

【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27年12月3日(2015.12.3)

【公表番号】特表2014-524411(P2014-524411A)

【公表日】平成26年9月22日(2014.9.22)

【年通号数】公開・登録公報2014-051

【出願番号】特願2014-523151(P2014-523151)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/40 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4409 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 213/40 C S P

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 3/04

A 6 1 K 31/4409

【手続補正書】

【提出日】平成27年7月31日(2015.7.31)

【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

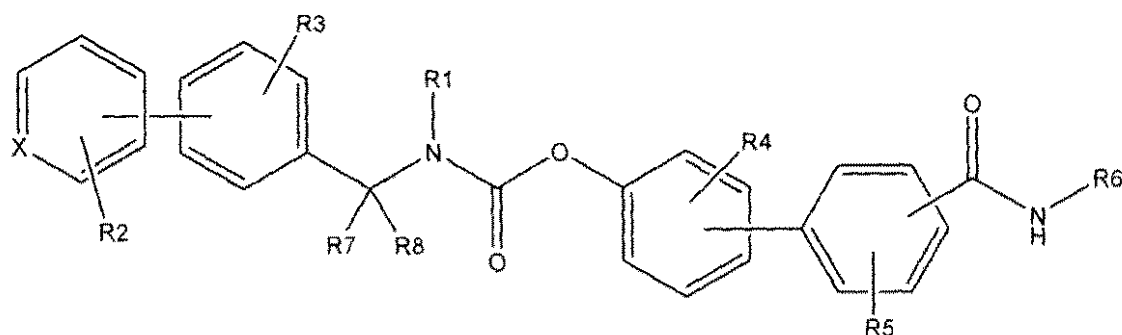
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】



(式中の、XはN又はCHであり；

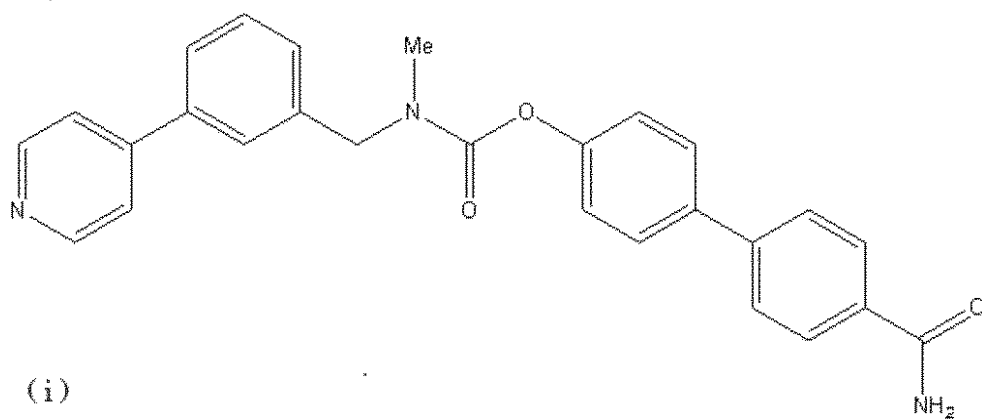
R 1 は、低級直鎖若しくは分岐鎖アルキル、シクロアルキル、低級直鎖若しくは分岐鎖アルケニル、シクロアルケニル又はアリールであり；

それぞれの R 2、R 3、R 4 及び R 5 は、H 又は 1 つ若しくはそれ以上の独立して選ばれる置換基であり；

R 6 は、H、低級直鎖若しくは分岐鎖アルキル、又はシクロアルキルであり；

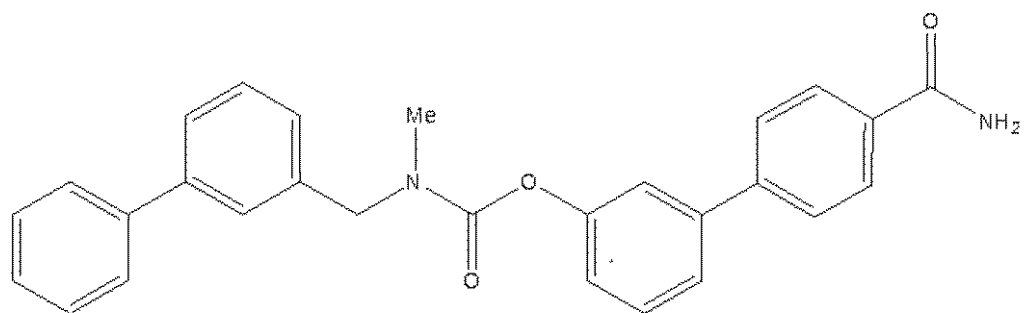
それぞれの R 7 及び R 8 は、独立して、H、低級アルキル又はフッ化物から選ばれるが、当該化合物は以下の化合物

