

【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31年1月24日 (2019.1.24)

【公表番号】特表2018-504391 (P2018-504391A)

【公表日】平成30年2月15日 (2018.2.15)

【年通号数】公開・登録公報2018-006

【出願番号】特願2017-533825 (P2017-533825)

【国際特許分類】

C 07 D 205/04 (2006.01)

C 07 D 295/135 (2006.01)

C 07 D 239/60 (2006.01)

C 07 D 213/71 (2006.01)

C 07 D 231/18 (2006.01)

C 07 D 261/10 (2006.01)

C 07 D 333/34 (2006.01)

C 07 D 207/12 (2006.01)

C 07 D 401/12 (2006.01)

C 07 D 207/14 (2006.01)

C 07 D 417/12 (2006.01)

A 61 K 31/40 (2006.01)

A 61 K 31/513 (2006.01)

A 61 K 31/4439 (2006.01)

A 61 K 31/4155 (2006.01)

A 61 K 31/422 (2006.01)

A 61 K 31/427 (2006.01)

A 61 K 31/397 (2006.01)

A 61 K 31/5377 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 25/04 (2006.01)

A 61 P 1/00 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 205/04 C S P

C 07 D 295/135

C 07 D 239/60

C 07 D 213/71

C 07 D 231/18

C 07 D 261/10

C 07 D 333/34

C 07 D 207/12

C 07 D 401/12

C 07 D 207/14

C 07 D 417/12

A 61 K 31/40

A 61 K 31/513

A 61 K 31/4439

A 61 K 31/4155

A 61 K 31/422

A 61 K 31/427

A 61 K 31/397

A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 25/04
 A 6 1 P 1/00

【手続補正書】

【提出日】平成30年12月4日(2018.12.4)

【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

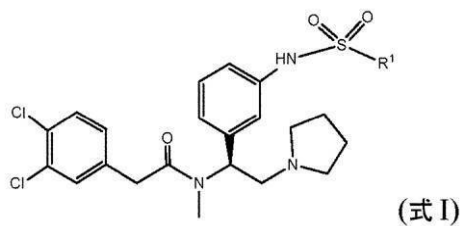
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

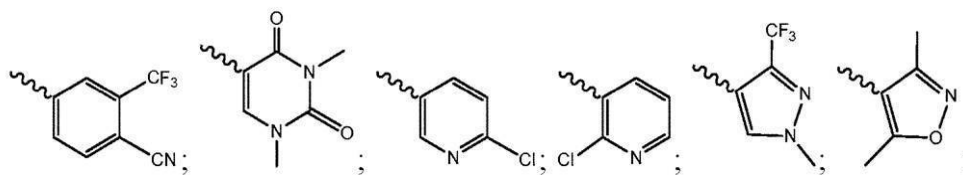
【請求項1】

以下の式：

【化101】

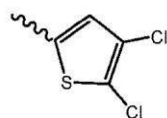
[式中、R¹ は、

【化102】



~ N (C H ₃) C H ₂ C H ₂ O C H ₃ ; ~ C H ₂ C H (C H ₃) O H ; ~ N (C H ₂ C H ₂ O C H ₃) ₂ ; 及び

【化103】

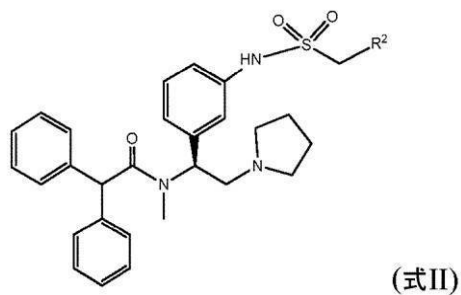


からなる群から選択される] に包含される構造を有する化合物、或いは前述のものの各々の薬学的に許容可能な塩又は溶媒和物。

【請求項2】

以下の式：

【化 1 0 4】



[式中、 R^2 は、 $\sim CH_2OCH_2CF_3$; 及び $\sim CH(CH_3)OH$ からなる群から選択される] に包含される構造を有する化合物、或いは 前述のものの各々の薬学的に許容可能な塩又は溶媒和物。

