

【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25年6月6日 (2013.6.6)

【公表番号】特表2012-524796(P2012-524796A)

【公表日】平成24年10月18日 (2012.10.18)

【年通号数】公開・登録公報2012-042

【出願番号】特願2012-507354(P2012-507354)

【国際特許分類】

C 0 7 D 221/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/473 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 221/10 C S P

A 6 1 K 31/473

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/14

【手続補正書】

【提出日】平成25年4月19日 (2013.4.19)

【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

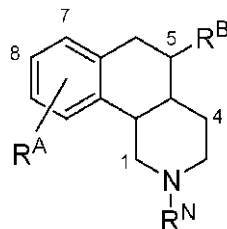
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式：

【化 1】



〔式中、

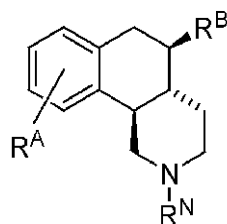
R^A は 7 , 8 - ジヒドロキシ又はその誘導体であり、 ;

R^B は、水素であるか、或いは R^B は、アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アリールアルキル又はヘテロアリールアルキルであり、それぞれ任意に置換されていてもよく、 ;

R^N は、水素又はアミノプロドラッグ基であるか、或いは R^N は、アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アリールアルキル又はヘテロアリールアルキルであり、それぞれ任意に置換されていてもよく、 ;

キラル炭素が、以下の相対的に表された立体異性構造：

【化 2】



を有する]

で示される化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

R^A が、7, 8 - ジヒドロキシである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

R^B が、アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、アリーールアルキル又はヘテロアリーールアルキルであり、それぞれ任意に置換されていてもよい、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^B が、シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、アリーール又はヘテロアリーールであり、それぞれ任意に置換されていてもよい、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 5】

R^B が、アリーール又はヘテロアリーールであり、それぞれ任意に置換されていてもよい、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 6】

R^B が、フェニル又は単環式ヘテロアリーールであり、それぞれ任意に置換されていてもよい、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 7】

R^N が水素である、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項記載の化合物又はその薬学的に許容される塩と、その薬学的に許容される担体、賦形剤又は希釈剤とを含む、医薬組成物。

【請求項 9】

パーキンソン病、統合失調症、記憶障害、認知障害又は運動障害のいずれかである、ドーパミン機能不全により生じる疾病を治療するための、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項記載の化合物又はその薬学的に許容される塩を含む、医薬組成物。

【請求項 10】

パーキンソン病、統合失調症、記憶障害、認知障害又は運動障害のいずれかである、ドーパミン機能不全により生じる疾病を治療するための薬剤の製造のための、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項記載の化合物又はその薬学的に許容される塩の使用方法。

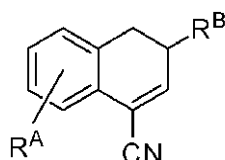
【請求項 11】

請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項記載の化合物を調製する方法であって、

下記の工程 (a) ~ 工程 (c) のいずれかを含む、方法：

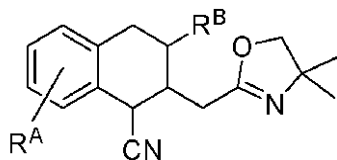
(a) 下記式：

【化 3】



で示される化合物を、2, 4, 4 - トリメチル - 2 - オキサゾリジンのアニオンと接触させて、下記式：

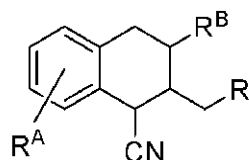
【化 4】



で示される化合物を調製する工程；

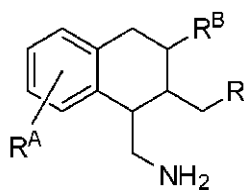
(b) 下記式：

【化 5】



で示される化合物を還元剤と接触させて、下記式：

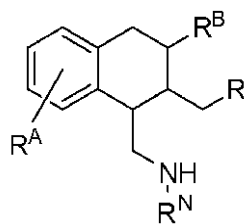
【化 6】



で示される化合物を調製する工程；又は、

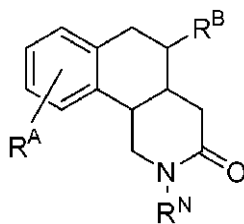
(c) 下記式：

【化 7】



で示される化合物を酸と接触させて、下記式：

【化 8】



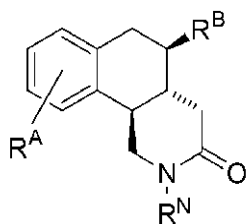
で示される化合物を調製する工程

〔式中、R は、カルボン酸又はその誘導体であり、

R^A、R^B、R^N は、それぞれ請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の R^A、R^B、R^N であり、

キラル炭素は、以下の相対的に表された立体異性構造：

【化 9】



を有する]

【請求項 1 2】

請求項 1 1 記載の方法における工程 (b) であって、還元剤が CoCl_2 及び KBH_4 を含む、工程。

【請求項 1 3】

請求項 1 1 記載の方法における工程 (b) 又は工程 (c) であって、R がオキサゾリンである、工程。

【請求項 1 4】

請求項 1 1 記載の方法における工程 (c) であって、前記酸がプロトン性溶媒に含まれる、工程。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 3 9

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 3 9】

【表 1】

化合物	D 1 様	D 2 様	D 1 選択性
1	6800 ± 490	2800 ± 210	0.4
2	850 ± 65	670 ± 36	0.8
3	6 ± 0.2	440 ± 72	73
SCH-23390	0.79 ± 0.10	ND	NA
クロルプロマジン	ND	3.2 ± 0.50	
DOX	18 ± 0.6	4400 ± 620	240