

【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20年5月8日 (2008.5.8)

【公表番号】特表2005-508381 (P2005-508381A)

【公表日】平成17年3月31日 (2005.3.31)

【年通号数】公開・登録公報2005-013

【出願番号】特願2003-542132 (P2003-542132)

【国際特許分類】

C 07 C 211/40 (2006.01)

A 61 K 31/13 (2006.01)

A 61 K 31/415 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 1/08 (2006.01)

A 61 P 1/16 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 21/04 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 25/02 (2006.01)

A 61 P 25/06 (2006.01)

A 61 P 25/08 (2006.01)

A 61 P 25/14 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 25/22 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 25/30 (2006.01)

A 61 P 25/32 (2006.01)

A 61 P 25/34 (2006.01)

A 61 P 25/36 (2006.01)

A 61 P 27/06 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 31/12 (2006.01)

A 61 P 31/18 (2006.01)

A 61 P 31/22 (2006.01)

A 61 P 33/02 (2006.01)

A 61 P 33/06 (2006.01)

A 61 P 37/02 (2006.01)

A 61 P 37/04 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

C 07 D 295/02 (2006.01)

【 F I 】

C 07 C 211/40

A 61 K 31/13

A 61 K 31/415

A 61 P 1/04

A 61 P 1/08

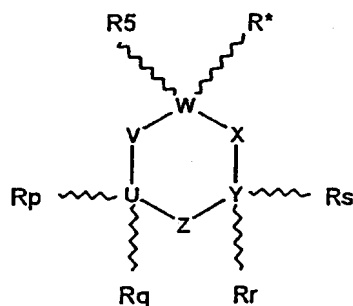
A 61 P 1/16

A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	21/04	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/02	1 0 1
A 6 1 P	25/06	
A 6 1 P	25/08	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/22	
A 6 1 P	25/24	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/30	
A 6 1 P	25/32	
A 6 1 P	25/34	
A 6 1 P	25/36	
A 6 1 P	27/06	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	31/12	
A 6 1 P	31/18	
A 6 1 P	31/22	
A 6 1 P	33/02	
A 6 1 P	33/06	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	37/04	
A 6 1 P	43/00	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
C 0 7 D	295/02	Z
C 0 7 M	7:00	

【誤訳訂正書】**【提出日】**平成20年3月17日(2008.3.17)**【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】**

次式 I :

【化 1】



[式中、

- R^* は、 $-(A)_n-(CR_1R_2)_m-NR_3R_4$ であり、
 - $n+m$ は、0、1 または 2 であり、
 - A は、線状もしくは分枝状 C 1 ~ C 6 アルキル、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル、及び線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニル からなる群から選択され、
 - R_1 及び R_2 は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 C 1 ~ C 6 アルキル、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル 及び線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニル からなる群から選択され、
 - R_3 及び R_4 は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 C 1 ~ C 6 アルキル、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル 及び線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニル からなる群から選ばれるか、または一緒にあって、C 2 ~ C 10 アルキレン または C 2 ~ C 10 アルケニレン を形成するか、または N 原子と一緒にあって、場合によっては C 1 ~ 6 アルキル 及び (又は) C 2 ~ 6 アルケニル によって置換された 3 ~ 7 員のアザシクロアルカンもしくはアザシクロアルケンを形成し、
 - R_5 は、独立して、線状もしくは分枝状 C 1 ~ C 6 アルキル、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル 及び線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニル からなる群から選ばれるか、または R_5 は、それが結合する炭素原子及び隣の炭素原子と組合わさって二重結合を形成し、
 - R_p 、 R_q 、 R_r 及び R_s は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 C 1 ~ C 6 アルキル、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル 及び線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニル からなる群から選ばれるか、または R_p 、 R_q 、 R_r 及び R_s は、独立して、それが結合する炭素原子及び隣の炭素原子と組合わさって二重結合を形成することができるか、または R_p 、 R_q 、 R_r 及び R_s は、独立して、それが結合する U ともしくは Y と二重結合を形成することができ、
- 但し、 $U-V-W-X-Y-Z$ は、
- シクロヘキサン、
- シクロヘキセ - 2 - エン、
- シクロヘキセ - 3 - エン、
- シクロヘキサ - 1, 4 - ジエン、
- シクロヘキサ - 1, 5 - ジエン、
- シクロヘキサ - 2, 4 - ジエン、及び
- シクロヘキサ - 2, 5 - ジエン
- から選択され、
- 及び但し、 R_p 及び R_q のうちの少なくとも一つは水素ではなく、かつ R_r 及び R_s のうちの少なくとも一つは水素ではなく、
- 及び但し、 $U-Z$ がシクロヘキサンである場合は、 $-(A)_n-(CR_1R_2)_m-$ 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_p 、 R_q 、 R_r 及び R_s のうちの少なくとも一つは、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル または線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニル である]
- で表されるものから選ばれる化合物

