

【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29年1月5日(2017.1.5)

【公表番号】特表2016-504992(P2016-504992A)

【公表日】平成28年2月18日(2016.2.18)

【年通号数】公開・登録公報2016-011

【出願番号】特願2015-548639(P2015-548639)

【国際特許分類】

C 0 7 C 217/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 K 31/381 (2006.01)

A 6 1 K 31/5375 (2006.01)

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

A 6 1 K 31/385 (2006.01)

A 6 1 K 31/404 (2006.01)

A 6 1 K 31/7004 (2006.01)

A 6 1 K 31/4015 (2006.01)

A 6 1 K 31/138 (2006.01)

A 6 1 K 31/165 (2006.01)

C 0 7 D 333/20 (2006.01)

C 0 7 D 339/04 (2006.01)

C 0 7 D 209/30 (2006.01)

C 0 7 D 211/22 (2006.01)

C 0 7 D 265/30 (2006.01)

C 0 7 C 217/28 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 217/18

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 9/00

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 25/20
 A 6 1 K 31/381
 A 6 1 K 31/5375
 A 6 1 K 31/445
 A 6 1 K 31/385
 A 6 1 K 31/404
 A 6 1 K 31/7004
 A 6 1 K 31/4015
 A 6 1 K 31/138
 A 6 1 K 31/165
 C 0 7 D 333/20 C S P
 C 0 7 D 339/04
 C 0 7 D 209/30
 C 0 7 D 211/22
 C 0 7 D 265/30
 C 0 7 C 217/28

【手続補正書】

【提出日】平成28年11月14日(2016.11.14)

【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

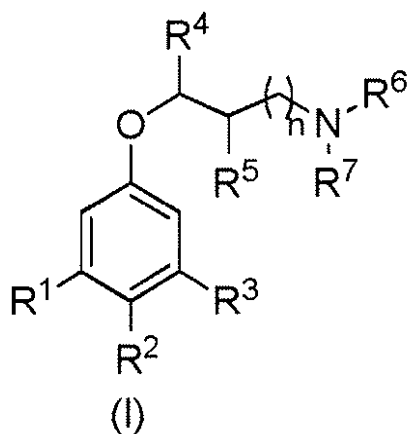
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)を有する化合物

【化1】



〔式中、

R¹ および R³ が水素原子を表し；R² が基 A-OR⁸ であり；ここで、A は C₁-C₆ アルキレンビラジカルを表し；

R⁴ が H；C₆-C₁₀ アリール：ならびに環内に N、O および S からなる群から独立に選択される 1 または 2 個のヘテロ原子を含む 5 員または 6 員の単環式ヘテロアリール基からなる群から選択され；かつ、

a) R⁵ が H であり；R⁶ が H および C₁-C₃ アルキルからなる群から選択され；かつ、R⁷ が H およびメチルから選択されるか；

b) R⁵ および R⁶ が一緒に -O-CH₂-CH₂- および -CH(R¹¹)-CH₂-CH₂- からなる群から選択される基を形成し；かつ、R⁷ が H であるか；または

c) R^5 が H であり；かつ、 R^6 および R^7 が一緒に基 $-(CH_2)_m-CO-$ を形成するかのいずれかであり；

R^8 が H であり；

R^{11} が 1 以上のハロゲン原子で置換されていてもよいフェニル基であり；

n は、0、1 および 2 から選択される整数であり；

m は、3 および 4 から選択される整数であり；

ただし、 R^4 および R^5 が両方とも H である場合には、 R^6 および R^7 は一緒に基 $-(CH_2)_m-CO-$ を形成する]

