

【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27年4月23日(2015.4.23)

【公表番号】特表2014-530810(P2014-530810A)

【公表日】平成26年11月20日(2014.11.20)

【年通号数】公開・登録公報2014-064

【出願番号】特願2014-534556(P2014-534556)

【国際特許分類】

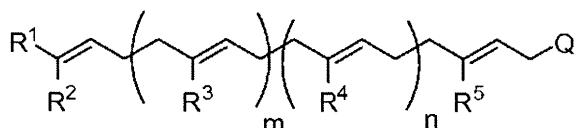
C 07 C 69/145 (2006.01)
C 07 C 69/24 (2006.01)
C 07 C 69/74 (2006.01)
C 07 C 69/75 (2006.01)
C 07 C 205/57 (2006.01)
C 07 C 69/738 (2006.01)
C 07 C 49/203 (2006.01)
C 07 C 49/533 (2006.01)
C 07 C 49/553 (2006.01)
C 07 C 49/255 (2006.01)
C 07 C 49/597 (2006.01)
C 07 C 49/603 (2006.01)
C 07 C 49/607 (2006.01)
C 07 C 309/66 (2006.01)
C 07 C 309/73 (2006.01)
C 07 C 251/40 (2006.01)
C 07 C 251/56 (2006.01)
C 07 C 271/12 (2006.01)
C 07 C 271/24 (2006.01)
C 07 D 317/12 (2006.01)
C 07 D 309/04 (2006.01)
C 07 D 319/06 (2006.01)
A 61 K 31/045 (2006.01)
A 61 K 31/232 (2006.01)
A 61 K 31/23 (2006.01)
A 61 K 31/11 (2006.01)
A 61 K 31/121 (2006.01)
C 07 D 307/46 (2006.01)
A 61 K 31/12 (2006.01)
A 61 K 31/122 (2006.01)
A 61 K 31/341 (2006.01)
A 61 K 31/16 (2006.01)
A 61 K 31/27 (2006.01)
A 61 K 31/21 (2006.01)
A 61 K 31/255 (2006.01)
A 61 K 31/235 (2006.01)
A 61 P 21/00 (2006.01)
A 61 P 25/00 (2006.01)
A 61 P 25/28 (2006.01)
A 61 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C	69/145	C S P
C 0 7 C	69/24	
C 0 7 C	69/74	Z
C 0 7 C	69/75	Z
C 0 7 C	205/57	
C 0 7 C	69/738	Z
C 0 7 C	49/203	Z
C 0 7 C	49/533	
C 0 7 C	49/553	
C 0 7 C	49/255	A
C 0 7 C	49/597	
C 0 7 C	49/603	
C 0 7 C	49/607	
C 0 7 C	309/66	
C 0 7 C	309/73	
C 0 7 C	251/40	
C 0 7 C	251/56	
C 0 7 C	271/12	
C 0 7 C	271/24	
C 0 7 D	317/12	
C 0 7 D	309/04	
C 0 7 D	319/06	
A 6 1 K	31/045	
A 6 1 K	31/232	
A 6 1 K	31/23	
A 6 1 K	31/11	
A 6 1 K	31/121	
C 0 7 D	307/46	
A 6 1 K	31/12	
A 6 1 K	31/122	
A 6 1 K	31/341	
A 6 1 K	31/16	
A 6 1 K	31/27	
A 6 1 K	31/21	
A 6 1 K	31/255	
A 6 1 K	31/235	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	43/00	1 1 1

【手続補正書】**【提出日】**平成27年2月6日(2015.2.6)**【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：
【化1】



の化合物

[式中、

m は0または1であり、

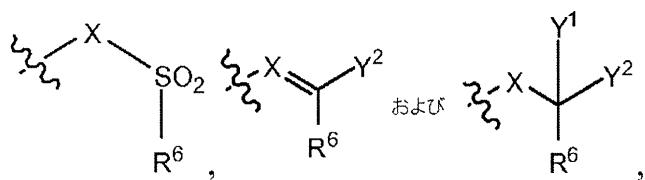
n は0、1または2であり、

各 R^1 および R^2 は独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであるか、または R^1 および R^2 は、それらが結合している炭素原子と一緒にになって、1~3個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基で任意選択により置換されている $C_5 \sim C_7$ シクロアルキル環を形成し、

R^3 、 R^4 および R^5 の各々は独立して、水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

Q は、

【化2】



からなる群から選択され、

X が単結合を介して結合されている場合、 X は $-O-$ 、 $-NR^7-$ または $-CR^8R^9-$ であり、 X が二重結合を介して結合されている場合、 X は $-CR^8-$ であり、

Y^1 は水素または $-OR^{10}$ であり、 Y^2 は $-OR^{11}$ または $-NHR^{12}$ であるか、または Y^1 および Y^2 は接合されることで、オキソ基($=O$)、イミン基($=NR^{13}$)、オキシム基($=N-OR^{14}$)、または置換もしくは非置換のビニリデン($=CR^{16}R^{17}$)を形成し、

