

【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 5 月 31 日 (2007.5.31)

【公表番号】 特表 2007-500740 (P2007-500740A)

【公表日】 平成 19 年 1 月 18 日 (2007.1.18)

【年通号数】 公開・登録公報 2007-002

【出願番号】 特願 2006-530499 (P2006-530499)

【国際特許分類】

C 0 7 D 211/70 (2006.01)

A 6 1 K 31/4465 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 211/70

A 6 1 K 31/4465

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/22

【手続補正書】

【提出日】 平成 19 年 4 月 5 日 (2007.4.5)

【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

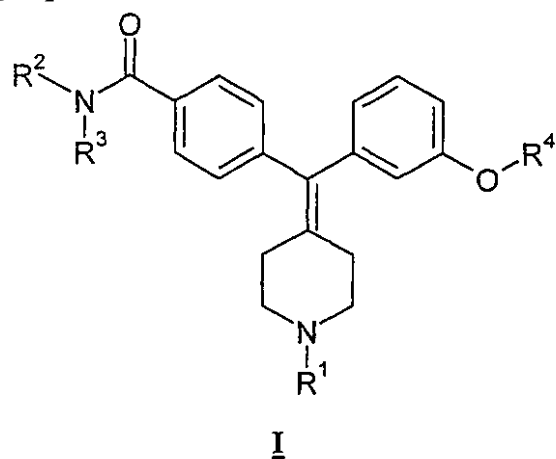
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】



[式中、

R^1 は水素、 C_{1-6} アルキル- $O-C(=O)-$ 、場合により置換された C_{1-6} アルキル、場合により置換された C_{3-6} シクロアルキル、場合により置換された C_{6-10} アリール、場合により置換された C_{2-9} ヘテロシクリル、場合により置換された C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルキルおよび場合により置換された C_{2-9} ヘテロシクリル- C_{1-3} アルキルから選択さ

れ；

R^2 および R^3 は、独立して、水素、場合により置換された C_{1-6} アルキルおよび場合により置換された C_{3-6} シクロアルキルから選択され；そして

R^4 は場合により置換された C_{3-6} アルキル、場合により置換された C_{3-8} シクロアルキル、場合により置換された C_{6-10} アリール、場合により置換された C_{2-9} ヘテロシクリル、場合により置換された C_{6-10} アリール- C_{1-6} アルキル、および場合により置換された C_{2-9} ヘテロシクリル- C_{1-6} アルキルから選択される]

の化合物、その製薬上許容される塩、そのジアステレオマー、そのエナンチオマー、またはそれらの混合物。

【請求項 2】

R^1 が水素、 C_{1-6} アルキル- $O-C(=O)-$ 、場合により置換された C_{1-6} アルキル、および場合により置換された C_{3-6} シクロアルキルから選択され；

R^2 および R^3 がエチルであり；そして

R^4 がフェニル、 C_{3-5} ヘテロシクリル、フェニル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-5} ヘテロシクリル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、および C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキルから選択され、ここで R^4 は場合により、 C_{1-6} アルキル、ハロゲン化 C_{1-6} アルキル、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 C_{1-6} アルコキシ、クロロ、フルオロ、ブromoおよびヨードから選択される 1 またはそれ以上の基で置換される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^1 が水素、 C_{1-6} アルキル- $O-C(=O)-$ から選択され；

R^2 および R^3 がエチルであり；そして

R^4 がフェニル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキルおよびフェニルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 が水素および t -ブチル- $O-C(=O)-$ から選択され；

R^2 および R^3 がエチルであり；そして

R^4 がフェニル、ベンジル、フェネチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

以下から選択される化合物およびその製薬上許容される塩：

4-[[3-(ベンジルオキシ)フェニル](ピペリジン-4-イリデン)メチル]- N,N -ジエチルベンズアミド；

N,N -ジエチル-4-[[3-(2-フェニルエトキシ)フェニル](ピペリジン-4-イリデン)メチル]ベンズアミド；

4-[[3-(シクロペンチルオキシ)フェニル](ピペリジン-4-イリデン)メチル]- N,N -ジエチルベンズアミド；

4-[[3-(シクロヘキシルオキシ)フェニル](ピペリジン-4-イリデン)メチル]- N,N -ジエチルベンズアミド；

N,N -ジエチル-4-[(3-フェノキシフェニル)(ピペリジン-4-イリデン)メチル]ベンズアミド。

【請求項 6】

医薬として使用するための、請求項 1～5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7】

痛み、不安症または機能性胃腸障害の治療のための医薬の製造における、請求項 1～5 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