またはその薬学上許容される塩もしくは立体異性体。

【請求項 2】

R^2 が基 $A-OR^8$ であり；ここで、A はエチレンビラジカルを表し、かつ、 R^8 は水素原子を表し；

R^4 がフェニル基を表し；

R^5 および R^6 が水素原子を表し；

R^7 がメチル基を表し；かつ

n が 1 の値を有する、

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物、またはその薬学上許容される塩もしくは立体異性体。

【請求項 3】

・ 1- [2- [4- (2-ヒドロキシエチル) フェノキシ] エチル] ピロリジン-2-オン；

・ 2- [4- [3- (メチルアミノ) -1-フェニルプロポキシ] フェニル] エタノール塩酸塩；

・ (R)-2- [4- [3- (メチルアミノ) -1-フェニルプロポキシ] フェニル] エタノール塩酸塩；

・ (S)-2- [4- [3- (メチルアミノ) -1-フェニルプロポキシ] フェニル] エタノール塩酸塩；

・ 2- [4- [3- (メチルアミノ) -1-フェニルプロポキシ] フェニル] エタノール L-アスコルビン酸塩；

・ 2- [4- [3- (メチルアミノ) -1-フェニルプロポキシ] フェニル] エタノールフェルラ酸塩；

・ 2- [4- [3- (メチルアミノ) -1-フェニルプロポキシ] フェニル] エタノールカフェ酸塩；

・ 2- [4- [3- (メチルアミノ) -1-フェニルプロポキシ] フェニル] エタノールバルプロ酸塩；

・ 2- [4- [3- (メチルアミノ) -1-フェニルプロポキシ] フェニル] エタノール (R)-リポ酸塩；

・ 2- [4- (3-アミノ-1-フェニルプロポキシ) フェニル] エタノール塩酸塩；

・ (R)-2- [4- [3- (メチルアミノ) -1- (チオフェン-2-イル) プロポキシ] フェニル] エタノール；

・ 4- [4- [3- (メチルアミノ) -1-フェニルプロポキシ] フェニル] ブタン-1-オール塩酸塩；

・ 3- [4- [3- (メチルアミノ) -1-フェニルプロポキシ] フェニル] プロパン-1-オール塩酸塩；

・ [4- [3- (メチルアミノ) -1-フェニルプロポキシ] フェニル] メタノール塩酸塩；

・ 2- [4- (モルホリン-2-イルメトキシ) フェニル] エタノール塩酸塩；

・ 2- [4- (3-ジメチルアミノ-1-フェニルプロポキシ) フェニル] エタノール；

・ 6- [4- (3-メチルアミノ-1-フェニルプロポキシ) フェニル] ヘキサン-1-オール；

- ・ (S) 2- [4- (3-メチルアミノ-1-チオフェン-2-イルプロポキシ) フェニル] エタノール；
- ・ 2- [4- (モルホリン-2-イル (フェニル) メトキシ) フェニル] エタノール；および
- ・ 2- [4- [[(3S, 4R) -4- (4-フルオロフェニル) ピペリジン-3-イル] メトキシ] フェニル] エタノール；

からなる群から選択される、請求項 1 または 2 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 4】

請求項 1 ～ 3 のいずれか一項に記載の化合物と 1 種類以上の薬学上許容される担体とを含んでなる医薬組成物。

【請求項 5】

薬剤として使用するための、請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

神経系疾患の治療ならびに／または認知障害に関連する発達障害、行動障害および／もしくは精神障害の治療において使用するための、請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

前記神経系疾患ならびに／または発達障害、行動障害および／もしくは精神障害が学習障害または記憶障害に関連する、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記認知障害に関連する発達障害がダウン症候群、アンジェルマン症候群、レット症候群、自閉症性障害、脆弱 X 障害およびアスペルガー症候群からなる群から選択される、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記認知障害に関連する行動障害および／または精神障害が鬱病、双極性障害、統合失調症、脳性認知症、心的外傷後ストレス障害、ピック病および睡眠障害からなる群から選択される、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記神経系疾患が、アルツハイマー病、パーキンソン病、ハンチントン病、筋萎縮性側索硬化症、前頭側頭型認知症およびフリードライヒ運動失調症からなる群から選択される認知障害に関連する神経変性障害である、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

神経因性疼痛、線維筋痛症、癲癇および脳卒中からなる群から選択される病態の治療において使用するための、請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

請求項 1 ～ 3 のいずれか一項に記載の化合物と、リバスチグミン、ドネペジル、ガランタミンおよびフベリジン A などのアセチルコリンエステラーゼ阻害剤；メマンチンおよびラトレピルジンなどの NMDA アンタゴニスト；ピトリサント、SAR-110894、ABT-288、S-38093 および AZD-5213 などのヒスタミン H₃ 受容体アンタゴニスト；レスベラトロール、HPP-854、LY-2886721、E-2609 および MK-8931 などの β-セクレターゼ 1 (BACE1) 阻害剤；(－)-没食子酸エピガロカテキン、(＋)-フェンセリンおよび AAD-2004 などの抗アミロイド形成剤；Lu-AE-58054、AVN-322、GSK-215083、GSK-742457 などの 5-HT₆ 受容体アンタゴニスト；SL-65.0102 および BIMU-1 などの 5-HT₄ 受容体アゴニスト；ラサギリン、ラドスチギルおよび RG-1577 などの MAO-B 阻害剤；エタゾラートおよび RG-1662 などの GABA (A) 受容体モジュレーター；サブコメリンおよび MCD-386 などのムスカリン性 M₁ 受容体アゴニスト；ならびにピニトールなどの γ-セクレターゼ阻害剤からなる群から選択される別の薬物とを含んでなる組合せ。