
【請求項２６】

環Arが、その各々が、ハロ、シアノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、1以上のフルオロで任意に置換された(C_1-C_3)アルキル、1以上のフルオロで任意に置換された(C_1-C_3)アルコキシル、任意に置換されたフェニル、及び任意に置換されたピリジルから独立に選択される1～3個の置換基で任意に置換されている、ピラゾロ、チエノ、ピリミド、ピラジノ、チアゾロ、イミダゾロ、フラノ、又はピリダジノ環である、請求項25記載の化合物。

【請求項２７】

下記のものである、請求項25記載の化合物:

【化２５】

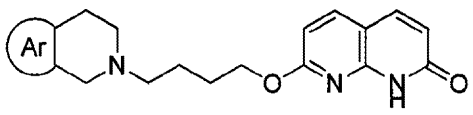


。

【請求項２８】

式(IV-c)を有する、請求項1記載の化合物:

【化２６】



(IV-c)

。

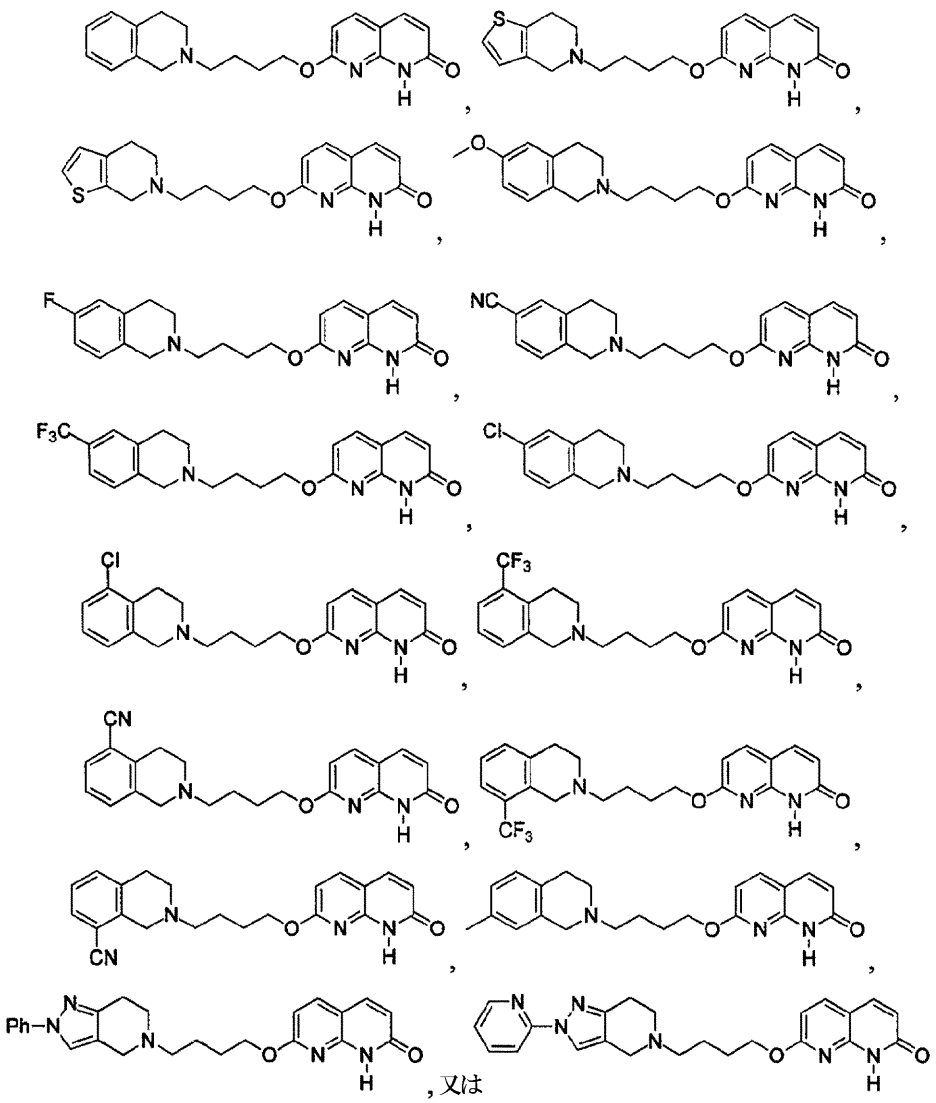
【請求項２９】

環Arが、その各々が、ハロ、シアノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、1以上のフルオロで任意に置換された(C_1-C_3)アルキル、1以上のフルオロで任意に置換された(C_1-C_3)アルコキシル、任意に置換されたフェニル、及び任意に置換されたピリジルから独立に選択される1～3個の置換基で任意に置換されている、ベンゾ、ピラゾロ、チエノ、ピリミド、ピラジノ、チアゾロ、イミダゾロ、フラノ、又はピリダジノ環である、請求項28記載の化合物。

