

【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 12 月 24 日 (2020.12.24)

【公表番号】特表 2019-512469 (P2019-512469A)

【公表日】令和 1 年 5 月 16 日 (2019.5.16)

【年通号数】公開・登録公報 2019-018

【出願番号】特願 2018-545336 (P2018-545336)

【国際特許分類】

C 07D 413/12 (2006.01)

A 61P 25/24 (2006.01)

A 61P 25/22 (2006.01)

A 61P 25/18 (2006.01)

A 61P 25/00 (2006.01)

A 61P 25/16 (2006.01)

A 61P 25/28 (2006.01)

A 61P 25/08 (2006.01)

A 61P 25/06 (2006.01)

A 61P 25/30 (2006.01)

A 61P 3/10 (2006.01)

A 61P 3/04 (2006.01)

A 61P 3/06 (2006.01)

A 61P 25/20 (2006.01)

A 61P 9/00 (2006.01)

A 61K 31/5377 (2006.01)

A 61P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 07D 413/12 C S P

A 61P 25/24

A 61P 25/22

A 61P 25/18

A 61P 25/00 1 0 1

A 61P 25/16

A 61P 25/28

A 61P 25/08

A 61P 25/06

A 61P 25/30

A 61P 3/10

A 61P 3/04

A 61P 3/06

A 61P 25/20

A 61P 9/00

A 61K 31/5377

A 61P 43/00 1 1 1

【誤訳訂正書】

【提出日】令和 2 年 11 月 10 日 (2020.11.10)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

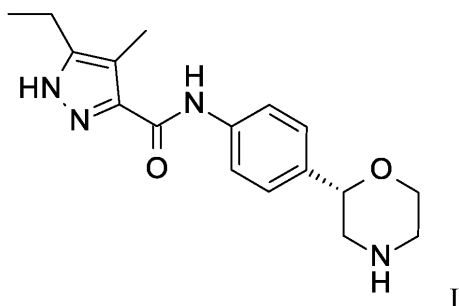
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

5 - エチル - 4 - メチル - N - [ 4 - [ ( 2 S ) モルホリン - 2 - イル ] フェニル ] - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボキサミドである、式 I :

【化 1】

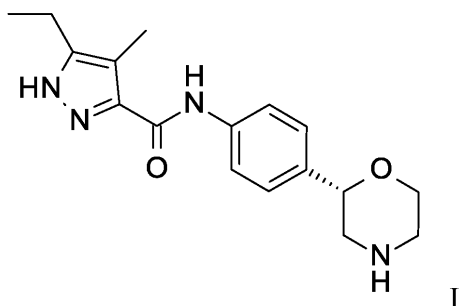


で示される化合物、又はその薬学的に好適な酸付加塩。

【請求項 2】

5 - エチル - 4 - メチル - N - [ 4 - [ ( 2 S ) モルホリン - 2 - イル ] フェニル ] - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボキサミドである、請求項 1 に記載の式 I :

【化 2】

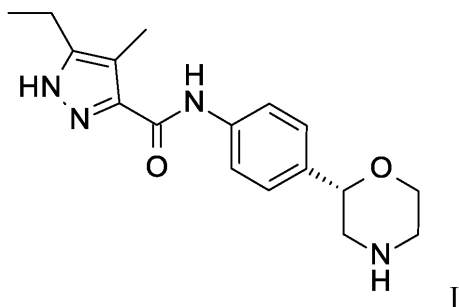


で示される化合物。

【請求項 3】

化合物が 5 - エチル - 4 - メチル - N - [ 4 - [ ( 2 S ) モルホリン - 2 - イル ] フェニル ] - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボキサミドである、請求項 1 に記載の式 I :

【化 3】



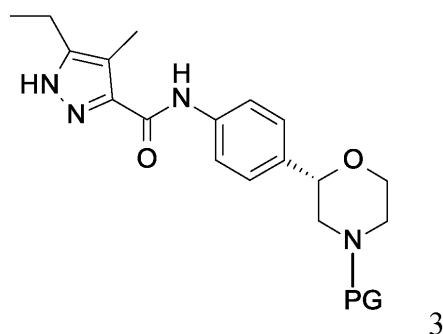
で示される化合物の薬学的に好適な酸付加塩。

【請求項 4】

請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物を製造するためのプロセスであって、

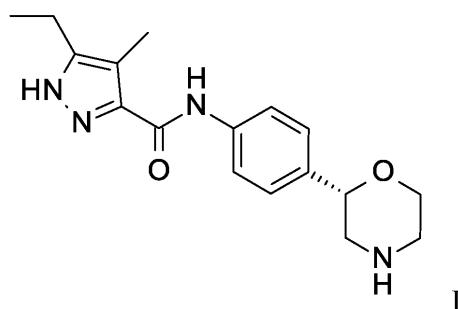
a) 式 3 :

【化 4】



[ 式中、PG は、 $-C(O)O-$ tert-ブチル (BOC) である ]  
 で示される化合物から N 保護基 (PG) を開裂して、式 I :

