

【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】令和 2 年 5 月 28 日 (2020.5.28)

【公表番号】特表 2019-525900 (P2019-525900A)

【公表日】令和 1 年 9 月 12 日 (2019.9.12)

【年通号数】公開・登録公報 2019-037

【出願番号】特願 2018-565312 (P2018-565312)

【国際特許分類】

C 0 7 D 295/096 (2006.01)

C 0 7 D 317/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 K 31/495 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

C 0 7 C 53/126 (2006.01)

C 0 7 C 65/05 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 295/096 C S P

C 0 7 D 317/24

A 6 1 P 25/24

A 6 1 K 31/495

A 6 1 K 31/496

C 0 7 C 53/126

C 0 7 C 65/05

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 4 月 10 日 (2020.4.10)

【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

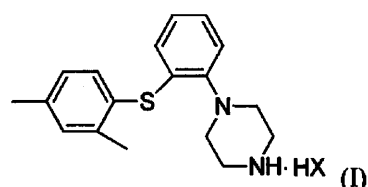
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



の化合物。

式中、H X は C₁₀ - C₂₀ 脂肪酸又はパモ酸である。

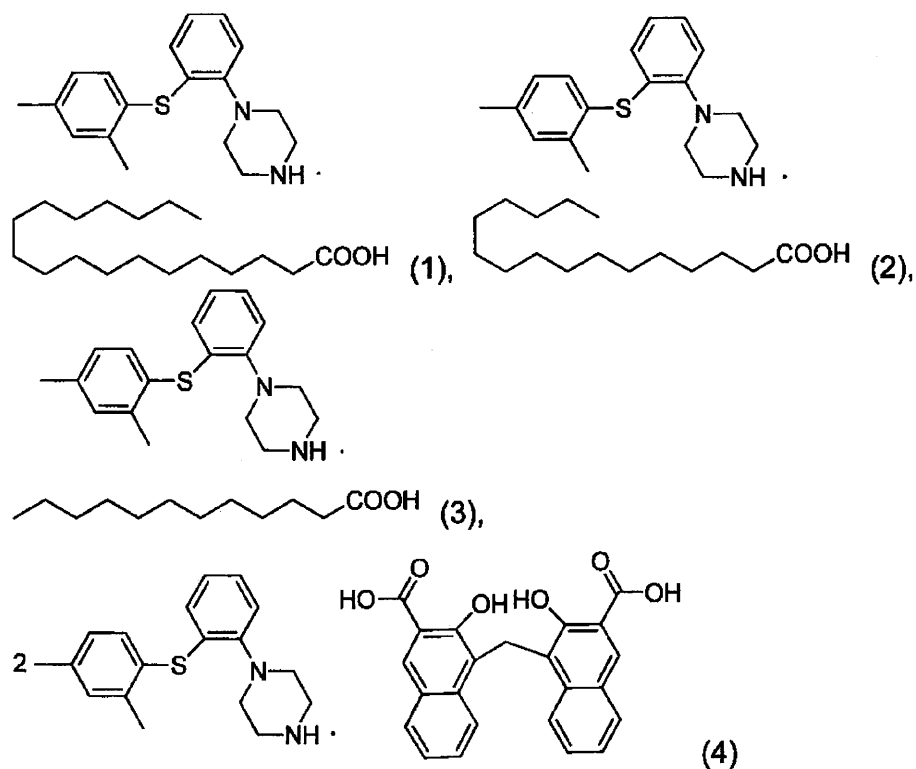
【請求項 2】

H X は、ステアリン酸、パルミチン酸、ラウリン酸又はパモ酸である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

