

【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22年12月16日 (2010.12.16)

【公表番号】特表2010-510231 (P2010-510231A)

【公表日】平成22年4月2日 (2010.4.2)

【年通号数】公開・登録公報2010-013

【出願番号】特願2009-537272 (P2009-537272)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

C 0 7 D 417/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/427 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/06 C S P

A 6 1 K 31/4439 Z N A

C 0 7 D 417/06

A 6 1 K 31/427

A 6 1 P 15/10

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 7/06

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/20

【手続補正書】

【提出日】平成22年10月28日 (2010.10.28)

【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

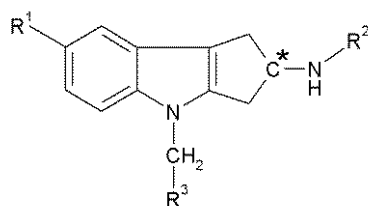
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) で表される化合物

【化 1】



式 (1)

(式中、

【化 2】

“C*”

で示される炭素中心は R、S 又は R / S 立体配置であってもよく、

R¹ はシアノ、-CH=NOCH₃、-OCHF₂ 又は -OCF₃ であり、

R² は -COR^{2a} 又は -SO₂R^{2b} を表し、

R^{2a} は (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ、シクロプロピル又は -NR^aR^b であり、

R^{2b} は (C₁ - C₄) アルキル、シクロプロピル又は -NR^aR^b を表し、

R^a 及び R^b は、各々独立に水素又は (C₁ - C₄) アルキルを表し、

R³ はピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、チアゾリル、イソチアゾリル及びチアジアゾリルからなる群から選択されるヘテロアリールを表し、

それらは各々、メチル、エチル、プロモ、クロロ、フルオロ、-CHF₂、-CF₃、ヒドロキシ、アミノ及び NHCH₂CO₂H からなる群から独立に選択される 1 個若しくは 2 個の置換基で任意に置換されてもよい)

又はその薬理学的に許容できる塩。

【請求項 2】

【化 3】

“C*”

で示される炭素中心が、

R² が -COR^{2a} を表すとき、S 立体配置であり、

R² が -SO₂R^{2b} を表すとき、R 立体配置であり、

R¹ がシアノ又は -CH=NOCH₃ を表し、

R^{2a} がエチル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、イソブトキシ、tert-ブトキシ、シクロプロピル又は N(CH₃)₂ を表し、R^{2b} がメチル、エチル、プロピル、シクロプロピル、-N(CH₃)₂ 又は N(C₂H₅)₂ を表し、

R³ が 6-フルオロ-ピリジン-2-イル、ピリジン-2-イル、3-ヒドロキシ-ピリジン-2-イル、6-ジフルオロメチル-ピリジン-2-イル、2-アミノ-ピリジン-3-イル、2-カルボキシメチルアミノ-ピリジン-3-イル、ピリミジン-4-イル、ピリミジン-2-イル、2-クロロ-ピリミジン-4-イル、チアゾール-4-イル、2-メチル-チアゾール-4-イル、2-クロロ-チアゾール-4-イル、チアゾール-2-イル、チアゾール-5-イル、4-アミノ-チアゾール-5-イル、ピラジン-2-イル、5-メチル-ピラジン-2-イル、3-クロロ-ピラジン-2-イル、6-メチル-ピラジン-2-イル、3-アミノ-ピラジン-2-イル、3-メチル-ピラジン-2-イル、ピリダジン-3-イル、5-プロモ-イソチアゾール-3-イル、イソチアゾール

- 3 - イル、4, 5 - ジクロロ - イソチアゾール - 3 - イル又は [1, 2, 5] チアジアゾール - 3 - イルを表す、請求項 1 記載の化合物又は塩。

【請求項 3】

(S) - (7 - シアノ - 4 - ピリジン - 2 - イルメチル - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - シクロペンタ [b] インドール - 2 - イル) - カルバミン酸イソプロピルエステル、
(S) - (7 - シアノ - 4 - チアゾール - 5 - イルメチル - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - シクロペンタ [b] インドール - 2 - イル) - カルバミン酸イソプロピルエステル、
(S) - [4 - (2 - アミノ - ピリジン - 3 - イルメチル) - 7 - シアノ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - シクロペンタ [b] インドール - 2 - イル] - カルバミン酸イソプロピルエステル、
(R) - N' - [4 - (4 - アミノ - チアゾール - 5 - イルメチル) - 7 - シアノ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - シクロペンタ [b] インドール - 2 - イル] - N, N - ジメチルスルファミド及び (S) - [4 - (4 - アミノ - チアゾール - 5 - イルメチル) - 7 - シアノ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - シクロペンタ [b] インドール - 2 - イル] - カルバミン酸イソプロピルエステル、又はその薬理学的に許容できる塩からなる群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 4】

(S) - (7 - シアノ - 4 - ピリジン - 2 - イルメチル - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - シクロペンタ [b] インドール - 2 - イル) - カルバミン酸イソプロピルエステルである請求項 3 記載の化合物。

【請求項 5】

性機能低下、骨量若しくは骨密度の減少、骨粗鬆症、骨減少症、筋肉質量若しくは強度の減少、筋肉減少症、加齢による機能低下、男児の思春期遅発症、貧血症、男性若しくは女性の性機能不全、勃起不全、性衝動低下、うつ病又は嗜眠の治療のための医薬の製造のための、請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物の使用。

【請求項 6】

1 つ以上の薬理学的に許容できる担体、希釈剤又は賦形剤と組み合わせて、請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物又は塩を含んでなる医薬組成物。