

【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19年2月1日(2007.2.1)

【公表番号】特表2006-514946(P2006-514946A)

【公表日】平成18年5月18日(2006.5.18)

【年通号数】公開・登録公報2006-019

【出願番号】特願2004-559325(P2004-559325)

【国際特許分類】

A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	1/18	(2006.01)
A 6 1 P	11/04	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 P	37/02	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	7/00	(2006.01)
A 6 1 P	29/02	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	15/06	(2006.01)
A 6 1 P	15/00	(2006.01)
A 6 1 P	13/02	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/02	(2006.01)
A 6 1 P	31/16	(2006.01)
A 6 1 P	31/22	(2006.01)
A 6 1 P	31/18	(2006.01)
A 6 1 P	31/14	(2006.01)
A 6 1 P	31/10	(2006.01)
A 6 1 P	33/06	(2006.01)
A 6 1 P	33/04	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/04	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	19/08	(2006.01)
A 6 1 P	19/06	(2006.01)
A 6 1 P	1/02	(2006.01)
A 6 1 P	21/04	(2006.01)
A 6 1 P	5/14	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 K	31/439	(2006.01)
A 6 1 K	31/444	(2006.01)
C 0 7 D	453/02	(2006.01)
C 0 7 D	401/04	(2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)
【 F I 】
A 6 1 K 45/00
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 1/18
A 6 1 P 11/04
A 6 1 P 1/16
A 6 1 P 11/06
A 6 1 P 37/08
A 6 1 P 37/02
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 31/04
A 6 1 P 9/00
A 6 1 P 7/00
A 6 1 P 29/02
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 15/06
A 6 1 P 15/00
A 6 1 P 13/02
A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 11/02
A 6 1 P 31/16
A 6 1 P 31/22
A 6 1 P 31/18
A 6 1 P 31/14
A 6 1 P 31/10
A 6 1 P 33/06
A 6 1 P 33/04
A 6 1 P 17/02
A 6 1 P 29/00 1 0 1
A 6 1 P 9/04
A 6 1 P 27/02
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 19/08
A 6 1 P 19/06
A 6 1 P 1/02
A 6 1 P 21/04
A 6 1 P 5/14
A 6 1 P 37/06
A 6 1 K 31/439
A 6 1 K 31/444
C 0 7 D 453/02
C 0 7 D 401/04
A 6 1 P 25/02 1 0 6

【 手続補正書 】

【 提出日 】 平成18年12月1日 (2006.12.1)

【 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】

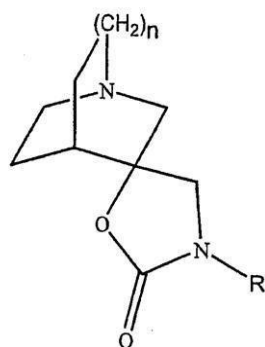
【請求項 1】

虫垂炎、消化器官、胃または十二指腸潰瘍、腹膜炎、膵臓炎、喉頭蓋炎、無弛緩症、胆管炎、胆嚢炎、肝炎、ホウrippル病、喘息、アレルギー、アナフィラキシー性ショック、免疫複合疾患、再灌流障害、臓器壊死、枯草熱、セプシス、敗血症、内毒素ショック、悪質液、異常高熱、エオシン好性肉芽腫、肉芽腫症、類肉芽腫症、敗血性流産、精巢上体炎、膣炎、前立腺炎、尿道炎、気管支炎、肺気腫、鼻炎、嚢胞性線維症、肺炎、珪性肺塵症、肺胞炎、細気管支炎、咽頭炎、胸膜炎、静脈洞炎、インフルエンザ、呼吸器シンチュームウイルス感染、ヘルペス感染、HIV感染、B型肝炎ウイルス感染、C型肝炎ウイルス感染、播種性菌血症、デング熱、カンディディアシス、マラリア、フィラリア、アメーバー症、包虫嚢胞、火傷、脈管炎、血管炎、心内膜炎、動脈炎、アテローム性動脈硬化症、血栓性静脈炎、心膜炎、心筋炎、結節性動脈周囲炎、リウマチ熱、セリアック病、うっ血性心不全、成人呼吸促進症候群、慢性閉塞性肺性疾患、髄膜炎、脳炎、神経炎、神経痛、脊髄損傷、麻痺、ぶどう膜炎、関節炎、関節痛、骨髓炎、筋膜炎、ページェット病、痛風、歯周疾患、リウマチ様関節炎、滑膜炎、重症筋無力症、甲状腺炎、全身性紅斑狼瘡、グッドパスチャー症候群、ベチェット症候群、同種移植拒絶、移植片対宿主疾患、強直性脊椎炎、バーガー病、強直性脊椎炎、バーガー病、リタイヤー症候群およびホジキン病からなる群より選ばれる状態を患う患者を処置するための医薬を製造するための 7ニコチン性受容体を選択性のあるコリン作動性アゴニストの使用。

