

【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21年10月1日 (2009.10.1)

【公表番号】特表2009-507002(P2009-507002A)

【公表日】平成21年2月19日 (2009.2.19)

【年通号数】公開・登録公報2009-007

【出願番号】特願2008-528510(P2008-528510)

【国際特許分類】

C 07D 451/02 (2006.01)

A 61K 31/439 (2006.01)

A 61P 25/24 (2006.01)

A 61P 25/18 (2006.01)

A 61P 25/28 (2006.01)

A 61P 3/04 (2006.01)

A 61P 25/22 (2006.01)

A 61P 25/16 (2006.01)

A 61P 25/30 (2006.01)

A 61P 25/04 (2006.01)

A 61P 25/06 (2006.01)

A 61P 19/02 (2006.01)

A 61P 1/00 (2006.01)

A 61P 25/00 (2006.01)

A 61P 15/00 (2006.01)

A 61P 13/00 (2006.01)

A 61P 15/10 (2006.01)

A 61P 3/00 (2006.01)

【F I】

C 07D 451/02 C S P

A 61K 31/439

A 61P 25/24

A 61P 25/18

A 61P 25/28

A 61P 3/04

A 61P 25/22

A 61P 25/16

A 61P 25/30

A 61P 25/04

A 61P 25/06

A 61P 19/02

A 61P 1/00

A 61P 25/00

A 61P 15/00

A 61P 13/00

A 61P 15/10

A 61P 3/00

【手続補正書】

【提出日】平成21年8月12日 (2009.8.12)

【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

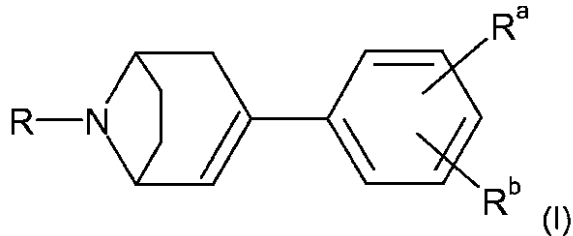
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物、

【化 1】



その異性体のいずれか又はその異性体のいずれかの混合物、或いは薬学的に許容されるその塩

[式中、

R は、水素又はアルキルを表し、

ここで、このアルキルは、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、アルコキシ、シクロアルコキシ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルケニル及びアルキニルからなる群から独立に選択される、1 種又は複数の置換基で場合によって置換されており、

R^a は、アルキルを表し、

R^b は、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルコキシ、シクロアルコキシ、アルコキシアルキル、シクロアルコキシアルキル、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルケニル、アルキニル、- NR'¹R''、- (C=O)NR'¹R'' 又は - NR'¹(C=O)R'' を表し、

ここで、R'¹ 及び R'' は、互いに独立に、水素又はアルキルである]。

【請求項 2】

R が、水素又はアルキルを表す、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^a が、メチル又はエチルを表す、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^b が、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、アルキル又はアルコキシを表す、請求項 1 ~ 3 までのいずれか一項に記載の化合物。

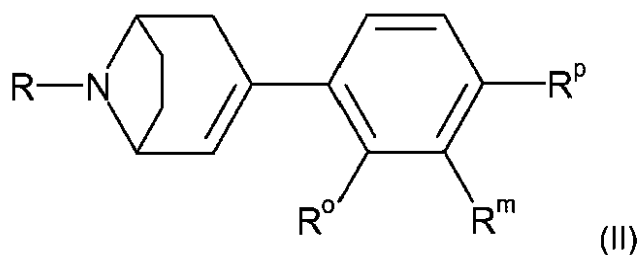
【請求項 5】

R^b が、ハロ又はアルキルを表す、請求項 1 ~ 3 までのいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

式 I I の化合物、

【化 2】



その異性体のいずれか又はその異性体のいずれかの混合物、或いは薬学的に許容されるその塩である、請求項 1 ～ 5 までのいずれか一項に記載の化合物

[式中、

R は、請求項 1 において定義されたとおりであり、

R^o、R^m 及び R^p の 1 つは、R^a を表し、

R^o、R^m 及び R^p の残りの 2 つのうちの 1 つは、R^b を表し、

R^o、R^m 及び R^p の残りの 1 つは、水素を表し、

ここで、R^a 及び R^b は、請求項 1 において定義されたとおりである]。

【請求項 7】

(±) - 3 - (4 - クロロ - 3 - メチルフェニル) - 8 - H - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;

(±) - 3 - (3 - クロロ - 4 - メチルフェニル) - 8 - H - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;

(±) - 3 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 8 - H - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;

(±) - 3 - (2 , 3 - ジメチルフェニル) - 8 - H - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;

(±) - 3 - (3 - フルオロ - 4 - メチルフェニル) - 8 - H - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;

(±) - 3 - (4 - フルオロ - 3 - メチルフェニル) - 8 - H - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;

(±) - 3 - (4 - クロロ - 3 - エチルフェニル) - 8 - H - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;

(-) - 3 - (3 - クロロ - 4 - メチルフェニル) - 8 - H - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;

(+) - 3 - (3 - クロロ - 4 - メチルフェニル) - 8 - H - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;

(-) - 3 - (4 - クロロ - 3 - メチルフェニル) - 8 - H - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;

