

【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 18 年 1 月 5 日 (2006.1.5)

【公表番号】特表 2005-504823 (P2005-504823A)

【公表日】平成 17 年 2 月 17 日 (2005.2.17)

【年通号数】公開・登録公報 2005-007

【出願番号】特願 2003-532066 (P2003-532066)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

C 0 7 D 513/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 487/04 1 4 9

A 6 1 K 31/55

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/02

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/28

C 0 7 D 513/04 3 6 1

C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 9 月 29 日 (2005.9.29)

【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

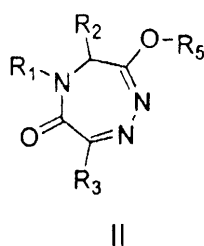
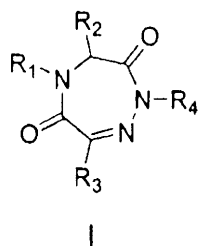
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I 又は II

【化 1】



式中、

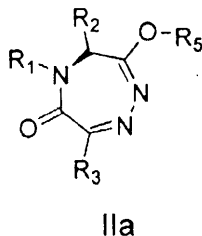
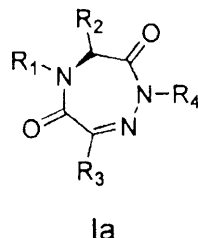
R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 は独立に水素、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、アリール及びヘテロサイクリルから選ばれ、又は R_1 、 R_1 に結合した窒素原子及び R_2 と一緒にあって、S、O及びNよりなる群から選ばれる1～4個のヘテロ原子を有する4～8員複素環を形成し、そして、

R_5 は $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、アリール及びヘテロサイクリルから選ばれ、又は R_1 、 R_1 に結合した窒素原子及び R_2 と一緒にあってS、O及びNよりなる群から選ばれる1～4個のヘテロ原子を有する4～8員複素環を形成する、
の化合物又はその製薬学的に許容できる塩。

【請求項2】

式I a又はII a

【化2】



式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 及び R_5 は請求項1に示されたとおりである、
の構造を有する請求項1記載の化合物。

【請求項3】

R_4 が水素又であるか又はアリールもしくはN含有ヘテロサイクリルで置換された $C_1 \sim C_{10}$ アルキルである請求項2記載の化合物。

【請求項4】

R_3 が $C_4 \sim C_{10}$ アルキルである請求項2記載の化合物。

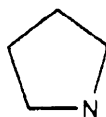
【請求項5】

R_1 、 R_1 に結合した窒素及び R_2 と一緒にあってS、O及びNよりなる群から選ばれる1～4個のヘテロ原子を有する4～8員複素環を形成する請求項2記載の化合物。

【請求項6】

R_1 、 R_1 に結合した窒素及び R_2 と一緒にあって

【化3】



を形成する請求項5記載の化合物。

【請求項7】

1H-ピロロ[2,1-d][1,2,5]トリアゼピン-1,5(2H)-ジオン, 4-(1,1-ジメチルプロピル)-7,8,9,9a-テトラヒドロ-である請求項1記載の化合物。

【請求項8】

1H-ピロロ[2,1-d][1,2,5]トリアゼピン-1,5(2H)-ジオン, 4-(1,1-ジメチルプロピル)-7,8,9,9a-テトラヒドロ-2-[3-(3-ピリジニル)プロピル]-, (9aS)-である請求項1記載の化合物。

【請求項9】

請求項1の化合物と製薬学的に許容できる担体を含んでなる製薬学的組成物。

【請求項10】

疾患又は外傷により引き起こされるニューロン損傷により特徴付けられる症状に苦しむ

患者を治療する製薬学的組成物を調製するための請求項1記載の化合物の使用。

【請求項11】

疾患又は外傷により引き起こされるニューロン損傷により特徴付けられる症状の発症を患者において抑制する製薬学的組成物を調製するための請求項1記載の化合物の使用。

【請求項12】

症状が脳、脊髄又は末梢神経のいずれかの部分に対する外傷により引き起こされる請求項10又は11記載の使用。

【請求項13】

症状がパーキンソン病、アルツハイマー病、脳卒中、多発性硬化症、筋萎縮性側索硬化症、末梢性ニューロパシー及びベル麻痺よりなる群から選ばれる請求項10又は11記載の使用。

【請求項14】

症状がパーキンソン病である請求項13記載の使用。

【請求項15】

症状がアルツハイマー病である請求項13記載の使用。

【請求項16】

症状が糖尿病性ニューロパシーである請求項13記載の使用。

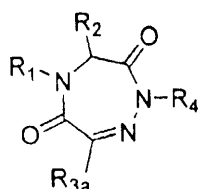
【請求項17】

ニューロン成長を刺激する製薬学的組成物を調製するため請求項1記載の使用。

【請求項18】

R_{3a} が $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、アリール及びヘテロサイクリルから選ばれ、又は R_1 が、 R_1 の結合している窒素原子及び R_2 と一緒にあってS、O及びNよりなる群から選ばれる1～4個のヘテロ原子を有する4～8員複素環を形成する、式Ia

【化4】

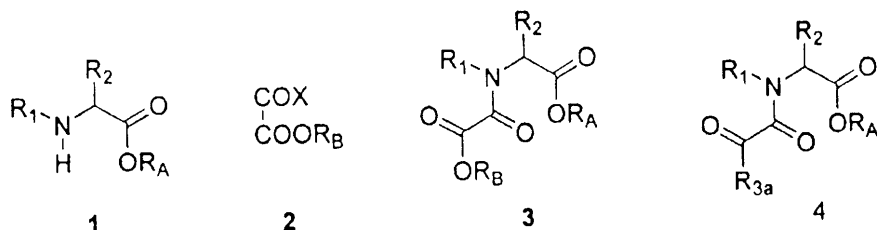


Ia

の化合物を製造する方法であって、

(a) 下記式で表される化合物1を化合物2と反応させて化合物3を生成させ、

【化5】



(b) 化合物3を $R_{3a}-M$ と反応させて上記式で表される化合物4を生成させ、そして

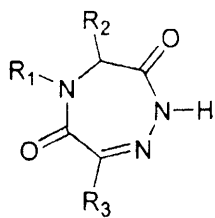
(c) 化合物4を H_2N-NHR_4 と反応させて化合物Iaを生成させる、

ことを含んでなる方法。

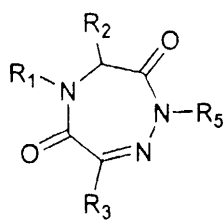
【請求項19】

下記式で表される化合物Icを R_5Y （式中、Yはハロゲンである）と反応させて下記式で表される化合物Id及びIiを生成させることを含んでなる式Id及びIiの化合物を製造する方法。

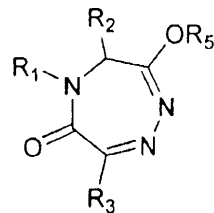
【化 6】



Ic



Id



II

【請求項 20】

化合物 Ic と II をクロマトグラフィーにより分離する段階を更に含んでなる請求項 19 記載の方法。