

【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21年11月5日(2009.11.5)

【公表番号】特表2009-508876(P2009-508876A)

【公表日】平成21年3月5日(2009.3.5)

【年通号数】公開・登録公報2009-009

【出願番号】特願2008-531431(P2008-531431)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

C 0 7 D 215/54 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

A 6 1 K 31/47 (2006.01)

A 6 1 K 31/46 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/454

C 0 7 D 215/54 C S P

A 6 1 K 31/496

C 0 7 D 401/04

A 6 1 K 31/551

A 6 1 K 31/47

A 6 1 K 31/46

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/00

【手続補正書】

【提出日】平成21年9月8日(2009.9.8)

【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

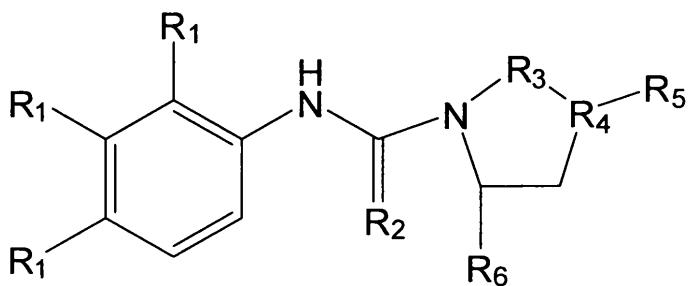
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の式の化合物、および薬学的に許容される担体を含む薬学的組成物：



式中、

それぞれのR<sub>1</sub>は、H、F、C1、Br、R<sub>7</sub>、および-O-R<sub>7</sub>からなる群より独立して選択され、ここでR<sub>7</sub>は置換された炭素1～6個のアルキル、または炭素6～14個のアリール基もしくはアラルキル基であり；

R<sub>2</sub>は、OまたはSから選択され；

R<sub>3</sub>は(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>であり、式中mは1、2、または3であり；

R<sub>4</sub>はNおよび(CH<sub>n</sub>)からなる群より選択され、式中nは1または2に等しく、ただしR<sub>4</sub>が窒素である場合は、R<sub>3</sub>におけるmは1に等しくてはならず；

R<sub>5</sub>は、R<sub>5</sub>が4-キノリニルである場合、2'位の置換はHまたはアミノ基となり得ないことを除き、置換された複素環芳香族基であり；

