

【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2005-508858(P2005-508858A)

【公表日】平成17年4月7日(2005.4.7)

【年通号数】公開・登録公報2005-014

【出願番号】特願2002-591484(P2002-591484)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 401/06

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/30

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 409/14

C 0 7 D 417/14

【F I】

C 0 7 D 401/06

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/30

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 409/14

C 0 7 D 417/14

【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

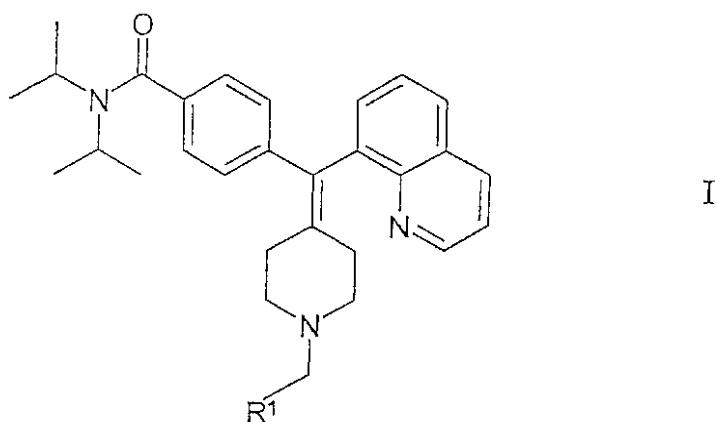
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物又はその塩。

【化1】



式I中、R¹は、

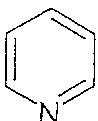
(i) フェニル

【化2】



(ii) ピリジニル

【化3】



(iii) チエニル

【化4】



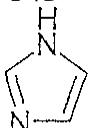
(iv) フラニル

【化5】



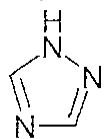
(v) イミダゾリル

【化6】



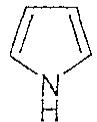
(vi) トリアゾリル

【化7】



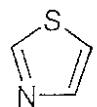
(vii) ピロリル

【化8】



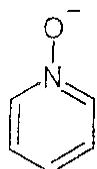
(viii) チアゾリル

【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、R¹フェニル環及びR¹複素芳香族環はそれぞれ独立して、直鎖及び分枝C₁～C₆アルキル、NO₂、CF₃、C₁～C₆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。

【請求項2】

R¹フェニル環及びR¹複素芳香族環がそれ各自由により、また独立して、メチル、CF₃、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】

R¹フェニル環及びR¹複素芳香族環が、それ各自由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】

R¹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】

4-[1-(1-ベンジル-ピペリジン-4-イリデン)-1-キノリン-8-イル-メチル]-N,N-ジイソプロピル-ベンズアミド、
 N,N-ジイソプロピル-4-[1-(1-ピリジン-2-イルメチル-ピペリジン-4-イリデン)-1-キノリン-8-イル-メチル]-ベンズアミド、
 N,N-ジイソプロピル-4-[1-(1-ピリジン-4-イルメチル-ピペリジン-4-イリデン)-1-キノリン-8-イル-メチル]-ベンズアミド、
 N,N-ジイソプロピル-4-[1-キノリン-8-イル-1-(1-チオフェン-2-イルメチル-ピペリジン-4-イリデン)-メチル]-ベンズアミド、
 N,N-ジイソプロピル-4-[1-キノリン-8-イル-1-(1-チオフェン-3-イルメチル-ピペリジン-4-イリデン)-メチル]-ベンズアミド、

N,N-ジイソプロピル-4-[1-キノリン-8-イル-1-(1-フラン-3-イルメチル-ピペリジン-4-イリデン)-メチル]-ベンズアミド、

N,N-ジイソプロビル-4-[1-キノリン-8-イル-1-(1-フラン-2-イルメチル-ピペリジン-4-イリデン)-メチル]-ベンズアミド、

N,N-ジイソプロピル-4-[1-キノリン-8-イル-1-(1-ピロール-2-イルメチル-ピペリジン-4-イリデン)-メチル]-ベンズアミド、

N,N-ジイソプロピル-4-[1-[1-(4-ブロモ-ベンジル)-ピペリジン-4-イリデン]-1-キノリン-8-イル-メチル}-ベンズアミド、

4 - { 1 - [1 - (1 H - イミダゾール - 2 - イルメチル) - ピペリジン - 4 - イリデン] - 1 - キノリン - 8 - イル - メチル } - N,N - ジイソプロピルベンズアミド、

