

【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2005-507932(P2005-507932A)

【公表日】平成17年3月24日(2005.3.24)

【年通号数】公開・登録公報2005-012

【出願番号】特願2003-539676(P2003-539676)

【国際特許分類】

C 07 D 231/14 (2006.01)  
A 61 K 31/415 (2006.01)  
A 61 K 31/4164 (2006.01)  
A 61 K 31/4178 (2006.01)  
A 61 K 31/4184 (2006.01)  
A 61 K 31/421 (2006.01)  
A 61 K 31/426 (2006.01)  
A 61 K 31/433 (2006.01)  
A 61 K 31/438 (2006.01)  
A 61 K 31/4439 (2006.01)  
A 61 K 31/454 (2006.01)  
A 61 K 31/4709 (2006.01)  
A 61 K 31/4725 (2006.01)  
A 61 K 31/496 (2006.01)  
A 61 K 31/5377 (2006.01)  
A 61 K 31/538 (2006.01)  
A 61 K 31/541 (2006.01)  
A 61 P 1/16 (2006.01)  
A 61 P 3/04 (2006.01)  
A 61 P 3/06 (2006.01)  
A 61 P 3/10 (2006.01)  
A 61 P 9/08 (2006.01)  
A 61 P 9/10 (2006.01)  
A 61 P 9/12 (2006.01)  
A 61 P 15/00 (2006.01)  
A 61 P 15/08 (2006.01)  
A 61 P 15/12 (2006.01)  
A 61 P 19/02 (2006.01)  
A 61 P 25/20 (2006.01)  
A 61 P 35/00 (2006.01)  
C 07 D 233/90 (2006.01)  
C 07 D 263/34 (2006.01)  
C 07 D 277/26 (2006.01)  
C 07 D 401/06 (2006.01)  
C 07 D 401/12 (2006.01)  
C 07 D 401/14 (2006.01)  
C 07 D 403/12 (2006.01)  
C 07 D 405/12 (2006.01)  
C 07 D 413/14 (2006.01)  
C 07 D 417/12 (2006.01)  
C 07 D 471/10 (2006.01)

C 0 7 D 277/20 (2006.01)  
C 0 7 D 277/56 (2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 D 231/14  
A 6 1 K 31/415  
A 6 1 K 31/4164  
A 6 1 K 31/4178  
A 6 1 K 31/4184  
A 6 1 K 31/421  
A 6 1 K 31/426  
A 6 1 K 31/433  
A 6 1 K 31/438  
A 6 1 K 31/4439  
A 6 1 K 31/454  
A 6 1 K 31/4709  
A 6 1 K 31/4725  
A 6 1 K 31/496  
A 6 1 K 31/5377  
A 6 1 K 31/538  
A 6 1 K 31/541  
A 6 1 P 1/16 1 0 5  
A 6 1 P 3/04  
A 6 1 P 3/06  
A 6 1 P 3/10  
A 6 1 P 9/08  
A 6 1 P 9/10  
A 6 1 P 9/10 1 0 1  
A 6 1 P 9/12  
A 6 1 P 15/00  
A 6 1 P 15/08  
A 6 1 P 15/12  
A 6 1 P 19/02  
A 6 1 P 25/20  
A 6 1 P 35/00  
C 0 7 D 233/90 A  
C 0 7 D 263/34  
C 0 7 D 277/26  
C 0 7 D 401/06  
C 0 7 D 401/12  
C 0 7 D 401/14  
C 0 7 D 403/12  
C 0 7 D 405/12  
C 0 7 D 413/14  
C 0 7 D 417/12  
C 0 7 D 471/10 1 0 3  
C 0 7 D 277/56

## 【手続補正書】

【提出日】平成17年10月7日(2005.10.7)

## 【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

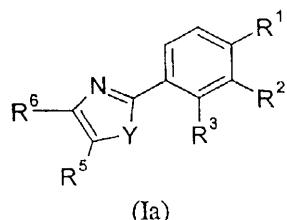
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(Ia)