【請求項 3】

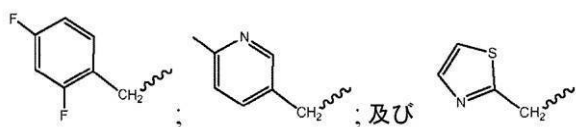
以下の式：

【化 1 0 5】



[式中、 R^3 は、

【化 1 0 6】

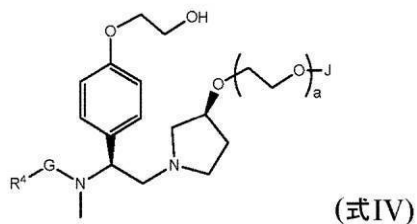


からなる群から選択される] に包含される構造を有する化合物、或いは 前述のものの各々の薬学的に許容可能な塩又は溶媒和物。

【請求項 4】

以下の式：

【化 1 0 7】



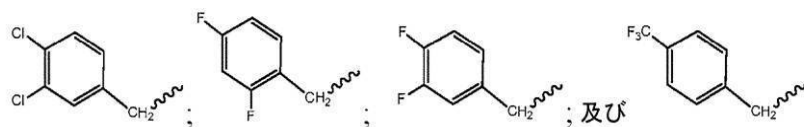
[式中：

G は、 $\sim C(O)\sim$ 及び $\sim S(O)_2\sim$ からなる群から選択され；

(a) は、0、1、2、3 及び 4 から選択され；

R^4 は、

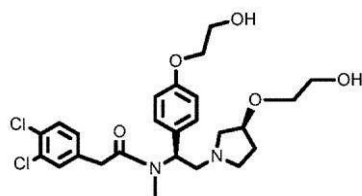
【化 1 0 8】



からなる群から選択され、且つ

J は $\sim H$ 又は $\sim CF_3$ である] に包含される構造を有する化合物であって、但し、

【化 1 0 9】

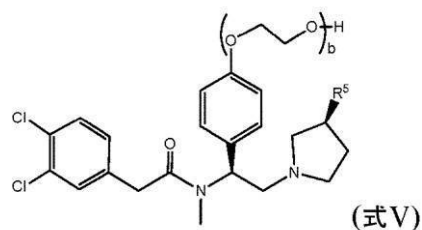


ではない化合物、或いは前述のものの各々の薬学的に許容可能な塩又は溶媒和物。

【請求項 5】

以下の式：

【化 1 1 0】

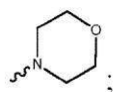


[式中：

(b) は、 0 又は 1 のいずれかであり；且つ

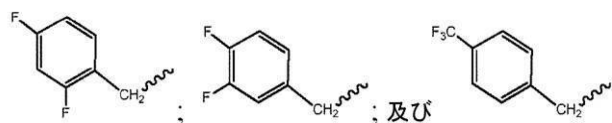
R^5 は、

【化 1 1 1】



$\sim NHCH_2CH_2OCH_2CH_2OCH_2CH_2OCF_3$ ； $\sim NHC(CH_3)_3$ ； $\sim NHCH_3$ ；及び $\sim N(CH_3)_2$ ；

