

【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 17 年 12 月 22 日 (2005.12.22)

【公表番号】特表 2005-508289(P2005-508289A)

【公表日】平成 17 年 3 月 31 日 (2005.3.31)

【年通号数】公開・登録公報 2005-013

【出願番号】特願 2002-591455(P2002-591455)

【国際特許分類第 7 版】

C 07 D 211/58

A 61 K 31/4468

A 61 K 31/4525

A 61 K 31/4535

A 61 K 31/454

A 61 K 31/4545

A 61 P 1/00

A 61 P 25/04

A 61 P 25/22

C 07 D 401/06

C 07 D 405/06

C 07 D 409/06

C 07 D 417/06

【F I】

C 07 D 211/58

A 61 K 31/4468

A 61 K 31/4525

A 61 K 31/4535

A 61 K 31/454

A 61 K 31/4545

A 61 P 1/00

A 61 P 25/04

A 61 P 25/22

C 07 D 401/06

C 07 D 405/06

C 07 D 409/06

C 07 D 417/06

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 5 月 11 日 (2005.5.11)

【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

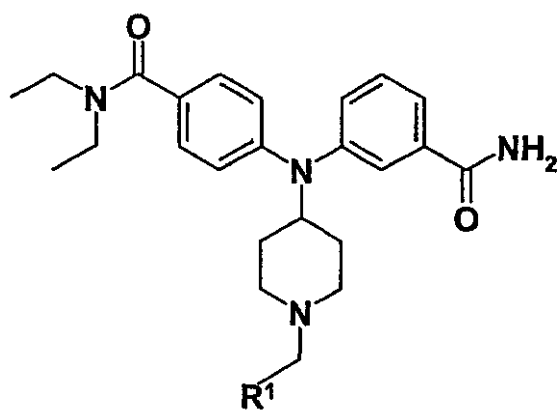
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

【化 1】



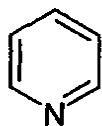
(式中、R¹は、
(i) フェニル；

【化 2】



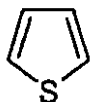
(ii) ピリジニル

【化 3】



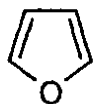
(iii) チエニル

【化 4】



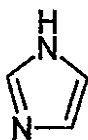
(iv) フラニル

【化 5】



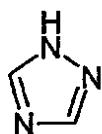
(v) イミダゾリル

【化 6】



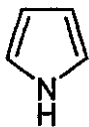
(vi) トリアゾリル

【化 7】



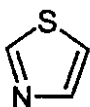
(vii) ピロリル

【化 8】



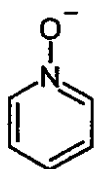
(viii) チアゾリル

【化 9】



(ix) ピリジル - N - オキシド

【化 10】



のいずれか一つから選ばれ、その際、 R^1 フェニル環及び R^1 複素芳香族環はそれぞれ独立して、直鎖及び分枝 $C_1 - C_6$ アルキル、 NO_2 、 CF_3 、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、クロロ、フルオロ、ブロモ及びヨードから独立して選ばれる 1、2 又は 3 個の置換基によってさらに置換されていてもよい) の化合物又はその塩。

【請求項 2】

R^1 フェニル環及び R^1 複素芳香族環がそれぞれ独立して、メチル、 CF_3 、クロロ、フルオロ、ブロモ及びヨードから独立して選ばれる 1、2 又は 3 個の置換基によってさらに置換されていてもよい請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

R^1 フェニル環及び R^1 複素芳香族環は、それぞれ独立してメチル基によってさらに置換されていてもよい請求項 1 記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 がフェニル、ピロリル、ピリジニル、チエニル又はフラニルである請求項 1 記載の化合物。

【請求項 5】

3 - [(1 - ベンジル - ピペリジン - 4 - イル) - (4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - アミノ] - ベンズアミド、

3 - [[1 - (2, 4 - ジクロロ - ベンジル) - ピペリジン - 4 - イル] - (4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - アミノ] - ベンズアミド、

3 - [(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - (1 - ピリジン - 4 - イルメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミノ] - ベンズアミド、

