

【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24年3月29日(2012.3.29)

【公表番号】特表2010-520223(P2010-520223A)

【公表日】平成22年6月10日(2010.6.10)

【年通号数】公開・登録公報2010-023

【出願番号】特願2009-551873(P2009-551873)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/50 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/506

A 6 1 P 25/08

C 0 7 D 403/12

A 6 1 K 31/50

A 6 1 K 31/5377

【手続補正書】

【提出日】平成23年2月18日(2011.2.18)

【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】

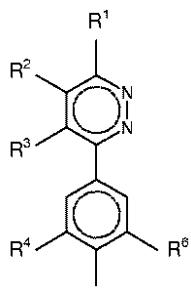
【特許請求の範囲】

【請求項1】

伝導障害、電撃痙攣および/または発作によって特徴付けられる障害を治療するための医薬組成物であって、該障害を治療するための治療有効量のピリダジン化合物、および医薬的に許容される担体、賦形剤、またはビヒクルを含み、ここで、該ピリダジン化合物は

、式Ib

【化10】



Ib

(式中、R¹、R²、およびR³は、独立して、水素、ヒドロキシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルキレン、アルケニレン、アルコキシ、アルケニルオキシ、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、シクロアルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アロイル、ヘテロアリール、複素環、アシリル、アシリルオキシ、スルホニル、スルフィニル、スルフェニル、スルホキシド、サルフェート、スルホ

ネート、アミノ、イミノ、アジド、チオール、チオアルキル、チオアルコキシ、チオアリール、ニトロ、ウレイド、シアノ、ハロ、シリル、シリルオキシ、シリルアルキル、シリルチオ、=O、=S、ホスホネート、カルボキシル、カルボニル、カルバモイル、またはカルボキサミドであり；R⁴、R⁵、およびR⁶は、独立して、水素、アルキル、アルコキシ、ハロ、またはニトロであり；またはR¹およびR²、またはR²およびR³は、ヘテロアリールまたは複素環を形成してよい）；またはその異性体もしくは医薬的に許容される塩を有する、医薬組成物。

【請求項2】

R¹が、ピペラジニルまたは置換されたピペラジニルである、請求項1に記載の医薬組成物。

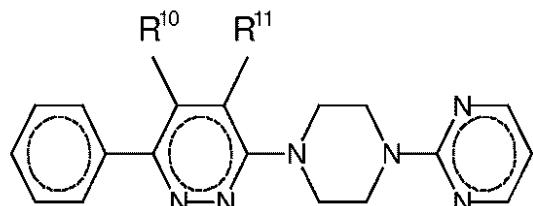
【請求項3】

R¹が、ピリミジニルで置換されたピペラジニルである、請求項2に記載の医薬組成物。

【請求項4】

前記ピリダジン化合物が、式II：

【化11】



II

（式中、R¹、R²は、独立して、水素、ヒドロキシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルキレン、アルケニレン、アルコキシ、アルケニルオキシ、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、シクロアルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アロイル、ヘテロアリール、複素環、アシル、アシルオキシ、スルホニル、スルフィニル、スルフェニル、スルホキシド、サルフェート、スルホネート、アミノ、イミノ、アジド、チオール、チオアルキル、チオアルコキシ、チオアリール、ニトロ、ウレイド、ホスホネート、シアノ、ハロ、シリル、シリルオキシ、シリルアルキル、シリルチオ、=O、=S、カルボキシル、カルボニル、カルバモイル、またはカルボキサミドである）；またはその異性体もしくは医薬的に許容される塩を有する、請求項3に記載の医薬組成物。

【請求項5】

R¹が水素であり、R²がピロリル、ピロリニル、イミダゾリル、ピラゾリル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、トリアゾリルまたはテトラゾリルである、請求項4に記載の医薬組成物。

【請求項6】

R¹が置換アミノであり、R²がピロリル、ピロリニル、イミダゾリル、ピラゾリル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、トリアゾリル、またはテトラゾリルであり、R³、R⁴、R⁵およびR⁶が水素である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項7】

R²はピリジニルである、請求項6に記載の医薬組成物。

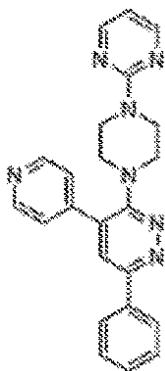
【請求項8】

前記ピリダジン化合物が、2-(4-(4-メチル-6-フェニルピリダジン-3-イル)ピペラジン-1-イル)ピリミジン二塩酸塩である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項9】

