

【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10月12日(2006.10.12)

【公表番号】特表2006-515587(P2006-515587A)

【公表日】平成18年6月1日(2006.6.1)

【年通号数】公開・登録公報2006-021

【出願番号】特願2004-560041(P2004-560041)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/197 (2006.01)

A 6 1 K 31/4245 (2006.01)

A 6 1 K 31/41 (2006.01)

A 6 1 K 31/401 (2006.01)

A 6 1 P 15/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/195 (2006.01)

C 0 7 D 271/06 (2006.01)

C 0 7 D 257/04 (2006.01)

C 0 7 D 207/16 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/197

A 6 1 K 31/4245

A 6 1 K 31/41

A 6 1 K 31/401

A 6 1 P 15/08

A 6 1 K 31/195

C 0 7 D 271/06

C 0 7 D 257/04

C

C 0 7 D 207/16

【手続補正書】

【提出日】平成18年8月22日(2006.8.22)

【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】

アルファ-2-デルタリガンド又は薬学的に許容できるその誘導体を含んでなる、早発射精の治療用の医薬組成物。

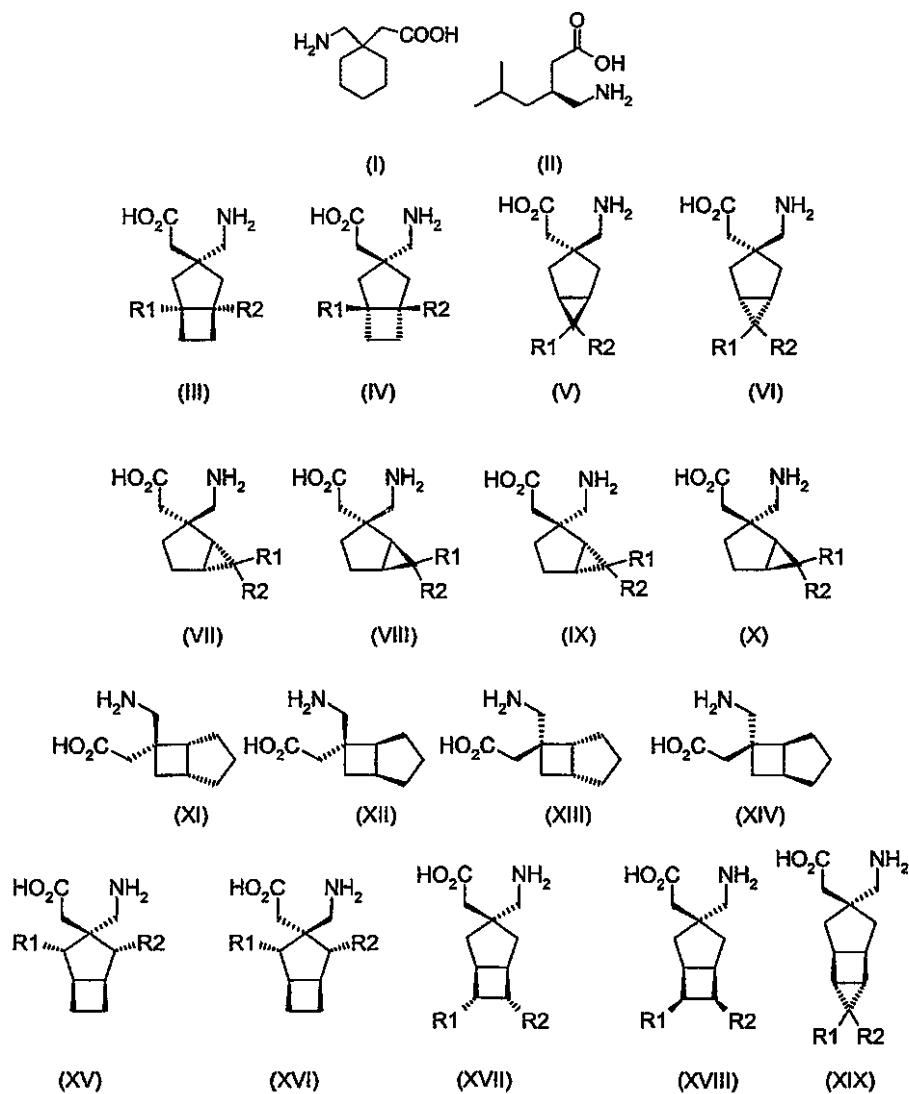
【請求項2】

請求項1の組成物であって、要時基準で投与される組成物。

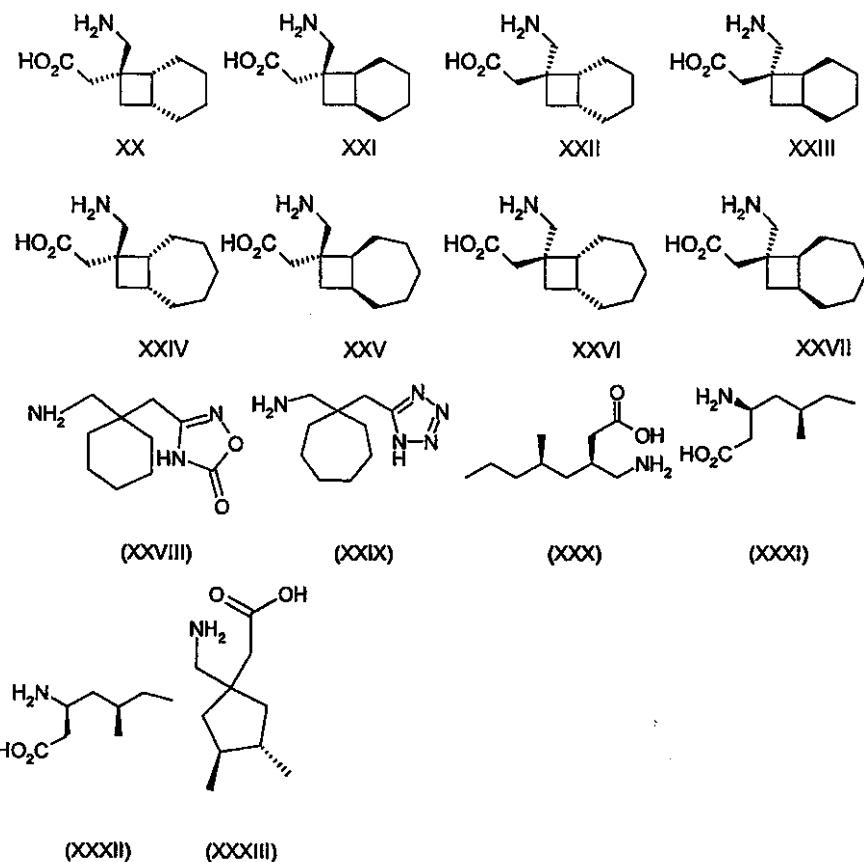
【請求項3】

