

【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17年4月21日(2005.4.21)

【公表番号】特表2004-517937(P2004-517937A)
【公表日】平成16年6月17日(2004.6.17)
【年通号数】公開・登録公報2004-023
【出願番号】特願2002-560616(P2002-560616)
【国際特許分類第7版】

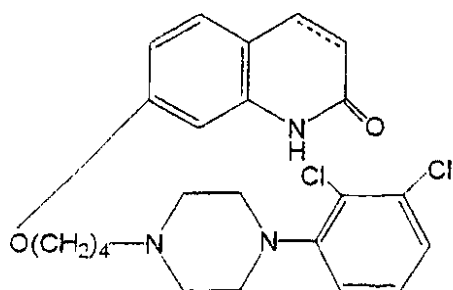
A 6 1 K 31/496
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 15/10
A 6 1 P 25/02
A 6 1 P 25/14
A 6 1 P 25/18
A 6 1 P 25/20
A 6 1 P 25/24
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 39/02
C 0 7 D 215/22

【F I】

A 6 1 K 31/496
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 15/10
A 6 1 P 25/02
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 39/02
C 0 7 D 215/22

【手続補正書】
【提出日】平成15年6月20日(2003.6.20)
【手続補正1】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】特許請求の範囲
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項1】

5 - H T_{1A} 受容体サブタイプに関連した中枢神経系の障害を治療するための医薬組成物であって、式(1)：



(1)

(カルボスチリル骨格の 3 位及び 4 位の間の炭素 - 炭素結合は、単結合又は二重結合である) ;

のカルボスチリル化合物、及び医薬として許容されるその塩又は溶媒和物の治療有効量を含む医薬組成物。

【請求項 2】

障害が鬱病である、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 3】

障害が、治療抵抗性精神分裂病、認知障害を伴う治療抵抗性精神分裂病、難治性精神分裂病、認知障害を伴う難治性精神分裂病、慢性精神分裂病、又は認知障害を伴う慢性精神分裂病である、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 4】

障害が、一般に入手し得る抗精神病薬に適切に反応しない、治療抵抗性精神分裂病、難治性精神分裂病又は慢性精神分裂病である、請求項 3 記載の医薬組成物。

【請求項 5】

障害が、一般に入手し得る抗精神病薬に適切に反応しない、認知障害を伴う治療抵抗性精神分裂病、認知障害を伴う難治性精神分裂病、又は認知障害を伴う慢性精神分裂病である、請求項 3 記載の医薬組成物。

【請求項 6】

一般に入手し得る抗精神病薬が、クロルプロマジン、ハロペリドール、スルピリド、フルフェナジン、ペルフェナジン、チオリダジン、ピモジド、ゾテピン、リスペリドン、オランザピン、ケチアピン又はアミスルプリドである、請求項 4 の医薬組成物。

【請求項 7】

一般に入手し得る抗精神病薬が、クロルプロマジン、ハロペリドール、スルピリド、フルフェナジン、ペルフェナジン、チオリダジン、ピモジド、ゾテピン、リスペリドン、オランザピン、ケチアピン又はアミスルプリドである、請求項 5 記載の医薬組成物。

【請求項 8】

一般に入手し得る抗精神病薬が、クロルプロマジン、ハロペリドール及びペルフェナジンから選択される 1 つ乃至 3 つの定型抗精神病薬、及びリスペリドン、オランザピン、ケチアピン及びアミスルプリドから選択される 1 つの非定型抗精神病薬である、請求項 4 記載の医薬組成物。

【請求項 9】

一般に入手し得る抗精神病薬が、クロルプロマジン、ハロペリドール及びペルフェナジンから選択される 1 つ乃至 3 つの定型抗精神病薬、及びリスペリドン、オランザピン、ケチアピン及びアミスルプリドから選択される 1 つの非定型抗精神病薬である、請求項 5 記載の医薬組成物。

【請求項 10】

一般に入手し得る抗精神病薬が、クロルプロマジン、ハロペリドール及びペルフェナジンから選択される 2 つの定型抗精神病薬、及びリスペリドン、オランザピン、ケチアピン及びアミスルプリドから選択される 1 つの非定型抗精神病薬である、請求項 4 記載の医薬組成物。

【請求項 11】

一般に入手し得る抗精神病薬が、クロルプロマジン、ハロペリドール及びペルフェナジン

から選択される2つの定型抗精神病薬、及びリスペリドン、オランザピン、ケチアピン及びアミスルプリドから選択される1つの非定型抗精神病薬である、請求項5記載の医薬組成物。

【請求項12】

一般に入手し得る抗精神病薬が、クロルプロマジン及びハロペリドールから選択される1つ乃至2つの定型抗精神病薬、及びリスペリドン、オランザピン、ケチアピン及びアミスルプリドから選択される1つの非定型抗精神病薬である、請求項4記載の医薬組成物。

【請求項13】

一般に入手し得る抗精神病薬が、クロルプロマジン及びハロペリドールから選択される1つ乃至2つの定型抗精神病薬、及びリスペリドン、オランザピン、ケチアピン及びアミスルプリドから選択される1つの非定型抗精神病薬である、請求項5記載の医薬組成物。

