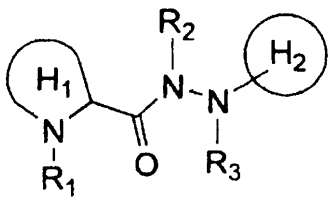
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成18年1月5日(2006.1.5)

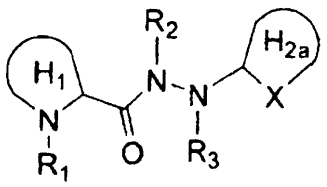
【公表番号】特表2005-506335(P2005-506335A)
【公表日】平成17年3月3日(2005.3.3)
【年通号数】公開・登録公報2005-009
【出願番号】特願2003-532495(P2003-532495)
【国際特許分類】
*Ｃ０７Ｄ 401/12 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/4155 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/437 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/4427 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/4439 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/4545 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/4709 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 3/10 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 9/00 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 21/00 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 25/00 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 25/02 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 25/16 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 25/28 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 403/12 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 409/14 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 471/04 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｂ 61/00 (2006.01)*
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 401/12
Ａ６１Ｋ 31/4155
Ａ６１Ｋ 31/437
Ａ６１Ｋ 31/4427
Ａ６１Ｋ 31/4439
Ａ６１Ｋ 31/4545
Ａ６１Ｋ 31/4709
Ａ６１Ｐ 3/10
Ａ６１Ｐ 9/00
Ａ６１Ｐ 21/00
Ａ６１Ｐ 25/00
Ａ６１Ｐ 25/02
Ａ６１Ｐ 25/16
Ａ６１Ｐ 25/28
Ａ６１Ｐ 43/00 １０５
Ｃ０７Ｄ 403/12
Ｃ０７Ｄ 409/14
Ｃ０７Ｄ 471/04 １０６Ｃ
Ｃ０７Ｂ 61/00 ３００
Ｃ０７Ｍ 7:00

【手続補正書】
【提出日】平成17年9月29日(2005.9.29)
【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】



Ｉ

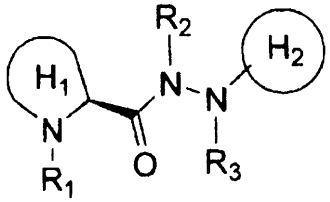
［式中
$H_1$は３個の炭素環原子を有する４員の窒素含有ヘテロシクリル、Ｏ、ＳおよびＮから選択される０もしくは１個の追加のヘテロ原子環員を有する５員の窒素含有ヘテロシクリル、ならびにＯ、ＳおよびＮから選択される０、１もしくは２個の追加のヘテロ原子環員を有する６もしくは７員の窒素含有ヘテロシクリルよりなる群から選択され；
$H_2$は５もしくは６員のヘテロアリールであり；
$R_1$は尿素、$C_1$－$C_{10}$アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－$SO_2$Ｒおよび－Ｐ（Ｏ）（ＯＲ'）（ＯＲ''）から選択され、式中Ｒ、Ｒ'およびＲ''はアルキル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルよりなる群から独立に選択され；そして
$R_2$および$R_3$は独立に水素もしくは$C_1$－$C_{10}$アルキルである］
の化合物、もしくはその製薬学的に許容できる塩。
【請求項２】
式Ｉａ
【化２】



Ia

［式中$H_{2a}$は５もしくは６員のヘテロアリールであり、かつ、ＸはＯ、Ｓおよびさらにここでから選択されるヘテロ原子であり、そして$R_1$、$R_2$、$R_3$および$H_1$は請求項１に記載されるとおりである］
の構造を有する請求項１記載の化合物。
【請求項３】
式Ｉｂ

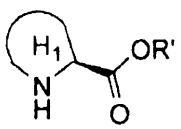
【化３】



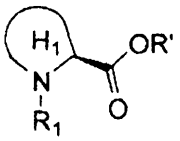
Ib

［式中$R_1$、$R_2$、$R_3$、$H_1$および$H_2$は請求項１に記載されるとおりである］
の構造を有する請求項１記載の化合物。
【請求項４】
$H_2$がβ－炭素原子にて結合される、請求項３記載の化合物。
【請求項５】
$R_1$が$C_1$－$C_{10}$アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）－Ｃ（Ｏ）Ｒおよび－$SO_2$Ｒよりなる群から選択される、請求項３記載の化合物。
【請求項６】
$R_1$が－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）－Ｃ（Ｏ）Ｒおよび－$SO_2$Ｒよりなる群から選択され、式中Ｒがアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよび$C_4$－$C_{10}$直鎖状もしくは分枝状アルキルよりなる群から選択される、請求項５記載の化合物。
【請求項７】
１－（３，３－ジメチル－２－オキソ－ペンタノイル）－ピロリジン－２－カルボン酸Ｎ'－ピリジン－２－イル－ヒドラジドである請求項１記載の化合物。
【請求項８】
１－（２－オキソ－２－チオフェン－２－イル－アセチル）ピペリジン－２－カルボン酸　Ｎ'－（６－メチル－４－トリフルオロメチル－ピリジン－２－イル）－ヒドラジドである、請求項１記載の化合物。
【請求項９】
２－アゼチジンカルボン酸、１－［（フェニルメチル）スルホニル］－、２－（２－ピリジニル）ヒドラジド、（２Ｓ）－である、請求項１記載の化合物。
【請求項１０】
請求項１記載の化合物および製薬学的に許容できる担体を含んで成る製薬学的組成物。
【請求項１１】
疾患もしくは外傷により引き起こされた神経損傷を特徴とする状態に苦しむ被験体を治療する製薬学的組成物の調製のための請求項1記載の化合物の使用。
【請求項１２】
被験体における疾患もしくは外傷により引き起こされる神経損傷を特徴とする状態の発症を阻害する製薬学的組成物の調製のための請求項1記載の使用。
【請求項１３】
状態が脳、脊髄もしくは末梢神経のいずれかの部分に対する外傷により引き起こされる、請求項１１もしくは１２記載の使用。
【請求項１４】
状態が、パーキンソン病、アルツハイマー病、卒中、多発性硬化症、筋萎縮性側索硬化症、末梢神経障害およびベル麻痺よりなる群から選択される、請求項１１もしくは１２記載の使用。
【請求項１５】
状態がパーキンソン病である、請求項１４記載の使用。
【請求項１６】
状態がアルツハイマー病である、請求項１４記載の使用。

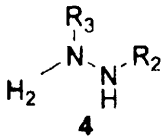
【請求項１７】
状態が糖尿病性ニューロパシーである、請求項１４記載の使用。
【請求項１８】
ニューロンと接触させることにより神経増殖の刺激をする製薬学的組成物の調製のための請求項1記載の化合物の使用。
【請求項１９】
（ａ）下記式で表される化合物１を化合物２に転化すること；および
【化４】



1

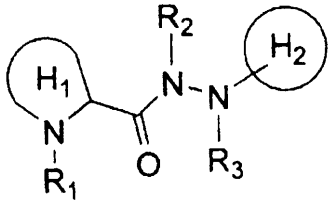


2



4

（ｂ）化合物２を上記式で表される化合物４と反応させて化合物Ｉを形成させることを含んで成る、式Ｉ
【化５】



I

の化合物の製造方法。