以下の構造のうちの少なくとも一つを有する請求項 1 に記載の化合物。

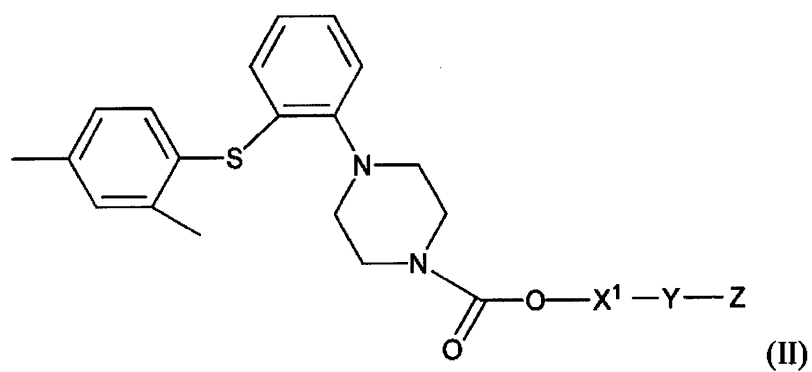
【化 2】



【請求項 4】

式 (II) の化合物、又はその立体異性体、互変異性体、溶媒和物、若しくは薬学的に許容され得る塩。

【化 3】

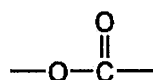


式中、

X^1 は、結合又は $-(CH_2)_n-$ であり；

Y は、結合又は

【化 4】



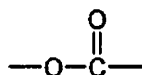
であり；

Y が結合であるとき、Z は C_{2-10} アルキル、 C_{5-10} ヘテロアリール、 C_{5-10}

C_{10} ヘテロシクリルであり、ここで、任意に C_{2-10} アルキル、 C_{5-10} ヘテロアリー
ル及び C_{5-10} ヘテロシクリルのそれぞれは、独立に、一つ又はそれ以上の R で置換さ
れていてもよく；

Y が

【化 5】



であるとき、

Z は C_{1-20} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{5-10} ヘテロアリール、 C_{5-10} ヘテロシクリルであり、ここで、任意に C_{1-20} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{5-10} ヘテロアリール及び C_{5-10} ヘテロシクリルのそれぞれは、独立に、一つ又はそれ以上の R で置換されていてもよく；

n は 1、2、3、4 又は 5 であり；

各 R は、独立に、F、Cl、Br、I、アミノ、ヒドロキシ又は C_{1-6} アルキルであり；

ただし、 X_1 が結合であり、Y が結合であるとき、Z は tert - ブチルではない。

【請求項 5】

Y が結合であるとき、Z はエチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、sec - ブチル、n - ペンチル、2 - ペンチル、3 - ペンチル、 C_{5-8} ヘテロアリール、 C_{5-8} ヘテロシクリルであり、ここで、任意にエチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、sec - ブチル、n - ペンチル、2 - ペンチル、3 - ペンチル、 C_{5-8} ヘテロアリール及び C_{5-8} ヘテロシクリルのそれぞれは、独立に、一つ又はそれ以上の R 基で置換されていてもよく；

n は 1、2 又は 3 であり；

各 R は、独立に、F、Cl、Br、I、アミノ、ヒドロキシ又は C_{1-3} アルキルである請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

Y が結合であるとき、Z は C_{2-5} 直鎖アルキル、 C_{5-7} ヘテロアリール、 C_{5-7} ヘテロシクリルであり、ここで、任意に C_{2-5} 直鎖アルキル、 C_{5-7} ヘテロアリール及び C_{5-7} ヘテロシクリルのそれぞれは、独立に、一つ又はそれ以上の R で置換されていてもよく；

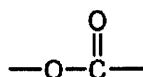
n は 1、2 又は 3 であり；

各 R は、独立に、F、Cl、Br、I、アミノ、ヒドロキシ又は C_{1-3} アルキルである請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 7】

Y が

【化 6】



であるとき、Z は C_{1-20} アルキル、フェニル、 C_{6-8} アリール、 C_{5-8} ヘテロアリール、 C_{5-8} ヘテロシクリルであり、ここで、任意に C_{1-20} アルキル、フェニル、 C_{6-8} アリール、 C_{5-8} ヘテロアリール及び C_{5-8} ヘテロシクリルのそれぞれは、独立に、一つ又はそれ以上の R で置換されていてもよく；

