

【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 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/5025 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 487/04 1 4 5

A 6 1 K 31/5025

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/22

A 6 1 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

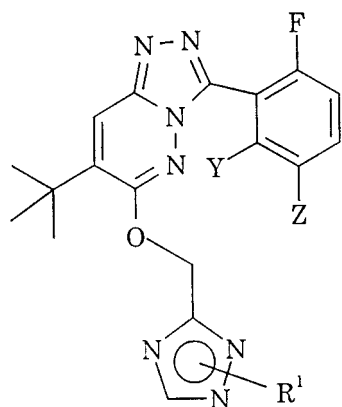
【補正方法】変更

【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】



(I)

[式中、

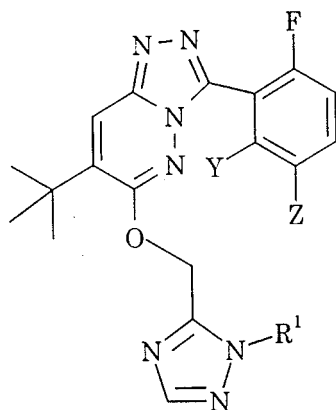
Y は水素を表し、Z はフッ素を表すか；あるいは Y はフッ素を表し、Z は水素またはフッ素を表し；

R¹ 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；R¹ 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 I A 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】

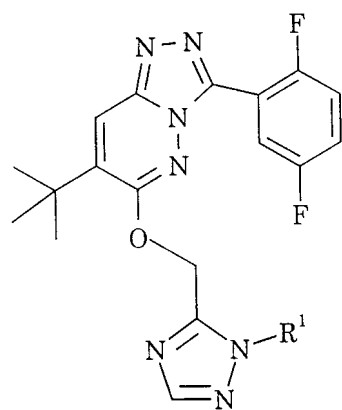


(IA)

[式中、Y、Z および R¹ は請求項 1 で定義の通りである。]

【請求項 4】 下記式 I I A 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】

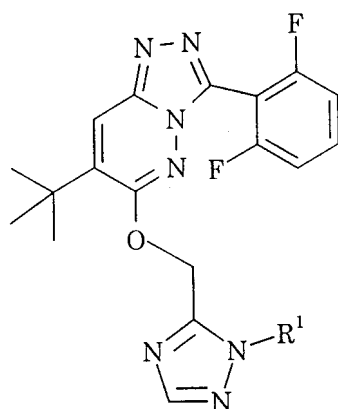


(IIA)

[式中、 R^1 は請求項 1 で定義の通りである。]

【請求項 5】 下記式 I I B 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】

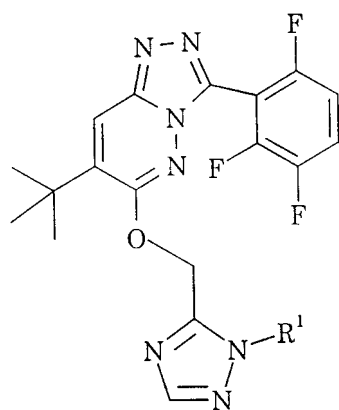


(IIB)

[式中、 R^1 は請求項 1 で定義の通りである。]

【請求項 6】 下記式 I I C 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、R¹ は請求項 1 で定義の通りである。]

【請求項 7】 R¹ 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】 R¹ 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 - 2 H - 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 - 2 H - 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 - 2 H - 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 - 2 H - 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 - 2 H - 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 - 1 H - 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。

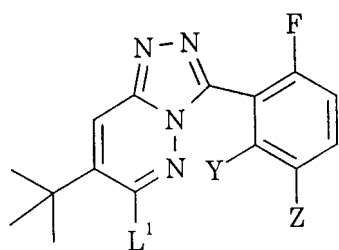
【請求項 12】 請求項 1 に記載の式 I の化合物または該化合物の医薬的に許容される塩を医薬的に許容される担体とともに含有する医薬組成物。

【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。

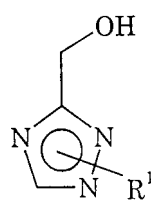
【請求項 14】 請求項 1 に記載の化合物の製造方法であって、

(A) 下記式 I I I の化合物と下記式 I V の化合物

【化 6】



(III)

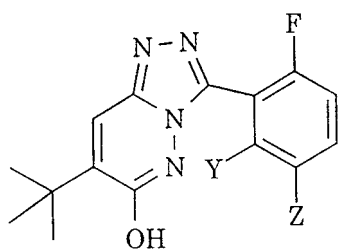


(IV)

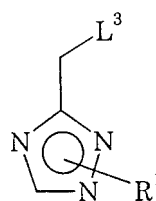
[式中、Y、ZおよびR¹ は請求項1で定義した通りであり；L¹ は好適な脱離基を表す。] とを反応させる段階；あるいは

(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)

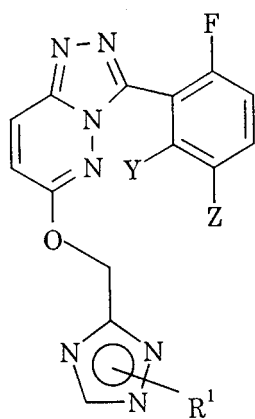


(XII)

[式中、Y、ZおよびR¹ は請求項1で定義した通りであり、L³ 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】



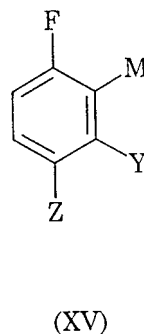
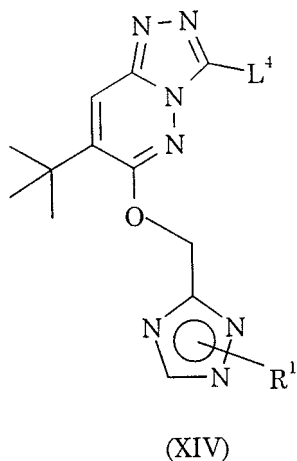
(XIII)

[Y、ZおよびR¹ 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

ウムが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】



[式中、Y、ZおよびR¹ は請求項1で定義した通りであり；Mは - B (O H)₂ または - S n (A l k)₃ を表し；A l k は C₁ - 6 アルキル基を表し；L⁴ 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。