

【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3月29日(2007.3.29)

【公表番号】特表2006-520755(P2006-520755A)

【公表日】平成18年9月14日(2006.9.14)

【年通号数】公開・登録公報2006-036

【出願番号】特願2006-502992(P2006-502992)

【国際特許分類】

C 0 7 C 323/49 (2006.01)
 C 0 7 D 333/62 (2006.01)
 A 6 1 K 31/381 (2006.01)
 C 0 7 D 307/82 (2006.01)
 A 6 1 K 31/343 (2006.01)
 C 0 7 D 213/70 (2006.01)
 A 6 1 K 31/44 (2006.01)
 C 0 7 D 231/18 (2006.01)
 A 6 1 K 31/415 (2006.01)
 C 0 7 D 263/32 (2006.01)
 A 6 1 K 31/421 (2006.01)
 A 6 1 K 31/192 (2006.01)
 C 0 7 D 319/18 (2006.01)
 A 6 1 K 31/357 (2006.01)
 C 0 7 D 409/04 (2006.01)
 A 6 1 K 31/506 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4436 (2006.01)
 A 6 1 K 31/422 (2006.01)
 C 0 7 D 271/12 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4245 (2006.01)
 C 0 7 D 277/20 (2006.01)
 C 0 7 D 277/36 (2006.01)
 A 6 1 K 31/426 (2006.01)
 A 6 1 P 3/10 (2006.01)
 A 6 1 P 3/06 (2006.01)
 A 6 1 P 9/04 (2006.01)
 A 6 1 P 9/12 (2006.01)
 A 6 1 P 3/04 (2006.01)
 C 0 7 D 213/74 (2006.01)
 A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
 C 0 7 D 207/48 (2006.01)
 A 6 1 K 31/40 (2006.01)
 C 0 7 D 209/08 (2006.01)
 A 6 1 K 31/404 (2006.01)
 C 0 7 D 209/48 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4035 (2006.01)
 C 0 7 D 401/12 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
 C 0 7 D 413/04 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4155 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 323/49
C 0 7 D 333/62 C S P
A 6 1 K 31/381
C 0 7 D 307/82
A 6 1 K 31/343
C 0 7 D 213/70
A 6 1 K 31/44
C 0 7 D 231/18
A 6 1 K 31/415
C 0 7 D 263/32
A 6 1 K 31/421
A 6 1 K 31/192
C 0 7 D 319/18
A 6 1 K 31/357
C 0 7 D 409/04
A 6 1 K 31/506
A 6 1 K 31/4436
A 6 1 K 31/422
C 0 7 D 271/12
A 6 1 K 31/4245
C 0 7 D 277/36
A 6 1 K 31/426
A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 3/06
A 6 1 P 9/04
A 6 1 P 9/12
A 6 1 P 3/04
C 0 7 D 213/74
A 6 1 K 31/5377
C 0 7 D 207/48
A 6 1 K 31/40
C 0 7 D 209/08
A 6 1 K 31/404
C 0 7 D 209/48 Z
A 6 1 K 31/4035
C 0 7 D 401/12
A 6 1 K 31/4439
C 0 7 D 413/04
A 6 1 K 31/4155

【手続補正書】

【提出日】平成19年2月7日(2007.2.7)

【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】

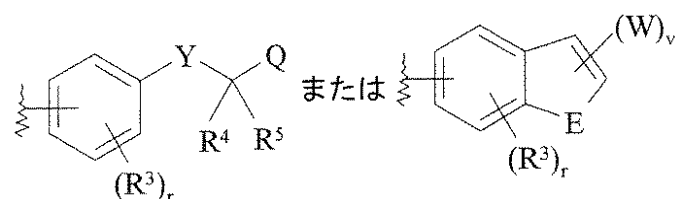
【請求項1】

構造式I：

$$\text{Z}-(\text{CH}_2)_m-\text{S}(=\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^1)-[\text{C}(\text{R}^{1a})(\text{R}^{1b})]_n-\text{C}(\text{R}^2)(\text{R}^{2a})-\text{X}-\text{A}$$

A

【化 3】



W は

$$\begin{array}{c} \text{Y} \quad \text{Q} \\ \diagdown \quad \diagup \\ \text{C} \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{R}^4 \quad \text{R}^5 \end{array}$$

Z は

- 員へテロアリアル、

- f) ヘテロ環基であり、

p は 1 または 2 であり、

r は 1、2、3 または 4 であり、

v は 1 または 2 であり、

R^1 は水素（ここに、 Z がフェニルまたはナフチルであり、 R^2 が水素であるとき、 R^1 は水素でない）、ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル - $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキル - アリール、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、アリールであるか、または R^1 および R^2 は一緒になって、5 ~ 8 員ヘテロ環基を形成し、そしてここに、アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびアルコキシは、 R^{15} から独立して選択される 1 つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

R^{1a} および R^{1b} はそれぞれ、独立して水素、 $C_1 - C_6$ アルキルであるか、または R^1 と R^{1a} 、 R^1 と R^{1b} 、 R^2 と R^{1a} 、 R^2 と R^{1b} もしくは R^{1a} と R^{1b} は一緒になって、3 ~ 6 員ヘテロ環基もしくは炭素環基（ここに、 R^{1a} および R^{1b} のうち少なくとも 1 つは水素でない）を形成し、

R^2 は水素、ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル - $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキル - アリール、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、アリールであるか、または R^1 および R^2 は一緒になって、5 ~ 8 員ヘテロ環基を形成し、そしてここに、アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびアルコキシは、 R^{15} から独立して選択される 1 つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

R^{2a} は水素、ハロまたは $C_1 - C_6$ アルキルであり、そしてここに、 R^2 および R^{2a} は一緒になって、3 ~ 8 員環を形成し、アルキルは R^{15} から独立して選択される 1 つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

R^3 は水素、ハロ、シアノ、ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4$ アルキル) ヘテロ環基（ここに、ヘテロ環基はオキソで適宜置換されていてもよい）、 $(C_1 - C_4$ アルキル) - $NR^7C(O)_pR^9$ であり、そしてここに、アルキル、シクロアルキルおよびヘテロ環基は、 R^{15} から独立して選択される 1 つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

R^4 および R^5 はそれぞれ、独立して水素、ハロ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、アリールオキシ、 $N(R^8)_2$ 、 SR^8 であるか、または R^4 および R^5 は一緒になって、3 ~ 8 員環を形成し、

R^6 は水素、 $C_1 - C_6$ 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、 $C_1 - C_3$ アルキルニトリル、スルホンアミド、アシルスルホンアミドまたはテトラゾールであり、

R^7 は水素または $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^8 および R^9 はそれぞれ、独立して水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロ環基であり、そしてここに、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環基は、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、 $C_1 - C_6$ アルキルおよび $C_1 - C_6$ アルコキシからなる群から選択される 1 つ以上の置換基で適宜置換されていてもよく、

R^{14} は水素、アリール、 $C_1 - C_6$ アルキルまたは $C_1 - C_6$ アルキル - $COOR^6$ であり、そしてここに、アリールおよびアルキルは、 R^{15} から独立して選択される 1 つ以上の基で適宜置換されていてもよく、そして

R^{15} 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、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $N(R^8)_2$ 、 $NR^8S(O)_2R^9$ 、 $NR^8C(O)_pR^9$ 、 $C(O)NR^8R^9$ 、 $C(O)_pR^8$ 、 SR^8 、 $S(O)_pR^8$ または $S(O)_2NR^8R^9$ である] で示される化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

【請求項 2】

X および Y がそれぞれ、S および O、S および C、または C および O である、請求項 1

記載の化合物。

【請求項 3】

Z が $C_1 - C_6$ アルキル、アリールまたはヘテロアリールである、請求項 2 記載の化合物。

【請求項 4】

Z がフェニル、ナフチル、チオフェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、ピリジル、ベンゾチオフェニル、ベンゾフラニル、インドリル、イソインドリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1, 4 - ベンゾジオキサン、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイミダゾリルまたは 2, 3 - ジヒドロベンゾフラニルである、請求項 3 記載の化合物。

【請求項 5】

R^1 が $C_3 - C_6$ アルキルまたは $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキルであり、 R^2 および R^3 がそれぞれ独立して $C_1 - C_3$ アルキルであり、そして r が 1 である、請求項 4 記載の化合物。

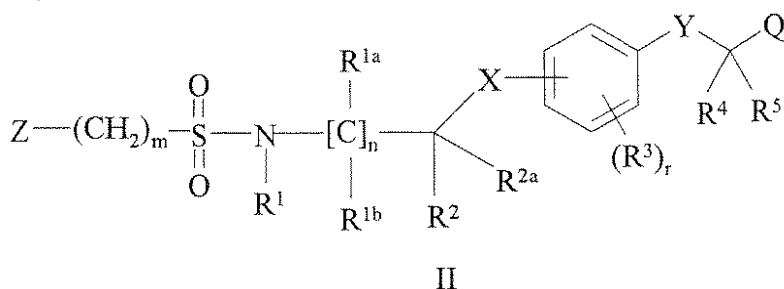
【請求項 6】

X が Y に対してパラ位にあり、 R^3 が Y に対してオルト位にある、請求項 5 記載の化合物。

【請求項 7】

構造式 I I :

