

【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22年12月16日(2010.12.16)

【公表番号】特表2010-514684(P2010-514684A)

【公表日】平成22年5月6日(2010.5.6)

【年通号数】公開・登録公報2010-018

【出願番号】特願2009-543168(P2009-543168)

【国際特許分類】

C 07 D 281/16	(2006.01)
A 61 P 25/24	(2006.01)
A 61 P 25/18	(2006.01)
A 61 P 25/22	(2006.01)
A 61 P 25/08	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 25/16	(2006.01)
A 61 P 25/06	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 13/00	(2006.01)
A 61 P 25/04	(2006.01)
A 61 P 25/20	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 K 31/554	(2006.01)

【F I】

C 07 D 281/16	C S P
A 61 P 25/24	
A 61 P 25/18	
A 61 P 25/22	
A 61 P 25/08	
A 61 P 25/28	
A 61 P 25/16	
A 61 P 25/06	
A 61 P 9/00	
A 61 P 13/00	
A 61 P 25/04	
A 61 P 25/20	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 25/00	
A 61 K 31/554	

【手続補正書】

【提出日】平成22年10月26日(2010.10.26)

【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

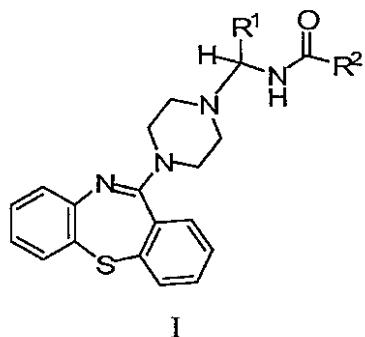
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I :
【化 1】



[式中、

R^1 は、H、 C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} ハロアルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、又はヘテロシクロアルキルアルキルであり、ここで C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} ハロアルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルはそれぞれ、1、2、3、4、又は5つの R^3 で場合により置換され；

R^2 は、H、 C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} ハロアルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、又はヘテロシクロアルキルアルキルであり、ここで C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} ハロアルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルはそれぞれ、1、2、3、4、又は5つの R^4 で場合により置換され；

R^3 はそれぞれ独立して、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、CN、 NO_2 、 OR^a 、 SR^a 、 $C(=O)R^b$ 、 $C(=O)NR^cR^d$ 、 $C(=O)OR^a$ 、 $OC(=O)R^b$ 、 $OC(=O)NR^cR^d$ 、 NR^cR^d 、 $NR^cC(=O)R^b$ 、 $NR^cC(=O)OR^a$ 、 $NR^cS(=O)_2R^b$ 、 $S(=O)R^b$ 、 $S(=O)NR^cR^d$ 、 $S(=O)_2R^b$ 、又は $S(=O)_2NR^cR^d$ であり；

R^4 はそれぞれ独立して、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、CN、 NO_2 、 OR^a 、 SR^a 、 $C(=O)R^b$ 、 $C(=O)NR^cR^d$ 、 $C(=O)OR^a$ 、 $OC(=O)R^b$ 、 $OC(=O)NR^cR^d$ 、 NR^cR^d 、 $NR^cC(=O)R^b$ 、 $NR^cC(=O)OR^a$ 、 $NR^cS(=O)_2R^b$ 、 $S(=O)R^b$ 、 $S(=O)NR^cR^d$ 、 $S(=O)_2R^b$ 、又は $S(=O)_2NR^cR^d$ であり；

R^a 及び R^a' はそれぞれ独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルより選択され、ここで該 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルはそれぞれ、OH、 C_{1-6} アルコキシ、アミノ、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、又はヘテロシクロアルキルで場合により置換され；

R^b 及び R^b' はそれぞれ独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アル

ケニル、C₂₋₆アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルより選択され、ここで該C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルはそれぞれ、OH、C₁₋₆アルコキシ、アミノ、ハロ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、又はヘテロシクロアルキルで場合により置換され；

R°及びR°dはそれぞれ独立して、H、C₁₋₁₀アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルより選択され、ここで該C₁₋₁₀アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルはそれぞれ、OH、C₁₋₆アルコキシ、アミノ、ハロ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、又はヘテロシクロアルキルで場合により置換され；

又はR°及びR°dは、それらが結合しているN原子とともに、4員、5員、6員、若しくは7員のヘテロシクロアルキル基を形成し；そして

R°'及びR°d'はそれぞれ独立して、H、C₁₋₁₀アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルより選択され、ここで該C₁₋₁₀アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルはそれぞれ、OH、C₁₋₆アルコキシ、アミノ、ハロ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、又はヘテロシクロアルキルで場合により置換され；

又はR°'及びR°d'は、それらが結合しているN原子とともに、4員、5員、6員、若しくは7員のヘテロシクロアルキル基を形成する]

の化合物又はその薬学的に許容しうる塩。

【請求項2】

R¹はH、C₁₋₄アルキル、又はC₁₋₄ハロアルキルであり；そしてR²はC₁₋₄アルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R¹はH、C₁₋₄アルキル、又はC₁₋₄ペルフルオロアルキルであり；R²はNHC(=O)-R³であり；そしてR³はC₁₋₄アルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物及びさらに薬学的に許容しうる担体を含む、医薬組成物。

【請求項5】

少なくとも1種の、抗うつ薬、非定型抗精神病薬、抗精神病薬、抗不安薬、抗けいれん薬、アルツハイマー病治療薬、パーキンソン病治療薬、片頭痛治療薬、脳卒中治療薬、尿失禁治療薬、神経因性疼痛治療薬、侵害受容性疼痛治療薬、不眠症治療薬、気分安定薬、5HT_{1B}リガンド、mGluR2アゴニスト、アルファ7ニコチンアゴニスト、ケモカイン受容体CCR1阻害剤、又はデルタオピオイドアゴニストをさらに含む、請求項4に記載の組成物。

【請求項 6】

少なくとも 1 種の、ベンゾジアゼピン、5 - HT_{1A}リガンド、5 - HT_{1B}リガンド、5 - HT_{1D}リガンド、mGluR2Aアゴニスト、mGluR5アンタゴニスト、抗精神病薬、NK1受容体アンタゴニスト、抗うつ薬、又はセロトニン再取り込み阻害剤をさらに含む、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 7】

統合失調症及び他の精神病性障害、痴呆及び他の認知障害、不安障害、気分障害、睡眠障害、通常乳児期、小児期、若しくは青年期に最初に診断される障害、又は神経変性障害に関連する少なくとも 1 つの症状又は状態を処置する方法であって、哺乳動物に治療有効量の請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物又は請求項 4 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の組成物を投与することからなる、方法。

【請求項 8】

症状又は状態が、不安、興奮、反抗、パニック、摂食障害、情動症状、気分の症状、又は陰性若しくは陽性の精神病症状を含む、請求項 7 に記載の方法。

【請求項 9】

統合失調症及び他の精神病性障害、痴呆及び他の認知障害、不安障害、気分障害、睡眠障害、通常乳児期、小児期、若しくは青年期に最初に診断される障害、又は神経変性障害に関連する少なくとも 1 つの症状又は状態の処置のための、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物又は請求項 4 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 10】

統合失調症及び他の精神病性障害、痴呆及び他の認知障害、不安障害、気分障害、睡眠障害、通常乳児期、小児期、若しくは青年期に最初に診断される障害、又は神経変性障害に関連する少なくとも 1 つの症状又は状態の処置のための医薬の製造のための、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。