

【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24年3月29日 (2012.3.29)

【公表番号】特表2011-513374(P2011-513374A)

【公表日】平成23年4月28日 (2011.4.28)

【年通号数】公開・登録公報2011-017

【出願番号】特願2010-549188(P2010-549188)

【国際特許分類】

C 0 7 D 205/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/397 (2006.01)

A 6 1 K 31/4427 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/501 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 P 1/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 37/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 33/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 205/04

C 0 7 D 401/12 C S P

C 0 7 D 401/14

A 6 1 K 31/397

A 6 1 K 31/4427

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/501

A 6 1 K 31/497

A 6 1 P 1/08

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/20
 A 6 1 P 25/08
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 37/08
 A 6 1 P 37/00
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 31/04
 A 6 1 P 33/00
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 19/10
 A 6 1 P 1/00
 A 6 1 P 9/12
 A 6 1 P 25/22
 A 6 1 P 25/24
 A 6 1 P 25/04
 A 6 1 P 17/04
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成24年2月10日(2012.2.10)

【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

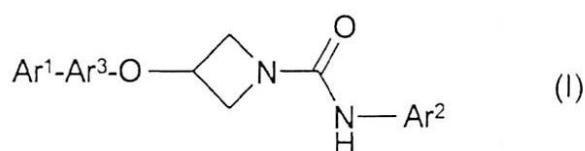
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

【化1】



(Ar¹は、任意に置換されたフェニル又は任意に置換された5又は6個の環原子を有するモノサイクリックヘテロアリアルである；

Ar²は、任意に置換されたフェニル、任意に置換された5又は6個の環原子を有するモノサイクリックヘテロアリアル又は任意に置換された個々の縮合環中に5又は6個の環原子を有する縮合ビスサイクリックヘテロアリアルである；及び

Ar³は、任意に置換されたフェニレン及び任意に置換された5又は6個の環原子を有するモノサイクリックヘテロアリーレン基からなる群から選択された二価の基である)の化合物又はその薬学的に受容な塩。

【請求項2】

Ar¹が、任意に置換されたフェニルである請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

Ar²が、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル又はピリダジニル、任意に置換されたこれらのいずれかである請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項4】

Ar²が、3-ピリジル、ピリミジン-4-イル、ピラジン-2-イル又はピリダジン-3-イル、任意に置換されたこれらのいずれかである請求項1又は2に記載の化合物。

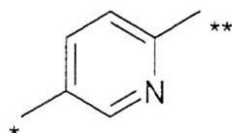
【請求項5】

Ar³が、任意に置換された二価のフェニレン又はピリジニレン基である請求項1～4のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項6】

Ar³基が、任意に置換された二価の、1,4-フェニレン又は式

【化2】



(式中、シングルアスタリスクの印をつけた結合はAr¹に結合し、ダブルアスタリスクの印をつけた結合は式(1)で示される酸素に結合する)

の2,5-ピリジニレン基である請求項5に記載の化合物。

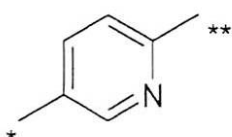
【請求項7】

Ar¹、Ar²及びAr³の任意の置換基が、クロロ、フルオロ、ブロモ、シクロプロピル、メチル、モノ-、ジ-又はトリ-メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、モノフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペントキシ、2-メトキシエトキシ、2-ベンジルオキシ-エトキシ、2-ヒドロキシ-エトキシ、モノ-、ジ-又はトリ-フルオロメトキシ、シアノ、ヒドロキシ、-CO₂R₁及び-SO₂R₁(R₁は水素、メチル又はエチル)テトラゾールイル、-NR₂R₃、-CH₂NR₂R₃及び-C(=O)NR₂R₃(R₂及びR₃は独立に水素、メチル又はエチル)から独立に選択される請求項1～6のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項8】

Ar²が3-ピリジル、ピリミジン-4-イル、ピラジン-2-イル又はピリダジン-3-イルであり；Ar³が、任意に置換されている二価の、1,4-フェニレン又は式

【化3】



(式中、シングルアスタリスクの印をつけた結合はAr¹に結合し、ダブルアスタリスクの印をつけた結合は式(1)で示される酸素に結合する)

