

【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28年12月1日(2016.12.1)

【公開番号】特開2016-155815(P2016-155815A)

【公開日】平成28年9月1日(2016.9.1)

【年通号数】公開・登録公報2016-052

【出願番号】特願2016-28453(P2016-28453)

【国際特許分類】

C 0 7 D	471/04	(2006.01)
C 0 7 D	519/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/4375	(2006.01)
A 6 1 K	31/4745	(2006.01)
A 6 1 K	31/4985	(2006.01)
A 6 1 K	31/519	(2006.01)
A 6 1 K	31/5383	(2006.01)
A 6 1 P	3/00	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/18	(2006.01)
A 6 1 P	25/20	(2006.01)
A 6 1 P	25/22	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/30	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D	471/04	1 0 5 P
C 0 7 D	471/04	C S P
C 0 7 D	519/00	3 0 1
C 0 7 D	519/00	3 1 1
A 6 1 K	31/4375	
A 6 1 K	31/4745	
A 6 1 K	31/4985	
A 6 1 K	31/519	
A 6 1 K	31/5383	
A 6 1 P	3/00	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/04	
A 6 1 P	25/06	
A 6 1 P	25/14	

A 6 1 P	25/16
A 6 1 P	25/18
A 6 1 P	25/20
A 6 1 P	25/22
A 6 1 P	25/24
A 6 1 P	25/28
A 6 1 P	25/30
A 6 1 P	43/00

1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成28年10月14日(2016.10.14)

【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)の化合物、又はその医薬として許容し得る塩若しくは立体異性体：

【化1】



(I),

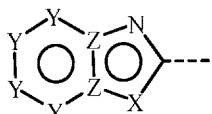
(式中、

Lは、 $-(\text{C}(\text{R}^{10})_2)_m-$ 、 $-\text{CR}^{10}=\text{CR}^{10}-$ 、 $-\text{K}-\text{C}(\text{R}^{10})_2-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{10})_2-\text{K}-$ 、又は-S-であり；Kは、 $-\text{NR}^{11}-$ 、-O-、又は-S-であり；

mは、2又は3であり；

Aは、

【化2】



であり；

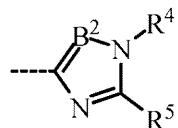
Xは、(i)CR¹若しくはN; 又は(ii)O若しくはNR²であり；各Yは、独立にN又はCR³であり；

各Zは、独立にN又はCであり；

但し、Aが、1、2、3、又は4個の窒素環原子を含むことを条件とし；

Bは、

【化3】



であり；

B²は、CR⁹又はNであり；R¹は、水素、ハロ、シアノ、アルキル、アルケニル、アルコキシル、アミノアルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アミノ、アミド、カルボニル、チオール、スルフィニル、又はスルホニルであり；

R^2 は、水素、アルキル、アルケニル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、カルボニル、又はスルホニルであり；

各 R^3 は、独立に、(i)水素、ハロ、シアノ、アルキル、アルケニル、アルコキシリ、アミノアルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アミノ、アミド、カルボニル、チオール、スルフィニル、又はスルホニルであり；或いは(ii)2個の隣接する R^3 の出現は、それらが結合している原子と共に、アリール又はヘテロアリール環を形成し；

R^4 と R^5 とは、それらが結合している原子と共に、単環式若しくは多環式のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、又はヘテロシクリル環を形成し；

R^9 は、水素、ハロ、シアノ、アルキル、アルケニル、アルコキシリ、アミノアルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、アラルキル、ヘテロアラルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アミノ、アミド、カルボニル、チオール、スルフィニル、又はスルホニルであり；

各 R^{10} は、独立に、水素、ハロ、又はアルキルであり；かつ

各 R^{11} は、水素又はアルキルである)。

【請求項2】

Lが、 $-(C(R^{10}))_2$ -である、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

mが2である、請求項1又は2記載の化合物。

【請求項4】

各 R^{10} が、独立に、水素又はメチルである、請求項1、2、又は3記載の化合物。

【請求項5】

R^{10} が水素である、請求項4記載の化合物。

【請求項6】

少なくとも1個の R^{10} がメチルである、請求項4記載の化合物。

【請求項7】

Lが、 $-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH(Me)-CH_2-$ 、又は $-CH_2-CH(Me)-$ である、請求項1記載の化合物。

