

【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2年9月17日(2020.9.17)

【公表番号】特表2019-527234(P2019-527234A)

【公表日】令和1年9月26日(2019.9.26)

【年通号数】 公開・登録公報2019-039

【出願番号】特願2019-505249(P2019-505249)

【國際特許分類】

C 0 7 D 487/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 K 31/438 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 487/10 C S P

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/18

A 6 1 K 31/438

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手續補正書】

【提出日】令和2年8月5日(2020.8.5)

【手續補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

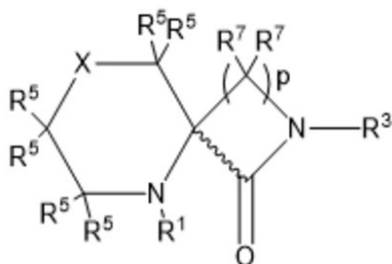
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

【化 1】



によって表される化合物又はその薬学的に許容可能な塩及び／もしくは立体異性体。

式中：

X は 0 又は $N R^2$ であり ;

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、 $-C(O)-C_1 \sim C_6$ アルキル及び $C(O)-O-C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群から選択され；

R^2 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、 $-C(O)-C_1 \sim C_6$ アルキル及び $C(O)-O-C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群から選択され；

p は 1 もしくは 2 であり；

R^5 は、各出現について、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-S(O)_w-C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-NR^a R^b$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、シアノ及びハロゲンからなる群から独立して選択され；

w は、0、1 又は 2 であり；

R^3 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、 $-C(O)R^{3\ 1}$ 及び $C(O)OR^{3\ 2}$ からなる群から選択され；

$R^{3\ 1}$ 及び $R^{3\ 2}$ は各々、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_6$ シクロアルキル及びフェニルからなる群から独立して選択され；ならびに

R^7 は、各出現について、H、ハロゲン、フェニル及び $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群から独立して選択され；ならびに

R^a 及び R^b は、各々独立して、各出現について、H、 $C_1 \sim C_3$ アルキル及びフェニルからなる群から選択され、又は、 R^a 及び R^b は、これらが結合している窒素と一緒に、4～6 員複素環を形成し；

ここで、前記 $C_1 \sim C_6$ アルキルのいずれかは、各出現について独立して、 $-C(O)NR^a R^b$ 、 $-NR^a R^b$ 、ヒドロキシ、 $S(O)_w-C_1 \sim C_3$ アルキル、SH、フェニル及びハロゲンから各々独立して選択される 1 個、2 個又は 3 個の置換基によって任意に置換されており、ならびに、前記フェニルのいずれかは、各出現について独立して、ヒドロキシ、ハロゲン、 $-C(O)-O-C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-C(O)-C_1 \sim C_3$ アルキル、メチル及び CF_3 から各々独立して選択される 1 個、2 個又は 3 個の置換基によって任意に置換されている。

【請求項 2】

R^1 が $-C(O)-O-C_1 \sim C_6$ アルキルである請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^1 が $-C(O)-C_1 \sim C_6$ アルキルである請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 が、ベンジル又は 1 個、2 個もしくは 3 個のフッ素により任意に置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキルである請求項 1 に記載の化合物。

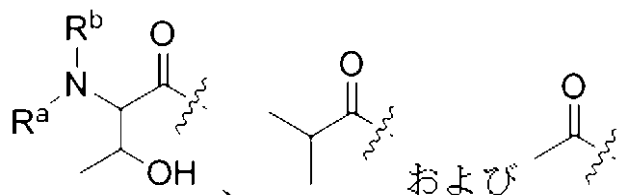
【請求項 5】

R^1 が H である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

R^1 が：

【化 2】



からなる群から選択される置換基により表され、式中、 R^a 及び R^b は、各出現について、水素及び $C_1 \sim C_3$ アルキルからなる群から各々独立して選択される請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 7】

R^1 が *tert*-ブチルオキシカルボニルである請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 8】

R^1 がベンジルである請求項 4 に記載の化合物。

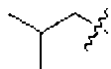
【請求項 9】

R^1 がメチルである請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 10】

R^1 が

【化 3】



である請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 11】

X が O である請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 12】

X が NR^2 である請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 13】

R^2 が H である請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 14】

R^2 が、ベンジル又は 1 個、2 個もしくは 3 個のフッ素により任意に置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキルである請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 15】

R^2 が $-C(O)-C_1 \sim C_6$ アルキルである請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 16】

R^2 が $-C(O)-O-C_1 \sim C_6$ アルキルである請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 17】

