

【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22年7月15日 (2010.7.15)

【公表番号】特表2009-531291 (P2009-531291A)

【公表日】平成21年9月3日 (2009.9.3)

【年通号数】公開・登録公報2009-035

【出願番号】特願2008-554770 (P2008-554770)

【国際特許分類】

C 07 D 309/10 (2006.01)

C 07 D 407/12 (2006.01)

A 61 K 31/351 (2006.01)

C 07 D 405/12 (2006.01)

A 61 K 31/453 (2006.01)

A 61 K 31/695 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 5/50 (2006.01)

A 61 P 3/06 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 9/12 (2006.01)

A 61 P 9/04 (2006.01)

A 61 P 7/10 (2006.01)

A 61 P 1/18 (2006.01)

A 61 P 1/16 (2006.01)

C 07 F 7/10 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 309/10 C S P

C 07 D 407/12

A 61 K 31/351

C 07 D 405/12

A 61 K 31/453

A 61 K 31/695

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 3/10

A 61 P 5/50

A 61 P 3/06

A 61 P 9/10 1 0 1

A 61 P 3/04

A 61 P 9/12

A 61 P 9/04

A 61 P 7/10

A 61 P 1/18

A 61 P 1/16

C 07 F 7/10 R

【手続補正書】

【提出日】平成22年5月25日 (2010.5.25)

【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

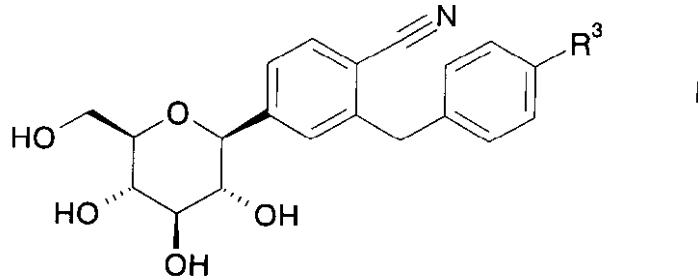
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式Iのグルコピラノシル置換ベンゾニトリル誘導体

【化 1】



(式中、 R^3 は、メチルオキシ、エチルオキシ、イソプロピルオキシ、シクロブチルオキシ、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシ、(S)-テトラヒドロフラン-3-イルオキシ、(R)-テトラヒドロフラン-3-イルオキシ、テトラヒドロピラン-4-イルオキシ又は1-アセチルピペリジン-4-イルオキシである)、又は

それらの誘導体(ここで、-D-グルコピラノシル基の一つ以上のヒドロキシル基は、(C_{1-18} -アルキル)カルボニル、(C_{1-18} -アルキル)オキシカルボニル、フェニルカルボニル及びフェニル-(C_{1-3} -アルキル)カルボニルより選ばれる基でアシル化されている); 又はそれらの互変異性体、立体異性体又はそれらの混合物; 又はそれらの生理的に許容され得る塩。

【請求項 2】

-D-グルコピラノシル基のヒドロキシル基O-6の水素原子が、(C_{1-8} -アルキル)カルボニル、(C_{1-8} -アルキル)オキシカルボニル及びフェニルカルボニルより選ばれる基で置換されることを特徴とする、請求項1に記載のグルコピラノシル置換ベンゾニトリル誘導体、又はその生理的に許容され得る塩。

【請求項 3】

無機酸又は有機酸による請求項1又は2に記載の化合物の生理的に許容される塩。

【請求項 4】

請求項1又は2に記載の化合物又は請求項3に記載の生理的に許容される塩を含み、一つ以上の不活性担体及び/又は希釈剤を共に含んでもよい、医薬組成物。

【請求項 5】

ナトリウム依存性グルコース共輸送体SGLTを阻害することによって影響され得る疾患又は症状の治療又は予防に適する医薬組成物を調製するための請求項1又は2に記載の少なくとも一つの化合物又は請求項3に記載の生理的に許容される塩の使用。

【請求項 6】

一つ以上の代謝異常の治療又は予防に適する医薬組成物を調製するための請求項1又は2に記載の少なくとも一つの化合物又は請求項3に記載の生理的に許容される塩の使用。

【請求項 7】

代謝異常が、1型及び2型糖尿病、糖尿病の合併症、代謝性アシドーシス又は代謝性ケトosis、反応性血糖低下、高インスリン血症、糖代謝異常、インスリン抵抗性、代謝性症候群、異なる原因の脂質異常症、アテローム性動脈硬化症及び関連疾患、肥満、高血圧、慢性心不全、浮腫及び脂質異常症からなる群より選ばれることを特徴とする、請求項6に記載の使用。

