

【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29年4月20日(2017.4.20)

【公表番号】特表2016-520112(P2016-520112A)

【公表日】平成28年7月11日(2016.7.11)

【年通号数】公開・登録公報2016-041

【出願番号】特願2016-516184(P2016-516184)

【国際特許分類】

C 0 7 D 211/46 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 211/46 C S P

A 6 1 P 25/24

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 31/445

【手続補正書】

【提出日】平成29年3月14日(2017.3.14)

【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

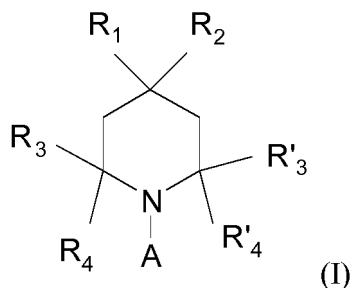
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

次式(I)：

【化 1】



(式中：

— R_1 及び R_2 は互いに独立して：H、 OR_a (ここで、 R_a はH、 $C_1 \sim C_{10}$ -アルキル、アリール又はヘテロアリール基を表す)を表すか、又は $R_1 = R_2$ であり、 $=O$ 、 $=NR_b$ (ここで、 R_b はH、 $C_1 \sim C_{10}$ -アルキル、アリール又はヘテロアリール基を表す)、 $=CR_cR_d$ (ここで、 R_c 及び R_d は互いに独立して $C_1 \sim C_{10}$ -アルキル、アリール又はヘテロアリール基を表す)を表し、

— R_3 及び R_4 は互いに独立してH、 $C_1 \sim C_{10}$ -アルキル又はヘテロアリール基を表し、

— R'_3 及び R'_4 は互いに独立してH、 $C_1 \sim C_{10}$ -アルキル又はヘテロアリール基を表し、

— A はOH又は

【化 2】

O[•]

を表す)

を有する化合物を含む、抑うつの治療及び/又は予防用(ただし、月経前不快気分障害に関連する女性の抑うつ状態の治療用ではない)組成物。

【請求項 2】

前記抑うつが古典的治療に対して抵抗性である、請求項 1 に記載の組成物。

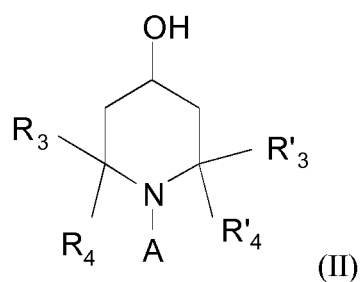
【請求項 3】

抑うつの初期治療として処方される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 4】

前記化合物が次式(II)：

【化 3】



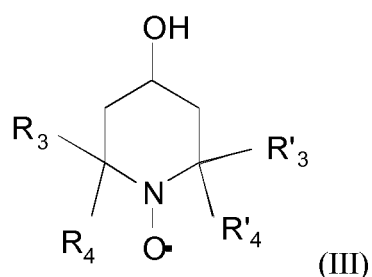
(式中：A、R₃、R₄、R'₃及びR'₄は請求項 1 のものと同義である)

を有する、請求項 1～3 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 5】

前記化合物が次式(III)：

【化 4】



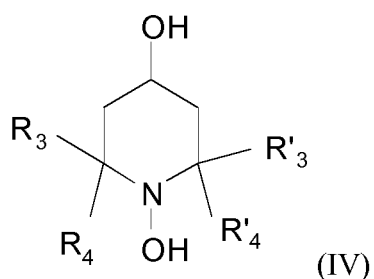
(式中：R₃、R₄、R'₃及びR'₄は請求項 1 のものと同義である)

を有する、請求項 1～4 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 6】

前記化合物が次式(IV)：

【化 5】



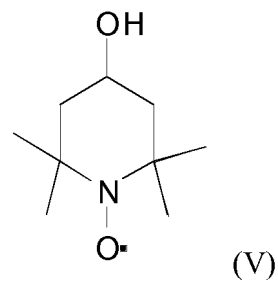
(式中：R₃、R₄、R'₃及びR'₄は請求項 1 のものと同義である)

を有する、請求項 1～5 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 7】

次式(V)：

【化 6】



を有する、請求項 1～6 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 8】

前記化合物が 0.1mg/kg～300mg/kg、特に 10mg/kg～125mg/kg の用量で慢性投与される、請求項 1～7 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 9】

前記化合物が 30mg/kg～275mg/kg の用量で急性投与される、請求項 1～7 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 10】

