

【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25年2月21日(2013.2.21)

【公表番号】特表2012-515152(P2012-515152A)

【公表日】平成24年7月5日(2012.7.5)

【年通号数】公開・登録公報2012-026

【出願番号】特願2011-544892(P2011-544892)

【国際特許分類】

C 0 7 D 513/04	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/24	(2006.01)
A 6 1 P 25/22	(2006.01)
A 6 1 P 25/18	(2006.01)
A 6 1 P 25/02	(2006.01)
A 6 1 P 25/16	(2006.01)
A 6 1 P 25/28	(2006.01)
A 6 1 P 25/14	(2006.01)
A 6 1 P 25/08	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 35/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/04	(2006.01)
A 6 1 P 3/00	(2006.01)
A 6 1 P 3/10	(2006.01)
A 6 1 P 27/02	(2006.01)
A 6 1 P 1/14	(2006.01)
A 6 1 P 1/04	(2006.01)
A 6 1 P 1/00	(2006.01)
A 6 1 K 45/00	(2006.01)
A 6 1 K 31/198	(2006.01)
A 6 1 K 31/277	(2006.01)
A 6 1 K 49/00	(2006.01)
A 6 1 K 31/4439	(2006.01)
A 6 1 K 31/506	(2006.01)
A 6 1 K 31/429	(2006.01)
A 6 1 K 31/497	(2006.01)
A 2 3 L 1/226	(2006.01)
A 6 1 P 25/30	(2006.01)
A 6 1 P 25/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/06	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 513/04	3 2 5
C 0 7 D 513/04	C S P
A 6 1 P 43/00	1 1 1
A 6 1 P 25/24	
A 6 1 P 25/22	
A 6 1 P 25/18	
A 6 1 P 25/02	1 0 1
A 6 1 P 25/16	
A 6 1 P 25/28	

A 6 1 P 25/14
 A 6 1 P 43/00 1 2 1
 A 6 1 P 25/08
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 25/04
 A 6 1 P 3/00
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 1/14
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 1/00
 A 6 1 K 45/00
 A 6 1 K 31/198
 A 6 1 K 31/277
 A 6 1 K 49/00 A
 A 6 1 K 31/4439
 A 6 1 K 31/506
 A 6 1 K 31/429
 A 6 1 K 31/497
 A 2 3 L 1/226 H
 A 6 1 P 25/30
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 25/06

【手続補正書】

【提出日】平成25年1月4日(2013.1.4)

【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

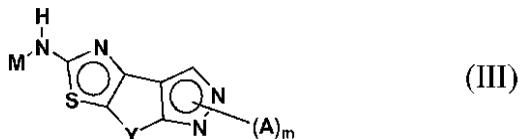
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I I I) :

【化1】



(式中、

Mは、アリール、ヘテロアリール、ヘテロサイクル及びシクロアルキルの群から選択される、置換されてもよい3~10員の環から選択され、

\underline{Y} は、-CR⁴R⁵-CR⁶R⁷-、-CR⁴R⁵-CR⁶R⁷-CR⁸R⁹-、-C=O-CR⁴R⁵-CR⁶R⁷-、-O-CR⁴R⁵-、-O-CR⁴R⁵-CR⁶R⁷-、-NR⁴-CR⁵R⁶-、-NR⁴-CR⁵R⁶-CR⁷R⁸-、-S-CR⁴R⁵-、-S-CR⁴R⁵-CR⁶R⁷-、-SO₂-CR⁴R⁵-、-SO₂-CR⁴R⁵-CR⁶R⁷-及び-SO₂-CR⁴R⁵-CR⁶R⁷-の群から

