

【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17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2004-517947(P2004-517947A)

【公表日】平成16年6月17日(2004.6.17)

【年通号数】公開・登録公報2004-023

【出願番号】特願2002-562330(P2002-562330)

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/44

A 6 1 P 17/04

A 6 1 P 43/00

// C 0 7 D 213/53

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/44

A 6 1 P 17/04

A 6 1 P 43/00 105

C 0 7 D 213/53

【手続補正書】

【提出日】平成17年1月25日(2005.1.25)

【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】

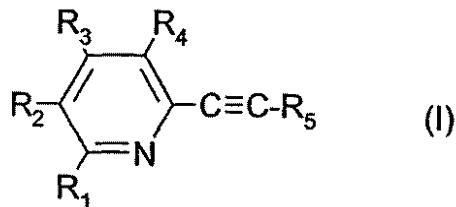
【請求項1】

そう痒状態の処置のためのmGluR5アンタゴニストの使用。

【請求項2】

mGluR5アンタゴニストが、遊離の形態または薬学的に許容される塩の形態の、式I

【化1】



〔式中、

R₁は、水素、(C₁-₄)アルキル、(C₁-₄)アルコキシ、シアノ、エチニルまたはジ(C₁-₄)アルキルアミノであり、

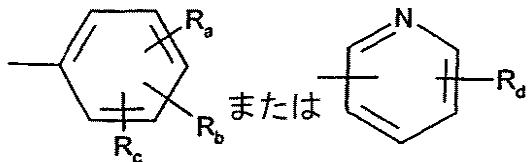
R₂は、水素、ヒドロキシ、カルボキシ、(C₁-₄)アルコキシカルボニル、ジ(C₁-₄)アルキルアミノメチル、4-(4-フルオロ-ベンゾイル)-ピペラジン-1-イル-カルボキシ、4-(4-アジド-2-ヒドロキシベンゾイル)-ピペラジン-1-イル-カルボキシ、4-(4-アジド-2-ヒドロキシ-3-ヨード-ベンゾイル)-ピペラジン-1-イル-カルボキシまたは4-(4-アジド-2-ヒドロキシ-3-ヨード-ベンゾイル)-ピペラジン-1-イル-カルボキシであり、

R_3 は、水素、(C₁ - C₄)アルキル、カルボキシ、(C₁ - C₄)アルコキシカルボニル、(C₁ - C₄)アルキルカルバモイル、ヒドロキシ(C₁ - C₄)アルキル、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノメチル、モルホリノカルボニルまたは4-(4-フルオロ-ベンゾイル)-ピペリジン-1-イル-カルボキシであり、

R_4 は、水素、ヒドロキシ、カルボキシ、(C₂ - C₅)アルカノイルオキシ、(C₁ - C₄)アルコキシカルボニル、アミノ(C₁ - C₄)アルコキシ、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノ(C₁ - C₄)アルコキシ、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノ(C₁ - C₄)アルキルまたはヒドロキシ(C₁ - C₄)アルキルであり、そして

R_5 は、式

【化2】



{式中、

R_a および R_b は、独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシまたは(C₂ - C₅)アルキニルであり、そして

R_c は水素、フッ素、塩素、臭素、ヒドロキシ(C₁ - C₄)アルキル、(C₂ - C₅)アルカノイルオキシ、(C₁ - C₄)アルコキシまたはシアノであり、そして

R_d は水素、ハロゲンまたは(C₁ - C₄)アルキルである。)

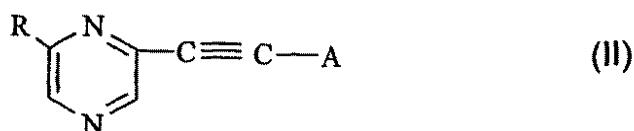
の基である。]

で示される化合物である、請求項1に記載の使用。

【請求項3】

m G 1 u R 5 アンタゴニストが、遊離の形態または薬学的に許容される塩の形態の、式I

【化3】

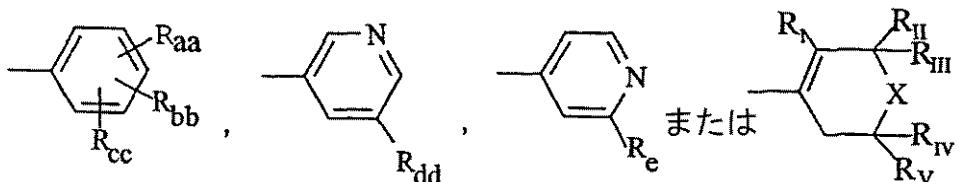


{式中、

R は、水素または(C₁ - C₄)アルキルであり、そして

A は、式

【化4】



{式中、

R_{aa} 、 R_{bb} および R_{cc} は、独立して、水素、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルコキシ、ヒドロキシ、ヒドロキシ(C₁ - C₄)アルキル、シアノまたはハロゲンであり、

R_{dd} は、シアノまたはハロゲンであり、

R_e は、ヒドロキシ、(C₁ - C₄)アルキルまたは(C₁ - C₄)アルコキシであり、

R_I は、水素または(C₁ - C₄)アルキルであり、

$R_{I\ I}$ および $R_{I\ I\ I}$ は、それぞれ、水素であるか、または一体となってオキソ、=C H - C N、=N-OH、=N-O-(C₁₋₄)アルキル、=C H - P O₃[(C₁₋₄)アルキル]₂ または=C H - C O - R_f [式中、R_f は(C₁₋₄)アルコキシまたは-N R_g R_h (ここで、R_g および R_h は独立して水素、(C₁₋₄)アルキルまたはフェニルである。)である。]を形成し、

$R_{I\ V}$ および R_V は、独立して水素、(C₁₋₄)アルキルまたはフェニルであり、そして

X は (C H₂)_n (ただし、n は 0、1 または 2 である。)、

C H R_i、(ただし、R_i はヒドロキシ、(C₁₋₄)アルキル、(C₁₋₄)アルコキシ、ヒドロキシ(C₁₋₄)アルキル、(C₁₋₄)アルコキシ(C₁₋₄)アルキル、(C₁₋₄)アルコキシカルボニル、カルバモイル、(C₁₋₄)アルキルカルバモイル、フェニル、ピリジル、チエニルまたは(R_j, R_k)N-(C₁₋₄)アルキルであり、ここで、R_j は水素、(C₁₋₄)アルキル、(C₁₋₄)アルカノイルもしくはベンゾイルであり、そして、R_k は水素または(C₁₋₄)アルキルである。)であるか、あるいは、もし、R_{I\ I} および R_{I\ I\ I} がそれぞれ水素であれば、

X は、また、N R₁ [ただし、R₁ は(C₁₋₄)アルコキシ-カルボニル、ベンジルオキシカルボニル、ベンゾイル、チエニル、(C₁₋₄)アルカノイル、カルバモイル、モノ-もしくはジ(C₁₋₄)アルキルカルバモイルまたはフェニルカルバモイル(ここで、R₁ における任意のフェニル環は、所望によりハロ、シアノ、(C₁₋₄)アルキルもしくは(C₁₋₄)アルコキシでモノ-またはジ置換されている。)であり得る。]の基である。

}

で示される化合物である、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 4】

m G l u R 5 アンタゴニストが、遊離の形態または薬学的に許容される塩の形態の、2-[2-(ピリジン-3-イル)エチニル]-6-メチル-ピリジンである、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 5】

そう痒状態の処置における使用のための医薬組成物の製造における m G l u R 5 アンタゴニストの使用。

【請求項 6】

そう痒状態の処置における使用のための、活性成分として m G l u R 5 アンタゴニストを含む医薬組成物。