

【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20年2月7日(2008.2.7)

【公表番号】特表2003-518136(P2003-518136A)

【公表日】平成15年6月3日(2003.6.3)

【出願番号】特願2001-547172(P2001-547172)

【国際特許分類】

C 0 7 D 211/58	(2006.01)
A 6 1 K 31/4468	(2006.01)
A 6 1 K 31/4525	(2006.01)
A 6 1 K 31/4535	(2006.01)
A 6 1 K 31/454	(2006.01)
A 6 1 K 31/4545	(2006.01)
A 6 1 P 1/00	(2006.01)
A 6 1 P 1/12	(2006.01)
A 6 1 P 9/12	(2006.01)
A 6 1 P 11/00	(2006.01)
A 6 1 P 13/02	(2006.01)
A 6 1 P 19/08	(2006.01)
A 6 1 P 23/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/02	(2006.01)
A 6 1 P 25/06	(2006.01)
A 6 1 P 25/22	(2006.01)
A 6 1 P 25/24	(2006.01)
A 6 1 P 25/32	(2006.01)
A 6 1 P 25/34	(2006.01)
A 6 1 P 25/36	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 31/12	(2006.01)
A 6 1 P 35/00	(2006.01)
A 6 1 P 37/02	(2006.01)
C 0 7 D 401/06	(2006.01)
C 0 7 D 405/06	(2006.01)
C 0 7 D 409/06	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 211/58	
A 6 1 K 31/4468	
A 6 1 K 31/4525	
A 6 1 K 31/4535	
A 6 1 K 31/454	
A 6 1 K 31/4545	
A 6 1 P 1/00	
A 6 1 P 1/12	
A 6 1 P 9/12	
A 6 1 P 11/00	
A 6 1 P 13/02	
A 6 1 P 19/08	
A 6 1 P 23/00	
A 6 1 P 25/02	

A 6 1 P 25/06  
 A 6 1 P 25/22  
 A 6 1 P 25/24  
 A 6 1 P 25/32  
 A 6 1 P 25/34  
 A 6 1 P 25/36  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 29/00 1 0 1  
 A 6 1 P 31/12  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 37/02  
 C 0 7 D 401/06  
 C 0 7 D 405/06  
 C 0 7 D 409/06

## 【手続補正書】

【提出日】平成19年12月6日(2007.12.6)

## 【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

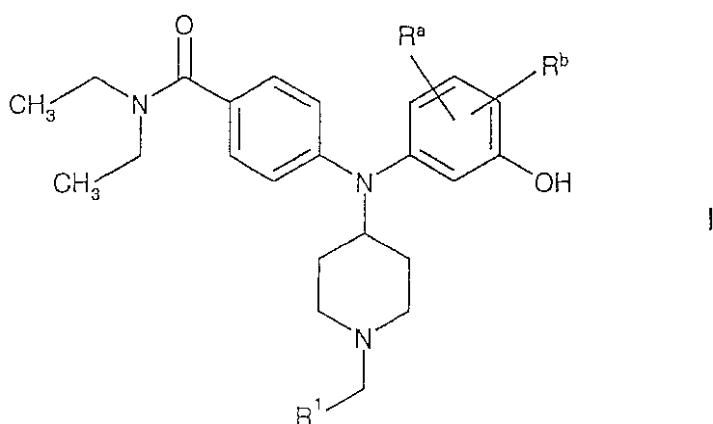
【補正方法】変更

## 【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

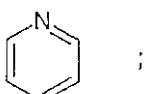
【請求項1】 下記式I

## 【化1】

[式中、R<sup>1</sup>は

- (i) フェニル；
- (ii) ピリジニル

## 【化2】



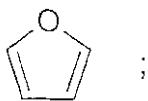
- (iii) チオフェニル

## 【化3】



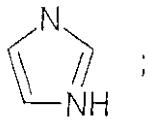
- (iv) フラニル

## 【化4】



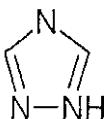
(v) イミダゾリル

## 【化5】



(vi) トリアゾリル

## 【化6】



から選択され；

ここで、各  $R^1$ フェニル環および  $R^1$ ヘテロ芳香族環は、場合によりかつ独立して、直鎖状および分枝鎖状の  $C_1$ ～ $C_6$ アルキル、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $C_1$ ～ $C_6$ アルコキシ、クロロ、フルオロ、プロモおよびヨードから選択される1個、2個または3個の置換基でさらに置換されていてもよく、フェニル環上およびヘテロ芳香族環上の置換基は、該環系の任意の位置に存在することができ；

$R^a$ および $R^b$ はそれぞれ独立して、水素、直鎖状および分枝鎖状の  $C_1$ ～ $C_6$ アルキル、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $C_1$ ～ $C_6$ アルコキシ、クロロ、フルオロ、プロモおよびヨードの何れかから選択される]

