

【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 07 D 333/20 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 K 31/381 (2006.01)

【F I】

C 07 D 333/20

A 61 P 25/24

A 61 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

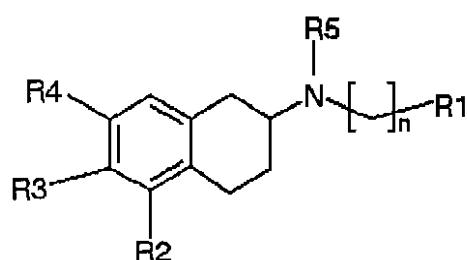
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式I

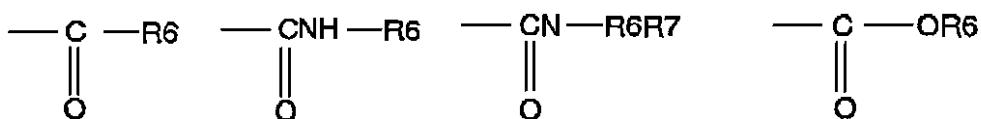
【化1】



【前記式中】

n = 1 ~ 5 であり；R 2 = OA であり； R 3 及び R 4 はそのつど相互に独立して H 及び OA 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。

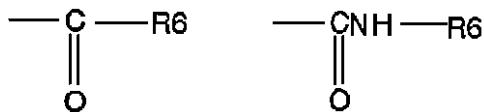
## 【請求項2】

R3及びR4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、R6はC1～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又は2記載の医薬品。

## 【請求項4】

nは1～3の値を有し、かつR5はC3～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】

R1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。

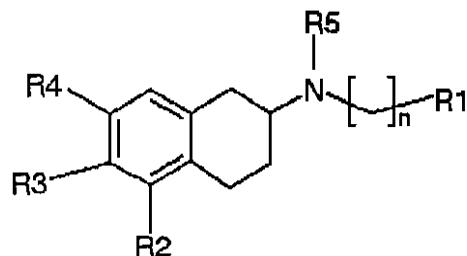
## 【請求項12】

前記一般式Iの化合物が、一日当たり0.5～50mg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】

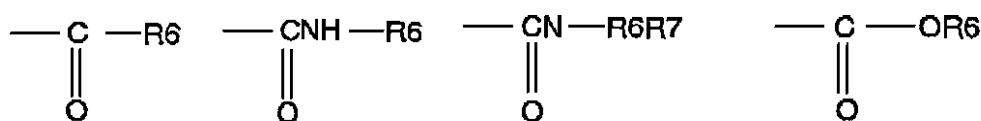


[前記式中：

n = 1 ~ 5 であり；

R2 = OA であり； R3 及び R4 はそのつど相互に独立して H 及び OA から選択され；  
その際、A は H、C1 ~ 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 ~ 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；1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。

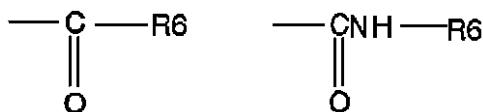
## 【請求項14】

R3 及び R4 はそのつど両方ともに水素である、請求項13記載の使用。

## 【請求項15】

A は水素原子又は以下の基

## 【化8】

[前記式中、R6 は C1 ~ 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13又は14記載の使用。

## 【請求項16】

n は 1 ~ 3 の値を有し、かつ R5 は C3 - アルキルである、請求項13から15までのいずれか 1 項記載の使用。

## 【請求項17】

X は硫黄原子である、請求項13から16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、フルベンチキソール、ゾテビン、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、プロムペリドール、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、アミスルブリド、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、抱水クロラール、ゾピクロン、ゾルピデム、トリプトファン、ザレプ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、クロラゼブ酸ニカリウム、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  
- アルモトリプタン、ゾルミトリプタン、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、イプラゾクロム、イブプロフェン、スマトリプタン、リザトリプタン、ナラトリプタン、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。