

【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11月8日(2007.11.8)

【公表番号】特表2007-509121(P2007-509121A)

【公表日】平成19年4月12日(2007.4.12)

【年通号数】公開・登録公報2007-014

【出願番号】特願2006-536175(P2006-536175)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 519/00 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/439 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/28 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/22 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/18 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/24 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/16 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/14 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/34 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/04 (2006.01)**

**A 6 1 P 1/04 (2006.01)**

**A 6 1 K 51/00 (2006.01)**

**G 0 1 N 33/50 (2006.01)**

**G 0 1 N 33/15 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/26 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 D 519/00 C S P

A 6 1 K 31/439

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/34

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 1/04

A 6 1 K 49/02 A

G 0 1 N 33/50 Z

G 0 1 N 33/15 Z

A 6 1 P 25/26

【手続補正書】

【提出日】平成19年9月19日(2007.9.19)

【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

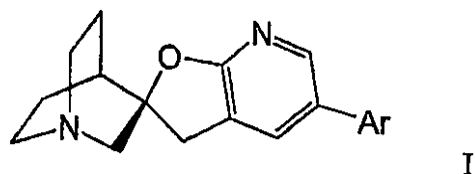
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I :

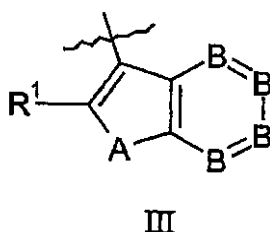
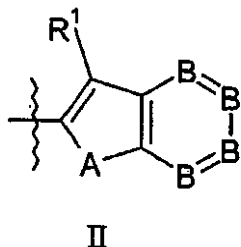
【化 1】



[ 式中、

Ar は式 II 又は III の部分 :

【化 2】



であり、

ここで、

A は、O 又は S であり ;

B は、1 個又は 2 個存在する N、およびその他の全ての存在する C R<sup>1</sup> であり ;

R<sup>1</sup> は、存在するごとに独立して、水素、- R<sup>2</sup>、- C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、- C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニル、ハロゲン、- CN、- NO<sub>2</sub>、- NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup> 又は - OR<sup>5</sup> であり ;

R<sup>2</sup> は、直鎖状、分枝鎖状又は環状の非置換 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル基、又は 1 個、2 個、3 個、4 個又は 5 個のハロゲン原子で置換され、且つ C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニル、- CN、- NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup> 又は - OR<sup>5</sup> から選択される 1 個又は 2 個の置換基で置換された直鎖状、分枝鎖状又は環状の C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル基であり ;

R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> は、存在するごとに独立して、水素、R<sup>5</sup>、又は組み合わせられて - NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup> に存在する場合においては、- (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub> J (CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub> - であり、ここで、J は O、S、NH、NR<sup>5</sup> 又は結合であり ;

R<sup>5</sup> は、直鎖状、分枝鎖状又は環状の非置換 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル基、又は 1 個、2 個、3 個、4 個又は 5 個のハロゲン原子で置換された直鎖状、分枝鎖状又は環状の C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル基であり ;

p は、存在するごとに、2、3 又は 4 であり ;

q は、存在するごとに、0、1 又は 2 である ]

の化合物、及びその製薬上許容される塩。

【請求項 2】

B が 1 個存在する N であり、そして 2 個又は 3 個存在する R<sup>1</sup> が水素である化合物、又は B が 2 個存在する N であり、そして 3 個又は 4 個存在する R<sup>1</sup> が水素である化合物から選択される、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

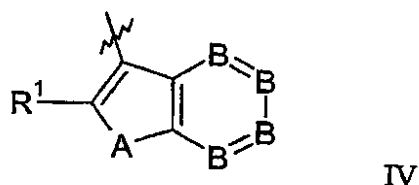
【請求項 3】

B が 1 個存在する N である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

Ar が式 IV :

## 【化 3】



である、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

## 【請求項 5】

A が O である、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬上許容される塩。

## 【請求項 6】

(2'R) - 5' - (フロ[3,2-b]ピリジン - 3 - イル)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} ;

(2'R) - 5' - (フロ[3,2-c]ピリジン - 3 - イル)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} ;

(2'R) - 5' - (フロ[2,3-b]ピリジン - 3 - イル)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} ; 及び

(2'R) - 5' - (フロ[2,3-c]ピリジン - 3 - イル)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}

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 7】

請求項 1 に記載の化合物、及び製薬上許容される希釈剤又は担体を含む医薬組成物。

## 【請求項 8】

7 ニコチン性受容体の活性化が有益であるヒトの疾患又は症状の治療又は予防に使用するための、請求項 7 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 9】

神経障害、精神障害又は知能障害性疾患の治療又は予防に使用するための、請求項 7 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 10】

アルツハイマー病、学習障害、認識障害、注意欠陥、記憶喪失、注意欠陥多動性障害、不安症、統合失調症又は躁病若しくは躁うつ病、パーキンソン病、ハンチントン病、トゥーレット症候群、コリン作動性シナプスの損失が存在する神経変性性障害、時差ぼけ、喫煙、タバコ中毒、ニコチン含有生成物への暴露に起因するものを包含するニコチン中毒、渴望、疼痛及び潰瘍性結腸炎の治療又は予防に使用するための、請求項 7 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 11】

7 ニコチン性受容体の活性化が有益であるヒトの疾患又は症状を治療又は予防するための医薬の製造における、請求項 1 に記載の化合物の使用。

## 【請求項 12】

神経障害、精神障害又は知能障害性疾患を治療又は予防するための医薬の製造における、請求項 1 に記載の化合物の使用。

## 【請求項 13】

症状又は障害がアルツハイマー病、学習障害、認識障害、注意欠陥、記憶喪失、注意欠陥多動性障害である、請求項 12 に記載の使用。

## 【請求項 14】

障害が不安症、統合失調症又は躁病若しくは躁うつ病である、請求項 12 に記載の使用。

## 【請求項 15】

障害がパーキンソン病、ハンチントン病、トゥーレット症候群又はコリン作動性シナプスの損失が存在する神経変性性障害である、請求項 12 に記載の使用。

## 【請求項 16】

時差ぼけ、喫煙、タバコ中毒、ニコチン含有生成物への暴露に起因するものを包含するニコチン中毒、渴望、疼痛及び潰瘍性結腸炎を治療又は予防するための医薬の製造における、請求項 1 に記載の化合物の使用。

## 【請求項 17】

1 個又はそれ以上の原子がその元素の放射性同位体である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 18】

放射性同位体がトリチウムである、請求項 17 に記載の化合物。

## 【請求項 19】

作動作用、部分的作動作用又は拮抗作用により、 $\alpha 7$  ニコチン性アセチルコリン受容体に結合し、そしてその活性を調節する新規な医薬用化合物の発見のためのスクリーンにおける、請求項 17 に記載の化合物の使用。