

【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18年2月2日(2006.2.2)

【公表番号】特表2005-516952(P2005-516952A)

【公表日】平成17年6月9日(2005.6.9)

【年通号数】公開・登録公報2005-022

【出願番号】特願2003-554664(P2003-554664)

【国際特許分類】

C 07 D 405/06 (2006.01)

A 61 K 31/496 (2006.01)

A 61 K 31/551 (2006.01)

A 61 P 25/18 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

C 07 D 405/14 (2006.01)

C 07 D 409/14 (2006.01)

C 07 D 413/14 (2006.01)

C 07 D 417/14 (2006.01)

【F I】

C 07 D 405/06 C S P

A 61 K 31/496

A 61 K 31/551

A 61 P 25/18

A 61 P 25/28

A 61 P 43/00 1 1 4

C 07 D 405/14

C 07 D 409/14

C 07 D 413/14

C 07 D 417/14

【手続補正書】

【提出日】平成17年12月6日(2005.12.6)

【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

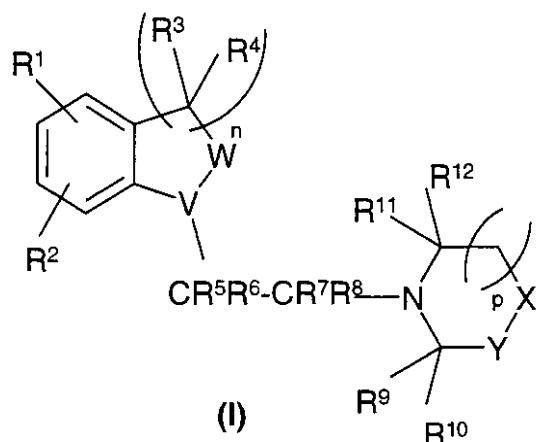
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式:

【化1】



[式中、

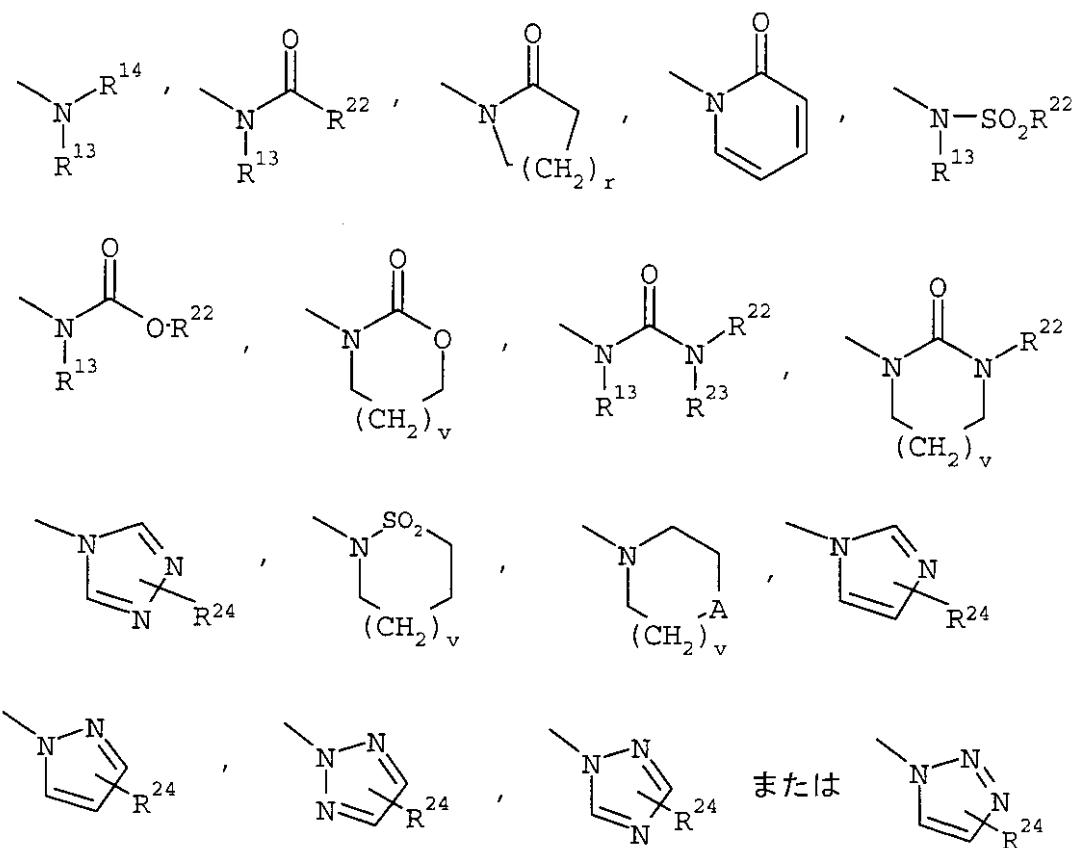
R¹は、-CN、-CONR¹³R¹⁴、-SO₂NR¹³R¹⁴、-(CH₂)t-R²¹、

