

【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11月29日(2007.11.29)

【公表番号】特表2007-508382(P2007-508382A)

【公表日】平成19年4月5日(2007.4.5)

【年通号数】公開・登録公報2007-013

【出願番号】特願2006-535505(P2006-535505)

【国際特許分類】

C 0 7 C 59/68 (2006.01)

C 0 7 C 317/22 (2006.01)

C 0 7 C 323/52 (2006.01)

A 6 1 K 31/192 (2006.01)

A 6 1 K 31/4406 (2006.01)

C 0 7 D 213/30 (2006.01)

A 6 1 K 31/4402 (2006.01)

C 0 7 D 213/64 (2006.01)

A 6 1 K 31/19 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 59/68 C S P

C 0 7 C 317/22

C 0 7 C 323/52

A 6 1 K 31/192

A 6 1 K 31/4406

C 0 7 D 213/30

A 6 1 K 31/4402

C 0 7 D 213/64

A 6 1 K 31/19

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 9/04

【手続補正書】

【提出日】平成19年9月27日(2007.9.27)

【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

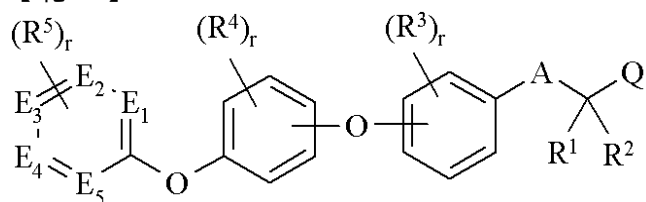
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I を有する化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、水和物または立体異性体であって、

【化 1】



I

E_1 、 E_2 、 E_3 、 E_4 および E_5 はそれぞれ、CH または R^5 を有する置換炭素、あるいは、 E_1 、 E_2 、 E_3 、 E_4 および E_5 のうち少なくとも 1 つは窒素であり、他はそれぞれ、CH または R^5 を有する置換炭素であり、

A は、結合、 CH_2 、 $(CH_2)_2$ 、O、S であり、あるいは、該 A および R^1 または該 A および R^2 は、該 A が炭素である場合、共に 3 員または 6 員カルボシクリルであり、

Q は、 $-C(O)OR^6$ または R^6A であり、

n は、1、2、3、4、5 または 6 であり

p は、1 または 2 であり、

r は、1、2、3 または 4 であり、

R^1 および R^2 はそれぞれ、独立しており、

水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、または R^1 および R^2 は共に、3 員または 8 員炭素環であり、

R^3 および R^4 はそれぞれ独立しており、

水素、

ニトロ、

シアノ、

ヒドロキシル、

ハロ、

ハロアルキル、

ハロアルキルオキシ、

$C_1 \sim C_6$ アルキル、

$C_1 \sim C_6$ アルコキシ、または

$C_3 \sim C_8$ シクロアルキル

であり、

R^5 は、

水素、

ニトロ、

シアノ、

ヒドロキシル、

ハロ、

ハロアルキル、

ハロアルキルオキシ、

アリールオキシ、

$C_1 \sim C_6$ アルキル、

$C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

[T] - アリール、

[T] - ヘテロアリール、

[T] - ヘテロシクリル、

[T] - $(CH_2)_n C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、

$C(O)_p R^7$ 、

$O(CH_2)_nR^7$ 、
 SR^7 、
 $S(O)_pR^7$ または
 $OS(O)_pR^7$ 、
 であり

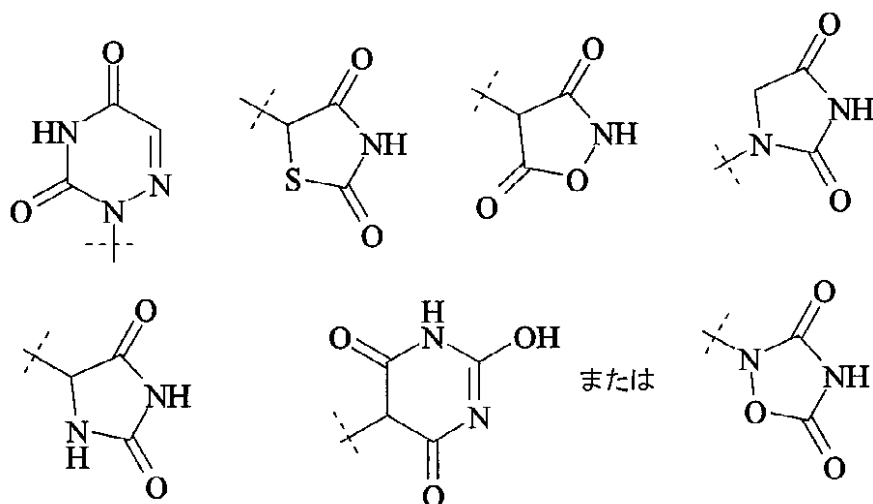
ここで、前記アリール、前記アリールオキシ、前記アルキル、前記ヘテロアリール、前記ヘテロシクリルおよび前記シクロアルキルは、 R^8 から独立して選択された1つ以上の置換基と必要に応じて置換され、