【化 5】



[式中、

Q は $-C(O)OR^6$ または R^{6A} であり、

X は結合、C、O、S または $S[O]_p$ であり、

Y は結合、S、C または O であり、

Z は

a) 脂肪族基、

b) アリール、

c) N、O もしくは S から選択される少なくとも 1 つのヘテロ原子を含む、5 ~ 10 員ヘテロアリール、

d) 別のアリールで置換されているアリール、もしくはヘテロアリールで置換されているアリールとして定義されるビアリールであり、

e) 別のヘテロアリールで置換されているヘテロアリール、もしくはアリールで置換されているヘテロアリールとして定義されるビヘテロアリール、または

f) ヘテロ環基であり、

ここに、脂肪族基、アリール、ヘテロアリール、ビアリール、ビヘテロアリールおよびヘテロ環基は、 R^{15} から独立して選択される 1 つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

m および n' はそれぞれ、独立して 0、1、2、3 または 4 であり、

n は 0、1、2 または 3 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 はアリール、ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル - $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキル - アリール、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシであるか、または R^1 および R^2

は一緒になって、5～8員ヘテロ環基を形成し、そしてここに、アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびアルコキシは、 R^{15} から独立して選択される1つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

R^{1a} および R^{1b} はそれぞれ、独立して水素、 $C_1 - C_6$ アルキルであるか、または R^1 と R^{1a} 、 R^1 と R^{1b} 、 R^2 と R^{1a} 、 R^2 と R^{1b} もしくは R^{1a} と R^{1b} は一緒になって、3～6員ヘテロ環基または炭素環基（ここに、 R^{1a} および R^{1b} のうち少なくとも1つは水素でない）を形成し、

R^2 は水素、ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル- $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキル-アリール、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、アリールであるか、または R^1 および R^2 は一緒になって、5～8員ヘテロ環基を形成し、そしてここに、アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびアルコキシは、 R^{15} から独立して選択される1つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

R^{2a} は水素、ハロまたは $C_1 - C_6$ アルキルであり、そしてここに、 R^2 および R^{2a} は一緒になって、3～8員環を形成し、アルキルは R^{15} から独立して選択される1つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

R^3 は水素、ハロ、シアノ、ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4$ アルキル) $-$ ヘテロ環基（ここに、ヘテロ環基はオキソで適宜置換されていてもよい）、 $(C_1 - C_4$ アルキル) $-NR^7C(O)_pR^9$ であり、そしてここに、アルキル、シクロアルキルおよびヘテロ環基は、 R^{15} から独立して選択される1つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

R^4 および R^5 はそれぞれ、独立して水素、ハロ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、アリールオキシ、 $N(R^8)_2$ 、 SR^8 であるか、または R^4 および R^5 は一緒になって、3～8員環を形成し、

R^6 は水素、 $C_1 - C_6$ 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、 $C_1 - C_3$ アルキルニトリル、スルホンアミド、アシルスルホンアミドまたはテトラゾールであり、

R^7 は水素または $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^8 および R^9 はそれぞれ、独立して水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロ環基であり、そしてここに、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環基は、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、 $C_1 - C_6$ アルキルおよび $C_1 - C_6$ アルコキシからなる群から選択される1つ以上の置換基で適宜置換されていてもよく、

R^{15} 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、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $N(R^8)_2$ 、 $NR^8S(O)_2R^9$ 、 $NR^8C(O)_pR^9$ 、 $C(O)NR^8R^9$ 、 $C(O)_pR^8$ 、 SR^8 、 $S(O)_pR^8$ または $S(O)_2NR^8R^9$ である]で示される化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

【請求項 8】

XおよびYがそれぞれ、SおよびO、SおよびC、またはCおよびOである、請求項7記載の化合物。

【請求項 9】

Zが $C_1 - C_6$ アルキル、アリールまたはヘテロアリールである、請求項8記載の化合物。

【請求項 10】

Zがフェニル、ナフチル、チオフェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、ピリジル、ベンゾチオフェニル、ベンゾフラニル、インドリル、イソインドリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1,4-ベンゾジオキサン、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイミダゾリルまたは2,3-ジヒドロベンゾフラニルである、請求項9記載の化合物。

【請求項 1 1】

R^1 が $C_3 - C_6$ アルキルまたは $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキルであり、 R^2 および R^3 がそれぞれ、独立して $C_1 - C_3$ アルキルであり、そして r が 1 である、請求項 1 0 記載の化合物。

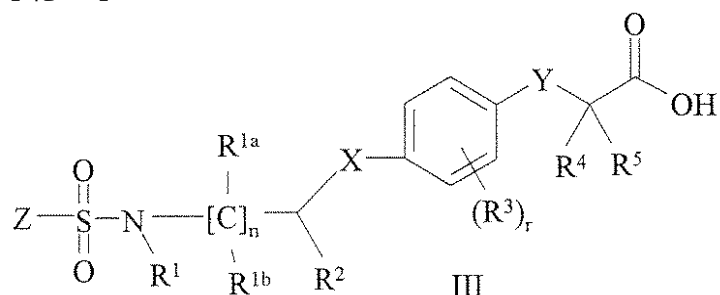
【請求項 1 2】

X が Y に対してパラ位にあり、 R^3 が Y に対してオルト位にある、請求項 1 1 記載の化合物。

【請求項 1 3】

構造式 I I I :

【化 6】



[式中、

n は 1 または 2 であり、

r は 1、2、3 または 4 であり、

X は S または C であり、

Y は C または O であり、

Z はアリールまたは 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり、ここに、アリールおよびヘテロアリールは、 R^{15} から独立して選択される 1 つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

R^1 および R^2 はそれぞれ、独立して $C_1 - C_6$ アルキルまたは $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキルであり、そして

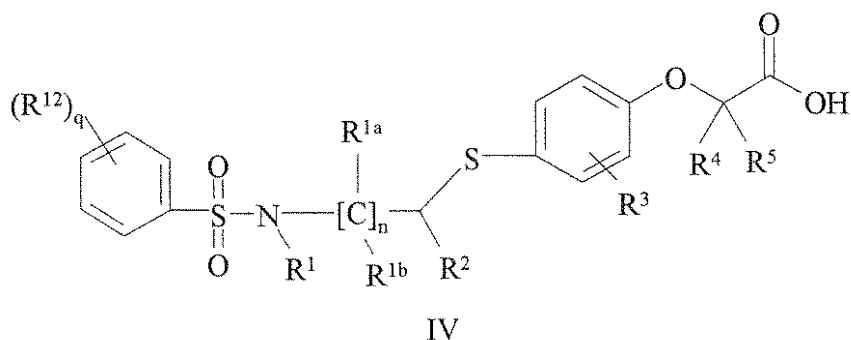
R^{1a} 、 R^{1b} 、 R^3 、 R^4 および R^5 はそれぞれ、独立して水素または $C_1 - C_6$ アルキルである]

で示される、請求項 7 記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

【請求項 1 4】

構造式 I V :

【化 7】



[式中、

q は 1、2、3、4 または 5 であり、

R^8 および R^9 はそれぞれ、独立して水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロ環基であり、ここに、アルキル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環基は、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、 $C_1 - C_6$ アルキルおよび $C_1 - C_6$ アルコキシからなる群が

ら選択される1つ以上の置換基で適宜置換されていてもよく、そして

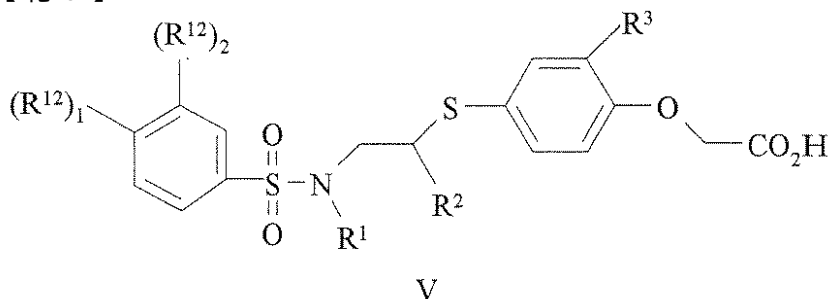
R^{12} は水素、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルキルオキシ、アリール、ヘテロアリール、アリールオキシ、オキソ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $N(R^8)_2$ 、 $NR^8S(O)_2R^9$ 、 $NR^8C(O)_pR^9$ 、 $C(O)NR^8R^9$ 、 $C(O)_pR^8$ 、 SR^8 、 $S(O)_pR^8$ または $S(O)_2NR^8R^9$ である]

で示される、請求項13記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

【請求項15】

構造式V：

【化8】



[式中、

R^1 および R^2 はそれぞれ、独立して $C_1 - C_4$ アルキルまたは $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキルであり、

R^3 は $C_1 - C_4$ アルキルであり、

$(R^{12})_1$ はハロ、ハロアルキルまたはハロアルキルオキシであり、そして

$(R^{12})_2$ はF、ClまたはBrである]

で示される、請求項14記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

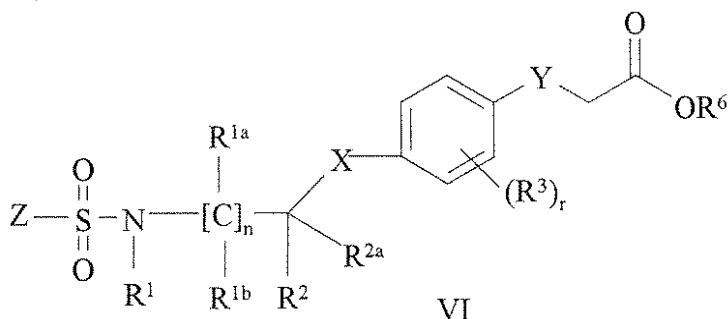
【請求項16】

R^1 がメチル、エチル、プロピル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、シクロブチルであり、 R^3 がメチルであり、そして $(R^{12})_1$ が OCF_3 である、請求項15記載の化合物。