R<sub>6</sub>はHである。

【請求項2】

少なくとも1つのR<sub>1</sub>が水素以外である、請求項1記載の薬学的組成物。

【請求項3】

前記薬学的組成物が、哺乳動物における、神経発生刺激用および/またはニューロン変性阻害用である、請求項1記載の薬学的組成物。

【請求項4】

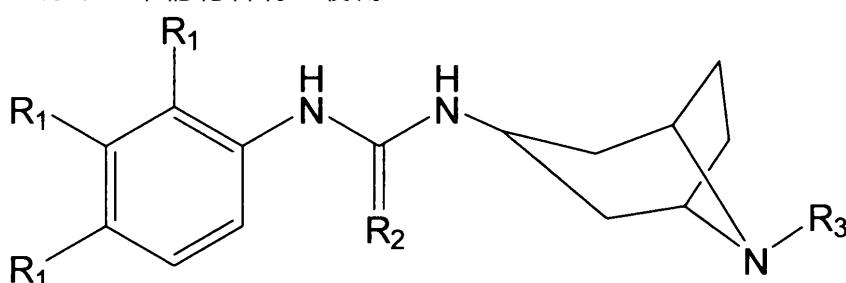
前記哺乳動物がヒトである、請求項3記載の薬学的組成物。

【請求項5】

神経変性疾患、精神障害、または加齢の処置用である、請求項1記載の薬学的組成物。

【請求項6】

哺乳動物における、神経発生刺激用および/またはニューロン変性阻害用の薬剤の製造のための下記化合物の使用：



式中、

それぞれのR<sub>1</sub>は、H、F、C1、Br、R<sub>7</sub>、および-O-R<sub>7</sub>からなる群より独立して選択され、