前記[T]は、結合、O、C(O)、S、 NR^7 、または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

R^6 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアミノアルキルであり、

R^{6A} は、カルボキサミド、スルホンアミド、アシルスルホンアミド、テトラゾールであり、

【化2】



R^7 は、

水素、

$C_1 \sim C_6$ アルキル、

$C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、

アリール、

ヘテロアリールまたは

ヘテロシクリル

であり、

ここで、前記アルキル、前記シクロアルキル、前記アリール、前記ヘテロアリールまたは前記ヘテロシクリルは、 R^8 から独立して選択された1つ以上の置換基と必要に応じて置換され、

前記 R^8 は、水素、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルキルオキシ、アリールオキシ、オキソ、

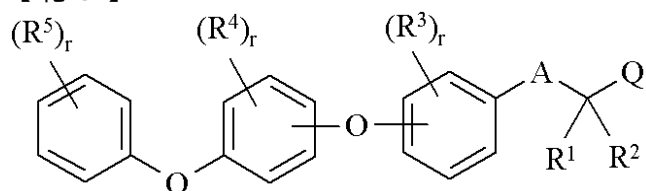
アシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシまたは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルである、

化合物。

【請求項2】

前記化合物は、式IIを有し、

【化 3】



I I

A は、結合、 CH_2 、 $(\text{CH}_2)_2$ 、O、S であり、あるいは、A および R^1 または A および R^2 は、A が炭素である場合、共に 3 員または 6 員カルボシクリルであり、

Q は、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$ または R^6A であり、

n は、1、2、3、4、5 または 6 であり、

p は、1 または 2 であり、

r は、1、2、3 または 4 であり、

R^1 および R^2 はそれぞれ、独立しており、

水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、または R^1 および R^2 は共に 3 員または 8 員炭素環であり

、
 R^3 および R^4 はそれぞれ独立しており、

水素、

ニトロ、

シアノ、

ヒドロキシル、

ハロ、

ハロアルキル、

ハロアルキルオキシ、

$\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、

$\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、または

$\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル、

であり、

R^5 は、

水素、

ニトロ、

シアノ、

ヒドロキシル、

ハロ、

ハロアルキル、

ハロアルキルオキシ、

アリールオキシ、

$\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、

$\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、

[T] - アリール、

[T] - ヘテロアリール、

[T] - ヘテロシクリル、

[T] - $(\text{CH}_2)_n \text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル、

$\text{C}(\text{O})_p \text{R}^7$ 、

$\text{O}(\text{CH}_2)_n \text{R}^7$ 、

SR^7 、

$\text{S}(\text{O})_p \text{R}^7$ または

$\text{OS}(\text{O})_p \text{R}^7$ 、

であり、

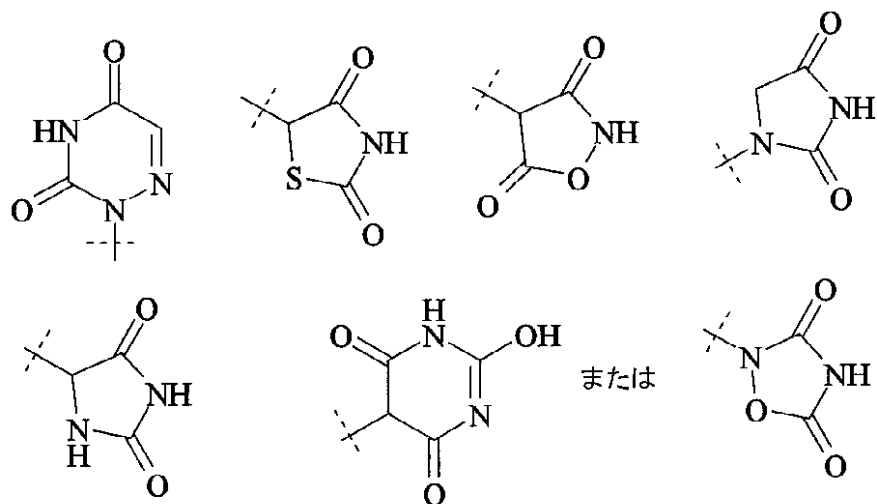
ここで、前記アリール、前記アリールオキシ、前記アルキル、前記ヘテロアリール、前記ヘテロシクリルおよび前記シクロアルキルは、 R^8 から独立して選択された 1 つ以上の置換基と必要に応じて置換され、

