

【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8月24日(2006.8.24)

【公表番号】特表2006-502239(P2006-502239A)

【公表日】平成18年1月19日(2006.1.19)

【年通号数】公開・登録公報2006-003

【出願番号】特願2004-569744(P2004-569744)

【国際特許分類】

C 0 7 D 211/26 (2006.01)

A 6 1 K 31/451 (2006.01)

A 6 1 K 31/4525 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (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 25/30 (2006.01)

A 6 1 P 25/32 (2006.01)

A 6 1 P 25/34 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 405/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 211/26 C S P

A 6 1 K 31/451

A 6 1 K 31/4525

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 13/02

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 15/10

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/16

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 25/30
 A 6 1 P 25/32
 A 6 1 P 25/34
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 C 0 7 D 405/04

【手続補正書】

【提出日】平成18年7月5日(2006.7.5)

【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

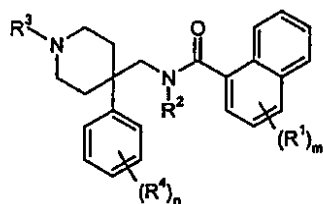
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式I:

【化1】



I

[式中、

R^1 は各々独立してCN、 CF_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、ハロゲン、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 R^a 、 R^b 、 SR^a 、 NR^aR^b 、 $CH_2NR^aR^b$ 、 OR^a または CH_2OR^a から選択され、ここで R^a および R^b は各々独立して水素、 C_{1-6} アルキル、 $C(O)R^c$ 、 $C(O)NHR^c$ または CO_2R^c であり、ここで R^c は各々 C_{1-6} アルキルであるか；または R^a と R^b は一緒になって $(CH_2)_jG(CH_2)_k$ または $G(CH_2)_jG$ であり、ここでGは酸素またはイオウであり、jは1、2、3または4であり、そしてkは0、1または2であり；

mは少なくとも1個の R^1 部分が水素ではない場合は1、2または3であり；

R_2 および R_3 は独立して水素、 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-4} アルコキシで置換された C_{1-6} アルキルであり；

R_4 は各々独立して水素、CN、 CF_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 SR^a 、 NR^aR^b 、 $CH_2NR^aR^b$ 、 OR^a または CH_2OR^a から選択され、ここで R^a および R^b は各々独立して水素、 C_{1-6} アルキル、 $C(O)R^c$ 、 $C(O)NHR^c$ または CO_2R^c であり、ここで R^c は各々 C_{1-6} アルキルであるか；または R^a と R^b は一緒になって $(CH_2)_jG(CH_2)_k$ または $G(CH_2)_jG$ であり；そして、

nは0、1、2または3である]

の化合物、そのインビボ加水分解性前駆体および製薬上許容しうるその塩。

【請求項2】

R^1 は各々独立してCN、 C_{1-6} アルキルまたは OR^c であり、そして、mは1、2または3であり；

R^2 および R^3 は独立して水素または C_{1-6} アルキルであり；そして、

R^4 はnが1または2である場合は各々独立してハロゲンである；

請求項 1 記載の化合物、そのインビボ加水分解性前駆体および製薬上許容しうるその塩。

【請求項 3】

R^1 は各々独立して CN、エチルまたはメトキシであり、そして、 m は 1、2 または 3 であり；

R^2 および R^3 は独立して水素またはメチルであり；そして、

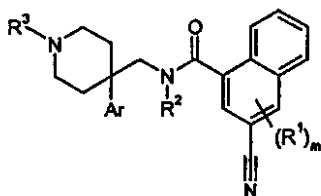
R^4 は n が 1 または 2 である場合は各々独立してハロゲンである；

請求項 1 記載の化合物、そのインビボ加水分解性前駆体および製薬上許容しうるその塩。

【請求項 4】

下記式 I I :

