

【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 0 7 C	69/145	(2006.01)
C 0 7 C	69/24	(2006.01)
C 0 7 C	69/74	(2006.01)
C 0 7 C	69/75	(2006.01)
C 0 7 C	205/57	(2006.01)
C 0 7 C	69/738	(2006.01)
C 0 7 C	49/203	(2006.01)
C 0 7 C	49/533	(2006.01)
C 0 7 C	49/553	(2006.01)
C 0 7 C	49/255	(2006.01)
C 0 7 C	49/597	(2006.01)
C 0 7 C	49/603	(2006.01)
C 0 7 C	49/607	(2006.01)
C 0 7 C	309/66	(2006.01)
C 0 7 C	309/73	(2006.01)
C 0 7 C	251/40	(2006.01)
C 0 7 C	251/56	(2006.01)
C 0 7 C	271/12	(2006.01)
C 0 7 C	271/24	(2006.01)
C 0 7 D	317/12	(2006.01)
C 0 7 D	309/04	(2006.01)
C 0 7 D	319/06	(2006.01)
A 6 1 K	31/045	(2006.01)
A 6 1 K	31/232	(2006.01)
A 6 1 K	31/23	(2006.01)
A 6 1 K	31/11	(2006.01)
A 6 1 K	31/121	(2006.01)
C 0 7 D	307/46	(2006.01)
A 6 1 K	31/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/122	(2006.01)
A 6 1 K	31/341	(2006.01)
A 6 1 K	31/16	(2006.01)
A 6 1 K	31/27	(2006.01)
A 6 1 K	31/21	(2006.01)
A 6 1 K	31/255	(2006.01)
A 6 1 K	31/235	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 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

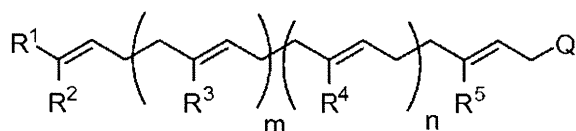
【補正の内容】

【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、

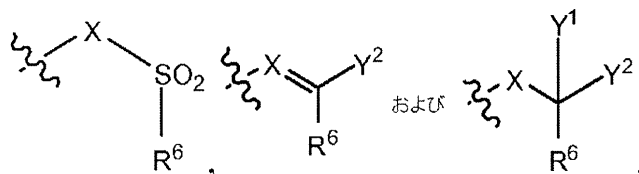
n は 0、1 または 2 であり、

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、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、オキシ基 ( $=O$ )、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ピニリデン ( $=CR^{16}R^{17}$ ) 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、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  $-COR^{82}$  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、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、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、 $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル、もしくは  $C_3 \sim C_8$  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  $R^{15}$  は独立して、水素、 $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル、 $-CO_2H$  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  $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_6 \sim C_{10}$  アリール、または  $C_3 \sim C_8$  ヘテロシクリルであるか、または2つの  $R^{15}$  基は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、5～7員のヘテロ環を形成し、

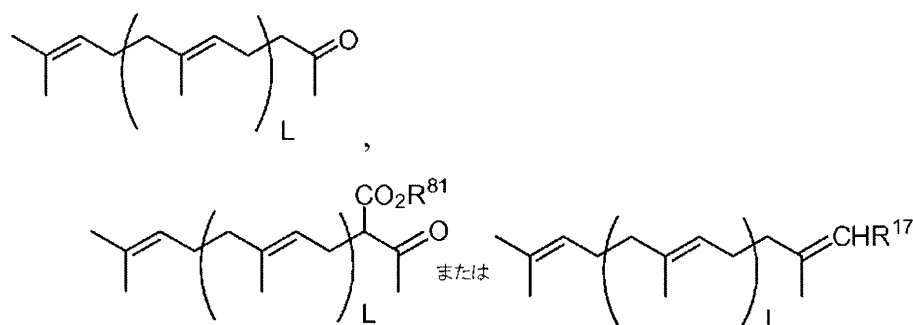
$R^{16}$  は水素または  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり、

$R^{17}$  は、水素、1～3個のヒドロキシ基で置換されている  $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-CHO$  であるか、または  $-CO_2H$  もしくはそのエステルであり、

各  $R^{18}$  は独立して、 $C_1 \sim C_6$  アルキルであり、

ただし、式：

【化3】

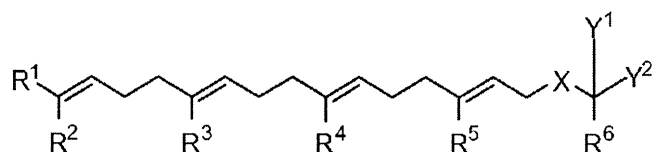


(式中、 $L$  は0、1、2または3であり、 $R^{17}$  は  $-CO_2H$  もしくはそのエステルであるか、または  $-CH_2OH$  である) の化合物は除外される]。

【請求項2】

式：

【化4】



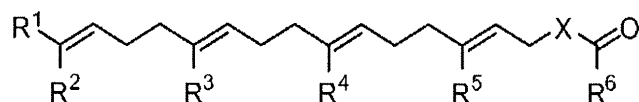
[式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $X$ 、 $Y^1$  および  $Y^2$  は、請求項1における通りに定義されている]

の、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

式：

【化5】



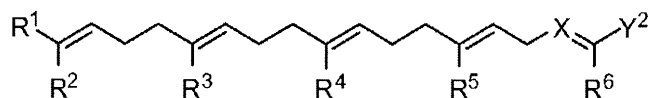
[式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  および  $X$  は、請求項1における通りに定義されている]

の、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

式：

## 【化 6】



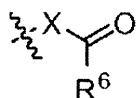
[ 式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、XおよびY<sup>2</sup>は、請求項1における通りに定義されている ]

の、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項5】

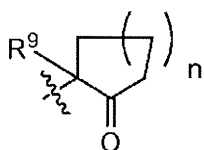
部分：

## 【化 7】



が、構造：

## 【化 8】



[ 式中、R<sup>9</sup>が水素、アルキル、または-CO<sub>2</sub>R<sup>8 1</sup>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、  
 ( i i ) ニューロンの軸索成長を増加させること、  
 ( i i i ) 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、  
 ( i v ) 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つまたは複数が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、  
 ( i i ) 1種または複数の神経伝達物質の発現レベルの低減、  
 ( i i i ) シナプスの形成における低減、および / または  
 ( i v ) 電氣的興奮性における低減

の1つまたは複数呈する、請求項6に記載の方法。

## 【請求項8】

神経刺激が、

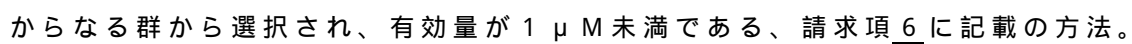
( i ) ニューロンのシナプス形成を増強または誘発すること、  
 ( i i ) ニューロンの電氣的興奮性を増加または増強すること、  
 ( i i i ) ニューロン中のGタンパク質の活性をモジュレートすること、および  
 ( i v ) ニューロン中のGタンパク質の活性化を増強すること

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  $1 \mu\text{M}$  未満である、請求項 6 に記載の方法。