

【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22年10月7日(2010.10.7)

【公表番号】特表2010-501624(P2010-501624A)

【公表日】平成22年1月21日(2010.1.21)

【年通号数】公開・登録公報2010-003

【出願番号】特願2009-526087(P2009-526087)

【国際特許分類】

C 0 7 D 211/22 (2006.01)

C 0 7 D 211/62 (2006.01)

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

C 0 7 D 211/64 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/30 (2006.01)

A 6 1 P 25/36 (2006.01)

A 6 1 P 25/34 (2006.01)

A 6 1 P 25/32 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/02 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/12 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 27/16 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 211/22

C 0 7 D 211/62 C S P

A 6 1 K 31/445

C 0 7 D 211/64

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 1/14

A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 25/30
 A 6 1 P 25/36
 A 6 1 P 25/34
 A 6 1 P 25/32
 A 6 1 P 25/04
 A 6 1 P 25/06
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 1/02
 A 6 1 P 15/00
 A 6 1 P 15/12
 A 6 1 P 13/02
 A 6 1 P 15/10
 A 6 1 P 27/16
 A 6 1 P 43/00 1 1 4

【手続補正書】

【提出日】平成22年8月23日(2010.8.23)

【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

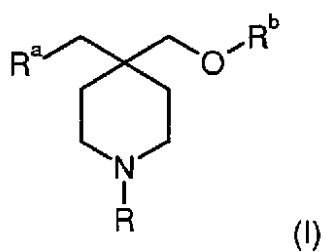
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物、

【化 1】



その立体異性体のいずれか若しくはその立体異性体の任意の混合物又は薬剤として許容されるその塩

[式中、

R は水素又はアルキルを表し、

前記アルキルはハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、アルコキシ、シクロアルコキシ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルケニル及びアルキニルからなる群から独立に選択される 1 つ又は複数の置換基で任意選択で置換されており、

R^a はアリール基を表し、

前記アリール基は、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、ニトロ

、ヒドロキシ、アルコキシ、シクロアルコキシ、アルコキシアルキル、シクロアルコキシアルキル、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルケニル、アルキニル、 $-NR'R''$ 、 $-(C=O)NR'R''$ 又は $-NR'(C=O)R''$ (R' 及び R'' は互いに独立に水素又はアルキルである)からなる群から独立に選択される1つ又は複数の置換基で任意選択で置換されており、 R^b は水素、アルキル又はアリール基を表し、

前記アルキル又はアリール基は、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルコキシ、シクロアルコキシ、アルコキシアルキル、シクロアルコキシアルキル、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルケニル、アルキニル、 $-NR'R''$ 、 $-(C=O)NR'R''$ 、 $-NR''(C=O)R''$ (R' 及び R'' は互いに独立に水素又はアルキルである)からなる群から独立に選択される1つ又は複数の置換基で任意選択で置換されており、

但し、前記化合物は、

[4-(3-トリフルオロメトキシベンジル)-ピペリジン-4-イル]-メタノール、
4-メトキシメチル-4-(2-メチルベンジル)-ピペリジン、
[4-(2-メチルベンジル)-ピペリジン-4-イル]-メタノール、
4-メトキシメチル-4-(3-メチルベンジル)-ピペリジン又は
(4-ベンジル-ピペリジン-4-イル)-メタノールではない]。

【請求項2】

R が水素又はアルキルを表す、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R^a がフェニル基を表し、

前記フェニル基は、

ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ及びアルコキシからなる群から独立に選択される1つ又は複数の置換基で任意選択で置換されている請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項4】

R^a が任意選択で置換されているナフチル基を表す

請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項5】

R^b が水素又はアルキルを表す

請求項1から4までのいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

R^b がフェニル基を表し、

前記フェニル基は、

ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ及びアルコキシからなる群から独立に選択される1つ又は複数の置換基で任意選択で置換されている請求項1から4までのいずれか一項に記載の化合物。

