

【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 7 月 20 日 (2006.7.20)

【公表番号】特表 2005-532392 (P2005-532392A)

【公表日】平成 17 年 10 月 27 日 (2005.10.27)

【年通号数】公開・登録公報 2005-042

【出願番号】特願 2004-519682 (P2004-519682)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (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 9/12 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 401/12 C S P

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/12

【手続補正書】

【提出日】平成 18 年 5 月 30 日 (2006.5.30)

【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

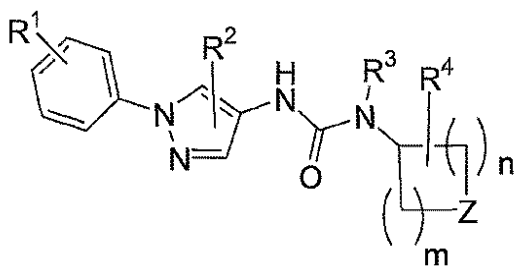
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

構造式

【化 1】



I

によって表される化合物またはその薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物であって、ここで、

m は、1 ~ 3 の数字であり；

n は、1 ~ 3 の数字であり；

mおよびnは、同じであり得るかまたは異なり得；

R^1 は、同じであり得るかまたは異なり得る 0 ~ 5 個の置換基であり、各々が、独立して、-OH、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、-CN、アルコキシ、シクロアルコキシ、アルキルチオ-、シクロアルキルチオ-、-NR⁵R⁶、-NO₂、-C(O)NR⁵R⁶、-NR⁵C(O)R⁶、-NR⁵C(O)NR⁵R⁶（ここで、2つのR⁵部分は、同じであり得るかまたは異なり得る）、-NC(O)OR⁷、-C(O)OR⁵、-SOR⁵、-SO₂R⁵、-SO₂NR⁵R⁶、アリールまたはヘテロアリールであり；

R^2 は、同じであり得るかまたは異なり得る 0 ~ 2 個の置換基であり、各々が、独立して、-OH、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、-CN、アルコキシ、シクロアルコキシ、アルキルチオ-、シクロアルキルチオ-、-NR⁵R⁶、-NO₂、-C(O)NR⁵R⁶、-NR⁵C(O)R⁶、-NR⁵C(O)NR⁵R⁶（ここで、2つのR⁵部分は、同じであり得るかまたは異なり得る）、-NC(O)OR⁷、-C(O)OR⁵、-SOR⁵、-SO₂R⁵、-SO₂NR⁵R⁶、アリールまたはヘテロアリールであり；

R^3 は、水素またはアルキルであり；

R^4 は、同じであり得るかまたは異なり得る 0 ~ 6 個の置換基であり、各々が、独立して、アルキル、アルコキシ、ヘテロアリール、アラルキル-、ヘテロアラルキル-、ハロアルキルまたは-OHであり；

R^5 および R^6 は、同じであり得るかまたは異なり得、各々が、独立して、水素、アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、ハロアルキルまたはシクロアルキルであり；

R^7 は、アルキルまたはシクロアルキルであり；

Zは、NR⁸またはCR³R⁹であり；

R^8 は、水素、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキル基で置換されたアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル-、ヘテロアラルキル-、-SO₂R¹⁰、-SO₂NR⁵R¹¹、-C(O)R¹¹、-C(O)NR⁵R¹¹または-C(O)OR¹⁰であり、

R^9 は、水素、アルキル、-OH、アルコキシ、-NR⁵R¹¹、アリール、またはヘテロアリールであるか；あるいは R^3 および R^9 は、一緒に結合して、それらが結合する炭素とともに、3 ~ 7 員環を形成し得；

R^{10} は、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；そして

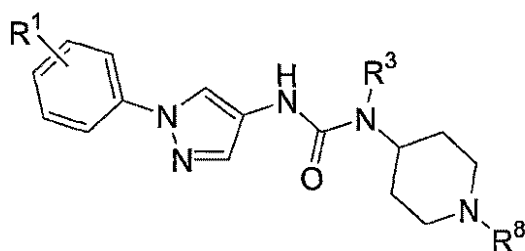
R^{11} は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、またはヘテロアリールである

、化合物またはその薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物。

【請求項 2】

式 I I：

【化 2】



式 II

を有する、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物

であって、ここで：

R^1 は、同じであり得るかまたは異なり得るハロゲンである 2 個の置換基であり；

R^3 は、アルキルであり；そして

R^8 は、 $-SO_2R^{10}$ または $-C(O)R^{11}$ である、
化合物またはその薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物。

【請求項 3】

R^1 が、ハロゲンである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 が、2 個の置換基である、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