ここでR<sub>7</sub>は置換された炭素1～6個のアルキル、または炭素6～14個のアリール基もしくはアラルキル基であり；

R<sub>2</sub>は、OまたはSから選択され；

R<sub>3</sub>は、炭素1～10個のアルキル、環状アルキル、アラルキル、置換された芳香族基、または置換されたヘテロ芳香族基から選択される。

【請求項7】

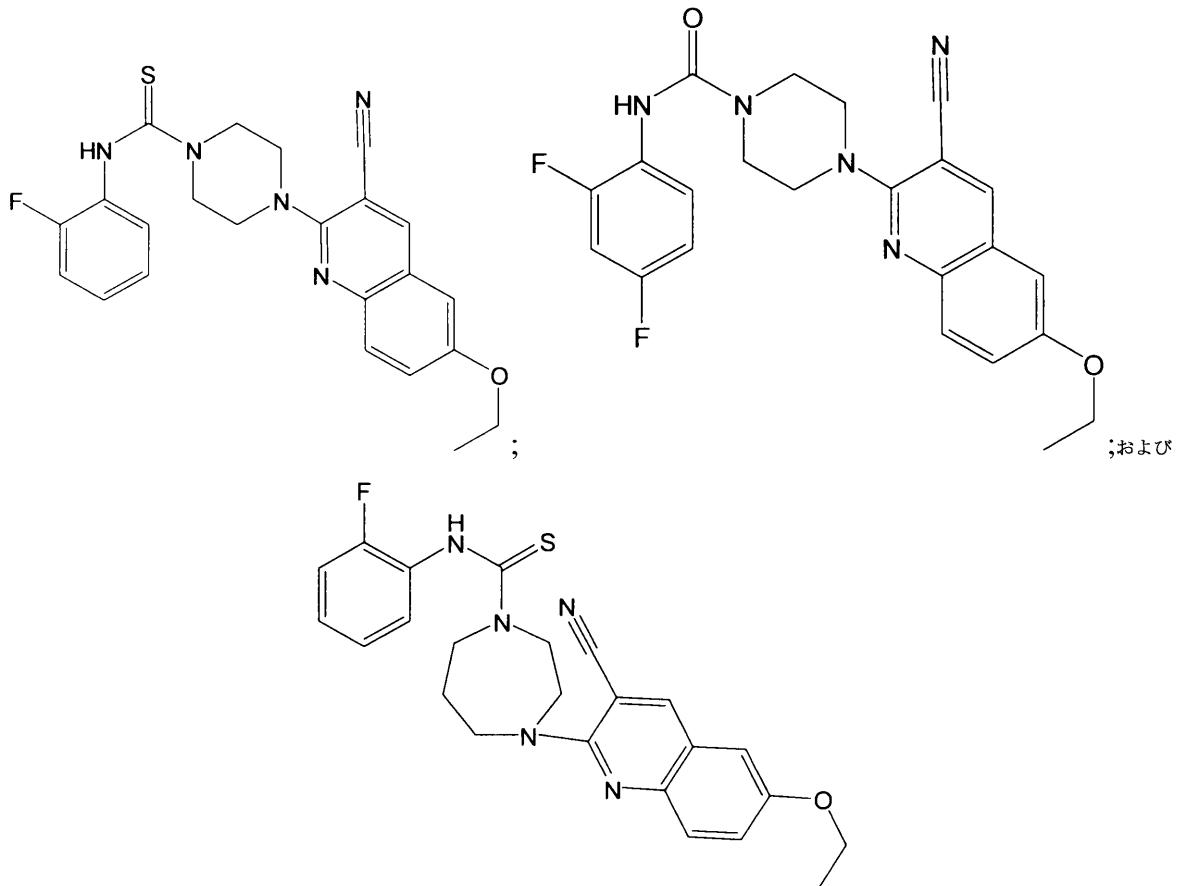
前記哺乳動物がヒトである、請求項6記載の使用。

【請求項8】

前記薬剤が、神経変性疾患、精神障害、または加齢の処置用である、請求項 6 記載の使用。

【請求項 9】

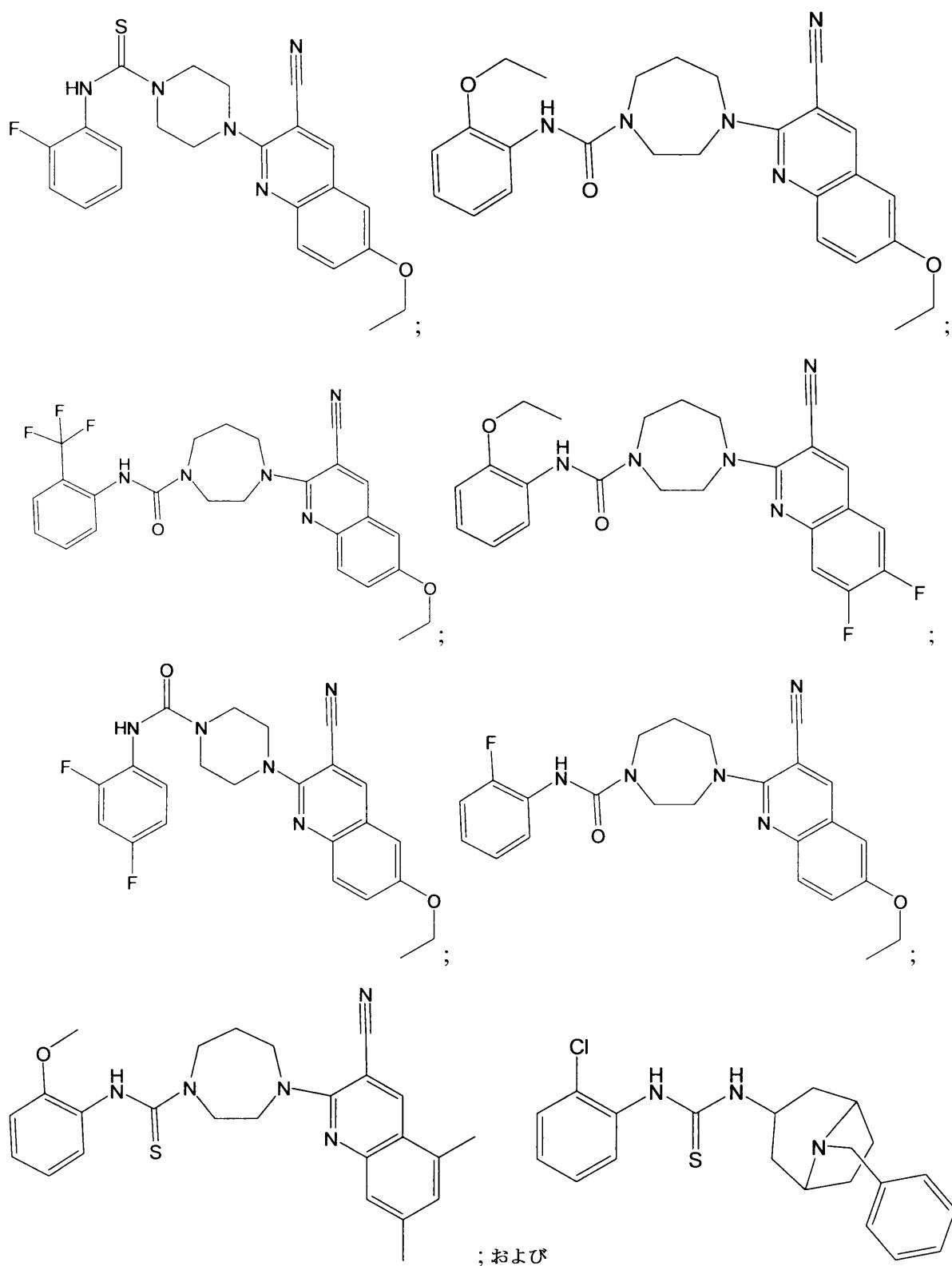
以下からなる群より選択される構造を有する化合物ならびにそれらの生理学的に許容される塩、溶媒和物、および水和物。



