

【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6月26日(2008.6.26)

【公開番号】特開2002-371059(P2002-371059A)

【公開日】平成14年12月26日(2002.12.26)

【出願番号】特願2001-145691(P2001-145691)

【国際特許分類】

C 07 D 209/08	(2006.01)
A 61 K 31/404	(2006.01)
A 61 K 31/454	(2006.01)
A 61 K 31/47	(2006.01)
A 61 K 31/4725	(2006.01)
A 61 K 31/538	(2006.01)
A 61 K 31/541	(2006.01)
A 61 K 31/55	(2006.01)
A 61 K 31/551	(2006.01)
A 61 P 3/00	(2006.01)
A 61 P 3/04	(2006.01)
A 61 P 5/02	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 9/12	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
C 07 D 215/12	(2006.01)
C 07 D 215/14	(2006.01)
C 07 D 223/16	(2006.01)
C 07 D 265/36	(2006.01)
C 07 D 401/06	(2006.01)
C 07 D 401/12	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
C 07 D 403/12	(2006.01)
C 07 D 405/06	(2006.01)
C 07 D 405/12	(2006.01)
C 07 D 405/14	(2006.01)
C 07 D 413/06	(2006.01)
C 07 D 413/12	(2006.01)

【F I】

C 07 D 209/08	
A 61 K 31/404	
A 61 K 31/454	
A 61 K 31/47	
A 61 K 31/4725	
A 61 K 31/538	
A 61 K 31/541	
A 61 K 31/55	
A 61 K 31/551	
A 61 P 3/00	
A 61 P 3/04	
A 61 P 5/02	
A 61 P 9/10	1 0 1

A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	43/00	1 2 3
C 0 7 D	215/12	
C 0 7 D	215/14	
C 0 7 D	223/16	A
C 0 7 D	223/16	B
C 0 7 D	223/16	Z
C 0 7 D	265/36	
C 0 7 D	401/06	
C 0 7 D	401/12	
C 0 7 D	401/14	
C 0 7 D	403/12	
C 0 7 D	405/06	
C 0 7 D	405/12	
C 0 7 D	405/14	
C 0 7 D	413/06	
C 0 7 D	413/12	

【手続補正書】

【提出日】平成20年5月14日(2008.5.14)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

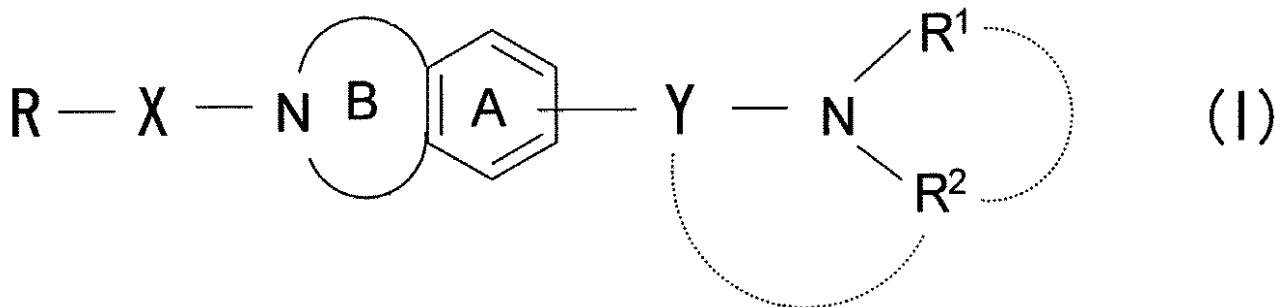
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式

【化1】



[式中、Rは水素原子、ハロゲン原子または置換基を有していてもよい環状基を；

Xは結合手または主鎖の原子数1ないし10のスペーサーを；

Yは主鎖の原子数1ないし6のスペーサーを；

A環はさらに置換基を有していてもよいベンゼン環を；

B環はさらに置換基を有していてもよい5ないし9員含窒素非芳香族複素環を；

R¹およびR²は同一または異なって水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基または置換基を有していてもよい複素環基を示すか、R¹とR²とは隣接する窒素原子とともに置換基を有していてもよい含窒素複素環を形成してもよく、R²は隣接する窒素原子およびYとともに置換基を有していてもよい含窒素複素環を形成していてもよい]で表される化合物またはその塩を含有してなるメラニン凝集ホルモン拮抗剤。

