

【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

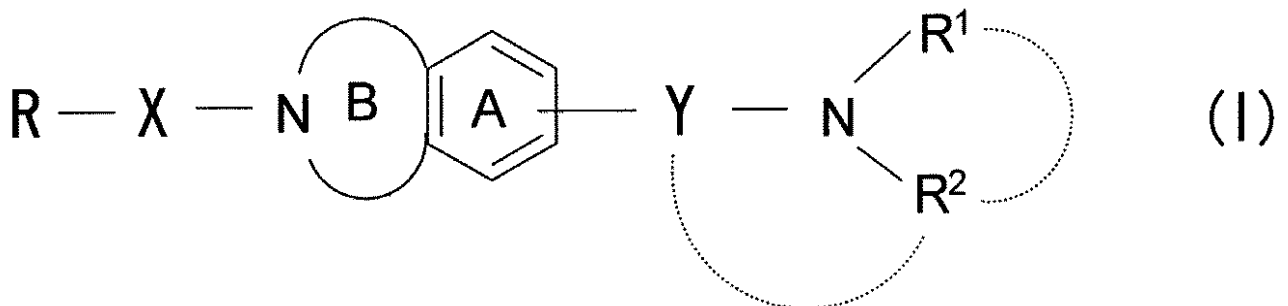
【補正の内容】

【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 が同一または異なって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。

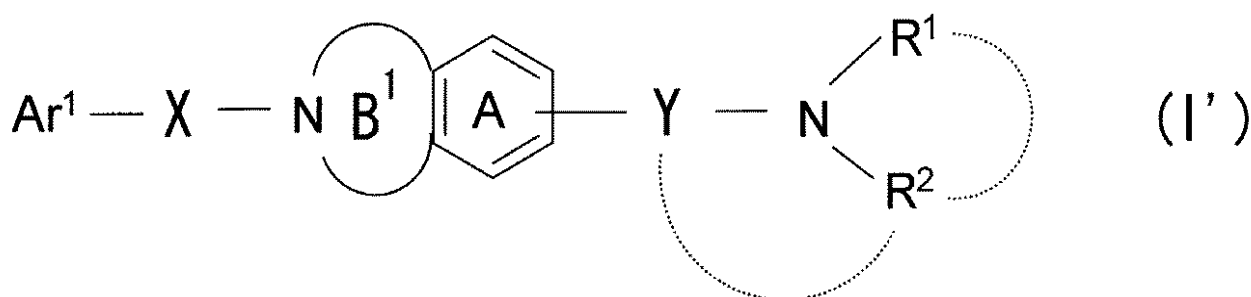
【請求項 4】

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（ピペリジンを除く）を形成していてもよい。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ルでない。また、Y は -CO-(C(R^a)H)_{n^a}- (R^a 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^a 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 が同一または異なって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 $C_1 - 6$ アルキル - カルボニル、ハロゲン化されていてもよい $C_1 - 6$ 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 価の $C_1 - 6$ 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 価基である請求項 5 記載の化合物。

