

【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20年7月31日(2008.7.31)

【公表番号】特表2007-509043(P2007-509043A)

【公表日】平成19年4月12日(2007.4.12)

【年通号数】公開・登録公報2007-014

【出願番号】特願2006-534356(P2006-534356)

【国際特許分類】

C 0 7 C	233/64	(2006.01)
C 0 7 D	319/18	(2006.01)
C 0 7 D	221/12	(2006.01)
C 0 7 D	307/14	(2006.01)
C 0 7 D	317/58	(2006.01)
C 0 7 D	333/20	(2006.01)
C 0 7 D	317/66	(2006.01)
C 0 7 D	213/75	(2006.01)
C 0 7 D	213/40	(2006.01)
C 0 7 D	233/61	(2006.01)
C 0 7 D	295/12	(2006.01)
C 0 7 D	231/40	(2006.01)
C 0 7 D	277/20	(2006.01)
C 0 7 D	277/46	(2006.01)
C 0 7 D	209/14	(2006.01)
C 0 7 D	211/58	(2006.01)
C 0 7 D	209/08	(2006.01)
C 0 7 D	239/42	(2006.01)
C 0 7 D	471/04	(2006.01)
C 0 7 D	215/38	(2006.01)
C 0 7 D	233/64	(2006.01)
C 0 7 D	307/52	(2006.01)
C 0 7 D	209/88	(2006.01)
C 0 7 D	217/02	(2006.01)
C 0 7 D	213/82	(2006.01)
C 0 7 D	405/12	(2006.01)
C 0 7 D	401/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/166	(2006.01)
A 6 1 K	31/167	(2006.01)
A 6 1 K	31/357	(2006.01)
A 6 1 K	31/473	(2006.01)
A 6 1 K	31/341	(2006.01)
A 6 1 K	31/36	(2006.01)
A 6 1 K	31/381	(2006.01)
A 6 1 K	31/44	(2006.01)
A 6 1 K	31/4409	(2006.01)
A 6 1 K	31/4164	(2006.01)
A 6 1 K	31/40	(2006.01)
A 6 1 K	31/4406	(2006.01)
A 6 1 K	31/415	(2006.01)
A 6 1 K	31/426	(2006.01)

A 6 1 K	31/5375	(2006.01)
A 6 1 K	31/4402	(2006.01)
A 6 1 K	31/4045	(2006.01)
A 6 1 K	31/495	(2006.01)
A 6 1 K	31/445	(2006.01)
A 6 1 K	31/505	(2006.01)
A 6 1 K	31/4745	(2006.01)
A 6 1 K	31/403	(2006.01)
A 6 1 K	31/4433	(2006.01)
A 6 1 K	31/4725	(2006.01)
A 6 1 K	31/4439	(2006.01)
A 6 1 K	31/443	(2006.01)
A 6 1 P	25/04	(2006.01)
A 6 1 P	37/02	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/22	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/20	(2006.01)
A 6 1 P	25/18	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	13/08	(2006.01)
A 6 1 P	13/10	(2006.01)
A 6 1 P	13/02	(2006.01)
A 6 1 P	1/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 P	27/16	(2006.01)
A 6 1 P	11/16	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	17/04	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/14	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	3/06	(2006.01)
A 6 1 P	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	19/08	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
C 0 7 C	233/65	(2006.01)
C 0 7 C	233/75	(2006.01)
C 0 7 C	233/68	(2006.01)
C 0 7 C	233/66	(2006.01)
C 0 7 C	233/78	(2006.01)

C 0 7 C 233/80 (2006.01)

