

【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18年4月6日(2006.4.6)

【公表番号】特表2006-506319(P2006-506319A)

【公表日】平成18年2月23日(2006.2.23)

【年通号数】公開・登録公報2006-008

【出願番号】特願2003-574643(P2003-574643)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/75 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 49/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/08 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 13/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 37/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 51/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 213/75 C S P

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/4725

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 49/00 C

A 6 1 P 1/08

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 13/00

A 6 1 P 15/10

A 6 1 P 25/00 1 0 1

A 6 1 P 25/02

A 6 1 P 25/06
 A 6 1 P 25/14
 A 6 1 P 25/18
 A 6 1 P 25/20
 A 6 1 P 25/22
 A 6 1 P 25/24
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 37/00
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 43/00 1 1 4
 C 0 7 D 401/14
 C 0 7 D 487/04 1 5 0
 A 6 1 K 43/00
 A 6 1 K 49/02 C

【手続補正書】

【提出日】平成18年2月16日(2006.2.16)

【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

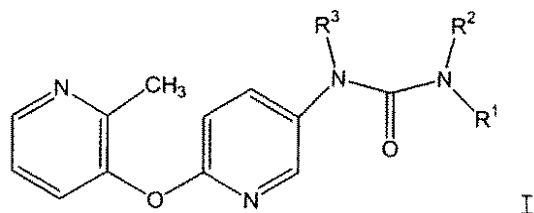
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



〔式中、

R^1 はアリール、置換されたアリール、アリール (C_{1-8} アルキレン)、置換されたアリール (C_{1-8} アルキレン)、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、ヘテロアリール (C_{1-8} アルキレン)、置換されたヘテロアリール (C_{1-8} アルキレン)、複素環、置換された複素環、複素環 (C_{1-8} アルキレン)、または置換された複素環 (C_{1-8} アルキレン) であり、 R^2 および R^3 は、各々、独立して、H、 C_{1-8} アルキル、アリール (C_{1-8} アルキレン) または置換されたアリール (C_{1-8} アルキレン) であり；

あるいは R^1 および R^2 は、それらが結合している窒素と一緒にあって、複素環、置換された複素環、ヘテロアリール、または置換されたヘテロアリールを形成し、および R^3 はH、 C_{1-8} アルキル、アリール (C_{1-8} アルキレン) または置換されたアリール (C_{1-8} アルキレン) であり；

但し、 R^1 および R^2 はそれらが結合している窒素と一緒にあって2,3-ジヒドロインドール-1-イル、または置換された2,3-ジヒドロインドール-1-イルではなく；および

R^1 および R^2 は、それらが結合している窒素と一緒にあって、2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾ[d]アゼピン-1-イル、または置換された2,3,4,5-

テトラヒドロ - 1 H - ベンゾ [d] アゼピン - 1 - イルではない]
の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項 2】

R¹ がアリールまたは置換されたアリールである請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

R¹ がヘテロアリールまたは置換されたヘテロアリールである請求項 1 記載の化合物。

【請求項 4】

R¹ が複素環または置換された複素環である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 5】

R¹ および R² が、それらが結合している窒素と一緒に、複素環、置換された複素環、ヘテロアリール、または置換されたヘテロアリールを形成し、および R³ が H、C₁ - 8 アルキル、アリール (C₁ - 8 アルキレン) または置換されたアリール (C₁ - 8 アルキレン) である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 6】

9 - { [({ 6 - [(2 - メチル - 3 - ピリジニル) オキシ] - 3 - ピリジニル } アミノ) カルボニル] アミノ } - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロアゼピノ [4 , 5 - b] インドール - 3 (2 H) - カルボン酸 tert - ブチル ;

N - (1 , 2 , 3 , 4 , 5 , 6 - ヘキサヒドロアゼピノ [4 , 5 - b] インドール - 9 - イル) - N' - { 6 - [(2 - メチル - 3 - ピリジニル) オキシ] - 3 - ピリジニル } 尿素 ;

6 - メチル - N - { 6 - [(2 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ] ピリジン - 3 - イル } - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロアゼピノ [4 , 5 - b] インドール - 3 (2 H) - カルボキサミド ;

N - { 6 - [(2 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ] ピリジン - 3 - イル } - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 1 (2 H) - カルボキサミド ;

N - { 6 - [(2 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ] ピリジン - 3 - イル } - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 2 (1 H) - カルボキサミド ;

4 - ベンジル - N - { 6 - [(2 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ] ピリジン - 3 - イル } ピペラジン - 1 - カルボキサミド ;

N - { 6 - [(2 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ] ピリジン - 3 - イル } - N' - (2 - フェニルエチル) 尿素 ; および

N - { 6 - [(2 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ] ピリジン - 3 - イル } アゼピン - 1 - カルボキサミドよりなる群から選択される請求項 1 記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項 7】

R² が H である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 8】

R² が C₁ - 8 アルキルである請求項 1 記載の化合物。

【請求項 9】

R² がアリール (C₁ - 8 アルキレン) または置換されたアリール (C₁ - 8 アルキレン) である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 10】

R³ が H である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 11】

R³ が C₁ - 8 アルキルである請求項 1 記載の化合物。

【請求項 12】

R³ がアリール (C₁ - 8 アルキレン) または置換されたアリール (C₁ - 8 アルキレン) である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 13】

