

【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20年12月25日 (2008.12.25)

【公表番号】特表2008-519818(P2008-519818A)

【公表日】平成20年6月12日 (2008.6.12)

【年通号数】公開・登録公報2008-023

【出願番号】特願2007-540742(P2007-540742)

【国際特許分類】

C 0 7 D	519/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/551	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/22	(2006.01)
A 6 1 P	27/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/04	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	19/10	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	7/06	(2006.01)
A 6 1 P	7/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/06	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	31/14	(2006.01)
A 6 1 P	31/16	(2006.01)
A 6 1 P	31/18	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/04	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D	519/00	3 0 1
C 0 7 D	519/00	C S P
A 6 1 K	31/551	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/24	
A 6 1 P	25/22	
A 6 1 P	27/06	

A 6 1 P 25/04
 A 6 1 P 9/10 1 0 1
 A 6 1 P 19/10
 A 6 1 P 21/00
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 7/06
 A 6 1 P 7/00
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 9/06
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 31/14
 A 6 1 P 31/16
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 9/04
 A 6 1 P 17/02

【手続補正書】

【提出日】平成20年10月31日(2008.10.31)

【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

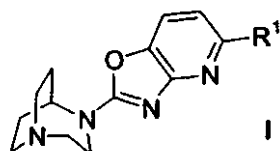
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

【化 1】



の化合物又はそのエナンチオマー、ジアステレオマー若しくは互変異性体、又はその医薬上許容される塩。

式中、

R^1 は、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $(C_1 - C_8)$ アルキル、 $(C_3 - C_8)$ シクロアルキル、3～8員ヘテロシクロアルキル、 $(C_6 - C_{10})$ アリール、5～12員ヘテロアリール、 OR^2 、 $-C(=O)NR^2R^3$ 、 $-NR^2C(=O)R^3$ 、 $-S(=O)_2R^3$ 、 $-S(=O)_2NR^2R^3$ 、及び $-NR^2R^3$ からなる群から選択され、ここで、該アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、 $C_6 - C_{10}$ アリール及びヘテロアリールのそれぞれは、 R^1 がメチル基でないことを条件として場合によりF、Cl、Br、I、ニトロ、シアノ、 CF_3 、 $-NR^4R^5$ 、 $-NR^4C(=O)R^5$ 、 $-NR^4S(=O)_2R^5$ 、 $-OR^5$ 、 $-OC(=O)R^5$ 、 $-C(=O)OR^5$ 、 $-C(=O)R^5$ 、 $-C(=O)NR^4R^5$ 、 $-S(=O)_2NR^4R^5$ から独立して選択される1個又はそれ以上の置換基で置換されており；

R^2 及び R^3 のそれぞれは、H、 $(C_1 - C_8)$ アルキル、 $(C_3 - C_8)$ シクロアルキル、3～

8員ヘテロシクロアルキル、($C_6 - C_{10}$)アリール又は5～12員ヘテロアリールから独立して選択され；ここで、 R^2 及び R^3 のそれぞれは、場合によりF、Cl、Br、I、ニトロ、シアノ、 CF_3 、 $-NR^4R^5$ 、 $-NR^4C(=O)R^5$ 、 $-NR^4S(=O)_2R^5$ 、 $-OR^5$ 、 $-OC(=O)R^5$ 、 $-C(=O)OR^5$ 、 $-C(=O)R^5$ 、 $-C(=O)NR^4R^5$ 、 $-S(=O)_2NR^4R^5$ 及び R^5 から独立して選択される1個又はそれ以上の置換基で置換されており；

又は、 R^2 及び R^3 は、 NR^2R^3 の窒素と一緒にあって、3～8員ヘテロシクロアルキルを形成し；

R^4 及び R^5 のそれぞれは、H、直鎖状若しくは分枝状($C_1 - C_8$)アルキル、($C_3 - C_8$)シクロアルキル、3～8員ヘテロシクロアルキル、($C_6 - C_{10}$)アリール及び(5～12員)ヘテロアリールから独立して選択され；

又は、 R^4 及び R^5 は、 NR^4R^5 の窒素と一緒にあって、3～8員ヘテロシクロアルキルを形成する。

【請求項2】

R^1 が、($C_1 - C_8$)アルキル、($C_3 - C_8$)シクロアルキル、3～8員ヘテロシクロアルキル、($C_6 - C_{10}$)アリール、5～12員ヘテロアリールであり、ここで、該アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールのそれぞれは、場合によりF、Cl、Br、I、ニトロ、CN、 CF_3 、 $-NR^4R^5$ 、 $-OR^5$ 及び R^5 から独立して選択される1個又はそれ以上の置換基で置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R^1 が、($C_1 - C_8$)アルキルであり；ここで、該アルキルは、場合によりF、Cl、Br、I、ニトロ、CN、 CF_3 、 $-NR^4R^5$ 、 $-OR^5$ 及び R^5 からなる群より独立して選択される1個又はそれ以上の置換基で置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

R^1 が、($C_6 - C_{10}$)アリール及び5～12員ヘテロアリールであり；ここで、該アリール及びヘテロアリールのそれぞれは、場合によりF、Cl、Br、I、ニトロ、CN、 CF_3 、 $-NR^4R^5$ 、 $-OR^5$ 及び R^5 からなる群より独立して選択される1個又はそれ以上の置換基で置換される、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