C 0 7 C 231/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 233/64 C S P

C 0 7 D 319/18

C 0 7 D 221/12

C 0 7 D 307/14

C 0 7 D 317/58

C 0 7 D 333/20

C 0 7 D 317/66

C 0 7 D 213/75

C 0 7 D 213/40

C 0 7 D 233/61 1 0 3

C 0 7 D 295/12 Z

C 0 7 D 231/40

C 0 7 D 277/46

C 0 7 D 209/14

C 0 7 D 295/12 A

C 0 7 D 211/58

C 0 7 D 209/08

C 0 7 D 239/42 Z

C 0 7 D 471/04 1 1 2 Z

C 0 7 D 215/38

C 0 7 D 233/64 1 0 5

C 0 7 D 307/52

C 0 7 D 209/88

C 0 7 D 217/02

C 0 7 D 213/82

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 401/12

A 6 1 K 31/166

A 6 1 K 31/167

A 6 1 K 31/357

A 6 1 K 31/473

A 6 1 K 31/341

A 6 1 K 31/36

A 6 1 K 31/381

A 6 1 K 31/44

A 6 1 K 31/4409

A 6 1 K 31/4164

A 6 1 K 31/40

A 6 1 K 31/4406

A 6 1 K 31/415

A 6 1 K 31/426

A 6 1 K 31/5375

A 6 1 K 31/4402

A 6 1 K 31/4045

A 6 1 K 31/495

A 6 1 K 31/445

A 6 1 K 31/505

A 6 1 K	31/4745	
A 6 1 K	31/403	
A 6 1 K	31/4433	
A 6 1 K	31/4725	
A 6 1 K	31/4439	
A 6 1 K	31/443	
A 6 1 P	25/04	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/06	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/22	
A 6 1 P	25/24	
A 6 1 P	25/20	
A 6 1 P	25/18	
A 6 1 P	25/08	
A 6 1 P	13/08	
A 6 1 P	13/10	
A 6 1 P	13/02	
A 6 1 P	1/00	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	27/16	
A 6 1 P	11/16	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	17/04	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	17/14	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	3/06	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	19/08	
A 6 1 P	13/12	
C 0 7 C	233/65	
C 0 7 C	233/75	
C 0 7 C	233/68	
C 0 7 C	233/66	
C 0 7 C	233/78	
C 0 7 C	233/80	
C 0 7 C	231/02	

【提出日】平成20年6月16日(2008.6.16)

【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

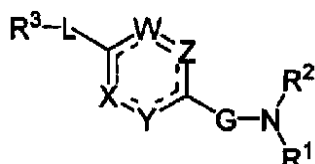
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の式：

【化1】



を有する化合物、またはその薬学的に受容可能な塩もしくは立体異性体であって、ここで：

W、X、YおよびZの各々が、NおよびC R⁴から独立して選択され；

Lは、置換もしくは非置換の - (C R⁵ = C R⁶) - または置換もしくは非置換の - (C C) - であり；

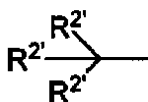
GはC = Oであり；

R¹は、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のシクロヘテロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

R²は、水素であり；

R³は、CF₃、n-プロピルまたは以下の式：

【化2】



の基であり；

ここでR^{2'}の各々は、R^{2'}のうちの少なくとも2つがアルキルであるという条件で、水素またはアルキルであり；そしてここでアルキルである2つのR^{2'}は、一緒になって3～8個の原子のシクロアルキル環またはシクロヘテロアルキル環を形成し得；

各々のR⁴は、独立して、水素、アルキル、置換もしくは非置換のアルキル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アルキルチオ、アルコキシ、アルコキシカルボニル、アルキルアリールアミノ、アリールアルキルオキシ、アミノ、アリール、アリールアルキル、スルフィニル、スルホニル、スルファニル、アミノスルホニル、アリールスルホニル、スルホ、置換スルホ、ジヒドロキシホスホリル、アミノヒドロキシホスホリル、アジド、カルボキシ、カルバモイル、カルボキシル、シアノ、シクロヘテロアルキル、ジアルキルアミノ、ハロ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアルキル、ヒドロキシル、ニトロ、またはチオールであり；そして

R⁵およびR⁶の各々は、独立して、H、ハロであるかまたは、置換もしくは非置換の脂肪族、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、置換もしくは非置換のアラルキルまたは置換もしくは非置換のヘテロアラルキルである、化合物。

【請求項2】

W、Z、XおよびYの各々がCHである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R¹が、置換もしくは非置換のピロリジニル、置換もしくは非置換のペピリジニル、または置換もしくは非置換のモルホリニルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 が、置換もしくは非置換のピリジニルまたは置換もしくは非置換のピリミジニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

R^1 が、置換もしくは非置換のフラニル、置換もしくは非置換のイミダゾリル、置換もしくは非置換のチオフェニル、置換もしくは非置換のピラゾリルまたは置換もしくは非置換のチアゾリルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

R^1 が、置換もしくは非置換のベンゾジオキサニル、置換もしくは非置換のベンゾピラニル、置換もしくは非置換のインドリル、置換もしくは非置換のインダゾリル、置換もしくは非置換のメチレンジオキシフェニル、置換もしくは非置換のキノリニル、置換もしくは非置換のイソキノリニル、置換もしくは非置換のテトラヒドロキノリニル、置換もしくは非置換のテトラヒドロイソキノリニル、置換もしくは非置換のヒジドロキノリニルまたは置換もしくは非置換のジヒドロイソキノリニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

R^1 が、置換もしくは非置換のキノリニルまたは置換もしくは非置換のイソキノリニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

W、X、Y および Z の各々が CR^4 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

W が N であり、そして X、Y および Z の各々が CR^4 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

Y が N であり、そして W、X および Z の各々が CR^4 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

W、X、Y および Z のうちのいずれか 2 つが N である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 12】

R^5 および R^6 のうちの一方がメチルであり、他方が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 13】

R^5 および R^6 の各々が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 14】

R^3 が、t - Bu、i - Pr、シクロプロピルまたはシクロブチルである、請求項 1 に記載の化合物。

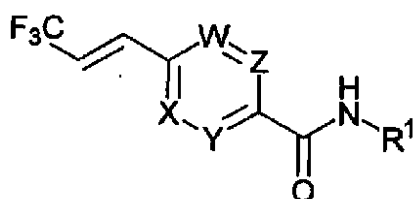
【請求項 15】

R^3 が CF_3 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 16】

以下の式：

【化 3】



を有する化合物、または、その薬学的に受容可能な塩もしくは立体異性体であって、ここで：

W、X、Y および Z の各々が、独立して CR^4 から選択され；

R^1 が、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のシクロヘテロアルキルまたは置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

