

【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1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2004-535452(P2004-535452A)

【公表日】平成16年11月25日(2004.11.25)

【年通号数】公開・登録公報2004-046

【出願番号】特願2003-508951(P2003-508951)

【国際特許分類】

C 0 7 F 5/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/69 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

【F I】

C 0 7 F 5/02 C

A 6 1 K 31/69

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/06

【手続補正書】

【提出日】平成17年6月29日(2005.6.29)

【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

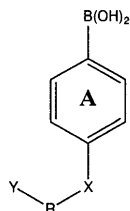
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の構造式：

【化1】



式中、フェニル環 A は置換されているか、または置換されていない；

X は -CZ'-'、-CHZ'-'、-CO-または-SO₂-であり；

R は、任意に1つ以上のアミン、アンモニウム、エーテル、チオエーテルまたはフェニレン結合基を含む置換または非置換のC₄~C₃₀直鎖ヒドロカルビル基であり；

Y は、Rの末端位に共有結合した-H、アミン、-[NH-(CH₂)_q]_r-NH₂、ハロゲン、-CF₃、チオール、アンモニウム、-OH、-COOH、-SO₃H、-OSO₃Hまたはホスホニウム基であり、ただし、Yが-Hであり、Rが直鎖ヒドロカルビル基である場合、Rは4~30炭素原子を有し、-[NH-(CH₂)_q]_r-NH₂の各-NHが任意にN-アルキル化またはN,N-ジアルキル化されており、-[NH-(CH₂)_q]_r-NH₂の-NH₂が任意にN-アルキル化、N,N-ジアルキル化またはN,N,N-トリアルキル化されており；

Z'はハロゲンであり；

q は 2 ~ 10の整数であり；

r は 1 ~ 5 の整数である、

により表される化合物またはその薬学的に許容されうる塩。

【請求項 2】

R が置換または非置換の $C_6 \sim C_{30}$ 直鎖ヒドロカルビル基である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

X が $-CO-$ であり、 R が、1 つ以上のアミンまたはアンモニウム結合基を含む置換もしくは非置換の直鎖ヒドロカルビル基であり、 Y が $-H$ 、アミンまたはアンモニウム基である請求項 1 または 2 記載の化合物。

【請求項 4】

R が、1 つのアンモニウム結合基を含む非置換の直鎖ヒドロカルビル基であり； Y が $-H$ であり；フェニル環 A が 1 つ以上の基 R_2 で置換されており、各 R_2 が、電子吸引基であり、独立して選ばれる請求項 1 または 2 記載の化合物。

【請求項 5】

X が $-CO-$ であり、 R が、任意に 1 つ以上のエーテル、チオエーテル、フェニレン、アミン、またはアンモニウム結合基を含む置換または非置換の直鎖ヒドロカルビル基であり、 Y は R の末端位に共有結合したアミンまたはアンモニウム基である請求項 1 または 2 記載の化合物もしくはその薬学的に許容されうる塩。

【請求項 6】

R が、 $-CH_2-O[-(CH_2)_pO]_m-(CH_2)_p-$ または $-CH_2-S[-(CH_2)_pO]_m-(CH_2)_p-$ であり、 p が 2 または 3 であり、 m が 1 ~ 8 の整数である請求項 5 記載の化合物。

【請求項 7】

R が、任意に 1 つ以上のエーテルまたはチオエーテル結合基を含む直鎖ヒドロカルビル基である請求項 5 記載の化合物。

【請求項 8】

フェニル環 A が 1 つ以上の基 R_2 で任意に置換されており、各 R_2 が、電子吸引基であり、独立して選ばれる請求項 7 記載の化合物。

【請求項 9】

R が、任意に 1 つのエーテルまたは 1 つのチオエーテル結合基を含む非置換の直鎖ヒドロカルビル基であり、 Y がトリアルキルアンモニウム基である請求項 8 記載の化合物。

