

【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21年4月2日(2009.4.2)

【公表番号】特表2008-530050(P2008-530050A)

【公表日】平成20年8月7日(2008.8.7)

【年通号数】公開・登録公報2008-031

【出願番号】特願2007-554541(P2007-554541)

【国際特許分類】

C 07 D 295/08 (2006.01)
A 61 K 31/4453 (2006.01)
A 61 K 31/4525 (2006.01)
A 61 K 31/454 (2006.01)
A 61 K 31/497 (2006.01)
A 61 K 31/519 (2006.01)
A 61 K 31/55 (2006.01)
A 61 K 31/551 (2006.01)
A 61 K 31/554 (2006.01)
A 61 K 31/135 (2006.01)
A 61 K 45/00 (2006.01)
A 61 P 1/02 (2006.01)
A 61 P 1/04 (2006.01)
A 61 P 1/08 (2006.01)
A 61 P 3/04 (2006.01)
A 61 P 5/02 (2006.01)
A 61 P 9/00 (2006.01)
A 61 P 11/00 (2006.01)
A 61 P 11/02 (2006.01)
A 61 P 11/06 (2006.01)
A 61 P 13/00 (2006.01)
A 61 P 13/08 (2006.01)
A 61 P 13/10 (2006.01)
A 61 P 15/00 (2006.01)
A 61 P 15/08 (2006.01)
A 61 P 17/00 (2006.01)
A 61 P 17/04 (2006.01)
A 61 P 19/02 (2006.01)
A 61 P 25/00 (2006.01)
A 61 P 25/04 (2006.01)
A 61 P 25/06 (2006.01)
A 61 P 25/08 (2006.01)
A 61 P 25/14 (2006.01)
A 61 P 25/18 (2006.01)
A 61 P 25/20 (2006.01)
A 61 P 25/24 (2006.01)
A 61 P 25/28 (2006.01)
A 61 P 27/02 (2006.01)
A 61 P 29/00 (2006.01)
A 61 P 37/00 (2006.01)
A 61 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 39/00 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 295/08 C S P Z

A 6 1 K 31/4453

A 6 1 K 31/4525

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/497

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 31/551

A 6 1 K 31/554

A 6 1 K 31/135

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 1/02

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/08

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 5/02

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 11/02

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 13/00

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 13/10

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 15/08

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 17/04

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 37/00

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 39/00

A 6 1 P 43/00 1 1 3

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】平成21年2月3日(2009.2.3)

【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

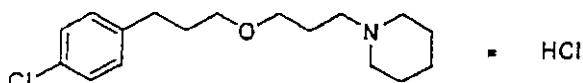
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



(I)

で表される、結晶性 1-[3-[3-(4-クロロフェニル)プロポキシ]プロピル]-ピペリジン-1-塩酸塩、又はその薬学的に許容される水和物を含む溶媒和物。

【請求項2】

11.2°、19.9°、20.7°及び34.1°±0.2°に特徴的ピーク(2)を含むX-線回折を有する、請求項1記載の結晶性 1-[3-[3-(4-クロロフェニル)プロポキシ]プロピル]-ピペリジン-1-塩酸塩。

【請求項3】

11.2°、15.4°、16.3°、16.9°、17.8°、19.9°、20.7°、21.0°、21.8°、22.6°、24.5°、24.6°、25.0°、25.5°、26.3°、28.3°、30.3°、34.1°、35.8°、40.0°、46.0°±0.2°に特徴的ピーク(2)を含むX-線回折を有する、請求項1又は2記載の結晶性 1-[3-[3-(4-クロロフェニル)プロポキシ]プロピル]-ピペリジン-1-塩酸塩。

【請求項4】

a) 1-[3-[3-(4-クロロフェニル)プロポキシ]プロピル]-ピペリジンを、好適な溶媒中で、塩化水素又は塩酸から選ばれる反応物と反応させ、沈殿した1-[3-[3-(4-クロロフェニル)プロポキシ]プロピル]-ピペリジン-1-塩酸塩を単離し；及び

b) 当該沈殿した1-[3-[3-(4-クロロフェニル)プロポキシ]プロピル]-ピペリジン-1-塩酸塩を好適な溶媒中で結晶化すること、

を含む、請求項1～3のいずれか1項記載の化合物の製造法。

【請求項5】

前記反応物が塩化水素である、請求項4記載の方法。

【請求項6】

前記塩化水素を、塩化水素ガスとして加える、請求項5記載の方法。

【請求項7】

ステップa)の好適な溶媒が、アセトン、メタノール、エタノール、プロパノール、水、酢酸エチル、i-プロパノール、ブタノール、i-ブタノール、s-ブタノール、t-ブタノール、ヘキサン、トルエン、t-ブチル-メチルエーテル、トリクロロエタン、及びそれらの混合物からなる群より選ばれる、請求項4記載の方法。