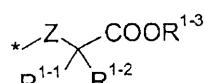
【化1】



[式中、

R<sup>1</sup>は式

【化2】



の基を示し、

ここで

ZはO又はSを示し、

R<sup>1-1</sup>は水素又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し、

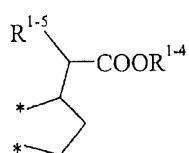
R<sup>1-2</sup>は水素又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し、

R<sup>1-3</sup>は水素又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し；

R<sup>2</sup>は水素又はメチルを示すか；あるいは

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は一緒になって式

【化3】



の基を示すことができ、

それは該基が結合している炭素と一緒にになって炭素環式環を形成し、

ここで

R<sup>1-4</sup>は水素又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し、

R<sup>1-5</sup>は水素又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し；

R<sup>3</sup>は水素又はメチルを示し；

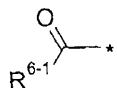
YはNR<sup>4</sup>、O又はSを示し；

R<sup>4</sup>は水素又は場合により(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ及び(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリールオキシより成る群から独立して選ばれる1もしくは2個の置換基で置換されていることができる(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し；

R<sup>5</sup>は水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルあるいは場合によりハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシで置換されていることができるフェニルを示し；

R<sup>6</sup>はベンジルオキシカルボニルアミノ又は式

## 【化4】



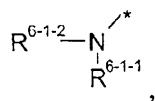
の基を示し、

ここで

$R^{6-1}$ は

- ・ヒドロキシ、
- ・( $C_1 - C_6$ )アルコキシ、
- ・ベンジルオキシ、
- ・式

## 【化5】



の基、

(ここで

$R^{6-1-1}$ は

水素、

場合により( $C_6 - C_{10}$ )アリール及び( $C_1 - C_6$ )アルコキシより成る群から独立して選ばれる1もしくは2個の置換基で置換されていることができる( $C_1 - C_6$ )アルキル、

場合により( $C_1 - C_6$ )アルキルで置換されていることができる( $C_3 - C_8$ )シクロアルキル、

場合によりハロゲン、ニトロ、シアノ、( $C_1 - C_6$ )アルキル、( $C_3 - C_8$ )シクロアルキル、( $C_1 - C_6$ )アルキルカルボニル、ヒドロキシ、( $C_1 - C_6$ )アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ヘテロシクリル、( $C_6 - C_{10}$ )アリール、( $C_6 - C_{10}$ )アリールオキシ及びベンジルより成る群から独立して選ばれる1、2又は3個の置換基で置換されていることができる( $C_6 - C_{10}$ )アリール又は

場合によりフェニル、ベンジル又はハロゲンで置換されていることができる3~9個の炭素原子及びO、N又はSから選ばれる1~3個のヘテロ原子を含んでなる5~-10~-員複素環式基

を示し、

$R^{6-1-2}$ は水素、( $C_1 - C_6$ )アルキル又は( $C_3 - C_8$ )シクロアルキルを示す)

・式-NH-NH-R^{6-2}の基(ここで $R^{6-2}$ は( $C_6 - C_{10}$ )アリールを示す)、

あるいは

・3~9個の炭素原子及びO、N又はSから選ばれる1~3個のヘテロ原子を含んでなり且つ場合により( $C_1 - C_6$ )アルキル、ベンジル又は場合により( $C_1 - C_6$ )アルキルで置換されていることができるフェニルより成る群から独立して選ばれる1もしくは2個の置換基で置換されていることができる5~-10~-員複素環式基

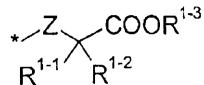
を示す]