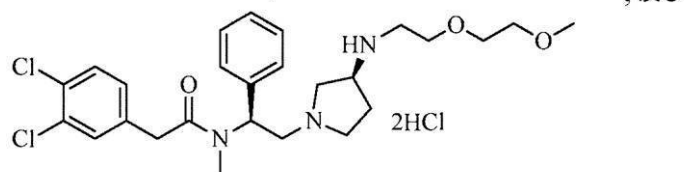
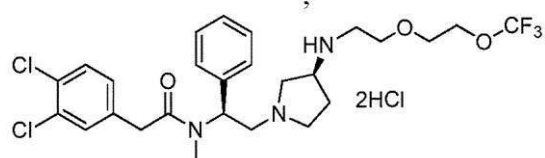
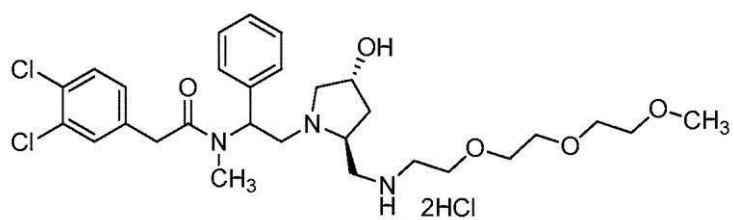
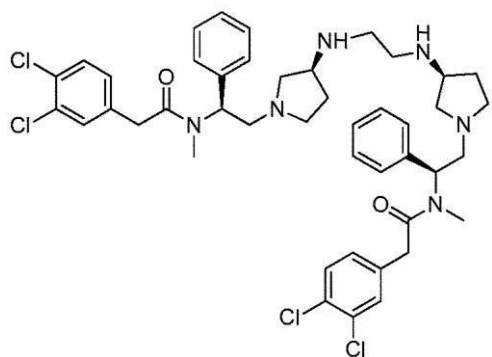
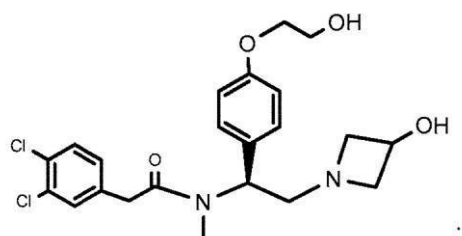
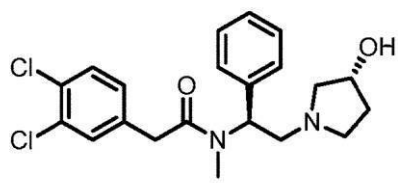
【化 1 1 2】



からなる群から選択される] に包含される構造を有する化合物、或いは前述のものの各々の薬学的に許容可能な塩又は溶媒和物。

【請求項 6】

以下：

CC(O)S(=O)(=O)Nc1ccc(cc1)[C@H](CN(C)C)C(=O)Cc2ccc(cc2)C(F)(F)F

【請求項 7】

請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物と少なくとも 1 つの薬学的に許容可能な賦形剤とを含む医薬組成物。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物を含む組成物であって、前記化合物が剤形で存在する、組成物。

【請求項 9】

前記剤形が経口剤形である、請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 10】

請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物を含む組成物であって、前記組成物がそれを必要としている患者に投与されることを特徴とする組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0006

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0006】

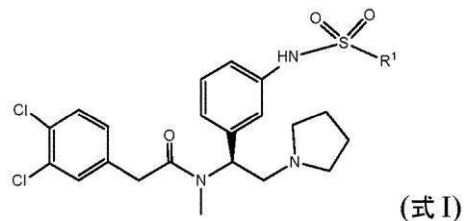
上記の観点から、内臓痛及び オピオイド受容体に関連する他の症状又は病状を治療するのに十分な有効性を保持しながらも CNS 副作用を低減する末梢作用性 オピオイド作動薬が依然として必要とされている。本発明は、これら及び他の必要に応えようとするものである。

本発明は、例えば、以下を提供する：

(項目 1)

