

【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22年11月18日(2010.11.18)

【公表番号】特表2010-504367(P2010-504367A)

【公表日】平成22年2月12日(2010.2.12)

【年通号数】公開・登録公報2010-006

【出願番号】特願2009-529679(P2009-529679)

【国際特許分類】

C 07 D 215/38	(2006.01)
A 61 P 15/00	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
A 61 K 31/4709	(2006.01)
C 07 D 487/08	(2006.01)
C 07 D 221/06	(2006.01)
A 61 K 31/473	(2006.01)
A 61 P 15/10	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 25/14	(2006.01)
A 61 P 21/00	(2006.01)
A 61 P 25/24	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 25/16	(2006.01)

【F I】

C 07 D 215/38	C S P
A 61 P 15/00	
A 61 K 31/496	
C 07 D 401/14	
A 61 K 31/4709	
C 07 D 487/08	
C 07 D 221/06	
A 61 K 31/473	
A 61 P 15/10	
A 61 P 25/28	
A 61 P 25/14	
A 61 P 21/00	
A 61 P 25/24	
A 61 P 25/00	
A 61 P 25/16	

【手続補正書】

【提出日】平成22年9月22日(2010.9.22)

【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

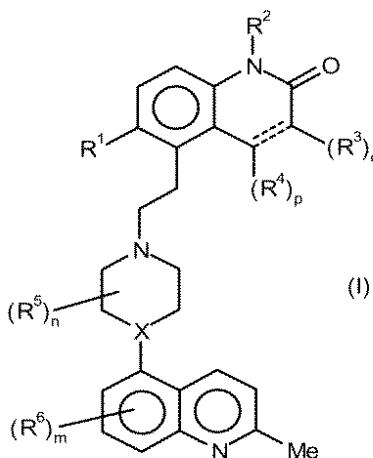
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：  
【化1】



[式中、  
R<sup>1</sup>は、C<sub>1-6</sub>アルキル、ハロまたはハロC<sub>1-6</sub>アルキルであり；  
R<sup>2</sup>は、水素またはC<sub>1-6</sub>アルキルであり；

【化2】

は、単結合または二重結合であり（ここで、

【化3】

が二重結合である場合、pおよびqは1であり；

【化4】

が単結合である場合、pおよびqは2である）；

各R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は、同一であっても異なっていてもよく、水素、C<sub>1-6</sub>アルキルまたはハロC<sub>1-6</sub>アルキルであるか；または

【化5】

が単結合である場合、1個のR<sup>3</sup>および1個のR<sup>4</sup>がそれらの相互接続原子と一緒にになって、同一であっても異なっていてもよい1個または2個のハロまたはメチル基によって置換されていてもよいシクロプロパン環を形成し；

Xは、CHまたはNであり；

存在する場合の各R<sup>5</sup>は、同一であっても異なっていてもよく、C<sub>1-6</sub>アルキルまたはハロであるか；または2個のR<sup>5</sup>基が連結して、1個または2個の原子を含有する橋を形成してもよく；

nは、0、1、2または3であり；

存在する場合の各R<sup>6</sup>は、同一であっても異なっていてもよく、C<sub>1-6</sub>アルキルまたはハロであり；

mは、0、1、2または3である]

で示される化合物。

【請求項2】

R<sup>1</sup>がC<sub>1-6</sub>アルキル、ハロまたはハロC<sub>1-6</sub>アルキルであり；

R<sup>2</sup>が水素またはC<sub>1-6</sub>アルキルであり；

【化6】

が単結合または二重結合であり；

各R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>が、同一であっても異なっていてもよく、水素、C<sub>1-6</sub>アルキルまたは

ハロ  $C_{1-6}$  アルキルであり；ここで、

i )

**【化 7】**

が二重結合である場合、p および q が 1 であり、

i i )

**【化 8】**

が単結合である場合、p および q が 2 であり、1 個の  $R^3$  および 1 個の  $R^4$  が、それらの相互接続原子と一緒にになって、同一であっても異なっていてもよい 1 個または 2 個のハロまたはメチル基によって置換されていてもよいシクロプロパン環を形成し；