請求項1又は2の組成物であって、アルファ-2-デルタリガンドが：

【化1】



## 【化2】

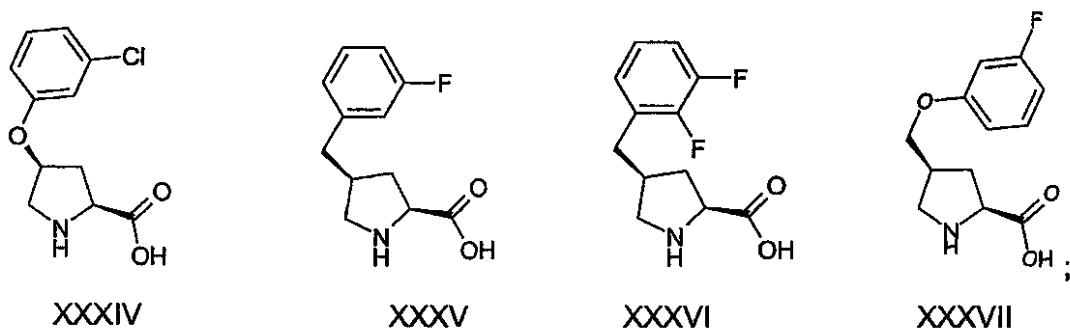


(式中、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、各々独立に、H、1～6炭素原子の直鎖状又は分枝状アルキル、3～6炭素原子のシクロアルキル、フェニル及びベンジルから選択され、但し、式(XVIII)のトリシクロオクタン化合物の場合を除いて、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が同時に水素であることはない。)

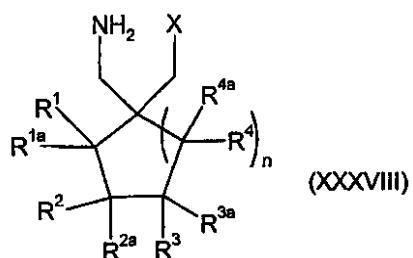
であるか又は薬学的に許容できるその誘導体；

## 【化3】



式(XXXXVIII)：

## 【化4】



(式中、

Xは、カルボン酸又はカルボン酸バイオイソステレであり；

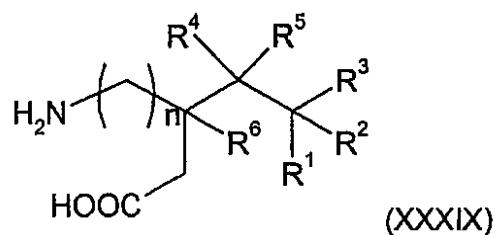
nは、0、1又は2であり；そして

R<sup>1</sup>、R<sup>1a</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>2a</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>4a</sup>は、独立に、H及びC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルから選択されるか、又は、R<sup>1</sup>とR<sup>2</sup>又はR<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>は、一緒になって、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルから選択される1又は2の置換基で置換されていてもよいC<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキル環を形成する。)