前記 [T] は、結合、O、C(O)、S、 NR^7 または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

R^6 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアミノアルキルであり、

R^{6A} は、カルボキサミド、スルホンアミド、アシルスルホンアミド、テトラゾール、であり

【化 4】



R^7 は、

水素、

$C_1 \sim C_6$ アルキル、

$C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、

アリール、

ヘテロアリールまたは

ヘテロシクリル

であり、

ここで、前記アルキル、前記シクロアルキル、前記アリール、前記ヘテロアリールまたは前記ヘテロシクリルは、 R^8 から独立して選択された 1 つ以上の置換基と必要に応じて置換され、

前記 R^8 は、水素、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルキルオキシ、アリールオキシ、オキソ、

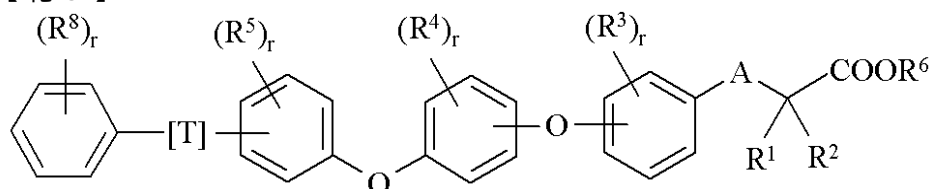
アシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシまたは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルである、

請求項 1 に記載の化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

【請求項 3】

前記化合物は、構造式 I I I を有する、

【化 5】



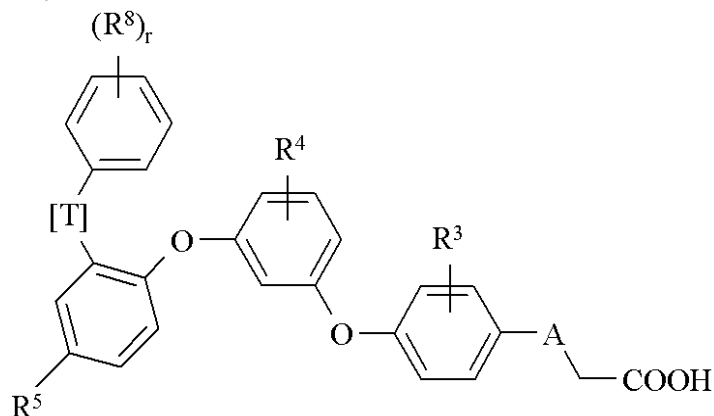
I I I

請求項 2 に記載の化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

【請求項 4】

前記化合物は、構造式 I V を有し、

【化 6】



I V

A は、 CH_2 、O、S であり、

[T] は、結合、O、C(O) または $C_1 \sim C_3$ アルキルであり、

R^3 および R^4 はそれぞれ各独立しており、

水素、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロ、ハロアルキルまたはハロアルキルオキシであり、

R^5 および R^8 はそれぞれ独立しており、

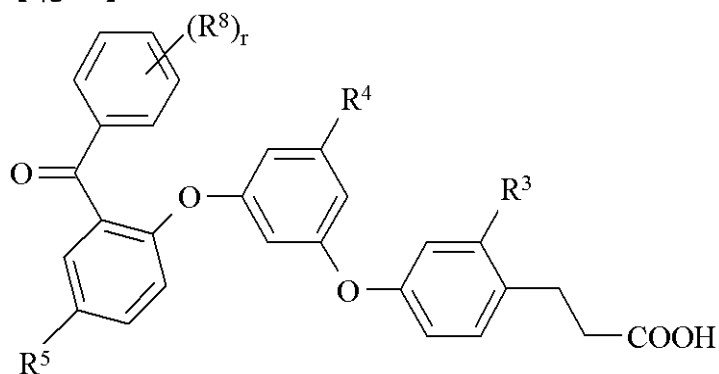
水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ、ハロアルキルまたはハロアルキルオキシであり、

