

【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18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-529970(P2005-529970A)

【公表日】平成17年10月6日(2005.10.6)

【年通号数】公開・登録公報2005-039

【出願番号】特願2004-515007(P2004-515007)

【国際特許分類】

C 0 7 C 235/34 (2006.01)

A 6 1 K 31/192 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 5/50 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

C 0 7 C 231/12 (2006.01)

C 0 7 C 319/20 (2006.01)

C 0 7 C 323/62 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 235/34 C S P

A 6 1 K 31/192

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 5/50

A 6 1 P 9/10 1 0 1

A 6 1 P 9/12

C 0 7 C 231/12

C 0 7 C 319/20

C 0 7 C 323/62

【手続補正書】

【提出日】平成17年9月6日(2005.9.6)

【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

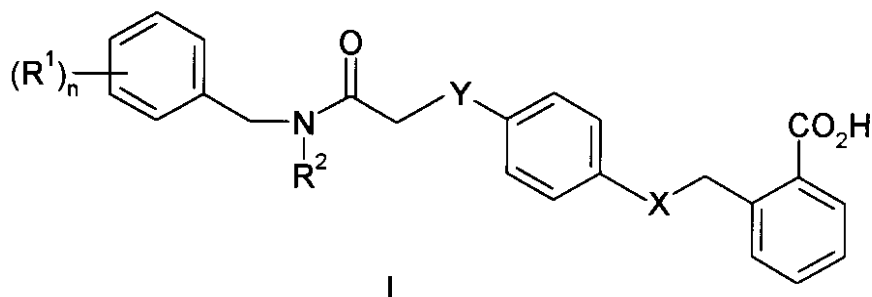
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物：

【化 1】



[式中 :

n は 0、1 または 2 であり、R¹ はハロ、1 個以上のフルオロにより置換されていてもよい C₁₋₄ アルキル基、1 個以上のフルオロにより置換されていてもよい C₁₋₄ アルコキシ基を表わし、n が 2 である場合、置換基 R¹ は同一でも異なってもよく；

R² は酸素により中断されていてもよい C₂₋₈ アルキル基を表わし；

Y は存在しないか、またはメチレンを表わし；

X は O または S である]

ならびにその医薬的に許容できる塩類およびプロドラッグ。

【請求項 2】

X が O である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

X が S である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

Y がメチレンである、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】

Y が存在しない、請求項 1、2 または 3 に記載の化合物。

【請求項 6】

R¹ がハロ、C₁₋₄ アルキル基または C₁₋₄ アルコキシ基であり、n が 0、1 または 2 である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7】

n が 1 または 2 である場合、R¹ がフルオロ、メトキシまたはイソプロピルである、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8】

n が 0 である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9】

R² が C₅₋₇ アルキル基を表わす、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 10】

下記のものから選択される化合物：

2-[(4-{3-[ベンジル(ヘキシル)アミノ]-3-オキソプロピル}フェノキシ)メチル]安息香酸；

2-[(4-{2-[(2,4-ジフルオロベンジル)(ヘプチル)アミノ]-2-オキソエチル}フェニル)チオ]メチル]安息香酸；

2-[(4-{2-[ベンジル(ヘキシル)アミノ]-2-オキソエチル}フェノキシ)メチル]安息香酸；

2-[(4-{2-[(2,4-ジフルオロベンジル)(ヘプチル)アミノ]-2-オキソエチル}フェノキシ)メチル]安息香酸；

2-[(4-{3-[(2,4-ジフルオロベンジル)(ヘプチル)アミノ]-3-オキソプロピル}フェノキシ)メチル]安息香酸；

2-[(4-{3-[(2,4-ジフルオロベンジル)(ヘプチル)アミノ]-3-オキソプロピル}フェニル)チオ]メチル]安息香酸；

2-[(4-{3-[ブチル(2,3-ジメトキシベンジル)アミノ]-3-オキソプロピル}フェノキシ)メチル]安息香酸；

2-[(4-{3-[(2,3-ジメトキシベンジル)(ヘブチル)-アミノ]-3-オキソプロピル}フェノキシ)メチル]安息香酸；

2-[(4-{3-[(3-エトキシプロピル)(4-イソプロピルベンジル)アミノ]-3-オキソプロピル}フェノキシ)メチル]-安息香酸；

2-[(4-{3-[(2,4-ジフルオロベンジル)(プロピル)アミノ]-3-オキソプロピル}フェノキシ)メチル]安息香酸；

2-[(4-{2-[エチル(2-フルオロベンジル)アミノ]-2-オキソエチル}フェノキシ)メチル]安息香酸；

2-[(4-{3-[エチル(2-フルオロベンジル)アミノ]-3-オキソプロピル}フェノキシ)メチル]安息香酸；

2-({[4-(2-{エチル[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]アミノ}-2-オキソエチル)フェニル]チオ}-メチル)安息香酸；