3 - { (4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - [1 - (1 - メチル - 1H - イミダゾール - 2 - イルメチル) - ピペリジン - 4 - イル] - アミノ } - ベンズアミド、

3 - [(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - (1 - フラン - 2 - イルメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミノ] - ベンズアミド、

3 - [[1 - (4 - ブロモ - ベンジル) - ピペリジン - 4 - イル] - (4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - アミノ] - ベンズアミド、

3 - { (4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - [1 - (4 - メチル - ベンジル) - ピペリジン - 4 - イル] - アミノ } - ベンズアミド、

3 - [(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - (1 - フラン - 3 - イルメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミノ] - ベンズアミド、

3 - [(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - (1 - チオフェン - 3 - イルメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミノ] - ベンズアミド、

3 - [(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - (1 - ピリジン - 2 - イルメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミノ] - ベンズアミド、

3 - { (4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - [1 - (3 H - イミダゾール - 4 - イルメチル) - ピペリジン - 4 - イル] - アミノ } - ベンズアミド、

3 - [(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - (1 - チアゾール - 2 - イルメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミノ] - ベンズアミド、

3 - [(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - (1 - チオフェン - 2 - イルメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミノ] - ベンズアミド、

3 - [(4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - (1 - ピリジン - 3 - イルメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミノ] - ベンズアミド、

3 - [[1 - (4 - クロロ - ベンジル) - ピペリジン - 4 - イル] - (4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - アミノ] - ベンズアミド、

3 - { (4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - [1 - (1 H - イミダゾール - 2 - イルメチル) - ピペリジン - 4 - イル] - アミノ } - ベンズアミド、

3 - { (4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - [1 - (4 - メトキシ - ベンジル) - ピペリジン - 4 - イル] - アミノ } - ベンズアミド、

3 - { (4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - [1 - (4 - フルオロ - ベンジル) - ピペリジン - 4 - イル] - アミノ } - ベンズアミド、

3 - { (4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - [1 - (1 H - ピロール - 2 - イルメチル) - ピペリジン - 4 - イル] - アミノ } - ベンズアミド及び

3 - { (4 - ジエチルカルバモイル - フェニル) - [1 - (1 - メチル - 1 H - ピロール - 2 - イルメチル) - ピペリジン - 4 - イル] - アミノ } - ベンズアミド

のいずれか一つから選ばれる請求項 1 記載の化合物。

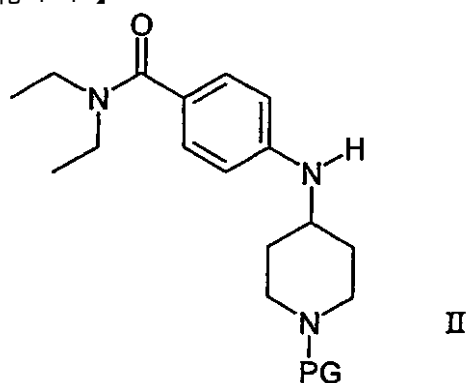
【請求項 6】

塩酸塩、二塩酸塩、硫酸塩、酒石酸塩、ジトリフルオロ酢酸塩又はクエン酸塩の形態の請求項 1 ~ 5 のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 7】

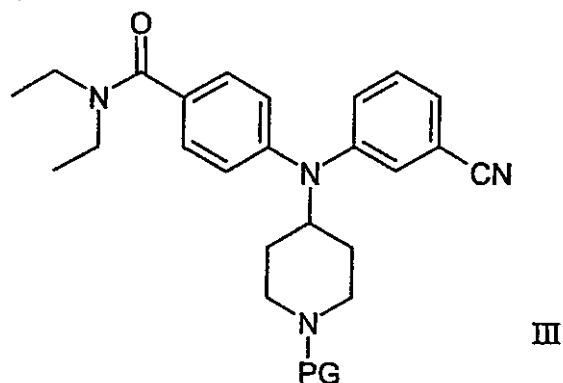
一般式 II

【化 1 1】



(式中、 P G は、ウレタン保護基、又はベンジルもしくは置換されたベンジル保護基である) の化合物を、塩基の存在下で、パラジウム触媒を用いて 3 - プロモベンゾニトリルと反応させて一般式 III

