

【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12月4日 (2014.12.4)

【公表番号】特表2014-500243(P2014-500243A)

【公表日】平成26年1月9日 (2014.1.9)

【年通号数】公開・登録公報2014-001

【出願番号】特願2013-535018(P2013-535018)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4365 (2006.01)

C 0 7 D 491/052 (2006.01)

A 6 1 K 31/4355 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

C 0 7 D 471/10 (2006.01)

C 0 7 D 319/18 (2006.01)

A 6 1 K 31/357 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

G 0 1 N 33/92 (2006.01)

G 0 1 N 33/68 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z

C 0 7 D 495/04 1 0 5 A

A 6 1 K 31/4365
C 0 7 D 491/052 C S P
A 6 1 K 31/4355
A 6 1 K 31/437
C 0 7 D 401/14
A 6 1 K 31/5377
A 6 1 K 31/506
C 0 7 D 471/10 1 0 2
C 0 7 D 319/18
A 6 1 K 31/357
A 6 1 K 9/20
A 6 1 K 9/48
A 6 1 P 3/06
A 6 1 P 43/00 1 0 5
A 6 1 P 3/00
A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 27/02
A 6 1 P 13/12
A 6 1 P 31/04
A 6 1 P 9/00
A 6 1 P 9/12
A 6 1 P 9/06
A 6 1 P 9/04
A 6 1 P 15/10
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 7/02
A 6 1 P 25/16
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 1/18
A 6 1 P 1/16
G 0 1 N 33/92 A
G 0 1 N 33/68

【手続補正書】

【提出日】平成26年10月17日(2014.10.17)

【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

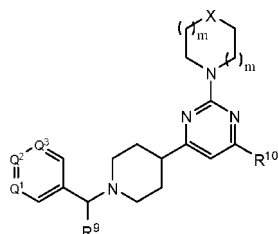
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I I)

【化 1】



の化合物又は薬学上許容可能なその塩

〔式中：

R^9 はそれぞれ独立して - H、- ヒドロカルビル、- アリール、- アラルキル、- ヘテロアリール、- ヘテロシクリル、- $C(O)O$ (アルキル)、- $OC(O)$ (アルキル)、- $C(O)NH_2$ 、- $C(O)NH$ (アルキル)、- $C(O)N$ (アルキル) (アルキル)、- $NHC(O)$ (アルキル)、 N (アルキル) $C(O)$ (アルキル) 又は - SO_2NH_2 であり、

R^{10} はそれぞれ独立して - H、- OH、- NH_2 、- NH (アルキル)、- N (アルキル) (アルキル)、ヒドロカルビル、- O - アルキル、- O - アルケニル、アリール、- O - アリール、アラルキル、- O - アラルキル、ヘテロアリール、- O - ヘテロアリール、ヘテロシクリル、- O - ヘテロシクリル、ハロ、- OCF_3 、- $C(O)O$ (アルキル)、- $OC(O)$ (アルキル)、- $C(O)NH_2$ 、- $C(O)NH$ (アルキル)、- $C(O)N$ (アルキル) (アルキル)、 $NHC(O)$ ($C_2 - C_{10}$ - アルキル)、 N (アルキル) $C(O)$ (アルキル)、- $OC(O)O$ (アルキル)、- $OC(O)NH_2$ 、- $OC(O)NH$ (アルキル)、- $OC(O)N$ (アルキル) (アルキル)、- $CHNH$ 、- CHN (アルキル) 又は - SO_2NH_2 であり、