[但し、1 - (3 , 3 , 5 , 5 - テトラメチルシクロヘキシリデン) - N、N - ジメチル - 2 - プロパンアミン、

1 - [(3 , 5 , 5 - トリメチル - 1 - シクロヘキシ - 2 - エニリデン) メチル] ピロリジン、

3 , 3 , 5 - トリメチルシクロヘキサ - 1 , 5 - ジエン - 1 - ピペリジン、及び
3 , 5 - ジメチルシクロヘキサ - 1 , 5 - ジエン - 1 - ピペリジンは除く。]

及びその光学異性体、又はその薬学的に許容し得る酸もしくは塩基付加塩。

【請求項 2】

次の物質、すなわち

1 - エテニル - 3 , 3 , 5 , 5 - テトラメチルシクロヘキシルアミン、

2 - (3 , 3 , 5 , 5 - テトラメチルシクロヘキシリデン) エタンアミン、

1 - アミノ - 3 , 3 , 5 - トリメチル - 2 - シクロヘキセン、

1 , 3 , 5 , 5 - テトラメチル - 2 - シクロヘキセン - 1 - アミン、

1 - アリル - 3 , 3 , 5 , 5 - テトラメチルシクロヘキサニルアミン、

1 - (3 , 3 , 5 , 5 - テトラメチルシクロヘキシリデン) - 2 - プロパンアミン、

1 - (3 , 3 - ジエチル - 5 , 5 - ジメチルシクロヘキシリデン) - 2 - プロパンアミン

、

c i s - 3 - ビニル - 1 , 3 , t r a n s - 5 - トリメチルシクロヘキシルアミン、

2 - メチル - 1 - (3 , 3 , 5 , 5 - テトラメチル - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル) -

2 - プロパンアミン、

1 - (1 - アリル - 3 , 3 , 5 , 5 - テトラメチルシクロヘキシル) ピペリジン、

2 - (1 - ビニル - 3 , 3 , 5 , 5 - テトラメチルシクロヘキシル - 1) エチルアミン、

1 - [3 , 3 , 5 , 5 - テトラメチル - 1 - (3 - メチル - 2 - ブテニル) シクロヘキシル] ピペリジン、

1 - [3 , 3 , 5 , 5 - テトラメチル - 1 - (2 - プロピニル) シクロヘキシル] ピペリジン、

2 - (1 , 3 , 3 , 5 , 5 - ペンタメチルシクロヘキシル) - 4 - ペンテニルアミン、

3 - (3 , 3 , 5 , 5 - テトラメチルシクロヘキシリデン) プロパンアミン、

2 - メチル - 1 - (3 , 3 , 5 , 5 - テトラメチルシクロヘキシリデン) - 2 - プロパンアミン、

2 - (3 , 3 , 5 , 5 - テトラメチルシクロヘキシリデン) プロパンアミン、

N - メチル - 1 - エテニル - 3 , 3 , 5 , 5 - テトラメチルシクロヘキシルアミン、

N - アリル - 1 , 3 , 3 , 5 , 5 - ペンタメチルシクロヘキサニルアミン、

からなる群から選ばれる請求項 1 の化合物、これの光学異性体又は薬学的に許容し得る酸もしくは塩基付加塩。

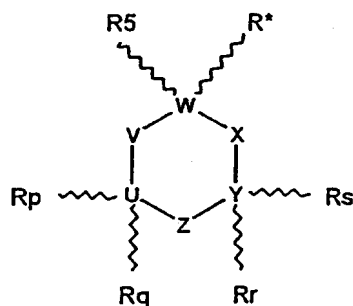
【請求項 3】

一種以上の薬学的に許容し得る希釈剤、賦形剤及び(又は)キャリアと組み合わせて、請求項 1 または 2 に記載の式 I で表わされる化合物を含む薬学的調合物。

【請求項 4】

次式 I :