【請求項8】

Lが、 $-CH(Me)-CH_2-$ 又は $-CH_2-CH(Me)-$ である、請求項1記載の化合物。

【請求項9】

Lが $-CH_2-CH_2-$ である、請求項1記載の化合物。

【請求項10】

R^4 と R^5 とが、それらが結合している原子と共に、単環式環を形成し、Bが二環式環系である、請求項1～9のいずれか一項記載の化合物。

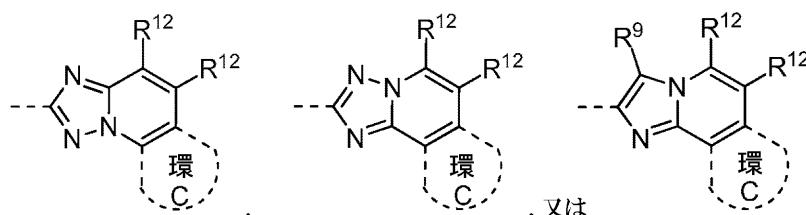
【請求項11】

R^4 と R^5 とが、それらが結合している原子と共に、多環式環を形成し、Bが三環式環系である、請求項1～9のいずれか一項記載の化合物。

【請求項12】

Bが

【化4】



である(式中、環Cは5員若しくは6員のヘテロアリール環又は5員から7員のシクロアルキル若しくはヘテロシクリル環であり；各 R^{12} は、独立に、水素、ハロゲン、シアノ、=O、-OR¹³、-NR¹³R¹⁴、-N(R¹³)C(O)R¹⁴、-C(O)NR¹³R¹⁴、-C(O)R¹³、-C(O)OR¹³、-OC(O)R¹³、-S

R^{13} 、 $-S(O)R^{13}$ 、 $-S(O)_2R^{13}$ 、 $-S(O)_2NR^{13}R^{14}$ 、アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、アラルキル、ヘテロアラルキル、アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリルであり；式中、各 R^{13} 及び R^{14} は、独立に、水素、アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、アラルキル、ヘテロアラルキル、アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリルであり；或いは、 R^{13} と R^{14} とが両方とも1個の窒素原子に結合している場合、 R^{13} と R^{14} とは、それらが結合している窒素原子と共に、3員から10員の環を形成する）、請求項11記載の化合物。