【化2】

であり；

R²¹は、

【化3】



であり；

ここで、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{22} および R^{23} はそれぞれ、水素または C_{1-6} アルキル、あるいは R^{13} および R^{14} はそれらが結合する窒素原子と一緒にになって、1 または 2 個の C_{1-6} アルキル基で必要に応じて置換されるモルホリノ、ピロリジノまたはピペリジニル環を形成し；

R^{13} および R^{24} はそれぞれ独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、カルボキシ、ヒドロキシ、シアノ、ハロ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、 C_{1-6} アシリルアミノ、 C_{1-6} アルキルチオ、フェニルまたはフェノキシから選ばれ；

Aは、OまたはS；

tは0、1または2；

rは0、1、2または3；

vは0、1または2；

R^2 は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシまたはハロ；

R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 および R^8 はそれぞれ、水素または C_{1-6} アルキル；

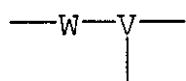
R^9 、 R^{10} 、 R^{11} および R^{12} はそれぞれ、水素、 C_{1-6} アルキルまたは $-(CH_2)^q-OR^{20}$ (ここで、 R^{20} は、 C_{1-6} アルキル)；

nは1または2；

pは0、1または2；

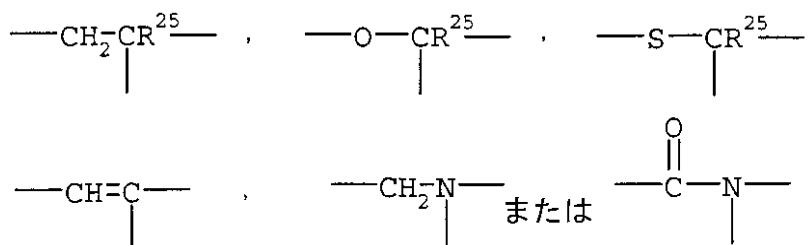
qは1または2；

【化4】



は、

【化5】

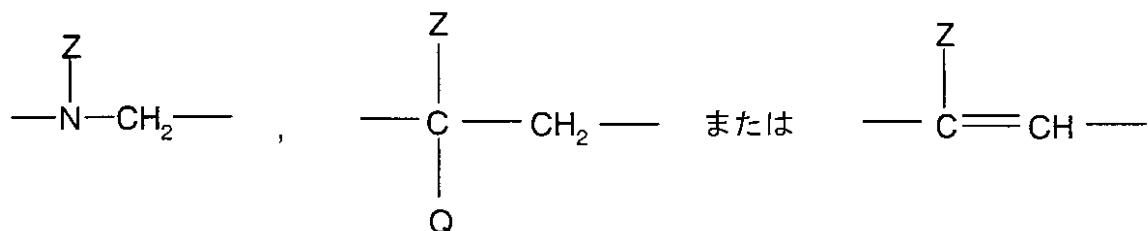


であり；

R^{25} は、水素または $C_{1\sim 6}$ アルキル；

- X - Y - は、

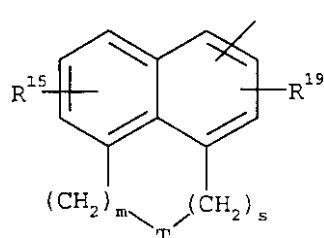
【化6】



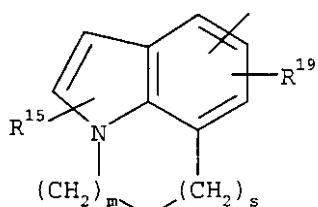
；

ここで、Zは、

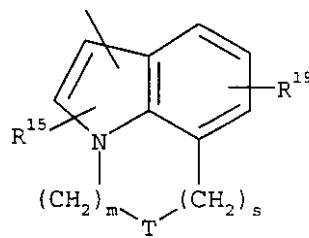
【化7】



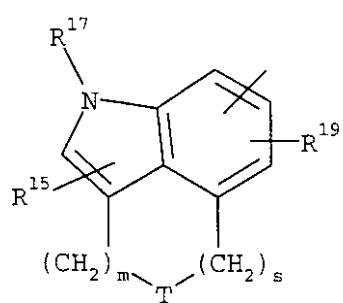
(xxi)



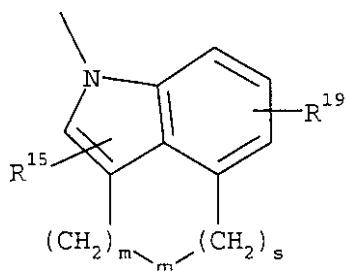
(xxii)



(xxiii)



(xxiv)



(xxv)

であり；

ここで、- T - は、- CH₂ - 、- O - 、- S - 、- C(O) - または- CH=CH - ；mおよびsはそれぞれ、0または1；

R¹⁵およびR¹⁹はそれぞれ、水素、ハロ、 $C_{1\sim 6}$ アルキルまたは $C_{1\sim 6}$ アルコキシ、カルボキシ- $C_{1\sim 6}$ アルキル、シアノ、ハロゲン、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロ、アミノ、 $C_1\sim C_6$ アシリルアミノまたは $C_1\sim C_6$ アルキルチオ；R¹⁷は、水素または $C_{1\sim 6}$ アルキル；および

Qは、水素、ハロ、ニトリル、カルボキシ- $C_{1\sim 6}$ アルキル、ヒドロキシ、 $C_{1\sim 6}$ アルキ

ルまたは $C_{1\sim 6}$ アルコキシである；

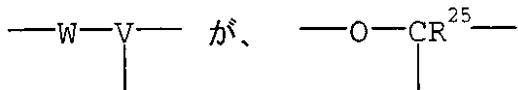
ただし：

