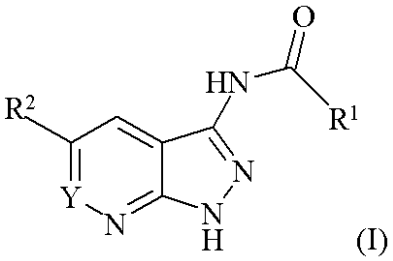
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成20年11月13日(2008.11.13)

【公表番号】特表2004-509891(P2004-509891A)
【公表日】平成16年4月2日(2004.4.2)
【年通号数】公開・登録公報2004-013
【出願番号】特願2002-529104(P2002-529104)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 471/04 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/437 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/5025 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 7/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/12 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 15/08 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/14 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 21/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/16 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/24 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/28 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 31/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 31/18 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 487/04 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 471/04 １０６Ｃ
Ａ６１Ｋ 31/437
Ａ６１Ｋ 31/5025
Ａ６１Ｐ 3/04
Ａ６１Ｐ 3/10
Ａ６１Ｐ 7/00
Ａ６１Ｐ 9/10
Ａ６１Ｐ 9/10 １０１
Ａ６１Ｐ 9/12
Ａ６１Ｐ 15/08
Ａ６１Ｐ 17/14
Ａ６１Ｐ 21/04
Ａ６１Ｐ 25/16
Ａ６１Ｐ 25/24
Ａ６１Ｐ 25/28
Ａ６１Ｐ 31/04
Ａ６１Ｐ 31/18
Ａ６１Ｐ 35/00
Ａ６１Ｐ 37/00
Ａ６１Ｐ 43/00 １１１

Ｃ０７Ｄ 487/04　１４１

【手続補正書】
【提出日】平成20年9月18日(2008.9.18)
【手続補正１】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】特許請求の範囲
【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】



(I)

［式中、
ＹはＣＨまたはＮであり；
Ｒ[1]はトリフルオロメチル、２，２，２－トリフルオロエチル、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｎ－ブチル、２－ブチル、ｎ－ペンチル、３－ペンチル、ｎ－ヘキシル、メトキシメチル、２－カルボキシエチル、ｎ－プロペニル、イソ－ブテニル、スチリル、フェニル、２－フリル、２－チエニル、ベンジル、フェニルエチル、３－（Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノ）プロピル、ピリジン－４－イル、３－（ピペリジン－１－イル）プロピル、３－（４－エチルピペラジン－１－イル）プロピル、３－（モルホリン－１－イル）プロピル、１，３－ベンゾジオキソラン－５－イル、Ｎ－メチルピペリジン－４－イル、イソ－プロピル、ピリジン－３－イルメチル、α，α－ジメチルベンジル、３－（メソ－３，５－ジメチルモルホリン－４－イル）プロピル、４－（１－ピリジニウム）ブチル臭化水素酸塩、２－（３－ピリジニル）エチル、ｔｅｒｔ－ブチル、フェノキシメチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、４－ジメチルアミノベンジル、４－（ジメチルアミノメチル）ベンジル、メトキシエトキシメチル、２，２，２－トリフルオロエトキシメチル、３－ジメチルアミノフェノキシメチル、（１－メチルピペリジン－４－イル）メチル、（１－エチルピペリジン－４－イル）メチル、（１－フェニルピペリジン－４－イル）メチル、（１－ベンジルピペリジン－４－イル）メチル、（１－（４－フルオロベンジル）ピペリジン－４－イル）メチル、（１－（フェノキシエチル）ピペリジン－４－イル）メチル、４－フルオロフェネチル、（６－メチルピリジン－３－イル）エチル、メトキシエチル、３－（Ｎ，Ｎ－ジエチルアミノ）プロピル、Ｎ－メトキシエチル（Ｎ－メチル）アミノプロピル、ジ－（Ｎ－メトキシエチル）アミノプロピル、３－（１，１－ジオキソ－１－チオモルホリン－４－イル）プロピル、３－（ピロリジン－１－イル）プロピル、３－（４－ベンジルピペラジン－１－イル）プロピル、３－（４－（４－クロロフェノキシ）ピペリジン－１－イル）プロピル、３－（４－メタンスルホニルピペラジン－１－イル）プロピル、４－（Ｎ，Ｎ－ジエチルアミノ）ブチル、４－（ピペリジン－１－イル）ブチル、ピペリジン－４－イル、１－エチルピペリジン－４－イル、１－ベンジルピペリジン－４－イル、１－（４－クロロベンジル）ピペリジン－４－イル、１－（４－フルオロベンジル）ピペリジン－４－イル、１－（メトキシエチル）ピペリジン－４－イル、１－（フェノキシエチル）ピペリジン－４－イル、１－（４－クロロフェノキシエチル）ピペリジン－４－イル、１－フェニルピペリジン－４－イル、１－ベン

