

【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18年1月12日(2006.1.12)

【公表番号】特表2005-521723(P2005-521723A)

【公表日】平成17年7月21日(2005.7.21)

【年通号数】公開・登録公報2005-028

【出願番号】特願2003-580276(P2003-580276)

【国際特許分類】

**C 0 7 C 229/08 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/197 (2006.01)**  
**A 6 1 P 1/04 (2006.01)**  
**A 6 1 P 1/12 (2006.01)**  
**A 6 1 P 1/14 (2006.01)**  
**A 6 1 P 3/10 (2006.01)**  
**A 6 1 P 5/24 (2006.01)**  
**A 6 1 P 7/10 (2006.01)**  
**A 6 1 P 9/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 15/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 17/06 (2006.01)**  
**A 6 1 P 19/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 21/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 21/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/04 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/06 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/08 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/14 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/16 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/18 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/20 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/22 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/24 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/28 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/30 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/32 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/34 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/36 (2006.01)**  
**A 6 1 P 27/16 (2006.01)**  
**A 6 1 P 29/00 (2006.01)**  
**C 0 7 C 229/28 (2006.01)**  
**C 0 7 C 229/34 (2006.01)**

【F I】

**C 0 7 C 229/08 C S P**  
**A 6 1 K 31/197**  
**A 6 1 P 1/04**  
**A 6 1 P 1/12**  
**A 6 1 P 1/14**  
**A 6 1 P 3/10**

A 6 1 P 5/24  
A 6 1 P 7/10  
A 6 1 P 9/00  
A 6 1 P 15/00  
A 6 1 P 17/06  
A 6 1 P 19/02  
A 6 1 P 21/00  
A 6 1 P 21/02  
A 6 1 P 25/00  
A 6 1 P 25/02  
A 6 1 P 25/04  
A 6 1 P 25/06  
A 6 1 P 25/08  
A 6 1 P 25/14  
A 6 1 P 25/16  
A 6 1 P 25/18  
A 6 1 P 25/20  
A 6 1 P 25/22  
A 6 1 P 25/24  
A 6 1 P 25/28  
A 6 1 P 25/30  
A 6 1 P 25/32  
A 6 1 P 25/34  
A 6 1 P 25/36  
A 6 1 P 27/16  
A 6 1 P 29/00  
A 6 1 P 29/00 1 0 1  
C 0 7 C 229/28  
C 0 7 C 229/34  
C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成17年10月4日(2005.10.4)

【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

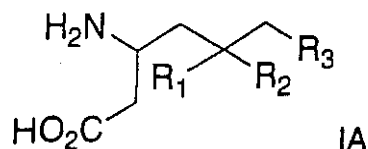
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の式 I A :

## 【化1】



{ 式中、 $R_1$ は、水素又は、1～5のフッ素原子で場合により置換される( $C_1 - C_3$ )アルキルである；

$R_2$ は、水素又は、1～5のフッ素原子で場合により置換される( $C_1 - C_3$ )アルキルである；及び

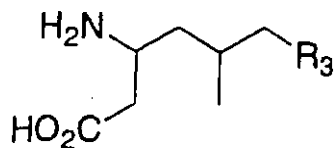
$R_3$ は、( $C_1 - C_6$ )アルキル、( $C_3 - C_6$ )シクロアルキル、( $C_3 - C_6$ )シクロアルキル - ( $C_1 - C_3$ )アルキル、フェニル、フェニル - ( $C_1 - C_3$ )アルキル、又はフェニル - N(H) - である、ここで、上記アルキル基のそれぞれは1～5のフッ素原子で場合により置換され、及びここで、前記フェニルのそれぞれは、クロロ、フルオロ、アミノ、ニトロ、シアノ、( $C_1 - C_3$ )アルキルアミノ、1～3のフッ素原子で場合により置換される( $C_1 - C_3$ )アルキル及び1～3のフッ素原子で場合により置換される( $C_1 - C_3$ )アルコキシから独立に選ばれる1～3の置換基で場合により置換される；

