

【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30年4月19日(2018.4.19)

【公表番号】特表2016-506939(P2016-506939A)

【公表日】平成28年3月7日(2016.3.7)

【年通号数】公開・登録公報2016-014

【出願番号】特願2015-555608(P2015-555608)

【国際特許分類】

| | | |
|--------|---------|-----------|
| C 07 D | 471/10 | (2006.01) |
| A 61 K | 31/519 | (2006.01) |
| C 07 D | 487/10 | (2006.01) |
| A 61 P | 43/00 | (2006.01) |
| A 61 P | 25/00 | (2006.01) |
| A 61 P | 25/30 | (2006.01) |
| A 61 P | 25/22 | (2006.01) |
| A 61 P | 25/18 | (2006.01) |
| A 61 P | 25/16 | (2006.01) |
| A 61 P | 25/14 | (2006.01) |
| A 61 P | 25/28 | (2006.01) |
| A 61 P | 9/00 | (2006.01) |
| A 61 P | 25/08 | (2006.01) |
| A 61 P | 29/00 | (2006.01) |
| A 61 P | 25/06 | (2006.01) |
| A 61 P | 25/04 | (2006.01) |
| A 61 P | 3/00 | (2006.01) |
| A 61 P | 3/10 | (2006.01) |
| A 61 P | 27/02 | (2006.01) |
| A 61 P | 1/00 | (2006.01) |
| A 61 P | 1/04 | (2006.01) |
| C 07 D | 498/10 | (2006.01) |
| A 61 K | 31/5386 | (2006.01) |
| A 61 K | 31/5377 | (2006.01) |
| A 61 K | 45/00 | (2006.01) |
| A 61 P | 35/00 | (2006.01) |

【F I】

| | | |
|--------|--------|-------|
| C 07 D | 471/10 | 1 0 1 |
| C 07 D | 471/10 | 1 0 2 |
| A 61 K | 31/519 | |
| C 07 D | 487/10 | C S P |
| A 61 P | 43/00 | 1 0 5 |
| A 61 P | 25/00 | |
| A 61 P | 25/30 | |
| A 61 P | 25/22 | |
| A 61 P | 25/18 | |
| A 61 P | 25/16 | |
| A 61 P | 25/14 | |
| A 61 P | 25/28 | |
| A 61 P | 9/00 | |
| A 61 P | 25/08 | |

| | |
|---------|---------|
| A 6 1 P | 29/00 |
| A 6 1 P | 25/06 |
| 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 | 1/00 |
| A 6 1 P | 1/04 |
| C 0 7 D | 498/10 |
| | S |
| A 6 1 K | 31/5386 |
| A 6 1 K | 31/5377 |
| A 6 1 K | 45/00 |
| A 6 1 P | 43/00 |
| | 1 2 1 |
| A 6 1 P | 35/00 |

【誤訛訂正書】

【提出日】平成30年3月12日(2018.3.12)

【誤訛訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

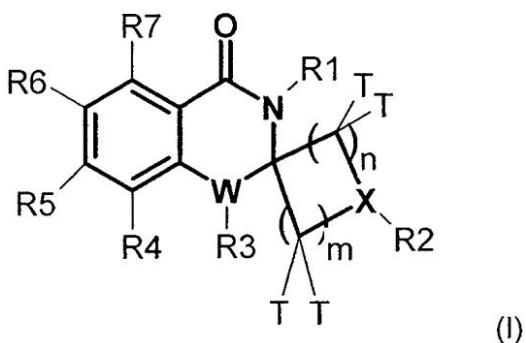
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



式中：

Wは、N、OまたはC Hを示し；

Xは、NまたはC Hを示し；

R 1は、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキルを示し、それは、任意に1つまたは2つ以上の同一であるかまたは異なる置換基Tによって置換され得；

R 2は、(NY)_p-シクロアルキル、(NY)_p-シクロアルキルアルキル、(NY)_p-ヘテロシクリル、(NY)_p-ヘテロシクリルアルキル、(NY)_p-アリール、(NY)_p-アリールアルキル、(NY)_p-ヘテロアリール、(NY)_p-ヘテロアリールアルキル、(NY)_p-C(O)-シクロアルキル、(NY)_p-C(O)-アルキル-シクロアルキル、(NY)_p-C(O)-ヘテロシクリル、(NY)_p-C(O)-アリール-ヘテロシクリル、(NY)_p-C(O)-アリール、(NY)_p-C(O)-アリール-アリール、(NY)_p-C(O)-ヘテロアリール、(NY)_p-C(O)-アルキル-ヘテロアリール、(NY)_p-C(O)O-シクロアルキル、(NY)_p-C(

O)O - アルキル - シクロアルキル、(N Y)_p - C(O)O - ヘテロシクリル、(N Y)_p - C(O)O - アルキル - ヘテロシクリル、(N Y)_p - C(O)O - アリール、(N Y)_p - C(O)O - アルキル - アリール、(N Y)_p - C(O)O - アルキル - ヘテロアリール、(N Y)_p - C(O)NH - シクロアルキル、(N Y)_p - C(O)NH - アルキル - シクロアルキル、(N Y)_p - C(O)NH - ヘテロシクリル、(N Y)_p - C(O)NH - アルキル - ヘテロシクリル、(N Y)_p - C(O)NH - アリール、(N Y)_p - C(O)NH - アルキル - アリール、(N Y)_p - C(O)NH - ヘテロアリール、(N Y)_p - C(O)NH - アルキル - ヘテロアリール、(N Y)_p - S(O)₂ - シクロアルキル、(N Y)_p - S(O)₂ - アルキル - シクロアルキル、(N Y)_p - S(O)₂ - ヘテロシクリル、(N Y)_p - S(O)₂ - アルキル - ヘテロシクリル、(N Y)_p - S(O)₂ - アリール、(N Y)_p - S(O)₂ - アルキル - アリール、(N Y)_p - S(O)₂ - ヘテロアリール、(N Y)_p - S(O)₂ - アルキル - ヘテロアリールを示し、それは、任意に1つまたは2つ以上の同一であるかまたは異なる置換基Tによって置換され得；

R3は、WがNまたはCHである場合には、R3は、Hまたはアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキルを示し；それは、任意に1つまたは2つ以上の同一であるかまたは異なる置換基Tによって置換され得；

WがOである場合には、R3は不在であり；

R4、R5、R6、R7は、互いに独立して、H、アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ハロゲン、F、Cl、Br、I、OH、CN、NO₂、NYY、CF₃、OCF₃、O - アルキル、O - アルキル - ヘテロシクリル、O - アルキル - アリール、O - アルキル - ヘテロアリール、O - アルキル - NYY、O - アルキル - O - アルキル、C(O)OY、C(O)NY - アルキル - NYY、C(O)NYY、C(O) - アルキル、C(O) - ヘテロシクリル、S(O)₂ - Yを示し；それによってアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリールは、任意に1つまたは2つ以上の同一であるかまたは異なる置換基Tによって置換され得；

Tは、互いに独立して、H、アルキル、ハロゲン、F、Cl、Br、I、OH、CN、NO₂、NYY、CF₃、OCF₃、O - アルキル、O - アルキル - ヘテロシクリル、アルキル - NYY、O - アルキル - アリール、O - アルキル - ヘテロアリール、O - アルキル - NYY、O - アルキル - O - アルキル、C(O)OY、C(O)NY - アルキル - NY Y、C(O)NYY、S(O)₂ - Y、S - アルキルを示し；または2つの隣接した置換基Tはまた、それらが結合した原子と一緒にシクロアルキルまたはヘテロシクリルを形成することができ；

Yは、互いに独立して、H、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルキル - O - アルキルを示し；

n、mは、互いに独立して1または2を示し；
pは、XがNである場合には互いに独立して0を示すか、またはXがCHである場合には互いに独立して1を示す；

で表される化合物、またはそれらの生理学的に許容し得る塩、溶媒和物、互変異性体または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項2】

n、mが共に2を示す、

請求項1に記載の化合物、またはそれらの生理学的に許容し得る塩、溶媒和物、互変異性体または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項3】

n、mが共に1を示す、

請求項1に記載の化合物、またはそれらの生理学的に許容し得る塩、溶媒和物、互変異性体または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項 4】

X が N を示し；

p が 0 を示す、

請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれらの生理学的に許容し得る塩、溶媒和物、互変異性体または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項 5】

X が C H を示し；

p が 1 を示す、

請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれらの生理学的に許容し得る塩、溶媒和物、互変異性体または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項 6】

R 1 が、シクロプロピル、またはフェニル、またはピリジル、チアゾリル、ベンズイミダゾールもしくはベンゾフラニルを示し；それは、任意に 1 つまたは 2 つ以上の同一であるかまたは異なる置換基 T によって置換され得る、