【化 2】



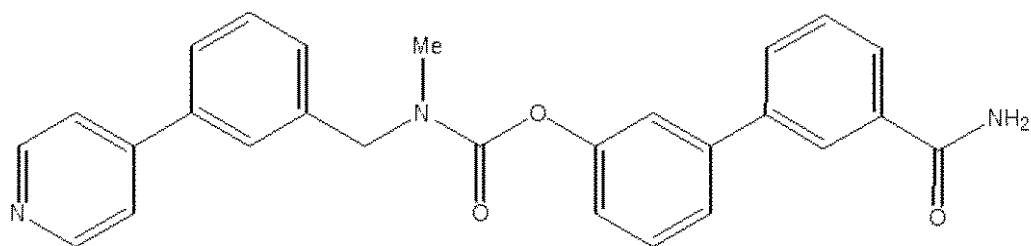
(i)

【化 3】



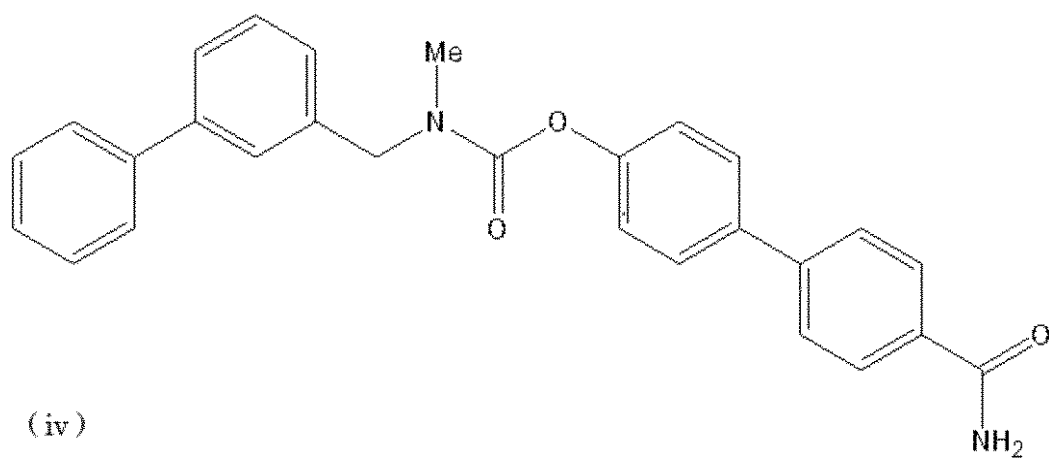
(ii)

【化 4】



(iii)

【化 5】



(iv)

以外である) :
の化合物又はその薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 2】

R 1 が、C 1 ~ 6 直鎖若しくは C 3 ~ 6 分岐鎖アルキル、C 3 ~ 6 シクロアルキル、又は置換されていてもよいフェニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R 6 が、H、C 1 ~ 6 直鎖アルキル、C 3 ~ 6 分岐鎖アルキル、又は C 3 ~ 6 シクロアルキルである、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R 2、R 3、R 4 及び R 5 が、H 又は 1 つの独立して選ばれる置換基である、請求項 1 ~ 3 の何れか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

それぞれの R 7 及び R 8 が、H 又は C 1 ~ 3 アルキルから独立して選ばれる、請求項 1 ~ 4 の何れか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

R 2、R 3、R 4、R 5、R 7 及び R 8 が、それぞれ H である、請求項 1 ~ 5 の何れか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

