

【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25年11月21日(2013.11.21)

【公表番号】特表2013-507371(P2013-507371A)

【公表日】平成25年3月4日(2013.3.4)

【年通号数】公開・登録公報2013-011

【出願番号】特願2012-533272(P2012-533272)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/56 (2006.01)

C 0 7 D 213/61 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 241/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/4418 (2006.01)

A 6 1 K 31/4433 (2006.01)

A 6 1 K 31/4965 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/30 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 213/56 C S P

C 0 7 D 213/61

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 241/12

A 6 1 K 31/4418

A 6 1 K 31/4433

A 6 1 K 31/4965

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/30

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 3/00

【手続補正書】

【提出日】平成25年10月1日(2013.10.1)

【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

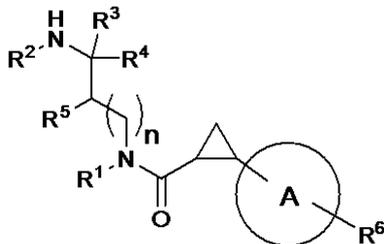
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



(I),

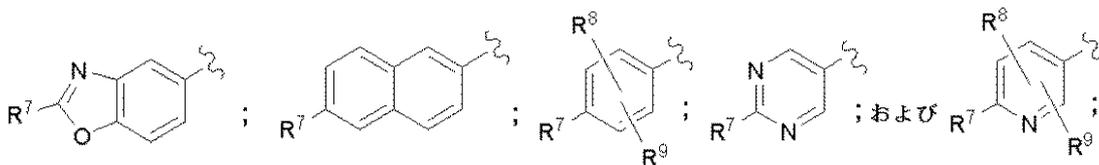
[式中、

nは、0または1であり；

Aは、イミダゾリル；フェニル；ピラジニル；ピリミジニル；ピリジニル；およびチアゾリルから選択され；

R¹は、

【化2】



から選択されるものであって、

ここで、

【化3】



は、親分子部分への結合点を表し；

R²は、水素；C₁-C₃アルキル；C₃-C₆シクロアルキル；およびC₃-C₆シクロアルキル-C₁-C₃アルキルから選択され；

R³は、水素；C₁-C₆アルキル；C₁-C₃アルコキシ-C₁-C₃アルキル；ヒドロキシ-C₁-C₃アルキルから選択されるか；

あるいは、R²およびR³は、それらが結合している原子と一緒になってピロリジン環を形成し；

R⁴は、水素；C₁-C₃アルキル；およびヒドロキシ-C₁-C₃アルキルから選択されるか；あるいは

R³およびR⁴は、それらが結合している炭素原子と一緒になってカルボニル基を形成するか、またはC₃-C₆シクロアルキル；テトラヒドロフリル；およびテトラヒドロピラニルから選択される環を形成し；

R⁵は、水素およびC₁-C₃アルキルから選択されるか；あるいは

R⁴およびR⁵は、それらが結合している炭素原子と一緒になってシクロペンチルまたはシクロヘキシル環を形成し；

R⁶は、水素；C₁-C₃アルコキシ；C₁-C₃アルキル；および八口から選択され；な

らびに

R⁷は、

C₃ - C₆アルケニル；

C₂ - C₆アルケニルオキシ；

C₃ - C₆アルコキシ；

C₁ - C₃アルコキシ - C₂ - C₃アルキニル；

C₁ - C₆アルキル；

C₂ - C₆アルキニル；

C₅ - C₆シクロアルケニル；

1または2個のC₁ - C₃アルキル基で適宜置換されていてもよいC₃ - C₆シクロアルキル；

シクロアルキルが1または2個のC₁ - C₃アルキル基で適宜置換されていてもよいC₃ - C₆シクロアルキル - C₁ - C₃アルコキシ；

1または2個のC₁ - C₃アルキル基で適宜置換されていてもよいC₃ - C₇シクロアルキルオキシ；

ハロ；

C₁ - C₃アルキル、ハロ - C₁ - C₃アルキルおよびフェニルから独立して選択される1または2個の基で適宜置換されていてもよいヘテロサイクリル；

1または2個のハロ - C₁ - C₃アルキル基で適宜置換されていてもよいヘテロサイクリルオキシ；

フェノキシ - C₁ - C₃アルコキシ；

C₁ - C₃アルコキシ、C₁ - C₆アルコキシ - C₁ - C₃アルキル、C₁ - C₃アルコキシカルボニル、C₁ - C₃アルコキシカルボニル - C₁ - C₃アルキル、C₁ - C₆アルキル、C₁ - C₃アルキルスルファニル、C₂ - C₆アルキニル、シアノ - C₁ - C₃アルキル、ハロ、ハロ - C₁ - C₃アルコキシ、-NH₂、ならびにC₁ - C₃アルコキシ - C₁ - C₃アルキルおよびハロから独立して選択される1または2個の基で適宜置換されていてもよいフェノキシから独立して選択される1、2または3個の置換基で適宜置換されていてもよいフェニル；ただし、フェニルが置換される場合、最初の置換基はフェニル環上のパラ位であるものとし；

