

【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24年11月22日(2012.11.22)

【公表番号】特表2012-505896(P2012-505896A)

【公表日】平成24年3月8日(2012.3.8)

【年通号数】公開・登録公報2012-010

【出願番号】特願2011-532190(P2011-532190)

【国際特許分類】

C 07 C	62/12	(2006.01)
A 61 P	3/10	(2006.01)
A 61 P	3/04	(2006.01)
A 61 P	3/06	(2006.01)
A 61 P	3/00	(2006.01)
A 61 P	9/10	(2006.01)
A 61 P	13/12	(2006.01)
A 61 P	7/02	(2006.01)
A 61 P	27/02	(2006.01)
A 61 P	15/10	(2006.01)
A 61 P	17/00	(2006.01)
A 61 P	1/14	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	7/10	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
A 61 K	31/192	(2006.01)
A 61 K	31/4418	(2006.01)
C 07 D	213/64	(2006.01)
C 07 D	249/08	(2006.01)
A 61 K	31/4196	(2006.01)
C 07 D	401/12	(2006.01)
A 61 K	31/444	(2006.01)
C 07 D	311/96	(2006.01)
A 61 K	31/353	(2006.01)
C 07 D	217/24	(2006.01)
A 61 K	31/4747	(2006.01)
C 07 D	277/24	(2006.01)
A 61 K	31/426	(2006.01)
C 07 D	271/06	(2006.01)
A 61 K	31/4245	(2006.01)
C 07 D	231/12	(2006.01)
A 61 K	31/415	(2006.01)
C 07 D	213/30	(2006.01)
C 07 D	213/61	(2006.01)
A 61 K	45/00	(2006.01)
A 61 K	31/155	(2006.01)
A 61 K	31/425	(2006.01)

【F I】

C 07 C	62/12	C S P
A 61 P	3/10	
A 61 P	3/04	

A 6 1 P 3/06
A 6 1 P 3/00
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 9/10 1 0 1
A 6 1 P 13/12
A 6 1 P 7/02
A 6 1 P 27/02
A 6 1 P 15/10
A 6 1 P 17/00
A 6 1 P 1/14
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 7/10
A 6 1 P 43/00 1 2 1
A 6 1 K 31/192
A 6 1 K 31/4418
C 0 7 D 213/64
C 0 7 D 249/08 5 3 5
A 6 1 K 31/4196
C 0 7 D 401/12
A 6 1 K 31/444
C 0 7 D 311/96
A 6 1 K 31/353
C 0 7 D 217/24
A 6 1 K 31/4747
C 0 7 D 277/24
A 6 1 K 31/426
C 0 7 D 271/06
A 6 1 K 31/4245
C 0 7 D 231/12 D
A 6 1 K 31/415
C 0 7 D 213/30
C 0 7 D 213/61
A 6 1 K 45/00
A 6 1 K 31/155
A 6 1 K 31/425

【手続補正書】

【提出日】平成24年10月4日(2012.10.4)

【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

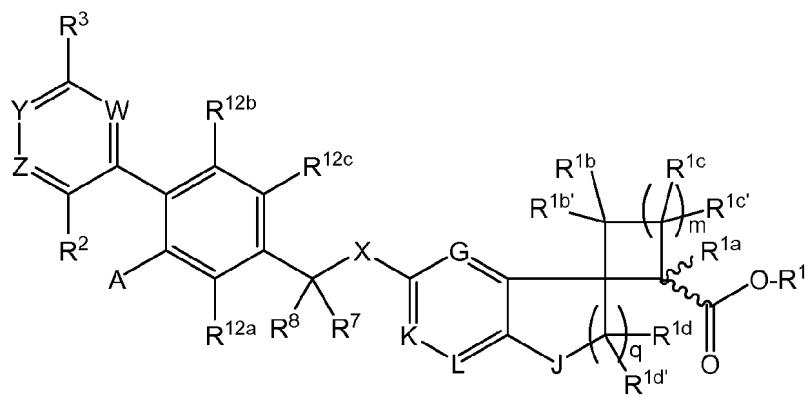
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

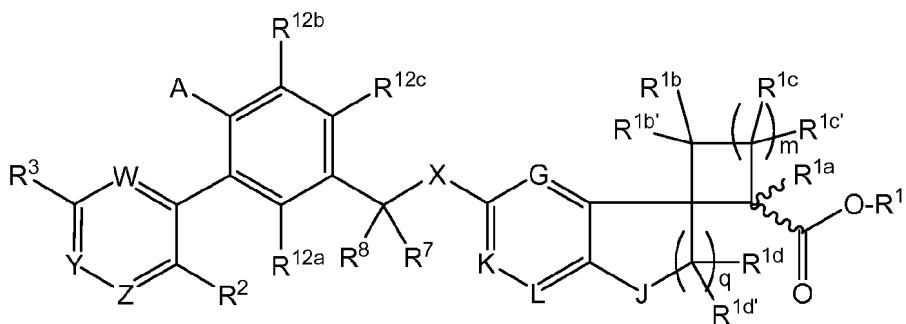
【請求項1】

化学式 I ' A 又は I ' B :

【化 1】



I'A



I' B

の化合物又はその薬学的に許容される塩、立体異性体、又は混合物であつて、

[式中、

G は N 又は C R ^{1 1 a} から選択され；

K は N 又は C R ^{1 1 b} から選択され；

L は N 又は C R ^{1 1 c} から選択され；

G、L、及びKのうちの0又は1つはNであり；

X は O、S、又は N R^a であり、ここで、R^a は -H 又は - (C₁ ~ C₆) アルキル基から選択され；

J は O、S、NR^b、CR^cR^d、C(=O)、又は -C(=O)-NR^b-から選択され；R^b は H 及び (C₁ ~ C₄) アルキルから選択され、ならびにさらに R^c 及び R^d は、独立して、H、F、及び (C₁ ~ C₄) アルキルから選択され；

W、Y、及びZはN又はCR¹⁻³から選択され；W、Y、及びZのうちの0、1つ、又は2つはNであり；ならびにさらに、R²が-Fであるならば、ZはNではなく；ならびにWがCである場合、A及びWは一緒に結合して、環員の0又は1個がN、O、又はSから選択されるヘテロ原子である5から7員環を形成しても良く、ならびにさらに5から7個の環員を有する環は、任意に、-(C₁~C₈)アルキル、-(C₁~C₈)アルケニル、-OH、-O-(C₁~C₈)アルキル、-O-(C₁~C₈)アルケニル、又はハロで置換され；

A は、 - H、 - (C₁ ~ C_{1,2}) アルキル； - (C₂ ~ C_{1,2}) アルケニル； - (C₁ ~ C_{1,2}) アルキル - O - (C₁ ~ C₄) アルキル； - (C₁ ~ C_{1,2}) アルキル - OH； - (C₁ ~ C_{1,2}) アルキル - O - (C₂ ~ C₄) アルケニル； - (C₂ ~ C_{1,2}) アルケニル - O - (C₁ ~ C₄) アルキル； - (C₂ ~ C_{1,2}) アルケニル - OH； - (C₂ ~ C_{1,2}) アルケニル - O - (C₂ ~ C₄) アルケニル； - O - (C₁ ~ C_{1,2}) アルキル； - O - (C₂ ~ C_{1,2}) アルケニル； - O - (C₁ ~ C₄) アルキル - アリール； - S - (C₁ ~ C_{1,2}) アルキル； - S - (C₂ ~ C_{1,2}) アルケニル； - S(O) - (C₁ ~ C_{1,2}) アルキル； - S(O) - (C₂ ~ C_{1,2}) アルケニル； - S(O)₂ - (C₁ ~ C_{1,2}) アルキル； - S(O)₂ - (C₂ ~ C_{1,2}) アルケニル；