。

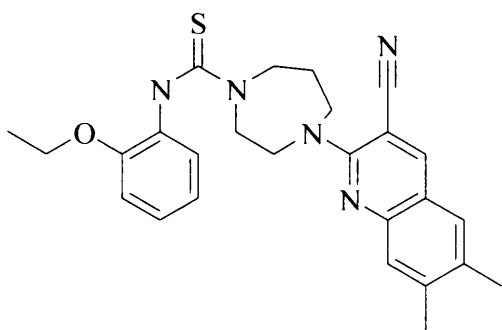
【請求項 10】

哺乳動物における、神経発生刺激用の、および／またはニューロン変性阻害用の薬剤の製造のための下記化合物の使用。



## 【請求項 11】

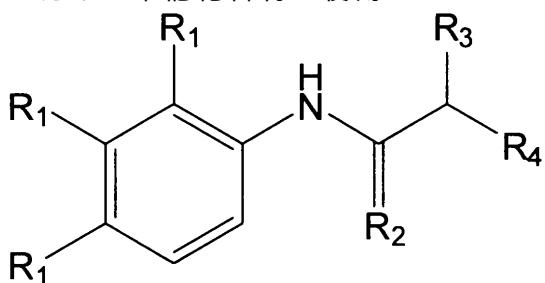
以下の構造を有する化合物、及びその生理学的に許容される塩。



。

## 【請求項 1 2】

哺乳動物における、神経発生刺激用および / またはニューロン変性阻害用の薬剤の製造のための下記化合物の使用 :



式中、

それぞれの R<sub>1</sub> は、 H、 F、 C 1、 Br、 R<sub>7</sub>、 および -O-R<sub>7</sub> からなる群より独立して選択され、ここで R<sub>7</sub> は置換された炭素 1 ~ 6 個のアルキル、または炭素 6 ~ 14 個のアリール基もしくはアラルキル基であり；

R<sub>2</sub> は、 O または S から選択され；

R<sub>3</sub> は、炭素 1 ~ 6 個のアルキルまたは炭素 1 ~ 6 個のエーテルから選択され；

R<sub>4</sub> は、炭素 6 ~ 14 個のアリール、アラルキル、置換された芳香族基、置換されたヘテロ芳香族基、もしくは置換されたヘテロ芳香族 - アルキル基から選択されるか、または R<sub>4</sub> は置換された 3 - キノリニルメチル、2 - ピリジル、2 - ピリジルメチル、2 - もしくは 4 - ピリミジニル、ベンゾ [1, 3] ジオキソール - 5 - イル、もしくはベンズオキサゾリル基から選択される。

## 【請求項 1 3】

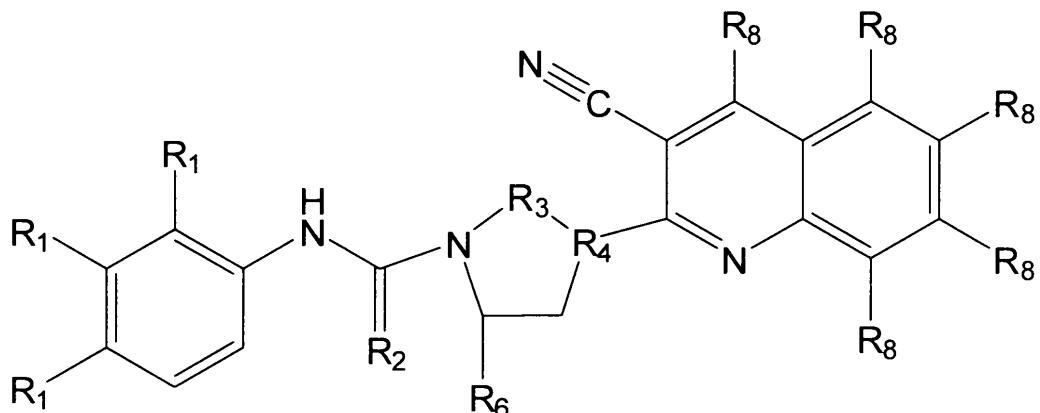
前記哺乳動物がヒトである、請求項 1 2 記載の使用。

## 【請求項 1 4】

前記薬剤が、神経変性疾患、精神障害、または加齢の処置用である、請求項 1 2 記載の使用。

## 【請求項 1 5】

以下の式の化合物、および薬学的に許容される担体を含む薬学的組成物 :



式中、

それぞれの  $R_1$  は、H、F、C1、Br、 $R_7$ 、および $-O-R_7$  からなる群より独立して選択され、ここで  $R_7$  は置換された炭素1~6個のアルキル、または炭素6~14個のアリール基もしくはアラルキル基であり；

