

【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21年11月5日(2009.11.5)

【公表番号】特表2004-532246(P2004-532246A)

【公表日】平成16年10月21日(2004.10.21)

【年通号数】公開・登録公報2004-041

【出願番号】特願2002-591475(P2002-591475)

【国際特許分類】

C 0 7 D 307/68 (2006.01)  
A 6 1 K 31/341 (2006.01)  
A 6 1 P 1/08 (2006.01)  
A 6 1 P 1/12 (2006.01)  
A 6 1 P 9/00 (2006.01)  
A 6 1 P 9/06 (2006.01)  
A 6 1 P 13/02 (2006.01)  
A 6 1 P 17/04 (2006.01)  
A 6 1 P 23/02 (2006.01)  
A 6 1 P 25/04 (2006.01)  
A 6 1 P 25/24 (2006.01)  
A 6 1 P 25/26 (2006.01)  
A 6 1 P 25/28 (2006.01)  
A 6 1 P 25/30 (2006.01)  
A 6 1 P 25/32 (2006.01)  
A 6 1 P 29/00 (2006.01)  
C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 307/68  
A 6 1 K 31/341  
A 6 1 P 1/08  
A 6 1 P 1/12  
A 6 1 P 9/00  
A 6 1 P 9/06  
A 6 1 P 13/02  
A 6 1 P 17/04  
A 6 1 P 23/02  
A 6 1 P 25/04  
A 6 1 P 25/24  
A 6 1 P 25/26  
A 6 1 P 25/28  
A 6 1 P 25/30  
A 6 1 P 25/32  
A 6 1 P 29/00  
C 0 7 B 61/00 3 0 0

【誤訳訂正書】

【提出日】平成21年9月9日(2009.9.9)

【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】請求項4

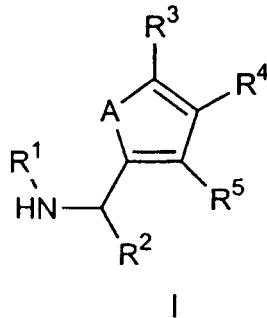
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【請求項 4】

そのラセミ化合物の形に、純粋な対掌体又はジアステレオマーの形に又は任意の混合割合での対掌体又はジアステレオマーの混合物の形にある、一般式 (I)

【化 4】

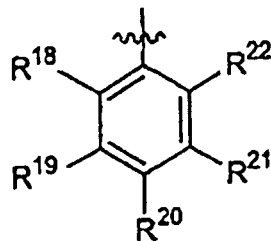


{ 式中 :

A は、O 又は S であり ;

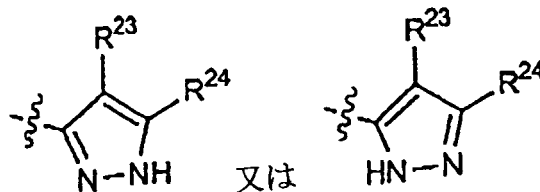
R<sup>1</sup> は

【化 5】



又は

【化 6】



を示し、

R<sup>2</sup> は -C(=O)-フェニル又は -シクロ-C<sub>3</sub>H<sub>4</sub>R<sup>17</sup> を示し、

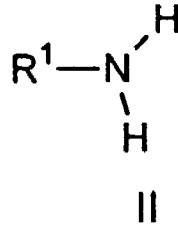
R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> 及び R<sup>5</sup> は相互に独立して H、メチル、-CH<sub>2</sub>-OH、-CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>3</sub> 又は -CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>2</sub>-フラン-2-イル、-C(=O)Oメチル、-C(=O)Oエチル、-CH<sub>2</sub>-C(=O)Oエチルを示し、

R<sup>17</sup> は -C(=O)OH 又は -C(=O)OC<sub>1-6</sub>-アルキルを示し、

R<sup>18</sup>、R<sup>19</sup>、R<sup>20</sup>、R<sup>21</sup>、R<sup>22</sup>、R<sup>23</sup> 及び R<sup>24</sup> は相互に独立して H、OH、SH、-O-C<sub>1-6</sub>-アルキル、-Oアリール、-S-C<sub>1-6</sub>-アルキル、-Sアリール、F、Cl、Br、I、-CN、C<sub>1-6</sub>-アルキル、CF<sub>3</sub>、CO(=O)H、CO(=O)-C<sub>1-6</sub>-アルキル 又は -N=N-アリールを示す。}

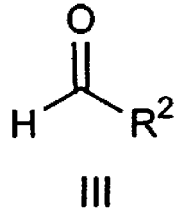
で表わされる化合物又はその薬学的に許容し得る塩を製造する方法において、一般式 (II)