の化合物及びその製薬学的塩又はエステル。

## 【請求項2】

$R^1$ が式

## 【化6】



の基を示し、

ここで

ZはSを示し、

R<sup>1-1</sup>は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し、

R<sup>1-2</sup>は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し、

R<sup>1-3</sup>は水素を示し；

R<sup>2</sup>が水素を示し；

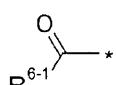
YがNR<sup>4</sup>を示し；

R<sup>4</sup>は場合により(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ及び(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリールオキシより成る群から独立して選ばれる1もしくは2個の置換基で置換されていることができる(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し；

R<sup>5</sup>が水素又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し；

R<sup>6</sup>が式

## 【化7】



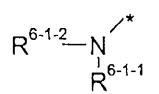
の基を示し、

ここで

R<sup>6-1</sup>は

・式

## 【化8】



の基を示し、

ここで

R<sup>6-1-1</sup>は

場合により(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリール及び(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシより成る群から独立して選ばれる1もしくは2個の置換基で置換されていることができる(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、

場合により(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルで置換されていることができる(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、

場合によりハロゲン、ニトロ、シアノ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルカルボニル、ヒドロキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ヘテロシクリル、(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリール、(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリールオキシ及びベンジルより成る群から独立して選ばれる1、2又は3個の置換基で置換されていることができる(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリール又は

場合によりフェニル、ベンジル又はハロゲンで置換されていることができる3~9個の炭素原子及びO、N又はSから選ばれる1~3個のヘテロ原子を含んでなる5~10-員複素環式基

を示し、

$R^{6-1-2}$  は水素又は ( $C_1 - C_6$ ) アルキルを示す  
請求項 1 の化合物及びその製薬学的塩又はエステル。

## 【請求項 3】

$R^{6-1-1}$  が

場合によりハロゲン、ニトロ、シアノ、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_3 - C_8$ ) シクロアルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニル、ヒドロキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ヘテロシクリル、( $C_6 - C_{10}$ ) アリール、( $C_6 - C_{10}$ ) アリールオキシ及びベンジルより成る群から独立して選ばれる 1、2 又は 3 個の置換基で置換されていることができる ( $C_6 - C_{10}$ ) アリールを示す

請求項 2 の化合物及びその製薬学的塩又はエステル。

## 【請求項 4】

$R^{6-1-1}$  が

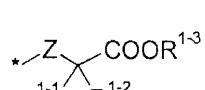
場合によりフェニル、ベンジル又はハロゲンで置換されていることができる 3 ~ 9 個の炭素原子及び O、N 又は S から選ばれる 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含んでなる 5 - ~ 10 - 員複素環式基を示す

請求項 2 の化合物及びその製薬学的塩又はエステル。

## 【請求項 5】

$R^1$  が式

## 【化 9】



の基を示し、

ここで

Z は S を示し、

$R^{1-1}$  は ( $C_1 - C_6$ ) アルキルを示し、

$R^{1-2}$  は ( $C_1 - C_6$ ) アルキルを示し、

$R^{1-3}$  は水素を示し；

$R^2$  が水素を示し；

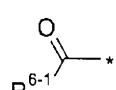
Y が N  $R^4$  を示し；

$R^4$  は場合により ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ及び ( $C_6 - C_{10}$ ) アリールオキシより成る群から独立して選ばれる 1 もしくは 2 個の置換基で置換されていることができる ( $C_1 - C_6$ ) アルキルを示し；

$R^5$  が水素又は ( $C_1 - C_6$ ) アルキルを示し；

$R^6$  が式

## 【化 10】



の基を示し、

ここで

$R^{6-1}$  は

3 ~ 9 個の炭素原子及び O、N 又は S から選ばれる 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含んでなり且つ場合により ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ベンジル又は場合により ( $C_1 - C_6$ ) アルキルで置換されていることができるフェニルより成る群から独立して選ばれる 1 もしくは 2 個の置換基で置換されていることができる 5 - ~ 10 - 員複素環式基