【請求項 8】

ナトリウム依存性グルコース共輸送体SGLT2を阻害する医薬組成物を調製するための請求項1又は2に記載の少なくとも一つの化合物又は請求項3に記載の生理的に許容される塩の使用。

【請求項 9】

膵臓ベータ細胞の変性の予防用及び/又は膵臓ベータ細胞の機能性の改善及び/又は回復の医薬組成物を調製するための請求項1又は2に記載の少なくとも一つの化合物又は請求項3に記載の生理的に許容される塩の使用。

【請求項 10】

肝臓脂肪の異常な蓄積に起因する疾患又は症状の、それらを必要としている患者における予防、緩徐、遅延又は治療用の医薬組成物を調製するための請求項1又は2に記載の少なくとも一つの化合物又は請求項3に記載の生理的に許容される塩の使用。

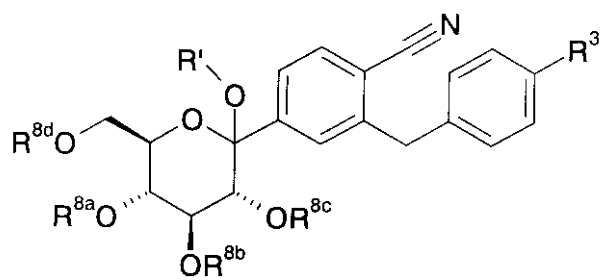
【請求項 11】

利尿剤及び/又は抗高血圧剤を調製するための請求項1又は2に記載の少なくとも一つの化合物又は請求項3に記載の生理的に許容される塩の使用。

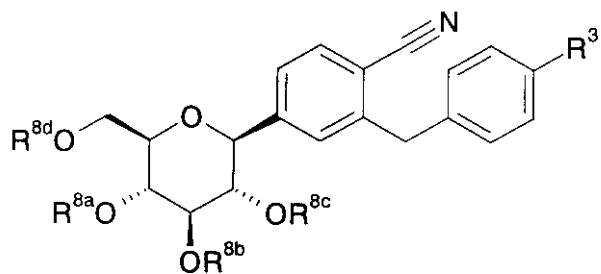
【請求項 12】

下記式II、III、i.1、i.2、i.3、i.4、i.5又はi.6のグルコピラノシル置換ベンゾニトリル誘導体、又はそれらの互変異性体、立体異性体又はそれらの混合物；又はそれらの生理的に許容される塩。