【化 7】



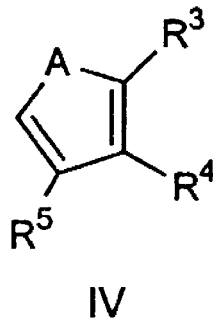
(式中、 $R^1$  は上記に定義された通りである。)  
 で表わされるアミンを一般式 ( I I I )

【化 8】



(式中、 $R^2$  は上記に定義された通りである。)  
 で表わされるアルデヒド及び一般式 ( I V )

【化 9】



(式中、 $A$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  及び  $R^5$  は上記に定義された通りである。)  
 で表わされるヘテロ環と酸の存在下に反応させる、上記一般式 ( I ) で表わされる化合物の製造方法。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】請求項 7

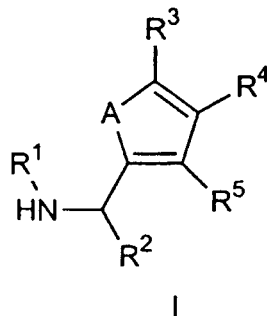
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【請求項 7】

そのラセミ化合物の形に、純粋な対掌体又はジアステレオマーの形に又は任意の混合割合での対掌体又はジアステレオマーの混合物の形にある、一般式 ( I )

【化 10】

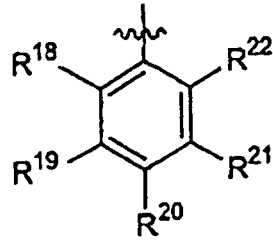


{ 式中 :

A は、O 又は S であり；

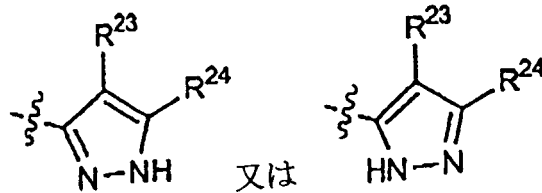
R<sup>1</sup> は

【化 1 1】



又は

【化 1 2】



を示し、

R<sup>2</sup> は -C(=O)-フェニル又は -シクロ-C<sub>3</sub>H<sub>4</sub>R<sup>17</sup> を示し、

R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> 及び R<sup>5</sup> は相互に独立して H、メチル、-CH<sub>2</sub>-OH、-CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>3</sub> 又は -CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>2</sub>-フラン-2-イル、-C(=O)Oメチル、-C(=O)Oエチル、-CH<sub>2</sub>-C(=O)Oエチルを示し、

R<sup>17</sup> は -C(=O)OH 又は -C(=O)OC<sub>1-6</sub>-アルキルを示し、

R<sup>18</sup>、R<sup>19</sup>、R<sup>20</sup>、R<sup>21</sup>、R<sup>22</sup>、R<sup>23</sup> 及び R<sup>24</sup> は相互に独立して H、OH、SH、-O-C<sub>1-6</sub>-アルキル、-Oアリール、-S-C<sub>1-6</sub>-アルキル、-Sアリール、F、Cl、Br、I、-CN、C<sub>1-6</sub>-アルキル、CF<sub>3</sub>、CO(=O)H、CO(=O)-C<sub>1-6</sub>-アルキル又は -N=N-アリールを示す。}

で表わされる化合物又は その薬学的に許容し得る塩 を含有する医薬。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】請求項 8

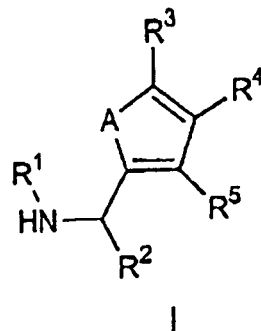
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【請求項 8】

そのラセミ化合物の形に、純粋な対掌体又はジアステレオマーの形に又は任意の混合割合での対掌体又はジアステレオマーの混合物の形にある、一般式 (I)