【化 2】



[式中、

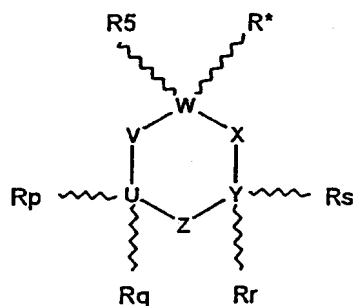
- R^* は、 $-(A)_n-(CR_1R_2)_m-NR_3R_4$ であり、
 - $n+m$ は、0、1 または 2 であり、
 - A は、線状もしくは分枝状 C 1 ~ C 6 アルキル、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル 及び線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニル からなる群から選択され、
 - R_1 及び R_2 は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 C 1 ~ C 6 アルキル、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル 及び線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニル からなる群から選択され、
 - R_3 及び R_4 は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 C 1 ~ C 6 アルキル、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル 及び線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニル からなる群から選ばれるか、または、一緒になって、C 2 ~ C 10 アルキレン または C 2 ~ C 10 アルケニレン を形成するか、または、窒素原子と一緒に、場合によっては C 1 ~ 6 アルキル 及び (又は) C 2 ~ 6 アルケニル によって置換された 3 ~ 7 員のアザシクロアルカンもしくはアザシクロアルケンを形成し、
 - R_5 、 R_p 、 R_q 、 R_r 及び R_s は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 C 1 ~ C 6 アルキル、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル 及び線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニル からなる群から選ばれるか、または R_5 、 R_p 、 R_q 、 R_r 及び R_s は、独立して、それが結合する炭素原子及び隣の炭素原子と組合わさって、二重結合を形成することができるか、または R_p 、 R_q 、 R_r 及び R_s は、独立して、それが結合する U とまたは Y と二重結合を形成することができ、
- 但し、 $U-V-W-X-Y-Z$ は、
- シクロヘキサン、
- シクロヘキセ - 1 - エン、
- シクロヘキセ - 2 - エン、
- シクロヘキセ - 3 - エン、
- シクロヘキサ - 1, 3 - ジエン、
- シクロヘキサ - 1, 4 - ジエン、
- シクロヘキサ - 1, 5 - ジエン、
- シクロヘキサ - 2, 4 - ジエン、及び
- シクロヘキサ - 2, 5 - ジエン、
- から選択され、
- 及び但し、 $U-Z$ がシクロヘキサンである場合は、 $-(A)_n-(CR_1R_2)_m-$ 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_p 、 R_q 、 R_r のうちの少なくとも一つは、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル または線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニル である]

で表されるものから選ばれる化合物、その光学異性体又はその薬学的に許容し得る酸もしくは塩基付加塩の有効な量を含む、NMDA アンタゴニストによって治療可能な病態を軽減するための薬学的調合物。

【請求項 5】

次式 I :

