

【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 0 7 D 405/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 405/06 C S P

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/551

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 43/00 1 1 4

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 409/14

C 0 7 D 413/14

C 0 7 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

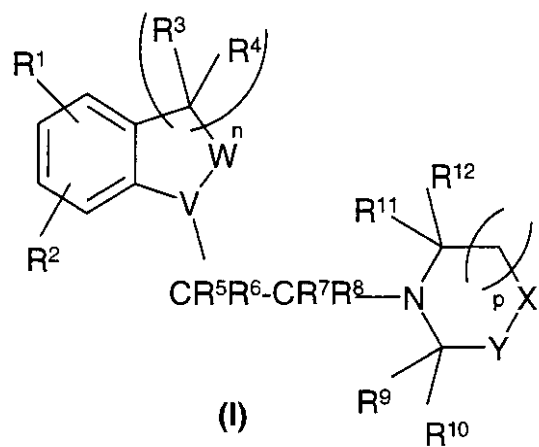
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式：

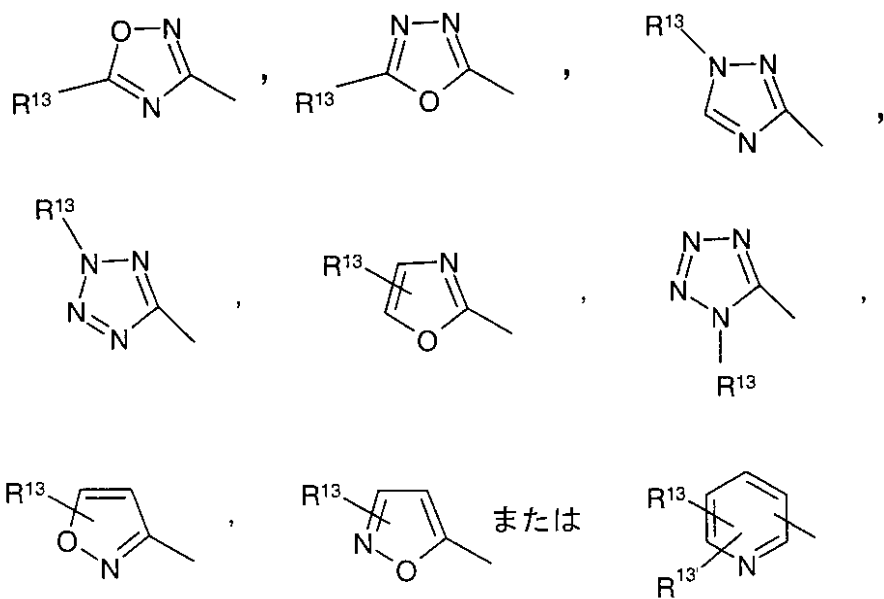
【化 1】



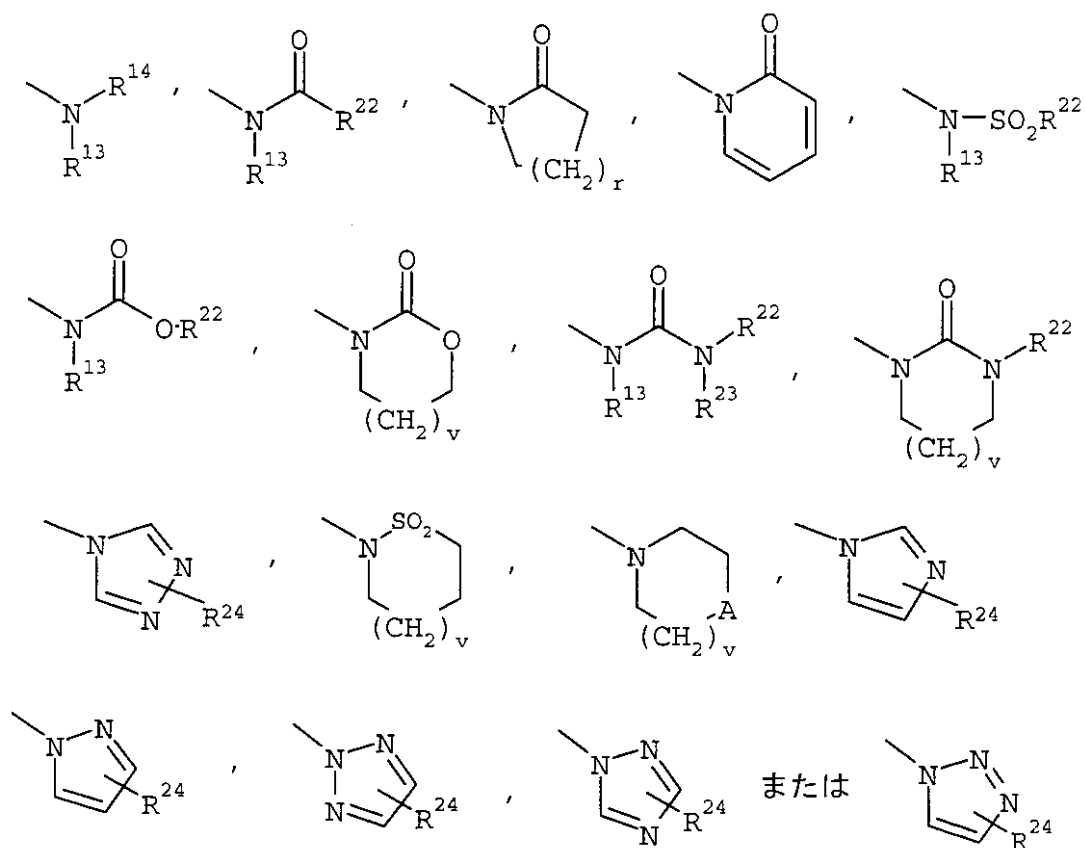
[式中、

 R^1 は、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CONR}^{13}\text{R}^{14}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ 、 $-(\text{CH}_2)_t-\text{R}^{21}$ 、

【化 2】



【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、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；

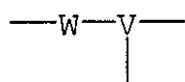
R^9 、 R^{10} 、 R^{11} および R^{12} はそれぞれ、水素、 C_{1-6} アルキルまたは $-(CH_2)_q-OR^{20}$ （ここで、 R^{20} は、 C_{1-6} アルキル）；

