

【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2月22日(2007.2.22)

【公表番号】特表2002-534419(P2002-534419A)

【公表日】平成14年10月15日(2002.10.15)

【出願番号】特願2000-592277(P2000-592277)

【国際特許分類】

C 0 7 D 265/24 (2006.01)
A 2 3 L 1/30 (2006.01)
A 6 1 J 3/00 (2006.01)
A 6 1 J 3/02 (2006.01)
A 6 1 J 3/06 (2006.01)
A 6 1 J 3/07 (2006.01)
A 6 1 K 31/536 (2006.01)
A 6 1 K 31/5365 (2006.01)
A 6 1 P 1/00 (2006.01)
A 6 1 P 3/00 (2006.01)
A 6 1 P 3/04 (2006.01)
A 6 1 P 3/06 (2006.01)
A 6 1 P 3/10 (2006.01)
A 6 1 P 9/00 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 9/12 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
C 0 7 D 413/12 (2006.01)
C 1 2 N 9/99 (2006.01)
C 0 7 D 498/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 265/24
A 2 3 L 1/30 Z
A 6 1 J 3/00 3 1 1 A
A 6 1 J 3/02 A
A 6 1 J 3/06 A
A 6 1 J 3/07 H
A 6 1 K 31/536
A 6 1 K 31/5365
A 6 1 P 1/00
A 6 1 P 1/00 1 7 1
A 6 1 P 3/00 1 7 1
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 3/06
A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 9/00
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 9/12
A 6 1 P 43/00 1 1 1
C 0 7 D 413/12
C 1 2 N 9/99
C 0 7 D 498/04 1 1 2 T

【手続補正書】

【提出日】平成19年1月5日(2007.1.5)

【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

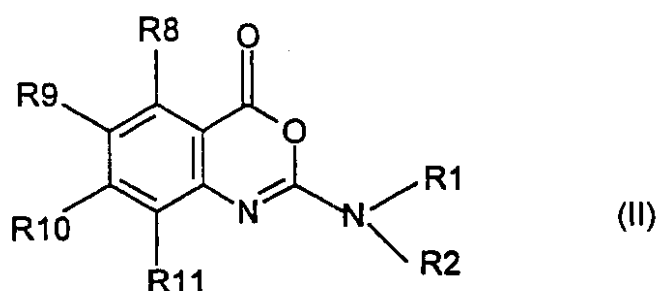
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 好ましい作用形態がエステル官能基の加水分解を触媒することである酵素の阻害を必要とする症状であって、該症状が肥満または肥満関連疾患である症状の予防又は治療のための薬物の製造における、式(II)を含む化合物、またはその薬学的に許容される塩、エステルまたはアミドの使用：

【化1】



式中、 R^1 は、分枝または非分枝アルキル（所望により1つ以上の酸素原子により割り込まれている）、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール、アリールアルキル、還元アリールアルキル、アリールアルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、還元アリール、還元ヘテロアリール、還元ヘテロアリールアルキルまたはその置換誘導体であり、ここでの置換基は、ハロゲン、アルキル、ハロ置換アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、還元ヘテロアリール、還元ヘテロアリールアルキル、アリールアルコキシ、シアノ、ニトロ、 $-C(O)R^4$ 、 $-CO_2R^4$ 、 $-SOR^4$ 、 $-SO_2R^4$ 、 $-NR^6R^7$ 、 $-OR^6$ 、 $-SR^6$ 、 $-C(O)CX^1X^2NR^6R^7$ 、 $-C(O)NR^4R^5$ 、 $-C(O)N(OR^5)R^6$ 、 $-NR^6C(O)R^4$ 、 $-CR^6(NH_2)CO_2R^6$ 、 $-NH CX^1X^2CO_2R^6$ 、 $-N(OH)C(O)NR^6R^7$ 、 $-N(OH)C(O)R^4$ 、 $-NH C(O)NR^6R^7$ 、 $-C(O)NHN R^6R^7$ 、 $-C(O)N(OR^5)R^6$ からなる群から独立に選択される1又は2以上であり、ただし、 R^1 および/または R^2 のどのヘテロ原子置換基も、少なくとも2炭素原子分（好ましくは飽和）、環外窒素原子から離れていなければならない；且つ

