

【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 17 年 12 月 22 日 (2005.12.22)

【公表番号】特表 2004-523556 (P2004-523556A)

【公表日】平成 16 年 8 月 5 日 (2004.8.5)

【年通号数】公開・登録公報 2004-030

【出願番号】特願 2002-567294 (P2002-567294)

【国際特許分類第 7 版】

A 6 1 K 31/27

A 6 1 P 25/18

【F I】

A 6 1 K 31/27

A 6 1 P 25/18

【手続補正書】

【提出日】平成 16 年 12 月 24 日 (2004.12.24)

【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

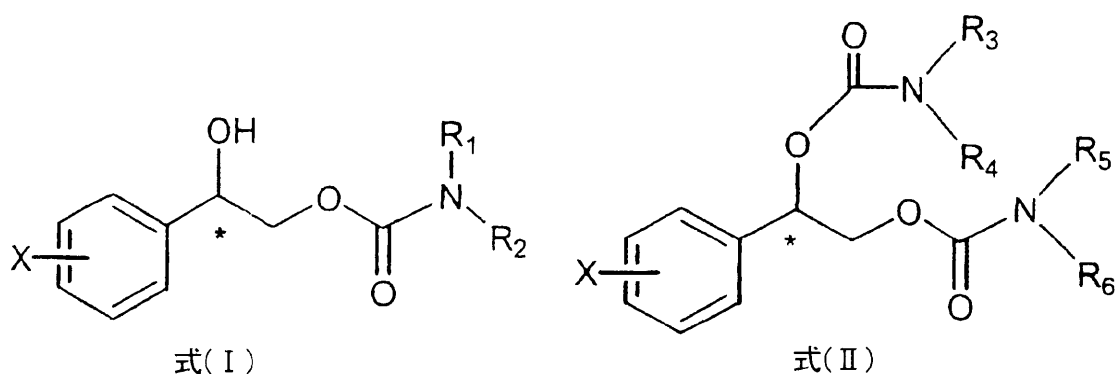
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

治療上有効な量の、式 (I) および式 (II) :

【化 1】



[式中、

フェニルは、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素よりなる群から選択される 1 ないし 5 個のハロゲン原子で X において置換されており ; そして

R₁、R₂、R₃、R₄、R₅ および R₆ は、水素および C₁ - C₄ アルキルよりなる群から独立に選択され ; ここで C₁ - C₄ アルキルはフェニル (ここで、フェニルは、ハロゲン、C₁ - C₄ アルキル、C₁ - C₄ アルコキシ、アミノ、ニトロおよびシアノよりなる群から独立に選択される置換基で場合によっては置換される) で場合によっては置換される]

よりなる群から選択される化合物を含んで成る、精神病性障害の予防もしくは治療のための医薬組成物。

【請求項 2】

X が塩素である、請求項 1 の組成物。

【請求項 3】

X がフェニル環のオルト位で置換される、請求項 1 の組成物。

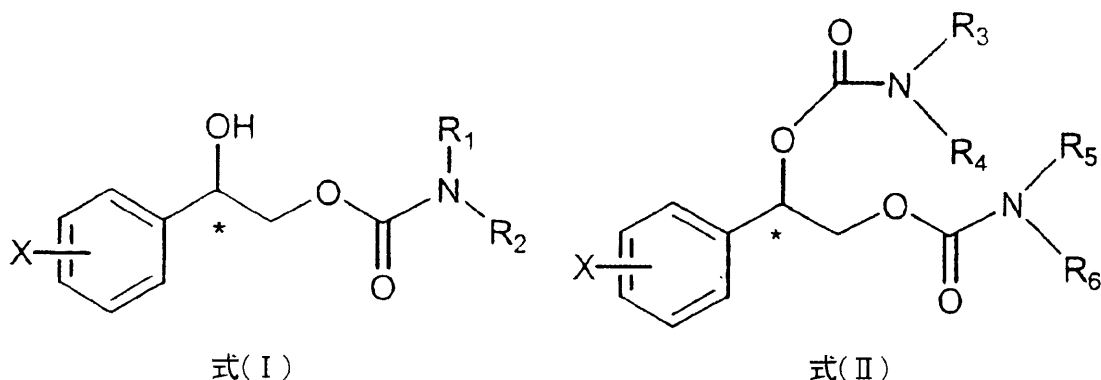
【請求項 4】

R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および R_6 が水素から選択される、請求項 1 の組成物。

【請求項 5】

治療上有効な量の式 (I) および式 (II) よりなる群から選択される 1 種の鏡像異性体、または式 (I) および式 (II) よりなる群から選択される一方の鏡像異性体が優勢を占める鏡像異性体の混合物：

【化 2】



[式中、

フェニルは、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素よりなる群から選択される 1 ないし 5 個のハロゲン原子で X において置換されており；そして

R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および R_6 は、水素および C_1 - C_4 アルキルよりなる群から独立に選択され；ここで C_1 - C_4 アルキルはフェニル（ここで、フェニルは、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、アミノ、ニトロおよびシアノよりなる群から独立に選択される置換基で場合によっては置換される）で場合によっては置換される]

を含んで成る、精神病性障害の予防もしくは治療のための医薬組成物。

【請求項 6】

X が塩素である、請求項 5 の組成物。

【請求項 7】

X がフェニル環のオルト位で置換される、請求項 5 の組成物。

【請求項 8】

R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および R_6 が水素から選択される、請求項 5 の組成物。