ジルピロリジン－３－イル、トランス－フェネテニル、トランス－４－フルオロフェネテニル、４－フルオロフェニル、４－ジメチルアミノフェニル、２，４，６－トリメチルフェニル、４－（ジエチルアミノメチル）フェニル、４－（ピペリジン－１－イルメチル）フェニル、４－（ピロリジン－１－イルメチル）フェニル、４－（チオモルホリン－４－イルメチル）フェニル、２，３－ジヒドロベンゾフラン－５－イル、３－（４－（２－フェニルエチル）ピペラジン－１－イル）プロピル、３－（４－シクロヘキシルメチルピペラジン－１－イル）プロピル、３－（４－シクロペンチルピペラジン－１－イル）プロピル、３－（４－イソ－プロピルピペラジン－１－イル）プロピル、３－（４－フェニルピペラジン－１－イル）プロピル、４－（４－エチルピペラジン－１－イル）ブチル、３－（ピペリジン－１－イルメチル）フェニル、４－（ジエチルアミノメチル）フェニル、４－（４－エチルピペラジン－１－イルメチル）フェニル、ベンゾチエン－２－イル、４－メトキシベンジルまたはベンジルオキシメチルであり；

R^2はフェニル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル、２－チエニル、２－ベンジルオキシフェニル、２－クロロフェニル、２－フルオロフェニル、２－メチルフェニル、２－メトキシピリド－３－イル、２－メトキシフェニル、３，４－メチレンジオキシフェニル、３，５－ジクロロフェニル、３－アセトアミドフェニル、３－トリフルオロメチルフェニル、３－クロロフェニル、３－フルオロフェニル、フラン－３－イル、３－メトキシフェニル、３－ニトロフェニル、３－チエニル、４－トリフルオロメチルフェニル、４－クロロフェニル、４－フルオロフェニル、４－メトキシフェニル、４－メチルフェニル、４－トリフルオロメトキシフェニル、インドール－５－イル、４－メトキシピリジン－３－イル、２－クロロ－３－フルオロフェニル、２，３－ジフルオロフェニル、２，３，６－トリフルオロフェニル、３－メチルフェニル、ピリジン－２－イル、キノリン－３－イル、２－ホルミルフェニル、３－ホルミルフェニル、３－メトキシカルボニルフェニル、３－カルボキシフェニル、３－シアノフェニル、２－［（モルホリン－４－イル）メチル］フェニル、３－［（モルホリン－４－イル）メチル］フェニル、４－［（モルホリン－４－イル）メチル］フェニル、２－［２－（モルホリン－４－イル）エチル］フェニル、３－［２－（モルホリン－４－イル）エチル］フェニル、４－［２－（モルホリン－４－イル）エチル］フェニル、３－ヒドロキシフェニル、４－ヒドロキシフェニル、３－メトキシフェニル、２－（ジメチルアミノエトキシ）フェニル、３－（ジメチルアミノエトキシ）フェニル、４－（ジメチルアミノエトキシ）フェニル、２－（３－ジメチルアミノプロポキシ）フェニル、３－（３－ジメチルアミノプロポキシ）フェニル、４－（３－ジメチルアミノプロポキシ）フェニル、２－［（モルホリン－４－イル）エトキシ］フェニル、３－［（モルホリン－４－イル）エトキシ］フェニル、４－［（モルホリン－４－イル）エトキシ］フェニル、２－［３－（モルホリン－４－イル）プロポキシ］フェニル、３－［３－（モルホリン－４－イル）プロポキシ］フェニル、４－［３－（モルホリン－４－イル）プロポキシ］フェニル、１，３－ベンゾジオキソラン－５－イル、２，５－ジフルオロフェニル、２，６－ジフルオロフェニル、３，４－ジフルオロフェニル、３，５－ジフルオロフェニル、２－フルオロ－４－クロロフェニル、３－フルオロ－４－クロロフェニル、２－クロロ－４－フルオロフェニル、３－クロロ－４－フルオロフェニル、２，５－ジクロロフェニル、２，４－ジクロロフェニル．、２，６－ジクロロフェニル、２，３，５－トリフルオロフェニル、２，３，４－トリフルオロフェニル、２，４，６－トリフルオロフェニル、２，４，５－トリフルオロフェニル、３，４，５－トリフルオロフェニル、３－ジメチルアミノフェニル、２－クロロピリジン－３－イル、６－クロロピリジン－３－イル、２－クロロ－５－メチルピリジン－３－イル、２－クロロ－４，５－ジメチルピリジン－３－イル、２，５－ジメチルピリジン－３－イル、２－（ｔ－ブトキシカルボニルアミノ）ピリジン－３－イル、２－（シアノメチル）ピリジン－３－イル、６－アミノピリジン－３－イル、６－（ピロール－１－イル）ピリジン－３－イル、６－ウレイドピリジン－３－イル、５－フェニルピリジン－３－イル、２－アミノ－５－メチルピリジン－３－イル、２－メチル－６－アミノピリジン－３－イル、５－メチル－６－アミノピリジン－３－イル、５－メチル－６－（３－ヒドロキシプロピルアミノ）ピリジ

