

【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25年10月3日(2013.10.3)

【公表番号】特表2009-530248(P2009-530248A)

【公表日】平成21年8月27日(2009.8.27)

【年通号数】公開・登録公報2009-034

【出願番号】特願2008-558820(P2008-558820)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/85 (2006.01)
 A 6 1 K 31/455 (2006.01)
 A 6 1 K 31/496 (2006.01)
 A 6 1 K 31/537 (2006.01)
 C 0 7 D 413/10 (2006.01)
 C 0 7 D 401/04 (2006.01)
 C 0 7 D 401/12 (2006.01)
 C 0 7 D 401/14 (2006.01)
 C 0 7 D 405/12 (2006.01)
 C 0 7 D 405/04 (2006.01)
 C 0 7 D 409/04 (2006.01)
 A 6 1 K 31/506 (2006.01)
 A 6 1 K 31/497 (2006.01)
 C 0 7 D 417/12 (2006.01)
 A 6 1 K 31/501 (2006.01)
 A 6 1 K 31/502 (2006.01)
 C 0 7 D 487/04 (2006.01)
 C 0 7 D 471/10 (2006.01)
 C 0 7 D 471/04 (2006.01)
 C 0 7 D 491/048 (2006.01)
 C 0 7 D 495/04 (2006.01)
 A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
 A 6 1 K 31/538 (2006.01)
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)
 A 6 1 P 25/02 (2006.01)
 A 6 1 P 25/06 (2006.01)
 A 6 1 P 25/08 (2006.01)
 A 6 1 P 25/18 (2006.01)
 A 6 1 P 25/22 (2006.01)
 A 6 1 P 25/24 (2006.01)
 A 6 1 P 25/28 (2006.01)
 A 6 1 P 25/32 (2006.01)
 A 6 1 P 25/34 (2006.01)
 A 6 1 P 25/36 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 213/85 C S P
 A 6 1 K 31/455
 A 6 1 K 31/496
 A 6 1 K 31/537
 C 0 7 D 413/10

C 0 7 D 401/04
C 0 7 D 401/12
C 0 7 D 401/14
C 0 7 D 405/12
C 0 7 D 405/04
C 0 7 D 409/04
A 6 1 K 31/506
A 6 1 K 31/497
C 0 7 D 417/12
A 6 1 K 31/501
A 6 1 K 31/502
C 0 7 D 487/04 1 3 7
C 0 7 D 471/10 1 0 1
C 0 7 D 471/04 1 0 3 A
C 0 7 D 491/048
C 0 7 D 495/04 1 0 5 A
A 6 1 K 31/5377
A 6 1 K 31/538
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 25/02 1 0 3
A 6 1 P 25/06
A 6 1 P 25/08
A 6 1 P 25/18
A 6 1 P 25/22
A 6 1 P 25/24
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 25/32
A 6 1 P 25/34
A 6 1 P 25/36
A 6 1 P 43/00 1 1 1

【誤訳訂正書】

【提出日】平成25年8月13日(2013.8.13)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

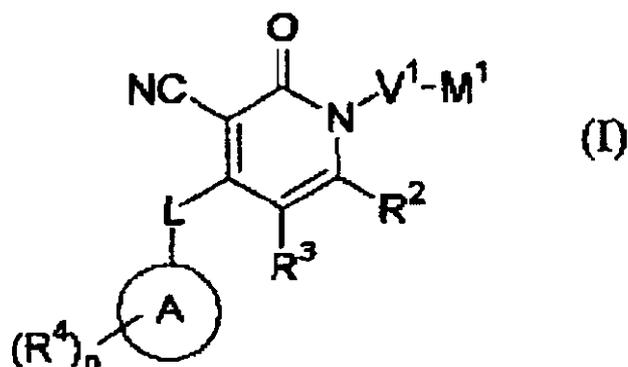
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(1),

【化1】



で表わされる化合物、薬学的に許容されるその酸または塩基の付加塩、その立体化学的異性体形態、そのN-オキッド形態またはその第4級アンモニウム塩：

V^1 は次の群、 $-\text{CH}_2-$ ； $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ ； $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ ； $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-$ ； $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ ； $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-$ ； $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ ； $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ ；および $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-$ から選択され；

M^1 は、水素；シクロ C_{3-7} アルキル；フェニル；ビフェニル；フェニルオキシ；ベンジルオキシ；フラニル；およびピリジニルの群から選択され、前記フェニル、ビフェニル、フェニルオキシ、ベンジルオキシの各基は必要に応じて、ハロ、 C_{1-3} アルキル、ポリハロ C_{1-3} アルキル、ポリハロ C_{1-3} アルキルオキシおよび C_{1-3} アルキルオキシの群から選択される1~3個の基で置換されていてもよく、前記シクロ C_{3-7} アルキルは、必要に応じて1以上のハロまたはポリハロ C_{1-3} アルキルで置換されていてもよい；

