

【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】令和 3 年 7 月 26 日 (2021.7.26)

【公表番号】特表 2020-524679 (P2020-524679A)

【公表日】令和 2 年 8 月 20 日 (2020.8.20)

【年通号数】公開・登録公報 2020-033

【出願番号】特願 2019-570108 (P2019-570108)

【国際特許分類】

C 07 C 69/84 (2006.01)

A 61 P 1/08 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 25/22 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

A 61 P 37/06 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 3/06 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 P 1/16 (2006.01)

A 61 P 25/14 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 25/04 (2006.01)

A 61 P 15/10 (2006.01)

A 61 P 25/20 (2006.01)

A 61 P 25/36 (2006.01)

A 61 P 25/30 (2006.01)

A 61 K 31/235 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

【 F I 】

C 07 C 69/84 C S P

A 61 P 1/08

A 61 P 25/24

A 61 P 25/22

A 61 P 25/28

A 61 P 25/00

A 61 P 13/12

A 61 P 37/06

A 61 P 29/00

A 61 P 3/04

A 61 P 3/06

A 61 P 27/02

A 61 P 1/16

A 61 P 25/14

A 61 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 0 7
 A 6 1 P 25/04
 A 6 1 P 15/10
 A 6 1 P 25/20
 A 6 1 P 25/36
 A 6 1 P 25/30
 A 6 1 K 31/235
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】令和3年6月7日(2021.6.7)

【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

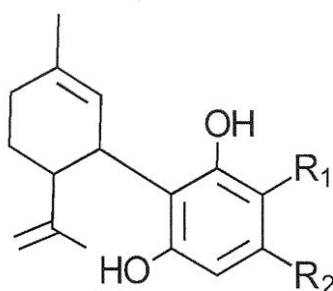
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

5-HT_{1A}受容体に関連する病態、疾患または症状の治療に使用する化合物であって、前記化合物が、一般式(I)：

【化1】



(I)

を有し、式中、

R₁が、-C(=O)OR₃、-OC(=O)R₄から選択され；

R₂が、直鎖または分岐鎖C₁～C₁₅アルキル、直鎖または分岐鎖C₂～C₁₅アルケニルおよび直鎖または分岐鎖C₂～C₁₅アルキニルから選択され；それぞれ独立に任意選択で、ヒドロキシ、ハロゲン、アミン、アミドおよびその任意の組合せから選択される少なくとも1つの置換基によって置換されており；

R₃およびR₄がそれぞれ独立に、直鎖または分岐鎖C₁～C₁₅アルキル、直鎖または分岐鎖C₂～C₁₅アルケニル、直鎖または分岐鎖C₂～C₁₅アルキニル、ハロゲン、アミンおよびアミドから選択され、

前記病態、疾患または症状が、不安、ストレス、うつ病、統合失調症、パニック、離脱症候群、自己免疫疾患、炎症、肥満、メタボリック症候群、網膜症、嘔気、嘔吐、腎機能異常、腎臓虚血性/再灌流傷害、神経損傷、ハンチントン病、アルツハイマー病、脳梗塞、肝性脳症、外傷性脳損傷、脳虚血、脊髄損傷、血管新生、癲癇、痙攣、神経因性疼痛、気道閉塞、強迫行動、認知障害、性衝動および性機能の低下、睡眠障害、オピオイドによる呼吸抑制、依存症ならびにその任意の組合せから選択される、化合物。

【請求項2】

前記病態、疾患または症状が、嘔気、嘔吐、痙攣およびその任意の組合せから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

前記病態、疾患または症状が、うつ病に関連する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

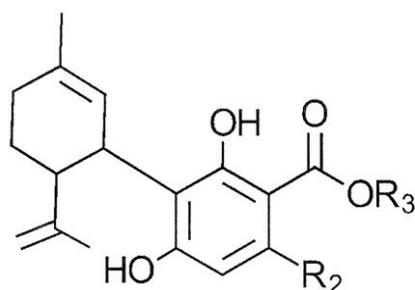
前記疾患、病態、症状または障害が、腎機能異常に関連する、請求項 1 に記載の化合物

。

【請求項 5】

前記化合物が、一般式 (I I) :

【化 2】



(I I)