フェニルがC₁ - C₃アルコキシ - C₁ - C₃アルキルおよびハロから独立して選択される1または2個の基で適宜置換されていてもよいフェニル - C₁ - C₃アルコキシ；ならびに

X - C(O) - NH - ；(式中、Xは、C₁ - C₃アルコキシ；C₁ - C₆アルキル；C₃ - C₁₀シクロアルキル；およびC₁ - C₆アルキルで適宜置換されていてもよいヘテロサイクリルから選択される)

から選択され；

R⁸は、水素；C₁ - C₃アルキル；およびハロから選択され；ならびに

R⁹は、水素；C₁ - C₃アルキル；およびハロから選択される]

の化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項2】

Bがフェニルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

Bがピリジニルである、請求項1に記載の化合物。

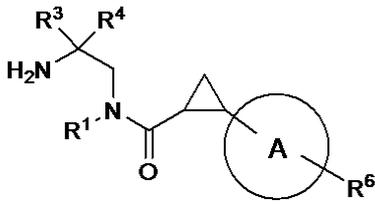
【請求項4】

Bが、イミダゾリル；ピラジニル；ピリミジニル；およびチアゾリルから選択されるものである、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

式(II)

【化4】



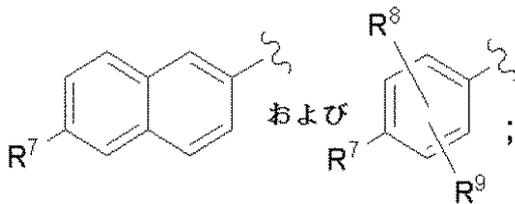
(II),

[式中、

Aは、ピラジニルおよびピリジニルから選択され；

R¹は、

【化5】



(式中、

【化6】

〰

は、親分子部分への結合点を表す)

から選択され；

R³は、C₄アルキルおよびC₁アルコキシ - C₂アルキルから選択され；R⁴は、水素であるか；あるいはR³およびR⁴は、それらが結合している炭素原子と一緒にカルボニル基を形成するか、またはC₅シクロアルキルおよびテトラヒドロピラニルから選択される環を形成し

；

R⁶は、水素およびハロゲンから選択され；ならびにR⁷は、C₅アルキニル；C₃シクロアルキル；C₄シクロアルキル - C₁アルコキシ；およびC₃アルコキシ、C₁アルコキシ - C₁アルキル、C₃アルキルおよびC₂アルキニ

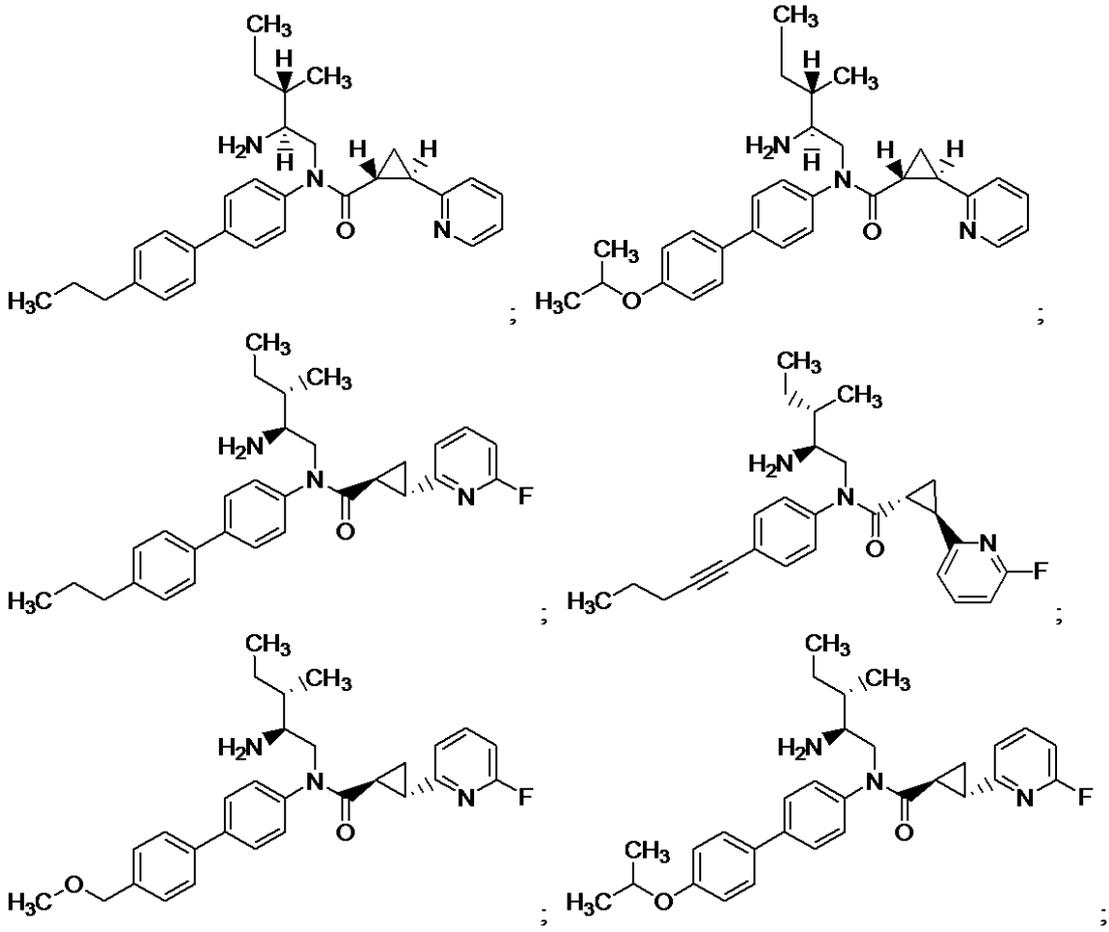
ルから選択される1個の置換基で適宜置換されていてもよいフェニル；ただし、フェニルが置換される場合、置換基はフェニル環上のパラ位であるものとする