【請求項2】

Rが置換基を有していてもよい環状基であり、Xが主鎖の原子数1ないし6のスペーサーであり、R¹およびR²が同一または異なる水素原子または置換基を有していてもよい炭化水素基を示すか、R¹とR²とが隣接する窒素原子とともに置換基を有していてもよい含窒素複素環を形成するか、R²が隣接する窒素原子およびYとともに置換基を有していてもよい含窒素複素環を形成する請求項1記載の剤。

【請求項3】

メラニン凝集ホルモンに起因する疾患の予防・治療剤である請求項1記載の剤。

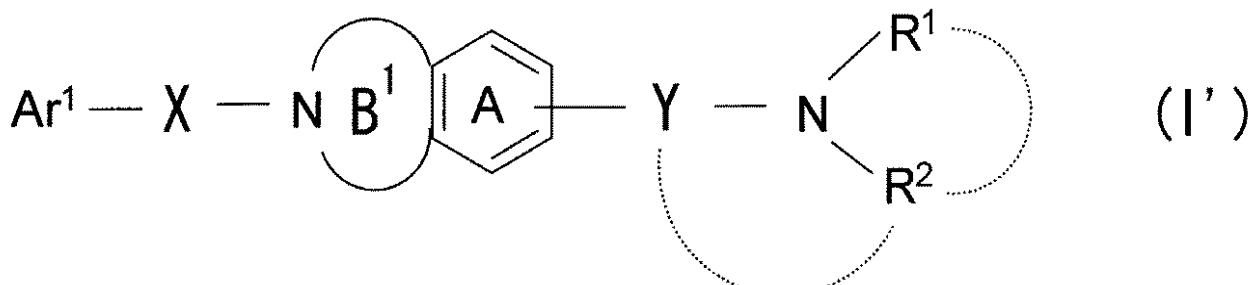
【請求項4】

肥満症の予防・治療剤である請求項1記載の剤。

【請求項5】

式

【化2】



[式中、Ar¹は置換基を有していてもよい環状基を；
 Xは結合手または主鎖の原子数1ないし10のスペーサーを；
 Yは主鎖の原子数1ないし6のスペーサーを；
 A環はさらに置換基を有していてもよいベンゼン環を；
 B¹環はさらに置換基を有していてもよい5ないし9員含窒素非芳香族複素環を；
 R¹およびR²は同一または異なる水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基または置換基を有していてもよい複素環基を示すか、R¹とR²とは隣接する窒素原子とともに置換基を有していてもよい含窒素複素環を形成してもよく、R²は隣接する窒素原子およびYとともに置換基を有していてもよい含窒素複素環（ピペリジンを除く）を形成してもよい。ただし、XがCOであるとき、B¹環がそれぞれさらに置換基を有していてもよいアゼパンまたは4,5-ジヒドロアゼピンでないか、またはAr¹が置換基を有していてもよいビフェニリルでない。また、Yは-CO-(C(Ra)H)_na-(Raは水素原子または置換基を有していてもよい炭化水素基を、nは1ないし10の整数を示す)でなく、アミノ基で置換された2環性含窒素複素環を有しない。]で表される化合物またはその塩。

【請求項6】

Xが主鎖の原子数1ないし6のスペーサーであり、R¹およびR²が同一または異なる水素原子または置換基を有していてもよい炭化水素基を示すか、R¹とR²とが隣接する窒素原子とともに置換基を有していてもよい含窒素複素環を形成するか、R²が隣接する窒素原子およびYとともに置換基を有していてもよい含窒素複素環（ピペリジンを除く）を形成する請求項5記載の化合物。

【請求項7】

Ar¹で示される環状基が芳香族基である請求項5記載の化合物。

【請求項8】

芳香族基が、炭素数6ないし14の単環式または縮合多環式芳香族炭化水素および5ないし10員芳香族複素環から選ばれる2または3個で形成される芳香環集合体から任意の水素原子1個を除いた基である請求項7記載の化合物。

【請求項9】

XおよびYで示されるスペーサーが、-O-；-S-；-CO-；-SO-；-SO₂-；-NR⁸-（R⁸は水素原子、ハロゲン化されていてもよいC₁-₆アルキル、ハロ

ゲン化されていてもよい C₁ - C₆ アルキル - カルボニル、ハロゲン化されていてもよい C₁ - C₆ アルキルスルホニルを示す) ; および置換基を有していてもよい 2 値の C₁ - C₆ 非環式炭化水素基から選ばれる 1 ないし 3 個からなる 2 値基である請求項 5 記載の化合物。