【化 2】



II

[式中、Ar はフェニル、3, 4 - ジクロロフェニル、3 - フルオロフェニル、4 - フルオロフェニル、3, 4 - ジフルオロフェニル、4 - メトキシフェニル、3, 4 - ジメトキシフェニル、3, 4 - メチレンジオキシフェニル、4 - ジフルオロメトキシフェニルまたは 4 - トリフルオロメトキシフェニルから選択され；

R^1 は m が 1 または 2 である場合は H、メチル、エチルまたはメトキシから選択され；そして、

R^2 および R^3 は独立して H またはメチルから選択される]

請求項 1 記載の化合物、そのインビボ加水分解性前駆体および製薬上許容しうるその塩。

【請求項 5】

生理学的に許容されるアニオンを与える無機または有機の酸と共に製造した請求項 1 記載の化合物の製薬上許容しうる塩。

【請求項 6】

無機または有機の酸が塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸、メタンサルホン酸、スルファミン酸、p - トルエンサルホン酸、酢酸、クエン酸、乳酸、酒石酸、マロン酸、フマル酸、エタンサルホン酸、ベンゼンサルホン酸、シクロヘキシルスルファミン酸、サリチル酸およびキナ酸から選択される請求項 5 記載の化合物の製薬上許容しうる塩。

【請求項 7】

請求項 1 記載の化合物、そのインビボ加水分解性前駆体または製薬上許容しうるその塩および製薬上許容しうる担体を含む医薬組成物。

【請求項 8】

NK_1 受容体の拮抗および S R I 活性が有益である疾患状態において使用するための医薬の製造における請求項 1 記載の化合物、そのインビボ加水分解性前駆体または製薬上許容しうるその塩の使用。

【請求項 9】

哺乳類における高血圧、癌患者における鬱病、パーキンソン病患者における鬱病、心筋梗塞後の鬱病、症候下の兆候的鬱病、不妊症の女性における鬱病、幼年性鬱病、主要鬱病、単エピソード鬱病、再発性鬱病、幼児虐待誘発性鬱病、出産後鬱病、全般性不安障害、広場恐怖症、社会嫌悪症、単純性嫌悪症、外傷後ストレス症候群、回避性人格障害、早発射精、神経性食欲不振、神経性大食症、肥満、アルコール、コカイン、ヘロイン、フェノバルビタール、ニコチンまたはベンゾジアゼピンに対する嗜癖；群発性頭痛、偏頭痛、疼痛、アルツハイマー病、強迫性障害、パニック障害、痴呆、健忘症、加齢関連性認知低下、パーキンソン病における痴呆、睡眠薬誘発性パーキンソン病、遅発性ジスキネジー、過

プロラクチン尿症、血管痙攣、脳血管痙攣、小脳性運動失調、胃腸管障害、統合失調症の陰性症状、月経前症候群、筋線維痛症候群、ストレス性失禁、トゥレット病、抜毛癖、盗癖、男性機能障害、注意欠陥過活動性障害、慢性発作性片頭痛および血管障害に関わる頭痛の治療のために有用な医薬の製造のための請求項1記載の化合物の使用。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0014

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0014】

式Iの化合物の製薬上許容しうる塩には、生理学的に許容されるアニオンを与える無機または有機の酸とともに、例えば、塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸、メタンサルホン酸、スルファミン酸、p-トルエンサルホン酸、酢酸、クエン酸、乳酸、酒石酸、マロン酸、フマル酸、エタンサルホン酸、ベンゼンサルホン酸、シクロヘキシルスルファミン酸、サリチル酸およびキナ酸と共に製造したものが包含される。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0021

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0021】

更に別の例においては、本発明は、式Iの化合物、そのインビボ加水分解性前駆体または製薬上許容しうるその塩の有効量を温血動物に投与することを含む、SRI活性と組み合わせたNK₁受容体の拮抗が有利である疾患状態の治療方法である。本発明はまた、NK₁受容体の拮抗およびSRI活性が有利である疾患状態において使用するための医薬の製造における式Iの化合物、そのインビボ加水分解性前駆体または製薬上許容しうるその塩の使用を提供する。