各々の R^4 は、独立して、水素、アルキル、置換もしくは非置換のアルキル、アシル、

アルキルチオ、アルコキシ、アルコキシカルボニル、アリーラルアルキルオキシ、アリーラル、アリーラルアルキル、スルフィニル、スルホニル、スルファニル、アミノスルホニル、アリーラルスルホニル、スルホ、置換スルホ、ジヒドロキシホスホリル、アミノヒドロキシホスホリル、アジド、カルボキシ、カルバモイル、カルボキシル、シアノ、シクロヘテロアルキル、ジアルキルアミノ、ハロ、ヘテロアリーラルオキシ、ヘテロアリーラル、ヘテロアルキル、ヒドロキシル、ニトロ、またはチオールである、化合物。

【請求項 17】

W、X、Y および Z の各々が C H である、請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 18】

R¹ が、置換もしくは非置換のピロリル、置換もしくは非置換のピリジニル、置換もしくは非置換のピリミジニル、置換もしくは非置換のフラニル、置換もしくは非置換のイミダゾリル、置換もしくは非置換のチオフェニル、置換もしくは非置換のピラゾリルまたは置換もしくは非置換のチアゾリルである、請求項 16 または 17 に記載の化合物。

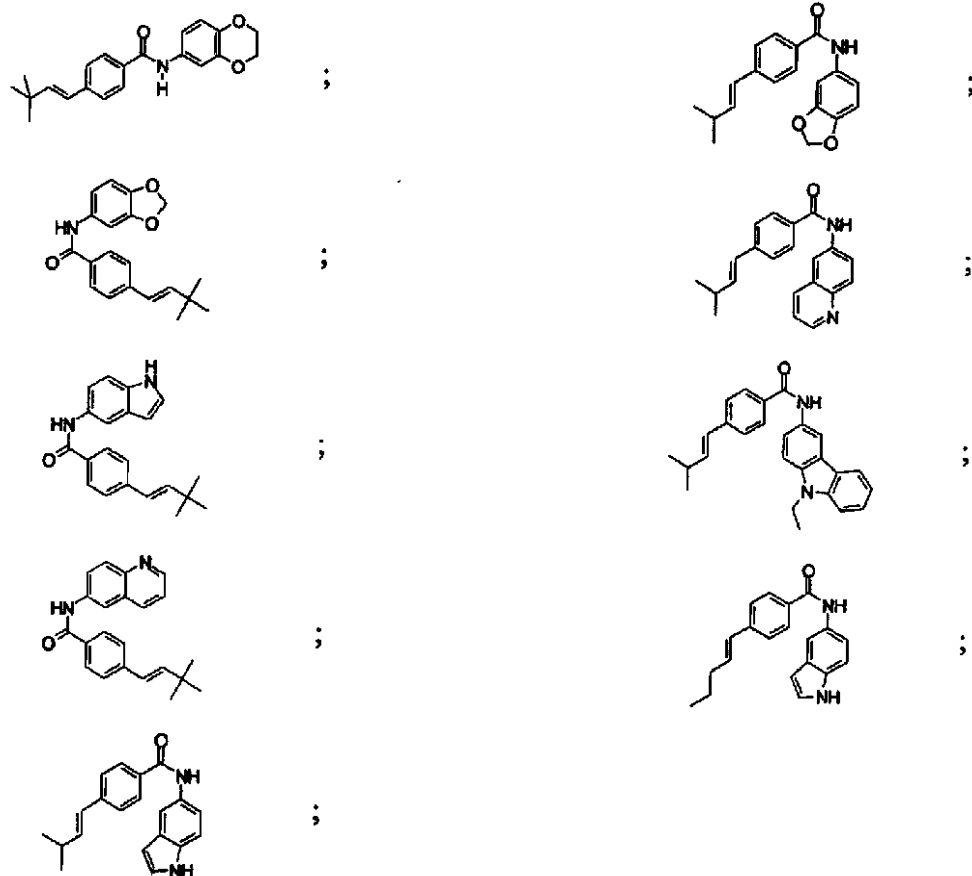
【請求項 19】

R¹ が、置換もしくは非置換のベンゾジオキサニル、置換もしくは非置換のベンゾピラニル、置換もしくは非置換のインドリル、置換もしくは非置換のインダゾリル、置換もしくは非置換のメチレンジオキシフェニル、置換もしくは非置換のキノリニル、置換もしくは非置換のイソキノリニル、置換もしくは非置換のテトラヒドロキノリニル、置換もしくは非置換のテトラヒドロイソキノリニル、置換もしくは非置換のジヒドロキノリニルまたは置換もしくは非置換のジヒドロイソキノリニルである、請求項 16 または 17 に記載の化合物。