ン－３－イル、５－メチル－６－［３－（ホルミルアミノ）プロピルアミノ］ピリジン－３－イル、５－（ピペリジン－１－イル）ピリジン－３－イル、５－アミノカルボニルピリジン－３－イル、５－（メトキシカルボニルメチルカルボニル）ピリジン－３－イル、５－エトキシカルボニルピリジン－３－イル、５－メトキシピリジン－３－イル、４－メチルピリジン－３－イル、ピリミジン－５－イル、ピリミジン－２－イル、ピラジン－２－イル、ナフタレン－１－イル、フラン－２－イル、ビフェニル－４－イル、またはベンゾ［ｂ］チオフェン－３－イルである］
で示される化合物またはその誘導体。
【請求項２】
ＹがＣＨであり；
R^1がシクロプロピル、シクロペンチル、シクロブチル、シクロヘキシル、ピリジン－３－イルメチル、３－ペンチル、α，α－ジメチルベンジル、２－ブチル、３－（メソ－３，５－ジメチルモルホリン－４－イル）プロピル、４－（Ｎ，Ｎ－ジエチルアミノ）ブチル、４－（１－ピリジニウム）ブチル臭化水素酸塩、トランス－フェニルエテニル、４－ジメチルアミノフェニル、１，３－ベンゾジオキソラン－５－イル、２，４，６－トリメチルフェニル、２－チエニル、トリフルオロメチル、２，２，２－トリフルオロエチル、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｎ－ブチル、ｎ－ペンチル、ｎ－ヘキシル、メトキシメチル、２－カルボキシエチル、ｎ－プロペニル、イソ－ブテニル、スチリル、フェニル、２－フリル、ベンジル、フェニルエチル、３－（Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノ）プロピル、ピリジン－４－イル、３－（ピペリジン－１－イル）プロピル、３－（４－エチルピペラジン－１－イル）プロピル、３－（モルホリン－１－イル）プロピル、Ｎ－メチルピペリジン－４－イル、イソ－プロピル、２－（３－ピリジニル）エチル、ｔｅｒｔ－ブチルまたはフェノキシメチルであり；および
R^2がフェニル、ピリジン－３－イル、２－チエニル、２－ベンジルオキシフェニル、２－クロロフェニル、２－フルオロフェニル、２－メチルフェニル、２－メトキシピリド－３－イル、２－メトキシフェニル、３，４－メチレンジオキシフェニル、３，５－ジクロロフェニル、３－アセトアミドフェニル、３－トリフルオロメチルフェニル、３－クロロフェニル、３－フルオロフェニル、フラン－３－イル、３－メトキシフェニル、３－ニトロフェニル、３－チエニル、４－トリフルオロメチルフェニル、４－クロロフェニル、４－フルオロフェニル、４－メトキシフェニル、４－メチルフェニル、４－トリフルオロメトキシフェニル、インドール－５－イル４－メトキシピリジン－３－イル、２－ホルミルフェニル、３－ホルミルフェニル、３－メトキシカルボニルフェニル、３－カルボキシフェニル、３－シアノフェニル、２－［（モルホリン－４－イル）メチル］フェニル、３－［（モルホリン－４－イル）メチル］フェニル、４－［（モルホリン－４－イル）メチル］フェニル、２－［２－（モルホリン－４－イル）エチル］フェニル、３－［２－（モルホリン－４－イル）エチル］フェニル、４－［２－（モルホリン－４－イル）エチル］フェニル、３－ヒドロキシフェニル、４－ヒドロキシフェニル、３－メトキシフェニル、２－（ジメチルアミノエトキシ）フェニル、３－（ジメチルアミノエトキシ）フェニル、４－（ジメチルアミノエトキシ）フェニル、２－（３－ジメチルアミノプロポキシ）フェニル、３－（３－ジメチルアミノプロポキシ）フェニル、４－（３－ジメチルアミノプロポキシ）フェニル、２－［（モルホリン－４－イル）エトキシ］フェニル、３－［（モルホリン－４－イル）エトキシ］フェニル、４－［（モルホリン－４－イル）エトキシ］フェニル、２－［３－（モルホリン－４－イル）プロポキシ］フェニル、３－［３－（モルホリン－４－イル）プロポキシ］フェニル、４－［３－（モルホリン－４－イル）プロポキシ］フェニル、１，３－ベンゾジオキソラン－５－イル、２，３－ジフルオロフェニル、２，５－ジフルオロフェニル、２，６－ジフルオロフェニル、３，４－ジフルオロフェニル、３，５－ジフルオロフェニル、２－フルオロ－４－クロロフェニル、３－フルオロ－４－クロロフェニル、２－クロロ－４－フルオロフェニル、３－クロロ－４－フルオロフェニル、２，５－ジクロロフェニル、２，４－ジクロロフェニル、２，６－ジクロロフェニル、２，３，６－トリフルオロフェニル、２，３，５－トリフルオロフェニル、２，

