

【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4月5日(2007.4.5)

【公表番号】特表2002-538148(P2002-538148A)

【公表日】平成14年11月12日(2002.11.12)

【出願番号】特願2000-602222(P2000-602222)

【国際特許分類】

C 0 7 D 277/60 (2006.01)

A 6 1 K 31/428 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

C 0 7 D 417/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 277/60

A 6 1 K 31/428

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 P 3/04

C 0 7 D 417/04

【手続補正書】

【提出日】平成19年1月26日(2007.1.26)

【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

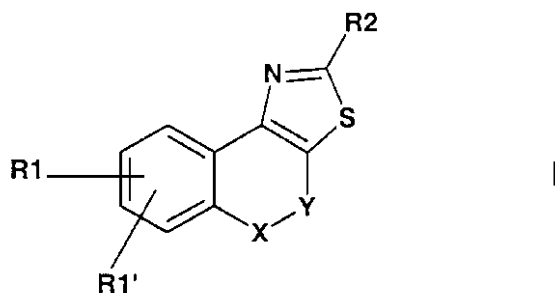
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記式I：

【化1】



[式中、Yは直接結合、CH₂、CH₂-CH₂であり、

XはCH₂、Oであり、

R1はCF₃、CN、COOH、COO(C₁-C₆)-アルキル、CONH₂、CONH(C₁-C₆)-アルキル、CON[(C₁-C₆)-アルキル]₂、(C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-アルケニル、(C₂-C₆)-アルキニル、O-(C₁-C₆)-アルキル、ただし、ここでアルキル、アルケニルおよびアルキニル基において1つ、2つ以上または全ての水素はフッ素で置き換えられていることができるか、または、水素1つがOH、OC(O)CH₃、OC(O)H、O-CH₂-Ph、NH₂またはNH-CO-CH₃またはN(COOCH₂Ph)₂で置き換えられていることができるもの；SO₂-NH₂、SO₂NH(C₁-C₆)-アルキル、SO₂N[(C₁-C₆)-アルキル]₂、S-(C₁-C₆)-アルキル、S-(CH₂)_n-フェニル、SO-(C₁-C₆)-アルキル、SO-(CH₂)_n-フェニル、SO₂-(C₁-C₆)-アルキル、SO₂-(CH₂)_n-フェニル、ただし、こ

ここで $n = 0 \sim 6$ であることができ、そしてフェニル基は F 、 Cl 、 Br 、 OH 、 CF_3 、 NO_2 、 CN 、 OCF_3 、 $O - (C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $(C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 NH_2 で 2 回まで置換されていることができるもの； NH_2 、 $NH - (C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $N((C_1 - C_6) - \text{アルキル})_2$ 、 $NH(C_1 - C_7) - \text{アシル}$ 、フェニル、ピフェニリル、 $O - (CH_2)_n - \text{フェニル}$ 、ただし $n = 0 \sim 6$ であることができるもの、1 - または 2 - ナフチル、2 - 、3 - または 4 - ピリジル、2 - または 3 - フラニルまたは 2 - または 3 - チエニル、ただし、ここでフェニル、ピフェニリル、ナフチル、ピリジル、フラニルまたはチエニル環は各々の場合、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 OH 、 CF_3 、 NO_2 、 CN 、 OCF_3 、 $O - (C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $(C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 NH_2 、 $NH(C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $N((C_1 - C_6) - \text{アルキル})_2$ 、 $SO_2 - CH_3$ 、 $COOH$ 、 $COO - (C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $CONH_2$ で 3 回まで置換されていることができるもの；1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル、ただしトリアゾール環はメチルまたはベンジルで 1 - 、2 - または 3 - 位で置換されていることができるもの；テトラゾール - 5 - イル、ただしテトラゾール環はメチルまたはベンジルで 1 - または 2 - 位で置換されていることができるものであり、