【請求項 10】

X が C O である請求項 5 記載の化合物。

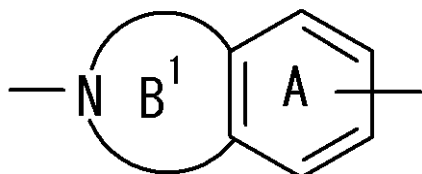
【請求項 11】

Y が置換基を有していてもよい $C_2 - 6$ アルケニレンである請求項 5 記載の化合物。

【請求項 12】

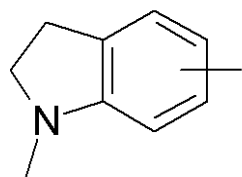
式

【化 3】

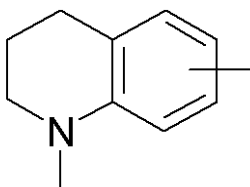


で表される基が、

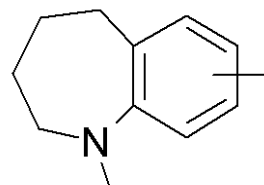
【化 4】



,



または



である請求項 5 記載の化合物。

【請求項 13】

R^1 と R^2 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】

R^1 および R^2 が $C_1 - 6$ 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】

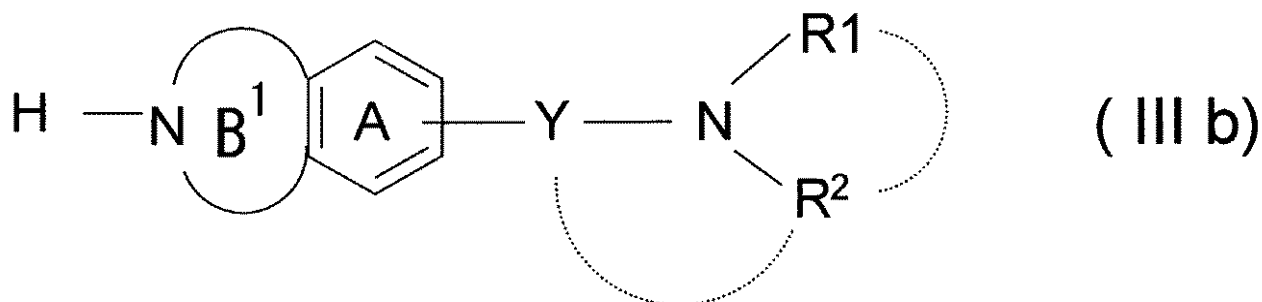
請求項 5 記載の化合物のプロドラッグ。

【請求項 17】

式: $Ar^1 - X - L$ (III b)

[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

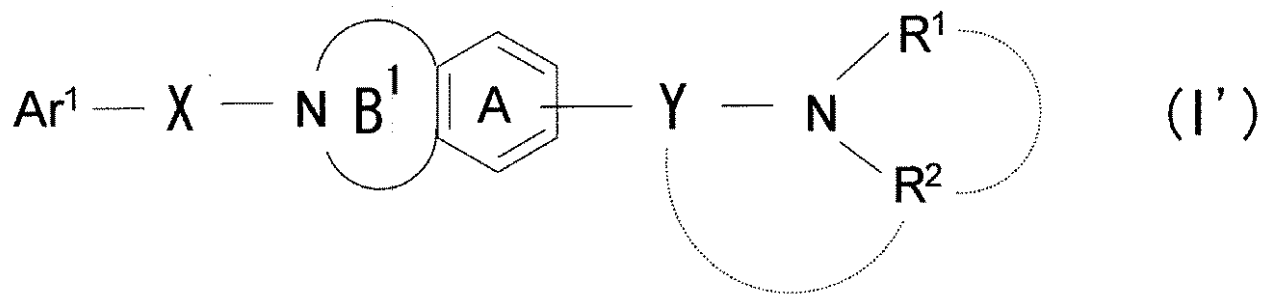
【化 5】



[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】

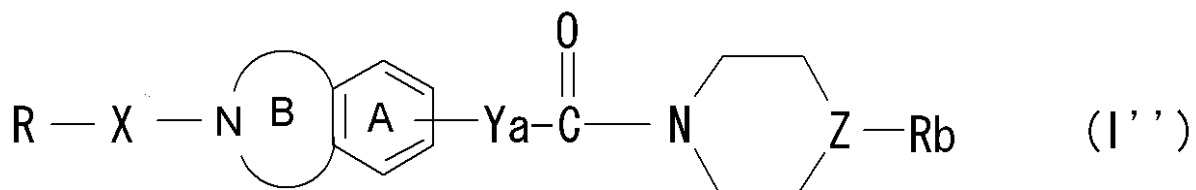


[式中の記号は前記と同意義を示す] で表される化合物またはその塩の製造方法。

【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 $-(CH_2)_{w1}CO(CH_2)_{w2}-$ ($w1$ 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。