の化合物ならびにその製薬上許容される塩。

【請求項2】  $R^a$ および $R^b$ が両方とも水素である、請求項1に記載の化合物。【請求項3】 各  $R^1$ フェニル環および  $R^1$ ヘテロ芳香族環が、場合によりかつ独立して、直鎖状および分枝鎖状の  $C_1$ ～ $C_6$ アルキル、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $C_1$ ～ $C_6$ アルコキシ、クロロ、フルオロ、プロモおよびヨードから選択される1個、2個または3個の置換基でさらに置換されていてもよい、請求項1または2に記載の化合物。【請求項4】  $N,N$ -ジエチル-4-[[(3-ヒドロキシフェニル)[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]アミノ]ベンズアミド； $N,N$ -ジエチル-4-[[(2-プロモ-5-ヒドロキシフェニル)[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]アミノ]-ベンズアミド； $N,N$ -ジエチル-4-[[(5-ヒドロキシ-2-ヨードフェニル)[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]アミノ]-ベンズアミド；4-[[(2-クロロ-5-ヒドロキシフェニル)[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]アミノ]- $N,N$ -ジエチルベンズアミド； $N,N$ -ジエチル-4-[[(2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニル)[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]アミノ]-ベンズアミド； $N,N$ -ジエチル-4-[[(1-(3-フラニルメチル)-4-ピペリジニル)(3-ヒドロキシフェニル)アミノ]-ベンズアミド； $N,N$ -ジエチル-4-[[(3-ヒドロキシフェニル)[1-(3-チエニルメチル)-4-ピペリジニル]アミノ]-ベンズアミド； $N,N$ -ジエチル-4-[[(3-ヒドロキシフェニル)[1-[[(4-(トリフルオロメチル)フェニル)メチル]-4-ピペリジニル]アミノ]-ベンズアミド； $N,N$ -ジエチル-4-[[(3-ヒドロキシフェニル)[1-[(4-ヨードフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]アミノ]-ベンズアミド $N,N$ -ジエチル-4-[[(1-[(4-プロモフェニル)メチル]-4-ピペリジニ

ル] (3-ヒドロキシフェニル)アミノ]-ベンズアミド；  
 N,N-ジエチル-4-[ [1-[ (4-クロロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル] (3-ヒドロキシフェニル)アミノ]-ベンズアミド；  
 N,N-ジエチル-4-[ [1-[ (4-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル] (3-ヒドロキシフェニル)アミノ]-ベンズアミド；  
 4-[ [1-[ (2,4-ジクロロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル] (3-ヒドロキシフェニル)アミノ]-N,N-ジエチル-ベンズアミド；  
 N,N-ジエチル-4-[ [1-(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル] (3-ヒドロキシフェニル)アミノ]ベンズアミド；  
 N,N-ジエチル-4-[ [1-(2-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル] (3-ヒドロキシフェニル)アミノ]-ベンズアミド；および  
 N,N-ジエチル-4-[ (3-ヒドロキシフェニル)[1-[ (4-メチルフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]アミノ]-ベンズアミド  
 から選択される化合物。

【請求項5】 その塩酸塩、硫酸塩、酒石酸塩またはクエン酸塩の形態で存在する、請求項1～4の何れかに記載の化合物。

【請求項6】 治療に使用するための、請求項1～5の何れかに記載の化合物。

【請求項7】 治療が疼痛処理である、請求項6に記載の化合物。

【請求項8】 治療が胃腸管障害に向けられる、請求項6に記載の化合物。

【請求項9】 治療が脊髄損傷に向けられる、請求項6に記載の化合物。

【請求項10】 治療が交感神経系の障害に向けられる、請求項6に記載の化合物。

【請求項11】 疼痛処理に用いられる医薬を製造するための、請求項1に記載の式Iの化合物の使用。

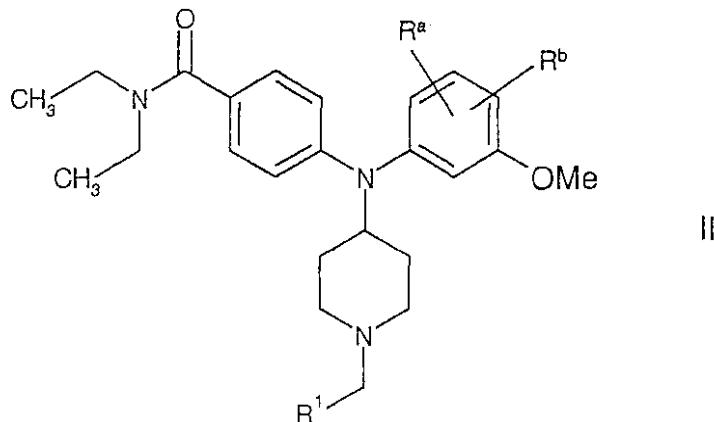
【請求項12】 胃腸管障害の処置に用いられる医薬を製造するための、請求項1に記載の式Iの化合物の使用。

【請求項13】 脊髄損傷の処置に用いられる医薬を製造するための、請求項1に記載の式Iの化合物の使用。

【請求項14】 請求項1に記載の化合物を活性成分として薬理学上および製薬上許容される担体と一緒に含む医薬組成物。

【請求項15】 下記式II

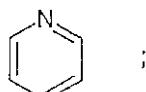
【化7】



[式中、R<sup>1</sup>は

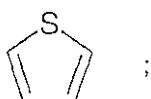
- (i) フェニル；
- (ii) ピリジニル

【化8】



(iii) チオフェニル

【化9】



;

(iv) フラニル

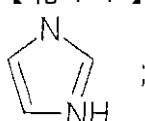
【化10】



;

(v) イミダゾリル

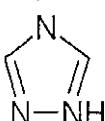
【化11】



;

(vi) トリアゾリル

【化12】



;

の何れかから選択され；

ここで、各  $R^1$ フェニル環および  $R^1$ ヘテロ芳香族環は、場合によりかつ独立して、直鎖状および分枝鎖状の  $C_1 \sim C_6$ 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、ブロモおよびヨードから選択される 1 個、2 個または 3 個の置換基でさらに置換されていてもよく、フェニル環上およびヘテロ芳香族環上の置換基は、該環系の任意の位置に存在することができ； $R^a$ および $R^b$ はそれぞれ独立して、水素、直鎖状および分枝鎖状の  $C_1 \sim C_6$ 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、ブロモおよびヨードから選択される]

の化合物。