の化合物又は薬学的に許容できるその塩；

式(XXXIX)：

## 【化5】



(式中、

nは、0又は1であり、R<sup>1</sup>は、水素又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであり；R<sup>2</sup>は、水素又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであり；R<sup>3</sup>は、水素又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであり；R<sup>4</sup>は、水素又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであり；R<sup>5</sup>は、水素又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであり、そして、R<sup>6</sup>は、水素又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルである。)

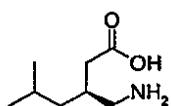
の化合物又は薬学的に許容できるその塩

から選択される組成物。

## 【請求項4】

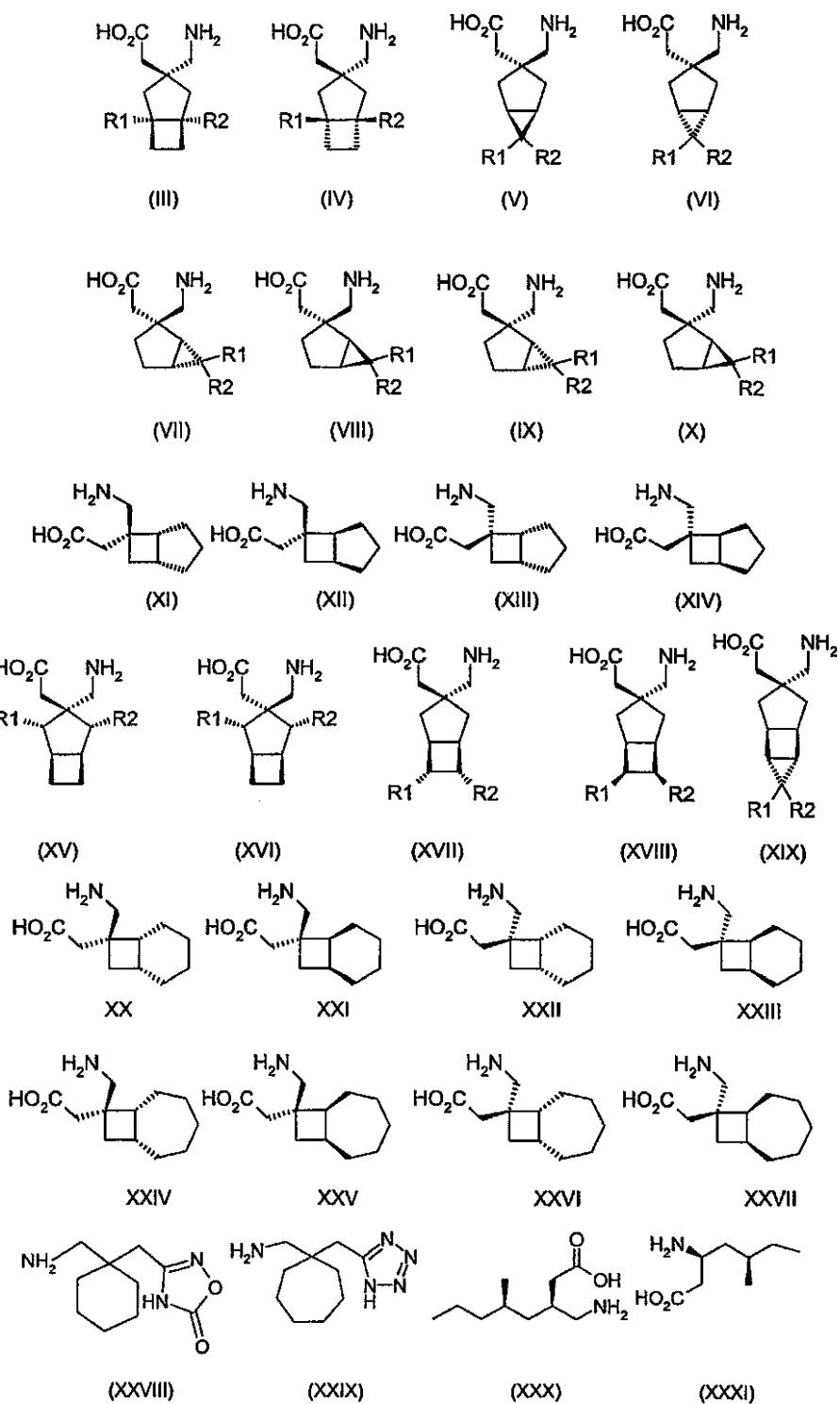
請求項1又は2の組成物であって、アルファ-2-デルタリガンドが：

## 【化6】

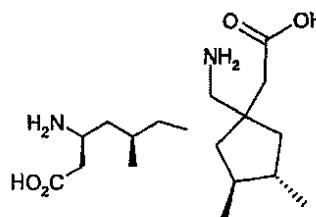


(II)