Q^1 、 Q^2 及び Q^3 はそれぞれ独立して CR^{10} 又は N であり、

X は、 CHR^{10} 、 S 、 O 、又は NR^9 であり、

m はそれぞれ独立して 0 ~ 3 の整数である〕。

【請求項 2】

R^9 が H であり、 R^{10} が OH である請求項 1 に記載の化合物又は薬学上許容可能な塩。

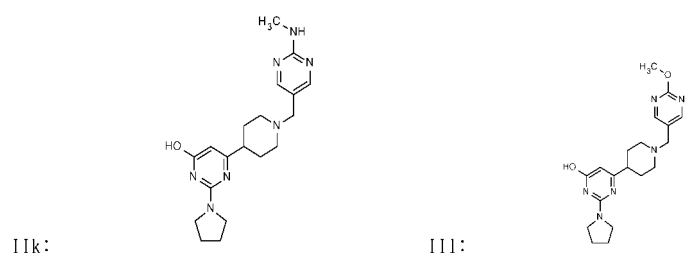
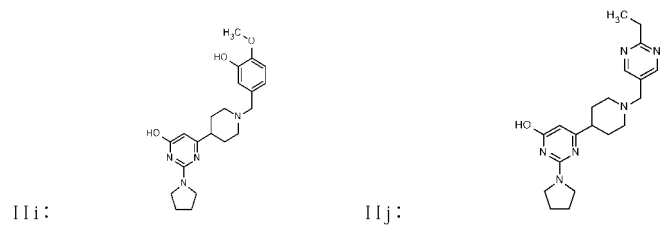
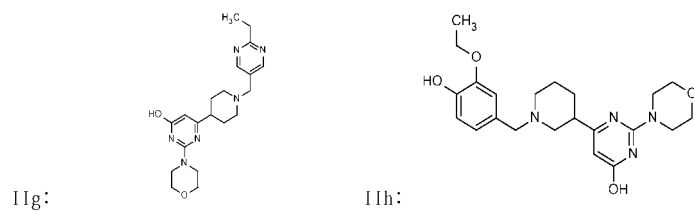
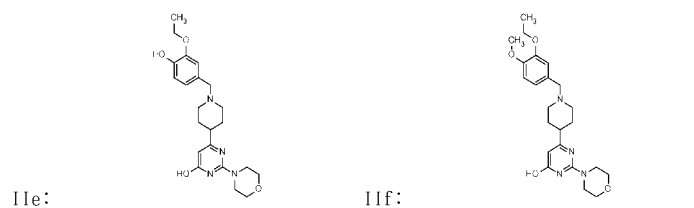
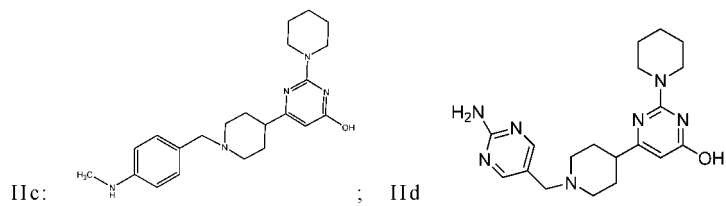
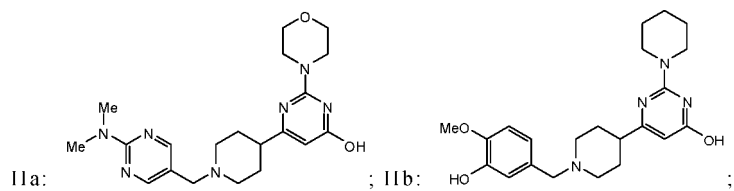
【請求項 3】

各 m が 1 である請求項 2 に記載の化合物又は薬学上許容可能な塩。

【請求項 4】

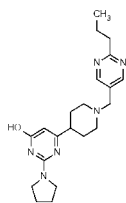
前記化合物が、

【化 2】

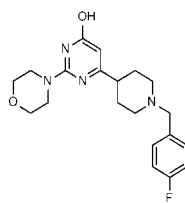


【化 3】

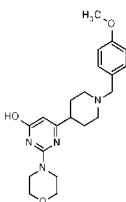
IIm:



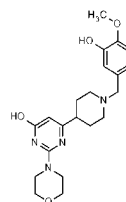
IIn:



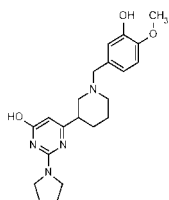
IIo:



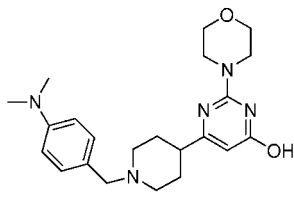
IIp:



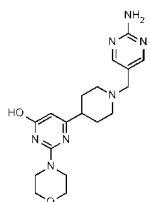
IIq:



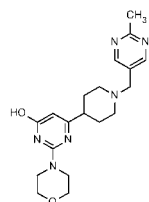
IIr:



IIs:

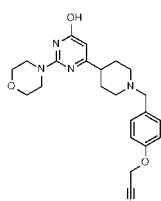


; II t:

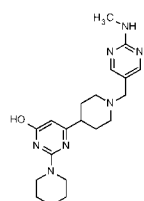


;

IIu:

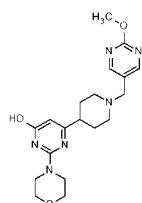


; II v:

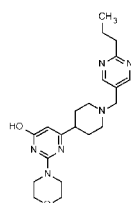


;

IIw:

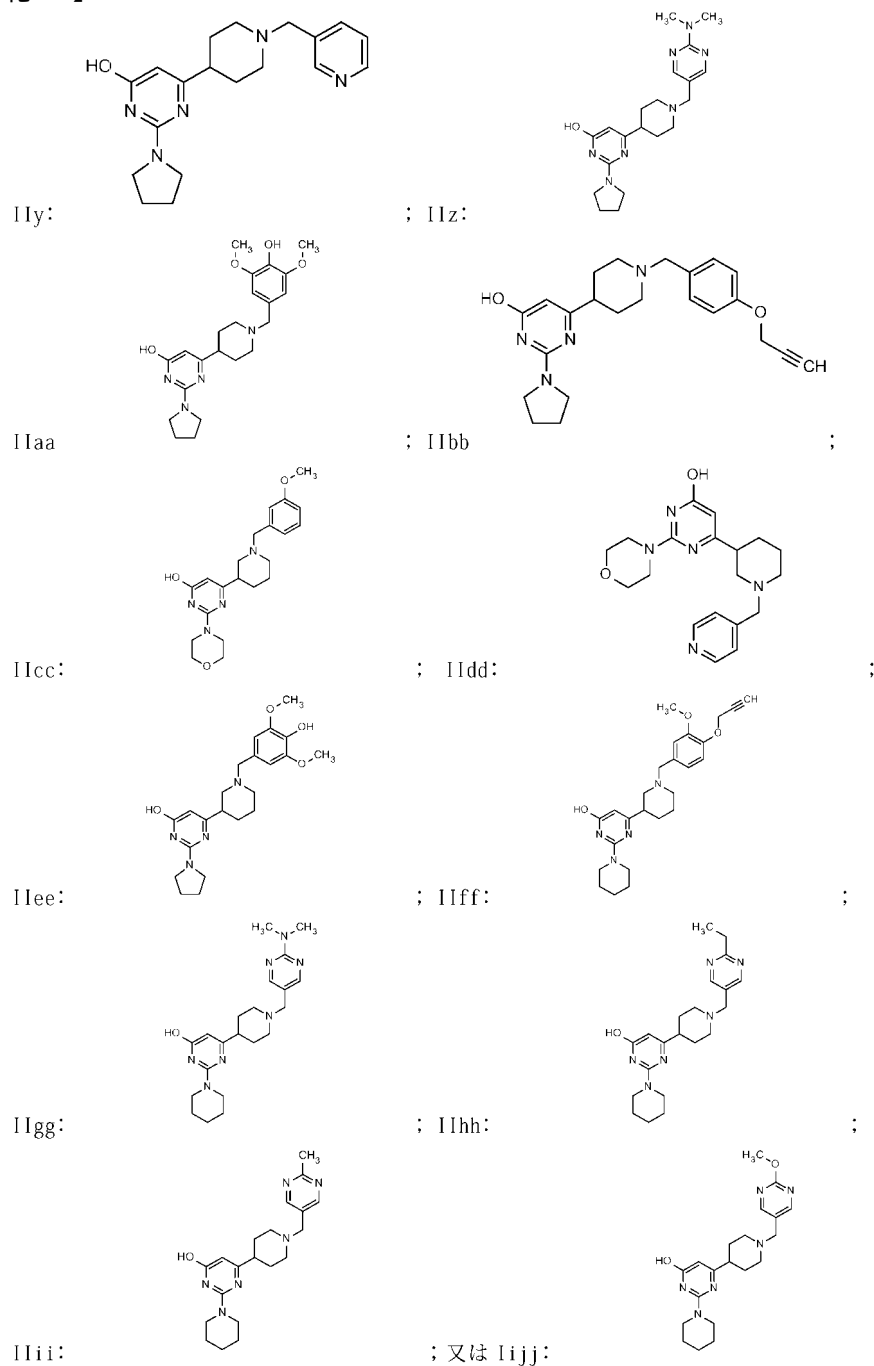


; II x:



;

【化 4】



或いは前述のいずれかの薬学上許容可能な塩である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

有効量の請求項 1 に記載の化合物又は該化合物の薬学上許容可能な塩と、薬学上許容可能なビヒクル又はキャリアとを含む組成物。

【請求項 6】

前記組成物が経口投与用に製剤化される請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 7】

前記組成物が錠剤又はカプセルの形状である請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 8】

前記化合物又はその塩が約 1 mg ~ 約 1,000 mg の量で存在する請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 9】

