

【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 19 年 10 月 11 日 (2007.10.11)

【公表番号】特表 2003-507380 (P2003-507380A)

【公表日】平成 15 年 2 月 25 日 (2003.2.25)

【出願番号】特願 2001-517527 (P2001-517527)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 471/04 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/437 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/4375 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/444 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/4545 (2006.01)**

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

**A 6 1 P 25/16 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/18 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/24 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/28 (2006.01)**

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

**C 0 7 D 519/00 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z

A 6 1 K 31/437

A 6 1 K 31/4375

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 P 25/00 1 0 1

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 519/00 3 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 8 月 10 日 (2007.8.10)

【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

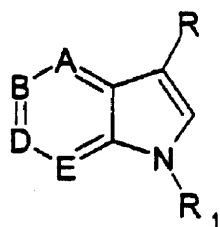
【補正方法】変更

【補正の内容】

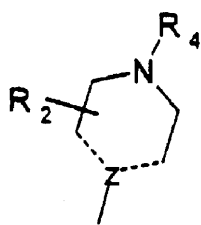
【特許請求の範囲】

【請求項 1】 下記の構造式 I として示す化合物及びその塩、溶媒和化合物または水和化合物であって、

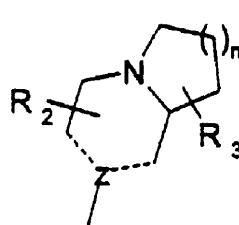
【化 1】



構造式 I



構造式 II



構造式 III

上述の構造式 I は、

R が構造式 I I に示す構造を持つ基である場合は、 $R_1$  が  $SO_2 Ar$  であることを条件とし、R は構造式 I I 又は構造式 I I I の構造を持つものであり；

A、B、D または E の 1 つが N 原子で、残りは CH 基であり；

$R_1$  は  $SO_2 Ar$ 、 $C(O) Ar$ 、 $CH_2 Ar$  及び Ar からなる群より選択されるものであり；

上述の構造式 I I 又は構造式 I I I を構成する  $R_2$ 、 $R_3$  及び  $R_4$  は H 及びアルキルからなる群より独立に選択されるものであり；

構造式中の - - - 表示部は同時に二重結合が一つだけあるとの条件で、単結合または二重結合を表すものであり；

構造式 I I I 中の n は 1 ~ 3 の整数であり；

上述の構造式 I I 又は構造式 I I I を構成する Z は、構造式中の - - - 表示部が二重結合であるときは C であり、構造式中の - - - 表示部が単結合であるときは CH 又は N のいずれかとして選択されるものとの条件で、C 及び CH 並びに N からなる群より選択されるものであり；

$R_1$  を構成する Ar は任意に置換されたアリール基であることを特徴とする化合物。

【請求項 2】 R が構造式 I I I の基である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】  $R_1$  が  $SO_2 Ar$  及び  $C(O) Ar$  からなる群より選択される請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】  $R_1$  が  $SO_2 Ar$  である請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】 Ar が置換フェニル及びナフチルからなる群より選択される請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】 Ar がナフチルである請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】 R が構造式 I I に示す基である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】 Ar が置換フェニル及びナフチルからなる群より選択される請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】 Ar がナフチルである、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】 下記の化合物からなる群より選択される構造式 I に相当するいずれかの化合物：

3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 H - 4 - アザインドール；

3 - ( オクタヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 H - 4 - アザインドール；

3 - ( オクタヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 - ( 1 - ナフタレンスルホニル ) - 4 - アザインドール；

3 - ( オクタヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 - ( 2 - ナフタレンスルホニル ) - 4 - アザインドール；

1 - ( 2 , 6 - ジクロロベンゾイル ) - 3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 5 - アザインドール；

1 - ( 2 , 6 - ジクロロベンゾイル ) - 3 - ( 1 - メチル - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロ - 4 - ピリジニル ) - 5 - アザインドール；

1 - ( 2 , 6 - ジクロロベンゾイル ) - 3 - ( 1 - メチル - 4 - ピペリジニル ) - 5 -

アザインドール；

1 - ( 2 , 6 - ジメトキシベンゾイル ) - 3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 5 - アザインドール；

1 - ( 2 - クロロベンゾイル ) - 3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 5 - アザインドール；

1 - ( 4 - クロロベンゼンスルホニル ) - 3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 5 - アザインドール；

1 - ( 4 - フルオロベンゼンスルホニル ) - 3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 5 - アザインドール；

1 - ベンゾイル - 3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 5 - アザインドール；

1 - ( 1 - ナフタレンスルホニル ) - 3 - ( オクタヒドロ - 8 - キノリジニル ) - 5 - アザインドール；

3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 - ( 4 - メチルベンゼンスルホニル ) - 5 - アザインドール；