【請求項 2】

コリン作動性アゴニストが、コカインの第 4 アナログ；(1-アザ-ピシクロ[2.2.2]オクチ-3-イル)-カルバミン酸 1-(2-フルオロフェニル)-エチルエステル；式 I：

【化 1】

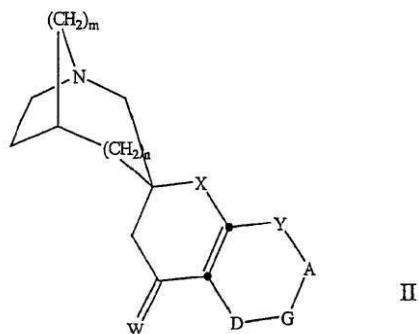


I

(式中、Rは水素またはメチルを表し、
nは0または1を表す)

の化合物；式 I の化合物の薬学的に許容されうる塩；式 II：

【化 2】



(式中：

mは、1または2である；

nは、0または1である；

Yは、CH、NまたはNOである；

Xは、酸素または硫黄である；

Wは、酸素、H₂またはF₂である；

Aは、NまたはC(R²)である；

Gは、NまたはC(R³)である；

Dは、NまたはC(R⁴)である；

ただし、A、GおよびDの内のわずか1つが、窒素であるが、Y、A、GおよびDの内の少なくとも1つは、窒素またはNOである；

R¹は、水素またはC₁～C₄アルキルである；

R²、R³およびR⁴は、独立して水素、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₂～C₄アルケニル、C₂～C₄アルキニル、アリール、ヘテロアリール、OH、OC₁～C₄アルキル、CO₂R₁、-CN、-NO₂、-NR₅R₆、-CF₃または-OSO₂CF₃であるか、またはR²およびR³、R³およびR⁴は、それぞれ、AおよびG、またはGおよびDをそれぞれ共有し、0～2の間の窒素原子を含有する別の6員芳香族またはヘテロ芳香族環と一緒に形成し得、以下の置換基：独立して水素、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₂～C₄アルケニル、C₂～C₄アルキニル、アリール、ヘテロアリール、OH、OC₁～C₄アルキル、CO₂R¹、-CN、-NO₂、-NR⁵R⁶、-CF₃または-OSO₂CF₃の1つから2つまでで置換されうる；

R⁵およびR⁶は、独立して、水素、C₁～C₄アルキル、C(O)R⁷、C(O)NHR⁸、C(O)OR⁹、SO₂R¹⁰であるか、または一緒に、(CH₂)_jQ(CH₂)_k(式中、QはO、S、NR¹¹である)、

または結合でありうる；

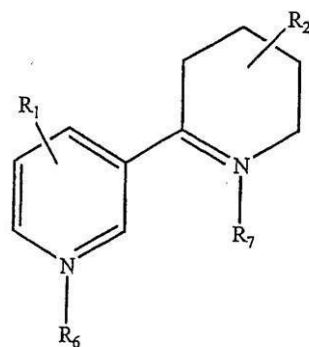
jは、2から7までである；

kは、0から2までである；

R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰およびR¹¹は、独立して、C₁～C₄アルキル、アリール、またはヘテロアリールであるか、またはそのエナンチオマーである)

