

【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 1 日 (2007.2.1)

【公表番号】特表 2006-519795 (P2006-519795A)

【公表日】平成 18 年 8 月 31 日 (2006.8.31)

【年通号数】公開・登録公報 2006-034

【出願番号】特願 2006-504448 (P2006-504448)

【国際特許分類】

**C 07 D 401/04 (2006.01)**

**A 61 K 31/4545 (2006.01)**

**A 61 P 3/10 (2006.01)**

**A 61 K 45/00 (2006.01)**

**A 61 P 3/06 (2006.01)**

**A 61 P 9/10 (2006.01)**

**A 61 P 5/50 (2006.01)**

**A 61 P 43/00 (2006.01)**

【F I】

C 07 D 401/04 C S P

A 61 K 31/4545

A 61 P 3/10

A 61 K 45/00

A 61 P 3/06

A 61 P 9/10 1 0 1

A 61 P 5/50

A 61 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成 18 年 12 月 8 日 (2006.12.8)

【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

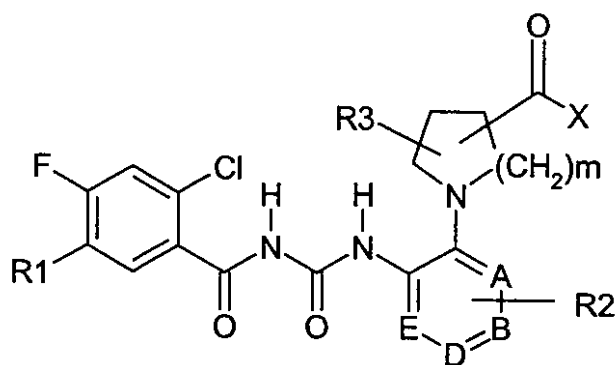
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

【化 1】



〔式中、

R1、R2は各々独立してH、F、Cl、Br、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、NO<sub>2</sub>、CN、O-(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、COOH、CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>0</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル-COOH、(C<sub>0</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル-COO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルであり；

R3は、OH、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>0</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル-アリール、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>)-アルキニルであり、ここで、該アルキル、アリール、アルケニル及びアルキニル基は、F、Cl又はBrにより単 - 又は多置換されてもよく；

Xは、OH、O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、NH<sub>2</sub>、NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、N((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル)<sub>2</sub>であり；

A、B、D及びEは、各々独立して、CH又はNであり、そして少なくともA、B、D及びE基の1つはNを意味し；

mは、0、1、2である]の化合物及びその生理学的に受容可能な塩。

#### 【請求項2】

R1、R2は各々独立してH、F、Cl、Br、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、NO<sub>2</sub>、CN、O-(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、COOH、CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>0</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル-COOH、(C<sub>0</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル-COO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルであり；

R3は、OH、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>0</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル-アリール、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>)-アルキニルであり、ここで、該アルキル、アリール、アルケニル及びアルキニル基は、F、Cl又はBrにより単 - 又は多置換されてもよく；

Xは、OH、O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、NH<sub>2</sub>、NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、N((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル)<sub>2</sub>であり；

A、B、D及びEは、各々独立して、CH又はNであり、そして少なくともA、B、D及びE基の1つはNを意味し；

mは、1、2である、

請求項1の式Iの化合物、及び、その生理学的に受容可能な塩。

#### 【請求項3】

R1は、H、Fであり；

R2は、各々独立してH、F、Cl、Br、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、O-(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、COOH、CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>0</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル-COOH、(C<sub>0</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル-COO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルであり；

R3は、OH、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>0</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル-アリール、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>)-アルキニルであり、ここで、該アルキル、アリール、アルケニル及びアルキニル基は、F、Cl又はBrにより単 - 又は多置換されてもよく；

Xは、OH、O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、NH<sub>2</sub>、NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、N((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル)<sub>2</sub>であり；

Aは、Nであり；

B、D、Eは、CHであり；

mは1、2である、

請求項1又は2の式Iの化合物、及びその生理学的に受容可能な塩。

#### 【請求項4】

R1は、H、Fであり；

R2は、H、Cl、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、CF<sub>3</sub>、COO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、COOHであり；

R3は、H、フェニルであり；

Xは、OH、O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、NH<sub>2</sub>、NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、N((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル)<sub>2</sub>であり；

Aは、Nであり；

B、D、Eは、CHであり；

mは2である、

請求項 1 ~ 3 のいずれかの式 I の化合物、及びその生理学的に受容可能な塩。

【請求項 5】

請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載された 1 つ又はそれ以上の化合物を含む医薬品。

【請求項 6】

請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載された 1 つ又はそれ以上の化合物、及び、少なくとも 1 つの更なる活性成分を含む医薬品。

【請求項 7】

更なる活性成分として、1 つ又はそれ以上の、抗糖尿病剤、血糖降下活性成分、HMG-CoA還元酵素阻害剤、コレステロール吸収阻害剤、PPAR 作動剤、PPAR 作動剤、PPAR / 作動剤、フィブレート、MTP阻害剤、胆汁酸吸収阻害剤、CETP阻害剤、ポリメリック胆汁酸吸着剤、LDL受容体誘導剤、ACAT阻害剤、抗酸化剤、リボプロテインリパーゼ阻害剤、ATP-クエン酸リアーゼ阻害剤、スクアレン合成酵素阻害剤、リボプロテイン(a)拮抗剤、リパーゼ阻害剤、インスリン、スルホニル尿素、ビッグアニド、メグリチニド、チアゾリジンジオン、 $\alpha$ -グルコシダーゼ阻害剤、細胞のATP-依存性カリウムチャンネルに作用する活性成分、CART作動剤、NPY作動剤、MC4作動剤、オレキシン作動剤、H3作動剤、TNF作動剤、CRF作動剤、CRFBP拮抗剤、ウロコルチン作動剤、 $\delta$ 作動剤、MSH(メラノサイト刺激ホルモン)作動剤、CCK作動剤、セロトニン再取込阻害剤、混合型セロトニン作動性及びノルアドレナリン作動性化合物、5HT作動剤、ボンベシン作動剤、ガラニン拮抗剤、成長ホルモン、成長ホルモン放出性化合物、TRH作動剤、脱共役プロテイン2もしくは3調節剤、レプチン作動剤、DA作動剤(プロモクリプチン、ドブレキシン)、リパーゼ/アミラーゼ阻害剤、PPAR調節剤、RXR調節剤、TR-作動剤又はアンフェタミンを含む、請求項 6 記載の医薬品。

【請求項 8】

血糖を減少させる医薬品を製造するための、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 9】

二型糖尿病の治療用医薬品を製造するための、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 10】

脂質及び炭水化物の代謝障害の治療用医薬品を製造するための、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 11】

動脈硬化性症状の治療用医薬品を製造するための、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 12】

インスリン抵抗性の治療用医薬品を製造するための、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。