【請求項17】

構造式VI：

【化9】



[式中、

Xは結合、C、O、Sまたは $S[O]_p$ であり、

Yは結合、S、CまたはOであり、

ZはN、OまたはSから選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含み、 R^{15} から選択される1つ以上の基で適宜置換されていてもよい、ヘテロアリールであり、

nは0、1、2または3であり、

n'は0、1、2、3または4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 は水素、ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル - $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキル - アリール、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、アリールであるか、または R^1 および R^2 は一緒になって、5 ~ 8 員ヘテロ環基を形成し、そしてここに、アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびアルコキシは、 R^{15} から独立して選択される 1 つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

R^{1a} および R^{1b} はそれぞれ、独立して水素、 $C_1 - C_6$ アルキルであるか、または R^1 と R^{1a} 、 R^1 と R^{1b} 、 R^2 と R^{1a} 、 R^2 と R^{1b} もしくは R^{1a} と R^{1b} は一緒になって、3 ~ 6 員ヘテロ環基もしくは炭素環基（ここに、 R^{1a} および R^{1b} のうち少なくとも 1 つは水素でない）を形成し、

R^2 は水素、ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル - $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキル - アリール、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、アリールであるか、または R^1 および R^2 は一緒になって、5 ~ 8 員ヘテロ環基を形成し、そしてここに、アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびアルコキシは、 R^{15} から独立して選択される 1 つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

R^{2a} は水素、ハロまたは $C_1 - C_6$ アルキルであり、そしてここに、 R^2 および R^{2a} は一緒になって、3 ~ 8 員環を形成し、アルキルは R^{15} から独立して選択される 1 つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

R^3 は水素、ハロ、シアノ、ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4$ アルキル) - ヘテロ環基（ここに、ヘテロ環基はオキソで適宜置換されていてもよい）、 $(C_1 - C_4$ アルキル) - $NR^7C(O)_pR^9$ であり、そしてここに、アルキル、シクロアルキルおよびヘテロ環基は、 R^{15} から独立して選択される 1 つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

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

R^7 は水素または $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^8 および R^9 はそれぞれ、独立して水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロ環基であり、そしてここに、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環基は、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、 $C_1 - C_6$ アルキルおよび $C_1 - C_6$ アルコキシからなる群から選択される 1 つ以上の置換基で適宜置換されていてもよく、そして

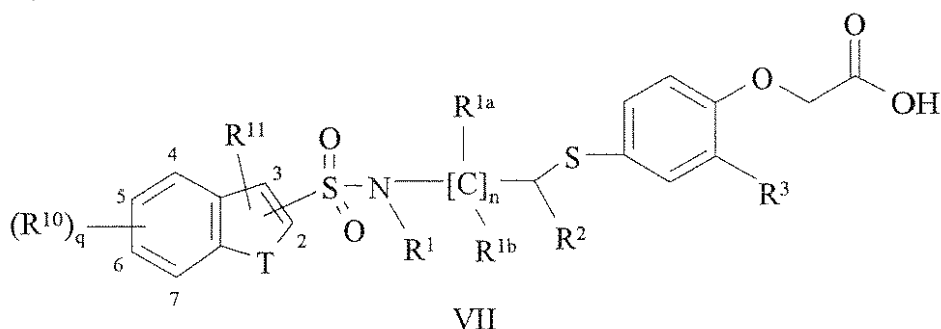
R^{15} は水素、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルキルオキシ、アリールオキシ、オキソ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $N(R^8)_2$ 、 $NR^8S(O)_2R^9$ 、 $NR^8C(O)_pR^9$ 、 $C(O)NR^8R^9$ 、 $C(O)_pR^8$ 、 SR^8 、 $S(O)_pR^8$ または $S(O)_2NR^8R^9$ である]

で示される化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

【請求項 18】

構造式 V I I :

【化 10】



[式中、

q は 1、2、3 または 4 であり、

T は O、N R^{1c} または S であり、

R^{1c} は水素または C₁ - C₆ アルキルであり、

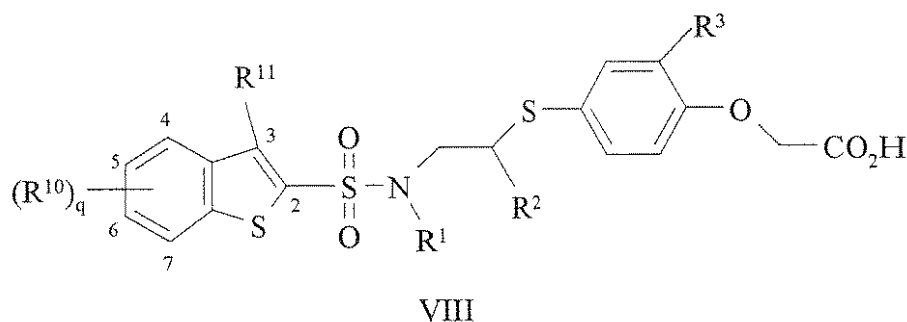
R¹⁰ および R¹¹ はそれぞれ、独立して水素、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルキルオキシ、アリールオキシ、C₁ - C₆ アルキルまたは C₁ - C₆ アルコキシであり、そしてここに、アルキル、アリールオキシおよびアルコキシは R¹⁵ から独立して選択される 1 つ以上の基で適宜置換されていてもよい]

で示される、請求項 17 記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

【請求項 19】

構造式 VII I I I :

【化 11】



[式中、

q は 1 または 2 であり、

R¹ は C₃ - C₅ アルキルまたは (CH₂)_n - C₃ - C₆ シクロアルキルであり、

R² および R³ はそれぞれ、独立して C₁ - C₃ アルキルであり、

R¹⁰ はハロ、ハロアルキルまたは C₁ - C₃ アルキルであり、そしてここに、R¹⁰ はベンゾチオフェニル環の 5 位もしくは 6 位にて、または 5 位と 6 位の両方にて置換されており、そして

R¹¹ は水素または C₁ - C₆ アルキルである]

で示される、請求項 18 記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

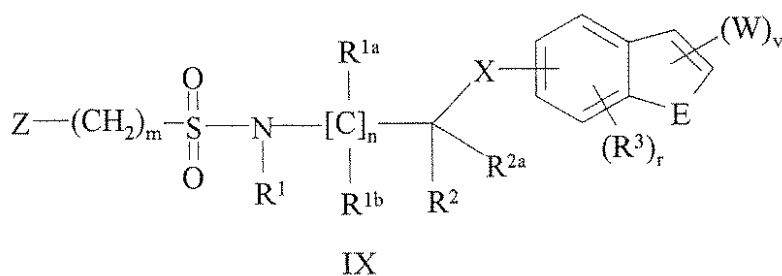
【請求項 20】

R¹⁰ が Cl、F、Br、CH₃ または CF₃ であり、ベンゾチオフェニル環の 5 位にて置換されている、請求項 19 記載の化合物。

【請求項 21】

構造式 I X :

【化 1 2】

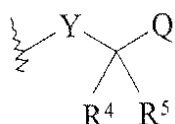


[式中、

E は O、S または N R¹⁴ であり、

W は

【化 1 3】



水素、C₁ - C₆アルキル、(CH₂)_{n'} - C₃ - C₆シクロアルキル、ハロアルキルまたはアシルであり、

Q は - C(O) O R⁶ または R^{6A} であり、X は結合、C、O、S または S [O]_p であり、

Y は結合、S、C または O であり、

Z は

a) 脂肪族基、

b) アリール、

c) N、O もしくは S から選択される少なくとも 1 つのヘテロ原子を含む、5 ~ 10 員ヘテロアリール、

d) 別のアリールで置換されているアリール、もしくはヘテロアリールで置換されているアリールとして定義されるビアリール、

e) 別のヘテロアリールで置換されているヘテロアリール、もしくはアリールで置換されているヘテロアリールとして定義されるビヘテロアリール、または

f) ヘテロ環基であり、

ここに、脂肪族基、アリール、ヘテロアリール、ビアリール、ビヘテロアリールおよびヘテロ環基は、R¹⁵ から独立して選択される 1 つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

m および n' はそれぞれ、独立して 0、1、2、3 または 4 であり、

n は 0、1、2 または 3 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、

v は 1 または 2 であり、

R¹ は水素、ハロアルキル、C₁ - C₆アルキル、C₁ - C₆アルキル - C₁ - C₆アルコキシ、C₁ - C₆アルキル - アリール、C₂ - C₆アルケニル、C₂ - C₆アルキニル、(CH₂)_{n'} - C₃ - C₆シクロアルキル、C₁ - C₆アルコキシ、アリールであるか、または R¹ および R² は一緒になって、5 ~ 8 員ヘテロ環基を形成し、そしてここに、アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびアルコキシは、R¹⁵ から独立して選択される 1 つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

R^{1a} および R^{1b} はそれぞれ、独立して水素、C₁ - C₆アルキルであるか、または R¹ と R^{1a}、R¹ と R^{1b}、R² と R^{1a}、R² と R^{1b} もしくは R^{1a} と R^{1b} は一緒になって、3 ~ 6 員ヘテロ環基もしくは炭素環基（ここに、R^{1a} および R^{1b} のうち少なくとも 1 つは水素でない）を形成し、