【化 1 3】

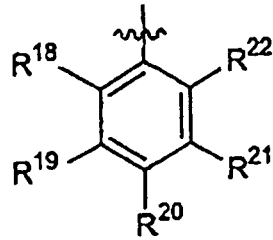


{ 式中：

A は、O 又は S であり；

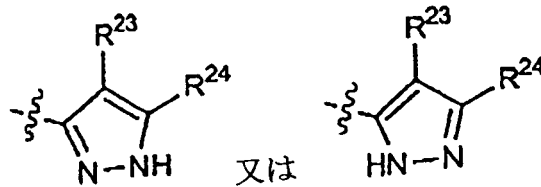
R<sup>1</sup> は

【化 1 4】



又は

【化 1 5】



を示し、

$R^2$  は - C ( = O ) - フェニル又は - シクロ -  $C_3H_4$   $R^{17}$  を示し、

$R^3$ 、 $R^4$  及び  $R^5$  は相互に独立して H、メチル、-  $CH_2$  - OH、-  $CH_2$  - S -  $CH_3$  又は -  $CH_2$  - S -  $CH_2$  - フラン - 2 - イル、- C ( = O ) Oメチル、- C ( = O ) Oエチル、-  $CH_2$  - C ( = O ) Oエチルを示し、

$R^{17}$  は - C ( = O ) OH 又は - C ( = O ) O  $C_{1-6}$  - アルキルを示し、

$R^{18}$ 、 $R^{19}$ 、 $R^{20}$ 、 $R^{21}$ 、 $R^{22}$ 、 $R^{23}$  及び  $R^{24}$  は相互に独立して H、OH、SH、- O -  $C_{1-6}$  - アルキル、- Oアリール、- S -  $C_{1-6}$  - アルキル、- Sアリール、F、Cl、Br、I、- CN、 $C_{1-6}$  - アルキル、 $CF_3$ 、CO ( = O ) H、CO ( = O ) -  $C_{1-6}$  - アルキル又は - N = N - アリールを示す。}

で表わされる化合物又はその薬学的に許容し得る塩を鎮痛剤の製造に使用する方法。

【誤訳訂正 4】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】請求項 9

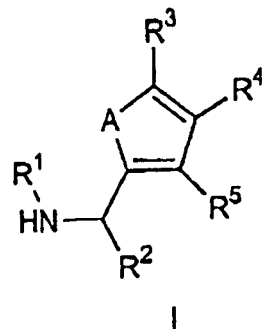
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【請求項 9】

そのラセミ化合物の形に、純粋な対掌体又はジアステレオマーの形に又は任意の混合割合での対掌体又はジアステレオマーの混合物の形にある、一般式 ( I )

【化 1 6】

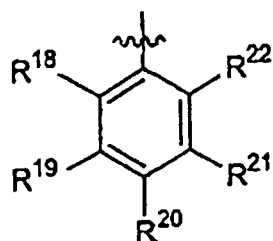


{ 式中 :

A は、O 又は S であり ;

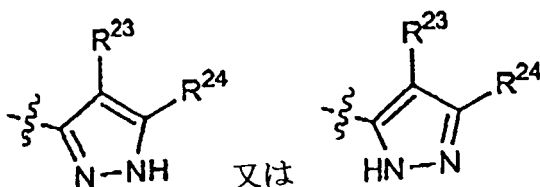
 $R^1$  は

【化 17】



又は

【化 18】



を示し、

$R^2$  は -C(=O)-フェニル又は -シクロ-C<sub>3</sub>H<sub>4</sub>R<sup>17</sup> を示し、

$R^3$ 、 $R^4$  及び  $R^5$  は相互に独立して H、メチル、-CH<sub>2</sub>-OH、-CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>3</sub> 又は -CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>2</sub>-フラン-2-イル、-C(=O)Oメチル、-C(=O)Oエチル、-CH<sub>2</sub>-C(=O)Oエチルを示し、

$R^{17}$  は -C(=O)OH 又は -C(=O)OC<sub>1-6</sub>-アルキルを示し、

$R^{18}$ 、 $R^{19}$ 、 $R^{20}$ 、 $R^{21}$ 、 $R^{22}$ 、 $R^{23}$  及び  $R^{24}$  は相互に独立して H、OH、SH、-O-C<sub>1-6</sub>-アルキル、-Oアリール、-S-C<sub>1-6</sub>-アルキル、-Sアリール、F、Cl、Br、I、-CN、C<sub>1-6</sub>-アルキル、CF<sub>3</sub>、CO(=O)H、CO(=O)-C<sub>1-6</sub>-アルキル又は -N=N-アリールを示す。}

で表わされる化合物又はその薬学的に許容し得る塩を局所麻酔薬又は不整脈治療薬の製造に使用する方法。

【誤訳訂正 5】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】請求項 10

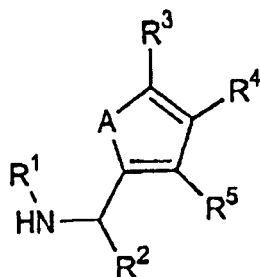
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【請求項 10】

