

【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6月19日 (2008.6.19)

【公表番号】特表2008-502651 (P2008-502651A)

【公表日】平成20年1月31日 (2008.1.31)

【年通号数】公開・登録公報2008-004

【出願番号】特願2007-515944 (P2007-515944)

【国際特許分類】

C 07 D 211/46 (2006.01)

A 61 K 31/445 (2006.01)

C 07 D 211/58 (2006.01)

A 61 K 31/4468 (2006.01)

C 07 D 211/48 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 25/04 (2006.01)

A 61 P 25/06 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 25/18 (2006.01)

A 61 P 25/22 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 25/30 (2006.01)

A 61 P 25/32 (2006.01)

A 61 P 25/34 (2006.01)

A 61 P 25/36 (2006.01)

A 61 P 21/00 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 1/00 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 25/02 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 15/08 (2006.01)

A 61 P 7/12 (2006.01)

A 61 P 15/10 (2006.01)

A 61 P 25/20 (2006.01)

A 61 P 1/14 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 211/46 C S P

A 61 K 31/445

C 07 D 211/58

A 61 K 31/4468

C 07 D 211/48

A 61 P 25/00

A 61 P 25/04

A 61 P 25/06

A 61 P 25/16

A 61 P 25/18

A 6 1 P 25/22
 A 6 1 P 25/24
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 25/30
 A 6 1 P 25/32
 A 6 1 P 25/34
 A 6 1 P 25/36
 A 6 1 P 21/00
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 1/00
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 25/02
 A 6 1 P 3/04
 A 6 1 P 15/08
 A 6 1 P 7/12
 A 6 1 P 15/10
 A 6 1 P 25/20
 A 6 1 P 1/14
 A 6 1 P 43/00 1 0 5

【手続補正書】

【提出日】平成20年4月21日(2008.4.21)

【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

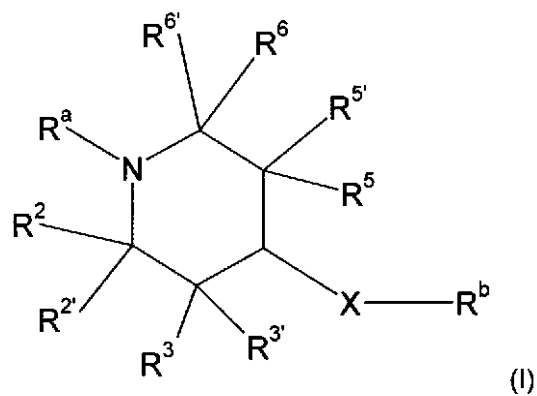
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I のピペリジン誘導体、

【化 1】



任意のその異性体若しくはその異性体の任意の混合物、又は薬剤として許容されるその塩
 [式中、

R^a は、水素又はアルキルを表し、前記アルキルは、ハロ、トリフルオロメチル、トリ

フルオロメトキシ、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、アルコキシ、シクロアルコキシ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルケニル及びアルキニルからなる群から独立に選択される 1 個又は複数の置換基により任意選択で置換されており、

X は、 $-O-$ 、 $-S-$ 又は $-NR^c-$ を表し、ここで、 R^c は、水素、アルキル、 $-C(=O)R^d$ 又は $-SO_2R^d$ を表し、ここで、 R^d は、水素又はアルキルを表し、

R^b は、アリール基を表し、前記アリール基は、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、アルコキシ、シクロアルコキシ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルケニル及びアルキニルからなる群から独立に選択される 1 個又は複数の置換基により任意選択で置換されており、

R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 及び $R^{6'}$ は、それぞれ互いに独立に水素又はアルキルを表し、

但し、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 及び $R^{6'}$ の少なくとも 1 個は、アルキルを表し、

但し、この化合物は、4 - (4 - ヒドロキシ - フェノキシ) - 2, 2, 6, 6 - テトラメチル - ピペリジン又は 4 - (4 - メトキシ - フェノキシ) - 2, 2, 6, 6 - テトラメチル - ピペリジンではない。】。

【請求項 2】

R^a が、水素又はアルキルを表す、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^b が、フェニル基を表し、前記フェニル基は、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ及びアルコキシからなる群から独立に選択される 1 個又は複数の置換基により任意選択で置換されている、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^b が、フェニル基を表し、前記フェニル基は、ハロにより 2 回任意選択で置換されている、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 5】

X が、 $-O-$ を表す、請求項 1 から 4 までのいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

X が、 $-NR^c-$ を表す、請求項 1 から 4 までのいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 及び $R^{6'}$ のうち 4 個が、アルキルを表し、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 及び $R^{6'}$ のうち残りの 4 個が、水素を表す、請求項 1 から 6 までのいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8】

4 - (3, 4 - ジクロロ - フェノキシ) - 2, 2, 6, 6 - テトラメチル - ピペリジン；

4 - (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - 1, 2, 2, 6, 6 - ペンタメチル - ピペリジン；

4 - (4 - クロロ - 3 - フルオロ - フェノキシ) - 1, 2, 2, 6, 6 - ペンタメチル - ピペリジン；

4 - (4 - ブロモ - 3 - クロロフェノキシ) - 2, 2, 6, 6 - テトラメチル - ピペリジン；

4 - (3, 4 - ジクロロ - フェノキシ) - 1, 2, 2, 6, 6 - ペンタメチル - ピペリジン；

4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロ - フェノキシ) - 1, 2, 2, 6, 6 - ペンタメチル - ピペリジン；