【請求項 10】

X が C₁ - C₆ アルキルである請求項 5 記載の化合物。

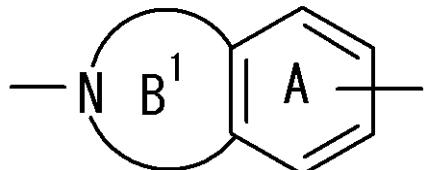
【請求項 11】

Y が置換基を有していてもよい C₂ - C₆ アルケニレンである請求項 5 記載の化合物。

【請求項 12】

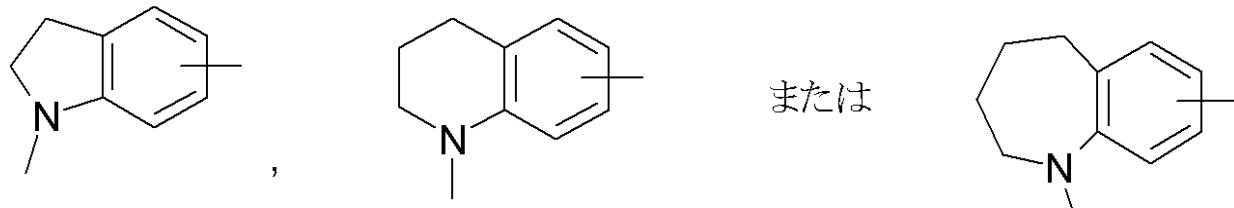
式

【化 3】



で表される基が、

【化 4】



である請求項 5 記載の化合物。

【請求項 13】

R¹ と R² とが隣接する窒素原子とともに置換基を有していてもよい含窒素複素環を形成する請求項 5 記載の化合物。

【請求項 14】

R¹ および R² が C₁ - C₆ アルキルである請求項 5 記載の化合物。

【請求項 15】

請求項 5 記載の化合物またはその塩を含有してなる医薬組成物。

【請求項 16】

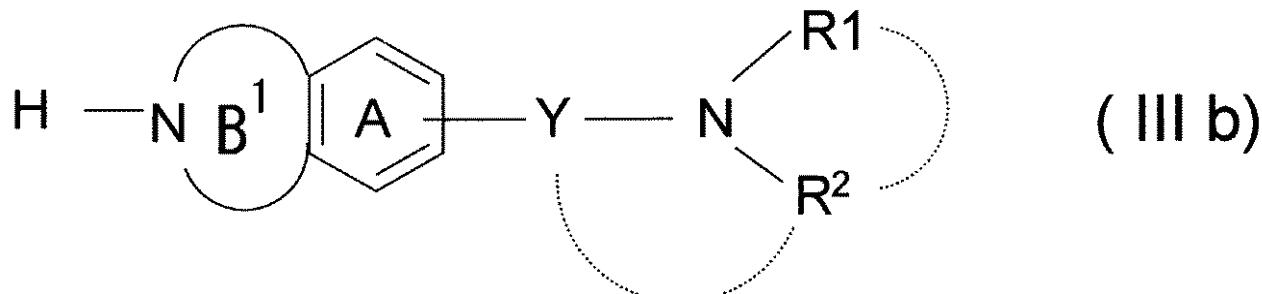
請求項 5 記載の化合物のプロドラッグ。

【請求項 17】

式 : Ar¹ - X - L (IIb)