nは1または2；

pは0、1または2；

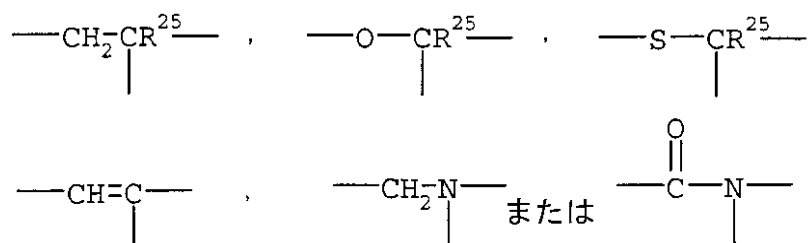
qは1または2；

【化 4】



は、

【化5】

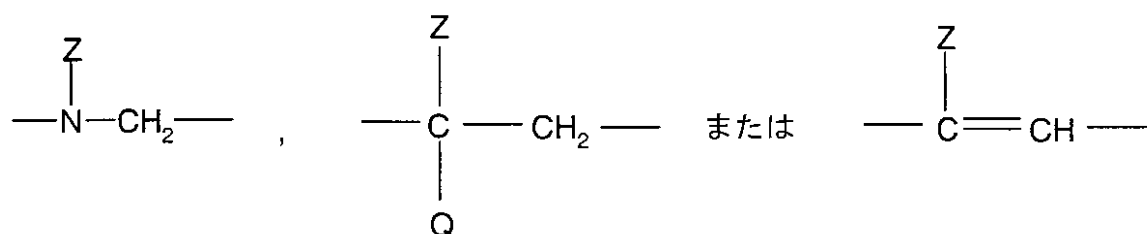


であり；

R^{25} は、水素または $C_1 - 6$ アルキル；

- X - Y - は、

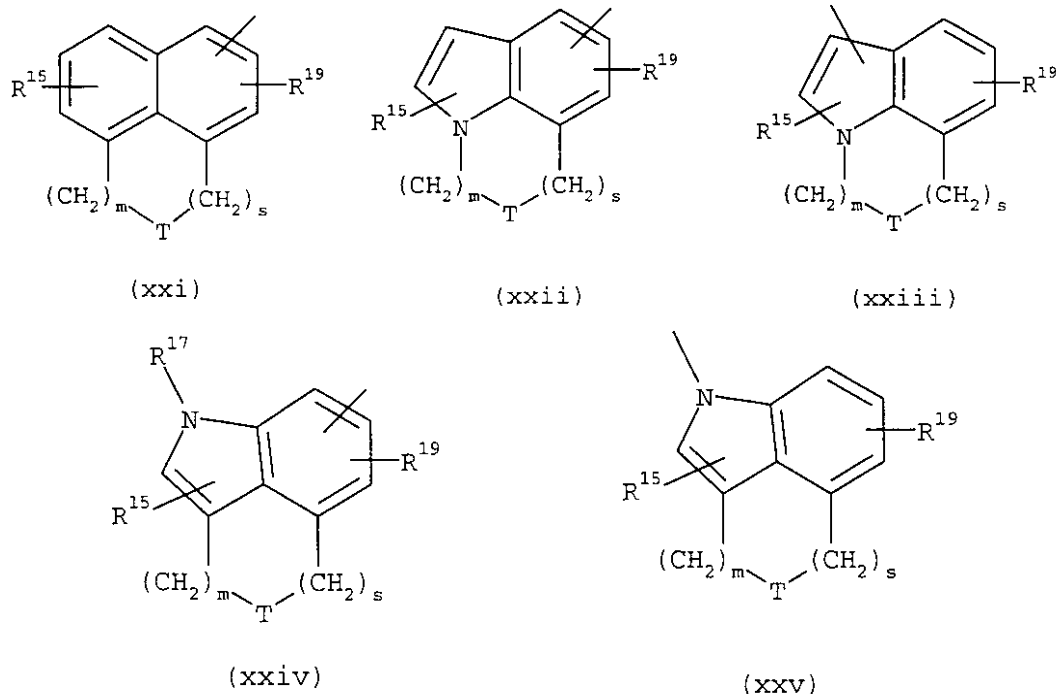
【化6】



；

ここで、Zは、

【化7】



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；

R^{15} および R^{19} はそれぞれ、水素、ハロ、 $C_1 - 6$ アルキルまたは $C_1 - 6$ アルコキシ、カルボキシ - $C_1 - 6$ 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、 $C_1 - C_6$ アシルアミノまたは $C_1 - C_6$ アルキルチオ； R^{17} は、水素または $C_1 - 6$ アルキル；および

Qは、水素、ハロ、ニトリル、カルボキシ - $C_1 - 6$ アルキル、ヒドロキシ、 $C_1 - 6$ アルキ

ルまたは C_{1-6} アルコキシである；

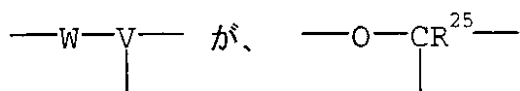
ただし：

- T - が、- CH_2 -、- O -、- S - または - C(O) - 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_{1-6} 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。

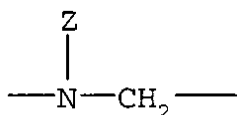
【請求項10】

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。

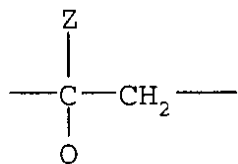
【請求項12】

R^9 、 R^{10} 、 R^{11} および R^{12} のうちの1つが C_{1-6} アルキルであり、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} および R^{12} の残りのそれぞ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】

R^9 、 R^{10} 、 R^{11} および R^{12} 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】

R^1 が、 $-\text{CONR}^{13}\text{R}^{14}$ 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】

R^{13} および R^{14} のそれぞれが、水素または $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルである請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 18】

R^{13} および R^{14} 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】

R^1 が、 $-(\text{CH}_2)_t - \text{R}^{21}$ 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】

