

【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22年2月12日 (2010.2.12)

【公表番号】特表2009-520034(P2009-520034A)

【公表日】平成21年5月21日 (2009.5.21)

【年通号数】公開・登録公報2009-020

【出願番号】特願2008-547471(P2008-547471)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/353 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/357 (2006.01)

A 6 1 K 31/36 (2006.01)

C 0 7 D 311/58 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

C 0 7 D 321/10 (2006.01)

C 0 7 D 317/58 (2006.01)

C 0 7 D 319/20 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/353

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/357

A 6 1 K 31/36

C 0 7 D 311/58

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/22

C 0 7 D 321/10

C 0 7 D 317/58

C 0 7 D 319/20

【手続補正書】

【提出日】平成21年12月16日 (2009.12.16)

【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

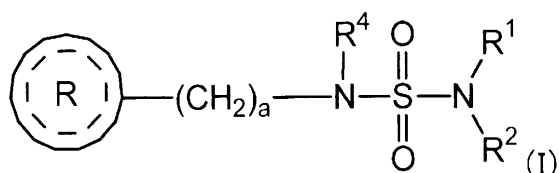
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

鬱病を治療するための製薬学的製剤の製造における、下記式 (I) で表される化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩の使用方法：

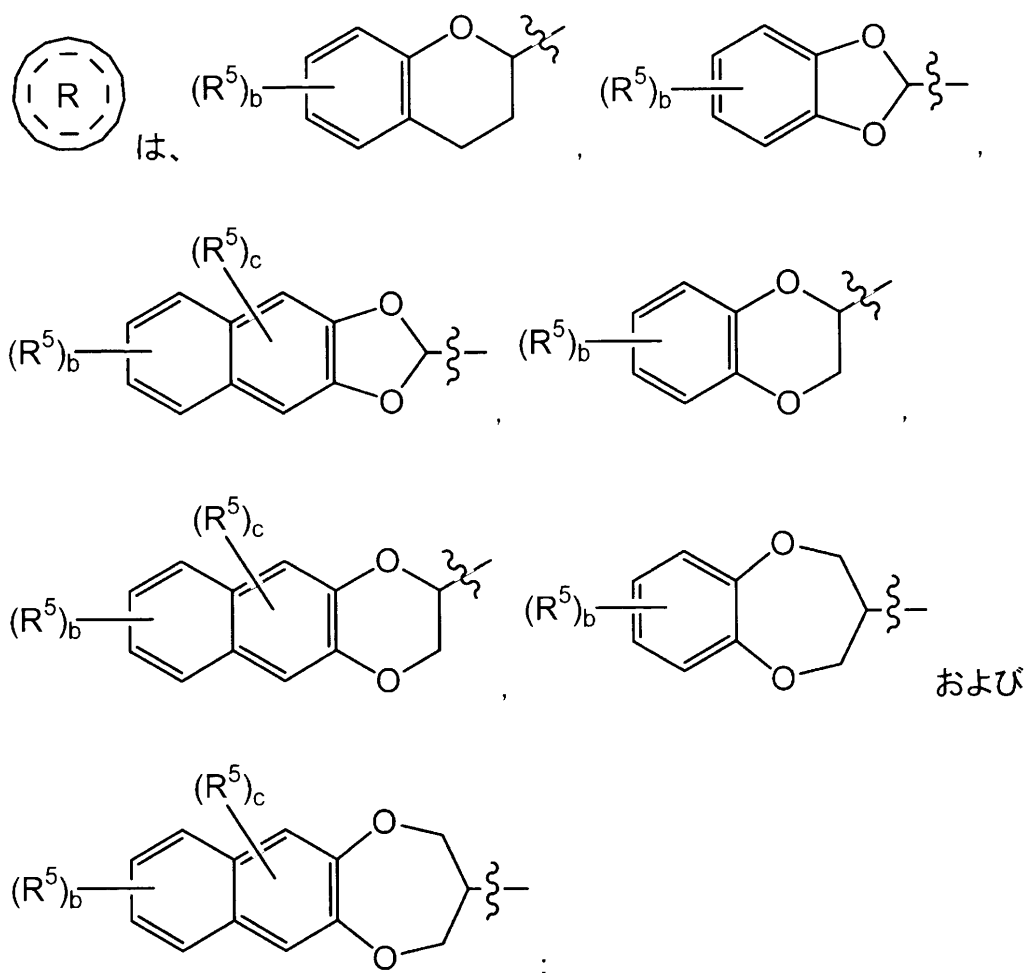
【化 1】



式中、

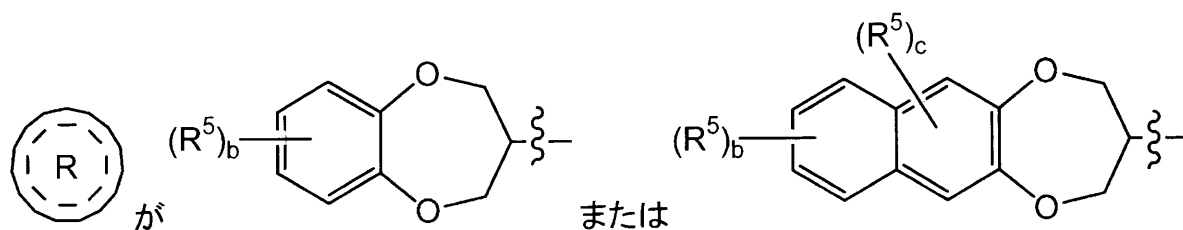
R^1 および R^2 は、各々独立して、水素および低級アルキルから成る群から選択され；
 R^4 は、水素および低級アルキルから成る群から選択され；
 a は、1から2の整数であり；

【化2】



から成る群から選択され、ここで、
 b は0から4の整数であり；そして c は0から2の整数であり；
 各 R^5 は、独立して、ハロゲン、低級アルキルおよびニトロから成る群から選択されるが；但し

