

【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 1 年 11 月 21 日 (2019.11.21)

【公表番号】特表 2018-536637 (P2018-536637A)

【公表日】平成 30 年 12 月 13 日 (2018.12.13)

【年通号数】公開・登録公報 2018-048

【出願番号】特願 2018-519321 (P2018-519321)

【国際特許分類】

C 07D 401/12 (2006.01)

A 61P 25/24 (2006.01)

A 61P 25/28 (2006.01)

A 61P 25/04 (2006.01)

A 61P 25/16 (2006.01)

A 61P 43/00 (2006.01)

A 61K 31/506 (2006.01)

C 07D 403/12 (2006.01)

A 61K 31/551 (2006.01)

A 61K 31/4439 (2006.01)

C 07D 487/08 (2006.01)

A 61K 31/496 (2006.01)

C 07D 401/14 (2006.01)

A 61K 31/675 (2006.01)

C 07F 9/6558 (2006.01)

【FI】

C 07D 401/12 C S P

A 61P 25/24

A 61P 25/28

A 61P 25/04

A 61P 25/16

A 61P 43/00 1 1 1

A 61K 31/506

C 07D 403/12

A 61K 31/551

A 61K 31/4439

C 07D 487/08

A 61K 31/496

C 07D 401/14

A 61K 31/675

C 07F 9/6558

【手続補正書】

【提出日】令和 1 年 10 月 10 日 (2019.10.10)

【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

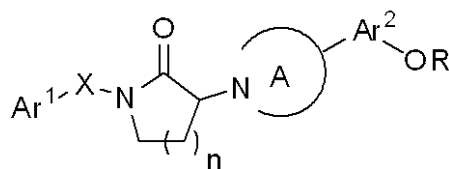
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :
【化 1】



I

【式中、

Ar¹ は、フェニルであって、シアノ、ハロ、アルキル、ハロアルキルおよびハロアルコキシから選択される 0 ~ 3 つの置換基で置換されており；

Ar² は、ピリジニルまたはピリミジニルであって、1 つの OR 置換基および 0 ~ 2 つのハロまたはアルキル置換基により置換されており；

R は、水素であるか、またはアルキルエステル、アミノ酸エステル、アルコキシエステル、ホスホン酸、ホスホン酸アルキルエステル、アルコキシホスホネート、アルコキシホスホネートアルキルエステル、アルキルカルバメート、アミノ酸カルバメート、アルキルホスホロアミデート、アリールホスホロアミデートおよびスルファメートからなる群から選択されるプロドラッグ部分であり；

X は、結合であるか、または C₁ - C₃ アルキレンであり；

n は、1 または 2 であり

環 A は、ピペラジニル、ホモピペラジニル、2,5 - ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプタンまたはピペラジン - 2 - オンであって、ハロ、アルキル、ヒドロキシまたはアルコキシから選択される 0 ~ 4 つの置換基で置換されている]

の化合物あるいはその医薬的に許容される塩。

【請求項 2】

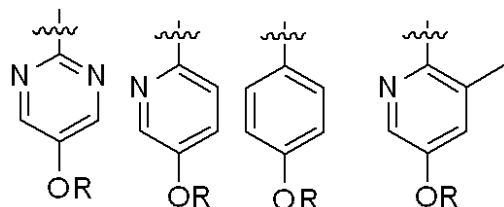
n が 1 であり、環 A が 0 ~ 2 つのアルキル置換基により置換されたピペラジニルである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

Ar¹ が、シアノ、ハロ、アルキル、ハロアルキルおよびハロアルコキシから選択される 0 ~ 3 つの置換基で置換されたフェニルである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 4】

Ar² が、



から選択され、

R が、水素、アミノ酸エステル、ホスホン酸、アルコキシホスホネート、アルキルカルバメート、アミノ酸カルバメート、アルキルホスホロアミデート、アリールホスホロアミデートおよびスルファメートから選択される、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 5】

