

【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16年12月2日(2004.12.2)

【公表番号】特表2000-506890(P2000-506890A)

【公表日】平成12年6月6日(2000.6.6)

【出願番号】特願平9-533496

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 243/02

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/16

A 6 1 K 31/551

C 0 7 D 491/056

【F I】

C 0 7 D 243/02

A 6 1 K 31/00 6 2 6 N

A 6 1 K 31/00 6 2 6 B

A 6 1 K 31/00 6 2 6 F

A 6 1 K 31/55 6 0 1

C 0 7 D 491/056

【手続補正書】

【提出日】平成16年3月12日(2004.3.12)

【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】

## 手続補正書

平成16年3月12日



特許庁長官 殿

## 1. 事件の表示

平成9年特許願第533496号

## 2. 補正をする者

住所 ルクセンブルグ国 エルー2330 ルクセンブルグ, プールバード

ドゥ ラ ペトリュス 122

名称 ユーローセルティック エス. ア.

## 3. 代理人

住所 〒540-6015 大阪府大阪市中央区城見一丁目2番27号

クリスタルタワー15階

氏名 (7828) 弁理士 山本 秀策

電話 (大阪) 06-6949-3910



## 4. 補正対象書類名

請求の範囲

## 5. 補正対象項目名

請求の範囲

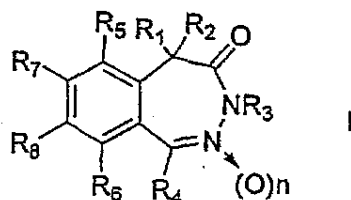
## 6. 補正の内容

請求の範囲を別紙のとおり補正します。

式  
査  
審

## 請求の範囲

1. 以下の式Iを有する化合物あるいはその薬学的に受容可能な塩またはプロドラッグ：



ここで：R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキルまたはチオアルキルであるか；あるいはR<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は一緒になって炭素環またはヘテロ環を形成する；

R<sub>3</sub>は、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、COR、CO<sub>2</sub>RまたはCONR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>であり、ここでR、R<sub>x</sub>、およびR<sub>y</sub>は、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキルまたはアミノアルキルであるか；あるいはR<sub>x</sub>およびR<sub>y</sub>は一緒になって炭素環またはヘテロ環を形成する；

R<sub>4</sub>は、置換または非置換アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基

、またはヘテロアリール基である；

$R_5$ および $R_6$ は、独立して水素、ハロ、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、ニトロ、アミノ、シアノ、アシルアミド、ヒドロキシ、チオール、アシルオキシ、アジド、アルコキシ、カルボキシ、カルボニルアミドまたはアルキルチオールである；

$R_7$ および $R_8$ は、独立して水素、ハロ、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、ニトロ、アミノ、シアノ、アシルアミド、ヒドロキシ、チオール、アシルオキシ、アジド、アルコキシ、カルボキシ、カルボニルアミドまたはアルキルチオールであるか；あるいは $R_7$ および $R_8$ は一緒になって、炭素環またはヘテロ環を形成する；および

$n$ は0または1である。

2.  $R_1$ および $R_2$ が、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキルまたはチオアルキルであり；そして

$R_3$ が、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、

ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、COR、CO<sub>2</sub>R またはCONR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>であり、ここでR、R<sub>x</sub>、およびR<sub>y</sub>が、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキルまたはアミノアルキルである、請求項1に記載の化合物。

3. R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>が一緒になって炭素環またはヘテロ環を形成する、請求項1に記載の化合物。

4. R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>が一緒になって-OCH<sub>2</sub>O-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-、-CH<sub>2</sub>N(R)CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>N(R)CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>N(R)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、または-N=C-C=N-である、請求項1に記載の化合物。

5. R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>が一緒になって-N(Me)-C(O)-O-である、請求項1に記載の化合物。

6. R<sub>4</sub>が置換または非置換アリールまたはヘテロアリールである、請求項1に記載の化合物。

7. R<sub>3</sub>が水素、COR、CO<sub>2</sub>RまたはCONR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>である、請求項1に記載の化合物。

8. R<sub>3</sub>がC<sub>3-10</sub>アルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、炭素環式基、カルボシクロアルキル、ヘテロ環式基、またはヘテロシクロアルキル基である、請求項1に記載の化合物。