R^2 がメチルである請求項 14 に記載の化合物。

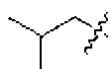
【請求項 18】

R^2 がベンジルである請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 19】

R^2 が

【化 4】

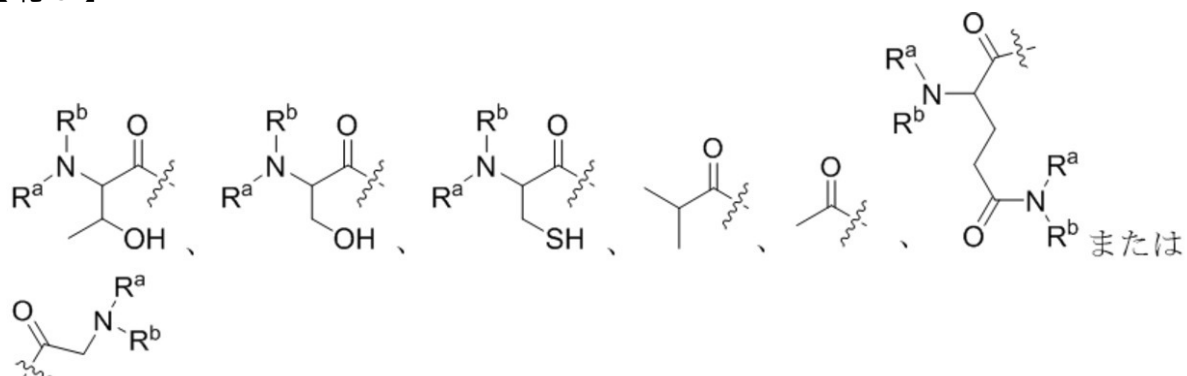


である請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 20】

R^2 が：

【化 5】



からなる群から選択される置換基により表され、式中、 R^a 及び R^b は、各出現について、水素及び $C_1 \sim C_3$ アルキルからなる群から各々独立して選択される請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 21】

R^2 が tert - ブチルオキシカルボニルである請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 2 2】

p が 1 である請求項 1 ~ 2 1 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 3】

p が 2 である請求項 1 ~ 2 1 のいずれか一項に記載の化合物。

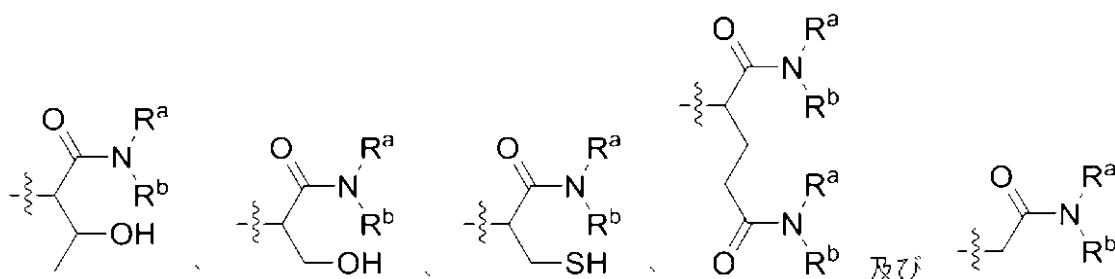
【請求項 2 4】

R³ が H である請求項 1 ~ 2 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 5】

R³ が：

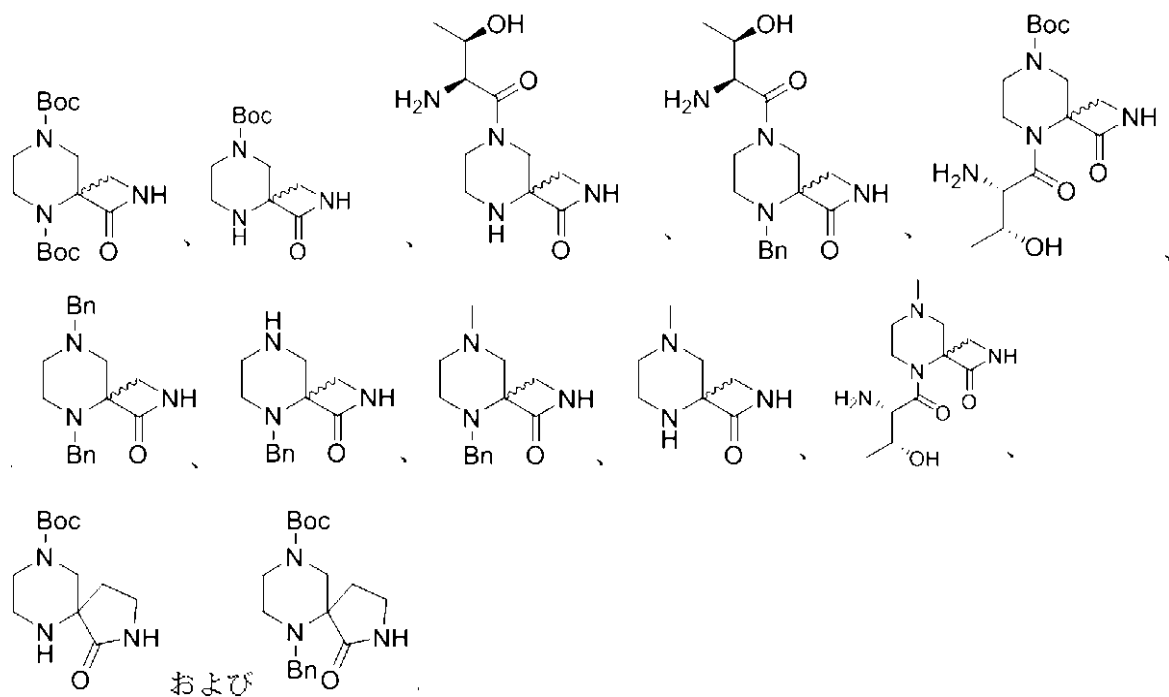
【化 6】



からなる群から選択され、式中、R^a 及び R^b は、各出現について、水素及び C₁ ~ C₆ アルキルからなる群から各々独立して選択される請求項 1 ~ 2 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 6】