【請求項13】

R^9 が水素又はメチルである、請求項12記載の化合物。

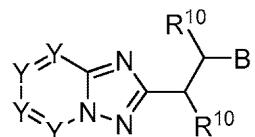
【請求項14】

R^{12} が水素である、請求項12及び13のいずれか一項記載の化合物。

【請求項15】

式(II-A)を有する請求項1～14のいずれか一項記載の化合物、又はその医薬として許容し得る塩若しくは立体異性体：

【化5】



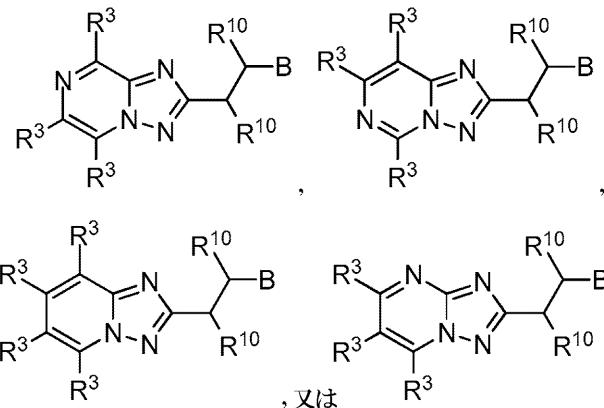
(II-A),

。

【請求項16】

下記式を有する請求項15記載の化合物、又はその医薬として許容し得る塩若しくは立体異性体：

【化6】



。

【請求項17】

各 R^3 が、独立に、水素、メチル、エチル、 CF_3 、又はハロである、請求項15及び16のいずれか一項記載の化合物。

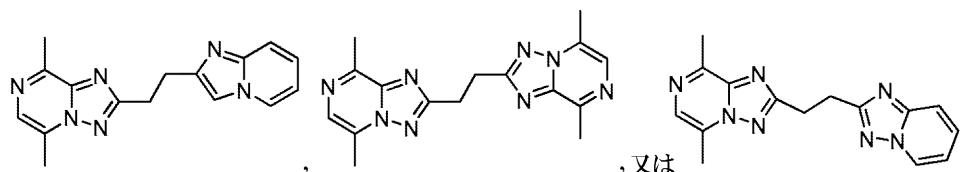
【請求項18】

R^{10} が水素である、請求項15～17のいずれか一項記載の化合物。

【請求項19】

前記化合物が

【化 7】

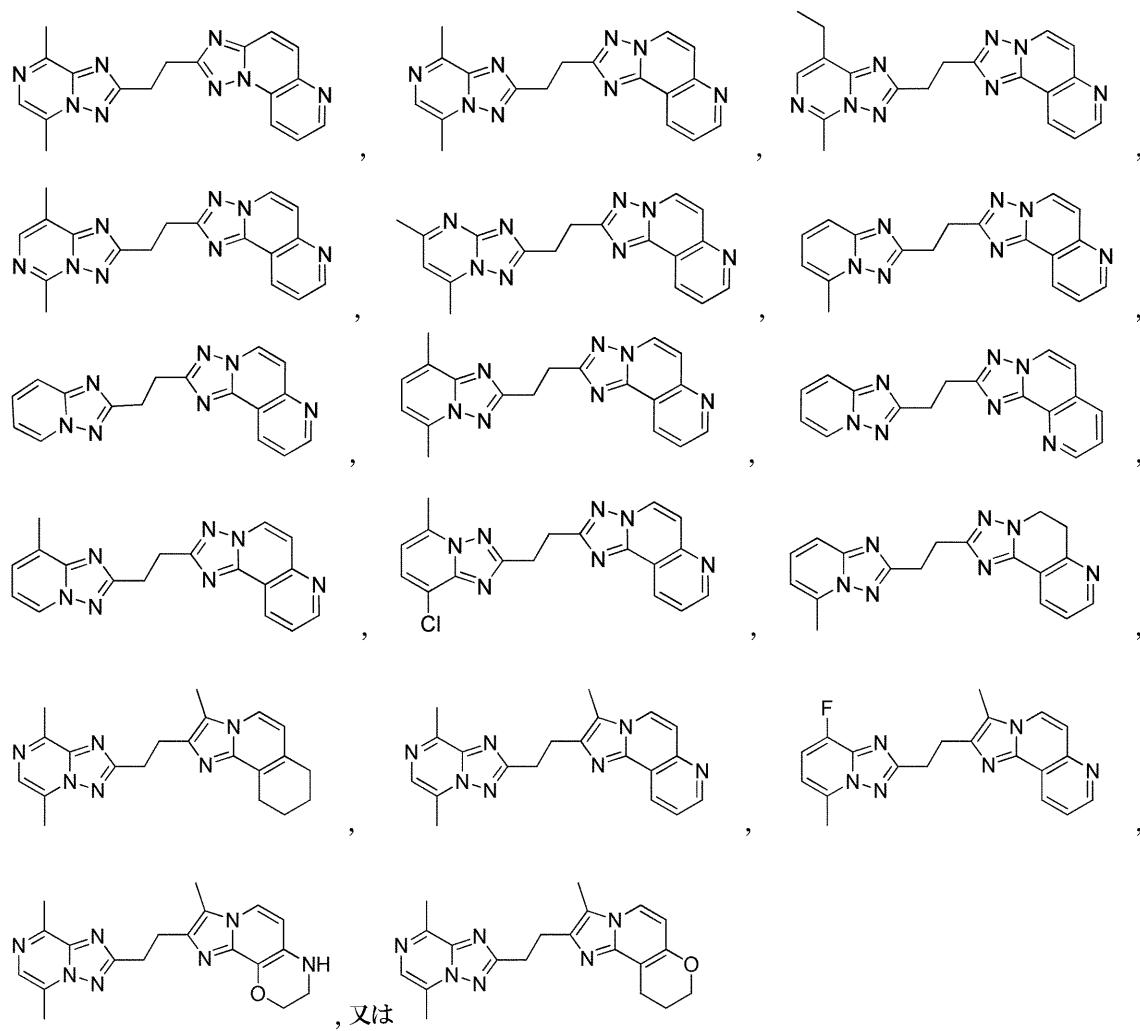


である、請求項 1 5 記載の化合物。

【請求項 20】

前記化合物が

【化 8】

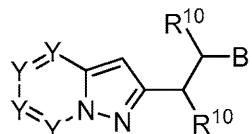


である、請求項 1 5 記載の化合物。

【請求項 21】

式(II-B)を有する請求項1～14のいずれか一項記載の化合物、又はその医薬として許容し得る塩若しくは立体異性体：

【化9】



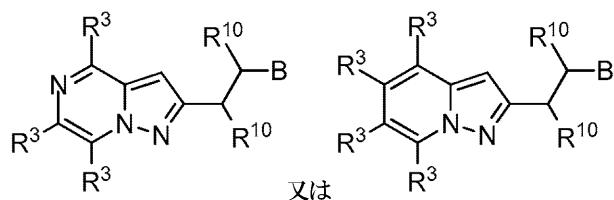
(II-B),

。

【請求項22】

下記式を有する請求項21記載の化合物、又はその医薬として許容し得る塩若しくは立体異性体：

【化10】



。

【請求項23】

各R³が、独立に、水素、メチル、エチル、CF₃、又はハロである、請求項21及び22のいずれか一項記載の化合物。

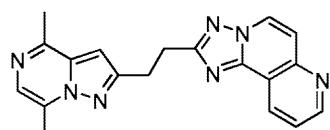
【請求項24】

R¹⁰が水素である、請求項21～23のいずれか一項記載の化合物。

【請求項25】

前記化合物が

【化11】

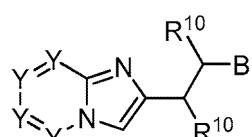


である、請求項24記載の化合物。

【請求項26】

式(II-C)を有する請求項1～14のいずれか一項記載の化合物、又はその医薬として許容し得る塩若しくは立体異性体：

【化12】



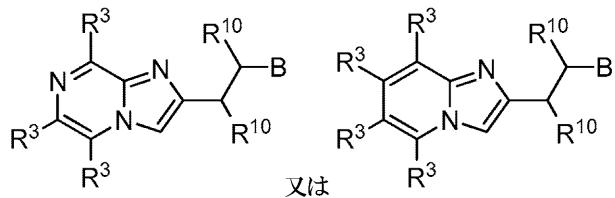
(II-C),

。