9. 前記化合物が以下からなる群より選択されるか、あるいはそれらの薬学的

に受容可能な塩またはプロドラッグである、請求項1に記載の化合物：

7,8-メチレンジオキシ-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-(4H)-オン、

7,8-エチレンジオキシ-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

1-フェニルシクロペンタ[h]-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

3-メチルアミノカルボニル-7,8-メチレンジオキシ-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

1-(4-アミノフェニル)-7,8-メチレンジオキシ-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

1-(4-アミノフェニル)-6-クロロ-7,8-メチレンジオキシ-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

1-(4-アミノフェニル)-9-クロロ-7,8-メチレンジオキシ-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

1-(4-イソプロピルアミノフェニル)-7,8-メチレンジオキシ-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

7,8-メチレンジオキシ-1-(4-メチルフェニル)-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

7,8-メチレンジオキシ-1-(4-メトキシフェニル)-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

1-(3-アミノフェニル)-7,8-メチレンジオキシ-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

1-(4-ヒドロキシフェニル)-7,8-メチレンジオキシ-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

1-(4-アミノ-3-メチルフェニル)-7,8-メチレンジオキシ-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

1-(4-アミノ-3-クロロフェニル)-7,8-メチレンジオキシ-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

1-(4-アミノフェニル)-5-メチル-7,8-メチレンジオキシ-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

1-(4-アミノ-2-クロロフェニル)-7,8-メチレンジオキシ-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

7,8-メチレンジオキシ-1-(3,4-メチレンジオキシフェニル)-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

7,8-メチレンジオキシ-1-(3,4-メチレンジオキシフェニル)-5-メチル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

1-(4-アセトアミドフェニル)-7,8-メチレンジオキシ-5-メチル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

1-(4-アジドフェニル)-7,8-メチレンジオキシ-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

1-(4-メチルアミノフェニル)-7,8-メチレンジオキシ-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

3-シクロヘプチル-7,8-メチレンジオキシ-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

3-(3-ヘキシル)-7,8-メチレンジオキシ-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

7,8-メチレンジオキシ-3-(2-ペンチル)-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

3-シクロヘキシル-7,8-メチレンジオキシ-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

3-シクロペンチル-7,8-メチレンジオキシ-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

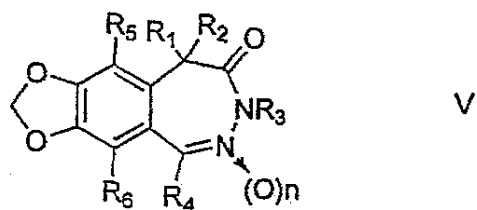
3-イソプロピル-7,8-メチレンジオキシ-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

3-(2-ブチル)-7,8-メチレンジオキシ-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、および

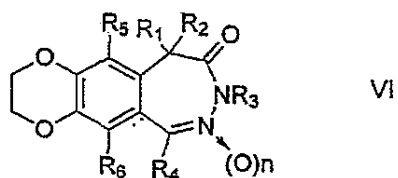
7,8-メチレンジオキシ-3-(3-ペンチル)-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾ

ジアゼピン-4(4H)-オン。

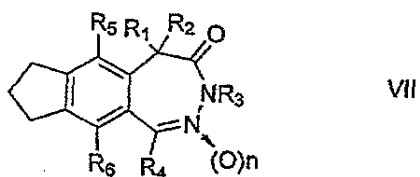
10. 以下の式Vを有する請求項1に記載の化合物あるいはその薬学的に受容可能な塩またはプロドラッグ：



11. 以下の式VIを有する請求項1に記載の化合物あるいはその薬学的に受容可能な塩またはプロドラッグ：

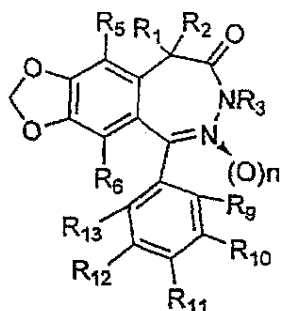


12. 以下の式VIIを有する請求項1に記載の化合物あるいはその薬学的に受容可能な塩またはプロドラッグ：



13. 以下の式VIIIを有する請求項1に記載の化合物あるいはその薬学的に受容可能な塩またはプロドラッグ：





VII

ここで、 $R_1$ - $R_3$ 、 $R_5$ - $R_6$ および $n$ は式Iに関して以前に定義した通りであり；そして $R_9$ - $R_{13}$ は、独立して水素、ハロ、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、ニトロ、アミノ、シアノ、アシルアミド、ヒドロキシ、チオール、アシルオキシ、アジド、アルコキシ、カルボキシ、カルボニルアミドまたはアルキルチオールである。