- T - が、 - CH_2 - 、 - O - 、 - S - または - C(0) - である場合、 ($m + s$) は 1 または 2 である
]

で示される化合物およびその医薬的に許容しうる塩。

【請求項 2】

【化 8】



である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^{25} が、水素である請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

n が 2 である請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 5】

n が 3 である請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 6】

R^2 が、水素または $C_{1\sim 6}$ アルキルである請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 7】

R^2 が、水素である請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 および R^8 がそれぞれ、水素である請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 9】

p が 1 である請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 つに記載の化合物。

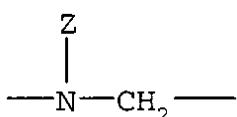
【請求項 10】

p が 2 である請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 11】

- X - Y - が、

【化 9】



である請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

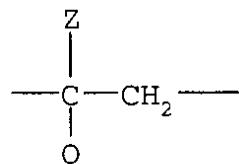
【請求項 12】

R^9 、 R^{10} 、 R^{11} および R^{12} のうちの 1 つが $C_{1\sim 6}$ アルキルであり、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} および R^{12} の残りのそれが水素である請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 13】

- X - Y - が、

【化 10】



である請求項1～10のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項14】

Qが、水素である請求項13に記載の化合物。

【請求項15】

R⁹、R¹⁰、R¹¹およびR¹²が、水素である請求項13または14に記載の化合物。

【請求項16】

R¹が、-CONR¹³R¹⁴である請求項1～15のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項17】

R¹³およびR¹⁴のそれぞれが、水素またはC₁～C₆アルキルである請求項16に記載の化合物。

【請求項18】

R¹³およびR¹⁴のそれぞれが、水素である請求項17に記載の化合物。

【請求項19】

R¹が、-(CH₂)t-R²¹である請求項1～15のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項20】

tが1である請求項19に記載の化合物。

【請求項21】

tが0である請求項19に記載の化合物。

【請求項22】

R¹が-CONR¹³R¹⁴であり、Zが(xxii)である請求項1～15のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項23】

