

【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9月14日(2006.9.14)

【公表番号】特表2002-526539(P2002-526539A)

【公表日】平成14年8月20日(2002.8.20)

【出願番号】特願2000-574523(P2000-574523)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/4436 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 K 31/498 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 409/12 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 401/12

A 6 1 K 31/4436

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/498

A 6 1 K 31/506

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 9/10

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 409/12

C 0 7 D 409/14

C 0 7 D 413/14

C 0 7 D 417/12

C 0 7 D 417/14

【手続補正書】

【提出日】平成18年7月20日(2006.7.20)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

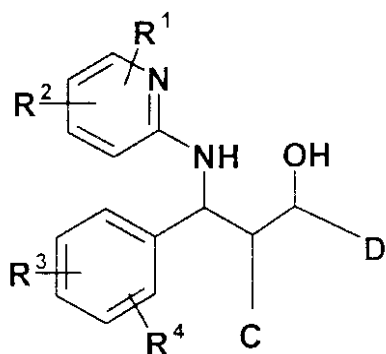
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 式I

【化1】



{ 式中、

Cは、フェニル、ピリジル、チエニル、フリル、ピリミジル、インドリル、チアゾリル、イミダゾリル、クマリニル、フタルイミジル、キノイル、ピペラジニル、テトラゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリルまたはそのチエノ -、ピリジノ - またはベンゾ - 縮合誘導体であり、芳香族または複素芳香族基は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、OH、CF₃、-NO₂、CN、(C₁~C₈)-アルコキシ、(C₁~C₈)-アルキル、NH₂、-NH-R⁹、-N(R⁹)R¹⁰、CHO、-COOH、-COOR¹¹、-(C=O)-R¹²、(C₁~C₆)-アルキル-OH、(C₁~C₆)-アルキル(-OH)-フェニル、(C₁~C₆)-アルキル-CF₃、(C₁~C₆)-アルキル-NO₂、(C₁~C₆)-アルキル-CN、(C₁~C₆)-アルキル-NH₂、(C₁~C₆)-アルキル-NH-R⁹、(C₁~C₆)-アルキル-N(R⁹)R¹⁰、(C₁~C₆)-アルキル-CHO、(C₁~C₆)-アルキル-COOH、(C₁~C₆)-アルキル-COOR¹¹、(C₁~C₆)-アルキル-(C=O)-R¹²、-O-(C₁~C₆)-アルキル-OH、-O-(C₁~C₆)-アルキル-CF₃、-O-(C₁~C₆)-アルキル-NO₂、-O-(C₁~C₆)-アルキル-CN、-O-(C₁~C₆)-アルキル-NH₂、-O-(C₁~C₆)-アルキル-NH-R⁹、-O-(C₁~C₆)-アルキル-N(R⁹)R¹⁰、-O-(C₁~C₆)-アルキル-CHO、-O-(C₁~C₆)-アルキル-COOH、-O-(C₁~C₆)-アルキル-COOR¹¹、-O-(C₁~C₆)-アルキル-(C=O)-R¹²、-N-SO₃H、-SO₂-CH₃または-O-(C₁~C₆)-アルキル-O-(C₁~C₆)-アルキルフェニル(ここで、アルキル基中の1つ以上の水素は、フッ素によって置き換えることができる)によってモノ - ないしジ置換することができ;