R^6 は、1~3個のアルコキシ基または1~5個のハロ基で任意選択により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、または $C_2 \sim C_{10}$ ヘテロアリールであり、ここで、各シクロアルキルまたはヘテロシクリルは、1~3個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基で任意選択により置換されているか、または各アリールまたはヘテロアリールは独立して、1~3個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基またはニトロ基で置換されており、

R^7 は水素であるか、または R^6 および介在する原子と一緒にになって、1~3個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基で任意選択により置換されている5~7員環を形成し、

各 R^8 および R^9 は独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-COR^{81}$ または $-CO_2R^{81}$ であるか、または R^8 は、 R^6 および介在する原子と一緒にになって、1~3個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基で任意選択により置換されている5~7員のシクロアルキル環またはヘテロシクリル環を形成し、

R^{10} は $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

R^{11} および R^{12} は独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $-CO_2R^{15}$ 、または $-CON(R^{15})_2$ であるか、または R^{10} および R^{11} は、介在する炭素原子および酸素原子と一緒にになって、1~3個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基で任意選択により置換されているヘテロ環を形成し、

R^{13} は、1~3個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基で任意選択により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキルであり、

R^{14} は、水素、 $-CO_2H$ もしくはそのエステルで任意選択により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル、または $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ア

ルキニル、C₃～C₁₀シクロアルキル、もしくはC₃～C₈ヘテロシクリルであり、ここで、各シクロアルキル、ヘテロシクリルまたはアリールは、1～3個のアルキル基で任意選択により置換されており、

各R^{1～5}は独立して、水素、C₃～C₁₀シクロアルキル、-CO₂Hもしくはそのエステルからなる群から選択される1～3個の置換基で任意選択により置換されているC₁～C₆アルキル、C₆～C₁₀アリール、またはC₃～C₈ヘテロシクリルであるか、または2つのR^{1～5}基は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、5～7員のヘテロ環を形成し、

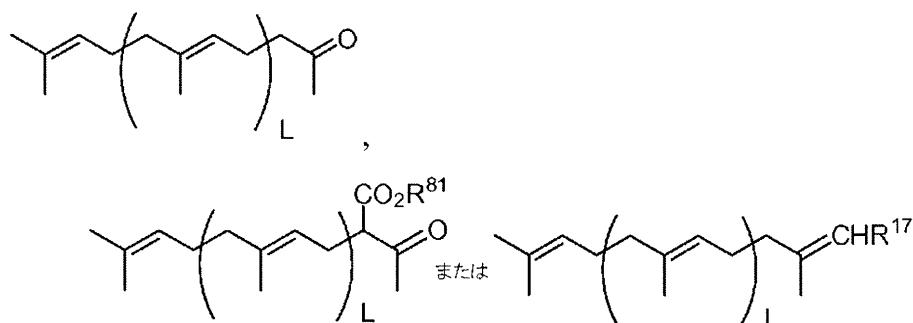
R^{1～6}は水素またはC₁～C₆アルキルであり、

R^{1～7}は、水素、1～3個のヒドロキシ基で置換されているC₁～C₆アルキル、-CHOであるか、またはCO₂Hもしくはそのエステルであり、

各R^{8～1}は独立して、C₁～C₆アルキルであり、

ただし、式：

【化3】

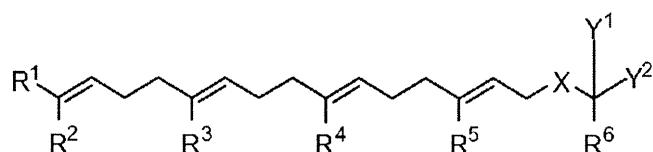


(式中、Lは0、1、2または3であり、R^{1～7}はCO₂Hもしくはそのエステルであるか、または-CH₂OHである)
の化合物は除外される]。

【請求項2】

式：

【化4】

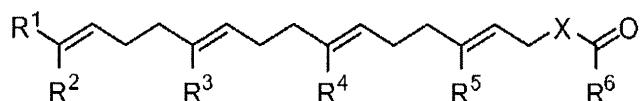


[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、X、Y¹およびY²は、請求項1における通りに定義されている]
の、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

式：

【化5】

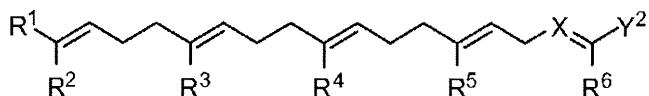


[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶およびXは、請求項1における通りに定義されている]
の、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

式：

【化6】



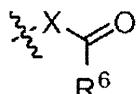
[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、XおよびY²は、請求項1における通りに定義されている]

の、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

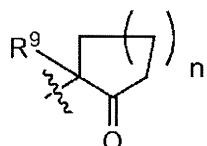
部分：

【化7】



が、構造：

【化8】



[式中、R⁹が水素、アルキル、または-CO₂R⁸¹であり、nが1、2または3である]