## 【化7】



## 【化 8】



(XXXII)

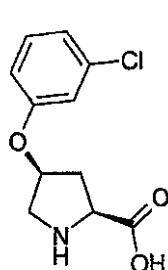
(XXXIII)

(式中、

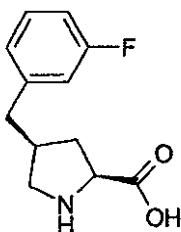
$R^1$  及び  $R^2$  は、各々独立に、H、1～6炭素原子の直鎖状又は分枝状アルキル、3～6炭素原子のシクロアルキル、フェニル及びベンジルから選択され、但し、式(XVIII)のトリシクロオクタン化合物の場合を除いて、 $R^1$  及び  $R^2$  が同時に水素であることはない。)

又は薬学的に許容できるその誘導体；及び

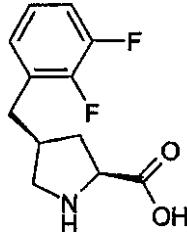
## 【化 9】



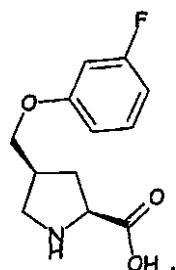
XXXIV



XXXV



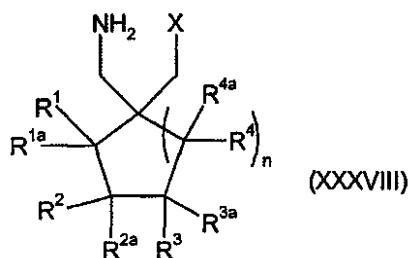
XXXVI



XXXVII

式 (XXXVIII) :

## 【化 10】



(XXXVIII)

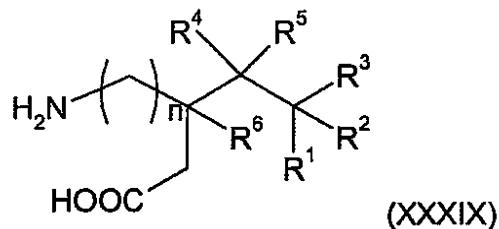
(式中、

 $X$  は、カルボン酸又はカルボン酸バイオイソステレであり； $n$  は、0、1又は2であり；そして

$R^1$ 、 $R^{1a}$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^4$  及び  $R^{4a}$  は、H であり、そして、 $R^2$  及び  $R^3$  は、独立に、H 及びメチルから選択されるか、又は、 $R^{1a}$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{3a}$  及び  $R^{4a}$  は、H であり、そして、 $R^1$  と  $R^2$  又は  $R^2$  と  $R^3$  は、一緒になって、 $C_4$ ～ $C_5$ シクロアルキル環を形成する。) の化合物又は薬学的に許容できるその塩；

式 (XXXIX) :

## 【化11】



(式中、

$R^1$ は、メチル、エチル、n-プロピル又はn-ブチルであり、 $R^2$ はメチルであり、 $R^3$ ～ $R^6$ は水素であり、そしてnは0又は1である。)

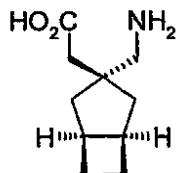
の化合物又は薬学的に許容できるその塩であって、3S,5R配置にあるものから選択される組成物。

## 【請求項5】

請求項1又は2の組成物であって、アルファ-2-デルタリガンドが：

プレガバリン(II)、(1,3,5)(3-アミノ-メチル-ビシクロ[3.2.0]ヘプチ-3-イル)-酢酸(III')：

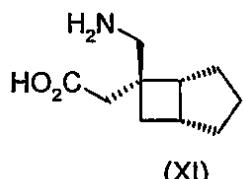
## 【化12】



(III')

[(1R,5R,6S)-6-(アミノメチル)ビシクロ[3.2.0]ヘプチ-6-イル]酢酸(XI)：

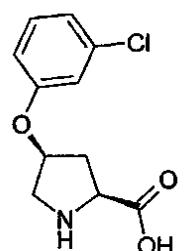
## 【化13】



及び

(2S,4S)-4-(3-クロロ-フェノキシ)-ピロリジン-2-カルボン酸(XXXIV)：

## 【化14】



(XXXIV)

から選択される組成物。