

【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3月8日(2007.3.8)

【公表番号】特表2002-535407(P2002-535407A)

【公表日】平成14年10月22日(2002.10.22)

【出願番号】特願2000-596008(P2000-596008)

【国際特許分類】

C 07 D 487/04 (2006.01)  
A 61 K 31/5025 (2006.01)  
A 61 P 9/10 (2006.01)  
A 61 P 25/00 (2006.01)  
A 61 P 25/06 (2006.01)  
A 61 P 25/18 (2006.01)  
A 61 P 25/22 (2006.01)  
A 61 P 25/24 (2006.01)

【F I】

C 07 D 487/04 1 4 5  
A 61 K 31/5025  
A 61 P 9/10  
A 61 P 25/00  
A 61 P 25/06  
A 61 P 25/18  
A 61 P 25/22  
A 61 P 25/24

【手続補正書】

【提出日】平成19年1月17日(2007.1.17)

【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

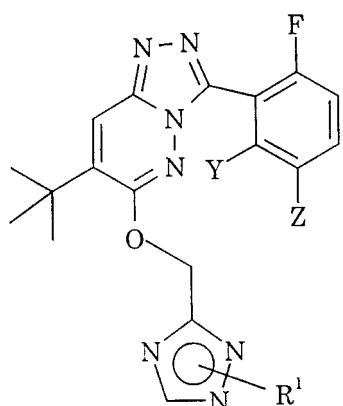
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記式Iの化合物または該化合物の医薬的に許容される塩。

【化1】



[式中、

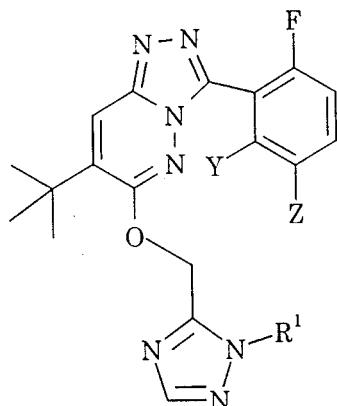
Yは水素を表し、Zはフッ素を表すか；あるいはYはフッ素を表し、Zは水素またはフッ素を表し；

R<sup>1</sup>はメチルまたはエチルを表す。]

【請求項2】 YおよびZがいずれもフッ素を表し；R<sup>1</sup>がメチルまたはエチルを表す請求項1に記載の式Iの化合物または該化合物の医薬的に許容される塩。

【請求項3】 下記式IAによって表される請求項1に記載の化合物および該化合物の医薬的に許容される塩。

【化2】

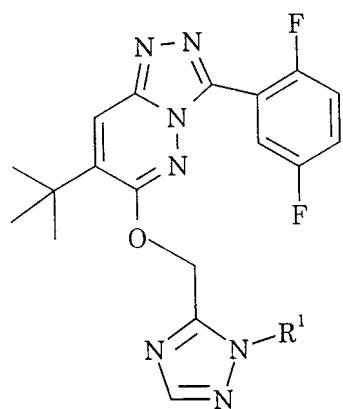


(IA)

[式中、Y、ZおよびR<sup>1</sup>は請求項1で定義の通りである。]

【請求項4】 下記式IIAによって表される請求項3に記載の化合物および該化合物の医薬的に許容される塩。

【化3】

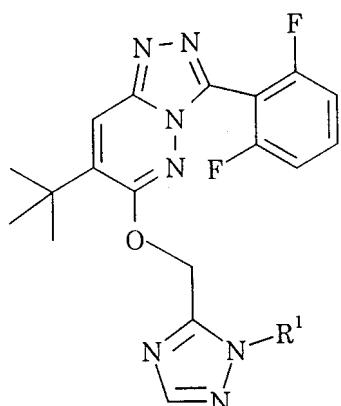


(IIA)

[式中、R<sup>1</sup>は請求項1で定義の通りである。]

【請求項5】 下記式IIBによって表される請求項3に記載の化合物および該化合物の医薬的に許容される塩。

【化4】

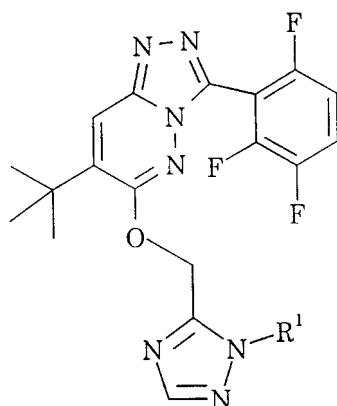


(IIB)

[式中、R<sup>1</sup>は請求項1で定義の通りである。]

【請求項6】 下記式IICによって表される請求項3に記載の化合物および該化合物の医薬的に許容される塩。

【化5】



(IIc)

[式中、R<sup>1</sup>は請求項1で定義の通りである。]

【請求項7】 R<sup>1</sup>がメチルを表す請求項1ないし6のいずれかに記載の化合物。

【請求項8】 R<sup>1</sup>がエチルを表す請求項1ないし6のいずれかに記載の化合物。

【請求項9】

3-(2,5-ジフルオロフェニル)-7-(1,1-ジメチルエチル)-6-(2-メチル-2H-1,2,4-トリアゾール-3-イルメトキシ)-1,2,4-トリアゾロ[4,3-b]ピリダジン；