請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれらの生理学的に許容し得る塩、溶媒和物、互変異性体または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項 7】

R 1 が、メチル、エチル、メトキシ - エチル、1 - メトキシ - エタン - 2 - イル、メトキシ - プロピル、1 - メトキシ - プロパン - 3 - イル、シクロプロピル、フェニル、メチル - フェニル、1 - メチル - フエン - 4 - イル、1 - メチル - フエン - 3 - イル、ヒドロキシ - フェニル、1 - ヒドロキシ - フエン - 2 - イル、1 - ヒドロキシ - フエン - 3 - イル、1 - ヒドロキシ - フエン - 4 - イル、メトキシ - フェニル、1 - メトキシ - フエン - 4 - イル、1 - メトキシ - フエン - 3 - イル、1 - メトキシ - フエン - 2 - イル、フルオロ - フェニル、1 - フルオロ - フエン - 4 - イル、フルオロ - メトキシ - フェニル、プロモ - フェニル、1 - プロモ - フエン - 4 - イル、シアノ - フェニル、1 - シアノ - フエン - 4 - イル、1 - メトキシ - 2 - フルオロ - フエン - 4 - イル、ピリジル、ピリジン - 3 - イル、メトキシ - ピリジル、2 - メトキシ - ピリジン - 5 - イル、チアゾリル、チアゾール - 2 - イル、ベンズイミダゾリル、ベンズイミダゾール - 2 - イル、ピラゾリル、ピラゾール - 3 - イル、メチル - ピラゾリル、1 - メチル - 3 - ピラゾール - 3 - イル、メチル - ベンゾフラニル、2 - メチル - ベンゾフラン - 5 - イル、ジメチル - アミノエチル、1 , 1 - ジメチルアミノエタン - 2 - イル、ジメチル - アミノプロピル、1 , 1 - ジメチルアミノプロパン - 3 - イル、ジメチル - アミノエトキシ - フェニル、1 , 1 - ジメチル - アミノエトキシ - フエン - 4 - イル、メトキシ - エトキシ - フェニル、2 - メトキシ - エトキシ - フエン - 4 - イル、クロロ - フェニル、1 - クロロ - フエン - 4 - イル、トリフルオロメトキシ - フェニル、1 - トリフルオロメトキシ - フエン - 4 - イル、トリフルオロメチル - フェニル、1 - トリフルオロメチル - フエン - 4 - イル、トリフルオロメチル - クロロ - フェニル、1 - トリフルオロメチル - 2 - クロロ - フエン - 4 - イル、トリフルオロメトキシ - クロロ - フェニル、1 - トリフルオロメトキシ - 2 - クロロ - フエン - 4 - イル、メチル - スルホニル - フェニル、1 - メチル - スルホニル - フエン - 4 - イル、メチル - チオ - フェニル、メチル - チオ - フエン - 4 - イルを示す、

請求項 6 に記載の化合物、またはにそれらの生理学的に許容し得る塩、溶媒和物、互変異性体または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項 8】

R 2 が、メチル、エチル、プロペニル、シクロプロピルメチル、フェニルメチル、フェニルエチル、フェニルプロピル、トリフルオロメトキシ - フェニルメチル、クロロ - フェニルメチル、クロロ - フェニルエチル、ジフルオロ - フェニルメチル、シアノ - フェニルメチル、ヒドロキシ - フェニルメチル、ピリジルメチル、フルオロ - ピリジルメチル、フルオロ - フェニルメチル、フルオロ - フェニルエチル、ジメチル - フェニルメチル、メチル - フェニルメチル、ベンゾ [1 , 3] ジオキソール - メチル、メトキシ - フェニルメチル、クロロ - チオフェニルメチル、エチル - フェニルメチル、ジクロロ - フェニルメチル

、クロロ - フェニルエチル、クロロ - フェニルプロピル、ジフルオロ - フェニルエチル、メチル - ピロリルメチル、メチル - フラニルメチル、キノリニルメチル、イソキノリニルメチル、ブロモ - チアゾリルメチル、メチル - ピラゾリルメチル、ジフルオロ - フェニルプロピル、メチル - チアゾリルメチル、メチル - イソキサゾリルメチル、[1 , 2 , 4] - オキサジアゾリルメチル、メチル - イミダゾリルメチル、イミダゾ - ピリジルメチル、フルオロ - フェニルメチル、トリフルオロメチル - フェニルメチル、ニトロ - フェニルメチル、フェニルメチルオキシ - フェニルメチル、ナフチルメチル、イソブチル - フェニルメチル、イソプロピル - フェニルメチル、トリフルオロ - フェニルメチル、ジクロロ - フェニル - カルボニル、フルオロ - フェニル - カルボニル、ジフルオロ - フェニル - トリフルオロエチル、フルオロ - フェニル - トリフルオロエチル、tert. - プチル - カルバメート、ジフルオロ - フェニル - メチル - アミノ、フェニル - メチル - アミノ、アセトアミド、トリフルオロ - アセトアミド、ベンズアミド、フェニルアミノ、メタン - スルホニアミド、ベンゼン - スルホニアミド、トリフルオロメチル - ベンゼン - スルホニアミド、フェニル尿素、メチル尿素を示す。

請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれらの生理学的に許容し得る塩、溶媒和物、互変異性体または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

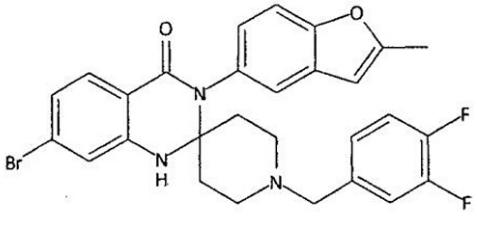
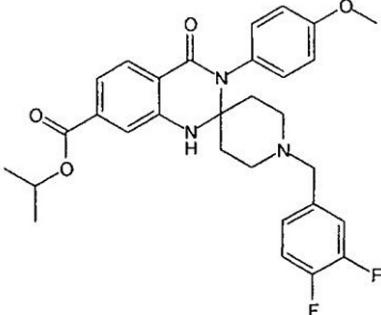
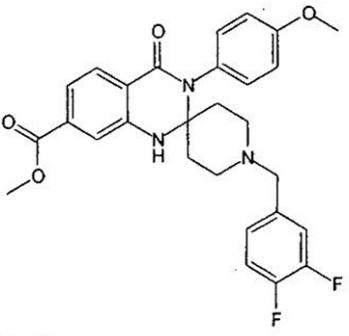
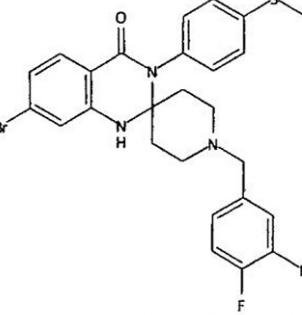
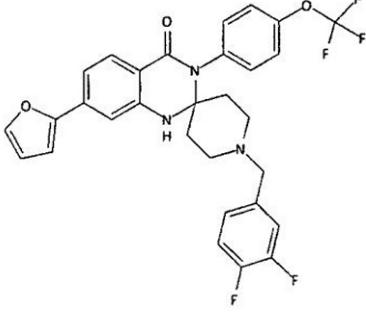
【請求項 9】

以下のもの：

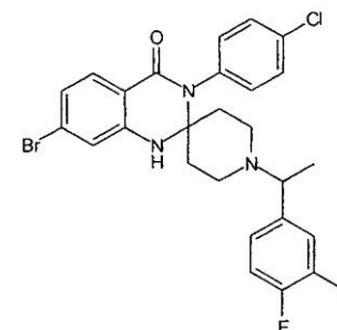
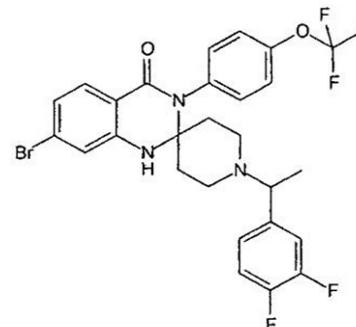
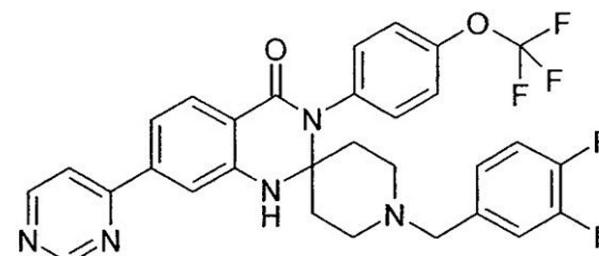
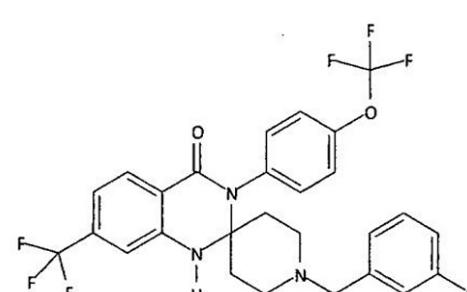
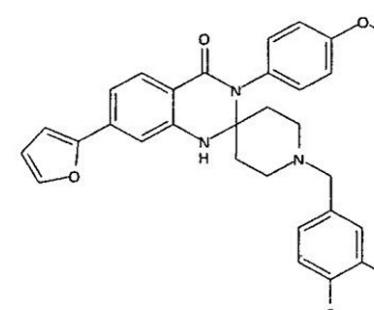
【表 1】