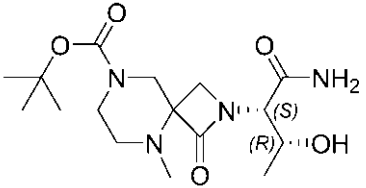
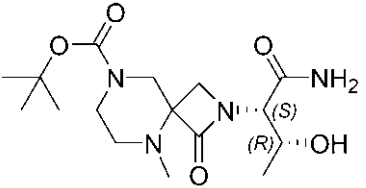
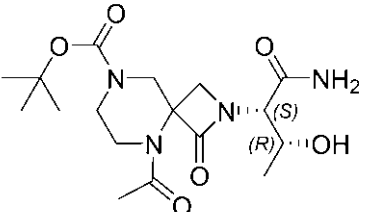
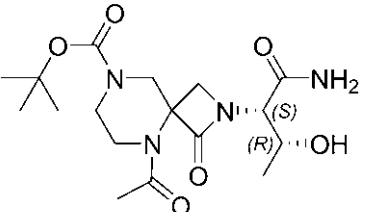
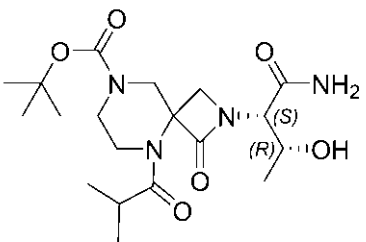
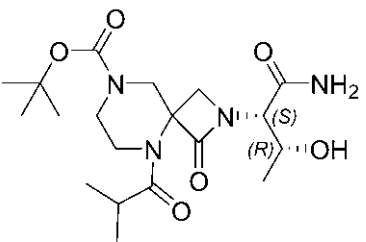
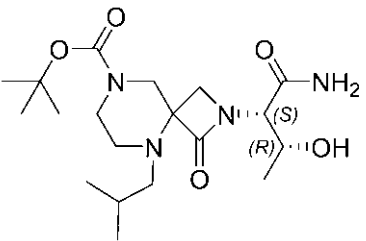
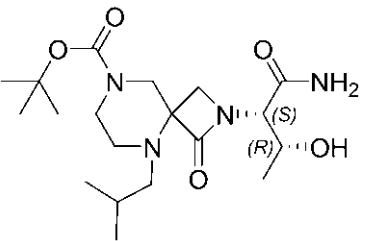
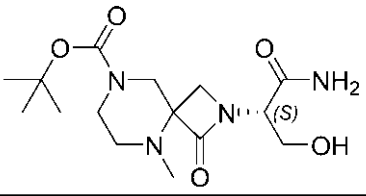
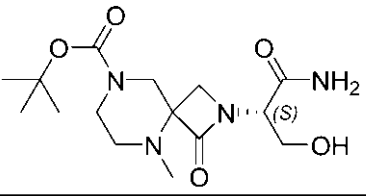
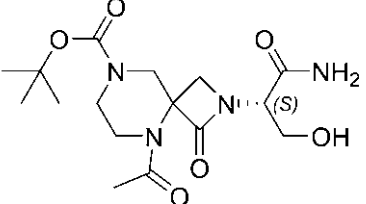
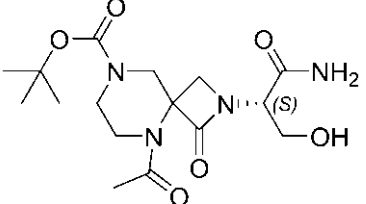
【化 7】