N,N-ジイソプロピル-4-[1-[4-(4-メトキシ-ベンジル)-ピペリジン-4-イリデン]-1-キノリン-8-イル-メチル]-ベンズアミド、及び

N,N-ジイソプロピル-4-[1-キノリン-8-イル-1-(1-チアゾール-2-

イルメチル - ピペリジン - 4 - イリデン) メチル] - ベンズアミド

のいずれか一つから選ばれる請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【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のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

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。

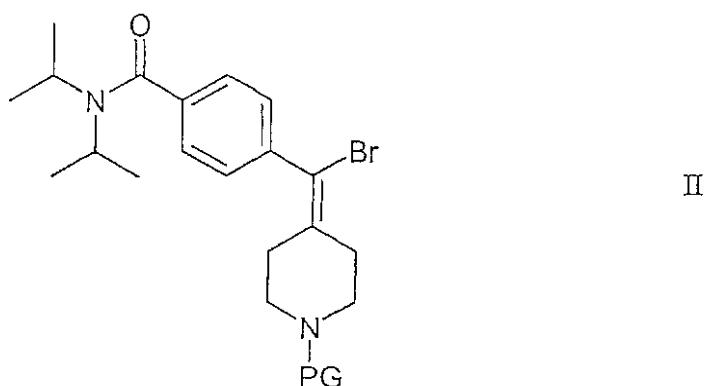
【請求項8】

疼痛、不安症又は機能性胃腸障害の治療のための請求項 8 記載の医薬。

【請求項9】

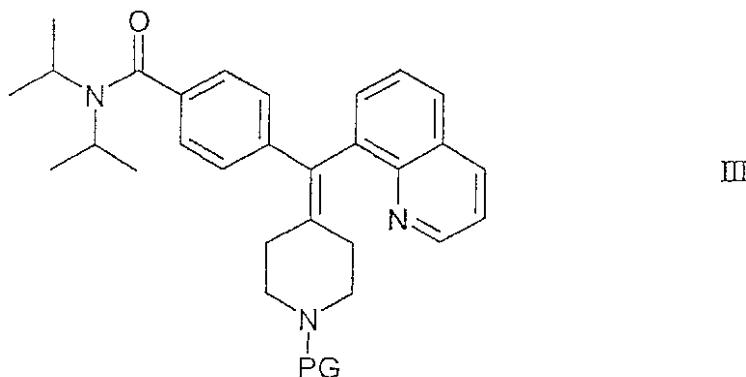
A) 一般式 ||

【化 1 1】



(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8-キノリンボロン酸と反応させて一般式III

【化12】

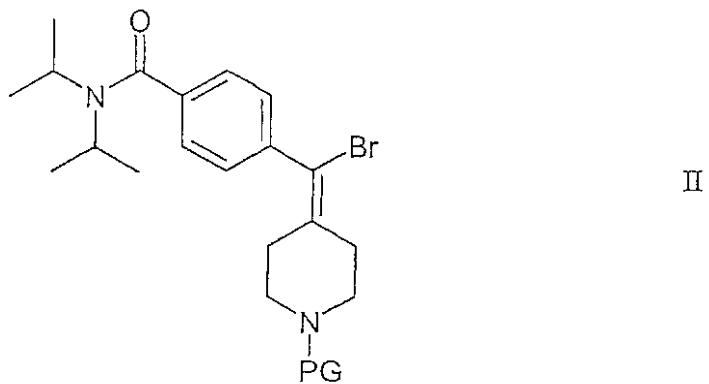


の化合物を得、その後、標準条件下で脱保護し、還元条件下で一般式 R¹-CHO の化合物を用いてアルキル化して一般式 I の化合物を得る反応からなる式 I の化合物の製造方法。

【請求項 10】

一般式 II

【化13】

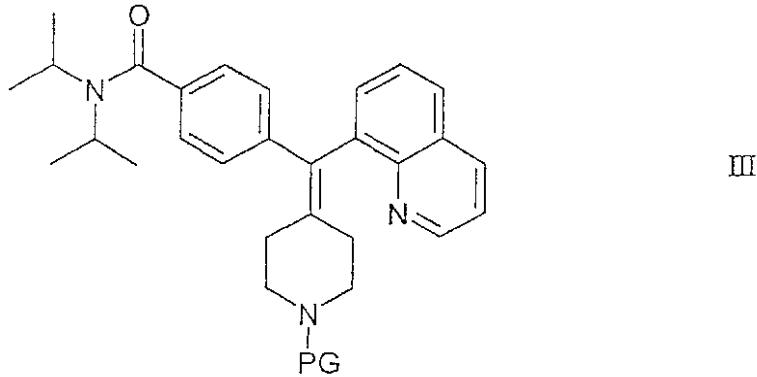


(式中、PGは、ウレタン保護基、又はベンジルもしくは置換されたベンジル保護基である)の化合物。

【請求項 11】

一般式 III

【化14】



(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。