

【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22年10月7日 (2010.10.7)

【公表番号】特表2006-519208(P2006-519208A)

【公表日】平成18年8月24日 (2006.8.24)

【年通号数】公開・登録公報2006-033

【出願番号】特願2006-502001(P2006-502001)

【国際特許分類】

C 0 7 D	471/08	(2006.01)
A 6 1 K	31/551	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/22	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	21/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/18	(2006.01)
A 6 1 P	25/20	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	1/14	(2006.01)
A 6 1 P	21/02	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	15/06	(2006.01)
A 6 1 P	1/12	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	15/10	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	5/18	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	9/06	(2006.01)
A 6 1 P	1/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/36	(2006.01)
A 6 1 P	25/34	(2006.01)
A 6 1 P	25/32	(2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D	471/08	C S P
A 6 1 K	31/551	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	25/00	1 0 1
A 6 1 P	25/22	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/14	

A 6 1 P 21/04
 A 6 1 P 25/24
 A 6 1 P 25/18
 A 6 1 P 25/20
 A 6 1 P 3/04
 A 6 1 P 1/14
 A 6 1 P 21/02
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 15/06
 A 6 1 P 1/12
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 25/08
 A 6 1 P 15/10
 A 6 1 P 21/00
 A 6 1 P 5/18
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 9/12
 A 6 1 P 9/06
 A 6 1 P 1/00
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 25/04
 A 6 1 P 25/36
 A 6 1 P 25/34
 A 6 1 P 25/32

【誤訳訂正書】

【提出日】平成22年8月17日(2010.8.17)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

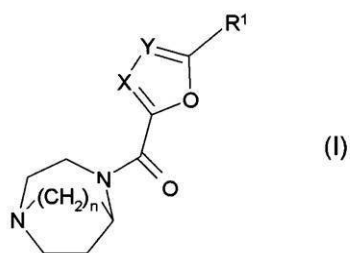
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I

【化1】



{式中、n は2であり、そして

X及びYは相互に独立してCR²、CR³及び又はNを示し、

R¹はC₁-6アルキル、C₃-7シクロアルキル、C₃-7シクロアルキル-C₁-6アルキル、C₁-6アルコキシ、CF₃、OCF₃、CN、ニトロ、2-ニトロ-フェニル、2-ニトロ-4-メチル-フェニル、3-ニトロ-フェニル、4-ニトロ-フェニル、3-トリフルオロ

メチル-フェニル、4-トリフルオロメチル-フェニル、2-ハロ-5-トリフルオロメチル-フェニル、2-アミノ-フェニル、2-アミノ-4-メチル-フェニル、3-アミノ-フェニル、2-アミノ-4-メチル-フェニル、4-ホルミルアミノ-フェニル、2-アセチルアミノ-フェニル、3-アセチルアミノ-フェニル、4-アセチルアミノ-フェニル、3-フェニル-アセトアミド、4-フェニル-アセトアミド、4-フェニル-プロピオンアミド、4-フェニル-イソブチルアミド、4-フェニル-ベンズアミド、4-(N,N-ジメチル-スルホニル-アミノ)-フェニル、4-フェニル-シクロプロパンカルボン酸アミド、4-フェニルオキシ、3,5-ジハロ-フェニルオキシ、フェニル-エチニル、2-ピリジル-チオメチル又は5-トリフルオロメチル-2-ピリジル-チオメチルを示し、

R^2 は水素、 C_{1-6} アルキル又はハロを示し、そして

R^3 は水素、 C_{1-6} アルキル又はハロを示す。}

で表わされるジアザビシクロアリアル誘導体、又はそのあらゆる対掌体又はその対掌体のあらゆる混合物、又はその薬学的に許容し得る付加塩。

【請求項2】

X及びYのうちの少なくとも一方がNを示し、そして

X及びYのうちの他方が CR^2 を示す、

請求項1記載のジアザビシクロアリアル誘導体。

【請求項3】

R^2 及び R^3 のうちの1又は2個が相互に独立して水素及び(又は)ハロを示す、請求項1記載のジアザビシクロアリアル誘導体。

【請求項4】

X及びYの双方が CR^2 、 CR^3 及び又はNを示し、

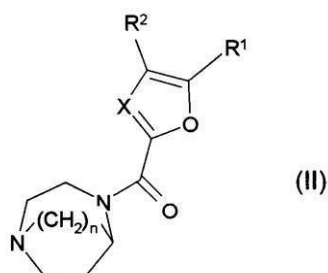
R^2 は水素、 C_{1-6} アルキル又はハロを示し、そして

R^3 は水素、 C_{1-6} アルキル又はハロを示す、請求項1記載のジアザビシクロアリアル誘導体。

【請求項5】

式II

【化2】



{ 式中、

nが2であり、そして

Xが CR^4 又はNを示し、

R^1 は C_{1-6} アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル、 C_{3-7} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 CF_3 、 OCF_3 、CN、ニトロ、2-ニトロ-フェニル、2-ニトロ-4-メチル-フェニル、3-ニトロ-フェニル、4-ニトロ-フェニル、3-トリフルオロメチル-フェニル、4-トリフルオロメチル-フェニル、2-ハロ-5-トリフルオロメチル-フェニル、2-アミノ-フェニル、2-アミノ-4-メチル-フェニル、3-アミノ-フェニル、2-アミノ-4-メチル-フェニル、4-ホルミルアミノ-フェニル、2-アセチルアミノ-フェニル、3-アセチルアミノ-フェニル、4-アセチルアミノ-フェニル、3-フェニル-アセトアミド、4-フェニル-アセトアミド、4-フェニル-プロピオンアミド、4-フェニル-イソブチルアミド、4-フェニル-ベンズアミド、4-(N,N-ジメチル-スルホニル-アミノ)-フェニル、4-フェニル-シクロプロパンカルボン酸アミド、4-フェニルオキシ、3,5-ジハロ-フェニルオキシ、フ

