

【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 22 日 (2007.11.22)

【公表番号】 特表 2007-511602 (P2007-511602A)
 【公表日】 平成 19 年 5 月 10 日 (2007.5.10)
 【年通号数】 公開・登録公報 2007-017
 【出願番号】 特願 2006-541085 (P2006-541085)
 【国際特許分類】

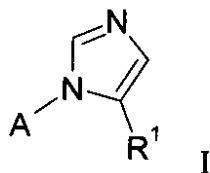
C 0 7 D 453/02 (2006.01)
A 6 1 K 31/439 (2006.01)
A 6 1 K 31/444 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
A 6 1 P 25/22 (2006.01)
A 6 1 P 25/18 (2006.01)
A 6 1 P 25/24 (2006.01)
A 6 1 P 25/28 (2006.01)
A 6 1 P 25/16 (2006.01)
A 6 1 P 25/14 (2006.01)
A 6 1 P 25/34 (2006.01)
A 6 1 P 25/04 (2006.01)
A 6 1 P 25/30 (2006.01)
A 6 1 P 1/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 453/02	C S P
A 6 1 K 31/439	
A 6 1 K 31/444	
A 6 1 P 43/00	1 1 1
A 6 1 P 25/22	
A 6 1 P 25/18	
A 6 1 P 25/24	
A 6 1 P 25/28	
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 25/30	
A 6 1 P 1/04	

【手続補正書】
 【提出日】 平成 19 年 10 月 1 日 (2007.10.1)
 【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 :

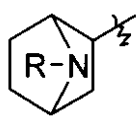
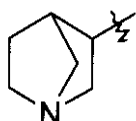
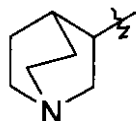
【化 1】



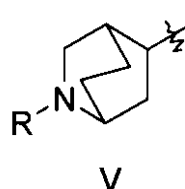
〔式中、

A は：

【化 2】



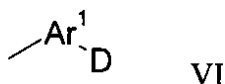
または



(式中、Rは水素又はメチルを示す)を示し、そして

R¹は水素又は式V I：

【化 3】



の基を示し、

式中、

A r¹は0、1若しくは2個の窒素原子、0若しくは1個の酸素原子、及び0若しくは1個の硫黄原子を有する5－若しくは6－員芳香族若しくはヘテロ芳香族環から選ばれるか、又は0、1、2若しくは3個の窒素原子、0若しくは1個の酸素原子、及び0若しくは1個の硫黄原子を有する8－、9－若しくは10－員の縮合芳香族若しくはヘテロ芳香族環系から選ばれ；

Dは水素、N R² R³、又はE－A r²から選ばれ；

ここで

Eは単結合、－O－、－S－、又は－N R³－であり；

A r²は0、1又は2個の窒素原子、0又は1個の酸素原子、及び0又は1個の硫黄原子を有する5－又は6－員芳香族又はヘテロ芳香族環から選ばれ；

ここで、各A r¹又はA r²基は非置換であるか、又は－R³、－C₁－C₆アルキル、－C₂－C₆アルケニル、－C₂－C₆アルキニル、ハロゲン、－CN、－NO₂、－CF₃、－S(O)_nR³、－N R² R³、－CH₂N R² R³、－OR³、－CH₂OR³若しくは－CO₂R⁴から選ばれる1、2若しくは3個の置換基を有してもよく；

R²及びR³は独立して、各場合において水素、－C₁－C₄アルキル、アリール、ヘテロアリール、－C(O)R⁴、－C(O)NHR⁴、－CO₂R⁴若しくは－SO₂R⁴から選ばれるか、又は

R²及びR³は一緒になって－(CH₂)_jG(CH₂)_k－(ここで、Gは酸素、硫黄、N R⁴又は結合である)であり；

jは2、3又は4であり；

kは0、1又は2であり；

nは0、1又は2であり、そして

R⁴は独立して各場合に水素、－C₁₋₄アルキル、アリール、又はヘテロアリールから選ばれる]

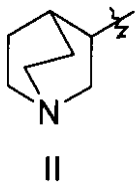
で表される化合物、並びにその立体異性体、エナンチオマー、生体内で加水分解可能な前

駆体、及び薬学的許容塩。

【請求項 2】

A が：

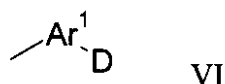
【化 4】



を示し、

R^1 が水素又は式 V I：

【化 5】



〔式中、

Ar^1 は 0 又は 1 個の窒素原子、0 又は 1 個の酸素原子、及び 0 又は 1 個の硫黄原子を有する 5-又は 6-員芳香族又はヘテロ芳香族環から選られ；

