

【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7月24日(2008.7.24)

【公表番号】特表2008-504267(P2008-504267A)

【公表日】平成20年2月14日(2008.2.14)

【年通号数】公開・登録公報2008-006

【出願番号】特願2007-518190(P2007-518190)

【国際特許分類】

C 07 D 513/04	(2006.01)
A 61 K 31/429	(2006.01)
A 61 P 25/14	(2006.01)
A 61 P 25/22	(2006.01)
A 61 P 25/24	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
C 07 H 15/26	(2006.01)
A 61 K 31/7056	(2006.01)

【F I】

C 07 D 513/04	3 3 1
A 61 K 31/429	
A 61 P 25/14	
A 61 P 25/22	
A 61 P 25/24	
A 61 P 25/28	
C 07 H 15/26	C S P
A 61 K 31/7056	

【手続補正書】

【提出日】平成20年6月9日(2008.6.9)

【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

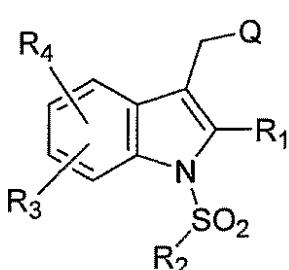
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物、あるいはそれらの立体異性体または薬学的に受容可能な塩：

【化1】



(I)

ここで、

Q は、  $\text{CO}_2\text{R}_5$  または  $\text{CH}_2\text{NR}_6\text{COR}_7$  である；

$\text{R}_1$  は、 H または  $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$  アルキルである；

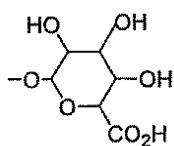
$\text{R}_2$  は、アリールまたはヘテロアリール基であり、各々は、必要に応じて、置換されているか、あるいは、必要に応じて置換した 8 員 ~ 13 員二環式または三環式環系であり、該環系は、橋頭において、N 原子を有し、そして必要に応じて、1 個、2 個または 3 個の追加ヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、N、O または S から選択される；

$\text{R}_3$  および  $\text{R}_4$  は、それぞれ別個に、H、ハロゲン、CN、 $\text{OCO}_2\text{R}_8$ 、 $\text{CO}_2\text{R}_9$ 、 $\text{CONR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $\text{CNR}_{12}\text{NR}_{13}\text{R}_{14}$ 、 $\text{SO}_m\text{R}_{15}$ 、 $\text{NR}_{16}\text{R}_{17}$ 、O、 $\text{R}_{18}$ 、 $\text{COR}_{19}$ 、あるいは  $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$  アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$  アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$  アルキニル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$  シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、アリールまたはヘテロアリール基であり、各々は、必要に応じて、置換されている；

$\text{R}_5$  および  $\text{R}_6$  は、それぞれ別個に、H または  $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$  アルキルである；

$\text{R}_7$  は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$  アルキルまたは

## 【化 2】



である；

$m$  は、0、あるいは 1 または 2 の整数である；

$\text{R}_8$ 、 $\text{R}_9$ 、 $\text{R}_{15}$  および  $\text{R}_{19}$  は、それぞれ別個に、H、あるいは  $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$  アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$  アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$  アルキニル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$  シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、アリールまたはヘテロアリール基であり、各々は、必要に応じて、置換されている；

$\text{R}_{10}$ 、 $\text{R}_{11}$  および  $\text{R}_{18}$  は、それぞれ別個に、H、あるいは  $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$  アルキル、アリールまたはヘテロアリール基であり、各々は、必要に応じて、置換されているか、あるいは  $\text{R}_{10}$  および  $\text{R}_{11}$  は、それらが結合する原子と一緒にになって、5 員 ~ 7 員環を形成し得、該環は、必要に応じて、別のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、O、N または S から選択される；そして