R^1 が $-\text{CONR}^{13}\text{R}^{14}$ であり、Z が (xxi) 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 $-\text{CH}_2 -$ 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 $-\text{CH}=\text{CH} -$ 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 $-\text{C}(0) -$ 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 $-0 -$ 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】

R^1 が $-(\text{CH}_2)_t - \text{R}^{21}$ 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。

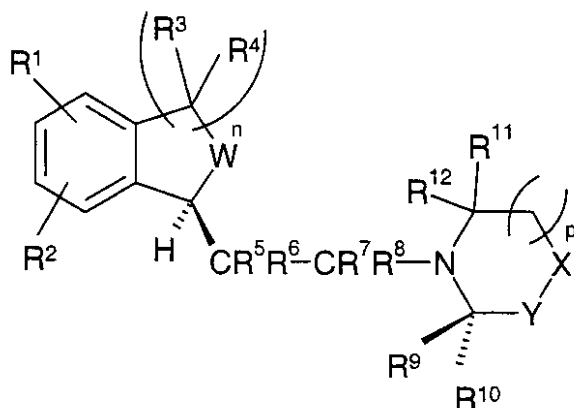
【請求項 29】

- T - が $-\text{CH}_2 -$ 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 1 1】



(Id)

[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 3 1】

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 3 0 に記載の化合物。

【請求項 3 2】

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 3 3】

医薬的に許容しうる塩が、フマル酸塩である請求項 3 2 に記載の化合物。

【請求項 3 4】

請求項 1 ~ 3 3 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 3 5】

医薬として使用するための請求項 1 ~ 3 3 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 3 6】

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 ~ 3 3 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 3 7】

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 ~ 3 3 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 3 8】

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 ~ 3 3 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 3 9】

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 ~ 3 3 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 4 0】

請求項 1 ~ 3 3 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。