但し、 $R_1$ が水素であるとき、 $R_2$ は水素ではない。}で表される化合物又は医薬として許容されるその塩。

## 【請求項2】

以下の式IA-1：

## 【化2】



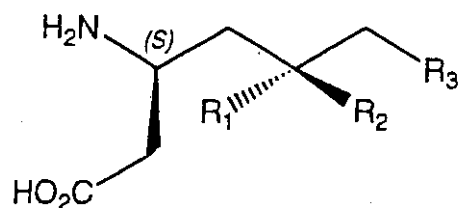
IA-1

{ 式中、 $R_3$ は、( $C_1 - C_6$ )アルキル、( $C_3 - C_6$ )シクロアルキル、( $C_3 - C_6$ )シクロアルキル - ( $C_1 - C_3$ )アルキル、フェニル、フェニル - ( $C_1 - C_3$ )アルキル、又はフェニル - N(H) - である、ここで、上記アルキル基のそれぞれは1～5のフッ素原子で場合により置換され、及びここで、前記フェニルのそれぞれは、クロロ、フルオロ、アミノ、ニトロ、シアノ、( $C_1 - C_3$ )アルキルアミノ、1～3のフッ素原子で場合により置換される( $C_1 - C_3$ )アルキル及び1～3のフッ素原子で場合により置換される( $C_1 - C_3$ )アルコキシから選ばれる1～3の置換基で場合により置換される。}で表される、請求項1に記載の化合物又は医薬として許容されるその塩。

## 【請求項3】

以下の式IA-2：

## 【化 3】



## IA-2

{ 式中、 $R_1$ は、水素又は、1～5のフッ素原子で場合により置換される( $C_1 - C_3$ )アルキルである；

$R_2$ は、水素又は、1～5のフッ素原子で場合により置換される( $C_1 - C_3$ )アルキルである；及び

$R_3$ は( $C_1 - C_6$ )アルキル、( $C_3 - C_6$ )シクロアルキル、( $C_3 - C_6$ )シクロアルキル - ( $C_1 - C_3$ )アルキル、フェニル、フェニル - ( $C_1 - C_3$ )アルキル、又はフェニル - N(H) - である、ここで、上記アルキル基のそれぞれは1～5のフッ素原子で場合により置換され、及びここで、前記フェニルのそれぞれは、クロロ、フルオロ、アミノ、ニトロ、シアノ、( $C_1 - C_3$ )アルキルアミノ、1～3のフッ素原子で場合により置換される( $C_1 - C_3$ )アルキル及び1～3のフッ素原子で場合により置換される( $C_1 - C_3$ )アルコキシから独立に選ばれる1～3の置換基で場合により置換される；

但し、 $R_1$ が水素であるとき、 $R_2$ は水素ではない。}で表される、請求項1に記載の化合物又は医薬として許容されるその塩。

## 【請求項 4】

以下の：

3 - アミノ - 5 - メチル - オクタノン酸；

3 - アミノ - 5 - メチル - ノナノン酸；

(3S, 5R) - 3 - アミノ - 5 - メチル - ヘプタノン酸；

(3S, 5R) - 3 - アミノ - 5 - メチル - オクタノン酸；

(3S, 5R) - 3 - アミノ - 5 - メチル - ノナノン酸；

3 - アミノ - 7 - シクロペンチル - 5 - メチル - ヘプタノン酸；

3 - アミノ - 7 - シクロヘキシル - 5 - メチル - ヘプタノン酸；

(3S, 5R) - 3 - アミノ - 7 - シクロペンチル - 5 - メチル - ヘプタノン酸；

(3S, 5R) - 3 - アミノ - 7 - シクロヘキシル - 5 - メチル - ヘプタノン酸；

3 - アミノ - 5 - メチル - 7 - フェニル - ヘプタノン酸；

3 - アミノ - 5 - メチル - 7 - (2, 4 - difluoro - フェニル) - ヘプタノン酸；

3 - アミノ - 8 - (2, 3 - difluoro - フェニル) - 5 - メチル - オクタノン酸；及び

び

3 - アミノ - 8 - (2, 4 - difluoro - フェニル) - 5 - メチル - オクタノン酸；

から選ばれる化合物又は医薬として許容されるその塩。

## 【請求項 5】

請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物又は医薬として許容されるその塩の治療的有効量、及び医薬として許容される担体を含む医薬組成物。

## 【請求項 6】

3 - アミノ - 5 - メチル - オクタノン酸である化合物又は医薬として許容されるその塩

。

## 【請求項 7】

請求項 6 に記載の化合物又は医薬として許容されるその塩の治療的有効量、及び医薬として許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 8】

(3S, 5R) - 3 - アミノ - 5 - メチル - オクタノン酸である化合物又は医薬として許容されるその塩。

【請求項 9】

請求項 8 に記載の化合物又は医薬として許容されるその塩の治療的有効量、及び医薬として許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 10】

