

【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22年12月16日 (2010.12.16)

【公表番号】特表2010-514682(P2010-514682A)

【公表日】平成22年5月6日 (2010.5.6)

【年通号数】公開・登録公報2010-018

【出願番号】特願2009-543160(P2009-543160)

【国際特許分類】

C 0 7 D 281/16 (2006.01)

A 6 1 K 31/554 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 281/16 C S P

A 6 1 K 31/554

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/00 1 0 1

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 43/00 1 2 3

【手続補正書】

【提出日】平成22年10月26日 (2010.10.26)

【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

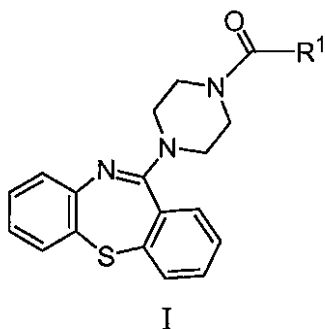
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】



[式中、

R^1 は、H、 C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} ハロアルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、又はヘテロシクロアルキルアルキルであり、ここで C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} ハロアルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルはそれぞれ場合により1、2、3、4、又は5つの R^2 で置換され；

R^2 はそれぞれ独立して、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、CN、 NO_2 、OH、 OR^3 、 SR^a 、 $C(=O)R^b$ 、 $C(=O)NR^cR^d$ 、 $C(=O)OR^a$ 、 $OC(=O)R^b$ 、 $OC(=O)NR^cR^d$ 、 NR^cR^d 、 $NR^cC(=O)R^b$ 、 $NR^cC(=O)OR^a$ 、 $NR^cS(=O)_2R^b$ 、 $S(=O)R^b$ 、 $S(=O)NR^cR^d$ 、 $S(=O)_2R^b$ 、又は $S(=O)_2NR^cR^d$ であり；

R^3 はそれぞれ独立して、 C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} ハロアルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、又はヘテロシクロアルキルアルキルであり、それぞれ場合により1、2、3、4、又は5つの R^4 で置換され；

R^4 はそれぞれ独立して、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、CN、 NO_2 、 $OR^{a'}$ 、 $SR^{a'}$ 、 $C(=O)R^{b'}$ 、 $C(=O)NR^{c'}R^{d'}$ 、 $C(=O)OR^{a'}$ 、 $OC(=O)R^{b'}$ 、 $OC(=O)NR^{c'}R^{d'}$ 、 $NR^{c'}R^{d'}$ 、 $NR^{c'}C(=O)R^{b'}$ 、 $NR^{c'}C(=O)OR^{a'}$ 、 $NR^{c'}S(=O)_2R^{b'}$ 、 $S(=O)R^{b'}$ 、 $S(=O)NR^{c'}R^{d'}$ 、 $S(=O)_2R^{b'}$ 、又は $S(=O)_2NR^{c'}R^{d'}$ であり；

R^a 及び $R^{a'}$ はそれぞれ独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルより選択され、ここで該 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルはそれぞれ場合によりOH、 C_{1-6} アルコキシ、アミノ、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、又はヘテロシクロアルキルで置換され；

R^b 及び $R^{b'}$ はそれぞれ独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルより選択され、ここで該 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキ

ル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルはそれぞれ場合により、OH、 C_{1-6} アルコキシ、アミノ、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、又はヘテロシクロアルキルで置換され；

R^c 及び R^d はそれぞれ独立して、H、 C_{1-10} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルより選択され、ここで該 C_{1-10} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルはそれぞれ場合により、OH、 C_{1-6} アルコキシ、アミノ、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、又はヘテロシクロアルキルで置換され；

又は R^c 及び R^d は、それらが結合しているN原子とともに4員、5員、6員、若しくは7員のヘテロシクロアルキル基を形成し；そして

$R^{c'}$ 及び $R^{d'}$ はそれぞれ独立して、H、 C_{1-10} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルより選択され、ここで該 C_{1-10} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルはそれぞれ場合により、OH、 C_{1-6} アルコキシ、アミノ、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、又はヘテロシクロアルキルで置換され；

又は $R^{c'}$ 及び $R^{d'}$ は、それらが結合しているN原子とともに、4員、5員、6員、若しくは7員のヘテロシクロアルキル基を形成する]

の化合物又はその薬学的に許容しうる塩。

【請求項2】

R^1 が、OH及び C_{1-4} アルコキシより独立して選択される1、2又は3つの置換基で置換される C_{1-6} アルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R^1 がメトキシメチルである、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物及びさらに薬学的に許容しうる担体を含む医薬組成物。

【請求項5】

少なくとも1種の抗うつ薬、非定型抗精神病薬、抗精神病薬、抗不安薬、抗痙攣薬、アルツハイマー病治療薬、パーキンソン病治療薬、片頭痛治療薬、脳卒中治療薬、尿失禁治療薬、神経因性疼痛治療薬、侵害受容性疼痛治療薬、不眠症治療薬、気分安定薬、5-HT_{1B}リガンド、mGluR2アゴニスト、アルファ7ニコチンアゴニスト、ケモカイン受容体CCR1阻害剤、又はデルタオピオイドアゴニストをさらに含む、請求項4に記載の組成物。

【請求項6】

少なくとも1種のベンゾジアゼピン、5-HT_{1A}リガンド、5-HT_{1B}リガンド、5-HT_{1D}リガンド、mGluR2Aアゴニスト、mGluR5アンタゴニスト、抗精神病薬、NK1受容体アンタゴニスト、抗うつ薬、又はセロトニン再取り込み阻害剤をさらに含

む、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 7】

統合失調症及び他の精神病性障害、痴呆及び他の認知障害、不安障害、気分障害、睡眠障害、通常乳児期、小児期、若しくは青年期に最初に診断される障害、又は神経変性障害に関連する少なくとも 1 つの症状又は状態を処置する方法であって、哺乳動物に治療有効量の、請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物又は請求項 4 ～ 6 のいずれか 1 項に記載の組成物を投与することからなる、方法。

【請求項 8】

症状又は状態が、不安、興奮、反抗、パニック、摂食障害、情動の症状、気分の症状、又は陰性若しくは陽性の精神病的症状を含む、請求項 7 に記載の方法。

【請求項 9】

統合失調症及び他の精神病性障害、痴呆及び他の認知障害、不安障害、気分障害、睡眠障害、通常乳児期、小児期、若しくは青年期に最初に診断される障害、又は神経変性障害に関連する少なくとも 1 つの症状又は状態の処置における医薬として使用するための、請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物又は請求項 4 ～ 6 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 10】

統合失調症及び他の精神病性障害、痴呆及び他の認知障害、不安障害、気分障害、睡眠障害、通常乳児期、小児期、若しくは青年期に最初に診断される障害、又は神経変性障害に関連する少なくとも 1 つの症状又は状態の処置のための医薬の製造における、請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。