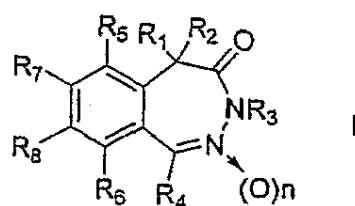
14.  $R_{10}$ および $R_{11}$ が一緒になって炭素環またはヘテロ環を形成する、請求項13に記載の化合物。

15.  $R_{10}$ および $R_{11}$ が一緒になって $-OCH_2O-$ 、 $-(CH_2)_3-$ 、 $-(CH_2)_4-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2N(R)CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2N(R)CH_2-$ 、 $-CH_2N(R)CH_2CH_2-$ または $-N=C-C=N-$ である、請求項13に記載の化合物。

16.  $R_{10}$ および $R_{11}$ が一緒になって $-N(Me)-C(=O)-O-$ である、請求項13に記載の化合物。

17. 請求項1から16のいずれか1項に記載の化合物および薬学的に受容可能なキャリアを含有する、薬学的組成物。

18. 卒中、虚血、CNS損傷、低血糖症または外科に関連する神経損失の処置、予防または改善；またはアルツハイマー病、筋萎縮性側索硬化症、ハンチントン舞踏病、パーキンソン病およびダウン症候群からなる群より選択される神経変性疾患の処置または改善；あるいは興奮性アミノ酸の過剰刺激の悪結果の処置、予防または改善；あるいは不安、精神病、痙攣、慢性疼痛、片頭痛、緑内障、尿失禁の処置または改善方法または麻酔の誘起；あるいは精神分裂病の処置または改善のための組成物であって、以下の式Iを有する化合物、あるいはその薬学的に受容可能な塩またはプロドラッグを含む、組成物：



ここで：R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキルまたはチオアルキルであるか；あるいはR<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は一緒になって炭素環またはヘテロ環を形成する；

R<sub>3</sub>は、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、COR、CO<sub>2</sub>RまたはCONR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>であり、ここでR、R<sub>x</sub>、およびR<sub>y</sub>は、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、

ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキルまたはアミノアルキルであるか；あるいは $R_x$ および $R_y$ は一緒になって炭素環またはヘテロ環を形成する；

$R_4$ は、置換および非置換アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、またはヘテロアリール基である；

$R_5$ および $R_6$ は、独立して水素、ハロ、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、ニトロ、アミノ、シアノ、アシルアミド、ヒドロキシ、チオール、アシルオキシ、アジド、アルコキシ、カルボキシ、カルボニルアミドまたはアルキルチオールである；

$R_7$ および $R_8$ は、独立して水素、ハロ、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、ニトロ、アミノ、シアノ、アシルアミド、ヒドロキシ、チオール、アシルオキシ、アジド、アルコキシ、カルボキシ、カルボニルアミドまたはアルキルチオールであるか；あるいは $R_7$ および $R_8$ は一緒になって炭素環またはヘテロ環を形成する；および

$n$ は0または1である。

19.  $R_1$ および $R_2$ が、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、ア

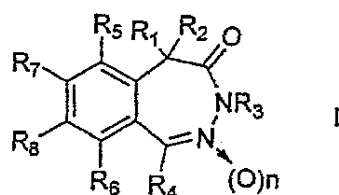
ミノアルキルまたはチオアルキルであり；そして

$R_3$ が、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、COR、CO<sub>2</sub>RまたはCONR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>であり、ここでR、R<sub>x</sub>、およびR<sub>y</sub>が、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキルまたはアミノアルキルである、請求項18に記載の組成物。

20.  $R_7$ および $R_8$ が一緒になって-OCH<sub>2</sub>O-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-、-CH<sub>2</sub>N(R)CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>N(R)CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>N(R)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-または-N=C-C=N-である、請求項18に記載の組成物。

21.  $R_7$ および $R_8$ が一緒になって-N(Me)-C(O)-O-である、請求項18に記載の組成物。

22. 全身虚血および神経変性を処置、予防または改善するための組成物であって、以下の式Iを有する化合物、あるいはその薬学的に受容可能な塩またはプロドラッグを含む、組成物：



ここで： $R_1$ および $R_2$ は、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、

縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキルまたはチオアルキルであるか；あるいは $R_1$ および $R_2$ は一緒になって炭素環またはヘテロ環を形成する；

