

【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 0 7 D 209/44 (2006.01)

C 0 7 D 209/52 (2006.01)

A 6 1 K 31/403 (2006.01)

A 6 1 K 31/4035 (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 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 209/44 C S P

C 0 7 D 209/52

A 6 1 K 31/403

A 6 1 K 31/4035

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 25/04

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/16

A 6 1 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

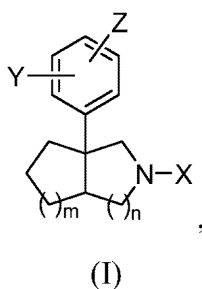
【補正の内容】

【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】



(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、(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)シクロアルキル-(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)アルケニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)アルキニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)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)-(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)アルキル、-OR<sup>1</sup>、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、-CF<sub>3</sub>、-CN、-NH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、ジオキソラノ、(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)アルケニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)アルキニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)アルコキシ、(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)シクロアルコキシ、又は-OR<sup>2</sup>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  
R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、それぞれ独立に、水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)アルケニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)アルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)シクロアルキル-(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)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)-(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)アルキル、-SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)アルキル、又は-SO<sub>2</sub>-(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(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)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。

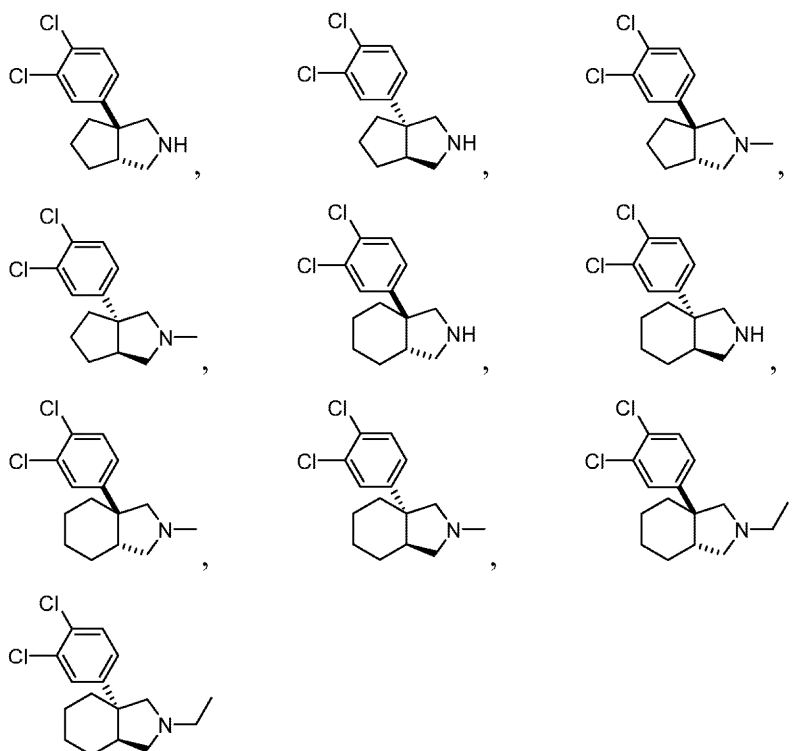
【請求項 9】

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 1 1】

請求項 1 記載の化合物を含む医薬組成物。

## 【請求項 1 2】

1 種以上の追加の活性薬剤をさらに含む、請求項 1 1 記載の医薬組成物。

## 【請求項 1 3】

モノアミントランスポーターリガンドのモノアミントラン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 1 4】

少なくとも 1 種のモノアミントラン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 1 5】

前記モノアミントランスポーターが、セロトニントランスポーター (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 1 3 又は 1 4 記載の医薬組成物。

## 【請求項 1 6】

前記化合物が、少なくとも 2 種の異なるモノアミントランスポーターの活性を阻害する、請求項 1 4 記載の医薬組成物。

## 【請求項 1 7】

細胞による、少なくとも 1 種のモノアミンの取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 1 8】

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 1 7 記載の医薬組成物。

## 【請求項 1 9】

前記化合物が少なくとも 2 種の異なるモノアミンの取込みを阻害する、請求項 1 7 記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 0】

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。