【化3】

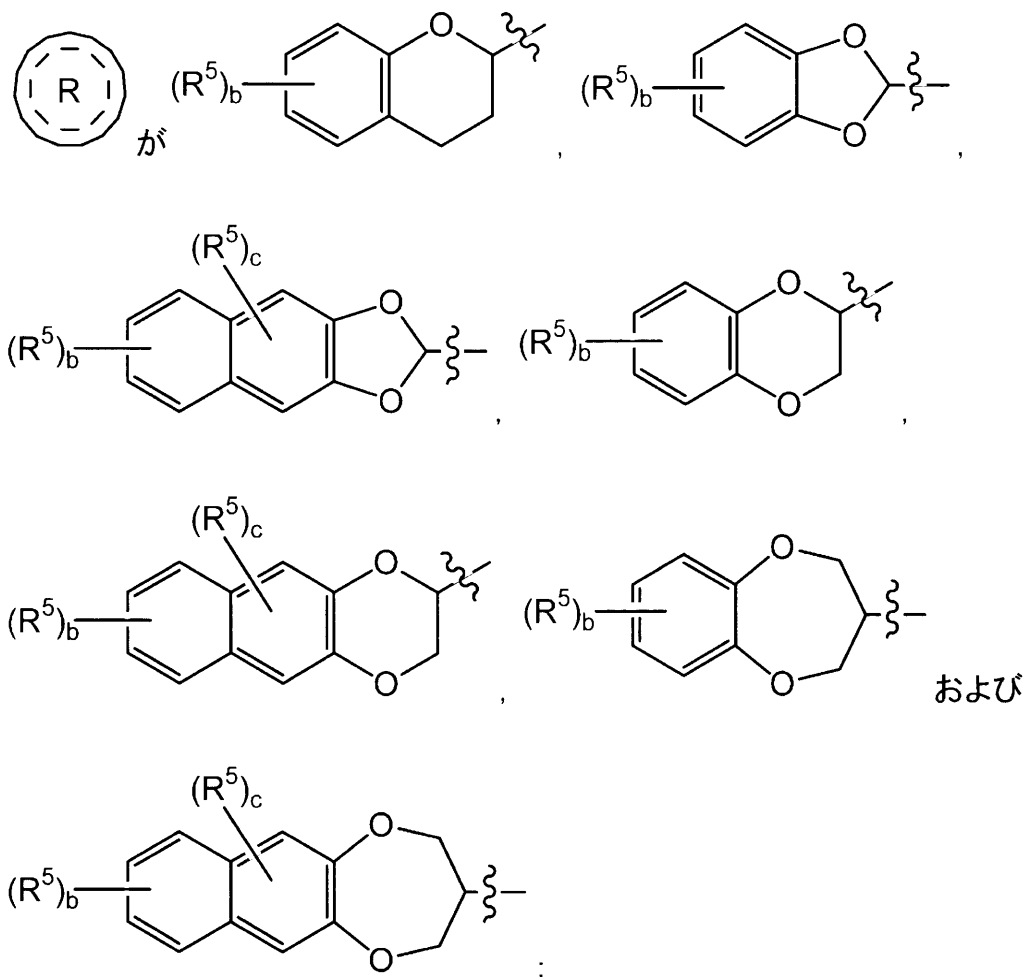


の時には a が1であることを条件とする。

【請求項2】

式(I)で表される化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩において、 R^1 および R^2 が各々独立して水素および低級アルキルから成る群から選択され；
 R^4 が水素および低級アルキルから成る群から選択され；
 a が1から2の整数であり；

【化 4】

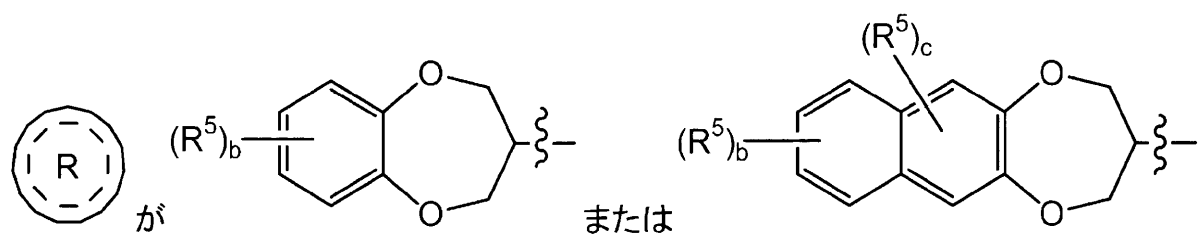


から成る群から選択され、ここで、