X がメチレンである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 6】

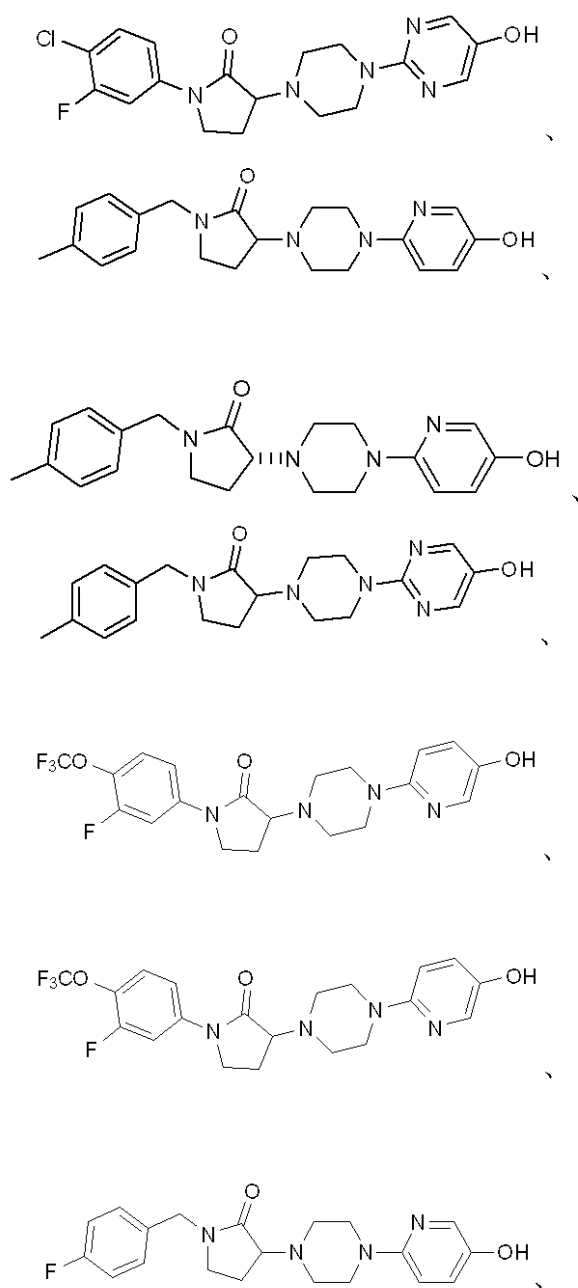
R が水素である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 7】

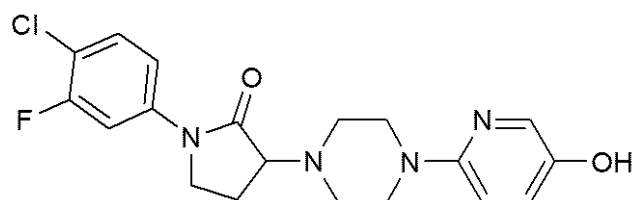
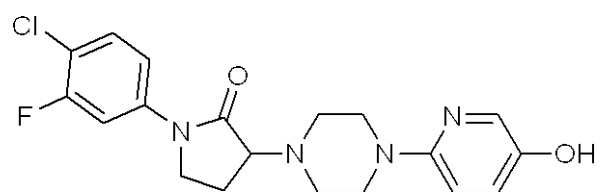
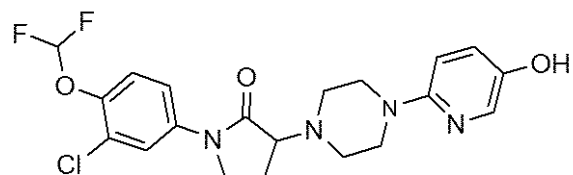
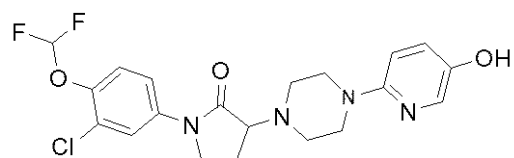
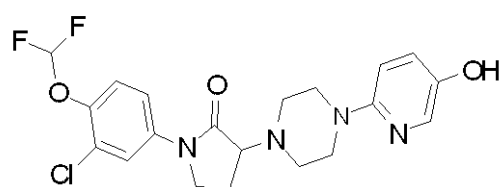
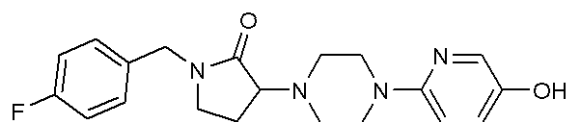
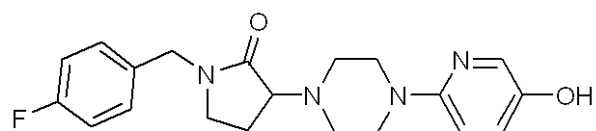
R が P(=O)(OH)₂ である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 8】