R^2 は、水素、または R^1 について上記で定義した基であり；

ここで、 R^4 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、還元ヘテロアリール、還元ヘテロアリールアルキル、 $-OR^6$ 、 $-NH CX^1X^2CO_2R^6$ または $-NR^6R^7$ であり；

R^5 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、還元ヘテロアリールまたは還元ヘテロアリールアルキルであり；

R^6 および R^7 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、還元ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、還元ヘテロアリールアルキルまたは $-(CH_2)_n(OR^5)_m$ （式中、 n は1~12であり、 m は1~3である）から独立に選択され；

X^1 および X^2 は、独立に水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール、ヘテロアリール、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、還元ヘテロアリールまたは還元ヘテロアリールアルキルであり；

R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} は、各々独立に、水素、ハロ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、シアノ、

または、上記に定義した R^1 基；

または、 R^{12} Q 基（式中、Q は O、CO、CONH、NHCO、S、SO、SO₂、又は SO₂NH₂、 R^{12} は水素又は上記に定義した R^1 基）；

または $R^1 R^2 N$ 基（式中、 R^1 および R^2 は上記に定義した通りであり、ただし、 R^1 および / または R^2 のどのヘテロ原子置換基も、少なくとも 2 炭素原子（好ましくは飽和）により、芳香族ヘテロ原子置換基から隔てられていなければならない。）である。

【請求項 2】 式 (II) の化合物において、

R^1 は、アリールまたはアリールアルキル基（アルキル部分は、25 以下の炭素原子を有する。）、またはアリールアリール基であり、ここでアリールアルキル基またはアリールアリール基は、スペーサーにより分離され得、該スペーサーは、エステル、アミド、O、CH₂、またはケトンであり得る；

R^2 は、水素、または R^1 について上記に定義した基であり；

R^8 は、水素またはフッ素であり；

R^9 は、1 ~ 10 個の炭素原子を有する低級分枝または非分枝アルキル；3 ~ 10 個の炭素原子を有する環式アルキル；ハロアルキル；またはハロゲンであり；

R^{10} は、1 ~ 10 個の炭素原子を有する低級分枝または非分枝アルキル；3 ~ 10 個の炭素原子を有する環式アルキル；ハロアルキル；またはハロゲンであり；

R^{11} は、水素、1 ~ 10 個の炭素原子を有する低級分枝または非分枝アルキル、またはハロゲンである、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 3】 R^1 は、OR¹³、-COR¹³、CO₂R¹³、SOR¹³、SO₂R¹³、CONR¹³R¹⁴、NR¹⁴C(O)NR¹³、C₁₋₁₀ アルキル、C₁₋₁₀ アルコキシ、ハロC₁₋₁₀ アルキル、アリール、アリールC₁₋₁₀ アルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアリールC₁₋₁₀ アルキルから選択した基により置換されたフェニル（ここで、 R^{13} および R^{14} は、各々独立に、水素、C₁₋₁₀ アルキル、C₂₋₁₀ アルケニル、C₂₋₁₀ アルキニル、C₃₋₆ シクロアルキル、C₃₋₆ シクロアルケニル、アリール、アリールC₁₋₁₀ アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールC₁₋₁₀ アルキル、還元ヘテロアリールまたは還元ヘテロアリールC₁₋₁₀ アルキルを示す）を示す、請求項 1 又は 2 に記載の使用。

【請求項 4】 R^1 は、OR¹³ または COR¹³（ここでの R^{13} はフェニルを示す）により置換されたフェニル；-CO₂R¹³（ここでの R^{13} はC₁₋₁₀ アルキルを示す）により置換されたフェニル；または、C₆₋₁₀ アルキルにより置換されたフェニルを示す、請求項 1 ないし 3 のいずれかに記載の使用。

【請求項 5】 前記酵素がリパーゼである、請求項 1 ないし 4 のいずれかに記載の使用。

【請求項 6】 前記肥満関連疾患が、高脂血症、高脂肪血症、高血糖（II 型糖尿病）、高血圧、心血管疾患、卒中、胃腸疾患および胃腸症から選択される、請求項 1 ないし 5 のいずれかに記載の使用。