【化 3】



[式中、

- R^* は、 $-(A)_n-(CR_1R_2)_m-NR_3R_4$ であり、
 - $n+m$ は、0、1 または 2 であり、
 - A は、線状もしくは分枝状 C 1 ~ C 6 アルキル、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル 及び線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニル からなる群から選択され、
 - R_1 及び R_2 は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 C 1 ~ C 6 アルキル、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル 及び線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニル からなる群から選択され、
 - R_3 及び R_4 は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 C 1 ~ C 6 アルキル、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル 及び線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニル からなる群から選ばれるか、または、一緒になって、C 2 ~ C 10 アルキレン または C 2 ~ C 10 アルケニレン を形成するか、または N 原子と一緒に、場合によっては C 1 ~ 6 アルキル 及び (又は) C 2 ~ 6 アルケニル によって置換された 3 ~ 7 員のアザシクロアルカンもしくはアザシクロアルケンを形成し、
 - R_5 、 R_p 、 R_q 、 R_r 及び R_s は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 C 1 ~ C 6 アルキル、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル 及び線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニル からなる群から選ばれるか、または R_5 、 R_p 、 R_q 、 R_r 及び R_s は、独立して、それが結合する炭素原子及び隣の炭素原子と組合わさって二重結合を形成することができるか、または R_p 、 R_q 、 R_r 及び R_s は、独立して、それが結合する U ともしくは Y と二重結合を形成することができ、
- 但し、 $U-V-W-X-Y-Z$ は、
- シクロヘキサン、
- シクロヘキセ - 1 - エン、
- シクロヘキセ - 2 - エン、
- シクロヘキセ - 3 - エン、
- シクロヘキサ - 1, 3 - ジエン、
- シクロヘキサ - 1, 4 - ジエン、
- シクロヘキサ - 1, 5 - ジエン、
- シクロヘキサ - 2, 4 - ジエン、及び
- シクロヘキサ - 2, 5 - ジエン、
- から選択され、
- 及び但し、 $U-Z$ がシクロヘキサンである場合には、 $-(A)_n-(CR_1R_2)_m-$ 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_p 、 R_q 、 R_r のうちの少なくとも一つは、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル または線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニル である]

で表されるものから選ばれる化合物、その光学異性体、又はその薬学的に許容し得る酸もしくは塩基付加塩の有効な量を含む、

・脳卒中の間の虚血、トラウマ、低酸素症、低血糖症、緑内障及び肝性脳症から選ばれる興奮毒性、

・アルツハイマー病、血管性痴呆、パーキンソン病、ハンティングトン病、多発性硬化症

、筋萎縮性側索硬化症、A I D S 神経変性、オリブ橋小脳萎縮、ツレット症候群、運動ニューロン疾患、ミトコンドリア機能障害、コルサコフ症候群及びクロイツフェルトヤコブ病から選ばれる慢性神経変性病、

・慢性苦痛、薬物耐性、依存及び嗜癖（例えば、オピオイド、コカイン、ベンゾジアゼピン類、ニコチン及びアルコール）から選ばれる中枢神経系の長期間形成変化に関連する他の疾患、及び

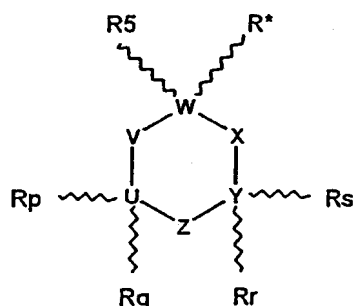
・てんかん、遅発性ジスキネジー、L - ドーパ誘発性ジスキネジー、総合失調症、不安、うつ病、急性痛、痙性及び耳鳴

からなる群から選ばれる、N M D A アнтаゴニストによって治療可能な病態の軽減のための薬学的調合物。

【請求項 6】

次式 I :

【化 4】



[式中、

- R^* は、 $-(A)_n-(CR_1R_2)_m-NR_3R_4$ であり、
- $n+m$ は、0、1 または 2 であり、
- A は、線状もしくは分枝状 $C_1 \sim C_6$ アルキル、線状もしくは分枝状 $C_2 \sim C_6$ アルケニル及び線状もしくは分枝状 $C_2 \sim C_6$ アルキニルからなる群から選択され、
- R_1 及び R_2 は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 $C_1 \sim C_6$ アルキル、線状もしくは分枝状 $C_2 \sim C_6$ アルケニル及び線状もしくは分枝状 $C_2 \sim C_6$ アルキニルからなる群から選択され、
- R_3 及び R_4 は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 $C_1 \sim C_6$ アルキル、線状もしくは分枝状 $C_2 \sim C_6$ アルケニル及び線状もしくは分枝状 $C_2 \sim C_6$ アルキニルからなる群から選ばれるか、または、一緒になって、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキレンまたは $C_2 \sim C_{10}$ アルケニレンを形成するか、または N 原子と一緒に、場合によっては $C_1 \sim 6$ アルキル及び（又は） $C_2 \sim 6$ アルケニルによって置換された 3 ～ 7 員のアザシクロアルカンもしくはアザシクロアルケンを形成し、
- R_5 、 R_p 、 R_q 、 R_r 及び R_s は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 $C_1 \sim C_6$ アルキル、線状もしくは分枝状 $C_2 \sim C_6$ アルケニル及び線状もしくは分枝状 $C_2 \sim C_6$ アルキニルからなる群から選ばれるか、または R_5 、 R_p 、 R_q 、 R_r 及び R_s は、独立して、それが結合する炭素原子及び隣の炭素原子と組合わさって二重結合を形成することができるか、または R_p 、 R_q 、 R_r 及び R_s は、独立して、それが結合する U ともしくは Y と二重結合を形成することができ、