$C_1 \sim C_{1,2}$) アルキル ; -S(O)₂ - ($C_2 \sim C_{1,2}$) アルケニル ; 複素環であって、4から7個の環員を含み、その環員の1もしくは2個がN、O、もしくはSから選択されるヘテロ原子であり、前記複素環が環員間で0もしくは1個の二重結合を有し、ならびに非置換であるかもしくは1から4個の($C_1 \sim C_2$) アルキル基で置換される、複素環 ; - ($C_1 \sim C_4$) アルキル - ヘテロシクリルであって、ここで、- ($C_1 \sim C_4$) アルキル - ヘテロシクリルのヘテロシクリルは、環員の1もしくは2個がN、O、もしくはSから選択されるヘテロ原子である4から7個の環員を含み、前記複素環は環員の間で0もしくは1個の二重結合を有し、ならびに非置換であるかもしくは1から4個の($C_1 \sim C_2$) アルキル基で置換される、- ($C_1 \sim C_4$) アルキル - ヘテロシクリル；又は-O-ヘテロシクリルであって、ここで、-O-ヘテロシクリルのヘテロシクリルは、環員の1もしくは2個がN、O、もしくはSから選択されるヘテロ原子である4から7個の環員を含み、前記複素環は環員の間で0もしくは1個の二重結合を有し、ならびに非置換であるかもしくは1から4個の($C_1 \sim C_2$) アルキル基で置換される、-O-ヘテロシクリルから選択され；さらに、- ($C_1 \sim C_{1,2}$) アルキル、- ($C_2 \sim C_{1,2}$) アルケニル、- ($C_1 \sim C_{1,2}$) アルキル - O - ($C_1 \sim C_4$) アルキル、- ($C_1 \sim C_{1,2}$) アルキル - O - H、- ($C_1 \sim C_{1,2}$) アルキル - O - ($C_2 \sim C_4$) アルケニル、- ($C_2 \sim C_{1,2}$) アルケニル - O - ($C_1 \sim C_4$) アルキル、- ($C_2 \sim C_{1,2}$) アルケニル - O - ($C_2 \sim C_4$) アルケニル、-O - ($C_1 \sim C_{1,2}$) アルキル、-O - ($C_2 \sim C_{1,2}$) アルケニル、及び-O - ($C_1 \sim C_4$) アルキル - アリールのアルキル基及びアルケニル基は、非置換であるか、又は-F、-Cl、-OH、(=O)、-NH₂、NH($C_1 \sim C_4$) アルキル、-N(($C_1 \sim C_4$) アルキル) ₂、アリール、非置換 - ($C_1 \sim C_2$) アルキル、又は非置換 -O - ($C_1 \sim C_2$) アルキルで置換され；

R^1 はH又は- ($C_1 \sim C_6$) アルキルであり；

$R^{1,a}$ は-H及び- ($C_1 \sim C_4$) アルキルから選択され；

$R^{1,b}$ は-H及び- ($C_1 \sim C_4$) アルキルから選択され；

$R^{1,b'}$ は-H及び- ($C_1 \sim C_4$) アルキルから選択され；

$R^{1,c}$ は-H及び- ($C_1 \sim C_4$) アルキルから選択され；

$R^{1,c'}$ は-H及び- ($C_1 \sim C_4$) アルキルから選択され；

$R^{1,d}$ は、それぞれの場合で独立して、-H、-F、及び- ($C_1 \sim C_4$) アルキルから選択され；

$R^{1,d'}$ は、それぞれの場合で独立して、-H、-F、及び- ($C_1 \sim C_4$) アルキルから選択され；

R^2 は、-H、-F、-CF₃、-Cl、又は-O- ($C_1 \sim C_6$) アルキルから選択され；

R^3 は-H、-F、-Cl、-OH、- ($C_1 \sim C_4$) アルキル、-O- ($C_1 \sim C_3$) アルキル、又は-S- ($C_1 \sim C_2$) アルキルであり；

R^7 及び R^8 は、-H及び- ($C_1 \sim C_4$) アルキルから独立して選択され；

$R^{1,1,a}$ 、 $R^{1,1,b}$ 、及び $R^{1,1,c}$ は、独立して、-H、-F、-Cl、- ($C_1 \sim C_4$) アルキル、又は-O($C_1 \sim C_4$) アルキルから選択され；

$R^{1,2,a}$ 、 $R^{1,2,b}$ 、及び $R^{1,2,c}$ は、独立して、-H、-F、-Cl、- ($C_1 \sim C_4$) アルキル、又は-O($C_1 \sim C_4$) アルキルから選択され；