R_1 は H 、 CF_3 、 CN 、 $COOH$ 、 $COO(C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $CONH_2$ 、 $ONH(C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $CON[(C_1 - C_6) - \text{アルキル}]_2$ 、 $(C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $(C_2 - C_6) - \text{アルケニル}$ 、 $(C_2 - C_6) - \text{アルキニル}$ 、 $O - (C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、ただし、ここでアルキル、アルケニルおよびアルキニル基において 1 つ、2 つ以上または全ての水素はフッ素で置き換えられていることができるか、または、水素 1 つが OH 、 $OC(O)CH_3$ 、 $OC(O)H$ 、 $O - CH_2 - Ph$ 、 NH_2 または $NH - CO - CH_3$ または $N(COOCH_2Ph)_2$ で置き換えられていることができるもの； $SO_2 - NH_2$ 、 $SO_2NH(C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $SO_2N[(C_1 - C_6) - \text{アルキル}]_2$ 、 $S - (C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $S - (CH_2)_n - \text{フェニル}$ 、 $SO - (C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $SO - (CH_2)_n - \text{フェニル}$ 、 $SO_2 - (C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $SO_2 - (CH_2)_n - \text{フェニル}$ 、ただし、ここで $n = 0 \sim 6$ であることができ、そしてフェニル基は F 、 Cl 、 Br 、 OH 、 CF_3 、 NO_2 、 CN 、 OCF_3 、 $O - (C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $(C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 NH_2 で 2 回まで置換されていることができるもの； NH_2 、 $NH - (C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $N((C_1 - C_6) - \text{アルキル})_2$ 、 $NH(C_1 - C_7) - \text{アシル}$ 、フェニル、ピフェニリル、 $O - (CH_2)_n - \text{フェニル}$ 、ただし $n = 0 \sim 6$ であることができるもの、1 - または 2 - ナフチル、2 - 、3 - または 4 - ピリジル、2 - または 3 - フラニルまたは 2 - または 3 - チエニル、ただし、ここでフェニル、ピフェニリル、ナフチル、ピリジル、フラニルまたはチエニル環は各々の場合、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 OH 、 CF_3 、 NO_2 、 CN 、 OCF_3 、 $O - (C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $(C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 NH_2 、 $NH(C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $N((C_1 - C_6) - \text{アルキル})_2$ 、 $SO_2 - CH_3$ 、 $COOH$ 、 $COO - (C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $CONH_2$ で 3 回まで置換されていることができるもの；1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル、ただしトリアゾール環はメチルまたはベンジルで 1 - 、2 - または 3 - 位で置換されていることができるもの；テトラゾール - 5 - イル、ただしテトラゾール環はメチルまたはベンジルで 1 - または 2 - 位で置換されていることができるものであり、

R_2 は NH_2 、 NHR_3 、 NR_4R_5 であり、

R_3 は $(C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 CN 、 $CH = NH$ 、 $C(S) - NH_2$ 、 $C(=NH) - NH - \text{フェニル}$ であり、ただし、ここでフェニル環は F 、 Cl 、 Br 、 I 、 OH 、 CF_3 、 NO_2 、 CN 、 OCF_3 、 $O - (C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $(C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 NH_2 、 $NH(C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $N((C_1 - C_6) - \text{アルキル})_2$ 、 $SO_2 - CH_3$ 、 $COOH$ 、 $COO - (C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $CONH_2$ で 2 回まで置換されていることができるもの；フェニル、 $CH_2 - \text{フェニル}$ 、ただしここでフェニル環は F 、 Cl 、 Br 、 I 、 OH 、 NO_2 、 CN 、 OCF_3 、 $O - (C_2 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $(C_2 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 NH_2 、 $NH(C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $N((C_1 - C_6) - \text{アルキル})_2$ 、 $SO_2 - CH_3$ 、 $COOH$ 、 $COO - (C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $CONH_2$ で 3 回まで置換されていること

