

【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19年11月29日(2007.11.29)

【公表番号】特表2007-508392(P2007-508392A)

【公表日】平成19年4月5日(2007.4.5)

【年通号数】公開・登録公報2007-013

【出願番号】特願2006-535598(P2006-535598)

【国際特許分類】

C 0 7 D 295/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/495 (2006.01)

C 0 7 D 309/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

C 0 7 D 307/52 (2006.01)

C 0 7 D 215/12 (2006.01)

C 0 7 D 307/81 (2006.01)

C 0 7 D 213/36 (2006.01)

C 0 7 D 333/28 (2006.01)

C 0 7 D 333/58 (2006.01)

C 0 7 D 209/14 (2006.01)

C 0 7 D 333/62 (2006.01)

C 0 7 D 215/14 (2006.01)

C 0 7 D 333/64 (2006.01)

C 0 7 D 317/28 (2006.01)

C 0 7 D 241/04 (2006.01)

C 0 7 D 243/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 15/12 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 13/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 295/08 C S P A

A 6 1 K 31/495

C 0 7 D 309/10

A 6 1 K 31/496

C 0 7 D 307/52

C 0 7 D 215/12

C 0 7 D 307/81

C 0 7 D 213/36

C 0 7 D 333/28

C 0 7 D 333/58

C 0 7 D 209/14
 C 0 7 D 333/62
 C 0 7 D 215/14
 C 0 7 D 333/64
 C 0 7 D 317/28
 C 0 7 D 241/04
 C 0 7 D 243/08 5 0 5
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 15/10
 A 6 1 P 15/12
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 13/00
 A 6 1 P 15/00
 A 6 1 P 25/00 1 0 1
 A 6 1 P 25/24
 A 6 1 P 25/02
 A 6 1 P 25/04
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 25/22
 A 6 1 P 25/20

【手続補正書】

【提出日】平成19年10月12日(2007.10.12)

【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

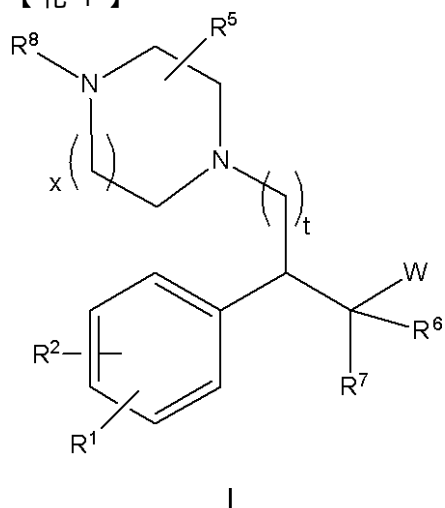
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I:

【化1】



[式中 :

WはHまたはOR⁹であり ;

R¹ および R² は、独立して、H、OH、アルキル、アルコキシ、ハロ、トリフルオロメチル、アルカノイルオキシまたはメチレンジオキシであり ;

R^5 は H、(C_1 - C_6) アルキルまたはトリフルオロメチルであり；

R^6 および R^7 は、独立して、(C_1 - C_6) アルキルであるか；または

R^6 および R^7 は一緒になって炭素数 4 ないし 8 の環を形成し；

R^8 は (C_1 - C_6) アルキル、ベンジル（ベンジルオキシまたはフェニルオキシで置換されていてもよい）、ナフチルメチル（1 個またはそれ以上の R^1 で置換されていてもよい）、フェニル（ C_2 - C_6 ）アルキル（1 個またはそれ以上の R^1 で置換されていてもよい）、ヘテロアリールメチル（ R^1 で置換されていてもよい）、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキルメチル（ここで、炭素原子はいずれも N、S または O と置き換えることができ、そのシクロアルキルメチルは OH、 CF_3 、ハロ、アルコキシ、アルキル、ベンジルオキシまたはアルカノイルオキシで置換されていてもよい）またはシクロアルケニルメチル（ここで、炭素原子はいずれも N、S または O と置き換えることができ、そのシクロアルケニルメチルは OH、 CF_3 、ハロ、アルコキシ、アルキル、ベンジルオキシまたはアルカノイルオキシで置換されていてもよい）であるか；あるいは

