

【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8月11日(2005.8.11)

【公表番号】特表2001-512459(P2001-512459A)

【公表日】平成13年8月21日(2001.8.21)

【出願番号】特願平10-535896

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 271/12

A 6 1 K 31/4245

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/54

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/28

C 0 7 D 285/14

C 0 7 D 413/06

【F I】

C 0 7 D 271/12

A 6 1 K 31/4245

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/54

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/28

C 0 7 D 285/14

C 0 7 D 413/06

【手続補正書】

【提出日】平成16年11月19日(2004.11.19)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】補正の内容のとおり

【補正方法】変更

【補正の内容】

## 手続補正書

平成16年11月19日

特許庁長官 殿



## 1. 事件の表示

平成10年特許願第535896号

## 2. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

住所 アメリカ合衆国 カリフォルニア 92718

アーヴィン バランカ パークウェイ 15241

名称 コーテックス ファーマシューティカルズ, インコーポレイテッド

## 3. 代理人

住所 〒215-0003

神奈川県川崎市麻生区高石4丁目15番1号

エーデルワイス百合ヶ丘504号

電話 044-952-9112

氏名 (7312) 弁理士 菅原 一郎



## 4. 補正対象書類名

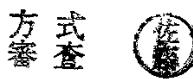
(1) 請求の範囲

## 5. 補正対象項目名

(1) 請求の範囲 (全文)

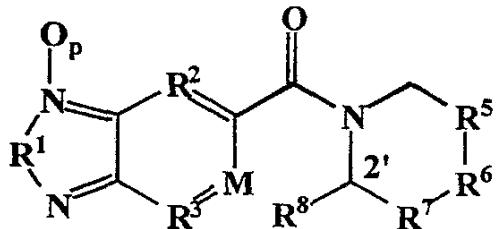
## 6. 補正の内容

別紙の通り



## 請求の範囲

1. 下記の構造を有しており



ここで

R<sup>1</sup>は、酸素または硫黄であり、

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、-N=、-CR=、-CX=からなる群から個別に選択されたものであり、

Mは、=N-または=CR<sup>4</sup>-であり、

R<sup>4</sup>とR<sup>8</sup>は個別にRまたは一緒になってMを環の頂点2'に結合する1個の結合部分を形成し、該結合部分は単結合、-CRR'-、-CR=CR' -、-C(O)-、-O-、-S(O)<sub>y</sub>-、-NR-、-N=、からなる群から選択され、

R<sup>5</sup>およびR<sup>7</sup>は、-(CRR')<sub>n</sub>-、-C(O)-、-CR=CR' -、-CR=CX-、-CRX-、-CX<sup>2</sup>-、-CX<sup>2</sup>X'-、-S-、-O-からなる群から個別に選択され、

R<sup>6</sup>は、-(CRR')<sub>m</sub>-、-C(O)-、-CR=CR' -、-CRX-、-CX<sup>2</sup>X'-、-S-、-O-からなる群から選択され、

ここでXおよびX'は、-Br、-Cl、-F、-CN、-NO<sub>2</sub>、-OR、-SR、-NRR'、-C(O)R、-CO<sub>2</sub>R、-CONRR'から個別に選択され、

ここで、個々の基Xまたは2個の隣接する基X上の2個の基RまたはR'は一緒になって環を形成することができ、

RおよびR'は(i)水素、(ii)C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>有枝または無枝アルキル、またはC<sub>3</sub>

$-C_6$  シクロアルキル、および (iii) アリルから個別に選択され、

上記の有枝または無枝アルキルまたは  $C_3-C_6$  シクロアルキルは非置換であるかまたはハロゲン、ニトロ、アルコキシ、ヒドロキシ、アルキルチオ、アミノ、ケト、アルデヒド、カルボン酸、カルボキシル・エステル、またはカルボキシルアミドから選ばれた 1 個以上の官能基で置換されており、

单一または隣接する炭素上の 2 個のそのようなアルキル基は一緒になって環を形成することができ、

上記のアリルは非置換であるかまたはハロゲン、ニトロ、アルコキシ、ヒドロキシ、アリロキシ、アルキルチオ、アミノ、ケト、アルデヒド、カルボン酸、カルボキシル・エステルまたはカルボキシルアミドから選ばれた 1 個以上の官能基で置換されており、

$m$  と  $p$  とは個別に 0 または 1 であり、

$n$  と  $y$  とは個別に 0、1 または 2 であり、

ここで「アルコキシ」はアルキル・エーテルを指し、「アルキルチオ」はアルキルチオ・エーテルを指し、該「アルキル」は 1 ~ 7 個の炭素を含み、

「アリル」は単環または複縮合環を有した置換または非置換の单原子価芳香族基を指し、かつフェニル、ナフチル、イマダゾール、フリル、ピロール、ピリジルおよびインドールのような環中に 1 個以上の窒素、酸素または硫黄原子を有したヘテロ環状芳香族環システムを含み、かつ「アリロキシ」はアリル・エーテルを指す

ことを特徴とする化合物。

2.  $R$  および  $R'$  が、個々に (i) 水素および (ii)  $C_1-C_6$  枝つきまたは枝なしアルキル、または  $C_3-C_6$  シクロアルキルから選択され、それらは、ハロゲン、ニトロ、アルコキシ、ヒドロキシ、アルキルチオ、アミノ、ケト、アルデヒド、カルボン酸、カルボキシル・エステル、またはカルボキシルアミドの内の、1 つ以上の官能基で未置換か置換され、ここで 1 つの炭素または隣の炭素上の 2 つのアルキル基が、共に 1 つの環をつくることを特徴とする、請求項 1 に記載の化合物。