Dは、フェニル、ピリジル、チエニル、フリル、ピリミジル、インドリル、チアゾリル、イミダゾリル、クマリニル、フタルイミジル、キノイル、ピペラジニル、テトラゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリルまたは4,5,6,7-テトラヒドロベンズイソオキサゾールまたはそのチエノ、ピリジノ - またはベンゾ - 縮合誘導体であり、芳香族または複素芳香族基は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、OH、CF₃、-NO₂、CN、(C₁~C₈)-アルコキシ、(C₁~C₈)-アルキル、NH₂、-NH-R⁹、-N(R⁹)R¹⁰、CHO、-COOH、-COOR¹¹、-(C=O)-R¹²、(C₁~C₆)-アルキル-OH、(C₁~C₆)-アルキル(-OH)-フェニル、(C₁~C₆)-アルキル-CF₃、(C₁~C₆)-アルキル-NO₂、(C₁~C₆)-アルキル-CN、(C₁~C₆)-アルキル-NH₂、(C₁~C₆)-アルキル-NH-R⁹、(C₁~C₆)-アルキル-N(R⁹)R¹⁰、(C₁~C₆)-アルキル-CHO、(C₁~C₆)-アルキル-COOH、(C₁~C₆)-アルキル-COOR¹¹、(C₁~C₆)-アルキル-(C=O)-R¹²、-O-(C₁~C₆)-アルキル-OH、-O-(C₁~C₆)-アルキル-CF₃、-O-(C₁~C₆)-アルキル-NO₂、-O-(C₁~C₆)-アルキル-CN、-O-(C₁~C₆)-アルキル-NH₂、-O-(C₁~C₆)-アルキル-NH-R⁹、-O-(C₁~C₆)-アルキル-N(R⁹)R¹⁰、-O-(C₁~C₆)-アルキル-CHO、-O-(C₁~C₆)-アルキル-COOH、-O-(C₁~C₆)-アルキル-COOR¹¹、-O-(C₁~C₆)-アルキル-(C=O)-R¹²、-N-SO₃H、-SO₂-CH₃、-(C₀~C₆)-アルキル-ピリジル、-O-(C₁~C₆)-アルキル-O-(C₁~C₆)-アルキルフェニルまたは-(C₀~C₆)-アルキルフェニル[ここで、フェニル基は、F、Cl、CF₃、OCF₃、(C₁~C₆)-アルキルまたは-O-(C₁

~ C₆) - アルキルによって2回まで置換することができ、そしてアルキル基中の1つ以上の水素は、フッ素によって置き換えることができる]によってモノ - ないしジ置換されていることができるが、但し、

CおよびDは、同時に、C = フェニルおよびD = フェニル、C = フェニルおよびD = ピリジル、C = ピリジルおよびD = フェニル、C = ピリジルおよびD = ピリジルではなく；

R¹、R²、R³、R⁴は、相互に独立して水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、OH、CF₃、-NO₂、CN、(C₁~C₈) - アルコキシ、(C₁~C₈) - アルキル、NH₂、-NH-R⁹、-N(R⁹)R¹⁰、CHO、-COOH、-COOR¹¹、-(C=O)-R¹²、(C₁~C₆) - アルキル-OH、(C₁~C₆) - アルキル(-OH)-フェニル、(C₁~C₆) - アルキル-CF₃、(C₁~C₆) - アルキル-NO₂、(C₁~C₆) - アルキル-CN、(C₁~C₆) - アルキル-NH₂、(C₁~C₆) - アルキル-NH-R⁹、(C₁~C₆) - アルキル-N(R⁹)R¹⁰、(C₁~C₆) - アルキル-CHO、(C₁~C₆) - アルキル-COOH、(C₁~C₆) - アルキル-COOR¹¹、(C₁~C₆) - アルキル-(C=O)-R¹²、-O-(C₁~C₆) - アルキル-OH、-O-(C₁~C₆) - アルキル-CF₃、-O-(C₁~C₆) - アルキル-NO₂、-O-(C₁~C₆) - アルキル-CN、-O-(C₁~C₆) - アルキル-NH₂、-O-(C₁~C₆) - アルキル-NH-R⁹、-O-(C₁~C₆) - アルキル-N(R⁹)R¹⁰、-O-(C₁~C₆) - アルキル-CHO、-O-(C₁~C₆) - アルキル-COOH、-O-(C₁~C₆) - アルキル-COOR¹¹、-O-(C₁~C₆) - アルキル-(C=O)-R¹²、-N-SO₃H、-SO₂-CH₃または-O-(C₁~C₆) - アルキル-O-(C₁~C₆) - アルキルフェニル(ここで、アルキル基中の1つ以上の水素は、フッ素によって置き換えられていることができる)であり；