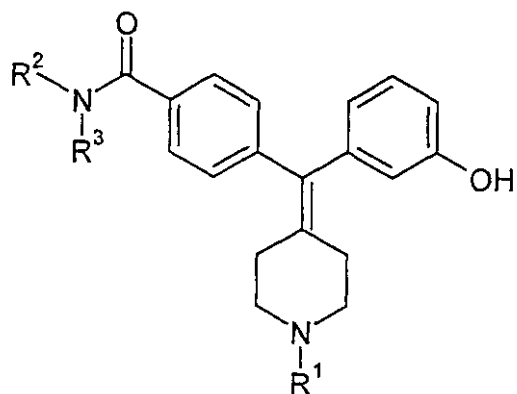
【請求項 8】

請求項 1～5 のいずれか 1 項に記載の化合物および製薬上許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 9】

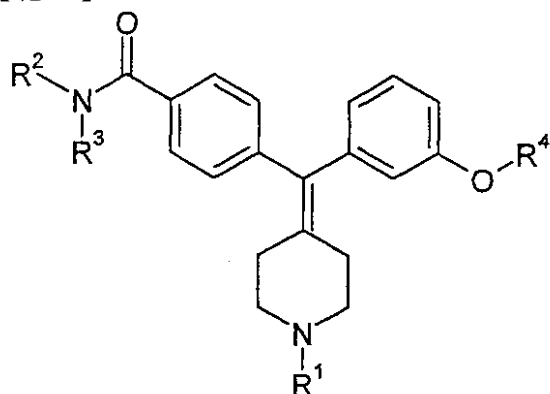
式 II

【化 2】

II

の化合物を R^4-X と反応させることを含む、式 I

【化 3】

I

の化合物の製造方法。

上記式中、

R^1 は C_{1-6} アルキル- $O-C(=O)-$ 、場合により置換された C_{1-6} アルキルおよび場合により置換された C_{3-6} シクロアルキルから選択され；

R^2 および R^3 はエチルであり；

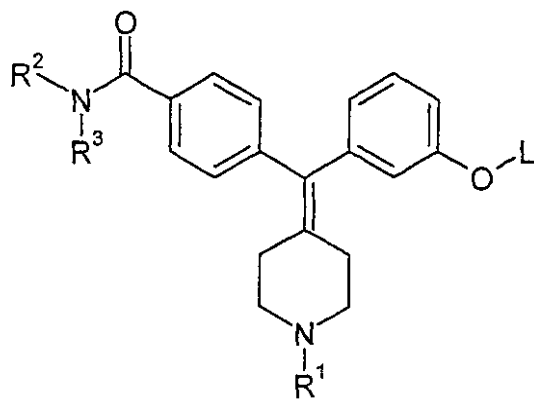
X は Cl 、 I 、 Br 、 OTf および OTs から選択され；そして

R^4 はフェニル、 C_{3-5} ヘテロシクリル、フェニル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-5} ヘテロシクリル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、および C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキルから選択され、ここで R^4 は、 C_{1-6} アルキル、ハロゲン化 C_{1-6} アルキル、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 C_{1-6} アルコキシ、クロロ、フルオロ、ブロモおよびヨードから選択される 1 またはそれ以上の基で場合により置換される。

【請求項 10】

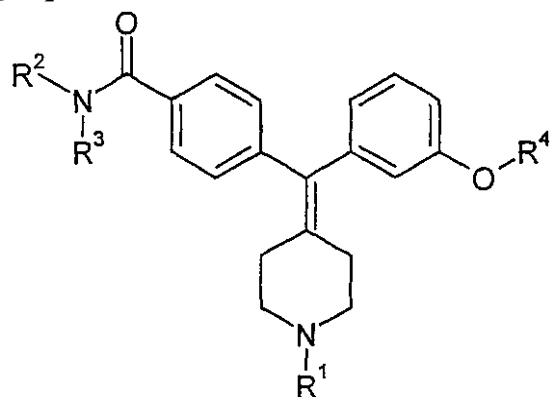
式 III

【化 4】

**III**

の化合物を R^4-OH と反応させることを含む、式 I

【化 5】

**I**

の化合物の製造方法。

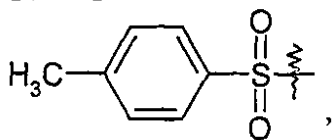
上記式中、

R^1 は C_{1-6} アルキル- $O-C(=O)-$ 、場合により置換された C_{1-6} アルキルおよび場合により置換された C_{3-6} シクロアルキルから選択され；

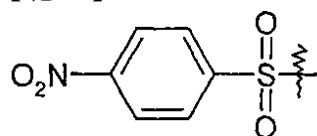
R^2 および R^3 はエチルであり；

L は $-S(=O)_2-CF_3$ 、

【化 6】



【化 7】



および $-S(=O)_2-CH_3$ から選択され；そして

R^4 はフェニル、 C_{3-5} ヘテロシクリル、フェニル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-5} ヘテロシクリル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキルおよび C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキルから選択され、ここで R^4 は場合により C_{1-6} アルキル、ハロゲン化 C_{1-6} アルキル、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 C_{1-6} アルコキシ、クロロ、フルオロ、ブロモおよびヨードから選択される 1

またはそれ以上の基で置換される。