

【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28年2月18日(2016.2.18)

【公表番号】特表2015-502386(P2015-502386A)

【公表日】平成27年1月22日(2015.1.22)

【年通号数】公開・登録公報2015-005

【出願番号】特願2014-548060(P2014-548060)

【国際特許分類】

C 07 D 211/22	(2006.01)
A 61 P 3/04	(2006.01)
A 61 P 3/10	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 K 31/451	(2006.01)
C 07 D 401/04	(2006.01)
A 61 K 31/4545	(2006.01)
C 07 D 417/12	(2006.01)
A 61 K 31/454	(2006.01)
C 07 D 413/12	(2006.01)
C 07 D 401/12	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)

【F I】

C 07 D 211/22	C S P
A 61 P 3/04	
A 61 P 3/10	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 K 31/451	
C 07 D 401/04	
A 61 K 31/4545	
C 07 D 417/12	
A 61 K 31/454	
C 07 D 413/12	
C 07 D 401/12	
A 61 K 31/5377	

【手続補正書】

【提出日】平成27年12月21日(2015.12.21)

【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

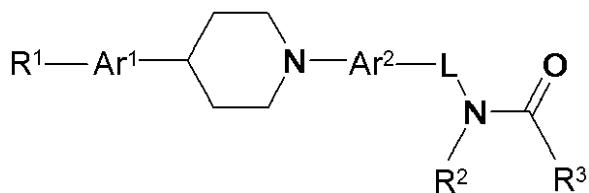
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(1)

## 【化1】



(式中、

$\text{Ar}^1$ は、6~10員アリーレン及び5~10員ヘテロアリーレン（全ては1つ以上の置換基 $\text{R}^A$ で置換されていてもよく、 $\text{Ar}^1$ の隣接C原子に結合している $\text{R}^1$ と $\text{R}^A$ が互いに結びついて一緒に $\text{C}_{3\sim 5}$ -アルキレン架橋基（1、2又は3個の $\text{CH}_2$ 基がO、C(=O)、S、S(=O)、S(=O)<sub>2</sub>、NH又はN( $\text{C}_{1\sim 4}$ -アルキル)-と置き換わっていてもよい）を形成していてもよく、前記アルキレン架橋は1又は2個の $\text{C}_{1\sim 3}$ -アルキル基で置換されていてもよい）からなる群 $\text{Ar}^1\text{-G1}$ より選ばれ；

$\text{R}^A$ は、H、F、Cl、Br、I、CN、OH、-NO<sub>2</sub>、 $\text{C}_{1\sim 4}$ -アルキル、 $\text{C}_{2\sim 4}$ -アルケニル、 $\text{C}_{1\sim 4}$ -アルキル-O-、 $\text{C}_{3\sim 7}$ -シクロアルキル-O-、 $\text{C}_{1\sim 4}$ -アルキル-C(=O)-、H<sub>2</sub>N-、H<sub>2</sub>N-C(=O)-、H<sub>2</sub>N-S(=O)<sub>2</sub>-、HO-C(=O)-、 $\text{C}_{1\sim 4}$ -アルキル-O-C(=O)-、フェニル及びフェニル-C<sub>1~3</sub>-アルキルからなる群 $\text{R}^A\text{-G1}$ より選ばれ（ここで、

各NH<sub>2</sub>基中、一方又は両方の水素原子は、独立して $\text{C}_{1\sim 4}$ -アルキルと置き換わっていてもよく；

各アルキル又はシクロアルキルは、F及びOHより選ばれる1つ以上の置換基で置換されていてもよい）；

$\text{Ar}^2$ は、フェニレン及びN、O又はSより選ばれる1、2又は3個のヘテロ原子を含有する5又は6員单環式芳香環からなる群 $\text{Ar}^2\text{-G1}$ より選ばれ（ここで、