$R^{1,3}$ は-H、-F、- ($C_1 \sim C_4$) アルキル、及び-O- ($C_1 \sim C_4$) アルキルから選択され；

Mは0又は1であり；ならびに

qは0、1、2、又は3から選択され、

式中、

【化2】



は、 R^1 及び $-C(=O)-O-R^1$ が、

【化 3】

~~~~~

が結合している環のいずれの側に結合されても良く、ならびに  $R$  と  $S$  のいずれの立体化学も許容されることを示す】

化学式  $I' A$  又は  $I' B$  の化合物、又はその薬学的に許容される塩、立体異性体、又は混合物。

【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】

$R^3$  が  $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_2)$  アルキル、又は  $-S(C_1 \sim C_2)$  アルキルから選択される、請求項 1 又は請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

$R^3$  がメトキシである、請求項 3 に記載の化合物。

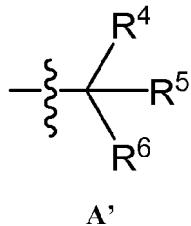
【請求項 5】

$A$  が  $(C_3 \sim C_{10})$  アルキル又は  $(C_4 \sim C_{10})$  アルケニルから選択される、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の化合物であって、 $A$  は化学式  $A'$

【化 4】



$A'$

の基であり、式中、波線は結合の点を示し；ならびに

$R^4$ 、 $R^5$ 、及び  $R^6$  は、 $H$ 、 $F$ 、 $(C_1 \sim C_4)$  アルキルから独立して選択され、 $R^4$ 、 $R^5$ 、及び  $R^6$  のうちの少なくとも 2 つが  $H$  以外であり；又は  $R^4$ 、 $R^5$ 、及び  $R^6$  のうちの 2 もしくは 3 個が一緒に結合して、任意に置換された飽和又は部分的に不飽和の 3 ~ 8 員单環もしくは二環を形成する、化合物。

【請求項 7】

請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の化合物であって、 $A$  が、 $- (C_4 \sim C_{12})$  アルキル、 $- (C_4 \sim C_{12})$  アルケニル、 $- (C_3 \sim C_{12})$  アルキル  $-O-$   $(C_1 \sim C_4)$  アルキル、 $- (C_3 \sim C_{12})$  アルキル  $-OH$ 、 $- (C_3 \sim C_{12})$  アルケニル  $-O-$   $(C_1 \sim C_4)$  アルキル、 $- (C_3 \sim C_{12})$  アルケニル  $-OH$ 、 $-O-$   $(C_4 \sim C_{12})$  アルキル、 $-O-$   $(C_4 \sim C_{12})$  アルケニル、 $N$  もしくは  $O$  から選択される 1 もしくは 2 個のヘテロ原子を含む 4 から 7 員複素環であって、前記複素環は環員間で 0 又は 1 個の二重結合を含み、ならびに非置換であるかもしくは 1 から 4 個の  $(C_1 \sim C_2)$  アルキル基で置換される、複素環、 $- (C_1 \sim C_4)$  アルキル  $-$  ヘテロシクリルであって、 $- (C_1 \sim C_4)$  アルキル  $-$  ヘテロシクリルのヘテロシクリルは  $N$  もしくは  $O$  から選択される 1 もしくは 2 個のヘテロ原子を含む 4 から 7 員複素環であり、ここで、前記複素環が環員の間で 0 もしくは 1 個の二重結合を有し、非置換であるかもしくは 1 から 4 個の  $(C_1 \sim C_2)$  アルキル基で置換される、 $- (C_1 \sim C_4)$  アルキル  $-$  ヘテロシクリル、又は  $-O-$  ヘテロシクリルであって、ここで、 $-O-$  ヘテロシクリルのヘテロシクリルは  $N$  もしくは  $O$  から選択される 1 もしくは 2 個のヘテロ原子を含む 4 から 7 員複素環であり、ここで、前記複素環が環員の間で 0 もしくは 1 個の二重結合を有し、ならびに非置換であるかもしくは 1 から 4 個の  $(C_1 \sim C_2)$  アルキル基で置換される、 $-O-$  ヘテロシクリルか

ら選択され；さらに、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルキル、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルケニル、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルキル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルキル - O - H、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルケニル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルケニル - OH、- O - (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルキル、又は - O - (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルケニルのアルキル基及びアルケニル基が、非置換であるか、又は - F、- Cl、- OH、(=O)、- NH<sub>2</sub>、NH (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- N ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)<sub>2</sub>、アリール、もしくは非置換 - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキルから選択される 1 から 3 個の置換基で置換される、化合物。

#### 【請求項 8】

請求項 7 に記載の化合物であって、A が、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルキル、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルケニル、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルキル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルキル - OH、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルケニル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルケニル - OH、- O - (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルキル、又は - O - (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルケニルから選択され、ここで、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルキル、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルケニル、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルキル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルキル - OH、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルケニル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルケニル - OH、- O - (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルキル、又は - O - (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルケニルのアルキル基及びアルケニル基が、非置換であるか、又は - F、- Cl、- OH、(=O)、- NH<sub>2</sub>、NH (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、もしくは - N ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)<sub>2</sub>、もしくは非置換 - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキルから選択される 1 から 3 個の置換基で置換される、化合物。

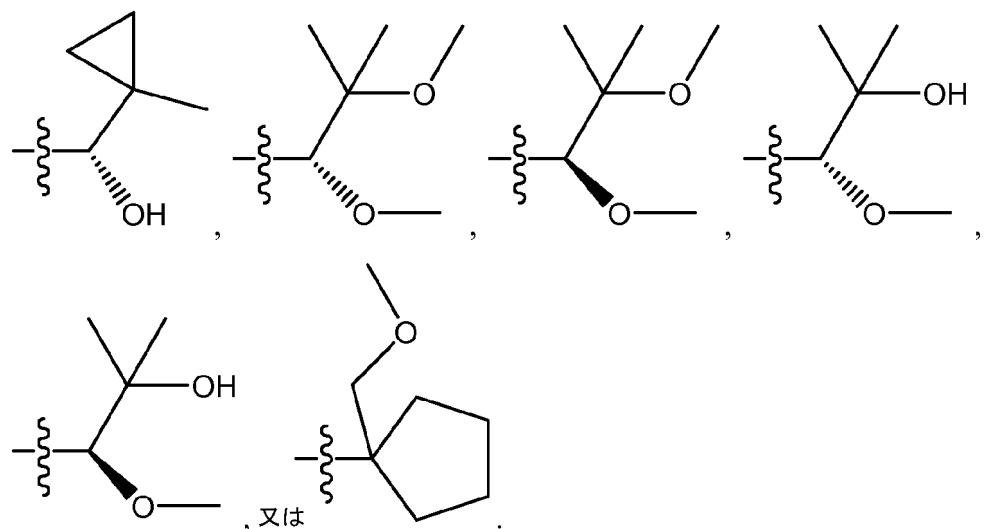
#### 【請求項 9】

請求項 7 に記載の化合物であって、A が、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル - OH、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルケニル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル、又は - (C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルケニル - OH であり、ならびに - (C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル - OH、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルケニル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル、又は - (C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルケニル - OH のアルキル基及びアルケニル基の各々は、非置換であるか又は - OH もしくは非置換 - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキルから選択される 1 つの置換基で置換される、化合物。

#### 【請求項 10】

請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の化合物であって、A が、



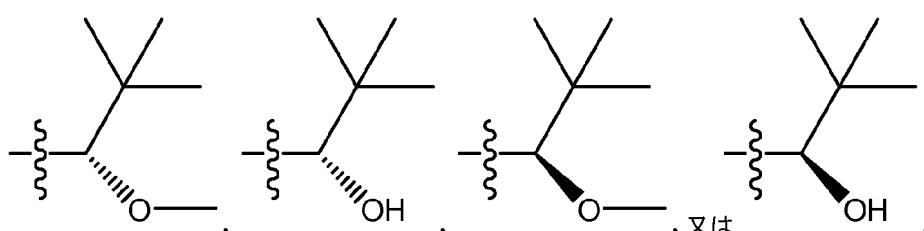


から選択される、化合物。

### 【請求項 11】

請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の化合物であって、A が、

【化 6】



である、化合物。

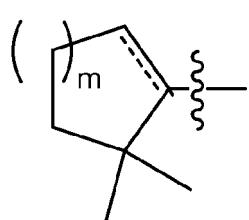
### 【請求項 12】

A が、1、2、3、又は4個のメチル基で任意に置換された( $C_5$  ~  $C_7$ )シクロアルキル基又は( $C_5$  ~  $C_7$ )シクロアルケニル基である、請求項1から4のいずれか一項に記載の化合物。

### 【請求項 13】

請求項 12 に記載の化合物であつて、A が化学式

【化 7】

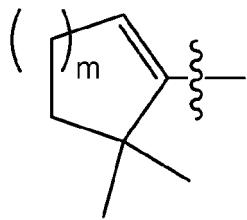


を有し、式中、 $m$  は 1、2、又は 3 であり、ならびに破線が一重結合又は二重結合を示す、化合物。

### 【請求項 14】

請求項 1-3 に記載の化合物であって、A が化学式

【化8】

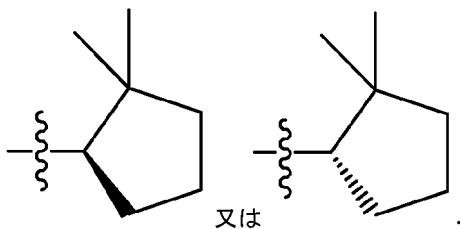


を有し、式中、mは1、2、又は3である、化合物。

【請求項15】

請求項13に記載の化合物であって、Aが

【化9】



から選択される、化合物。

【請求項16】

$R^7$ 及び $R^8$ が両方ともHである、請求項1から15のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項17】

$R^{1a}$ がH又は $-CH_3$ である、請求項1から16のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項18】

$R^{1a}$ がHである、請求項17に記載の化合物。

【請求項19】

$R^{1b}$ がH又は $-CH_3$ である、請求項1から18のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項20】

$R^{1b}$ がHである、請求項19に記載の化合物。

【請求項21】

$R^{1b'}$ がH又は $-CH_3$ である、請求項1から20のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項22】

$R^{1b'}$ がHである、請求項21に記載の化合物。

【請求項23】

存在する場合、 $R^{1c}$ がH又は $-CH_3$ である、請求項1から22のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項24】