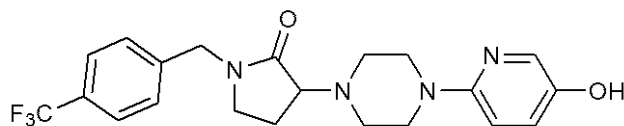
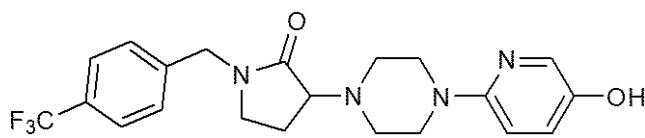
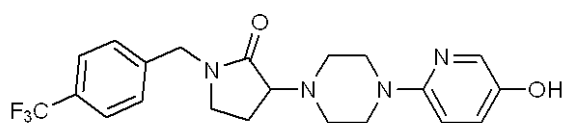
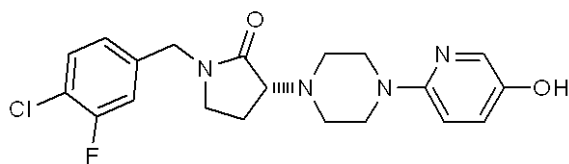
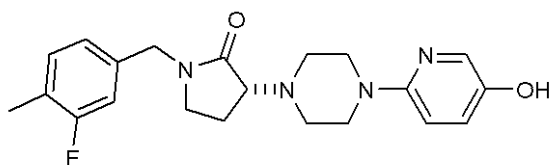
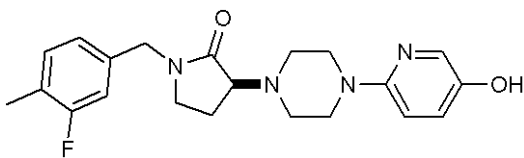
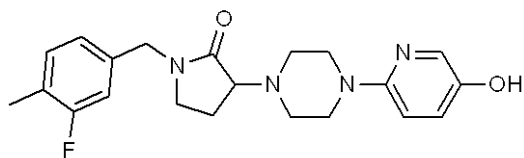
【化 2】



