

【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29年12月14日(2017.12.14)

【公表番号】特表2016-535099(P2016-535099A)
 【公表日】平成28年11月10日(2016.11.10)
 【年通号数】公開・登録公報2016-063
 【出願番号】特願2016-551110(P2016-551110)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 31/055 (2006.01)
 A 6 1 K 31/137 (2006.01)
 A 6 1 K 31/496 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4545 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4025 (2006.01)
 A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
 A 6 1 K 31/08 (2006.01)
 A 6 1 K 31/05 (2006.01)
 A 6 1 K 31/66 (2006.01)
 A 6 1 K 45/00 (2006.01)
 A 6 1 P 3/10 (2006.01)
 A 6 1 P 5/50 (2006.01)
 A 6 1 P 13/12 (2006.01)
 A 6 1 P 7/00 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)

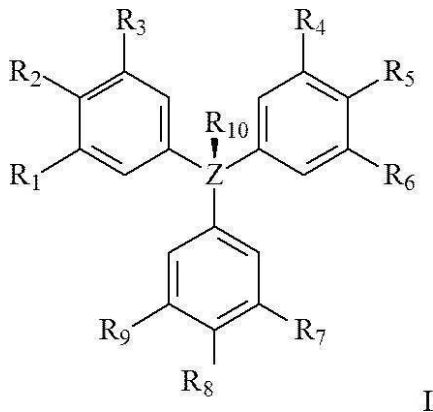
【F I】

A 6 1 K 31/055
 A 6 1 K 31/137
 A 6 1 K 31/496
 A 6 1 K 31/4545
 A 6 1 K 31/4025
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 K 31/08
 A 6 1 K 31/05
 A 6 1 K 31/66
 A 6 1 K 45/00
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 5/50
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 7/00
 A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】
 【提出日】平成29年11月1日(2017.11.1)
 【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 の構造により表される化合物、又はその異性体、その医薬上許容される塩、その医薬品、その水和物、その N - オキシド、その結晶若しくはそれらの任意の組み合わせを含む、それを必要とする対象における糖尿病又は糖尿病関連合併症の治療に用いるための医薬：

【化 1】



[式中、

Z は、炭素、窒素、リン、ヒ素、ケイ素又はゲルマニウムであり；

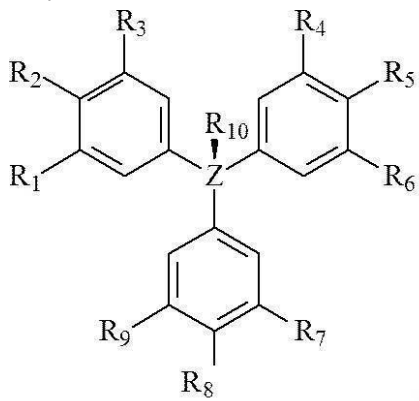
R₁ ないし R₉ は、同一又は異なって、H、D、OH、ハロゲン、ニトロ、CN、ニトリルアミド、アミドスルフィド、アミノ、アルデヒド、置換ケトン、-COOH、エステル、トリフルオロメチル、アミド、置換又は無置換アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、アルキルアリール、アリールスルホニル、アリールアルキレンスルホニル、アルコキシ、アルキルアルコキシ、ハロアルキル、アルキルハロアルキル、ハロアリール、アリールオキシ、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルアミド、アリールアミノ、アリールアミド、アルキルチオ、アリールチオ、ヘテロシクロアルキル、アルキルヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルキルヘテロアリールであるか；或いは R₃、R₄、又は R₇ が、メインの芳香環と共に縮合したシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、芳香環又は芳香族複素環を形成し；

