



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21), (22) Заявка: 2007144076/04, 28.04.2006

(30) Конвенционный приоритет:
28.04.2005 JP 2005-130879

(43) Дата публикации заявки: 10.06.2009 Бюл. № 16

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: 28.11.2007(86) Заявка РСТ:
JP 2006/309349 (28.04.2006)(87) Публикация РСТ:
WO 2006/118341 (09.11.2006)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул.Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", пат.пов. А.В.Мицу, рег. № 364

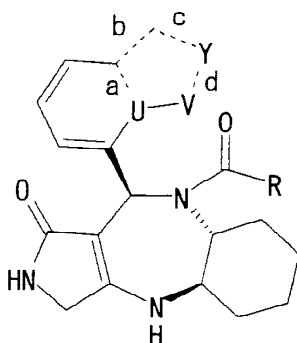
(71) Заявитель(и):

АДЗИНОМОТО КО., ИНК. (JP)

(72) Автор(ы):

ТАНАКА Хидеюки (JP),
МИЯНАГА Ватару (JP),
ТАКАЯНАГИ Масару (JP),
ХИРАМА Рюсукэ (JP),
КАГЕЯМА Йоко (JP),
ИСИКАВА Тацуя (JP),
ТАНАБЕ Ицуя (JP),
ОКАМАЦУ Йорико (JP)(54) **НОВОЕ ПРОИЗВОДНОЕ ЛАКТАМА**(57) **Формула изобретения**

1. Производное лактама, представленное следующей формулой (1), или его фармацевтически приемлемая соль:



(1)

где R означает низшую алкильную группу, низшую алкенильную группу, низшую алкинильную группу или низшую алкоксильную группу, которые могут иметь один-три заместителя (выбираемые из заместителей группы 1, описанной ниже);

Y означает или N или CR' (или NH или CHR', где связи, указанные как c и d, обе

являются одинарными связями), причем R' означает атом водорода или низшую алкильную группу, низшую алкенильную группу, низшую алкинильную группу или низшую алкоксильную группу, низшую алкилтиогруппу, низшую алкиламиногруппу, галоген, нитрогруппу или цианогруппу, которые могут иметь один-три заместителя (выбираемые из заместителей группы 1, описанной ниже);

U означает C или N,

в отношении связей, указанных как a, b, c и d, и V,

i) когда U означает C,

то a представляет собой двойную связь, b и d представляют собой одинарные связи, а c представляет собой или одинарную связь или двойную связь,

V означает -X- или -CH₂-O-, -O-CH₂-, -CH=N-, -N=N- или -N=CH-, со стороны Y;

ii) когда U означает N,

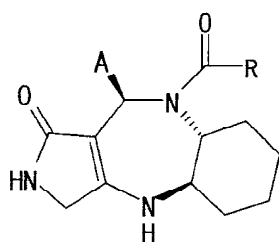
a и c представляют собой одинарные связи, b и d представляют собой двойные связи, V означает -N- или -CH-X-, со стороны Y,

X означает O, S или NH; и

конденсированный бицикл, включающий U, может быть замещен одним-тремя атомами фтора;

заместители группы 1: галоген, гидроксильная группа, метоксигруппа, этоксигруппа, ацетоксигруппа, метилтиогруппа, метансульфонильная группа, аминогруппа, метиламиногруппа, диметиламиногруппа, ацетиламиногруппа, метоксикарбамоильная группа.

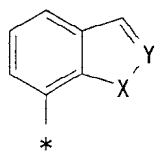
2. Производное лактама по п.1, представленное следующей формулой (1-1), или его фармацевтически приемлемая соль:



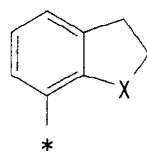
(1-1)

где R означает низшую алкильную группу или низшую алкоксильную группу, которые могут быть замещены одним-тремя заместителями (выбираемыми из заместителей группы 1 по п.1); и

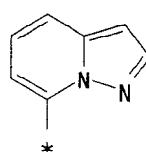
A означает любую из органических групп следующих формул (2)-(7):



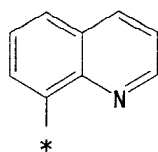
(2)



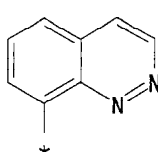
(3)



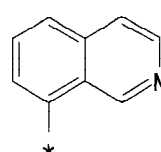
(4)



(5)



(6)



(7)

где, в формулах (2) и (3), X означает O, S или NH, и Y означает N или CR', при этом, R' означает атом водорода или низшую алкильную группу, низшую

алкенильную группу, низшую алкинильную группу, низшую алкоксильную группу, низшую алкилтиогруппу, низшую алкиламиногруппу, галоген, нитрогруппу или цианогруппу, которые могут иметь один-три заместителя (выбираемые из заместителей группы 1 по п.1).