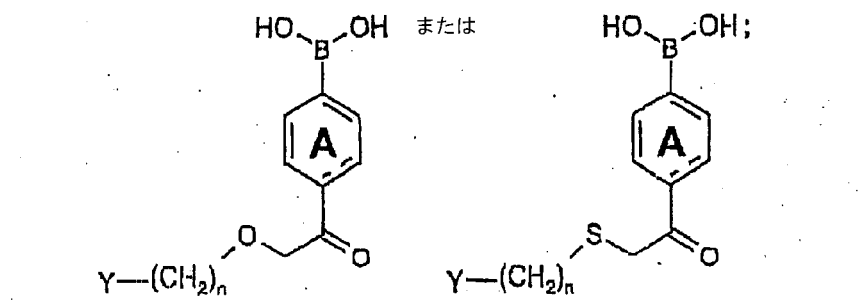
【請求項 10】

フェニル環 A が、1 つまたは 2 つの基 R_2 で置換されており、各 R_2 が $-F$ である請求項 8 記載の化合物。

【請求項 11】

以下の構造式：

【化 2】



式中、 Y はトリアルキルアンモニウム基であり； n は 6 ~ 30 の整数であり；フェニル環 A は、1 つまたは 2 つの基 R_2 で置換されており、各 R_2 は、電子吸引基であり、独立して選ばれる、

から選ばれる構造式により表される請求項 1 または 2 記載の化合物もしくはその薬学的に許容されうる塩。

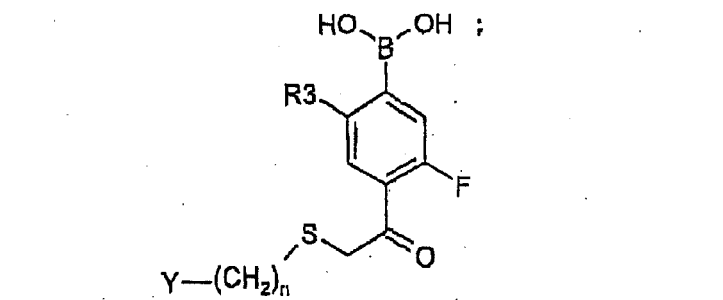
【請求項 1 2】

Y がトリメチルアンモニウム基であり、フェニル環 A が 2 つまでのフッ素基で置換されている請求項 1 1 記載の化合物。

【請求項 1 3】

以下の構造式：

【化 3】

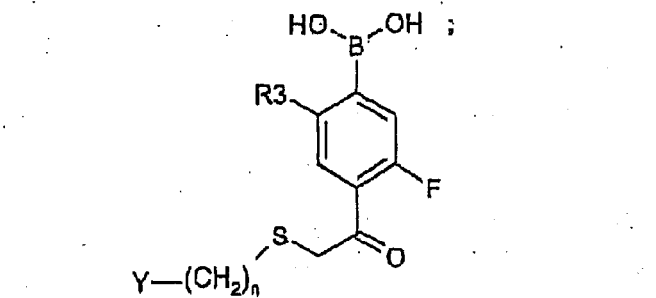


式中、R₃ は -H または -F である、
により表される請求項 1 2 記載の化合物。

【請求項 1 4】

以下の構造式：

【化 4】



式中、R₃ は -H または -F であり；n は 6 ~ 15 の整数であり；Y はトリメチルアンモニウム基である、
により表される請求項 1 1 記載の化合物またはその薬学的に許容されうる塩。

【請求項 1 5】

薬学的に許容されうる担体または希釈剤および請求項 1 ~ 1 4 いずれか記載の化合物を含有してなる医薬組成物。

【請求項 1 6】

薬学的に許容されうる塩が、塩化物、臭化物、酢酸塩、ギ酸塩、クエン酸塩、アスコルビン酸塩、硫酸塩またはリン酸塩である請求項 2 5 記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