R² は水素、ハロアルキル、C₁ - C₆アルキル、C₁ - C₆アルキル - C₁ - C₆アルコキシ

シ、 $C_1 - C_6$ アルキル・アリール、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、アリールであるか、または R^1 および R^2 は一緒になって、5～8員ヘテロ環基を形成し、そしてここに、アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびアルコキシは、 R^{15} から独立して選択される1つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

R^{2a} は水素、ハロまたは $C_1 - C_6$ アルキルであり、そしてここに、 R^2 および R^{2a} は一緒になって、3～8員環を形成し、アルキルは R^{15} から独立して選択される1つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

R^3 は水素、ハロ、シアノ、ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4$ アルキル) $-$ ヘテロ環基(ここに、ヘテロ環基はオキソで適宜置換されていてもよい)、 $(C_1 - C_4$ アルキル) $-NR^7C(O)_pR^9$ であり、そしてここに、アルキル、シクロアルキルおよびヘテロ環基は、 R^{15} から独立して選択される1つ以上の基で適宜置換されていてもよく、

R^4 および R^5 はそれぞれ、独立して水素、ハロ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、アリールオキシ、 $N(R^8)_2$ 、 SR^8 であるか、または R^4 および R^5 は一緒になって、3～8員環を形成し、

R^6 は水素、 $C_1 - C_6$ 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、 $C_1 - C_3$ アルキルニトリル、スルホンアミド、アシルスルホンアミドまたはテトラゾールであり、

R^7 は水素または $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^8 および R^9 はそれぞれ、独立して水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロ環基であり、そしてここに、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環基は、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、 $C_1 - C_6$ アルキルおよび $C_1 - C_6$ アルコキシからなる群から選択される1つ以上の置換基で適宜置換されていてもよく、

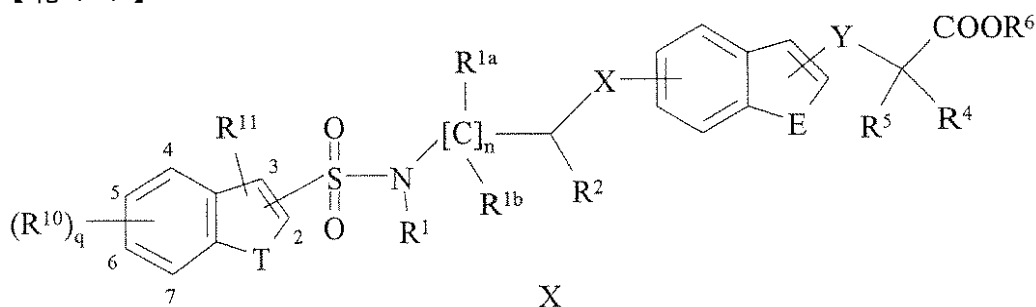
R^{14} は水素、アリール、 $C_1 - C_6$ アルキルまたは $C_1 - C_6$ アルキル $-COOR^6$ であり、そしてここに、アリールおよびアルキルは、 R^{15} から独立して選択される1つ以上の基で適宜置換されていてもよく、そして

R^{15} 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、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $N(R^8)_2$ 、 $NR^8S(O)_2R^9$ 、 $NR^8C(O)_pR^9$ 、 $C(O)NR^8R^9$ 、 $C(O)_pR^8$ 、 SR^8 、 $S(O)_pR^8$ または $S(O)_2NR^8R^9$ である]で示される化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

【請求項 22】

構造式 X :

【化 14】



[式中、

n および q はそれぞれ、独立して 1、2、3 または 4 であり、

T は O 、 NR^{10} または S であり、

X は C 、 O または S であり、

R^1 は水素、 $C_1 - C_6$ アルキルまたは $(CH_2)_n - C_3 - C_6$ シクロアルキルであり、
 R^{1a} 、 R^{1b} 、 R^{1c} および R^2 はそれぞれ、独立して水素または $C_1 - C_6$ アルキルであり、

、そして

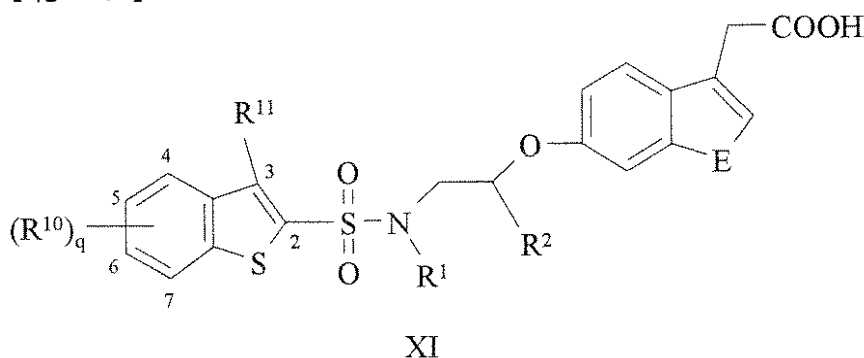
R^{10} および R^{11} はそれぞれ、独立して水素、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルキルオキシ、アリールオキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルまたは $C_1 - C_6$ アルコキシであり、そしてここに、アルキル、アルコキシおよびアリールオキシは、 R^{15} から選択される 1 つ以上の基で適宜置換されていてもよい]

で示される、請求項 2 1 記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

【請求項 2 3】

構造式 X I :

【化 1 5】



[式中、

q は 1 または 2 であり、

E は O、S または NR^{14} であり、

R^1 、 R^2 および R^{11} はそれぞれ、独立して $C_1 - C_4$ アルキルであり、

R^{10} は Cl、F、Br、 CH_3 または CF_3 であり、そしてここに、 R^{10} はベンゾチオフェニル環の 5 位もしくは 6 位にて、または 5 位と 6 位の両方にて置換されており、そして
 R^{14} は水素、 $C_1 - C_6$ アルキルまたはアリールである]

で示される、請求項 2 2 記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物、水和物または立体異性体。

【請求項 2 4】

化合物番号 1 ~ 1 2 0 および 1 2 1 :

番号	構造	化合物名
1		3-(4-{2-[(5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]}エチルスルファニル}-2-メチル-フェニル)プロピオン酸
2		3-(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]}エチルスルファニル}-2-メチル-フェニル)プロピオン酸
3		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾフラン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]}-1-メチル-エトキシ)-2-メチル-フェノキシ)酢酸
4		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾフラン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]}-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
5		3-(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]}-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェニル)プロピオン酸

番号	構造	化合物名
1		3-(4-{2-[(5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]}エチルスルファニル)-2-メチル-フェニル)プロピオン酸
2		3-(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]}エチルスルファニル)-2-メチル-フェニル)プロピオン酸
3		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾフラン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]}-1-メチル-エトキシ)-2-メチル-フェノキシ)酢酸
4		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾフラン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]}-1-メチル-エチルスルファニル)-2-メチル-フェノキシ)酢酸
5		3-(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]}-1-メチル-エチルスルファニル)-2-メチル-フェニル)プロピオン酸

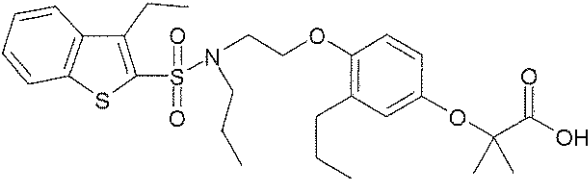
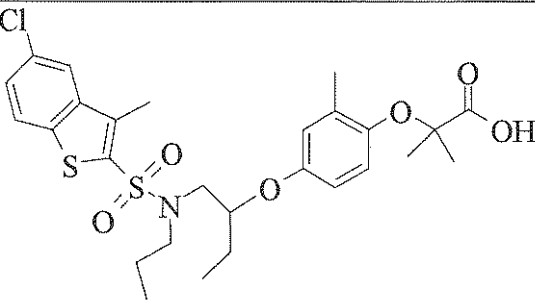
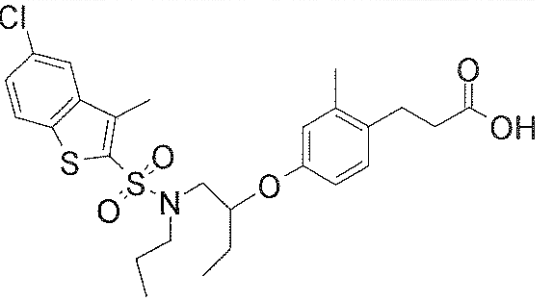
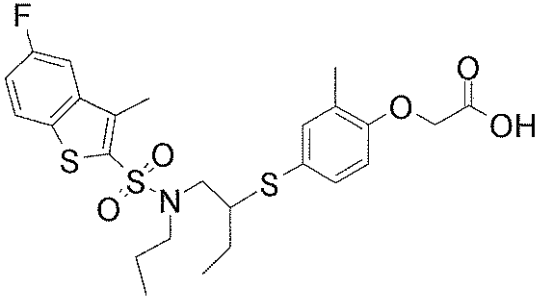
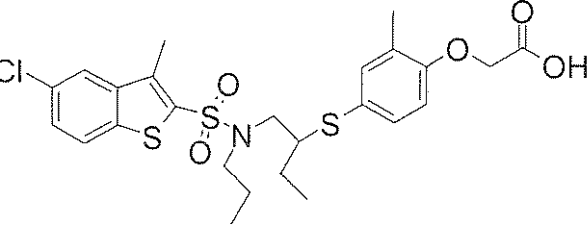
【表 2】

