

【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21年10月22日(2009.10.22)

【公表番号】特表2009-507912(P2009-507912A)

【公表日】平成21年2月26日(2009.2.26)

【年通号数】公開・登録公報2009-008

【出願番号】特願2008-530635(P2008-530635)

【国際特許分類】

C 0 7 D 207/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/40 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 207/12 C S P

A 6 1 K 31/40

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 13/02

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/18

C 0 7 D 405/12

A 6 1 K 31/4439

C 0 7 D 401/12

【手続補正書】

【提出日】平成21年9月3日(2009.9.3)

【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

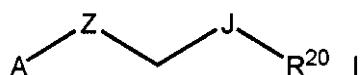
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物

【化 1】



またはその薬学的に受容可能な塩であって：

R^{20} が 3 - ピロリジニルであって、 $C_1 - C_4$ アルキルおよびハロからなる群より各々独立して選択される 1 ~ 8 個の置換基で置換されていてもよい 3 - ピロリジニルであり；

J が、O または $-N-R^{22}$ であって、 R^{22} が H、 $C_1 - C_4$ アルキル、または $-C(O)-C_1 - C_4$ アルキルであり；

Z は：フェニレン、ナフチレン、5 ~ 6 員のヘテロアリーレン、9 ~ 11 員の二環式アリーレン、および 8 ~ 10 員の二環式ヘテロアリーレンからなる群より選択され、そのいずれかが： $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、OH、 $C_1 - C_4$ アルキル-S-、および $-NR^{30}R^{31}$ からなる群より独立して選択される 1 ~ 5 個の置換基で置換されていてもよく、

R^{30} および R^{31} が各々独立して：H、および $C_1 - C_4$ アルキルからなる群より選択され；

A が：フェニル、ナフチル、5 ~ 6 員のヘテロアリール、9 ~ 11 員の二環式アリール、および 8 ~ 10 員の二環式ヘテロアリールからなる群より選択され、そのいずれかが： $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、ハロ、OH、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 CF_3O- 、 $C_1 - C_4$ アルキル-S-、フェニル、 $C_1 - C_4$ アルキル-C(O)-、5 または 6 員のヘテロアリール、5 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルキル-スルホニル、 $-C(O)O-R^{12}$ 、 $-C(O)NR^{14}R^{16}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-O-$ フェニル、および $-O-CH_2-$ フェニルからなる群より独立して選択される 1 ~ 5 個の置換基で置換されていてもよく；

R^{10} および R^{11} は各々が独立して：H、 $-C(O)-C_1 - C_4$ アルキル、および $C_1 - C_4$ アルキルからなる群より選択され；

R^{12} が、H または $C_1 - C_4$ アルキルであり；かつ

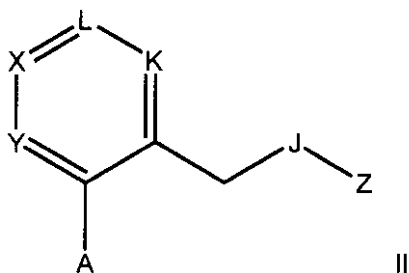
R^{14} および R^{16} が各々独立して：H および $C_1 - C_4$ アルキルからなる群より選択される、

化合物またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩であって、該化合物が式 I の化合物

【化 2】



であって、ここで：

Kは CR^1 またはNであり；

Lは CR^2 またはNであり；

Xは CR^3 またはNであり；

Yは CR^4 またはNであり；

ここでK、L、XおよびYのうちの0、1または2つがNであり；

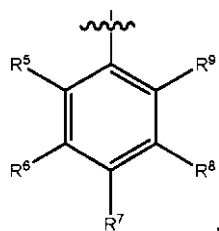
R^1 、 R^2 、 R^3 、および R^4 が各々独立して；

H、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、OH、 $C_1 - C_4$ アルキル-S-、および $-NR^{30}R^{31}$ からなる群より選択され、ここで R^{30} および R^{31} が各々独立して：H、および $C_1 - C_4$ アルキルからなる群より選択される、化合物またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項3】

請求項2に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩であって、ここでAが、

【化3】



であり、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 が各々独立して：

H、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、ハロ、OH、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 CF_3O- 、 $C_1 - C_4$ アルキル-S-、フェニル、 $C_1 - C_4$ アルキル-C(O)-、5または6員のヘテロアリール、5～7員のヘテロシクロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルキル-スルホニル、 $-C(O)O-R^{12}$ 、 $-C(O)NR^{14}R^{16}$ 、 $NR^{10}R^{11}$ 、および $-O-CH_2-$ フェニルからなる群より選択され、

R^{10} および R^{11} が各々独立して：H、 $C(O)-C_1 - C_4$ アルキル、および $C_1 - C_4$ アルキルからなる群より選択され；

R^{12} がH、または $C_1 - C_4$ アルキルであり；かつ

R^{14} および R^{16} が各々独立して：Hおよび $C_1 - C_4$ アルキルからなる群より選択される、化合物またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項4】

前記置換されていてもよい3-ピロリジニルの3位の炭素が、S立体配置を有する、請求項3に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項5】

JがOであり；Kが CR^1 であり；Lが CR^2 であり；Xが CR^3 であり；Yが CR^4 であり；かつ R^{20} が未置換ピロリジニルである、請求項3に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項6】

R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、および R^9 が各々独立して、H、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、およびハロからなる群より選択される、請求項5に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項7】

請求項1に記載の化合物であって、前記化合物が、(S)-3-(2',4'-ジフルオロ-ピフェニル-2-イルメトキシ)-ピロリジン塩酸塩であるか、あるいは前記化合

物が：

(S) - 3 - (4, 2', 4' - トリフルオロ - ビフェニル - 2 - イルメトキシ) - ピロリジン；

(S) - 3 - (4, 2', 3' - トリフルオロ - ビフェニル - 2 - イルメトキシ) - ピロリジン；

(S) - 3 - (4, 2' - ジフルオロ - ビフェニル - 2 - イルメトキシ) - ピロリジン；

(S) - 3 - (4' - メチル - ビフェニル - 2 - イルメトキシ) - ピロリジン；

(S) - 3 - (3' - 4' - ジフルオロ - ビフェニル - 2 - イルメチルオキシ) - ピロリジン；

(S) - 3 - (2', 3' - ジフルオロ - ビフェニル - 2 - イルメトキシ) - ピロリジン；

(S) - 3 - (ビフェニル - 2 - イルメトキシ) - ピロリジン；

(S) - 3 - (4' - フルオロ - ビフェニル - 2 - イルメトキシ) - ピロリジン；および

(S) - 3 - (2', 4' - ジフルオロ - ビフェニル - 2 - イルメトキシ) - ピロリジン；

からなる群より選択される、化合物またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 8】

薬学的組成物であって：治療上有効な量の請求項 1 乃至請求項 7 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、および薬学的に受容可能な賦形剤を含む、薬学的組成物。

【請求項 9】

線維筋痛を処置するための、請求項 8 に記載の薬学組成物。

【請求項 10】

注意欠陥過活動性（多動性）障害、神経因性疼痛、尿失禁、全般性不安障害、抑うつおよび統合失調症からなる群より選択される疾患を処置するための、請求項 8 に記載の薬学組成物。