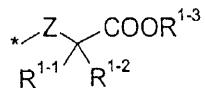
を示す

請求項 1 の化合物及びその製薬学的塩又はエステル。

【請求項 6】

$R^1$  が式

【化 1 1】



の基を示し、

ここで

$Z$  は  $S$  を示し、

$R^{1-1}$  は ( $C_1 - C_6$ ) アルキルを示し、

$R^{1-2}$  は ( $C_1 - C_6$ ) アルキルを示し、

$R^{1-3}$  は ( $C_1 - C_6$ ) アルキルを示し；

$R^2$  が水素を示し；

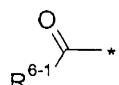
$Y$  が  $N R^4$  を示し；

$R^4$  は場合により ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ及び ( $C_6 - C_{10}$ ) アリールオキシより成る群から独立して選ばれる 1 もしくは 2 個の置換基で置換されていることができる ( $C_1 - C_6$ ) アルキルを示し；

$R^5$  が水素又は ( $C_1 - C_6$ ) アルキルを示し；

$R^6$  が式

【化 1 2】



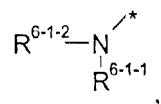
の基を示し、

ここで

$R^{6-1}$  は

・式

【化 1 3】



の基を示し、

ここで

$R^{6-1-1}$  は

ヒドロキシ、

( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ

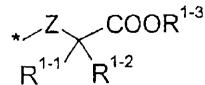
を示す

請求項 1 の化合物及びその製薬学的塩又はエステル。

【請求項 7】

$R^1$  が式

## 【化14】



の基を示し、

ここで

ZはOを示し、

R<sup>1-1</sup>は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し、

R<sup>1-2</sup>は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し、

R<sup>1-3</sup>は水素を示し；

R<sup>2</sup>が水素を示し；

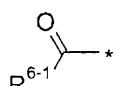
YがNR<sup>4</sup>を示し；

R<sup>4</sup>は場合により(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ及び(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリールオキシより成る群から独立して選ばれる1もしくは2個の置換基で置換されていることができる(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し；

R<sup>5</sup>が水素を示し；

R<sup>6</sup>が式

## 【化15】



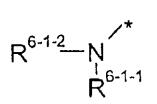
の基を示し、

ここで

R<sup>6-1</sup>は

・式

## 【化16】



の基を示し、

ここで

R<sup>6-1-1</sup>は

場合によりハロゲン、ニトロ、シアノ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルカルボニル、ヒドロキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ヘテロシクリル、(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリール、(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリールオキシ及びベンジルより成る群から独立して選ばれる1、2又は3個の置換基で置換されていることができる(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリールを示すか、あるいは

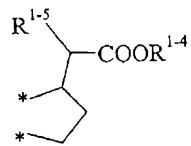
R<sup>6-1-2</sup>は水素を示す

請求項1の化合物及びその製薬学的塩又はエステル。

## 【請求項8】

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が一緒になって式

## 【化17】



の基を示すことができ、

それは該基が結合している炭素と一緒にになって炭素環式環を形成し、

ここで

R<sup>1-4</sup>は水素又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し、

R<sup>1-5</sup>は水素又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し；

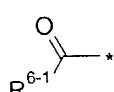
YがNR<sup>4</sup>を示し；

R<sup>4</sup>は場合により(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ及び(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリールオキシより成る群から独立して選ばれる1もしくは2個の置換基で置換されていることができる(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し；

R<sup>5</sup>が水素又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し；

R<sup>6</sup>が式

## 【化18】



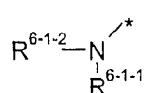
の基を示し、

ここで

R<sup>6-1</sup>は

式

## 【化19】



の基を示し、

ここで

R<sup>6-1-1</sup>は

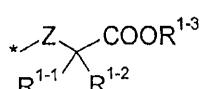
場合によりハロゲン、ニトロ、シアノ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルカルボニル、ヒドロキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ヘテロシクリル、(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリール、(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリールオキシ及びベンジルより成る群から独立して選ばれる1、2又は3個の置換基で置換されていることができる(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリールを示し、