| 化合物番号 | 化学構造 |
|-------|------|
| 1 | |

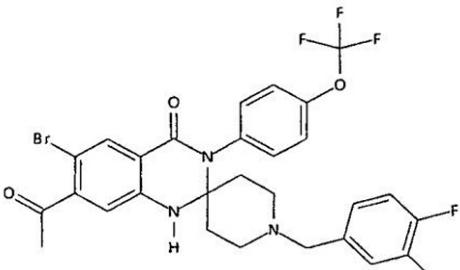
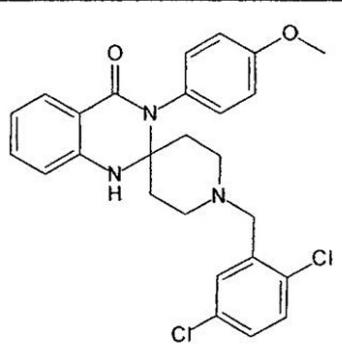
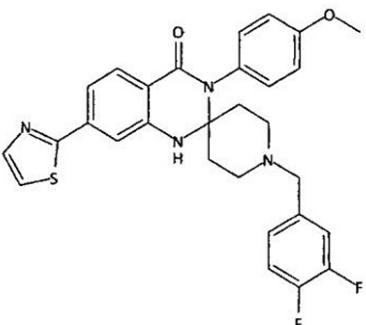
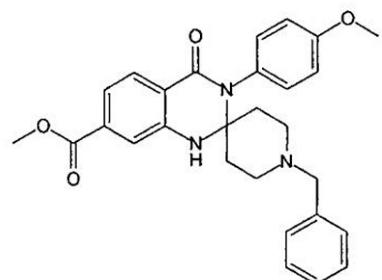
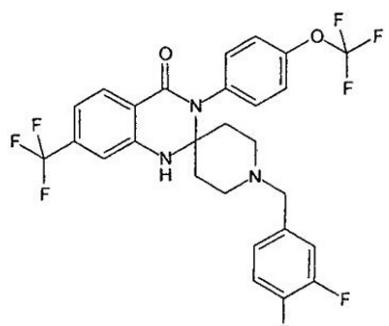
【表2】

| | |
|---|---|
| 2 |  |
| 3 |  |
| 4 |  |
| 5 |  |
| 6 |  |

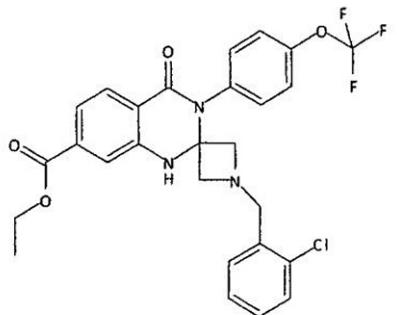
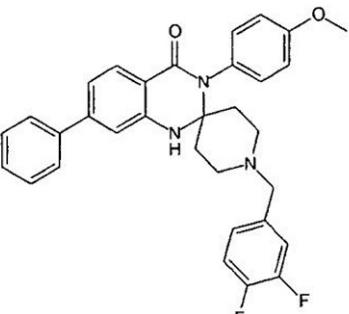
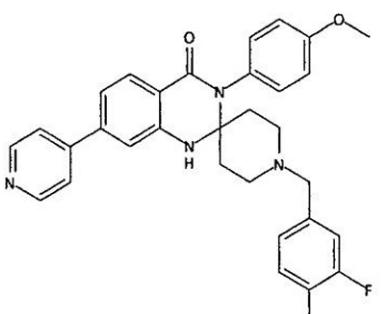
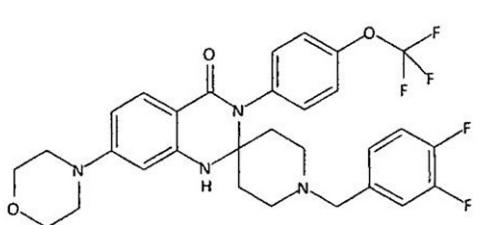
【表3】

| | |
|----|--|
| 7 |  |
| 8 |  |
| 9 |  |
| 10 |  |
| 11 |  |

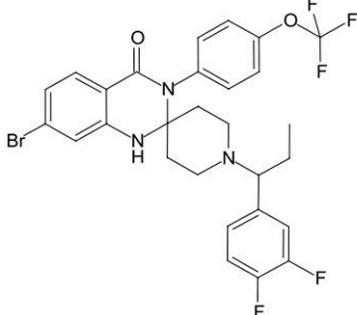
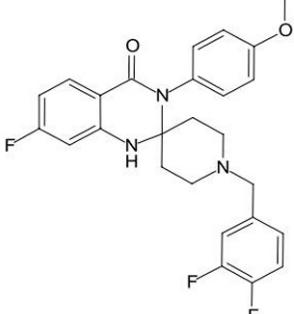
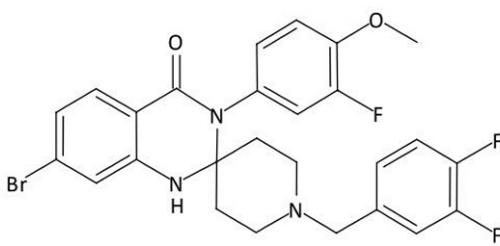
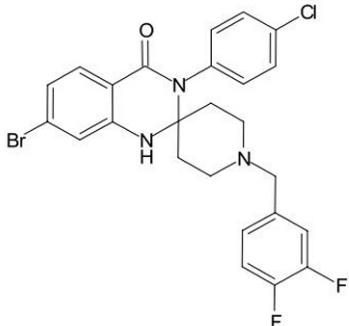
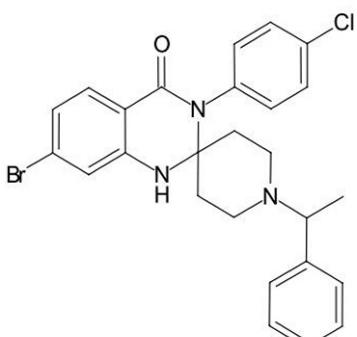
【表4】

| | |
|----|---|
| 12 |  |
| 13 |  |
| 14 |  |
| 15 |  |
| 16 |  |

【表5】

| | |
|----|---|
| 17 |  |
| 18 |  |
| 19 |  |
| 20 |  |
| 21 |  |

【表 6】

| | |
|----|---|
| 22 |  |
| 23 |  |
| 24 |  |
| 25 |  |
| 26 |  |

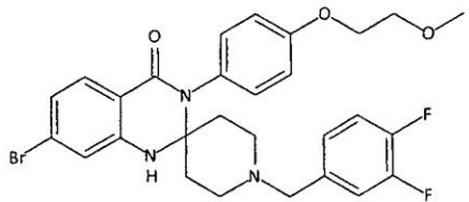
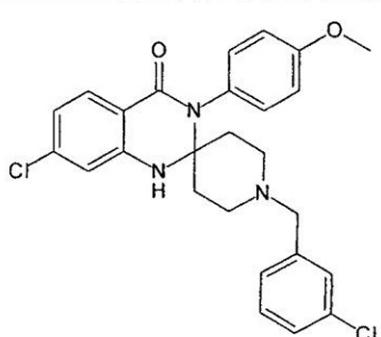
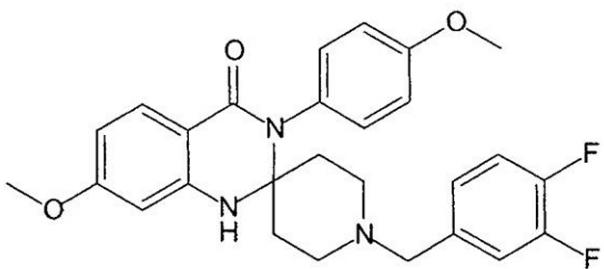
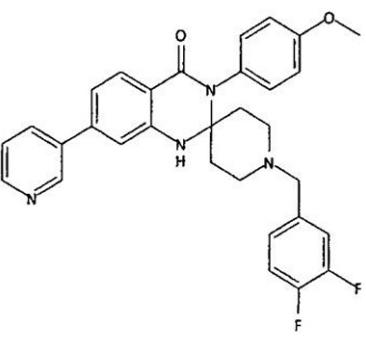
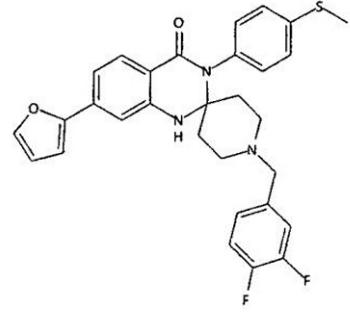
【表 7】

