

【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 18 年 3 月 30 日 (2006.3.30)

【公表番号】特表 2005-519085 (P2005-519085A)

【公表日】平成 17 年 6 月 30 日 (2005.6.30)

【年通号数】公開・登録公報 2005-025

【出願番号】特願 2003-571261 (P2003-571261)

【国際特許分類】

C 0 7 D 271/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/4245 (2006.01)

A 6 1 K 31/575 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

C 0 7 J 43/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 271/10

A 6 1 K 31/4245

A 6 1 K 31/575

A 6 1 P 3/10

C 0 7 J 43/00

【手続補正書】

【提出日】平成 18 年 2 月 9 日 (2006.2.9)

【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

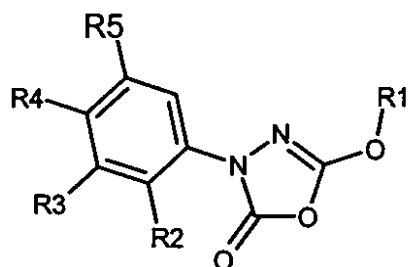
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 1

【化 1】



1

〔式中、R¹は、C₇～C₂₂-アルキル；C₄～C₂₀-アルコキシ-、C₆～C₁₀-アリール-、C₆～C₁₀-アリールオキシ-またはC₄～C₁₂-アルコキシ-C₂～C₄-アルコキシ-で置換されたC₂～C₄アルキル（ここでアリールはハロゲン、C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-アルコキシ、ニトロまたはCF₃によって1回またはそれ以上置換されたフェニルまたはナフチル基であってよい）；C₇～C₂₀-アルケニル；3-コレスタン-3-イル；C₆～C₁₂-アルキルまたはフェノキシによって置換されたフェニルを意味し、

R²、R³、R⁴およびR⁵は互いに独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、C₁～C₄-アルキル、C₁～C₉-アルキルオキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、または

$C_6 \sim C_{10}$ - アリール - $C_1 \sim C_4$ - アルキルオキシ、 $C_6 \sim C_{10}$ - アリールオキシ、 $C_6 \sim C_{10}$ - アリール、 $C_3 \sim C_8$ - シクロアルキルもしくは $O - C_3 \sim C_8$ - シクロアルキル（これらの各々は、ハロゲン、 CF_3 、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルオキシまたは $C_1 \sim C_4$ - アルキルによって 1 回、2 回または 3 回置換されていてもよい）を意味する）

の化合物ならびにその薬学的に受容可能な塩および酸付加塩。

【請求項 2】

R^1 が、 $C_7 \sim C_{22}$ - アルキル、 $C_7 \sim C_{20}$ - アルケニル、3 - コレスタン - 3 - イル、または $C_6 \sim C_{12}$ - アルキルもしくはフェノキシによって置換されたフェニルである請求項 1 に記載の式 1 の化合物。

【請求項 3】

R^2 が、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルまたは $C_1 \sim C_9$ - アルコキシである請求項 1 または 2 に記載の式 1 の化合物。

【請求項 4】

R^3 が、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、トリフルオロメトキシ、 $C_6 \sim C_{10}$ - アリール - $C_1 \sim C_4$ - アルキルオキシ（このアリール部分は場合によってハロゲンによって置換されてよい）である請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の式 1 の化合物。

【請求項 5】

R^4 が、水素、トリフルオロメトキシまたはクロロフェノキシである請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の式 1 の化合物。

【請求項 6】

R^5 が水素である請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の式 1 の化合物。

【請求項 7】

R^1 が $C_8 \sim C_{16}$ - アルキルである請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の式 1 の化合物。

【請求項 8】

R^1 が $C_8 \sim C_{16}$ - アルキルであり、

R^2 が水素であり、

R^3 が水素またはトリフルオロメチルオキシであり、

R^4 が水素、トリフルオロメチルオキシまたは 4 - クロロフェノキシであり、そして

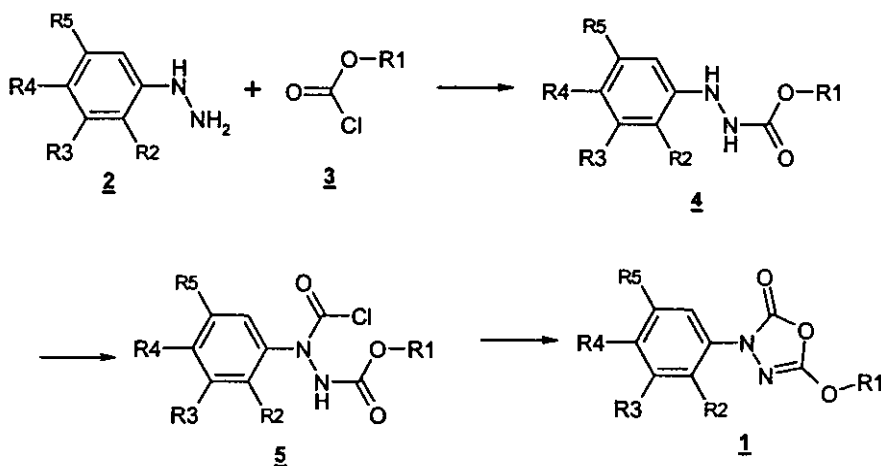
R^5 が水素である

請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の式 1 の化合物。

【請求項 9】

下式

【化 2】



（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 が請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に規定したとおりである）に従って、式 2 のヒドラジンを式 3 のクロロギ酸エステルまたは他の反応性炭酸エステル誘導体と反応させて、式 4 の化合物を生成し、これをホスゲン、カルボニルジイミダゾール、ジホスゲンまたはトリホスゲンによってアシル化し、環化しそして所望によ

り、基 $R^2 \sim R^5$ をさらに化学的に修飾することにより、式 1 の化合物へと転化することからなる請求項 1 ～ 8 のいずれか 1 項に記載の式 1 の化合物を製造する方法。

【請求項 10】

請求項 1 ～ 8 のいずれか 1 項に記載の式 1 の化合物を少なくとも 1 つ含有する医薬。

【請求項 11】

請求項 1 ～ 8 のいずれか 1 項に記載の式 1 の化合物を少なくとも 1 つ含有する肥満治療のための医薬。

【請求項 12】

請求項 1 ～ 8 のいずれか 1 項に記載の式 1 の化合物の少なくとも 1 つの医薬としての使用。