請求項 1 ないし 12 いずれか 1 記載の化合物および医薬上許容される賦形剤を含む医薬

組成物。

【請求項 1 4】

哺乳動物において中枢神経系の病気または障害の治療または予防で有用な医薬を調製するための請求項 1 ないし 1 2 いずれか 1 記載の化合物の使用。

【請求項 1 5】

該治療が中枢神経系の病気または障害の治療である請求項 1 4 記載の使用。

【請求項 1 6】

5 - H T 受容体が関係し、5 - H T 機能の変調が望まれる哺乳動物における病気または疾患を治療するのに有用な医薬を調製するための請求項 1 ないし 1 2 いずれか 1 記載の化合物の使用。

【請求項 1 7】

哺乳動物において中枢神経系の病気または障害を治療または予防するのに有用な医薬を調製するための請求項 1 ないし 1 2 いずれか 1 記載の化合物の使用。

【請求項 1 8】

1 以上の放射性同位体を含む請求項 1 ないし 1 2 いずれか 1 記載の化合物である放射性標識化合物。

【請求項 1 9】

1 以上の炭素 - 1 1、フッ素 - 1 8、フッ素 - 1 9、ヨウ素 - 1 2 3 またはヨウ素 - 1 2 5 を含む請求項 1 8 記載の化合物。

【請求項 2 0】

請求項 1 8 または 1 9 記載の放射性標識化合物と組織とを接触させ、次いで、該組織に結合した化合物を検出することを特徴とする 5 - H T 受容体を含む組織をイメージングする方法。

【請求項 2 1】

該イメージングが陽電子射出断層撮影法によって行われる請求項 2 0 記載の方法。

【請求項 2 2】

該イメージングが核磁気共鳴によって行われる請求項 2 0 記載の方法。

【請求項 2 3】

該イメージングが単光子放射型コンピューター断層撮影法によって行われる請求項 2 0 記載の方法。

【請求項 2 4】

治療上有効量の請求項 1 ないし 1 2 いずれか 1 記載の化合物および医薬上許容される賦形剤を含む、哺乳動物における中枢神経系の病気または障害の治療または予防用医薬組成物。

【請求項 2 5】

該治療が中枢神経系の病気または障害の治療である請求項 2 4 記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

治療上有効量の請求項 1 ないし 1 2 いずれか 1 記載の化合物および医薬上許容される賦形剤を含む、5 - H T 受容体が関係し、5 - H T 機能の変調が望まれる哺乳動物における病気または疾患を治療するための医薬組成物。

【請求項 2 7】

治療上有効量の請求項 1 ないし 1 2 いずれか 1 記載の化合物および医薬上許容される賦形剤を含む、哺乳動物において中枢神経系の病気または障害を治療または予防するための医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 1 7

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 1 7】

[式中、

R^1 はアリール、置換されたアリール、アリール (C_{1-8} アルキレン)、置換されたアリール (C_{1-8} アルキレン)、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、ヘテロアリール (C_{1-8} アルキレン)、置換されたヘテロアリール (C_{1-8} アルキレン)、複素環、置換された複素環、複素環 (C_{1-8} アルキレン)、または置換された複素環 (C_{1-8} アルキレン) であり、 R^2 および R^3 は、各々、独立して、H、 C_{1-8} アルキル、アリール (C_{1-8} アルキレン) または置換されたアリール (C_{1-8} アルキレン) であり；

あるいは R^1 および R^2 は、それらが結合している窒素と一緒にあって、複素環、置換された複素環、ヘテロアリール、または置換されたヘテロアリールを形成し、および R^3 は H、 C_{1-8} アルキル、アリール (C_{1-8} アルキレン) または置換されたアリール (C_{1-8} アルキレン) であり；

但し、 R^1 および R^2 はそれらが結合している窒素と一緒にあって 2, 3 - ジヒドロインドール - 1 - イル、または置換された 2, 3 - ジヒドロインドール - 1 - イルではなく；および

R^1 および R^2 は、それらが結合している窒素と一緒にあって、2, 3, 4, 5 - テトラヒドロ - 1 H - ベンゾ [d] アゼピン - 1 - イル、または置換された 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロ - 1 H - ベンゾ [d] アゼピン - 1 - イルではない]

の [6 - (2 - メチル - ピリジン - 3 - イルオキシ) ピリジン - 3 - イル] 尿素を提供する。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0032

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0032】

R^1 に対する具体的な値はアリールまたは置換されたアリールである。

R^1 に対する具体的な値はヘテロアリールまたは置換されたヘテロアリールである。

R^1 に対する具体的な値は複素環または置換された複素環である。

それらが結合している窒素と一緒にあって複素環、置換された複素環、ヘテロアリール、または置換されたヘテロアリールを形成する R^1 および R に対する具体的な値は H、 C_{1-8} アルキル、アリール (C_{1-8} アルキレン) または置換されたアリール (C_{1-8} アルキレン) である。

それらが結合している窒素と一緒になる R^1 および R^2 に対する具体的な値は 1, 2, 3, 4, 5, 6 - ヘキサヒドロアゼピノ [4, 5 - b] インドール - 9 - イルである。

R^2 に対する具体的な値は C_{1-8} アルキルである。

R^2 に対する具体的な値はアリール (C_{1-8} アルキレン) または置換されたアリール (C_{1-8} アルキレン) である。

R^2 に対するより具体的な値は H である。

R^1 、 R^2 およびそれらが結合している窒素に対する具体的な値は複素環である。

R^3 に対する具体的な値は C_{1-8} アルキルである。

R^3 に対する具体的な値はアリール (C_{1-8} アルキレン) または置換されたアリール (C_{1-8} アルキレン) である。

R^3 に対するより具体的な値は H である。