前記基の全ては、1つ以上の置換基 $\text{R}^A$ で置換されていてもよい）；

$\text{L}$ は、1又は2個の $\text{C}_{1\sim 3}$ -アルキル基で置換されていてもよい直鎖 $\text{C}_{1\sim 4}$ -アルキレンからなる群 $\text{L-G1}$ より選ばれ；

$\text{R}^1$ は、OH、 $\text{C}_{1\sim 4}$ -アルキル-O-、 $\text{C}_{3\sim 7}$ -シクロアルキル-O-、 $\text{C}_{3\sim 7}$ -シクロアルキル-C<sub>1~3</sub>-アルキル-O-、H<sub>2</sub>N-、(C<sub>1~4</sub>-アルキル)NH-、(C<sub>1~4</sub>-アルキル)<sub>2</sub>N-、 $\text{C}_{3\sim 7}$ -シクロアルキル-N-、 $\text{C}_{3\sim 7}$ -シクロアルキル-N(C<sub>1~4</sub>-アルキル)-、 $\text{C}_{3\sim 7}$ -シクロアルキル-C<sub>1~3</sub>-アルキル-N(C<sub>1~4</sub>-アルキル)-、 $\text{C}_{3\sim 7}$ -シクロアルキル-C<sub>1~3</sub>-アルキル-NH-、C<sub>1~4</sub>-アルキル-C(=O)-、C<sub>1~4</sub>-アルキル-S(=O)<sub>2</sub>-、HO-C(=O)-、C<sub>1~4</sub>-アルキル-OC(=O)-、H<sub>2</sub>N-C(=O)-、(C<sub>1~4</sub>-アルキル)HN-C(=O)-、ヘテロシクリル-O-、ヘテロシクリル-C<sub>1~3</sub>-アルキル-O-、アリール-O-、アリール-C<sub>1~3</sub>-アルキル-O-、及び(C<sub>1~4</sub>-アルキル)<sub>2</sub>N-C(=O)-からなる群 $\text{R}^1\text{-G1}$ より選ばれ（ここで、

各アルキル又はシクロアルキルは、F及びOHより選ばれる1つ以上の置換基で置換されていてもよい）；

$\text{R}^2$ は、H及びC<sub>1~3</sub>-アルキルからなる群 $\text{R}^2\text{-G1}$ より選ばれ；

$\text{R}^3$ は、H、 $\text{C}_{1\sim 6}$ -アルキル、-O-(C<sub>1~4</sub>-アルキル)、C<sub>3~10</sub>-カルボシクリル、C<sub>3~10</sub>-カルボシクリル-C<sub>1~3</sub>-アルキル、C<sub>2~6</sub>-アルケニル、C<sub>2~6</sub>-アルキニル、R<sup>N1</sup>R<sup>N2</sup>N-、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル-C<sub>1~3</sub>-アルキル、アリール、アリール-C<sub>1~3</sub>-アルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリール-C<sub>1~3</sub>-アルキルからなる群 $\text{R}^3\text{-G1}$ より選ばれ（ここで、

各アリール、ヘテロアリール、カルボシクリル及びヘテロシクリルは、1つ以上のC<sub>1~4</sub>-アルキルで置換されていてもよく、かつ

各カルボシクリル及びヘテロシクリル中、-CH<sub>2</sub>-基は、-C(=O)-で置き換えられていてもよく、かつ

各アルキル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリール基は、1つ以上の置換基 $\text{R}^4$ で置換されていてもよい）；

$\text{R}^4$ は、F、Cl、Br、CN、OH、C<sub>1~4</sub>-アルキル、-O-(C<sub>1~4</sub>-アルキル)、-S-(C<sub>1~4</sub>-アルキル)、及び-NHC(=O)-C<sub>1~3</sub>-アルキルからなる群 $\text{R}^4\text{-G1}$ より選ばれ；