当該化合物が、X が CH であり、R 1 が C 1 ~ 3 直鎖アルキル、C 3 分岐鎖アルキル又は置換されていてもよいフェニルであり、そして R 6 が H、C 1 ~ 3 直鎖アルキル、C 3 分岐鎖アルキル又は C 3 シクロアルキルである化合物である、請求項 1 ~ 6 の何れか一項に記載の化合物。

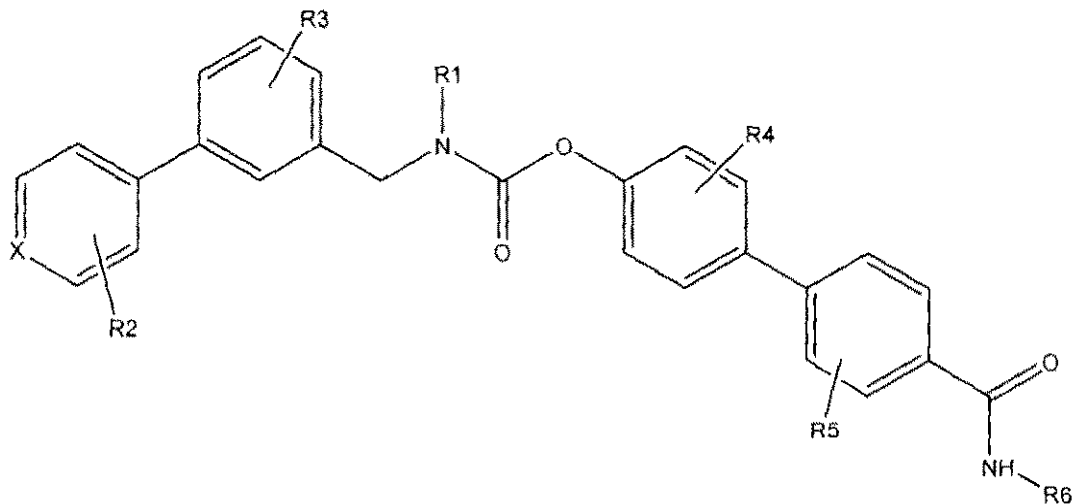
【請求項 8】

当該化合物が、X が N であり、R 1 が C 1 ~ 3 直鎖アルキル、C 3 分岐鎖アルキル又は置換されていてもよいフェニルであり、そして R 6 が H、C 1 ~ 3 直鎖アルキル、C 3 分岐鎖アルキル、又は C 3 シクロアルキルである化合物である、請求項 1 ~ 6 の何れか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

当該化合物が、式 I I :

【化 6】



II

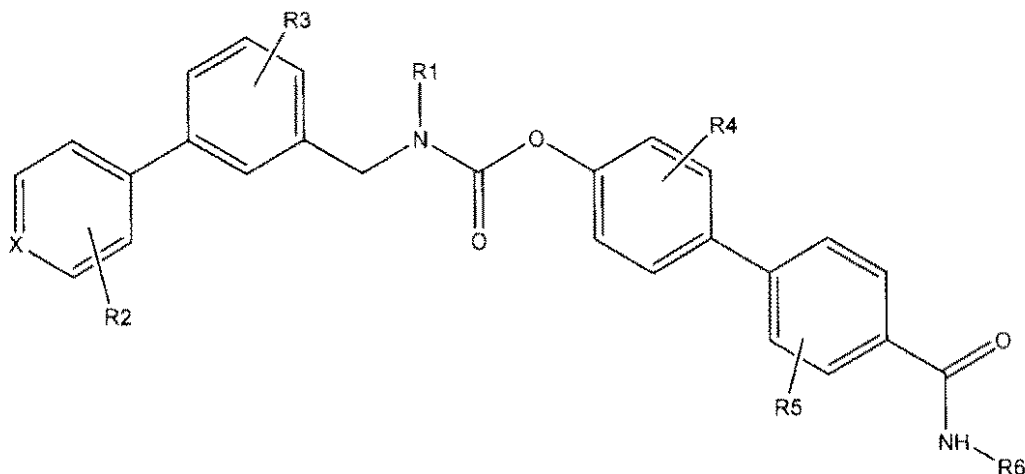
(式中の、X は N であり、R 1 は C 1 ~ 3 直鎖アルキル、C 3 分岐鎖アルキル又は置換されていてもよいフェニルであり、そして R 6 は H、C 1 ~ 3 直鎖アルキル、C 3 分岐鎖アルキル又は C 3 シクロアルキルである) :