| | |
|----|---|
| 27 | <p>Chemical structure 27: A quinoline derivative substituted with a piperazine ring and a 4-(trifluoromethyl)phenyl group.</p> |
| 28 | <p>Chemical structure 28: A quinoline derivative substituted with a piperazine ring and a 4-phenylphenyl group.</p> |
| 29 | <p>Chemical structure 29: A quinoline derivative substituted with a piperazine ring, an ethyl ester group, and a 4-(trifluoromethyl)phenyl group.</p> |
| 30 | <p>Chemical structure 30: A quinoline derivative substituted with a piperazine ring, an ethyl ester group, and a 4-chlorophenyl group.</p> |
| 31 | <p>Chemical structure 31: A quinoline derivative substituted with a piperazine ring, an isopropyl ester group, and a 4-(trifluoromethyl)phenyl group.</p> |

【表 8】

| | |
|----|--|
| 32 | |
| 33 | |
| 34 | |
| 35 | |
| 36 | |

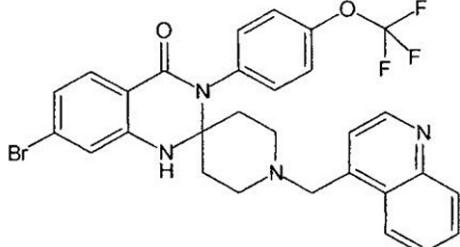
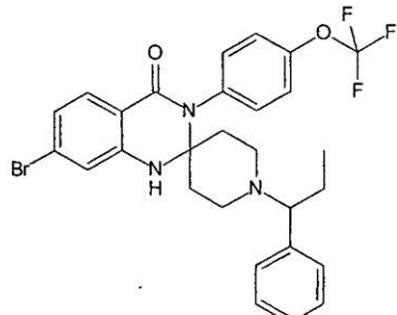
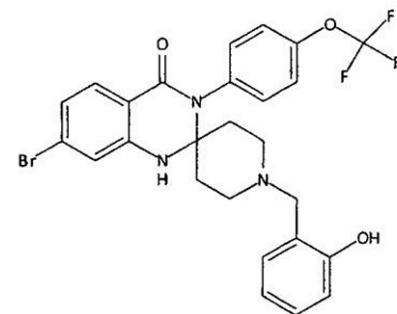
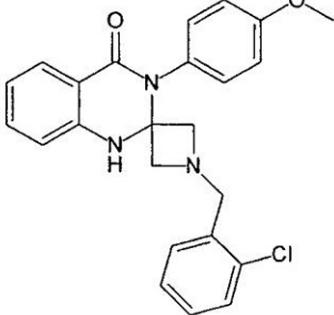
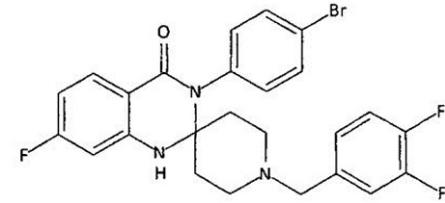
【表9】

| | |
|----|---|
| 37 |  |
| 38 |  |
| 39 |  |
| 40 |  |
| 41 |  |

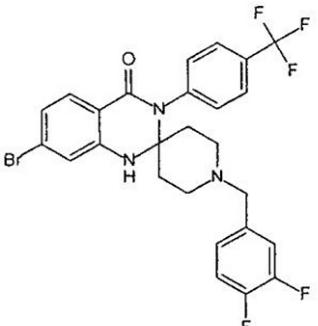
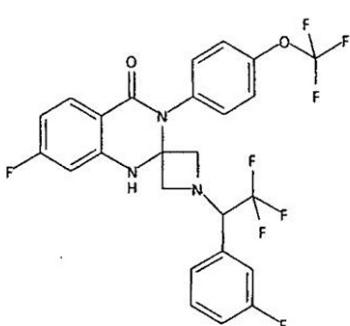
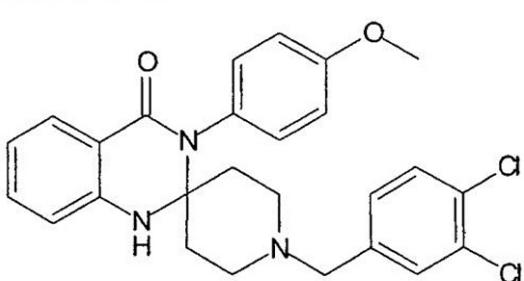
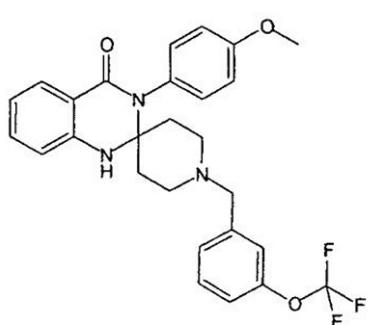
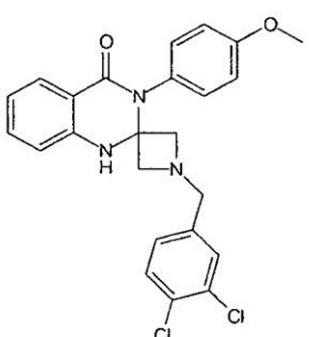
【表 10】

| | |
|----|--|
| 42 | |
| 43 | |
| 44 | |
| 45 | |
| 46 | |

【表 11】

| | |
|----|---|
| 47 |  |
| 48 |  |
| 49 |  |
| 50 |  |
| 51 |  |

【表 1 2】

| | |
|----|---|
| 52 |  |
| 53 |  |
| 54 |  |
| 55 |  |
| 56 |  |

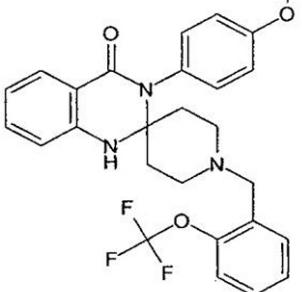
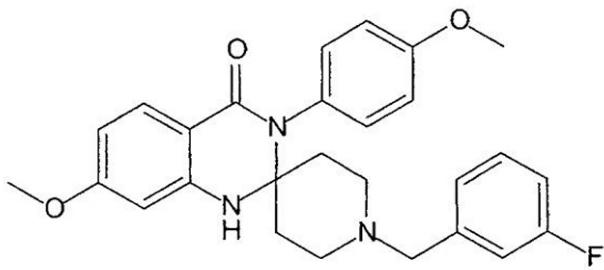
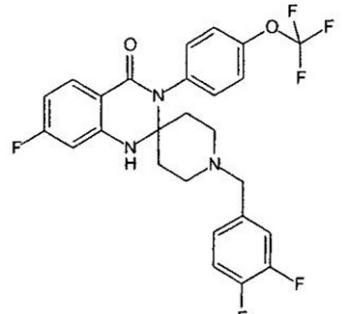
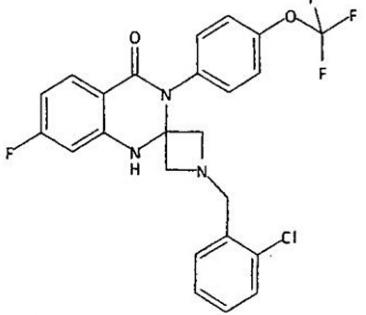
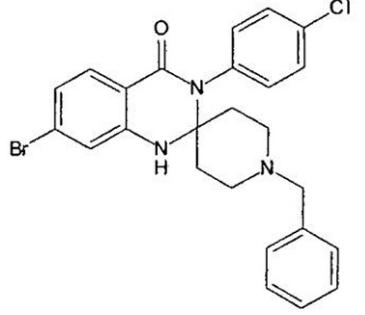
【表 1 3】

| | |
|----|--|
| 57 | <p>Chemical structure 57: A quinolinic acid derivative substituted with a piperazine ring and a 4-(difluoromethoxy)phenyl group.</p> |
| 58 | <p>Chemical structure 58: A quinolinic acid derivative substituted with a cyclopropylmethyl ester group and a 4-(difluoromethoxy)phenyl group.</p> |
| 59 | <p>Chemical structure 59: A quinolinic acid derivative substituted with a 4-methoxyphenyl group and a 2-chlorothiophene-5-methyl group.</p> |
| 60 | <p>Chemical structure 60: A quinolinic acid derivative substituted with a 4-methoxyphenyl group and a 4-fluorophenyl group.</p> |
| 61 | <p>Chemical structure 61: A quinolinic acid derivative substituted with a 4-chlorophenyl group and a 4-phenylbutyl group.</p> |