R₁₀ は、存在しないか、H、D、OH、ハロゲン、オキシ、ニトロ、CN、ニトリルアミド、アミドスルフィド、アミノ、アルデヒド、置換ケトン、-COOH、エステル、トリフルオロメチル、アミド、置換又は無置換アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、アルキルアリール、アリールスルホニル、アリールアルキレンスルホニル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアリール、シクロアルキル、アルキルシクロアルキル、アリールオキシ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルアミド、アリールアミノ、アリールアミド、アルキルチオ、アリールチオ、ヘテロシクロアルキル、アルキルヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルキルヘテロアリールである。]。

【請求項 2】

式 I の構造により表される化合物、又はその異性体、その医薬上許容される塩、その医薬品、その水和物、その N - オキシド、その結晶若しくはそれらの任意の組み合わせを含む、それを必要とする対象において、循環ブドウ糖濃度を低下させるか、インスリン抵抗性を減少させるか、インスリン感受性を促進又は増加させるか、膵臓のベータ細胞質量を促進又は増加させるか、又はクレアチンクリアランスを促進又は増加させるか、或いはそれを必要とする糖尿病の対象において、腎障害を予防又は減少させるために用いるための医薬：

【化2】



I

[式中、

Zは、炭素、窒素、リン、ヒ素、ケイ素又はゲルマニウムであり；

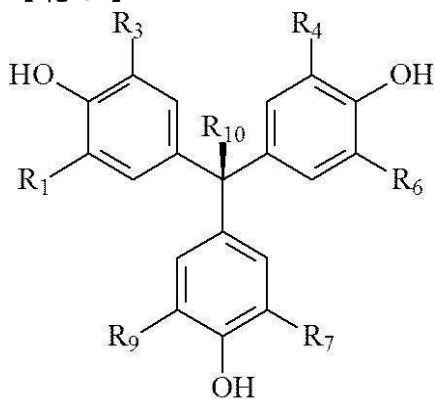
R₁ないしR₉は、同一又は異なって、H、D、OH、ハロゲン、ニトロ、CN、ニトリルアミド、アミドスルフィド、アミノ、アルデヒド、置換ケトン、-COOH、エステル、トリフルオロメチル、アミド、置換又は無置換アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、アルキルアリール、アリールスルホニル、アリールアルキレンスルホニル、アルコキシ、アルキルアルコキシ、ハロアルキル、アルキルハロアルキル、ハロアリール、アリールオキシ、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルアミド、アリールアミノ、アリールアミド、アルキルチオ、アリールチオ、ヘテロシクロアルキル、アルキルヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルキルヘテロアリールであるか；或いはR₃、R₄、又はR₇が、メインの芳香環と共に縮合したシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、芳香環又は芳香族複素環を形成し；

R₁₀は、存在しないか、H、D、OH、ハロゲン、オキソ、ニトロ、CN、ニトリルアミド、アミドスルフィド、アミノ、アルデヒド、置換ケトン、-COOH、エステル、トリフルオロメチル、アミド、置換又は無置換アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、アルキルアリール、アリールスルホニル、アリールアルキレンスルホニル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアリール、シクロアルキル、アルキルシクロアルキル、アリールオキシ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルアミド、アリールアミノ、アリールアミド、アルキルチオ、アリールチオ、ヘテロシクロアルキル、アルキルヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルキルヘテロアリールである。]

【請求項3】

上記化合物が式IIの構造により表される請求項1又は2に記載の医薬：

【化3】



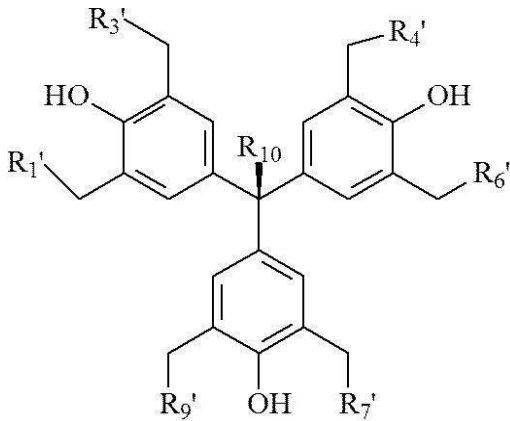
II

[式中、R₁、R₃、R₄、R₆、R₇、R₉及びR₁₀は、上記の通りである。]

