

【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8月2日(2007.8.2)

【公表番号】特表2007-500158(P2007-500158A)

【公表日】平成19年1月11日(2007.1.11)

【年通号数】公開・登録公報2007-001

【出願番号】特願2006-521514(P2006-521514)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/18 (2006.01)

A 6 1 K 31/138 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00 Z N A

A 6 1 P 1/04

A 6 1 K 31/18

A 6 1 K 31/138

【手続補正書】

【提出日】平成19年6月13日(2007.6.13)

【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】

治療上有効量のLXRアゴニスト、またはその医薬上許容される塩、溶媒和物もしくは生理学上機能的な誘導体を含んでなる、IBDの治療または予防用医薬組成物。

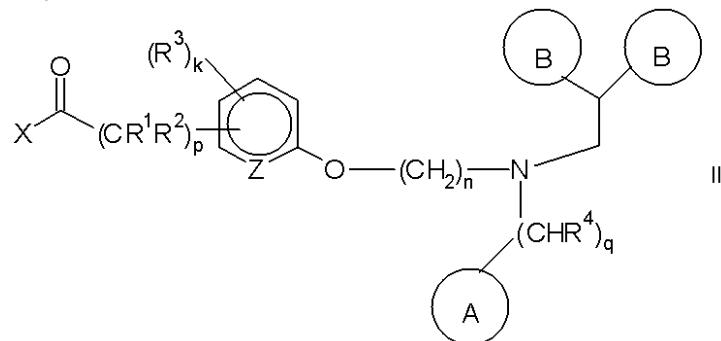
【請求項2】

IBDがクロール病、潰瘍性大腸炎、および細菌、虚血、放射、薬物または化学物質によって引き起こされる炎症性大腸炎からなる群から選択される請求項1記載の医薬組成物。

【請求項3】

LXRアゴニストが式(I)：

【化1】



【式中、

Xは、OHまたはNH₂であり；

pは、0-6であり；

R¹およびR²が各々、同一または異なって、それぞれ独立して、H、C₁-C₈アルキル

、 C_{1-8} アルコキシおよび C_{1-8} チオアルキルからなる群から選択され；

Z は、 CH または N であり；

Z が CH である場合、 k は $0-4$ であり；

Z が N である場合、 k は $0-3$ であり；

各 R^3 は、 同一または異なって、 ハロ、 $-OH$ 、 C_{1-8} アルキル、 C_{2-8} アルケニル、 C_{1-8} アルコキシ、 C_{2-8} アルケニルオキシ、 $-S(O)_aR^6$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-COR^6$ 、 $COOR^6$ 、 $R^{10}COOR^6$ 、 $OR^{10}COOR^6$ 、 $CONR^7R^8$ 、 $-OC(O)R^9$ 、 $-R^{10}NR^7R^8$ 、 $-OR^{10}NR^7R^8$ 、 5-6員の複素環、 ニトロおよびシアノからなる群から独立して選択され；

a は、 0 、 1 または 2 であり；

R^6 は、 H 、 C_{1-8} アルキル、 C_{1-8} アルコキシおよび C_{2-8} アルケニルからなる群から選択され；

R^7 および R^8 は各々、 同一または異なって、 それぞれ独立して、 H 、 C_{1-8} アルキル、 C_{2-8} アルケニル、 C_{3-8} アルキニルからなる群から選択され；