存在する場合、 $R^{1c}$ がHである、請求項23に記載の化合物。

【請求項25】

存在する場合、 $R^{1c'}$ がH又は $-CH_3$ である、請求項1から24のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項26】

存在する場合、 $R^{1c'}$ がHである、請求項25に記載の化合物。

【請求項27】

存在する場合、 $R^{1d}$ がH又は $-CH_3$ である、請求項1から26のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項28】

存在する場合、 $R^{1d}$ がHである、請求項27に記載の化合物。

【請求項29】

存在する場合、 $R^{1-d}$  が H 又は  $-CH_3$  である、請求項 1 から 28 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 30】

存在する場合、 $R^{1-d}$  が H である、請求項 29 に記載の化合物。

【請求項 31】

q が 0、1、又は 2 である、請求項 1 から 30 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 32】

q が 0 である、請求項 31 に記載の化合物。

【請求項 33】

q が 1 である、請求項 31 に記載の化合物。

【請求項 34】

q が 2 である、請求項 31 に記載の化合物。

【請求項 35】

m が 0 である、請求項 1 から 34 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 36】

J が O、 $NR^b$ 、又は S である、請求項 1 から 35 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 37】

J が  $CR^cR^d$  である、請求項 1 から 35 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 38】

$R^c$  及び  $R^d$  が H 又は  $-CH_3$  から独立して選択される、請求項 37 に記載の化合物。

【請求項 39】

$R^c$  及び  $R^d$  が両方とも H である、請求項 37 に記載の化合物。

【請求項 40】

化合物が化学式 I' A を有する、請求項 1 から 39 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 41】

化合物が化学式 I' B を有する、請求項 1 から 39 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 42】

W、Y、及び Z は全て C - H である、請求項 1 から 41 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 43】

W 及び Z が C - H であり、Y が N である、請求項 1 から 41 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 44】

$R^{1-2-c}$  が H である、請求項 1 から 43 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 45】

$R^{1-2-c}$  が F である、請求項 1 から 43 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 46】

$R^{1-2-a}$  及び  $R^{1-2-b}$  が両方とも H である、請求項 1 から 45 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 47】

G が  $CR^{1-1-a}$  であり、 $R^{1-1-a}$  が H である、請求項 1 から 46 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 48】

G が  $CR^{1-1-a}$  であり、 $R^{1-1-a}$  が F である、請求項 1 から 46 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 49】

K は  $CR^{1-1-b}$  であり、L は  $CR^{1-1-c}$  であり、ならびに  $R^{1-1-b}$  と  $R^{1-1-c}$  の両方は H である、請求項 1 から 48 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 50】

$R^2$  が -H、-F、-CF<sub>3</sub>、又は -O-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>) アルキルから選択される、請

求項 1 から 4 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5 1】

$R^2$  が F、  $CF_3$ 、 又は ( $C_1$  ~  $C_6$ ) アルコキシから選択される、 請求項 1 から 5 0 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5 2】

$R^2$  が F、  $CF_3$ 、 又は ( $C_4$  ~  $C_6$ ) アルコキシから選択される、 請求項 5 1 に記載の化合物。

【請求項 5 3】

$R^2$  が F である、 請求項 5 1 に記載の化合物。

【請求項 5 4】

$R^2$  がプロポキシ、 ブトキシ、 又はペントキシである、 請求項 5 1 に記載の化合物。

【請求項 5 5】

$R^2$  が -  $C_1$  である、 請求項 1 から 4 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5 6】

$G$  は  $CR^{1\ 1\ a}$  であり；  $K$  は  $CR^{1\ 1\ b}$  であり；  $L$  は  $CR^{1\ 1\ c}$  であり；  $R^{1\ 1\ b}$ 、  $R^{1\ 1\ c}$ 、  $R^{1\ 2\ a}$ 、 及び  $R^{1\ 2\ b}$  は全て H であり；  $J$  は  $CR^c R^d$  であり；  $R^c$  は H であり；  $R^d$  は H であり；  $R^{1\ a}$  は H であり；  $R^{1\ b}$  は H であり；  $R^{1\ b\ '}$  は H であり； 存在する場合、  $R^{1\ d}$  は H であり； 存在する場合、  $R^{1\ d\ '}$  は H であり；  $W$  は C - H であり；  $Y$  は C - H 又は N であり；  $Z$  は C - H であり；  $R^2$  は F であり；  $R^3$  はメトキシであり；  $R^7$  は H であり；  $R^8$  は H であり；  $X$  は O であり；  $m$  は 0 であり； ならびに  $q$  は 0、 1、 又は 2 である、 請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5 7】

$Y$  が C - H である、 請求項 5 6 に記載の化合物。

【請求項 5 8】

$Y$  が N である、 請求項 5 6 に記載の化合物。

【請求項 5 9】

$q$  が 0 である、 請求項 5 6 から 5 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6 0】

$q$  が 1 である、 請求項 5 6 から 5 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6 1】

$q$  が 2 である、 請求項 5 6 から 5 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6 2】

$R^{1\ 2\ c}$  が H である、 請求項 5 6 から 6 1 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6 3】

$R^{1\ 2\ c}$  が F である、 請求項 5 6 から 6 1 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6 4】

$R^{1\ 1\ a}$  が H である、 請求項 5 6 から 6 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6 5】

$R^{1\ 1\ a}$  が F である、 請求項 5 6 から 6 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6 6】

$R^1$  が H である、 請求項 1 から 6 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6 7】

化合物が塩である、 請求項 1 から 6 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6 8】

$R^1$  が -  $CH_3$  又は -  $CH_2CH_3$  である、 請求項 1 から 6 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6 9】

薬学的に許容される担体、 希釈剤、 又は賦形剤、 及び請求項 1 から 6 8 のいずれか一項に記載の化合物を含む、 薬学的組成物。

【請求項 7 0】

疾患又は状態を治療するための薬学的組成物であって、前記疾患又は状態は、ⅠⅠ型糖尿病、肥満、高血糖、耐糖能異常、インスリン抵抗性、高インスリン血症、高コレステロール血症、高血圧、高リポタンパク血症、高脂質血症、高トリグリセリド血症、異常脂質血症、代謝症候群、X症候群、心臓血管疾患、アテローム性動脈硬化症、腎臓病、ケトアシドーシス、血栓疾患、腎症、糖尿病性腎症、糖尿病性網膜症、性機能障害、皮膚症、消化不良、低血糖症、癌、及び浮腫からなる群より選択される、請求項69に記載の薬学的組成物。

【請求項71】

疾患又は状態がⅠⅠ型糖尿病である、請求項70に記載の薬学的組成物。

【請求項72】

さらに第2の治療剤を含む、請求項70又は請求項71に記載の薬学的組成物。

【請求項73】

第2の治療剤がメトホルミンであるか、チアゾリジンジオンであるか、又はDPP-IV阻害剤である、請求項72に記載の薬学的組成物。

【請求項74】

ⅠⅠ型糖尿病、肥満、高血糖、耐糖能異常、インスリン抵抗性、高インスリン血症、高コレステロール血症、高血圧、高リポタンパク血症、高脂質血症、高トリグリセリド血症、異常脂質血症、代謝症候群、X症候群、心臓血管疾患、アテローム性動脈硬化症、腎臓病、ケトアシドーシス、血栓疾患、腎症、糖尿病性腎症、糖尿病性網膜症、性機能障害、皮膚症、消化不良、低血糖症、癌、及び浮腫からなる群より選択される疾患又は状態を治療するための医薬の調製における、請求項1から68のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項75】

疾患又は状態がⅠⅠ型糖尿病である、請求項74に記載の使用。

【請求項76】

ⅠⅠ型糖尿病、肥満、高血糖、耐糖能異常、インスリン抵抗性、高インスリン血症、高コレステロール血症、高血圧、高リポタンパク血症、高脂質血症、高トリグリセリド血症、異常脂質血症、代謝症候群、X症候群、心臓血管疾患、アテローム性動脈硬化症、腎臓病、ケトアシドーシス、血栓疾患、腎症、糖尿病性腎症、糖尿病性網膜症、性機能障害、皮膚症、消化不良、低血糖症、癌、及び浮腫からなる群より選択される疾患又は状態を治療するための、請求項1から68のいずれか一項に記載の化合物。

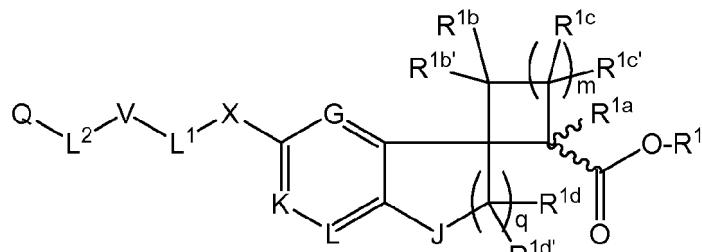
【請求項77】

疾患又は状態がⅠⅠ型糖尿病である、請求項76に記載の化合物。

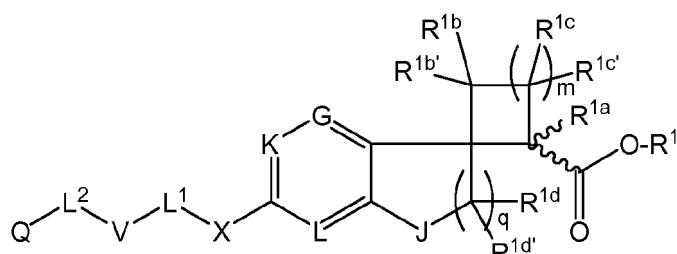
【請求項78】

化学式IA又はIB：

【化10】



IA



IB

の化合物又はその薬学的に許容される塩、立体異性体、又は混合物であって、  
〔式中、

GはN又はC R<sup>1</sup> R<sup>1</sup><sup>a</sup>から選択され；

KはN又はC R<sup>1</sup> R<sup>1</sup><sup>b</sup>から選択され；

LはN又はC R<sup>1</sup> R<sup>1</sup><sup>c</sup>から選択され；

G、L、及びKのうちの0又は1つはNであり；

XはO、S、又はNR<sup>a</sup>であり、R<sup>a</sup>は-H又は-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル基から選択され；

JはO、S、NR<sup>b</sup>、CR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>、C(=O)、又は-C(=O)-NR<sup>b</sup>-から選択され；R<sup>b</sup>はH及び(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキルから選択され、ならびにさらにR<sup>c</sup>及びR<sup>d</sup>は、独立して、H、F、及び(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキルから選択され；

