

【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】

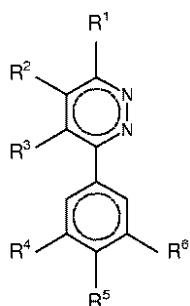
【特許請求の範囲】

【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 I b

【化 1 0】



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、アリーロキシ、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； R^4 、 R^5 、および R^6 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 R^1 および R^2 、または R^2 および R^3 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】

R^1 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。

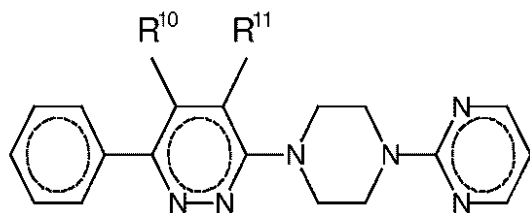
【請求項 3】

R^1 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 I I :

【化 1 1】



II

(式中、 R^{10} および R^{11} 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】

R^{10} が水素であり、 R^{11} 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】

R^1 が置換アミノであり、 R^2 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、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 が水素である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

R^2 はピリジニルである、請求項 6 に記載の医薬組成物。

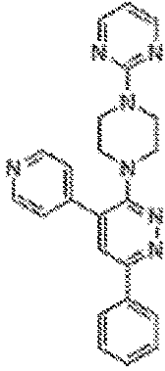
【請求項 8】

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】

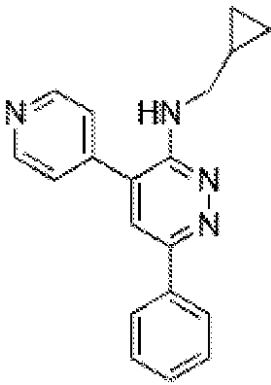


を有する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【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）

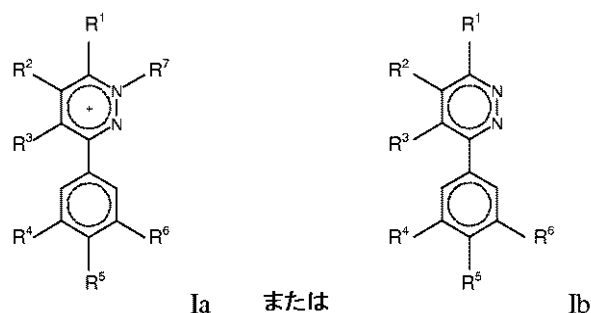
前記ヘテロアリールが、ピリミジニルまたはピリジニルで置換されたピペラジニルであ

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 I a または I b :

【化 1 0】

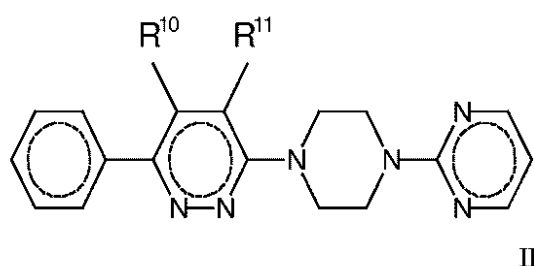


(式中、 R^1 、 R^2 、および R^3 は、独立して、水素、ヒドロキシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルキレン、アルケニレン、アルコキシ、アルケニルオキシ、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、シクロアルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アロイル、ヘテロアリール、複素環、アシル、アシルオキシ、スルホニル、スルフィニル、スルフェニル、スルホキシド、サルフェート、スルホネート、アミノ、イミノ、アジド、チオール、チオアルキル、チオアルコキシ、チオアリール、ニトロ、ウレイド、シアノ、ハロ、シリル、シリルオキシ、シリルアルキル、シリルチオ、 $=O$ 、 $=S$ 、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； R^7 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 R^7 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； R^4 、 R^5 、および R^6 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 R^1 および R^2 、 R^1 および R^7 、または R^2 および R^3 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 I I :

【化 1 1】



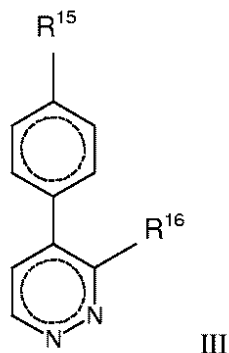
(式中、 R^{10} および R^{11} は、独立して、水素、ヒドロキシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルキレン、アルケニレン、アルコキシ、アルケニルオキシ、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、シクロアルコキシ、アリール、アリールオ

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、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 1 2】

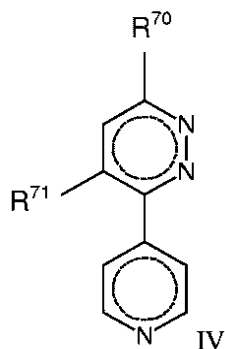


(式中、 R^{15} および R^{16} は、独立して、置換もしくは非置換の、水素、ヒドロキシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルキレン、アルケニレン、アルコキシ、アルケニルオキシ、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、シクロアルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アロイル、ヘテロアリール、複素環、アシル、アシルオキシ、スルホニル、スルフィニル、スルフェニル、スルホキシド、サルフェート、スルホネート、アミノ、イミノ、アジド、チオール、チオアルキル、チオアルコキシ、チオアリール、ニトロ、ウレイド、シアノ、ハロ、シリル、シリルオキシ、シリルアルキル、シリルチオ、 $=O$ 、 $=S$ 、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 7)

前記ピリダジン化合物が、式 IV :

【化 1 3】



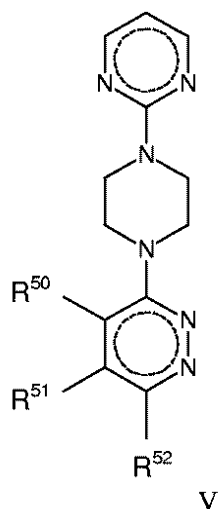
(式中、 R^{70} は、置換もしくは非置換の、水素、ヒドロキシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルキレン、アルケニレン、アルコキシ、アルケニルオキシ、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、シクロアルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アロイル、ヘテロアリール、複素環、アシル、アシルオキシ

、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 R^{7 1} 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 1 4】



(式中、R^{5 0}、R^{5 1}、および R^{5 2} 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 1 0)

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 1 1)

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 ~ 1 0 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 1 2)

障害がてんかんである、項目 1 1 に記載の方法。

(項目 1 3)

対象が小児患者である、項目 1 1 または 1 2 に記載の方法。

(項目 1 4)

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 ~ 1 3 のいずれかに記載の組成物の使用。

(項目 1 5)

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 ~ 1 4 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。