

【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30年2月8日 (2018.2.8)

【公表番号】特表2017-503804(P2017-503804A)

【公表日】平成29年2月2日 (2017.2.2)

【年通号数】公開・登録公報2017-005

【出願番号】特願2016-545818(P2016-545818)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/661 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

C 0 7 F 9/59 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/04 C S P

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/661

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/04

C 0 7 F 9/59

【手続補正書】

【提出日】平成29年12月25日 (2017.12.25)

【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

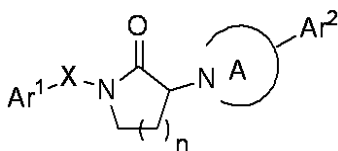
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】



I

[ 式中 :

Ar<sup>1</sup> は、フェニルまたはインダニルであり、シアノ、ハロ、アルキル、ハロアルキルおよびハロアルコキシから選ばれる 0 ~ 3 の置換基で置換されており ;

Ar<sup>2</sup> は、1 の OR 置換基で置換されており、かつ、シアノ、ハロ、アルキル、ハロアルキルおよびハロアルコキシから選ばれる 0 ~ 3 の置換基でもまた置換されているフェニルであり ;

R は、アルキルエステル、アミノ酸エステル、アルコキシエステル、ホスホン酸、ホスホン酸アルキルエステル、アルコキシホスホノナート酸、アルコキシホスホノナート アルキルエステル、アルキルカルバメート、アミノ酸カルバメート、アルキルホスホロアミダート、アリールホスホロアミダートおよびスルファメートから成る群から選ばれるプロドラッグ部分であり；

X は、結合または  $C_1 - C_3$  アルキレンであり；

n は、1 または 2 であり；

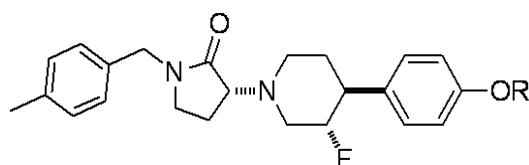
環 A は、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、ホモピペリジニルまたはホモピペラジニルであり、ハロ、アルキル、ヒドロキシまたはアルコキシから選ばれる 0 ~ 4 の置換基で置換されている]

の化合物、またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 2】

式：

【化 2】



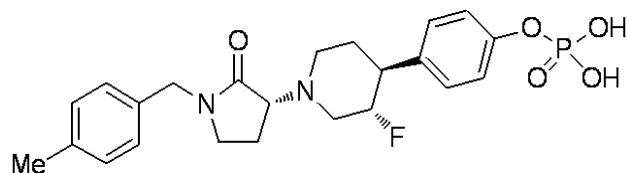
[ 式中、R は、アルキルエステル、アミノ酸エステル、アルコキシエステル、ホスホン酸、ホスホン酸アルキルエステル、アルコキシホスホノナート酸、アルコキシホスホノナート アルキルエステル、アルキルカルバメート、アミノ酸カルバメート、アルキルホスホロアミダート、アリールホスホロアミダートおよびスルファメートから成る群から選ばれるプロドラッグ部分である ]

を有する請求項 1 の化合物、またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 3】

4 - ( ( 3 S , 4 S ) - 3 - フルオロ - 1 - ( ( R ) - 1 - ( 4 - メチルベンジル ) - 2 - オキシピロリジン - 3 - イル ) ピペリジン - 4 - イル ) フェニル 二水素ホスフェートである請求項 2 の化合物、またはその医薬的に許容される塩。

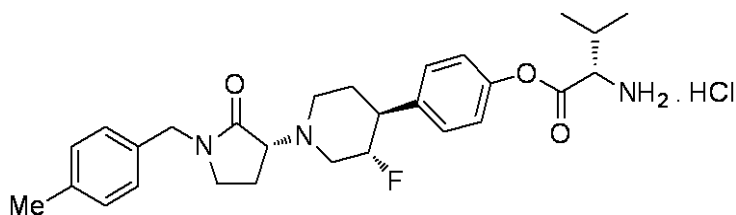
【化 3】



【請求項 4】

( S ) - 4 - ( ( 3 S , 4 S ) - 3 - フルオロ - 1 - ( ( R ) - 1 - ( 4 - メチルベンジル ) - 2 - オキシピロリジン - 3 - イル ) ピペリジン - 4 - イル ) フェニル 2 - アミノ - 3 - メチルブタノエート 塩酸塩である請求項 2 の化合物、またはその医薬的に許容される塩。

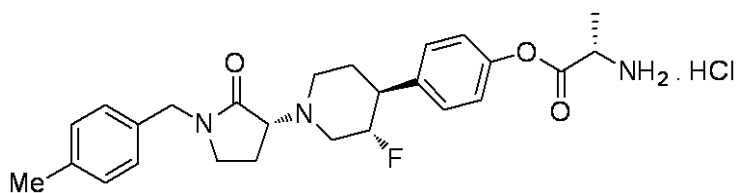
【化 4】



【請求項 5】

( S ) - 4 - ( ( 3 S , 4 S ) - 3 - フルオロ - 1 - ( ( R ) - 1 - ( 4 - メチルベン

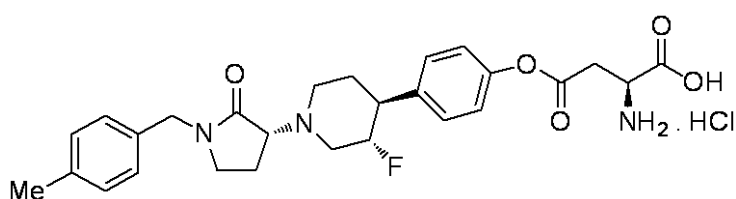
ジル) - 2 - オキソピロリジン - 3 - イル) ピペリジン - 4 - イル) フェニル 2 - アミノプロパノアート 塩酸塩である請求項 2 の化合物、またはその医薬的に許容される塩。  
【化 5】



【請求項 6】

(S) - 2 - アミノ - 4 - (4 - ((3S, 4S) - 3 - フルオロ - 1 - ((R) - 1 - (4 - メチルベンジル) - 2 - オキソピロリジン - 3 - イル) ピペリジン - 4 - イル) フェノキシ) - 4 - オキソブタン酸 塩酸塩である請求項 2 の化合物、またはその医薬的に許容される塩。

【化 6】

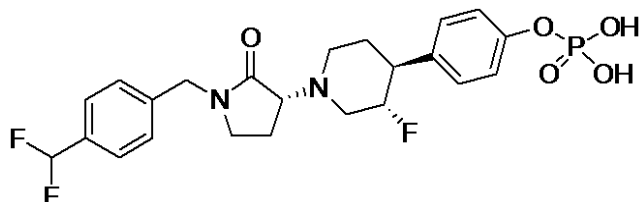


I

【請求項 7】

4 - ((3S, 4S) - 3 - フルオロ - 1 - ((R) - 1 - (4 - メチルベンジル) - 2 - オキソピロリジン - 3 - イル) ピペリジン - 4 - イル) フェニル 二水素ホスフェートである請求項 1 の化合物、またはその医薬的に許容される塩。

【化 7】



【請求項 8】

請求項 1 の化合物またはその医薬的に許容される塩および医薬的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 9】

請求項 1 から 7 のいずれかに記載の化合物を含む、鬱病、アルツハイマー病、神経障害性疼痛またはパーキンソン病の治療剤。

【請求項 10】

鬱病の治療を対象にする請求項 9 の治療剤。

【請求項 11】

アルツハイマー病の治療を対象にする請求項 9 の治療剤。

【請求項 12】

神経障害性疼痛の治療を対象にする請求項 9 の治療剤。