3. Производное лактама или его фармацевтически приемлемая соль по п.2, где R означает метильную группу, этильную группу, циклопропильную группу, гидроксиметильную группу, метоксиметильную группу, дифторметильную группу, трифторметильную группу или метоксильную группу в формуле (1-1).

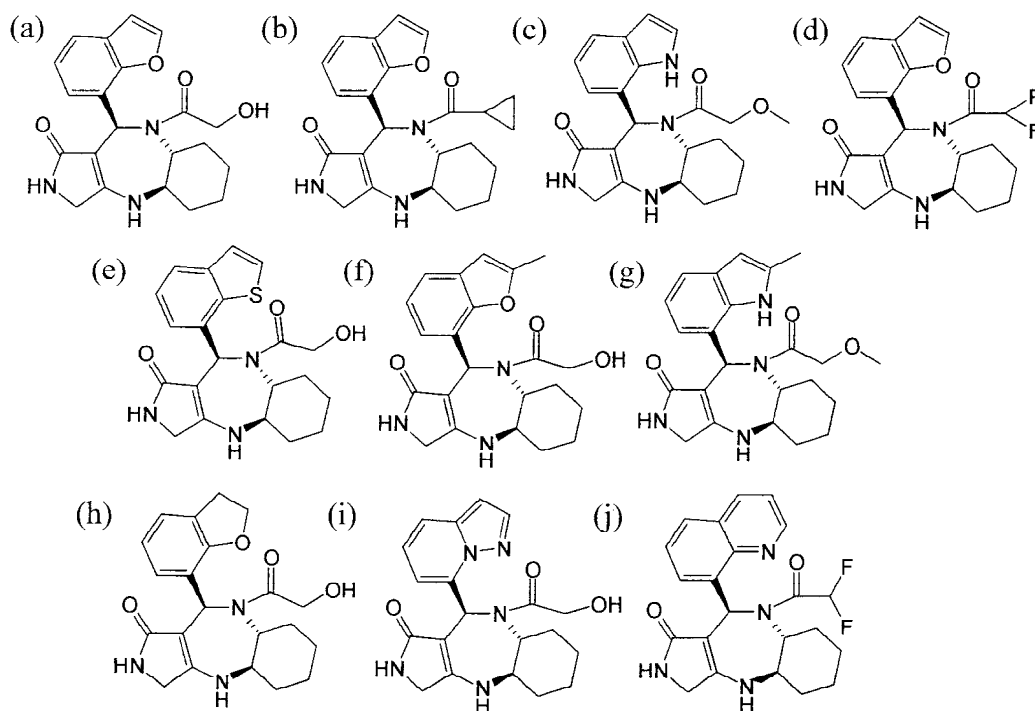
4. Производное лактама или его фармацевтически приемлемая соль по п.2, где A представляет собой органическую группу, представленную формулами (2), (3), (4) или (5) в формуле (1-1).

5. Производное лактама или его фармацевтически приемлемая соль по п.2, где A представляет собой органическую группу, представленную формулой (2) в формуле (1-1), и Y означает CR' в формуле (2).

6. Производное лактама или его фармацевтически приемлемая соль по п.2, где A представляет собой органическую группу, представленную формулой (2) в формуле (1-1), и Y означает CR', и R' означает атом водорода или низшую алкильную группу в формуле (2).

7. Производное лактама или его фармацевтически приемлемая соль по п.2, где A представляет собой органическую группу, представленную формулой (5) в формуле (1-1).

8. Производное лактама или его фармацевтически приемлемая соль по п.2, где соединение, представленное формулой (1-1), выбирают из соединений группы, представленной следующими формулами (a)-(j):



9. Производное лактама или его фармацевтически приемлемая соль по п.8, где соединение, представленное формулой (1-1), является соединением, представленным формулой (a).

10. Производное лактама или его фармацевтически приемлемая соль по п.8, где соединение, представленное формулой (1-1), является соединением, представленным формулой (b).

11. Производное лактама или его фармацевтически приемлемая соль по п.8, где

соединение, представленное формулой (1-1), является соединением, представленным формулой (с).

12. Производное лактама или его фармацевтически приемлемая соль по п.8, где соединение, представленное формулой (1-1), является соединением, представленным формулой (d).

13. Производное лактама или его фармацевтически приемлемая соль по п.8, где соединение, представленное формулой (1-1), является соединением, представленным формулой (e).

14. Производное лактама или его фармацевтически приемлемая соль по п.8, где соединение, представленное формулой (1-1), является соединением, представленным формулой (f).

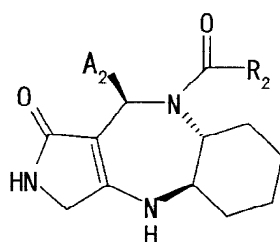
15. Производное лактама или его фармацевтически приемлемая соль по п.8, где соединение, представленное формулой (1-1), является соединением, представленным формулой (g).

