

【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23年9月1日(2011.9.1)

【公表番号】特表2010-533717(P2010-533717A)

【公表日】平成22年10月28日(2010.10.28)

【年通号数】公開・登録公報2010-043

【出願番号】特願2010-517021(P2010-517021)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/27	(2006.01)
A 6 1 K	31/407	(2006.01)
A 6 1 K	31/445	(2006.01)
A 6 1 K	31/553	(2006.01)
A 6 1 K	31/55	(2006.01)
A 6 1 K	31/4525	(2006.01)
A 6 1 K	31/381	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/20	(2006.01)
A 6 1 P	25/26	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/02	(2006.01)
C 0 7 D	487/04	(2006.01)
C 0 7 D	211/34	(2006.01)
C 0 7 D	267/20	(2006.01)
C 0 7 D	223/26	(2006.01)
C 0 7 D	405/12	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/27	
A 6 1 K	31/407	
A 6 1 K	31/445	
A 6 1 K	31/553	
A 6 1 K	31/55	
A 6 1 K	31/4525	
A 6 1 K	31/381	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/20	
A 6 1 P	25/26	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	25/02	1 0 3
C 0 7 D	487/04	1 3 7
C 0 7 D	211/34	
C 0 7 D	267/20	
C 0 7 D	223/26	
C 0 7 D	405/12	

【手続補正書】

【提出日】平成23年7月15日(2011.7.15)

【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

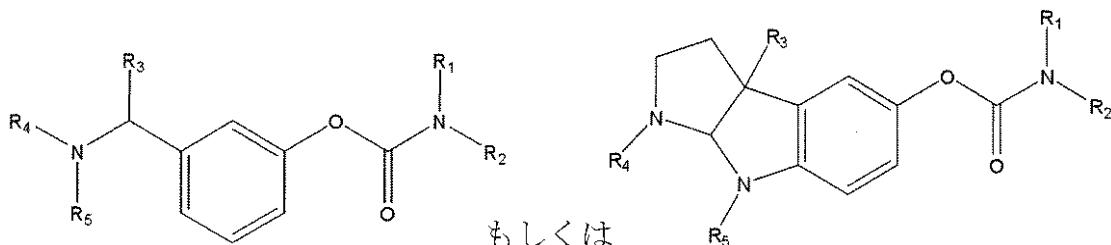
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式：

【化 1】



【式中、

R<sub>1</sub> は水素、非置換アルキル、および置換アルキルからなる群から選択され；

R<sub>2</sub> は置換アルキル、非置換アラルキル、置換アラルキル、非置換ヘテロアラルキル、置換ヘテロアラルキル、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、非置換シクロアルキル、置換シクロアルキル、非置換ヘテロシクロアルキルおよび置換ヘテロシクロアルキルからなる群から選択され；

または R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> はそれらが結合している窒素原子と一緒にになって、5 もしくは 6 員環を形成し、さらに該環は置換もしくは非置換であり；

R<sub>3</sub> は水素、非置換アルキル、および置換アルキルからなる群から選択され；

R<sub>4</sub> は水素、非置換アルキル、および置換アルキルからなる群から選択され；

R<sub>5</sub> は水素、非置換アルキル、および置換アルキルからなる群から選択される】

を有する化合物またはその医薬的に許容される塩を有効成分として含む、個体における覚醒を促進するための医薬組成物。

【請求項 2】

R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、および R<sub>5</sub> のそれぞれが非置換アルキルである、請求項 1 の医薬組成物。

【請求項 3】

R<sub>1</sub> が非置換アルキルである、請求項 1 または 2 の医薬組成物。

【請求項 4】

非置換アルキルがメチルである、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項の医薬組成物。

【請求項 5】

R<sub>3</sub> が結合している立体中心の立体配置が S 立体配置である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項の医薬組成物。