$R_2$  は、OまたはSから選択され；

$R_3$  は $(CH_2)_m$ であり、式中mは1、2、または3であり；

$R_4$  はNおよび $(CH_n)$ からなる群より選択され、式中nは1または2に等しく、ただし  $R_4$  が窒素である場合は、 $R_3$  におけるmは1に等しくてはならず；

$R_6$  はHであり；

それぞれの  $R_8$  は、独立して、-X、- $R_9$ 、- $OR_9$ 、- $SR_9$ 、- $N(R_9)_2$ 、-CN、- $NO_2$ 、- $NC(O)R_9$ 、- $C(O)R_9$ 、- $C(O)N(R_9)_2$ 、- $S(O)_2R_9$ 、- $S(O)_2NR_9$ 、- $S(O)R_9$ 、- $C(O)R_9$ 、- $C(O)OR_9$ 、または- $C(O)N(R_9)_2$ であり；

ここでそれぞれのXは独立してハロゲンであり；

それぞれの  $R_9$  は、独立して、-H、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環、保護基、またはプロドラッグ部分である。

【請求項16】

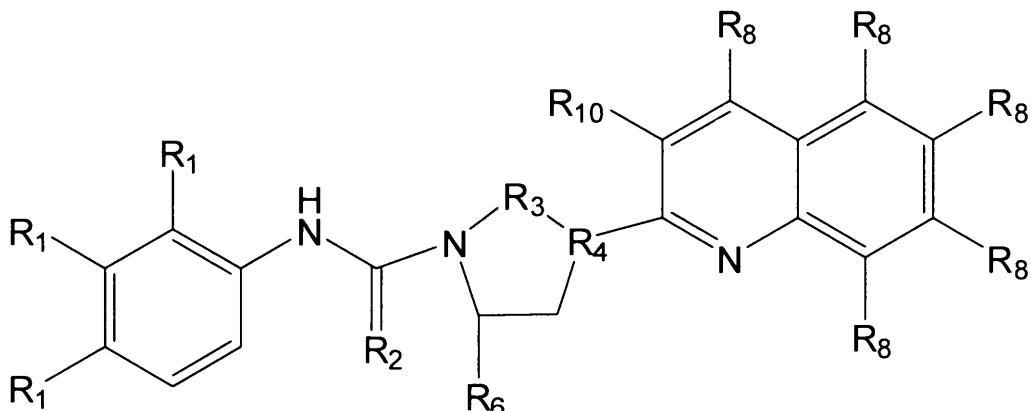
少なくとも1つの  $R_1$  が水素以外である、請求項15記載の薬学的組成物。

【請求項17】

前記薬学的組成物が、哺乳動物における、神経発生刺激用および/またはニューロン変性阻害用である、請求項15記載の薬学的組成物。

【請求項18】

以下の式の化合物、および薬学的に許容される担体を含む薬学的組成物：



式中、

それぞれの  $R_1$  は、H、F、C1、Br、 $R_7$ 、および $-O-R_7$  からなる群より独立して選択され、ここで  $R_7$  は置換された炭素1~6個のアルキル、または炭素6~14個のアリール基もしくはアラルキル基であり；

$R_2$  は、OまたはSから選択され；

$R_3$  は $(CH_2)_m$ であり、式中mは1、2、または3であり；

$R_4$  はNおよび $(CH_n)$ からなる群より選択され、式中nは1または2に等しく、ただし  $R_4$  が窒素である場合は、 $R_3$  におけるmは1に等しくてはならず；

$R_6$  はHであり；

$R_{10}$  は、アルキル、- $C(O)OH$ 、- $C(O)O-$ アルキル、または- $C(O)NH_2$ であり；

それぞれの  $R_8$  は、独立して、-X、- $R_9$ 、- $OR_9$ 、- $SR_9$ 、- $N(R_9)_2$ 、-CN、- $NO_2$ 、- $NC(O)R_9$ 、- $C(O)R_9$ 、- $C(O)N(R_9)_2$ 、- $S(O)_2R_9$ 、- $S(O)_2NR_9$ 、- $S(O)R_9$ 、- $C(O)R_9$ 、- $C(O)OR_9$ 、または- $C(O)N(R_9)_2$ であり；

ここでそれぞれのXは独立してハロゲンであり；

それぞれの  $R_9$  は、独立して、-H、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環、保護基、またはプロドラッグ部分である。