の化合物；式IIの化合物の薬学的に許容されうる塩；式III：

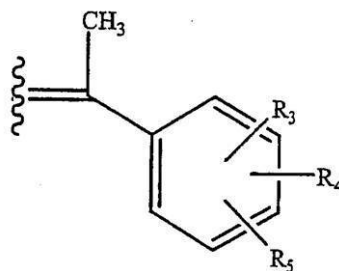
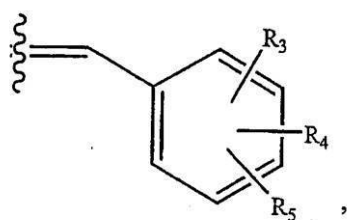
【化 3】



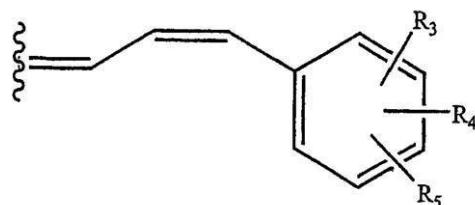
III

(式中、 R_1 、 R_6 および R_7 は、水素または $C_1 \sim C_4$ アルキルである； R_2 は、

【化 4】



および

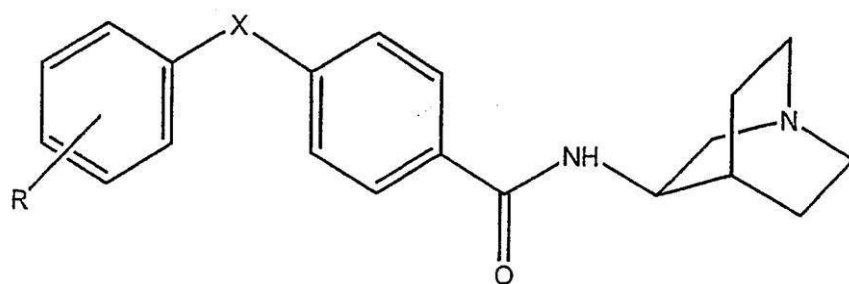


(式中、 R_3 、 R_4 および R_5 は、水素、アルキルの各々で1～4個の炭素を有する、N,N-ジアルキルアミノで任意に置換された $C_1 \sim C_4$ アルキル、アルキルの各々に1～4個の炭素を有する、N,N-ジアルキルアミノで任意に置換された $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、アルコキシに1～4個の炭素を有するカルボアルコキシ、アミノ、アシルに1～4個の炭素を有するアミド；シアノ、および各々のアルキルに1～4個の炭素を有するN,N-ジアルキルアミノ；ハロ；ヒドロキシルまたはニトロからなる群から選ばれる)

から選ばれる)

の化合物；および式IV：

【化 5】



IV

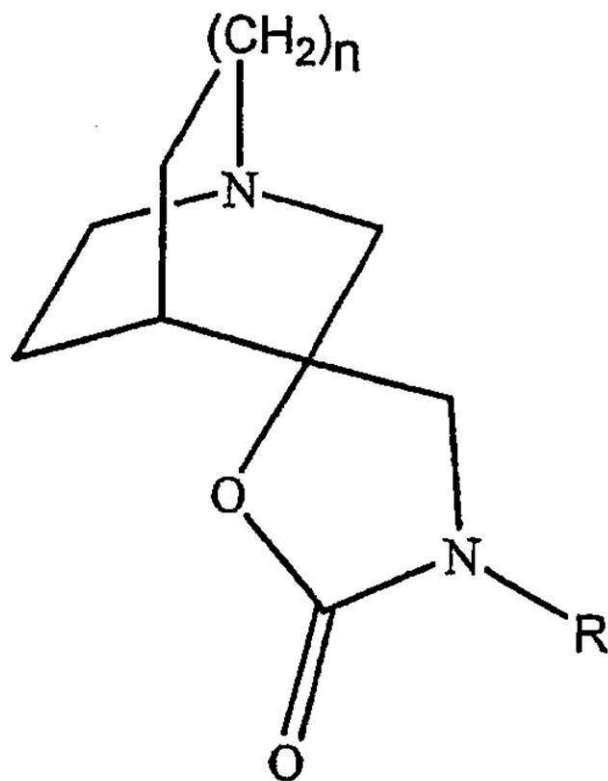
(式中、Xは、OまたはSであり、Rは、H、OR₁、NHC(O)R₁、およびハロゲンからなる群より選ばれ、R₁はC₁-C₄アルキルである)