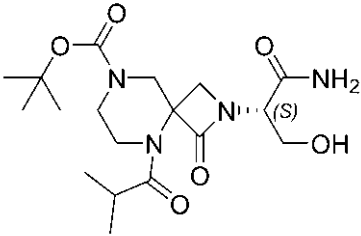
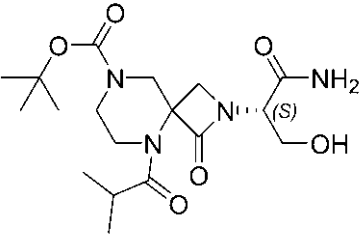
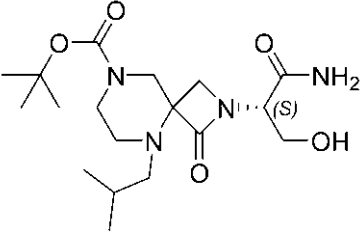
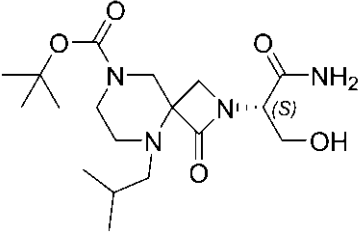
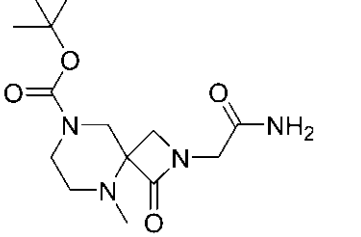
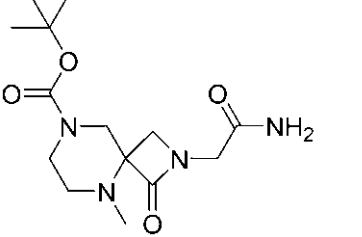
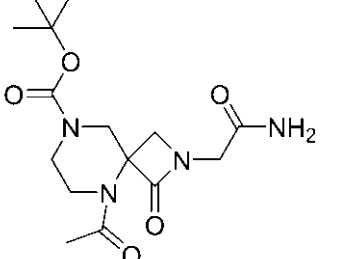
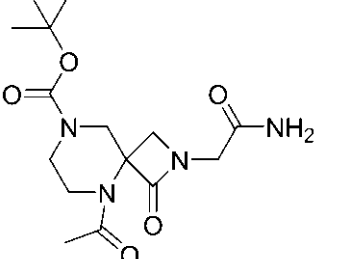
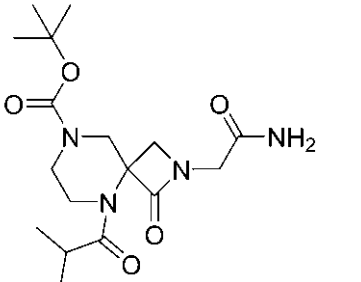
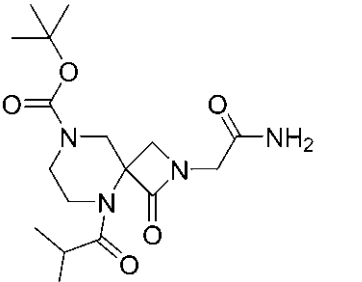


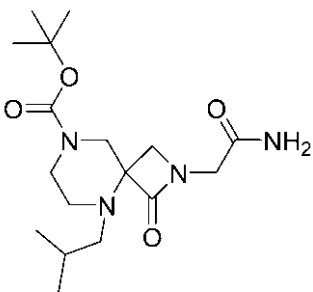
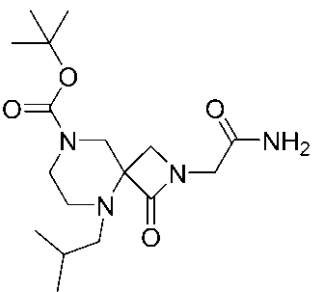
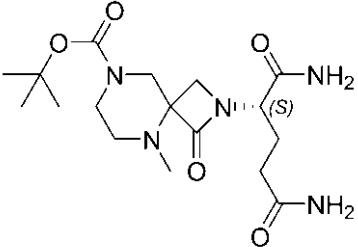
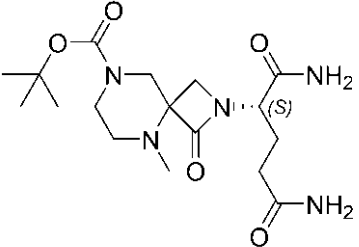
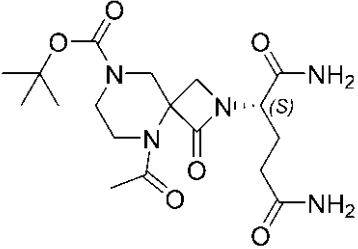
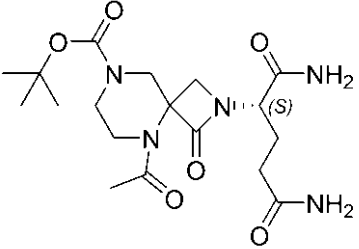
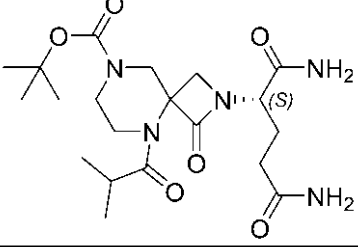
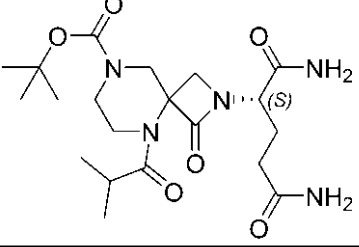
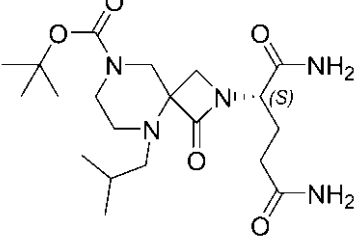
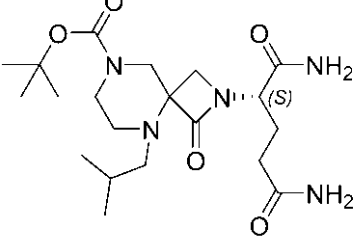
からなる群から選択される化合物又はその薬学的に許容可能な塩及び / もしくは立体異性体。