【請求項4】

上記化合物が、式 V I の構造により表される請求項 3 に記載の 医薬：

【化 4】



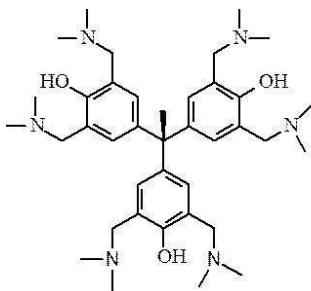
VI

[式中、 R_1' 、 R_3' 、 R_4' 、 R_6' 、 R_7' 、及び R_9' は、ハロゲン、アリール、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アルコキシ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ又はアリールアミノを含む同一又は異なるものであり； R_{10} は上記の通りである。]。

【請求項 5】

上記化合物が、式 V I I の構造により表される請求項 4 に記載の 医薬。

【化 5】

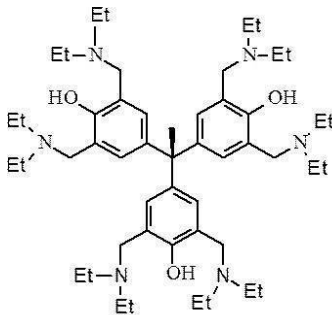


VII

【請求項 6】

上記化合物が、式 V I I I の構造により表される請求項 4 に記載の 医薬。

【化 6】

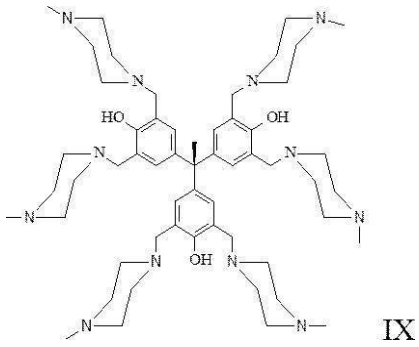


VIII

【請求項 7】

上記化合物が、式 I X の構造により表される請求項 4 に記載の 医薬。

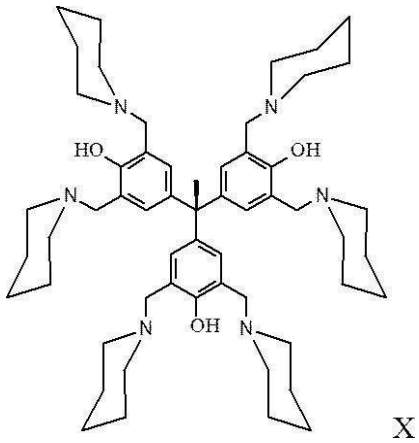
【化 7】



【請求項 8】

上記化合物が、式 X の構造により表される請求項 4 に記載の 医薬。

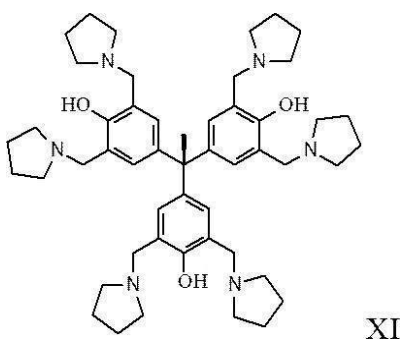
【化 8】



【請求項 9】

上記化合物が、式 X I の構造により表される請求項 4 に記載の 医薬。

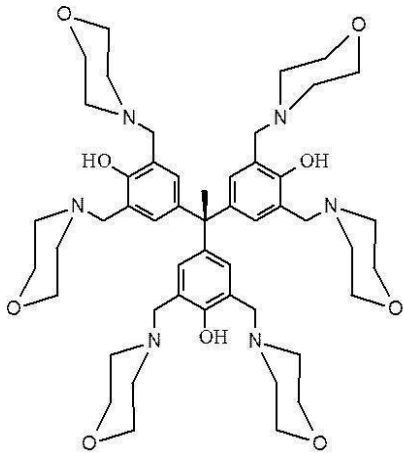