$R_3$ は、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、 $COR$ 、 $CO_2R$ または $CONR_xR_y$ であり、ここで $R$ 、 $R_x$ 、および $R_y$ は、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキルまたはアミノアルキルであるか；あるいは $R_x$ および $R_y$ は一緒になって炭素環またはヘテロ環を形成する；

$R_4$ は、置換および非置換アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、またはヘテロアリール基である；

$R_5$ および $R_6$ は、独立して水素、ハロ、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、ニトロ、アミノ、シアノ、アシルアミド、ヒドロキシ、チオール、アシルオキシ、アジド、アルコキシ、カルボキシ、カルボニルアミドまたはアルキルチオールである；

$R_7$ および $R_8$ は、独立して水素、ハロ、ハロアルキル、アリール、縮合アリール

、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、ニトロ、アミノ、シアノ、アシルアミド、ヒドロキシ、チオール、アシルオキシ、アジド、アルコキシ、カルボキシ、カルボニルアミドまたはアルキルチオールであるか；あるいは $R_7$ および $R_8$ は一緒になって炭素環またはヘテロ環を形成する；および  
 $n$ は0または1である。

23.  $R_1$ および $R_2$ が、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキルまたはチオアルキルであり；そして

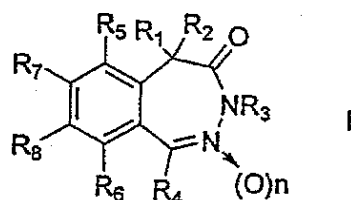
$R_3$ が、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、COR、CO<sub>2</sub>RまたはCONR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>であり、ここでR、R<sub>x</sub>、およびR<sub>y</sub>が、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキルまたはアミノアルキルである、請求項22に記載の組成物。

24.  $R_7$ および $R_8$ が一緒になって $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-(\text{CH}_2)_3-$ 、 $-(\text{CH}_2)_4-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R})\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{R})\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R})\text{CH}_2\text{CH}_2-$ または $-\text{N}=\text{C}-\text{C}=\text{N}-$ である、請求項22に記載の組成物。

25.  $R_7$ および $R_8$ が一緒になって $-\text{N}(\text{Me})-\text{C}(\text{O})-\text{O}-$ である、請求項22に記載の組成物。

26. 前記神経変性が筋萎縮性側索硬化症の結果である、請求項22に記載の組成物。

27. 精神分裂病を処置、予防または改善するための組成物であって、以下の式Iを有する化合物、あるいはその薬学的に受容可能な塩またはプロドラッグを含む、組成物：



ここで： $R_1$ および $R_2$ は、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキルまたはチオアルキルであるか；あるいは $R_1$ および $R_2$ は一緒になって炭素環またはヘテロ環を形成する；

$R_3$ は、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、 $\text{COR}$ 、 $\text{CO}_2\text{R}$

または $\text{CONR}_x\text{R}_y$ であり、ここで $\text{R}$ 、 $\text{R}_x$ 、および $\text{R}_y$ は、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキルまたはアミノアルキルであるか；あるいは $\text{R}_x$ および $\text{R}_y$ は一緒になって炭素環またはヘテロ環を形成する；

$\text{R}_4$ は、置換および非置換アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、またはヘテロアリール基である；

$\text{R}_5$ および $\text{R}_6$ は、独立して水素、ハロ、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、ニトロ、アミノ、シアノ、アシルアミド、ヒドロキシ、チオール、アシルオキシ、アジド、アルコキシ、カルボキシ、カルボニルアミドまたはアルキルチオールである；

$\text{R}_7$ および $\text{R}_8$ は、独立して水素、ハロ、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、ニトロ、アミノ、シアノ、アシルアミド、ヒドロキシ、チオール、アシルオキシ、アジド、アルコキシ、カルボキシ、カルボニルアミドまたはアルキルチオールであるか；あるいは $\text{R}_7$ および $\text{R}_8$ は一緒になって、炭素環またはヘテロ環を形成する；および

$n$ は0または1である。

28.  $\text{R}_1$ および $\text{R}_2$ が、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮



合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキルまたはチオアルキルであり；そして

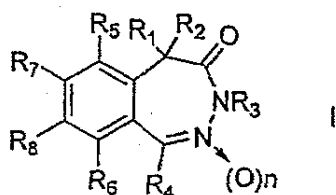
$R_3$ が、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、 $\text{COR}$ 、 $\text{CO}_2\text{R}$ または $\text{CONR}_x\text{R}_y$ であり、ここで $\text{R}$ 、 $\text{R}_x$ 、および $\text{R}_y$ が、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキルまたはアミノアルキルである、請求項 27 に記載の組成物。