r は 1 または 2 である、請求項 3 に記載の化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

【請求項 5】

前記化合物は、構造式 V を有し、

【化 7】



V

R^3 および R^4 はそれぞれ独立しており、水素、メチル、エチル、Br、Cl または F であり、

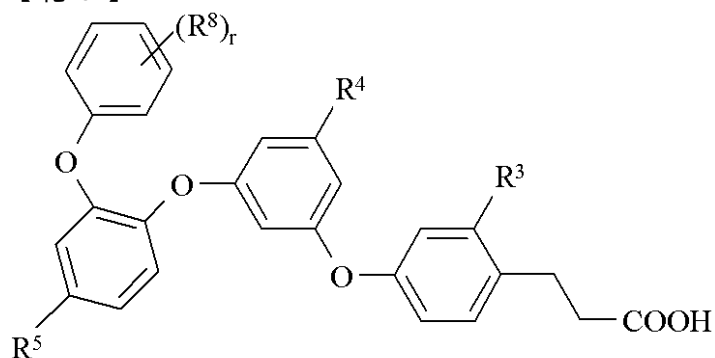
R^5 および R^8 はそれぞれ独立しており、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、Br、Cl、F または CF_3 であり、

r は 1 または 2 である、請求項 4 に記載の化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

【請求項 6】

前記化合物は、構造式 V I を有し、

【化 8】



V I

R^3 および R^4 はそれぞれ独立しており、水素、メチル、エチル、Br、Cl または F であり、

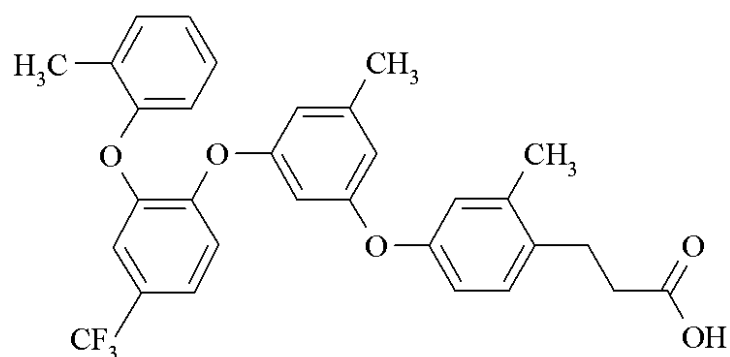
R^5 および R^8 はそれぞれ独立しており、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、Br、Cl、F または CF_3 であり、

r は 1 または 2 である、請求項 4 に記載の化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、水和物またはその立体異性体。

【請求項 7】

前記化合物は、構造式 V I I を有する、

【化 9】



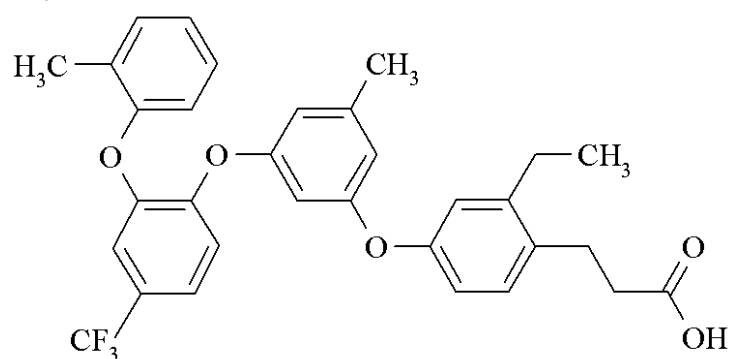
V I I

請求項 6 に記載の化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物または水和物。

【請求項 8】

前記化合物は、構造式 V I I I を有し、

【化 10】



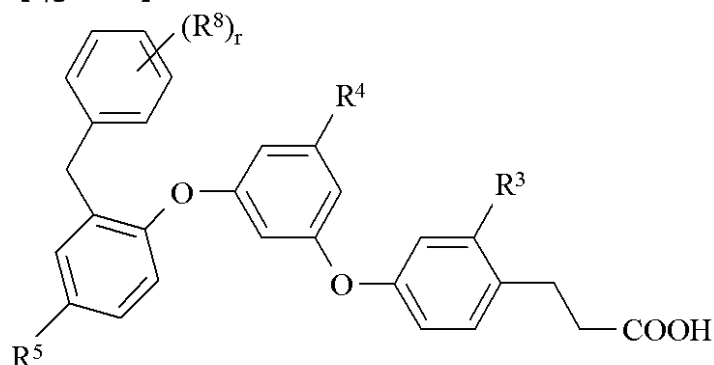
V I I I

請求項 6 に記載の化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、水和物。

【請求項 9】

前記化合物は、構造式 I X を有し、

【化 1 1】



I X

R^3 および R^4 はそれぞれ独立しており、水素、メチル、エチル、Br、Cl または F であり、

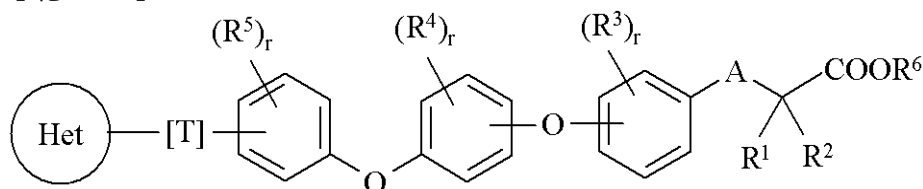
R^5 および R^8 はそれぞれ独立しており、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、Br、Cl、F または CF_3 であり、