【化 9】



【請求項 10】

上記化合物が、式 X I I の構造により表される請求項 4 に記載の 医薬。

【化 1 0】

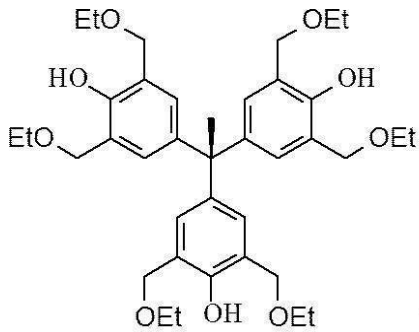


XII

【請求項 1 1】

上記化合物が、式 X I I I の構造により表される請求項 4 に記載の 医薬。

【化 1 1】

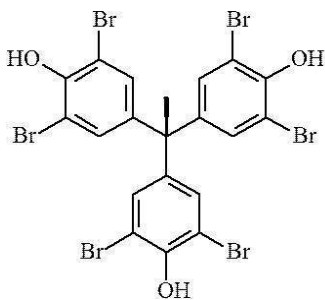


XIII

【請求項 1 2】

上記化合物が、式 X I V の構造により表される請求項 1 又は 2 に記載の 医薬。

【化 1 2】

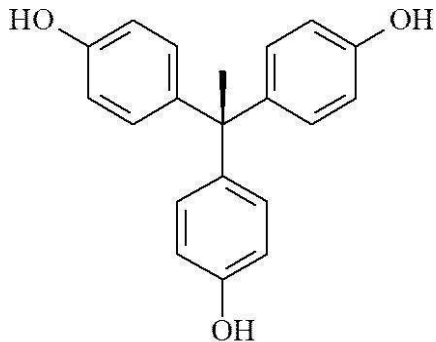


XIV

【請求項 1 3】

上記化合物が、式 X V の構造により表される請求項 1 又は 2 に記載の 医薬。

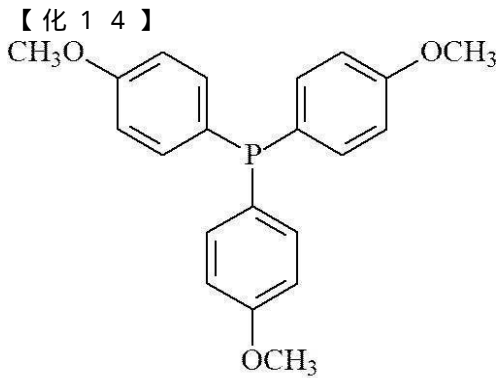
【化 1 3】



XV

【請求項 1 4】

上記化合物が、式 X V I の構造により表される請求項 1 又は 2 に記載の 医薬。



XVI

【請求項 1 5】

糖尿病又は糖尿病関連合併症の治療に有用な第二の薬剤を含む請求項 1 又は 2 に記載の医薬。

【請求項 1 6】

補助治療として糖尿病又は糖尿病関連合併症の治療に有用な第二の薬剤を与えられる対象に投与するために用いるための請求項 1 又は 2 に記載の医薬。

【請求項 1 7】

対象における循環ブドウ糖濃度の低下、インスリン抵抗性の減少、インスリン感受性の促進又は増加、膵臓のベータ細胞質量の促進又は増加、又はクレアチニンクリアランスの促進又は増加、或いは上記対象における腎疾患の予防又は減少に有用な第二の薬剤を含む請求項 1 又は 2 に記載の医薬。

