

【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 07 D 401/06

A 61 K 31/4709

A 61 P 1/00

A 61 P 9/10

A 61 P 11/00

A 61 P 19/02

A 61 P 25/04

A 61 P 25/06

A 61 P 25/16

A 61 P 25/22

A 61 P 25/30

A 61 P 37/02

A 61 P 37/06

A 61 P 37/08

A 61 P 43/00

C 07 D 401/14

C 07 D 405/14

C 07 D 409/14

C 07 D 417/14

【F I】

C 07 D 401/06

A 61 K 31/4709

A 61 P 1/00

A 61 P 9/10

A 61 P 11/00

A 61 P 19/02

A 61 P 25/04

A 61 P 25/06

A 61 P 25/16

A 61 P 25/22

A 61 P 25/30

A 61 P 37/02

A 61 P 37/06

A 61 P 37/08

A 61 P 43/00 1 1 1

C 07 D 401/14

C 07 D 405/14

C 07 D 409/14

C 07 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

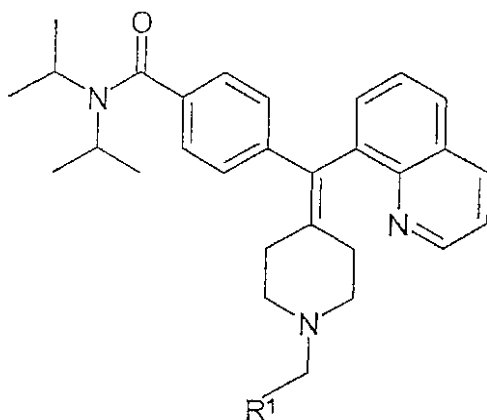
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物又はその塩。

【化1】



I

式I中、R<sup>1</sup>は、

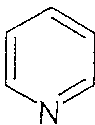
(i) フェニル

【化2】



(ii) ピリジニル

【化3】



(iii) チエニル

【化4】



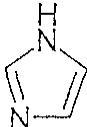
(iv) フラニル

【化5】



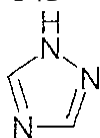
(v) イミダゾリル

【化6】



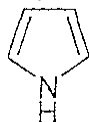
(vi) トリアゾリル

【化 7】



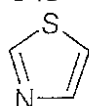
(vii) ピロリル

【化 8】



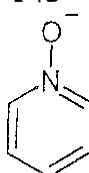
(viii) チアゾリル

【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、 $R^1$ フェニル環及び $R^1$ 複素芳香族環はそれぞれ独立して、直鎖及び分枝 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、クロロ、フルオロ、ブromo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】

$R^1$ フェニル環及び $R^1$ 複素芳香族環がそれぞれ場合により、また独立して、メチル、 $CF_3$ 、クロロ、フルオロ、ブromo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】

$R^1$ フェニル環及び $R^1$ 複素芳香族環が、それぞれ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】

$R^1$ 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 - ジイソプロピル - 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 - (1H - 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 - [1 - (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。

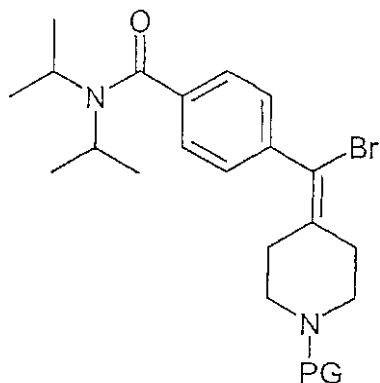
【請求項 8】

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 II

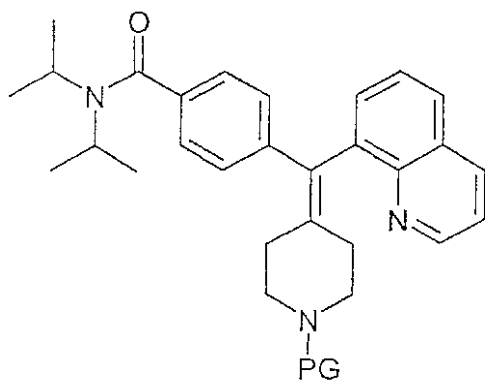
【化 1 1】



II

(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 1 2】



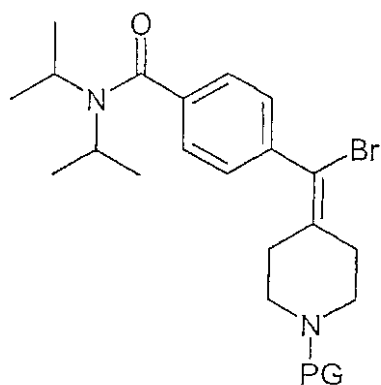
III

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  $R^1 - CHO$  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 1 3】



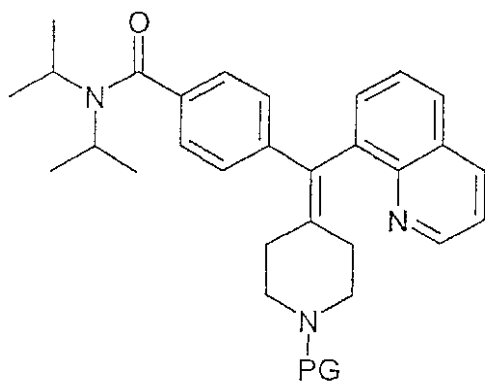
II

(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 1 4】



III

(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。