R<sup>6-1-2</sup>は水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル又は(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキルを示す請求項1の化合物及びその製薬学的塩又はエステル。

## 【請求項9】

R<sup>1</sup>が式

## 【化20】



の基を示し、

ここで

ZはO又はSを示し、

R<sup>1-1</sup>は水素又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し、

R<sup>1-2</sup>は水素又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し、

R<sup>1-3</sup>は水素又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルを示し；

R<sup>2</sup>が水素を示し；

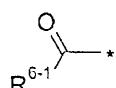
R<sup>3</sup>が水素を示し；

YがSを示し；

R<sup>5</sup>が場合によりハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシで置換されていることができるフェニルを示し；

R<sup>6</sup>が式

### 【化21】



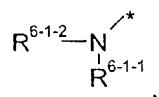
の基を示し、

ここで

R<sup>6-1</sup>は

- ・ヒドロキシ、
- ・(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、
- ・式

### 【化22】



の基、

(ここで

R<sup>6-1-1</sup>は

場合によりハロゲン、ニトロ、シアノ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルカルボニル、ヒドロキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ヘテロシクリル、(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリール、(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリールオキシ及びベンジルより成る群から独立して選ばれる1、2又は3個の置換基で置換されていることができる(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリールを示し、

R<sup>6-1-2</sup>は水素を示す)；

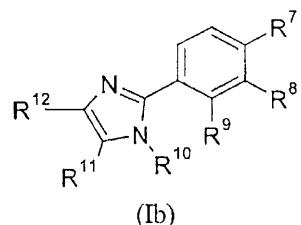
・3~9個の炭素原子及びO、N又はSから選ばれる1~3個のヘテロ原子を含んでなり且つ場合により(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、ベンジル又は場合により(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルで置換されていることができるフェニルより成る群から独立して選ばれる1もしくは2個の置換基で置換されていることができる5~10-員複素環式基を示す

請求項1の化合物及びその製薬学的塩又はエステル。

### 【請求項10】

式(Ib)

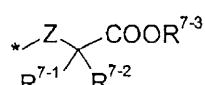
## 【化23】



[式中、

 $R^7$ は式

## 【化24】

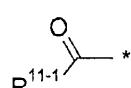


の基を示し、

ここで

 $Z$ はSを示し、 $R^{7-1}$ は水素又は( $C_1 - C_6$ )アルキルを示し、 $R^{7-2}$ は水素又は( $C_1 - C_6$ )アルキルを示し、 $R^{7-3}$ は水素又は( $C_1 - C_6$ )アルキルを示し； $R^8$ は水素又はメチルを示し； $R^9$ は水素又はメチルを示し； $R^{10}$ は場合により( $C_1 - C_6$ )アルコキシ及び( $C_6 - C_{10}$ )アリールオキシより成る群から独立して選ばれる1もしくは2個の置換基で置換されていることができる( $C_1 - C_6$ )アルキルを示し； $R^{11}$ は式

## 【化25】



の基を示し、

ここで

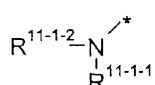
 $R^{11-1}$ は

・ヒドロキシ、

・( $C_1 - C_6$ )アルコキシ、・場合により1もしくは2個の( $C_1 - C_6$ )アルキル又は場合によりハロゲンで置換されていることができるフェニルで置換されていることができる3~9個の炭素原子及びO、N又はSから選ばれる1~3個のヘテロ原子を含んでなる5~10~員複素環式基

・式

## 【化26】



の基

を示し、

ここで

$R^{11-1-1}$  は

場合によりハロゲン、ニトロ、シアノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、トリフルオロメチル、フェニルから独立して選ばれる最高で 3 個の置換基で置換されていることができる (C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) アリール又は