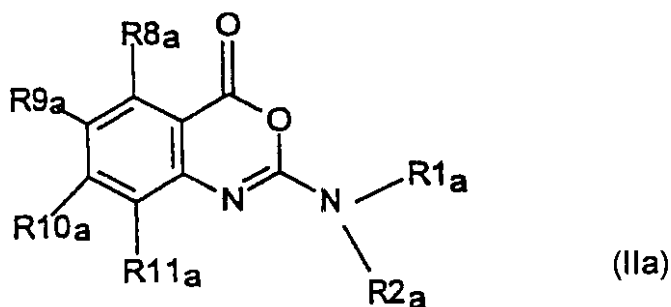
【請求項 7】 前記薬物は、体脂肪中のトキシンのレベルを減少させるためのものである、請求項 1 ないし 5 のいずれかに記載の使用。

【請求項 8】 薬物はヒト投与用である、請求項 1 ないし 7 のいずれかに記載の使用。

【請求項 9】 薬物は動物投与用である、請求項 1 ないし 7 のいずれかに記載の使用。

【請求項 10】 式 (IIa) で示される化合物またはその薬学的に許容される塩、エステル又はアミド；

【化2】



式中、

R^{1a} は、

(i) C_{10-30} 分枝または非分枝アルキル、 C_{2-30} アルケニル、 C_{2-30} アルキニル、シクロアルケニル、アリール- C_{10-30} アルキル、アリール- C_{10-30} アルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- C_{1-30} アルキル、ヘテロアリール- C_{2-30} アルケニル、還元アリール、還元ヘテロアリール、還元ヘテロアリール- C_{1-30} アルキルまたはこれらの置換誘導体であり、ここで置換基は、ハロゲン、 C_{1-10} アルキル、ハロ置換 C_{1-10} アルキル、アリール、アリール- C_{1-10} アルキル、ヘテロアリール、還元ヘテロアリール、還元ヘテロアリール- C_{1-10} アルキル、アリール- C_{1-10} アルコキシ、シアノ、ニトロ、 $-C(O)R^{13}$ 、 $-CO_2R^{13}$ 、 $-SOR^{13}$ 、 $-SO_2R^{13}$ 、 $-NR^{13}R^{14}$ 、 $-OR^{13}$ 、 $-SR^{13}$ 、 $-C(O)NR^{13}R^{14}$ 、および $-NR^{14}C(O)R^{13}$ からなる群から独立に選択した 1 または 2 以上であり、ただし、 R^1 のどのヘテロ原子置換基も、少なくとも 2 炭素原子分（好ましくは飽和型）、環外窒素原子から隔てられていなければならない；または

(ii) ハロ置換 C_{1-10} アルキル、アリール、アリール- C_{1-10} アルキル、ヘテロアリール、還元ヘテロアリール、還元ヘテロアリール- C_{1-10} アルキル、アリール- C_{1-10} アルコキシ、シアノ、 $-C(O)R^{13}$ 、 $-CO_2R^{13}$ 、 $-SOR^{13}$ 、 $-SO_2R^{13}$ 、 $-NR^{13}R^{14}$ 、 $-OR^{13}$ （ただし、この場合 R^{13} は、アリールまたはアルキルを示さない）、 $-SR^{13}$ 、 $-C(O)NR^{13}R^{14}$ 、および $-NR^{14}C(O)R^{13}$ からなる群から独立に選択した 1 または 2 以上により置換されたアリールを示し、

ここで R^{13} および R^{14} は、各々独立に、水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルケニル、アリール、アリール C_{1-10} アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール C_{1-10} アルキル、還元ヘテロアリールまたは還元ヘテロアリール C_{1-10} アルキルを示し；

R^{2a} は、水素、または R^1 について上記に定義した基であり；

R^{8a} 、 R^{9a} 、および R^{11a} は、式 (II) の R^8 、 R^9 、および R^{11} について上記に定義した通りであり；

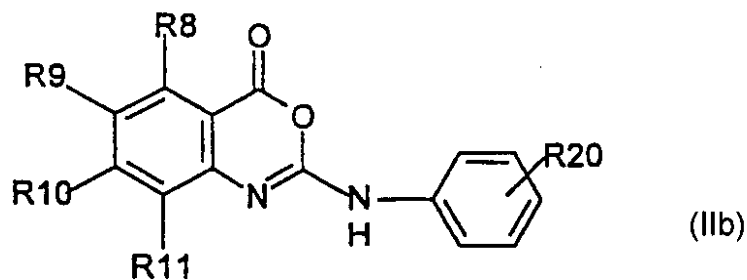
R^{10a} は、独立にハロ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、シアノ、または式 (II) において定義した R^1 基、または、 $R^{12}Q$ 基（ここでの Q は O、CO、CONH、NHCO、S、SO、SO₂、または SO₂NH であり、 R^{12} は、水素または式 (II) において R^1 について定義した基である）である；