番号	構造	化合物名
6		(4-{2-[(5-クロロ-3-エチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
7		4-{2-[(6-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
8		4-{2-[(7-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
9		(4-{2-[(4-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
10		(4-{2-[(5-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
11		(4-{2-[(5-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エトキシ

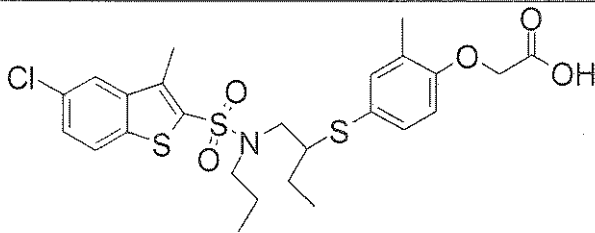
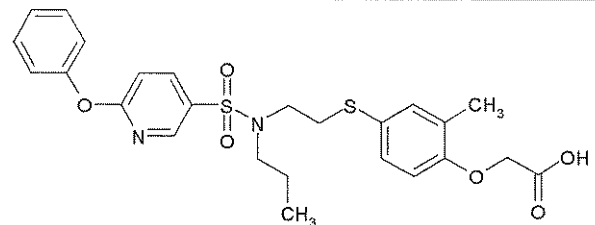
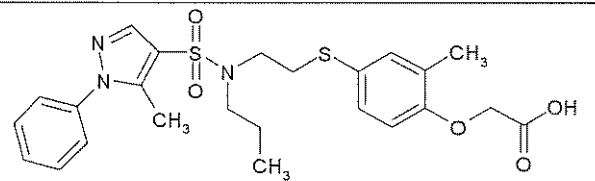
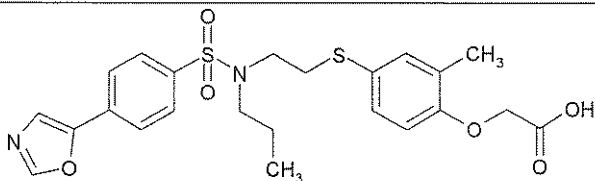
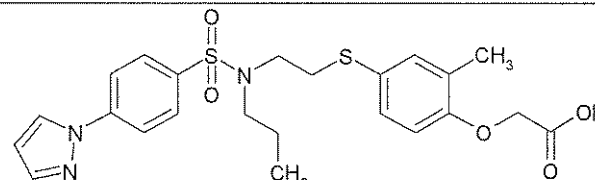
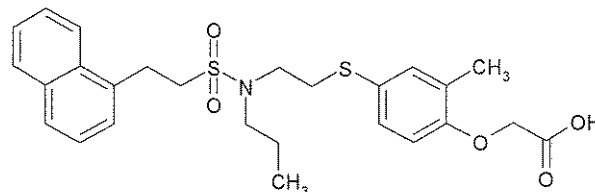
【表 3】

番号	構造	化合物名
		}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
12		2-[4-(3-{[5-(4'-フルオロ-ビフェニル-4-イル)チオフェン-2-スルホニル]プロピル-アミノ}プロピル)フェノキシ]-2-メチル-プロピオン酸
13		2-(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]エチル}フェノキシ)-2-メチル-プロピオン酸
14		2-(4-{3-[(3,5-ジメチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]プロピル}フェノキシ)-2-メチル-プロピオン酸
15		2-(4-{3-[(5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]プロピル}フェノキシ)-2-メチル-プロピオン酸
16		2-(4-{3-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)アミノ]プロピル}フェノキシ)-2-メチル-プロピオン酸

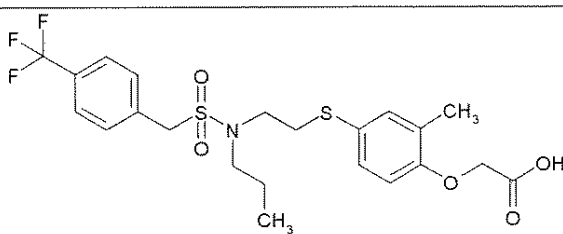
【表 4】

番号	構造	化合物名
17		2-(4-{2-[(3-エチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]エトキシ}-3-プロピル-フェノキシ)-2-メチル-プロピオン酸
18		2-[4-(1-{ [(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]メチル}プロポキシ)-2-メチル-フェノキシ]-2-メチル-プロピオン酸
19		3-[4-(1-{ [(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]メチル}プロポキシ)-2-メチル-フェニル]プロピオン酸
20		[4-(1-{ [(5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]メチル}プロピルスルファニル)-2-メチル-フェノキシ]酢酸
21		[4-(1-{ [(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]メチル}プロピルスルファニル)-2-メチル-フェノキシ]酢酸

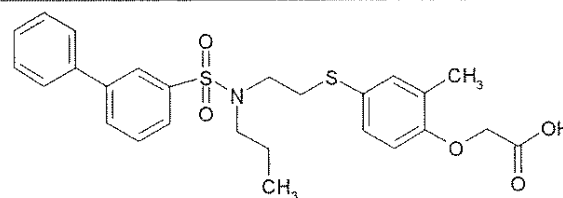
【表 5】

番号	構造	化合物名
22		[4-(1-{[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]メチル}プロピルスルファニル)-2-メチル-フェノキシ]酢酸
23		(2-メチル-4-{2-[(6-フェノキシ-ピリジン-3-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
24		(2-メチル-4-{2-[(5-メチル-1-フェニル-1H-ピラゾール-4-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
25		(2-メチル-4-{2-[(4-オキサゾール-5-イル-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
26		(2-メチル-4-{2-[プロピル-(4-ピラゾール-1-イル-ベンゼンスルホニル)アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
27		(2-メチル-4-{2-[(2-ナフタレン-1-イル-エタン)スルホニル]プロピル-アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸

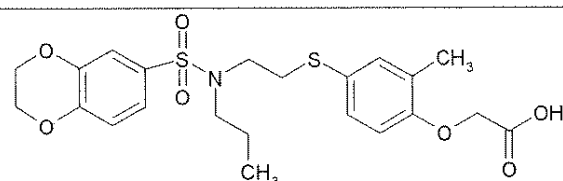
番号	構造	化合物名
28		(2-メチル-4-{2-[プロピル-(4-トリフルオロメチルフェニルメタンスルホニル)アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
29		(4-{2-[(ビフェニル-3-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
30		(4-{2-[(2,3-ジヒドロベンゾ[1,4]ジオキシン-6-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
31		[2-メチル-4-(2-{[5-(2-メチルスルファニル-ピリミジン-4-イル)チオフエン-2-スルホニル]プロピル-アミノ}エチルスルファニル)フェノキシ]酢酸
32		[2-メチル-4-(2-{[5-(1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-イル)チオフエン-2-スルホニル]プロピル-アミノ}エチルスルファニル)フェノキシ]酢酸
33		[2-メチル-4-(2-{[5-(1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)チオフエン-2-スルホニル]プロピル-ア



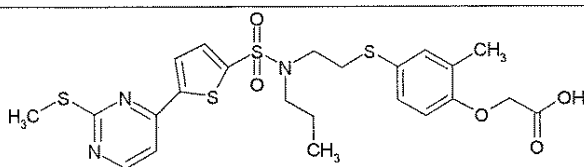
(2-メチル-4-{2-[プロピル-(4-トリフルオロメチルフェニル)メタンスルホニル]アミノ}エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸



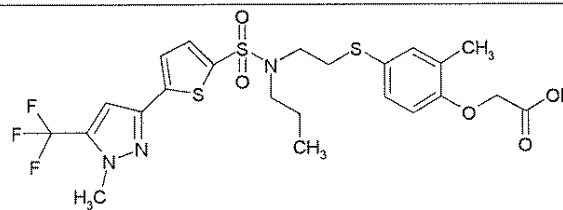
(4-{2-[(ピフェニル-3-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸



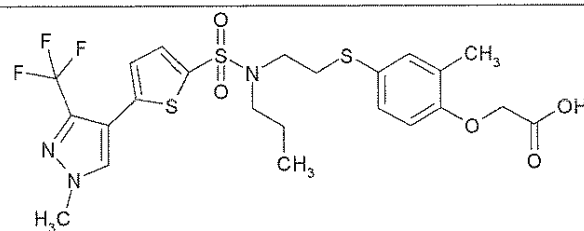
(4-{2-[(2,3-ジヒドロベンゾ[1,4]ジオキシン-6-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸



[2-メチル-4-(2-{[5-(2-メチルスルファニル-ピリミジン-4-イル)チオフェン-2-スルホニル]プロピル-アミノ}エチルスルファニル)フェノキシ]酢酸



[2-メチル-4-(2-{[5-(1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-イル)チオフェン-2-スルホニル]プロピル-アミノ}エチルスルファニル)フェノキシ]酢酸



[2-メチル-4-(2-{[5-(1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)チオフェン-2-スルホニル]プロピル-ア