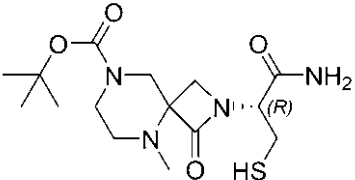
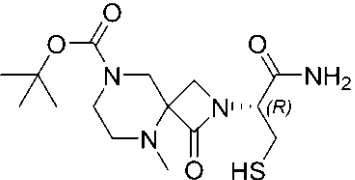
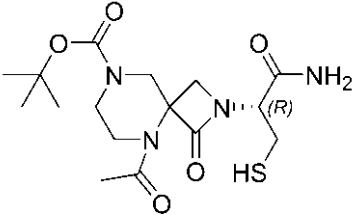
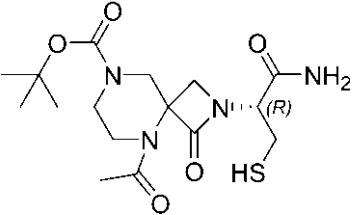
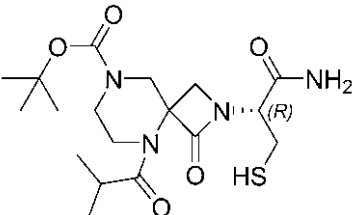
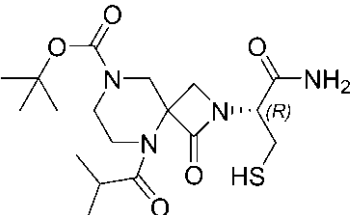
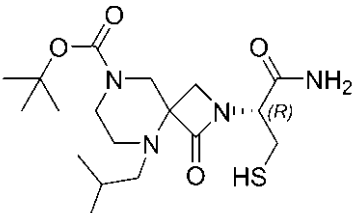
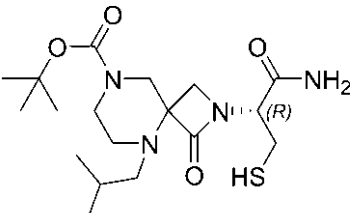
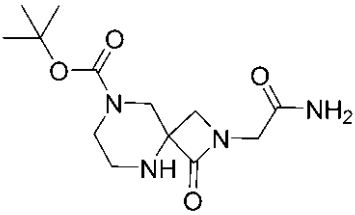
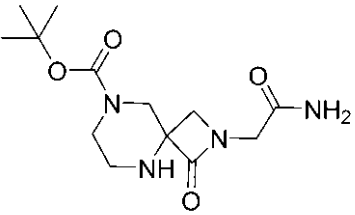
【請求項 2 7】

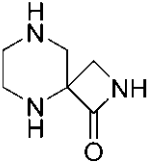
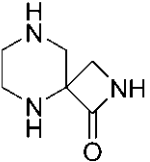
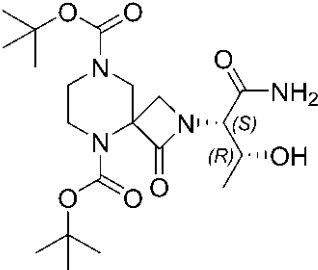
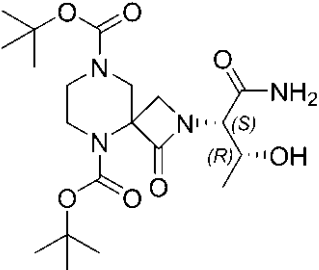
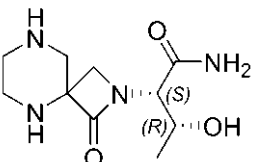
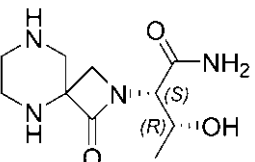
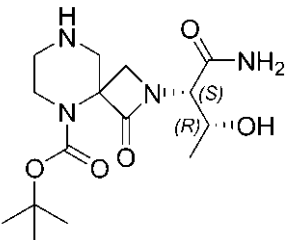
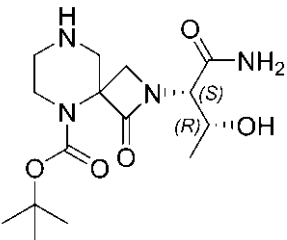
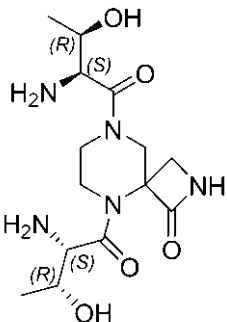
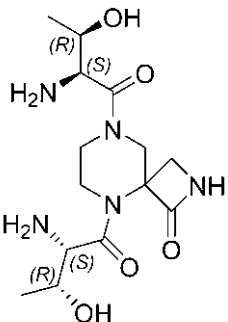
以下の表に記載の化合物から選択される化合物又はその薬学的に許容可能な塩及び / もしくは立体異性体。