$R^{N1}$ は、H及び $C_{1-3}$ -アルキルからなる群 $R^{N1}-G1$ より選ばれ；

$R^{N2}$ は、H、 $C_{1-3}$ -アルキル、 $C_{3-10}$ -カルボシクリル、 $C_{3-10}$ -カルボシクリル- $C_{1-3}$ -アルキル、 $C_{2-6}$ -アルケニル、 $C_{2-6}$ -アルキニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル- $C_{1-3}$ -アルキル、アリール、アリール- $C_{1-3}$ -アルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリール- $C_{1-3}$ -アルキルからなる群 $R^{N2}-G1$ より選ばれ（ここで、

各カルボシクリル及びヘテロシクリルは、1つ以上の $C_{1-4}$ -アルキル、アリール又はアリール- $C_{1-3}$ -アルキルで置換されていてもよく、かつ

各カルボシクリル及びヘテロシクリル中、 $CH_2$ -基は、 $-C(=O)-$ で置き換えられていてもよく；かつ

各アルキル又はシクロアルキルは、F及びOHより選ばれる1つ以上の置換基で置換されていてもよい；

但し、アルケニル基とアルキニル基の任意の二重結合又は三重結合と、それらの基が付着している窒素原子との間に少なくとも1つの $CH_2$ -基がある）の化合物（その任意の互変異性体及び立体異性体を含む）、又はその塩。

#### 【請求項2】

$Ar^1$ が、フェニレン及びピリジニレンからなる群 $Ar^1-G3$ より選ばれ、ここで、

前記基の各々は、置換基 $R^A$ で置換されていてもよい、

請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項3】

$R^A$ が、H、F、 $-CH_3$ 及び $-OCH_3$ からなる群 $R^A-G4$ より選ばれる、  
請求項1又は2に記載の化合物。

#### 【請求項4】

$Ar^2$ が、F又は $-OCH_3$ で置換されていてもよいフェニレンからなる群 $Ar^2-G2a$ より選ばれる、  
請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物。

#### 【請求項5】

基Lが、1つのメチル基で置換されていてもよい直鎖 $C_{1-3}$ -アルキレンからなる群L-G3aより選ばれる、

請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物。

#### 【請求項6】

Lが、 $-CH(CH_3)-$ からなる群L-G5より選ばれる、  
請求項5に記載の化合物。

#### 【請求項7】

$R^2$ が、H及び $CH_3$ からなる群 $R^2-G2$ より選ばれる、  
請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物。

#### 【請求項8】

$R^2$ が、Hからなる群 $R^2-G3$ より選ばれる、  
請求項7に記載の化合物。

#### 【請求項9】

$R^1$ が、 $C_{1-4}$ -アルキル-O-、 $C_{3-6}$ -シクロアルキル-O-及び $C_{3-6}$ -シクロアルキル- $C_{1-3}$ -アルキル-O-からなる群 $R^1-G4$ より選ばれ、ここで、

各アルキル及びシクロアルキルは、1つ以上のF原子で置換されていてもよい、  
請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物。

#### 【請求項10】

$R^3$ が、 $C_{1-3}$ -アルキル、 $-O-(C_{1-2}$ -アルキル)、 $C_{3-5}$ -シクロアルキル、 $R^{N1}R^{N2}N-$ 、モルホリニル、ヘテロアリール及びヘテロアリール- $CH_2$ -からなる群 $R^3-G4$ より選ばれ、ここで、

各アルキルは、1～3個のF原子又は1つのCN、OH、 $-O-CH_3$ 及び $-S-CH_3$ で置換されていてもよく、かつ

各シクロアルキルは、1つのCN、OH、又は $-CH_3$ で置換されていてもよく、かつ

各ヘテロアリール基は、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ベンズイミダゾリル及びピリジニルからなる群より選ばれ、かつ

各ヘテロアリール基は、独立してフェニル、-CH<sub>3</sub>及び-NHC(=O)-CH<sub>3</sub>からなる群より選ばれる1つ以上の置換基で置換されていてもよく、かつ