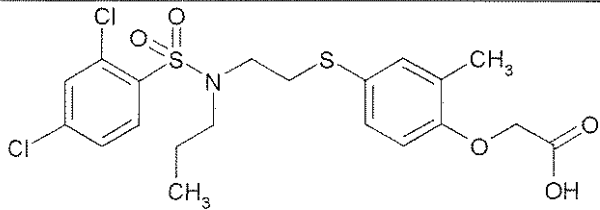
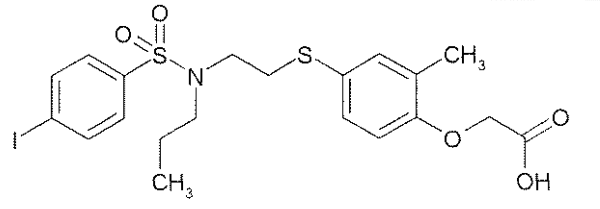
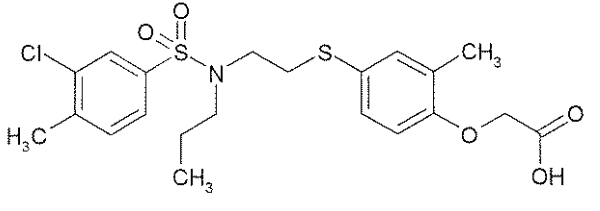
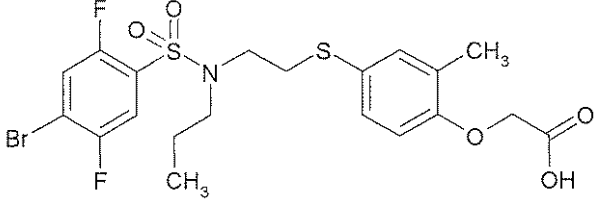
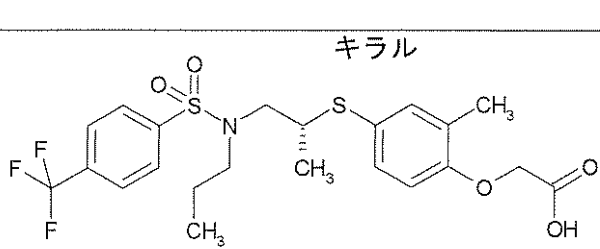
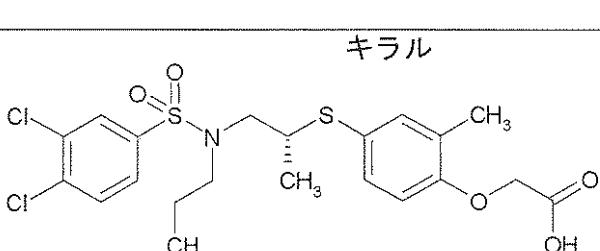
【表 7】

番号	構造	化合物名
		ミノ}エチルスルファニル)フェノキシ]酢酸
34	<p>キラル</p>	(R)-(2-メチル-4-{1-メチル-2-[(3-メチル-5-トリフルオロメチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
35	<p>キラル</p>	(R)-3-(4-{2-[(6-クロロ-5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェニル)プロピオン酸
36	<p>キラル</p>	(R)-(4-{2-[(6-クロロ-5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
37		(4-{2-[(4-ブロモベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
38		(4-{2-[(3,4-ジクロロベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸

【表 8】

番号	構造	化合物名
39		(4-{2-[(4-イソプロピル-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
40		(2-メチル-4-{2-[(4-ペンチル-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
41		(4-{2-[(2-クロロ-4-トリフルオロメチル-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
42		(2-メチル-4-{2-[プロピル-(3-トリフルオロメチル-ベンゼンスルホニル)アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
43		(4-{2-[(4-ブロモ-2-メチル-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
44		(4-{2-[(3,4-ジブロモ-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
45		(2-メチル-4-{2-[プロピル-(4-プロピル-ベンゼンスルホニル)アミノ]エチルスルファニル}フェ

【表 9】

番号	構造	化合物名
		ノキシ)酢酸
46		(4-{2-[(2, 4-ジクロロ-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
47		(4-{2-[(4-ヨード-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
48		(4-{2-[(3-クロロ-4-メチル-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
49		(4-{2-[(4-ブromo-2,5-ジフルオロ-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
50		(2-メチル-4-{1-メチル-2-[プロピル-(4-トリフルオロメチル-ベンゼンスルホニル)アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
51		(4-{2-[(3, 4-ジクロロ-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸

【表 10】

番号	構造	化合物名
52		(2-メチル-4-{2-[プロピル-(2'-トリフルオロメチル-ビフェニル-4-スルホニル)アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
53		(2-メチル-4-{2-[プロピル-(3'-トリフルオロメチル-ビフェニル-4-スルホニル)アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
54		(2-メチル-4-{2-[プロピル-(4'-トリフルオロメチル-ビフェニル-4-スルホニル)アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
55		(4-{2-[(2'-フルオロ-ビフェニル-4-スルホニル)プロピルアミノ]エチルスルファニル}-2-メチルフェノキシ)酢酸
56		(4-{2-[(4'-フルオロ-ビフェニル-4-スルホニル)プロピルアミノ]エチルスルファニル}-2-メチルフェノキシ)酢酸
57		(2-メチル-4-{2-[プロピル-(4'-トリフルオロメトキシ-ビフェニル-4-スルホニル)アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸

【表 1 1】

番号	構造	化合物名
58		(4-{2-[(3',4'-ジクロロビフェニル-4-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
59		(4-{2-[(3'-フルオロビフェニル-4-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
60		(4-{2-[(2'-クロロビフェニル-4-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
61		(4-{2-[(4'-メトキシビフェニル-4-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
62		(4-{2-[(4'-メトキシビフェニル-4-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
63		(4-{2-[(3'-クロロ-4'-フルオロビフェニル-4-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
64		(4-{2-[(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フ

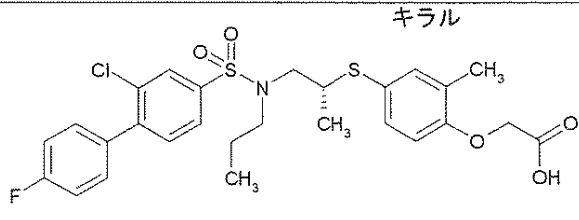
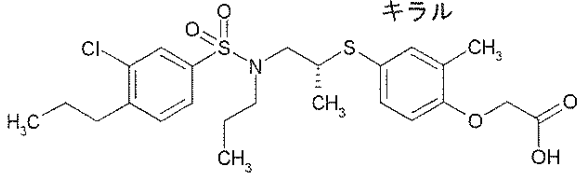
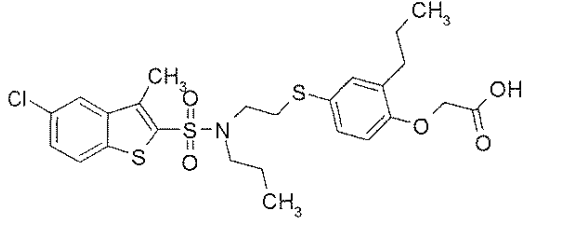
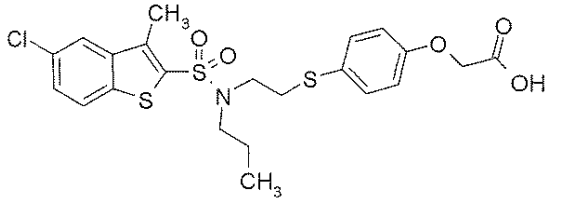
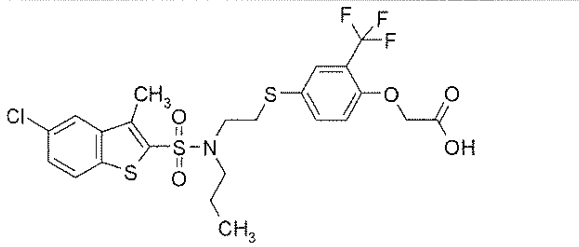
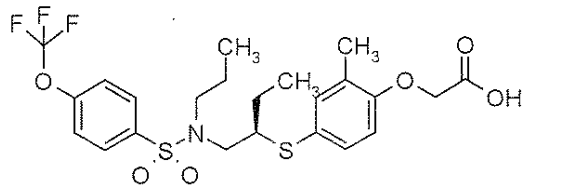
【表 1 2】

番号	構造	化合物名
		エノキシ)酢酸
65	<p style="text-align: center;">キラル</p>	(2-メチル-4-{1-メチル-2-[プロピル-(4-トリフルオロメトキシ-ベンゼンスルホニル)アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
66	<p style="text-align: center;">キラル</p>	(2-メチル-4-{1-メチル-2-[プロピル-(4-プロピル-ベンゼンスルホニル)アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
67	<p style="text-align: center;">キラル</p>	(4-{2-[(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
68	<p style="text-align: center;">キラル</p>	(4-{2-[(3-クロロ-4-トリフルオロメチル-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
69		(4-{2-[(4-ブチル-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
70		(4-{2-[(4-イソブチル-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸

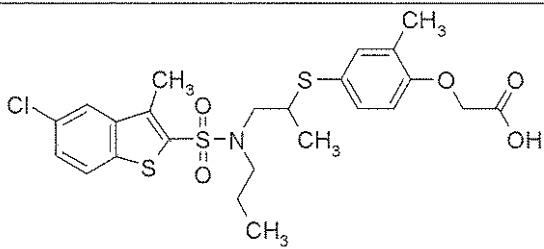
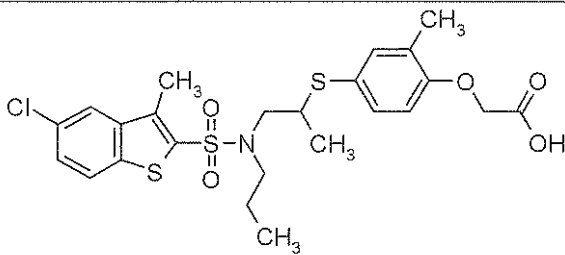
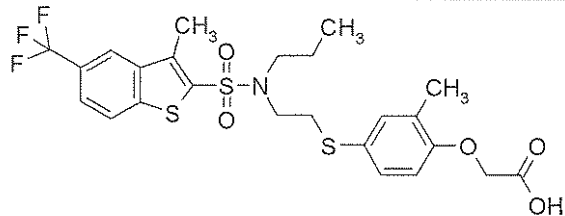
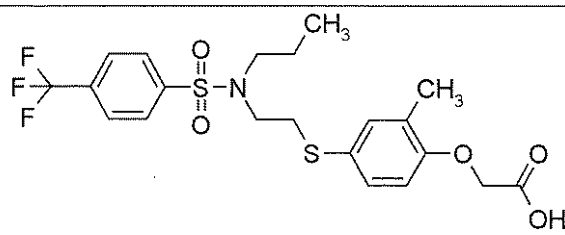
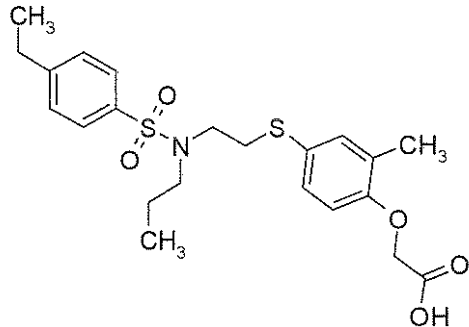
【表 13】

番号	構造	化合物名
71	<p style="text-align: center;">キラル</p>	(4-{2-[(2-クロロ-4-トリフルオロメチル-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
72	<p style="text-align: center;">キラル</p>	(4-{2-[(4-ブromo-3-クロロ-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
73	<p style="text-align: center;">キラル</p>	(4-{2-[(4-ブチル-3-クロロ-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
74	<p style="text-align: center;">キラル</p>	(4-{2-[(3-クロロ-4-イソブチル-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
75	<p style="text-align: center;">キラル</p>	(4-{2-[(4-ブromo-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
76	<p style="text-align: center;">キラル</p>	(4-{2-[(4-ブチル-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸

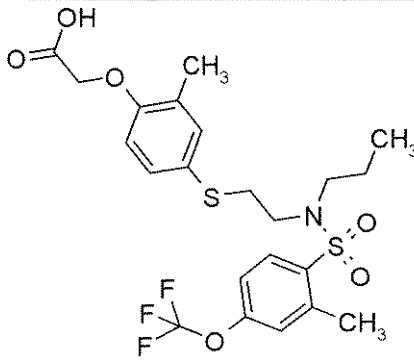
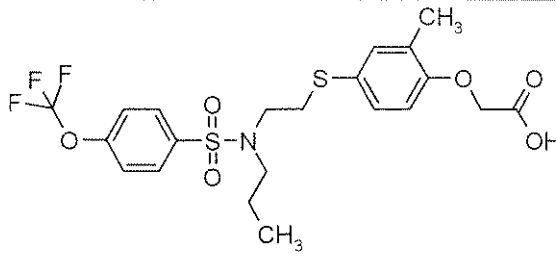
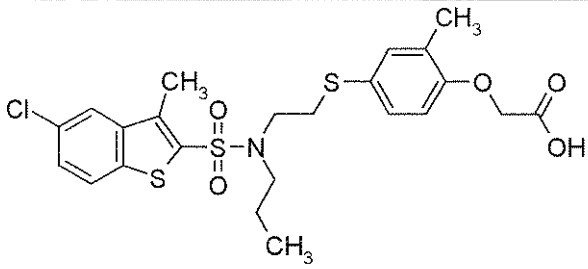
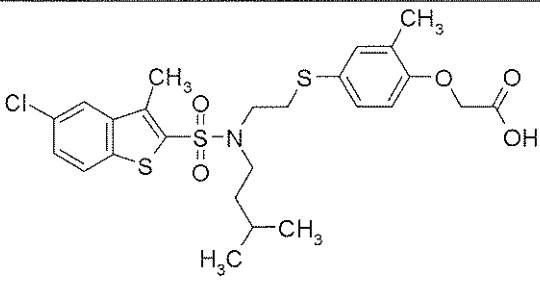
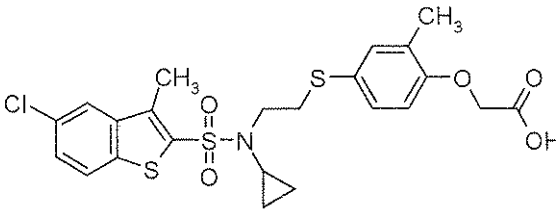
【表 1 4】

番号	構造	化合物名
77		(4-{2-[(2-クロロ-4'-フルオロ-ビフェニル-4-スルホニル)プロピル-アミノ]}-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
78		(4-{2-[(3-クロロ-4-プロピル-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]}-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
79		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]}エチルスルファニル}-2-プロピル-フェノキシ)酢酸
80		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]}エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
81		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]}エチルスルファニル}-2-トリフルオロメチル-フェノキシ)酢酸
82		[2-メチル-4-(1-{[プロピル-(4-トリフルオロメトキシ-ベンゼンスルホニル)アミノ]メチル}プロピルスルファニル)フェノキシ]酢酸

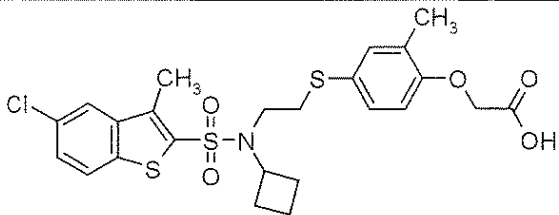
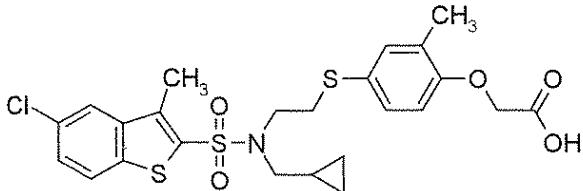
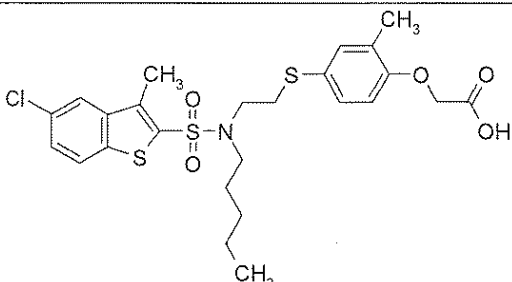
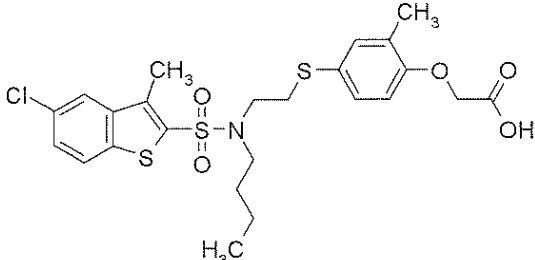
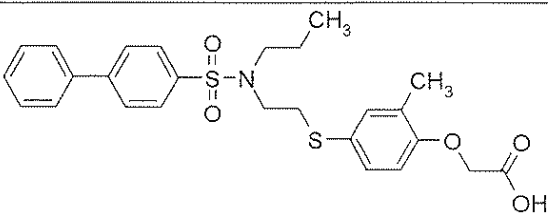
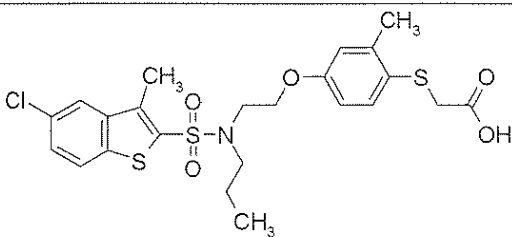
【表 15】

番号	構造	化合物名
83		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
84		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
85		(2-メチル-4-{2-[(3-メチル-5-トリフルオロメチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
86		(2-メチル-4-{2-[プロピル-(4-トリフルオロメチル-ベンゼンスルホニル)アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
87		(4-{2-[(4-エチル-ベンゼンスルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸

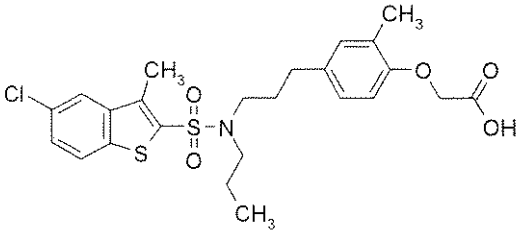
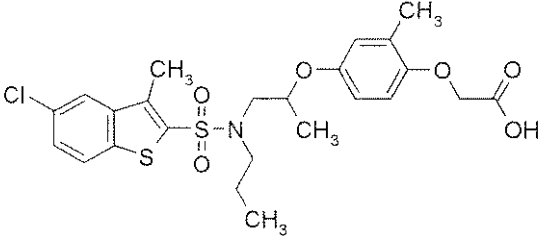
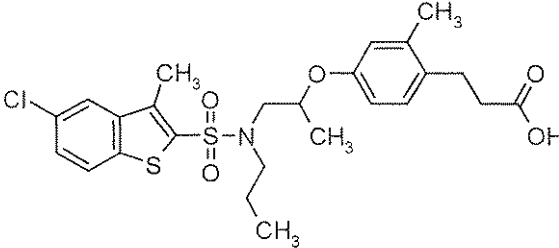
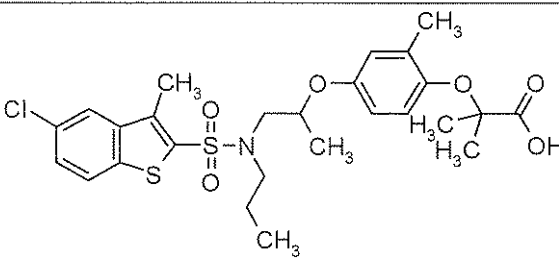
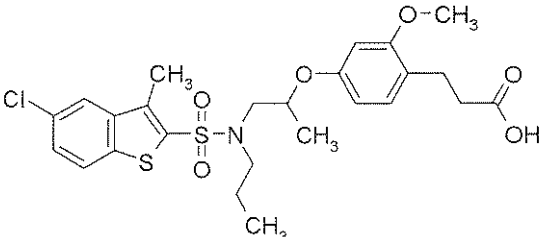
【表 16】