の2,5-ピリジニレン基であり；

Ar¹が任意に置換されたフェニルである請求項1に記載の化合物。

【請求項9】

Ar¹が、フェニル、2-フルオロフェニル、3-(2-メトキシ-エトキシ)-フェニル、又は2-メトキシ-5-(2-メトキシ-エトキシ)-フェニルである請求項8に記載の化合物。

【請求項10】

Ar²が、ピリダジン-3-イルである請求項8又は9に記載の化合物。

【請求項11】

3-(ビフェニル-4-イルオキシ)-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッドフェニルアミド、

3-(ビフェニル-4-イルオキシ)-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッド(3-フルオロ-フェニル)-アミド、

3-(ビフェニル-4-イルオキシ)-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッド(2-フルオロ-フェニル)-アミド、

3-(ビフェニル-4-イルオキシ)-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッドピリジン-3-イ

ルアミド、

3-[5-[3-(2-メトキシ-エトキシ)-フェニル]-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッドピリミジン-4-イルアミド、

3-[5-[3-(2-メトキシ-エトキシ)-フェニル]-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッドピラジン-2-イルアミド、

3-[5-[3-(2-メトキシ-エトキシ)-フェニル]-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッドピリダジン-3-イルアミド、

3-[5-[3-(2-メトキシ-エトキシ)-フェニル]-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッドピリジン-3-イルアミド、

3-[5-[3-(2-ベンジルオキシ-エトキシ)-フェニル]-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッドピリダジン-3-イルアミド、

3-[5-[3-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-フェニル]-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッドピリダジン-3-イルアミド、

3-[5-[2-メトキシ-5-(2-メトキシ-エトキシ)-フェニル]-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッドピリダジン-3-イルアミド、

3-[5-(2,5-ジメトキシ-フェニル)-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッドピリダジン-3-イルアミド、

3-(5-フェニル-ピリジン-2-イルオキシ)-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッドピリダジン-3-イルアミド、

3-[5-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッドピリダジン-3-イルアミド、

1-(3-[5-[2-クロロ-5-(2-メトキシ-エトキシ)-フェニル]-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-イル)-2-ピリダジン-3-イル-エタノン、

3-[5-(2-フルオロ-フェニル)-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッドピラジン-2-イルアミド、

3-[5-(2-メトキシ-フェニル)-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッドピリダジン-3-イルアミン、

3-[5-(2-フルオロ-フェニル)-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッドピリダジン-3-イルアミド、

3-[5-(2-フルオロ-3-メトキシ-フェニル)-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッドピリダジン-3-イルアミド、

3-[5-(2-フルオロ-フェニル)-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッド(6-メチル-ピリダジン-3-イル)-アミド、

3-[5-(2-フルオロ-フェニル)-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッド(6-メトキシ-ピリダジン-3-イル)-アミド、

3-[5-(2-フルオロ-フェニル)-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッド(5-メチル-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イル)-アミド、

3-[5-(2-フルオロ-フェニル)-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッドピリダジン-4-イルアミド、

3-[5-(2-フルオロ-フェニル)-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッド(5-メチル-ピリダジン-3-イル)-アミド及び

3-[5-(2-フルオロ-フェニル)-ピリジン-2-イルオキシ]-アゼチジン-1-カルボキシリックアシッド(4-メチル-ピリダジン-3-イル)-アミド

である請求項1～10のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項12】

1以上の薬学的に受容な担体及び/又は賦形剤と共に、請求項1～11のいずれか1つに記載された化合物又はその薬学的に受容な塩を含む医薬組成物。

【請求項13】

請求項1～11のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に受容な塩の効果量を投与することを含むFAAH活性の阻害から恩恵を得る疾病又は医学的状態の治療に使用される請求項1

2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

疾病又は状態が、急性又は慢性疼痛、目眩、嘔吐、吐き気、節食障害、神経学的及び心理学的な病理学、急性又は慢性神経変性疾患、てんかん、睡眠障害、心血管疾患、腎虚血、ガン、免疫系疾患、アレルギー性疾患、寄生虫、ウィルス又はバクテリア伝染性疾患、炎症性疾患、骨粗しょう症、眼球不安、肺疾患、消化器疾患、緑内障関連高血圧及び尿失禁の中から選択される請求項12又は13に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

疾病又は状態が、不安、うつ病、疼痛、炎症、痒疹(pruritus)、又は運動障害である請求項12又は13に記載の医薬組成物。