r は 1 または 2 である、請求項 4 に記載の化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

【請求項 1 0】

前記化合物は、構造式 X を有し、

【化 1 2】



X

【化 1 3】



は、5 員または 6 員ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、該ヘテロアリールおよび該ヘテロシクリルは、 R^8 から独立して選択された 1 つ以上の置換基と必要に応じて置換される、請求項 2 に記載の化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

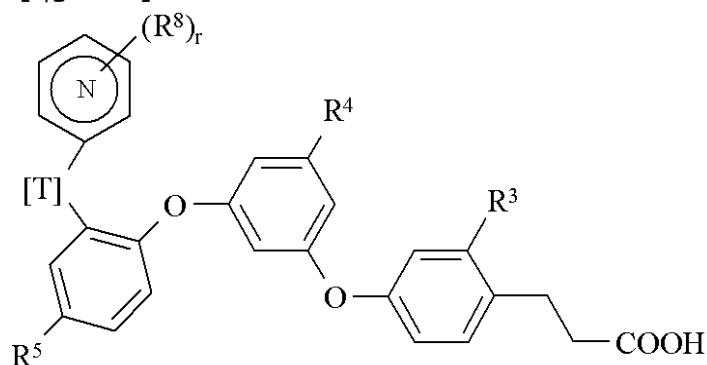
【請求項 1 1】

前記ヘテロアリールは、ピラゾリル、ピロリル、ピラジニル、ピリジル、ピリミジルまたはピリミジニルである、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 2】

前記化合物は、構造式 X I を有し、

【化 1 4】



X I

[T] は、結合、O、C (O) または C₁ ~ C₃ アルキルであり、
R³ および R⁴ はそれぞれ独立しており、水素、メチル、エチル、Br、Cl または F
であり、

R⁵ および R⁸ はそれぞれ独立しており、水素、C₁ ~ C₄ アルキル、Br、Cl、F
または CF₃ であり、

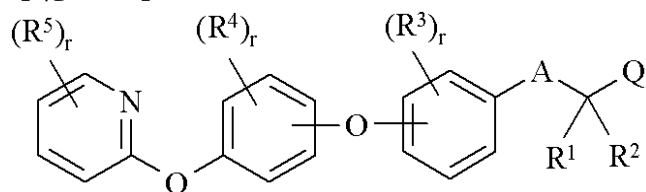
r は 1 または 2 である、請求項 10 に記載の化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、
溶媒和物、水和物または立体異性体。

