

【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23年8月18日 (2011.8.18)

【公表番号】特表2010-532751(P2010-532751A)

【公表日】平成22年10月14日 (2010.10.14)

【年通号数】公開・登録公報2010-041

【出願番号】特願2010-514127(P2010-514127)

【国際特許分類】

C 0 7 C 271/44 (2006.01)

C 0 7 C 307/02 (2006.01)

C 0 7 C 309/25 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/22 (2006.01)

C 0 7 D 207/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/40 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 271/44 C S P

C 0 7 C 307/02

C 0 7 C 309/25

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 31/22

C 0 7 D 207/00

A 6 1 K 31/40

【手続補正書】

【提出日】平成23年7月1日 (2011.7.1)

【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

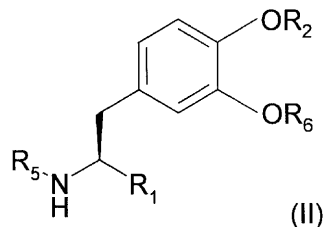
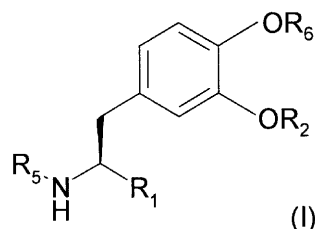
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(I)または式(II)：

【化 1】



[式中、

R_1 はカルボキシ、カルボキシエステルまたはカルボキシアミド基であり；

R_2 は基 $-C(=O)-NR_3R_4$ または $-S(=O)_2-NR_3R_4$ であり；

R_3 および R_4 は、独立して、水素、任意に置換されていてもよい C_1-C_6 アルキル、(C_1-C_5 フルオロアルキル)- CH_2- 、 $-Q$ および $-CH_2Q$ (ここで、 Q は 3~6 の環原子を有し、任意に置換されていてもよい単環式の炭素環または複素環である) から選択されるか；または

R_3 および R_4 は、それらが結合している窒素と一緒に、3~8 の環原子を有し、任意に置換されていてもよい単環式のシクロアルキル環もしくは非芳香族複素環を形成し；

R_5 は水素、またはペプチド結合を介して結合した天然もしくは非天然の α -アミノ酸の残基であり；

R_6 は水素または基 $R_7C(=O)-$ であり；そして

R_7 は C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 フルオロアルキルまたはシクロプロピルである]

の、置換されたフェニラルアニン化合物、またはその塩、水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 2】

R_6 が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R_6 が $CH_3C(=O)-$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

R_2 が基 $-C(=O)-NR_3R_4$ である、請求項 1~3 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 5】

R_3 および R_4 の一方が水素であり、他方が C_1-C_3 アルキルである、請求項 1~4 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 6】

R_3 が水素であり、 R_4 がメチルである、請求項 1~5 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 7】

R_3 および R_4 が、それらが結合している窒素と一緒に、任意に置換されていてもよい、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニルまたはピロリジニル環を形成する、請求項 1~4 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 8】

任意の置換基が、トリフルオロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、メルカプト、オキソ、 $-NH_2$ 、 $-NHR^A$ および $-NR^AR^B$ (ここで、 R^A および R^B は独立して、メチルまたはエチルである) から選択される、請求項 1~7 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 9】

R_1 がカルボキシ基である、請求項 1~8 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 10】

R_1 が式 $-COOR^C$ (ここで、 R^C は C_1-C_6 アルキルである) のカルボキシエステル基である、請求項 1~8 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 11】

R^C がメチルである、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

R_1 が $-CONH_2$ である、請求項 1~8 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 13】

R_5 が水素である、請求項1～12のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項 14】

R_5 が式 $-C(=O)C(R_8)(R_9)NH_2$ (ここで、 R_8 および R_9 は、独立して、

(a) 水素；または

(b) 天然アミノ酸の側鎖、または

(c) 任意に置換されていてもよい、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 C_2 - C_4 アルケニル、 C_2 - C_4 アルケニルオキシもしくは C_2 - C_4 アルキニル、または

(d) $-CH_2XCH_3$ 、 $-CH_2CH_2XCH_3$ もしくは $-CH_2XCH_2CH_3$ [ここで、 X は $-O-$ 、 S または $-NR_{10}$ (ここで、 R_{10} は水素、メチルまたはエチルである)である]；または

(e) $-CH_2Q$ もしくは CH_2OQ (ここで、 Q は請求項1で定義されたとおりである)であるか；または

R_8 および R_9 は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、3～8の環原子を有し、任意に置換されていてもよいシクロアルキル環もしくは複素環を形成し、それらの環は、第2の任意に置換されていてもよい炭素環もしくは複素環と任意に縮合していてもよい)のアミノ酸残基である、請求項1～12のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項 15】

