

【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18日(2007.10.18)

【公表番号】特表2007-506726(P2007-506726A)

【公表日】平成19年3月22日(2007.3.22)

【年通号数】公開・登録公報2007-011

【出願番号】特願2006-527499(P2006-527499)

【国際特許分類】

**A 6 1 K 31/197 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/04 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/06 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/08 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/34 (2006.01)**

**A 6 1 P 19/02 (2006.01)**

【F I】

A 6 1 K 31/197

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/34

A 6 1 P 19/02

【手続補正書】

【提出日】平成19年8月29日(2007.8.29)

【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

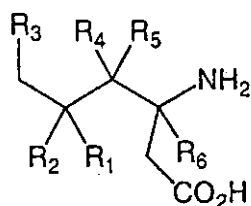
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

癲癇、禁煙、中毒性物質および依存性からの離脱、痙縮、筋痙縮、麻痺を伴う緊張低下症、ヘルペス感染後神経痛、慢性頭痛、腰痛、外科的疼痛、軟骨損傷、変形性関節炎の疾患変性の治療用医薬組成物であって、治療的有效量の式I：

【化1】



(式中、 $R_1$ は、水素、または1～5個のフッ素原子で任意に置換される( $C_1 \sim C_6$ )アルキルであり；

$R_2$ は、水素、または1～5個のフッ素原子で任意に置換される( $C_1 \sim C_6$ )アルキル

であり；あるいは

$R_1$  および  $R_2$  は、それらが結合される炭素と一緒にあって、3～6員シクロアルキル環を形成し；

$R_3$  は、( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、( $C_3 \sim C_6$ ) シクロアルキル、( $C_3 \sim C_6$ ) シクロアルキル - ( $C_1 \sim C_3$ ) アルキル、フェニル、フェニル - ( $C_1 \sim C_3$ ) アルキル、ピリジル、ピリジル - ( $C_1 \sim C_3$ ) アルキル、フェニル - N(H) -、またはピリジル - N(H) - であり（ここで、前記アルキル部分は各々、1～5個のフッ素原子で、好ましくは0～3個のフッ素原子で任意に置換され得るし、そして前記フェニルおよび前記ピリジル、ならびに前記フェニル - ( $C_1 \sim C_3$ ) アルキルおよび前記ピリジル - ( $C_1 \sim C_3$ ) アルキルのフェニルおよびピリジル部分は、それぞれ、クロロ、フルオロ、アミノ、ニトロ、シアノ、( $C_1 \sim C_3$ ) アルキルアミノ、( $C_1 \sim C_3$ ) アルキル（1～3個のフッ素原子で任意に置換される）、および( $C_1 \sim C_3$ ) アルコキシ（1～3個のフッ素原子で任意に置換される）から独立して選択される1～3個の置換基で、好ましくは0～2個の置換基で任意に置換され得る）；

$R_4$  は、水素、または( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル（1～5個のフッ素原子で任意に置換される）であり；

$R_5$  は、水素、または( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル（1～5個のフッ素原子で任意に置換される）であり；そして

$R_6$  は、水素または( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルである）

の化合物、またはこのような化合物の製薬上許容可能な塩を含む前記医薬組成物。

【請求項2】

哺乳類、例えばヒトにおける睡眠を増強することによる神経変性障害、例えばパーキンソン病(PD)、ハンチントン病(HD)、アルツハイマー病および繊維筋痛における認知の治療用医薬組成物であって、このような障害または症状を治療するのに有効である量の請求項1記載の化合物またはその製薬上許容可能な塩を含む前記医薬組成物。

【請求項3】

哺乳類、例えばヒトにおける睡眠障害、例えば非安静脚症候群、時差ぼけ、周期性体肢運動障害および睡眠構築変容からなる群から選択される障害または症状の治療用医薬組成物であって、このような障害または症状を治療するのに有効である量の請求項1記載の化合物またはその製薬上許容可能な塩を含む前記医薬組成物。

【請求項4】

哺乳類、例えばヒトにおける食欲不振、癌、高齢および/または意志薄弱から選択される障害または症状を有する哺乳類における体重増加の促進用医薬組成物であって、このような障害または症状を治療するのに有効である量の請求項1記載の化合物またはその製薬上許容可能な塩を含む前記医薬組成物。

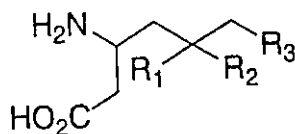
【請求項5】

哺乳類、例えばヒトにおける社会的不安障害および飛ぶことに対する恐怖から選択される障害または症状の治療用医薬組成物であって、このような障害または症状を治療するのに有効である量の請求項1記載の化合物またはその製薬上許容可能な塩を含む前記医薬組成物。