の化合物である、請求項 1 ~ 6 の何れか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

当該化合物が、式 I I :

【化 7】



II

(式中の、XはCHであり、R1はC1～3直鎖アルキル、C3分岐鎖アルキル又は置換されていてもよいフェニルであり、そしてR6はH、C1～3直鎖アルキル、C3分岐鎖アルキル又はC3シクロアルキルである)：

の化合物である、請求項1～6の何れか一項に記載の化合物。

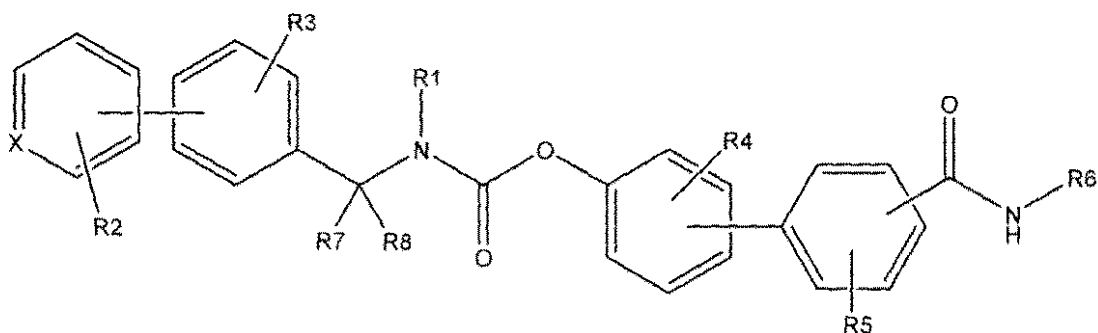
【請求項 11】

請求項1～10の何れか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物、及び許容される賦形剤を含有してなる、医薬組成物。

【請求項 12】

式 I :

【化 8】



I

(式中の、XはN又はCHであり；

R1は、低級直鎖若しくは分岐鎖アルキル、シクロアルキル、低級直鎖若しくは分岐鎖アルケニル、シクロアルケニル又はアリールであり；

それぞれのR2、R3、R4及びR5は、H又は1つ若しくはそれ以上の独立して選ばれる置換基であり；

R6は、H、低級直鎖若しくは分岐鎖アルキル、又はシクロアルキルであり；

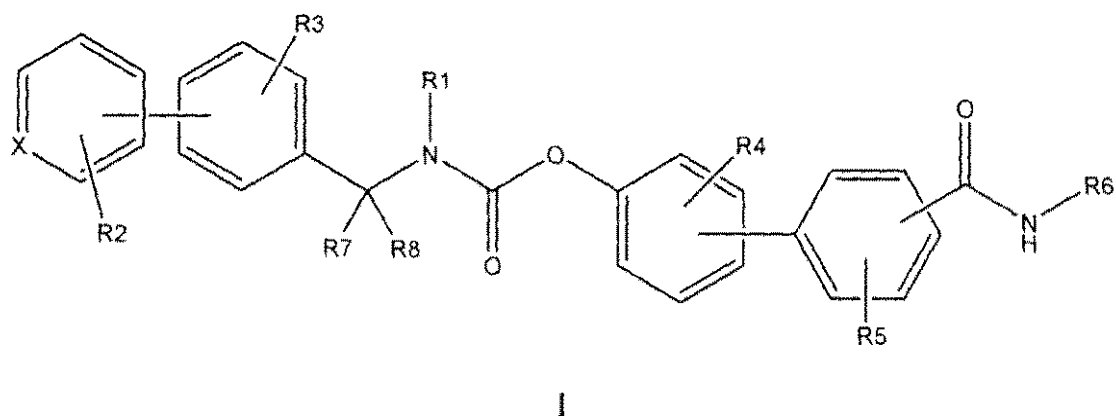
それぞれのR7及びR8は、独立して、H、低級アルキル又はフッ素から選ばれる)：
の化合物又はその薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物を含んでなる、糖尿病を予防又

は治療するための医薬組成物。

【請求項 13】

式 I :

