

【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

【手續補正書】

【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

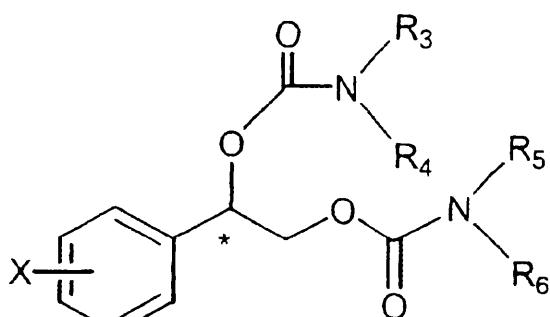
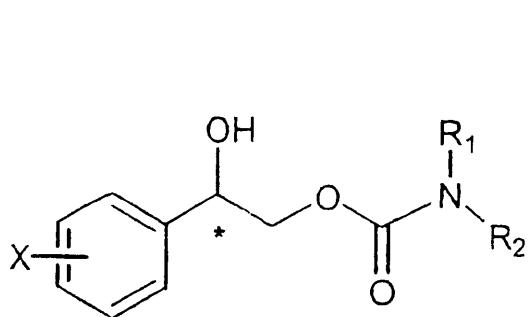
【補正の内容】

【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

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つては置換される）で場合によつては置換される】

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。

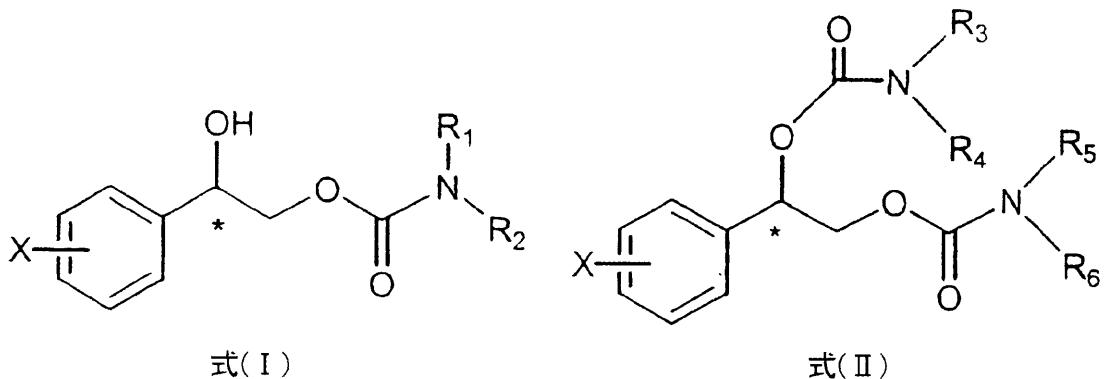
【請求項4】

R₁、R₂、R₃、R₄、R₅およびR₆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】

R₁、R₂、R₃、R₄、R₅およびR₆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。

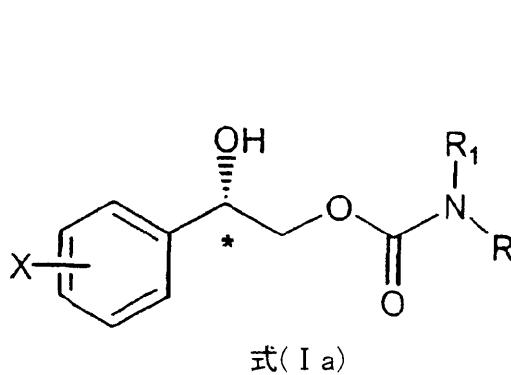
【請求項10】

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。

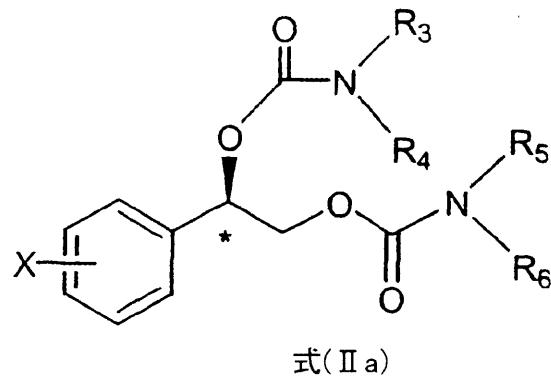
【請求項 11】

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(Ia)



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 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 1

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 11 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 11 の組成物。

【請求項 1 4】

R₁、R₂、R₃、R₄、R₅およびR₆が水素から選択される、請求項11の組成物。

【請求項 15】

式(Ⅰa)および式(Ⅱa)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11の組成物。

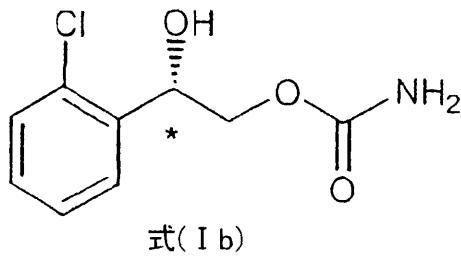
【請求項 16】

式(Ⅰa)および式(Ⅱa)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11の組成物。

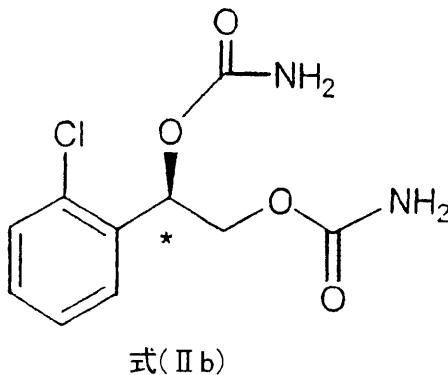
【請求項 17】

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(Ⅰb)および式(Ⅱb)：

【化 4】



式(Ib)



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(Ⅰb)および式(Ⅱb)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(Ⅰb)および式(Ⅱb)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(brief)精神病性障害、共有(shared)精神病性障害、一般的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、精神病性後鬱病、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0.01mg/kg/用量ないし約100mg/kg/用量である、請求項1もしくは5記載の組成物。