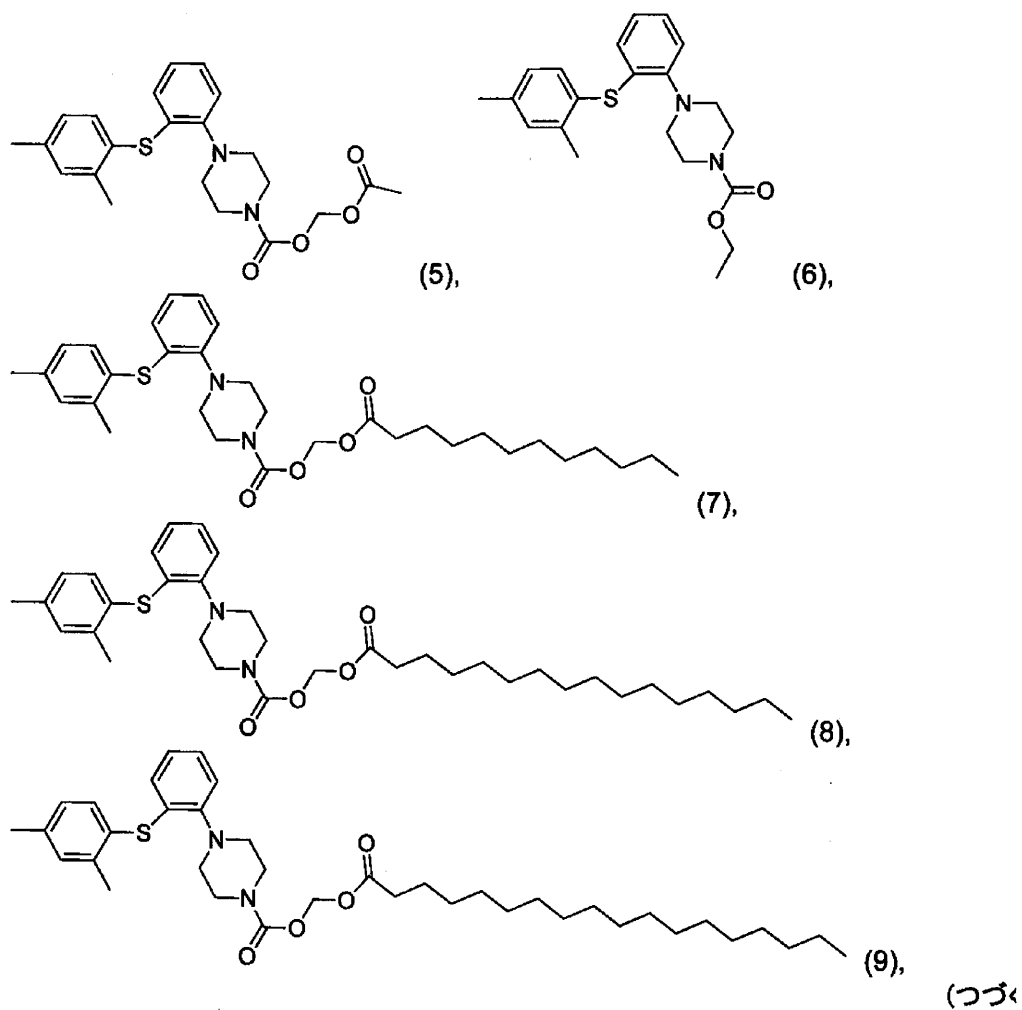
n は 1、2 又は 3 であり；

各 R は、独立に、F、Cl、Br、I、アミノ、ヒドロキシ又は C₁ - ₃ アルキルである請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 8】