各 R^1 が、フッ素である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

R^2 が、2 個の置換基である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

各 R^2 が、水素である、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

R^3 が、アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

R^3 が、メチルである、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

m が、2 であり、 n が 2 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

R^4 が、水素である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

Z が、 NR^8 である、請求項 11 に記載の化合物。

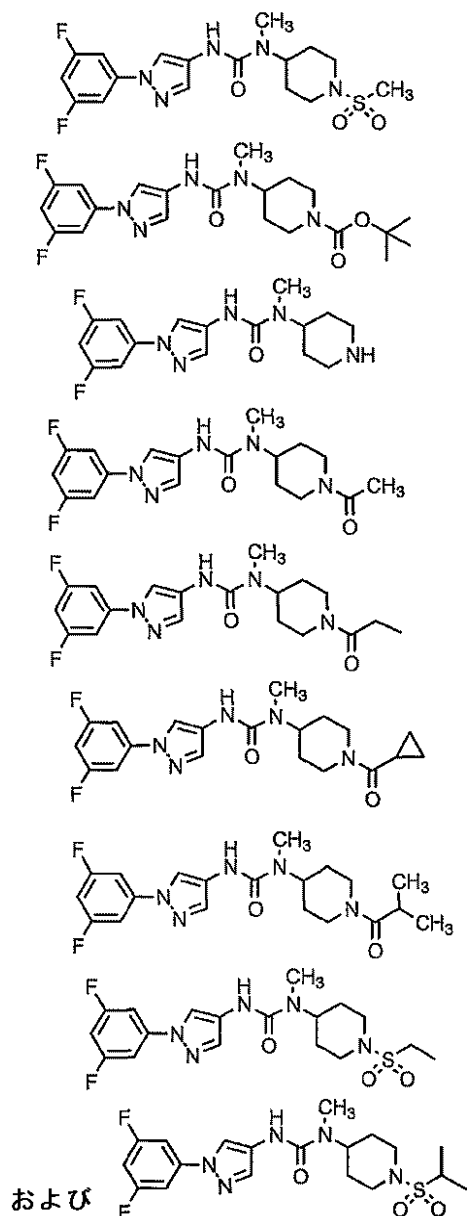
【請求項 13】

請求項 1 に記載の化合物であって、 R^8 が、 $-SO_2CH_3$ 、 $-C(O)OC(CH_3)_3$ 、水素、 $-C(O)CH_3$ 、 $-C(O)CH_2CH_3$ 、 $-C(O)$ シクロプロピル、 $-C(O)CH(CH_3)_2$ 、 $-SO_2CH_2CH_3$ 、または $-SO_2CH(CH_3)_2$ である、化合物。

【請求項 14】

請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物であって、以下

【化 3】



からなる群より選択される、化合物または薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物。

【請求項 15】

治療的有效量の少なくとも 1 つの請求項 1 に記載の化合物を、少なくとも 1 つの薬学的に受容可能なキャリアとともに含む、薬学的組成物。

【請求項 16】

代謝障害、摂食障害または糖尿病を処置するための薬学的組成物であって、治療的有效量の少なくとも 1 つの請求項 1 に記載の化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物を含む、このような処置を必要とする哺乳動物に投与するために処方されている、薬学的組成物。

【請求項 17】

治療的有效量の少なくとも 1 つの請求項 14 に記載の化合物を、少なくとも 1 つの薬学的に受容可能なキャリアとともに含む、薬学的組成物。

【請求項 18】

代謝障害、摂食障害または糖尿病を処置するための薬学的組成物であって、治療的有效量の少なくとも 1 つの請求項 14 に記載の化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩を

含み、このような処置を必要とする哺乳動物に投与するために処方されている、薬学的組成物。

【請求項 19】

前記摂食障害が過食症である、請求項 16 に記載の薬学的組成物。

【請求項 20】

前記代謝障害が肥満である、請求項 16 に記載の薬学的組成物。

【請求項 21】

肥満に関連する障害を処置するための薬学的組成物であって、治療的有效量の少なくとも 1 つの請求項 1 に記載の化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物を含み、このような処置を必要とする哺乳動物に投与するために処方されている、薬学的組成物。

【請求項 22】

請求項 21 に記載の薬学的組成物であって、前記肥満に関連する障害が I I 型の糖尿病、インスリン抵抗性、高脂血症、および高血圧である、薬学的組成物。

【請求項 23】

薬学的組成物であって、治療的有效量の以下：

第 1 の化合物であって、該第 1 の化合物が、請求項 1 に記載の化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物である、第 1 の化合物；

第 2 の化合物であって、該第 2 の化合物が、該第 1 の化合物とは異なる₃ アゴニスト、甲状腺ホルモン様剤、食欲抑制剤または N P Y アンタゴニストからなる群より選択された抗肥満剤および / または食欲抑制剤である、第 2 の化合物；および

薬学的に受容可能なキャリア、
を含む、薬学的組成物。

【請求項 24】

摂食障害を処置するためのキットであって、該キットは、以下：

一定量の第 1 の化合物であって、該第 1 の化合物が、請求項 1 に記載の化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物である、第 1 の化合物；および

第 2 の化合物であって、該第 2 の化合物が、該第 1 の化合物とは異なる₃ アゴニスト、甲状腺ホルモン様剤、食欲抑制剤または N P Y アンタゴニストからなる群より選択された抗肥満剤および / または食欲抑制剤である、第 2 の化合物；

を含み、

ここで、該一定量の第 1 の化合物および第 2 の化合物が、治療的效果を生じる、キット。

【請求項 25】

薬学的組成物であって、治療的有效量の以下：

第 1 の化合物であって、該第 1 の化合物が、請求項 1 に記載の化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物である、第 1 の化合物；

第 2 の化合物であって、該第 2 の化合物が、アルドースレダクターゼインヒビター、グリコーゲンホスホリラーゼインヒビター、ソルビトールデヒドロゲナーゼインヒビター、プロテインチロシンホスファターゼ 1 B インヒビター、ジペプチジルプロテアーゼインヒビター、インスリン、インスリン模倣物、メトホルミン、アカルボース (a c a r b o s e)、トログリタゾン、ロサグリタゾン、ピオグリタゾン、G W - 1 9 2 9、スルホニル尿素、グリバジド、グリブリド、およびクロルプロパミドからなる群より選択される、第 2 の化合物；ならびに

薬学的に受容可能なキャリア、
を含む、薬学的組成物。

【請求項 26】

少なくとも 1 つの請求項 14 に記載の化合物、および少なくとも 1 つの薬学的に受容可能なキャリアを組み合わせる工程を包含する、薬学的組成物を作製するためのプロセス。