

【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18年2月23日(2006.2.23)

【公表番号】特表2002-501046(P2002-501046A)

【公表日】平成14年1月15日(2002.1.15)

【出願番号】特願2000-528537(P2000-528537)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 205/04 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/397 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/4427 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/4523 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/04 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/08 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/20 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/22 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/30 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/32 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

**C 0 7 D 401/06 (2006.01)**

**C 0 7 D 401/12 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 D 205/04

A 6 1 K 31/397

A 6 1 K 31/4427

A 6 1 K 31/4523

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/30

A 6 1 P 25/32

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 401/06

C 0 7 D 401/12

【手続補正書】

【提出日】平成18年1月5日(2006.1.5)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

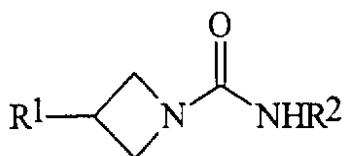
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 式(1)の化合物およびその薬学的に受容可能な付加化合物であって

【化1】



(1)

ここで、R<sup>1</sup>は置換アリアルであり、そしてR<sup>2</sup>は水素またはアルキルである、化合物およびその薬学的に受容可能な付加化合物。

【請求項2】 請求項1に記載の化合物であって、ここで、R<sup>1</sup>が置換フェニルおよび置換ナフチルから選択される、化合物。

【請求項3】 請求項1または2に記載の化合物であって、ここで、R<sup>1</sup>が1、2または3個の置換基を有する、化合物。

【請求項4】 請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物であって、ここで、R<sup>1</sup>がハロ、トリフルオロメチルおよびtert-ブチルから選択される1個以上の置換基で置換される、化合物。

【請求項5】 請求項4に記載の化合物であって、ここで、前記ハロ基がクロロおよびフルオロから選択される、化合物。

【請求項6】 請求項1、2、3、4または5に記載の化合物であって、ここで、R<sup>1</sup>がメタ置換フェニル基またはパラ置換フェニル基である、化合物。

【請求項7】 請求項1に記載の化合物であって、ここで、R<sup>1</sup>が4-クロロフェニル、4-フルオロフェニル、4-(トリフルオロメチル)フェニルおよび3-(トリフルオロメチル)フェニルから選択される、化合物。

【請求項8】 請求項1、2、3、4または5に記載の化合物であって、ここで、R<sup>1</sup>が2,3-二置換フェニル基、2,4-二置換フェニル基、3,4-二置換フェニル基および3,5-二置換フェニル基である、化合物。

【請求項9】 請求項8に記載の化合物であって、ここで、R<sup>1</sup>が同一または異なる2個のハロ基で、あるいは1個のハロ基および1個のトリフルオロメチル基で置換される、化合物。

【請求項10】 請求項9に記載の化合物であって、ここで、R<sup>1</sup>がジクロロ-置換、ジフルオロ-置換、クロロ-フルオロ-置換またはフルオロ-トリフルオロメチル-置換される、化合物。

【請求項11】 請求項1に記載の化合物であって、ここで、R<sup>1</sup>が3,4-ジクロロフェニル、3,4-ジフルオロフェニル、3-クロロ-4-フルオロフェニル、4-クロロ-3-フルオロフェニル、3-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル、4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニルおよび3-クロロ-5-フルオロフェニルから選択される、化合物。

【請求項12】 請求項1～11のいずれか1項に記載の化合物であって、ここで、R<sup>2</sup>がアルキルである、化合物。

【請求項13】 請求項1～12のいずれか1項に記載の化合物であって、ここで、R<sup>2</sup>がC<sub>1-8</sub>アルキルである、化合物。

【請求項14】 請求項1～13のいずれか1項に記載の化合物であって、ここで、R<sup>2</sup>がアルケニル、アルキニル、ヒドロキシアルキルまたはアルコキシアルキルである、化合物。

【請求項15】 請求項1～13のいずれか1項に記載の化合物であって、ここで、R<sup>2</sup>が非置換の飽和した環式または非環式ヒドロカルビルである、化合物。