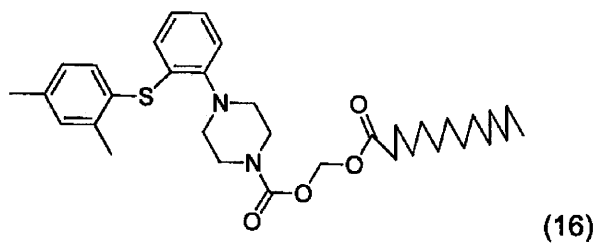
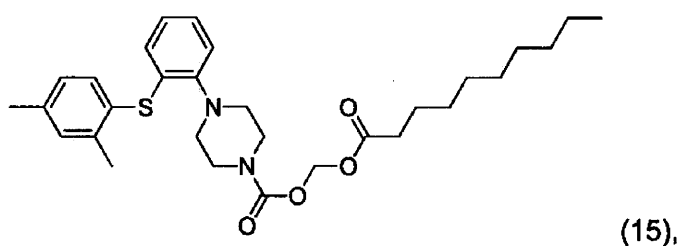
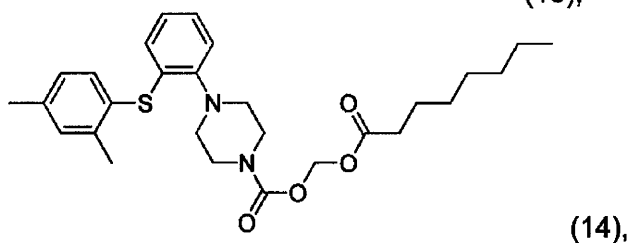
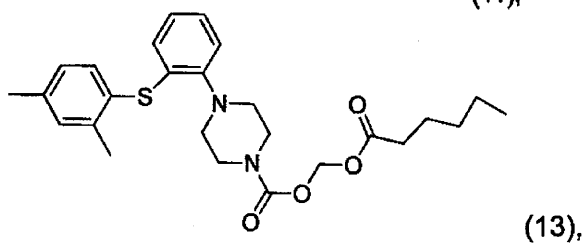
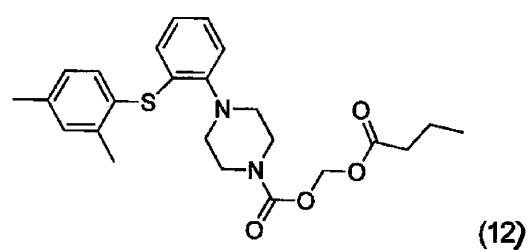
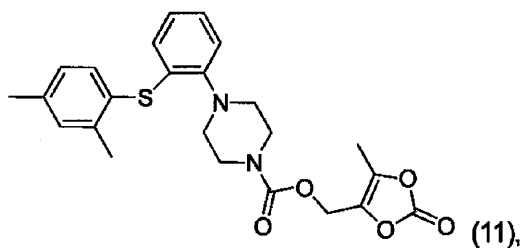
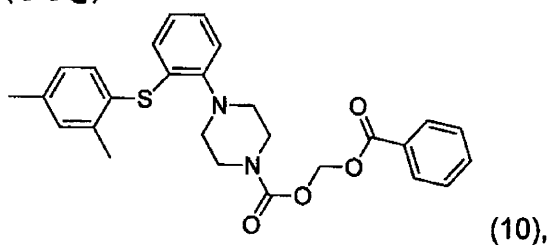
以下の構造のうちの一つを有する請求項 4 に記載の化合物、又はその立体異性体、互変異性体、溶媒和物、若しくは薬学的に許容され得る塩。

【化 7 - 1】



【化 7 - 2】

(つづき)