【請求項 20】

請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩および立体異性体であって、該化合物が、以下：

【化 4】

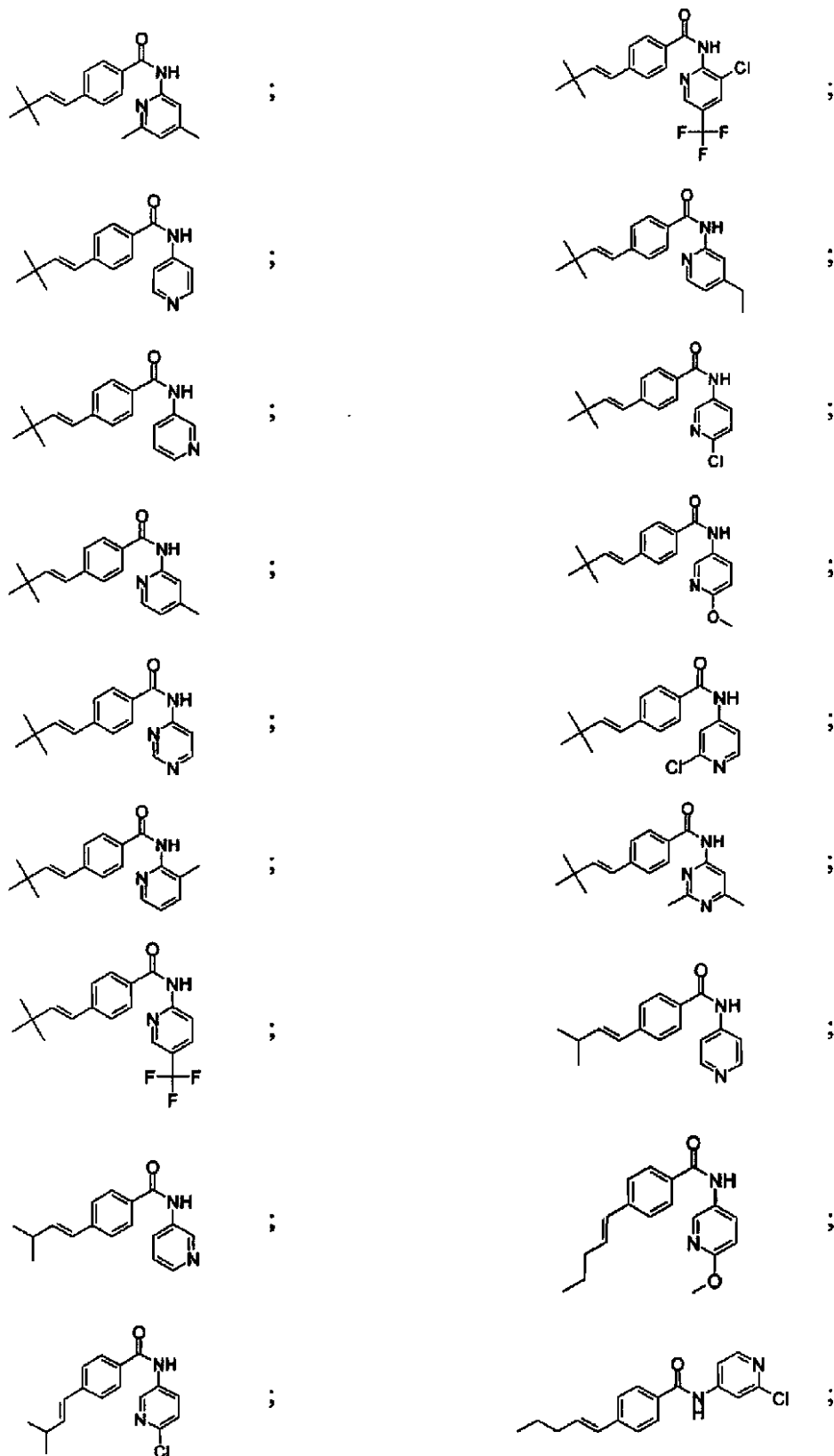


からなる群より選択される、化合物。

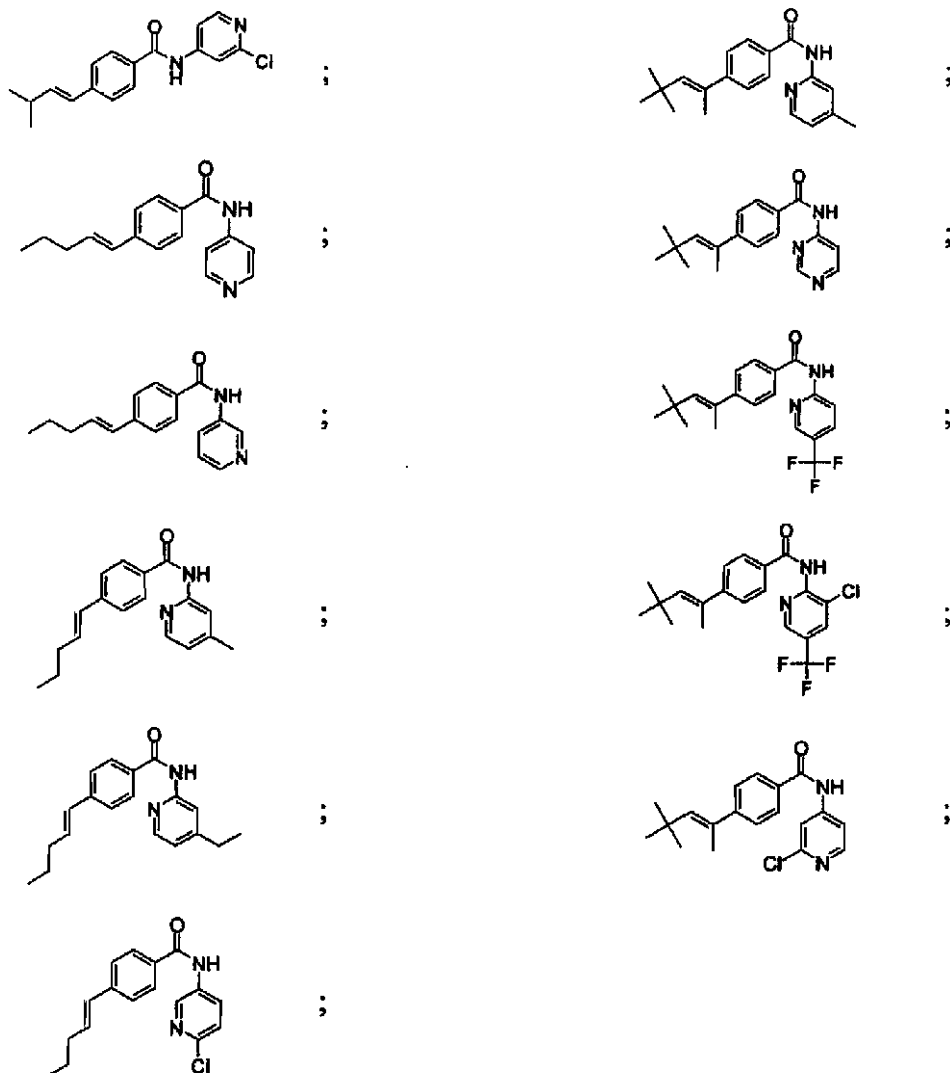
【請求項 21】

請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩および立体異性体であって、