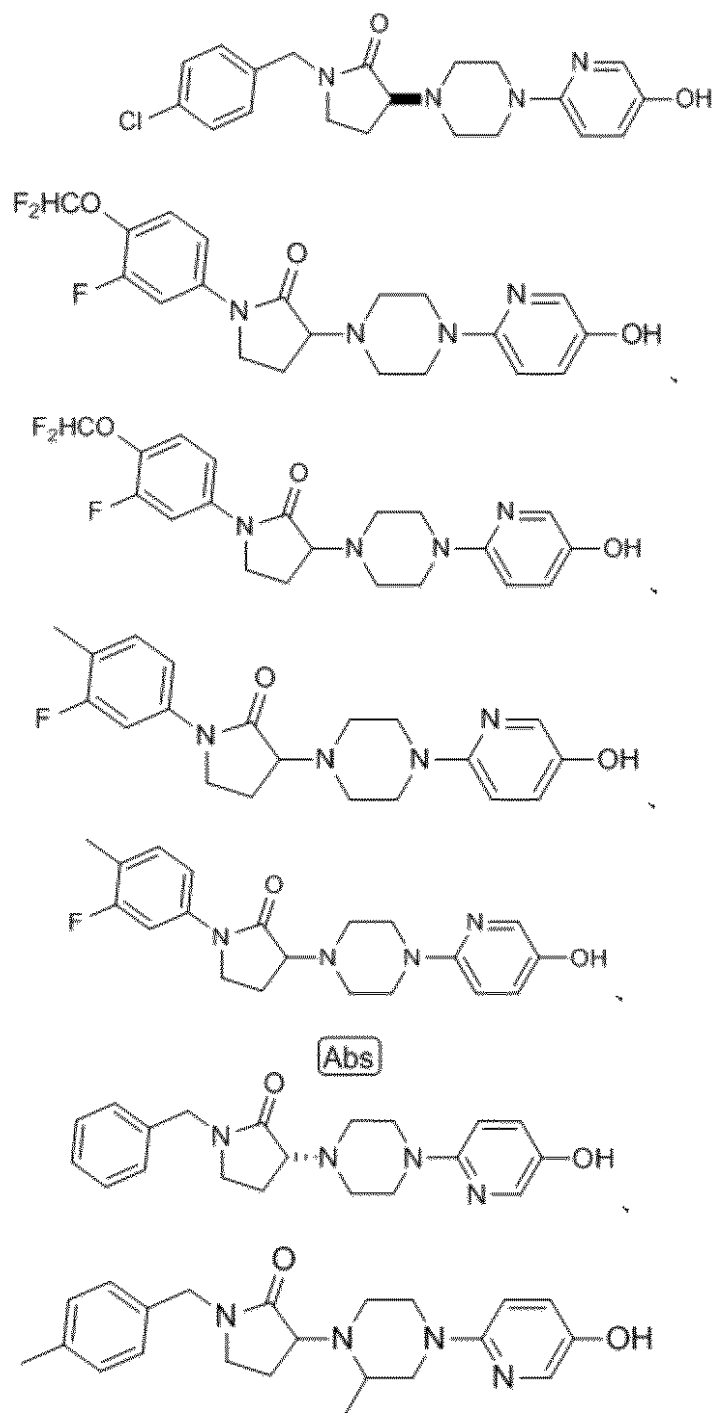
【化 3】



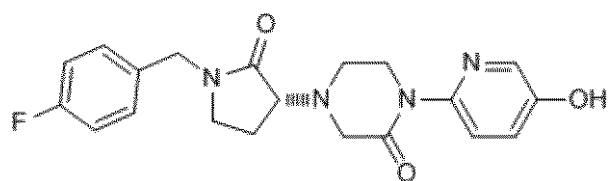
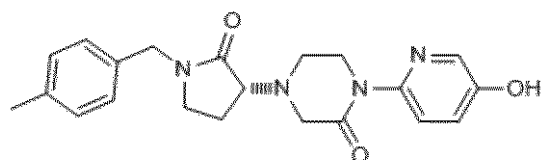
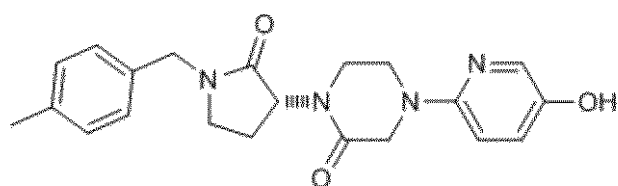
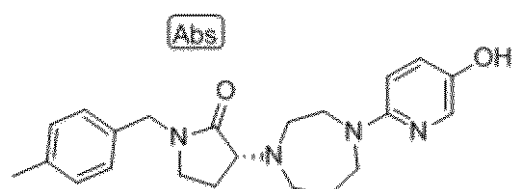
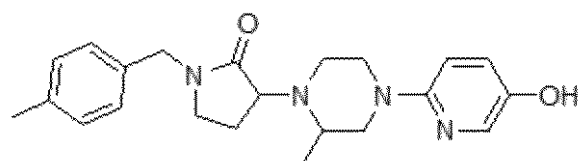
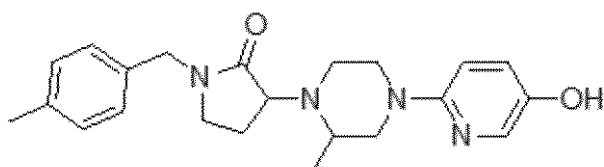
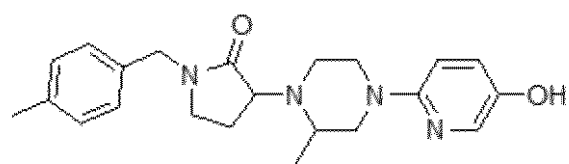
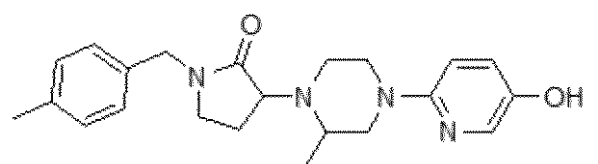
【化 4】