【請求項３０】

下記のものである、請求項28記載の化合物:

【化２７】



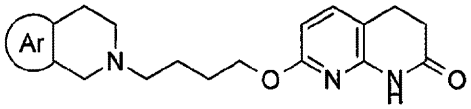
,又は

。

【請求項３１】

式(IV-d)を有する、請求項1記載の化合物:

【化２８】



(IV-d)

。

【請求項３２】

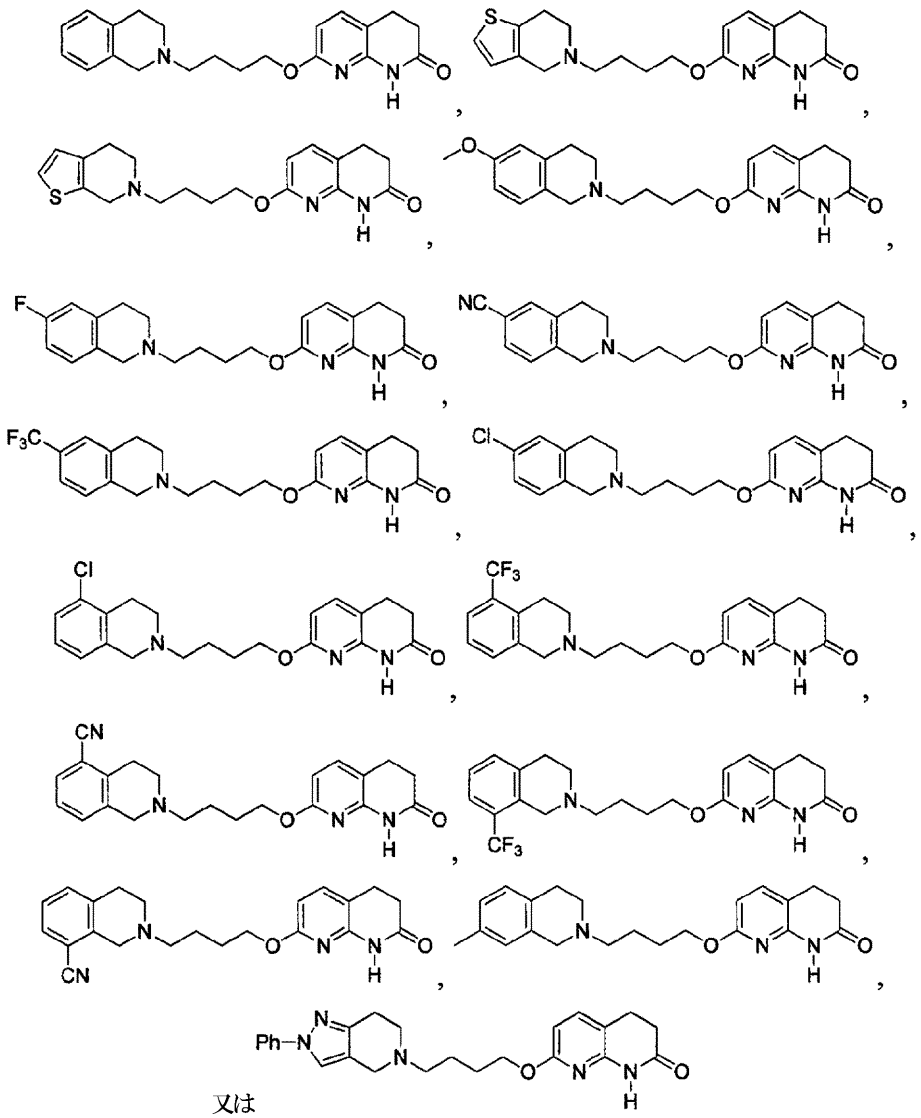
環Arが、その各々が、ハロ、シアノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、1以上のフ

