

【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2月22日(2007.2.22)

【公表番号】特表2006-516971(P2006-516971A)

【公表日】平成18年7月13日(2006.7.13)

【年通号数】公開・登録公報2006-027

【出願番号】特願2006-500523(P2006-500523)

【国際特許分類】

**C 0 7 C 275/54 (2006.01)**  
**C 0 7 D 239/28 (2006.01)**  
**C 0 7 D 333/38 (2006.01)**  
**C 0 7 D 307/68 (2006.01)**  
**C 0 7 D 307/85 (2006.01)**  
**C 0 7 D 209/42 (2006.01)**  
**C 0 7 D 295/12 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/17 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/22 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/19 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/192 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/216 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/505 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/381 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/341 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/343 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/404 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/402 (2006.01)**  
**A 6 1 P 3/10 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 C 275/54 C S P  
 C 0 7 D 239/28  
 C 0 7 D 333/38  
 C 0 7 D 307/68  
 C 0 7 D 307/85  
 C 0 7 D 209/42  
 C 0 7 D 295/12 Z  
 A 6 1 K 31/17  
 A 6 1 K 31/22  
 A 6 1 K 31/19  
 A 6 1 K 31/192  
 A 6 1 K 31/216  
 A 6 1 K 31/505  
 A 6 1 K 31/381  
 A 6 1 K 31/341  
 A 6 1 K 31/343  
 A 6 1 K 31/404  
 A 6 1 K 31/402  
 A 6 1 P 3/10

【手続補正書】

【提出日】平成18年12月26日(2006.12.26)

【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

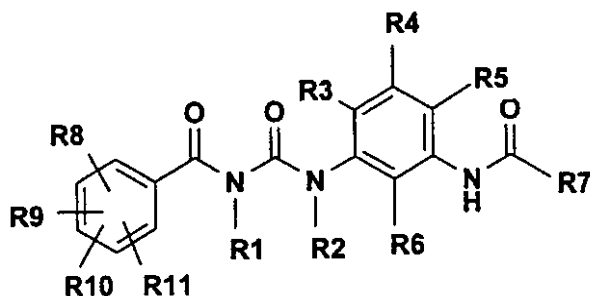
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I

【化1】



I

の化合物及びそれらの生理的に許容される塩。

式中、

R8、R9、R10、R11は、それぞれ独立して、H、F、Cl、Br、OH、NO<sub>2</sub>、CN、O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、O-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニル、O-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニル、O-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニル又は(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキニルであり、ここで、アルキル、アルケニル及びアルキニルは、F、Cl又はBrで多置換されていてもよく；

R1、R2は、それぞれ独立して、H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル(ここで、アルキルは、OH、O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、NH<sub>2</sub>、NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、N[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル]<sub>2</sub>で置換されていてもよい)、又はO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、COO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキレン-COOH又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキレン-COO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルであり；

R3、R4、R5、R6は、それぞれ独立して、H、F、Cl、Br、NO<sub>2</sub>、CN、O-R12、O-フェニル、S-R12、COOR12、N(R13)(R14)、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキレン又はO-(C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>)-アルキル-COOR12であり、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルキレン及びアルキニルは、F、Cl、Br、OR12、COOR12又はN(R13)(R14)で多置換されていてもよく；

R7は、H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキレン、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルカルボキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキレン、COOR12、(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-アリーール、(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-アリーール-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキレン、ヘテロ環式基、ヘテロアリーール-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキレン又はヘテロアリーールカルボニルであり、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルキレン、アルケニル及びアルキニルは、F、Cl、Br、OR12、COOR12、CONH<sub>2</sub>、CONH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、CON[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル]<sub>2</sub>又はN(R13)(R14)で多置換されていてもよく、そしてアリーール及びヘテロアリーールは、F、Cl、Br、NO<sub>2</sub>、CN、O-R12、S-R12、COOR12、N(R13)(R14)又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルで多置換されていてもよく；

R12は、H、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-アルケニル又は(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-アル

キニルであり、ここで、アルキル、アルケニル及びアルキニルは、F、Cl、Br、OH又はO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルで多置換されていてもよく、

R 13、R 14は、それぞれ独立して、H、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-アルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキレン、COO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、COO-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-アルケニル、フェニル又はSO<sub>2</sub>-フェニルであり、ここで、フェニル環は、F、Cl、CN、OH、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、COOH、COO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル又はCONH<sub>2</sub>で二置換までされていてもよく；

ここで、R 13及びR 14は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、N、O及びSの群からのさらに2個までのヘテロ原子を含んでいてもよい3～7員の飽和ヘテロ環式環を形成してもよく、ここで、ヘテロ環式環は、F、Cl、Br、OH、オキソ、N(R 21)(R 22)又は(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルで三置換までされていてもよく；

R 21、R 22は、それぞれ独立して、H、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-アルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキレン、COO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、COO-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-アルケニル、フェニル又はSO<sub>2</sub>-フェニルであり、ここで、フェニル環は、F、Cl、CN、OH、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、COOH、COO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル又はCONH<sub>2</sub>で二置換までされていてもよく；