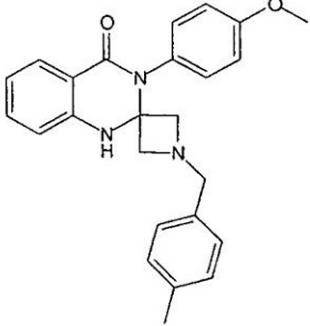
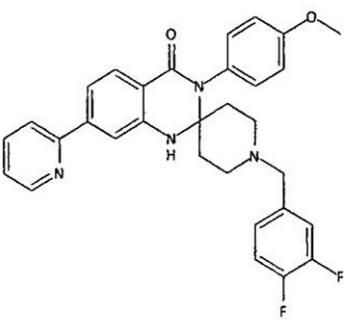
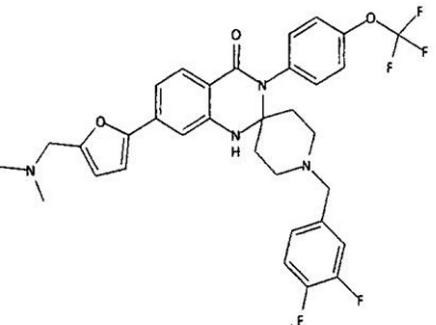
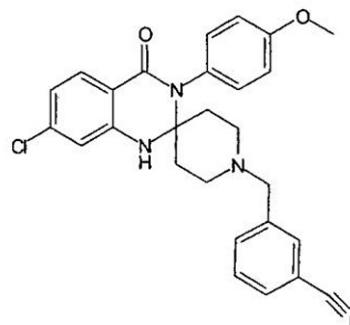
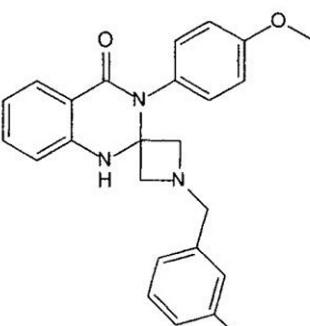
【表14】

| | |
|----|--|
| 62 | |
| 63 | |
| 64 | |
| 65 | |
| 66 | |

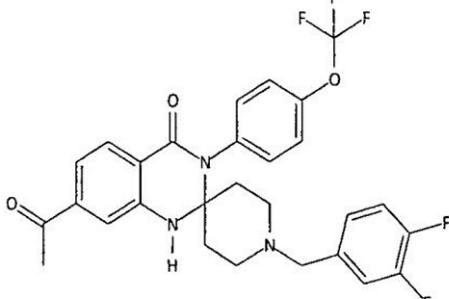
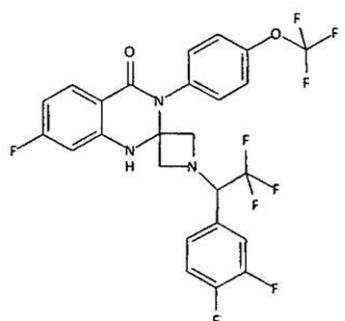
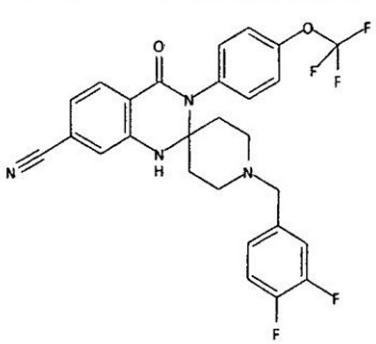
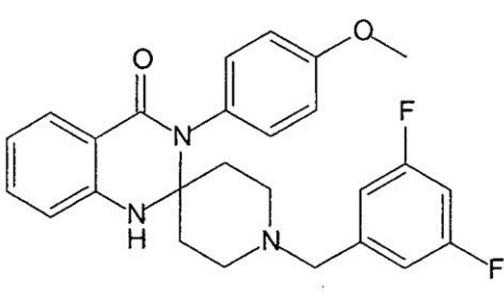
【表 15】

| | |
|----|---|
| 67 |  |
| 68 |  |
| 69 |  |
| 70 |  |
| 71 |  |

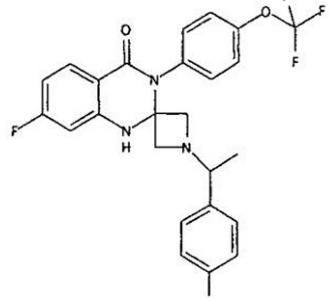
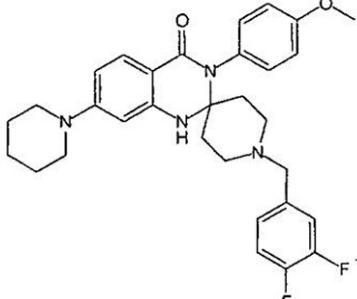
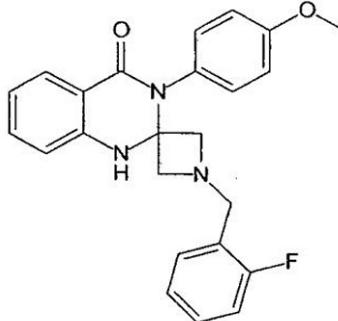
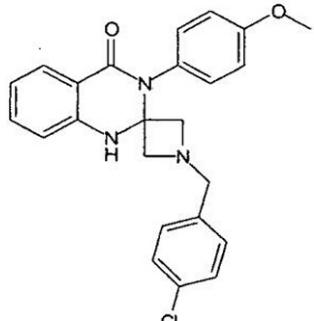
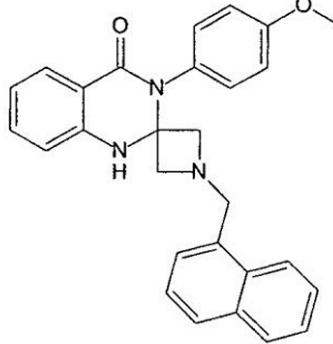
【表 16】

| | |
|----|---|
| 72 |  |
| 73 |  |
| 74 |  |
| 75 |  |
| 76 |  |

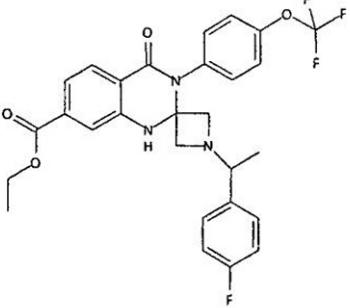
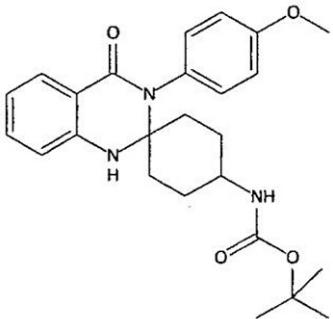
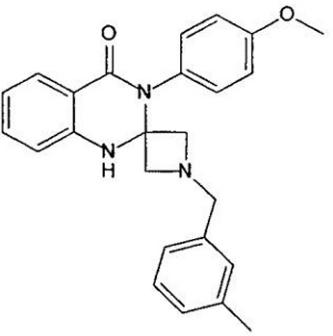
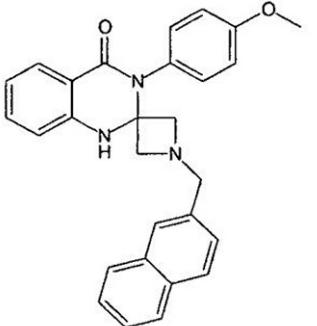
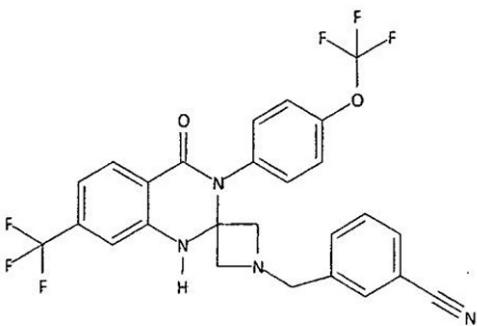
【表 17】

| | |
|----|---|
| 77 |  <p>Chemical structure 77: A quinolinic acid derivative substituted with a piperazine ring and a 4-(4-fluorophenyl)butyl group.</p> |
| 78 |  <p>Chemical structure 78: A quinolinic acid derivative substituted with a piperazine ring and a 4-(4-fluorophenyl)butyl group, where the piperazine ring is part of a larger fused ring system.</p> |
| 79 |  <p>Chemical structure 79: A quinolinic acid derivative substituted with a piperazine ring and a 4-(4-fluorophenyl)butyl group, where the piperazine ring has a cyano group attached.</p> |
| 80 |  <p>Chemical structure 80: A quinolinic acid derivative substituted with a piperazine ring and a 4-(4-fluorophenyl)butyl group, where the piperazine ring is part of a larger fused ring system.</p> |
| 81 |  <p>Chemical structure 81: A quinolinic acid derivative substituted with a piperazine ring and a 4-(4-fluorophenyl)butyl group, where the piperazine ring is part of a larger fused ring system.</p> |