から選択される]

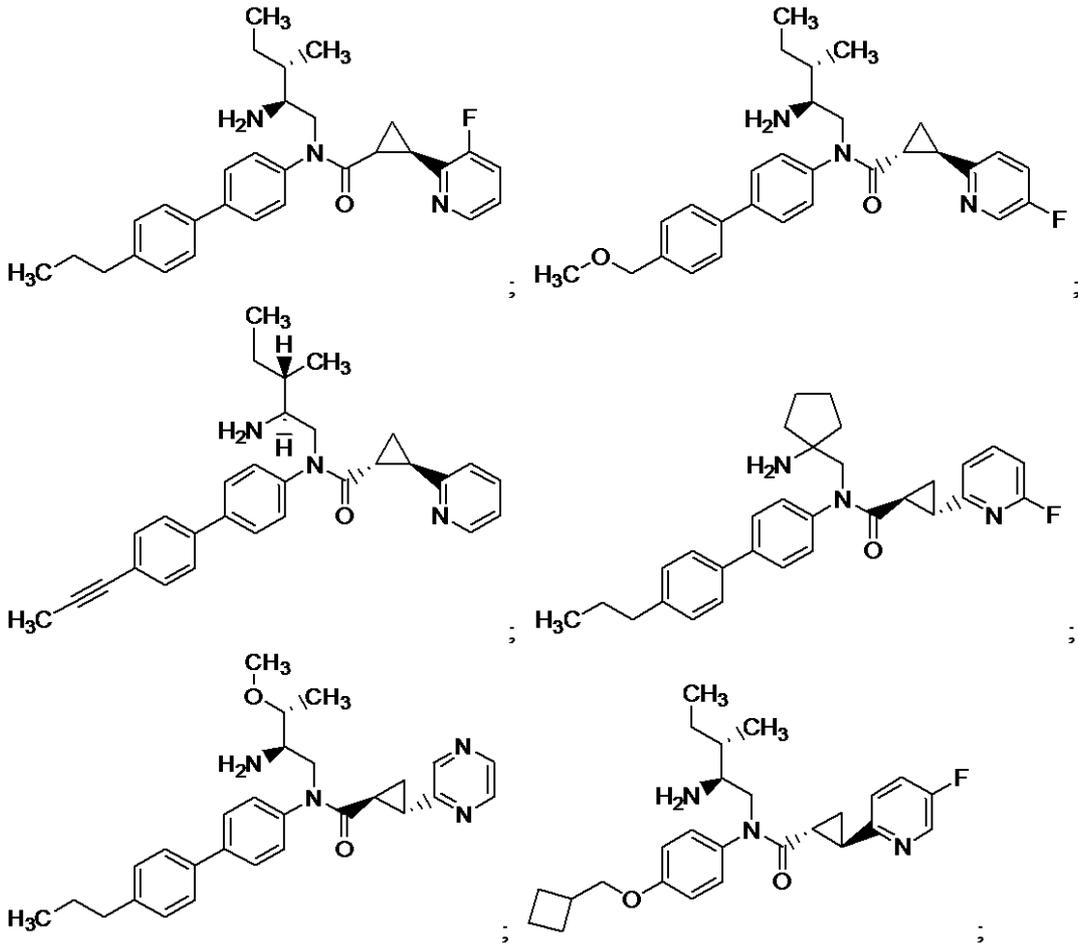
の化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項6】