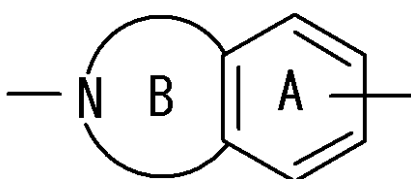
【請求項 22】

Rb が置換基を有していてもよい C_{6-14} アリールである請求項 18 記載の化合物。

【請求項 23】

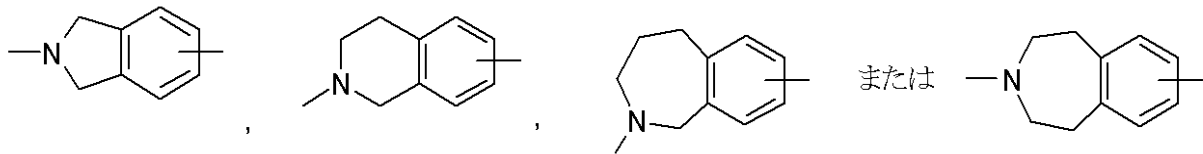
式

【化 8】



で表される基が、

【化 9】



である請求項 18 記載の化合物。

【請求項 24】

請求項 18 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 25】

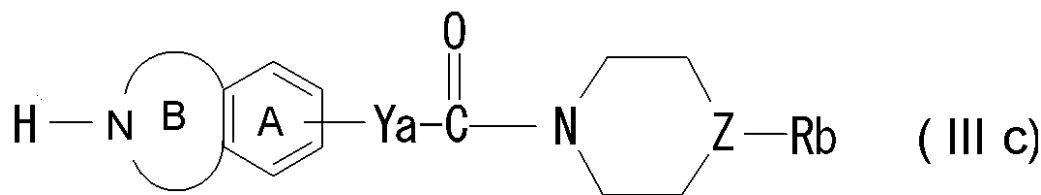
請求項 18 記載の化合物のプロドラッグ。

【請求項 26】

式： $R - X - L$ (II a)

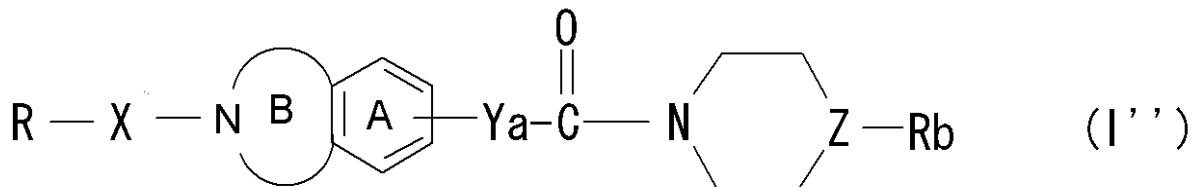
[式中、L は脱離基を、その他の記号は請求項 18 記載と同意義を示す] で表される化合物またはその塩と、式

【化 10】



[式中の記号は請求項 18 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 11】

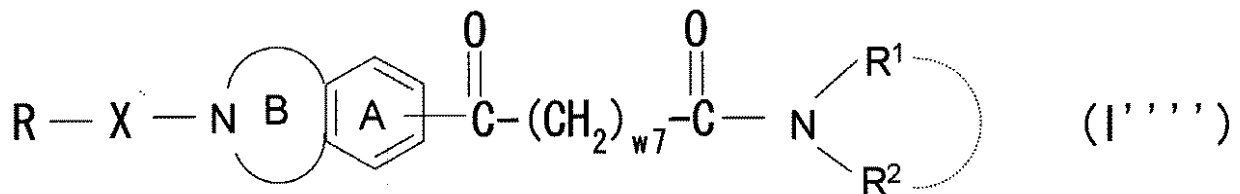


[式中の記号は前記と同意義を示す] で表される化合物またはその塩の製造方法。

【請求項 27】

式

【化 12】



[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 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 28】

請求項 27 記載の化合物またはその塩を含有してなる医薬組成物。

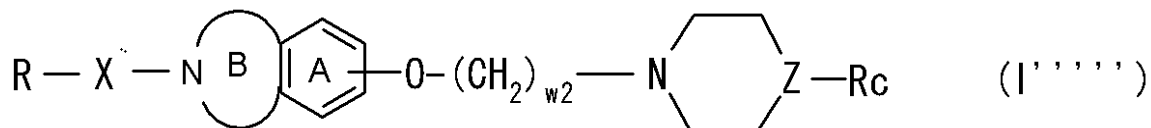
【請求項 29】

請求項 27 記載の化合物のプロドラッグ。

【請求項 30】

式

【化 13】



[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 31】

Z が CH である請求項 30 記載の化合物。

【請求項 32】

Rc 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 30 記載の化合物。

【請求項 33】

請求項 30 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 34】

請求項 30 記載の化合物のプロドラッグ。

【請求項 35】

摂食抑制剤である請求項 1 記載の剤。

【請求項 36】

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る医薬。