

【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25年5月16日 (2013.5.16)

【公表番号】特表2012-526096(P2012-526096A)

【公表日】平成24年10月25日 (2012.10.25)

【年通号数】公開・登録公報2012-044

【出願番号】特願2012-509115(P2012-509115)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 491/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/12 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 19/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/14 C S P

C 0 7 D 491/08

A 6 1 K 31/506

C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z

C 0 7 D 519/00 3 0 1

C 0 7 D 487/04 1 4 0

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/10 1 0 3

A 6 1 P 3/08

A 6 1 P	9/04	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	27/12	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	7/02	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	15/10	
A 6 1 P	19/04	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/18	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 K	45/00	

【手続補正書】

【提出日】平成25年4月1日(2013.4.1)

【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

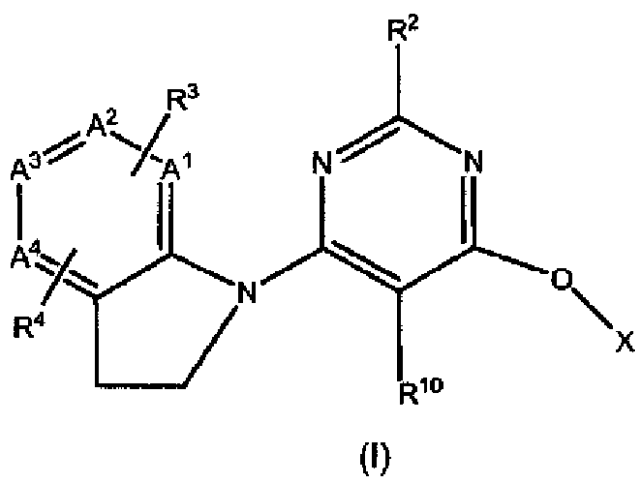
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

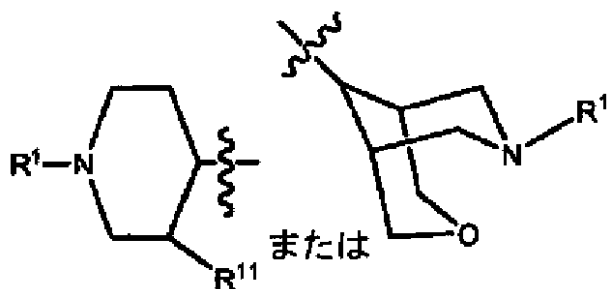
式 (I) の化合物

【化 1】



[式中、
X は、

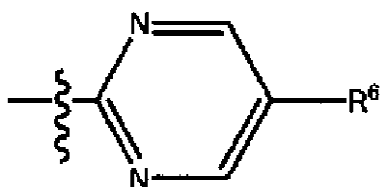
【化 2】



であり、

R^1 は、 $-C(O)-O-R^5$ または

【化 3】



であり、

R^2 は、水素、シアノ、またはメチルであり、

R^3 は、水素、OH、ハロゲン、シアノ、 CF_3 、 OCF_3 、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、または $C_1 \sim C_5$ アルキルであり、

R^4 は、 SO_2-R^7 または $-NH-(CH_2)_2-OH$ であり、

R^5 は、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、またはシクロアルキル部分の 1 個の炭素原子がメチルもしくはエチルで置換されていてもよい $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、

R^6 は、 CF_3 、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、ハロゲン、シアノ、または $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、

R^7 は、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 NH_2 、または $-(CH_2)_2-OH$ であり、

R^8 は、水素または $C_1 \sim C_5$ アルキルであり、

R^9 は、水素、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-CH_2-CH_2-OH$ 、 $-CH_2-CH_2-O-CH_3$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-O-CH_3$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-OH$ 、3-オキセタニル、または 3-ヒドロキシシクロブチルであり、

R^{10} は、水素、シアノ、ニトロ、 CF_3 、 OCF_3 、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、または $C_1 \sim C_5$ アルキルであり、

R^{11} は、水素、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、またはハロゲンであり、

A^1 、 A^2 、 A^3 および A^4 は、それぞれ独立に、 CH 、 N -オキシド、または N であり、

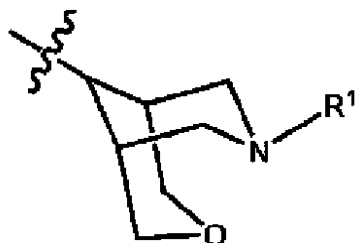
但し、

d) A^1 、 A^2 、 A^3 および A^4 の 2 つ以下が、 N であり、

e) A^1 、 A^2 、 A^3 および A^4 の 1 つ以下が、 N -オキシドであり、

f) $A^1 \sim A^4$ がフェニル環を形成するとき、 X は

【化 4】



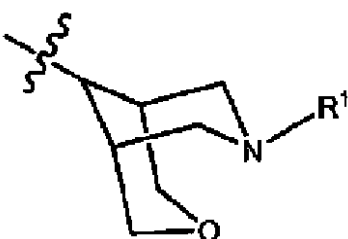
である]

または薬学的に許容できるその塩。

【請求項 2】

X が

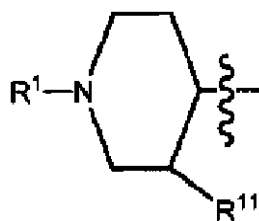
【化 5】

である、請求項 1 に記載の化合物 または薬学的に許容できるその塩。

【請求項 3】

X が

【化 6】

である、請求項 1 に記載の化合物 または薬学的に許容できるその塩。

【請求項 4】

A¹ ~ A⁴ が、A¹、A²、A³ および A⁴ の 1 つまたは 2 つが N である環を形成している、請求項 1、2、または 3 に記載の化合物 または薬学的に許容できるその塩。