3 ~ 9 個の炭素原子及び O、N 又は S から選ばれる 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含んでなる 5 - ~ 10 - 員複素環式基

を示し、

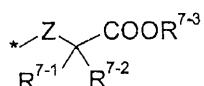
$R^{11-1-2}$  は水素を示し；

$R^{12}$  は水素又は (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルを示す] の化合物及びその製薬学的塩又はエステル。

### 【請求項 11】

$R^7$  が式

### 【化 2 7】



の基を示し、

ここで

Z は S を示し、

$R^{7-1}$  は (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルを示し、

$R^{7-2}$  は (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルを示し、

$R^{7-3}$  は水素を示し；

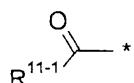
$R^8$  が水素を示し；

$R^9$  が水素を示し；

$R^{10}$  が場合により 1 もしくは 2 個の (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシで置換されていることができる (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルを示し；

$R^{11}$  が式

### 【化 2 8】



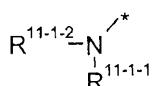
の基を示し、

ここで

$R^{11-1}$  は

式

### 【化 2 9】



の基

を示し、

ここで

$R^{11-1-1}$  は

場合によりハロゲン、ニトロ、シアノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、トリフルオロメチル、フェニルから独立して選ばれる最高で 3 個の置換基で置換されていることができる (C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) アリール

を示し、

$R^{11-1-2}$  は水素を示し；

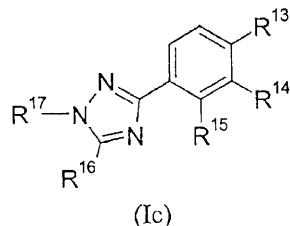
$R^{12}$  が水素又は ( $C_1 - C_6$ ) アルキルを示す

請求項 10 の化合物及びその製薬学的塩又はエステル。

【請求項 12】

式 (Ic)

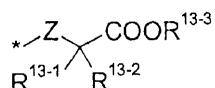
【化 30】



[式中、

$R^{13}$  は式

【化 31】



の基を示し、

ここで

Z は S を示し、

$R^{13-1}$  は水素又は ( $C_1 - C_6$ ) アルキルを示し、

$R^{13-2}$  は水素又は ( $C_1 - C_6$ ) アルキルを示し、

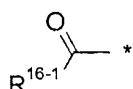
$R^{13-3}$  は水素又は ( $C_1 - C_6$ ) アルキルを示し；

$R^{14}$  は水素又はメチルを示し；

$R^{15}$  は水素又はメチルを示し；

$R^{16}$  は式

【化 32】

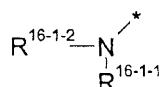


の基を示し、

ここで

$R^{16-1}$  は式

【化 33】



の基を示し、

ここで

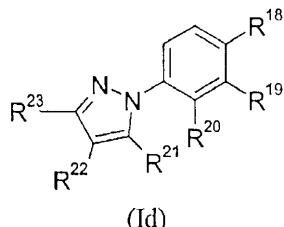
$R^{16-1-1}$  は場合によりハロゲン、ニトロ、シアノ、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ及びトリフルオロメチルから独立して選ばれる 1、2 もしくは 3 個の置換基で置換されていることができる ( $C_6 - C_{10}$ ) アリールを示し、

$R^{16-1-2}$  は水素を示し；  
 $R^{17}$  は場合により 1 もしくは 2 個の ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシで置換されていることができるアルキル ( $C_1 - C_6$ ) アルキルを示す】  
 の化合物及びその製薬学的塩又はエステル。

## 【請求項 1 3】

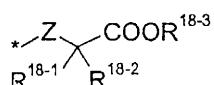
式 (I d)