番号	構造	化合物名
88		(2-メチル-4-{2-[(2-メチル-4-トリフルオロメトキシ-ベンゼンスルホニル) プロピル-アミノ] エチルスルファニル} フェノキシ) 酢酸
89		(2-メチル-4-{2-[プロピル-(4-トリフルオロメトキシ-ベンゼンスルホニル) アミノ] エチルスルファニル} フェノキシ) 酢酸
90		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル) プロピル-アミノ] エチルスルファニル} -2-メチル-フェノキシ) 酢酸
91		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル) -(3-メチル-ブチル) アミノ] エチルスルファニル} -2-メチル-フェノキシ) 酢酸
92		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル) シクロプロピル-アミノ] エチルスルファニル} -2-メチル-フェノキシ) 酢酸

【表 17】

番号	構造	化合物名
93		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)シクロブチル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
94		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)シクロプロピルメチル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
95		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)ペンチル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
96		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
97		(4-{2-[(ビフェニル-4-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
98		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]エトキシ}-2-メチル-フェニルスルファニル)酢酸

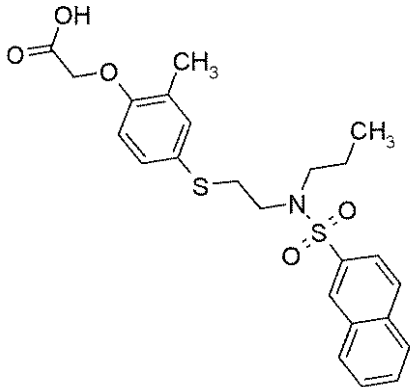
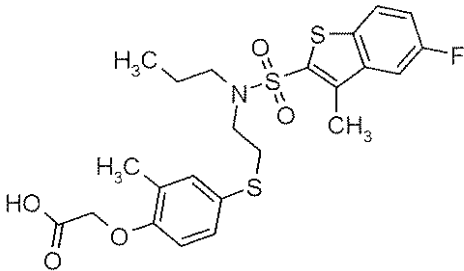
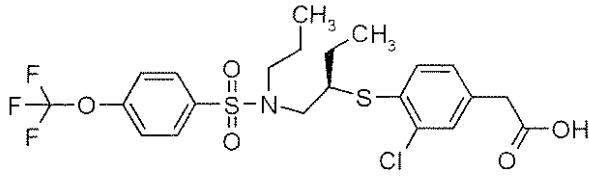
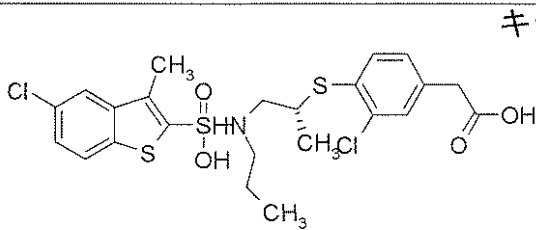
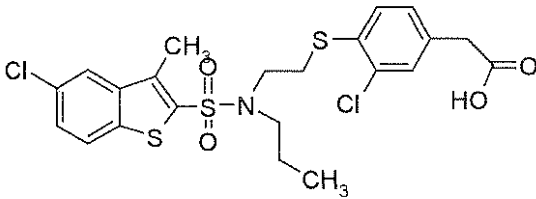
【表 18】

番号	構造	化合物名
99		(4-{3-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]プロピル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
100		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エトキシ}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
101		3-(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エトキシ}-2-メチル-フェニル)プロピオン酸
102		2-(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エトキシ}-2-メチル-フェノキシ)-2-メチル-プロピオン酸
103		3-(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エトキシ}-2-メトキシ-フェニル)プロピオン酸

【表 19】

番号	構造	化合物名
104		(4-{2-[(5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
105		3-(4-{2-[(5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エトキシ}-2-メチル-フェニル)プロピオン酸
106		(4-{2-[(5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エトキシ}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
107		(2-クロロ-4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
108		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-エチル-フェノキシ)酢酸

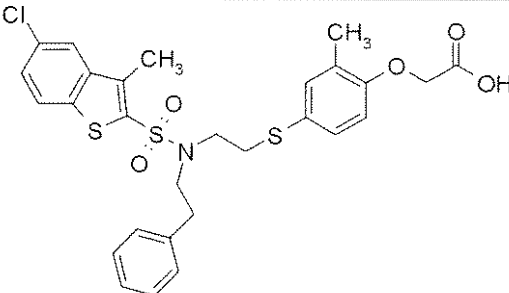
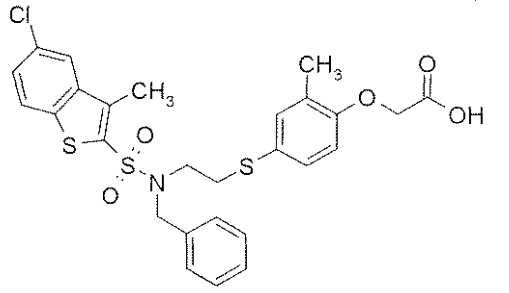
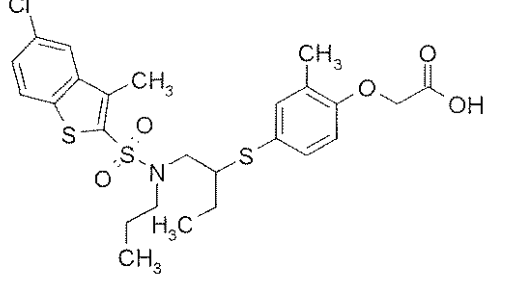
【表 20】

番号	構造	化合物名
109		(2-メチル-4-{2-[(ナフタレン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}フェノキシ)酢酸
110		(4-{2-[(5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ)酢酸
111		[3-クロロ-4-(1-{[プロピル-(4-トリフルオロメトキシ-ベンゼンスルホニル)アミノ]メチル}プロピルスルファニル)フェニル]酢酸
112		キラル (R)-(3-クロロ-4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]-1-メチル-エチルスルファニル}フェニル)酢酸
113		(3-クロロ-4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]エチルスルファニル}フェニル)酢酸

【表 2 1】

番号	構造	化合物名
114		[4-(1-{[(5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]メチル}プロポキシ)-2-メチル-フェノキシ]酢酸
115		3-[4-(1-{[(5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]メチル}プロポキシ)-2-メチル-フェニル]プロピオン酸
116		3-(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]ブトキシ}-2-メチル-フェニル)プロピオン酸
117		[4-(1-{[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]メチル}プロポキシ)-2-メチル-フェノキシ]酢酸
118		[4-(1-{[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホニル)プロピル-アミノ]メチル}プロポキシ)-2-メトキシ-フェノキシ]酢酸

【表 2 2】

番号	構造	化合物名
119		(4-{2-[(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-スルホニル) フェネチル-アミノ] エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ) 酢酸
120		(4-{2-[ベンジル-(5-クロロ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-スルホニル) アミノ] エチルスルファニル}-2-メチル-フェノキシ) 酢酸
121		[4-(1-{ (5-クロロ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-スルホニル) プロピル-アミノ } メチル) プロピルスルファニル]-2-メチル-フェノキシ] 酢酸

からなる群から選択される化合物。

【請求項 2 5】

医薬的に許容される担体および請求項 1 ~ 2 4 記載の少なくとも 1 つの化合物またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物もしくは水和物を含む医薬組成物。

【請求項 2 6】

(1) 請求項 1 ~ 2 4 記載の化合物またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物、水和物もしくは立体異性体、(2) インスリン増感剤、スルホニル尿素、ピグアニド、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 H D L 上昇剤、H M G - C o A 還元酵素阻害剤、スタチン、アクリル C o A : コレステロール・アシルトランスフェラーゼ阻害剤、肥満抑制化合物、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二治療薬、ならびに (3) 医薬的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 2 7】

請求項 1 ~ 2 4 記載の少なくとも 1 つの化合物を含む、高血糖症、異常脂質血症、I I 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、インスリン抵抗性、心不全、糖尿病性異常脂質血症、高脂血症、高コレステロール血症、高血圧症、肥満症、過食症、拒食症、心疾患、およびインスリン抵抗性が構成要素である他の疾患からなる群から選択される疾患または状態の治療剤または予防剤。

【請求項 2 8】

P P A R により調節される状態の治療用医薬品の製造のための、請求項 1 ~ 2 4 記載の化合物およびその医薬的に許容される塩、溶媒和物、水和物または立体異性体の使用。