【請求項 19】

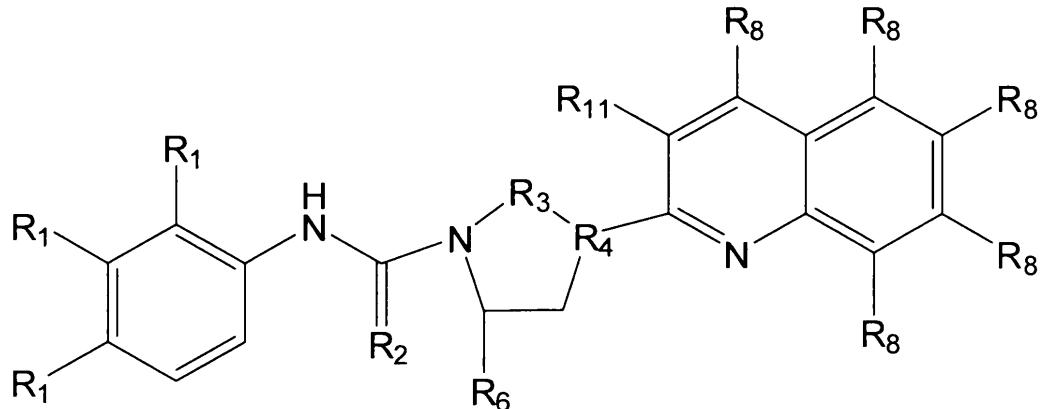
少なくとも 1 つの  $R_1$  が水素以外である、請求項 18 記載の薬学的組成物。

【請求項 20】

前記薬学的組成物が、哺乳動物における、神経発生刺激用および/またはニューロン変性阻害用である、請求項 18 記載の薬学的組成物。

【請求項 21】

以下の式の化合物、および薬学的に許容される担体を含む薬学的組成物：



式中、

それぞれの  $R_1$  は、H、F、Cl、Br、R<sub>7</sub>、および-O-R<sub>7</sub> からなる群より独立して選択され、ここで  $R_7$  は置換された炭素 1~6 個のアルキル、または炭素 6~14 個のアリール基もしくはアラルキル基であり；

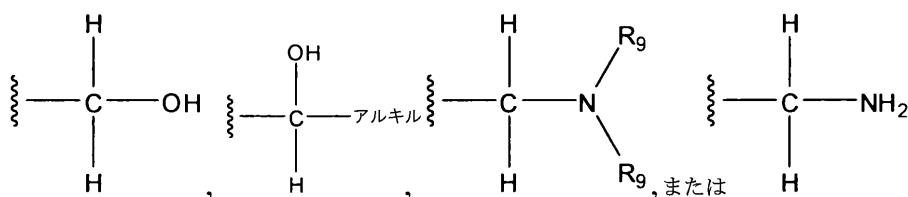
$R_2$  は、O または S から選択され；

$R_3$  は (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> であり、式中 m は 1、2、または 3 であり；

$R_4$  は N および (CH<sub>n</sub>) からなる群より選択され、式中 n は 1 または 2 に等しく、ただし  $R_4$  が窒素である場合は、 $R_3$  における m は 1 に等しくてはならず；

$R_6$  は H であり；

$R_{11}$  は、



であり：かつ

それぞれの  $R_8$  は、独立して、-X、-R<sub>9</sub>、-OR<sub>9</sub>、-SR<sub>9</sub>、-N(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub>、-CN、-NO<sub>2</sub>、-NC(O)R<sub>9</sub>、-C(O)R<sub>9</sub>、-C(O)N(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R<sub>9</sub>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sub>9</sub>、-S(O)R<sub>9</sub>、-C(O)R<sub>9</sub>、-C(O)OR<sub>9</sub>、または-C(O)N(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub> であり；

ここでそれぞれの X は独立してハロゲンであり；

それぞれの  $R_9$  は、独立して、-H、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環、保護基、またはプロドラッグ部分である。

【請求項 22】

少なくとも 1 つの  $R_1$  が水素以外である、請求項 21 記載の薬学的組成物。

【請求項 23】

前記薬学的組成物が、哺乳動物における、神経発生刺激用および/またはニューロン変性阻害用である、請求項 21 記載の薬学的組成物。