前記ピリダジン化合物が以下の構造：

【化15】

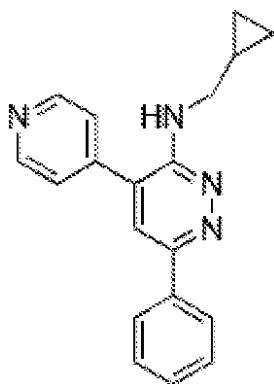


を有する、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項10】

前記ピリダジン化合物が以下の構造：

【化16】



を有する、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項11】

前記障害がてんかんである、請求項1～10のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項12】

前記障害が小児てんかんである、請求項1～11のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0030

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0030】

本発明のこれらおよび他の態様、特徴、ならびに利点は、以下の詳細な記載から当業者には明らかであるはずである。

本発明の好ましい実施形態では、例えば以下が提供される：

(項目1)

伝導障害、電撃痙攣および/または発作によって特徴付けられる障害を治療するための医薬組成物であって、該障害を治療するための治療有効量のピリダジン化合物、および医薬的に許容される担体、賦形剤、またはビヒクルを含む医薬組成物。

(項目2)

ピリダジン化合物が、アリールまたは置換アリール、ヘテロアリールまたは置換ヘテロアリールを有するペンダント状のピリダジニル基を含む、項目1に記載の医薬組成物。

(項目3)

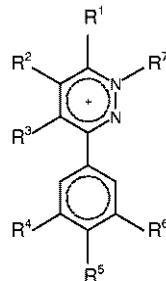
前記ヘテロアリールが、ピリミジニルまたはピリジニルで置換されたピペラジニルであ

る、項目2に記載の医薬組成物。

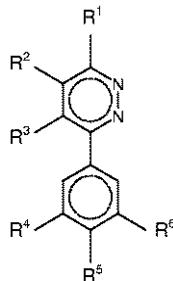
(項目4)

前記ピリダジン化合物が、式IaまたはIb：

【化10】



Ia または



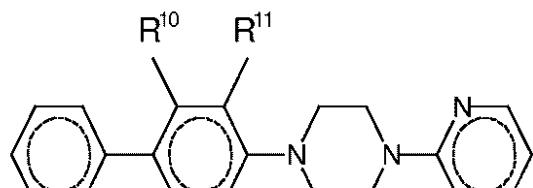
Ib

(式中、R¹、R²、およびR³は、独立して、水素、ヒドロキシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルキレン、アルケニレン、アルコキシ、アルケニルオキシ、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、シクロアルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アロイル、ヘテロアリール、複素環、アシル、アシルオキシ、スルホニル、スルフィニル、スルフェニル、スルホキシド、サルフェート、スルホネート、アミノ、イミノ、アジド、チオール、チオアルキル、チオアルコキシ、チオアリール、ニトロ、ウレイド、シアノ、ハロ、シリル、シリルオキシ、シリルアルキル、シリルチオ、=O、=S、ホスホネート、カルボキシル、カルボニル、カルバモイル、またはカルボキサミドであり；R⁷は、置換もしくは非置換の、水素、ヒドロキシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルキレン、アルケニレン、アルコキシ、アルケニルオキシ、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、シクロアルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アロイル、ヘテロアリール、複素環、アシル、アシルオキシ、スルホニル、スルフィニル、スルフェニル、スルホキシド、サルフェート、スルホネート、アミノ、イミノ、アジド、チオール、チオアルキル、チオアルコキシ、チオアリール、ニトロ、ウレイド、シアノ、ハロ、シリル、シリルオキシ、シリルアルキル、シリルチオ、=O、=S、ホスホネート、カルボキシル、カルボニル、カルバモイル、またはカルボキサミドであり、またはR⁷は不在であってよく、1位のNと6位のCとの間には二重結合が存在し；R⁴、R⁵、およびR⁶は、独立して、水素、アルキル、アルコキシ、ハロ、またはニトロであり；またはR¹およびR²、R¹およびR⁷、またはR²およびR³は、ヘテロアリールまたは複素環を形成してよい）；またはその異性体もしくは医薬的に許容される塩を有する、項目1に記載の医薬組成物。

(項目5)

前記ピリダジン化合物が、式II：

【化11】



II

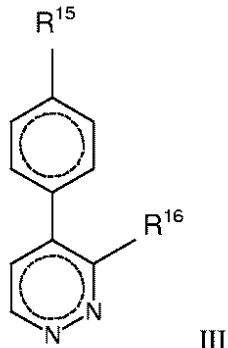
(式中、R¹⁰およびR¹¹は、独立して、水素、ヒドロキシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルキレン、アルケニレン、アルコキシ、アルケニルオキシ、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、シクロアルコキシ、アリール、アリールオ

キシ、アリールアルコキシ、アロイル、ヘテロアリール、複素環、アシル、アシルオキシ、スルホニル、スルフィニル、スルフェニル、スルホキシド、サルフェート、スルホネット、アミノ、イミノ、アジド、チオール、チオアルキル、チオアルコキシ、チオアリール、ニトロ、ウレイド、ホスホネット、シアノ、ハロ、シリル、シリルオキシ、シリルアルキル、シリルチオ、=O、=S、カルボキシル、カルボニル、カルバモイル、またはカルボキサミドである) ; またはその異性体もしくは医薬的に許容される塩を有する、項目1に記載の医薬組成物。

