

【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25日(2007.10.25)

【公表番号】特表2007-505888(P2007-505888A)

【公表日】平成19年3月15日(2007.3.15)

【年通号数】公開・登録公報2007-010

【出願番号】特願2006-526721(P2006-526721)

【国際特許分類】

C 0 7 D 249/08 (2006.01)

C 0 7 D 403/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/4196 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 K 31/501 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 15/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 249/08 5 1 3

C 0 7 D 403/14 C S P

A 6 1 K 31/4196

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/497

A 6 1 K 31/501

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 15/10

A 6 1 P 15/06

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 27/02

【手続補正書】

【提出日】平成19年9月6日(2007.9.6)

【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

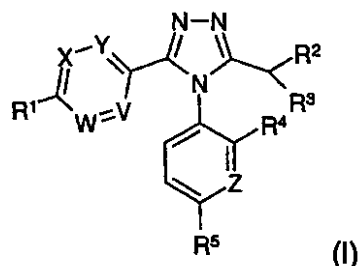
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



[式中、

V、W、X 及び Z は、同一でも異なってもよく、C - R⁶ 又は N を表し；

Z は、C - H 又は N であり；

R¹ は、

(i) 同一でも異なってもよく、ハロ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、シアノ、C (O) NR⁷R⁸、NR⁷R⁸、NR⁷C (O) R¹⁰ 及び N [C (O) R¹⁰]₂ から各々独立に選択される 2 つ又はそれ以上の置換基で置換されたフェニル環；及び、

(ii) N、O 及び S から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含む 5 ~ 7 員の芳香族複素環及びその N - オキシドであって、該環は、同一でも異なってもよく、ハロ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、シアノ、C (O) NR⁷R⁸、NR⁷R⁸、NR⁷C (O) R¹⁰ 及び N [C (O) R¹⁰]₂ から選択される 2 つ又はそれ以上の置換基で場合により置換された複素環；

から選択され；

R² は、

(i) H、OH、OR⁹、NR⁷R⁸、NR⁷C (O) R¹⁰ 及び N [C (O) R¹⁰]₂；

(ii) N、O 及び S から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含む 5 ~ 7 員環の N - 結合複素環であって、該環は、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ及び C (O) NR⁷R⁸ から選択される 1 つ又はそれ以上の基で場合により置換された複素環；及び、

(iii) N、O 及び S から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含む N - 結合の 5 ~ 7 員環の複素環で場合により置換された (C₁ - C₆) アルキル；

から選択され；

R³ は、H 及び (C₁ - C₆) アルキルから選択され；R⁴ は、H、(C₁ - C₆) アルキル及び OR⁹ から選択され；

R⁵ は、ハロ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、NR⁷R⁸、NR⁷C (O) R¹⁰ 及び N [C (O) R¹⁰]₂ から選択され；

R⁶ は、H、ハロ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、シアノ、NR⁷R⁸、NR⁷C (O) R¹⁰、N [C (O) R¹⁰]₂ 及び C (O) NR⁷R⁸ から選択され；

R⁷ 及び R⁸ は、同一でも異なってもよく、H 及び (C₁ - C₆) アルキルから選択され；

R⁹ は、(C₁ - C₆) アルコキシ及び N、O 及び S から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含む N - 結合の 5 ~ 7 員の複素環から各々独立に選択される 1 つ又はそれ以上の基で場合により置換された (C₁ - C₆) アルキルであり；

R¹⁰ は、(C₁ - C₆) アルキル及び (C₁ - C₆) アルコキシから選択される]

の化合物、その互変異性体、又はそれらの薬学的に許容し得る塩、溶媒和物若しくは多形体；[但し、式 (I) の化合物は、

3 - エチル - 5 - (4 - イミダゾール - 1 - イルフェニル) - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 4 H - [1, 2, 4] トリアゾール；

3 - (3', 5' - ジクロロピフェニル - 4 - イル) - 4 - (2 - メトキシフェニル) - 5 - メチル - 4 H - [1, 2, 4] トリアゾール；

3 - (3' , 5' - ビス - トリフルオロメチルピフェニル - 4 - イル) - 4 - (2 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール ; 又は、