L<sup>1</sup>は存在しないか又は(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキルであり；

Vは(C<sub>4</sub>~C<sub>8</sub>)シクロアルキル；(C<sub>6</sub>~C<sub>10</sub>)アリール；5から10員環員を含むヘテロアリールであって、その環員の1から3個がN、O、及びSから選択されるヘテロ原子であるヘテロアリール；ベンゾ縮合(C<sub>5</sub>~C<sub>8</sub>)シクロアルキルであって、ベンゾ縮合(C<sub>5</sub>~C<sub>8</sub>)シクロアルキルのシクロアルキル基が、存在する場合、L<sup>1</sup>に結合されており、もしくはL<sup>1</sup>が存在しない場合、Xに結合されているベンゾ縮合(C<sub>5</sub>~C<sub>8</sub>)シクロアルキル；ベンゾ縮合(C<sub>5</sub>~C<sub>8</sub>)シクロアルキルであって、ベンゾ縮合(C<sub>5</sub>~C<sub>8</sub>)シクロアルキルの芳香族基が、存在する場合、L<sup>1</sup>に結合されており、もしくはL<sup>1</sup>が存在しない場合、Xに結合されているベンゾ縮合(C<sub>5</sub>~C<sub>8</sub>)シクロアルキル；ヘテロアリール縮合シクロアルキルであって、ヘテロアリール縮合シクロアルキルのシクロアルキル基が、存在する場合、L<sup>1</sup>に結合され、又はL<sup>1</sup>が存在しない場合にはXに結合される、ヘテロアリール縮合(C<sub>5</sub>~C<sub>8</sub>)シクロアルキル；又はヘテロアリール縮合シクロアルキルであって、ヘテロアリール縮合シクロアルキルのヘテロアリール基が、存在する場合、L<sup>1</sup>に結合され、もしくは、L<sup>1</sup>が存在しない場合、Xに結合される、ヘテロアリール縮合(C<sub>5</sub>~C<sub>8</sub>)シクロアルキルから選択され；ここで、(C<sub>6</sub>~C<sub>10</sub>)アリール、ヘテロアリール、ベンゾ縮合(C<sub>5</sub>~C<sub>8</sub>)シクロアルキル、及びヘテロアリール縮合(C<sub>5</sub>~C<sub>8</sub>)シクロアルキル基は、F、Cl、Br、OH、-O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル基、-S(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル基(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル基、-CF<sub>3</sub>、又は化学式Aの基から独立して選択される1から4個の置換基で任意に置換され、こ

ここで、Aは、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルキル；- (C<sub>2</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルケニル；- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルキル-O- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル；- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルキル-OH；- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルキル-O- (C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルケニル；- (C<sub>2</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルケニル-O- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル；- (C<sub>2</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルケニル-OH；- (C<sub>2</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルケニル-O- (C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルケニル；- O- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルキル；- O- (C<sub>2</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルケニル；- O- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル-アリール；- S- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルキル；- S- (C<sub>2</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルケニル；- S(O)- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルキル；- S(O)- (C<sub>2</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルケニル；- S(O)<sub>2</sub>- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルキル；- S(O)<sub>2</sub>- (C<sub>2</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルケニル；複素環であって、4から7個の環員を含み、その環員の1又は2個がN、O、もしくはSから選択されるヘテロ原子であり、前記複素環が環員の間で0もしくは1個の二重結合を有し、ならびに非置換であるかもしくは1から4個の(C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル基で置換される、複素環；- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル-ヘテロシクリルであって、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル-ヘテロシクリルのヘテロシクリルが、4から7個の環員を含み、その環員の1又は2個がN、O、もしくはSから選択されるヘテロ原子であり、前記複素環が環員の間で0もしくは1個の二重結合を有し、ならびに非置換であるかもしくは1から4個の(C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル基で置換される、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル-ヘテロシクリル；又は、- O- ヘテロシクリルであって、- O- ヘテロシクリルが4から7個の環員を含み、その1又は2個がN、O、もしくはSから選択されるヘテロ原子であり、前記複素環が環員の間で0もしくは1個の二重結合を有し、ならびに非置換であるかもしくは1から4個の(C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル基で置換される、- O- ヘテロシクリルから選択され；さらに、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルキル、- (C<sub>2</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルケニル、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルキル-O- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルキル-O-H、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルキル-O- (C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルケニル、- (C<sub>2</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルケニル-OH、- (C<sub>2</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルケニル-O- (C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルケニル、- O- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルキル、- O- (C<sub>2</sub> ~ C<sub>1,2</sub>) アルケニル、及び- O- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル-アリールのアルキル基及びアルケニル基は、非置換であるか、又は- F、- Cl、- OH、(=O)、- NH<sub>2</sub>、NH(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)<sub>2</sub>、アリール、非置換- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル、又は非置換- O- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキルから選択される1から4個の置換基で置換され；

L<sup>2</sup>は存在しないか、又はO、S、SO、SO<sub>2</sub>、C(=O)、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル、もしくはNR<sup>x</sup>から選択され、ここで、R<sup>x</sup>は-H又は- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル基から選択され；

Qは、H、(C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>) シクロアルキル；(C<sub>6</sub> ~ C<sub>1,0</sub>) アリール；又はヘテロアリールであって、5 ~ 10個の環員を含み、その環員の1から3個が、N、O、及びSから選択されるヘテロ原子であるヘテロアリールから選択され；ここで、(C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>) シクロアルキル基、(C<sub>6</sub> ~ C<sub>1,0</sub>) アリール基、及びヘテロアリール基は、F、Cl、Br、OH、- O(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル基、- S(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル基(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル基、又は- CF<sub>3</sub>から独立して選択される1から5個の置換基で任意に置換され、

R<sup>1</sup>はH又は- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキルであり；

R<sup>1,a</sup>は-H及び- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキルから選択され；

R<sup>1,b</sup>は-H及び- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキルから選択され；

R<sup>1,b'</sup>は-H及び- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキルから選択され；

R<sup>1,c</sup>は-H及び- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキルから選択され；

R<sup>1,c'</sup>は-H及び- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキルから選択され；

R<sup>1,d</sup>は、それぞれの場合で独立して、- H、- F、及び- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキルから選択され；

R<sup>1,d'</sup>は、それぞれの場合で独立して、- H、- F 及び- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル

から独立して選択され；

$R^{1-1a}$ 、 $R^{1-1b}$ 、及び $R^{1-1c}$ は、独立して、-H、-F、-Cl、-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル、又は-O(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキルから選択され；

mは0又は1であり；ならびに

qは0、1、2、又は3から選択され、

ここで、

【化11】