エニル-エチニル、2-ピリジル-チオメチル又は5-トリフルオロメチル-2-ピリジル-チオメチルを示し、

R²は水素、C₁₋₆アルキル又はハロを示し、そして

R⁴は水素、C₁₋₆アルキル又はハロを示す。}

で表わされる、請求項1記載のジアザピシクロアリール誘導体、そのあらゆる対掌体又はその対掌体のあらゆる混合物、又はその薬学的に許容し得る付加塩。

【請求項6】

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-(2-フェニル-オキサゾール-5-イル)-メタノン;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-フェニル-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル-メタノン;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-ニトロ-フラン-2-イル-メタノン;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-(4-ニトロフェニル)-フラン-2-イル-メタノン;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-フラン-2-イル-メタノン;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-(2-ニトロフェニル)-フラン-2-イル-メタノン;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-(3-ニトロフェニル)-フラン-2-イル-メタノン;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-(4-アセチルアミノフェニル)-フラン-2-イル-メタノン;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-(2-アミノフェニル)-フラン-2-イル-メタノン;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-(3-アミノフェニル)-フラン-2-イル-メタノン;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-(2-アセチルアミノフェニル)-フラン-2-イル-メタノン;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-(3-アセチルアミノフェニル)-フラン-2-イル-メタノン;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル)-フラン-2-イル-メタノン;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-(2-ニトロ-4-メチルフェニル)-フラン-2-イル-メタノン;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-(2-アミノ-4-メチルフェニル)-フラン-2-イル-メタノン;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-[4-(N,N-ジメチルスルホニル)アミノフェニル]-フラン-2-イル-メタノン;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-(4-ホルミルアミノフェニル)-フラン-2-イル-メタノン;

N-{4-[5-(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-カルボニル)-フラン-2-イル]-フェニル}-プロピオンアミド;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-(3,5-ジクロロフェノキシ)-フラン-2-イル-メタノン;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-[5-(トリフルオロメチル-2-ピリジル)-チオメチル]-フラン-2-イル-メタノン;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-フェニルエチニル-フラン-2-イル-メタノン;

N-{4-[5-(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-カルボニル)-フラン-2-イル]-フェニル}

}-ベンズアミド;

(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-イル)-5-[4-(N,N-ジフェニルスルホニルアミノ)フェニル]-フラン-2-イル-メタノン;

N-{4-[5-(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-カルボニル)-フラン-2-イル]-フェニル}-イソブチルアミド;又は

シクロプロパンカルボン酸 {4-[5-(1,4-ジアザ-ピシクロ[3.2.2]ノン-4-カルボニル)-フラン-2-イル]-フェニル}-アミド;

又は

その対掌体又はその対掌体の混合物、又はその薬学的に許容し得る付加塩である、請求項1記載のジアザピシクロアリアル誘導体。

【請求項7】

請求項1-6のいずれか1つに記載のジアザピシクロアリアル誘導体又はその薬学的に許容し得る付加塩の治療上有効な量を、少なくとも1種の薬学的に許容し得るキャリアー又は希釈剤と共に含有する医薬調合物。

【請求項8】

急性、慢性又は反復特徴の軽い、穏やかな又は激しい痛み、並びに神経障害痛、及び偏頭痛に起因する痛み、術後の痛み、幻想肢痛、慢性頭痛、中心性疼痛；糖尿病性神経痛、帯状疱疹後神経痛又は末梢神経損傷に関連する痛みの治療、予防又は緩和用医薬調合物/薬剤の製造に請求項1-6のいずれか1つに記載のジアザピシクロアリアル誘導体又はその薬学的に許容し得る付加塩を使用する方法。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0001

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0001】

本発明は、ニコチン性アセチルコリン受容体に於けるコリン作動性リガンドであると見出されている新規ジアザピシクロアリアル誘導体に関する。その薬理学的プロファイルの故に、本発明の化合物は中枢神経系(CNS)、末梢神経系(PNS)のコリン作動性系に関連する疾患又は障害、平滑筋収縮に関連する疾患又は障害、内分泌性疾患又は障害、神経変性に関連する疾患又は障害、炎症に関連する疾患又は障害、痛み、化学物質乱用の中止に起因する禁断症状のようなさまざまな疾患又は障害の治療に有効であるといえる。

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0094

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0094】

また別の実施態様において、本発明の化合物は急性、慢性又は反復特徴の軽い、穏やかな又は激しい痛み、並びに偏頭痛に起因する痛み、術後の痛み及び幻想肢痛に有用である。この痛みは、特に神経障害性の痛み、慢性頭痛、中心性疼痛；糖尿病性神経障害、帯状疱疹後神経痛又は末梢神経損傷に関連する痛みの治療に有用である。