

【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26年2月13日 (2014.2.13)

【公表番号】特表2013-518032(P2013-518032A)

【公表日】平成25年5月20日 (2013.5.20)

【年通号数】公開・登録公報2013-025

【出願番号】特願2012-533416(P2012-533416)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/215 (2006.01)

A 6 1 K 31/4192 (2006.01)

A 6 1 K 31/41 (2006.01)

A 6 1 K 31/27 (2006.01)

A 6 1 K 31/223 (2006.01)

A 6 1 K 31/337 (2006.01)

A 6 1 K 31/475 (2006.01)

A 6 1 K 33/24 (2006.01)

A 6 1 K 31/282 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/215

A 6 1 K 31/4192

A 6 1 K 31/41

A 6 1 K 31/27

A 6 1 K 31/223

A 6 1 K 31/337

A 6 1 K 31/475

A 6 1 K 33/24

A 6 1 K 31/282

A 6 1 P 25/02

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】平成25年12月18日 (2013.12.18)

【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

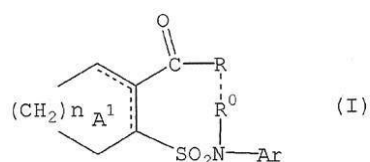
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 ( I ) :

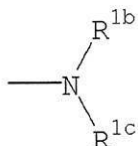
【化 1】



[ 式中、  
R は、

- (1) 置換基を有していてもよい脂肪族炭化水素基、
- (2) 置換基を有していてもよい芳香族炭化水素基、
- (3) 置換基を有していてもよい複素環基、
- (4) 式：  $-OR^1$  (式中、 $R^1$  は、水素原子または置換基を有していてもよい脂肪族炭化水素基を示す。) で表される基、または
- (5) 式：

【化 2】



( 式中、 $R^{1b}$  および  $R^{1c}$  は、同一または異なって、水素原子または置換基を有していてもよい脂肪族炭化水素基を示す。) で表される基を示し、

$R^0$  は、水素原子または脂肪族炭化水素基を示すか、あるいは R と  $R^0$  とは結合して結合手を形成してもよく、

環  $A^1$  は、

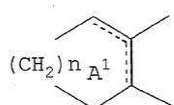
- (i) 置換基を有していてもよい脂肪族炭化水素基、
- (ii) 置換基を有していてもよい芳香族炭化水素基、
- (iii) 式：  $-OR^{11}$  (式中、 $R^{11}$  は、水素原子または置換基を有していてもよい脂肪族炭化水素基を示す。) で表される基、および
- (iv) ハロゲン原子

からなる群より選ばれる 1 ~ 4 個の置換基で置換されていてもよいシクロアルケンを示し、

$Ar$  は、置換基を有していてもよい芳香族炭化水素基を示し、

式：

【化 3】



で表される基は、式：

【化 4】

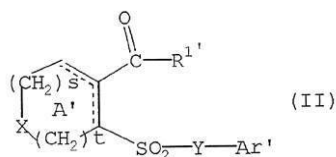


で表される基を示し、

$n$  は 1 ~ 4 の整数を示す。]

で表される化合物もしくはその塩またはそのプロドラッグ、あるいは、  
式 (II)：

## 【化 5】

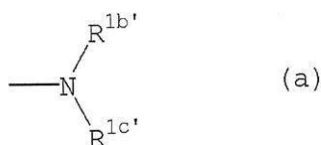


[ 式中、

 $R^{1'}$  は、

- (1) 置換基を有していてもよい脂肪族炭化水素基、
- (2) 置換基を有していてもよい芳香族炭化水素基、
- (3) 置換基を有していてもよい複素環基、
- (4) 式：  $-OR^{1a'}$  (式中、 $R^{1a'}$  は、水素原子または置換基を有していてもよい脂肪族炭化水素基を示す。) で表される基、または
- (5) 式：

## 【化 6】



( 式中、 $R^{1b'}$  および  $R^{1c'}$  は、同一または異なって、水素原子または置換基を有していてもよい脂肪族炭化水素基を示す。 ) で表される基を示し、

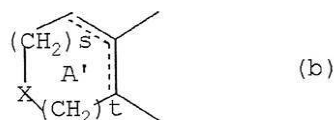
$X$  は、メチレン、 $NH$ 、硫黄原子または酸素原子を示し、

$Y$  は、置換基を有していてもよいメチレンまたは置換基を有していてもよい  $NH$  を示し、環  $A'$  は、

- (i) 置換基を有していてもよい脂肪族炭化水素基、
- (ii) 置換基を有していてもよい芳香族炭化水素基、
- (iii) 式：  $-OR^{2'}$  (式中、 $R^{2'}$  は、水素原子または置換基を有していてもよい脂肪族炭化水素基を示す。) で表される基、および
- (iv) ハロゲン原子

