

【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2月14日(2013.2.14)

【公表番号】特表2012-512251(P2012-512251A)

【公表日】平成24年5月31日(2012.5.31)

【年通号数】公開・登録公報2012-021

【出願番号】特願2011-542333(P2011-542333)

【国際特許分類】

C 07 D	209/44	(2006.01)
C 07 D	209/52	(2006.01)
A 61 K	31/403	(2006.01)
A 61 K	31/4035	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
A 61 P	25/24	(2006.01)
A 61 P	25/28	(2006.01)
A 61 P	25/04	(2006.01)
A 61 P	25/20	(2006.01)
A 61 P	25/18	(2006.01)
A 61 P	25/08	(2006.01)
A 61 P	25/14	(2006.01)
A 61 P	25/22	(2006.01)
A 61 P	25/16	(2006.01)
A 61 P	21/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D	209/44	C S P
C 07 D	209/52	
A 61 K	31/403	
A 61 K	31/4035	
A 61 P	43/00	1 1 1
A 61 P	25/24	
A 61 P	25/28	
A 61 P	25/04	
A 61 P	25/20	
A 61 P	25/18	
A 61 P	25/08	
A 61 P	25/14	
A 61 P	25/22	
A 61 P	25/16	
A 61 P	21/00	

【手続補正書】

【提出日】平成24年12月14日(2012.12.14)

【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

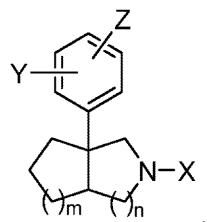
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物、又はその医薬として許容し得る塩、溶媒和物、もしくは立体異性体：
【化1】



(I)

(式中、

mは、0、1、又は2であり；

nは、0、1、又は2であり；

Xは、水素、(C₁-C₁₀)アルキル、(C₃-C₁₀)シクロアルキル、(C₃-C₁₀)シクロアルキル-(C₁-C₁₀)アルキル、(C₁-C₁₀)アルケニル、(C₁-C₁₀)アルキニル、(C₁-C₁₀)アルコキシ、6員から10員のアリール、(6員から10員のアリール)-(C₁-C₁₀)アルキル、-OR¹、ヘテロアルキル、ヘテロアルケニル、又はヘテロアルキニルであり；Y及びZは、それぞれ独立に、ハロゲン、-CF₃、-CN、-NH₂、-NO₂、ジオキソラノ、(C₁-C₁₀)アルキル、(C₃-C₁₀)シクロアルキル、(C₁-C₁₀)アルケニル、(C₁-C₁₀)アルキニル、(C₁-C₁₀)アルコキシ、(C₃-C₁₀)シクロアルコキシ、又は-OR²であり；あるいはY及びZは共に、5員、6員、又は7員のシクロアルキルを形成してもよく；かつR¹及びR²は、それぞれ独立に、水素、(C₁-C₁₀)アルキル、(C₁-C₁₀)アルケニル、(C₁-C₁₀)アルキニル、(C₃-C₁₀)シクロアルキル、(C₃-C₁₀)シクロアルキル-(C₁-C₁₀)アルキル、(C₁-C₁₀)アルコキシ、6員から10員のアリール、6員から10員のヘテロアリール、(6員から10員のアリール)-(C₁-C₁₀)アルキル、-SO₂(C₁-C₁₀)アルキル、又は-SO₂-(6員から10員のアリール)である)。