b が 0 から 2 の整数であり；そして c が 0 から 1 の整数であり；

各 R^5 が独立してハロゲン，低級アルキルおよびニトロから成る群から選択されるが；但し

【化 5】



の時には a が 1 であることを条件とする；

請求項 1 記載の方法。

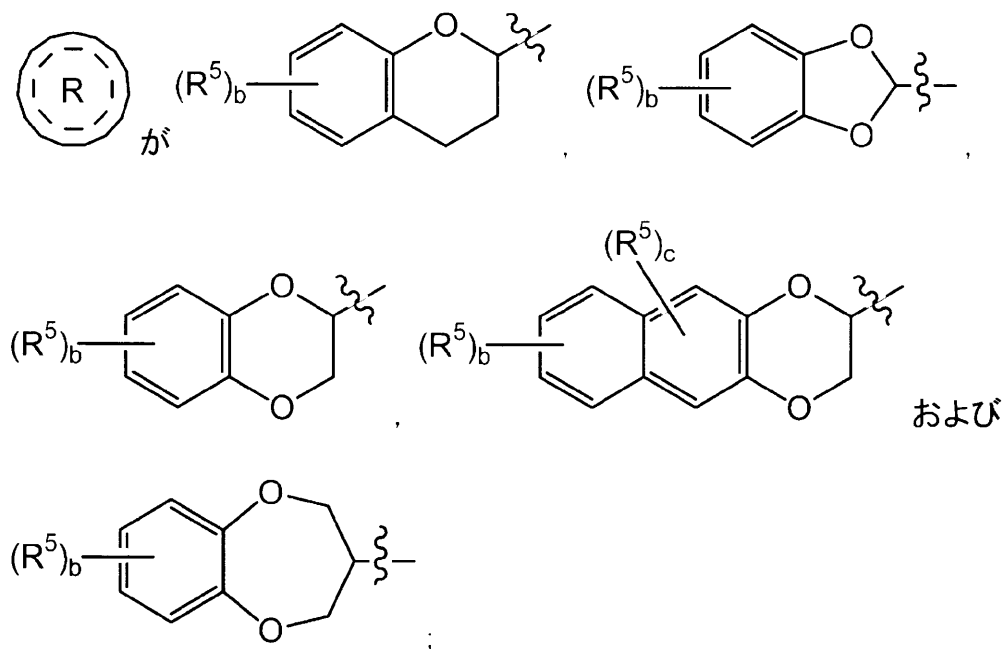
【請求項 3】

式 (I) で表される化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩において、 R^1 および R^2 が各々独立して水素および低級アルキルから成る群から選択され；

