

【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 07 D 271/10 (2006.01)

A 61 K 31/4245 (2006.01)

A 61 K 31/575 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

C 07 J 43/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 271/10

A 61 K 31/4245

A 61 K 31/575

A 61 P 3/10

C 07 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

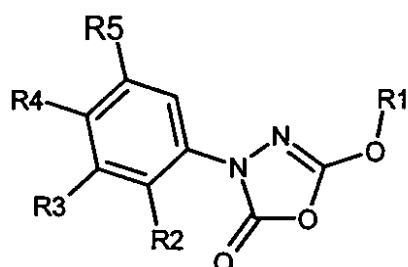
【補正の内容】

【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

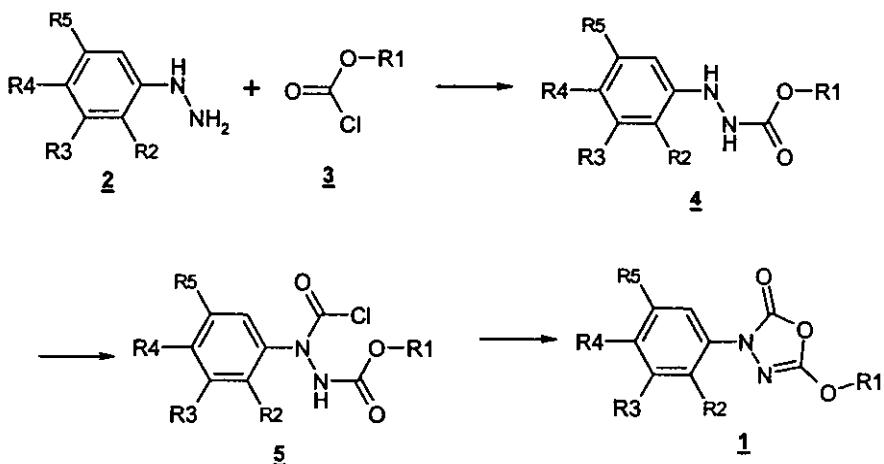
R^5 が水素である

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斯特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 R² ~ R⁵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。