2-({[3-{2-[(2,4-ジフルオロベンジル)(ヘブチル)アミノ]-2-オキソエチル}フェニル]チオ}メチル)安息香酸；および

2-({[4-{2-[(4-クロロベンジル)(エチル)アミノ]-2-オキソエチル}フェニル]チオ}メチル)安息香酸；

ならびにその医薬的に許容できる塩類。

【請求項 1 1】

下記のものから選択される、請求項 2 に記載の化合物：

2-[(4-{3-[ベンジル(ヘキシル)アミノ]-3-オキソプロピル}フェノキシ)メチル]安息香酸；

2-[(4-{2-[ベンジル(ヘキシル)アミノ]-2-オキソエチル}フェノキシ)メチル]安息香酸；

2-[(4-{2-[(2,4-ジフルオロベンジル)(ヘブチル)アミノ]-2-オキソエチル}フェノキシ)メチル]安息香酸；

2-[(4-{3-[(2,4-ジフルオロベンジル)(ヘブチル)アミノ]-3-オキソプロピル}フェノキシ)メチル]安息香酸；

2-[(4-{3-[ブチル(2,3-ジメトキシベンジル)アミノ]-3-オキソプロピル}フェノキシ)メチル]安息香酸；

2-[(4-{3-[(2,3-ジメトキシベンジル)(ヘブチル)-アミノ]-3-オキソプロピル}フェノキシ)メチル]安息香酸；

2-[(4-{3-[(3-エトキシプロピル)(4-イソプロピルベンジル)アミノ]-3-オキソプロピル}フェノキシ)メチル]-安息香酸；

2-[(4-{3-[(2,4-ジフルオロベンジル)(プロピル)アミノ]-3-オキソプロピル}フェノキシ)メチル]安息香酸；

2-[(4-{2-[エチル(2-フルオロベンジル)アミノ]-2-オキソエチル}フェノキシ)メチル]安息香酸；

2-[(4-{3-[エチル(2-フルオロベンジル)アミノ]-3-オキソプロピル}フェノキシ)メチル]安息香酸；

ならびにその医薬的に許容できる塩類。

【請求項 1 2】

下記の化合物である、請求項 3 に記載の化合物：

2-({[4-{2-[(2,4-ジフルオロベンジル)(ヘブチル)アミノ]-2-オキソエチル}フェニル]チオ}メチル)安息香酸；

ならびにその医薬的に許容できる塩類。

【請求項 1 3】

下記の化合物である、請求項 3 に記載の化合物：

2-({[4-{3-[(2,4-ジフルオロベンジル)(ヘブチル)アミノ]-3-オキソプロピル}フェニル]

)チオ]メチル}安息香酸；
ならびにその医薬的に許容できる塩類。

【請求項 14】

下記の化合物である、請求項 3 に記載の化合物：

2-([4-(2-(エチル[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]アミノ)-2-オキシエチル)フェニル]チオ)-メチル)安息香酸；

ならびにその医薬的に許容できる塩類。

【請求項 15】

下記の化合物である、請求項 3 に記載の化合物：

2-([3-(2-[(2,4-ジフルオロベンジル)(ヘプチル)アミノ]-2-オキシエチル)フェニル]チオ)メチル)安息香酸；

ならびにその医薬的に許容できる塩類。

【請求項 16】

下記の化合物である、請求項 3 に記載の化合物：

2-([4-(2-[(4-クロロベンジル)(エチル)アミノ]-2-オキシエチル)フェニル]チオ)メチル)安息香酸；

ならびにその医薬的に許容できる塩類。

【請求項 17】

医薬的に許容できる佐剤、希釈剤および/またはキャリアーと混合した請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む医薬配合物。

【請求項 18】

インスリン抵抗性を治療または予防するための方法であって、その必要がある哺乳動物に請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の化合物を投与することを含む方法。

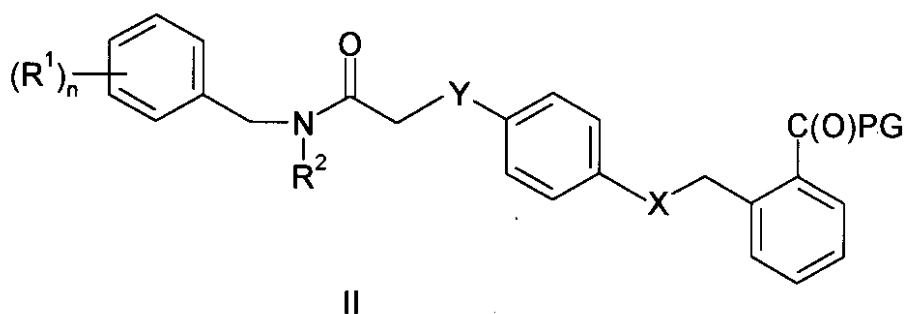
【請求項 19】

インスリン抵抗性を処置するための医薬の製造における、請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 20】

式 I の化合物の製造方法であって、式 II の化合物：

【化 2】



(式中、 R^1 、 R^2 、 X および Y は前記に定めたものであり、 PG はカルボキシル性ヒドロキシ基の保護基である)を脱保護剤と反応させることを含む方法。

【請求項 21】

請求項 20 に記載の式 II の化合物。

【請求項 22】

請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の化合物を、アテローム硬化症、高血圧症、高脂血症、異脂血症、糖尿病および肥満症の発症および進行に関連する障害の処置に有用な他の療法薬と組み合わせて含む、併用療法剤。