を有する化合物であり、式中、

R_2 が、直鎖または分岐鎖 $C_1 \sim C_{15}$ アルキル、直鎖または分岐鎖 $C_2 \sim C_{15}$ アルケニルおよび直鎖または分岐鎖 $C_2 \sim C_{15}$ アルキニルから選択され；それぞれ独立に任意選択で、ヒドロキシ、ハロゲン、アミンおよびアミド、ならびにその任意の組合せから選択される少なくとも 1 つの置換基によって置換されており；

R_3 が、直鎖または分岐鎖 $C_1 \sim C_{15}$ アルキル、直鎖または分岐鎖 $C_2 \sim C_{15}$ アルケニル、直鎖または分岐鎖 $C_2 \sim C_{15}$ アルキニル、ハロゲン、アミンおよびアミドから選択される、

請求項 1 ～ 4 のいずれか 1 項に記載の、化合物。

【請求項 6】

R_2 が直鎖または分岐鎖 $C_1 \sim C_{15}$ アルキルである、請求項 1 ～ 5 のいずれか 1 項に記載の、化合物。

【請求項 7】

R_2 が直鎖または分岐鎖 $C_2 \sim C_{15}$ アルケニルである、請求項 1 ～ 5 のいずれか 1 項に記載の、化合物。

【請求項 8】

R_2 が直鎖または分岐鎖 $C_2 \sim C_{15}$ アルキニルである、請求項 1 ～ 5 のいずれか 1 項に記載の、化合物。

【請求項 9】

R_3 が直鎖または分岐鎖 $C_1 \sim C_{15}$ アルキルである、請求項 1 ～ 5 のいずれか 1 項に記載の、化合物。

【請求項 10】

R_3 が直鎖または分岐鎖 $C_2 \sim C_{15}$ アルケニルである、請求項 1 ～ 5 のいずれか 1 項に記載の、化合物。

【請求項 11】

R_3 が直鎖または分岐鎖 $C_2 \sim C_{15}$ アルキニルである、請求項 1 ～ 5 のいずれか 1 項に記載の、化合物。

【請求項 12】

R_3 が、ハロゲン、アミンおよびアミドから選択される、請求項 1 ～ 5 のいずれか 1 項に記載の、化合物。

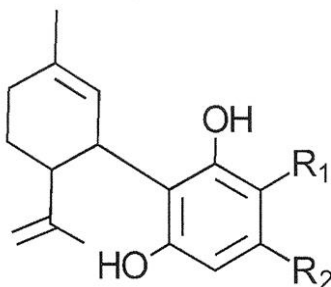
【請求項 13】

5 - H T_{1A} 受容体に関連する病態、疾患または症状の治療に使用し、
 前記病態、疾患または症状が、不安、ストレス、うつ病、統合失調症、パニック、離脱
 症候群、自己免疫疾患、炎症、肥満、メタボリック症候群、網膜症、嘔気、嘔吐、腎機能
 異常、腎臓虚血性 / 再灌流傷害、神経損傷、ハンチントン病、アルツハイマー病、脳梗塞
 、肝性脳症、外傷性脳損傷、脳虚血、脊髄損傷、血管新生、癲癇、痙攣、神経因性疼痛、
 気道閉塞、強迫行動、認知障害、性衝動および性機能の低下、睡眠障害、オピオイドによ
 る呼吸抑制、依存症ならびにその任意の組合せから選択され、
 請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の化合物を少なくとも 1 つ含む、組成物。

【請求項 14】

一般式 (I) :

【化 3】



(I)

を有し、式中、

R₁ が、- C (= O) O R₃、- O C (= O) R₄ から選択され；

R₂ が、直鎖または分岐鎖 C₂ ~ C₁₅ アルケニルおよび直鎖または分岐鎖 C₂ ~ C₁₅ アルキニルから選択され；それぞれ独立に任意選択で、ヒドロキシ、ハロゲン、アミン
 およびアミドまたはその任意の組合せから選択される少なくとも 1 つの置換基によって置
 換されており；

R₃ が、直鎖または分岐鎖 C₂ ~ C₁₅ アルキニル、ハロゲン、アミンおよびアミドか
 ら選択され；

R₄ が、直鎖または分岐鎖 C₁ ~ C₁₅ アルキル、直鎖または分岐鎖 C₂ ~ C₁₅ アル
 ケニルおよび直鎖または分岐鎖 C₂ ~ C₁₅ アルキニル、ハロゲン、アミン、ならびにア
 ミドから選択される、
 化合物。