3.  $R^2$ および $R^3$ が、 $-CR-$ で、Mが $=CR^4-$ であることを特徴とする、請求項1に記載の化合物。

4. pが0、 $R^1$ が酸素、 $R^4$ および $R^8$ が水素であることを特徴とする、請求項3に記載の化合物。

5.  $R^5$ および $R^7$ が、 $- (CRR')_n -$ で、 $R^6$ が $- (CRR')_m -$ であることを特徴とする、請求項4に記載の化合物。

6. Rおよび $R'$ が水素、 $m=n=1$ で、上記化合物が1-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)ピペリジンであることを特徴とする、請求項5に記載の化合物。

7. pが0、 $R^1$ が硫黄、 $R^4$ 、 $R^8$ 、Rおよび $R'$ が水素、 $m=n=1$ で、上記化合物が1-(ベンゾ-2,1,3-チアジアゾール-5-イルカルボニル)ピペリジンであることを特徴とする、請求項3に記載の化合物。

8.  $R^5$ が $-CR=CX-$ 、 $R^6$ が $- (CRR')_m -$ 、 $R^7$ が $- (CRR')_n -$ 、mが0であることを特徴とする、請求項4に記載の化合物。

9. Rおよび $R'$ が水素であることを特徴とする、請求項8に記載の化合物。

10. Xがフルオリンでnが1、上記化合物が1-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)-4-フルオロ-1,2,3,6-テトラヒドロピリジンであることを特徴とする、請求項9に記載の化合物。

11.  $R^5$ が $-CR=CR'-$ 、 $R^6$ が $- (CRR')_m -$ 、 $R^7$ が $- (CRR')_n -$ 、およびmが0であることを特徴とする、請求項4に記載の化合物。

12. RおよびR'が水素であることを特徴とする、請求項11に記載の化合物。

13. nが1、上記化合物が1-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジンであることを特徴とする、請求項12に記載の化合物。

14. R<sup>5</sup>およびR<sup>7</sup>が、-(CRR')<sub>n</sub>-で、R<sup>6</sup>が-C(O)-、-CRX-、-CXX'-、-O-または-S-、であることを特徴とする、請求項4に記載の化合物。

15. R<sup>6</sup>が-CXX'-、RおよびR'が水素、nが1、Xがフルオリン、上記化合物が1-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)-4', 4'-ジフルオロピペリジンであることを特徴とする、請求項14に記載の化合物。

16. R<sup>6</sup>が-CRX'-、RおよびR'が水素、nが1であることを特徴とする、請求項14に記載の化合物。

17. 上記化合物が1-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)-4'-フルオロピペリジン、1-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)-4'-シアノピペリジン、および1-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)-4'-ヒドロキシピペリジンから選択されることを特徴とする、請求項16に記載の化合物。

18. R<sup>6</sup>が-O-、-S-または-C(O)-、nが1、およびRおよびR'が水素、上記化合物が4-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)モルフォリン、4-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)チオモルフォリン、および4-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)-4-ピペリドンから選択されることを特徴とする、請求項14に記載の化合物。

19. Mが=CR<sup>4</sup>-、ここでR<sup>4</sup>とR<sup>8</sup>がMを環頂点2'に結合する単結合部分を共に形成し、結合部分は単結合が-CRR'-、-CR=CR'-、-C(O)-、-O-、-S-、-NR-、または-N=、であることを特徴とする、請求項1に記載の化合物。

20. R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が-CR=、であることを特徴とする、請求項19に記載の化合物。

21. pが0、R<sup>1</sup>が酸素、R<sup>5</sup>およびR<sup>7</sup>が-(CRR')<sub>n</sub>-、およびR<sup>6</sup>が-(CRR')<sub>m</sub>-、であることを特徴とする、請求項20に記載の化合物。

22. nが1であることを特徴とする、請求項21に記載の化合物。

23. 結合部分が-CRR'-、-O-、-S-、または-N=、であることを特徴とする、請求項21に記載の化合物。

24. 結合部分が、-O-、であることを特徴とする、請求項23に記載の化合物。

25. 対象哺乳動物のAMPAレセプタ作用を高めるため、製薬上許容される基剤であると、請求項1から24のいずれかに記載されていることを特徴とする化合物の使用。

26. 上記高揚が、グルタミン酸塩の不足状態や、興奮を示すシナプスの数や強度またはAMPAレセプタの数の低下によって起こる記憶やその他の認識作用の悪化を、軽減する効果があると、請求項25に記載されていることを特徴とする化合物の使用。

27. 上記高揚が、グルタミン酸塩の不足状態や、興奮を示す結合部の数や強度

またはAMPAレセプタの数の低下によって起こる皮質部／溝部の不均衡から引き起こされる精神分裂症や精神分裂様挙動の取り扱いに効果があると、請求項25に記載されていることを特徴とする化合物の使用。

28. 上記高揚が、AMPAレセプタの作用に依存する挙動の認識を促進するのに効果があると、請求項25に記載されていることを特徴とする化合物の使用。

29. 上記化合物が、請求項2から18のいずれかに従うと、請求項25に記載されていることを特徴とする化合物の使用。

30. 上記化合物が、下記の構成の基から選択されると、請求項26に記載されていることを特徴とする化合物の使用、

- a. 1-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)ピペリジン、
- b. 1-(ベンゾ-2, 1, 3-チアジアゾール-5-イルカルボニル)ピペリジン、
- c. 1-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)-4-フルオロ-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピペリジン、
- d. 1-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)-4'-フルオロピペリジン、
- e. 1-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)-4', 4'-ジフルオロピペリジン、
- f. 1-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)-4'-シアノピペリジン、
- g. 1-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)-4'-ヒドロキシピペリジン、
- h. 4-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)モルフォリン、
- i. 4-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)チオモルフォリン、および
- j. 4-(ベンゾフラザン-5-イルカルボニル)-4-ピペリドン。