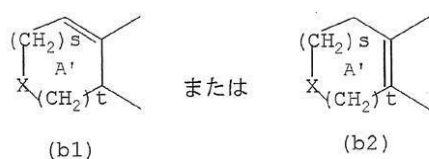
からなる群より選ばれる 1 乃至 4 個の置換基を有していてもよい 5 ないし 8 員環を示し、 $Ar'$  は、置換基を有していてもよい芳香族炭化水素基を示し、式：

## 【化 7】



で表される基は式：

## 【化 8】



で表される基を示し、

$s$  は 0 乃至 2 の整数を示し、

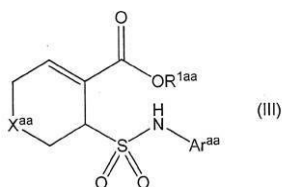
t は 1 乃至 3 の整数を示し、  
s と t の和は 4 以下である；

ただし、X がメチレンの場合、Y は置換基を有していてもよいメチレンを示す。]  
で表される化合物もしくはその塩またはそのプロドラッグを含有してなる、抗癌剤により  
誘発される末梢神経障害の抑制剤。

【請求項 2】

式 ( I I I ) :

【化 9】



【式中、 $R^{1aa}$  は、 $C_{1-6}$  アルキルを示し、

$X^{aa}$  は、メチレンまたは酸素原子を示し、

$Ar^{aa}$  は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキルおよび  $C_{1-6}$  アルコキシより選ばれる 1  
または 2 個の置換基を有していてもよいフェニルを示す。]

で表される化合物もしくはその塩またはそのプロドラッグを含有してなる、抗癌剤により  
誘発される末梢神経障害の抑制剤。

【請求項 3】

該化合物がエチル (6R)-6-[N-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)スルファモイル]-1-シクロ  
ヘキセン-1-カルボキシラートもしくはその塩またはそのプロドラッグである、請求項 1  
または 2 記載の剤。

【請求項 4】

該化合物がエチル (3S)-3-[N-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)スルファモイル]-3,6-ジヒ  
ドロ-2H-ピラン-4-カルボキシラートもしくはその塩またはそのプロドラッグである、請  
求項 1 または 2 記載の剤。

【請求項 5】

該化合物がエチル (-)-6-[(2-クロロ-4-フルオロベンジル)スルホニル]-1-シクロヘキセ  
ン-1-カルボキシラートもしくはその塩またはそのプロドラッグである、請求項 1 記載の  
剤。

【請求項 6】

該化合物がエチル (+)-6-[(2-クロロ-4-フルオロベンジル)スルホニル]-1-シクロヘキセ  
ン-1-カルボキシラートもしくはその塩またはそのプロドラッグである、請求項 1 記載の  
剤。

【請求項 7】

抗癌剤が、パクリタキセル、ドセタキセル、ビンクリスチン、ビンブラスチン、シスプラ  
チン、カルボプラチン、オキサリプラチンおよびボルテゾミブから選択される、請求項 1  
または 2 記載の剤。

【請求項 8】

抗癌剤が、パクリタキセル、ドセタキセル、ビンクリスチン、シスプラチン、カルボプラ  
チン、およびボルテゾミブから選択される、請求項 1 または 2 記載の剤。

【請求項 9】

抗癌剤がパクリタキセルである、請求項 8 記載の剤。

【請求項 10】

抗癌剤が、タキサン系抗癌剤、ビンカアルカロイド系抗癌剤、白金製剤および分子標的薬  
から選択される、請求項 1 または 2 記載の剤。

【請求項 11】

タキサン系抗癌剤が、パクリタキセルおよびドセタキセルから選択される、請求項 10 記載の剤。

【請求項 12】

ビンカルカロイド系抗癌剤が、ビンクリスチンおよびビンブラスチンから選択される、請求項 10 記載の剤。

【請求項 13】

白金製剤が、シスプラチン、カルボプラチンおよびオキサリプラチンから選択される、請求項 10 記載の剤。

【請求項 14】

分子標的薬が、ボルテゾミブである、請求項 10 記載の剤。

【請求項 15】

該化合物が、抗癌剤の副作用を抑制する他の薬物と併用して使用される、請求項 1 または 2 記載の剤。

【請求項 16】

他の薬物が、プレガバリン、ガバペンチンおよびモルヒネから選択される、請求項 15 記載の剤。

【請求項 17】

抗癌剤により誘発される末梢神経障害が、抗癌剤により誘発される末梢神経障害による感覚異常である、請求項 1 記載の剤。

【請求項 18】

抗癌剤により誘発される末梢神経障害が、抗癌剤により誘発される末梢神経障害による痺れまたは疼痛である、請求項 1 記載の剤。

【請求項 19】

抗癌剤により誘発される末梢神経障害が、抗癌剤により誘発される末梢神経障害による疼痛である、請求項 1 記載の剤。