

【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22年8月12日 (2010.8.12)

【公表番号】特表2009-541269(P2009-541269A)

【公表日】平成21年11月26日 (2009.11.26)

【年通号数】公開・登録公報2009-047

【出願番号】特願2009-515888(P2009-515888)

【国際特許分類】

C 0 7 C 59/68 (2006.01)

C 0 7 C 323/22 (2006.01)

C 0 7 C 323/18 (2006.01)

C 0 7 C 59/90 (2006.01)

A 6 1 K 31/192 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 39/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

C 0 7 C 323/47 (2006.01)

C 1 2 N 15/09 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 59/68

C 0 7 C 323/22 C S P

C 0 7 C 323/18 Z N A

C 0 7 C 59/90

A 6 1 K 31/192

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 39/06

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 9/14
 A 6 1 P 25/00 1 0 1
 C 0 7 C 323/47
 C 1 2 N 15/00 A

【手続補正書】

【提出日】平成22年5月27日(2010.5.27)

【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

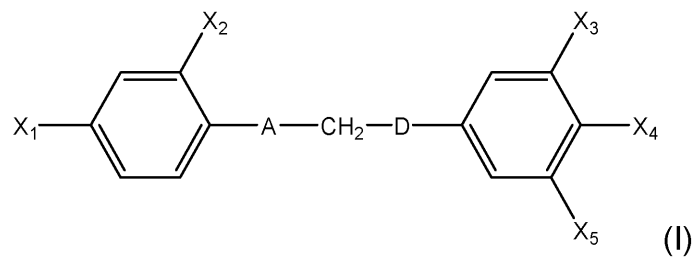
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (I) :

【化 5 2】



〔式中、

X 1 は、R 1 または G 1 - R 1 基を表し；

X 2 は、ハロゲン原子、R 2 または G 2 - R 2 基を表し；

X 3 は、R 3 または G 3 - R 3 基を表し；

X 4 は、ハロゲン原子、R 4 または G 4 - R 4 基を表し；

X 5 は、R 5 または G 5 - R 5 基を表し；

R 1 は、水素原子またはハロゲン化されていないアルキル基を表し；

R 2 は、水素原子またはハロゲン化されていないアルキル基を表し；

R 3、R 4 および R 5 は、同一であるかまたは相異なり、水素原子を表すかまたは、1 つまたは複数の基 1 または基 2 置換基により置換されているアルキル基または置換されていないアルキル基を表し；

G 1、G 2、G 3、G 4 および G 5 は、同一であるかまたは相異なり、酸素原子または硫黄原子を表し；

但し、X 3、X 4 または X 5 の中の少なくとも1つの基は、R 3、G 3 R 3、R 4、G 4 R 4、R 5 または G 5 R 5 式（式中、G 3、G 4 および G 5 は前記したとおりであり、そして R 3、R 4 および R 5 は、同一であるかまたは相異なり、1 つまたは複数の基 1 または基 2 置換基により置換されているアルキル基を表す）

に相当し；

A は、

(i) C R 6 R 7 基（式中、R 6 および R 7 は、同一であるかまたは相異なり、水素原子、ヒドロキシル基、アルキル基または - O R 8 基を表し、R 8 は下記のとおりである）；

(i i) カルボニル基 (C O)、

(i i i) オキシム基 ($C = N - O - H$) またはオキシムエーテル ($C = N - O - R_8$) (R_8 は、同一であるかまたは相異なり、アリールまたはシクロアルキル基により置換されているアルキル基または置換されていないアルキル基を表す) を表し ;

D は、

(i) 2 つの水素原子に連結された炭素原子 (CH_2) 、
(i i) 水素原子および G 2 の両方に連結され、それにより酸素化または硫黄化された複素環を形成する炭素原子、
を表し ;

基 1 の置換基は - $COOR_9$ および - $CONR_9R_{10}$ の中から選ばれ ;

基 2 の置換基は、 - SO_3H および - $SO_2NR_9R_{10}$ の中から選ばれ ;

R_9 、 R_{10} および R_5 は、同一であるかまたは相異なり、水素原子を表すかまたは、少なくとも 1 つの基 1 または基 2 置換基により置換されているアルキル基または置換されていないアルキル基を表し ;