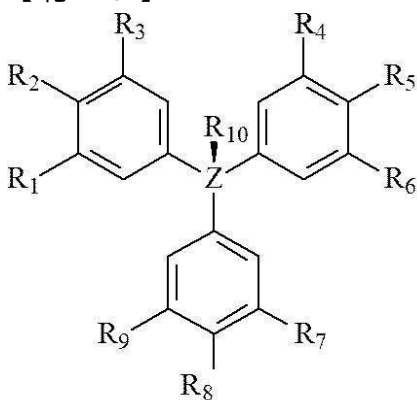
【請求項 1 8】

補助治療として、循環ブドウ糖濃度の低下、インスリン抵抗性の減少、インスリン感受性の促進又は増加、膵臓のベータ細胞質量の促進又は増加、又はクレアチニンクリアランスの促進又は増加、或いは腎障害の予防又は減少に有用な第二の薬剤を与えられる対象に投与するために用いるための請求項 1 又は 2 に記載の医薬。

【請求項 1 9】

式 I の構造により表される化合物又はその異性体、その医薬上許容される塩、その医薬品、その水和物、その N - オキシド、その結晶若しくはそれらの任意の組み合わせの使用であって、それを必要とする対象における糖尿病又は糖尿病関連合併症の治療に用いるための医薬の製造における使用：

【化 1 5】



I

[式中、

Z は、炭素、窒素、リン、ヒ素、ケイ素又はゲルマニウムであり；

R₁ ないし R₉ は、同一又は異なって、H、D、OH、ハロゲン、ニトロ、CN、ニトリルアミド、アミドスルフィド、アミノ、アルデヒド、置換ケトン、-COOH、エステル、トリフルオロメチル、アミド、置換又は無置換アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、アルキルアリール、アリールスルホニル、アリールアルキレンスルホニル、アルコキシ、アルキルアルコキシ、ハロアルキル、アルキルハロアルキ

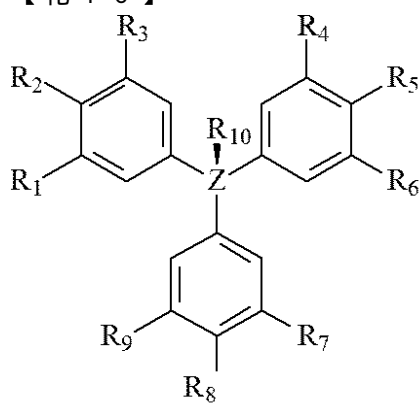
ル、ハロアリール、アリールオキシ、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルアミド、アリールアミノ、アリールアミド、アルキルチオ、アリールチオ、ヘテロシクロアルキル、アルキルヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルキルヘテロアリールであるか；或いは R_3 、 R_4 、又は R_7 が、メインの芳香環と共に縮合したシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、芳香環又は芳香族複素環を形成し；

R_{10} は、存在しないか、H、D、OH、ハロゲン、オキシ、ニトロ、CN、ニトリルアミド、アミドスルフィド、アミノ、アルデヒド、置換ケトン、-COOH、エステル、トリフルオロメチル、アミド、置換又は無置換アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、アルキルアリール、アリールスルホニル、アリールアルキレンスルホニル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアリール、シクロアルキル、アルキルシクロアルキル、アリールオキシ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルアミド、アリールアミノ、アリールアミド、アルキルチオ、アリールチオ、ヘテロシクロアルキル、アルキルヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルキルヘテロアリールである。]。

【請求項 20】

式 I の構造により表される化合物又はその異性体、その医薬上許容される塩、その医薬品、その水和物、その N - オキシド、その結晶若しくはそれらの任意の組み合わせの使用であって、それを必要とする対象において、循環ブドウ糖濃度を低下させるか、インスリン抵抗性を減少させるか、インスリン感受性を促進又は増加させるか、膵臓のベータ細胞質量を促進又は増加させるか、又はクレアチンクリアランスを促進又は増加させるか、或いはそれを必要とする糖尿病の対象において、腎障害を予防又は減少させるために用いるための医薬の製造における使用；

