

【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25年10月17日 (2013.10.17)

【公表番号】特表2013-503908(P2013-503908A)

【公表日】平成25年2月4日 (2013.2.4)

【年通号数】公開・登録公報2013-006

【出願番号】特願2012-528118(P2012-528118)

【国際特許分類】

C 07 C 69/30 (2006.01)

A 61 K 31/23 (2006.01)

A 61 K 9/08 (2006.01)

A 61 K 9/10 (2006.01)

A 61 K 9/20 (2006.01)

A 61 K 9/14 (2006.01)

A 61 K 9/06 (2006.01)

A 61 K 9/48 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 25/22 (2006.01)

A 61 P 13/02 (2006.01)

A 61 P 1/00 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

【F I】

C 07 C 69/30 C S P

A 61 K 31/23

A 61 K 9/08

A 61 K 9/10

A 61 K 9/20

A 61 K 9/14

A 61 K 9/06

A 61 K 9/48

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 25/24

A 61 P 25/22

A 61 P 13/02

A 61 P 1/00

A 61 P 1/04

【手続補正書】

【提出日】平成25年8月29日 (2013.8.29)

【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

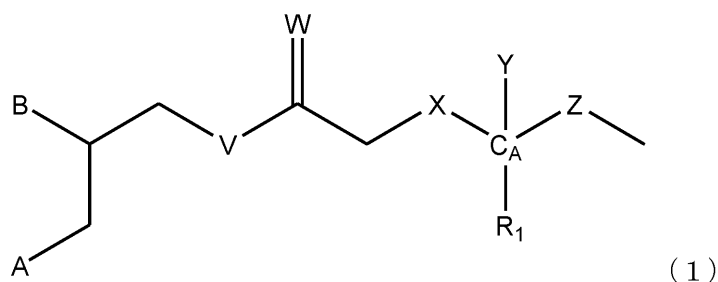
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記の構造を有する式 (1) の化合物 (薬学的に許容されるその塩を含む) 。

【化 1】



(式中、

A および B は独立して -OH または -SH であり、

V および W は独立して酸素原子または硫黄原子であり、かつ V および W のうち少なくとも 1 つは酸素原子であり、

R_1 は $-(CH_2)_pCH_3$ または $-H$ であり、

p は 0 ~ 3 の整数であり、かつ

X が $-(CH_2)_m-$ であり、

Y が $-H$ であり、

Z が $-(CH_2)_n-$ であり、

m および n が整数であり、

$m = 1 \sim 5$ 、

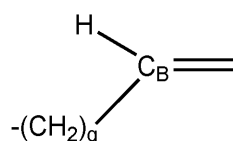
$n = 4 \sim 14$ 、

あらゆる m、n について $6 \leq m + n \leq 14$ であり、

任意に 2 つ以下の炭素-炭素二重結合を有してもよく、該炭素-炭素二重結合が 2 つ存在する場合、式 (1) の隣接するメチレン基間に形成された二重結合の炭素原子それぞれが少なくとも 1 つの水素原子に結合する；または

X が

【化 2】



であり、

Y が存在せず、 C_A が C_B とともに二重結合を形成し、

Z が $-(CH_2)_r-$ であり、

q および r が整数であり、

$q = 0 \sim 4$ 、

$r = 1 \sim 13$ 、

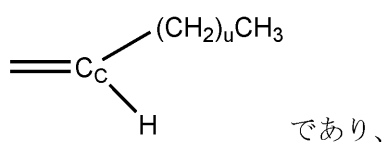
あらゆる q、r について $5 \leq q + r \leq 13$ であり、

任意に式 (1) の隣接するメチレン基間に形成された第 2 の二重結合を有してもよく、該二重結合の炭素原子それぞれが少なくとも 1 つの水素原子に結合する；または

X が $-(CH_2)_t-$ であり、

Z が

【化 3】



Y が存在せず、 C_A が C_C とともに二重結合を形成し、

R_1 が $-(CH_2)_vCH_3$ または $-H$ であり、

t および u が整数であり、

$t = 1 \sim 5$ 、

$u = 0 \sim 12$ 、

あらゆる t、u について $5 \leq t + u \leq 13$ であり、

任意に式 (1) の隣接するメチレン基間に形成された第 2 の二重結合を有してもよく、
(該二重結合の炭素原子それぞれが少なくとも 1 つの水素原子に結合する。)

