

【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 11 月 30 日 (2006.11.30)

【公表番号】特表 2006-505559 (P2006-505559A)

【公表日】平成 18 年 2 月 16 日 (2006.2.16)

【年通号数】公開・登録公報 2006-007

【出願番号】特願 2004-544204 (P2004-544204)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 209/10 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/496 (2006.01)**

**A 6 1 P 1/04 (2006.01)**

**A 6 1 P 3/04 (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 25/18 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/24 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/28 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

**C 0 7 D 209/30 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 D 209/10 C S P

A 6 1 K 31/496

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 209/30

【手続補正書】

【提出日】平成 18 年 10 月 11 日 (2006.10.11)

【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

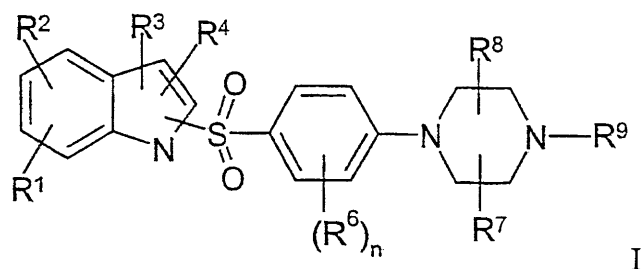
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 ( I ) :

## 【化 1】



[ 式中、

$R^1$  及び  $R^2$  は、それぞれ独立に、水素、アルキル、アリール、アシル、ハロ、ニトロ、アミノ、シアノ、アルコキシ、ヒドロキシ、アリールオキシ、アルキルチオ、アリールチオ、チオール、カルボニルアミノ、アミノカルボニル、又はハロアルキルであり；

$R^3$  及び  $R^4$  は、それぞれ独立に、水素、ハロ、アルキル、アシル、アリール、又はアリールアルキルであり；

$n$  は、0 ~ 4 であり；

$R^6$  は、それぞれ独立の存在として、水素、アルキル、アルコキシ、又はハロであり；

$R^7$  及び  $R^8$  は、それぞれ独立に、水素又はアルキルであり；そして

$R^9$  は、水素、アルキル、又はアリールアルキルである ] で示される化合物、あるいはその個々の異性体、異性体のラセミ若しくは非ラセミ混合物、プロドラッグ、又は薬剤学的に許容しうる塩若しくは溶媒和物。

## 【請求項 2】

$R^1$  及び  $R^2$  が、それぞれ独立に、水素、ハロ、又はアルコキシであり；

$R^3$  及び  $R^4$  が、それぞれ独立に、水素、ハロ又はアルキルであり；

$n$  が、1 であり、かつ  $R^6$  が、水素又はハロであり；

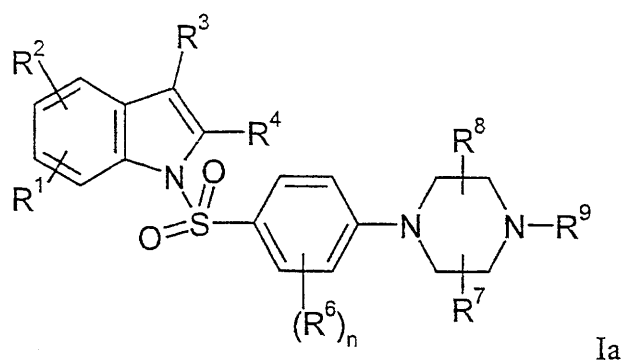
$R^7$  及び  $R^8$  が、水素であり；そして

$R^9$  が、水素又はアルキルである、請求項 1 記載の式 ( I ) の化合物。

## 【請求項 3】

該化合物が、式 ( Ia )：

## 【化 2】

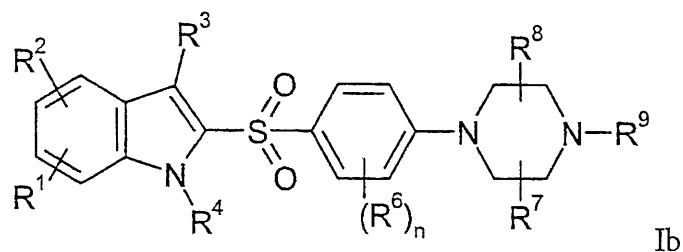


[ 式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $n$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、及び  $R^9$  は、請求項 1 と同義である ]  
で示される、請求項 1 記載の式 ( I ) の化合物。