(+) - 3 - (4 - クロロ - 3 - メチルフェニル) - 8 - H - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;

(-) - 3 - (4 - クロロ - 3 - エチルフェニル) - 8 - H - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;

(±) - 3 - (4 - プロモ - 3 - メチルフェニル) - 8 - H - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;

(±) - 3 - (3 - プロモ - 4 - メチルフェニル) - 8 - H - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;

(±) - 3 - (4 - クロロ - 3 - メチルフェニル) - 8 - メチル - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;

(±) - 3 - (3 - クロロ - 4 - メチルフェニル) - 8 - メチル - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;
 (±) - 3 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 8 - メチル - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;
 (±) - 3 - (2 , 3 - ジメチルフェニル) - 8 - メチル - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;
 (±) - 3 - (3 - フルオロ - 4 - メチルフェニル) - 8 - メチル - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;
 (±) - 3 - (4 - フルオロ - 3 - メチルフェニル) - 8 - メチル - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;
 (±) - 3 - (4 - クロロ - 3 - エチルフェニル) - 8 - メチル - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;
 (±) - 3 - (4 - プロモ - 3 - メチルフェニル) - 8 - メチル - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;
 (±) - 3 - (3 - プロモ - 4 - メチルフェニル) - 8 - メチル - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;
 (-) - 3 - (4 - クロロ - 3 - メチルフェニル) - 8 - メチル - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;
 (-) - 3 - (3 - クロロ - 4 - メチルフェニル) - 8 - メチル - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;
 (+) - 3 - (4 - クロロ - 3 - メチルフェニル) - 8 - メチル - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;
 (+) - 3 - (3 - クロロ - 4 - メチルフェニル) - 8 - メチル - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;
 (+) - 3 - (4 - クロロ - 3 - エチルフェニル) - 8 - メチル - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 2 - エン ;

又は薬学的に許容されるそれらの塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 7 までのいずれか一項に記載の化合物、その異性体のいずれか又はその異性体のいずれかの混合物、或いは薬学的に許容されるその塩の治療有効量を、少なくとも 1 種の薬学的に許容される担体、賦形剤又は希釈剤と一緒に含む薬剤組成物。

【請求項 9】

請求項 1 ~ 7 までのいずれか一項に記載の化合物、その異性体のいずれか又はその異性体のいずれかの混合物、或いは薬学的に許容されるその塩を含む医薬。

【請求項 10】

中枢神経系におけるモノアミン神経伝達物質再取り込みの阻害に反応性である、ヒトを含めた哺乳類の疾患又は障害又は状態の治療、予防又は緩和のためのの、請求項 9 に記載の医薬。

【請求項 11】

前記疾患、障害又は状態が、気分障害、うつ病、非定型うつ病、疼痛に続発するうつ病、大うつ病性障害、気分変調性障害、双極性障害、双極Ⅰ型障害、双極Ⅱ型障害、気分循環性障害、一般病状による気分障害、薬物誘発性気分障害、偽認知症、ガンゼル症候群、強迫性障害、パニック障害、広場恐怖症を伴わないパニック障害、広場恐怖症を伴うパニック障害、パニック障害の病歴のない広場恐怖症、パニック発作、記憶障害、記憶喪失、注意欠陥過活動性障害、肥満、不安、全般性不安障害、摂食障害、パーキンソン病、パーキンソニズム、認知症、老化による認知症、老年性認知症、アルツハイマー病、後天性免疫不全症候群認知症複合、老化による記憶機能障害、特定恐怖症、社会恐怖症、社会不安障害、心的外傷後ストレス障害、急性ストレス障害、薬物嗜癖、薬物乱用、コカイン乱用、ニコチン乱用、たばこ乱用、アルコール嗜癖、アルコール依存症、窃盗癖、疼痛、慢性疼痛、炎症性疼痛、神経因性疼痛、片頭痛、緊張型頭痛、慢性緊張型頭痛、うつ病に伴

う疼痛、線維筋痛、関節炎、変形性関節炎、関節リウマチ、背痛、癌疼痛、過敏性腸の疼痛、過敏性腸症候群、術後疼痛、乳房切除後疼痛症候群（P M P S）、脳卒中後の疼痛、薬物性神経障害、糖尿病性神経障害、交感神経依存性疼痛、三叉神経痛、歯痛、顔面筋疼痛、幻想肢痛、過食症、月経前症候群、月経前不快気分障害、黄体形成後期症候群、外傷後症候群、慢性疲労症候群、尿失禁、緊張性尿失禁、急迫性尿失禁、夜尿、性機能不全、早漏、勃起困難、勃起障害、早発性女性オルガスム、下肢静止不能症候群、周期性四肢運動障害、摂食障害、拒食症、睡眠障害、広汎性発達障害、自閉症、アスペルガー症候群、レット障害、小児期崩壊性障害、学習障害、運動能力障害、無言症、抜毛癖、発作性睡眠、脳卒中後のうつ病、脳卒中による脳損傷、脳卒中による神経損傷、ジルドラトウレット病、耳鳴、チック障害、身体醜形障害、反抗的行動障害又は脳卒中後の身体障害である、請求項 10 に記載の医薬。