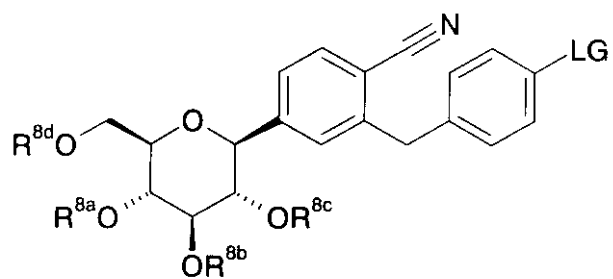
【化 2】



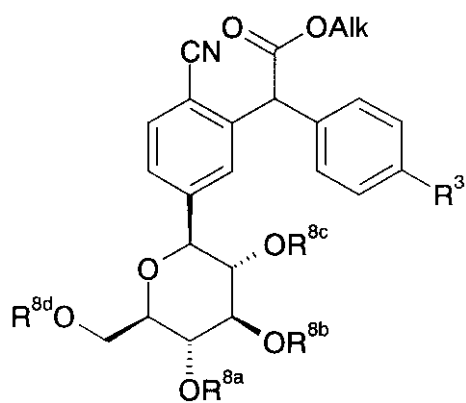
II



III

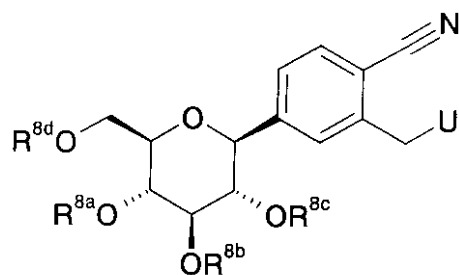


i.1

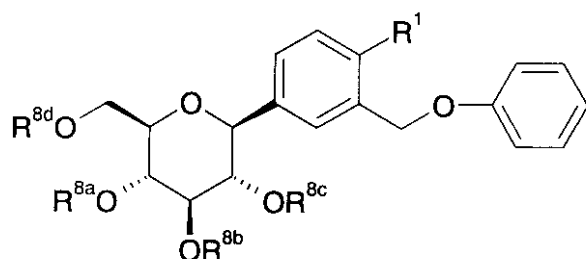


i.2

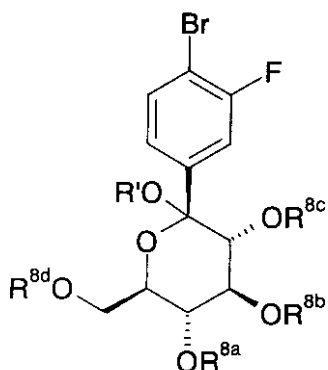
【化 3】



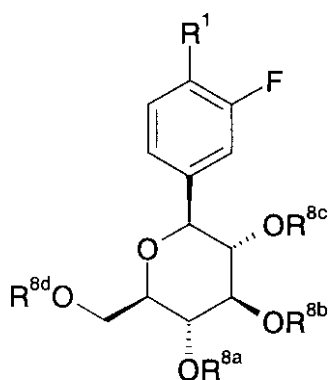
i.3



i.4



i.5



i.6

(式中、 R^3 は、請求項1のように定義され、

R^1 は、H、 C_{1-4} -アルキル、(C_{1-18} -アルキル)カルボニル、(C_{1-18} -アルキル)オキシカルボニル、アリールカルボニル又はアリール(C_{1-3} -アルキル)カルボニルであり、ここで、アルキル基又はアリール基は、ハロゲンによってモノ置換又は多置換されていてもよく；

R^{8a} 、 R^{8b} 、 R^{8c} 、 R^{8d} は、互いに独立して、水素又はアリル基、ベンジル基、(C_{1-4} -アルキル)カルボニル基、(C_{1-4} -アルキル)オキシカルボニル基、アリールカルボニル基、アリール(C_{1-3} -アルキル)カルボニル基又はアリール(C_{1-3} -アルキル)オキシカルボニル基又は $R^a R^b R^c Si$ 基又はケタール基又はアセタール基、特にアルキリデン基又はアリールアルキリデンケタール基又はアセタール基であり、それぞれの場合において、二つの隣接基 R^{8a} 、 R^{8b} 、 R^{8c} 、 R^{8d} は、環状ケタール基又は環状アセタール基又は1,2-ジ(C_{1-3} アルコキシ)-1,2-

ジ(C₁₋₃-アルキル)エチレン架橋を形成していてもよく、上述のエチレン架橋は、二つの酸素原子とピラノース環の二つの会合した炭素原子と共に、置換ジオキサン環、特に2,3-ジメチル-2,3-ジ(C₁₋₃アルコキシ)-1,4-ジオキサン環を形成し、アルキル基、アリル基、アリール基及び/又はベンジル基は、ハロゲン又はC₁₋₃-アルコキシによってモノ置換又は多置換されていてもよく、ベンジル基もまた、ジ(C₁₋₃-アルキル)アミノ基によって置換されていてもよく；

R^a、R^b、R^cは、互いに独立して、C₁₋₄-アルキル、アリール又はアリール-C₁₋₃-アルキルであり、ここで、アリール基又はアルキル基は、ハロゲンによってモノ置換又は多置換されていてもよく；

上記の基の定義において述べられるアリール基は、フェニル基又はナフチル基、好ましくはフェニル基を意味し；

Alkは、C₁₋₄-アルキルであり；

R¹は、塩素、臭素、シアノ、カルボキシ、カルボン酸エステル、カルボキシアミド又はそれらの誘導体、ホウ素基又はシリル基、保護された又はマスクされたアルデヒド基、又は保護された又はマスクされたアミノ基であり、好ましくはR¹はBr又はCNであり；

LGは、脱離基、例えば、Br、I又は-O-(SO₂)-CF₃であり；

Uは、Cl、Br、I、-O-CO-C₁₋₄-アルキル、-O-C(=O)-O-C₁₋₄-アルキル又は-OP(O)(O-C₁₋₄-アルキル)₂である)。