R^1 が、 $-NR^2R^3$ 、 $-O(C_1 - C_6)$ アルキル、及び $-O - (C_6 - C_{10})$ アリールからなる群から選択され、ここで、該アルキル及びアリールのそれぞれは、場合によりF、Cl、Br、I、ニトロ、CN、 CF_3 、 $-NR^4R^5$ 、 $-OR^5$ 及び R^5 からなる群より独立して選択される1個又はそれ以上の置換基で置換される、請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

R^1 が、($C_2 - C_6$)アルキルであり、ここで、該アルキルは、場合によりF、Br、Cl、($C_6 - C_{10}$)アリール及び5～12員ヘテロアリールで置換される、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

R^1 が、($C_6 - C_{10}$)アリールであり、ここで、該アリールは、場合によりF、Cl、Br、 $-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-O(C_1 - C_6)$ アルキルからなる群から独立して選択される1個又は2個の置換基で置換される、請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

下記の化合物：

4-(5-エチル-オキサゾロ[4,5-b]ピリジン-2-イル)-1,4-ジアザ-ビシクロ[3.2.2]ノナン；

4-(5-フェニル-オキサゾロ[4,5-b]ピリジン-2-イル)-1,4-ジアザ-ビシクロ[3.2.2]ノナン；

4-[5-(4-フルオロ-フェニル)-オキサゾロ[4,5-b]ピリジン-2-イル)-1,4-ジアザ-ビシクロ[3.2.2]ノナン；

4 - [5 - (3 - フルオロ - フェニル) - オキサゾロ[4,5 - b]ピリジン - 2 - イル) - 1,4 - ジアザ - ピシクロ[3.2.2]ノナン ;

4 - [5 - (2 - フルオロ - フェニル) - オキサゾロ[4,5 - b]ピリジン - 2 - イル) - 1,4 - ジアザ - ピシクロ[3.2.2]ノナン ;

4 - (5 - フェネチル - オキサゾロ[4,5 - b]ピリジン - 2 - イル) - 1,4 - ジアザ - ピシクロ[3.2.2]ノナン ; 及び

4 - (5 - モルホリン - 4 - イル - オキサゾロ[4,5 - b]ピリジン - 2 - イル) - 1,4 - ジアザ - ピシクロ[3.2.2]ノナン、

からなる群から選択される化合物又はその医薬上許容される塩、水和物若しくは溶媒和物、又はその光学異性体若しくは立体異性体。

【請求項 9】

請求項 1 に記載の化合物又はその医薬上許容される塩、及び医薬上許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 10】

アルツハイマー病の認知及び注意欠陥症状、アルツハイマー病のような疾患に関連する神経変性、初老期認知症（軽度認知障害）、老年認知症、統合失調症若しくは精神病（それに関連する認知欠陥を含む）、注意欠陥障害、注意欠陥多動性障害（ADHD）、気分及び情動障害、筋萎縮性側索硬化症、境界性人格障害、外傷性脳損傷、脳腫瘍に関連する行動及び認知上の問題、エイズ認知症複合症、ダウン症候群に関連する認知症、レヴィー小体に関連する認知症、ハンチントン病、うつ病、全般性不安障害、加齢黄斑変性症、パーキンソン病、遅発性ジスキネジー、ピック病、外傷後ストレス障害、神経性過食症及び神経性食欲不振症を含む食物摂取の調節異常、喫煙中止及び依存薬物中止に関連する禁断症状、トゥーレット症候群、緑内障、緑内障に関連する神経変性、疼痛に関連する症状、疼痛及び炎症、TNF - 関連疾患、関節リウマチ、リウマチ様脊椎炎、筋肉変性、骨粗鬆症、骨関節炎、乾癬、接触皮膚炎、骨吸収疾患、アテローム性動脈硬化症、ページェット病、ブドウ膜炎、通風性関節炎、炎症性腸疾患、成人呼吸窮迫症候群（ARDS）、クローン病、鼻炎、潰瘍性大腸炎、アナフィラキシー、喘息、ライター症候群、移植片の組織拒絶反応、虚血再かん流傷害、発作、多発性硬化症、脳マラリア、敗血症、敗血症性ショック、毒素性ショック症候群、感染による発熱及び筋肉痛、HIV - 1、HIV - 2、及びHIV - 3、サイトメガロウイルス（CMV）、インフルエンザ、アデノウイルス、ヘルペスウイルス（HSV - 1、HSV - 2を含む）、帯状疱疹、癌（多発性骨髄腫、急性及び慢性骨髄性白血病、又は癌関連悪液質）、糖尿病（膵臓ベータ細胞破壊、又はI及びII型糖尿病）、創傷治癒（熱傷、及び手術によるものを一般的に含む傷の治癒）、骨折治癒、虚血性心疾患、耳鳴、又は安定狭心症から選択される障害又は状態を治療するための、上記障害又は状態の治療に有効である量の請求項 1 に記載の化合物又はその医薬上許容される塩、及び医薬上許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 11】

請求項 1 に記載の化合物又はその医薬上許容される塩、及び抗精神病薬又はその医薬上許容される塩を含む医薬組成物。

【請求項 12】

統合失調症の治療に有効である量の請求項 1 に記載の化合物又はその医薬上許容される塩、及び抗精神病薬又はその医薬上許容される塩を含む、統合失調症又は精神病を治療するための医薬。