薬学的に許容されうる塩が塩化物である請求項 2 7 記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

被験体の胃腸管において脂肪の取り込みを阻害する医薬の製造のための請求項 1 ~ 1 4 いずれか記載の化合物の使用。

【請求項 1 9】

被験体が肥満症について治療される請求項 1 8 記載の使用。

【請求項 2 0】

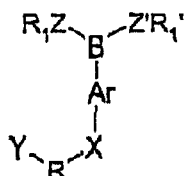
被験体が II 型糖尿病、グルコース寛容減損、高血圧症、環状動脈血栓症、心臓発作、脂質症候群、高血糖症、高トリグリセリド血症、高脂血症、睡眠時無呼吸、裂孔ヘルニア、逆流性食道炎、変形性関節炎、通風、体重増加に関連する癌、胆石、腎臓結石、肺高血圧症、不妊または心臓血管疾患について治療される請求項 1 8 記載の使用。

【請求項 2 1】

肥満症について被験体を治療するか、または被験体の脂肪の取り込みを阻害するための医薬の製造における、

以下の構造式：

【化 5】



式中、ZおよびZ'は、独立して、-O-、-NH-または-S-であり；

Arは、置換または非置換のアリール基であり；

Xは電子吸引基であり；

Rは、任意に1つ以上のアミン、アンモニウム、エーテル、チオエーテルまたはフェニレン結合基を含む置換または非置換の直鎖ヒドロカルビル基であり；

Yは、Rの末端位に共有結合した-H、アミン、 $-[NH-(CH_2)_q]_r-NH_2$ 、ハロゲン、 $-CF_3$ 、チオール、アンモニウム、 $-OH$ 、 $-COOH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-OSO_3H$ またはホスホニウム基であり、ただし、Yが-Hであり、Rが直鎖ヒドロカルビル基である場合、Rは1~30炭素原子を有し、ただし、 $-[NH-(CH_2)_q]_r-NH_2$ の各-NHは任意にN-アルキル化またはN,N-ジアルキル化されており、 $-[NH-(CH_2)_q]_r-NH_2$ の-NH₂は任意にN-アルキル化、N,N-ジアルキル化またはN,N,N-トリアルキル化されている；

qは2~10の整数であり；

rは1~5の整数であり；

R₁およびR₁'は、独立して、-H、脂肪族基、置換脂肪族基、アリール基または置換アリール基、または一緒になって、任意にアミン結合基 $[-N^+(R^{1a})-]$ を含むC2~C5の置換または非置換のアルキレン基であり；

R^{1a}は、-H、アルキル、置換アルキル、フェニルまたは置換フェニルである、により表される化合物の使用。

【請求項 2 2】

Yが-Hであり、RがC4~C30直鎖ヒドロカルビル基である請求項 2 1の使用。

【請求項 2 3】

RがC6~C30直鎖ヒドロカルビル基である請求項 2 2記載の使用。

【請求項 2 4】

ZおよびZ'が両方とも-O-である請求項 2 2または2 3の使用。

【請求項 2 5】

Arが置換または非置換のフェニル基である請求項 2 4の使用。

【請求項 2 6】

R₁およびR₁'が両方とも-Hである請求項 2 5の使用。

【請求項 2 7】

Xが、 $-CZ''_2-$ 、 $-CHZ''-$ 、 $-COO-$ 、 $-CONR^{1b}-$ 、 $-CO-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2O-$ または $-SO_2-$ であり；R^{1b}が-H、アルキルまたは置換アルキルであり；Z''がハロゲンであり、 $-X-R-Y$ が $-B(OH)_2$ に対してパラである請求項 2 6の使用。

【請求項 2 8】

Xが、 $-CZ''_2-$ 、 $-CHZ''-$ 、 $-COO-$ 、 $-CONR^{1b}-$ 、 $-CO-$ または $-SO_2-$ である請求項 2 7の使用。

【請求項 2 9】

Xが $-CO-$ であり、Rが、1つ以上のアミンまたはアンモニウム結合基を含む置換または非置換の直鎖ヒドロカルビル基であり、Yが-H、アミンまたはアンモニウム基である請求項 2 7の使用。

【請求項 3 0】

R が 1 つのアンモニウム結合基を含む非置換の直鎖ヒドロカルビル基であり ; Y が -H であり ; フェニル環 A が 1 つ以上の基 R_2 で置換されており、各 R_2 は電子吸引基であり、独立して選ばれる請求項 29 の使用。