

【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2004-537554(P2004-537554A)

【公表日】平成16年12月16日(2004.12.16)

【年通号数】公開・登録公報2004-049

【出願番号】特願2003-513970(P2003-513970)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 277/64 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/4245 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/496 (2006.01)**

**A 6 1 P 3/06 (2006.01)**

**A 6 1 P 3/10 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/06 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/10 (2006.01)**

**A 6 1 P 17/02 (2006.01)**

**A 6 1 P 19/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 21/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 37/06 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

**C 0 7 D 413/12 (2006.01)**

**C 0 7 D 417/12 (2006.01)**

**C 0 7 D 417/14 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 D 277/64

A 6 1 K 31/4245

A 6 1 K 31/496

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/06

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 19/00

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 417/12

C 0 7 D 417/14

【手続補正書】

【提出日】平成17年5月31日(2005.5.31)

【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

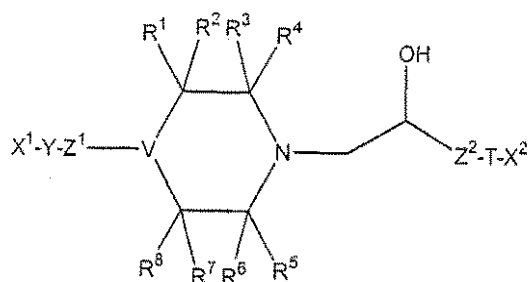
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式：

【化 1】



式 I

[ 式中、

カルボニル基の最大数は 2 であり；

- C(O)NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup> 基の最大数は 1 であり；そして、

架橋基の最大数は 1 であるという条件で、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> は、水素、低級アルキル、または - C(O)R であり、ここで R は - OR<sup>9</sup> または - NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup> であって、そして R<sup>9</sup> および R<sup>10</sup> は水素または低級アルキルであるか；

R<sup>1</sup> と R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup> と R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup> と R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup> と R<sup>8</sup> はそれらが結合している炭素と一緒に becoming カルボニルであるか；あるいは

R<sup>1</sup> と R<sup>5</sup>、R<sup>1</sup> と R<sup>7</sup>、R<sup>3</sup> と R<sup>5</sup>、または R<sup>3</sup> と R<sup>7</sup> は一緒になって架橋基 - (C R<sup>12</sup>R<sup>13</sup>)<sub>n</sub> - を形成し、ここで n は 1、2 または 3 であって、そして R<sup>12</sup> および R<sup>13</sup> は独立して水素または低級アルキルであり；

T は、酸素、硫黄または NR<sup>11</sup> であり、ここで R<sup>11</sup> は水素または低級アルキルであり；

V は、- N<、- CH<、または - N - CH< であり；

X<sup>1</sup> は、水素、場合により置換された低級アルキル、場合により置換されたシクロアルキル、場合により置換されたアリール、または場合により置換されたヘテロアリールであり；

X<sup>2</sup> は、場合により置換されたアリールまたは場合により置換されたヘテロアリールであり；

Y は、場合により置換された単環ヘテロアリーレニルであり；そして、

Z<sup>1</sup> および Z<sup>2</sup> は独立して、場合により置換された炭素数が 1 ~ 4 のアルキレンである

]

の化合物。

【請求項 2】

V が窒素であって、そして Z<sup>1</sup> および Z<sup>2</sup> が独立して低級アルキレンである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

T は酸素である、請求項 2 記載の化合物。

【請求項 4】

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> は独立して水素またはメチルから選ばれる、請求項 3 記載の化合物。

【請求項 5】

X<sup>1</sup> は場合により置換されたアリールまたは場合により置換されたヘテロアリールである、請求項 4 記載の化合物。

【請求項 6】

X<sup>1</sup> は場合により置換されたフェニルであり、そして X<sup>2</sup> は場合により置換されたフェニルまたは場合により置換された二環式ヘテロアリールである、請求項 5 記載の化合物。

## 【請求項 7】

Y は、ピラゾール、1,2-オキサゾール、1,3-オキサゾール、1,3-チアゾール、1,2,4-オキサジアゾール、または1,3,4-オキサジアゾール由来の二価の基である、請求項 6 記載の化合物。

## 【請求項 8】

X<sup>2</sup> は、2-メチルベンゾ-1,3-チアゾール-5-イル、2-シクロヘキシルベンゾ-1,3-チアゾール-5-イル、2-フェニルベンゾ-1,3-チアゾール-5-イル、2-フェニルベンゾ-1,3-オキサゾール-5-イル、または2-メトキシフェニルである、請求項 7 記載の化合物。

## 【請求項 9】

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> は全て水素である、請求項 8 記載の化合物。

## 【請求項 10】

Z<sup>1</sup> および Z<sup>2</sup> は共にメチレンである、請求項 9 記載の化合物。

## 【請求項 11】

X<sup>1</sup> は、場合により低級アルキル、低級アルコキシ、ハロゲン、またはトリフルオロメチルによって置換されたフェニルである、請求項 10 記載の化合物。