【化 9】



(式中の、X は N 又は CH であり ;

R 1 は、低級直鎖若しくは分岐鎖アルキル、シクロアルキル、低級直鎖若しくは分岐鎖アルケニル、シクロアルケニル又はアリールであり ;

それぞれの R 2、R 3、R 4 及び R 5 は、H 又は 1 つ若しくはそれ以上の独立して選ばれる置換基であり ;

R 6 は、H、低級直鎖若しくは分岐鎖アルキル、又はシクロアルキルであり ;

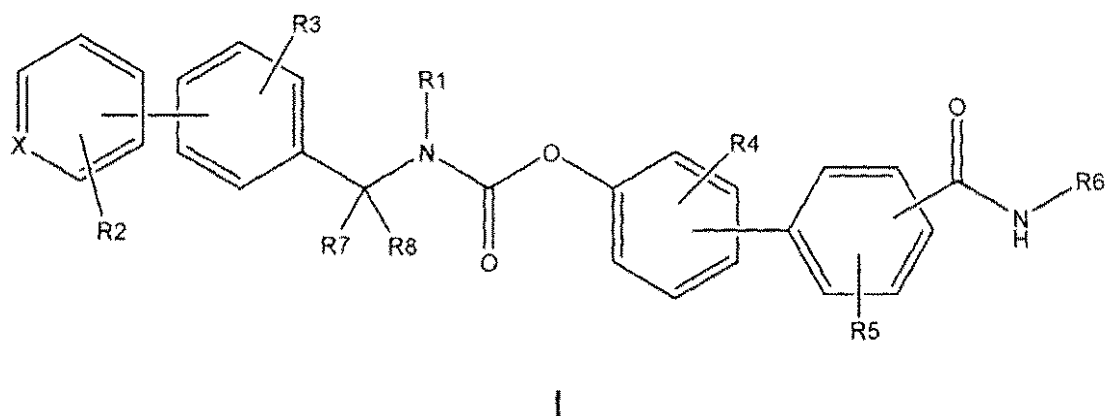
それぞれの R 7 及び R 8 は、独立して、H、低級アルキル又はフッ素から選ばれる) :

の化合物又はその薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物を含んでなる、メタボリックシンドロームを予防又は治療するための医薬組成物。

【請求項 14】

式 I :

【化 10】



(式中の、X は N 又は CH であり ;

R 1 は、低級直鎖若しくは分岐鎖アルキル、シクロアルキル、低級直鎖若しくは分岐鎖アルケニル、シクロアルケニル又はアリールであり ;

それぞれの R 2、R 3、R 4 及び R 5 は、H 又は 1 つ若しくはそれ以上の独立して選ばれる置換基であり ;

R 6 は、H、低級直鎖若しくは分岐鎖アルキル、又はシクロアルキルであり ;

それぞれの R 7 及び R 8 は、独立して、H、低級アルキル又はフッ素から選ばれる) :

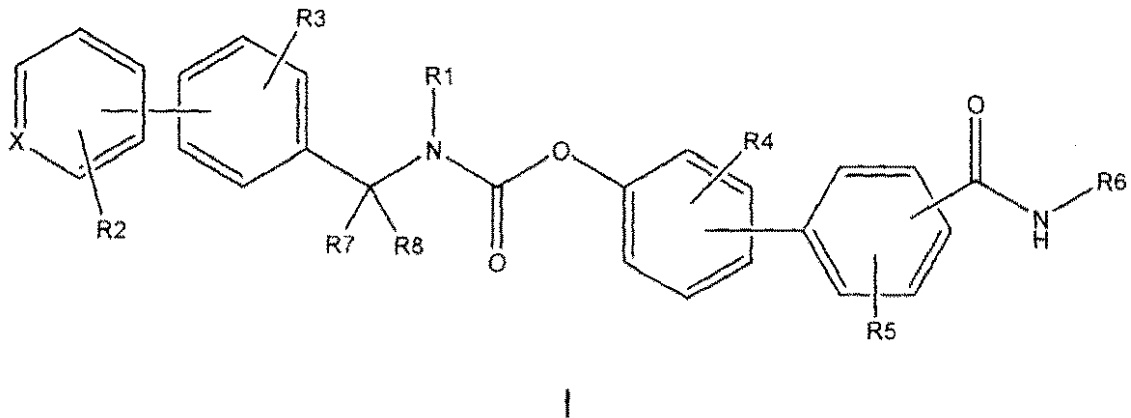
の化合物又はその薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物を含んでなる、インスリン分泌