【請求項 5】

A¹ ~ A⁴ がピリジル環を形成している、請求項 1、2、3 または 4 に記載の化合物 または薬学的に許容できるその塩。

【請求項 6】

R⁴ が -SO₂-R⁷ である、請求項 1 から 5 のいずれかに記載の化合物 または薬学的に許容できるその塩。

【請求項 7】

R¹ が -C(O)-O-R⁵ アルキルである、請求項 1 から 6 のいずれかに記載の化合物 または薬学的に許容できるその塩。

【請求項 8】

R³ がフルオロまたは水素である、請求項 1 から 7 のいずれかに記載の化合物 または薬学的に許容できるその塩。

【請求項 9】

R² が水素またはシアノである、請求項 1 から 8 のいずれかに記載の化合物 または薬学

的に許容できるその塩。

【請求項 10】

9 - アンチ - ({ 6 - [5 - (メチルスルホニル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 1 - イル] ピリミジン - 4 - イル } オキシ) - 3 - オキサ - 7 - アザビシクロ [3 . 3 . 1] ノナン - 7 - カルボン酸イソプロピル、および

9 - シン - ({ 6 - [5 - (メチルスルホニル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 1 - イル] ピリミジン - 4 - イル } オキシ) - 3 - オキサ - 7 - アザビシクロ [3 . 3 . 1] ノナン - 7 - カルボン酸イソプロピル

からなる群から選択される化合物または薬学的に許容できるその塩。

【請求項 11】

少なくとも 1 種の薬学的に許容できる賦形剤と混和された、治療有効量で存在する請求項 1 から 10 のいずれかに記載の化合物 または薬学的に許容できるその塩 を含む医薬組成物。

【請求項 12】

抗肥満薬および抗糖尿病薬からなる群から選択される少なくとも 1 種の追加の薬剤をさらに含む、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 13】

前記抗肥満薬が、ジルロタピド、ミトラタピド、イミブリタピド、R 5 6 9 1 8 (C A S 番号 4 0 3 9 8 7)、C A S 番号 9 1 3 5 4 1 - 4 7 - 6、ロルカセリン、セチリスタット、P Y Y₃ - 3 6、ナルトレキソン、オレオイル - エストロン、オビネピチド、プラムリンチド、テソフェンシン、レブチン、リラグルチド、プロモクリブチン、オルリスタット、エクセナチド、A O D - 9 6 0 4 (C A S 番号 2 2 1 2 3 1 - 1 0 - 3)、およびシブトラミンからなる群から選択される、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 14】

前記抗糖尿病薬が、メトホルミン、アセトヘキサミド、クロルプロパミド、ジアビネース、グリベンクラミド、グリビジド、グリブリド、グリメピリド、グリクラジド、グリペンチド、グリキドン、グリソラミド、トラザミド、トルブタミド、テンダミスタット、トレスタチン、アカルボース、アジポシン、カミグリボース、エミグリテート、ミグリトール、ボグリボース、ブラジミシン Q、サルボスタチン、バラグリタゾン、シグリタゾン、ダルグリタゾン、エングリタゾン、イサグリタゾン、ピオグリタゾン、ロシグリタゾン、トログリタゾン、エキセンディン 3、エキセンディン 4、トロダスケミン、レセルバトロール、ヒルチオサル抽出物、シタグリブチン、ビルダグリブチン、アログリブチン、およびサクサグリブチンからなる群から選択される、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 15】

代謝性または代謝関連の疾患、状態、または障害の治療に用いるための、請求項 11 から 14 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 16】

高脂血症、I 型糖尿病、II 型糖尿病、特発性 I 型糖尿病 (I b 型)、成人潜在性自己免疫性糖尿病 (L A D A)、早発性 2 型糖尿病 (E O D)、若年性非定型糖尿病 (Y O A D)、若年発症成人型糖尿病 (M O D Y)、栄養不良関連糖尿病、妊娠糖尿病、冠動脈心疾患、虚血発作、血管形成術後の再狭窄、末梢血管疾患、間欠性跛行、心筋梗塞、異脂血症、食後脂肪血症、耐糖能障害 (I G T) 状態、空腹時血漿グルコース異常状態、代謝性アシドーシス、ケトーシス、関節炎、肥満、骨粗鬆症、高血圧、うっ血性心不全、左室肥大、末梢動脈疾患、糖尿病性網膜症、黄斑変性、白内障、糖尿病性腎症、糸球体硬化症、慢性腎不全、糖尿病性ニューロパシー、メタボリック症候群、シンドローム X、月経前症候群、冠動脈心疾患、狭心症、血栓症、アテローム性動脈硬化症、心筋梗塞、一過性脳虚血発作、卒中、血管再狭窄、高血糖、高インスリン血症、高脂血症、高トリグリセリド血症、インスリン抵抗性、グルコース代謝障害、耐糖能障害状態、空腹時血漿グルコース異常状態、肥満、勃起機能不全、皮膚および結合組織の障害、足の潰瘍化および潰瘍性大腸炎、内皮障害および血管伸展性の障害、高アポ B リポタンパク質血症、アルツハイマー病

、統合失調症、認知障害、炎症性腸疾患、潰瘍性大腸炎、クローン病、ならびに過敏性腸症候群からなる群から選択される状態の治療に用いるための、請求項 1 1 から 1 4 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 1 7】

G タンパク質共役受容体 G P R 1 1 9 の活性を調節する疾患、状態、または障害の治療に用いるための、請求項 1 1 から 1 4 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 1 8】

糖尿病または前記糖尿病に付随する病的状態の治療に用いるための、請求項 1 1 から 1 4 のいずれか一項に記載の組成物。