【請求項 9】

式 (I) および式 (II) よりなる群から選択される一方の鏡像異性体が約 90% もしくはそれ以上の程度まで優勢を占める、請求項 5 の組成物。

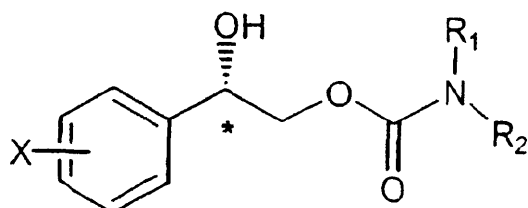
【請求項 10】

式 (I) および式 (II) よりなる群から選択される一方の鏡像異性体が約 98% もしくはそれ以上の程度まで優勢を占める、請求項 5 の組成物。

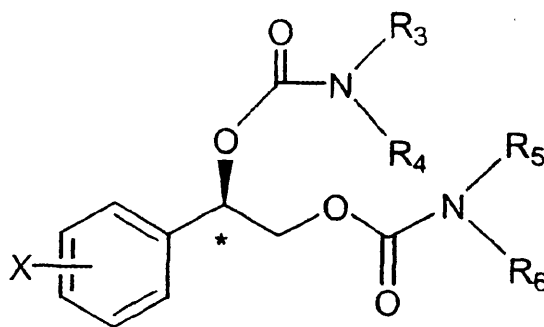
【請求項 11】

式 (I) および式 (II) よりなる群から選択される鏡像異性体が、式 (Ia) および式 (IIa)：

【化 3】



式(I a)



式(II a)

〔式中、

フェニルは、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素よりなる群から選択される 1 ないし 5 個のハロゲン原子で X において置換されており；そして R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および R_6 は、水素および $C_1 - C_4$ アルキルよりなる群から独立に選択され；ここで $C_1 - C_4$ アルキルはフェニル（ここで、フェニルは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、アミノ、ニトロおよびシアノよりなる群から独立に選択される置換基で場合によっては置換される）で場合によっては置換される〕

よりなる群から選択される 1 種の鏡像異性体である、請求項 5 の組成物。

【請求項 1 2】

X が塩素である、請求項 1 1 の組成物。

【請求項 1 3】

X がフェニル環のオルト位で置換される、請求項 1 1 の組成物。

【請求項 1 4】

R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および R_6 が水素から選択される、請求項 1 1 の組成物。

【請求項 1 5】

式 (I a) および式 (II a) よりなる群から選択される一方の鏡像異性体が約 90 % もしくはそれ以上の程度まで優勢を占める、請求項 1 1 の組成物。

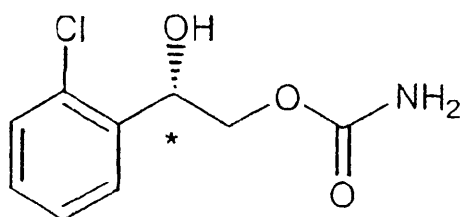
【請求項 1 6】

式 (I a) および式 (II a) よりなる群から選択される一方の鏡像異性体が約 98 % もしくはそれ以上の程度まで優勢を占める、請求項 1 1 の組成物。

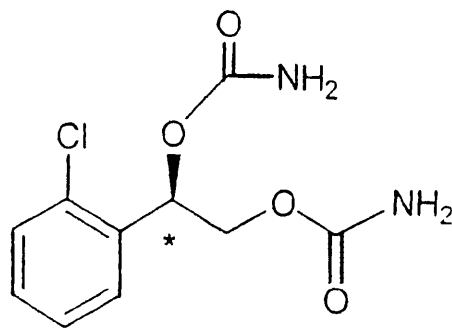
【請求項 1 7】

式 (I) および式 (II) よりなる群から選択される鏡像異性体が、式 (I b) および式 (II b)：

【化 4】



式(I b)



式(II b)

よりなる群から選択される 1 種の鏡像異性体である、請求項 5 の組成物。

【請求項 18】

式 (I b) および式 (I I b) よりなる群から選択される一方の鏡像異性体が約 90% もしくはそれ以上の程度まで優勢を占める、請求項 17 の組成物。

【請求項 19】

式 (I b) および式 (I I b) よりなる群から選択される一方の鏡像異性体が約 98% もしくはそれ以上の程度まで優勢を占める、請求項 17 の組成物。

【請求項 20】

精神病性障害が、精神分裂病、分裂病型障害、分裂感情性障害、妄想性障害、単純 (b r i e f) 精神病性障害、共有 (s h a r e d) 精神病性障害、一般の医学的症状による精神病性障害、物質に誘導される精神病性障害もしくは他に特定されない精神病性障害から選択される、請求項 1 もしくは 5 記載の組成物。

【請求項 21】

精神分裂病が、妄想型精神分裂病、破瓜型分裂病、緊張型分裂病、未分化分裂病、精神分裂病後鬱病、残遺分裂病、単純型分裂病もしくは不特定分裂病から選択される、請求項 20 の組成物。

【請求項 22】

治療上有効な量が約 0.01 mg / kg / 用量ないし約 100 mg / kg / 用量である、請求項 1 もしくは 5 記載の組成物。