低下に関連している疾患を治療又は予防するための医薬組成物。

【請求項 15】

式 I :

【化 11】



(式中の、X は N 又は CH であり ;

R 1 は、低級直鎖若しくは分岐鎖アルキル、シクロアルキル、低級直鎖若しくは分岐鎖アルケニル、シクロアルケニル又はアリールであり ;

それぞれの R 2、R 3、R 4 及び R 5 は、H 又は 1 つ若しくはそれ以上の独立して選ばれる置換基であり ;

R 6 は、H、低級直鎖若しくは分岐鎖アルキル、又はシクロアルキルであり ;

それぞれの R 7 及び R 8 は、独立して、H、低級アルキル又はフッ素から選ばれる) :
 の化合物又はその薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物を含んでなる、A B H D 6 を阻害するための医薬組成物。

【請求項 16】

R 1 が、C 1 ~ 6 直鎖若しくは C 3 ~ 6 分岐鎖アルキル、C 3 ~ 6 シクロアルキル、又は置換されていてもよいフェニルである、請求項 12 ~ 15 の何れか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

R 6 が、H、C 1 ~ 6 直鎖アルキル、C 3 ~ 6 分岐鎖アルキル、又は C 3 ~ 6 シクロアルキルである、請求項 12 ~ 16 の何れか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

R 2、R 3、R 4 及び R 5 が、H 又は 1 つの独立して選ばれる置換基である、請求項 12 ~ 17 の何れか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

それぞれの R 7 及び R 8 が、H 又は C 1 ~ 3 アルキルから独立して選ばれる、請求項 12 ~ 18 の何れか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

X が CH であり、R 1 が C 1 ~ 3 直鎖アルキル、C 3 分岐鎖アルキル又は置換されていてもよいフェニルであり、そして R 6 が H、C 1 ~ 3 直鎖アルキル、C 3 分岐鎖アルキル又は C 3 シクロアルキルである化合物である、請求項 12 ~ 15 の何れか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

X が N であり、R 1 が C 1 ~ 3 直鎖アルキル、C 3 分岐鎖アルキル又は置換されていてもよいフェニルであり、そして R 6 が H、C 1 ~ 3 直鎖アルキル、C 3 分岐鎖アルキル、又は C 3 シクロアルキルである化合物である、請求項 12 ~ 15 の何れか一項に記載の医薬組成物。

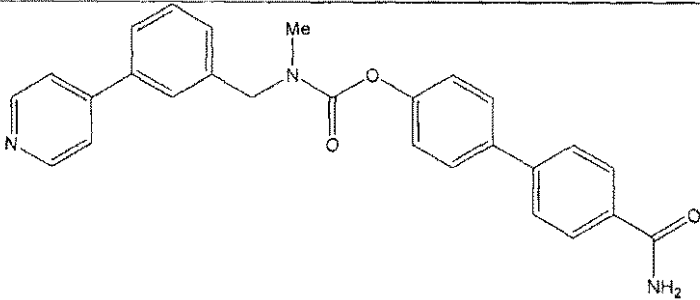
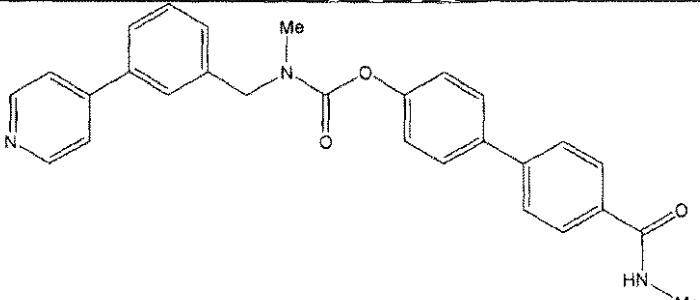
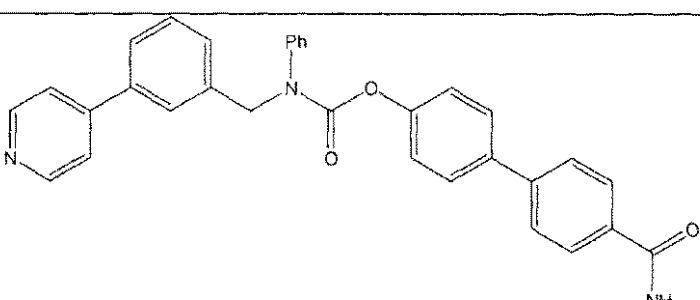
【請求項 22】