経口経路又は静脈内経路により投与される、請求項 8 又は 9 に記載の組成物。

【請求項 11】

ヒト患者が患っている前記抑うつが、コントロール患者のものと比較して率で約 35% 減少した、特に血清中で測定される、脳由来神経栄養因子レベルを示し、及び/又は古典的マーカー、例えば該患者におけるカタラーゼの生理学的レベル及び/又は脂質過酸化チオバルビツール酸反応性物質(tBARS)のレベル及び/又はスーパーオキシドジスムターゼ(SOD)のレベル及び/又は脂質過酸化(tBARS [例えば、チオバルビツール酸反応性物質]、オキシステロール)のレベル及び/又はグルタチオンレダクターゼ(GSR)のレベル及び/又は比GS H/GSSG(還元型グルタチオン/酸化型グルタチオン)のレベル及び/又はタンパク質酸化のレベル及び/又はグルタチオンペルオキシダーゼ(GPx)のレベル及び/又はカタラーゼのレベル及び/又は反応性酸素種(ONOO⁻、^{*}OH、NO、H₂O₂、O₂⁻)を用いて測定した酸化ストレスを示す、請求項 1～9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 12】

抗うつ剤様特性を有する化合物又は抗うつ薬、特に 7,8 DHF(抗うつ剤様特性を有する化合物)、SSRI(選択的セロトニン再取込み阻害剤 [例えば、シタロプラム、エスシタロプラム、フルオキセチン、フルボキサミン...])、TCA(三環系抗うつ剤 [例えば、イミプラミン、デシプラミン、アミトリプチリン...])、MAOI(モノアミンオキシダーゼ阻害剤 [例えば、クロルジリン、モクロベミド、トロキサトン...])、SNRI(セロトニン-ノルエピネフリン再取込み阻害剤 [例えば、ベンラファキシン、デュロキセチン])、NDRI(ノルエピネフリン-ドーパミン再取込み阻害剤 [例えば、ブプロピオン])、SARI(セロトニンアンタゴニスト及び再取込み阻害剤 [トラゾドン])、ドーパミン再取込み阻害剤 [例えば、アミネプチン]、リチウムからなる群より選択される抗うつ剤様特性を有する化合物又は抗うつ薬との組み合わせられた、請求項 1～11 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 13】

電気ショック療法、電気痙攣療法(ECT)、経頭蓋磁気刺激(TMS)、反復経頭蓋磁気刺激(rTMS)、行動療法からなる群より選択される治療法の実施の間に投与される、請求項 1～12 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 14】

(i)少なくとも 1 つの、請求項 1～7 のいずれか 1 項に記載の化合物、及び
(ii)少なくとも 1 つの抗うつ薬、特に、7,8 DHF(抗うつ剤様特性を有する化合物)、SSRI(選択的セロトニン再取込み阻害剤 [例えば、シタロプラム、エスシタロプラム、フルオキ

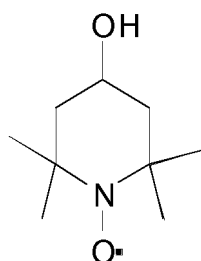
セチン、フルボキサミン...」)、TCA(三環系抗うつ剤 [例えば、イミプラミン、デシプラミン、アミトリプチリン...])、MAOI(モノアミンオキシダーゼ阻害剤 [例えば、クロルジリン、モクロベミド、トロキサトン...])、SNRI(セロトニン-ノルエピネフリン再取込み阻害剤 [例えば、ベンラファキシン、デュロキセチン])、NDRI(ノルエピネフリン-ドーパミン再取込み阻害剤 [例えば、ブプロピオン])、SARI(セロトニンアンタゴニスト及び再取込み阻害剤 [トラゾドン])、ドーパミン再取込み阻害剤 [例えば、アミネプチン]、リチウムからなる群より選択される抗うつ薬を、医薬的に許容されるビヒクルとの組合せで含んでなる医薬組成物。

【請求項 15】

抑うつの治療及び/又は予防のための同時、別個の使用又は逐次投与用の組合せとして

(i) 少なくとも 1 つの、請求項 1～7 のいずれか 1 項に記載の化合物、特に式 V

【化 7】



の化合物、及び

(ii) 少なくとも 1 つの抗うつ薬、特に、7,8 DHF(抗うつ剤様特性を有する化合物)、SSRI(選択的セロトニン再取込み阻害剤 [例えば、シタロプラム、エスシタロプラム、フルオキセチン、フルボキサミン...])、TCA(三環系抗うつ剤 [例えば、イミプラミン、デシプラミン、アミトリプチリン...])、MAOI(モノアミンオキシダーゼ阻害剤 [例えば、クロルジリン、モクロベミド、トロキサトン...])、SNRI(セロトニン-ノルエピネフリン再取込み阻害剤 [例えば、ベンラファキシン、デュロキセチン])、NDRI(ノルエピネフリン-ドーパミン再取込み阻害剤 [例えば、ブプロピオン])、SARI(セロトニンアンタゴニスト及び再取込み阻害剤 [トラゾドン])、ドーパミン再取込み阻害剤 [例えば、アミネプチン]、リチウムからなる群より選択される抗うつ薬を含んでなる製品。