R_8 および R_9 の一方が水素であり、他方がグリシン以外の天然アミノ酸の側鎖である、請求項14に記載の化合物。

【請求項 16】

R_8 および R_9 が独立して、任意に置換されていてもよい、 C_1 - C_4 アルキル、フェニル、ベンジル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、ピリジル、ピリジルメチル、ピペリジニル、ピペラジニルもしくはモルホリニルである、請求項14または15に記載の化合物。

【請求項 17】

R_8 および R_9 の一方がメチルである、請求項15または16に記載の化合物。

【請求項 18】

R_8 および R_9 がそれぞれメチルである、請求項14に記載の化合物。

【請求項 19】

R_8 および R_9 が、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、任意にベンゼンと縮合していてもよい C_1 - C_6 シクロアルキル環を形成する、請求項14に記載の化合物。

【請求項 20】

R_8 および R_9 が、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル環を形成する、請求項14に記載の化合物。

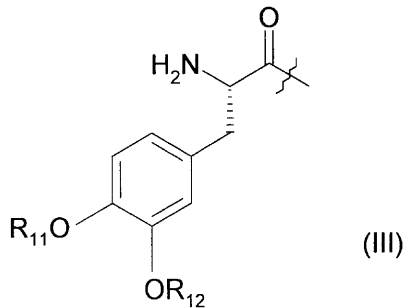
【請求項 21】

任意の置換基が、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、シクロプロピル、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、メルカプト、オキソ、 $-NH_2$ 、 $-NHR^A$ または $-NR^A R^B$ (ここで、 R^A および R^B は独立してメチルまたはエチルである)から選択される、請求項14～20のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項 22】

R_5 が式 (III) :

【化 2】



(式中、(a) R_{11} および R_{12} は、独立して、水素、請求項1で定義された基 R_6 、基 $-C(=O)OR_{13}$ または基 $-C(=O)OR_{13}$ (ここで、 R_{13} は C_1 - C_3 アルキルである) から選択されるか；または (b) R_{11} および R_{12} の一方は水素であり、他方が請求項1で定義された基 R_2 である) の基である、請求項1～12のいずれか1つに記載の化合物。

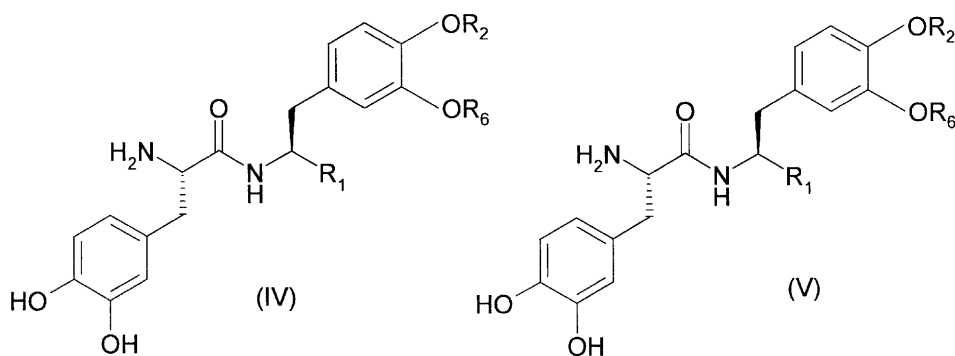
【請求項 2 3】

R_{11} および R_{12} がそれぞれ水素である、請求項22に記載の化合物。

【請求項 2 4】

式(IV)または式(V)：

【化 3】



[式中、 R_1 は基 $R_{14}O(C=O)-$ であり； R_2 は基 $R_{15}NH(C=O)-$ であり；そして R_6 は水素または基 $R_{16}(C=O)-$ (ここで、 R_{14} 、 R_{15} および R_{16} は、独立して、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 フルオロアルキルおよびシクロプロピルから選択される) である]
の化合物、またはその塩、水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 2 5】

R_{14} 、 R_{15} および R_{16} がそれぞれメチルである、請求項25に記載の化合物。

【請求項 2 6】

実施例で得られる構造式(I)または(II)を有する請求項1に記載の化合物、またはその塩、水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 2 7】

請求項1～26のいずれか1つに記載の化合物を医薬的に許容される担体とともに含む医薬組成物。

【請求項 2 8】

損なわれたドーパミン作用性信号伝達を伴う疾病を治療するための、請求項27に記載の医薬組成物。

【請求項 2 9】

疾病が、パーキンソン病または不穏下肢症候群である、請求項28に記載の医薬組成物。

【請求項 3 0】

疾病が、トゥーレット症候群、注意欠陥過活動性障害、下垂体腫瘍の発生、パーキンソン-プラス症候群、レボドパ応答失調症、運動障害、睡眠中の周期運動、嚥下障害または神経遮断薬性悪性症候群である、請求項28に記載の医薬組成物。