３，４－トリフルオロフェニル、２，４，６－トリフルオロフェニル、２，４，５－トリフルオロフェニル、３，４，５－トリフルオロフェニル、３－ジメチルアミノフェニル、ピリジン－２－イル、ピリジン－４－イル、２－クロロピリジン－３－イル、６－クロロピリジン－３－イル、２－クロロ－５－メチルピリジン－３－イル、２－クロロ－４，５－ジメチルピリジン－３－イル、２，５－ジメチルピリジン－３－イル、２－（ｔ－ブトキシカルボニルアミノ）ピリジン－３－イル、２－（シアノメチル）ピリジン－３－イル、６－アミノピリジン－３－イル、６－（ピロール－１－イル）ピリジン－３－イル、６－ウレイドピリジン－３－イル、５－フェニルピリジン－３－イル、２－アミノ－５－メチルピリジン－３－イル、２－メチル－６－アミノピリジン－３－イル、５－メチル－６－アミノピリジン－３－イル、５－メチル－６－（３－ヒドロキシプロピルアミノ）ピリジン－３－イル、５－メチル－６－［３－（ホルミルアミノ）プロピルアミノ］ピリジン－３－イル、５－（ピペリジン－１－イル）ピリジン－３－イル、５－アミノカルボニルピリジン－３－イル、５－（メトキシカルボニルメチルカルボニル）ピリジン－３－イル、５－エトキシカルボニルピリジン－３－イル、５－メトキシピリジン－３－イル、４－メチルピリジン－３－イル、キノリン－３－イル、ピリミジン－５－イル、ピリミジン－２－イル、ピラジン－２－イル、ナフタレン－１－イル、フラン－２－イル、ビフェニル－４－イル、ベンゾ［ｂ］チオフェン－３－イルである、
ところの請求項１記載の式（Ｉ）の化合物。