$\text{R}_{12}$ 、 $\text{R}_{13}$ 、 $\text{R}_{14}$ 、 $\text{R}_{16}$  および  $\text{R}_{17}$  は、それぞれ別個に、H、あるいは  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル、アリールまたはヘテロアリール基であり、各々は、必要に応じて、置換されている；あるいは  $\text{R}_{13}$  および  $\text{R}_{14}$  または  $\text{R}_{16}$  および  $\text{R}_{17}$  は、それらが結合する原子と一緒にになって、5 員 ~ 7 員環を形成し得、該環は、必要に応じて、別のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、O、N または S から選択される。

化合物、あるいはそれらの立体異性体または薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 2】

$\text{R}_1$ 、 $\text{R}_3$  および  $\text{R}_4$  が、H である、請求項 1 に記載の化合物。

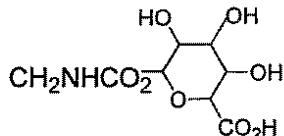
## 【請求項 3】

$\text{R}_2$  が、イミダゾリルまたはイミダゾチアゾリル基であり、各々が、必要に応じて、置換されている、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

Q が、 $\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{CH}_2\text{NHCOCH}_3$  または

【化 3】



である、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

## 【請求項5】

以下からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物：

N - ( 2 - { 1 - [ ( 6 - クロロイミダゾ [ 2 , 1 - b ] [ 1 , 3 ] チアゾール - 5 - イル ) スルホニル ] - 1 H - インドール - 3 - イル } エチル ) アセトアミド；

1 - O - { [ ( 2 - { 1 - [ ( 6 - クロロイミダゾ [ 2 , 1 - b ] [ 1 , 3 ] チアゾール - 5 - イル ) スルホニル ] - 1 H - インドール - 3 - イル } エチル ) アミノ ] カルボニル } - - D - グルコピラヌロン酸 :

{ 1 - [ ( 6 - クロロイミダゾ [ 2 , 1 - b ] [ 1 , 3 ] チアゾール - 5 - イル ) スルホニル ] - 1 H - インドール - 3 - イル } 酢酸；

N - [ ( 1 - { [ 4 - クロロ - 2 - ( メチルチオ ) - 1 H - イミダゾール - 5 - イル ]  
スルホニル } - 1 H - インドール - 3 - イル ) メチル ] アセトアミド ;

### それらの立体異性体；および

それらの薬学的に受容可能な塩。

### 【請求項 6】

N - ( 2 - { 1 - [ ( 6 - クロロイミダゾ [ 2 , 1 - b ] [ 1 , 3 ] チアゾール - 5 - イル ) スルホニル ] - 1 H - インドール - 3 - イル } エチル ) アセトアミドである、請求項 5 に記載の化合物。

### 【請求項 7】

1 - O - { [ ( 2 - { 1 - [ ( 6 - クロロイミダゾ [ 2 , 1 - b ] [ 1 , 3 ] チアゾール - 5 - イル ) スルホニル ] - 1 H - インドール - 3 - イル } エチル ) アミノ ] カルボニル } - - D - グルコピラヌロン酸である、請求項 5 に記載の化合物。

### 【請求項 8】

必要とする患者において 5 - H T 6 レセプターに関連したまたはそれにより影響される中枢神経系障害を治療するための組成物であって、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物の治療有効量を含む、組成物。

### 【請求項 9】

前記障害が、神経変性疾患；不安障害；および認知障害からなる群から選択される、請求項8に記載の組成物。

【請求項 10】

前記不安または認知障害が、多動症候群；強迫性障害；および全般性不安障害からなる群から選択される、請求項9に記載の組成物。

### 【請求項 11】

薬学的に受容可能な担体と、請求項1～7のいずれか1項に記載の式Iの化合物の有効量とを含有する、医薬組成物。

## 【請求項 12】

(1-アリールスルホニル-1H-インドール-3-イル)エチルアミン誘導体の代謝を定量する方法であって、請求項1～7のいずれか1項に記載の式Iの化合物の存在について、試験試料を評価する工程を包含する、方法。

### 【請求項 13】

神経変性疾患、不安障害または認知障害を治療する医薬を製造するための、請求項1～7のいずれか1項に記載の化合物の使用。