該化合物が、以下：

【化 5】



【化 6】

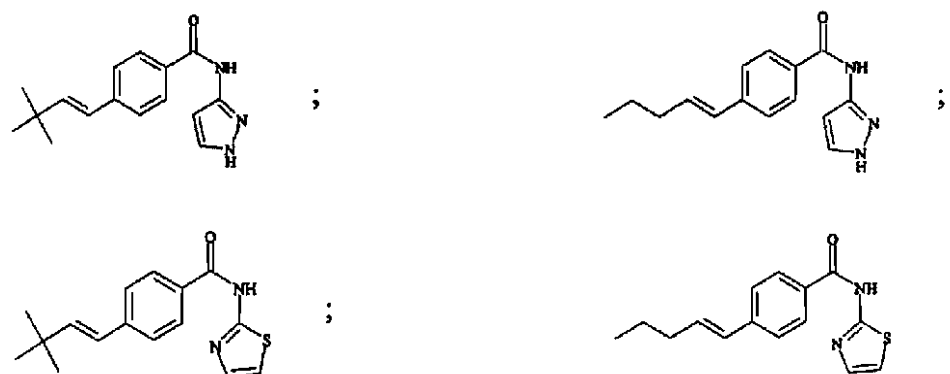


からなる群より選択される、化合物。

【請求項 2 2】

請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩および立体異性体であって、
該化合物が、以下：

【化 7】

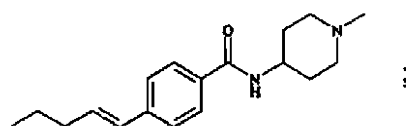
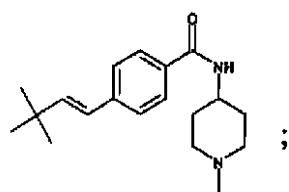