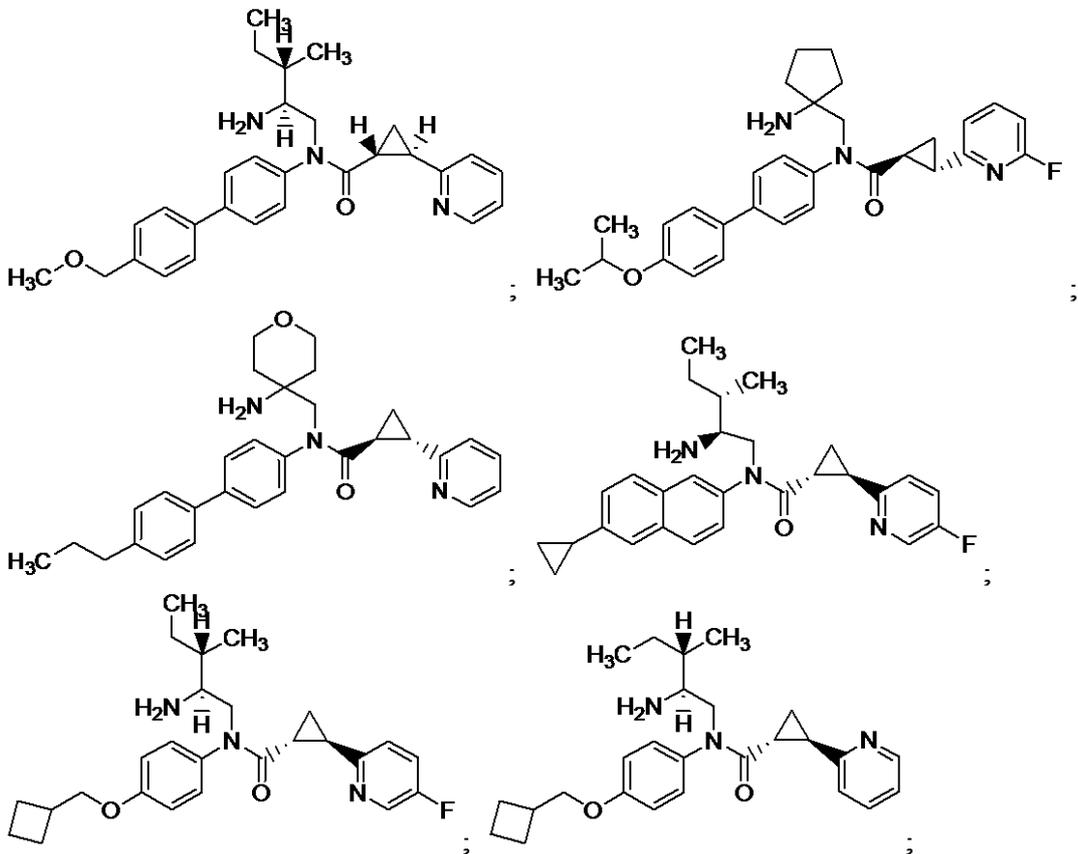
【化 7】



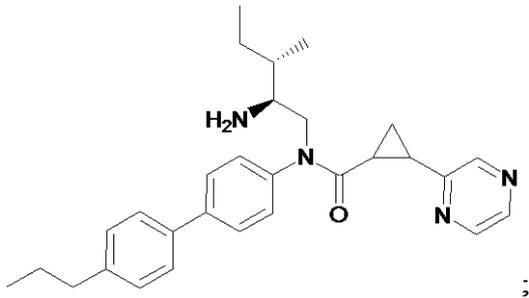
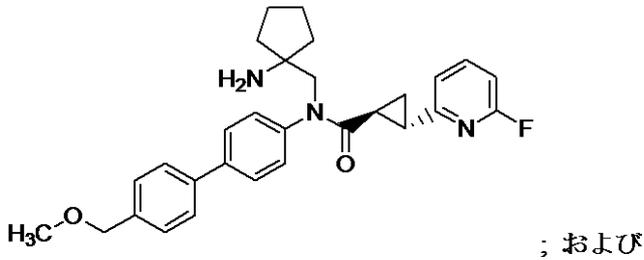
【化 8】



【化 9】



【化 1 0】



から選択される化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 7】

請求項 1 に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩、および医薬的に許容される担体を含む組成物。

【請求項 8】

精神病、統合失調症の失認、感情障害、注意欠陥多動障害、薬物依存、パーキンソン病およびアルツハイマー病から選択される疾患の治療剤の製造における、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩の使用。

【請求項 9】

治療上の有効量の請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、精神病、統合失調症の失認、感情障害、注意欠陥多動障害、薬物依存、パーキンソン病およびアルツハイマー病から選択される疾患の治療剤。