## 【請求項 4】

該化合物が、式 ( Ib )：

## 【化 3】

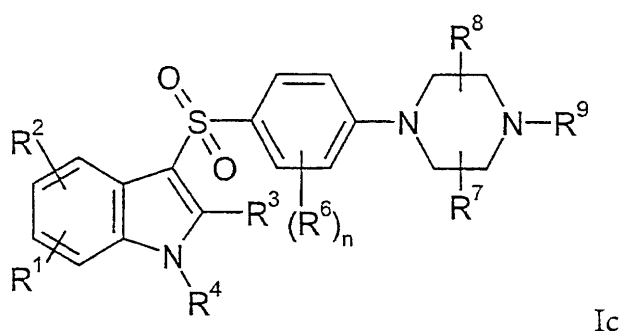


[ 式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $n$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、及び $R^9$ は、請求項 1 と同義である ]  
 で示される、請求項 1 記載の式 ( I ) の化合物。

## 【請求項 5】

該化合物が、式 ( Ic ) :

## 【化 4】



[ 式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $n$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、及び $R^9$ は、請求項 1 と同義である ]  
 で示される、請求項 1 記載の式 ( I ) の化合物。

## 【請求項 6】

$R^1$  及び  $R^2$  が、それぞれ独立に、水素、ハロ、又はアルコキシであり； $R^3$  が、水素又はハロであり； $R^4$  が、水素又はアルキルであり； $R^6$ 、 $R^7$  及び  $R^8$  が、水素であり；そして  $R^9$  が、水素又はアルキルである、請求項 3 記載の式 ( Ia ) の化合物。

## 【請求項 7】

$R^1$  及び  $R^2$  が、それぞれ独立に、水素、フルオロ、ブromo又はメトキシであり； $R^3$  が、水素又はクロロであり； $R^4$  が、それぞれ水素又はメチルであり； $R^6$ 、 $R^7$  及び  $R^8$  が、水素であり；そして  $R^9$  が、水素又はメチルである、請求項 6 記載の式 ( Ia ) の化合物。

## 【請求項 8】

化合物が、

5 - フルオロ - 1 - ( 4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール；

4 - ブロモ - 1 - ( 4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール；

5 - メトキシ - 1 - ( 4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール；

1 - ( 4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール；

5 - フルオロ - 1 - [ 4 - ( 4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル ) - ベンゼンスルホニル ] - 1 H - インドール；

3 - クロロ - 5 - メトキシ - 2 - メチル - 1 - ( 4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール

である、請求項 7 記載の式 ( Ia ) の化合物。

## 【請求項 9】

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 及び $R^9$ が、水素である、請求項 4 記載の式 (1b) の化合物。

## 【請求項 10】

化合物が、2 - (4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル) - 1 H - インドールである、請求項 9 記載の式 (1b) の化合物。

## 【請求項 11】

$R^1$ 及び $R^2$ が、それぞれ独立に、水素、ハロ又はアルコキシであり； $R^3$ が、水素であり； $R^4$ が、水素又はアルキルであり；n が、1 であり、かつ $R^6$ が、水素又はハロであり； $R^7$ 及び $R^8$ が、水素であり；そして $R^9$ が、水素又はアルキルである、請求項 5 記載の式 (1c) の化合物。

## 【請求項 12】

$R^1$ 及び $R^2$ が、それぞれ独立に、水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード又はメトキシであり； $R^3$ が、水素であり； $R^4$ が、水素又はメチルであり；n が、1 であり、かつ $R^6$ が、水素又はクロロであり； $R^7$ 及び $R^8$ が、水素であり；そして $R^9$ が、水素又はメチルである、請求項 11 記載の式 (1c) の化合物。

## 【請求項 13】

化合物が、

5 - ブロモ - 1 - メチル - 3 - (4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル) - 1 H - インドール；

5 - ブロモ - 3 - (4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル) - 1 H - インドール；

3 - (4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル) - 1 H - インドール；

1 - メチル - 3 - (4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル) - 1 H - インドール；

6 - クロロ - 3 - (4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル) - 1 H - インドール；

4 - クロロ - 3 - (4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル) - 1 H - インドール；

5 - メトキシ - 3 - (4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル) - 1 H - インドール；

5 - クロロ - 3 - (4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル) - 1 H - インドール；

7 - クロロ - 3 - (4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル) - 1 H - インドール；

6 - クロロ - 1 - メチル - 3 - (4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル) - 1 H - インドール；

3 - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - ベンゼンスルホニル] - 1 H - インドール；

7 - ブロモ - 3 - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - ベンゼンスルホニル] - 1 H - インドール；

7 - ブロモ - 3 - (4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル) - 1 H - インドール；

7 - ブロモ - 3 - (4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル) - 1 H - インドール；

6 - ブロモ - 3 - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - ベンゼンスルホニル] - 1 H - インドール；

5 - ヨード - 3 - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - ベンゼンスルホニル] - 1 H - インドール；

4 - ブロモ - 3 - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - ベンゼンスルホニル]

]- 1 H - インドール ;

4 - ブロモ - 3 - ( 4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール ;

