

【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 19 年 8 月 30 日 (2007.8.30)

【公表番号】特表 2007-500155 (P2007-500155A)

【公表日】平成 19 年 1 月 11 日 (2007.1.11)

【年通号数】公開・登録公報 2007-001

【出願番号】特願 2006-521477 (P2006-521477)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 333/20 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/24 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/381 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 D 333/20

A 6 1 P 25/24

A 6 1 K 31/381

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 7 月 9 日 (2007.7.9)

【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

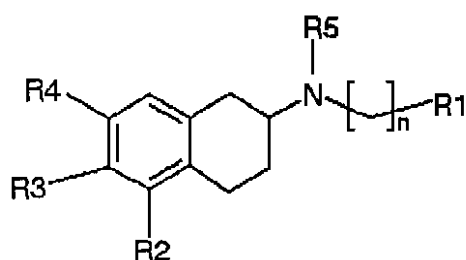
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 I

【化 1】



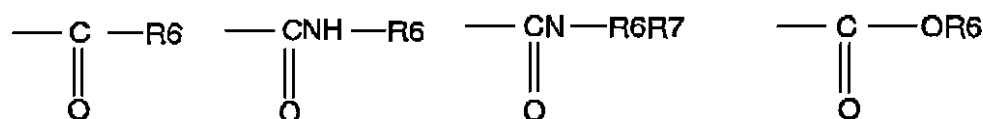
〔前記式中：〕

$n = 1 \sim 5$  であり；

$R 2 = O A$  であり； $R 3$  及び  $R 4$  はそのつど相互に独立して H 及び O A から選択され；

その際、A は H、C 1 ~ 3 アルキル又は以下の基

【化 2】



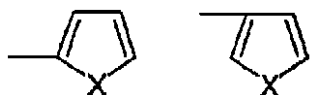
〔前記式中、 $R 6$  及び  $R 7$  は相互に独立してアルキル又はアリールである〕から選択され

；

$R 5$  は C 1 ~ C 3 アルキルであり；

$R 1$  は、

## 【化 3】



[ 前記式中、X は S、O 又は NH から選択される； ] から選択された基である； ] の、ラセミ体として又は純粋な ( R ) - エナンチオマー又は ( S ) - エナンチオマーとして存在する

化合物又は前記化合物の生理学的に許容可能な塩を含有する、パーキンソン病に関連しない内因性うつ病又は器質性うつ病の治療のための医薬品。

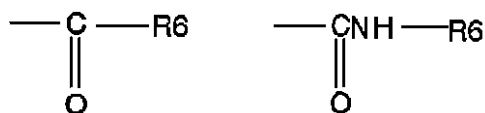
## 【請求項 2】

R 3 及び R 4 はそのつど両方ともに水素である、請求項 1 記載の医薬品。

## 【請求項 3】

A は水素原子又は以下の基

## 【化 4】



[ 前記式中、R 6 は C 1 ~ C 12 アルキル、フェニル又はメトキシフェニルである ] である、請求項 1 又は 2 記載の医薬品。

## 【請求項 4】

n は 1 ~ 3 の値を有し、かつ R 5 は C 3 - アルキルである、請求項 1 から 3 までのいずれか 1 項記載の医薬品。

## 【請求項 5】

X は硫黄原子である、請求項 1 から 4 までのいずれか 1 項記載の医薬品。

## 【請求項 6】

R 1 は 2 - チエニルである、請求項 1 から 5 までのいずれか 1 項記載の医薬品。

## 【請求項 7】

前記化合物が、5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 6 - [ プロピル [ 2 - ( 2 - チエニル ) エチル ] アミノ ] - 1 - ナフトールである、請求項 1 から 6 までのいずれか 1 項記載の医薬品。

## 【請求項 8】

前記化合物が純粋な ( S ) - エナンチオマー ( ロチゴチン ) である、請求項 7 記載の医薬品。

## 【請求項 9】

前記うつ病は、単極性うつ病 [ 大うつ病 ] 又は躁うつ障害のうつ相である、請求項 1 から 8 までのいずれか 1 項記載の医薬品。

## 【請求項 10】

前記うつ病は、パーキンソン病に依存しない器質性うつ病である、請求項 1 から 9 までのいずれか 1 項記載の医薬品。

## 【請求項 11】

非経口投与、経皮投与又は粘膜投与のための医薬品が予定されている、請求項 1 から 10 までのいずれか 1 項記載の医薬品。

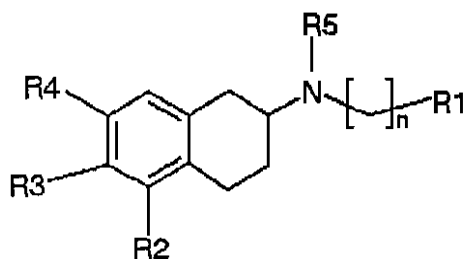
## 【請求項 12】

前記一般式 I の化合物が、一日当たり 0.5 ~ 50 mg の用量で投与される、請求項 1 から 11 までのいずれか 1 項記載の医薬品。

## 【請求項 13】

一般式 I

## 【化 5】

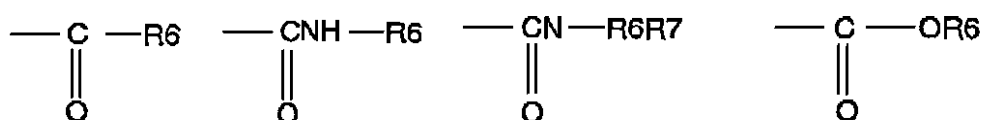


[ 前記式中：

$n = 1 \sim 5$  であり；

$R2 = O A$  であり； $R3$  及び  $R4$  はそのつど相互に独立して  $H$  及び  $O A$  から選択され；  
その際、 $A$  は  $H$ 、 $C1 \sim 3$  アルキル又は以下の基