【請求項 2】

(a) A と B がいずれも $-OH$ であること；

(b) V と W がいずれも酸素原子であること；

(c) R_1 が $-(CH_2)_pCH_3$ であること；

(d) p が $0 \sim 2$ であること；

(e) p が 0 または 1 であること；

(f) p が 0 であること；

(g) $n = 2 \sim 12$ 、かつ $7 \leq m + n \leq 13$ であること；

(h) $n = 3 \sim 11$ 、かつ $8 \leq m + n \leq 12$ であること；

(i) $n = 4 \sim 10$ 、かつ $9 \leq m + n \leq 11$ であること；

(j) $n = 5 \sim 9$ 、かつ $m + n = 10$ であること；

(k) $m = 2 \sim 4$ であること；

(l) $m = 3$ であること；

(m) $r = 2 \sim 12$ 、かつ $6 \leq q + r \leq 12$ であること；

(n) $r = 3 \sim 11$ 、かつ $7 \leq q + r \leq 11$ であること；

(o) $r = 4 \sim 10$ 、かつ $8 \leq q + r \leq 10$ であること；

(p) $r = 5 \sim 9$ 、かつ $q + r = 9$ であること；

(q) $q = 1 \sim 3$ であること；

(r) $q = 2$ であること；

(s) $u = 1 \sim 11$ 、かつ $6 \leq t + u \leq 12$ であること；

(t) $u = 2 \sim 10$ 、かつ $7 \leq t + u \leq 11$ であること；

(u) $u = 3 \sim 9$ 、かつ $8 \leq t + u \leq 10$ であること；

(v) $u = 4 \sim 8$ 、かつ $t + u = 9$ であること；

(w) $t = 2 \sim 4$ であること；および / または

(x) $t = 3$ であること

を特徴とする、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

(a) 前記 2 つ以下の炭素 炭素二重結合が存在するとき、該結合がそれぞれ Z のメチレン基間に形成されており、前記 2 つ以下の炭素 炭素二重結合が好ましくは 1 つの該結合であること；

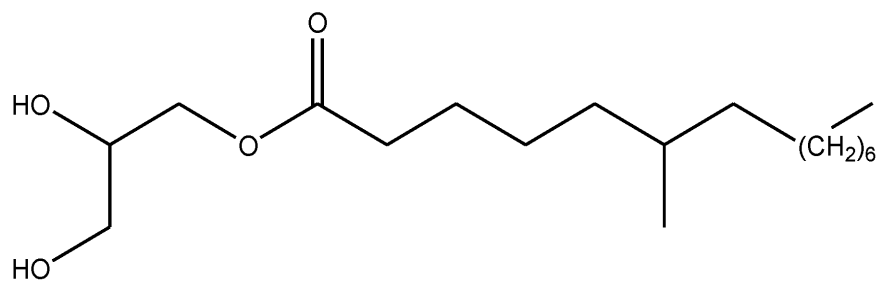
(b) 前記二重結合が存在するとき、該結合が Z のメチレン基間に形成されていること；または

(c) 前記 2 つ以下の炭素 炭素二重結合および前記第 2 の二重結合が存在しないことを特徴とする、請求項 1 または 2 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 4】

下記式：

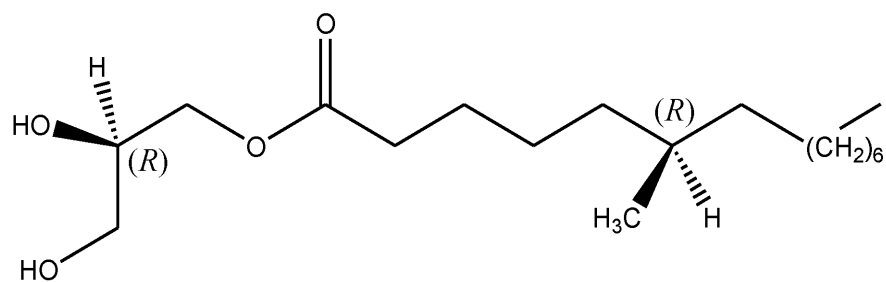
【化 4】



を有し、
好ましくは下記式：

(a)