16. Производное лактама или его фармацевтически приемлемая соль по п.8, где соединение, представленное формулой (1-1), является соединением, представленным формулой (h).

17. Производное лактама или его фармацевтически приемлемая соль по п.8, где соединение, представленное формулой (1-1), является соединением, представленным формулой (i).

18. Производное лактама или его фармацевтически приемлемая соль по п.8, где соединение, представленное формулой (1-1), является соединением, представленным формулой (j).

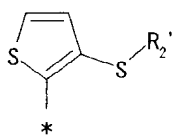
19. Производное лактама, представленное следующей формулой (1-2), или его фармацевтически приемлемая соль:



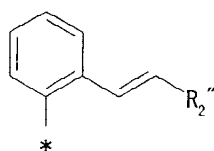
(1-2)

где R₂ означает метильную группу, этильную группу, циклопропильную группу, гидроксиметильную группу, метоксиметильную группу, диформетильную группу, триформетильную группу или метоксигруппу, и

A₂ означает любую из следующих формул (2-2) и (3-2):



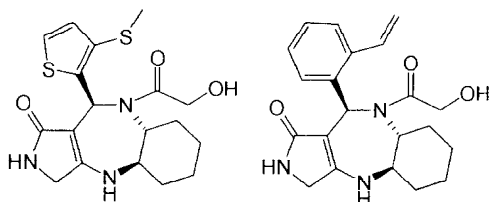
(2-2)



(3-2)

где, в формуле (2-2), R₂' означает низшую алкильную группу, и, в формуле (3-2), R₂'' означает атом водорода или низшую алкильную группу.

20. Производное лактама или его фармацевтически приемлемая соль по п.19, выбираемые из группы соединений, представленных следующими формулами:



21. Агент, усиливающий транспорт сахара, содержащий, в качестве активного ингредиента, производное лактама или его фармацевтически приемлемую соль по любому из пп.1-20.

22. Гипогликемический агент, содержащий в качестве активного ингредиента производное лактама или его фармацевтически приемлемую соль по любому из пп.1-20.

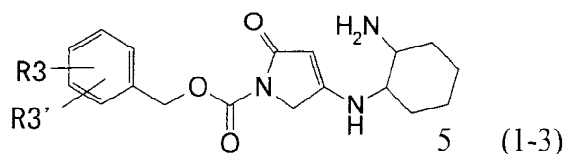
23. Агент для предупреждения и/или лечения сахарного диабета, диабетической периферической невропатии, диабетической нефропатии, диабетической ретинопатии, диабетического макроваскулярного заболевания, аномалии толерантности к глюкозе или ожирения, содержащий в качестве активного ингредиента производное лактама или его фармацевтически приемлемую соль по любому из пп.1-20.

24. Лекарственное средство, содержащее в качестве активного ингредиента производное лактама или его фармацевтически приемлемую соль по любому из пп.1-20.

25. Фармацевтическая композиция, содержащая в качестве активного ингредиента производное лактама или его фармацевтически приемлемую соль по любому из пп.1-20.

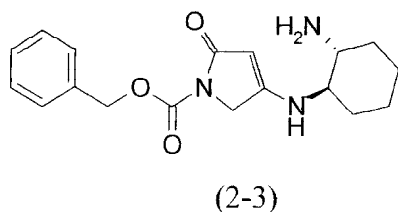
26. Применение производного лактама или его фармацевтически приемлемой соли по любому из пп.1-20 для получения гипогликемического агента.

27. Производное циклогексана, представленное следующей формулой (1-3), или его соль с химически приемлемыми кислотами:

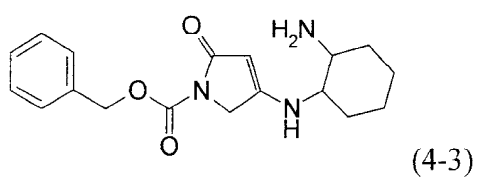
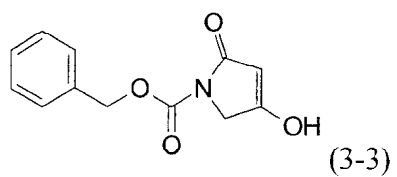


где R3 и R3', каждый, независимо, означают атом водорода, нитрогруппу, низшую алкоксильную группу, галоген или низшую алкильную группу.

28. Соединение, представленное следующей формулой (2-3), где R3 и R3' означают атомы водорода в формуле (1-3) по п.27, и конфигурацией части 2-аминоциклогексиламиногруппы является (1R,2R), или его соль с химически приемлемыми кислотами:



29. Способ получения соединения, представленного формулой (4-3), или его соли с химически приемлемыми кислотами, где соединение, представленное формулой (3-3), вводят во взаимодействие с 1,2-диаминоциклогексаном:



RU 2007144076 A

RU 2007144076 A