【請求項7】

4-(3,4-ジクロロ-ベンジル)-4-メトキシメチル-ピペリジン;
[4-(3,4-ジクロロ-ベンジル)-ピペリジン-4-イル]-メタノール;
4-(3,4-ジクロロ-ベンジル)-4-エトキシメチル-ピペリジン;
4-(3,4-ジクロロ-ベンジル)-4-フェノキシメチル-ピペリジン;
4-(2,3-ジクロロ-ベンジル)-4-メトキシメチル-ピペリジン;
4-(3,4-ジクロロ-ベンジル)-4-(2,3-ジクロロ-フェノキシメチル)-ピペリジン;
4-(3,4-ジクロロ-ベンジル)-4-(3,4-ジクロロ-フェノキシメチル)-ピペリジン;
4-ベンジル-4-(3,4-ジクロロ-フェノキシメチル)-ピペリジン;

4 - ベンジル - 4 - (2 , 3 - ジクロロ - フェノキシメチル) - ピペリジン ;
4 - メトキシメチル - 4 - ナフタレン - 2 - イルメチル - ピペリジン ;

又は薬剤として許容されるその塩
である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 7 までのいずれか一項に記載の化合物、その立体異性体のいずれか若しくはその立体異性体の任意の混合物又は薬剤として許容されるその塩を治療有効量で、少なくとも 1 種の薬剤として許容される担体、賦形剤又は希釈剤とともに含む医薬組成物。

【請求項 9】

中枢神経系におけるモノアミン神経伝達物質再取込みの阻害に応答する、ヒトを含む哺乳動物の疾患若しくは障害又は状態を治療、予防又は緩和するための請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記疾患、障害又は状態が、気分障害、うつ病、非定型うつ病、疼痛に続くうつ病、大うつ病性障害、気分変調性障害、双極性障害、双極性障害Ⅰ型、双極性障害Ⅱ型、循環病、全身状態に起因する気分障害、物質誘発性気分障害、偽認知症、ガンザー症候群、強迫性障害、パニック障害、広場恐怖症を伴わないパニック障害、広場恐怖症を伴うパニック障害、パニック障害の履歴を伴わない広場恐怖症、パニック発作、記憶障害、記憶喪失、注意欠陥過活動性障害、肥満、不安神経症、全般性不安障害、摂食障害、パーキンソン病、パーキンソニズム、認知症、加齢による認知症、老年性認知症、アルツハイマー病、ダウン症候群、後天性免疫不全症候群認知症複合、加齢に伴う記憶機能障害、特定恐怖症、社会恐怖症、社会不安障害、心的外傷後ストレス障害、急性ストレス障害、薬物依存症、薬物乱用、薬物乱用傾向、コカイン乱用、ニコチン中毒、たばこ乱用、飲酒癖、アルコール依存症、窃盗癖、中毒性物質使用の停止によって引き起こされる禁断症候群、疼痛、慢性疼痛、炎症性痛覚、神経因性疼痛、片頭痛、緊張性頭痛、慢性緊張性頭痛、うつ病に伴う疼痛、線維筋痛、関節炎、変形性関節症、関節リウマチ、背痛、癌性疼痛、過敏性腸症候群、過敏性腸症候群、術後痛、乳房切除後疼痛症候群 (P M P S)、脳卒中後疼痛、薬物誘発性神経障害、糖尿病性神経障害、交感神経依存性疼痛、三叉神経痛、歯痛、筋膜痛、幻肢痛、過食症、月経前症候群、月経前不快気分、黄体期晩期症候群、心的外傷症候群、慢性疲労症候群、遷延性植物状態、尿失禁、緊張性尿失禁、急迫性尿失禁、夜尿、性的機能不全、早漏、勃起困難、勃起障害、早期女性オルガスム、下肢静止不能症候群、周期性四肢運動障害、摂食障害、神経性無食欲症、睡眠障害、広汎性発達障害、自閉症、アスペルガー障害、レット障害、小児期崩壊性障害、学習障害、運動能力障害、無言症、抜毛癖、ナルコレプシー、脳卒中後うつ病、脳卒中誘発性脳損傷、脳卒中誘発性神経損傷、ジルドラトレット症候群、耳鳴り、チック障害、身体醜形障害、反抗的行動障害又は脳卒中後能力障害である請求項 9 に記載の医薬組成物。