R^4 が水素および低級アルキルから成る群から選択され；

a が 1 から 2 の整数であり；

【化 6】

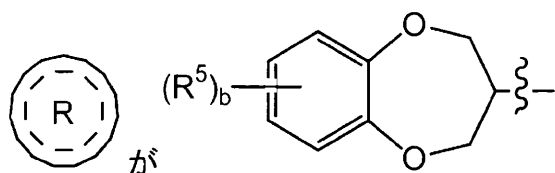


から成る群から選択され、ここで、

b が 0 から 2 の整数であり；そして c が 0 であり；

各 R^5 が独立してハロゲン，低級アルキルおよびニトロから成る群から選択されるが；但し

【化 7】



の時には a が 1 であることを条件とする；

請求項 2 記載の方法。

【請求項 4】

式 (I) で表される化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩において、 R^1 および R^2 が各々独立して水素および低級アルキルから成る群から選択され； R^4 が水素およびメチルから成る群から選択され；

a が 1 から 2 の整数であり；

【化 8】



が 2 - (2, 3-ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシニル)，2 - (ベンゾ [1, 3] ジオキシソリル)，2 - (3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ [1, 4] ジオキセピニル)，2 - (2, 3-ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシニル)，2 - (6-クロロ-2, 3-ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシニル)，2 - (6-フルオロ-2, 3-ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシニル)，2 - (クロマニル)，2 - (5-フルオロ-2, 3-ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシニル)，2 - (7-クロロ-2, 3-ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシニル)，2 - (6-クロロベンゾ [1, 3] ジオキシソリル)，2 - (7-ニトロ-2, 3-ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシニル)，2 - (7-

メチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ [1, 4] ジオキシニル), 2-(5-クロロ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ [1, 4] ジオキシニル), 2-(6-ブロモ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ [1, 4] ジオキシニル), 2-(6, 7-ジクロロ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ [1, 4] ジオキシニル), 2-(8-クロロ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ [1, 4] ジオキシニル), 2-(2, 3-ジヒドロ-ナフト [2, 3-b] [1, 4] ジオキシニル) および 2-(4-メチル-ベンゾ [1, 3] ジオキシソリル) から成る群から選択されるが、但し

【化 9】



が 2-(3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ [1, 4] ジオキセピニル) の時には a が 1 であることを条件とする；

請求項 3 記載の方法。

【請求項 5】

式 (I) で表される化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩において、 R^1 および R^2 が各々独立して水素およびメチルから成る群から選択され；

R^4 が水素およびメチルから成る群から選択され；

a が 1 から 2 の整数であり；

【化 10】



が 2-(ベンゾ [1, 3] ジオキシソリル), 2-(2, 3-ジヒドロ-ベンゾ [1, 4] ジオキシニル), 2-(2, 3-ジヒドロ-ベンゾ [1, 4] ジオキシニル), 2-(6-クロロ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ [1, 4] ジオキシニル), 2-(7-クロロ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ [1, 4] ジオキシニル), 2-(7-メチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ [1, 4] ジオキシニル), 2-(6-ブロモ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ [1, 4] ジオキシニル) および 2-(6, 7-ジクロロ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ [1, 4] ジオキシニル) から成る群から選択される；

請求項 4 記載の方法。

【請求項 6】

前記式 (I) で表される化合物を (2S) - (1) - N-(6-クロロ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ [1, 4] ジオキシニル-2-イルメチル) -スルファミドおよびこれの製薬学的に受け入れられる塩から成る群から選択する請求項 1 記載の方法。