選択され、

mは、1～2の範囲の整数であり、

(A)_m基は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、-CN、-OH、-CF₃、-SH、-NH₂及び-(C₁～C₆)アルキル、-(C₁～C₆)ハロアルキル、-(C₂～C₆)アルキニル、-(C₂～C₆)アルケニル、-(C₃～C₇)シクロアルキル、-(C₃～C₈)シクロアルケニル、-(C₁～C₆)シアノアルキル、-(C₁～C₆)アルキレン-ヘテロアリール、-(C₁～C₆)アルキレン-アリール、アリール、ヘテロアリール、ヘテロサイクル、-(C₀～C₆)アルキル-OR¹⁰、-O-(C₂～C₆)アルキレン-OR¹⁰、-(C₃～C₇)シクロアルキル-OR¹⁰、-NR¹⁰(C₂～C₆)アルキレン-OR¹¹、-(C₃～C₇)シクロアルキル-(C₁～C₆)アルキル、-O-(C₃～C₇)シクロアルキル-(C₁～C₆)アルキル、-NR¹⁰-(C₃～C₇)シクロアルキル-(C₁～C₆)アルキル、-(C₁～C₆)ハロアルキル-OR¹⁰、-(C₁～C₆)ハロアルキル-NR¹⁰R¹¹、-(C₃～C₆)アルキニル-OR¹⁰、-(C₃～C₆)アルケニル-OR¹⁰、-(C₃～C₆)アルケニル-NR¹⁰R¹¹、-(C₀～C₆)アルキル-S-R¹⁰、-O-(C₂～C₆)アルキレン-S-R¹¹、-(C₀～C₆)アルキル-S(=O)-R¹⁰、-O-(C₁～C₆)アルキレン-S(=O)-R¹¹、-(C₀～C₆)アルキル-S(=O)₂-R¹⁰、-O-(C₁～C₆)アルキレン-S(=O)₂-R¹¹、-(C₀～C₆)アルキル-NR¹⁰R¹¹、-O-(C₂～C₆)アルキレン-NR¹⁰R¹¹、-NR¹⁰-(C₂～C₆)アルキレン-NR¹¹R¹²、-(C₀～C₆)アルキル-S(=O)₂NR¹⁰R¹¹、-O-(C₁～C₆)アルキレン-S(=O)₂NR¹¹R¹²、-NR¹⁰-(C₁～C₆)アルキレン-S(=O)₂NR¹¹R¹²、-(C₀～C₆)アルキル-NR¹⁰-S(=O)₂R¹¹、-O-(C₂～C₆)アルキレン-NR¹⁰-S(=O)₂R¹¹、-NR¹⁰-(C₂～C₆)アルキレン-NR¹¹-S(=O)₂R¹²、-(C₀～C₆)アルキル-S(=O)₂R¹²、-O-(C₁～C₆)アルキレン-C(=O)-NR¹⁰R¹¹、-O-(C₁～C₆)アルキレン-C(=O)-NR¹¹R¹²、-(C₀～C₆)アルキル-NR¹⁰C(=O)-R¹¹、-NR¹⁰-(C₂～C₆)アルキレン-NR¹¹C(=O)-R¹²、-(C₀～C₆)アルキル-O-C(=O)-R¹⁰、-O-(C₂～C₆)アルキレン-O-C(=O)-R¹¹、-(C₀～C₆)アルキル-NR¹⁰-C(=O)-OR¹⁰、-O-(C₁～C₆)アルキレン-C(=O)-OR¹¹、-NR¹⁰-(C₁～C₆)アルキレン-C(=O)-OR¹¹、-(C₀～C₆)アルキル-NR¹⁰-C(=O)-NR¹⁰-C(=NR¹¹)-NR¹²R¹³、-(C₀～C₆)アルキレン-NR¹⁰-C(=O)-NR¹¹R¹²、-O-(C₂～C₆)アルキレン-NR¹⁰-C(=O)-NR¹¹R¹²、-NR¹⁰-(C₂～C₆)アルキレン-NR¹¹-C(=O)-NR¹²R¹³及び-(C₀～C₆)アルキル-NR¹⁰-C(=S)-NR¹¹R¹²の群から選択される置換されてもよい基、の群から選択され、

R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²及びR¹³は、それぞれ独立して、水素又は-(C₁～C₆)ハロアルキル、-(C₁～C₆)アルキル、-(C₁～C₆)シアノアルキル、-(C₃～C₇)シクロアルキル、-(C₄～C₁₀)アルキレン-シクロアルキル、ヘテロアリール、-(C₁～C₆)アルキレン-ヘテロアリール、アリール、ヘテロサイクル及び-(C₁～C₆)アルキレン-アリールの群から選択される置換されてもよい基、の群から選択される)

を有する化合物。

【請求項 2】

請求項1に記載の化合物であって、

Mが、アリール、ヘテロアリール及びシクロアルキルの群から選択される置換されてもよい3～10員の環から選択され、

Yが、-CR⁴R⁵-CR⁶R⁷-及び-CR⁴R⁵-CR⁶R⁷-CR⁸R⁹-の群から選択され、

mが1であり、

(A)_m基が、それぞれ独立して、水素、並びに-(C₁～C₆)アルキル及び-(C₀～C₆)アルキル-C(=O)-R¹⁰の群から選択される置換されてもよい基の群から選択され、