但し、A が $-CR_6R_7$ 基を表し、 R_6 および R_7 が水素原子を表し、そして基 X_1 、 X_2 、 X_3 、 X_4 および / または X_5 の少なくとも 3 つが水素原子を表す、一般式 (I) の化合物は除くものとする]

を有する置換された 1, 3 - ジフェニルプロパンに由来する化合物、それらの純粋なものしくは混合した立体異性体 (ジアステレオアイソマー、エナンチオマー)、ラセミ混合物、幾何異性体、互変異性体、塩、水和物、溶媒和物、固体形態およびそれらの混合物。

【請求項 2】

A が CH_2 基を表わさないことを特徴とする、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

A がカルボニル基 (CO) を表すことを特徴とする、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

X_3 、 X_4 および X_5 基の 1 つのみが R_3 、 R_4 、 R_5 、 G_3R_3 、 G_4R_4 、または G_5R_5 (式中、 G_3 、 G_4 および G_5 は請求項 1 に記載のとおりであり、そして

R_3 、 R_4 および R_5 は、請求項 1 に定義されたとおりの、1 つまたは複数の基 1 または基 2 置換基により置換されているアルキル基を表す) を表すことを特徴とする、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】

X_3 、 X_4 および X_5 のうち X_4 のみが R_4 または G_4R_4 基を表し、

G_4 は請求項 1 に定義されたとおりであり、そして

R_4 は、1 つまたは複数の基 1 または基 2 置換基により置換されているアルキル基を表すことを特徴とする、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6】

G_3 、 G_4 および / または G_5 が酸素原子を表すことを特徴とする、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7】

前記置換基が、請求項 1 に定義されたとおりの、基 1 置換基の中から選ばれることを特徴とする、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8】

X_3 、 X_4 および X_5 基の 1 つのみが、式 - $OC(CH_3)_2COOR_9$ に相当し、 R_9 は請求項 1 に定義されたとおりであることを特徴とする、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9】

X_3 および X_5 が、同一であるかまたは相異なり、それぞれ R_3 および R_5 基を表し、 R_3 および R_5 は、請求項 1 に定義されたとおりの、1 つまたは複数の基 1 または基 2 置換基により置換されているアルキル基または置換されていないアルキル基を表すことを特徴とする、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 10】

X 1 が R 1 または G 1 R 1 基を表し、G 1 は請求項 1 に定義されたとおりでありそして R 1 がハロゲン化されていないアルキル基を表すことを特徴とする、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 11】

X 2 が水素原子を表すことを特徴とする、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 12】

D が -CH₂ 基を表すことを特徴とする、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 13】

前記化合物が、

2 - [2, 6 - ジメチル - 4 - [3 - [4 - (メチルチオ)フェニル] - 3 - オキソ - プロピル]フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸、

2 - [2, 6 - ジメチル - 4 - [3 - [2 - (ヘキシルオキシ)フェニル] - 3 - オキソ - プロピル]フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸、

2 - [2, 6 - ジメチル - 4 - [3 - [4 - (メチルチオ)フェニル] - 3 - メトキシイミノ - プロピル]フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸

2 - [2, 6 - ジメチル - 4 - [3 - [4 - (メトキシ)フェニル] - 3 - オキソ - プロピル]フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸

2, 6 - ジメチル - 4 - [3 - [4 - (メチルチオ)フェニル] - 3 - オキソ - プロピル]フェノキシ] - エタン酸

2 - [2, 6 - ジメチル - 4 - [3 - [4 - (プロピルオキシ)フェニル] - 3 - オキソ - プロピル]フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸、

2 - [2 - メチル - 4 - [3 - [4 - (ヘブチル)フェニル] - 3 - オキソ - プロピル]フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸、

2 - [2, 6 - ジメチル - 4 - [3 - [2 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 3 - オキソ - プロピル]フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸、

2 - [2, 6 - ジメチル - 4 - [3 - [4 - (メチルチオ)フェニル] - プロピル]フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸

2 - [2, 6 - ジメチル - 4 - [3 - [4 - (メチルチオ)フェニル] - 3 - オキソ - プロピル]フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸イソプロピル、

2 - [2, 6 - ジメチル - 4 - [3 - [4 - (メチルチオ)フェニル] - 3 - ヒドロキシイミノ - プロピル]フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸

2 - [2, 6 - ジメチル - 4 - [3 - [4 - (プロピルオキシ)フェニル] - 3 - ヒドロキシプロピル]フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸

2 - [2, 6 - ジメチル - 4 - [3 - [2 - (トリフルオロメトキシ)フェニル] - 3 - オキソ - プロピル]フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸

2 - [2, 6 - ジメチル - 4 - [2, 3 - ジヒドロ - 4H - 1 - ベンゾチオピラン - 4 - オン - 2 - イル]フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸

2 - [3 - [3 - [4 - (メチルチオ)フェニル] - 3 - オキソ - プロピル]フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸

2 - [2, 6 - ジメチル - 4 - [3 - [4 - (メチルチオ)フェニル] - 3 - シクロヘキシルメトキシ - プロピル]フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸

2 - [2, 6 - ジメチル - 4 - [3 - [4 - (メチルチオ)フェニル] - 3 - ブチルオキシ - プロピル]フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸

2 - [2, 6 - ジメチル - 4 - [3 - [4 - (メチルチオ)フェニル] - 3 - イソプロピルオキシ - プロピル]フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸

2 - [2, 6 - ジメチル - 4 - [3 - [4 - (メチルチオ)フェニル] - 3 - シクロヘキシルエチルオキシ - プロピル]フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸

2 - [2 , 6 - ジメチル - 4 - [3 - [4 - (メチルチオ) フェニル] - 3 - ベンジルオキシ - プロピル] フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸

2 - [2 , 6 - ジメチル - 4 - [3 - [4 - (メチルチオ) フェニル] - 3 - ヒドロキシ - プロピル] フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸

2 - [2 , 6 - ジメチル - 4 - [3 - [4 - (メチルチオ) フェニル] - 3 - エトキシ - プロピル] フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸、

2 - [2 , 6 - ジメチル - 4 - [3 - [4 - (メチルチオ) フェニル] - 3 - メトキシ - プロピル] フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸

2 - [2 - メチル - 4 - [3 - [4 - (プロピルチオ) フェニル] - 3 - オキソ - プロピル] フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸

2 - [4 - [3 - [4 - (メチルフェニル] - 3 - オキソ - プロピル] フェノキシ] - 2 - メチルプロパン酸、

の中から選ばれることを特徴とする、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 4】

医薬としての請求項 1 ~ 1 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 5】

場合により 1 つまたは複数の他の治療的有効成分および / または化粧品有効成分とともに、請求項 1 ~ 1 3 に定義されたとおりの化合物の少なくとも 1 つを、薬学的に許容される支持体中に含む医薬組成物。

【請求項 1 6】

下記のリスト：

抗糖尿病薬、

インスリン、

脂質低下分子および / またはコレステロール低下分子、

抗高血圧薬または血圧降下薬、

抗血小板薬、

抗肥満薬、

抗炎症薬、

酸化防止剤、

心不全の処置に使用される作用物質、

冠不全の処置に使用される作用物質、

抗癌薬、

抗喘息薬、

抗喘息薬、

皮膚病理を処置するのに使用されるコルチコイド、

血管拡張薬および / または抗虚血薬、

における 1 つまたは複数の他の化合物とともに、請求項 1 ~ 1 3 のいずれか 1 項に記載の化合物の少なくとも 1 つを、許容される薬学的形態で含む医薬組成物。

【請求項 1 7】

メタボリック症候群と関連した合併症、インスリン抵抗性、糖尿病、異脂肪血症、アテローム性動脈硬化症、心臓血管疾患、肥満、高血圧、炎症性疾患、神経変性病理または癌の処置のための、請求項 1 5 または 1 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

異脂肪血症の処置のための、請求項 1 5 または 1 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

脂質および / または糖質代謝の調節異常に関する心臓血管リスク因子を処置するための、請求項 1 5 または 1 6 に記載の医薬組成物。