[式中、L は脱離基を、その他の記号は請求項 5 記載と同意義を示す] で表される化合物またはその塩と、式

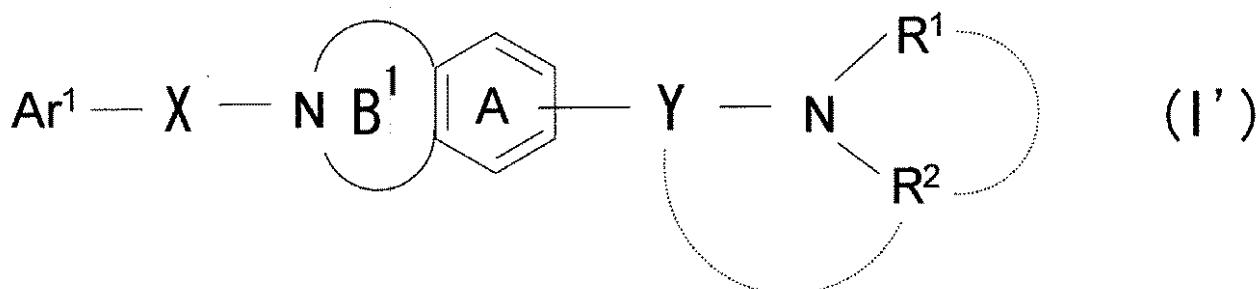
【化 5】



[式中の記号は請求項 5 記載と同意義を示す] で表される化合物またはその塩とを反応さ

せることを特徴とする、式

【化6】

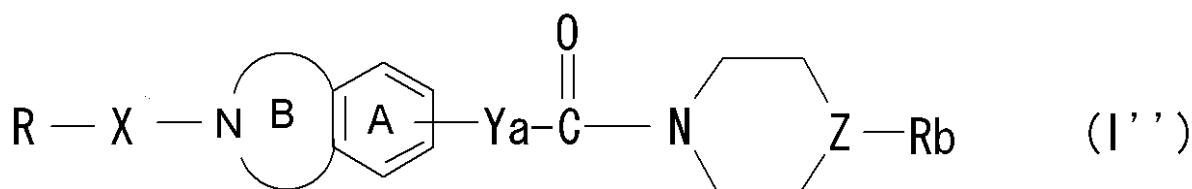


[式中の記号は前記と同意義を示す]で表される化合物またはその塩の製造方法。

【請求項18】

式

【化7】



[式中、Rは水素原子、ハロゲン原子または置換基を有していてもよい環状基を；Xは結合手または主鎖の原子数1ないし10のスペーサーを；

Yaは主鎖の原子数1ないし5のスペーサーを；

A環はさらに置換基を有していてもよいベンゼン環を；

B環はさらに置換基を有していてもよい5ないし9員含窒素非芳香族複素環を；

ZはCHまたはNを；

Rbは水素原子または置換基を有していてもよい炭化水素基を示す。ただし、Yaはアミノ基で置換された2環性含窒素複素環を有しない。]で表される化合物またはその塩。

【請求項19】

Rが水素原子である請求項18記載の化合物。

【請求項20】

Yaが- $(CH_2)_{w_1}CO(CH_2)_{w_2}-$ （w1およびw2は0ないし5の整数を、かつw1+w2が0ないし5を示す）である請求項18記載の化合物。

【請求項21】

ZがCHである請求項18記載の化合物。

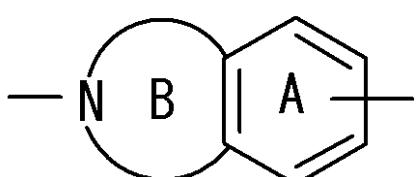
【請求項22】

Rbが置換基を有していてもよいC₆-₁4アリールである請求項18記載の化合物。

【請求項23】

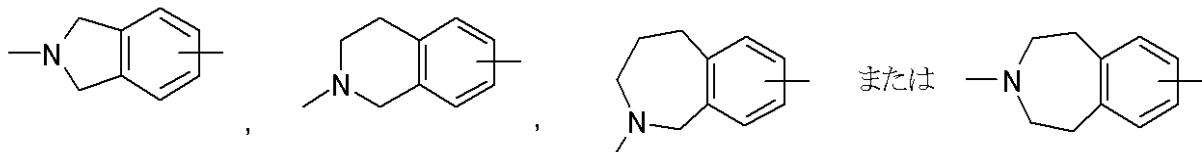
式

【化8】



で表される基が、

【化9】



である請求項 1 8 記載の化合物。

【請求項 2 4】

請求項 1 8 記載の化合物またはその塩を含有してなる医薬組成物。

【請求項 2 5】

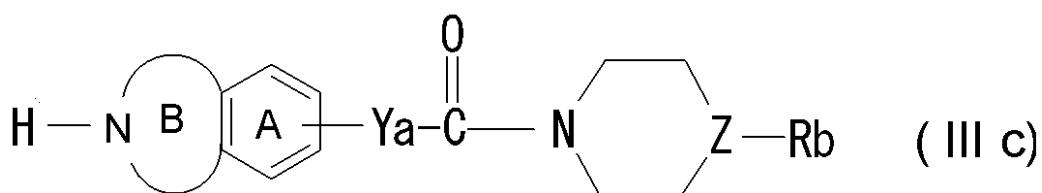
請求項 1 8 記載の化合物のプロドラッグ。

【請求項 2 6】

式 : $R - X - L$ (II a)