R^5 および R^8 は、 R^8 が結合する窒素原子と一緒に、 R^5 で置換されていてもよい環を形成し；

R^9 は H、(C_1 - C_4) アルキルまたは (C_1 - C_4) アルキル - C(=O) であり；

t は 1、2 または 3 であり；および

x は 0、1 または 2 である]

で示される化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項 2】

R^1 および R^2 が、独立して、水素、OH、ハロゲン、 C_1 - C_6 アルキルおよび C_1 - C_6 アルコキシから選択されるところの、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

R^6 および R^7 が 4、5 または 6 員の炭素環を形成するところの、請求項 1 または請求項 2 記載の式 I の化合物。

【請求項 4】

R^6 および R^7 がシクロヘキシル環を形成するところの、請求項 3 記載の式 I の化合物。

【請求項 5】

W が OH であるところの、請求項 1 ないし 4 のいずれか一項に記載の式 I の化合物。

【請求項 6】

t が 1 または 2 であるところの、請求項 1 ないし 5 のいずれか一項に記載の式 I の化合物。

【請求項 7】

x が 1 であるところの、請求項 1 ないし 6 のいずれか一項に記載の式 I の化合物。

【請求項 8】

R^8 が (C_1 - C_6) アルキル、ベンジル、ナフチルメチル、フェニル（ C_2 - C_6 ）アルキル、ヘテロアリールメチル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキルメチル（その炭素原子はいずれも O と置き換えることができる）またはシクロアルケニルメチルであり、ここでベンジル、フェニル、ナフチルおよびヘテロアリール部分が (C_1 - C_6) アルキル、(C_1 - C_6) アルコキシ、フェノキシおよびハロゲンから選択される 1 個または 2 個の同一または異なる基で置換されていてもよいところの、請求項 1 ないし 7 のいずれか一項に記載の式 I の化合物。

【請求項 9】

ヘテロアリールがフリル、ピリジル、キノリルまたはベンゾフラニルであるところの、請求項 8 記載の式 I の化合物。

【請求項 10】

W が H または OR^9 であり；

R^1 および R^2 が、独立して、H、OH、アルキル、アルコキシ、ハロ、トリフルオロ

メチル、アルカノイルオキシまたはメチレンジオキシであり；

R^5 が H、(C_1 - C_6) アルキルまたはトリフルオロメチルであり；

R^6 および R^7 が一緒になって炭素数 4 ないし 8 の環を形成し；

R^8 が (C_1 - C_6) アルキル、ベンジル (ベンジルオキシまたはフェニルオキシで置換されていてもよい)、ナフチルメチル (1 個またはそれ以上の R^1 で置換されていてもよい)、フェニル (C_2 - C_6) アルキル (1 個またはそれ以上の R^1 で置換されていてもよい)、ヘテロアリールメチル (R^1 で置換されていてもよい)、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキルメチル (ここで、炭素原子はいずれも N、S または O と置き換えることができ、そのシクロアルキルメチルは OH、 CF_3 、ハロ、アルコキシ、アルキル、ベンジルオキシまたはアルカノイルオキシで置換されていてもよい) またはシクロアルケニルメチル (ここで、炭素原子はいずれも N、S または O と置き換えることができ、そのシクロアルケニルメチルは OH、 CF_3 、ハロ、アルコキシ、アルキル、ベンジルオキシまたはアルカノイルオキシで置換されていてもよい) であるか；あるいは