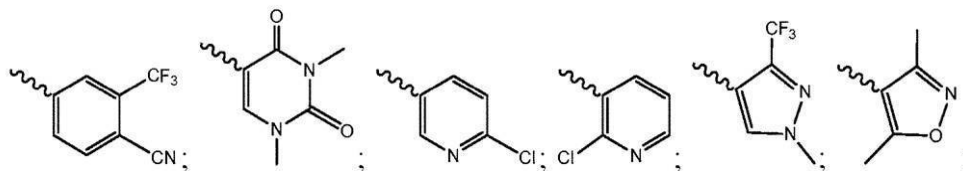
以下の式：

【化 101】



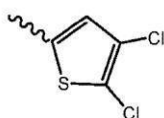
[式中、R¹は、

【化 102】



$\sim N(CH_3)CH_2CH_2OCH_3$; $\sim CH_2CH(CH_3)OH$; $\sim N(CH_2CH_2OCH_3)_2$; 及び

【化 103】

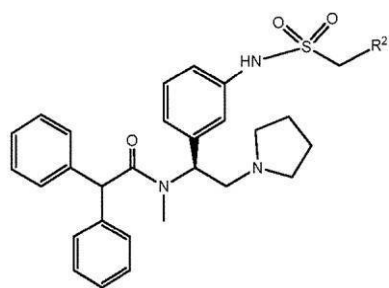


からなる群から選択される] に包含される構造を有する化合物、並びに前述のものの各々の薬学的に許容可能な塩及び溶媒和物。

(項目2)

以下の式：

【化104】



(式II)

[式中、 R^2 は、 $\sim CH_2OCH_2CF_3$ ；及び $\sim CH(CH_3)OH$ からなる群から選択される]に包含される構造を有する化合物、並びに前述のものの各々の薬学的に許容可能な塩及び溶媒和物。

(項目3)

以下の式：

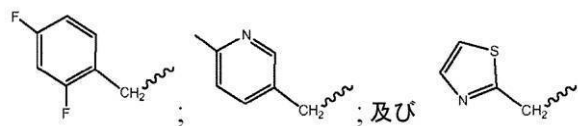
【化105】



(式III)

[式中、 R^3 は、

【化106】

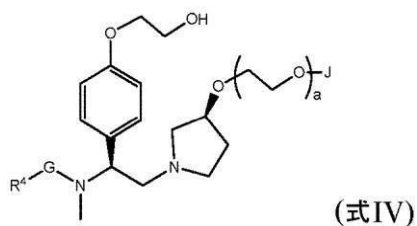


からなる群から選択される]に包含される構造を有する化合物、並びに前述のものの各々の薬学的に許容可能な塩及び溶媒和物。

(項目4)

以下の式：

【化107】



(式IV)

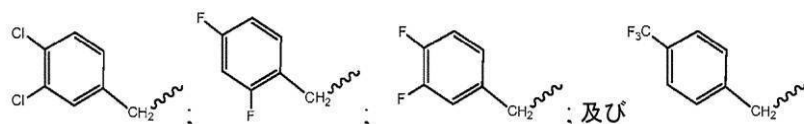
[式中：

Gは、 $\sim C(O)\sim$ 及び $\sim S(O)_2\sim$ からなる群から選択され；

(a)は、0、1、2、3及び4から選択され；

R⁴ は、

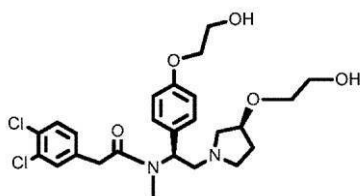
【化 1 0 8】



からなる群から選択され、且つ

「J は ~ H 又は ~ CF₃ である」に包含される構造を有する化合物であって、但し、

【化 1 0 9】

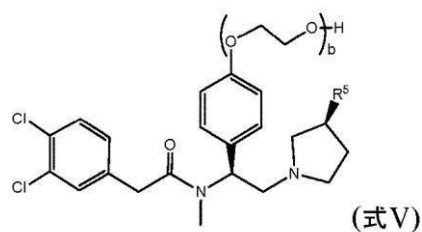


ではない化合物、並びに前述のものの各々の薬学的に許容可能な塩及び溶媒和物。

(項目 5)