-T-が-CH₂-であり、(m+s)が1である請求項22に記載の化合物。

【請求項24】

-T-が-CH=CH-であり、(m+s)が0である請求項22に記載の化合物。

【請求項25】

-T-が-C(O)-であり、(m+s)が1である請求項22に記載の化合物。

【請求項26】

-T-が-O-であり、mが1およびsが1である請求項22に記載の化合物。

【請求項27】

-T-が-S-であり、mが1およびsが1である請求項22に記載の化合物。

【請求項28】

R¹が-(CH₂)t-R²¹であり、Zが(xi)である請求項1～15のいずれか1つに記載の化合物。

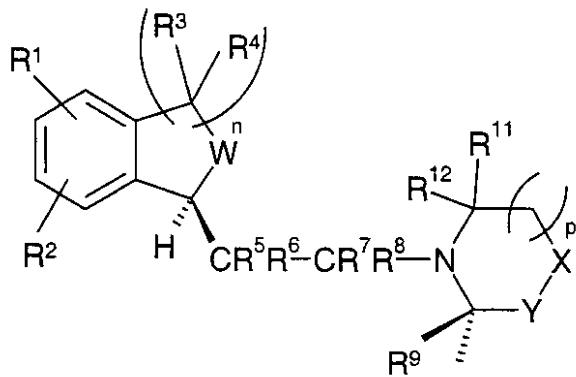
【請求項29】

-T-が-CH₂-であり、(m+s)が1である請求項28に記載の化合物。

【請求項30】

式(I d)：

【化11】



[式中、-X-Y-、R¹～R¹²、nおよびpは、但し書きも含めて、請求項1に記載の式(I)の化合物と同意義であり；

R⁹およびR¹⁰基の定義は相異し、R⁹基は、Cahn-Ingold-Prelogの順位規則にしたがい、R¹⁰に優先し；および

-W-は、-CH₂-、-O-または-S-である]

で示される請求項1に記載の化合物またはその医薬的に許容しうる塩。

【請求項31】

R⁹がC₁～₆アルキルであり、R¹⁰、R¹¹およびR¹²が水素である請求項30に記載の化合物。

【請求項32】

化合物：(1S)-1-[2-[(2R)-4-(1,2-ジヒドロ-5-アセナフチレニル)-2-メチルピペラジニル]エチル]-3,4-ジヒドロ-1H-2-ベンゾピラン-6-カルボキサミドまたはその医薬的に許容しうる塩。

【請求項33】

医薬的に許容しうる塩が、フマル酸塩である請求項32に記載の化合物。

【請求項34】

請求項1～33のいずれか1つに記載の式(I)の化合物またはその医薬的に許容しうる塩、および医薬的に許容しうる希釈剤または担体を含む医薬組成物。

【請求項35】

医薬として使用するための請求項1～33のいずれか1つに記載の式(I)の化合物またはその医薬的に許容しうる塩。

【請求項36】

哺乳動物におけるセロトニン機能不全に関連する疾患の治療において使用するための請求項1～33のいずれか1つに記載の式(I)の化合物またはその医薬的に許容しうる塩。

【請求項37】

哺乳動物における中枢神経系の疾患の治療において使用するための請求項1～33のいずれか1つに記載の式(I)の化合物またはその医薬的に許容しうる塩。

【請求項38】

哺乳動物におけるセロトニン機能不全に関連する疾患の治療のための薬剤の製造における、請求項1～33のいずれか1つに記載の式(I)の化合物またはその医薬的に許容しうる塩の使用。

【請求項39】

哺乳動物における中枢神経系の疾患の治療のための薬剤の製造における、請求項1～33のいずれか1つに記載の式(I)の化合物またはその医薬的に許容しうる塩の使用。

【請求項40】

請求項1～33のいずれか1つに記載の式(I)の化合物またはその医薬的に許容しうる

塩を含む、中枢神経系の疾患を患っているか、または罹りやすいヒトを含む動物の治療のための医薬組成物。