【請求項 7】

前記鬱病が大鬱病性障害、単極性鬱病、治療不応性鬱病、難治性鬱病、不安抑鬱および気分変調から成る群から選択される請求項 1 記載の方法。

【請求項 8】

前記鬱病が大鬱病性障害、単極性鬱病、治療不応性鬱病、難治性鬱病および不安抑鬱から成る群から選択される請求項 1 記載の方法。

【請求項 9】

前記鬱病が大鬱病性障害、単極性鬱病、治療不応性鬱病、難治性鬱病および不安抑鬱から成る群から選択される請求項 1 記載の方法。

【請求項 10】

前記鬱病が大鬱病性障害である請求項 1 記載の方法。

【請求項 11】

鬱病を治療するための製薬学的製剤の製造における、(2S) - (-) - N - (6 - クロロ - 2, 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1, 4] ジオキシシン - 2 - イルメチル) - スルファミドおよびこれの製薬学的に受け入れられる塩から成る群から選択した化合物の使用方法。

【請求項 1 2】

前記鬱病が大鬱病性障害、単極性鬱病、治療不応性鬱病、難治性鬱病、不安抑鬱および気分変調から成る群から選択される請求項 1 1 記載の方法。

【請求項 1 3】

前記鬱病が単極性鬱病、治療不応性鬱病、難治性鬱病および不安抑鬱から成る群から選択される請求項 1 1 記載の方法。

【請求項 1 4】

前記鬱病が大鬱病性障害、単極性鬱病、治療不応性鬱病、難治性鬱病および不安抑鬱から成る群から選択される請求項 1 1 記載の方法。

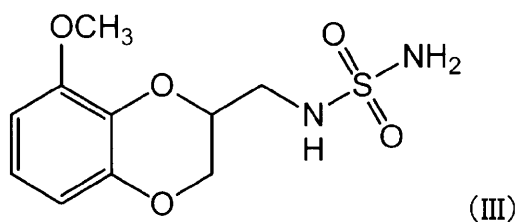
【請求項 1 5】

前記鬱病が大鬱病性障害である請求項 1 1 記載の方法。

【請求項 1 6】

鬱病を治療するための製薬学的製剤の製造における、式 (I I I)

【化 1 1】



で表される化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩の使用方法。

【請求項 1 7】

前記鬱病が大鬱病性障害、単極性鬱病、治療不応性鬱病、難治性鬱病および不安抑鬱から成る群から選択される請求項 1 6 記載の方法。

【請求項 1 8】

前記鬱病が大鬱病性障害、単極性鬱病、治療不応性鬱病、難治性鬱病および不安抑鬱から成る群から選択される請求項 1 6 記載の方法。

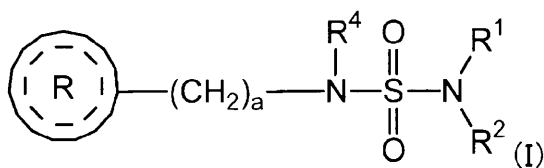
【請求項 1 9】

前記鬱病が大鬱病性障害である請求項 1 6 記載の方法。

【請求項 2 0】

少なくとも 1 種の抗鬱薬との共治療を施すことにより鬱病を治療するための製薬学的製剤の製造における、下記式 (I) で表される化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩の使用方法：