## 【化 3 4】



[ 式中、  
 $R^{18}$  は式

## 【化 3 5】

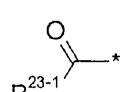


の基を示し、

ここで

 $Z$  は  $S$  を示し、 $R^{18-1}$  は水素又は ( $C_1 - C_6$ ) アルキルを示し、 $R^{18-2}$  は水素又は ( $C_1 - C_6$ ) アルキルを示し、 $R^{18-3}$  は水素又は ( $C_1 - C_6$ ) アルキルを示し； $R^{19}$  は水素又はメチルを示し； $R^{20}$  は水素又はメチルを示し； $R^{21}$  は ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシを示し； $R^{22}$  は水素、 ( $C_1 - C_6$ ) アルキル又はフェニルを示し； $R^{23}$  は式

## 【化 3 6】

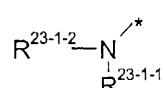


の基を示し、

ここで

 $R^{23-1}$  はヒドロキシ、 ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ又はベンジルオキシあるいは式

## 【化 3 7】



の基を示し、

ここで

 $R^{23-1-1}$  は場合によりハロゲン、ニトロ、シアノ、 ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、

(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及びトリフルオロメチルから独立して選ばれる最高で 3 個の置換基で置換されていることができる (C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) アリールを示し、

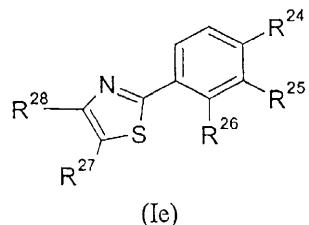
R<sup>23-1-2</sup> は水素を示す]

の化合物及びその製薬学的塩又はエステル。

【請求項 1 4】

式 (Ie)

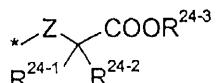
【化 3 8】



[式中、

R<sup>24</sup> は式

【化 3 9】



の基を示し、

ここで

Z は S を示し、

R<sup>24-1</sup> は水素又は (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルを示し、

R<sup>24-2</sup> は水素又は (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルを示し、

R<sup>24-3</sup> はナトリウム、水素又は (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルを示し；