【請求項8】

前記好適な溶媒が、酢酸エチルである、請求項7記載の方法。

【請求項9】

ステップb)の好適な溶媒が、アセトン、メタノール、エタノール、プロパノール、水、酢酸エチル、i-プロパノール、ブタノール、i-ブタノール、s-ブタノール、t-ブタノール

ル、ヘキサン、トルエン、t-ブチル-メチルエーテル、トリクロロエタン、及びそれらの混合物からなる群より選ばれる、請求項4記載の方法。

【請求項10】

前記好適な溶媒が、酢酸エチルとi-プロパノールとの混合物である、請求項9記載の方法。

【請求項11】

請求項1～3のいずれか1項記載の化合物を含む、中枢神経系疾患を治療するための医薬組成物。

【請求項12】

癲癇を治療するための、請求項11記載の医薬組成物。

【請求項13】

前記中枢神経系疾患が、アルツハイマー病、並びに注意欠陥障害、不眠障害及び記憶障害からなる群より選ばれる、請求項11記載の医薬組成物。

【請求項14】

前記中枢神経系疾患が、精神疾患における認識障害からなる群より選ばれる、請求項11記載の医薬組成物。

【請求項15】

前記中枢神経系疾患が、高齢者の疾患、抑鬱状態及び無力状態からなる群より選ばれる、請求項11記載の医薬組成物。

【請求項16】

前記中枢神経系疾患が、目眩及び乗り物酔いからなる群より選ばれる、請求項11記載の医薬組成物。

【請求項17】

請求項1～3のいずれか1項記載の化合物を含む、肥満の治療のための医薬組成物。

【請求項18】

請求項1～3のいずれか1項記載の化合物を含む、心因性の障害、呼吸性アレルギー症状、炎症症状、心臓病、胃腸病、泌尿生殖器系の症状、及び皮膚系の症状を治療するための医薬組成物。

【請求項19】

睡眠障害、睡眠時無呼吸、睡眠誘導無呼吸、日中の眠気、ストレス、片頭痛、頭痛、疼痛、心因性の障害、喘息、気管支炎、鼻炎、気管炎、胃潰瘍、十二指腸潰瘍、潰瘍性大腸炎、クーロン病、過敏性腸症候群、膀胱炎、子宮筋層炎、尿糞失禁、蕁麻疹、痒み、関節炎、結膜炎、月経前症候群、前立腺炎症、生殖障害、リウマチ様症状及び眼症状、唾液分泌過多、痙攣、鬱病、視床下部下垂体分泌性、脳循環性及び免疫系の障害を治療するための、請求項18記載の医薬組成物。

【請求項20】

請求項1～3のいずれか1項記載の化合物を含む、抗精神病薬又は抗鬱剤により生じる望ましくない副作用を抑制するための医薬組成物。

【請求項21】

前記抗精神病薬が、アリビプラゾール、クロザピン、オランザピン、リスペリドン、クエチアピン及びセルチンドールからなる群より選ばれる、請求項20記載の医薬組成物。

【請求項22】

前記抗鬱剤が、ミルタザピン、アミトリプチリン及びパロキセチンからなる群より選ばれる、請求項20記載の医薬組成物。

【請求項23】

前記の抗精神病薬又は抗鬱剤により生じる望ましくない副作用が、体重増加、眠気及び記憶障害から選ばれる少なくとも1つである、請求項20記載の医薬組成物。

【請求項24】

請求項1～3のいずれか1項で定義された化合物の治療上有効量、及び薬学的に許容される賦形剤又は担体を含む、医薬組成物。

【請求項 25】

抗精神病薬を更に含む、請求項24記載の組成物。

【請求項 26】

前記抗精神病薬が、アリピプラゾール、クロザピン、オランザピン、リスペリドン、クエチアピン及びセルチンドールからなる群より選ばれる、請求項25記載の組成物。

【請求項 27】

抗鬱剤を更に含む、請求項24記載の組成物。

【請求項 28】

前記抗鬱剤が、ミルタザピン、アミトリプチリン及びパロキセチンからなる群より選ばれる、請求項27記載の組成物。