を有する、請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

(i) 神経傷害または神経死のリスクがあるニューロンの神経保護、
 (ii) ニューロンの軸索成長を増加させること、
 (iii) ニューロン細胞死に感受性のニューロンの細胞死を阻害すること、
 (iv) ニューロンの神経突起成長を増加させること、ならびに／または
 (v) ニューロン由来の1種または複数の神経伝達物質の発現および／もしくは放出を増加させることを含む神経刺激
 の1つまたは複数を必要とするニューロンを処置するための方法であって、請求項1から5のいずれか一項に記載の化合物の有効量と前記ニューロンとを接触させることを含む方法。

【請求項7】

接触前のニューロンが、
 (i) 軸索成長能力における低減、
 (ii) 1種または複数の神経伝達物質の発現レベルの低減、
 (iii) シナプスの形成における低減、および／または
 (iv) 電気的興奮性における低減
 の1つまたは複数を呈する、請求項6に記載の方法。

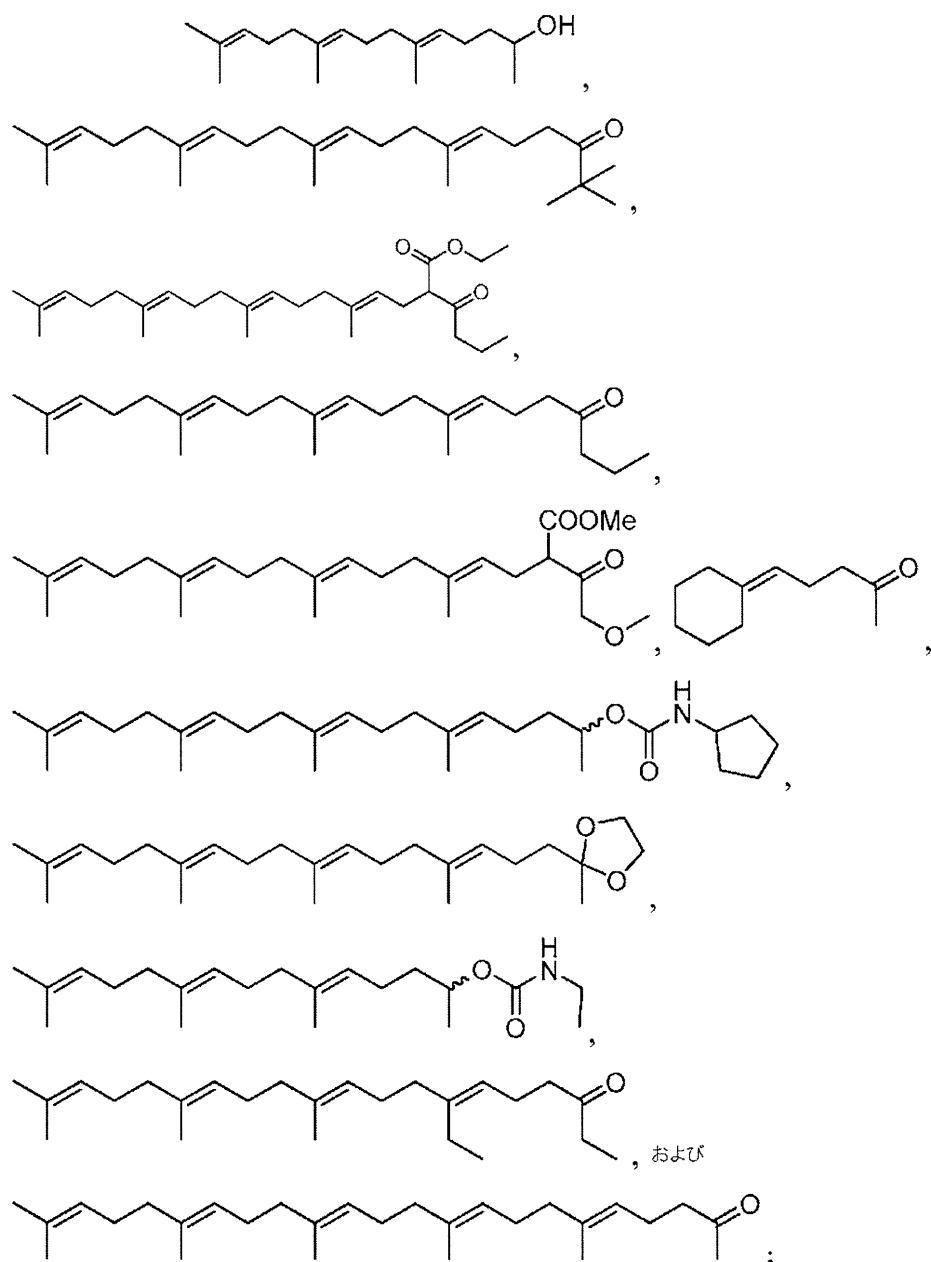
【請求項8】

神経刺激が、
 (i) ニューロンのシナプス形成を増強または誘発すること、
 (ii) ニューロンの電気的興奮性を増加または増強すること、
 (iii) ニューロン中のGタンパク質の活性をモジュレートすること、および
 (iv) ニューロン中のGタンパク質の活性化を増強すること
 の1つまたは複数をさらに含む、請求項7に記載の方法。

【請求項9】

前記化合物が、

【化9】



からなる群から選択され、有効量が 1 μM 未満である、請求項6に記載の方法。