【化 16】



[式中、

Z は、炭素、窒素、リン、ヒ素、ケイ素又はゲルマニウムであり；

R_1 ないし R_9 は、同一又は異なって、H、D、OH、ハロゲン、ニトロ、CN、ニトリルアミド、アミドスルフィド、アミノ、アルデヒド、置換ケトン、-COOH、エステル、トリフルオロメチル、アミド、置換又は無置換アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、アルキルアリール、アリールスルホニル、アリールアルキレンスルホニル、アルコキシ、アルキルアルコキシ、ハロアルキル、アルキルハロアルキル、ハロアリール、アリールオキシ、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルアミド、アリールアミノ、アリールアミド、アルキルチオ、アリールチオ、ヘテロシクロアルキル、アルキルヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルキルヘテロアリールであるか；或いは R_3 、 R_4 、又は R_7 が、メインの芳香環と共に縮合したシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、芳香環又は芳香族複素環を形成し；

R_{10} は、存在しないか、H、D、OH、ハロゲン、オキシ、ニトロ、CN、ニトリルアミド、アミドスルフィド、アミノ、アルデヒド、置換ケトン、-COOH、エステル、

トリフルオロメチル、アミド、置換又は無置換アルキル、アルケニル、アルキニル、アリーール、アリーールアルキル、アルキルアリーール、アリーールスルホニル、アリーールアルキレンスルホニル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアリーール、シクロアルキル、アルキルシクロアルキル、アリーールオキシ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルアミド、アリーールアミノ、アリーールアミド、アルキルチオ、アリーールチオ、ヘテロシクロアルキル、アルキルヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、ヘテロアリーール、ヘテロアリーールアルキル、アルキルヘテロアリーールである。]。

【請求項 2 1】

上記医薬が、糖尿病又は糖尿病関連合併症の治療に有用な第二の薬剤を含む請求項 1 9 又は 2 0 に記載の使用。

【請求項 2 2】

上記医薬を、補助治療として糖尿病又は糖尿病関連合併症の治療に有用な第二の薬剤を与えられる対象に提供する、請求項 1 9 又は 2 0 に記載の使用。

【請求項 2 3】

上記医薬が、対象における循環ブドウ糖濃度の低下、インスリン抵抗性の減少、インスリン感受性の促進又は増加、膵臓のベータ細胞質量の促進又は増加、又はクレアチンクリアランスの促進又は増加、或いは腎障害の予防又は減少に有用な第二の薬剤を含む請求項 1 9 又は 2 0 に記載の使用。

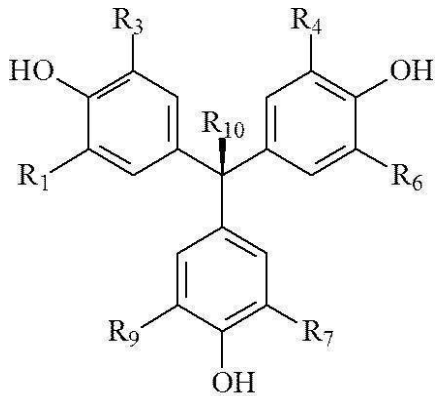
【請求項 2 4】

上記医薬を、補助治療として、対象における循環ブドウ糖濃度の低下、インスリン抵抗性の減少、インスリン感受性の促進又は増加、膵臓のベータ細胞質量の促進又は増加、又はクレアチンクリアランスの促進又は増加、或いは腎障害の予防又は減少に有用な第二の薬剤を与えられる対象に提供する、請求項 1 9 又は 2 0 に記載の使用。