~~~~~

は、 R^{1-a} 及び-C(=O)-O-R¹が、

【化12】

~~~~~

が結合している環のいずれの側に結合されても良く、RとSのいずれの立体化学も許容されることを示す]、

化学式IA又はIBの化合物、又はその薬学的に許容される塩、立体異性体、又は混合物。

【請求項79】

GはCR<sup>1-1a</sup>であり、R<sup>1-1a</sup>はHである、請求項78に記載の化合物。

【請求項80】

GはCR<sup>1-1a</sup>であり、R<sup>1-1a</sup>はFである、請求項78に記載の化合物。

【請求項81】

KはCR<sup>1-1b</sup>であり、LはCR<sup>1-1c</sup>であり、ならびにR<sup>1-1b</sup>とR<sup>1-1c</sup>の両方がHである、請求項78から80のいずれか一項に記載の化合物。

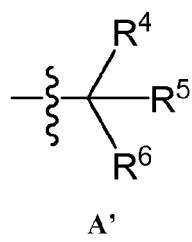
【請求項82】

Aが(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)アルキル又は(C<sub>4</sub>~C<sub>10</sub>)アルケニルから選択される、請求項78から80のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項83】

請求項78から81のいずれか一項に記載の化合物であって、Aは化学式A'、

【化13】



A'

の基であり、式中、波線は結合の点を示し；ならびに

$R^4$ 、 $R^5$ 、及び $R^6$ は、H、F、(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキルから独立して選択され、 $R^4$ 、 $R^5$ 、及び $R^6$ のうちの少なくとも2つがH以外であり；又は $R^4$ 、 $R^5$ 、及び $R^6$ のうちの2もしくは3個が一緒に結合して、任意に置換された飽和又は部分的に不飽和の3~8員单環もしくは二環を形成する、化合物。

【請求項84】

請求項78から81のいずれか一項の化合物であって、Aが、-(C<sub>4</sub>~C<sub>12</sub>)アルキル、-(C<sub>4</sub>~C<sub>12</sub>)アルケニル、-(C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>)アルキル-O-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル、-(C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>)アルキル-OH、-(C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>)アルケニル-O-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル、-(C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>)アルケニル-OH、-O-(C<sub>4</sub>~C<sub>12</sub>)アルキル、-O-(C<sub>4</sub>~C<sub>12</sub>)アルケニル、NもしくはOから選択される1もしくは2個のヘテロ原子を含む4から7員複素環であって、前記複素環は環員間で0又は1個の二重結合を含み、ならびに非置換であるかもしくは1から4個の(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルキ

ル基で置換される、複素環、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル - ヘテロシクリルであって、ここで、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル - ヘテロシクリルのヘテロシクリルは、NもしくはOから選択される1もしくは2個のヘテロ原子を含む4から7員複素環であり、前記複素環は環員の間でOもしくは1個の二重結合を含み、ならびに非置換であるかもしくは1から4個の(C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル基で置換される、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル - ヘテロシクリル、又は、- O - ヘテロシクリルであって、ここで、- O - ヘテロシクリルのヘテロシクリルは、NもしくはOから選択される1もしくは2個のヘテロ原子を含む4から7員複素環であり、前記複素環は環員の間でOもしくは1個の二重結合を含み、ならびに非置換であるかもしくは1から4個の(C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル基で置換される、- O - ヘテロシクリルから選択され、さらに、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルキル、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルケニル、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルキル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルキル - O - H、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルケニル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルケニル - OH、- O - (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルキル、又は- O - (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルケニルのアルキル基及びアルケニル基が、非置換であるか、又は- F、- Cl、- OH、(=O)、- NH<sub>2</sub>、NH (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- N ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)<sub>2</sub>、アリール、もしくは非置換 - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキルから選択される1から3個の置換基で置換される、化合物。

#### 【請求項 8 5】

請求項7 8から8 1に記載のいずれか一項の化合物であって、Aが、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルキル、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルケニル、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルキル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルキル - OH、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルケニル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルケニルから選択され、ここで、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルキル、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルケニル、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルキル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルキル - OH、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルケニル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、又は- O - (C<sub>4</sub> ~ C<sub>1</sub><sub>2</sub>) アルケニルのアルキル基及びアルケニル基が、非置換であるか、又は- F、- Cl、- OH、(=O)、- NH<sub>2</sub>、NH (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、もしくは- N ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)<sub>2</sub>、もしくは非置換 - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキルから選択される1から3個の置換基で置換される、化合物。

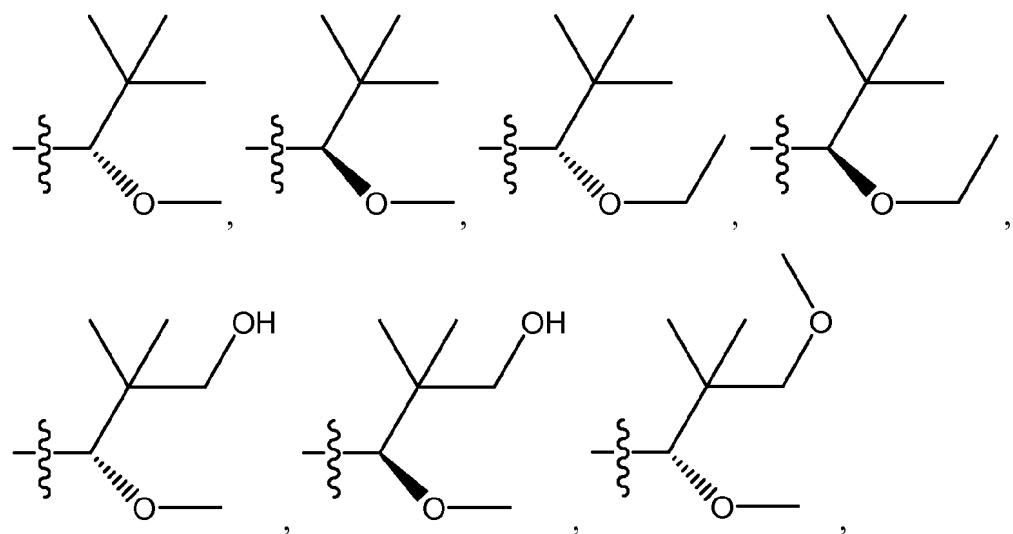
#### 【請求項 8 6】

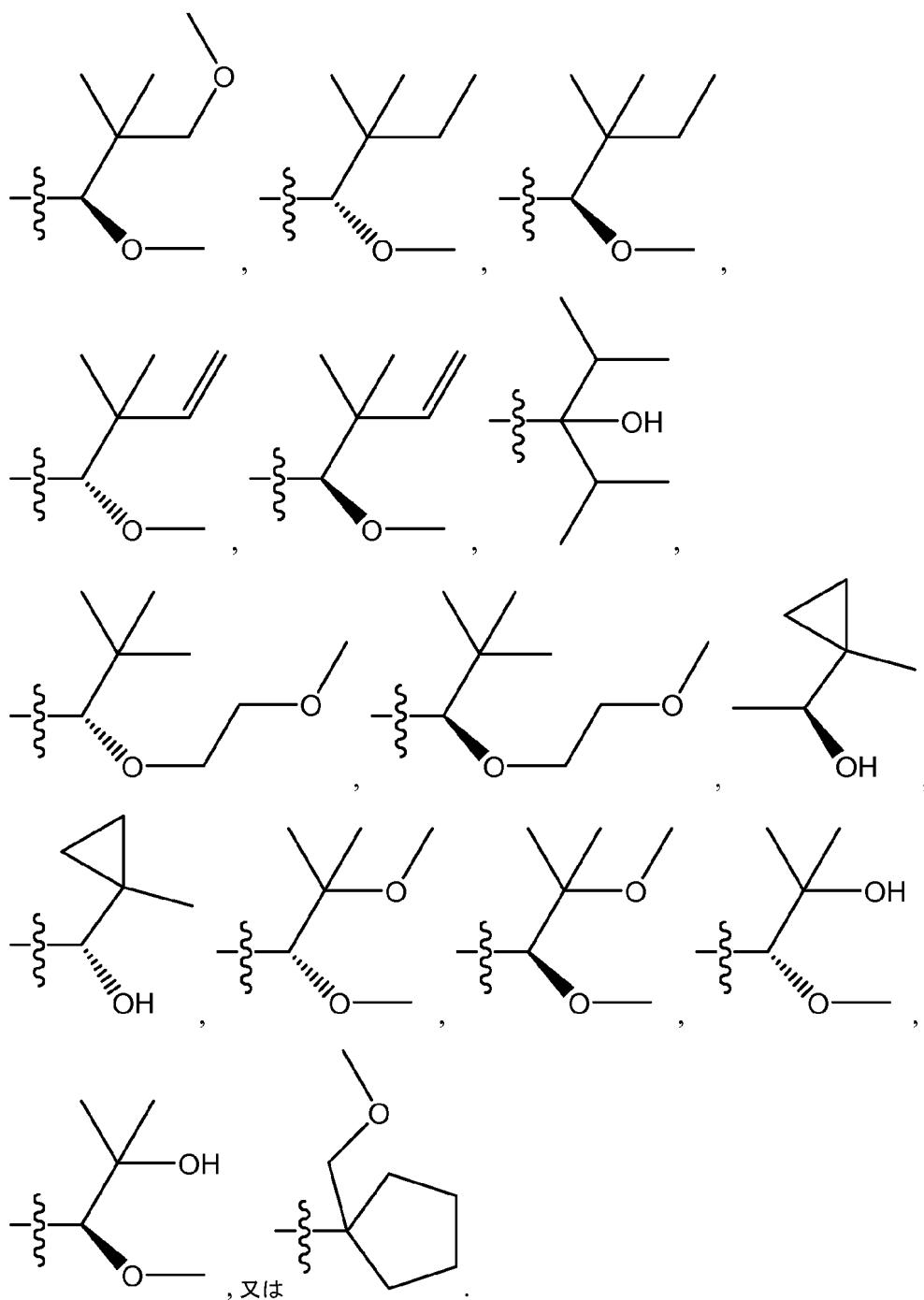
請求項7 8から8 1のいずれか一項に記載の化合物であって、Aが、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル - OH、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルケニル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル、又は- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルケニル - OHであり、ならびに- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル - OH、- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルケニル - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル、又は- (C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルケニル - OHのアルキル基及びアルケニル基の各々は、非置換であるか又は- OHもしくは非置換 - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキルから選択される1つの置換基で置換される、化合物。

#### 【請求項 8 7】

請求項7 8から8 1のいずれか一項に記載の化合物であって、Aが、

【化 14】



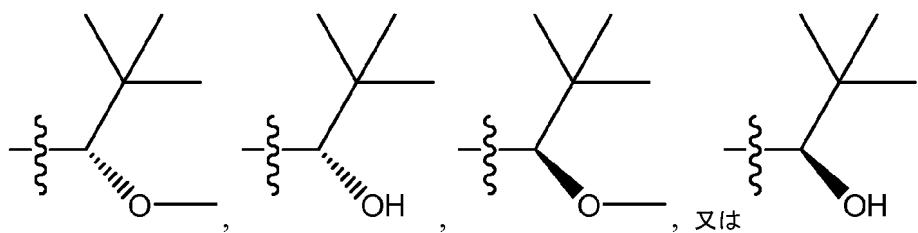


から選択される、化合物。

【請求項 8 8】

請求項 7 8 から 8 1 のいずれか一項の化合物であって、A が、

【化 1 5】



である、化合物。

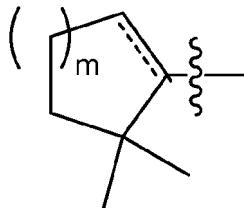
【請求項 8 9】

Aが、1、2、3、又は4個のメチル基で任意に置換された( $C_5$ ~ $C_7$ )シクロアルキル基又は( $C_5$ ~ $C_7$ )シクロアルケニル基である、請求項78から81のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項90】

請求項89に記載の化合物であって、Aが化学式

【化16】

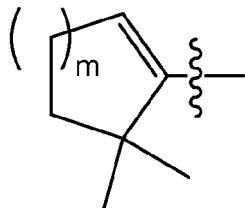