L は、次の群から選択される；共有結合； $-\text{O}-$ ； $-\text{OCH}_2-$ ； $-\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ ； $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ ； $-\text{OC}_2\text{H}_4\text{OCH}_2-$ ； $-\text{NR}^7-$ ； $-\text{NR}^7\text{CH}_2-$ ； $-\text{NR}^7$ -シクロ C_{3-7} ； $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^7)\text{CH}_2-$ ； $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ； $-\text{C}-\text{C}-$ ； $-\text{C}(=\text{O})-$ ；および $-\text{CH}=\text{CH}-$ ；ここで各 R^7 は、互いに独立に水素および C_{1-3} アルキルの群より選ばれ；

R^2 および R^3 は、おのおの互いに独立に水素、ハロまたはアルキルであり；

A は、ピペラジニルおよびピペリジニルの群より選択される[該基の各々は必要に応じて、 n (n は整数で0または1に等しい)個の基 R^4 で置換されていてもよい]；

R^4 は次の群より選択される；ハロ；シアノ；ヒドロキシ；エタノイル；アルキル；アルキルオキシ；アルキルオキシアルキル；アルキルオキシカルボニル；アルキルオキシカルボニルアルキル；アルキルカルボニル；アルキルカルボニルオキシ；アルキルカルボニルアルキルオキシ；ポリハロ C_{1-3} アルキル；ポリハロ C_{1-3} アルキルオキシ；ポリハロ C_{1-3} アルキルチオ；アルキルチオ；アルキルスルホニル； Het^3 ； Het^3 -アルキル； Het^3 -オキシ； Het^3 -オキシアルキル； Het^3 -アルキルオキシ； Het^3 -オキシアルキルオキシ； Het^3 -カルボニル； Het^3 -チオアルキル；アリール；アリールアルキル；アリールオキシ；アリールオキシアルキル；アリールアルキルオキシ；アリールアルケニル；アリールカルボニルアルキル；アリールスルホニル； $-\text{NR}^a\text{R}^b$ ；アルキル- NR^aR^b ； O -アルキル- NR^aR^b ； $-\text{C}(=\text{O})-\text{NR}^a\text{R}^b$ ； $-\text{C}(=\text{O})$ -アルキル- NR^aR^b ；および O -アルキル- $\text{C}(=\text{O})-\text{NR}^a\text{R}^b$ ；ここで、 R^a および R^b は、次の群から選択される；水素、アルキル、アルキルカルボニル、アリールアルキル、アルキルオキシアルキル、 Het^3 、 Het^3 アルキル、アルキルスルホニル、アルキル- NR^cR^d および $\text{C}(=\text{O})$ アルキル- NR^cR^d [ここで R^c および R^d は、水素、アルキルおよびアルキルカルボニルの群から選択される]；

Het^3 は、次の群から選択される；ピリジニル；ピリミジニル；ピリダジニル；ピラジニル；ピペリジニル；ピロリジニル；ピペラジニル；トリアゾリル；テトラヒドロピラニル；テトラヒドロ-チオピラン-1,1-ジオキッド；チアゾリル；オキサゾリル；モルフォリニル；オキサジアゾリル；イミダゾリル；ベンゾキサゾリル；ベンゾチエニル；ベンゾフラニル；1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリニル；インドリル；インドリニル；フタラジニル；およびベンゾ[1,3]ジオキサソリル[各基は、必要に応じて1, 2 または3個の置換基で置換さ

れていてもよく、各置換基は互いに独立に、ハロ、 C_{1-6} アルキル、ポリハロ C_{1-3} アルキル、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、エタノイル、フェニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピリジニル、モルフォリニル、モノ- およびジ(アルキル)アミノ、および C_{1-3} アルキルオキシの群から選ばれる];

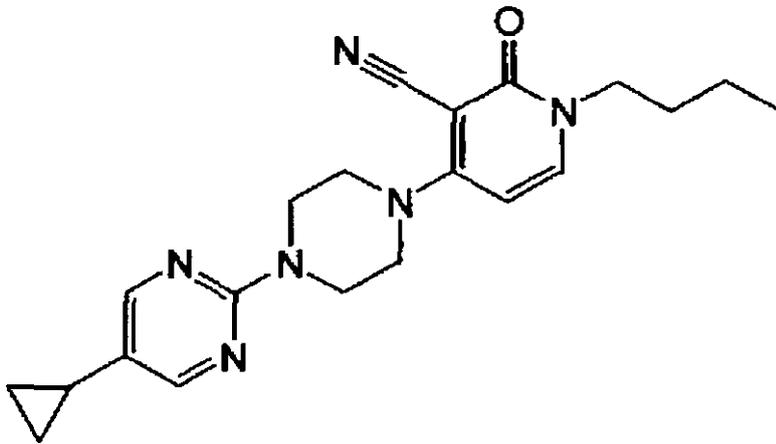
アリールは、フェニルまたはビフェニルである[各基は必要に応じて1、2 または3個の置換基で置換されていてもよく、各置換基は互いに独立に、ハロ、 C_{1-3} アルキル、ポリハロ C_{1-3} アルキル、ポリハロ C_{1-3} アルキルオキシ、シアノ、ニトロ、エチルオキシカルボニルおよび C_{1-3} アルキルオキシの群から選択される]; ならびに