の化合物からなる群より選ばれる請求項1記載の使用。

【請求項3】

コリン作動性アゴニストが式I：

【化 6】



I

(式中、Rは水素またはメチルを表し、

nは0または1である)

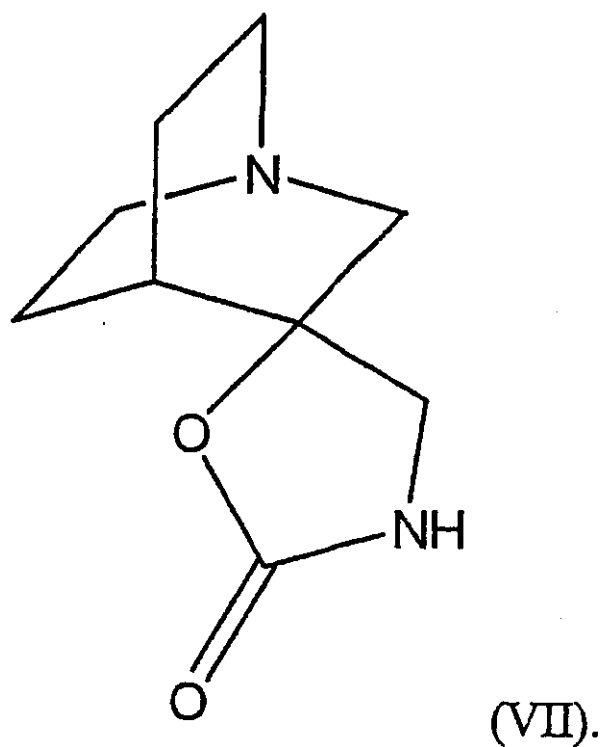
の化合物；

またはその薬学的に許容されうる塩である請求項1記載の使用。

【請求項 4】

コリン作動性アゴニストが(-)-スピロ[1-アザビシクロ[2.2.2]オクタン-3,5'-オキサゾリジン-2'-オン]

【化 7】

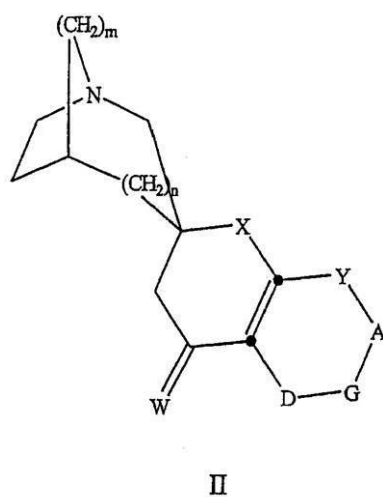


である請求項 3 記載の使用。

【請求項 5】

コリン作動性アゴニストが式 II :