29.  $\text{R}_7$ および $\text{R}_8$ が一緒になって $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-(\text{CH}_2)_3-$ 、 $-(\text{CH}_2)_4-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R})\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{R})\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R})\text{CH}_2\text{CH}_2-$ または $-\text{N}=\text{C}-\text{C}=\text{N}-$ である、請求項 27 に記載の組成物。

30.  $\text{R}_7$ および $\text{R}_8$ が一緒になって $-\text{N}(\text{Me})-\text{C}(\text{O})-\text{O}-$ である、請求項 27 に記載の組成物。

31. 興奮性アミノ酸の過小刺激の悪結果の処置または改善；認識の増強；栄養失調および神経発達不良の処置または改善；アルツハイマー病、筋萎縮性側索硬化症、ハンチントン舞踏病、パーキンソン病およびダウン症候群を含む神経変性疾患の処置または改善；あるいは精神分裂病の処置または改善のための

組成物であって、以下の式Iを有する化合物、あるいはその薬学的に受容可能な塩またはプロドラッグを含む、組成物：



ここで：R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキルまたはチオアルキルであるか；あるいはR<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は一緒になって炭素環またはヘテロ環を形成する；

R<sub>3</sub>は、アルキル、ハロアルキル、炭素環式基、ヘテロ環式基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、またはアミノアルキルである；

R<sub>4</sub>は、置換および非置換アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、またはヘテロアリール基である；

R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は、独立して水素、ハロ、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、ニトロ、アミノ、シアノ、アシルアミド、ヒドロキシ、チオール、アシルオキシ、アジド、アルコキシ、カルボキシ、カルボニルアミドまたはアルキルチオールである；

R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は、独立して水素、ハロ、ハロアルキル、アリール、縮合アリール

、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、ニトロ、アミノ、シアノ、アシルアミド、ヒドロキシ、チオール、アシルオキシ、アジド、アルコキシ、カルボキシ、カルボニルアミドまたはアルキルチオールであるか；あるいは $R_7$ および $R_8$ は一緒になって炭素環またはヘテロ環を形成する；および  
 $n$ は0または1である。

32.  $R_1$ および $R_2$ が、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキルまたはチオアルキルである、請求項31に記載の組成物。

33.  $R_7$ および $R_8$ が一緒になって $-OCH_2O-$ 、 $-(CH_2)_3-$ 、 $-(CH_2)_4-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2N(R)CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2N(R)CH_2-$ 、 $-CH_2N(R)CH_2CH_2-$ または $-N=C-C=N-$ である、請求項31に記載の組成物。

34.  $R_7$ および $R_8$ が一緒になって $-N(Me)-C(O)-O-$ である、請求項31に記載の組成物。

35. 前記化合物が以下からなる群より選択されるか、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩またはプロドラッグである、請求項31に記載の組成物：

3-シクロヘプチル-7,8-メチレンジオキシ-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジアゼピン-4(4H)-オン、

3-(3-ヘキシル)-7,8-メチレンジオキシ-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾ

ジアゼピン-4(4H)-オン、

7,8-メチレンジオキシ-3-(2-ペンチル)-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾ  
ジアゼピン-4(4H)-オン、

3-シクロヘキシル-7,8-メチレンジオキシ-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベン  
ゾジアゼピン-4(4H)-オン、

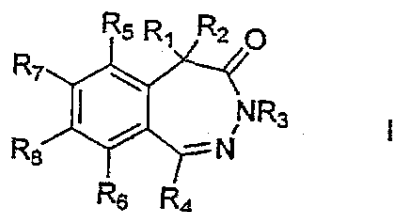
3-シクロペンチル-7,8-メチレンジオキシ-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベン  
ゾジアゼピン-4(4H)-オン、

3-イソプロピル-7,8-メチレンジオキシ-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾ  
ジアゼピン-4(4H)-オン、

3-(2-ブチル)-7,8-メチレンジオキシ-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾジ  
アゼピン-4(4H)-オン、および