【請求項27】

下記式を有する請求項26記載の化合物、又はその医薬として許容し得る塩若しくは立体異性体：

【化13】



。

【請求項28】

各R³が、独立に、水素、メチル、エチル、CF₃、又はハロである、請求項26及び27のいずれか一項記載の化合物。

【請求項29】

R¹⁰が水素である、請求項26～28のいずれか一項記載の化合物。

【請求項30】

前記化合物が

【化14】



である、請求項26記載の化合物。

【請求項31】

請求項1～30のいずれか一項記載の化合物、又はその医薬として許容し得る塩若しくは立体異性体を含む、医薬組成物。

【請求項32】

1種以上の追加の活性剤をさらに含む、請求項31記載の医薬組成物。

【請求項33】

請求項1～30のいずれか一項記載の化合物、又はその医薬として許容し得る塩若しくは立体異性体を含む、CNS疾患又は代謝性疾患を治療、予防、又は管理するための医薬組成物。

【請求項34】

前記疾患が、神経疾患、統合失調症、統合失調症-関連疾患、統合失調症スペクトラム障害、急性統合失調症、慢性統合失調症、NOS統合失調症、統合失調情動障害、統合失調症様障害、パラフレニー、妄想性パーソナリティー障害、スキゾイドパーソナリティー障害、統合失調型パーソナリティー障害、妄想性障害、精神病、精神病の要素を有する疾病、精神病性障害、短期精神病性障害、アルツハイマー病性精神病、パーキンソン病性精神病、共有精神病性障害、物質誘発性精神病性障害、一般身体疾患による精神病性障害、精神病性情動障害、攻撃性、せん妄、興奮精神病、トウレット症候群、躁障害、器質性精神病、NOS精神病、痙攣、発作、激越、心的外傷後ストレス障害、行動障害、神経変性疾患、ハンチントン病、アルツハイマー病、パーキンソン病、運動障害、認知症、気分障害、双極性障害、不安、うつ病、大うつ病性障害、单極性うつ、治療抵抗性うつ病、気分変調症、情動障害、季節性情動障害、強迫性障害、注意欠陥障害、注意欠陥多動性障害、めまい、疼痛、神経因性疼痛、神経因性疼痛を伴う感作、炎症性疼痛、線維筋痛症、片頭痛、認知機能障害、統合失調症に関連する認知機能障害、アルツハイマー病における認知障害、パーキンソン病における認知障害、運動障害、レストレスレッグ症候群、多発性硬化症、睡眠障害、物質の乱用若しくは依存症、中毒、摂食障害、自閉症、肥満、望ましくない体重の保持若しくは体重の増加、代謝症候群、糖尿病、非インスリン依存性糖尿病、耐糖能異常、又は高血糖症である、請求項33記載の医薬組成物。

【請求項35】

前記疾患が、統合失調症、統合失調症に関連する認知障害、認知障害、精神病、うつ病、又はハンチントン病である、請求項3~4記載の医薬組成物。

【請求項3~6】

第2の活性剤をさらに含む、請求項3~3~5のいずれか一項記載の医薬組成物。