R^9 は、 H 、 C_{1-8} アルキルおよび $-NR^7R^8$ からなる群から選択され；

R^{10} は、 C_{1-8} アルキルであり；

n は、 $2-8$ であり；

q は、 0 または 1 であり；

R^4 は、 H 、 C_{1-8} アルキル、 C_{1-8} アルケニルおよびアルケニルオキシからなる群から選択され；

環 A は、 C_{3-8} シクロアルキル、 アリール、 4-8員の複素環および5-6員のヘテロアリールからなる群から選択され；

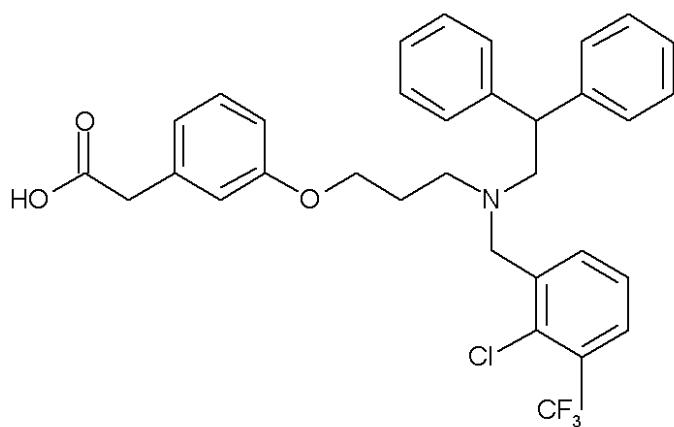
各環 B は、 同一または異なって、 C_{3-8} シクロアルキルおよびアリールからなる群から独立して選択される]

で示される化合物である請求項1または2記載の医薬組成物。

【請求項4】

LXR アゴニストが式(I)Ia)

【化2】



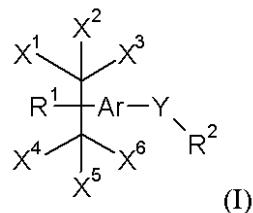
(IIa)

で示される化合物である請求項3記載の医薬組成物。

【請求項5】

LXR アゴニストが式(I)：

【化3】



[式中、

Arは、アリール基を示し；R¹は、-OH、-O-(C₁-C₇)アルキル、-OC(O)- (C₁-C₇)アルキル、-O-(C₁-C₇)ヘテロアルキル、-OC(O)- (C₁-C₇)ヘテロアルキル、-CO₂H、-NH₂、-NH(C₁-C₇)アルキル、-N((C₁-C₇)アルキル)、または-NH-S(O)₂-(C₁-C₅)アルキルであり；

R²は、(C₁-C₇)アルキル、(C₁-C₇)ヘテロアルキル、アリールまたはアリール(C₁-C₇)アルキルであり；

X¹、X²、X³、X⁴、X⁵およびX⁶は、それぞれ独立して、H、(C₁-C₅)アルキル、(C₁-C₅)ヘテロアルキル、FまたはClであり、但し、X¹～X⁶のうちの3個以下がH、(C₁-C₅)アルキルまたは(C₁-C₅)ヘテロアルキルであり；および

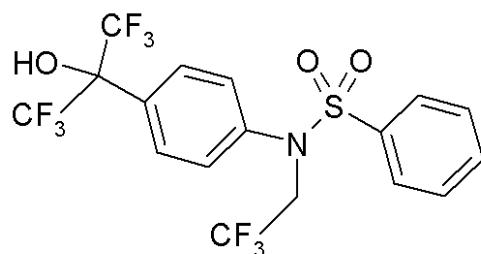
Yは、-N(R¹²)S(O)_m-、-N(R¹²)S(O)_mN(R¹³)-、-N(R¹²)C(O)-、-N(R¹²)C(O)N(R¹³)-、-N(R¹²)C(S)-または-N(R¹²)C(O)O-であり、ここに、R¹²およびR¹³は、それぞれ独立して、水素、(C₁-C₇)アリール、(C₁-C₇)ヘテロアルキル、アリールまたはアリール(C₁-C₇)アルキルであり、Yが-N(R¹²)S(O)_m-または-N(R¹²)S(O)_mN(R¹³)-である場合、R¹²は、ArまたはR²に対する共有結合を介して、各々、ArまたはR²に縮合した5、6または7員環を形成してもよく、上記Y基において、下付のmは、1～2の整数である]

で示される化合物である請求項1または2記載の医薬組成物。

【請求項6】

LXRアゴニストが式(Ia)：

【化4】



Ia

で示される化合物である請求項5記載の医薬組成物。