3 - (3' , 5' - ビス - トリフルオロメチルピフェニル - 4 - イル) - 5 - メチル - 4 - (3 - トリフルオロメチルフェニル) - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾールではない]。

【請求項 2】

X が C H である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

V、W 及び Y が各々独立に C H、C - O C H₃ 又は N である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

W 及び Y が各々独立に C H 又は N であり、そして X 及び V が各々 C H である、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

Z が N である、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

Z が C H である、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

R¹ が、

(i) 同一でも異なってもよく、ハロ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、シアノ、C (O) N R⁷ R⁸、N R⁷ R⁸、N R⁷ C (O) R¹⁰ 及び N [C (O) R¹⁰]₂ から各々独立に選択される 2 つの置換基で置換されたフェニル環 ; 及び、

(ii) 同一でも異なってもよく、ハロ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、シアノ、C (O) N R⁷ R⁸、N R⁷ R⁸、N R⁷ C (O) R¹⁰ 及び N [C (O) R¹⁰]₂ から各々独立に選択される 2 つの置換基で各々置換されたピリジル環又はその N - オキシド ;

から選択される、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8】

R¹ が、同一でも異なってもよく、フルオロ、クロロ、メチル、メトキシ及びシアノから各々独立に選択される 2 つの置換基で置換されるフェニル環である、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

R¹ が、2 個のメチル基で置換されたピリジン - N - オキシドである、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 10】

R² が、

(i) H、(C₁ - C₃) アルコキシ、(C₁ - C₃) アルコキシ - (C₁ - C₃) アルコキシ及び N ((C₁ - C₃) アルキル)₂ ; 及び

(ii) 1 ~ 3 個の窒素原子を含む N - 結合の 5 員複素環であって、該環は、場合により C (O) N R⁷ R⁸ で置換された複素環 ;

から選択される、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 11】

R² が、H、メトキシ、エトキシ、2 - メトキシエトキシ、ジメチルアミノ、1, 2, 3 - トリアゾール - 2 - イル及びピロリジニルから選択され、ここで後者は、場合により C O N H₂ で置換される、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

R² が H 及びメトキシから選ばれる、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】

R³ が H である、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 14】

R^4 が H、メチル又はメトキシである、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物

。

【請求項 15】

R^4 が H である、請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 16】

R^5 がメトキシ又は $NHCH_3$ である、請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 17】

R^5 がメトキシである、請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 18】

以下の化合物：

2 - (4 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) - 5 - (5 - メトキシメチル - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イル) - ピリジン；

2 - (2, 3 - ジメチルフェニル) - 5 - (5 - メトキシメチル - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イル) - ピリジン；

5 - (4 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) - 2 - (5 - メトキシメチル - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イル) - ピリジン；

5 - (2, 3 - ジメチルフェニル) - 2 - (5 - メトキシメチル - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イル) - ピリジン；

1 - [5 - [5 - (2, 3 - ジメチルフェニル) - ピリジン - 2 - イル] - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イルメチル] - ピロリジン - (2S) - 2 - カルボン酸アミド；

5 - (2, 3 - ジメチルフェニル) - 2 - (5 - ピロリジン - 1 - イルメチル) - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イル) - ピリジン；

2 - (4 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) - 5 - [5 - メトキシメチル - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピラジン；

2 - (2, 3 - ジメチルフェニル) - 5 - [5 - メトキシメチル - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピラジン；

2 - (4 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) - 5 - [4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 5 - メチル - 4 H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピラジン；

2 - (2, 3 - ジメチルフェニル) - 5 - [4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 5 - メチル - 4 H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピラジン；

2 - (4 - シアノ - 2 - メチルフェニル) - 5 - [4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 5 - メチル - 4 H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピラジン；

2 - (5 - フルオロ - 2 - メトキシフェニル) - 5 - [4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 5 - メチル - 4 H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピラジン；

2 - (4 - シアノ - 2 - メチルフェニル) - 5 - [5 - メトキシメチル - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピラジン；

5 - (4 - シアノ - 2 - メチルフェニル) - 2 - [5 - メトキシメチル - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピリジン；