但し、 $U-V-W-X-Y-Z$ は、

シクロヘキサン、

シクロヘキセ - 1 - エン、

シクロヘキセ - 2 - エン、

シクロヘキセ - 3 - エン、

シクロヘキサ - 1, 3 - ジエン、

シクロヘキサ - 1, 4 - ジエン、

シクロヘキサ - 1 , 5 - ジエン、
シクロヘキサ - 2 , 4 - ジエン、及び
シクロヘキサ - 2 , 5 - ジエン、
から選択され、

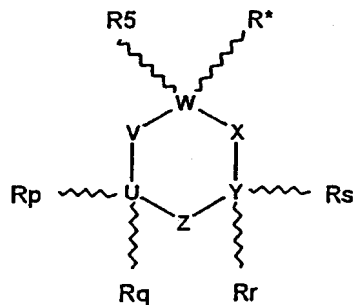
及び但し、U - Z がシクロヘキサンである場合には、 $-(A)_n-(CR_1R_2)_m-$ 、
R₃、R₄、R₅、R_p、R_q、R_r のうちの少なくとも一つは、線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルケニル または 線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルキニル である]

で表されるものから選ばれる化合物、その光学異性体、又はその薬学的に許容し得る酸もしくは塩基付加塩の有効な量を含む、5HT₃ レセプターアンタゴニストによって治療可能な病態の軽減のための薬学的調合物。

【請求項 7】

次式 I :

【化 5】



[式中、

- R^{*} は、 $-(A)_n-(CR_1R_2)_m-NR_3R_4$ であり、
 - $n+m$ は、0、1 または 2 であり、
 - A は、線状もしくは分枝状 C₁ ~ C₆ アルキル、線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルケニル 及び 線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルキニル からなる群から選択され、
 - R₁ 及び R₂ は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 C₁ ~ C₆ アルキル、線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルケニル 及び 線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルキニル からなる群から選択され、
 - R₃ 及び R₄ は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 C₁ ~ C₆ アルキル、線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルケニル 及び 線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルキニル からなる群から選ばれるか、または、一緒になって、C₂ ~ C₁₀ アルキレン または C₂ ~ C₁₀ アルケニレン を形成するか、または窒素原子と一緒に、場合によっては C₁ ~ C₆ アルキル 及び (又は) C₂ ~ C₆ アルケニル によって置換された 3 ~ 7 員のアザシクロアルカンもしくはアザシクロアルケンを形成し、
 - R₅、R_p、R_q、R_r 及び R_s は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 C₁ ~ C₆ アルキル、線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルケニル 及び 線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルキニル からなる群から選ばれるか、または R₅、R_p、R_q、R_r 及び R_s は、独立して、それが結合する炭素及び隣の炭素と組合わさって二重結合を形成することができるか、または R_p、R_q、R_r 及び R_s は、独立して、それが結合する U ともしくは Y と二重結合を形成することができ、
- 但し、U - V - W - X - Y - Z は、
シクロヘキサン、
シクロヘキセ - 1 - エン、
シクロヘキセ - 2 - エン、
シクロヘキセ - 3 - エン、
シクロヘキサ - 1 , 3 - ジエン、
シクロヘキサ - 1 , 4 - ジエン、