【化 8】



(式中：mは、1または2である；

nは、0または1である；

Yは、CH、NまたはNOである；

Xは、酸素または硫黄である；

Wは、酸素、 H_2 または F_2 である；

Aは、Nまたは $C(R^2)$ である；

Gは、Nまたは $C(R^3)$ である；

Dは、Nまたは $C(R^4)$ である；

ただし、A、GおよびDの内のわずか1つが、窒素であるが、Y、A、GおよびDの内の少なくとも1つは、窒素またはNOである；

R^1 は、水素または $C_1 \sim C_4$ アルキルである；

R^2 、 R^3 および R^4 は、独立して水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、OH、 $OC_1 \sim C_4$ アルキル、 CO_2R_1 、-CN、-NO₂、-NR₅R₆、-CF₃または-OSO₂CF₃であるか、または R^2 および R^3 、 R^3 および R^4 は、それぞれ、AおよびG、またはGおよびDをそれぞれ共有し、0～2の間の窒素原子を含有する別の6員芳香族またはヘテロ芳香族環と一緒に形成し得、以下の置換基：独立して水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、OH、 $OC_1 \sim C_4$ アルキル、 CO_2R^1 、-CN、-NO₂、-NR⁵R⁶、-CF₃または-OSO₂CF₃の1つから2つまでで置換されうる；

R^5 および R^6 は、独立して、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)NHR^8$ 、 $C(O)OR^9$ 、 SO_2R^{10} であるか、または一緒に、 $(CH_2)_jQ(CH_2)_k$ (式中、QはO、S、NR¹¹である)、

または結合でありうる；

jは、2から7までである；

kは、0から2までである；

R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} および R^{11} は、独立して、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、アリール、またはヘテロアリールであるか、またはそのエナンチオマーである)

の化合物またはその薬学的に許容されうる塩である請求項1記載の使用。

【請求項6】

コリン作動性アゴニストが式IIの化合物であり、式中、mが1である；nは0である；pは0である；xは酸素である；Aは $C(R^2)$ である；Gは $C(R^3)$ である；Dは $C(R^4)$ である、請求項5記載の使用。

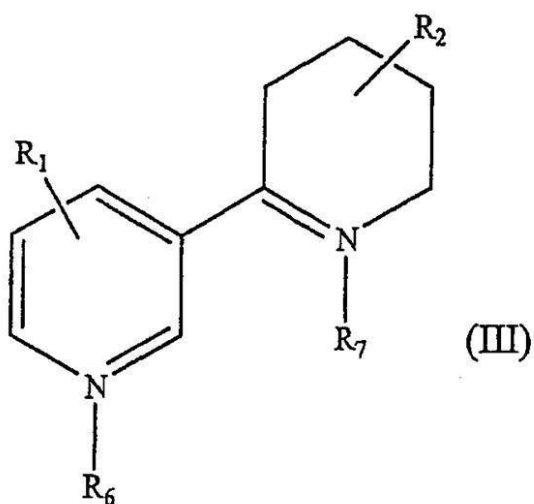
【請求項7】

コリン作動性アゴニストが5'-フェニルスピロ[1-アザビシクロ[2.2.2]オクタン-3,2'-(3'H)-フロ[2,3-b]ピリジン]である請求項5記載の使用。

【請求項8】

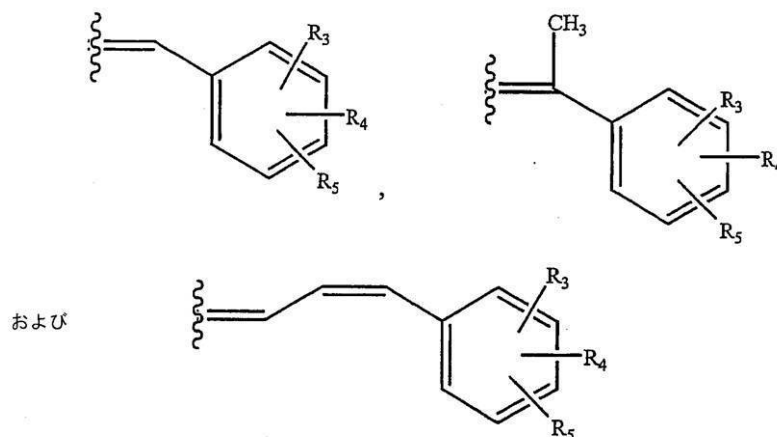
コリン作動性アゴニストが式III：

【化9】



(式中、 R_1 、 R_6 および R_7 は、水素または $C_1 \sim C_4$ アルキルである； R_2 は、

【化 10】



(式中、 R_3 、 R_4 および R_5 は、水素、アルキルの各々で1～4個の炭素を有する、 N,N -ジアルキルアミノで任意に置換された $C_1 \sim C_4$ アルキル、アルキルの各々に1～4個の炭素を有する、 N,N -ジアルキルアミノで任意に置換された $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、アルコキシに1～4個の炭素を有するカルボアルコキシ、アミノ、アシルに1～4個の炭素を有するアミド；シアノ、および各々のアルキルに1～4個の炭素を有する N,N -ジアルキルアミノ；ハロ；ヒドロキシルまたはニトロからなる群から選ばれる)から選ばれる)