【請求項 9】

(1) 式 (a) の化合物と式 (b) の化合物とを接触させて式 (c) の化合物を得ること；

(2) 式 (c) の化合物と式 (d) の化合物とを接触させて式 (III) の化合物を得ること；

を含む、請求項 4 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を調製する方法。

式中、

X^1 は、結合又は $-(CH_2)_n-$ であり；

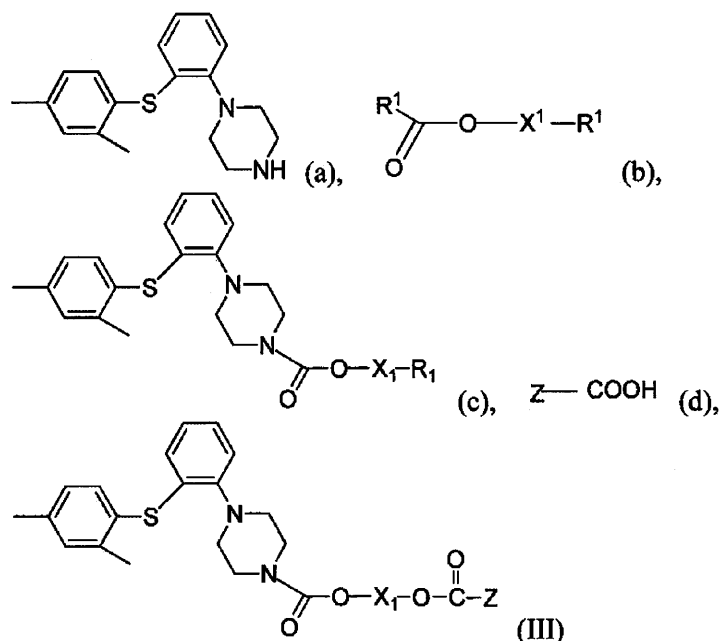
各 R^1 は、独立に、F、Cl、Br 又は I であり；

Z は、 C_{1-20} アルキル、 C_{6-10} ヘテロアリール、 C_{5-10} アリール、 C_{5-10} ヘテロシクリルであり、ここで、任意に C_{1-20} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{5-10} ヘテロアリール及び C_{5-10} ヘテロシクリルのそれぞれは、独立に、一つ又はそれ以上の R で置換されていてもよく；

n は 1、2、3、4 又は 5 であり；

各 R は独立に F、Cl、Br、I、アミノ、ヒドロキシ又は C_{1-6} アルキルである。

【化 8】



【請求項 10】

Z は、 C_{1-20} アルキル、フェニル、 C_{6-8} アリール、 C_{5-8} ヘテロアリール、 C_{5-8} ヘテロシクリルであり、ここで、任意に C_{1-20} アルキル、フェニル、 C_{6-8} アリール、 C_{5-8} ヘテロアリール及び C_{5-8} ヘテロシクリルのそれぞれは、独立に、一つ又はそれ以上の R で置換されていてもよく；

n は 1、2 又は 3 であり；

各 R は、独立に、F、Cl、Br、I、アミノ、ヒドロキシ又は C_{1-3} アルキルである請求項 9 に記載の方法。

【請求項 11】

請求項 1～3 のいずれか 1 項に記載の化合物、請求項 4～8 のいずれか 1 項に記載の化合物、又は請求項 9 若しくは 10 に記載の方法によって調製された化合物を含む医薬組成物。

【請求項 12】

薬学的に許容され得る担体、賦形剤、希釈剤、アジュバント又はビヒクルのうちの少なくとも一つをさらに含む請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

追加の治療剤をさらに含み、前記追加の治療剤は抑うつ障害を治療するために用いられる請求項 11 又は 12 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

医薬品の製造における、請求項 1～3 のいずれか 1 項に記載の化合物、請求項 4～8 のいずれか 1 項に記載の化合物、請求項 9 若しくは 10 に記載の方法によって調製された化合物、又は請求項 11～13 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物の使用であって、前記医薬品は罹患体の抑うつ障害を治療するために用いられる該使用。

【請求項 15】

罹患体の抑うつ障害の治療のための、請求項 11～13 のいずれか 1 項に記載の医薬組

成物。