シクロヘキサ - 1 , 5 - ジエン、
シクロヘキサ - 2 , 4 - ジエン、及び
シクロヘキサ - 2 , 5 - ジエン、
から選択され、

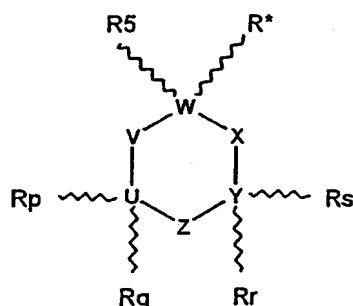
及び但し、U - Z がシクロヘキサンである場合には、 $-(A)_n-(CR_1R_2)_m-$ 、
R₃、R₄、R₅、R_p、R_q、R_r のうちの少なくとも一つは、線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルケニルまたは線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルキニルである]

で表されるものから選ばれる化合物、その光学異性体、又はその薬学的に許容し得る酸もしくは塩基付加塩の有効な量を含む、神経性ニコチンレセプターアンタゴニストによって治療可能な病態を軽減するための薬学的調合物。

【請求項 8】

次式 I :

【化 6】



- R^{*} は、 $-(A)_n-(CR_1R_2)_m-NR_3R_4$ であり、
 - $n+m$ は、0、1 または 2 であり、
 - A は、線状もしくは分枝状 C₁ ~ C₆ アルキル、線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルケニル及び線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルキニルからなる群から選択され、
 - R₁ 及び R₂ は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 C₁ ~ C₆ アルキル、線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルケニル及び線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルキニルからなる群から選択され、
 - R₃ 及び R₄ は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 C₁ ~ C₆ アルキル、線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルケニル及び線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルキニルからなる群から選ばれるか、または、一緒になって、C₂ ~ C₁₀ アルキレンまたは C₂ ~ C₁₀ アルケニレンを形成するか、または窒素原子と一緒に、場合によっては C₁ ~ C₆ アルキル及び (又は) C₂ ~ C₆ アルケニルによって置換された 3 ~ 7 員のアザシクロアルカンもしくはアザシクロアルケンを形成し、
 - R₅、R_p、R_q、R_r 及び R_s は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 C₁ ~ C₆ アルキル、線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルケニル及び線状もしくは分枝状 C₂ ~ C₆ アルキニルからなる群から選ばれるか、または R₅、R_p、R_q、R_r 及び R_s は、独立して、それが結合する炭素及び隣の炭素と組合わさって二重結合を形成することができるか、または R_p、R_q、R_r 及び R_s は、独立して、それが結合する U ともしくは Y と二重結合を形成することができ、
- 但し、U - V - W - X - Y - Z は、
シクロヘキサン、
シクロヘキセ - 1 - エン、
シクロヘキセ - 2 - エン、
シクロヘキセ - 3 - エン、
シクロヘキサ - 1 , 3 - ジエン、
シクロヘキサ - 1 , 4 - ジエン、
シクロヘキサ - 1 , 5 - ジエン、

シクロヘキサ - 2 , 4 - ジエン、及び
シクロヘキサ - 2 , 5 - ジエン、
から選択され、

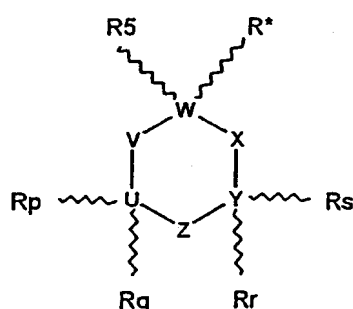
及び但し、U - Z がシクロヘキサンである場合には、 $-(A)_n-(CR_1R_2)_m-$ 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_p 、 R_q 、 R_r のうちの少なくとも一つは、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニルまたは線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニルである]

で表されるものから選ばれる化合物、その光学異性体、又はその薬学的に許容し得る酸もしくは塩基付加塩の有効な量を含む、不安障害、抑うつ障害、総合失調症及び治療関連精神病、薬物及びアルコール乱用障害、認知障害、アルツハイマー病、パーキンソン病、小脳振せん、片頭痛、欲求障害、炎症性腸症候群 (I B S)、及び嘔吐からなる群から選ばれる、5 H T 3 アンタゴニストによって治療可能な病態を軽減するための薬学的調合物。

【請求項 9】

次式 I :