の化合物である請求項1記載の使用。

【請求項9】

コリン作動性アゴニストが式IIIの化合物であり、式中、 R_2 は、テトラヒドロピリジン環の3位置に結合され、さらにフェニル環の4-または2-位置に結合される R_3 は、アミノ、ヒドロキシ、クロロ、シアノ、ジメチルアミノ、メチル、メトキシ、アセチルアミノ、アセトキシ、およびニトロからなる群より選ばれる請求項8記載の使用。

【請求項10】

コリン作動性アゴニストが式III、式中、 R_3 はヒドロキシルであり、 R_1 、 R_4 および R_5 は水素である；式III、式中、 R_3 は、アセチルアミノであり、 R_1 、 R_4 および R_5 は、水素である；式III、式中、 R_3 は、アセトキシであり、 R_1 、 R_4 および R_5 は、水素である；式III、式中、 R_3 は、メトキシであり、 R_1 、 R_4 および R_5 は、水素である、式III、式中、 R_3 は、メトキシであり、 R_1 および R_4 は、水素であり、さらに式中 R_3 は、フェニル環の2位置に結合され、フェニル環の4位に結合される R_5 はメトキシまたはヒドロキシである群より選ばれる請求項8記載の使用。

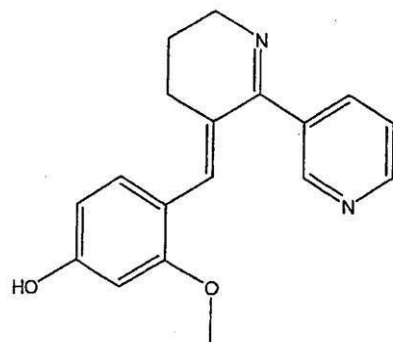
【請求項11】

コリン作動性アゴニストが、3-2,4-ジメトキシベンジリジンアナバセイン(DMXB-A)、3-(4-ヒドロキシベンジリデン)アナバセイン、3-(4-メトキシベンジリデン)アナバセイン、3-(4-アミノベンジリデン)アナバセイン、3-(4-ヒドロキシ-2-メトキシベンジリデン)アナバセイン、3-(4-メトキシ-2-ヒドロキシベンジリデン)アナバセイン、トランス-3-シンナミリデンアナバセイン、トランス-3-(2-メトキシ-シンナミリデン)アナバセインおよびトランス-3-(4-メトキシシンナミリデン)アナバセインからなる群より選ばれる請求項8記載の使用。

【請求項12】

コリン作動性アゴニストが3-(4-ヒドロキシ-2-メトキシベンジリデン)アナバシン

【化 1 1】



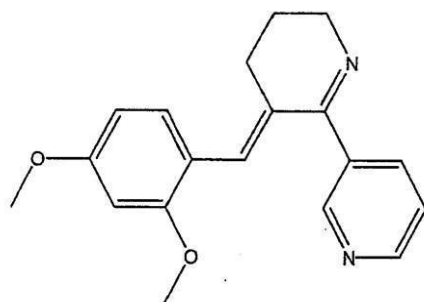
(VI).