下記治療の必要のある哺乳類に治療的に有効な量の請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物又はその医薬として許容される塩を含む、ヒトを含む哺乳類における、失神発作、線維筋痛症、運動低下症、頭側の障害、一過性熱感、本態性振せん、化学物質依存及び嗜癖、例えば、アルコール、アンフェタミン又はアンフェタミン様物質、カフェイン、大麻、コカイン、ヘロイン、幻覚薬、タバコ、吸入剤及びエーロゾル駆出剤、ニコチン、オピオイド、フェニルグリシチン誘導体、鎮静薬、催眠薬、ベンゾジアゼピン及び他の抗不安薬への依存又は嗜癖、及び上記依存又は嗜癖に関連する離脱症状、賭博の如き習慣性行動；片頭痛、痙性、関節炎、過敏性腸症候群 (IBS)、慢性の痛み、急性の痛み、神経障害性の痛み、血管性頭痛、洞頭痛、炎症性障害、例えば、慢性関節リウマチ、変形性関節症、乾癬；利尿、月経前症候群、月経前不快気分障害、耳鳴、及び胃の損傷から選ばれる障害又は状態の治療用医薬組成物。

【請求項 11】

前記哺乳類に上記障害又は状態を治療するのに有効な量の請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物又はその医薬として許容される塩を含む、ヒトを含む哺乳類における、パーキンソン病 (PD)、ハンチントン病 (HD)、アルツハイマー病、老年性痴呆、アルツハイマー型の痴呆、記憶障害、血管性痴呆、及び例えば、HIV 疾患、頭部外傷、パーキンソン病、ハンチントン病、ピック病、クロイツフェルト - ヤコブ病のための又は複数の病因のための他の痴呆の如き、せん妄、痴呆、及び健忘の及び他の認識の又は神経変性の障害；家族性発作性運動異常症、痙性、ツレット症候群、スコット症候群、PALSY 及び運動不能 - 硬直症候群を含む、運動不能症、運動異常症の如き運動障害；投薬誘発運動障害、例えば、神経弛緩薬誘発振せん麻痺、神経弛緩薬悪性症候群、神経弛緩薬誘発急性失調症、神経弛緩薬誘発急性静座不能、神経弛緩薬誘発遅発性ジスキネジー及び投薬誘発姿勢振せんの如き、錐体外運動障害；ダウン症候群；多発性硬化症 (MS) 及び筋萎縮性側索硬化症 (ALS) の如き脱髄疾患、末梢神経障害、例えば、糖尿病及び化学療法 - 誘発 - 神経障害、及びヘルペス後神経痛、三叉神経痛、分節又は肋間神経痛及び他の神経痛；及び大脳梗塞、クモ膜下出血又は大脳水腫の如き急性又は慢性大脳血管損傷のための大脳血管障害から成る群から選ばれる障害又は状態の治療用医薬組成物。

【請求項 12】

前記哺乳類に上記障害又は状態の治療において有効な量の請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物又はその医薬として許容される塩を含む、ヒトを含む哺乳類における、睡眠障害、例えば、不眠症、薬物関連不眠、REM 睡眠障害、過眠症、ナルコレプシー、睡眠 - 覚醒周期障害、睡眠無呼吸症候群、錯眠、及びシフトワーク及び不規則な勤務時間に関連する睡眠障害から成る群から選ばれる障害又は状態の治療用医薬組成物。

【請求項 13】

前記哺乳類に上記障害又は状態の治療において有効な量の請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物又はその医薬として許容される塩を含む、ヒトを含む哺乳類における、うつ病又はより特には、うつ障害、例えば、単一のエピソードの又は再発性の主要なうつ障害、気分変調性障害、抑うつ神経症及び神経性のうつ病、食欲不振、体重減少、不眠症、早朝起床及び精神遅滞を含むメランコリックうつ病、増大した食欲、過眠症、精神運動振動又は短気を含む異型のうつ病又は反応性うつ病、季節性感情障害及び小児うつ病；又は双極性障害又は躁うつ病、例えば、双極性 I 障害、双極性 II 障害及び循環病、行為障害及び

破壊的行為障害；広場恐怖症を伴う又は伴わない恐慌性障害、恐慌性障害歴を有しない広場恐怖症、特定の恐怖、例えば、特定の動物への恐怖、社会不安、社会恐怖、強迫性障害、心的外傷後ストレス障害及び急性ストレス障害を含むストレス障害、及び一般化された不安障害の如き不安障害；境界性人格障害；統合失調症及び他の精神病性障害、例えば、統合失調症様障害、統合失調感情性障害、妄想性障害、短期間の精神病性障害、共有精神病障害、妄想又は幻覚を有する精神病性障害、不安の精神病性エピソード、精神病に関連する不安、重篤大うつ病性障害の如き精神病性気分障害；双極性障害に関連する急性躁病及びうつ病の如き精神病性障害に関連する気分障害、統合失調症に関連する気分障害；精神遅滞、自閉症、及び行為障害に関連する行動妨害の如き気分障害から選ばれる障害又は状態の治療用医薬組成物。