からなる群より選択される、化合物。

【請求項 2 3】

請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩および立体異性体であって、
該化合物が、以下：

【化 8】

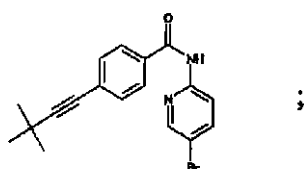
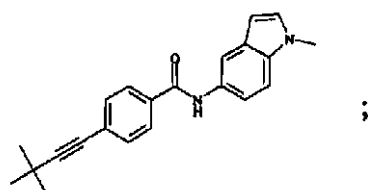
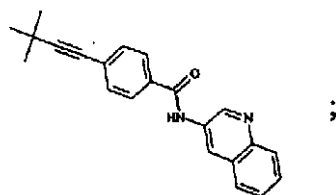
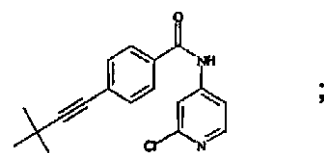
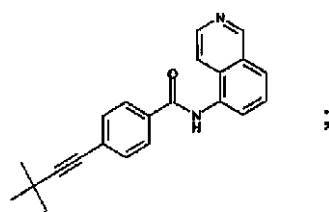
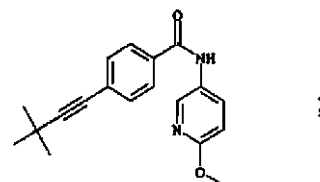
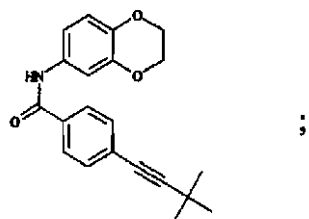
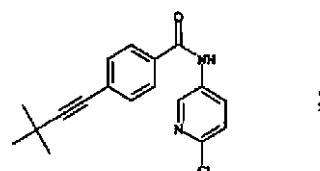
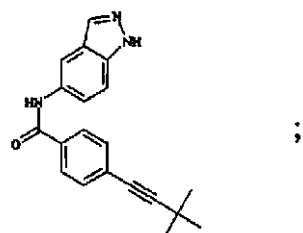
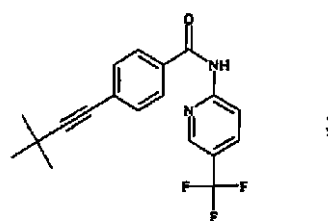
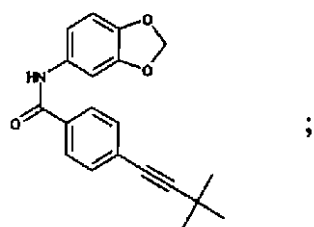


