

【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2004-533415(P2004-533415A)

【公表日】平成16年11月4日(2004.11.4)

【年通号数】公開・登録公報2004-043

【出願番号】特願2002-567288(P2002-567288)

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 31/27

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/24

【F I】

A 6 1 K 31/27

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/24

【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

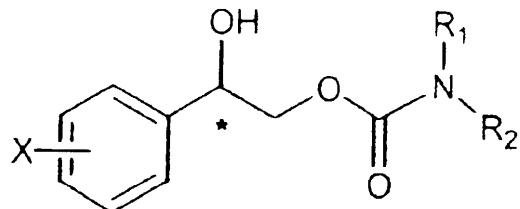
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

治療上有効な量の式(I)：

【化1】



式(I)

[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で置換され；ならびに

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は水素およびC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルよりなる群から独立に選択され；ここでC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルはフェニルで場合によっては置換される（ここで、フェニルは、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>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）】

の化合物を含んで成る、双極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記載の組成物。

【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記載の組成物。

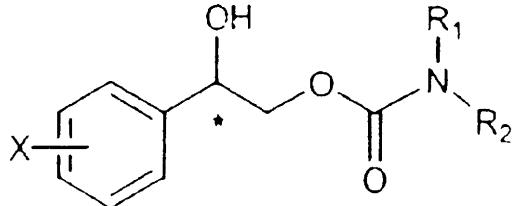
【請求項4】

$R_1$  および  $R_2$  が水素から選択される、請求項 1 記載の組成物。

【請求項 5】

治療上有効な量の式(Ⅰ)の1種の鏡像異性体、もしくは式(Ⅰ)の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(Ⅰ)

[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で置換され；ならびに

$R_1$  および  $R_2$  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で場合によっては置換される（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）

を含んで成る、双極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記載の組成物。

【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記載の組成物。

【請求項 8】

$R_1$  および  $R_2$  が水素から選択される、請求項5記載の組成物。

【請求項 9】

式(Ⅰ)の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記載の組成物。

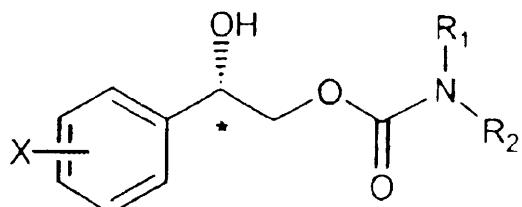
【請求項 10】

式(Ⅰ)の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記載の組成物。

【請求項 11】

式(Ⅰ)の鏡像異性体が、式(Ⅰa)：

【化3】



式(Ⅰa)

[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で置換され；ならびに

$R_1$  および  $R_2$  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で場合によっては置換される（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) ] の鏡像異性体である、請求項 5 記載の組成物。

**【請求項 12】**

$X$ が塩素である、請求項 11 記載の組成物。

**【請求項 13】**

$X$ がフェニル環のオルト位で置換される、請求項 11 記載の組成物。

**【請求項 14】**

$R_1$ および $R_2$ が水素から選択される、請求項 11 記載の組成物。

**【請求項 15】**

式(Ia)の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 記載の組成物。

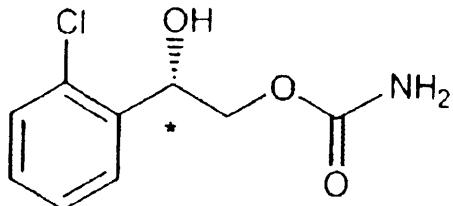
**【請求項 16】**

式(Ia)の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 記載の組成物。

**【請求項 17】**

式(I)の鏡像異性体が、式(Ib)：

**【化4】**



式(Ib)

の鏡像異性体である、請求項 5 記載の組成物。

**【請求項 18】**

式(Ib)の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 記載の組成物。

**【請求項 19】**

式(Ib)の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 記載の組成物。

**【請求項 20】**

双極性障害が、双極 I 型障害、双極 II 型障害、循環病、急速交代型、超概日性交代型、双極性うつ病、急性躁病、躁病、混合型躁病、軽躁病、および双極性障害に関連するエピソードよりなる群から選択される、請求項 1 もしくは 5 記載の組成物。

**【請求項 21】**

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。

**【請求項 22】**

組成物が、治療上有効な量の式(I)の 1 種の鏡像異性体もしくは式(I)の一方の鏡像異性体が優勢を占める鏡像異性体の混合物を含んで成る、双極性障害の進行を遅らせるもしくは遅延させる組成物である、請求項 1 もしくは 5 記載の組成物。

**【請求項 23】**

治療上有効な量が約 0.01 mg / kg / 用量から約 100 mg / kg / 用量までである、請求項 22 記載の組成物。