4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロ - フェノキシ) - 2, 2, 6, 6 - テトラメチル - ピペリジン；

4 - (2 - クロロ - 5 - フルオロ - フェノキシ) - 2, 2, 6, 6 - テトラメチル - ピペリジン；

4 - (4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - 2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン ;
 4 - (4 - クロロ - フェノキシ) - 2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン ;
 4 - (2 , 4 - ジクロロ - フェノキシ) - 2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン ;
 4 - (2 , 5 - ジクロロ - フェノキシ) - 2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン ;
 4 - (2 , 4 , 5 - トリクロロ - フェノキシ) - 2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン ;
 4 - (3 - ブロモ - 4 - クロロ - フェノキシ) - 2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン ;
 4 - (2 , 3 , 4 - トリクロロ - フェノキシ) - 2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン ;
 4 - (1 - ナフチルオキシ) - 2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン ;
 (3 , 4 - ジクロロ - フェニル) - (2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミン ;
 (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチルフェニル) - (2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミン ;
 (3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - (2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミン ;
 (2 - クロロ - 5 - フルオロフェニル) - (2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミン ;
 (4 - クロロ - 3 - メトキシフェニル) - (2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミン ;
 (2 , 4 - ジクロロ - フェニル) - (2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミン ;
 (2 , 5 - ジクロロ - フェニル) - (2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミン ;
 (2 , 3 , 5 - ジクロロ - フェニル) - (2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミン ;
 (2 , 3 - ジメトキシ - フェニル) - (2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミン ;
 (1 - ナフトキシ - フェニル) - (2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミン ;
 [4 - (3 , 4 - ジクロロ - フェノキシ) - 2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン - 1 - イル] - アセトニトリル ;
 4 - (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - 2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン ;
 (3 , 4 - ジクロロ - フェニル) - メチル - (1 , 2 , 2 , 6 , 6 - ペンタメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミン ;
 (4 - ブロモ - 2 , 3 - フルオロ - フェニル) - (2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミン ;
 (4 - クロロ - 2 - フルオロ - フェニル) - (2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミン ;
 (2 - ブロモ - 4 - クロロ - 5 - メトキシフェニル) - (2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミン ;

又は薬剤として許容されるその塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

少なくとも 1 種の薬剤として許容される担体、賦形剤若しくは希釈剤と共に、治療上有効な量の請求項 1 から 8 までのいずれか一項に記載の化合物、又は化合物 4 - (4 - ヒド

ロキシ - フェノキシ) - 2, 2, 6, 6 - テトラメチル - ピペリジン若しくは 4 - (4 - メトキシ - フェノキシ) - 2, 2, 6, 6 - テトラメチル - ピペリジン、任意のその異性体若しくはその異性体の任意の混合物、又は薬剤として許容されるその塩を含む薬剤組成物。

【請求項 10】

ヒトを含む哺乳動物の疾患若しくは障害若しくは状態を治療、予防若しくは軽減するための請求項 9 に記載の薬剤組成物であって、前記疾患若しくは障害若しくは状態が中枢神経系におけるモノアミン神経伝達物質再取込み障害に応答性である、上記薬剤組成物。

【請求項 11】

疾患若しくは障害若しくは状態が、気分障害、うつ病、非定型うつ病、疼痛続発性うつ病、大うつ病性障害、情緒異常障害、双極性障害、双極性 1 型障害、双極性 2 型障害、循環病、一般薬物条件による気分障害、物質誘因性気分障害、仮性認知症、ガンサー症候群、強迫性障害、パニック障害、広場恐怖無随伴パニック障害、広場恐怖随伴パニック障害、パニック障害病歴のない広場恐怖、不安発作、記憶欠損、記憶喪失、注意欠陥多動性障害、肥満症、不安、全身性不安障害、摂食障害、パーキンソン病、パーキンソン症、認知症、加齢認知症、老年認知症、アルツハイマー病、複合性エイズ認知症、老人性記憶機能障害、特異的恐怖症、社会的恐怖症、外傷後ストレス障害、急性ストレス障害、薬物嗜癖、薬物乱用、コカイン乱用、ニコチン乱用、タバコ乱用、アルコール中毒、アルコール依存症、疼痛、慢性痛、炎症痛、神経因性痛、片頭痛、緊張型頭痛、慢性緊張型頭痛、疼痛随伴うつ病、線維筋痛症、関節炎、骨関節炎、リウマチ性関節炎、背痛、がん疼痛、過敏性腸痛、過敏性腸症候群、術後痛、乳房切除後疼痛症候群 (P M P S)、脳卒中後痛、薬物誘因性神経障害、糖尿病性神経障害、交感神経性維持痛、三叉神経痛、歯痛、顔面筋疼痛、幻肢痛、過食症、月経前緊張症、後期黄体期症候群、外傷後症候群、慢性疲労症候群、尿失禁、ストレス失調症、緊急性失調症、夜間失調症、性機能障害、早発性射精、勃起障害、勃起不全、早発性女性オルガスム、下肢静止不能症候群、摂食障害、神経性摂食障害、睡眠障害、自閉症、無言症、抜毛癖、過眠症、脳卒中後うつ病、脳卒中誘因性脳損傷、脳卒中誘因性神経損傷又はジル - ド - ラ - ツレット病である、請求項 10 に記載の薬剤組成物。