## 【請求項 12】

X<sup>1</sup>-Y- は3-(4-t-ブチルフェニル)-1,2,4-オキサジアゾール-5-イルであり、そしてX<sup>2</sup> は2-メチルベンゾ-1,3-チアゾール-5-イルである、すなわち3-{4-[3-(4-t-ブチルフェニル)-[1,2,4]オキサジアゾール-5-イルメチル]-ピペラジン-1-イル}-1-(2-メチルベンゾチアゾ-5-イルオキシ)-プロパン-2-オールである、請求項 11 記載の化合物。

## 【請求項 13】

X<sup>1</sup>-Y- は5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イルであり、そしてX<sup>2</sup> は2-メチルベンゾ-1,3-チアゾール-5-イルである、すなわち3-{4-[5-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-[1,2,4]オキサジアゾール-3-イルメチル]-ピペラジン-1-イル}-1-(2-メチルベンゾチアゾール-5-イルオキシ)-プロパン-2-オールである、請求項 11 記載の化合物。

## 【請求項 14】

X<sup>1</sup>-Y- は5-(4-クロロフェニル)-1,2-オキサゾール-3-イルであり、そしてX<sup>2</sup> は2-メチルベンゾ-1,3-チアゾール-5-イルである、すなわち3-{4-[5-(4-クロロフェニル)イソオキサゾール-3-イル]メチル}ピペラジニル)-1-(2-メチルベンゾチアゾール-5-イルオキシ)プロパン-2-オールである、請求項 11 記載の化合物。

## 【請求項 15】

X<sup>1</sup>-Y- は5-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-イソオキサゾール-3-イルであり、そしてX<sup>2</sup> は2-メチルベンゾ-1,3-チアゾール-5-イルである、すなわち(2S)-1-(2-メチルベンゾチアゾール-5-イルオキシ)-3-[4-({5-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]イソオキサゾール-3-イル}メチル)ピペラジニル]プロパン-2-オールである、請求項 11 記載の化合物。

## 【請求項 16】

X<sup>1</sup>-Y- は2-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-オキサゾール-4-イルであり、X<sup>2</sup> は2-メチルベンゾ-1,3-チアゾール-5-イルである、すなわち1-(2-メチルベンゾチアゾール-5-イルオキシ)-3-[4-({2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル](1,3-オキサゾール-4-イル)}メチル)ピペラジニル]プロパン-2-オールである、請求項 11 記載の化合物。

## 【請求項 17】

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> の1つはメチルであって、そして残りは水素である、請求項 8 記載の化合物。

## 【請求項 18】

Z<sup>1</sup> および Z<sup>2</sup> は共にメチレンである、請求項 17 記載の化合物。

## 【請求項 19】

X<sup>1</sup> は、場合により低級アルキル、低級アルコキシ、ハロゲンまたはトリフルオロメチルによって置換されたフェニルである、請求項 18 記載の化合物。

## 【請求項 20】

R<sup>4</sup> はメチルであって、そして R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> は水素である、請求項 19 記載の化合物。

## 【請求項 21】

X<sup>1</sup> - Y - は 5 - (4 - (トリフルオロメチル)フェニル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イルであり、そして X<sup>2</sup> は 2 - メチルベンゾ - 1, 3 - チアゾール - 5 - イルである、すなわち (2S) - 3 - [(2S) - 2 - メチル - 4 - ({5 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル](1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル)}メチル)ピペラジニル] - 1 - (2 - メチルベンゾチアゾール - 5 - イルオキシ)プロパン - 2 - オールである、請求項 20 記載の化合物。

## 【請求項 22】

治療学的に有効な量の請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 つ記載の化合物および医薬的に許容し得る賦形剤を含有する、医薬組成物。

## 【請求項 23】

脂肪酸酸化インヒビターを用いる処置によって緩和することができる哺乳動物における疾患状態を処置するための医薬組成物であって、治療学的に有効な量の請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 つ記載の化合物および医薬的に許容し得る賦形剤を含有する、該医薬組成物。

## 【請求項 24】

疾患状態は外傷、ショックまたは循環器疾患から生じる骨格筋肉への損傷である、請求項 23 記載の医薬組成物。

## 【請求項 25】

循環器疾患は、心房不整脈、間欠性は行、心室性不整脈、プリンツメタル（異型）アングナ、安定型アングナ、運動誘発性アングナ、うっ血性心不全、または心筋梗塞である、請求項 24 記載の医薬組成物。

## 【請求項 26】

疾患状態は糖尿病である、請求項 25 記載の医薬組成物。

## 【請求項 27】

動物における血漿中の HDL レベルを増大するための医薬組成物であって、治療学的に有効な量の請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 つ記載の化合物および医薬的に許容し得る賦形剤を含有する、該医薬組成物。

## 【請求項 28】

動物における移植において使用するドナーの組織および臓器を保存するための医薬組成物であって、治療学的に有効な量の請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 つ記載の化合物および医薬的に許容し得る賦形剤を含有する、該医薬組成物。

## 【請求項 29】

哺乳動物はヒトである、請求項 23 ~ 28 のいずれか 1 つ記載の医薬組成物。