

【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 19 年 12 月 27 日 (2007.12.27)

【公表番号】特表 2003-528096 (P2003-528096A)

【公表日】平成 15 年 9 月 24 日 (2003.9.24)

【出願番号】特願 2001-568934 (P2001-568934)

【国際特許分類】

C 0 7 D 217/26 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 K 31/498 (2006.01)

A 6 1 K 31/5025 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

C 0 7 D 405/06 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/06 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/06 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 498/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 217/26

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/497

A 6 1 K 31/498

A 6 1 K 31/5025

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/22

C 0 7 D 401/06

C 0 7 D 405/06

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 413/06

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 413/14

C 0 7 D 417/06

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D 471/04 1 0 1

C 0 7 D 471/04 1 0 7 E

C 0 7 D 471/04 1 0 8 A

C 0 7 D 498/04 1 0 5

C 0 7 M 7:00

【誤訳訂正書】

【提出日】平成19年11月6日(2007.11.6)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】特許請求の範囲

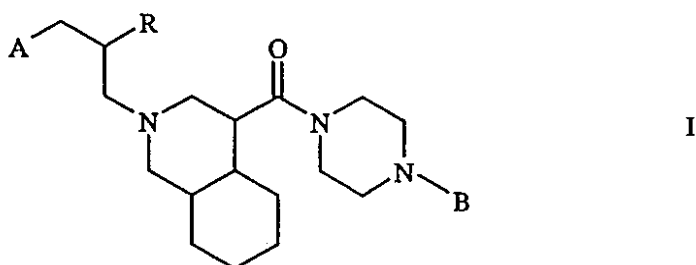
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

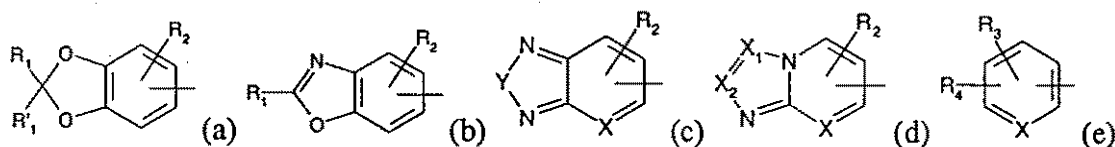
【請求項1】 式I

【化1】



〔式中、Rは、水素又は(C₁ - 4)アルキルであり、A及びBは独立して式(a)、(b)、(c)、(d)又は(e)

【化2】



〔式中、

X、X₁、及びX₂は、独立して - CR₁ =、又は - N = であり、

Yは、- O -、- S -、- CH = CH -、又は - NH - であり、

R₁、及びR_{1'}は、独立して水素、(C₁ - 4)アルキル、又は(C₁ - 4)アルコキシであり、

R₂は、水素、(C₁ - 4)アルキル、(C₁ - 4)アルコキシ、(C₁ - 4)アルコキシカルボニル、又はハロゲンであり、そして

R₃、及びR₄は、独立して水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチル、(C₁ - 4)アルキル、(C₁ - 4)アルコキシ、(C₁ - 4)アルコキシカルボニル、又は(C₁ - 4)アルカノイル

で示される基である〕で示す、遊離塩基又は酸付加塩の形態にある、化合物。

【請求項2】 遊離塩基又は酸付加塩の形態にある、

[4 - (3,4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4S,4aS,8aR) - 2 - (2(S) - メチル - 3 - キノキサリン - 6 - イル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (4 - ニトロフェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4SR,4aSR,8aSR) - 2 - ((R,S) - 3 - (ベンゾ[1,3]ジオキサール - 5 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (1 - メチル - 6 - オキソ - 1,6 - ジヒドロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4SR,4aSR,8aSR) - 2 - ((R,S) - 3 - (ベンゾ[1,3]ジオキサール - 5 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (イミダゾ[1,2-b]ピリダジン - 6 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4S

R , 4 a S R , 8 a S R) - 2 - ((R , S) - 3 - (ベンゾ[1 , 3]ジオキソール - 5 - イル
) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (4 - ニトロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S R , 4 a S R , 8 a S R
) - 2 - (3 - (ベンゾ[1 , 3]ジオキソール - 5 - イル) - プロピル) - デカヒドロ - イ
ソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3 , 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S , 4 a S , 8 a
S) - 2 - (3 - (ベンゾ[1 , 3]ジオキソール - 5 - イル) - プロピル) - デカヒドロ -
イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3 , 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S , 4 a S , 8 a
S) - 2 - ((S) - 3 - (ベンゾ[1 , 3]ジオキソール - 5 - イル) - 2 - メチル - プロピ
ル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (ベンゾ[1 , 2 , 5]オキサジアゾール - 5 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(
4 S , 4 a S , 8 a S) - 2 - ((S) - 3 - (ベンゾ[1 , 3]ジオキソール - 5 - イル) - 2
- メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3 , 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S , 4 a S , 8 a
S) - 2 - ((S) - 3 - (ベンゾ[1 , 3]ジオキソール - 5 - イル) - 2 - イソプロピル -
プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (ベンゾ[1 , 2 , 5]オキサジアゾール - 5 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(
4 S , 4 a S , 8 a S) - 2 - ((S) - 3 - (ベンゾ[1 , 3]ジオキソール - 5 - イル) - 2
- イソプロピル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3 , 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 R S , 4 a R S ,
8 a R S) - 2 - ((R , S) - 3 - (4 - メトキシカルボニル - ベンゾ[1 , 3] ジオキシ
ソール - 6 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メ
タノン ;