【化 1 2】



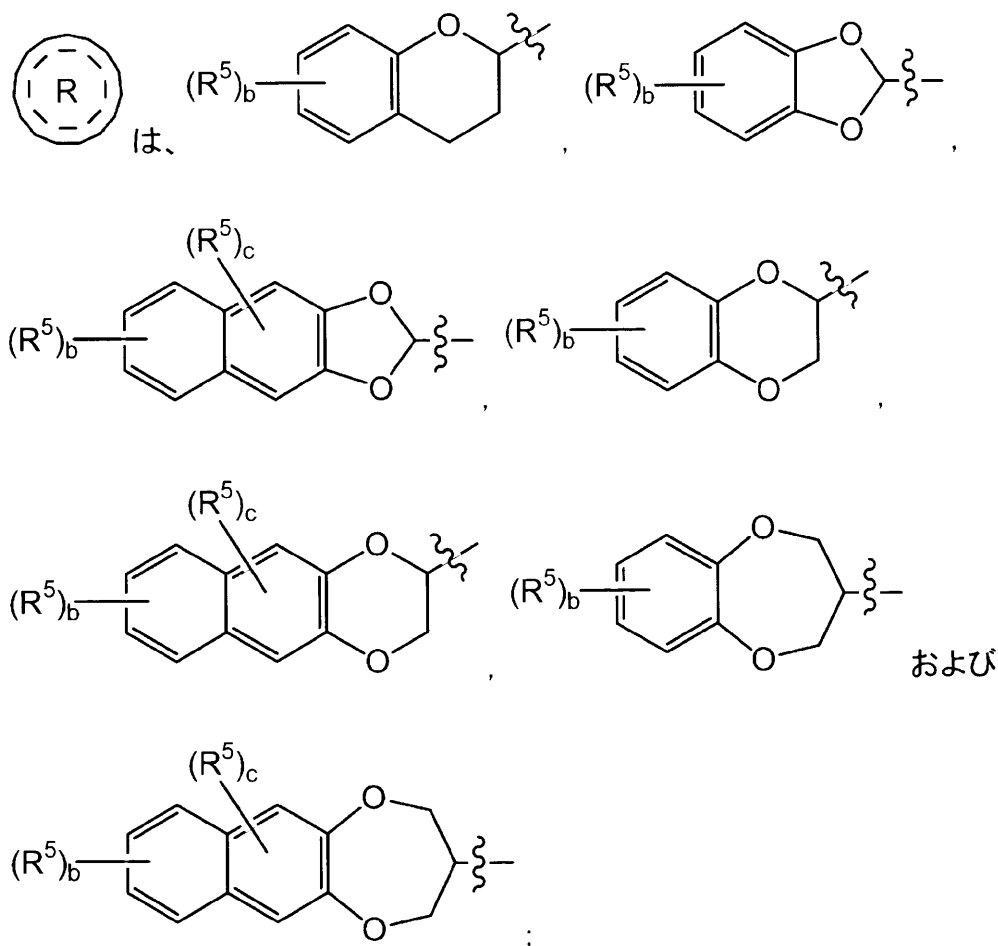
式中、

R^1 および R^2 は、各々独立して、水素および低級アルキルから成る群から選択され；

R^4 は、水素および低級アルキルから成る群から選択され；

a は、1 から 2 の整数であり；

【化 1 3】

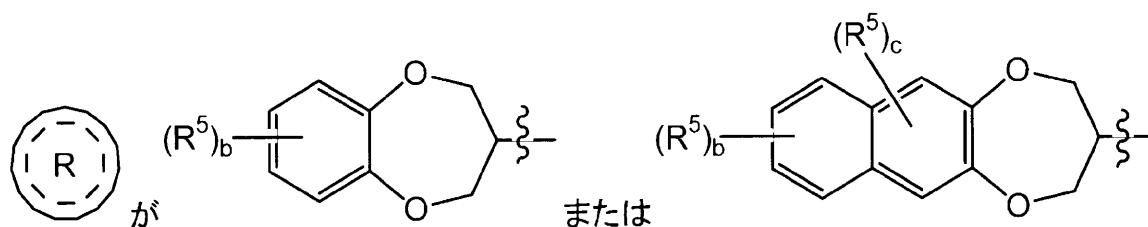


から成る群から選択され、ここで、

b は 0 から 4 の整数であり；そして c は 0 から 2 の整数であり；

各 R^5 は、独立して、ハロゲン，低級アルキルおよびニトロから成る群から選択されるが；但し

【化 1 4】



の時には a が 1 であることを条件とする。

【請求項 2 1】

前記式 (I) で表される化合物を (2S) - (−) - N - (6 - クロロ - 2, 3 - ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシシン - 2 - イルメチル) - スルファミドおよびこれの製薬学的に受け入れられる塩から成る群から選択する請求項 2 0 記載の方法。

【請求項 2 2】

前記抗鬱薬をイミプラミン，アミトリプチリン，デシプラミン，ノルトリプチリン，ドキシペリン，プロトリプチリン，トリミプラミン，マプロチリン，アモキサピン，トラゾドン，ブプロピオン，クロミプラミン，フルオキセチン，デュロキセチン，エシタロプラム，シタロプラム，セルトラリン，パロキセチン，フルボキサミン，ネファザドン，ベンラ

