

【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 07 D 217/26	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
A 61 K 31/497	(2006.01)
A 61 K 31/498	(2006.01)
A 61 K 31/5025	(2006.01)
A 61 P 25/14	(2006.01)
A 61 P 25/18	(2006.01)
A 61 P 25/22	(2006.01)
C 07 D 401/06	(2006.01)
C 07 D 405/06	(2006.01)
C 07 D 405/14	(2006.01)
C 07 D 413/06	(2006.01)
C 07 D 413/12	(2006.01)
C 07 D 413/14	(2006.01)
C 07 D 417/06	(2006.01)
C 07 D 417/14	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)
C 07 D 498/04	(2006.01)

【F I】

C 07 D 217/26	
A 61 K 31/496	
A 61 K 31/497	
A 61 K 31/498	
A 61 K 31/5025	
A 61 P 25/14	
A 61 P 25/18	
A 61 P 25/22	
C 07 D 401/06	
C 07 D 405/06	
C 07 D 405/14	
C 07 D 413/06	
C 07 D 413/12	
C 07 D 413/14	
C 07 D 417/06	
C 07 D 417/14	
C 07 D 471/04	1 0 1
C 07 D 471/04	1 0 7 E
C 07 D 471/04	1 0 8 A
C 07 D 498/04	1 0 5
C 07 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

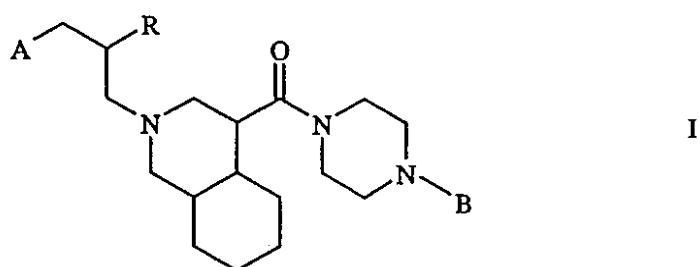
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

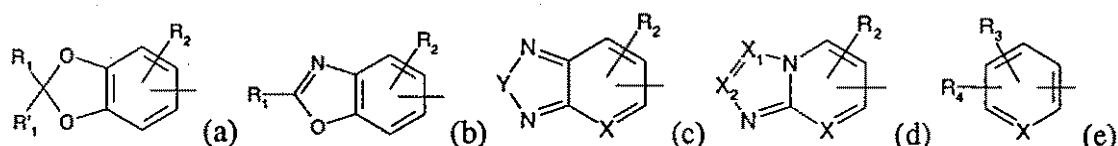
【請求項1】式I

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

- ((S) - 3 - (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 - (4 - シアノ-フェニル) - ピペラジン-1-イル] - [(4S, 4aS, 8aS) - 2 - ((S) - 3 - (ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-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 - (4 - シアノ-フェニル) - ピペラジン-1-イル] - [(4S, 4aS, 8aS) - 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 - (5 - シアノ-ピリジン-2-イル) - ピペラジン-1-イル] - [(4S, 4aS, 8aS) - 2 - ((S) - 3 - (ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 2 - ((R, S) - 3 - ([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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 2 - ((R, S) - 3 - (イミダゾ[1, 2 - 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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 2 - ((R, S) - 3 - (5-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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 2 - ((R, S) - 3 - (6-フルオロ-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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 2 - ((S) - 3 - (2-メチル-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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 2 - ((R) - 3 - ([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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 2 - (3 - (2-メチル-ベンゾオキサゾール-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 - (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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 2 - ((S) - 3 - (イミダゾ[1, 2 - 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 - (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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 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;
[4 - (4 - シアノ-フェニル) - ピペラジン-1-イル] - [(4S, 4aS, 8aS) - 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;
[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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 2 - ((S) - 3 - (2-メチル-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 - (4 - シアノ-フェニル) - ピペラジン-1-イル] - [(4S, 4aS, 8aS) - 2 - ((S) - 3 - (2-メチル-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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 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] - [(4S, 4aS, 8aS) - 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;

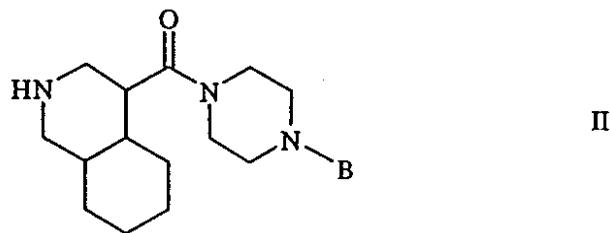
[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4S, 4aS, 8aS) - 2 - ((R, S) - 3 - (2, 2 - ジメチル - ベンゾ[1, 3]ジオキソール - 5 - イル) - 2 - メチル - プロピル) - デカヒドロ - イソキノリン - 4 - イル] - メタノン;

[4 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - [(4S, 4aS, 8aS) - 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;

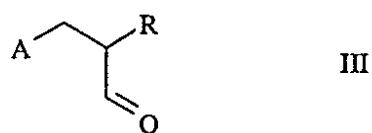
からなる群から選択される化合物。

【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] - {(4S, 4aS, 8aR) - 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】



[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】



[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】0002

【訂正方法】変更

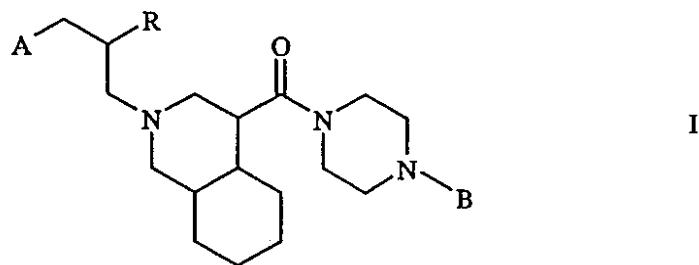
【訂正の内容】

【0002】

(本発明の背景)

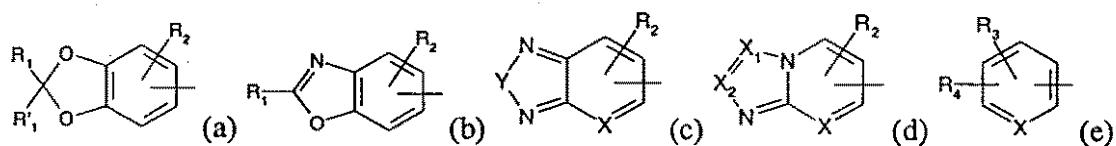
より具体的には、本発明は、式I

【化5】



[式中、Rは、水素又は(C₁-C₄)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-C₄)アルキル、又は(C₁-C₄)アルコキシであり、

R₂は、水素、(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)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-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)アルコキシカルボニル、又は(C₁-C₄)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。