以下の式：

【化 1 1 0】

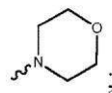


[式中：

(b) は、 0 又は 1 のいずれかであり；且つ

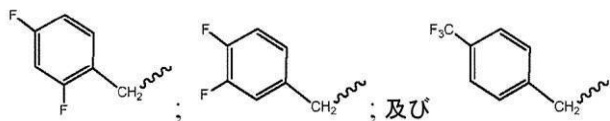
R⁵ は、

【化 1 1 1】



~ NHCH₂CH₂OCH₂CH₂OCH₂CH₂OCF₃；~ NHC(CH₃)₃；~ NHCH₃；及び ~ N(CH₃)₂；

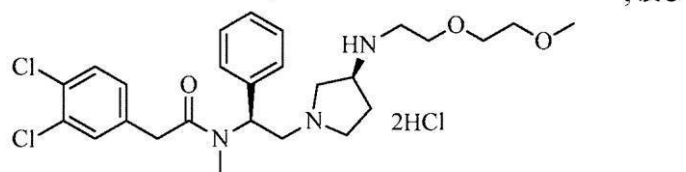
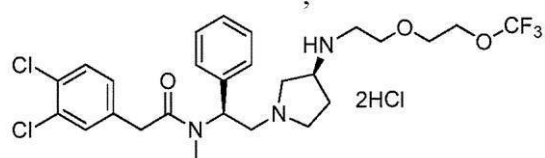
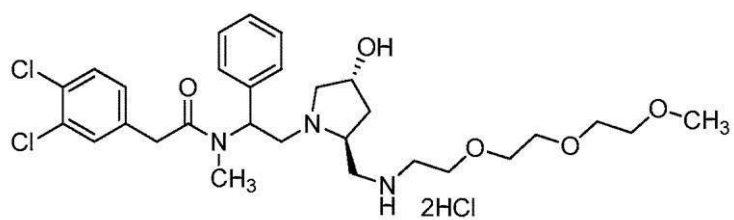
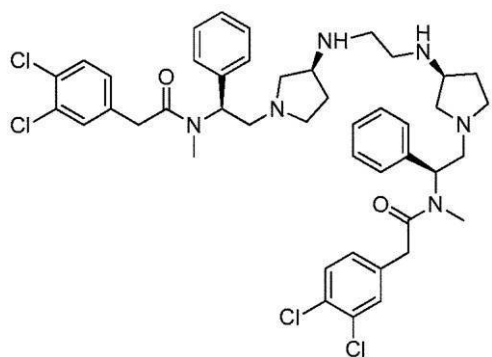
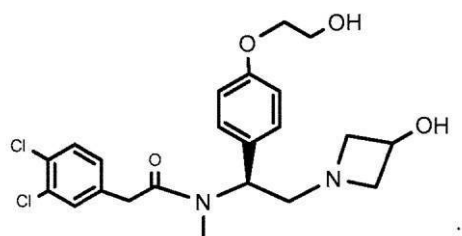
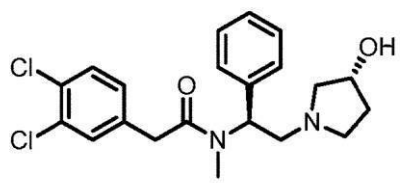
【化 1 1 2】



からなる群から選択される」に包含される構造を有する化合物、並びに前述のものの各々の薬学的に許容可能な塩及び溶媒和物。

(項目 6)

以下：

CC(O)S(=O)(=O)Nc1ccc(cc1)[C@H](CN(C)C)C(=O)Cc2ccc(cc2)C(F)(F)F

(項目 7)

項目 1 ～ 6 のいずれか一項に記載の化合物と少なくとも 1 つの薬学的に許容可能な賦形剤とを含む医薬組成物。

(項目 8)

項目 1 ～ 7 のいずれか一項に記載の化合物を含む組成物であって、前記化合物が剤形で存在する、組成物。

(項目 9)

項目 1 ～ 8 のいずれか一項に記載の化合物を、それを必要としている患者に投与するステップを含む方法。