但し、 R^{1a} がヘテロアリール基を表わすとき、チアジアゾイル、トリアゾイル又はチアゾイルではなく、 R^{1a} が還元ヘテロアリール基を表わすとき、チアゾリジニルではない。

【請求項 1.1】 R^{8a} および R^{11a} は、水素原子を示す、請求項 1.0 に記載の化合物。

【請求項 1.2】 式 (IIb) で示される化合物：

【化3】



式中、

$R^8 \sim R^{11}$ は、請求項 1 に定義した通りであり、

R^{20} は、所望により置換されたフェノキシを示す。

【請求項 13】 下記から選択される式 (II) の化合物、またはその塩、エステル又はアミド：

- 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 6 - クロロ - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 6 - メチル - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 2 - (4 - クロロフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 6 - メチル - 2 - (ナフト - 2 - イルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 7 - フルオロ - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 5 - フルオロ - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 7 - メチル - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 7 - エチル - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 7 - オクチル - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 7 - ブチル - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 2 - フェニルアミノ - 4 H - ピリド [2 , 3 - d] [1 , 3] オキサジン - 4 - オン ;
- 6 - ニトロ - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 6 - アセトアミド - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 2 - フェニルアミノ - 7 - トリフルオロメチル - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 7 - アミノ - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 2 - フェニルアミノ - 4 H - ピリド [3 , 4 - d] [1 , 3] オキサジン - 4 - オン ;
- 2 - シクロプロピルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 2 - (ナフト - 2 - イルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 2 - (6 - フェニルヘキシルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 6 - シアノ - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 6 - トリフルオロメチル - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 6 - ホルミル - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン - 6 - スルフィン酸 ;
- 7 - ヒドロキシ - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 7 - シクロプロピル - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 6 , 7 - ジメチル - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 6 - ヨード - 2 - オクチルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 7 - ブチル - 2 - オクチルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- 6 - メチル - 2 - (ドデカ - 7 - イニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;

- 8 - フルオロ - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 6 - シクロプロピル - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 6 - メルカプト - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ; および
 6 - シアノ - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン。

【請求項 1 4】 下記から選択される式 (IIa) の化合物、またはその塩、エステル又はアミド :

- 2 - (4 - トリフルオロメチルフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - (3 - トリフルオロメチルフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - (4 - ブトキシカルボニルフェニルアミノ) - 6 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - ヘキサデシルアミノ - 6 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - (4 - ベンゾイルフェニルアミノ) - 7 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - (4 - フェノキシフェニルアミノ) - 7 - トリフルオロメチル - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - (2 - シアノフェニルアミノ) - 7 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - (3 - シアノフェニルアミノ) - 7 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - (4 - シアノフェニルアミノ) - 7 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - (4 - シアノフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - (4 - カルボキシフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - (4 - アミノフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - (4 - ヒドロキシフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - (4 - N - メチルカルバモイルフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 , 2' - (1 , 8 - オクチリデンジアミノ) - ビス - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - (ピロール - 3 - イルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - (ピペリジン - 4 - イルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - [6 - (ピロール - 2 - イル) - ヘキシルアミノ] - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - (4 - エトキシカルボニルフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ; および
 6 - メチル - 2 - [6 - (チエン - 2 - イル) ヘキシルアミノ] - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン。

【請求項 1 5】 下記から選択される式 (IIb) の化合物、またはその塩、エステル又はアミド :

