

【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 07 C 271/44 (2006.01)

C 07 C 307/02 (2006.01)

C 07 C 309/25 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 25/20 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 K 31/22 (2006.01)

C 07 D 207/00 (2006.01)

A 61 K 31/40 (2006.01)

【F I】

C 07 C 271/44 C S P

C 07 C 307/02

C 07 C 309/25

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 25/16

A 61 P 25/00

A 61 P 25/20

A 61 P 35/00

A 61 K 31/22

C 07 D 207/00

A 61 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

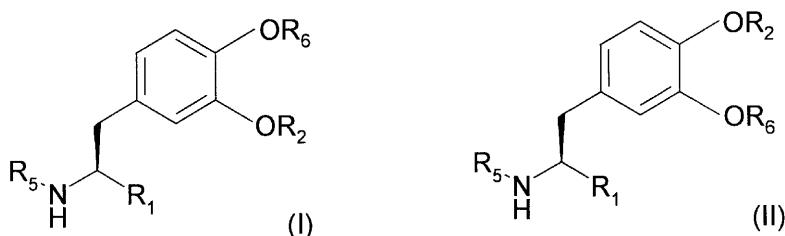
【補正の内容】

【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になって、3~8の環原子を有し、任意に置換されていてもよい单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；

R₅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

R₇はC₁-C₆アルキル、C₁-C₆フルオロアルキ

の、置換されたフェニルアラニン化合物、またはその塩、水和物もしくは溶

【請求項 2】

R_6 が水素で

【請求項3】

R_6 が $CH_3C(=O)CH_2-$

【請求項 4】

R₁ が基-C(-)

【請求項5】 R_2 および R_4 の一方が水素であり、他方が C_1 ~ C_2 アルキルである、請求項1~4のいずれか1

つに記載の化

【請求項 6】

R₂ が水素で

【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になって、任意に置換されてもよい、ペリジニル、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のいす

【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、メルカブト、オキソ、-NH₂、-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

（請求項 9）

R₁ がカルボ辛

【請求項 10】
R₁が式-COOR^C（ここで、R^CはC₁-C₆アルキルである）のカルボキシエステル基である、請求項1-9に記載されたに記載の化合物。

請求項1～8のい ふり

DFがナトリウムである。請求項12に記載の化合物

R・ガスチル

B が CONH₂ 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 1 3】

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 1 4】

R_5 が式-C(=O)C(R_8)(R_9)NH₂（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、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄アルコキシ、C₂-C₄アルケニル、C₂-C₄アルケニルオキシもしくはC₂-C₄アルキニル、または

(d) -CH₂XCH₃、-CH₂CH₂XCH₃もしくは-CH₂XCH₂CH₃ [ここで、Xは-O-、Sまたは-NR₁₀（ここで、R₁₀は水素、メチルまたはエチルである）である]；または

(e) -CH₂QもしくはCH₂OQ（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になって、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 1 5】

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 1 6】

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、C₁-C₄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、シクロヘキシリル、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、シクロヘキシリルメチル、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 1 7】

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 1 8】

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 1 9】

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になって、任意にベンゼンと縮合していてもよいC₁-C₆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 2 0】

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になって、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リル環を形成する、請求項14に記載の化合物。

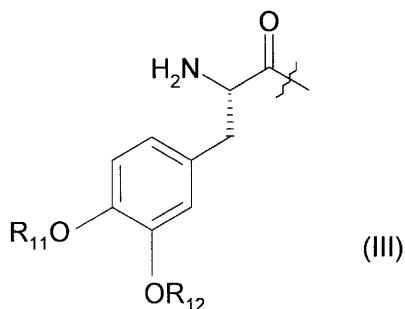
【請求項 2 1】

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、-NH₂、-NHR^Aまたは-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14~20のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項 2 2】

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)OR₁₃ または基-C(=O)OR₁₃ (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。

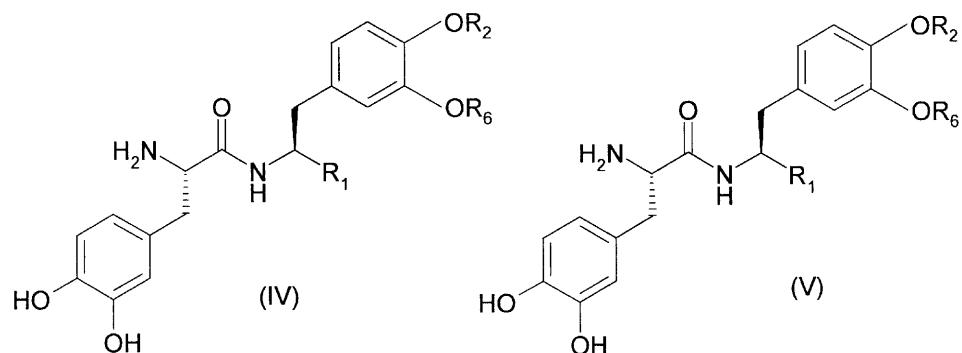
【請求項 2 3】

R₁₁ および R₁₂ 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、R₁は基R₁₄O(C=O)-であり；R₂は基R₁₅NH(C=O)-であり；そしてR₆は水素または基R₁₆(C=O)-（ここで、R₁₄、R₁₅およびR₁₆は、独立して、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆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 25】

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 26】

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 27】

【請求項27】
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 28】

【請求項27】
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 29】

疾患が、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 30】

【前半】
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。