

【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18年9月7日(2006.9.7)

【公表番号】特表2002-526530(P2002-526530A)

【公表日】平成14年8月20日(2002.8.20)

【出願番号】特願2000-574510(P2000-574510)

【国際特許分類】

C 07 D 213/74 (2006.01)
A 61 K 31/444 (2006.01)
A 61 K 31/506 (2006.01)
A 61 K 31/513 (2006.01)
A 61 P 3/06 (2006.01)
A 61 P 9/10 (2006.01)
C 07 D 401/14 (2006.01)
C 07 D 405/14 (2006.01)
C 07 D 409/12 (2006.01)
C 07 D 409/14 (2006.01)
C 07 D 417/14 (2006.01)

【F I】

C 07 D 213/74
A 61 K 31/444
A 61 K 31/506
A 61 K 31/513
A 61 P 3/06
A 61 P 9/10 101
C 07 D 401/14
C 07 D 405/14
C 07 D 409/12
C 07 D 409/14
C 07 D 417/14

【手続補正書】

【提出日】平成18年7月20日(2006.7.20)

【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

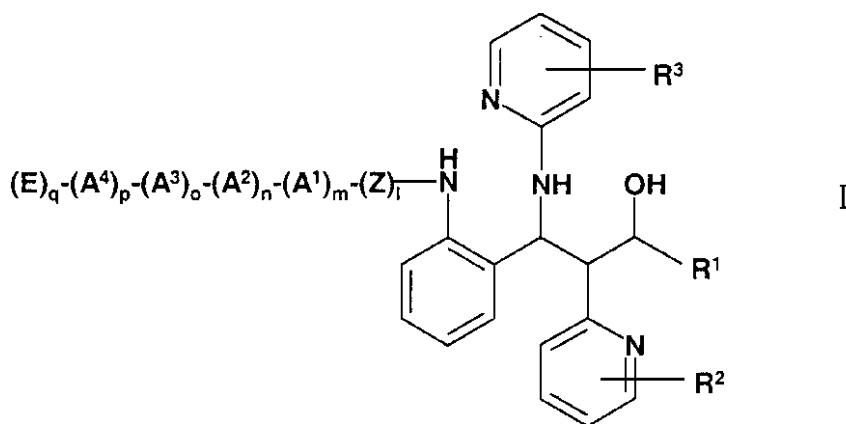
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記式I:

【化1】



[式中、

Z は、 - NH - ($C_1 - C_{16}$ - アルキル) - ($C = O$) - ;
 - ($C = O$) - ($C_1 - C_{16}$ - アルキル) - ($C = O$) - ;
 - ($C = O$) - フェニル - ($C = O$) - ;

であり；

A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 は相互に独立してアミノ酸基、アミノ酸保護基によりモノまたはボリ置換されたアミノ酸基であり；

E は - $S O_2$ - R^4 、 - $C O$ - R^4 であり；

R^1 はフェニル、チアゾリル、オキサゾリル、チエニル、チオフェニル、フラニル、ピリジル、ピリミジルであり、ここで環は F、Cl、Br、OH、CF₃、NO₂、CN、OCF₃、- ($C_1 - C_6$) - アルキル、O - ($C_1 - C_6$) - アルキル、S - ($C_1 - C_6$) - アルキル、SO - ($C_1 - C_6$) - アルキル、SO₂ - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、COOH、COO($C_1 - C_6$) - アルキル、COO($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、CONH₂、CONH($C_1 - C_6$) - アルキル、CON[($C_1 - C_6$) - アルキル]₂、CONH($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、NH₂、NH - CO - ($C_1 - C_6$) - アルキル、NH - CO - フェニルで 3 回まで置換することができ；

R^2 は H、OH、CH₂OH、OME であり；

R^3 は H、F、メチル、OME であり；

R^4 は - ($C_1 - C_{16}$) - アルキル、- ($C_0 - C_{16}$ - アルキレン) - R^5 、- ($C = O$) - ($C_0 - C_{16}$ - アルキレン) - R^5 、- ($C = O$) - ($C_0 - C_{16}$ - アルキレン) - NH - R^5 、- ($C_1 - C_8$ - アルケニレン) - R^5 、- ($C_1 - C_8$ - アルキニル)、- ($C_1 - C_4$ - アルキレン) - S(O)₀₋₂ - R^5 、- ($C_1 - C_4$ - アルキレン) - O - R^5 、- ($C_1 - C_4$ - アルキレン) - NH - R^5 であり；

