

【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8月14日(2008.8.14)

【公表番号】特表2005-510568(P2005-510568A)

【公表日】平成17年4月21日(2005.4.21)

【年通号数】公開・登録公報2005-016

【出願番号】特願2003-547416(P2003-547416)

【国際特許分類】

C 0 7 D	471/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/4985	(2006.01)
A 6 1 K	31/706	(2006.01)
A 6 1 P	1/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	1/06	(2006.01)
A 6 1 P	1/12	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	9/06	(2006.01)
A 6 1 P	9/08	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	21/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	25/12	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/18	(2006.01)
A 6 1 P	25/20	(2006.01)
A 6 1 P	25/22	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/30	(2006.01)
A 6 1 P	25/34	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
C 0 7 H	13/10	(2006.01)
C 0 7 H	19/23	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D	471/04	1 2 0
A 6 1 K	31/4985	
A 6 1 K	31/706	
A 6 1 P	1/00	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	1/06	
A 6 1 P	1/12	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	9/06	
A 6 1 P	9/08	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	21/02	

A 6 1 P 25/02
 A 6 1 P 25/02 1 0 3
 A 6 1 P 25/08
 A 6 1 P 25/12
 A 6 1 P 25/14
 A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 25/18
 A 6 1 P 25/20
 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 25/34
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 C 0 7 H 13/10 C S P
 C 0 7 H 19/23

【誤訛訂正書】

【提出日】平成20年6月27日(2008.6.27)

【誤訛訂正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

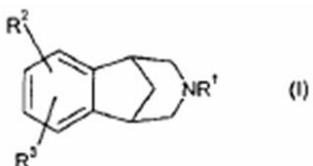
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