5 - ヨード - 3 - ( 4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール ;

6 - ブロモ - 3 - ( 4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール ;

3 - ( 2 - クロロ - 4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール ;

3 - ( 3 - クロロ - 4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール ;

5 - ブロモ - 3 - [ 2 - クロロ - 4 - ( 4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル ) - ベンゼンスルホニル ] - 1 H - インドール ;

5 - ブロモ - 3 - ( 2 - クロロ - 4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール ;

5 - クロロ - 3 - ( 3 - クロロ - 4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール ;

5 - クロロ - 3 - ( 3 - クロロ - 4 - ( 4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル ) - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール ;

3 - ( 3 - クロロ - 4 - ( 4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル ) - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール ;

5 - ブロモ - 3 - ( 3 - クロロ - 4 - ( 4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル ) - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール ;

5 - ブロモ - 3 - ( 3 - クロロ - 4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール ;

5 - クロロ - 3 - ( 2 - クロロ - 4 - ピペラジン - 1 - イル - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール ;

5 - クロロ - 3 - ( 2 - クロロ - 4 - ( 4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル ) - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール ;

3 - ( 2 - クロロ - 4 - ( 4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル ) - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール ;

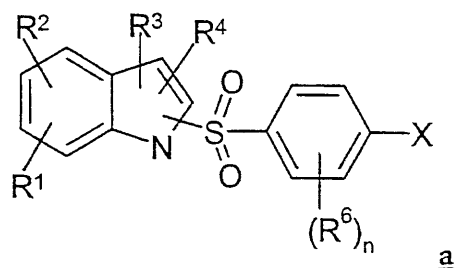
5 - ブロモ - 3 - ( 2 - クロロ - 4 - ( 4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル ) - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - インドール

である、請求項 12 記載の式 (Ic) の化合物。

【請求項 14】

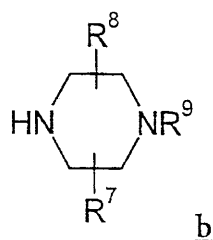
請求項 1 記載の式 (I) の化合物の製造方法であって、式 (a) :

【化 5】



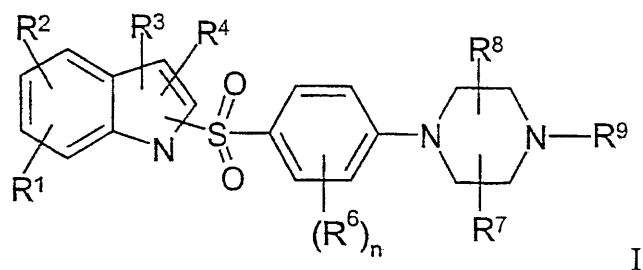
[ 式中、X は、ハロである ] で示される 4 - ハロベンゼンスルホニル - インドールを、式 (b) :

【化 6】



で示されるピペラジンと接触させることにより、式 (I) :

【化 7】

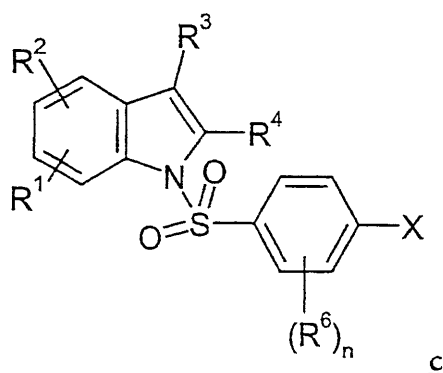


[ 式中、 $n$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$  及び  $R^9$  は、請求項 1 と同義である ] で示される化合物を製造することの特徴とする方法。

【請求項 15】

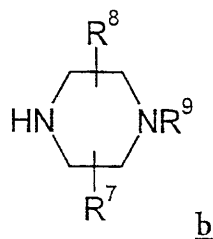
請求項 3 記載の式 (Ia) の化合物の製造方法であって、式 (c) :

【化 8】



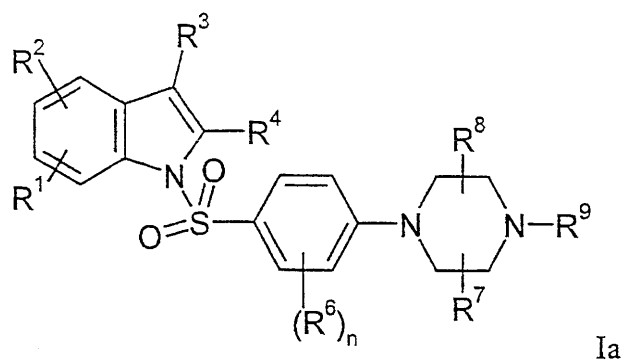
[ 式中、 $X$  は、ハロである ] で示される化合物を、式 (b) :