【化 5】



で示される化合物にすること、及び、所望により、

b) 得られた式 I で示される化合物をその薬学的に許容し得る酸付加塩に変換すること  
 を含む、プロセス。

【請求項 5】

請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物と薬学的に許容し得る賦形剤とを含む医薬組成物。

【請求項 6】

鬱病、不安障害、双極性障害、注意欠陥多動性障害 (ADHD)、ストレス関連障害、統合失調症、パーキンソン病、アルツハイマー病、てんかん、片頭痛、高血圧、薬物乱用、中毒、摂食障害、糖尿病、糖尿病合併症、肥満、脂質異常症、エネルギーの消費及び同化の障害、体温恒常性の障害及び機能不全、睡眠及び概日リズムの障害、並びに心血管障害を処置するための請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

鬱病を処置するための請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

双極性障害を処置するための請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

統合失調症を処置するための請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

薬物乱用を処置するための請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

中毒を処置するための請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

摂食障害を処置するための請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

糖尿病を処置するための請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む経口医薬製剤であって、錠剤、コーティング錠、糖衣錠、硬及び軟ゼラチンカプセル剤、液剤、乳剤ならびに懸濁剤からなる群より選択される形態である経口医薬製剤。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 0 8

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 0 8】

したがって、式 I で示される化合物は、鬱病、不安障害、双極性障害、注意欠陥多動性障害 (ADHD)、ストレス関連障害、統合失調症のような精神障害、パーキンソン病のような神経疾患、アルツハイマー病のような神経変性障害、てんかん、片頭痛、高血圧 (hypertension)、中毒、薬物乱用、並びに摂食障害、糖尿病、糖尿病合併症、肥満、脂質異常症のような代謝障害、エネルギーの消費及び同化の障害、体温恒常性の障害及び機能不全、睡眠及び概日リズムの障害、並びに心血管障害を処置するための安全な薬物として使用され得る。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 1 1

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 1 1】

長い間、TA 特異的受容体は、ヒト及び他の哺乳動物の CNS における解剖学的に離散した高親和性 TA 結合部位に基づいて、仮説として取り上げられていただけであった [ 1 0、1 1 ]。したがって、TA の薬理作用には、古典的な生体アミンの放出を誘発するか、それらの再取り込みを阻害するかによって、又はそれらの受容体系と「交差反応」するか のいずれかによって、古典的な生体アミンの周知の機構が介在すると考えられていた [ 9、1 2、1 3 ]。この見解は、GPCR の新しいファミリーである微量アミン関連受容体 (TAAR) の幾つかのメンバーの同定により、大きく変化した [ 7、1 4 ]。ヒトには 9 個の TAAR 遺伝子 ( 3 個の偽遺伝子を含む ) があり、マウスには 1 6 個の遺伝子 ( 1 個の偽遺伝子を含む ) がある。TAAR 遺伝子はイントロンを含まず ( TAAR 2 は 1 個のイントロンを含むという 1 つの例外を除いて )、そして、同じ染色体セグメント上に互いに隣接して位置する。レセプター遺伝子の系統発生的関係は、GPCR のファーマコフォア類似性の詳細な比較、及び薬理学的データに一致して、これらのレセプターが 3 つの異なるサブファミリーを形成することを示唆している [ 7、1 4 ]。TAAR 1 は、ヒトと齧歯類との間で高度に保存された 4 つの遺伝子 ( TAAR 1 ~ 4 ) の最初のサブクラスにある。TA は、G を介して TAAR 1 を活性化する。TA の調節異常は、鬱病、不安障害、双極性障害、注意欠陥多動性障害 ( ADHD )、ストレス関連障害、統合失調症のような精神障害、パーキンソン病のような神経疾患、アルツハイマー病のような神経変性障害、てんかん、片頭痛、高血圧、中毒、薬物乱用、並びに摂食障害、糖尿病、糖尿病合併症、肥満、脂質異常症のような代謝障害、エネルギーの消費及び同化の障害、体温恒常性の障害及び機能不全、睡眠及び概日リズムの障害、並びに心血管障害のような種々の疾患の病因に寄与することが明らかになった。

【誤訳訂正 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 1 1 7

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

## 【 0 1 1 7 】

したがって、表 1 のデータの全てを考慮して、式 I で示される化合物（実施例 1）は、ヒトにおける T A A R 1 関連障害を処置するための、特に、鬱病、不安障害、双極性障害、注意欠陥多動性障害（A D H D）、ストレス関連障害のような慢性 C N S 障害、統合失調症のような精神障害、パーキンソン病のような神経疾患、アルツハイマー病のような神経変性障害、てんかん、片頭痛、高血圧、薬物乱用、中毒、並びに摂食障害、糖尿病、糖尿病合併症、肥満、脂質異常症のような代謝障害、エネルギーの消費及び同化の障害、体温恒常性の障害及び機能不全、睡眠及び概日リズムの障害、並びに心血管障害を治療するための、安全かつ有効な治療剤としての意図された使用のための全体的に最も好ましい化合物である。最も好ましい障害は、統合失調症、双極性障害又は鬱病である。