からなる群より選択される、化合物。

【請求項 2 4】

請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩および立体異性体であって、
該化合物が、以下：

【化 9】

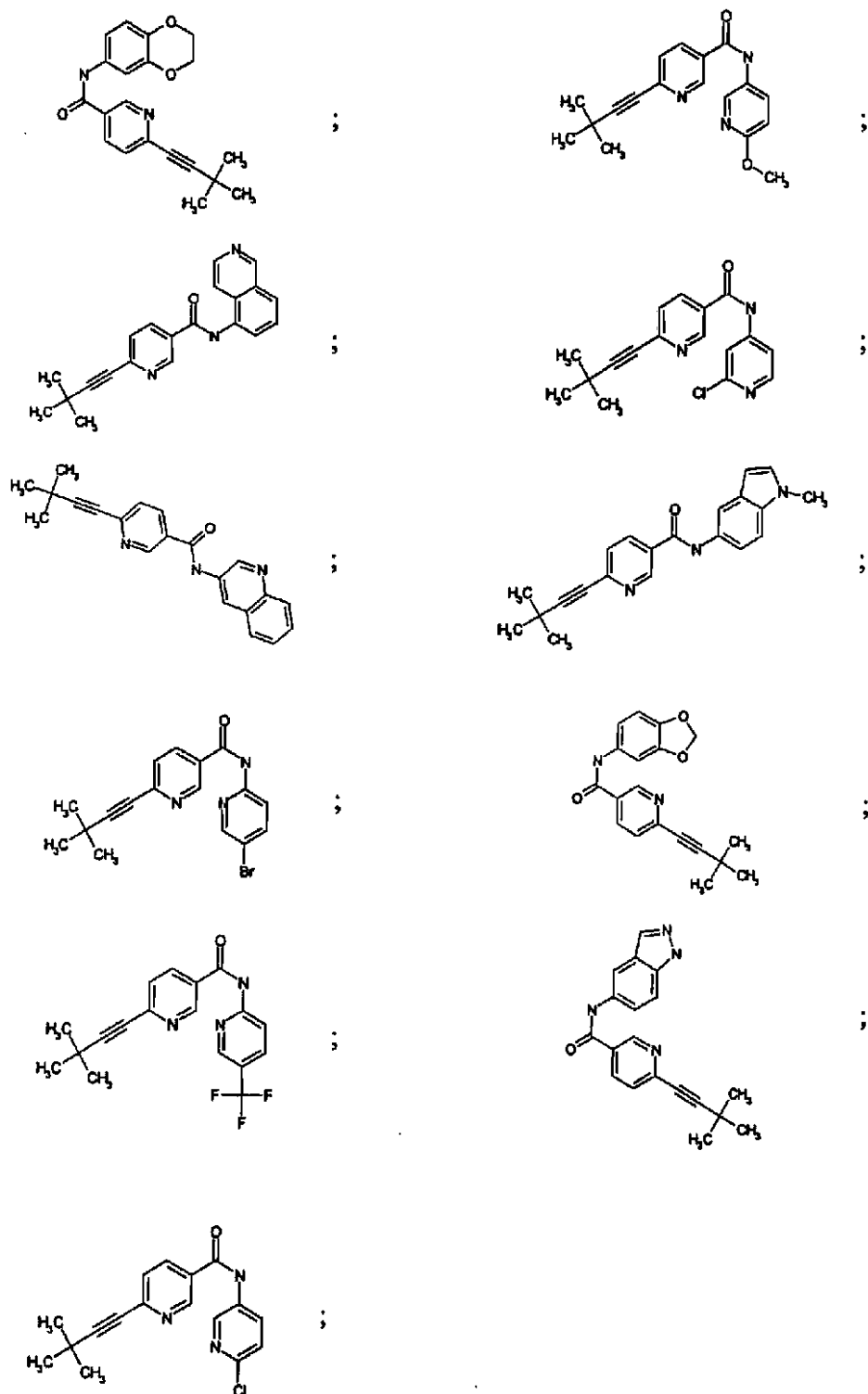


からなる群より選択される、化合物。

【請求項 25】

請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩および立体異性体であって、
該化合物が、以下：

【化 10】

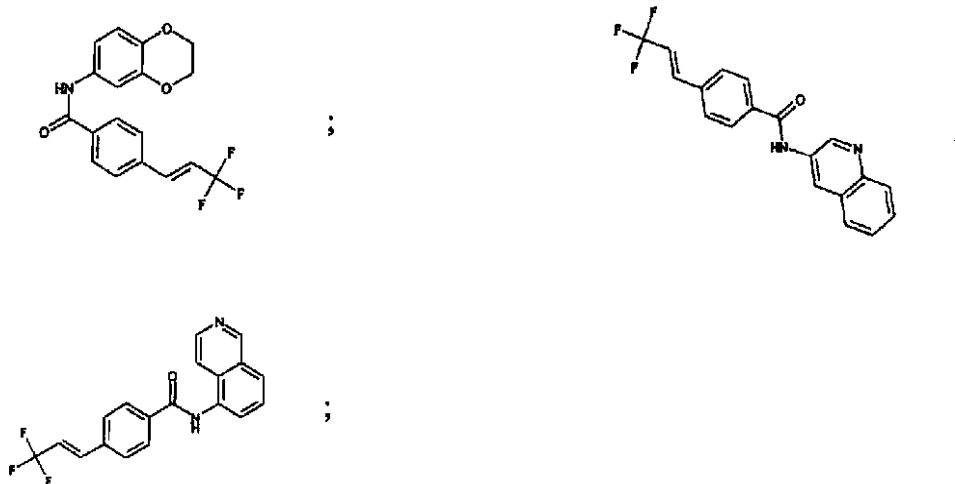


からなる群より選択される、化合物。

【請求項 26】

請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩および立体異性体であって、
該化合物が、以下：

【化 1 1】



からなる群より選択される、化合物。

【請求項 2 7】

薬学的に受容可能なキャリアおよび薬学的に有効な量の請求項 1 に記載の化合物を含む、
薬学的組成物。

【請求項 2 8】

前記キャリアが経口用である、請求項 2 7 に記載の薬学的組成物。

【請求項 2 9】

前記キャリアが経口用である、請求項 2 7 に記載の薬学的組成物。

【請求項 3 0】

前記キャリアが局所用である、請求項 2 7 に記載の薬学的組成物。

【請求項 3 1】

疼痛状態、神経性疾患もしくは神経性状態、または神経変性疾患もしくは神経変性状態、
自己免疫疾患、あるいは、炎症性の疾患もしくは状態を処置または予防するための医薬と
して使用するための、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3 2】

前記医薬が、疼痛状態を処置または予防するためのものである、請求項 3 1 に記載の化合
物。

【請求項 3 3】

前記医薬が、自己免疫疾患を処置または予防するためのものである、請求項 3 1 に記載の
化合物。

【請求項 3 4】

前記医薬が、炎症性の疾患または状態を処置または予防するためのものである、請求項 3
1 に記載の化合物。

【請求項 3 5】

前記医薬が、神経性疾患もしくは神経性状態、または神経変性疾患もしくは神経変性状態
を処置または予防するためのものである、請求項 3 1 に記載の化合物。

【請求項 3 6】

疼痛、急性疼痛、炎症性疼痛、ニューロパシー性疼痛、慢性疼痛、歯痛；頭痛、偏頭痛、
群発性頭痛、緊張性頭痛；パーキンソン病；アルツハイマー病；多発性硬化症；神経性炎
症、外傷性脳損傷、発作または脳炎により媒介されるかまたは神経性炎症、外傷性脳損傷
、発作または脳炎を生じる疾患または障害；中心性に媒介される神経性精神医学的疾患ま
たは障害、鬱病、躁病、双極性疾患、不安、統合失調症、摂食障害、睡眠障害、認識障害
、癲癇障害、痙攣障害；前立腺不全、膀胱不全、腸不全、尿失禁、排尿躊躇、直腸過敏症
、便失禁、良性前立腺肥大、炎症性腸疾患；呼吸性または気道性の疾患または障害、アレ
ルギー性鼻炎、喘息、反応性気道疾患、慢性閉塞性肺疾患；炎症により媒介されるかまた