【請求項 6】

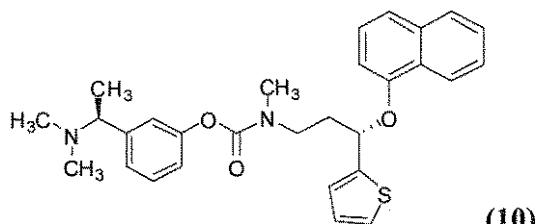
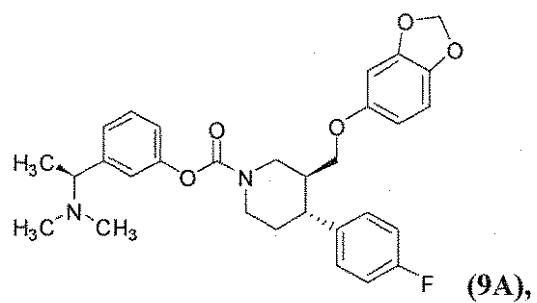
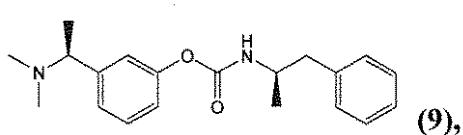
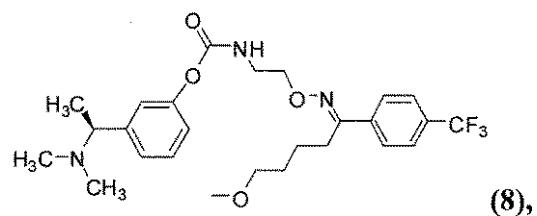
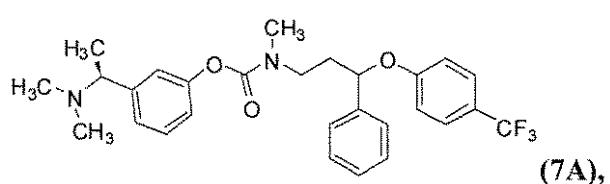
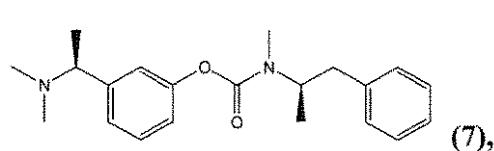
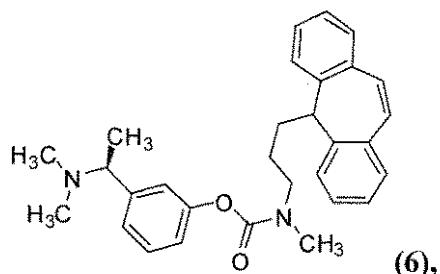
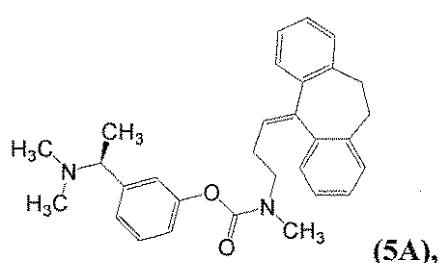
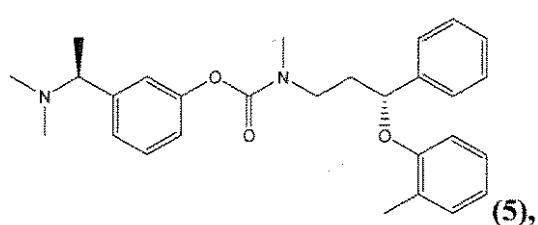
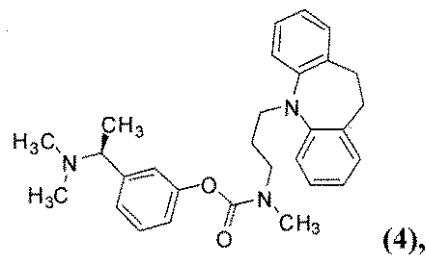
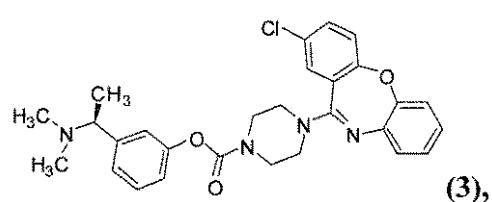
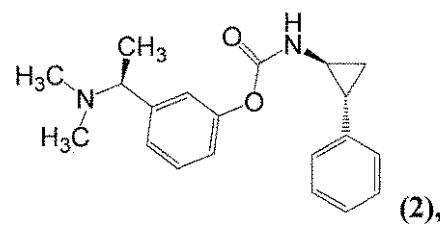
R<sub>2</sub> が非置換アラルキルである、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項の医薬組成物。