【請求項 2 5】

上記化合物が、式 I I の構造により表される請求項 1 9 又は 2 0 に記載の使用：

【化 1 7】

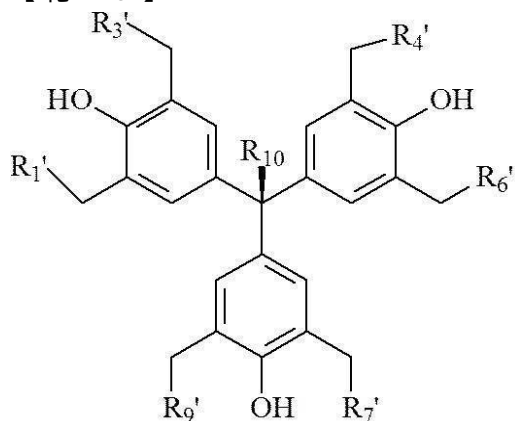


[式中、R₁、R₃、R₄、R₆、R₇、R₉ 及び R₁₀ は、上記の通りである。]。

【請求項 2 6】

上記化合物が、式 V I の構造により表される請求項 1 9 又は 2 0 に記載の使用：

【化 1 8】



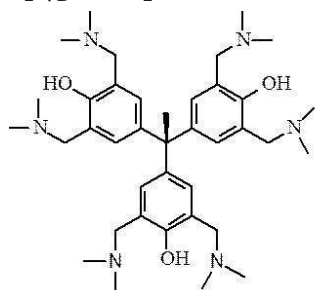
VI

[式中、 R_1' 、 R_3' 、 R_4' 、 R_6' 、 R_7' 、及び R_9' は、ハロゲン、アリール、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アルコキシ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ又はアリールアミノを含む同一又は異なるものであり； R_{10} は、上記の通りである。]。