。

【請求項 1 3】

前記化合物は、式 X I I を有し、

【化 1 5】



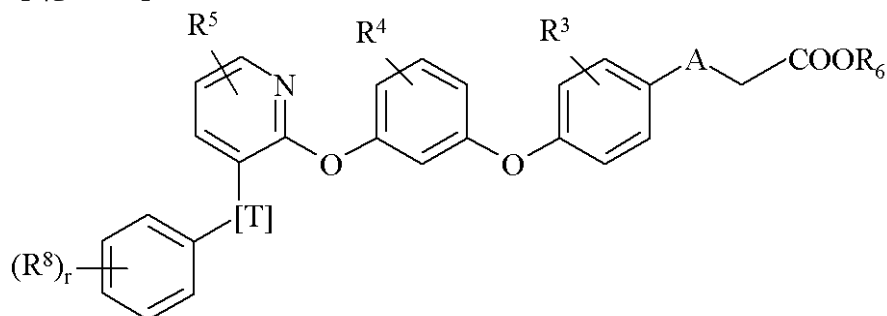
X I I

請求項 1 に記載の化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、水和物または
立体異性体。

【請求項 1 4】

前記化合物は、式 X I I I を有し、

【化 1 6】



X I I I

A は、CH₂、O、S であり、

[T] は、結合、O、C (O) または C₁ ~ C₃ アルキルであり、

R³ および R⁴ はそれぞれ独立しており、

水素、C₁ ~ C₃ アルキル、ハロ、ハロアルキルまたはハロアルキルオキシであり、

R⁵ および R⁸ はそれぞれ独立しており、

水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ、ハロアルキルまたはハロアルキルオキシであり、

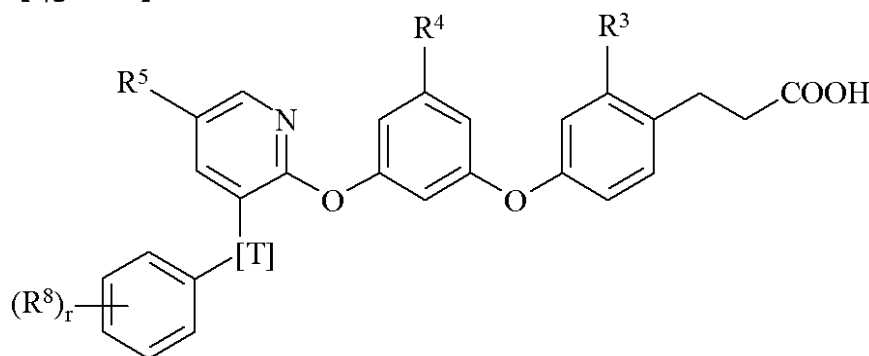
R^6 は、水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

r は 1 または 2 である、請求項 13 に記載の化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

【請求項 15】

前記化合物は、式 XIV を有し、

【化 17】



XIV

[T] は、結合、O または $C_1 \sim C_3$ アルキルであり、

R^3 および R^4 はそれぞれ独立しており、水素、メチル、エチル、Br、Cl または F であり、

R^5 および R^8 はそれぞれ独立しており、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、Br、Cl、F または CF_3 であり、

r は 1 または 2 である、請求項 14 に記載の化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

【請求項 16】

以下の化合物からなる群から選択される化合物：

3 - { 4 - [3 - (4 - クロロ - 2 - フェノキシ - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸；

3 - { 4 - [3 - (2 - ベンゾイル - 4 - エチル - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸；

3 - { 4 - [3 - (4 - エチル - 2 - フェノキシ - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸；

3 - { 4 - [3 - (2 - ベンゾイル - 4 - クロロ - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸；

3 - { 4 - [3 - (2 - ベンゾイル - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸；

3 - { 2 - メチル - 4 - [3 - (2 - フェノキシ - フェノキシ) - フェノキシ] - フェニル } - プロピオン酸；

3 - { 2 - メチル - 4 - [3 - (2 - フェノキシ - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - フェノキシ] - フェニル } - プロピオン酸；

3 - { 4 - [3 - (4 - クロロ - 2 - フェノキシ - フェノキシ) - 5 - フルオロ - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸；

3 - { 4 - [3 - (4 - エチル - 2 - フェノキシ - フェノキシ) - 5 - フルオロ - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸；

3 - (4 - { 3 - [4 - エチル - 2 - (1 - メチル - 1 - フェニル - エチル) - フェノキシ] - 5 - フルオロ - フェノキシ } - 2 - メチル - フェニル) - プロピオン酸；

3 - { 4 - [3 - (4 - エチル - 2 - フェノキシ - フェノキシ) - 5 - フルオロ - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸；

3 - { 4 - [3 - (4 - クロロ - 2 - フェノキシ - フェノキシ) - 5 - メチル - フェニル } - プロピオン酸；

キシ] - 2 - メチル - フェニル} - プロピオン酸 ;

3 - { 4 - [3 - (2 - ベンゾイル - 4 - クロロ - フェノキシ) - 5 - メチル - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - { 2 - メチル - 4 - [3 - メチル - 5 - (2 - ピリジン - 3 - イル - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - フェノキシ] - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - { 2 - メチル - 4 - [3 - メチル - 5 - (2 - ピリジン - 2 - イル - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - フェノキシ] - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - { 4 - [3 - (2' - アセチル 5 - トリフルオロメチル - ビフェニル 2 - イルオキシ) - 5 - メチル - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - { 4 - [3 - (4' - メタンスルホニル 5 - トリフルオロメチル - ビフェニル 2 - イルオキシ) - 5 - メチル - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - { 2 - メチル - 4 - [3 - メチル - 5 - (2' - トリフルオロメトキシ - 5 - トリフルオロメチル - ビフェニル 2 - イルオキシ) - フェノキシ] - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - { 2 - メチル - 4 - [3 - メチル - 5 - (2 - フェノキシ - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - フェノキシ] - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - (2 - メチル - 4 - { 3 - メチル - 5 - [2 - (ピリジン - 2 - イルオキシ) - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ] - フェノキシ } - フェニル) - プロピオン酸 ;

3 - (2 - メチル - 4 - { 3 - メチル - 5 - [2 - (2 - オキソ - 2 H - ピリジン - 1 - イル) - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ] - フェノキシ } - フェニル) - プロピオン酸 ;