R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹及びR¹⁰が、それぞれ独立して、水素又は-(C₁～C₆)ハロアルキル、-(C₁～C₆)アルキル、-(C₁～C₆)シアノアルキル、-(C₃～C₇)シクロアルキル、-(C₄～C₁₀)アルキレン-シクロアルキル、ヘテロアリール、-(C₁～C₆)アルキレン-ヘテロアリール、アリール、ヘテロサイクル及び-(C₁～C₆)アルキレン-アリールの群から選択される置換されてもよい基の群から選択される、

化合物。

【請求項 3】

請求項1又は2に記載の化合物であって、

光学異性体として存在することができ、ラセミ混合物であるか、又は個々の光学異性体の1つ若しくは両方のいずれかである、

化合物。

【請求項 4】

請求項1から3のいずれかに記載の化合物であって、

N-(ピリジン-2-イル)-5,6-ジヒドロ-4H-チアゾロ[4,5-e]インダゾール-2-アミン

2-メチル-1-(2-(ピリジン-2-イルアミノ)-4H-チアゾロ[4,5-e]インダゾール-6(5H)-イル)プロパン-1-オン

N-(6-メチルピリジン-2-イル)-5,6-ジヒドロ-4H-チアゾロ[4,5-e]インダゾール-2-アミン

N-(6-クロロピリジン-2-イル)-5,6-ジヒドロ-4H-チアゾロ[4,5-e]インダゾール-2-アミン

N-(2,5-ジフルオロフェニル)-5,6-ジヒドロ-4H-チアゾロ[4,5-e]インダゾール-2-アミン

N-(6-フルオロピリジン-2-イル)-5,6-ジヒドロ-4H-チアゾロ[4,5-e]インダゾール-2-アミン

4-メチル-N-(ピリジン-2-イル)-5,6-ジヒドロ-4H-チアゾロ[4,5-e]インダゾール-2-アミン

ピリジン-2-イル-(4,5,6,7-テトラヒドロ-3-チア-1,7,8-トリアザ-シクロペンタ[e]アズレン-2-イル)-アミン

4-エチル-N-(ピリジン-2-イル)-5,6-ジヒドロ-4H-チアゾロ[4,5-e]インダゾール-2-アミン

N-(3-フルオロピリジン-2-イル)-5,6-ジヒドロ-4H-チアゾロ[4,5-e]インダゾール-2-アミン

(6-メチル-ピリジン-2-イル)-(4,5,6,7-テトラヒドロ-3-チア-1,7,8-トリアザ-シクロペンタ[e]アズレン-2-イル)-アミン

(5-フルオロ-ピリジン-2-イル)-(4,5,6,7-テトラヒドロ-3-チア-1,7,8-トリアザ-シクロペンタ[e]アズレン-2-イル)-アミン

(3-フルオロ-ピリジン-2-イル)-(4,5,6,7-テトラヒドロ-3-チア-

- 1 , 7 , 8 - トリアザ - シクロペンタ [e] アズレン - 2 - イル) - アミン
 (6 - メトキシ - ピリジン - 2 - イル) - (4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 3 - チア
 - 1 , 7 , 8 - トリアザ - シクロペンタ [e] アズレン - 2 - イル) - アミン
 N - (5 - フルオロピリジン - 2 - イル) - 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - チアゾロ [4 ,
 5 - e] インダゾール - 2 - アミン
 (6 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - (4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 3 - チア -
 1 , 7 , 8 - トリアザ - シクロペンタ [e] アズレン - 2 - イル) - アミン
 N - (ピラジン - 2 - イル) - 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - チアゾロ [4 , 5 - e] イン
 ダゾール - 2 - アミン
 N - シクロペンチル - 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - チアゾロ [4 , 5 - e] インダゾール
 - 2 - アミン
 8 - メチル - N - (ピリジン - 2 - イル) - 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - チアゾロ [4 ,
 5 - e] インダゾール - 2 - アミン
 N - シクロブチル - 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - チアゾロ [4 , 5 - e] インダゾール -
 2 - アミン
 (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - (4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 3 - チア
 - 1 , 7 , 8 - トリアザ - シクロペンタ [e] アズレン - 2 - イル) - アミン
 シクロプロピル - (4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 3 - チア - 1 , 7 , 8 - トリアザ
 - シクロペンタ [e] アズレン - 2 - イル) - アミン
 シクロブチル - (4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 3 - チア - 1 , 7 , 8 - トリアザ -
 シクロペンタ [e] アズレン - 2 - イル) - アミン
 シクロペンチル - (4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 3 - チア - 1 , 7 , 8 - トリアザ
 - シクロペンタ [e] アズレン - 2 - イル) - アミン
 ピリミジン - 2 - イル - (4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 3 - チア - 1 , 7 , 8 - ト
 リアザ - シクロペンタ [e] アズレン - 2 - イル) - アミン
 N - (ピリミジン - 2 - イル) - 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - チアゾロ [4 , 5 - e] イ
 ンダゾール - 2 - アミン (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) - (4 , 5 , 6 ,
 7 - テトラヒドロ - 3 - チア - 1 , 7 , 8 - トリアザ - シクロペンタ [e] アズレン - 2
 - イル) - アミン
 N - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) - 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - チアゾ
 ロ [4 , 5 - e] インダゾール - 2 - アミン
 N - (4 - メチルピリミジン - 2 - イル) - 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - チアゾロ [4 ,
 5 - e] インダゾール - 2 - アミン
 (4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル) - (4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 3 - チア
 - 1 , 7 , 8 - トリアザ - シクロペンタ [e] アズレン - 2 - イル) - アミン
 並びに医薬として許容されるその酸又は塩基の付加塩、その立体化学的異性体及びその
 N - オキシド体、
 から選択される、化合物。