【化 7】



[式中、

- R^* は、 $-(A)_n-(CR_1R_2)_m-NR_3R_4$ であり、
 - $n+m$ は、0、1 または 2 であり、
 - A は、線状もしくは分枝状 C 1 ~ C 6 アルキル、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル及び線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニルからなる群から選択され、
 - R_1 及び R_2 は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 C 1 ~ C 6 アルキル、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル及び線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニルからなる群から選択され、
 - R_3 及び R_4 は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 C 1 ~ C 6 アルキル、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル及び線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニルからなる群から選ばれるか、または、一緒になって、C 2 ~ C 10 アルキレンまたは C 2 ~ C 10 アルケニレンを形成するか、または窒素原子と一緒にあって、場合によっては C 1 ~ 6 アルキル及び (又は) C 2 ~ 6 アルケニルによって置換された 3 ~ 7 員のアザシクロアルカンもしくはアザシクロアルケンを形成し、
 - R_5 、 R_p 、 R_q 、 R_r 及び R_s は、独立して、水素、線状もしくは分枝状 C 1 ~ C 6 アルキル、線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルケニル及び線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニルからなる群から選ばれるか、または R_5 、 R_p 、 R_q 、 R_r 及び R_s は、独立して、それが結合する炭素及び隣の炭素と組み合わせることで二重結合を形成することができるか、または R_p 、 R_q 、 R_r 及び R_s は、独立して、それが結合する U ともしくは Y と二重結合を形成することができ、
- 但し、U - V - W - X - Y - Z は、
シクロヘキサン、
シクロヘキセ - 1 - エン、
シクロヘキセ - 2 - エン、
シクロヘキセ - 3 - エン、

シクロヘキサ - 1 , 3 - ジエン、
シクロヘキサ - 1 , 4 - ジエン、
シクロヘキサ - 1 , 5 - ジエン、
シクロヘキサ - 2 , 4 - ジエン、及び
シクロヘキサ - 2 , 5 - ジエン、
から選択され、

及び但し、U - Z がシクロヘキサンである場合には、 - (A) n - (C R 1 R 2) m - 、
R 3 、 R 4 、 R 5 、 R p 、 R q 、 R r のうちの少なくとも一つは、線状もしくは分枝状 C
2 ~ C 6 アルケニルまたは線状もしくは分枝状 C 2 ~ C 6 アルキニルである]

で表されるものから選ばれる化合物、その光学異性体、又はその薬学的に許容し得る
酸もしくは塩基付加塩の有効な量を含む、ツレット症候群、不安障害、総合失調症、薬物
乱用、ニコチン乱用、コカイン乱用、ジスキネジー（ハンティングトン病、L - ドーパ誘
発性）、注意欠陥多動性障害（ADHD）、アルツハイマー病、パーキンソン病、及び痛
みからなる群から選ばれる、神経性ニコチンレセプターアンタゴニストによって治療可能
な病態を軽減するための薬学的調合物。

【請求項 10】

請求項 4 ~ 9 のいずれか 1 つに記載の式 I の化合物、その光学異性体、又はその薬学
的に許容し得る酸もしくは塩基付加塩を、請求項 4 ~ 9 のいずれか 1 つに記載の薬剤の製
造に使用する方法。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0022

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0022】

[式中、

- R^{*} は、 - (A) n - (C R 1 R 2) m - N R 3 R 4 であり、
- n + m は、0、1 または 2 であり、
- A は、線状もしくは分枝状低級アルキル（C 1 ~ C 6）、線状もしくは分枝状低級アルケニル（C 2 ~ C 6）及び線状もしくは分枝状低級アルキニル（C 2 ~ C 6）からなる群から選択され、
- R 1 及び R 2 は、独立して、水素、線状もしくは分枝状低級アルキル（C 1 ~ C 6）、線状もしくは分枝状低級アルケニル（C 2 ~ C 6）及び線状もしくは分枝状低級アルキニル（C 2 ~ C 6）からなる群から選択され、
- R 3 及び R 4 は、独立して、水素、線状もしくは分枝状低級アルキル（C 1 ~ C 6）、線状もしくは分枝状低級アルケニル（C 2 ~ C 6）及び線状もしくは分枝状低級アルキニル（C 2 ~ C 6）からなる群から選ばれるか、または、一緒になって、アルキレン（C 2 ~ C 10）またはアルケニレン（C 2 ~ C 10）を形成するか、または、窒素原子と一緒に、場合によっては C 1 - 6 アルキル及び / または C 2 - 6 アルケニルによって置換された 3 ~ 7 員のアザシクロアルカンもしくはアザシクロアルケンを形成し、
- R 5 、 R p 、 R q 、 R r 及び R s は、独立して、水素、線状もしくは分枝状低級アルキル（C 1 ~ C 6）、線状もしくは分枝状低級アルケニル（C 2 ~ C 6）及び線状もしくは分枝状低級アルキニル（C 2 ~ C 6）からなる群から選ばれるか、または R 5 、 R p 、 R q 、 R r 及び R s は、独立して、それが結合する炭素原子及び隣の炭素原子と組合わさって二重結合を形成することができるか、または R p 、 R q 、 R r 及び R s は、独立して、それが結合する U ともしくは Y と二重結合を形成することができ、