である請求項 8 記載の使用。

【請求項 1 3】

コリン作動性アゴニストが 3-(2,4-ジメトキシベンジリデン)アナバセイン

【化 1 2】



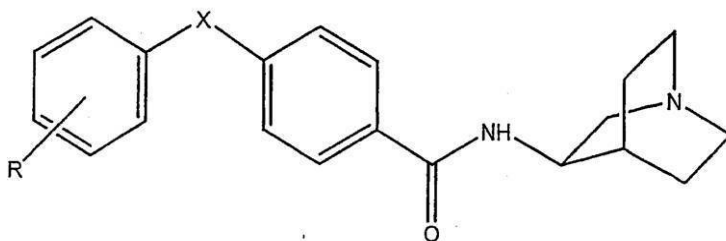
(V).

である請求項 8 記載の使用。

【請求項 1 4】

コリン作動性アゴニストが式 IV :

【化 1 3】



IV

(式中、XはOまたはSである；

RはH、OR₁、NHC(O)R₁およびハロゲンからなる群から選ばれ、R₁はC₁-C₄アルキルである)の化合物である請求項 1 記載の使用。

【請求項 1 5】

コリン作動性アゴニストが、N-[(3R)-1-アザビシクロ[2.2.2]オクチ-3-イル]-4-(4-ヒドロキシフェノキシ)ベンズアミド、N-[(3R)-1-アザビシクロ[2.2.2]オクチ-3-イル]-4-(4-アセトアミドフェノキシ)ベンズアミド、N-[(3R)-1-アザビシクロ[2.2.2]オクチ-3-イル]-4-(フェニルスルファニル)ベンズアミド、およびN-[(3R)-1-アザビシクロ[2.2.2]オクチ-3-イル]-4-(3-クロロフェニルスルホニル)ベンズアミドからなる群より選ばれる請

求項 1 3 記載の使用。

【請求項 1 6】

コリン作動性アゴニストが、N-[(3R)-1-アザビシクロ[2.2.2]オクチ-3-イル]-4-(フェニルスルファニル)ベンズアミドである請求項 1 3 記載の使用。

【請求項 1 7】

コリン作動性アゴニストがコカインメチオガイドである請求項 1 記載の使用。

【請求項 1 8】

状態が、虫垂炎、消化器官、胃または十二指腸潰瘍、腹膜炎、膵臓炎、肝炎、喘息、アレルギー、アナフィラキシー性ショック、臓器壊死、枯草熱、セプシス、敗血症、内毒素ショック、悪質液、敗血性流産、播種性菌血症、火傷、セリアック病、うっ血性心不全、成人呼吸促進症候群、慢性閉塞性肺性疾患、リウマチ様関節炎、全身性紅斑狼瘡、脊髄損傷、麻痺、同種移植拒絶および移植片対宿主疾患からなる群より選ばれる請求項 1 記載の使用。

【請求項 1 9】

状態が、虫垂炎、消化器官、胃または十二指腸潰瘍、腹膜炎、膵臓炎、肝炎、喘息、アレルギー、アナフィラキシー性ショック、臓器壊死、枯草熱、セプシス、敗血症、内毒素ショック、悪質液、敗血性流産、播種性菌血症、火傷、うっ血性心不全、成人呼吸促進症候群、慢性閉塞性肺性疾患、リウマチ様関節炎、全身性紅斑狼瘡、脳梗塞、脳塞栓症、脊髄損傷、麻痺、同種移植拒絶または移植片対宿主疾患からなる群より選ばれる請求項 1 記載の使用。

【請求項 2 0】

状態が、腹膜炎、膵臓炎、セプシス、内毒素ショック、成人呼吸促進症候群、慢性閉塞性肺性疾患、リウマチ様関節炎、全身性紅斑狼瘡、同種移植拒絶、喘息、移植片対宿主疾患、うっ血性心不全および嚢胞性線維症からなる群より選ばれる請求項 1 記載の使用。

【請求項 2 1】

状態が、腹膜炎、膵臓炎、セプシス、内毒素ショック、悪液質、成人呼吸促進症候群、慢性閉塞性肺性疾患、リウマチ様関節炎、全身性紅斑狼瘡、および同種移植拒絶からなる群より選ばれる請求項 1 記載の使用。

【請求項 2 2】

状態がセプシスである請求項 1 記載の使用。