そのラセミ化合物の形に、純粋な対掌体又はジアステレオマーの形に又は任意の混合割合での対掌体又はジアステレオマーの混合物の形にある、少なくとも 1 種の一般式 (I)

【化 19】

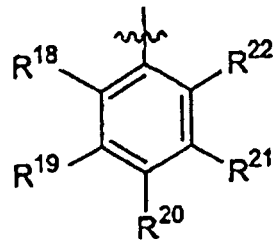


{ 式中 :

A は、O 又は S であり ;

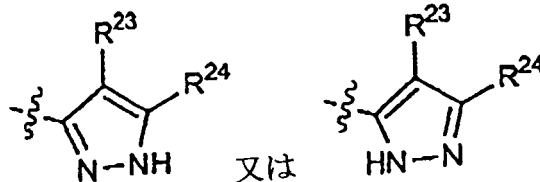
 $R^1$  は

【化20】



又は

【化21】



を示し、

$R^2$  は -C(=O)-フェニル又は -シクロ-C<sub>3</sub>H<sub>4</sub>R<sup>17</sup> を示し、

$R^3$ 、 $R^4$  及び  $R^5$  は相互に独立してH、メチル、-CH<sub>2</sub>-OH、-CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>3</sub> 又は -CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>2</sub>-フラン-2-イル、-C(=O)Oメチル、-C(=O)Oエチル、-CH<sub>2</sub>-C(=O)Oエチルを示し、

$R^{17}$  は -C(=O)OH 又は -C(=O)OC<sub>1-6</sub>-アルキルを示し、

$R^{18}$ 、 $R^{19}$ 、 $R^{20}$ 、 $R^{21}$ 、 $R^{22}$ 、 $R^{23}$  及び  $R^{24}$  は相互に独立してH、OH、SH、-O-C<sub>1-6</sub>-アルキル、-Oアリール、-S-C<sub>1-6</sub>-アルキル、-Sアリール、F、Cl、Br、I、-CN、C<sub>1-6</sub>-アルキル、CF<sub>3</sub>、CO(=O)H、CO(=O)-C<sub>1-6</sub>-アルキル又は -N=N-アリールを示す。}

で表わされる化合物又はその薬学的に許容し得る塩及び少なくとも1種の医薬用助剤を含有する薬学的調合物。

【誤訳訂正6】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0002

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0002】

慢性および非慢性痛状態の治療は医療において重要な意味を有する。したがって慢性および非慢性痛状態の患者に合い、かつ目的にかなった治療への十分に有効な治療が世界的に要求されている。但しこの場合これは患者に対して効果があり、そして満足のいく痛みの治療を意味する。

【誤訳訂正7】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0003

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0003】

モルフィンのような古典的オピオイドが強い痛みないし著しく強い痛みの治療に十分に有効である。その使用は公知の副作用、たとえば呼吸抑制、嘔吐、鎮静、便秘及び耐薬性の発生によって制限される。更にこれは特に腫瘍患者が煩う神経障害又は付随する痛みあまり有効でない。

【誤訳訂正8】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0004

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0004】

オピオイドは、いわゆるGタンパク質結合レセプターのファミリーに属する、細胞膜に存在するレセプターと結合することによってその鎮静作用を発揮する。これと共に、痛みの発生及び痛みの更なる伝達系に著しく関与するその他のレセプターおよびイオンチャネル、たとえばナトリウムチャネルのいわゆるパトラコトキシン - ( B T X - ) 結合部位 ( = 結合部位 2 ) がある。

【誤訳訂正9】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0005

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0005】

本発明は、痛みの治療に、場合によっては慢性痛および神経症性痛の治療にも適している鎮痛効果のある化合物を提供することを課題とする。これらの物質としては、この特性を持つ上に、モルヒネ類の薬物適用時に通例発現するような、例えば悪心、嘔吐、依存症、呼吸活動の低下または便秘などの副作用をできる限り起こさないものでなければならない。

【誤訳訂正10】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0048

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0048】

さらに、それぞれのジアステレオマーまたは対掌体だけでなく、ラセミ化合物または対掌体の混合物も含めた、本発明に基づく一般式 ( I ) を持つ少なくとも1つの化合物を、遊離塩基または遊離酸の形態で、あるいは生理学的相容性のある酸または塩基によって形成される塩、特に塩化水素酸塩およびナトリウム塩の形態で、痛み治療用医薬の製造のために使用することも本発明の対象である。本発明に基づく化合物は鎮痛効果を有することが実証されており、ナトリウムチャネルの結合位置 2 ( B T X 結合位置 ) に対し高い親和性を持っている。