但し、U - V - W - X - Y - Z は、

シクロヘキサン、
シクロヘキセ - 1 - エン、
シクロヘキセ - 2 - エン、

シクロヘキセ - 3 - エン、
シクロヘキサ - 1 , 3 - ジエン、
シクロヘキサ - 1 , 4 - ジエン、
シクロヘキサ - 1 , 5 - ジエン、
シクロヘキサ - 2 , 4 - ジエン、及び
シクロヘキサ - 2 , 5 - ジエン、
から選択され、

及び但し、U - Z がシクロヘキサンである場合は、- (A) n - (C R 1 R 2) m - 、 R 3 、 R 4 、 R 5 、 R p 、 R q 、 R r のうちの少なくとも一つは、線状もしくは分枝状低級アルケニル (C 2 ~ C 6) または線状もしくは分枝状低級アルキニル (C 2 ~ C 6) である]

で表されるものから選ばれる化合物、その光学異性体、及びその薬学的に許容し得る酸もしくは塩基付加塩の上記症状の軽減に有効な量を動物生体に投与する段階を含む上記方法；

次の症状、すなわち

- ・ 脳卒中の間の虚血、トラウマ、低酸素症、低血糖症、緑内障及び肝性脳障害から選ばれる興奮毒性、
 - ・ アルツハイマー病、血管性痴呆、パーキンソン病、ハンティングトン病、多発性硬化症、筋萎縮性側索硬化症、A I D S 神経変性、オリーブ橋小脳萎縮、ツレット症候群、運動ニューロン疾患、ミトコンドリア機能障害、コルサコフ症候群及びクロイツフェルトヤークوپ病から選ばれる慢性神経変性病、
 - ・ 慢性苦痛、薬物耐性、依存及び嗜癖（例えば、オピオイド、コカイン、ベンゾジアゼピン類、ニコチン及びアルコール）から選ばれる中枢神経系の長期間形成変化 (long term plastic change) に関連する他の疾患、及び
 - ・ てんかん、遅発性ジスキネジー、L - ドーパ誘発性ジスキネジー、総合失調症、不安、うつ病、急性痛、痙性及び耳鳴
- からなる群から選ばれる、N M D A アンタゴニストによって治療可能な病態の軽減のための動物生体の治療方法であって、次式 I :

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 9 2

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 9 2】

したがってこれらの化合物は動物生体、特にヒトの下記の疾患の治療で投与される。

1. 脳卒中の間の虚血、トラウマ、低酸素症、低血糖症、緑内障及び肝性脳症から選ばれる興奮毒性。
2. アルツハイマー病、血管性痴呆、パーキンソン病、ハンティングトン病、多発性硬化症、筋萎縮性側索硬化症、A I D S 神経変性、オリーブ橋小脳萎縮、ツレット症候群、運動ニューロン疾患、ミトコンドリア機能障害、コルサコフ症候群及びクロイツフェルトヤークوپ病から選ばれる慢性神経変性病。
3. 慢性苦痛、薬物耐性、依存及び嗜癖（例えば、オピオイド、コカイン、ベンゾジアゼピン類、ニコチン及びアルコール）から選ばれる中枢神経系の長期間形成変化に関連する他の疾患。
4. てんかん、遅発性ジスキネジー、L - ドーパ誘発性ジスキネジー、総合失調症、不安、うつ病、急性痛、痙性及び耳鳴。