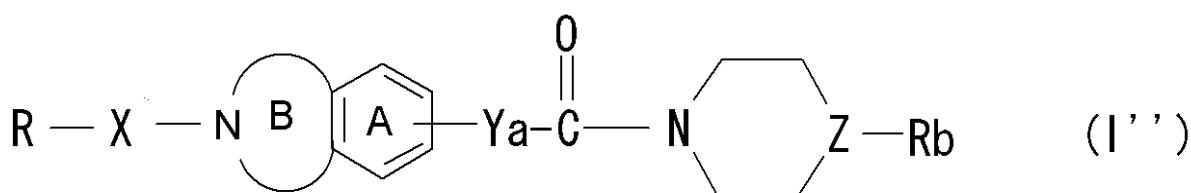
[式中、L は脱離基を、その他の記号は請求項 1 8 記載と同意義を示す] で表される化合物またはその塩と、式

【化 1 0】



[式中の記号は請求項 1 8 記載と同意義を示す] で表される化合物またはその塩とを反応させることを特徴とする、式

【化 1 1】

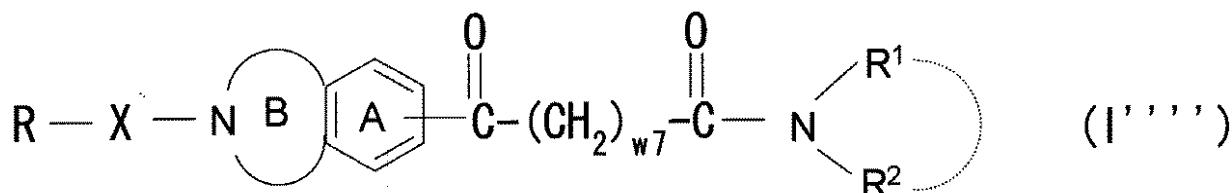


[式中の記号は前記と同意義を示す] で表される化合物またはその塩の製造方法。

【請求項 2 7】

式

【化 1 2】



[式中、R は水素原子、ハロゲン原子または置換基を有していてもよい環状基を；

X は結合手または主鎖の原子数 1 ないし 10 のスペーサーを；

A 環はさらに置換基を有していてもよいベンゼン環を；

B 環はさらに置換基を有していてもよい 5 ないし 9 員含窒素非芳香族複素環を；

w 7 は 0 ないし 4 の整数を；

R¹ および R² は同一または異なって水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基または置換基を有していてもよい複素環基を示すか、R¹ と R² とは隣接する窒素原子とともに置換基を有していてもよい含窒素複素環を形成してもよい。] で表される化合物またはその塩。

【請求項 2 8】

請求項 2 7 記載の化合物またはその塩を含有してなる医薬組成物。

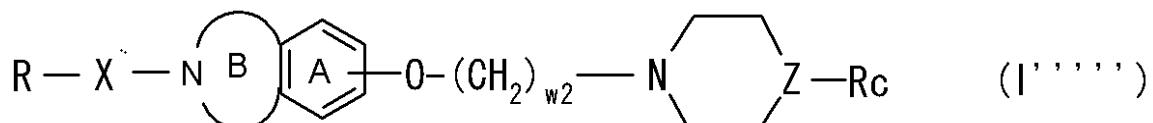
【請求項 2 9】

請求項 2 7 記載の化合物のプロドラッグ。

【請求項 3 0】

式

【化 1 3】



[式中、Rは水素原子、ハロゲン原子または置換基を有していてもよい環状基を；

Xは結合手または主鎖の原子数1ないし10のスペーサーを；

A環はさらに置換基を有していてもよいベンゼン環を；

B環はさらに置換基を有していてもよい5ないし9員含窒素非芳香族複素環を；

w2は0ないし5の整数を；

ZはCHまたはNを；

Rcは置換基を有していてもよい炭化水素基を示す。]で表される化合物またはその塩。

【請求項 3 1】

ZがCHである請求項 3 0 記載の化合物。

【請求項 3 2】

Rcが置換基を有していてもよいC₆-C₁アリールである請求項 3 0 記載の化合物。

【請求項 3 3】

請求項 3 0 記載の化合物またはその塩を含有してなる医薬組成物。

【請求項 3 4】

請求項 3 0 記載の化合物のプロドラッグ。

【請求項 3 5】

摂食抑制剤である請求項 1 記載の剤。

【請求項 3 6】

請求項 1 記載のメラニン凝集ホルモン拮抗剤と、糖尿病治療薬、高血圧治療薬および動脈硬化症治療薬から選ばれる少なくとも1種以上とを組み合わせてなる医薬。