ルオロで任意に置換された(C_1-C_3)アルキル、1以上のフルオロで任意に置換された(C_1-C_3)アルコキシル、任意に置換されたフェニル、及び任意に置換されたピリジルから独立に選択される1～3個の置換基で任意に置換されている、ベンゾ、ピラゾロ、チエノ、ピリミド、ピラジノ、チアゾロ、イミダゾロ、フラノ、又はピリダジノ環である、請求項31記載の化合物。

【請求項３３】

下記のものである、請求項31記載の化合物:

【化２９】

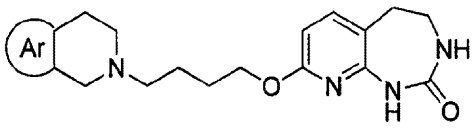


。

【請求項３４】

式(IV-e)を有する、請求項1記載の化合物:

【化３０】



(IV-e)

。

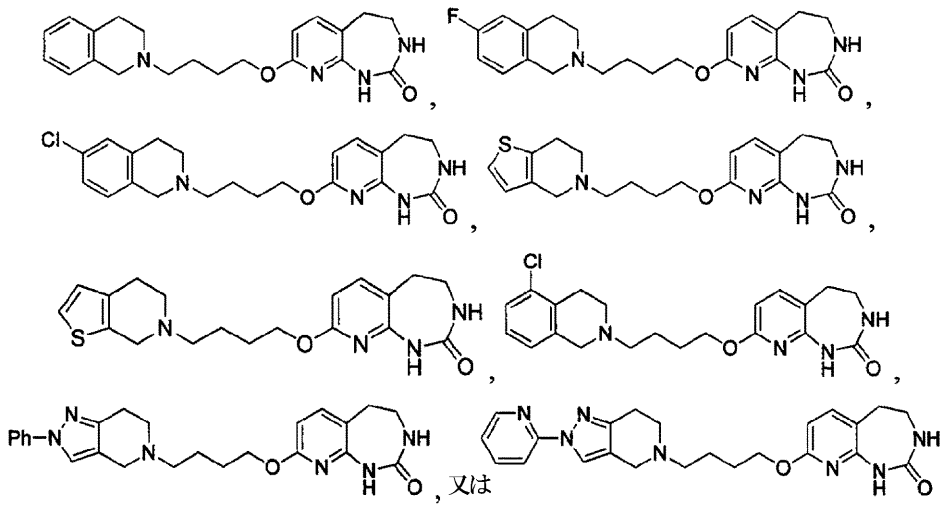
【請求項３５】

環Arが、その各々が、ハロ、シアノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、1以上のフルオロで任意に置換された(C_1-C_3)アルキル、1以上のフルオロで任意に置換された(C_1-C_3)アルコキシル、任意に置換されたフェニル、及び任意に置換されたピリジルから独立に選択される1～3個の置換基で任意に置換されている、ベンゾ、ピラゾロ、チエノ、ピリミド、ピラジノ、チアゾロ、イミダゾロ、フラノ、又はピリダジノ環である、請求項34記載の化合物。

【請求項３６】

下記のものである、請求項34記載の化合物:

【化３１】

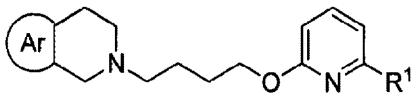


。

【請求項３７】

式(IV-f)を有する、請求項1記載の化合物:

【化３２】



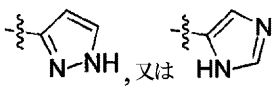
(IV-f)