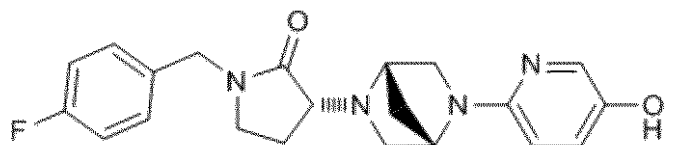
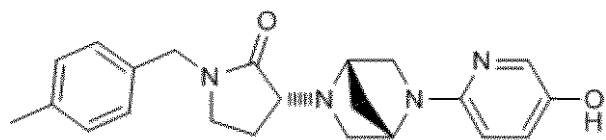
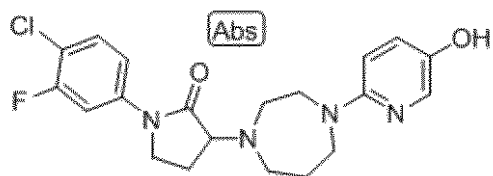
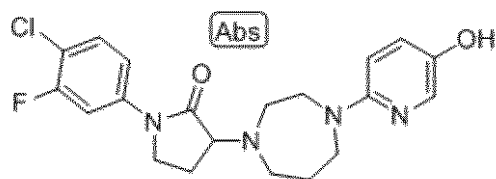
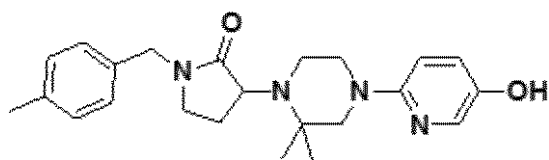
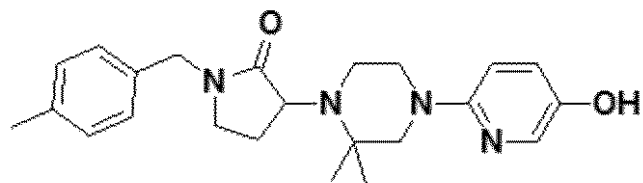
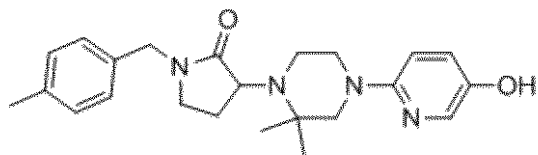
【化 5】



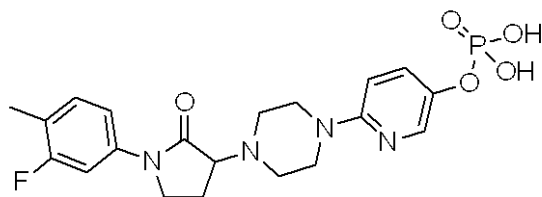
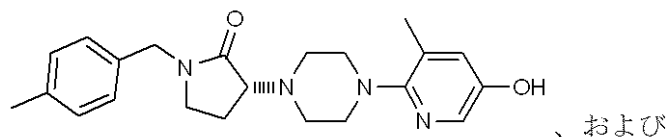
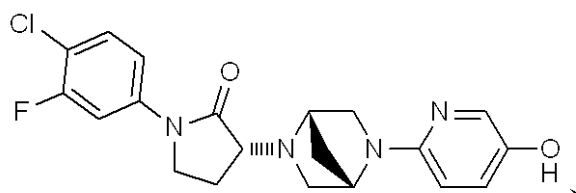
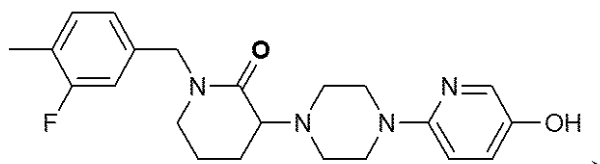
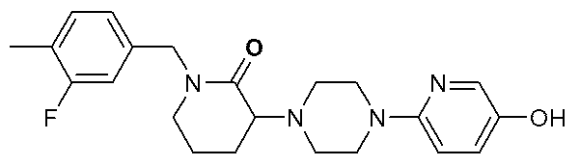
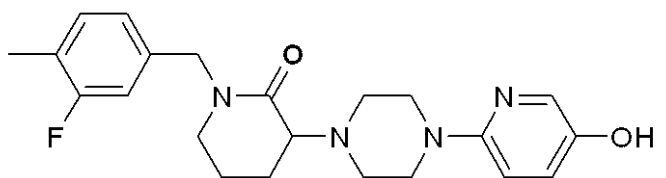
【化 6】



【化 7】



【化 8】



からなる群から選択される、請求項 1 記載の化合物あるいはその医薬的に許容される塩。

【請求項 9】

請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物あるいはその医薬的に許容される塩、および医薬的に許容し得る担体を含む、医薬組成物。

【請求項 10】

請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、うつ病、アルツハイマー病、神経性疼痛またはパーキンソン病の治療剤。

【請求項 11】

うつ病の治療に関する、請求項 10 記載の治療剤。

【請求項 12】

アルツハイマー病の治療に関する、請求項 10 記載の治療剤。

【請求項 13】

神経性疼痛の治療に関する、請求項 10 記載の治療剤。