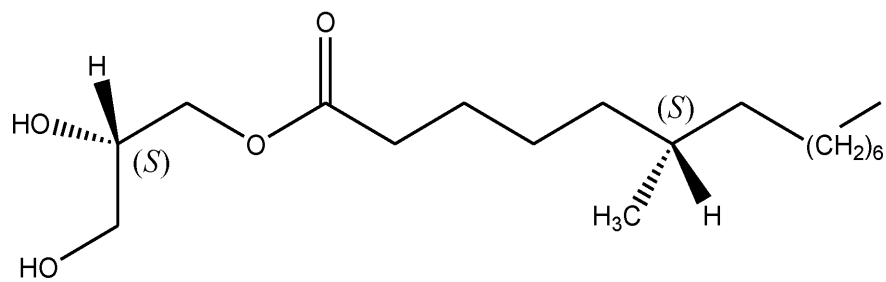
【化 5】



;

(b)

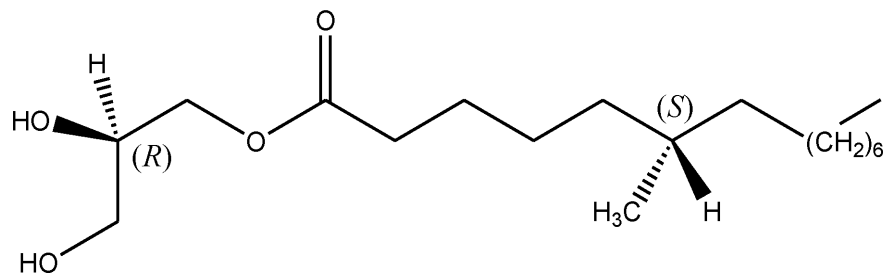
【化 6】



;

(c)

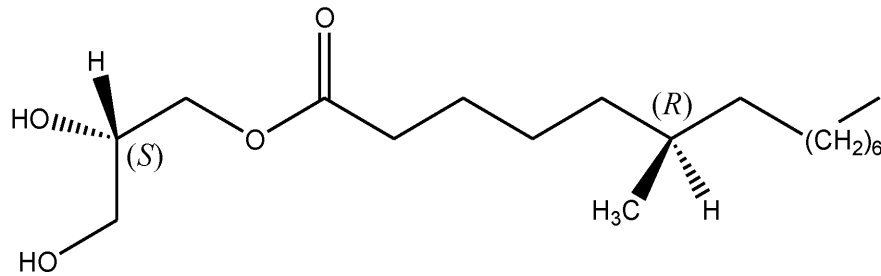
【化 7】



; または

(d)

【化 8】



を有し、かつ立体化学的に実質上純粋であることを特徴とする、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

先行する請求項のいずれかに記載の化合物と、薬学的に許容される担体とを含む医薬組成物であって、好ましくは経口送達、非経口送達、局所送達、直腸送達、経膈送達、経口吸入による投与または経鼻送達に適していることを特徴とする医薬組成物。

【請求項 6】

請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む剤形であって、好ましくは液剤、懸濁剤、シロップ剤、錠剤、カプセル剤、細粒剤、軟膏剤、クリーム剤またはロゼンジ剤であり、より好ましくはカプセル剤または錠剤であることを特徴とする剤形。

【請求項 7】

ニューロキニン 2 (NK₂) 受容体活性に関連する障害または疾患を治療するための方法において使用するための化合物または薬学的に許容されるその塩であって、該方法がその必要のある対象に治療有効量の該化合物または塩を投与する工程を含み、該化合物または塩が