3 - (2 - メチル - 4 - { 3 - メチル - 5 - [2 - (ピリジン - 3 - イルオキシ) - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ] - フェノキシ } - フェニル) - プロピオン酸 ;

3 - { 2 - メチル - 4 - [3 - メチル - 5 - (2 - o - トリルオキシ 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - フェノキシ] - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - { 2 - メチル - 4 - [3 - メチル - 5 - (2 - m - トリルオキシ 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - フェノキシ] - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - { 2 - メチル - 4 - [3 - メチル - 5 - (2 - p - トリルオキシ 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - フェノキシ] - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - (4 - { 3 - [2 - (3、5 - ジフルオロフェノキシ) - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ] - 5 - メチル - フェノキシ } - 2 - メチル - フェニル) - プロピオン酸 ;

3 - { 4 - [3 - フルオロ - 5 - (2 - フェノキシ - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - { 4 - [3 - フルオロ - 5 - (2 - ピリジン - 2 - イル - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - { 4 - [3 - フルオロ - 5 - (2 - ピリジン - 3 - イル - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - { 4 - [3 - クロロ - 5 - (2 - フェノキシ - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - (4 - { 3 - クロロ - 5 - [2 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ] - フェノキシ } - 2 - メチル - フェニル) - プロピオン酸 ;

3 - { 4 - [3 - クロロ - 5 - (2 - ピリジン - 2 - イル - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - { 4 - [3 - クロロ - 5 - (2 - ピリジン - 3 - イル - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸 ;

{ 4 - [3 - (4 - クロロ - 2 - フェノキシ - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニルスルファニル } - 酢酸 ;

2 - { 4 - [3 - (4 - クロロ - 2 - フェノキシ - フェノキシ) - フェノキシ] - フェノキシ } - 2 - メチル - プロピオン酸 ;

2 - { 4 - [3 - (4 - クロロ - 2 - フェノキシ - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 -

メチル - フェノキシ } - 2 - メチル - プロピオン酸 ;

{ 4 - [3 - (4 - クロロ - 2 - フェノキシ - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 - メチル - フェノキシ } - 酢酸 ;

3 - { 4 - [3 - (4 - クロロ - 2 - フェノキシ - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 - フルオロ - フェニル } - プロピオン酸 ;

4 - { 4 - [3 - (4 - クロロ - 2 - フェノキシ - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - 酪酸 ;

3 - { 4 - [3 - (4 - クロロ - 2 - フェノキシ - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 - エチル - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - { 4 - [3 - (2 - ベンジル 4 - クロロ - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - { 4 - [3 - (2 - ベンジル 4 - クロロ - フェノキシ) - 5 - メチル - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - { 4 - [3 - (4 - クロロ - 2 - シクロヘキシルフェノキシ) - 5 - メチル - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - { 4 - [3 - (2 - ベンジル 4 - クロロ - フェノキシ) - 5 - フルオロ - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸 ;

3 - { 2 - メチル - 4 - [3 - メチル - 5 - (3 - フェノキシ - 5 - トリフルオロメチル - ピリジン - 2 - イルオキシ) - フェノキシ] - フェニル } - プロピオン酸。

【請求項 17】

前記化合物が、3 - { 4 - [3 - (4 - クロロ - 2 - フェノキシ - フェノキシ) - 5 - メチル - フェノキシ] - 2 - メチル - フェニル } - プロピオン酸である、請求項 16 に記載の化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物または水和物。

【請求項 18】

前記化合物が、{ 4 - [3 - (4 - クロロ - 2 - フェノキシ - フェノキシ) - フェノキシ] - 2 - メチル - フェノキシ } - 酢酸である、請求項 16 に記載の化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物または水和物。

【請求項 19】

薬学的に受容可能なキャリアおよび請求項 1 ~ 18 の化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物または水和物を含む医薬組成物。

【請求項 20】

(1) 請求項 1 ~ 18 の化合物、または該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、水和物または立体異性体と、

(2) インスリン抵抗性改善薬、スルホニル尿素、ビグアニド、メグリチナイド、チアゾリジンジオン、 α -グルコシダーゼ阻害剤、インスリン分泌促進物質、インスリン、抗高脂血症薬、血漿 HDL を増加させる薬物、HMG - CoA 還元酵素阻害剤、スタチン、アクリル CoA、コレステロール (cholestrol) アシル基転移酵素阻害剤、抗肥満化合物、高コレステロール症用薬、フィブラート、ビタミンおよびアスピリンからなる群から選択される第 2 の処理薬と、