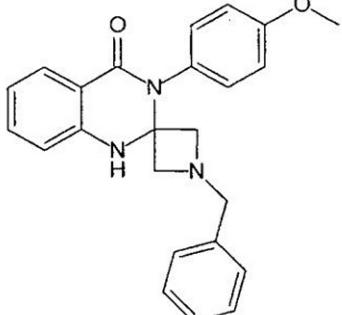
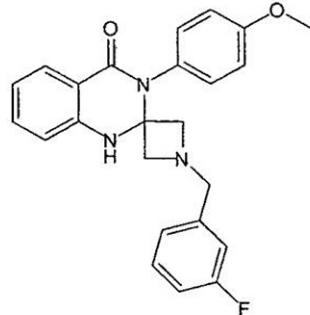
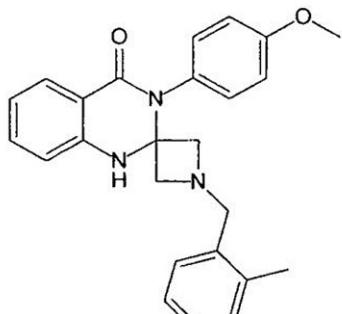
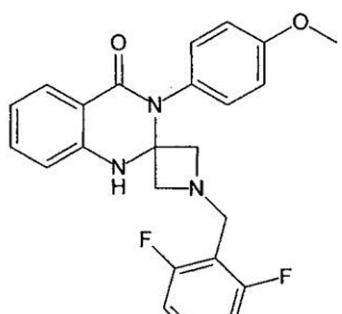
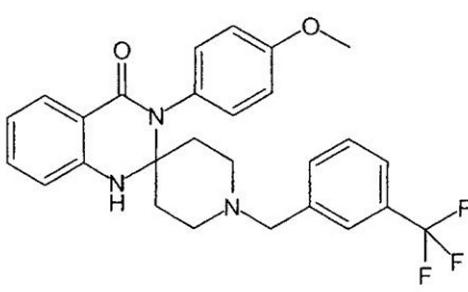
【表 18】

| | |
|----|---|
| 82 |  |
| 83 |  |
| 84 |  |
| 85 |  |
| 86 |  |

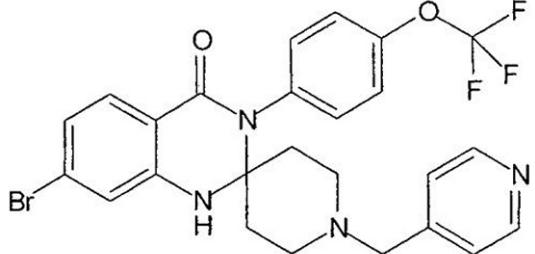
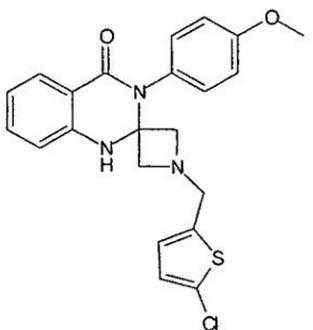
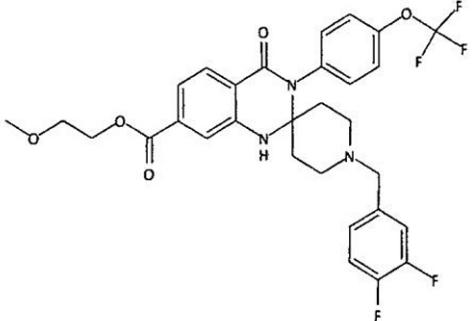
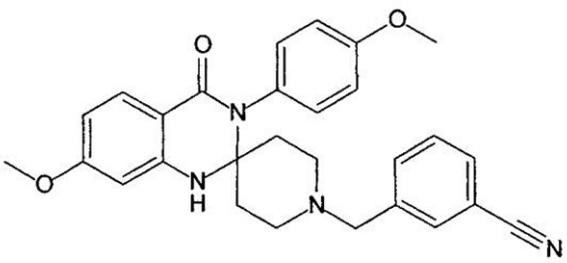
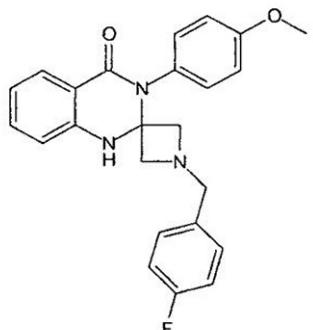
【表 19】

| | |
|----|---|
| 87 |  |
| 88 |  |
| 89 |  |
| 90 |  |
| 91 |  |

【表 20】

| | |
|----|---|
| 92 |  |
| 93 |  |
| 94 |  |
| 95 |  |
| 96 |  |

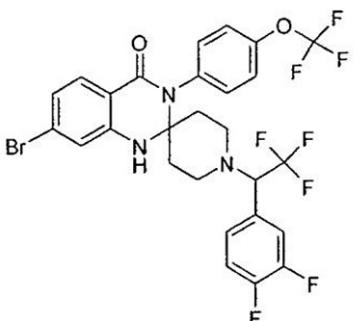
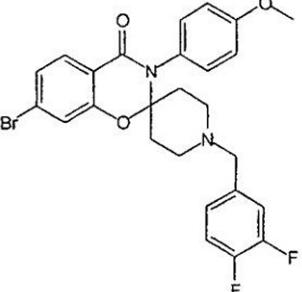
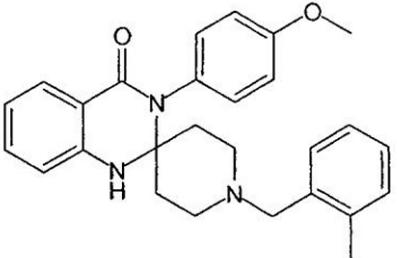
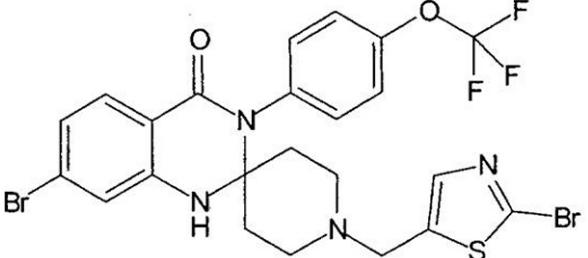
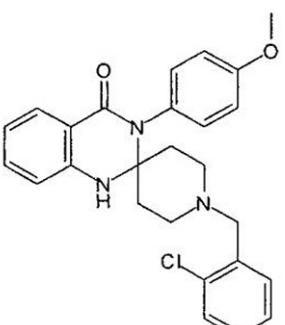
【表 2 1】

| | |
|-----|--|
| 97 |  |
| 98 |  |
| 99 |  |
| 100 |  |
| 101 |  |

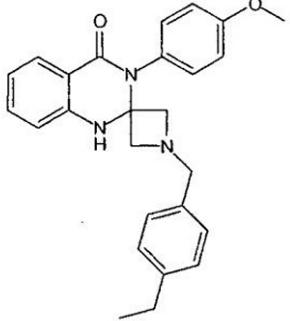
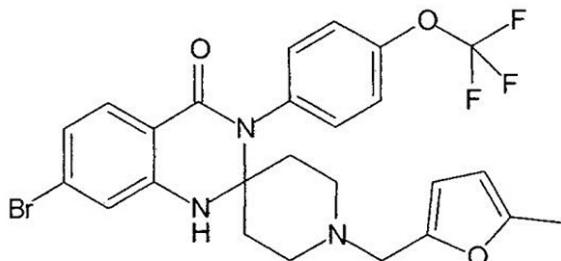
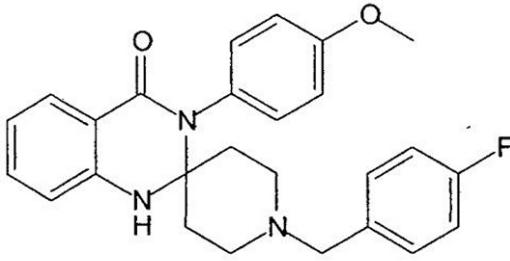
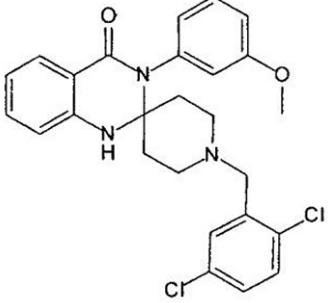
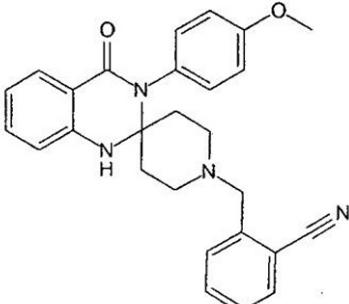
【表 2 2】