(a) 請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくは塩；または

(b) 請求項 1 に記載の化合物もしくは塩（ここで、A および B はそれぞれ -OH、V および W はそれぞれ酸素原子、R₁ は H、X は -(CH₂)_m-、Z は -(CH₂)_n-、m は 3、n は 7 であり、かつ C = C 二重結合は存在しない）であることを特徴とする化合物または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 8】

前記 NK₂ 受容体活性に関連する障害または疾患が、抑うつ性気分障害、不安障害、過敏性腸症候群、炎症性腸疾患、炎症性気道疾患または尿失禁であり、好ましくは抑うつ性気分障害であり、最も好ましくは大うつ病性障害であり、該 NK₂ 受容体活性に関連する障害または疾患が大うつ病性気分障害であるとき、対象が (a) 前記治療と並行する精神療法を受けていない、(b) 前記治療と並行する精神療法を受けている、のいずれであってもよいことを特徴とする、請求項 7 に記載の化合物または塩。

【請求項 9】

(a) 前記化合物が、薬学的に許容される担体を含む医薬製剤に含まれていること；

(b) 治療有効量の前記化合物を投与する工程が、別の治療剤を投与することをさらに含むこと；および / または

(c) 前記対象がヒトであること

を特徴とする請求項 7 または 8 に記載の化合物または塩。

【請求項 10】

抑うつ性気分障害に関連する障害または症候群を治療するための方法において使用するための化合物または薬学的に許容されるその塩であって、該方法がその必要のある対象に治療有効量の該化合物または塩を投与する工程を含み、該化合物または塩が

(a) 請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくは塩；または

(b) 請求項 1 に記載の化合物もしくは塩（ここで、A および B はそれぞれ -OH、V および W はそれぞれ酸素原子、R₁ は H、X は -(CH₂)_m-、Z は -(CH₂)_n-、m は 3、n は 7 であり、かつ C = C 二重結合は存在しない）であることを特徴とする化合物

物または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 1 1】

前記障害または症候群が脳または神経系の障害、不安障害、性機能不全、薬物乱用、摂食障害またはホルモン障害であることを特徴とする、請求項 1 0 に記載の化合物または塩。

【請求項 1 2】

抗うつ薬によって治療可能な障害または状態を治療するための方法において使用するための化合物または薬学的に許容されるその塩であって、該方法がその必要のある対象に治療有効量の該化合物または塩を投与する工程を含み、該化合物または塩が

(a) 請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくは塩；または

(b) 請求項 1 に記載の化合物もしくは塩（ここで、A および B はそれぞれ - O H、V および W はそれぞれ酸素原子、 R_1 は H、X は $-(CH_2)_m-$ 、Z は $-(CH_2)_n-$ 、m は 3、n は 7 であり、かつ $C=C$ 二重結合は存在しない）であることを特徴とする化合物または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 1 3】

抗うつ薬によって治療可能な前記障害または状態が、更年期障害に関連するのぼせやほてり、疼痛、または禁煙であることを特徴とする、請求項 1 2 に記載の化合物または塩。

【請求項 1 4】

NK_2 受容体活性を調節するための方法において使用するための化合物または薬学的に許容されるその塩であって、該方法が該 NK_2 受容体を該化合物または塩の有効量と接触させることを含み、該化合物または塩が

(a) 請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくは塩；または

(b) 請求項 1 に記載の化合物もしくは塩（ここで、A および B はそれぞれ - O H、V および W はそれぞれ酸素原子、 R_1 は H、X は $-(CH_2)_m-$ 、Z は $-(CH_2)_n-$ 、m は 3、n は 7 であり、かつ $C=C$ 二重結合は存在しない）であることを特徴とする化合物または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 1 5】

NK_2 受容体活性を調節するためのインビトロの方法であって、該 NK_2 受容体を

(a) 請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくは薬学的に許容されるその塩；または

(b) 請求項 1 に記載の化合物もしくは薬学的に許容されるその塩（ここで、A および B はそれぞれ - O H、V および W はそれぞれ酸素原子、 R_1 は H、X は $-(CH_2)_m-$ 、Z は $-(CH_2)_n-$ 、m は 3、n は 7 であり、かつ $C=C$ 二重結合は存在しない）の有効量と接触させることを含む方法。