

【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 3 年 4 月 8 日 (2021.4.8)

【公表番号】特表 2020-509043 (P2020-509043A)

【公表日】令和 2 年 3 月 26 日 (2020.3.26)

【年通号数】公開・登録公報 2020-012

【出願番号】特願 2019-547448 (P2019-547448)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/5383 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/5383

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 2 月 24 日 (2021.2.24)

【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

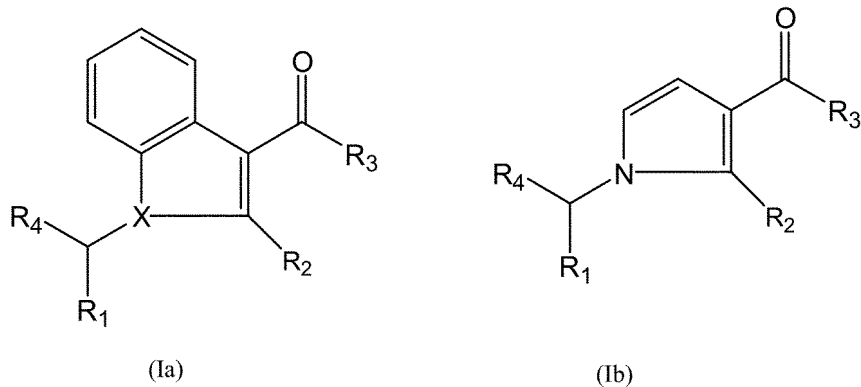
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

不可逆タイプの認知症の予防または治療のための医薬組成物であって、当該認知症が、基底前脳のコリン作動性病変に起因するものであり、当該医薬組成物が、下記の式 (I a) または (I b) の化合物、その塩または溶媒和物を含んでなり、当該化合物が、0.001 mg / kg から 5 mg / kg 未満の間の用量において投与される、医薬組成物：

【化 1】



[式中、

X は、N または CH であり、

R₁ は、

・ C₂ ~ C₆ アルキル、

・ 非置換であるか、またはその窒素原子においてメチルで置換された、ピペリジニル基、ピロリジニル基、またはオキサジナニル基、および

・ -CH₂-モルホリニル基、-CH₂-チオモルホリニル基、または -CH₂-ピペリジニル基

から選択され、

R₂ は、H、C₁ ~ C₆ アルキル、ハロゲン、-CN、および -OH から選択され、

R₃ は、非置換アリールおよび、その利用可能な位置の 1 つまたは複数において C₁ ~ C₆ アルキル、-O-C₁ ~ C₆ アルキル、ハロゲン、-CN、-NO₂、または -OH で置換されたアリールから選択され、

R₄ は、H であり、式 (Ia) の化合物の場合、-CH₂-Y 基であってもよく、ここで、Y は、O、S、または NR₅ であり、また、Y は、前記インドール環またはインデン環の 7 位に直接結合しており、R₅ は、H または C₁ ~ C₆ アルキルであり、

式 (Ia) の化合物の場合、インドール環 (X は N である) またはインデン環 (X は CH である) のフェニル部分は、非置換であるか、またはその利用可能な位置の 1 つまたは複数において、C₁ ~ C₆ アルキル、-O-C₁ ~ C₆ アルキル、またはハロゲンで置換される]。

【請求項 2】

前記化合物が、式 (Ia) の化合物である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

X が N である、請求項 1 または 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

R₁ が、-CH₂-モルホリニル基、-CH₂-チオモルホリニル基、または -CH₂-ピペリジニル基である、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

R₂ が、H または C₁ ~ C₆ アルキルである、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

R₃ がナフチルである、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

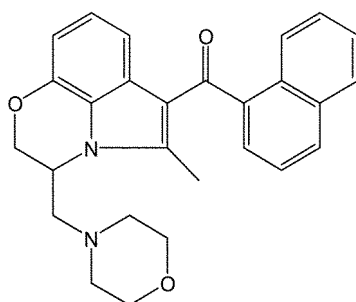
【請求項 7】

R₄ が -CH₂-Y 基であり、ここで Y は O であり、前記インドール環またはインデン環の 7 位に直接結合している、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記化合物が、

【化 2】

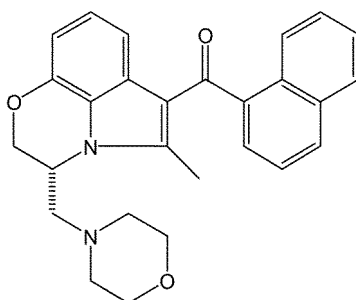


もしくは、その塩または溶媒和物である、請求項 1 ～ 7 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記化合物が、

【化 3】



もしくは、その塩または溶媒和物である、請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記式 (I a) または (I b) の化合物、その塩または溶媒和物が、0.1 mg / kg から 5 mg / kg 未満の用量において投与される、請求項 1 ～ 9 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記投与される用量が 1 日用量である、請求項 1 ～ 10 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

前記式 (I a) または (I b) の化合物、その塩または溶媒和物が、腹腔内投与される、請求項 1 ～ 11 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

前記不可逆的タイプの認知症が、アルツハイマー型認知症、血管性認知症、パーキンソン病に起因する認知症、ハンチントン病に起因する認知症、ピック病に起因する認知症、クロイツフェルト - ヤコブ病に起因する認知症、HIV 疾患に起因する認知症、およびそれらの組み合わせから選択されるものである、請求項 1 ～ 12 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記不可逆的タイプの認知症がアルツハイマー型認知症である、請求項 1 ～ 13 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

前記式 (I a) または (I b) の化合物が、コリンエステラーゼ阻害剤および NMDA グルタマート受容体遮断薬から選択される少なくとも 1 種の有効成分と伴に使用される、請求項 1 ～ 14 のいずれか一項に記載の医薬組成物。