【請求項2】

m及びnの両方が1である、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

mが2であり、nが1である、請求項1記載の化合物。

【請求項4】

Xが水素である、請求項1記載の化合物。

【請求項5】

Xが(C₁-C₁₀)アルキルである、請求項1記載の化合物。

【請求項6】

Xがメチル又はエチルである、請求項5記載の化合物。

【請求項7】

Y及びZの両方がハロゲンである、請求項1記載の化合物。

【請求項8】

Y及びZの両方が塩化物である、請求項7記載の化合物。

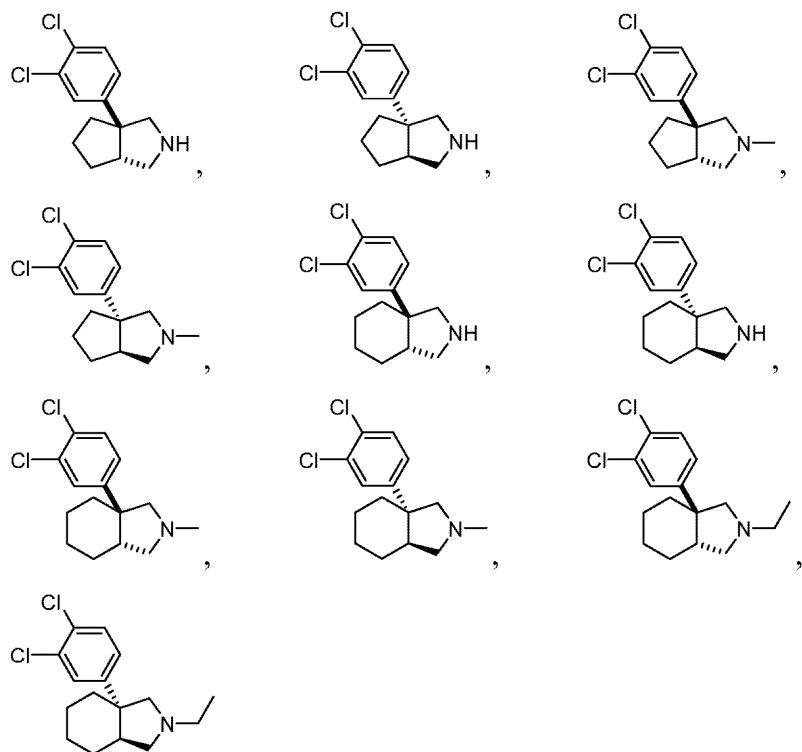
【請求項9】

前記化合物が立体異性体的に純粋である、請求項1記載の化合物。

【請求項10】

下記である請求項1記載の化合物、又はその医薬として許容し得る塩もしくは溶媒和物

【化2】



。

【請求項11】

請求項1記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項12】

1種以上の追加の活性薬剤をさらに含む、請求項11記載の医薬組成物。

【請求項13】

モノアミントラヌスポーターイガンドのモノアミントラヌスポーターへの結合を阻害するための医薬組成物であって、請求項1記載の化合物を含む、前記医薬組成物。

【請求項14】

少なくとも1種のモノアミントラヌスポーターの活性を阻害するための医薬組成物であって、請求項1記載の化合物を含む、前記医薬組成物。

【請求項15】

前記モノアミントラヌスポーターが、セロトニトランスポーター(SERT)、ドーパミントランスポーター(DAT)、ノルエピネフリントランスポーター(NET)、又はこれらの組み合わせである、請求項13又は14記載の医薬組成物。

【請求項16】

前記化合物が、少なくとも2種の異なるモノアミントラヌスポーターの活性を阻害する、請求項14記載の医薬組成物。

【請求項17】

細胞による、少なくとも1種のモノアミンの取り込みを阻害するための医薬組成物であって、請求項1記載の化合物を含む、前記医薬組成物。

【請求項18】

前記モノアミンが、セロトニン、ドーパミン、ノルエピネフリン、又はこれらの組み合わせである、請求項17記載の医薬組成物。

【請求項19】

前記化合物が少なくとも2種の異なるモノアミンの取り込みを阻害する、請求項17記載の医薬組成物。

【請求項20】

請求項 1 記載の化合物を含む、患者のうつ病を治療するための医薬組成物。

【請求項 2 1】

前記患者がヒトである、請求項 2 0 記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

請求項 1 記載の化合物を含む、患者の中枢神経系疾患を治療するための医薬組成物。

【請求項 2 3】

前記患者がヒトである、請求項 2 2 記載の医薬組成物。

【請求項 2 4】

前記中枢神経系疾患が、うつ病、認知障害、線維筋痛症、疼痛、睡眠障害、注意欠陥障害(ADD)、注意欠陥多動性障害(ADHD)、レストレスレッグ症候群、統合失調症、不安、強迫性障害、心的外傷後ストレス障害、月経前不機嫌、又は神経変性疾患である、請求項 2 2 記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

前記うつ病が、大うつ病性障害(MDD)、単極性うつ、双極性障害、季節性情動障害(SAD)、又は気分変調症である、請求項 2 4 記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

前記神経変性疾患がパーキンソン病である、請求項 2 4 記載の医薬組成物。

【請求項 2 7】

前記睡眠障害が睡眠時無呼吸である、請求項 2 4 記載の医薬組成物。

【請求項 2 8】

前記疼痛が神経因性疼痛である、請求項 2 4 記載の医薬組成物。