を有し、式中、mは1、2、又は3であり、ならびに破線が一重結合又は二重結合を示す化合物。

【請求項91】

請求項90に記載の化合物であって、Aが化学式

【化17】

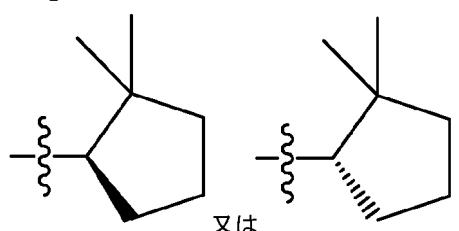


を有し、式中、mは1、2、又は3である、化合物。

【請求項92】

請求項90に記載の化合物であって、Aが

【化18】



から選択される、化合物。

【請求項93】

$R^{1a}$ がH又は $-CH_3$ である、請求項78から92のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項94】

$R^{1a}$ がHである、請求項93に記載の化合物。

【請求項95】

$R^{1b}$ がH又は $-CH_3$ である、請求項78から94のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項96】

$R^{1b}$ がHである、請求項95に記載の化合物。

【請求項97】

$R^{1b'}$ がH又は $-CH_3$ である、請求項78から96のいずれか一項に記載の化合物

。

【請求項98】

$R^{1b'}$ がHである、請求項97に記載の化合物。

**【請求項 9 9】**

存在する場合、 $R^{1c}$  が H 又は -CH<sub>3</sub> である、請求項 7 8 から 9 8 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 1 0 0】**

存在する場合、 $R^{1c}$  が H である、請求項 9 9 に記載の化合物。

**【請求項 1 0 1】**

存在する場合、 $R^{1c'}$  が H 又は -CH<sub>3</sub> である、請求項 7 8 から 1 0 0 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 1 0 2】**

存在する場合、 $R^{1c'}$  が H である、請求項 1 0 1 に記載の化合物。

**【請求項 1 0 3】**

存在する場合、 $R^{1d}$  が H 又は -CH<sub>3</sub> である、請求項 7 8 から 1 0 2 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 1 0 4】**

存在する場合、 $R^{1d}$  が H である、請求項 1 0 3 に記載の化合物。

**【請求項 1 0 5】**

存在する場合、 $R^{1d'}$  が H 又は -CH<sub>3</sub> である、請求項 7 8 から 1 0 4 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 1 0 6】**

存在する場合、 $R^{1d'}$  が H である、請求項 1 0 5 に記載の化合物。

**【請求項 1 0 7】**

q が 0、1、又は 2 である、請求項 7 8 から 1 0 6 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 1 0 8】**

q が 0 である、請求項 1 0 7 に記載の化合物。

**【請求項 1 0 9】**

q が 1 である、請求項 1 0 7 に記載の化合物。

**【請求項 1 1 0】**

q が 2 である、請求項 1 0 7 に記載の化合物。

**【請求項 1 1 1】**

m が 0 である、請求項 7 8 から 1 1 0 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 1 1 2】**

J が O、NR<sup>b</sup>、又は S である、請求項 7 8 から 1 1 0 のいずれか一項に記載の化合物。

。

**【請求項 1 1 3】**

J が CR<sup>c</sup>R<sup>d</sup> である、請求項 7 8 から 1 1 0 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 1 1 4】**

R<sup>c</sup> 及び R<sup>d</sup> が H 又は -CH<sub>3</sub> から独立して選択される、請求項 1 1 3 に記載の化合物。

。

**【請求項 1 1 5】**

R<sup>c</sup> 及び R<sup>d</sup> が両方とも H である、請求項 1 1 3 に記載の化合物。

**【請求項 1 1 6】**

化合物が化学式 I A を有する、請求項 7 8 から 1 1 5 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 1 1 7】**

化合物が化学式 I B を有する、請求項 7 8 から 1 1 5 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 1 1 8】**

X が O である、請求項 7 8 から 1 1 7 のいずれか一項に記載の化合物。

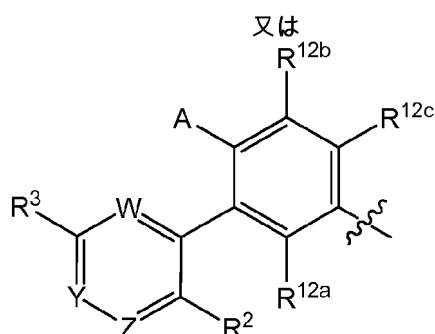
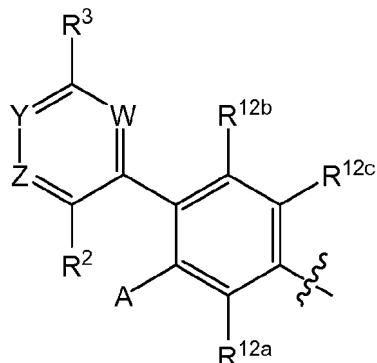
**【請求項 1 1 9】**

請求項 7 8 に記載の化合物であって、

【化19】

Q—L<sup>2</sup>—V—

が化学式



を有し、

[式中、

W、Y、及びZはN又はC R<sup>1~3</sup>から選択され；W、Y、及びZのうちの0、1つ、又は2つはNであり；ならびにさらに、R<sup>2</sup>が-Fであるならば、ZはNではなく；

Aは、-(C<sub>1</sub>~C<sub>1~2</sub>)アルキル；-(C<sub>2</sub>~C<sub>1~2</sub>)アルケニル；-(C<sub>1</sub>~C<sub>1~2</sub>)アルキル-O-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル；-(C<sub>1</sub>~C<sub>1~2</sub>)アルキル-OH；-(C<sub>1</sub>~C<sub>1~2</sub>)アルキル-O-(C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>)アルケニル；-(C<sub>2</sub>~C<sub>1~2</sub>)アルケニル-OH；-(C<sub>2</sub>~C<sub>1~2</sub>)アルケニル-O-(C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>)アルケニル；-O-(C<sub>1</sub>~C<sub>1~2</sub>)アルキル；-O-(C<sub>2</sub>~C<sub>1~2</sub>)アルケニル；-O-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル-アリール；-S-(C<sub>1</sub>~C<sub>1~2</sub>)アルキル；-S-(C<sub>2</sub>~C<sub>1~2</sub>)アルケニル；-S(O)-(C<sub>1</sub>~C<sub>1~2</sub>)アルキル；-S(O)-(C<sub>2</sub>~C<sub>1~2</sub>)アルケニル；-S(O)<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>~C<sub>1~2</sub>)アルキル；複素環であって、4から7個の環員を含み、その環員の1又は2個がN、O、もしくはSから選択されるヘテロ原子であり、前記複素環が環員の間で0もしくは1個の二重結合を有し、ならびに非置換であるかもしくは1から4個の(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルキル基で置換される、複素環；-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル-ヘテロシクリルであって、-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル-ヘテロシクリルのヘテロシクリルが、4から7個の環員を含み、その1又は2個がN、O、もしくはSから選択されるヘテロ原子であり、前記複素環が環員の間で0もしくは1個の二重結合を有し、ならびに非置換であるかもしくは1から4個の(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルキル基で置換される、-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル-ヘテロシクリル；又は、-O-ヘテロシクリルであって、-O-ヘテロシクリルのヘテロシクリルが4から7個の環員を含み、その1又は2個がN、O、もしくはSから選択されるヘテロ原子であり、前記複素環が環員の間で0もしくは1個の二重結合を有し、ならびに非置換であるかもしくは1から4個の(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルキル基で置換される、-O-ヘテロシクリルから選択され；さらに、-(C<sub>1</sub>~C<sub>1~2</sub>)アルキル、-(C<sub>2</sub>~C<sub>1~2</sub>)アルケニル、-(C<sub>1</sub>~C<sub>1~2</sub>)アルキル-O-

(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルキル-O-H、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルキル-O-(C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルケニル、- (C<sub>2</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルケニル-OH、- (C<sub>2</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルケニル-O-(C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルケニル、- O-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルキル、- O-(C<sub>2</sub> ~ C<sub>1~2</sub>) アルケニル、及び - O-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル - アリールのアルキル基及びアルケニル基は、非置換であるか、又は - F、- Cl、- OH、(=O)、- NH<sub>2</sub>、NH(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)<sub>2</sub>、アリール、非置換 - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル、もしくは非置換 - O-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキルから選択される 1 から 4 個の置換基で置換され；

R<sup>2</sup> は、- H、- F、- CF<sub>3</sub>、- Cl、又は - O-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキルから選択され；

R<sup>3</sup> は - H、- F、- Cl、- OH、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- O-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルキル、又は - S-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキルであり；