R 2、R 3、R 4、R 5、R 7 及び R 8 が、それぞれ H である、請求項 1 2 ～ 2 1 の何れか一項に記載の医薬組成物。

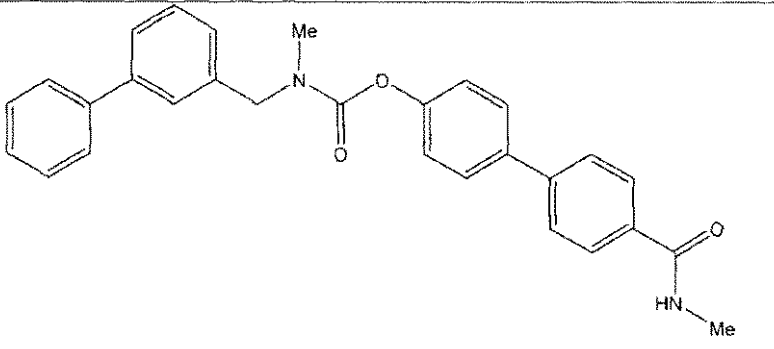
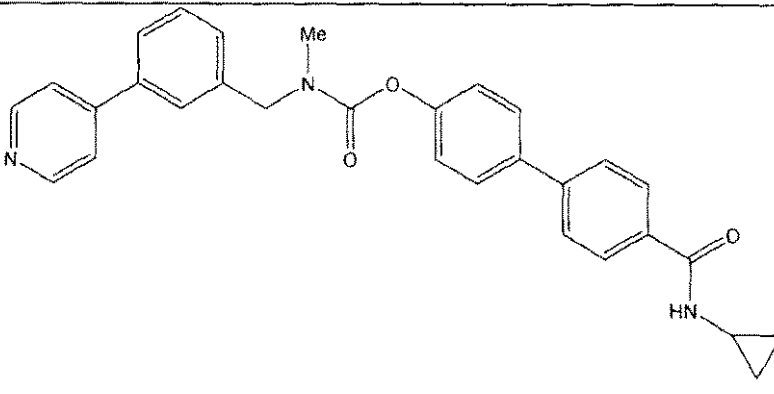
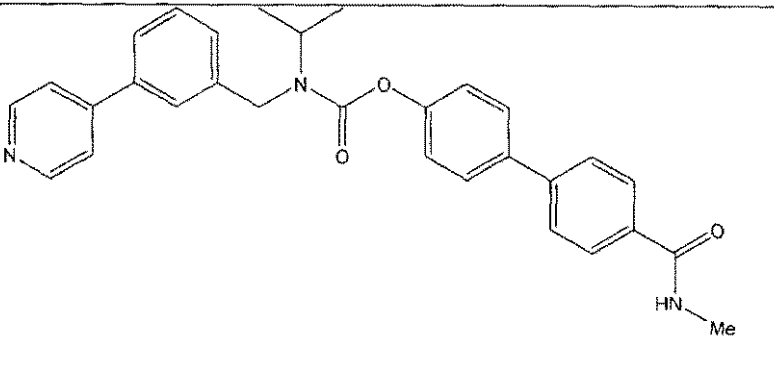
【請求項 2 3】

化合物が、

【表 1 - 1】

化合物番号	構造
1	
2	
3	

【表 1 - 2】

4	
5	
6	

である、請求項 1 2 ~ 1 5 の何れか一項に記載の医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 4 4

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 4 4】

実施例 2

4'-カルバモイルビフェニル-4-イル N-フェニル-N-(3-(ピリジン-4-イル)ベンジル)カルバメート・トリフルオロ酢酸塩(化合物 3)