リポタンパク質代謝の障害を治療するための医薬組成物であって、有効量の請求項1に記載の化合物又は該化合物の薬学上許容可能な塩を含む医薬組成物。

【請求項10】

前記リポタンパク質代謝の障害が、脂質異常症、異常リポタンパク質血症、リポタンパク質の過剰産生又は欠乏、総コレステロールの上昇、低密度リポタンパク質濃度の上昇、トリグリセリド濃度の上昇、胆汁における脂質排出、代謝性疾患、胆汁におけるリン脂質排出、胆汁におけるオキシステロールの排出、又はペルオキシソーム増殖因子活性化受容体に関連する疾患である請求項9に記載の医薬組成物。

【請求項11】

グルコース代謝の障害を治療するための医薬組成物であって、有効量の請求項1に記載の化合物又は該化合物の薬学上許容可能な塩を含む医薬組成物。

【請求項12】

前記グルコース代謝の障害が、インスリン耐性、損傷された耐糖能、損傷された空腹時血中グルコースレベル、糖尿病、リポジストロフィ、中枢性肥満、末梢性皮下脂肪萎縮症、糖尿病性神経症、糖尿病性網膜症、腎疾患、又は敗血症である請求項11に記載の医薬組成物。

【請求項13】

循環器疾患を治療するための医薬組成物であって、有効量の請求項1に記載の化合物又は該化合物の薬学上許容可能な塩を含む医薬組成物。

【請求項14】

前記循環器疾患又は関連する血管性疾患が、高血圧症、冠状動脈疾患、心筋梗塞、不整脈、心房細動、心臓弁疾患、心不全、心筋症、又は心膜炎である請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項15】

循環器疾患の少なくとも1つの症状の緩和を提供する請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項16】

前記症状がインポテンスである請求項15に記載の医薬組成物。

【請求項17】

炎症を治療するための医薬組成物であって、有効量の請求項1に記載の化合物又は該化合物の薬学上許容可能な塩を含む医薬組成物。

【請求項18】

虚血性壊死を治療するための医薬組成物であって、有効量の請求項1に記載の化合物又は該化合物の薬学上許容可能な塩を含む医薬組成物。

【請求項19】

結腸癌、肺癌、乳癌又は皮膚癌を治療するための医薬組成物であって、有効量の請求項1に記載の化合物又は該化合物の薬学上許容可能な塩を含む医薬組成物。

【請求項20】

血栓症を治療するための医薬組成物であって、有効量の請求項1に記載の化合物又は該化合物の薬学上許容可能な塩を含む医薬組成物。

【請求項21】

アルツハイマー病を治療するための医薬組成物であって、有効量の請求項1に記載の化合物又は該化合物の薬学上許容可能な塩を含む医薬組成物。

【請求項22】

パーキンソン病を治療するための医薬組成物であって、有効量の請求項1に記載の化合物又は該化合物の薬学上許容可能な塩を含む医薬組成物。

【請求項23】

膵炎を治療するための医薬組成物であって、有効量の請求項1に記載の化合物又は該化合物の薬学上許容可能な塩を含む医薬組成物。

【請求項24】

膵クレアティタスを治療するための医薬組成物であって、有効量の請求項1に記載の

化合物又は該化合物の薬学上許容可能な塩を含む医薬組成物。

【請求項 2 5】

異常な胆汁産生を治療するための医薬組成物であって、有効量の請求項 1 に記載の化合物又は該化合物の薬学上許容可能な塩を含む医薬組成物。

【請求項 2 6】

対象において循環器疾患の治療の進行を監視する方法であって、

(a) 前記対象の血液において高密度リポタンパク質における遊離コレステロールのレベルを測定する工程と；

(b) 前記対象に請求項 1 に記載の化合物を投与する工程と、

(c) 前記化合物の投与後、所定期間、前記対象の血液における遊離コレステロールのレベルを監視する工程と、

(d) 前記工程 (a) 及び (c) の結果の比較に基づいて前記対象における改善のレベルを評価する工程とを含む方法。

【請求項 2 7】

前記循環器疾患が、動脈から肝臓へのコレステロールの逆輸送又は胆汁酸におけるコレステロールの排出である請求項 2 6 に記載の方法。

【請求項 2 8】

対象における P 2 Y 1 3 活性のレベルを測定する方法であって、

(a) 前記対象の血液において高密度リポタンパク質における遊離コレステロールのレベルを測定する工程と、

(b) 前記対象に請求項 1 に記載の化合物を投与する工程と、

(c) 前記化合物の投与後、所定期間、前記対象の血液における遊離コレステロールのレベルを監視する工程と、

(d) 前記工程 (a) 及び (c) の結果の比較に基づいて前記対象における P 2 Y 1 3 活性のレベルを評価する工程とを含む方法。