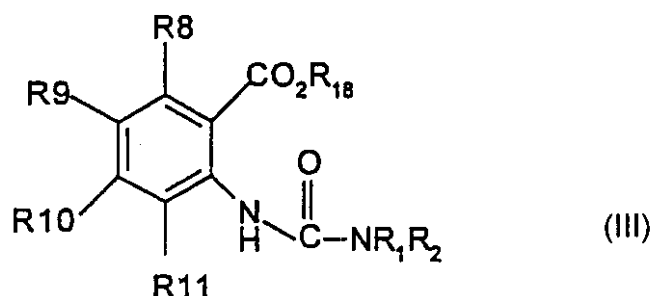
- 2 - (4 - ブチルフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - (4 - メトキシフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - (4 - メチルフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - (4 - フェノキシフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 2 - [4 (1 - メチルエチル) フェニルアミノ] - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 6 - メチル - 2 - (4 - フェノキシフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン

- 4 - オン ;
 - 7 - エチル - 2 - フェニルアミノ - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 - 2 - (4 - ヘキシルフェニルアミノ) - 6 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 - 2 - (4 - ヘプチルオキシフェニルアミノ) - 6 - メチル - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 - 7 - メチル - 2 - (4 - フェノキシフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 - 7 - メチル - 2 - (2 - フェノキシフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 - 7 - メチル - 2 - (3 - フェノキシフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 - 7 - メチル - 2 - (4 - オクチルフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
 - 2 - (2 - フェノキシフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン ;
- および
- 2 - (3 - フェノキシフェニルアミノ) - 4 H - 3 , 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン。

【請求項 16】 下記工程を含む、請求項 10 ~ 15 のいずれかに規定される新規な式 (II) の化合物の合成方法 :

工程 (A) : 式 (III) の化合物を環化する工程 ;

【化 4】

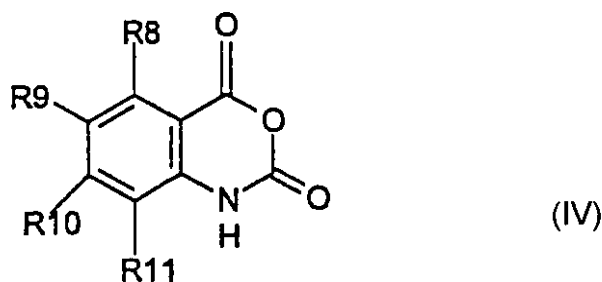


式中、 R^1 および $R^8 \sim R^{11}$ は上記に定義した通りであり、 R^{18} は水素または C_{1-6} アルキルである ;

または、

工程 (B) : 式 (IV) で示される化合物を、式 (V) で示されるアミンと反応させる工程 ;

【化 5】



【化 6】



または、

工程 (C) : 式 (II)、(IIa) または (IIb) の化合物を、例えば下記 (i) 又は (ii) により、異なる式 (IIa) または (IIb) の化合物に変換する工程 ;

(i) 式 (II)、(IIa) または (IIb) (ここでの R^1 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} および R^{11} のいずれかが、アルケニルまたはアルキニル基または部分を含む) の化合物の、対応するアルキルまたはアルケニル基または部分への還元 ;

(ii) 式 (II)、(IIa) または (IIb) (ここでの R^8 、 R^9 、 R^{10} および R^{11} の1つ以上がハロゲン原子を示す) の化合物のアルキル化。

【請求項 17】 薬物に使用するための、請求項 10 ~ 15 のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項 18】 薬学的に許容される担体または希釈剤と組合せて、請求項 10 ~ 15 のいずれかに規定される新規な式 (II) の化合物またはその薬学的に許容される塩、エステル、アミドまたはプロドラッグを含む医薬組成物。

【請求項 19】 肥満または肥満関連疾患の予防もしくは治療のための請求項 17 に記載の化合物、または請求項 18 に記載の組成物。

【請求項 20】 肥満関連疾患が、高脂血症、高脂肪血症、高血糖 (II型糖尿病)、高血圧、心血管疾患、卒中、胃腸疾患および胃腸症から選択される、請求項 19 に記載の化合物または組成物。

【請求項 21】 請求項 10 ~ 15 のいずれかに記載の式 (II) の化合物、またはその薬学的に許容される塩、エステルまたはアミドを含む食品。

【請求項 22】 好ましい作用形態がエステル官能基の加水分解を触媒することである酵素の阻害に使用するための、請求項 10 ~ 15 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 23】 一定の体重を維持するための、または美容的減量のための美容法であって、請求項 1 ~ 15 のいずれかに記載の化合物を投与することを含む、前記美容法。