2 - (5 - フルオロ - 2 - メトキシフェニル) - 5 - [5 - メトキシメチル - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピリジン；

2 - (2 - フルオロ - 5 - メトキシフェニル) - 5 - [4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 5 - メチル - 4 H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピラジン；

2 - (3 - フルオロ - 2 - メトキシ - フェニル) - 5 - [4 - (6 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル) - 5 - メチル - 4 - H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピラジン ;

から選択される請求項 1 に記載の化合物及びその互変異性体、並びにそれらの薬学的に許容し得る塩、溶媒和物及び多形体。

【請求項 19】

以下の化合物：

2 - (4 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) - 5 - (5 - メトキシメチル - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イル) - ピリジン；

2 - (2 , 3 - ジメチルフェニル) - 5 - (5 - メトキシメチル - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イル) - ピリジン；

5 - (4 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) - 2 - (5 - メトキシメチル) - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イル) - ピリジン；

5 - (2 , 3 - ジメチルフェニル) - 2 - (5 - メトキシメチル) - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イル) - ピリジン；

1 - [5 - [5 - (2 , 3 - ジメチルフェニル) - ピリジン - 2 - イル] - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イルメチル] - ピロリジン - (2 S) - 2 - カルボン酸アミド；

5 - (2 , 3 - ジメチルフェニル) - 2 - (5 - ピロリジン - 1 - イルメチル) - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イル) - ピリジン；

2 - (4 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) - 5 - [5 - メトキシメチル - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピラジン；

2 - (2 , 3 - ジメチルフェニル) - 5 - [5 - メトキシメチル - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピラジン；

2 - (4 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) - 5 - [4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 5 - メチル - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピラジン；

2 - (2 , 3 - ジメチルフェニル) - 5 - [4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 5 - メチル - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピラジン；

2 - (4 - シアノ - 2 - メチルフェニル) - 5 - [4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 5 - メチル - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピラジン；

2 - (5 - フルオロ - 2 - メトキシフェニル) - 5 - [4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 5 - メチル - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピラジン；

2 - (4 - シアノ - 2 - メチルフェニル) - 5 - [5 - メトキシメチル - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピラジン；

5 - (4 - シアノ - 2 - メチルフェニル) - 2 - [5 - メトキシメチル - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピリジン；

2 - (5 - フルオロ - 2 - メトキシフェニル) - 5 - [5 - メトキシメチル - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピリジン；

2 - (3 - フルオロ - 2 - メトキシフェニル) - 5 - [5 - メトキシメチル - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピラジン；及び、

2 - (3 - フルオロ - 2 - メトキシ - フェニル) - 5 - [4 - (6 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル) - 5 - メチル - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イル] - ピラジン；

から選択される請求項 18 に記載の化合物及びその互変異性体、並びにそれらの薬学的に許容し得る塩、溶媒和物及び多形体。

【請求項 20】

請求項 1 ～ 19 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物又は薬学的に許容し得るその塩、溶媒和物若しくは多形体、及び薬学的に許容し得る希釈剤又は担体を含む医薬組成物。

【請求項 21】

オキシトシンの阻害が有益な効果を生じることが知られているか、又は有益な効果を示すことができる疾患又は状態の治療のための医薬の製造における、請求項 1 ～ 19 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物 (但し書に記載の化合物を含む)、又は薬学的に許容し得るその塩、溶媒和物若しくは多形体の使用。

【請求項 22】

疾患又は状態が、性機能障害、雄性性機能障害、雌性性機能障害、性的欲求低下障害、性的興奮障害、オルガスム障害、性的疼痛障害、早漏、早期陣痛、分娩における合併症、食欲障害及び摂食障害、良性前立腺肥大、早産、月経困難症、鬱血性心不全、動脈性高血圧、肝硬変、ネフローゼ性高血圧、眼圧亢進症、強迫性障害及び精神神経疾患から選択されたものである、請求項 21 に記載の使用。

【請求項 23】

疾患又は状態が、性的興奮障害、オルガスム障害、性的疼痛障害及び早漏から選択されたものである、請求項 22 に記載の使用。