[4 - (3 , 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 R S , 4 a R S ,
8 a R S) - 2 - ((R , S) - 3 - (2 , 2 - ジフルオロ - ベンゾ[1 , 3] ジオキソール
- 5 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノ
ン ;

[4 - (4 - ニトロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 R S , 4 a R S , 8 a R S
) - 2 - ((R , S) - 3 - (4 - ジフルオロ - フェニル) - 2 - メチル - プロピル) - デカ
ヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (4 - ニトロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 R S , 4 a R S , 8 a R S
) - 2 - ((R , S) - 3 - (4 - フルオロ - 2 - メチル - フェニル) - 2 - メチル - プロピ
ル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3 , 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 R S , 4 a R S ,
8 a R S) - 2 - ((R , S) - 3 - (ベンゾ[1 , 2 , 5]オキサゾール - 5 - イル) - 2 -
メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3 , 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S , 4 a S , 8 a
S) - 2 - (3 - (ベンゾ[1 , 2 , 5]オキサゾール - 5 - イル) - プロピル) - デカヒド
ロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3 , 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 R S , 4 a R S ,
8 a R S) - 2 - ((R , S) - 3 - (ベンゾ[1 , 2 , 5]オキサゾール - 5 - イル) - 2 -
メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3 , 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S , 4 a S , 8 a
S) - 2 - ((S) - 3 - (ベンゾ[1 , 2 , 5]オキサゾール - 5 - イル) - 2 - メチル - プ
ロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (ベンゾ[1 , 2 , 5] - オキサジアゾール - 5 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] -
[(4 S , 4 a S , 8 a S) - 2 - ((S) - 3 - (ベンゾ[1 , 2 , 5]オキサゾール - 5 - イル)
) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (ベンゾ[1 , 2 , 5] - オキサジアゾール - 5 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] -

[(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((S) - 3 - (キノキサリル - 6 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;
[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 R S, 4 a R S, 8 a R S) - 2 - ((R, S) - 3 - (3, 5 - ジアセチル - フェニル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;
[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - (3 - (3, 5 - ジアセチル - フェニル) - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;
[4 - (ベンゾ[1, 2, 5] - オキサジアゾール - 5 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - (3 - (3, 5 - ジアセチル - フェニル) - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;
[4 - (4 - ニトロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 R S, 4 a R S, 8 a R S) - 2 - ((R, S) - 3 - (3, 5 - ジメトキシ - カルボニル - フェニル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;
[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 R S, 4 a R S, 8 a R S) - 2 - ((R, S) - 3 - (3, 5 - ジメトキシ - カルボニル - フェニル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;
[4 - (ベンゾ[1, 2, 5] - オキサジアゾール - 5 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 R S, 4 a R S, 8 a R S) - 2 - ((R, S) - 3 - (3, 5 - ジメトキシ - カルボニル - フェニル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;
[4 - (4 - ニトロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - (3 - (3, 5 - ジメトキシ - カルボニル - フェニル) - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;
[4 - (4 - ニトロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 R, 4 a R, 8 a R) - 2 - ((R, S) - 3 - (3, 5 - ジメトキシ - カルボニル - フェニル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;
[4 - (4 - ニトロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((R, S) - 3 - (3, 5 - ジメトキシ - カルボニル - フェニル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;
[4 - ([1, 2, 5] - オキサジアゾロ[3, 4 - b]ピリジン - 5 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((S) - 3 - (ベンゾ[1, 3] - ジメトキシ - カルボニル - フェニル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;
[4 - ([1, 2, 5] - オキサジアゾロ[3, 4 - b]ピリジン - 5 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((S) - 3 - (キノキサリン - 6 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;
[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((S) - 2 - 3 - (6 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル) - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;
[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((R) - 2 - 3 - (ベンゾオキサゾール - 5 - イル) - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;
[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((S) - 3 - (ベンゾオキサゾール - 5 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;
[4 - (ベンゾ[1, 2, 5] - オキサジアゾール - 5 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((R) - 3 - (ベンゾオキサゾール - 5 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;
[4 - (4 - シアノ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2

[illegible]