ファクシン、ミルナシبران、レボキセチン、ミルタザピン、フェネルジン、トラニルシプロミン、モクロベミド、カバカバ、セントジョンズワート、 α -アデノシルメチオニン、甲状腺刺激ホルモン放出ホルモン、ニューロキニン受容体拮抗薬およびトリヨードチロニンから成る群から選択する請求項 20 記載の方法。

【請求項 23】

前記抗鬱薬をモノアミンオキシダーゼ阻害剤、三環系薬、セロトニン再摂取阻害剤、ノルアドレナリン作動性セロトニン再摂取阻害剤；ノルアドレナリン作動性・特異的セロトニン作動性薬および非定型抗鬱薬から成る群から選択する請求項 20 記載の方法。

【請求項 24】

前記抗鬱薬をフェネルジン、トラニルシプロミン、モクロベミド、イミプラミン、アミトリプチリン、デシプラミン、ノルトリプチリン、ドキセピン、プロトリプチリン、トリミプラミン、クロミプラミン、アモキサピン、フルオキセチン、セルトラリン、パロキセチン、シタロプラム、フルボキサミン、ベンラファクシン、ミルナシبران、ミルタザピンおよびブプロピオンから成る群から選択する請求項 20 記載の方法。

【請求項 25】

前記抗鬱薬を神経ペプチド、神経ペプチド受容体を標的にする化合物およびホルモンから成る群から選択する請求項 20 記載の方法。

【請求項 26】

少なくとも 1 種の抗鬱薬との共治療を施すことにより鬱病を治療するための製薬学的製剤の製造における、 (2S) - (1) - N - (6-クロロ-2, 3-ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシン-2-イルメチル) -スルファミドおよびこれの製薬学的に受け入れられる塩から成る群から選択した化合物の使用方法。

【請求項 27】

前記抗鬱薬をイミプラミン、アミトリプチリン、デシプラミン、ノルトリプチリン、ドキセピン、プロトリプチリン、トリミプラミン、マプロチリン、アモキサピン、トラゾドン、ブプロピオン、クロミプラミン、フルオキセチン、デュロキセチン、エシタロプラム、シタロプラム、セルトラリン、パロキセチン、フルボキサミン、ネファザドン、ベンラファクシン、ミルナシبران、レボキセチン、ミルタザピン、フェネルジン、トラニルシプロミン、モクロベミド、カバカバ、セントジョンズワート、 α -アデノシルメチオニン、甲状腺刺激ホルモン放出ホルモン、ニューロキニン受容体拮抗薬およびトリヨードチロニンから成る群から選択する請求項 26 記載の方法。

【請求項 28】

前記抗鬱薬をモノアミンオキシダーゼ阻害剤、三環系薬、セロトニン再摂取阻害剤、ノルアドレナリン作動性セロトニン再摂取阻害剤；ノルアドレナリン作動性・特異的セロトニン作動性薬および非定型抗鬱薬から成る群から選択する請求項 26 記載の方法。

【請求項 29】

前記抗鬱薬をフェネルジン、トラニルシプロミン、モクロベミド、イミプラミン、アミトリプチリン、デシプラミン、ノルトリプチリン、ドキセピン、プロトリプチリン、トリミプラミン、クロミプラミン、アモキサピン、フルオキセチン、セルトラリン、パロキセチン、シタロプラム、フルボキサミン、ベンラファクシン、ミルナシبران、ミルタザピンおよびブプロピオンから成る群から選択する請求項 26 記載の方法。

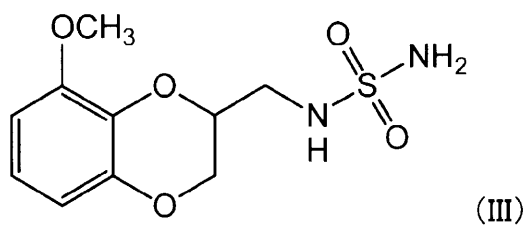
【請求項 30】

前記抗鬱薬を神経ペプチド、神経ペプチド受容体を標的にする化合物およびホルモンから成る群から選択する請求項 26 記載の方法。

【請求項 31】

少なくとも 1 種の抗鬱薬との共治療を施すことにより鬱病を治療するための製薬学的製剤の製造における、式 (I I I)

【化 1 5】



で表される化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩の使用方法。