ただし、上記の基が同時に下記：

R 5はハロゲン又は非置換(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルであり、R 7はヘテロ環式基又はヘテロアリールである

と定義される式Iの化合物を除く。

#### 【請求項2】

R 8、R 9、R 10、R 11が、それぞれ独立して、H、F、Cl、Br、OH、NO<sub>2</sub>、CN、O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルであり、ここで、アルキルは、F、Cl又はBrで多置換されていてもよく；

R 1、R 2が、それぞれHであり；

R 3、R 4、R 5、R 6が、それぞれ独立して、H、F、Cl、Br、NO<sub>2</sub>、CN、O-R 12、O-フェニル、S-R 12、COOR 12、N(R 13)(R 14)、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキレン又はO-(C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>)-アルキル-COOR 12であり、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルキレン及びアルキニルは、F、Cl、Br、OR 12、COOR 12又はN(R 13)(R 14)で多置換されていてもよく；

R 7が、H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルカルボキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキレン、COOR 12、(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-アリール、(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-アリール-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキレン、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキレン又はヘテロアリールカルボニルであり、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルキレン、アルケニル及びアルキニルは、F、Cl、Br、OR 12、COOR 12、CONH<sub>2</sub>、CONH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、CON[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル]<sub>2</sub>又はN(R 13)(R 14)で多置換されていてもよく、そしてアリール及びヘテロアリールは、F、Cl、Br、NO<sub>2</sub>、CN、O-R 12、S-R 12、COOR 12、N(R 13)(R 14)又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルで多置換されていてもよく；

R 12が、H、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-アルケニル又は(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-アルキニルであり、ここで、アルキル、アルケニル及びアルキニルは、F、Cl、Br、OH又はO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルで多置換されていてもよく、

R 13、R 14が、それぞれ独立して、H、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-アルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキレン、COO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、COO-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-

- アルケニル、フェニル又は $\text{SO}_2$ -フェニルであり、ここで、フェニル環は、F、Cl、CN、OH、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキル、O- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキル、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{OCF}_3$ 、 $\text{COOH}$ 、 $\text{COO}(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキル又は $\text{CONH}_2$ で二置換までされていてもよく；ここで、R13及びR14は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、N、O及びSの群からのさらに2個までのヘテロ原子を含んでいてもよい3～7員の飽和ヘテロ環式環を形成してもよく、ここで、ヘテロ環式環は、F、Cl、Br、OH、オキソ、 $\text{N}(\text{R}21)(\text{R}22)$ 又は $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキルで三置換までされていてもよく；

R21、R22が、それぞれ独立して、H、 $(\text{C}_1 - \text{C}_8)$ -アルキルであり；

ただし、上記の基が同時に下記：

R5はハロゲン又は非置換 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルであり、R7はヘテロ環式基又はヘテロアリールである

と定義される式Iの化合物を除く；

請求項1に記載の式Iの化合物及びそれらの生理的に許容される塩。

【請求項3】

R8、R9、R10、R11が、それぞれ独立して、H、F又はClであり；

R1、R2、R4、R6が、それぞれHであり；

R3、R5が、それぞれ独立して、H、Cl、OR12、COOR12、 $\text{N}(\text{R}13)(\text{R}14)$ 又は $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルであり；

R7が、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキル（ここで、アルキルは、F、OR12、COOR12又は $\text{N}(\text{R}13)(\text{R}14)$ で多置換されていてもよい）、又は $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ -シクロアルキル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ -アルケニル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ -アルキニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_5)$ -アルキルカルボキシ- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキレン、COOR12、フェニル（ここで、フェニルは、F、OMe又は $\text{OCF}_3$ で多置換されていてもよい）、又はベンジル（そのフェニル環は、OMe、ピリジル、チエニル、フラニル、インドリルカルボニル、ベンゾフラニルで置換されていてもよく、ここで、ベンゾフラニルは、Cl又はOMeで置換されていてもよい）であり；

R12が、H又は $(\text{C}_1 - \text{C}_8)$ -アルキルであり、ここで、アルキルは、Fで多置換されていてもよく；

R13、R14が、それぞれ独立して、H又は $(\text{C}_1 - \text{C}_8)$ -アルキルであり；ここで、

R13及びR14は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、5員の飽和ヘテロ環式環を形成してもよく；

ただし、上記の基が同時に下記：

R5はハロゲン又は非置換 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルであり、R7はヘテロ環式基又はヘテロアリールである

と定義される式Iの化合物を除く；

請求項1又は2に記載の式Iの化合物及びそれらの生理的に許容される塩。

【請求項4】

請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物の1種又はそれ以上を含む医薬品。

【請求項5】

請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物の1種又はそれ以上、及び1種又はそれ以上の血糖低下活性成分を含む医薬品。

【請求項6】

請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物の1種又はそれ以上、及びスタチンの1種又はそれ以上を含む医薬品。

【請求項7】

2型糖尿病を治療する薬剤を製造するための、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物の使用。

【請求項8】

血糖を低下させる薬剤を製造するための、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物の使用。