。

【請求項３８】

R^1が、-NHCO(C_1-C_3)アルキル、-NHS(O)$_2$(C_1-C_3)アルキル、

【化３３】



である、請求項37記載の化合物。

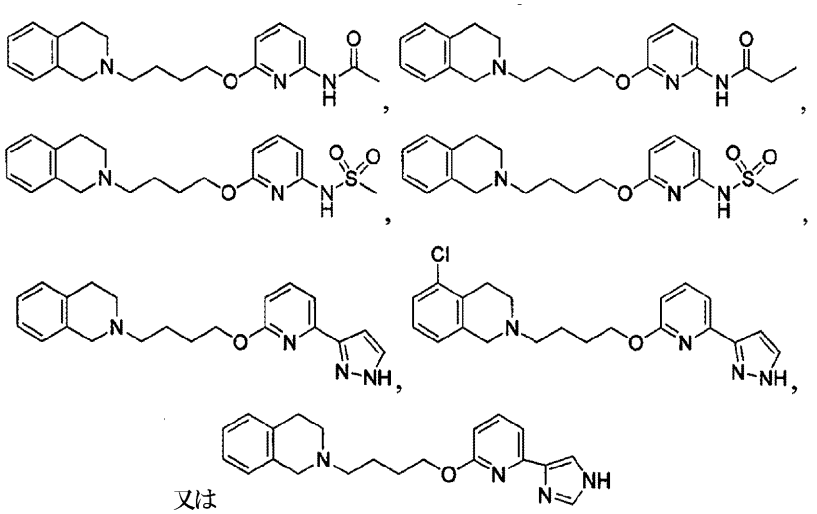
【請求項３９】

環Arが、ハロ、シアノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、1以上のフルオロで任意に置換された(C_1-C_3)アルキル、及び1以上のフルオロで任意に置換された(C_1-C_3)アルコキシルから独立に選択される1～3個の置換基で任意に置換されたベンゾ環である、請求項37又は38記載の化合物。

【請求項４０】

下記のものである、請求項37記載の化合物:

【化３４】



。

【請求項４１】

請求項1～40のいずれか一項記載の化合物、又はその医薬として許容し得る塩もしくは立体異性体を含む、医薬組成物。

【請求項４２】

1種以上の追加の活性剤をさらに含む、請求項41記載の医薬組成物。

【請求項４３】

CNS障害又は神経学的障害を治療、予防、又は管理するための医薬組成物であって、請求項1～40のいずれか一項記載の化合物、又はその医薬として許容し得る塩もしくは立体異性体を含む、前記医薬組成物。

【請求項４４】

前記障害が、パーキンソン病、運動障害、運動失調症、筋失調症、本態性振戦、ハンチントン病、多系統萎縮症、ミオクローヌス、進行性核上まひ、レット症候群、続発性パーキンソニズム、痙直、遅発性ジスキネジア、ウィルソン病、ジスキネジア、又はレストレスレッグ症候群である、請求項43記載の医薬組成物。

【請求項４５】

前記障害が、統合失調症、精神病、統合失調症関連障害、統合失調症スペクトラム障害、急性統合失調症、慢性統合失調症、NOS統合失調症、統合失調感情障害、統合失調症様障害、パラフレニー、妄想性パーソナリティ障害、スキゾイドパーソナリティ障害、統合失調型パーソナリティ障害、妄想性障害、精神病の要素を有する疾患、精神病性障害、短期精神病性障害、アルツハイマー病性精神病、パーキンソン病性精神病、共有精神病性障害、物質誘発性精神病性障害、一般的な医学的疾患による精神病性障害、精神病性情動障害、攻撃性、せん妄、興奮性精神病、トゥレット症候群、躁障害、器質性精神病、又はNOS精神病である、請求項43記載の医薬組成物。

【請求項４６】

前記障害が、情動障害;鬱病;軽度、中等度、もしくは重度型の大鬱病エピソード;躁病性もしくは混合性気分エピソード;軽躁病性気分エピソード;非定型の特徴を伴う鬱病エピソード;メランコリアの特徴を伴う鬱病エピソード;緊張病の特徴を伴う鬱病エピソード;分娩後の発症を伴う気分エピソード;卒中後鬱病;大鬱病性障害;単極性鬱病;治療抵抗性鬱病;気分変調症性障害;小鬱病性障害;月経前不快気分障害;統合失調症の精神病後鬱病性障害;精神病性障害に併発する大鬱病性障害;双極性障害;双極I型障害;双極II型障害;気分循環性障害;季節性情動障害;注意欠陥障害;又は注意欠陥多動性障害である、請求項43記載の医薬組成物。

【請求項４７】

前記障害が、中毒又は物質乱用もしくは依存である、請求項43記載の医薬組成物。

【請求項４８】
前記障害が、心的外傷後ストレス障害、行動障害、神経変性疾患、アルツハイマー病、認知症、気分障害、不安症、強迫性障害、目眩、疼痛、神経因性疼痛、神経因性疼痛を伴う感作、炎症性疼痛、線維筋痛、片頭痛、認知障害、認知機能障害、統合失調症と関連する認知機能障害、アルツハイマー病における認知欠陥、パーキンソン病における認知欠陥、多発性硬化症、睡眠障害、摂食障害、又は自閉症である、請求項43記載の医薬組成物。
【請求項４９】
第二の活性剤をさらに含む、請求項43～48のいずれか一項記載の医薬組成物。