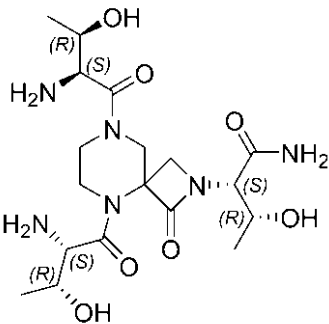
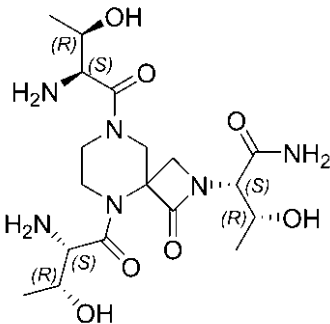
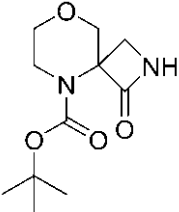
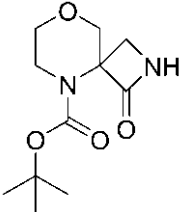
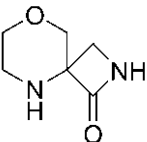
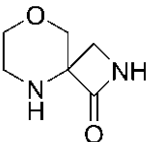
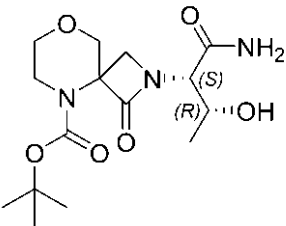
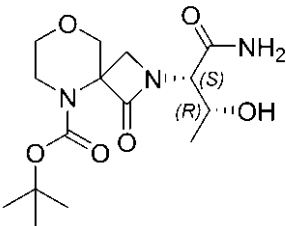
構造	化合物	構造	化合物
	ER-101		ER-102
	ER-103		ER-104
	ER-105		ER-106
	ER-107		ER-108
	ER-109		ER-110
	ER-111		ER-112

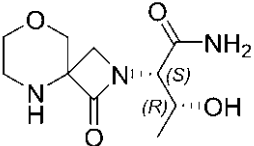
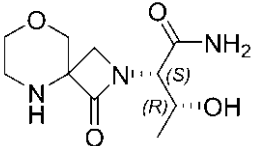
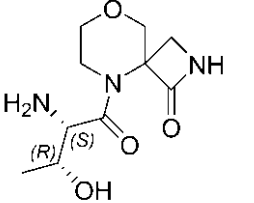
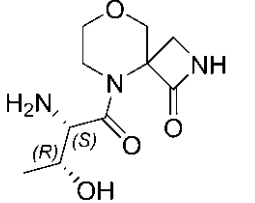
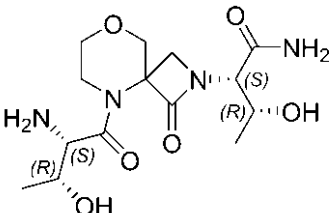
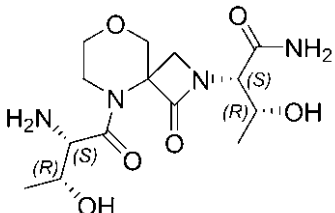
	ER-113		ER-114
	ER-115		ER-116
	ER-117		ER-118
	ER-119		ER-120
	ER-121		ER-122

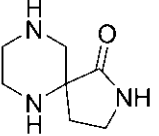
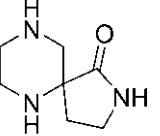
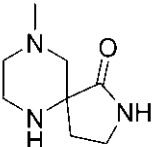
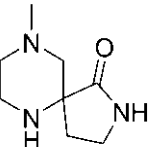
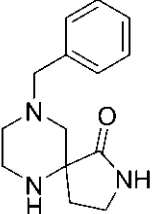
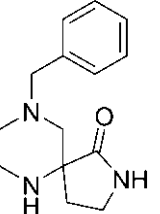
	ER-123		ER-124
	ER-125		ER-126
	ER-127		ER-128
	ER-129		ER-130
	ER-131		ER-132

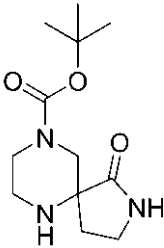
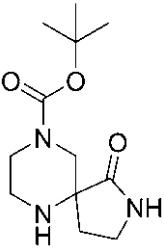
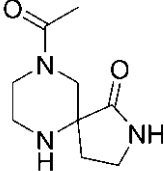
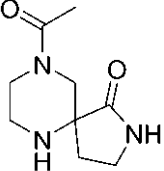
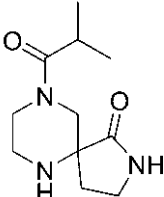
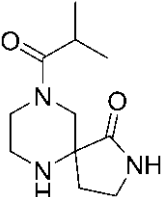
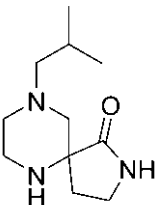
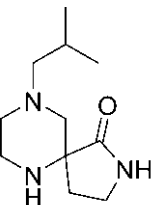
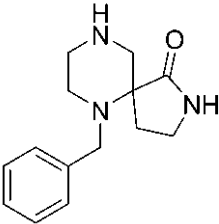
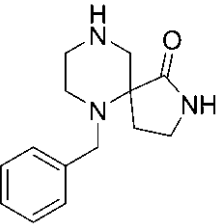
	ER-133		ER-134
	ER-135		ER-136
	ER-137		ER-138
	ER-139		ER-140
	ER-141		ER-142

