

【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 3 月 23 日 (2006.3.23)

【公表番号】 特表 2005-516994(P2005-516994A)

【公表日】 平成 17 年 6 月 9 日 (2005.6.9)

【年通号数】 公開・登録公報 2005-022

【出願番号】 特願 2003-565486(P2003-565486)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/166 (2006.01)

A 6 1 K 31/4045 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/10 (2006.01)

A 6 1 P 1/12 (2006.01)

A 6 1 P 1/14 (2006.01)

A 6 1 P 13/10 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/166

A 6 1 K 31/4045

A 6 1 K 31/55

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/10

A 6 1 P 1/12

A 6 1 P 1/14

A 6 1 P 13/10

【手続補正書】

【提出日】 平成 18 年 1 月 31 日 (2006.1.31)

【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

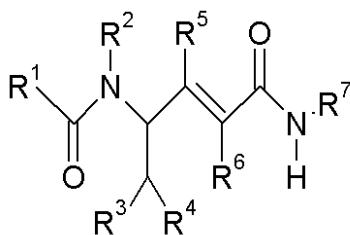
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

内臓の機能性運動障害、好ましくは過敏性腸症候群または機能性消化不良の処置のための、活性成分として遊離の形態または医薬上許容される塩の形態の式 I

【化 1】



〔式中、

R¹ は、非置換、またはハロゲン、C₁ - C₇ - アルキル、トリフルオロメチル、ヒドロキシおよび C₁ - C₇ - アルコキシからなる群から選択される 1、2 もしくは 3 個の置換基により置換されたフェニルであり、

R^2 は、水素または $C_1 - C_7$ -アルキルであり、

R^3 は、水素、 $C_1 - C_7$ -アルキル、あるいは非置換、またはハロゲン、 $C_1 - C_7$ -アルキル、トリフルオロメチル、ヒドロキシおよび $C_1 - C_7$ -アルコキシからなる群から選択される 1、2 もしくは 3 個の置換基により置換されたフェニルであり、

R^4 は、非置換、またはハロゲン、 $C_1 - C_7$ -アルキル、トリフルオロメチル、ヒドロキシおよび $C_1 - C_7$ -アルコキシからなる群から選択される 1、2 もしくは 3 個の置換基により置換されたフェニル；あるいはナフチル、1H-インドール-3-イルまたは 1- $C_1 - C_7$ -アルキル-インドール-3-イルであり、

R^5 および R^6 は、それぞれ互いに独立して、水素または $C_1 - C_7$ -アルキルであり、

R^5 および R^6 の少なくとも一方は、水素であり、そして

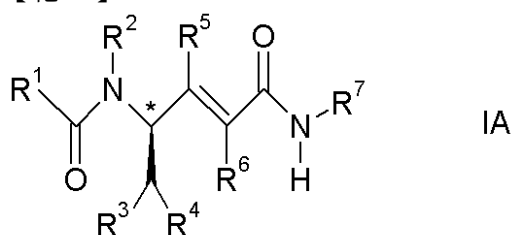
R^7 は、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、D-アザシクロヘプタン-2-オン-3-イルまたは L-アザシクロヘプタン-2-オン-3-イルである。]

で示される化合物を、所望により医薬上許容される希釈剤または担体とともに含んでなる医薬組成物。

【請求項 2】

式 I の化合物が式 I A

【化 2】



〔式中、*はR配置を示し、そして R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は請求項 1 において定義したとおりである。〕

で示される化合物である、請求項 1 に記載の 医薬組成物。

【請求項 3】

R^1 が、フェニル、3,5-ビストリフルオロメチル-フェニルまたは 3,4,5-トリメトキシフェニルであり、

R^2 が、水素または $C_1 - C_7$ -アルキルであり、

R^3 が、水素またはフェニルであり、

R^4 が、フェニル、ハローフェニル、ジハローフェニル、トリハローフェニル、2-ナフチル、1H-インドール-3-イルまたは 1- $C_1 - C_7$ -アルキル-インドール-3-イルであり、