R<sup>N1</sup>は、H及びC<sub>1-3</sub>-アルキルからなる群より選ばれ、かつ

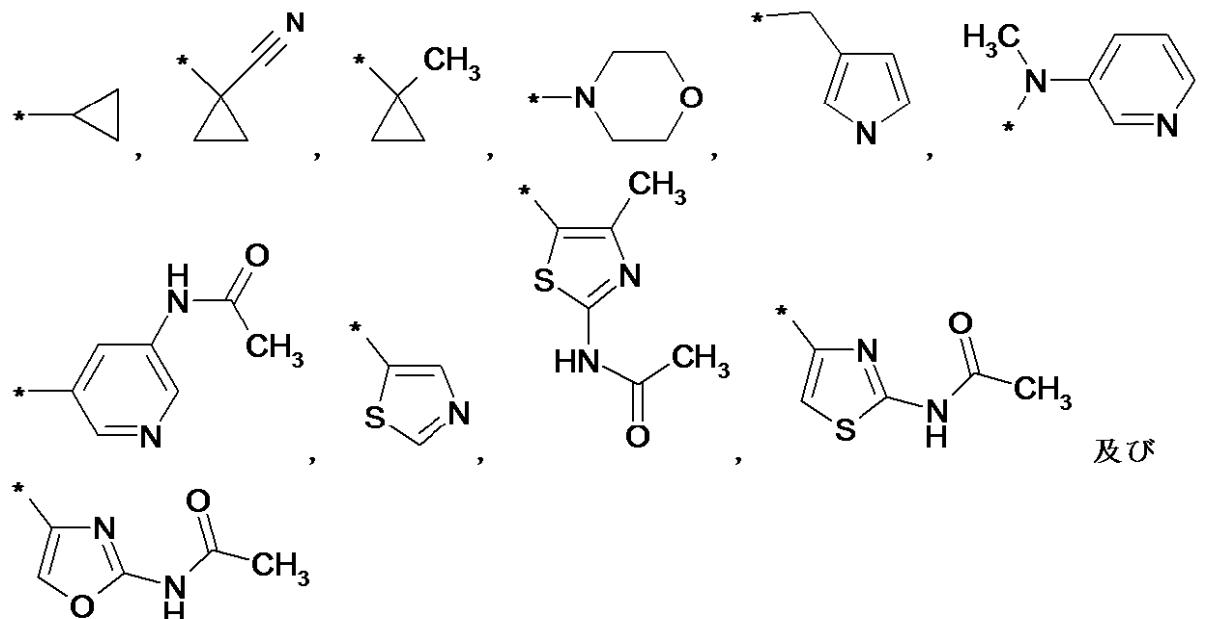
R<sup>N2</sup>は、H、C<sub>1-3</sub>-アルキル及びピリジニルからなる群から選ばれる、

請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項11】**

R<sup>3</sup>が、C<sub>1-3</sub>-アルキル、-CH<sub>2</sub>F、-CHF<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-CHF-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>-OH、-CH<sub>2</sub>-OCH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>3</sub>、-OCH<sub>3</sub>、-N(C<sub>1-2</sub>-アルキル)<sub>2</sub>、下記基

**【化2】**



からなる群R<sup>3</sup>-G5aより選ばれる、

請求項10に記載の化合物。

**【請求項12】**

R<sup>3</sup>が、-CH<sub>3</sub>、シクロプロビル及び-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>からなる群R<sup>3</sup>-G6より選ばれる、

請求項11に記載の化合物。

**【請求項13】**

請求項1～12のいずれか1項に記載の化合物の医薬的に許容され得る塩。

**【請求項14】**

請求項1～12のいずれか1項に記載の化合物又はその医薬的に許容され得る塩を含む医薬組成物。

**【請求項15】**

肥満症又は2型糖尿病の治療に用いるための請求項14に記載の医薬組成物。

**【請求項16】**

アセチルCoAカルボキシラーゼ酵素の活性を阻害することによって媒介される疾患又は状態を治療するための、請求項14に記載の医薬組成物。

**【請求項17】**

請求項1～12のいずれか1項に記載の1種以上の化合物又はその医薬的に許容され得る塩と1種以上の追加治療薬とを含む医薬組成物。