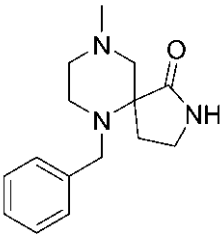
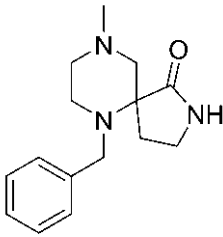
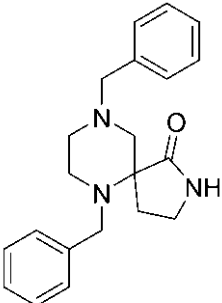
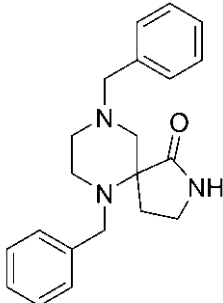
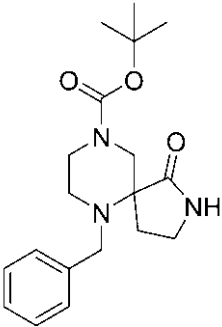
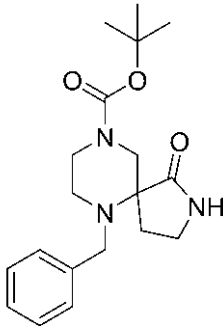
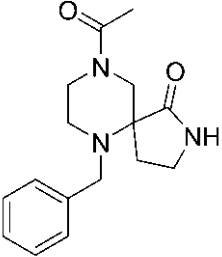
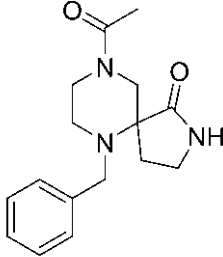
	ER-143		ER-144
	ER-145		ER-146
	ER-147		ER-148
	ER-149		ER-150
	ER-151		ER-152

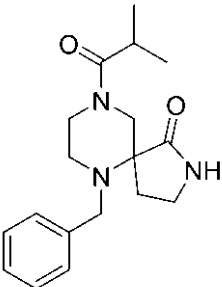
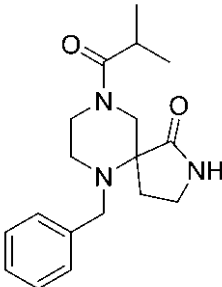
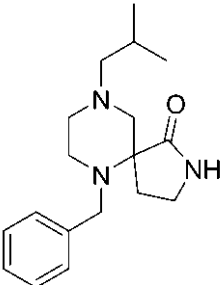
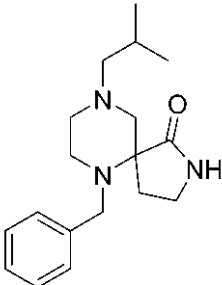
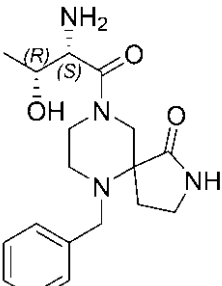
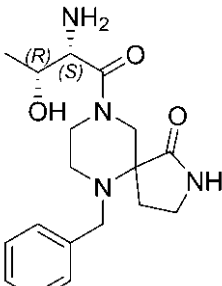
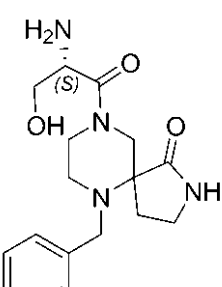
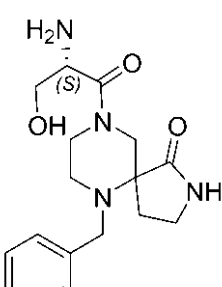
	ER-153		ER-154
	ER-155		ER-156
	ER-157		ER-158
	ER-159		ER-160