【請求項14】

一般に入手し得る抗精神病薬が、クロルプロマジン及びハロペリドールから選択される2つの定型抗精神病薬、及びリスペリドン、オランザピン、ケチアピン及びアミスルプリドから選択される1つの非定型抗精神病薬である、請求項4記載の医薬組成物。

【請求項15】

一般に入手し得る抗精神病薬が、クロルプロマジン及びハロペリドールから選択される2つの定型抗精神病薬、及びリスペリドン、オランザピン、ケチアピン及びアミスルプリドから選択される1つの非定型抗精神病薬である、請求項5記載の医薬組成物。

【請求項16】

障害が、自閉症、ダウン症候群又は注意欠陥多動障害（ADHD）である、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項17】

障害が神経変性疾患である、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項18】

神経変性疾患がアルツハイマー病又はパーキンソン病である、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項19】

障害が、パニック障害、強迫性障害（OCD）、睡眠障害、性的機能不全、アルコール及び薬物耽溺、嘔吐、乗物酔い、肥満又は片頭痛である、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項20】

カルボスチリル化合物が、7 - { 4 - [4 - (2 , 3 - ジクロロフェニル) - 1 - ピペラジニル] ブトキシ } - 3 , 4 - ジヒドロカルボスチリルである、請求項1乃至19に記載の医薬組成物。

【請求項21】

障害が、内因性鬱病、大鬱病、メランコリー又は治療抵抗性鬱病のような鬱病；性的機能不全；アルコール及び薬物耽溺；認知障害；アルツハイマー病又はパーキンソン病のような神経変性疾患；自閉症；注意欠陥多動障害（ADHD）；治療抵抗性精神分裂病に起因する認知障害、難治性精神分裂病に起因する認知障害、又は慢性精神分裂病に起因する認知障害である、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項22】

障害が、内因性鬱病、大鬱病、メランコリー又は治療抵抗性鬱病のような鬱病である、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項23】

障害が、治療抵抗性精神分裂病に起因する認知障害、難治性精神分裂病に起因する認知障害、慢性精神分裂病に起因する認知障害である、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項24】

障害が、一般に入手し得る抗精神病薬に適切に反応しない、治療抵抗性精神分裂病に起因する認知障害、難治性精神分裂病に起因する認知障害、慢性精神分裂病に起因する認知障害である、請求項23記載の医薬組成物。

【請求項 25】

一般に入手し得る抗精神病薬が、クロルプロマジン、ハロペリドール、スルピリド、フルフェナジン、ペルフェナジン、チオリダジン、ピモジド、ゾテピン、リスペリドン、オランザピン、ケチアピン又はアミスルプリドである、請求項 24 記載の医薬組成物。

【請求項 26】

一般に入手し得る抗精神病薬が、クロルプロマジン、ハロペリドール及びペルフェナジンから選択される 1 つ乃至 3 つの定型抗精神病薬、及びリスペリドン、オランザピン、ケチアピン及びアミスルプリドから選択される 1 つの非定型抗精神病薬である、請求項 24 記載の医薬組成物。

【請求項 27】

一般に入手し得る抗精神病薬が、クロルプロマジン、ハロペリドール及びペルフェナジンから選択される 2 つの定型抗精神病薬、及びリスペリドン、オランザピン、ケチアピン及びアミスルプリドから選択される 1 つの非定型抗精神病薬である、請求項 24 記載の医薬組成物。

【請求項 28】

一般に入手し得る抗精神病薬が、クロルプロマジン及びハロペリドールから選択される 1 つ乃至 2 つの定型抗精神病薬、及びリスペリドン、オランザピン、ケチアピン及びアミスルプリドから選択される 1 つの非定型抗精神病薬である、請求項 24 記載の医薬組成物。

【請求項 29】

一般に入手し得る抗精神病薬が、クロルプロマジン及びハロペリドールから選択される 2 つの定型抗精神病薬、及びリスペリドン、オランザピン、ケチアピン及びアミスルプリドから選択される 1 つの非定型抗精神病薬である、請求項 24 記載の医薬組成物。

【請求項 30】

障害が神経変性疾患に起因する認知障害である、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 31】

神経変性疾患に起因する認知障害がアルツハイマー病又はパーキンソン病である、請求項 30 記載の医薬組成物。

【請求項 32】

カルボスチリル化合物が、7 - { 4 - [4 - (2 , 3 - ジクロロフェニル) - 1 - ピペラジニル] ブトキシ } - 3 , 4 - ジヒドロカルボスチリルである、請求項 21 乃至 31 記載の医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0001

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0001】

(技術分野)

本発明は、5 - HT_{1A} 受容体サブタイプに関連した中枢神経系の障害に罹患した患者を治療するための医薬組成物に関する。有効成分は、カルボスチリル誘導体又はその塩を含む。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0005

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0005】

上記に加えて、米国特許第 4 , 734 , 416 号、カナダ特許第 1 , 117 , 110 号、英国特許第 2 , 017 , 701 号、ドイツ特許第 2 , 912 , 105 号及び同第 2 , 953 , 723 号、特開昭 54 - 130587 (1979)、同 55 - 127371 (198

0) 及び同 62 - 149664 (1987) に開示されたカルボスチリル誘導体は、本発明におけるカルボスチリル誘導体の同類体を有しており、抗ヒスタミン活性及び中枢神経制御作用を有している。