3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 H - 5 - アザインドール；

3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 - ( 1 - ナフタレンスルホニル ) - 5 - アザインドール；

3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 - ベンゼンスルホニル - 5 - アザインドール；

3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 - ( 2 - ナフタレンスルホニル ) - 5 - アザインドール；

3 - ( 1 , 2 , 4 , 6 , 7 , 9 a - ヘキサヒドロ - 2 H - キノリジン - 2 - イル ) - 5 - アザインドール；

3 - ( 1 - メチル - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロ - 4 - ピリジニル ) - 1 - ベンゼンスルホニル - 5 - アザインドール；

3 - ( 1 - メチル - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロ - 4 - ピリジニル ) - 5 - アザインドール；

3 - ( 1 - メチル - 4 - ピペリジニル ) - 5 - アザインドール；

3 - ( 1 - メチル - 4 - ピペリジニル ) - 1 - ベンゼンスルホニル - 5 - アザインドール；

3 - ( オクタヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 H - 5 - アザインドール；

3 - ( オクタヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 - ( 1 - ナフタレンスルホニル ) - 5 - アザインドール；

3 - ( オクタヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 - ベンゼンスルホニル - 5 - アザインドール；

3 - ( オクタヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 2 , 5 - ジクロロベンゼンスルホニル - 5 - アザインドール；

3 - ( オクタヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 - ( 2 - ナフタレンスルホニル ) - 5 - アザインドール；

3 - ( オクタヒドロ - キノリジン ) - 1 H - 5 - アザインドール；

3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 H - 6 - アザインドール；

3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 - ( 1 - ナフタレンスルホニル ) - 6 - アザインドール；

3 - ( オクタヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 H - 6 - アザインドール；

3 - ( オクタヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 - ( 1 - ナフタレンスルホニル ) - 6 - アザインドール；

1 - ( 2 , 6 - ジクロロベンゾイル ) - 3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ

ロ - 7 - インドリジニル) - 7 - アザインドール ;

1 - ( 2 , 6 - ジメトキシベンゾイル ) - 3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 7 - アザインドール ;

1 - ( 4 - クロロベンゼンスルホニル ) - 3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 7 - アザインドール ;

1 - ( 4 - フルオロベンゾイル ) - 3 - ( 1 - メチル - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロ - 4 - ピリジニル ) - 7 - アザインドール ;

1 - ( 4 - フルオロベンゼンスルホニル ) - 3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 7 - アザインドール ;

1 - ( 4 - フルオロベンゼンスルホニル ) - 3 - ( 1 - メチル - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロ - 4 - ピリジニル ) - 7 - アザインドール ;

1 - ( 4 - メトキシベンゾイル ) - 3 - ( 1 - メチル - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロ - 4 - ピリジニル ) - 7 - アザインドール ;

1 - ( 4 - メトキシベンゼンスルホニル ) - 3 - ( 1 - メチル - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロ - 4 - ピリジニル ) - 7 - アザインドール ;

1 - ベンゾイル - 3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 7 - アザインドール ;

1 - ベンゾイル - 3 - ( 1 - メチル - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロ - 4 - ピリジニル ) - 7 - アザインドール ;

3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 - ( 4 - メチルベンゼンスルホニル ) - 7 - アザインドール ;

3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 H - 7 - アザインドール ;

3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 - ( 1 - ナフタレンスルホニル ) - 7 - アザインドール ;

3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 - ベンゼンスルホニル - 7 - アザインドール ;

3 - ( 1 , 2 , 3 , 5 , 8 , 8 a - ヘキサヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 - ( 2 - ナフタレンスルホニル ) - 7 - アザインドール ;

3 - ( 1 - メチル - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロ - 4 - ピリジニル ) - 1 - ベンゼンスルホニル - 7 - アザインドール ;

3 - ( オクタヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 H - 7 - アザインドール ;

3 - ( オクタヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 - ( 1 - ナフタレンスルホニル ) - 7 - アザインドール ;

3 - ( オクタヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 - ( 1 - ベンゼンスルホニル ) - 7 - アザインドール ; 及び

3 - ( オクタヒドロ - 7 - インドリジニル ) - 1 - ( 2 - ナフタレンスルホニル ) - 7 - アザインドール。

【請求項 11】 医薬品として許容される担体と、5 - HT<sub>6</sub> 受容体に拮抗するのに有効な量の構造式 I の化合物、またはその塩、溶媒和化合物もしくは水和化合物とを含む、医薬品組成物。