

【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 L X R 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、I B D の治療または予防用医薬組成物。

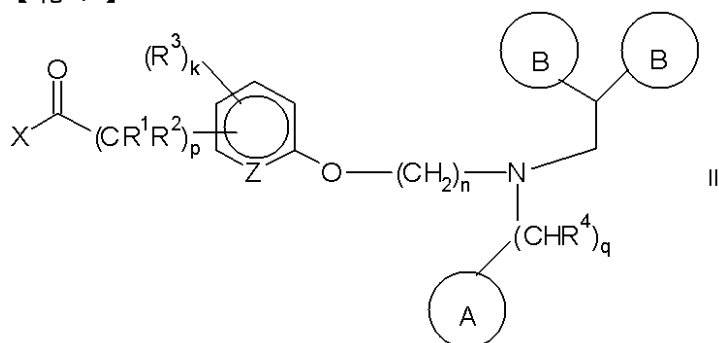
【請求項 2】

I B D がクローン病、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】

L X R アゴニストが式 (I 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 - 8 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、 $-S(O)_a R^6$ 、 $-NR^7 R^8$ 、 $-COR^6$ 、 $COOR^6$ 、 $R^{10} COOR^6$ 、 $OR^{10} COOR^6$ 、 $CONR^7 R^8$ 、 $-OC(O)R^9$ 、 $-R^{10} NR^7 R^8$ 、 $-OR^{10} NR^7 R^8$ 、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 $-NR^7 R^8$ 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；

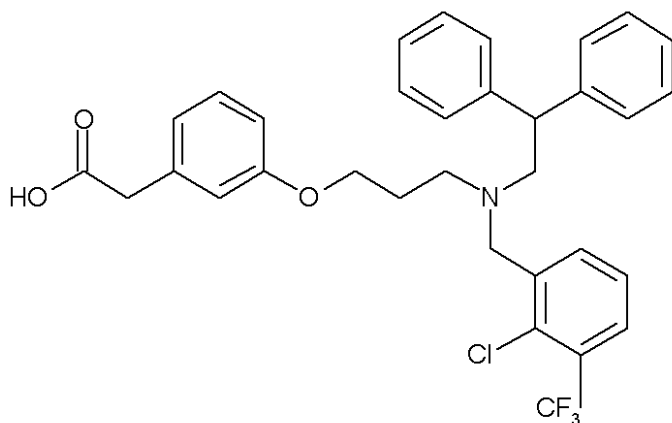
各環 B は、同一または異なって、 C_{3-8} シクロアルキルおよびアリールからなる群から独立して選択される]

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 (IIa)

【化 2】



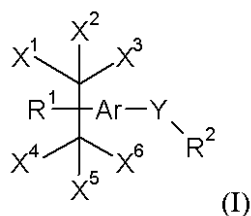
(IIa)

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； R^1 は、 $-OH$ 、 $-O-(C_1-C_7)$ アルキル、 $-OC(O)-(C_1-C_7)$ アルキル、 $-O-(C_1-C_7)$ ヘテロアルキル、 $-OC(O)-(C_1-C_7)$ ヘテロアルキル、 $-CO_2H$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_7)$ アルキル、 $-N((C_1-C_7) \text{ アルキル})_2$ または $-NH-S(O)_2-(C_1-C_5)$ アルキルであり；

R^2 は、 (C_1-C_7) アルキル、 (C_1-C_7) ヘテロアルキル、アリールまたはアリール (C_1-C_7) アルキルであり；

X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 X^5 および X^6 は、それぞれ独立して、 H 、 (C_1-C_5) アルキル、 (C_1-C_5) ヘテロアルキル、 F または Cl であり、但し、 $X^1 \sim X^6$ のうちの 3 個以下が H 、 (C_1-C_5) アルキルまたは (C_1-C_5) ヘテロアルキルであり；

および

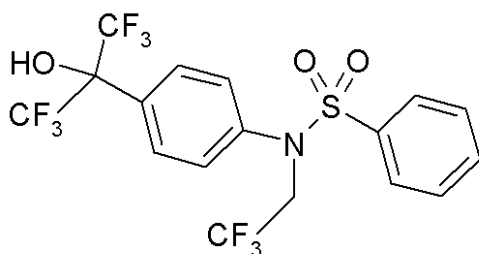
Y は、 $-N(R^{1,2})S(O)_m-$ 、 $-N(R^{1,2})S(O)_mN(R^{1,3})-$ 、 $-N(R^{1,2})C(O)-$ 、 $-N(R^{1,2})C(O)N(R^{1,3})-$ 、 $-N(R^{1,2})C(S)-$ または $-N(R^{1,2})C(O)O-$ であり、ここに、 $R^{1,2}$ および $R^{1,3}$ は、それぞれ独立して、水素、 (C_1-C_7) アリール、 (C_1-C_7) ヘテロアルキル、アリールまたはアリール (C_1-C_7) アルキルであり、Y が $-N(R^{1,2})S(O)_m-$ または $-N(R^{1,2})S(O)_mN(R^{1,3})-$ である場合、 $R^{1,2}$ は、Ar または R^2 に対する共有結合を介して、各々、Ar または R^2 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。