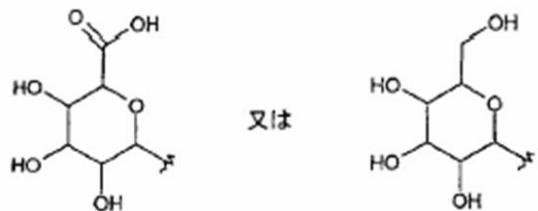
下記式(I)：

【化1】



{式中、R¹は-COOR⁴であり、ここで、R⁴は以下の式：

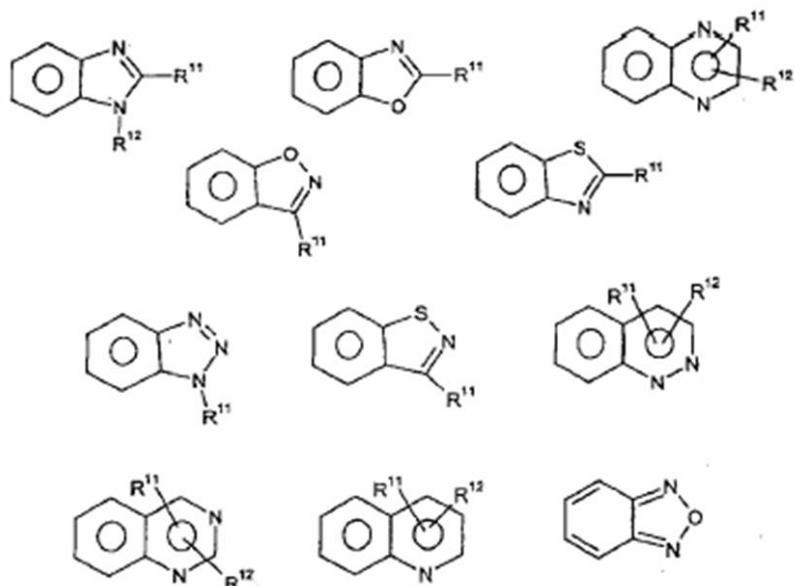
【化2】



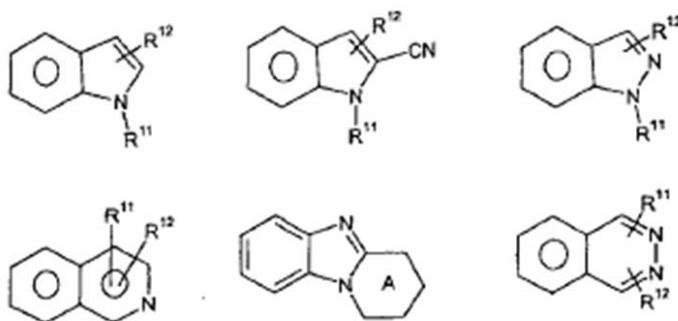
により表される基であり、

R²とR³は、それらが結合するところのベンゾ環と一緒にになって、以下の式：

【化3】



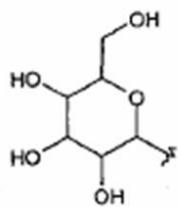
【化4】



(式中、環Aの炭素原子の内の1は、酸素又はN(C₁-C₆)アルキルで場合により置換されることができ、

式中、R¹¹及びR¹²は、独立して、水素、(C₁-C₆)アルキル、及び(C₁-C₆)アルコキシ-(C₀-C₆)アルキル-(ここで、炭素原子の合計数は6を超えず、そして上記アルキル部分のいずれも、1~7個のフッ素原子；ニトロ、シアノ、ハロ、アミノ、(C₁-C₆)アルキルアミノ-、((C₁-C₆)アルキル)₂アミノ-、-CO₂R⁵、-CONR⁶R⁷、-SO₂NR⁸R⁹、-C(=O)R¹⁰、-XC(=O)R¹⁰、フェニル、単環式ヘテロアリールの基で、場合により置換ができる)、又は窒素原子に結合するとき、以下の式：

【化5】



の基から選択され、

R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、及びR¹⁰の各々は、水素及び(C₁-C₆)アルキル、から独立して選ばれるか、或いは

R⁶とR⁷、又はR⁸とR⁹は、それらが結合しているところの窒素と一緒にになって、ピロリジン環、ピペリジン環、モルフォリン環、アゼチヂン環、ピペラジン環、-N-(C₁-C₆)アルキルピペラジン環、又はチオモルフォリン環、或いはチオモルフォリン環であって

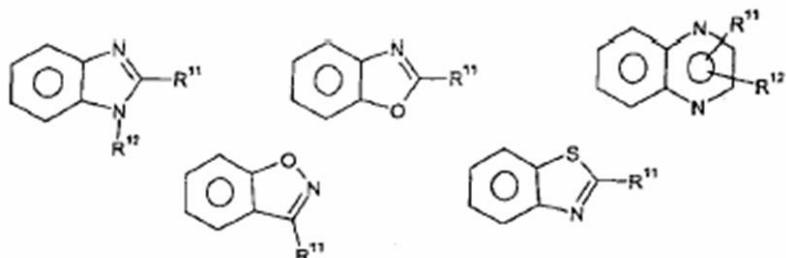
その環の硫黄がスルフォキシド又はスルホンで置換されているものを形成し；そして各Xは独立して(C₁-C₆)アルキレンである。)から選ばれた2環式の環状構造を形成する。

}により表される化合物及び医薬として許容されるその塩。

【請求項2】

R²とR³が、それらが結合するところのベンゾ環と一緒にになって、下記：

【化6】

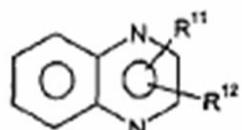


(式中、R¹¹とR¹²は請求項1において定義したものと同じである。)により表される式から選択される2環式の環状構造を形成する、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R²とR³が、それらが結合するところのベンゾ環と一緒にになって、下記の基：