【請求項３】

ＹがＮであり；

R^1がメチル、ｎ－プロピル、イソ－プロピル、シクロプロピル、シクロペンチル、ベンジル、３－（Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノ）プロピル、３－（モルホリン－４－イル）プロピル、４－ジメチルアミノベンジル、４－（ジメチルアミノメチル）ベンジル、メトキシメチル、メトキシエトキシメチル、２，２，２－トリフルオロエトキシメチル、フェノキシメチル、３－ジメチルアミノフェノキシメチル、（１－メチルピペリジン－４－イル）メチル、（１－エチルピペリジン－４－イル）メチル、（１－フェニルピペリジン－４－イル）メチル、（１－ベンジルピペリジン－４－イル）メチル、（１－（４－フルオロベンジル）ピペリジン－４－イル）メチル、（１－（フェノキシエチル）ピペリジン－４－イル）メチル、フェネチル、４－フルオロフェネチル、（６－メチルピリジン－３－イル）エチル、メトキシエチル、３－（Ｎ，Ｎ－ジエチルアミノ）プロピル、Ｎ－メトキシエチル（Ｎ－メチル）アミノプロピル、ジ－（Ｎ－メトキシエチル）アミノプロピル、３－（１，１－ジオキソ－１－チオモルホリン－４－イル）プロピル、３－（ピペリジン－１－イル）プロピル、３－（ピロリジン－１－イル）プロピル、３－（４－エチルピペラジン－１－イル）プロピル、３－（４－ベンジルピペラジン－１－イル）プロピル、３－（４－（４－クロロフェノキシ）ピペリジン－１－イル）プロピル、３－（４－メタンスルホニルピペラジン－１－イル）プロピル、４－（Ｎ，Ｎ－ジエチルアミノ）ブチル、４－（ピペリジン－１－イル）ブチル、ピペリジン－４－イル、１－メチルピペリジン－４－イル、１－エチルピペリジン－４－イル、１－ベンジルピペリジン－４－イル、１－（４－クロロベンジル）ピペリジン－４－イル、１－（４－フルオロベンジル）ピペリジン－４－イル、１－（メトキシエチル）ピペリジン－４－イル、１－（フェノキシエチル）ピペリジン－４－イル、１－（４－クロロフェノキシエチル）ピペリジン－４－イル、１－フェニルピペリジン－４－イル、１－ベンジルピロリジン－３－イル、トランス－フェネテニル、トランス－４－フルオロフェネテニル、フェニル、４－フルオロフェニル、４－ジメチルアミノフェニル、２，４，６－トリメチルフェニル、４－（ジエチルアミノメチル）フェニル、４－（ピペリジン－１－イルメチル）フェニル、４－（ピロリジン－１－イルメチル）フェニル、４－（チオモルホリン－４－イルメチル）フェニル、２，３－ジヒドロベンゾフラン－５－イル、３－（４－（２－フェニルエチル）ピペラジン－１－イル）プロピル、３－（４－シクロヘキシルメチルピペラジン－１－イル）プロピル、３－（４－シクロペンチルピペラジン－１－イル）プロピル、３－（４－イソ－プロピルピペラジン－１－イル）プロピル、３－（４－フェニルピペラジン－１－イル）プロピル、４

－（４－エチルピペラジン－１－イル）ブチル、３－（ピペリジン－１－イルメチル）フェニル、４－（ジエチルアミノメチル）フェニル、４－（４－エチルピペラジン－１－イルメチル）フェニル、ベンゾチエン－２－イル、４－メトキシベンジルまたはベンジルオキシメチル；および

R^2がフェニル、２－クロロフェニル、２－クロロ－３－フルオロフェニル、２，３－ジフルオロフェニル、２，３，６－トリフルオロフェニル、３－メチルフェニル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イルまたはキノリン－３－イルである、

ところの請求項１記載の式（Ｉ）の化合物。

【請求項４】

請求項１ないし３のいずれか１項に記載の化合物またはその医薬上許容される誘導体、および医薬上許容される担体を含む、医薬組成物。

【請求項５】

療法にて用いるための請求項１ないし３のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項６】

ＧＳＫ－３の阻害の必要性と関連する症状の治療薬を製造するための請求項１ないし３のいずれか１項に記載の化合物の使用。