【請求項 5】

請求項 1 から 3 のいずれかに記載の化合物であって、
 4 , 4 - ジメチル - N - (ピリジン - 2 - イル) - 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - チアゾロ
 [4 , 5 - e] インダゾール - 2 - アミン
 4 , 4 - ジメチル - N - (ピリミジン - 2 - イル) - 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - チアゾ
 ロ [4 , 5 - e] インダゾール - 2 - アミン
 4 - メチル - N - (ピリミジン - 2 - イル) - 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - チアゾロ [4
 , 5 - e] インダゾール - 2 - アミン
 5 , 5 - ジメチル - N - (ピリミジン - 2 - イル) - 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - チアゾ
 ロ [4 , 5 - e] インダゾール - 2 - アミン
 並びに医薬として許容されるその酸又は塩基の付加塩、その立体化学的異性体及びその
 N - オキシド体、

から選択される、化合物。

【請求項 6】

請求項 1 から 5 のいずれかに記載の化合物又は医薬として許容されるその酸若しくはその塩基付加塩、又はその立体化学的異性体若しくはその N - オキシド体の治療有効量、並びに、医薬として許容される担体及び / 又は賦形剤、
を含有する医薬組成物。

【請求項 7】

ヒトを含めた哺乳動物の状態を治療又は予防する方法であって、
その治療又は予防が m G 1 u R 4 アロステリックモジュレーターの神経調節作用により影響又は促進される、方法であり、

そのような治療又は予防を必要とする哺乳動物に請求項 1 から 6 までのいずれか一項に記載の化合物 / 組成物の有効量を投与する工程、
を含む方法。

【請求項 8】

ヒトを含めた哺乳動物の状態を治療又は予防する方法であって、
その治療又は予防が m G 1 u R 4 ポジティブアロステリックモジュレーターの神経調節作用により影響又は促進される、方法であり、
請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の化合物 / 組成物の有効量をそのような治療又は予防を必要とする哺乳動物に投与する工程、
を含む方法。

【請求項 9】

中枢神経系障害を治療又は予防するのに有用な方法であって、
中枢神経障害は、
耽溺、耐性又は依存症、
うつ病及び不安のような情動障害、
精神性障害のような精神医学的疾患、
注意欠陥 / 多動性障害又は双極性障害、
パーキンソン病、記憶障害、アルツハイマー病、認知症、振戦譫妄、他の形態の神経変性、神経毒性又は虚血、
からなる群から選択され、
請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の化合物 / 組成物の有効量をそのような治療又は予防を必要とする哺乳動物の患者に投与する工程、
を含む方法。

【請求項 10】

中枢神経系障害を治療又は予防するのに有用な方法であって、
中枢神経系障害は、動作緩慢のようなパーキンソン病又は運動障害、固縮、ジストニア、
薬剤誘発性パーキンソニズム、ジスキネジア、遅発性ジスキネジア、L - ドーパ - 誘発性ジスキネジア、ドーパミン作動薬誘発性ジスキネジア、運動過剰障害、ジルドウラトウレット症候群、静止時振戦、動作時振戦、無動症、無動 - 強固症候群、静坐不能、無定位運動症、固定姿勢保持困難、チック、姿勢保持障害、脳炎後パーキンソニズム、筋強剛、
舞蹈病及び舞蹈病様運動、痙攣、間代性筋痙攣、ヘミバリズム、進行性核上性麻痺、下肢静止不能症候群、又は周期性四肢運動障害からなる群から選択され、