【請求項 2 7】

上記化合物が、式 VII の構造により表される請求項 1 9 又は 2 0 に記載の使用。

【化 1 9】

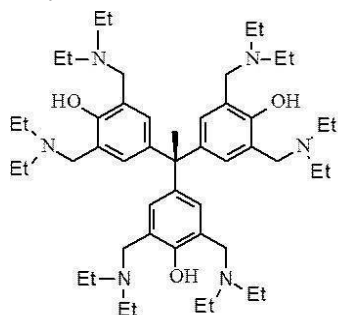


VII

【請求項 2 8】

上記化合物が、式 VIII の構造により表される請求項 1 9 又は 2 0 に記載の使用。

【化 2 0】

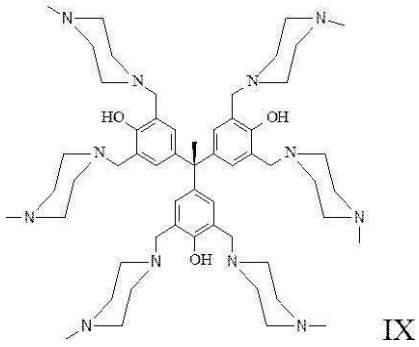


VIII

【請求項 2 9】

上記化合物が、式 IX の構造により表される請求項 1 9 又は 2 0 に記載の使用。

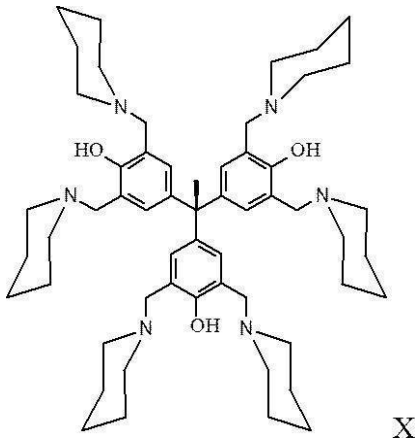
【化 2 1】



【請求項 3 0】

上記化合物が、式 X の構造により表される請求項 1 9 又は 2 0 に記載の使用。

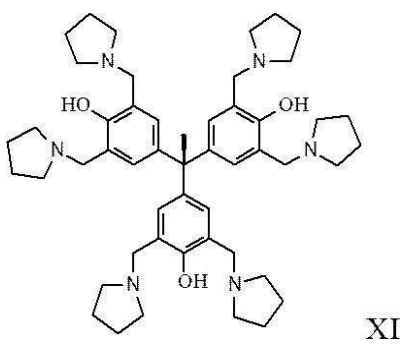
【化 2 2】



【請求項 3 1】

上記化合物が、式 X I の構造により表される請求項 1 9 又は 2 0 に記載の使用。

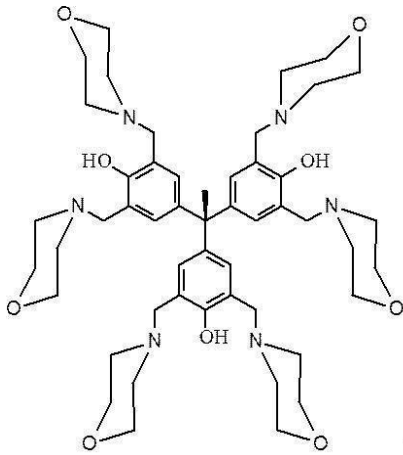
【化 2 3】



【請求項 3 2】

上記化合物が、式 X I I の構造により表される請求項 1 9 又は 2 0 に記載の使用。

【化 2 4】

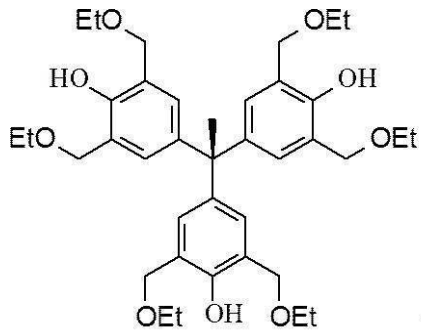


XII

【請求項 3 3】

上記化合物が、式 X I I I の構造により表される請求項 1 9 又は 2 0 に記載の使用。

【化 2 5】

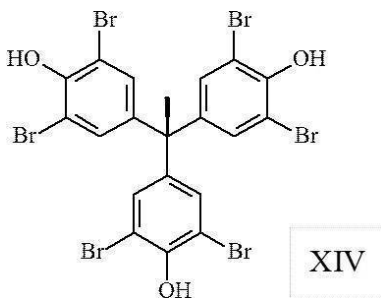


XIII

【請求項 3 4】

上記化合物が、式 X I V の構造により表される請求項 1 9 又は 2 0 に記載の使用。

【化 2 6】

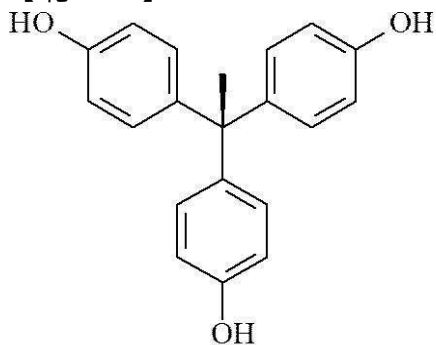


XIV

【請求項 3 5】

上記化合物が、式 X V の構造により表される請求項 1 9 又は 2 0 に記載の使用。

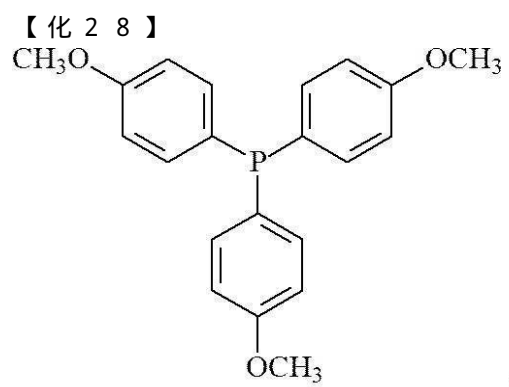
【化 2 7】



XV

【請求項 3 6】

上記化合物が、式 X V I の構造により表される請求項 1 9 又は 2 0 に記載の使用。



XVI