アルキルは、飽和で直鎖もしくは分岐した炭素原子数1 ~6の炭化水素基であり; あるいは飽和で炭素原子数3 ~7の環式炭化水素基であり; 、あるいは、飽和で炭素原子数4 ~12個の炭化水素基であり、かつ、少なくとも1つの飽和で直鎖もしくは分岐した炭素原子数1 ~6の炭化水素基および少なくとも1つの飽和で炭素原子数3 ~7の環式炭化水素基を含む[ここで各炭素原子は、必要に応じて、シアノ、ヒドロキシ、カルボキシル、カルバモイル、フェニルおよび二価の基の $-OCH_2CH_2O-$ の群から選択される1つ以上の基で置換されていてもよい]である。

【請求項2】

次の群から選択される:

【化2】



(化合物2-006);

3-シアノ-1シクロプロピルメチル-4-(4-フェニル-ピペリジン-1-イル)-ピリジン-2(1H)-オン(化合物4-047);

請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

前記化合物が光学異性体として存在し、ラセミ混合物であるか個々の光学異性体である、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物の治療有効量と、製薬学的に許容される担体および/または賦形剤とを含む医薬組成物。

【請求項5】

薬物として使用する請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

ヒトを含む哺乳動物の状態を治療または予防するための薬物を製造するための請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物または請求項4に記載の医薬組成物の使用であって、前記の状態が、不安障害、精神障害、人格障害、化学物質関連障害、摂食障害、気分障害、片頭痛、てんかんまたは痙攣性障害、幼児期障害、認知障害、神経変性、神経毒症状および虚血の群から選択される中枢神経系障害である使用。

【請求項7】

前記中枢神経系障害が、広場恐怖症、全般性不安障害（GAD）、強迫観念性障害（OCD）、パニック障害、心的外傷後ストレス障害（PTSD）、対人恐怖およびその他の恐怖症の群から選択される不安障害である、請求項6に記載の使用。

【請求項 8】

前記中枢神経系障害が、統合失調症、妄想性障害、統合失調性感情障害、統合失調症様障害および物質誘発性精神障害の群から選択される精神障害である、請求項6に記載の使用。

【請求項 9】

前記中枢神経系障害が、強迫性人格障害および分裂性統合失調型障害の群から選択される人格障害である請求項6に記載の使用。

【請求項 10】

前記中枢神経系障害が、アルコール乱用、アルコール依存症、アルコール禁断症状、アルコール禁断譫妄、アルコール誘発性精神障害、アンフェタミン依存症、アンフェタミン禁断症状、コカイン依存症、コカイン禁断症状、ニコチン依存症、ニコチン禁断症状、オピオイド依存症およびオピオイド禁断症状の群から選択される化学物質関連障害である、請求項6に記載の使用。

【請求項 11】

前記中枢神経系障害が、神経性食欲不振症および神経性過食症の群から選択される摂食障害である請求項6に記載の使用。

【請求項 12】

前記中枢神経系障害が、双極性障害（IおよびII）、気分循環性障害、うつ病、気分変調性障害、大うつ病性障害および物質誘発性気分障害の群から選択される気分障害である請求項6に記載の使用。

【請求項 13】

前記中枢神経系障害が、片頭痛である請求項6に記載の使用。

【請求項 14】

中枢神経系障害が、非痙攣性全般てんかん、痙攣性全般てんかん、小発作性てんかん重積、大発作性てんかん重積、意識障害を伴うか伴わない部分てんかん、幼児けいれん、部分持続てんかん、およびその他の形態のてんかんの群から選択されるてんかんまたは痙攣性の障害である請求項6に記載の使用。

【請求項 15】

前記幼児期障害が、注意欠陥/多動性障害である請求項6に記載の使用。

【請求項 16】

前記中枢神経系障害が、譫妄、物質誘発持続性譫妄、認知症、HIV疾患による認知症、ハンチントン病による認知症、パーキンソン病による認知症、アルツハイマー型認知症、物質誘発持続性認知症および軽度認知障害の群から選択される認知障害である、請求項6に記載の使用。

【請求項 17】

前記中枢神経系障害が、不安症、統合失調症、片頭痛、うつ病、およびてんかんの群から選択される、請求項6に記載の使用。

【請求項 18】

請求項 1 から 3 のいずれかに記載された化合物が、 $1 \mu\text{M}$ 以下の EC_{50} を有する、請求項 6 から 17 のいずれか一項に記載の使用。

【請求項 19】

mGluR2 レセプターをイメージングするためのトレーサーを調製するための請求項 1 から 3 のいずれか 一項 に記載の化合物の使用。

【請求項 20】

ヒトを含む哺乳動物の請求項 6 から 17 のいずれか 一項 に挙げた状態を治療または予防するための薬物を製造するための、mGluR2 のオルトステリックアゴニストと組み合わせた請求項 1 から 3 のいずれか 一項 に記載の化合物の使用。