【請求項 7】

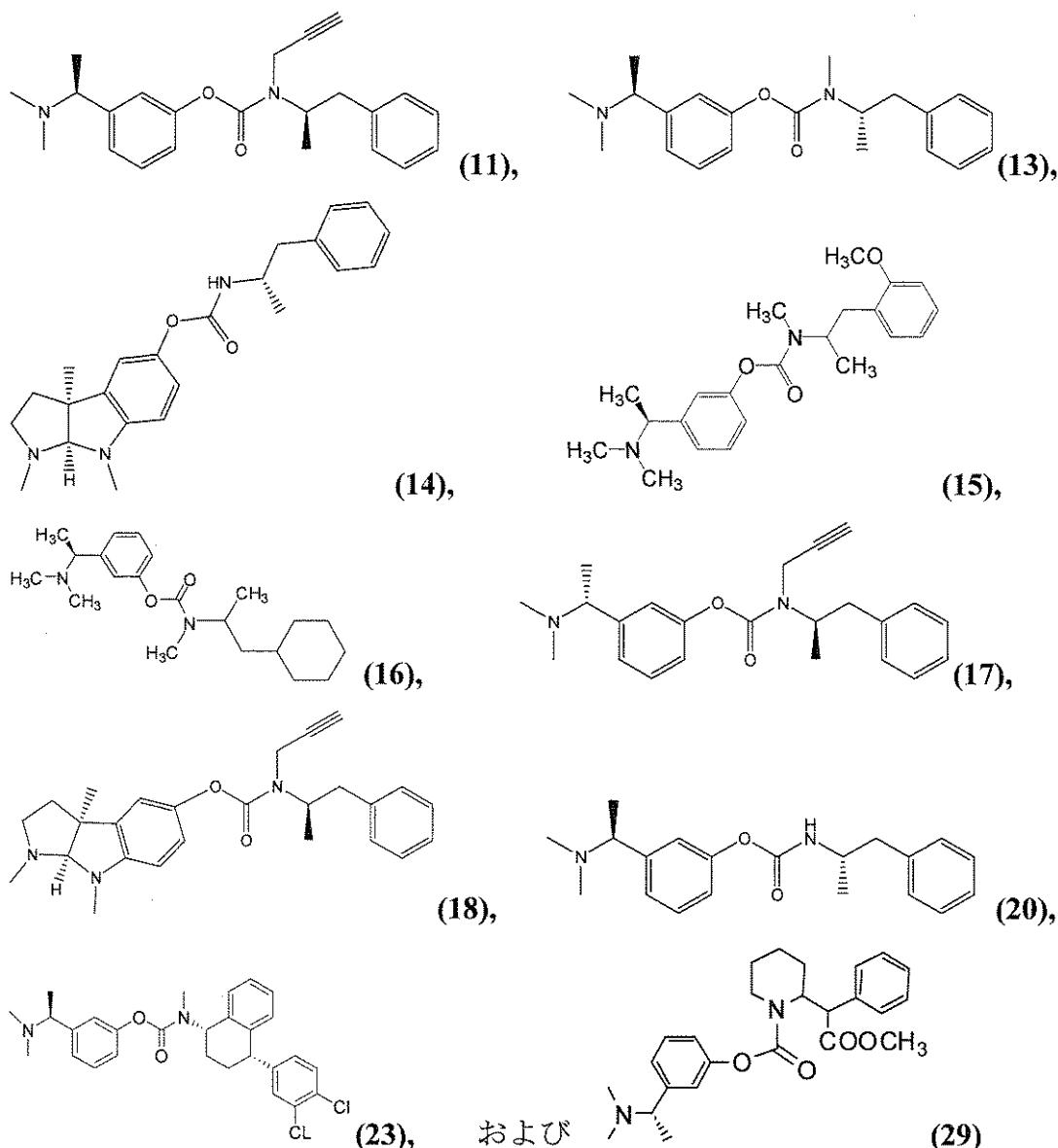
アラルキル基が、分枝鎖状アルキル基によって結合したアリール置換基である、請求項 6 の医薬組成物。