【化 9】



で示されるピペラジンと接触させることにより、式 (Ia) :

【化 1 0】

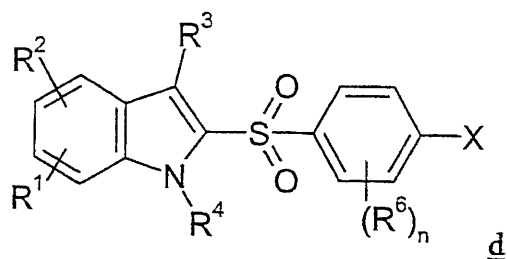


[ 式中、 $n$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 及び $R^9$ は、請求項 1 と同義である ] で示される化合物を製造することを特徴とする方法。

【請求項 1 6】

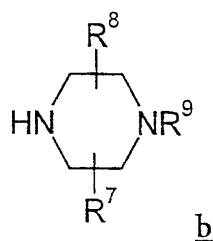
請求項 4 記載の式 ( Ib ) の化合物の製造方法であって、式 ( d ) :

【化 1 1】



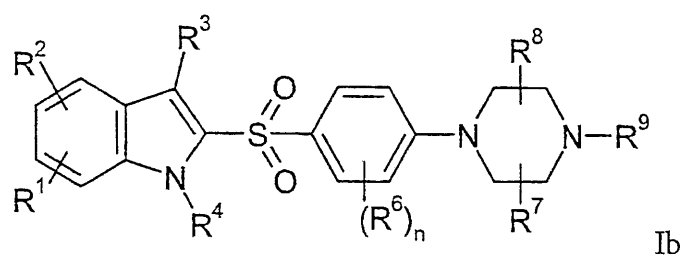
[ 式中、 $X$  は、ハロゲンである ] で示される化合物を、式 ( b ) :

【化 1 2】



で示されるピペラジンと接触させることにより、式 ( Ib ) :

【化 1 3】



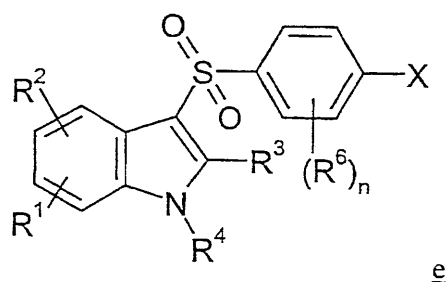
[ 式中、 $n$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 及び $R^9$ は、請求項 1 と同義である ] で

示される化合物を製造することの特徴とする方法。

【請求項 17】

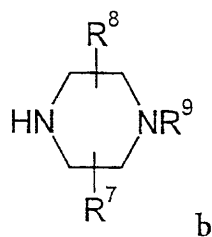
請求項 5 記載の式 (Ic) の化合物の製造方法であって、式 (e) :

【化 14】



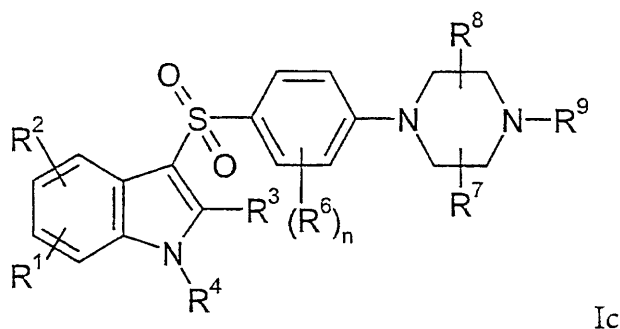
[式中、X は、ハロである]で示される化合物を、式 (b) :

【化 15】



で示されるピペラジンと接触させることにより、式 (Ic) :

【化 16】



[式中、n、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>及びR<sup>9</sup>は、請求項 1 と同義である]で示される化合物を製造することの特徴とする方法。

【請求項 18】

疾患の処置のための、少なくとも 1 つの請求項 1 ~ 13 記載の化合物の治療有効量を、1 つ以上の薬剤学的に許容しうる担体との混合物として含む、薬剤組成物。

【請求項 19】

5-HT<sub>6</sub> アゴニストにより軽減される病状の治療又は予防用の医薬の製造のための、請求項 1 記載の 1 つ以上の式 (I) の化合物の使用。

【請求項 20】

病状が、CNS 障害を含む、請求項 19 記載の使用。

【請求項 21】

病状が、精神病、統合失調症、躁鬱病、神経障害、記憶障害、注意欠陥障害、パーキン



ソン病、筋萎縮性側索硬化症、アルツハイマー病及びハンチントン舞踏病を含む、請求項 20 記載の使用。

【請求項 22】

病状が、胃腸管障害を含む、請求項 19 記載の使用。

【請求項 23】

病状が、肥満を含む、請求項 19 記載の使用。