ができるもの；ピフェニリル、1 - または 2 - ナフチル、4 - ピリジル、2 - または 3 - フラニル、2 - または 3 - チエニル、5 - テトラゾリル、ただし、ここでピフェニリル、ナフチル、ピリジル、フラニルまたはチエニル環は各々の場合、F、Cl、Br、I、OH、CF₃、NO₂、CN、OCF₃、O - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキル、NH₂、NH(C₁ - C₆) - アルキル、N((C₁ - C₆) - アルキル)₂、SO₂ - CH₃、COOH、COO - (C₁ - C₆) - アルキル、CONH₂で2回まで置換されていることができるもの；CH₂ - フェニル、CH₂ - 2 - ピリジルまたはCH₂ - 4 - ピリジル、ただし、ここでフェニルまたはピリジル環はF、Cl、Br、I、OH、CF₃、NO₂、CN、OCF₃、O - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキル、NH₂、NH(C₁ - C₆) - アルキル、N((C₁ - C₆) - アルキル)₂、SO₂ - CH₃、COOH、COO - (C₁ - C₆) - アルキル、CONH₂で1回または2回置換されていることができるもの、

R 4 は C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、フェニル、CH₂ - フェニルであり、ただし、ここでフェニル環はF、Cl、Br、I、OH、CF₃、NO₂、CN、OCF₃、O - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキル、NH₂、NH(C₁ - C₆) - アルキル、N((C₁ - C₆) - アルキル)₂、SO₂ - CH₃、COOH、COO - (C₁ - C₆) - アルキル、CONH₂で1回または2回置換されていることができるもの、

R 5 は C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、フェニル、CH₂ - フェニルであり、ただし、ここでフェニル環はF、Cl、Br、I、OH、CF₃、NO₂、CN、OCF₃、O - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキル、NH₂、NH(C₁ - C₆) - アルキル、N((C₁ - C₆) - アルキル)₂、SO₂ - CH₃、COOH、COO - (C₁ - C₆) - アルキル、CONH₂で1回または2回置換されていることができるものであるか、または、

R 4 と R 5 は一緒になって以下の基：CH₂ - CH₂ - CH₂ - CH₂ - CH₂、CH₂ - CH₂ - N(CH₃) - CH₂ - CH₂、CH₂ - CH₂ - N(CH₂ - フェニル) - CH₂ - CH₂、CH₂ - CH₂ - O - CH₂ - CH₂、CH₂ - CH₂ - CH₂ - CH₂の1つを形成する]の化合物およびその生理学的に許容される塩および生理学的に機能性のある誘導体。

【請求項2】 Yは直接結合、CH₂、CH₂ - CH₂であり、

XはCH₂、Oであり、

R 1 は CF₃、CN、COOH、COO(C₁ - C₆) - アルキル、CONH₂、CONH(C₁ - C₆) - アルキル、CON[(C₁ - C₆) - アルキル]₂、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、O - (C₁ - C₆) - アルキル、ただし、ここでアルキル、アルケニルおよびアルキニル基において1つ、2つ以上または全ての水素はフッ素で置き換えられていることができるか、または、水素1つがOH、OC(O)CH₃、OC(O)H、O - CH₂ - Ph、NH₂、NH - CO - CH₃またはN(COOCH₂Ph)₂で置き換えられていることができるもの；SO₂ - NH₂、SO₂NH(C₁ - C₆) - アルキル、SO₂N[(C₁ - C₆) - アルキル]₂、S - (C₁ - C₆) - アルキル、S - (CH₂)_n - フェニル、SO - (C₁ - C₆) - アルキル、SO - (CH₂)_n - フェニル、SO₂ - (C₁ - C₆) - アルキル、SO₂ - (CH₂)_n - フェニル、ただし、ここでn = 0 ~ 6であることができ、そしてフェニル基はF、Cl、Br、OH、CF₃、NO₂、CN、OCF₃、O - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキル、NH₂で2回まで置換されていることができるもの；NH₂、NH - (C₁ - C₆) - アルキル、N((C₁ - C₆) - アルキル)₂、NH(C₁ - C₇) - アシル、フェニル、O - フェニル、ただしここでフェニル基はF、Cl、Br、I、OH、CF₃、NO₂、CN、OCF₃、O - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキル、NH₂、NH(C₁ - C₆) - アルキル、N((C₁ - C₆) - アルキル)₂、SO₂ - CH₃、COOH、COO - (C₁ - C₆) - アルキル、CONH₂で3回まで置換されていることができるもの、