R^5 および R^8 が、 R^8 が結合する窒素原子と一緒に、 R^5 で置換されていてもよい環を形成し；

R^9 が H であり；

t が 1 または 2 であり；および

x が 1 または 2 であるところの、請求項 1 記載の式 I の化合物。

【請求項 11】

以下に示す化合物：

1 - (1 - (3 - クロロフェニル) - 2 - {4 - [(6 - メトキシ - 2 - ナフチル) メチル] ピペラジン - 1 - イル} エチル) シクロヘキサノール・二塩酸塩；

1 - {1 - (3 - クロロフェニル) - 2 - [4 - (シクロプロピルメチル) ピペラジン - 1 - イル] エチル} シクロヘキサノール・二塩酸塩；

1 - {1 - (3 - クロロフェニル) - 2 - [4 - (シクロヘキサ - 3 - エン - 1 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] エチル} シクロヘキサノール・二塩酸塩；

6 - ({4 - [2 - (3 - クロロフェニル) - 2 - (1 - ヒドロキシシクロヘキシル) エチル] ピペラジン - 1 - イル} メチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - オール・二塩酸塩；

1 - {1 - (3 - クロロフェニル) - 2 - [4 - (3 - フェニルブチル) ピペラジン - 1 - イル] エチル} シクロヘキサノール・二塩酸塩；

1 - {1 - (3 - クロロフェニル) - 2 - [4 - (2 - フェニルエチル) ピペラジン - 1 - イル] エチル} シクロヘキサノール・二塩酸塩；

1 - {1 - (3 - クロロフェニル) - 2 - [4 - (3 - フェノキシベンジル) ピペラジン - 1 - イル] エチル} シクロヘキサノール・二塩酸塩；

1 - {1 - (3 - クロロフェニル) - 2 - [4 - (2 - ナフチルメチル) ピペラジン - 1 - イル] エチル} シクロヘキサノール・二塩酸塩；

1 - {1 - (3 - クロロフェニル) - 2 - [4 - (3 - フリルメチル) ピペラジン - 1 - イル] エチル} シクロヘキサノール・二塩酸塩；

1 - {1 - (3 - クロロフェニル) - 2 - [4 - (シクロヘキシルメチル) ピペラジン - 1 - イル] エチル} シクロヘキサノール・二塩酸塩；

1 - {1 - (3 - クロロフェニル) - 2 - [4 - (キノリン - 4 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] エチル} シクロヘキサノール・二塩酸塩；

1 - (1 - (3 - クロロフェニル) - 2 - {4 - [(5 - エチル - 2 - フリル) メチル] ピペラジン - 1 - イル} エチル) シクロヘキサノール・二塩酸塩；

1 - {1 - (3 - クロロフェニル) - 2 - [4 - (2 - フェニルプロピル) ピペラジン - 1 - イル] エチル} シクロヘキサノール・二塩酸塩；

1 - [2 - [4 - (1 - ベンゾフラン - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] - 1 - (3 - クロロフェニル) エチル] シクロヘキサノール・二塩酸塩；

1 - [2 - {4 - [4 - (ベンジルオキシ) ベンジル] ピペラジン - 1 - イル} - 1 - (

3 - クロロフェニル) エチル] シクロヘキサノール・二塩酸塩 ;

1 - { 1 - (3 - クロロフェニル) - 2 - [4 - (4 - フェノキシベンジル) ピペラジン - 1 - イル] エチル } シクロヘキサノール・二塩酸塩 ;

1 - { 1 - (3 - クロロフェニル) - 2 - [4 - (ピリジン - 4 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] エチル } シクロヘキサノール・二塩酸塩 ;

1 - { 1 - (3 - クロロフェニル) - 2 - [4 - (ピリジン - 3 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] エチル } シクロヘキサノール・二塩酸塩 ;

またはその医薬上許容される塩の一つであるところの、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 2】

a : 請求項 1 ないし 1 1 のいずれか一項に記載の少なくとも一つの化合物または医薬上許容される塩 ; および

b : 少なくとも一つの医薬上許容される担体
を含む、モノアミン再取り込みにより改善される症状の治療または予防用医薬組成物。