は炎症を生じる疾患または障害、関節炎、慢性関節リウマチ、変形性関節症；心筋梗塞；自己免疫疾患または自己免疫障害；ブドウ膜炎、アテローム性硬化症；痒み、掻痒、乾癬；脱毛症；肥満；脂質障害；癌；高血圧；脊髄損傷；あるいは腎臓障害を処置または防止するための医薬として使用するための、請求項 1 に記載の、化合物。

【請求項 37】

前記医薬がパーキンソン病を処置または予防するためのものである、請求項 36 に記載の化合物。

【請求項 38】

前記医薬がアルツハイマー病を処置または予防するためのものである、請求項 36 に記載の化合物。

【請求項 39】

前記医薬が外傷性脳損傷を処置または予防するためのものである、請求項 36 に記載の化合物。

【請求項 40】

前記医薬が発作を処置または予防するためのものである、請求項 36 に記載の化合物。

【請求項 41】

前記医薬が疼痛を処置または予防するためのものである、請求項 36 に記載の化合物。

【請求項 42】

前記医薬がニューロパシー性疼痛を処置または予防するためのものである、請求項 36 に記載の化合物。

【請求項 43】

カプサイシンへの曝露の症状、熱への曝露に起因する火傷または刺激の症状、光への曝露に起因する火傷または刺激の症状、火傷の症状、催涙ガスへの曝露に起因する気管支収縮または刺激、あるいは酸への曝露に起因する火傷または曝露刺激の症状を処置するための医薬として使用するための、請求項 1 に記載の化合物。

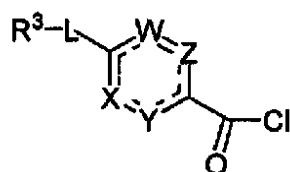
【請求項 44】

前記医薬が、乳房切除術後の疼痛症候群、断端疼痛、幻想肢痛、咽頭ニューロパシー性疼痛、シャルコー疼痛、歯痛、毒蛇の咬傷、蜘蛛の咬傷、虫刺され、疱疹後の神経痛、糖尿病性ニューロパシー、反射性交感神経性ジストロフィ、三叉神経痛、変形性関節症、慢性関節リウマチ、線維筋痛症、ギヤン - バレー症候群、感覚異常性大腿神経痛、口内焼灼感症候群、両側性末梢ニューロパシー、カウザルギー、坐骨神経炎、末梢神経炎、多発性神経炎、分節性神経炎、ゴンボー神経炎、ニューロン炎、頸腕神経痛、頭側神経痛、膝神経痛、舌咽頭筋神経痛、偏頭痛性神経痛、特発性神経痛、肋間神経痛、乳房神経痛、顎関節神経痛、モートン神経痛、鼻毛様体神経痛、後頭神経痛、紅色神経痛、スラダー神経痛、脾臓口蓋神経痛、眼窩上神経痛、ヴィディウス神経痛、洞頭痛、緊張頭痛、分娩、出産、腸管ガス、月経、癌または外傷を処置または予防するためのものである、請求項 41 に記載の化合物。

【請求項 45】

請求項 1 に記載の化合物の調製方法であって、該方法は、以下の式：

【化 12】



の化合物を、請求項 1 に記載の化合物を形成するのに十分な条件下で、式 $R^1 R^2 N H$ の化合物と接触させる工程を包含し、ここで：

W、X、Y および Z の各々が、N および $C R^4$ から独立して選択され；

L は、置換もしくは非置換の - ($C R^5 = C R^6$) - または置換もしくは非置換の - (

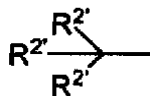
C - C) - であり ;

R¹ は、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のシクロヘテロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり ;

R² は、水素であり ;

R³ は、CF₃、n - プロピルまたは以下の式 :

【化 1 3】



の基であり ;

ここで R^{2'} の各々は、R^{2'} のうちの少なくとも 2 つがアルキルであるという条件で、水素またはアルキルであり ; そしてここでアルキルである 2 つの R^{2'} は、一緒になって 3 ~ 8 個の原子のシクロアルキル環またはシクロヘテロアルキル環を形成し得 ;

各々の R⁴ は、独立して、水素、アルキル、置換もしくは非置換のアルキル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アルキルチオ、アルコキシ、アルコキシカルボニル、アルキルアリールアミノ、アリールアルキルオキシ、アミノ、アリール、アリールアルキル、スルフィニル、スルホニル、スルファニル、アミノスルホニル、アリールスルホニル、スルホ、置換スルホ、ジヒドロキシホスホリル、アミノヒドロキシホスホリル、アジド、カルボキシ、カルバモイル、カルボキシル、シアノ、シクロヘテロアルキル、ジアルキルアミノ、ハロ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアルキル、ヒドロキシル、ニトロ、またはチオールであり ; そして

R⁵ および R⁶ の各々は、独立して、H、ハロであるかまたは、置換もしくは非置換の脂肪族、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、置換もしくは非置換のアラルキルまたは置換もしくは非置換のヘテロアラルキルである、方法。