R 1 はH、CF₃、CN、COOH、COO(C₁ - C₆) - アルキル、CONH₂、CONH(C₁ - C₆) - アルキル、CON[(C₁ - C₆) - アルキル]₂、(C₁ - C₆) - ア

ルキル、(C₂-C₆)-アルケニル、(C₂-C₆)-アルキニル、O-(C₁-C₆)-アルキル、ただし、ここでアルキル、アルケニルおよびアルキニル基において1つ、2つ以上または全ての水素はフッ素で置き換えられていることができるか、または、水素1つがOH、OC(O)CH₃、OC(O)H、O-CH₂-Ph、NH₂またはNH-CO-CH₃またはN(COOCH₂Ph)₂で置き換えられていることができるもの；SO₂-NH₂、SO₂NH(C₁-C₆)-アルキル、SO₂N[(C₁-C₆)-アルキル]₂、S-(C₁-C₆)-アルキル、S-(CH₂)_n-フェニル、SO-(C₁-C₆)-アルキル、SO-(CH₂)_n-フェニル、SO₂-(C₁-C₆)-アルキル、SO₂-(CH₂)_n-フェニル、ただし、ここでn=0~6であることができ、そしてフェニル基はF、Cl、Br、OH、CF₃、NO₂、CN、OCF₃、O-(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルキル、NH₂で2回まで置換されていることができるもの；NH₂、NH-(C₁-C₆)-アルキル、N((C₁-C₆)-アルキル)₂、NH(C₁-C₇)-アシル、フェニル、O-フェニル、ただしここでフェニル基はF、Cl、Br、I、OH、CF₃、NO₂、CN、OCF₃、O-(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルキル、NH₂、NH(C₁-C₆)-アルキル、N((C₁-C₆)-アルキル)₂、SO₂-CH₃、COOH、COO-(C₁-C₆)-アルキル、CONH₂で3回まで置換されていることができるもの、

R₂はNH₂、NHR₃、NR₄R₅であり、

R₃は(C₁-C₆)-アルキル、CN、CH=NH、C(S)-NH₂、C(=NH)-NH-フェニルであり、ただし、ここでフェニル環はF、Cl、Br、I、OH、CF₃、NO₂、CN、OCF₃、O-(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルキル、NH₂、NH(C₁-C₆)-アルキル、N((C₁-C₆)-アルキル)₂、SO₂-CH₃、COOH、COO-(C₁-C₆)-アルキル、CONH₂で2回まで置換されていることができるもの；フェニル、CH₂-フェニル、ただしここでフェニル環はF、Cl、Br、I、OH、NO₂、CN、OCF₃、O-(C₂-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-アルキル、NH₂、NH(C₁-C₆)-アルキル、N((C₁-C₆)-アルキル)₂、SO₂-CH₃、COOH、COO-(C₁-C₆)-アルキル、CONH₂で3回まで置換されていることができるもの、

R₄はC₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、フェニル、CH₂-フェニルであり、ただし、ここでフェニル環はF、Cl、Br、I、OH、CF₃、NO₂、CN、OCF₃、O-(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルキル、NH₂、NH(C₁-C₆)-アルキル、N((C₁-C₆)-アルキル)₂、SO₂-CH₃、COOH、COO-(C₁-C₆)-アルキル、CONH₂で1回または2回置換されていることができるもの、

R₅はC₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、フェニル、CH₂-フェニルであり、ただし、ここでフェニル環はF、Cl、Br、I、OH、CF₃、NO₂、CN、OCF₃、O-(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルキル、NH₂、NH(C₁-C₆)-アルキル、N((C₁-C₆)-アルキル)₂、SO₂-CH₃、COOH、COO-(C₁-C₆)-アルキル、CONH₂で1回または2回置換されていることができるもの

