

【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4月13日(2006.4.13)

【公表番号】特表2005-526745(P2005-526745A)

【公表日】平成17年9月8日(2005.9.8)

【年通号数】公開・登録公報2005-035

【出願番号】特願2003-572956(P2003-572956)

【国際特許分類】

C 07 D 209/96 (2006.01)

A 61 K 31/403 (2006.01)

A 61 P 25/04 (2006.01)

【F I】

C 07 D 209/96 C S P

A 61 K 31/403

A 61 P 25/04

【手続補正書】

【提出日】平成18年2月23日(2006.2.23)

【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

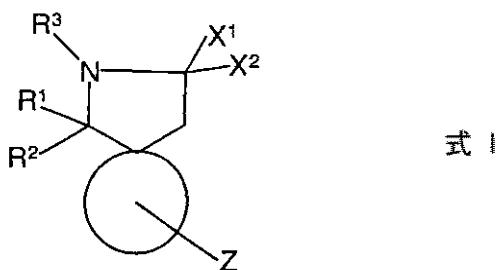
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

薬剤としての一般式I

【化1】



[式中、X¹およびX²は一緒にになってチオキソ基を表し、

R¹は水素であり、かつR²は水素、ヒドロキシ、ホルミル、カルボキシ、ハロゲン、メルカブト、スルホニル、アミノ、アミドもしくは基-R⁷Q¹から選択されているか、またはR¹およびR²は一緒にになってオキソ基もしくはチオキソ基を形成し、

R³は水素、ヒドロキシ、アミノもしくは基-R⁸Q²であり、

Zは共通する炭素原子を介して第一の複素環と結合した飽和の環であり、該環はアザスピロ原子を含んで5~8員であり、炭素原子以外にOもしくはSから選択される1つもしくは2つの環形成ヘテロ原子を有していてもよく、かつ非置換であるか、または水素、ヒドロキシ、ホルミル、カルボキシ、ハロゲン、メルカブト、スルホニル、アミノ、アミドもしくは基-R⁹Q³から選択される1つもしくは複数の置換基により置換されており、

R⁷およびR⁹は相互に無関係にC₁~C₅-アルキル、C₃~C₆-シクロアルキル、C₂~C₅-アルケニル、C₂~C₅-アルキニル、C₁~C₅-アルコキシ、C₁~C₅-アルキルカルボニル、C₁~C₅-アルコキカルボニル、C₁~C₅-アルキルチオ、C₁~C₅-アルキルアミノ、C₁~C₅-アルキルスルフィニル、C₁~C₅-

アルキルスルホニル、C₁～C₅-アルキルアミノ-C₁～C₅-アルキル、C₁～C₅-アルキルチオ-C₁～C₅-アルキルまたはC₁～C₅-アルコキシ-C₁～C₅-アルキルであり、

R⁸はC₁～C₅-アルキル、C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₅-アルコキシ、C₁～C₅-アルキルカルボニル、C₁～C₅-アルコキシカルボニル、C₁～C₅-アルキルチオ、C₁～C₅-アルキルアミノ、C₁～C₅-アルキルスルフィニル、C₁～C₅-アルキルスルホニル、C₁～C₅-アルキルチオ-C₁～C₅-アルキルまたはC₁～C₅-アルコキシ-C₁～C₅-アルキルから選択されており、

Q¹およびQ³は相互に無関係に水素、ヒドロキシ、ホルミル、カルボキシ、ハロゲン、メルカプト、スルホニル、アミノまたはアミドであり、

Q²は水素、ヒドロキシ、ホルミル、カルボキシ、ハロゲン、メルカプト、スルホニルまたはアミドから選択されている]のアザスピロ化合物ならびにその可能な互変異性体および/または薬剤学的に許容される塩。

【請求項2】

R³が水素またはC₁～C₅-アルキルカルボニルである、請求項1記載の薬剤としてのアザスピロ化合物。

【請求項3】

Zが5員、6員もしくは7員の環である、請求項1または2記載の薬剤としてのアザスピロ化合物。

【請求項4】

Zが非置換の環である、請求項1から3までのいずれか1項記載の薬剤としてのアザスピロ化合物。

【請求項5】

Zがシクロヘキサン、シクロヘキサンまたはシクロヘプタンである、請求項1から4までのいずれか1項記載の薬剤としてのアザスピロ化合物。

【請求項6】

R¹およびR²がそれぞれ水素であるか、または一緒になってオキソ基またはチオキソ基を形成する、請求項1から5までのいずれか1項記載の薬剤としてのアザスピロ化合物。

【請求項7】

R¹およびR²がそれぞれ水素であり、かつR³が水素またはメチルカルボニルである、請求項1から6までのいずれか1項記載の薬剤としてのアザスピロ化合物。

【請求項8】

アザスピロ化合物が次の群：
 2-アザスピロ[4,5]デカン-3-チオン、
 2-アザスピロ[4,4]ノナン-3-チオン、
 2-アザスピロ[4,6]ウンデカン-3-チオン、
 から選択されている、薬剤としてのアザスピロ化合物。