【請求項16】 請求項1～13のいずれか1項に記載の化合物であって、ここで、R<sup>2</sup>がプロピル、2-プロペニル、2-プロピニルまたは2-ヒドロキシプロピルである、化合物。

【請求項 17】 請求項 1 に記載の化合物であって、ここで、該化合物が 3 - (4 - クロロフェニル) - N - (2 - プロピニル) アゼチジン - 1 - カルボキサミド、(S) - 3 - (4 - フルオロフェニル) - N - (2 - ヒドロキシプロピル) アゼチジン - 1 - カルボキサミド、3 - (4 - フルオロフェニル) - N - (2 - プロピニル) アゼチジン - 1 - カルボキサミド、(R) - 3 - (4 - フルオロフェニル) - N - (2 - ヒドロキシプロピル) アゼチジン - 1 - カルボキサミド、3 - (4 - クロロフェニル) - N - (2 - プロペニル) アゼチジン - 1 - カルボキサミド、(R) - 3 - (4 - クロロフェニル) - N - (2 - ヒドロキシプロピル) アゼチジン - 1 - カルボキサミド、3 - (4 - フルオロフェニル) - N - (2 - プロペニル) アゼチジン - 1 - カルボキサミド、3 - (4 - (トリフルオロメチル)フェニル) - N - (2 - プロピニル) アゼチジン - 1 - カルボキサミド、(R) - 3 - (4 - (トリフルオロメチル)フェニル) - N - (2 - ヒドロキシプロピル) アゼチジン - 1 - カルボキサミド、(S) - 3 - (4 - (トリフルオロメチル)フェニル) - N - (2 - ヒドロキシプロピル) アゼチジン - 1 - カルボキサミド、3 - (3 - (トリフルオロメチル)フェニル) - N - (2 - プロピニル) アゼチジン - 1 - カルボキサミドおよび 3 - (4 - (トリフルオロメチル)フェニル) - N - アゼチジン - 1 - カルボキサミドから選択される、化合物。

【請求項 18】 治療に使用するための、請求項 1 ~ 17 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 19】 CNS 障害の処置 (予防を含む) のための薬剤の製造における、請求項 1 ~ 17 のいずれか 1 項に記載の化合物の、使用。

【請求項 20】 請求項 19 に記載の使用であって、ここで、前記薬剤が不安、癲癇、不眠 (旅行不眠および末期の疾病に関連した不眠を含む)、アルコール離脱症候群、慢性および急性の疼痛、神経変性疾患、物質乱用に起因する離脱に関する症状または痙性の処置 (予防を含む) のためである、使用。

【請求項 21】 請求項 19 に記載の使用であって、ここで、前記薬剤が不安または癲癇の処置 (予防を含む) のためである、使用。

【請求項 22】 手術または外科的処置の前の筋弛緩のための、すなわち、手術前の前投薬としての、薬剤の製造における、請求項 1 ~ 17 のいずれか 1 項に記載の化合物の、使用。

【請求項 23】 薬学的に受容可能なキャリアまたは賦形剤と組み合わせた、請求項 1 ~ 17 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、薬学的組成物。

【請求項 24】 CNS 障害の処置 (予防を含む) のための組成物であって、請求項 1 ~ 17 のいずれか 1 項に記載の化合物の有効用量を含む、組成物。

【請求項 25】 請求項 24 に記載の組成物であって、ここで、該組成物が、不安、癲癇、不眠 (旅行不眠および末期の疾病に関連した不眠を含む)、アルコール離脱症候群、慢性および急性の疼痛、神経変性疾患、物質乱用に起因する離脱に関する症状または痙性の処置のために処方される、組成物。

【請求項 26】 請求項 24 に記載の組成物であって、ここで、該組成物が、不安または癲癇の処置のために処方される、組成物。

【請求項 27】 手術または外科的処置の前の筋弛緩のための組成物、すなわち、手術前の前投薬のための組成物であって、請求項 1 ~ 17 のいずれか 1 項に記載の化合物の有効用量を含む、組成物。