R⁹ないしR¹²は、相互に独立して水素または(C₁~C₈) - アルキルである}の化合物およびその医薬上許容される塩および生理的に機能性の誘導体。

【請求項2】 Cがフェニル、ピリジル、チエニル、フリル、ピリミジル、インドリル、チアゾリル、イミダゾリル、クマリニル、フタルイミジル、キノリル、ピペラジニル、テトラゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリルまたはそのベンゾ - 縮合誘導体であり、芳香族または複素芳香族基は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、OH、CF₃、-NO₂、CN、(C₁~C₈) - アルコキシ、(C₁~C₈) - アルキル、C₃~C₆ - シクロアルキル、NH₂、CHO、-COOHまたはOCF₃によってモノ - ないしジ置換されていることができ；

Dはフェニル、ピリジル、チエニル、フリル、ピリミジル、インドリル、チアゾリル、イミダゾリル、クマリニル、フタルイミジル、キノリル、ピペラジニル、テトラゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリルまたはそのベンゾ - 縮合誘導体であり、芳香族または複素芳香族基は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、OH、CF₃、-NO₂、CN、(C₁~C₈) - アルコキシ、(C₁~C₈) - アルキル、C₃~C₆ - シクロアルキル、NH₂、CHO、-COOHまたはOCF₃によってモノ - ないしジ置換することができるが、但し、

CおよびDは、同時に、C = フェニルおよびD = フェニル、C = フェニルおよびD = ピリジル、C = ピリジルおよびD = フェニル、C = ピリジルおよびD = ピリジルではなく；

R¹、R²、R³、R⁴が相互に独立して水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、OH、CF₃、OCF₃、NO₂、CN、(C₁~C₈) - アルコキシ、(C₁~C₈) - アルキル、C₃~C₆ - シクロアルキル、NH₂、-NH-R⁹、-N(R⁹)R¹⁰、CHO、-COOH、-COOR¹¹または-(C=O)-R¹²(ここで、アルキル基中の1つ以上の水素は、フッ素によって置き換えられていることができる)であり；

R⁹ないしR¹²が相互に独立して水素、(C₁~C₈) - アルキルである、請求項1に記載の式Iの化合物およびその医薬上許容される塩および生理的に機能性の誘導体。

【請求項3】 Cがフェニル、ピリジル、チエニル、ピリミジル、インドリル、チアゾリル、キノイル、オキサゾリルまたはイソオキサゾリルであり、芳香族または複素芳香族基は、フッ素、塩素、臭素または(C₁~C₈) - アルキルによってモノ - ないしジ置換さ

れていることができ；

Dはフェニル、ピリジル、チエニル、ピリミジル、インドリル、チアゾリル、キノイル、イミダゾリル、トリアゾリル、オキサゾリルまたはイソオキサゾリルであり、芳香族または複素芳香族基は、フッ素、塩素、臭素または(C₁~C₈)-アルキルによってモノ-ないしジ置換されていることができるが、但し、

CおよびDは、同時に、C = フェニルおよびD = フェニル、C = フェニルおよびD = ピリジル、C = ピリジルおよびD = フェニル、C = ピリジルおよびD = ピリジルではなく；

R¹、R²、R³、R⁴が相互に独立して水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、OH、CF₃、OCF₃、NO₂、CN、(C₁~C₈)-アルコキシ、(C₁~C₈)-アルキル、C₃~C₆-シクロアルキル、NH₂、-NH-R⁹、-N(R⁹)R¹⁰、CHO、-COOH、-COOR¹¹、または-(C=O)-R¹²(ここで、アルキル基中の1つ以上の水素は、フッ素によって置き換えることができる)であり；

R⁹ないしR¹²が相互に独立して水素、(C₁~C₈)-アルキルである、請求項1または2に記載の式Iの化合物およびその医薬上許容される塩。

【請求項4】 請求項1ないし3のいずれか一項に記載の1種以上の化合物より成る医薬。

【請求項5】 請求項1ないし3のいずれか一項に記載の化合物を含有する高脂血症の治療用医薬。