(項目6)

前記ピリダジン化合物が、式III:

【化12】

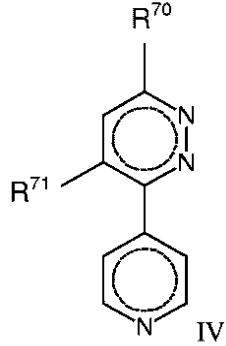


(式中、R¹⁵およびR¹⁶は、独立して、置換もしくは非置換の、水素、ヒドロキシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルキレン、アルケニレン、アルコキシ、アルケニルオキシ、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、シクロアルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アロイル、ヘテロアリール、複素環、アシル、アシルオキシ、スルホニル、スルフィニル、スルフェニル、スルホキシド、サルフェート、スルホネット、アミノ、イミノ、アジド、チオール、チオアルキル、チオアルコキシ、チオアリール、ニトロ、ウレイド、シアノ、ハロ、シリル、シリルオキシ、シリルアルキル、シリルチオ、=O、=S、ホスホネット、カルボキシル、カルボニル、カルバモイル、またはカルボキサミドである) ; またはその異性体もしくは医薬的に許容される塩を有する、項目1に記載の医薬組成物。

(項目7)

前記ピリダジン化合物が、式IV:

【化13】



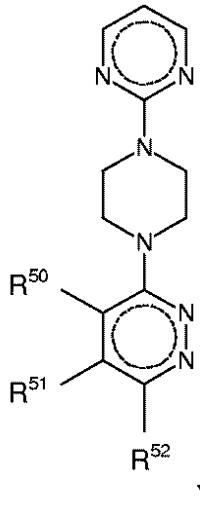
(式中、R⁷⁰は、置換もしくは非置換の、水素、ヒドロキシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルキレン、アルケニレン、アルコキシ、アルケニルオキシ、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、シクロアルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アロイル、ヘテロアリール、複素環、アシル、アシルオキシ

、スルホニル、スルフィニル、スルフェニル、スルホキシド、サルフェート、スルホネート、アミノ、イミノ、アジド、チオール、チオアルキル、チオアルコキシ、チオアリール、ニトロ、ウレイド、シアノ、ハロ、シリル、シリルオキシ、シリルアルキル、シリルチオ、=O、=S、カルボキシル、ホスホネート、カルボニル、カルバモイル、またはカルボキサミド、特に複素環、ヘテロアリール、アミノ、および置換アミノであり；およびR⁷は、アリールまたは置換アリールである）；またはその異性体もしくは医薬的に許容される塩を有する、項目1に記載の医薬組成物。

（項目8）

前記ピリダジン化合物が、式V：

【化14】



（式中、R⁵⁰、R⁵¹、およびR⁵²は、独立して、水素、ヒドロキシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルキレン、アルケニレン、アルコキシ、アルケニルオキシ、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、シクロアルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アロイル、ヘテロアリール、複素環、アシル、アシルオキシ、スルホニル、スルフィニル、スルフェニル、スルホキシド、サルフェート、スルホネート、アミノ、イミノ、アジド、チオール、チオアルキル、チオアルコキシ、チオアリール、ニトロ、ウレイド、シアノ、ハロ、シリル、シリルオキシ、シリルアルキル、シリルチオ、=O、=S、ホスホネート、カルボキシル、カルボニル、カルバモイル、またはカルボキサミドである）；またはその異性体もしくは医薬的に許容される塩を有する、項目1に記載の医薬組成物。

（項目9）

前記ピリダジン化合物が、表1に記述された化合物を含まない、項目1に記載の医薬組成物。

（項目10）

前記ピリダジン化合物が、2-(4-(4-メチル-6-フェニルピリダジン-3-イル)ピペラジン-1-イル)ピリミジン二塩酸塩である、項目1に記載の医薬組成物。

（項目11）

対象における伝導障害、電撃痙攣および/または発作によって特徴付けられる障害を治療および/または予防するための方法であって、項目1～10のいずれかに記載の組成物の治療有効量を投与することを含む方法。

（項目12）

障害がてんかんである、項目11に記載の方法。

（項目13）

対象が小児患者である、項目11または12に記載の方法。

(項目14)

伝導障害、電撃痙攣および／または発作によって特徴付けられる障害を治療および／または予防するための、項目1～13のいずれかに記載の組成物の使用。

(項目15)

伝導障害、電撃痙攣および／または発作によって特徴付けられる障害を治療および／または予防するための、項目1～14のいずれかに記載のピリダジン化合物または組成物、容器、およびその使用法の指示書を含むキット。