| | |
|-----|---|
| 102 | <p>Chemical structure 102: A quinolinic acid derivative substituted with a piperazine ring, a 4-chlorophenyl group, and a 4-(difluoromethoxy)phenyl group.</p> |
| 103 | <p>Chemical structure 103: A quinolinic acid derivative substituted with a piperazine ring, a 4-chlorophenyl group, and a 4-pyridylmethyl group.</p> |
| 104 | <p>Chemical structure 104: A quinolinic acid derivative substituted with a piperazine ring, a 4-chlorophenyl group, and a 4-(4-chlorophenylmethyl)phenyl group.</p> |
| 105 | <p>Chemical structure 105: A quinolinic acid derivative substituted with a piperazine ring, a 4-chlorophenyl group, and a 4-(4-isopropylphenylmethyl)phenyl group.</p> |
| 106 | <p>Chemical structure 106: A quinolinic acid derivative substituted with a piperazine ring, a 4-chlorophenyl group, and a 4-(4-(2-methoxyethyl)phenylmethyl)phenyl group.</p> |

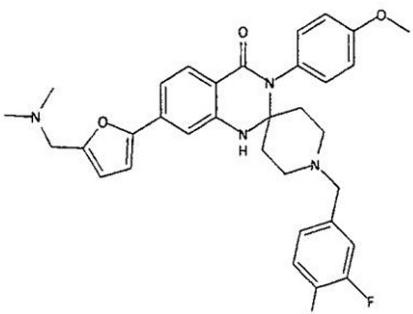
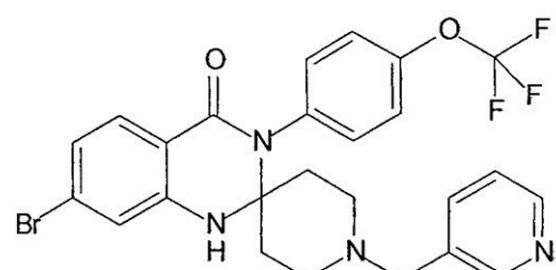
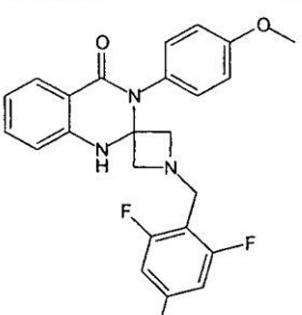
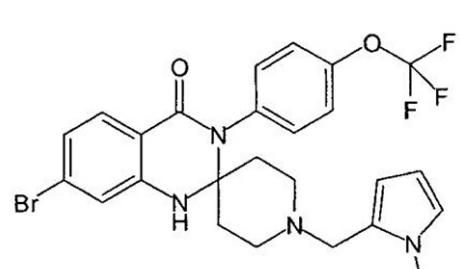
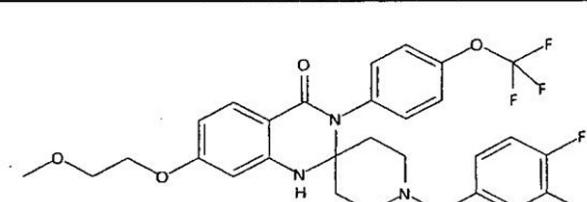
【表 2 3】

| | |
|-----|--|
| 107 |  |
| 108 |  |
| 109 |  |
| 110 |  |
| 111 |  |

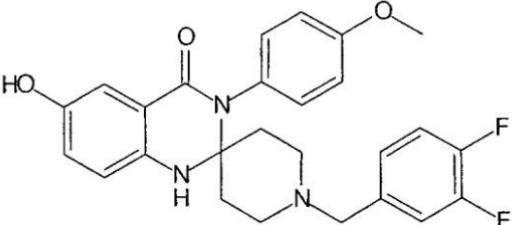
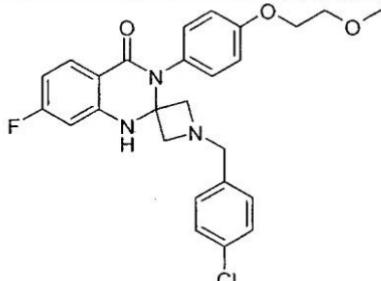
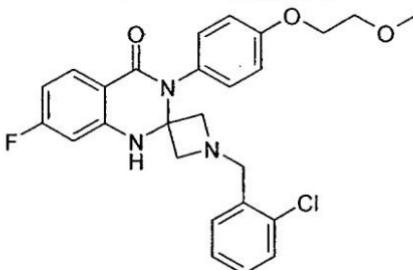
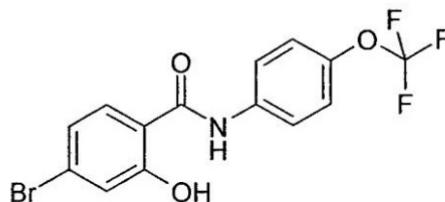
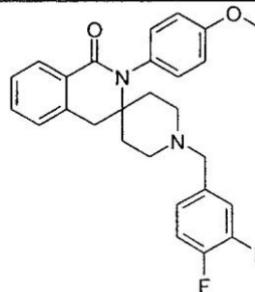
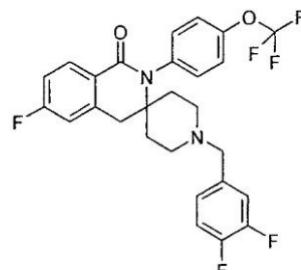
【表 2 4】

| | |
|-----|---|
| 112 |  |
| 113 |  |
| 114 |  |
| 115 |  |
| 116 |  |

【表 25】

| | |
|-----|---|
| 117 |  |
| 118 |  |
| 119 |  |
| 120 |  |
| 121 |  |

【表 26】

| | |
|-----|---|
| 122 |  |
| 123 |  |
| 124 |  |
| 125 |  |
| 126 |  |
| 127 |  |

からなる群から選択される、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれら

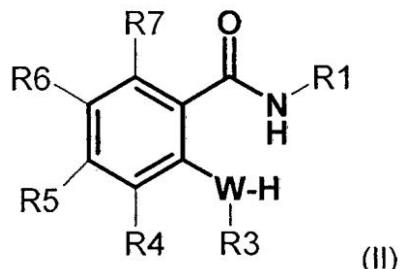
の生理学的に許容し得る塩、溶媒和物、互変異性体または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項 10】

式(Ⅰ)で表される化合物の製造方法であって、以下のステップ：

(a) 式(Ⅱ)

【化2】



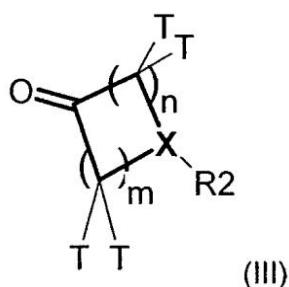
式中

W、R1、R3、R4、R5、R6、R7は、請求項1～8のいずれか一項において定義した通りである、

で表される化合物を、

式(Ⅲ)

【化3】

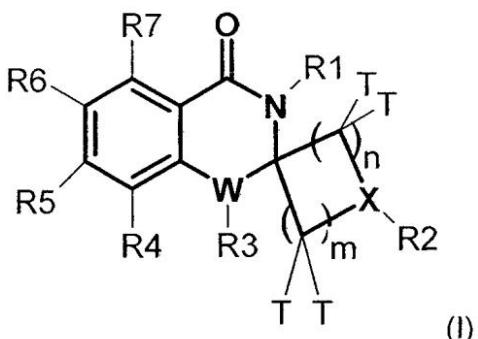


式中

X、R2、T、n、mは、請求項1～8のいずれか一項において定義した通りである、
で表される化合物と反応させて、

式(Ⅳ)