R<sup>1~2<sup>a</sup></sup>、R<sup>1~2<sup>b</sup></sup>、及び R<sup>1~2<sup>c</sup></sup> は、独立して、- H、- F、- Cl、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、又は - O(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキルから選択され；ならびに

R<sup>1~3</sup> は - H、- F、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、及び - O-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキルから選択され；ならびに

結合を横切る

【化 2 0】



は、存在するならば、L<sup>1</sup>への結合点を示し、又は L<sup>1</sup> が存在しないならば、Xへの結合点を示す】、化合物。

【請求項 1 2 0】

X が O である、請求項 1 1 9 に記載の化合物。

【請求項 1 2 1】

R<sup>3</sup> が - OH、- O(C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル、又は - S(C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキルから選択される、請求項 1 1 9 又は請求項 1 2 0 に記載の化合物。

【請求項 1 2 2】

R<sup>3</sup> がメトキシである、請求項 1 1 9 に記載の化合物。

【請求項 1 2 3】

W、Y、及び Z は全て C-H である、請求項 1 1 9 から 1 2 2 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 2 4】

W 及び Z が C-H であり、Y が N である、請求項 1 1 9 から 1 2 2 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 2 5】

R<sup>1~2<sup>c</sup></sup> が H である、請求項 1 1 9 から 1 2 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 2 6】

R<sup>1~2<sup>c</sup></sup> が F である、請求項 1 1 9 から 1 2 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 2 7】

R<sup>1~2<sup>a</sup></sup> 及び R<sup>1~2<sup>b</sup></sup> が両方とも H である、請求項 1 1 9 から 1 2 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 2 8】

G が CR<sup>1~1<sup>a</sup></sup> であり、R<sup>1~1<sup>a</sup></sup> が H である、請求項 1 1 9 から 1 2 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 2 9】

G が CR<sup>1~1<sup>a</sup></sup> であり、R<sup>1~1<sup>a</sup></sup> が F である、請求項 1 1 9 から 1 2 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 3 0】

K は  $C R^{1 \sim 1^b}$  であり、L は  $C R^{1 \sim 1^c}$  であり、ならびに  $R^{1 \sim 1^b}$  と  $R^{1 \sim 1^c}$  の両方がH である、請求項 119 から 129 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 131】

$R^2$  が -H、-F、-CF<sub>3</sub>、又は -O-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>) アルキルから選択される、請求項 119 から 130 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 132】

$R^2$  が -Cl から選択される、請求項 119 から 130 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 133】

$R^2$  が F、CF<sub>3</sub>、又は (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>) アルコキシから選択される、請求項 119 から 130 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 134】

$R^2$  が F、CF<sub>3</sub>、又は (C<sub>4</sub>~C<sub>6</sub>) アルコキシから選択される、請求項 133 に記載の化合物。

【請求項 135】

$R^2$  が F である、請求項 133 に記載の化合物。

【請求項 136】

$R^2$  が プロポキシ、ブトキシ、又は ペントキシである、請求項 133 に記載の化合物。

【請求項 137】

G が  $C R^{1 \sim 1^a}$  であり； K は  $C R^{1 \sim 1^b}$  であり； L は  $C R^{1 \sim 1^c}$  であり；  $R^{1 \sim 1^b}$ 、 $R^{1 \sim 1^c}$ 、 $R^{1 \sim 2^a}$ 、及び  $R^{1 \sim 2^b}$  は全て H であり； J は  $C R^c R^d$  であり；  $R^c$  は H であり；  $R^d$  は H であり；  $R^{1^a}$  は H であり；  $R^{1^b}$  は H であり；  $R^{1^b'}$  は H であり； 存在する場合、 $R^{1^d}$  は H であり； 存在する場合、 $R^{1^d'}$  は H であり； W は C-H であり； Y は C-H 又は N であり； Z は C-H であり；  $R^2$  は F であり；  $R^3$  は メトキシであり；  $R^7$  は H であり；  $R^8$  は H であり； X は O であり； m は 0 であり； ならびに q は 0、1、又は 2 である、請求項 119 に記載の化合物。

【請求項 138】

Y が C-H である、請求項 137 に記載の化合物。

【請求項 139】

Y が N である、請求項 137 に記載の化合物。

【請求項 140】

q が 0 である、請求項 137 から 139 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 141】

q が 1 である、請求項 137 から 139 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 142】

q が 2 である、請求項 137 から 139 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 143】

$R^{1 \sim 2^c}$  が H である、請求項 137 から 142 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 144】

$R^{1 \sim 2^c}$  が F である、請求項 137 から 142 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 145】

$R^{1 \sim 1^a}$  が H である、請求項 137 から 144 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 146】

$R^{1 \sim 1^a}$  が F である、請求項 137 から 144 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 147】

$R^1$  が H である、請求項 78 から 146 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 148】

化合物が 塩である、請求項 78 から 146 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 149】

$R^1$  が -CH<sub>3</sub> 又は -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> である、請求項 78 から 146 のいずれか一項に記

載の化合物。

【請求項 150】

薬学的に許容される担体、希釈剤、又は賦形剤、及び請求項78から149のいずれか一項に記載の化合物を含む、薬学的組成物。

【請求項 151】

疾患又は状態を治療するための薬学的組成物であって、前記疾患又は状態は、ⅠⅠ型糖尿病、肥満、高血糖、耐糖能異常、インスリン抵抗性、高インスリン血症、高コレステロール血症、高血圧、高リポタンパク血症、高脂質血症、高トリグリセリド血症、異常脂質血症、代謝症候群、X症候群、心臓血管疾患、アテローム性動脈硬化症、腎臓病、ケトアシドーシス、血栓疾患、腎症、糖尿病性腎症、糖尿病性網膜症、性機能障害、皮膚症、消化不良、低血糖症、癌、及び浮腫からなる群より選択される、請求項150に記載の薬学的組成物。

【請求項 152】

疾患又は状態がⅠⅠ型糖尿病である、請求項151に記載の薬学的組成物。

【請求項 153】

さらに第2の治療剤を含む、請求項151又は請求項152に記載の薬学的組成物。

【請求項 154】

第2の治療剤がメトホルミンであるか、チアゾリジンジオンであるか、又はDPP-IV阻害剤である、請求項153に記載の薬学的組成物。

【請求項 155】

ⅠⅠ型糖尿病、肥満、高血糖、耐糖能異常、インスリン抵抗性、高インスリン血症、高コレステロール血症、高血圧、高リポタンパク血症、高脂質血症、高トリグリセリド血症、異常脂質血症、代謝症候群、X症候群、心臓血管疾患、アテローム性動脈硬化症、腎臓病、ケトアシドーシス、血栓疾患、腎症、糖尿病性腎症、糖尿病性網膜症、性機能障害、皮膚症、消化不良、低血糖症、癌、及び浮腫からなる群より選択される疾患又は状態を治療するための医薬の調製における、請求項78から149のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 156】

疾患又は状態がⅠⅠ型糖尿病である、請求項155に記載の使用。

【請求項 157】

ⅠⅠ型糖尿病、肥満、高血糖、耐糖能異常、インスリン抵抗性、高インスリン血症、高コレステロール血症、高血圧、高リポタンパク血症、高脂質血症、高トリグリセリド血症、異常脂質血症、代謝症候群、X症候群、心臓血管疾患、アテローム性動脈硬化症、腎臓病、ケトアシドーシス、血栓疾患、腎症、糖尿病性腎症、糖尿病性網膜症、性機能障害、皮膚症、消化不良、低血糖症、癌、及び浮腫からなる群より選択される疾患又は状態を治療するための、請求項78から149のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 158】

疾患又は状態がⅠⅠ型糖尿病である、請求項157に記載の化合物。