

【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 7 月 21 日 (2011.7.21)

【公表番号】特表 2010-529080 (P2010-529080A)

【公表日】平成 22 年 8 月 26 日 (2010.8.26)

【年通号数】公開・登録公報 2010-034

【出願番号】特願 2010-510782 (P2010-510782)

【国際特許分類】

C 07 D 207/08 (2006.01)

A 61 K 31/40 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 25/22 (2006.01)

A 61 P 25/20 (2006.01)

【F I】

C 07 D 207/08 C S P

A 61 K 31/40

A 61 P 25/00 1 0 1

A 61 P 25/28

A 61 P 25/24

A 61 P 25/22

A 61 P 25/20

【手続補正書】

【提出日】平成 23 年 5 月 31 日 (2011.5.31)

【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

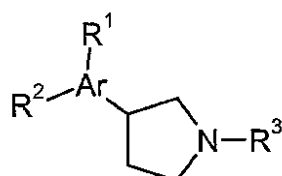
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (2)

【化 1】



(2)

(式中、

Ar は、フェニル、チオフェニル、フラニル、2 - ピリミジニル、オキサゾイル及びチアゾリルからなる群から選択され、

R<sup>1</sup> は、F 及び Cl からなる群から選択され、

R<sup>2</sup> は、F 及び Cl からなる群から選択され、及び

$R^3$  は、H 及び Me からなる群から選択され、

ただし、Ar がフェニルであり、 $R^1$  及び  $R^2$  の 1 つがパラ位に位置し、 $R^1$  及び  $R^2$  の他方がメタ位に位置する場合、このとき  $R^3$  が H である場合は  $R^1$  及び  $R^2$  の両方が F であることはない)

の化合物、その立体異性体のいずれか若しくはその立体異性体の任意の混合物、

又はそれらの N - オキシド、或いは医薬として許容できるそれらの塩。

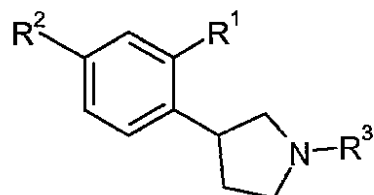
【請求項 2】

Ar がフェニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

式 (3)

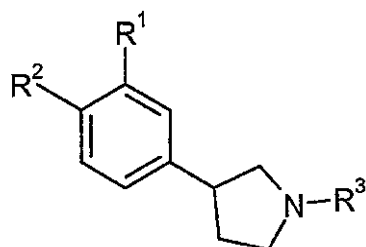
【化 2】



(3)

又は式 (4)

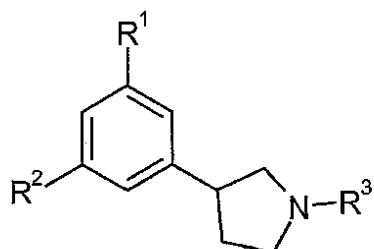
【化 3】



(4)

又は式 (5)

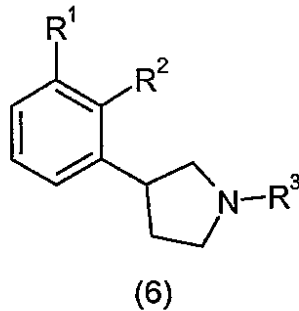
【化 4】



(5)

又は式 (6)

## 【化 5】



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$  及び  $R^3$  は、請求項 1 で定義した通りであり、ただし、上記の式 (5) において、 $R^3$  が H の場合、 $R^1$  及び  $R^2$  の両方が F であることはない) の請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

$R^1$  が F である、請求項 1 から 3 までのいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 5】

$R^3$  が H 又は Me である場合  $R^2$  が F である、請求項 1 から 4 までのいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 6】

$R^3$  が H である、請求項 1 から 5 までのいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 7】

(+) - エナンチオマーの形態における、請求項 1 から 6 までのいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 8】

(-) - エナンチオマーの形態における、請求項 1 から 6 までのいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 9】

3 - (3, 4 - ジクロロフェニル) ピロリジン、  
 3 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) ピロリジン、  
 3 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) ピロリジン、  
 3 - (3, 4 - ジフルオロフェニル) - 1 - メチルピロリジン、  
 又は医薬として許容できるそれらの塩である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 10】

請求項 1 から 9 までのいずれかに記載の化合物若しくは化合物

3 - (3, 4 - ジフルオロフェニル) ピロリジン；

その立体異性体のいずれか若しくはその立体異性体の任意の混合物、又はそれらの N - オキシド、或いは医薬として許容できるそれらの塩の治療有効量とともに、1 つ若しくは複数の医薬として許容できる担体又は希釈剤を含む医薬組成物。

## 【請求項 11】

請求項 1 から 9 までのいずれかに記載の化合物若しくは化合物

3 - (3, 4 - ジフルオロフェニル) ピロリジン；

その立体異性体のいずれか若しくはその立体異性体の任意の混合物、又はそれらの N - オキシド、或いは医薬として許容できるそれらの塩を含む医薬。

## 【請求項 12】

ヒトを含めた哺乳動物の疾患若しくは中枢神経系障害を治療、予防又は軽減するための、請求項 11 に記載の医薬。

## 【請求項 13】

中枢神経系障害が、認知障害、神経変性疾患、認知症、加齢性認知障害、発達障害、自閉症スペクトラム障害、ADHD、脳性麻痺、ジル・ドゥ・ラ・トゥレット症候群、統合

失調症の中核症状の一部として起こる認知障害、統合失調症、統合失調症様障害、感情障害、うつ病、双極性障害、不安障害、全般性不安障害（GAD）、特定恐怖症、パニック障害（PD）又は睡眠障害である、請求項12に記載の医薬。

【請求項14】

医薬として使用するための、請求項1から9までのいずれか一項に記載の化合物若しくは化合物

3 - (3, 4 - ジフルオロフェニル)ピロリジン<sub>2</sub>;

その立体異性体のいずれか若しくはその立体異性体の任意の混合物、又はそれらのN - オキシド、或いは医薬として許容できるそれらの塩。

【請求項15】

中枢神経系におけるドーパミン作動性機能の調節に応答する、ヒトを含めた哺乳動物の疾患又は障害又は状態を治療、予防又は軽減するのに使用するための、請求項1から9までのいずれか一項に記載の化合物若しくは化合物

3 - (3, 4 - ジフルオロフェニル)ピロリジン<sub>2</sub>;

その立体異性体のいずれか若しくはその立体異性体の任意の混合物、又はそれらのN - オキシド、或いは医薬として許容できるそれらの塩。