

【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26年5月15日(2014.5.15)

【公表番号】特表2013-532682(P2013-532682A)

【公表日】平成25年8月19日(2013.8.19)

【年通号数】公開・登録公報2013-044

【出願番号】特願2013-521285(P2013-521285)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/426	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	27/12	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	3/06	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/426
A 6 1 P	1/16
A 6 1 P	9/00
A 6 1 P	27/12
A 6 1 P	13/12
A 6 1 P	25/00
A 6 1 P	9/10
A 6 1 P	9/12
A 6 1 P	17/00
A 6 1 P	17/06
A 6 1 P	11/00
A 6 1 P	3/10
A 6 1 P	3/06

【手続補正書】

【提出日】平成26年3月28日(2014.3.28)

【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

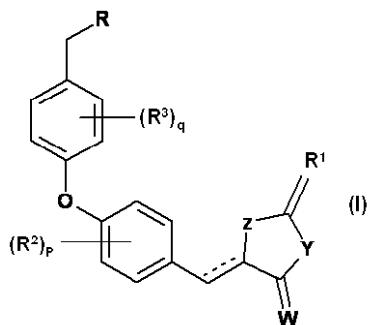
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

肝臓障害および関連疾患、肺障害および関連疾患、糖尿病合併症および心血管疾患の予防または処置に用いられる、式(I)の化合物、それらの誘導体、類似体、互変異性型、立体異性体、多形、水和物、溶媒和物、薬学的に許容される塩、代謝産物またはプロドラッグを含む医薬組成物。

【化1】

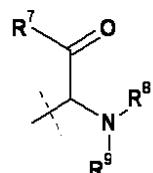


[式中、- - - - は任意選択の結合を表し；Wは、OまたはSを表し；Yは、NR⁴、SまたはOを表し；ここでR⁴は、水素、アルキル、アルケニルおよびアリールから選択される置換型または非置換型の基、対イオンまたは-C₂H₂COR⁶を表し；ここでR⁶は、-OH、-NH₂、-NHOHまたはOR¹⁸を表し；ここでR¹⁸はアルキル基であり；Zは、-CR⁵またはSを表し；R¹は、O、Sを表すか、あるいはR⁵と一緒に、炭素原子またはO、SもしくはNから選択される1つまたは2つのヘテロ原子を含む縮合5員または6員の芳香族環系もしくは芳香族複素環系を形成し；R²、R³およびR⁵は、独立して水素、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、ホルミル、アミノ、アルキル、ハロアルキルまたはアルコキシを表し；

Rは、UまたはVのいずれかを表し；ここでUは、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、ホルミル、アミノ、-COR¹⁰、または直鎖状もしくは分枝状の(C₁-C₆)アルキル基および(C₁-C₆)アルコキシ基から選択される置換型もしくは非置換型の基を表し；R¹⁰は、-OR¹¹または-NR¹²R¹³を表し；ここでR¹¹は、水素、アルキル、アルケニル、アリール、アラルキルおよびヘテロアリールから選択される置換型もしくは非置換型の基、または対イオンを表し；R¹²およびR¹³は、独立して水素、アルキル、アルケニル、アリールおよびヘテロアリールから選択される置換型もしくは非置換型の基を表し；またはR¹²およびR¹³はヘテロ脂肪族または芳香族複素環を一緒に形成し；

Vは；

【化2】



を表し、R⁷は-OR¹⁴を表し、ここでR¹⁴は、水素、アルキル、アルケニル、アリール、アラルキルおよびヘテロアリールから選択される置換型もしくは非置換型の基、または対イオン；または-NR¹⁵R¹⁶を表し；ここでR¹⁵およびR¹⁶は、独立して水素、またはアルキル、アルケニル、アリールおよびヘテロアリールから選択される置換型もしくは非置換型の基を表し；R⁸およびR⁹は、独立して水素、アルキル、アルケニル、アリールおよびヘテロアリールから選択される置換型もしくは非置換型の基、または-COR¹⁷を表し；ここでR¹⁷は、アルキル、アリール、ヘテロアリール、アルケニル、アルケニルオキシ、アリールオキシ、アルコキシおよびアラルコキシから選択される置換型または非置換型の基を表し；

pおよびqは、1～3から選択される整数である】

【請求項2】

式(I)の化合物が、

i. メチル(2S)-2-アミノ-3-(4-{4-[(2,4-ジオキソ-1,3-チアゾリジン-5-イル)メチル]フェノキシ}フェニル)プロパノエートまたはその塩；

ii. (2S)-2-アミノ-3-(4-{4-[(2,4-ジオキソ-1,3-チア

ゾリジン - 5 - イル) メチル] フェノキシ} フェニル) プロパン酸またはその塩、および
i i i . (4 - { 4 - [(2 , 4 - ジオキソ - 1 , 3 - チアゾリジン - 5 - イル) メチ
ル] フェノキシ} フェニル) 酢酸またはその塩
から選択される、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

前記塩が、塩酸塩、臭化水素酸塩、ナトリウム、カリウムまたはマグネシウム塩から選
択される、請求項 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

式 (I) の化合物が、メチル (2 S) - 2 - アミノ - 3 - (4 - { 4 - [(2 , 4 - ジ
オキソ - 1 , 3 - チアゾリジン - 5 - イル) メチル] フェノキシ} フェニル) プロパンエ
ートの塩酸塩である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

式 (I) の化合物が、(2 S) - 2 - アミノ - 3 - (4 - { 4 - [(2 , 4 - ジオキソ
- 1 , 3 - チアゾリジン - 5 - イル) メチル] フェノキシ} フェニル) プロパン酸の塩酸
塩である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

式 (I) の化合物が、(4 - { 4 - [(2 , 4 - ジオキソ - 1 , 3 - チアゾリジン - 5
- イル) メチル] フェノキシ} フェニル) 酢酸である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

式 (I) の化合物が、(4 - { 4 - [(2 , 4 - ジオキソ - 1 , 3 - チアゾリジン - 5
- イル) メチル] フェノキシ} フェニル) 酢酸の二ナトリウム塩である、請求項 1 に記載
の医薬組成物。

【請求項 8】

肝臓障害が非アルコール性脂肪肝疾患 (N A F L D) 、非アルコール性脂肪性肝炎 (N
A S H) 、肝線維症、肝硬変およびアルコール性脂肪性肝臓症から選択される、請求項 1
に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

肝臓障害がN A F L D およびN A S H である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

N A F L D およびN A S H を処置するための、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

糖尿病合併症が、虚血性心疾患、脳血管疾患および末梢血管疾患から選択されるマクロ
合併症または白内障、網膜症、腎症、神経障害、黄斑症および緑内障から選択されるミク
ロ合併症である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

心血管疾患が、アテローム硬化症、再狭窄、高血圧、血管けいれんおよび心肥大から選
択される、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

関連疾患が、乾癬、強皮症、肺転移、肺線維症、多囊胞卵巣症候群および閉塞性無呼吸
から選択される、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

糖尿病合併症が、糖尿病網膜症、糖尿病腎症、糖尿病神経障害および糖尿病白内障から
選択される、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

血漿または肝臓のトリグリセリドレベルを低減するための、請求項 1 に記載の医薬組成
物。

【請求項 16】

血漿のグルコースレベルを低減するための、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

T N F - 、 I L - 6 、 i N O S 、アルドースレダクターゼおよびマトリックスメタロ

プロテイナーゼ 2 を阻害するための、請求項 1 に記載の医薬組成物。