【化 1 2】

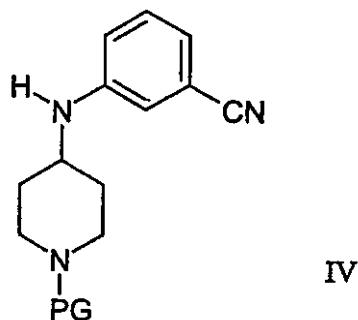


の化合物を得、その後、標準条件下で脱保護し、還元条件下で一般式 $R^1 - CHO$ の化合物を用いてアルキル化して一般式 I の化合物を得ることからなる式 I の化合物の製造方法。

【請求項 8】

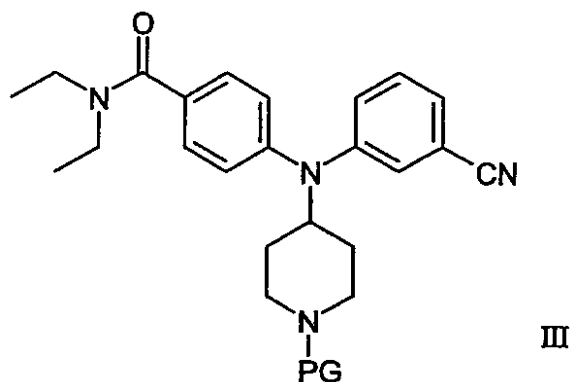
一般式 IV

【化 1 3】



(式中、PGは、ウレタン保護基、又はベンジルもしくは置換されたベンジル保護基である)の化合物を、塩基の存在下で、パラジウム触媒を用いてN,N-ジエチル-4-プロモベンズアミドと反応させて一般式 III

【化 1 4】



の化合物を得、これをその後、標準条件下で脱保護し、還元条件下で一般式 $R^1 - CHO$ の化合物を用いてアルキル化し、一般式 I の化合物を得ることからなる式 I の化合物の製造方法。

【請求項 9】

式 I の化合物又はその塩を有効成分として含有する医薬。

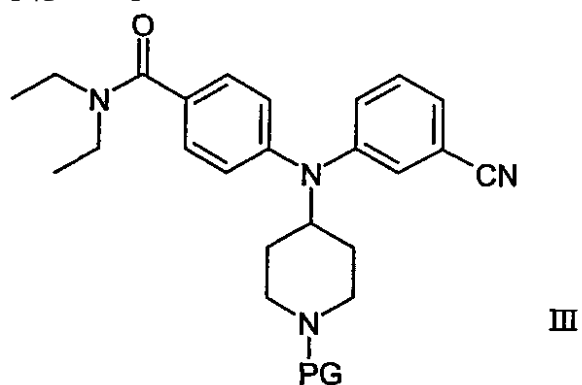
【請求項 10】

疼痛、不安症又は機能性胃腸障害の治療のための請求項 9 記載の医薬。

【請求項 11】

式 III

【化 1 5】

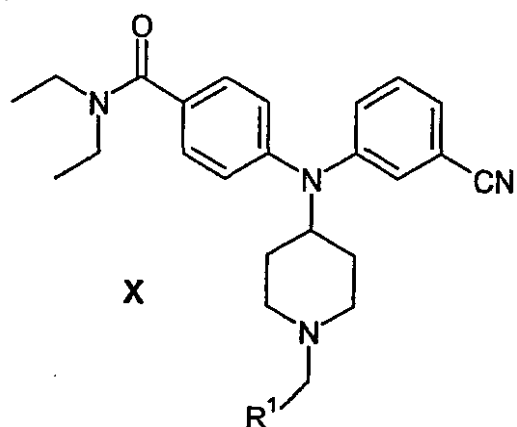


(式中、 P G は、ウレタン保護基、又はベンジルもしくは置換されたベンジル保護基である) の化合物。

【請求項 1 2】

式 X

【化 1 6】



(式中、 R¹ は、フェニル、ピリジニル、チエニル、フラニル、イミダゾリル、トリアゾリル、ピロリル、チアゾリル又はピリジル - N - オキシドのいずれか一つから選択される) の化合物。