【化7】

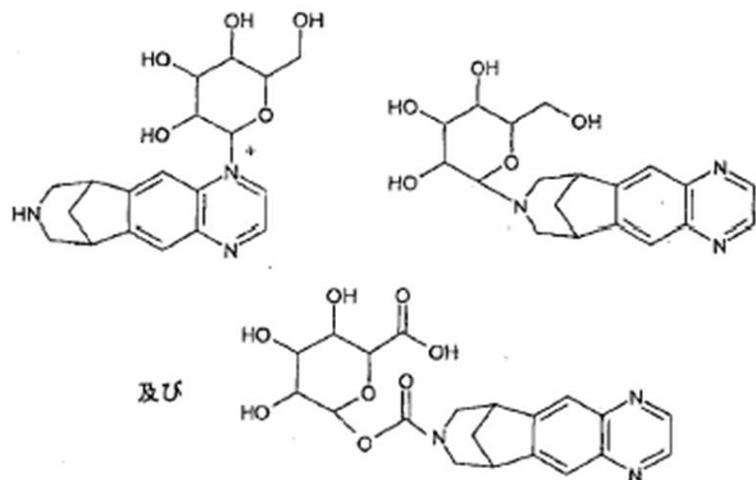


(基中、R¹¹とR¹²は請求項1において定義したものと同じである。)を形成する、請求項1に記載の化合物。

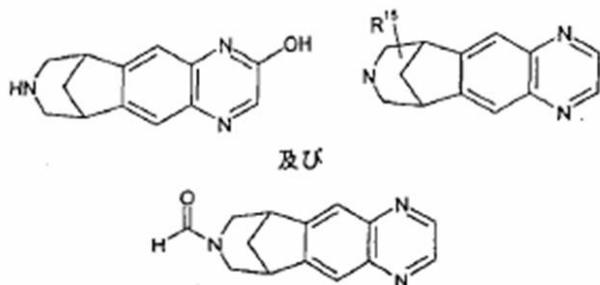
【請求項4】

下記：

【化8】



【化9】



(式中、R¹⁵は、分子の不飽和部位上の利用できるいづれの炭素原子を伴って機能的なカルボニルを形成するオキソ基である。)

から成る基から選ばれる、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

人を含む哺乳動物において、ニコチン中毒を低減し又はタバコの使用を止めるか若しくは減らすのを手助けする際に使用する医薬組成物であって、ニコチン中毒を低減し又はタバコの使用を休止若しくは減らす手助けをする際に有効である、請求項1～4のいづれかに記載の一定量の化合物又は医薬として許容されるその塩及び医薬として許容される担体を含む前記医薬組成物。

【請求項6】

人を含む哺乳動物においてニコチン中毒を減らし又はタバコの使用を止めるか若しくは減らす手助けをするための方法であって、ニコチン中毒を減らす際に又はタバコの使用を止める若しくは減らす手助けをする際に有効である、請求項1～4のいづれかに記載の一定量の化合物或いは医薬として許容されるその塩を上記の哺乳動物に投与することを含む前記方法。

【請求項7】

哺乳動物における炎症性腸疾患、潰瘍性大腸炎、壞疽性膿皮症、クローン病、過敏性大腸症候群、痙攣性筋緊張異常、慢性痛、急性痛、腹腔熱帯性下痢、囊炎、血管収縮、不安、恐慌症、うつ病、双極性障害、自閉症、睡眠障害、時差ぼけ、筋萎縮性側索硬化症(ALS)、認知機能障害、高血圧症、過食症、摂食障害、肥満、心不整脈、胃酸过多、潰瘍、褐色細胞種、進行性核上性麻痺；ニコチン、タバコ産物、アルコール、ベンゾジアゼピン、バルビツレート、オピオイド、又はコカインに対する化学物質依存症及び化学物質中毒；頭痛、偏頭痛、脳卒中、外傷性脳損傷(TBI)、強迫性障害(OCD)、精神病、ハンチントン舞蹈病、遅発性ジスキネジア、運動亢進症、失読症、統合失調症、脳血管性痴呆、年齢と関連する認識能低下、てんかん、小発作性てんかん、アルツハイマー型老人性痴呆(AD)、パーキンソン病(PD)、注意欠陥多動性障害(ADHD)、及びトウレット症候群から選ばれる疾患や症状を治療する方法であって、そういう治療が必要な哺乳動物に、そのような疾患や症状を治療するために有効である、請求項1～4のいづれかに記載の一定量の化合物又は医薬として許容されるその塩を投与することを含む前記方法。

【請求項8】

哺乳動物における炎症性腸疾患、潰瘍性大腸炎、壞疽性膿皮症、クローン病、過敏性大腸症候群、痙攣性筋緊張異常、慢性痛、急性痛、腹腔熱帯性下痢、囊炎、血管収縮、不安、恐慌症、うつ病、双極性障害、自閉症、睡眠障害、時差ぼけ、筋萎縮性側索硬化症(ALS)、認知機能障害、高血圧症、過食症、摂食障害、肥満、心不整脈、胃酸过多、潰瘍、褐色細胞種、進行性核上性麻痺；ニコチン、タバコ産物、アルコール、ベンゾジアゼピン、バルビツレート、オピオイド、又はコカインに対する化学物質依存症及び化学物質中毒；頭痛、偏頭痛、脳卒中、外傷性脳損傷(TBI)、強迫性障害(OCD)、精神病、ハンチントン舞蹈病、遅発性ジスキネジア、運動亢進症、失読症、統合失調症、脳血管性痴呆、年齢と関連する認識能低下、てんかん、小発作性てんかん、アルツハイマー型老人性痴呆(AD)、パーキンソン病(PD)、注意欠陥多動性障害(ADHD)、及びトウレット症候群から選ばれる疾患若しくは症状を治療するための医薬組成物であって、請求項1～4のいづれ