R^5 は - COO - R^6 、- ($C = O$) - R^6 、- ($C_1 - C_6$ - アルキレン) - R^7 、- ($C_1 - C_6$ - アルケニレン) - R^7 、- ($C_1 - C_7$) - シクロアルキル、フェニル、ナフチル、チエニル、チオフェニル、フラニル、ピリジル、ピリミジル、ジヒドロピリミジン - 2,4 - ジオン - 6 - イル、クロマニル、フタルイミドイル、チアゾリルであり、ここで環は F、Cl、Br、OH、CF₃、NO₂、CN、OCF₃、- ($C_1 - C_6$) - アルキル、O - ($C_1 - C_6$) - アルキル、S - ($C_1 - C_6$) - アルキル、SO - ($C_1 - C_6$) - アルキル、SO₂ - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、COOH、COO($C_1 - C_6$) - アルキル、COO($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、CONH₂、CONH($C_1 - C_6$) - アルキル、CON[($C_1 - C_6$) - アルキル]₂、CONH($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、NH₂、NH - CO - ($C_1 - C_6$) - アルキル、NH - CO - フェニル、ピリジルで 3 回まで置換することができ；

R^6 は H、- ($C_1 - C_6$) - アルキルであり；

R^7 は H、- ($C_1 - C_7$) - シクロアルキル、フェニル、ナフチル、チエニル、チオフェニル、フラニル、ピリジル、ピリミジル、ジヒドロピリミジン - 2,4 - ジオン - 6 -

イル、クロマニル、フタルイミドイル、チアゾリルであり、ここで環はF、C1、Br、OH、CF₃、NO₂、CN、OCF₃、-(C₁-C₆)-アルキル、O-(C₁-C₆)-アルキル、S-(C₁-C₆)-アルキル、SO-(C₁-C₆)-アルキル、SO₂-(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルキル、(C₃-C₆)-シクロアルキル、COOH、COO(C₁-C₆)-アルキル、COO(C₃-C₆)-シクロアルキル、CONH₂、CONH(C₁-C₆)-アルキル、CON[(C₁-C₆)-アルキル]₂、CONH(C₃-C₆)-シクロアルキル、NH₂、NH-CO-(C₁-C₆)-アルキル、NH-CO-フェニルで3回まで置換されることが可能；

l、q、m、n、o、pは相互に独立して0または1であり、ここでl+q+m+n+o+pは1以上である]

の化合物および医薬上許容性のあるその塩および生理的に作用性のあるその誘導体。

【請求項2】 Zが、-NH-(C₁-C₁₆-アルキル)-(C=O)-；
-(C=O)-(C₁-C₁₆-アルキル)-(C=O)-；
-(C=O)-フェニル-(C=O)-；

であり；

A¹、A²、A³、A⁴は相互に独立してアミノ酸基、アミノ酸保護基によりモノまたはボリ置換されたアミノ酸基であり；

Eは-SO₂-R⁴、-CO-R⁴であり；

R¹はフェニル、チアゾリル、オキサゾリル、チエニル、チオフェニル、フラニル、ピリジル、ピリミジルであり、ここで環はF、C1、Br、OH、CF₃、NO₂、CN、OCF₃、-(C₁-C₆)-アルキル、O-(C₁-C₆)-アルキル、S-(C₁-C₆)-アルキル、SO-(C₁-C₆)-アルキル、SO₂-(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルキル、(C₃-C₆)-シクロアルキル、COOH、COO(C₁-C₆)-アルキル、COO(C₃-C₆)-シクロアルキル、CONH₂、CONH(C₁-C₆)-アルキル、CON[(C₁-C₆)-アルキル]₂、CONH(C₃-C₆)-シクロアルキル、NH₂、NH-CO-(C₁-C₆)-アルキル、NH-CO-フェニルで3回まで置換されることが可能；

R²はH、OH、CH₂OH、OMeであり；

R³はH、F、メチル、OMeであり；

R⁴は-(C₁-C₁₆)-アルキル、-(C₀-C₁₆-アルキレン)-R⁵、-(C=O)-(C₀-C₁₆-アルキレン)-R⁵、-(C=O)-(C₀-C₁₆-アルキレン)-NH-R⁵、-(C₁-C₈-アルケニレン)-R⁵、-(C₁-C₈-アルキニル)、-(C₁-C₄-アルキレン)-S(O)₀₋₂-R⁵、-(C₁-C₄-アルキレン)-O-R⁵、-(C₁-C₄-アルキレン)-NH-R⁵であり；