である、請求項1記載の式Iの化合物およびその生理学的に許容される塩および生理学的に機能性のある誘導体。

【請求項3】 Yは直接結合であり、

XはCH₂であり、

R₁はCF₃、CN、COOH、COO(C₁-C₆)-アルキル、CONH₂、CONH(C₁-C₆)-アルキル、CON[(C₁-C₆)-アルキル]₂、(C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-アルケニル、(C₂-C₆)-アルキニル、O-(C₁-C₆)-アルキル、ただし、ここでアルキル、アルケニルおよびアルキニル基において1つ、2つ以上または全ての水素はフッ素で置き換えられていることができるもの；SO₂-NH₂、SO₂NH(C₁-C₆)-アルキル、SO₂N[(C₁-C₆)-アルキル]₂、S-(C₁-C₆)-アルキル、S-(CH₂)_n-フェニル、SO-(C₁-C₆)-アルキル、SO-(CH₂)_n

- フェニル、 $\text{SO}_2 - (\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 $\text{SO}_2 - (\text{CH}_2)_n - \text{フェニル}$ 、ただし、ここで $n = 0 \sim 6$ であることができ、そしてフェニル基は F、Cl、Br、OH、 CF_3 、 NO_2 、CN、 OCF_3 、 $\text{O} - (\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 NH_2 で 2 回まで置換されていることができるもの；フェニル、 $\text{O} - \text{フェニル}$ 、ただしここでフェニル基は F、Cl、Br、I、OH、 CF_3 、 NO_2 、CN、 OCF_3 、 $\text{O} - (\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 NH_2 、 $\text{NH}(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 $\text{N}((\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル})_2$ 、 $\text{SO}_2 - \text{CH}_3$ 、 COOH 、 $\text{COO} - (\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 CONH_2 で 3 回まで置換されていることができるもの、

R1 は H、 CF_3 、CN、 COOH 、 $\text{COO}(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 CONH_2 、 $\text{CONH}(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 $\text{CON}[(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}]_2$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6) - \text{アルケニル}$ 、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6) - \text{アルキニル}$ 、 $\text{O} - (\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、ただし、ここでアルキル、アルケニルおよびアルキニル基において 1 つ、2 つ以上または全ての水素はフッ素で置き換えられていることができるもの； $\text{SO}_2 - \text{NH}_2$ 、 $\text{SO}_2\text{NH}(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}[(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}]_2$ 、 $\text{S} - (\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 $\text{S} - (\text{CH}_2)_n - \text{フェニル}$ 、 $\text{SO} - (\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 $\text{SO} - (\text{CH}_2)_n - \text{フェニル}$ 、 $\text{SO}_2 - (\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 $\text{SO}_2 - (\text{CH}_2)_n - \text{フェニル}$ 、ただし、ここで $n = 0 \sim 6$ であることができ、そしてフェニル基は F、Cl、Br、OH、 CF_3 、 NO_2 、CN、 OCF_3 、 $\text{O} - (\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 NH_2 で 2 回まで置換されていることができるもの；フェニル、 $\text{O} - \text{フェニル}$ 、ただしここでフェニル基は F、Cl、Br、I、OH、 CF_3 、 NO_2 、CN、 OCF_3 、 $\text{O} - (\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 NH_2 、 $\text{NH}(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 $\text{N}((\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル})_2$ 、 $\text{SO}_2 - \text{CH}_3$ 、 COOH 、 $\text{COO} - (\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 CONH_2 で 3 回まで置換されていることができるもの、

R2 は NH_2 、 NHR_3 、 NR_4R_5 であり、

R3 は $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ であり、

R4 は $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ であり、

R5 は $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$

である、請求項 1 または 2 記載の式 I の化合物およびその生理学的に許容される塩。

【請求項 4】 請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の化合物 1 つまたは 2 つ以上を含有する医薬。

【請求項 5】 請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の化合物 1 つまたは 2 つ以上および食欲減退活性成分 1 つまたは 2 つ以上を含有する医薬。