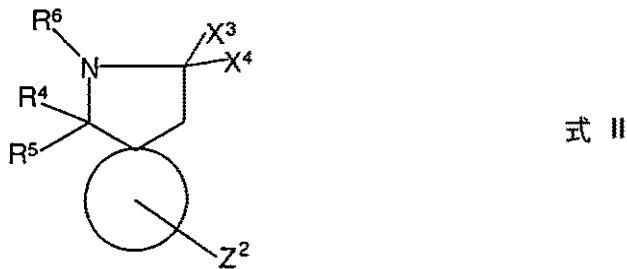
【請求項9】

請求項1から8までのいずれか1項記載のアザスピロ化合物および少なくとも1種の医薬品添加剤を含有する医薬組成物。

【請求項10】

痛みを治療するための薬剤を製造するための、一般式II

【化2】



[式中、 X^3 および X^4 は一緒になってチオキソ基を表し、

R^4 、 R^5 は相互に無関係に水素、ヒドロキシ、ホルミル、カルボキシ、ハロゲン、メルカプト、スルホニル、アミノ、アミドもしくは基 - $R^{1\sim 0}Q^4$ であるか、または一緒になってオキソ基もしくはチオキソ基を形成し、

R^6 は水素、ヒドロキシ、アミノもしくは基 - $R^{1\sim 1}Q^5$ であり、

Z^2 は共通の炭素原子を介して第一の複素環に結合した飽和の環であり、該環はアザスピロ原子を含んで4~10員であり、炭素原子以外にN、OもしくはSから選択される1つもしくは2つの環形成ヘテロ原子を有していてもよく、かつ非置換であるか、または水素、ヒドロキシ、ホルミル、カルボキシ、ハロゲン、メルカプト、スルホニル、アミノ、アミドもしくは基 - $R^{1\sim 2}Q^6$ から選択される1つもしくは複数の置換基により置換されており、

$R^{1\sim 0}$ 、 $R^{1\sim 1}$ および $R^{1\sim 2}$ は相互に無関係に $C_1 \sim C_5$ - アルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_2 \sim C_5$ - アルケニル、 $C_2 \sim C_5$ - アルキニル、 $C_1 \sim C_5$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_5$ - アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_5$ - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_5$ - アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_5$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_5$ - アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_5$ - アルキルアミノ - $C_1 \sim C_5$ - アルキル、 $C_1 \sim C_5$ - アルキルチオ - $C_1 \sim C_5$ - アルキルもしくは $C_1 \sim C_5$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_5$ - アルキルであり、

Q^4 、 Q^5 および Q^6 は相互に無関係に水素、ヒドロキシ、ホルミル、カルボキシ、ハロゲン、メルカプト、スルホニル、アミノもしくはアミドである]のアザスピロ化合物または可能な互変異性体および/または薬剤学的に許容される塩の使用。

【請求項11】

R^6 が水素または $C_1 \sim C_5$ - アルキルカルボニルである、請求項10記載の使用。

【請求項12】

Z^2 が5員、6員もしくは7員の環である、請求項10または11記載の使用。

【請求項13】

Z^2 が非置換の環である、請求項10から12までのいずれか1項記載の使用。

【請求項14】

Z^2 がシクロヘキサン、シクロヘキサンまたはシクロヘプタンである、請求項10から13までのいずれか1項記載の使用。

【請求項15】

R^4 および R^5 がそれぞれ水素であるか、または一緒になってオキソ基もしくはチオキソ基を形成する、請求項10から14までのいずれか1項記載の使用。

【請求項16】

R^4 および R^5 がそれぞれ水素であり、かつ R^6 が水素またはメチルカルボニルである、請求項10から15までのいずれか1項記載の使用。

【請求項17】

アザスピロ化合物が、次の群

2 - アザスピロ [4 , 5] デカン - 3 - チオン、

2 - アザスピロ [4 , 4] ノナン - 3 - チオン、

2 - アザスピロ [4 , 6] ウンデカン - 3 - チオン、
から選択されている、請求項 10 記載の使用。

【請求項 18】

痛みが慢性、慢性の炎症性および / または神経障害性の痛みである、請求項 10 から 17 までのいずれか 1 項記載の使用。

【請求項 19】

次の群

2 - アザスピロ [4 , 5] デカン - 3 - チオン、
2 - アザスピロ [4 , 4] ノナン - 3 - チオン、
2 - アザスピロ [4 , 6] ウンデカン - 3 - チオン、
N - (2 - アザスピロ [4 . 5] デカン - 3) - オキシム、
N - (2 - アザスピロ [4 . 6] ウンデカン) - 3 - オキシム
1 - (2 - アザスピロ [4 . 5] デセ - 2 イル) - エタノン
から選択されるアザスピロ化合物。