3-(2,5-ジフルオロフェニル)-7-(1,1-ジメチルエチル)-6-(2-エチル-2H-1,2,4-トリアゾール-3-イルメトキシ)-1,2,4-トリアゾロ[4,3-b]ピリダジン；

および該化合物の医薬的に許容される塩から選択される化合物。

【請求項10】

3-(2,6-ジフルオロフェニル)-7-(1,1-ジメチルエチル)-6-(2-エチル-2H-1,2,4-トリアゾール-3-イルメトキシ)-1,2,4-トリアゾロ[4,3-b]ピリダジンおよび該化合物の医薬的に許容される塩から選択される化合物。

【請求項11】

7-(1,1-ジメチルエチル)-6-(2-エチル-2H-1,2,4-トリアゾール-3-イルメトキシ)-3-(2,3,6-トリフルオロフェニル)-1,2,4-トリアゾロ[4,3-b]ピリダジン；

7-(1,1-ジメチルエチル)-6-(2-メチル-2H-1,2,4-トリアゾール-3-イルメトキシ)-3-(2,3,6-トリフルオロフェニル)-1,2,4-トリアゾロ[4,3-b]ピリダジン；

7-(1,1-ジメチルエチル)-6-(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イルメトキシ)-3-(2,3,6-トリフルオロフェニル)-1,2,4-トリアゾロ[4,3-b]ピリダジン

およびこれら化合物の医薬的に許容される塩から選択される化合物。

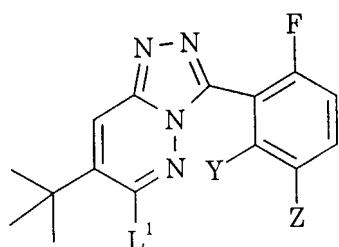
【請求項12】 請求項1に記載の式Iの化合物または該化合物の医薬的に許容される塩を医薬的に許容される担体とともに含有する医薬組成物。

【請求項13】 不安の治療および/または予防用の医薬品製造における請求項1に記載の式Iの化合物または該化合物の医薬的に許容される塩の使用。

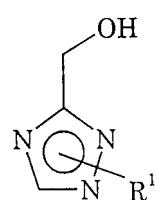
【請求項14】 請求項1に記載の化合物の製造方法であって、

(A) 下記式IIIIの化合物と下記式IVの化合物

【化6】



(III)

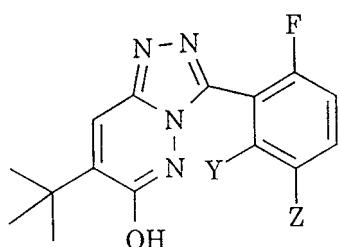


(IV)

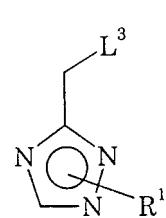
[式中、Y、ZおよびR<sup>1</sup>は請求項1で定義した通りであり；L<sup>1</sup>は好適な脱離基を表す。]とを反応させる段階；あるいは

(B)下記式XⅠの化合物（またはそれの1，2，4-トリアゾロ[4，3-b]ピリダジン-6-オン互変異体）と下記式XⅡの化合物

【化7】



(XI)

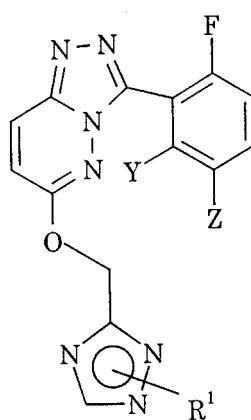


(XII)

[式中、Y、ZおよびR<sup>1</sup>は請求項1で定義した通りであり、L<sup>3</sup>は好適な脱離基を表す。]とを反応させる段階；あるいは

(C)トリメチル酢酸と式XⅢの化合物

【化8】



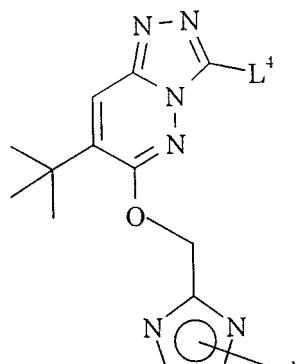
(XIII)

[Y、ZおよびR<sup>1</sup>は請求項1で定義の通りである。]とを硝酸銀および過硫酸アンモニ

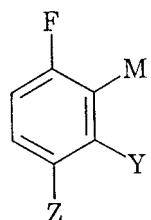
ウムの存在下に反応させる段階；あるいは

(D) 下記式XIVの化合物と下記式XVの化合物

【化9】



(XIV)



(XV)

[式中、Y、ZおよびR<sup>1</sup>は請求項1で定義した通りであり；Mは-B(OH)<sub>2</sub>または-Sn(Alk)<sub>3</sub>を表し；AlkはC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基を表し；L<sup>4</sup>は好適な脱離基を表す。]とを、遷移金属触媒存在下に反応させる段階

を有する方法。

【請求項15】不安の治療および/または予防方法であって、そのような処置を必要とする患者に対して、有効量の請求項1に記載の式Iの化合物または該化合物の医薬的に許容される塩を投与する段階を有する方法。