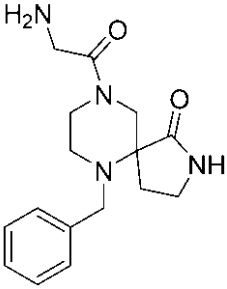
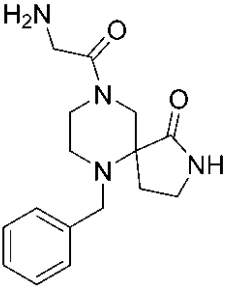
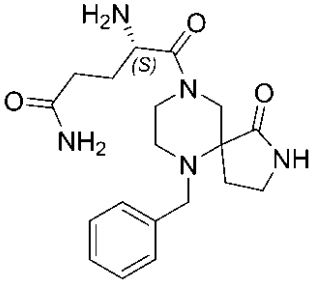
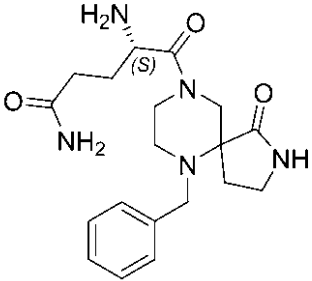
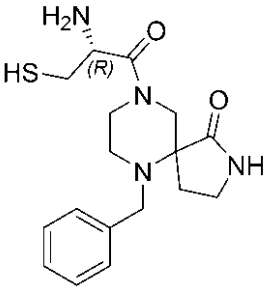
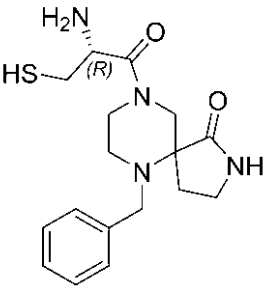
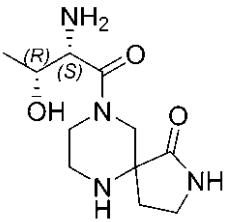
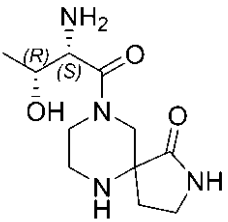
	ER-161		ER-162
	ER-163		ER-164
	ER-165		ER-166

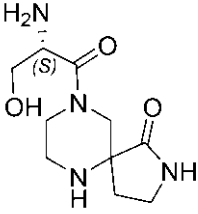
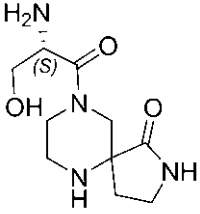
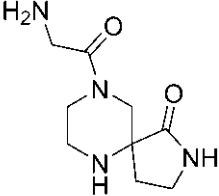
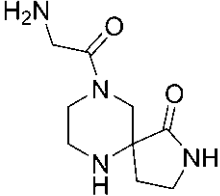
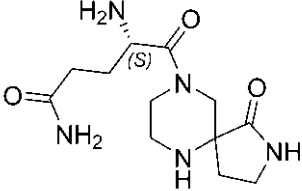
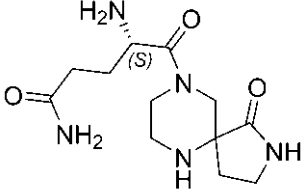
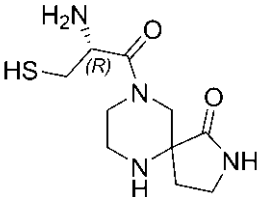
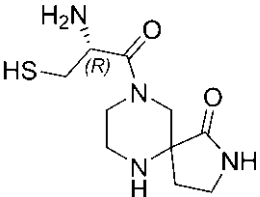
構造	化合物	構造	化合物
	ES-301		ES-302
	ES-303		ES-304
	ES-305		ES-306

	EM		EN
	ES-307		ES-308
	ES-309		ES-310
	ES-311		ES-312
	ES-313		ES-314

	ES-315		ES-316
	ES-317		ES-318
	MO		MP
	ES-319		ES-320

	ES-321		ES-322
	ES-323		ES-324
	ES-325		ES-326
	ES-327		ES-328

	ES-329		ES-330
	ES-331		ES-332
	ES-333		ES-334
	ES-335		ES-336

	ES-337		ES-338
	ES-339		ES-340
	ES-341		ES-342
	ES-343		ES-344

【請求項 28】

請求項 1 ～ 27 のいずれか一項に記載の化合物及び薬学的に許容可能な賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 29】

経口投与、非経口投与、局所投与、腔内投与、直腸内投与、舌下投与、点眼投与、経皮投与又は鼻噴投与に適する請求項 28 に記載の医薬組成物。

【請求項 30】

治療的有效量の請求項 1 ～ 27 のいずれか一項に記載の化合物を含む、うつ病、アルツハイマー病、注意欠陥障害、統合失調症又は不安の治療用の医薬組成物。

【請求項 31】

治療的有效量の請求項 1 ～ 27 のいずれか一項に記載の化合物を含む、急性神経障害性疼痛又は慢性神経障害性疼痛の治療用の医薬組成物。

【請求項 32】

前記神経障害性疼痛が慢性又は急性である請求項 31 に記載の医薬組成物。

【請求項 33】

前記神経障害性疼痛が、ヘルペス、HIV、外傷性神経損傷、脳卒中、後虚血、慢性的背痛、带状疱疹後神経痛、線維筋痛症、反射性交感神経性ジストロフィ、複合性局所疼痛症候群、脊髄傷害、坐骨神経痛、幻肢痛、糖尿病ニューロパシー及びがん化学療法誘発性神経障害性疼痛からなる群から選択される請求項 31 に記載の医薬組成物。

【請求項 34】

治療的有効量の請求項 1 ～ 27 のいずれか一項に記載の化合物を含む、シナプス機能不全に関連する神経発達障害の治療用の医薬組成物。