かに記載の一定量の化合物又は医薬として許容されるその塩、及び医薬として許容される担体を含む前記医薬組成物。

【請求項 9】

前記化合物が単離された形態である、請求項 1 に記載の化合物。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 0 4

【訂正方法】変更

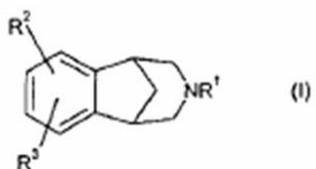
【訂正の内容】

【0 0 0 4】

発明の要約

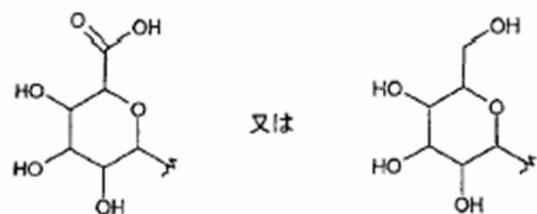
本発明は、以下の式(I)：

【化 1 0】



{式中、R¹は、独立して、水素又は-COOR⁴であり、ここで、R⁴は以下の式：

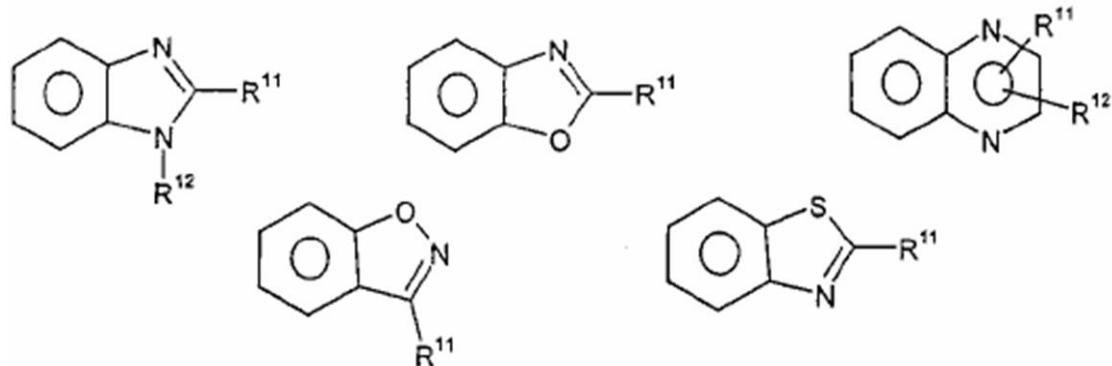
【化 1 1】



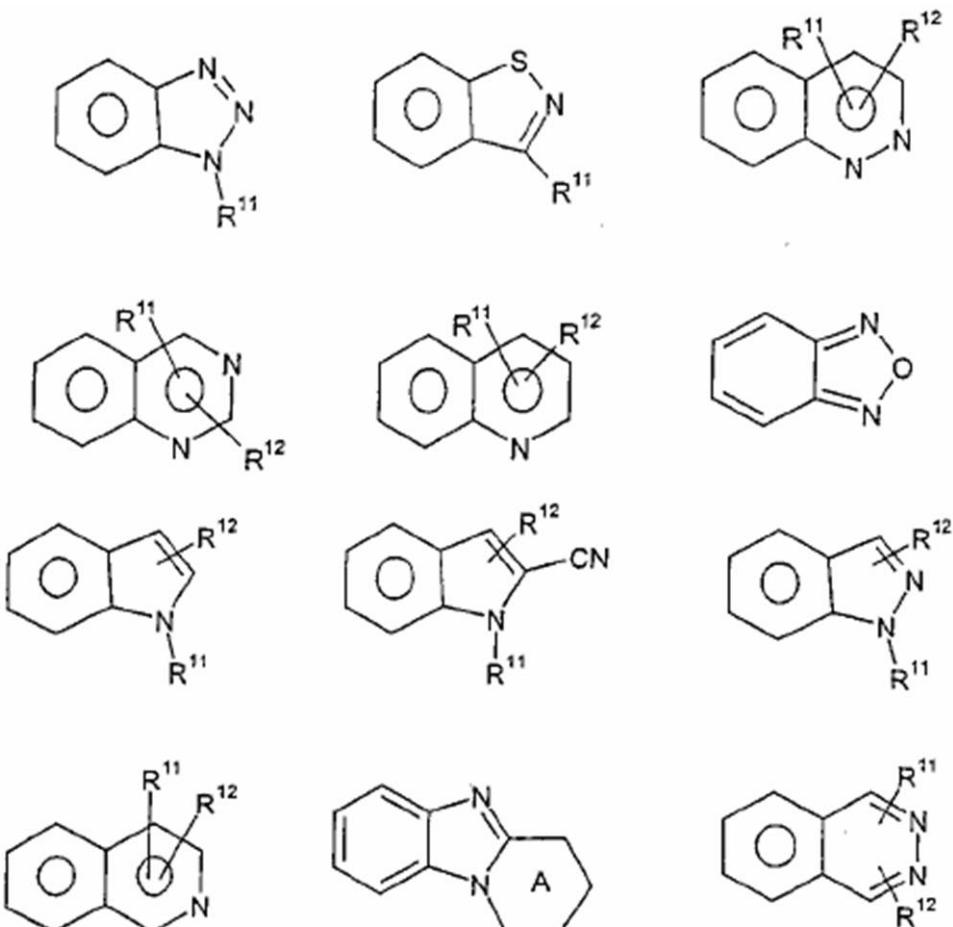
により表される基であり、

R²とR³は、それらが結合するところのベンゾ環と一緒にになって、以下の式：

【化 1 2】



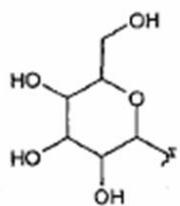
【化13】



(式中、環Aの炭素原子のうち1は、酸素又はN(C₁-C₆)アルキルで場合により置換することができ、

式中、R¹¹及びR¹²は、独立して、水素、(C₁-C₆)アルキル、及び(C₁-C₆)アルコキシ-(C₀-C₆)アルキル-(ここで、炭素原子の合計数は6を超えず、そして上記アルキル部分のいずれも、1~7個のフッ素原子；ニトロ、シアノ、ハロ、アミノ、(C₁-C₆)アルキルアミノ-、((C₁-C₆)アルキル)₂アミノ-、-CO₂R⁵、-CONR⁶R⁷、-SO₂NR⁸R⁹、-C(=O)R¹⁰、-XC(=O)R¹⁰、フェニル、単環式ヘテロアリールの基で、場合により置換されることがある)、又は窒素原子に結合するとき、以下の式：

【化14】



の基から選択され、

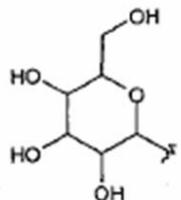
R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、及びR¹⁰の各々は、水素及び(C₁-C₆)アルキル、から独立して選ばれるか、或いは

R⁶とR⁷、又はR⁸とR⁹は、それらが結合しているところの窒素と一緒にになって、ピロリジン環、ピペリジン環、モルフォリン環、アゼチヂン環、ピペラジン環、-N-(C₁-C₆)アルキルピペラジン環、又はチオモルフォリン環、或いはチオモルフォリン環であってその環の硫黄はスルフォキシド又はスルホンで置換されているものを形成し、そして各Xは独立して(C₁-C₆)アルキレンであり；

但し

R¹がHであるとき、R¹¹又はR¹²の少なくとも1は、R²及びR³基により形成されている環内の窒素原子に結合し、かつ、必要ならば存在している結合関係を満たすように当該窒素原子上にアンモニウムイオン中心を形成する以下の式：

【化15】



により表される基でなくてはならない。)により表される式から選ばれた2環式の環状構造を形成する。}により表されるアリール基が結合したアザポリサイクリック化合物及び医薬

として許容されるその塩に関する。