【請求項 8】

【化 2】



## 【化 3】

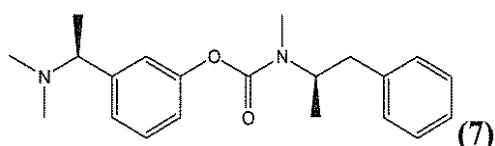


から選択される化合物またはその医薬的に許容される塩を有効成分として含む、個体における覚醒を促進するための医薬組成物。

## 【請求項 9】

式：

## 【化 4】



を有する化合物またはその医薬的に許容される塩を有効成分として含む、個体における覚醒を促進するための医薬組成物。

## 【請求項 10】

医薬的に許容される担体を含む、請求項 1～9 のいずれか 1 項の医薬組成物。

## 【請求項 11】

個体が覚醒障害、過眠症、睡眠時無呼吸、中枢性の睡眠障害、疲労、ナルコレプシーと関連する日中の過剰な眠気、うつ病性障害または抗うつ薬治療と関連する疲労および過剰な眠気から選択される障害または状態を患う、請求項 1～10 のいずれか 1 項の医薬組成物。

## 【請求項 1 2】

化合物またはその医薬的に許容される塩が用量を制限する副作用を有する、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項の医薬組成物。

## 【請求項 1 3】

用量を制限する副作用が恶心である、請求項 1 2 の医薬組成物。

## 【請求項 1 4】

化合物または医薬的に許容される塩の最小有効量 (M E D) が経口で 8 mg / kg である、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項の医薬組成物。

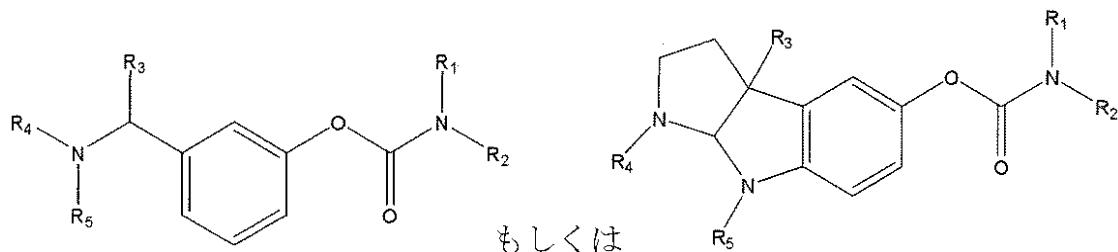
## 【請求項 1 5】

経腸的、非経口的、経口的、または筋肉内投与の形態である、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項の医薬組成物。

## 【請求項 1 6】

式：

## 【化 5】



[式中、

R<sub>1</sub> は水素、非置換アルキル、および置換アルキルからなる群から選択され；

R<sub>2</sub> は置換アルキル、非置換アラルキル、置換アラルキル、非置換ヘテロアラルキル、置換ヘテロアラルキル、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、非置換シクロアルキル、置換シクロアルキル、非置換ヘテロシクロアルキルおよび置換ヘテロシクロアルキルからなる群から選択され；

または R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> はそれらが結合している窒素原子と一緒にになって、5 もしくは 6員環を形成し、さらに該環は置換もしくは非置換であり；

R<sub>3</sub> は水素、非置換アルキル、および置換アルキルからなる群から選択され；

R<sub>4</sub> は水素、非置換アルキル、および置換アルキルからなる群から選択され；

R<sub>5</sub> は水素、非置換アルキル、および置換アルキルからなる群から選択される]

を有する化合物またはその医薬的に許容される塩を有効成分として含む、個体において覚醒を増強し、または睡眠リズムの規則性を増大させる医薬組成物。