【化4】



式中

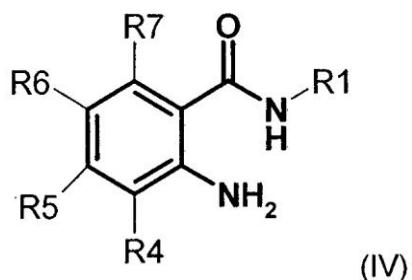
W、X、R1、R2、R3、R4、R5、R6、R7、T、n、mは、請求項1～8のいずれか一項において定義した通りである、

で表される化合物を得ること、

または

(b) 式(IV)

【化5】



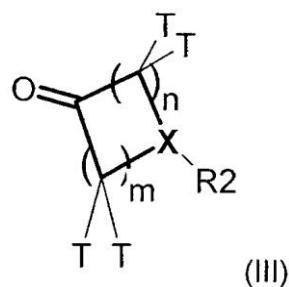
式中

R1、R4、R5、R6、R7は、請求項1～8のいずれか一項において定義した通りである、

で表される化合物を、

式(I)(II)

【化6】

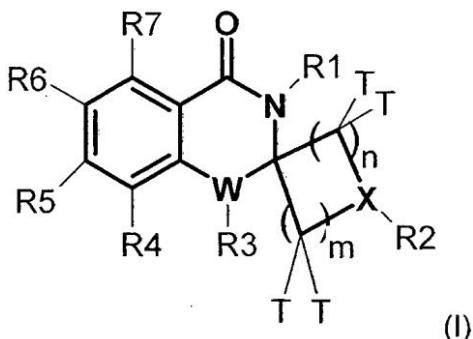


式中

X、R2、T、n、mは、請求項1～8のいずれか一項において定義した通りである、
で表される化合物と反応させて、

式(I)

【化7】



式中

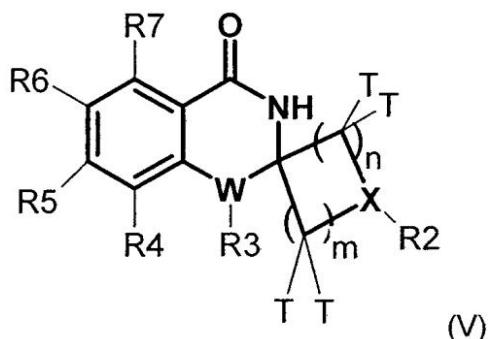
X、R1、R2、R4、R5、R6、R7、T、n、mは、請求項1～8のいずれか一項において定義した通りであり、Wは、Nであり、R3は、Hである；

で表される化合物を得ること、

または

(c) 式(V)

【化 8】



式中

W、X、R2、R3、R4、R5、R6、R7、T、n、mは、請求項1～8のいずれか一項において定義した通りである。

で表される化合物を、

式(VI)

Z-R1 (VI)

式中

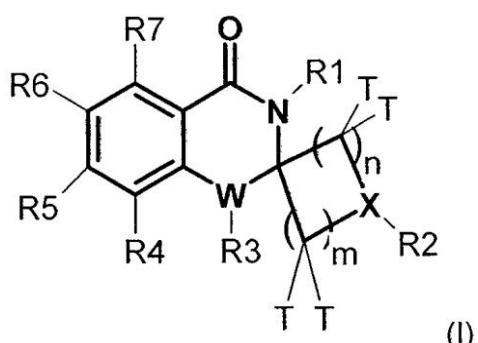
Zは、ハロゲン、ボロン酸またはボロン酸のエステルを示し、

R1は、請求項1～8のいずれか一項において定義した通りである。

で表される化合物と反応させて、

式(I)

【化9】



式中

W、X、R1、R2、R3、R4、R5、R6、R7、T、n、mは、請求項1～8のいずれか一項において定義した通りである；

で表される化合物を得ること、

ならびに任意に

(d) 式(I)で表される化合物の塩基または酸をその塩に変換することを含む、前記方法。

【請求項11】

請求項1～9のいずれか一項に記載の少なくとも1種の化合物を含む、代謝型グルタミン酸受容体サブタイプ4(mGluR4)を調節するための、および/またはグルタマートレベルもしくはグルタミン酸作動性シグナリングを変化させるための医薬。

【請求項12】

請求項1～9のいずれか一項に記載の少なくとも1種の化合物を含む、医薬。

【請求項13】

「中枢神経系障害、嗜癖、耐性または依存性、感情障害、例えば不安、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、外傷後ストレス障害(PTSD)、社会恐怖症、他の恐怖症、物質誘発不安障害、ならびに急性ストレス障害、気分障害、双極性障害(IおよびII)、気分循環性障害、うつ、気分変調性障害、大うつ病性障害、および物質誘発気分障害、精神疾患、例えば精神障害および注意欠陥多動性

障害、パーキンソン病、および運動障害、例えば動作緩慢、強剛性、ジストニア、薬剤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-DOPA誘発ジスキネジア、ドーパミンアゴニスト誘発ジスキネジア、運動過剰障害、ジル・ドゥ・ラ・トウレット症候群、安静時振戦、動作時振戦、無動、無動・強剛症候群、静坐不能、アテトーシス、固定姿勢保持困難、チック、姿勢の不安定、脳炎後パーキンソニズム、筋強剛、舞蹈病および舞蹈病形態運動、痙攣、ミオクローヌス、片側パリズム、進行性核上性麻痺、下肢静止不能症候群、および周期性四肢運動障害、認知障害、例えばせん妄、物質誘発持続性せん妄、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認知症コンプレックス、アルツハイマー病タイプの認知症、物質誘発持続性認知症、および軽度認知障害、神経障害、例えば神経変性、神経毒性、脊髄損傷、低酸素脳症、頭蓋内血腫、記憶障害、アルツハイマー病、認知症、振戦せん妄、神経変性、および神経毒性の他の形態、外傷性脳損傷に起因する炎症および/または神経変性、炎症性中枢神経系障害、例えば多発性硬化症、例えば良性多発性硬化症、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、および進行性・再発性多発性硬化症、片頭痛、てんかんおよび振戦、側頭葉てんかん、別の疾患または損傷に対して続発性のてんかん、例えば慢性脳炎、外傷性脳損傷、脳卒中または虚血、髄芽腫、炎症性または神経障害性疼痛、2型糖尿病、網膜の疾患または障害、網膜変性症または黄斑変性症、胃食道逆流症(GERD)、下部食道括約筋疾患または障害を含む消化管の疾患または障害、胃腸運動の疾患、大腸炎、クローン病または過敏性大腸症候群(IBS)、癌」からなる群から選択された生理学的および/または病態生理学的状態の処置および/または予防において使用するための、請求項1~9のいずれか一項に記載の少なくとも1種の化合物を含む医薬。

【請求項14】

かかる医薬が少なくとも1種の追加的な薬理学的に活性な物質を含む、請求項12~13のいずれか一項に記載の医薬。

【請求項15】

医薬を少なくとも1種の追加的な薬理学的に活性な物質での処置の前および/または間および/または後に適用する、請求項12~14のいずれか一項に記載の医薬。

【請求項16】

任意にさらに生理学的に許容し得る賦形剤、補助剤、アジュバント、希釈剤、担体および/または請求項1~9のいずれか一項に記載の化合物以外の追加的な薬理学的に活性な物質からなる群から選択された少なくとも1種の追加的な化合物を含む、治療的に有効な量の請求項1~9のいずれか一項に記載の少なくとも1種の化合物を含む医薬組成物。

【請求項17】

治療的に有効な量の請求項1~9のいずれか一項に記載の少なくとも1種の化合物および/または請求項16に記載の少なくとも1種の医薬組成物および治療的に有効な量の請求項1~9のいずれか一項に記載の化合物以外の少なくとも1種のさらなる薬理学的に活性な物質を含む、キット。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0153

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0153】

および軽度認知障害、神経障害、例えば神経変性、神経毒性または虚血、例えば脳卒中、脊髄損傷、低酸素脳症、頭蓋内血腫、記憶障害、アルツハイマー病、認知症、振戦せん妄、神経変性、神経毒性および虚血の他の形態、外傷性脳損傷に起因する炎症および/または神経変性、炎症性中枢神経系障害、例えば多発性硬化症、例えば良性多発性硬化症、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、

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 1 5 4

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 1 5 4】

および進行性・再発性多発性硬化症、片頭痛、てんかんおよび振戻、側頭葉てんかん、別の疾患または損傷に対して続発性のてんかん、例えば慢性脳炎、外傷性脳損傷、脳卒中または虚血、髄芽腫、炎症性または神経障害性疼痛、グルタマート機能障害と関連する代謝障害、2型糖尿病、網膜の疾患または障害、網膜変性症または黄斑変性症、胃食道逆流症（G E R D）、下部食道括約筋疾患または障害を含む消化管の疾患または障害、胃腸運動の疾患、大腸炎、クローン病または過敏性大腸症候群（I B S）、癌」。