[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((S) - 3 - (6 - エトキシ - ピリジン - 3 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (4 - シアノ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((S) - 3 - (6 - エトキシ - ピリジン - 3 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((S) - 3 - (6 - エトキシ - ピリジン - 3 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((S) - 3 - (6 - エチルアミノ - ピリジン - 3 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((S) - 3 - (2 - メチル[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5 - a]ピリジン - 6 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((S) - 3 - (2 - メチル[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5 - a]ピリジン - 6 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((R, S) - 3 - (2 - メチルベンゾチアゾール - 5 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((R) - 3 - (6 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((R, S) - 3 - (6 - メチルアミノ - ピリジン - 3 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((R, S) - 3 - (2 - エチル - ベンゾオキサゾール - 5 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((R, S) - 3 - (2 - イソプロピル - ベンゾオキサゾール - 5 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((R, S) - 3 - (2 - メトキシ - ベンゾオキサゾール - 5 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((R, S) - 3 - (2 - メチル - ベンゾオキサゾール - 6 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((R, S) - 3 - (2, 2 - ジメチル - ベンゾ[1, 3]ジオキサゾール - 5 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

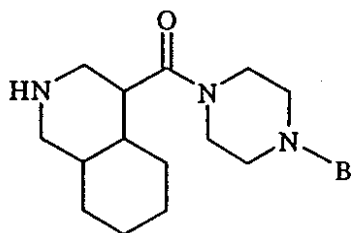
[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4 S, 4 a S, 8 a S) - 2 - ((R, S) - 3 - (2, 3 - ジヒドロ - ベンゾ[1, 4]ジオキシン - 6 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン ;

からなる群から選択される化合物。

【請求項 3】 遊離塩基又は酸付加塩の形態にある、[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - {(4 S, 4 a S, 8 a R) - 2 - [(S) - 3 - (6 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル) - 2 - メチル - プロピル] - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル} - メタノン。

【請求項 4】 請求項 1 に記載の式 I で示す化合物又はその塩の製造方法であって、
式 II

【化 3】

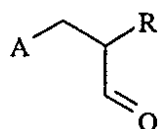


II

〔式中、B は請求項 1 で定義の通り〕

で示す化合物を、式 III

【化 4】



III

〔式中、A 及び R は請求項 1 で定義の通り〕

で示す化合物と反応させ、式 I で示す化合物を遊離塩基又は酸付加塩の形態で回収することを特徴とする方法。

【請求項 5】 医薬品として使用される、遊離塩基又は薬学的に許容される酸付加塩の形態の請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】 精神分裂症、鬱病、不安症、または双極性障害の処置に使用される、遊離塩基又は薬学的に許容される酸付加塩の形態の請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】 遊離塩基又は薬学的に許容される酸付加塩の形態の請求項 1 に記載の化合物を、医薬品担体又は賦形剤と共に含む、医薬品組成物。

【請求項 8】 遊離塩基又は薬学的に許容される酸付加塩の形態の請求項 1 に記載の化合物を含む、精神分裂症、鬱病、不安症、または双極性障害の処置用の医薬組成物。

【請求項 9】 精神分裂症、鬱病、不安症、または双極性障害の処置用の薬物製造のための、遊離塩基又は薬学的に許容される酸付加塩の形態の請求項 1 に記載の化合物の使用。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 0 2

【訂正方法】変更

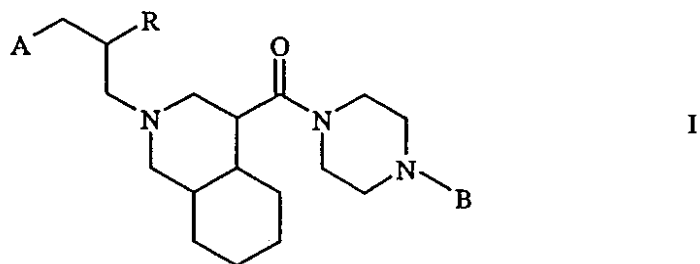
【訂正の内容】

【0 0 0 2】

(本発明の背景)

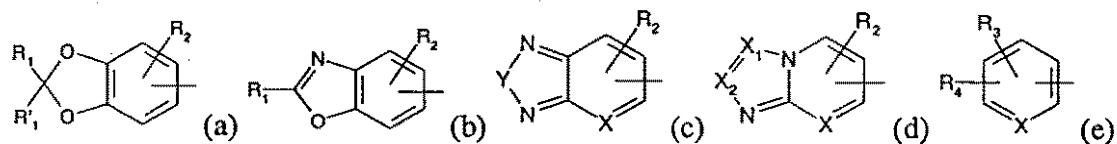
より具体的には、本発明は、式 I

【化 5】



〔式中、R は、水素又は (C₁ - 4) アルキルであり、A 及び B は独立して式 (a)、(b)、(c)、(d) 又は (e)〕

【化 6】



〔式中、

X、X₁、及び X₂ は、独立して -CR₁=、又は -N= であり、

Y は、-O-、-S-、-CH=CH-、又は -NH- であり、

R₁、及び R'₁ は、独立して水素、(C₁ - 4) アルキル、又は (C₁ - 4) アルコキシであり、

R₂ は、水素、(C₁ - 4) アルキル、(C₁ - 4) アルコキシ、(C₁ - 4) アルコキシカルボニル、又はハロゲンであり、そして

R₃、及び R₄ は、独立して水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチル、(C₁ - 4) アルキル、(C₁ - 4) アルコキシ、(C₁ - 4) アルコキシカルボニル、又は (C₁ - 4) アルカノイル〕

で示される基である〕で示される遊離塩基又は酸付加塩の形態の化合物を提供する。