【請求項6】

前記化合物またはこのような化合物の製薬上許容可能な塩が、式IA：

## 【化 2】



IA

(式中、 $R_1$ は、水素、または1～5個のフッ素原子で任意に置換される( $C_1 \sim C_6$ )アルキルであり；

$R_2$ は、水素、または1～5個のフッ素原子で任意に置換される( $C_1 \sim C_6$ )アルキルであり；そして

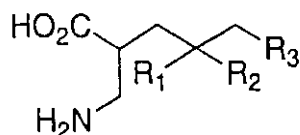
$R_3$ は、( $C_1 \sim C_6$ )アルキル、( $C_3 \sim C_6$ )シクロアルキル、( $C_3 \sim C_6$ )シクロアルキル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、フェニル、フェニル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、ピリジル、ピリジル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、フェニル - N(H) -、またはピリジル - N(H) - であり(ここで、前記アルキル部分は各々、1～5個のフッ素原子で、好ましくは0～3個のフッ素原子で任意に置換され得るし、そして前記フェニルおよび前記ピリジル、ならびに前記フェニル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキルおよび前記ピリジル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキルのフェニルおよびピリジル部分は、それぞれ、クロロ、フルオロ、アミノ、ニトロ、シアノ、( $C_1 \sim C_3$ )アルキルアミノ、( $C_1 \sim C_3$ )アルキル(1～3個のフッ素原子で任意に置換される)、および( $C_1 \sim C_3$ )アルコキシ(1～3個のフッ素原子で任意に置換される)から独立して選択される1～3個の置換基で、好ましくは0～2個の置換基で任意に置換され得る)；

但し、 $R_1$ が水素である場合、 $R_2$ は水素ではない)  
を有する、請求項1記載の医薬組成物。

## 【請求項7】

前記化合物またはこのような化合物の製薬上許容可能な塩が、式II：

## 【化 3】



II

(式中、 $R_1$ は、水素、または1～5個のフッ素原子で任意に置換される( $C_1 \sim C_6$ )アルキルであり；

$R_2$ は、水素、または1～5個のフッ素原子で任意に置換される( $C_1 \sim C_6$ )アルキルであり；そして

$R_3$ は、( $C_1 \sim C_6$ )アルキル、( $C_3 \sim C_6$ )シクロアルキル、( $C_3 \sim C_6$ )シクロアルキル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、フェニル、フェニル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、ピリジ

ル、ピリジル - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルキル、フェニル - N(H) - 、またはピリジル - N(H) - であり(ここで、前記アルキル部分は各々、1~5個のフッ素原子で、好ましくは0~3個のフッ素原子で任意に置換され得るし、そして前記フェニルおよび前記ピリジル、ならびに前記フェニル - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルキルおよび前記ピリジル - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルキルのフェニルおよびピリジル部分は、それぞれ、クロロ、フルオロ、アミノ、ニトロ、シアノ、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルキル(1~3個のフッ素原子で任意に置換される)、および(C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルコキシ(1~3個のフッ素原子で任意に置換される)から独立して選択される1~3個の置換基で、好ましくは0~2個の置換基で任意に置換され得る) ;

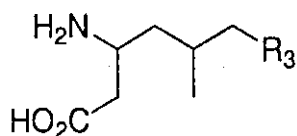
但し、R<sub>1</sub>が水素である場合、R<sub>2</sub>は水素ではない)

を有する、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項8】

前記化合物またはこのような化合物の製薬上許容可能な塩が、式 I A - 1 :

【化4】



IA-1

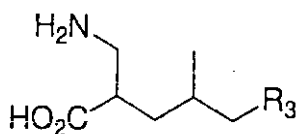
(式中、R<sub>3</sub>は、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルキル、フェニル、フェニル - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルキル、ピリジル、ピリジル - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルキル、フェニル - N(H) - 、またはピリジル - N(H) - であり(ここで、前記アルキル部分は各々、1~5個のフッ素原子で、好ましくは0~3個のフッ素原子で任意に置換され得るし、そして前記フェニルおよび前記ピリジル、ならびに前記フェニル - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルキルおよび前記ピリジル - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルキルのフェニルおよびピリジル部分は、それぞれ、クロロ、フルオロ、アミノ、ニトロ、シアノ、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルキル(1~3個のフッ素原子で任意に置換される)、および(C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルコキシ(1~3個のフッ素原子で任意に置換される)から選択される1~3個の置換基で、好ましくは0~2個の置換基で任意に置換され得る))

を有する、請求項6記載の医薬組成物。

【請求項9】

前記化合物またはこのような化合物の製薬上許容可能な塩が、式 I I A :

【化5】



IIA

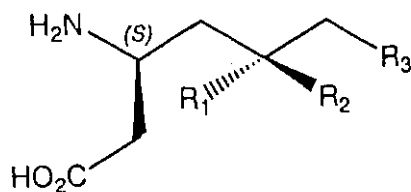
(式中、 $R_3$ は、( $C_1 \sim C_6$ )アルキル、( $C_3 \sim C_6$ )シクロアルキル、( $C_3 \sim C_6$ )シクロアルキル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、フェニル、フェニル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、ピリジル、ピリジル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、フェニル - N(H) -、またはピリジル - N(H) - であり(ここで、前記アルキル部分は各々、1~5個のフッ素原子で、好ましくは0~3個のフッ素原子で任意に置換され得るし、そして前記フェニルおよび前記ピリジル、ならびに前記フェニル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキルおよび前記ピリジル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキルのフェニルおよびピリジル部分は、それぞれ、クロロ、フルオロ、アミノ、ニトロ、シアノ、( $C_1 \sim C_3$ )アルキルアミノ、( $C_1 \sim C_3$ )アルキル(1~3個のフッ素原子で任意に置換される)、および( $C_1 \sim C_3$ )アルコキシ(1~3個のフッ素原子で任意に置換される)から選択される1~3個の置換基で、好ましくは0~2個の置換基で任意に置換され得る))