請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の化合物 / 組成物の有効量をそのような治療又は予防を必要とする哺乳動物の患者に投与する工程、
を含む方法。

【請求項 11】

請求項 10 に記載の方法であって、
そのような治療又は予防を必要とする哺乳動物の患者に、請求項 1 から 6 のいずれかに記載の化合物 / 組成物の有効量を、薬剤と組み合わせて投与する工程、
を含む方法であり、

薬剤は、レボドパ、又は選択的脳外デカルボキシラーゼ阻害剤と併用したレボドパ、又はカルビドパ、又はエンタカポン、又はCOMT阻害剤又はドーパミン作動薬からなる群から選択される、

方法。

【請求項 1 2】

中枢神経系障害を治療又は予防するのに有用な方法であって、

中枢神経系障害は、譫妄のような認知障害、物質誘発性持続性譫妄、認知症、HIV疾患による認知症、ハンチントン病による認知症、パーキンソン病による認知症、パーキンソンALS認知症複合、アルツハイマー型認知症、物質誘発持続性認知症、又は軽中度認知障害、からなる群から選択され、

請求項1から6のいずれか一項に記載の化合物／組成物の有効量をそのような治療又は予防を必要とする哺乳動物の患者に投与する工程、

を含む方法。

【請求項 1 3】

情動障害を治療するのに有用な方法であって、

情動障害は、不安、広場恐怖症、全般性不安障害（GAD）、強迫性障害（OCD）、パニック障害、心的外傷後ストレス障害（PTSD）、対人恐怖症、他の恐怖症、物質誘発性不安障害、又は急性ストレス障害、からなる群から選択され、

請求項1から6のいずれか一項に記載の化合物／組成物の有効量をそのような治療を必要とする哺乳動物の患者に投与する工程、

を含む方法。

【請求項 1 4】

神経疾患を治療又は予防するのに有用な方法であって、

神経疾患は、神経変性、脳卒中のような神経毒性又は虚血、脊椎損傷、脳低酸素症、脳内血腫、パーキンソン病、記憶障害、アルツハイマー病、認知症、又は振戦譫妄、からなる群から選択され、

請求項1から6のいずれか一項に記載の化合物／組成物の有効量をそのような治療又は予防を必要とする哺乳動物の患者に投与する工程、

を含む方法。

【請求項 1 5】

炎症性中枢神経系障害を治療又は予防するのに有用な方法であって、

炎症性中枢神経系障害は、良性多発性硬化症のような多発性硬化症形態、再発寛解型多発性硬化症、二次性進行型多発性硬化症、一次性進行型多発性硬化症、又は進行再発型多発性硬化症、からなる群から選択され、

そのような治療又は予防を必要とする哺乳動物の患者に、請求項1から6のいずれかに記載の化合物／組成物の有効量を投与する工程、

を含む方法。

【請求項 1 6】

片頭痛を治療又は予防するのに有用な方法であって、

そのような治療又は予防を必要とする哺乳動物の患者に、請求項1から6のいずれかに記載の化合物／組成物の有効量を投与する工程、

を含む方法。

【請求項 1 7】

髄芽腫を治療するのに有用な方法であって、

請求項1から6のいずれか一項に記載の化合物／組成物の有効量をそのような治療を必要とする哺乳動物の患者に投与する工程、

を含む方法。

【請求項 1 8】

グルタメート機能不全に伴う様々な代謝障害を、治療する、予防する、改善する、そのリスクを制御する又は減らす、のに有用な方法であって、

請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の化合物 / 組成物の有効量をそのような治療、予防、改善又はリスクの制御を必要とする哺乳動物の患者に投与する工程、
を含む方法。

【請求項 19】

2型糖尿病を治療又は予防するのに有用な方法であって、

請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の化合物 / 組成物の有効量をそのような治療又は予防を必要とする哺乳動物の患者に投与する工程、
を含む方法。

【請求項 20】

請求項 7 から 19 のいずれか一項に記載の使用のための医薬の製造のための、請求項 1 から 5 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 21】

請求項 7 から 12、14 から 16、及び 19 のいずれかに記載の治療又は予防における使用のための、請求項 1 から 5 のいずれかに記載の化合物又は請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 22】

請求項 18 に記載の使用のための、請求項 1 から 5 のいずれかに記載の化合物又は請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 23】

請求項 13 又は 17 のいずれかに記載の治療における使用のための、請求項 1 から 5 のいずれかに記載の化合物又は請求項 6 に記載の組成物。