7,8-メチレンジオキシ-3-(3-ペンチル)-1-フェニル-3,5-ジヒドロ-2,3-ベンゾ  
ジアゼピン-4(4H)-オン。

36. 以下の式Iにより表される化合物あるいはその薬学的に受容可能な塩ま  
たはプロドラッグの調製方法であって：



ここで：R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、  
縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、  
アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、  
ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキ  
ニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、  
アミノアルキルまたはチオアルキルであるか；あるいはR<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は一緒にな  
って炭素環またはヘテロ環を形成する；

R<sub>3</sub>は、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基  
、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアル

キル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、COR、CO<sub>2</sub>RまたはCONR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>であり、ここでR、R<sub>x</sub>、およびR<sub>y</sub>は、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキルおよびアミノアルキルであるか；あるいはR<sub>x</sub>およびR<sub>y</sub>は一緒になって炭素環またはヘテロ環を形成する；

R<sub>4</sub>は、置換および非置換アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、またはヘテロアリール基である；

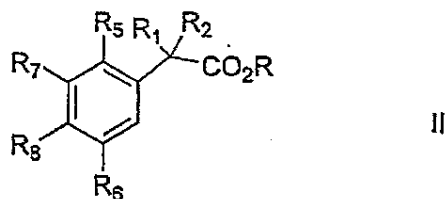
R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は、独立して水素、ハロ、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、ニトロ、アミノ、シアノ、アシルアミド、ヒドロキシ、チオール、アシルオキシ、アジド、アルコキシ、カルボキシ、カルボニルアミドまたはアルキルチオールであり；

R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は、独立して水素、ハロ、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、ニトロ、アミノ、シアノ、アシルアミド、ヒドロキシ、チオール、アシルオキシ、アジド、アルコキシ、カルボキシ、カルボニルアミドまたはアルキルチオールであるか；あるいはR<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は一緒になって炭素環またはヘテロ環を形成する；および

nは0または1である；

以下の工程：

(a)触媒存在下、以下の式IIの化合物：

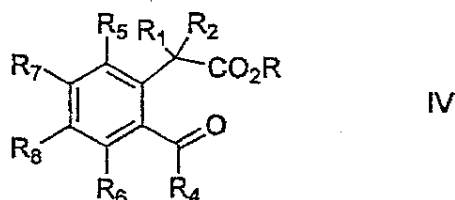


ここでRは低級アルキルであり、 $R_1$ - $R_2$ 、 $R_5$ - $R_8$ は式Iにおいて以前に定義した通りである；を、以下の式IIIの化合物：



ここでXはOHまたはハロゲンであり、 $R_4$ は式Iにおいて以前に定義した通りである；

と反応させ、以下の式IVの化合物：



ここで $R_1$ - $R_2$ 、 $R_4$ - $R_8$ およびRは式Iにおいて以前に定義した通りである；

を得る工程；および

(b)式IVの化合物を $H_2NNHR_3$ （ここで $R_3$ は式Iにおいて以前に定義した通りである）と反応させ、式Iの化合物（ここでnは0である）を得る工程；および

(c) $R_3$ が水素である場合、塩基存在下、式Iの化合物を $XR_3$ （ここでXは脱離基である）と反応させ、式Iの化合物を得る工程；および

(d)nが0である場合、式Iの化合物を $H_2O_2$ または過酸と反応させ、式Iの化合物（ここでnは1である）を得る工程；

を包含する、方法。

37.  $R_1$ および $R_2$ が、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキルまたはチオアルキルであり；そして

$R_3$ が、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、 $\text{COR}$ 、 $\text{CO}_2\text{R}$ または $\text{CONR}_x\text{R}_y$ であり、ここで $\text{R}$ 、 $\text{R}_x$ 、および $\text{R}_y$ が、独立して水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、縮合アリール、炭素環式基、ヘテロ環式基、ヘテロアリール基、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、カルボシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキルまたはアミノアルキルである、請求項36に記載の方法。

38. 前記触媒がルイス酸である、請求項36に記載の方法。

39. 前記ルイス酸が $\text{SnCl}_4$ または $\text{P}_2\text{O}_5$ である、請求項38に記載の方法。

40.  $R_7$ および $R_8$ が $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-(\text{CH}_2)_3-$ 、 $-(\text{CH}_2)_4-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R})\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{R})\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R})\text{CH}_2\text{CH}_2-$ または $\text{N}=\text{C}-\text{C}=\text{N}-$ を形成する、請求項36に記載の方法。

41.  $R_7$ および $R_8$ が $-\text{N}(\text{Me})-\text{C}(\text{O})-\text{O}-$ を形成する、請求項36に記載の方法。