を有する、請求項7記載の医薬組成物。

【請求項10】

前記化合物またはこのような化合物の製薬上許容可能な塩が、式IA-2：

【化6】



IA-2

(式中、 $R_1$ は、水素、または1~5個のフッ素原子で任意に置換される( $C_1 \sim C_6$ )アルキルであり；

$R_2$ は、水素、または1~5個のフッ素原子で任意に置換される( $C_1 \sim C_6$ )アルキルであり；そして

$R_3$ は、( $C_1 \sim C_6$ )アルキル、( $C_3 \sim C_6$ )シクロアルキル、( $C_3 \sim C_6$ )シクロアルキル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、フェニル、フェニル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、ピリジル、ピリジル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、フェニル - N(H) -、またはピリジル - N(H) - であり(ここで、前記アルキル部分は各々、1~5個のフッ素原子で、好ましくは0~3個のフッ素原子で任意に置換され得るし、そして前記フェニルおよび前記ピリジル、ならびに前記フェニル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキルおよび前記ピリジル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキルのフェニルおよびピリジル部分は、それぞれ、クロロ、フルオロ、アミノ、ニトロ、シアノ、( $C_1 \sim C_3$ )アルキルアミノ、( $C_1 \sim C_3$ )アルキル(1~3個のフッ素原子で任意に置換される)、および( $C_1 \sim C_3$ )アルコキシ(1~3個のフッ素原子で任意に置換される)から独立して選択される1~3個の置換基で、好ましくは0~2個の置換基で任意に置換され得る)；

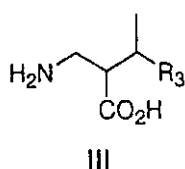
但し、 $R_1$ が水素である場合、 $R_2$ は水素ではない)

を有する、請求項6記載の医薬組成物。

【請求項11】

前記化合物またはその製薬上許容可能な塩が、式III：

## 【化 7】



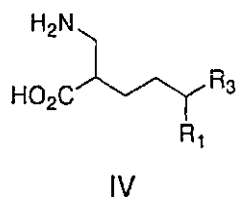
(式中、 $R_3$ は、( $C_1 \sim C_6$ )アルキル、( $C_3 \sim C_6$ )シクロアルキル、( $C_3 \sim C_6$ )シクロアルキル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、フェニル、フェニル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、ピリジル、ピリジル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、フェニル - N(H) -、またはピリジル - N(H) - であり(ここで、前記アルキル部分は各々、1~5個のフッ素原子で、好ましくは0~3個のフッ素原子で任意に置換され得るし、そして前記フェニルおよび前記ピリジル、ならびに前記フェニル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキルおよび前記ピリジル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキルのフェニルおよびピリジル部分は、それぞれ、クロロ、フルオロ、アミノ、ニトロ、シアノ、( $C_1 \sim C_3$ )アルキルアミノ、( $C_1 \sim C_3$ )アルキル(1~3個のフッ素原子で任意に置換される)、および( $C_1 \sim C_3$ )アルコキシ(1~3個のフッ素原子で任意に置換される)から選択される1~3個の置換基で、好ましくは0~2個の置換基で任意に置換され得る))

を有する、請求項1記載の医薬組成物。

## 【請求項12】

前記化合物またはこのような化合物の製薬上許容可能な塩が、式IV:

## 【化 8】



(式中、 $R_1$ は、水素、または1~5個のフッ素原子で任意に置換される( $C_1 \sim C_6$ )アルキルであり；そして

$R_3$ は、( $C_1 \sim C_6$ )アルキル、( $C_3 \sim C_6$ )シクロアルキル、( $C_3 \sim C_6$ )シクロアルキル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、フェニル、フェニル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、ピリジル、ピリジル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、フェニル - N(H) -、またはピリジル - N(H) - であり(ここで、前記アルキル部分は各々、1~5個のフッ素原子で、好ましくは0~3個のフッ素原子で任意に置換され得るし、そして前記フェニルおよび前記ピリジル、ならびに前記フェニル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキルおよび前記ピリジル - ( $C_1 \sim C_3$ )アルキルのフェニルおよびピリジル部分は、それぞれ、クロロ、フルオロ、アミノ、ニトロ、シアノ、( $C_1 \sim C_3$ )アルキルアミノ、( $C_1 \sim C_3$ )アルキル(1~3個のフッ素原子で任意に置換される)、および( $C_1 \sim C_3$ )アルコキシ(1~3個のフッ素原子で任意に置換される)から選択される1~3個の置換基で、好ましくは0~2個の置換基で任意に置換され得る))を有する、請求項1記載の医薬組成物。