R^5 および R^6 が、それぞれ互いに独立して、水素または $C_1 - C_7$ -アルキルであり、

R^5 および R^6 の少なくとも一方は、水素であり、そして

R^7 が、 $C_5 - C_7$ シクロアルキル、D-アザシクロヘプタン-2-オン-3-イルまたは L-アザシクロヘプタン-2-オン-3-イルである、

請求項 1 または 2 に記載の 医薬組成物。

【請求項 4】

R^1 が、3,5-ビストリフルオロメチル-フェニルであり、

R^2 が、水素、メチルまたはエチルであり、

R^3 が、水素またはフェニルであり、

R^4 が、フェニル、4-クロロフェニル、4-フルオロフェニル、3,4-ジクロロフェニル、3,4-ジフルオロフェニル、3-フルオロ-4-クロロフェニル、3,4,5-トリフルオロフェニル、2-ナフチル、1H-インドール-3-イルまたは 1-メチル-インドール-3-イルであり、

R^5 および R^6 が、それぞれ互いに独立して、水素またはメチルであり、 R^5 および R^6 の少なくとも一方は、水素であり、そして

R⁷ が、シクロヘキシル、D-アザシクロヘプタン-2-オン-3-イルまたはL-アザシクロヘプタン-2-オン-3-イルである、

請求項1または2に記載の医薬組成物。

【請求項5】

R¹ が、3,5-ビストリフルオロメチルフェニルであり、

R² が、水素またはメチルであり、

R³ が、水素またはフェニルであり、

R⁴ が、フェニル、4-クロロフェニル、3,4-ジクロロフェニル、2-ナフチル、1H-インドール-3-イルまたは1-メチルインドール-3-イルであり、

R⁵ および R⁶ が、水素であり、そして

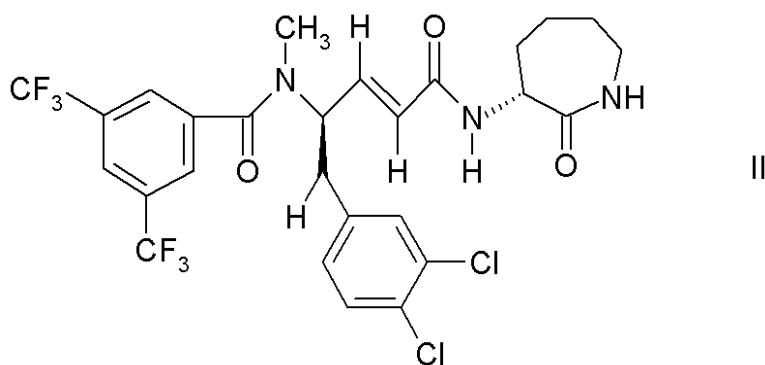
R⁷ が、シクロヘキシル、D-アザシクロヘプタン-2-オン-3-イルまたはL-アザシクロヘプタン-2-オン-3-イルである、

請求項1または2に記載の医薬組成物。

【請求項6】

式Iの化合物が、式

【化3】



で示される化合物である、請求項1に記載の医薬組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0033

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0033】

可変要素の性質および不斉中心の対応する数および選択された出発物質および手順に依存して、式Iの化合物は、立体異性体の混合物、たとえばジアステレオマーの混合物またはエナンチオマーの混合物、たとえばラセミ体の形態で、または場合によっては純粋な立体異性体の形態で得られ得る。当該方法にしたがってまたはいくつかの他の方法により得られ得るジアステレオマーの混合物は、常套の方法で、エナンチオマーの混合物、たとえばラセミ体へと、または個々のジアステレオ異性体、たとえば分別晶出、蒸留および／またはクロマトグラフィーによる既知の方法での構成要素間の物理化学的相違に基づいて、分離され得る。有利には、より活性な異性体が単離される。