X が C H または N であり；

存在する場合の各  $R^5$  が、同一であっても異なっていてもよく、 $C_{1-6}$  アルキルまたはハロであるか；または 2 個の  $R^5$  基が連結して、1 個または 2 個の原子を含有する橋を形成してもよく；

n が 0、1、2 または 3 であり；

存在する場合の各  $R^6$  が、同一であっても異なっていてもよく、 $C_{1-6}$  アルキルまたはハロであり；

m が 0、1、2 または 3 である、

請求項 1 記載の化合物。

**【請求項 3】**

$R^1$  が  $C_{1-6}$  アルキルである、請求項 1 または 2 記載の化合物。

**【請求項 4】**

$R^2$  が水素または  $C_{1-6}$  アルキルである、請求項 1 ~ 3 いずれか 1 項記載の化合物。

**【請求項 5】**

**【化 9】**

が単結合であり、各  $R^3$  および各  $R^4$  が水素である、請求項 1 記載の化合物。

**【請求項 6】**

n が 0、1 または 2 である、請求項 1 ~ 5 いずれか 1 項記載の化合物。

**【請求項 7】**

存在する場合の各  $R^5$  が  $C_{1-6}$  アルキルである、請求項 1 ~ 6 いずれか 1 項記載の化合物。

。

**【請求項 8】**

2 個の  $R^5$  基が結合して橋を形成する場合、該橋が 2 個の炭素原子を含有し、該橋が非隣接炭素原子に結合している、請求項 1 ~ 6 いずれか 1 項記載の化合物。

**【請求項 9】**

m が 0 または 1 である、請求項 1 ~ 8 いずれか 1 項記載の化合物。

**【請求項 10】**

存在する場合の各  $R^6$  がキノリン環の 7 位に結合している、請求項 1 ~ 9 いずれか 1 項記載の化合物。

**【請求項 11】**

式 (I) で示される化合物が以下のものからなる群から選択される、請求項 1 記載の化合物：

6 - メチル - 5 - { 2 - [ 4 - ( 2 - メチルキノリン - 5 - イル) ピペラジン - 1 - イル] エチル } - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 2 ( 1 H ) - オン ( 化合物 1 ) ;

5 - { 2 - [( 2 S ) - 4 - ( 7 - フルオロ - 2 - メチルキノリン - 5 - イル) - 2 - メチルピペラジン - 1 - イル] エチル } - 6 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 2 ( 1 H ) - オン ( 化合物 2 ) ;

1 , 6 - ジメチル - 5 - { 2 - [ 4 - ( 2 - メチルキノリン - 5 - イル) ピペラジン - 1 -

イル]エチル} - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 2(1H) - オン ( 化合物 7 ) ;  
6 - メチル - 5 - { 2 - [ 4 - ( 2 - メチル - 5 - キノリニル) - 1 - ピペラジニル]エチル } - 2(1H) - キノリノン ( 化合物 14 ) ;  
5 - { 2 - [ 4 - ( 7 - フルオロ - 2 - メチル - 5 - キノリニル) - 1 - ピペラジニル]エチル } - 6 - メチル - 2(1H) - キノリノン ( 化合物 15 ) ;  
6 - メチル - 5 - { 2 - [ 4 - ( 2 - メチル - 5 - キノリニル) - 1 - ピペリジニル]エチル } - 2(1H) - キノリノン ( 化合物 16 ) ;  
5 - { 2 - [ 4 - ( 7 - フルオロ - 2 - メチル - 5 - キノリニル) - 1 - ピペラジニル]エチル } - 1 , 6 - ジメチル - 2(1H) - キノリノン ( 化合物 19 ) ;  
1 , 6 - ジメチル - 5 - { 2 - [(2S) - 2 - メチル - 4 - ( 2 - メチル - 5 - キノリニル) - 1 - ピペラジニル]エチル } - 2(1H) - キノリノン ( 化合物 21 ) ;  
5 - { 2 - [(2S) - 4 - ( 7 - フルオロ - 2 - メチル - 5 - キノリニル) - 2 - メチル - 1 - ピペラジニル]エチル } - 1 , 6 - ジメチル - 2(1H) - キノリノン ( 化合物 23 ) ; および  
3 , 6 - ジメチル - 7 - { 2 - [(2S) - 2 - メチル - 4 - ( 2 - メチル - 5 - キノリニル) - 1 - ピペラジニル]エチル } - 1 , 1a , 3 , 7b - テトラヒドロ - 2H - シクロプロパ [ c ] キノリン - 2 - オン ( 化合物 33 ) 。

【請求項 1 2】

式 ( I ) で示される化合物が 6 - メチル - 5 - { 2 - [ 4 - ( 2 - メチルキノリン - 5 - イル)ピペラジン - 1 - イル]エチル } - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 2(1H) - オン ( 化合物 1 ) である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 3】

請求項 1 ~ 1 2 いずれか 1 項記載の化合物の医薬上許容される塩。

【請求項 1 4】

医薬として用いるための請求項 1 ~ 1 2 いずれか 1 項記載の化合物または請求項 1 3 記載の塩。

【請求項 1 5】

性機能障害の治療用または予防用の薬剤の製造における請求項 1 ~ 1 2 いずれか 1 項記載の化合物または請求項 1 3 記載の塩の使用。