R⁵は-COO-R⁶、-(C=O)-R⁶、-(C₁-C₆-アルキレン)-R⁷、-(C₁-C₆-アルケニレン)-R⁷、-(C₁-C₇)-シクロアルキル、フェニル、ナフチル、チエニル、チオフェニル、フラニル、ピリジル、ピリミジル、ジヒドロピリミジン-2,4-ジオン-6-イル、クロマニル、フタルイミドイル、チアゾリルであり、ここで環はF、C1、Br、OH、CF₃、NO₂、CN、OCF₃、-(C₁-C₆)-アルキル、O-(C₁-C₆)-アルキル、S-(C₁-C₆)-アルキル、SO-(C₁-C₆)-アルキル、SO₂-(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルキル、(C₃-C₆)-シクロアルキル、COOH、COO(C₁-C₆)-アルキル、COO(C₃-C₆)-シクロアルキル、CONH₂、CONH(C₁-C₆)-アルキル、CON[(C₁-C₆)-アルキル]₂、CONH(C₃-C₆)-シクロアルキル、NH₂、NH-CO-(C₁-C₆)-アルキル、NH-CO-フェニル、ピリジルで3回まで置換されることが可能；

R⁶はH、-(C₁-C₆)-アルキルであり；

R⁷はH、-(C₁-C₇)-シクロアルキル、フェニル、ナフチル、チエニル、チオフェニル、フラニル、ピリジル、ピリミジル、ジヒドロピリミジン-2,4-ジオン-6-イル、クロマニル、フタルイミドイル、チアゾリルであり、ここで環はF、C1、Br、OH、CF₃、NO₂、CN、OCF₃、-(C₁-C₆)-アルキル、O-(C₁-C₆)-

アルキル、S - (C₁ - C₆) - アルキル、SO - (C₁ - C₆) - アルキル、SO₂ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、COO H、COO(C₁ - C₆) - アルキル、COO(C₃ - C₆) - シクロアルキル、CONH₂、CONH(C₁ - C₆) - アルキル、CON[(C₁ - C₆) - アルキル]₂、CONH(C₃ - C₆) - シクロアルキル、NH₂、NH - CO - (C₁ - C₆) - アルキル、NH - CO - フェニルで3回まで置換されることができ；

lは0または1であり；

m、nは0であり；

oは1であり；

pは0または1であり；

qは0または1である；

請求項1記載の式Iの化合物および医薬上許容性のあるその塩および生理的に作用性のあるその誘導体。

【請求項3】 Zが、-NH - (C₁ - C₁₂ - アルキル) - (C = O) - ;
- (C = O) - (C₁ - C₁₂ - アルキル) - (C = O) - ;
- (C = O) - フェニル - (C = O) - ；

であり；

A¹、A²、A³、A⁴は相互に独立してアミノ酸基、アミノ酸保護基によりモノまたはボリ置換されたアミノ酸基であり；

Eは-SO₂ - R⁴、-CO - R⁴であり；

R¹はフェニル、チアゾリル、オキサゾリルであり、ここで環は-(C₁ - C₆) - アルキルで3回まで置換されることができ；

R²はH、OH、CH₂OH、OMeであり；

R³はH、F、メチル、OMeであり；

R⁴は-(C₁ - C₁₆) - アルキル、-(C₀ - C₁₆ - アルキレン) - R⁵、-(C = O) - (C₀ - C₁₆ - アルキレン) - R⁵、-(C = O) - (C₀ - C₁₆ - アルキレン) - NH - R⁵、-(C₁ - C₈ - アルケニレン) - R⁵、-(C₁ - C₈ - アルキニル)、-(C₁ - C₄ - アルキレン) - SO(O)₀₋₂ - R⁵、-(C₁ - C₄ - アルキレン) - O - R⁵、-(C₁ - C₄ - アルキレン) - NH - R⁵であり；

R⁵は-COO - R⁶、-(C = O) - R⁶、-(C₁ - C₇) - シクロアルキル、フェニル、ナフチル、チエニル、チオフェニル、フラニル、ピリジル、ピリミジル、ジヒドロピリミジン-2,4-ジオン-6-イル、クロマニル、フタルイミドイル、チアゾリルであり、ここで環はF、Cl、Br、OH、CF₃、NO₂、CN、OCF₃、-(C₁ - C₆) - アルキル、O - (C₁ - C₆) - アルキル、COOH、COO(C₁ - C₆) - アルキル、CONH₂、CONH(C₁ - C₆) - アルキル、CON[(C₁ - C₆) - アルキル]₂、CONH(C₃ - C₆) - シクロアルキル、NH₂、NH - CO - (C₁ - C₆) - アルキル、NH - CO - フェニル、ピリジルで2回まで置換されることができ；

R⁶はH、-(C₁ - C₆) - アルキルであり；

l、m、nは0であり；

oは1であり；

pは0または1であり；

qは0または1である；

請求項1または2記載の式Iの化合物および医薬上許容性のあるその塩。

【請求項4】 請求項1～3のいずれかに記載の化合物1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を含有する、高脂血症の治療のための医薬。