(3) 必要に応じて薬学的に受容可能なキャリアと、を含む、医薬組成物。

【請求項 21】

哺乳類の血糖を低下させるのに必要とする薬物を製造するための、請求項 1 ~ 18 のいずれかの 1 つに記載の化合物の使用。

【請求項 22】

哺乳類の疾患または状態を治療するのに必要とする前記薬物の製造するための、請求項 1 ~ 18 のいずれかの 1 つに記載の化合物の使用であって、前記疾患または前期状態が、高血糖症、異常脂質血症、II 型糖尿病、I 型糖尿病、高トリグリセリド血症、シンドローム X、インスリン抵抗、心不全、糖尿病異常脂質血症、高脂血症、高コレステロール血症、高血圧、肥満、アノレキシア・ブルミア、拒食症、循環器疾患およびインスリン抵抗

を要因とする他の疾患からなる群から選択される、化合物の使用。

【請求項 23】

哺乳類の真性糖尿病を治療するのに必要とするための薬物の製造のための、請求項 1 ~ 18 のいずれかの 1 つに記載の化合物の使用。

【請求項 24】

哺乳類の循環器疾患を治療するのに必要とするための薬物の製造のための、請求項 1 ~ 18 のいずれかの 1 つに記載の化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、水和物または立体異性体の使用。

【請求項 25】

P P A R によって調節される状態を治療する薬物の製造のための、請求項 1 ~ 18 の化合物、該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、水和物または立体異性体の使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0018

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0018】

一実施形態において、本発明は、本発明の化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物またはその水和物ならびに薬学的に受容可能なキャリアを含む医薬組成物にも関する。本発明の範囲には、さらなる治療薬ならびに本発明の化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物またはその水和物ならびに薬学的に受容可能なキャリアを含む医薬組成物も含まれる。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0048

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0048】

本発明によってさらに包含されるのは、薬学的に受容可能なキャリアおよび本発明の化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物またはその水和物を含む医薬組成物である。

本発明によってさらに包含されるのは、(1) 本発明の化合物、または該化合物の薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、水和物またはその立体異性体と、(2) インスリン抵抗性改善薬、スルホニル尿素、ピグアニド、メグリチナイド、チアゾリジンジオン、 α -グルコシダーゼ阻害剤、インスリン分泌促進物質、インスリン、抗高脂血症薬、血漿 HDL を増加させる薬物、HMG-CoA 還元酵素阻害剤、スタチン、アクリル CoA : コレステロール (cholesterol) アシル基転移酵素阻害剤、抗肥満化合物、高コレステロール症用薬、フィブラート、ビタミンおよびアスピリンからなる群から選択される第 2 の処理薬と、(3) 必要に応じて薬学的に受容可能なキャリアと、を含む、医薬組成物である。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0083

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0083】

「薬学的に受容可能な」という用語は、キャリア、希釈剤、賦形剤および塩が当該組成物のその他の成分と適合しなければならず、かつ、その受容者にとって有害ではなければならないことを意味する。本発明の医薬組成物は、周知かつ容易に入手可能な成分を用いた当業界において公知の手順によって作製される。

【手続補正 5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 1 5

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 1 5】

本発明の化合物および薬学的に受容可能な塩、溶媒和物およびその水和物は、貴重な薬理特性を有し、治療上効果的な量の本発明の化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩、そのエステルまたはそのプロドラッグを含む医薬組成物と、1つ以上の薬学的に受容可能な賦形剤との組み合わせとにおいて使用可能である。賦形剤は、不活性物質（例えば、キャリア、希釈剤、溶加剤、着色料、甘味料、潤滑剤、可溶化剤、懸濁化剤、湿潤剤、結合剤、崩壊剤、封入材料および他の従来のアジュバント（ただし、これらに限定されない））である。適切な賦形剤は、選択された投与経路に依存する。医薬組成物は典型的には、約1～約99重量パーセントの本発明の化合物である活性成分を含む。

【手続補正 6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 1 9

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 1 9】

本発明の医薬組成物の適切な投与経路を挙げると、例えば、経口、点眼、直腸、経粘膜または腸内投与；非経口送達（ボ-ラスまたは注入）（例えば、筋肉内、皮下、髄内注射、ならびに鞘内、直接心室内、静脈内、腹腔内、経鼻、または眼内注射）がある。本発明の化合物はまた、目標薬送達系（例えば、内皮細胞特異抗体でコ-トされたりボソ-ム）中で投与してもよい。

【手続補正 7】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 3 5

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 3 5】

本発明の医薬組成物は、公知の方法（例えば、従来混合、溶解、粒状化、糖衣錠作製、微粒子状化、乳化、カプセル化、封入または凍結乾燥プロセス）によって製造可能である。