## 【化 6】

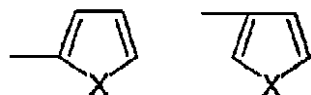


[ 前記式中、 $R6$  及び  $R7$  は相互に独立してアルキル又はアリールである ] から選択され；

$R5$  は  $C1 \sim C3$  アルキルであり；

$R1$  は、

## 【化 7】



[ 前記式中、 $X$  は  $S$ 、 $O$  又は  $NH$  から選択される； ] から選択された基である； ] の、  
ラセミ体として又は純粋な  $(R)$  - エナンチオマー又は  $(S)$  - エナンチオマーとして存在する

化合物並びに前記化合物の生理学的に許容可能な塩の、パーキンソン病に関連しない内因性うつ病又は器質性うつ病の治療のための医薬品の製造のための使用。

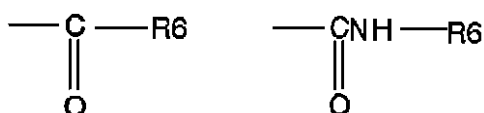
## 【請求項 1 4】

$R3$  及び  $R4$  はそのつど両方ともに水素である、請求項 1 3 記載の使用。

## 【請求項 1 5】

$A$  は水素原子又は以下の基

## 【化 8】



[ 前記式中、 $R6$  は  $C1 \sim C12$  アルキル、フェニル又はメトキシフェニルである ] である、請求項 1 3 又は 1 4 記載の使用。

## 【請求項 1 6】

$n$  は  $1 \sim 3$  の値を有し、かつ  $R5$  は  $C3$  - アルキルである、請求項 1 3 から 1 5 までのいずれか 1 項記載の使用。

## 【請求項 1 7】

$X$  は硫黄原子である、請求項 1 3 から 1 6 までのいずれか 1 項記載の使用。

## 【請求項 18】

R 1 は 2 - チエニルである、請求項 13 から 17 までのいずれか 1 項記載の使用。

## 【請求項 19】

前記化合物が、5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 6 - [プロピル [2 - (2 - チエニル) エチル] アミノ] - 1 - ナフトールである、請求項 13 から 18 までのいずれか 1 項記載の使用。

## 【請求項 20】

前記化合物が純粋な (S) - エナンチオマー (ロチゴチン) である、請求項 19 記載の使用。

## 【請求項 21】

前記うつ病は、単極性うつ病 [大うつ病] 又は躁うつ障害のうつ相である、請求項 13 から 20 までのいずれか 1 項記載の使用。

## 【請求項 22】

前記うつ病は、パーキンソン病に依存しない器質性うつ病である、請求項 13 から 21 までのいずれか 1 項記載の使用。

## 【請求項 23】

非経口投与、経皮投与又は粘膜投与のための医薬品が予定されている、請求項 13 から 22 までのいずれか 1 項記載の使用。

## 【請求項 24】

前記一般式 I の化合物が、一日当たり 0.5 ~ 50 mg の用量で投与される、請求項 13 から 23 までのいずれか 1 項記載の使用。

## 【請求項 25】

請求項 1 から 8 までのいずれか 1 項記載の化合物と、

- 選択的セロトニン再取り込み阻害剤、混合した、セロトニン再取り込み阻害剤、ノルアドレナリン再取り込み阻害剤、選択的ノルアドレナリン再取り込み阻害剤、モノアミンオキシダーゼ阻害剤、アルファ 2 - レセプター及び / 又はセロトニンレセプターの調節剤、アデノシン - アンタゴニスト、シグマ - オピオイドレセプター - リガンド、NK - アンタゴニスト、メラトニン - アゴニスト、又は視床下部 - 下垂体 - 副腎軸の調節剤のグループから選択された抗うつ薬；

- プロメタジン、フルフェナジン、ペルフェナシン、レボメプロマジン、チオリダジン、ペラジン、プロマジン、クロルプロチキセン、ズクロベンチキソール、プロチベンジル、フルペンチキソール、ゾテピン、ベンペリドール、ピパンペロン、メルペロン、ハロペリドール、ブロムペリドール、スルピリド、クロザピン、ピモジド、リスペリドン、クエチアピン、アミスルプリド、オランザピンから選択された抗精神病薬；

- ジフェンヒドラミン、コハク酸ドキシラミン、ニトラゼパム、ミダゾラム、ロルメタゼパム、フルニトラゼパム、フルラゼパム、オキサゼパム、プロマゼパム、トリアゾラム、プロチゾラム、テマゼパム、抱水クロラル、ゾピクロン、ゾルピデム、トリプトファン、ザレブロンから選択された鎮静剤；

- フルスピリレン、チオリダジン、オキサゼパム、アルプラゾラム、プロマゼパム、ロラゼパム、プラゼパム、ジアゼパム、クロバザム、メダゼパム、クロルジアゼポキシド、クロラゼパ酸二カリウム、ノルダゼパム、メプロバメート、ブスピロン、カバイン、ヒドロキシジンから選択された抗不安薬；

又は

- アルモトリブタン、ゾルミトリブタン、アセチルサリチル酸、エルゴタミン、ジヒドロエルゴタミン、メチルセルジド、イブラゾクロム、イブプロフェン、スマトリブタン、リザトリブタン、ナラトリブタン、パラセタモールから選択された偏頭痛薬

のグループからなる更なる作用物質 1 つとを含有する、うつ病の治療のための組み合わせ製剤。