D は水素、 NR^2R^3 、又は $E-Ar^2$ から選られ；

ここで

E は単結合、 $-O-$ 、 $-S-$ 、又は $-NR^3-$ であり；

Ar^2 は 0 又は 1 個の窒素原子、0 又は 1 個の酸素原子、及び 0 又は 1 個の硫黄原子を有する 5-又は 6-員芳香族又はヘテロ芳香族環から選られ；

ここで、各 Ar^1 又は Ar^2 基は非置換であるか、又はハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-CH_3$ 若しくは $-C_2H_5$ から選ばれる 1、2 若しくは 3 個の置換基を有してもよく；

R^2 及び R^3 は独立して、各場合において水素、 $-C_1-C_4$ アルキル、アリール、ヘテロアリールから選ばれるか、又は

R^2 及び R^3 は一緒になって $-(CH_2)_jG(CH_2)_k-$ (ここで G は酸素である) であり；

j は 2、3 又は 4 であり；

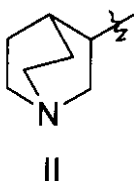
k は 0、1 又は 2 である〕

の基を示す、請求項 1 記載の化合物、並びにその立体異性体、エナンチオマー、生体内で加水分解可能な前駆体、及び薬学的許容塩。

【請求項 3】

A が：

【化 6】

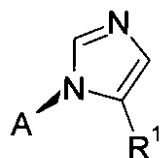


を示す請求項 1 記載の化合物、又はそのエナンチオマー及びその薬学的許容塩。

【請求項 4】

式 V I I：

【化 7】



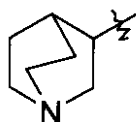
VII

(式中、A 及び R^1 は式 I の化合物について定義した通りである) で表される R-異性体である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 5】

A が式 I I :

【化 8】



II

で表され、そして R^1 が式 I の化合物について定義した通りである、請求項 4 記載の化合物。

【請求項 6】

E が単結合を示す、請求項 1 記載の化合物、又はそのエナンチオマー及びその薬学的許容塩。

【請求項 7】

Ar^1 がチオフェニルである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 8】

Ar^1 がチオフェニルであり、そして Ar^2 が場合によっては置換基を有するフェニル、フラニル又はチオフェニルから選ばれる、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 9】

1 つ又はそれ以上の原子が同じ元素の放射性同位体である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 10】

請求項 1 記載の化合物及び薬学的に許容される希釈剤、滑沢剤又は担体を含む医薬組成物。

【請求項 11】

$\alpha 7$ ニコチン性受容体の活性化が有益である疾患又は症状を治療又は予防するための請求項 10 記載の医薬組成物。

【請求項 12】

疾患又は症状が不安、統合失調症、躁病又は躁うつ病である、請求項 11 記載の医薬組成物。

【請求項 13】

神経障害、精神異常又は知的機能障害の治療又は予防のための請求項 10 記載の医薬組成物。

【請求項 14】

障害がアルツハイマー病、学習障害、認知障害、注意力欠如、記憶喪失、注意欠陥過活動性障害、パーキンソン病、ハンチントン病、トゥレット症候群、コリン作用性シナプスの喪失がある神経変性障害、時差ぼけ、ニコチン中毒、渴望、痛み、又は潰瘍性大腸炎である、請求項 13 記載の医薬組成物。

【請求項 15】

禁煙を誘導するための請求項 10 記載の医薬組成物。

【請求項 16】

神経障害、精神異常、知的機能障害、アルツハイマー病、学習障害、認知障害、注意力欠如、記憶喪失、注意欠陥過活動性障害、不安、統合失調症、躁病若しくは躁うつ病、パーキンソン病、ハンチントン病、トゥレット症候群、又はコリン作用性シナプスの喪失がある神経変性障害から選ばれる、 $\alpha 7$ 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用の医薬の製造における、請求項 1 記載の化合物、そのエナンチオマー又はその薬学的許容塩の使用。

【請求項 17】

時差ぼけ、痛み、又は潰瘍性大腸炎の治療又は予防用の医薬、又は禁煙を容易にするため、又はニコチンを含む製品への曝露から生じる場合を含むニコチン中毒又は渴望を治療するための医薬の製造における、請求項 1 記載の化合物の使用。