R<sup>25</sup> は水素又はメチルを示し；

R<sup>26</sup> は水素又はメチルを示し；

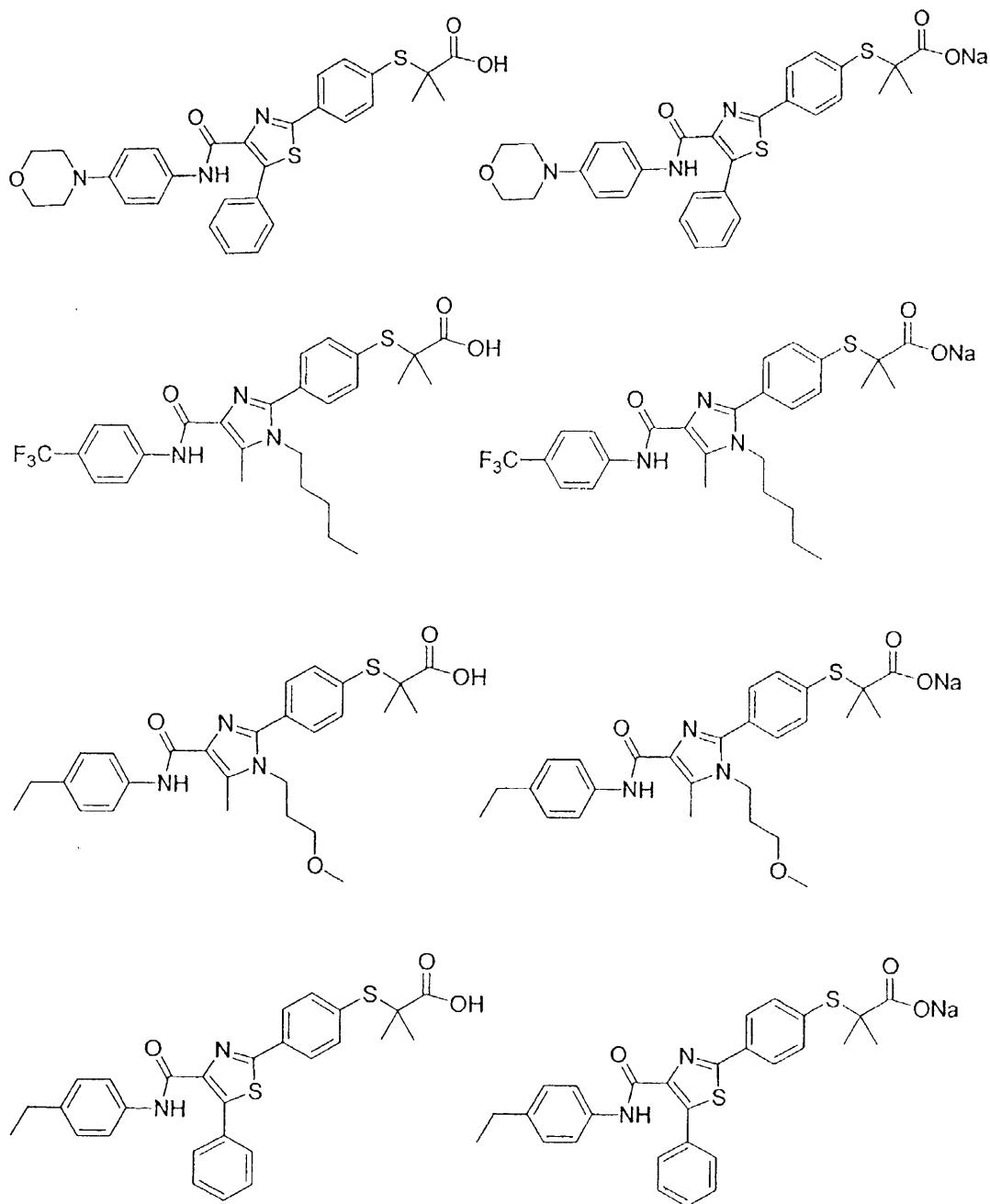
R<sup>27</sup> はフェニルを示し；

R<sup>28</sup> は水素を示す]

の化合物及びその製薬学的塩又はエステル。

【請求項 1 5】

## 【化40】



より成る群から選ばれる化合物。

## 【請求項16】

有効量の請求項1の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

## 【請求項17】

有効量の請求項10の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

## 【請求項18】

有効量の請求項12の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

## 【請求項19】

有効量の請求項13の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

**【請求項 20】**

有効量の請求項14の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

**【請求項 21】**

有効量の請求項1の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体及び1種もしくはそれより多い血糖降下薬と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

**【請求項 22】**

該血糖降下薬がインスリン、ビグアニジン、スルホニルウレア、インスリン分泌促進薬、 $\alpha$ -グリコシダーゼ阻害剤及び $\beta_3$ -アドレナリン受容体アゴニストより成る群から選ばれる請求項21の製薬学的組成物。

**【請求項 23】**

有効量の請求項10の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体及び1種もしくはそれより多い血糖降下薬と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

**【請求項 24】**

該血糖降下薬がインスリン、ビグアニジン、スルホニルウレア、インスリン分泌促進薬、 $\alpha$ -グリコシダーゼ阻害剤及び $\beta_3$ -アドレナリン受容体アゴニストより成る群から選ばれる請求項23の製薬学的組成物。

**【請求項 25】**

有効量の請求項12の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体及び1種もしくはそれより多い血糖降下薬と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

**【請求項 26】**

該血糖降下薬がインスリン、ビグアニジン、スルホニルウレア、インスリン分泌促進薬、 $\alpha$ -グリコシダーゼ阻害剤及び $\beta_3$ -アドレナリン受容体アゴニストより成る群から選ばれる請求項25の製薬学的組成物。

**【請求項 27】**

有効量の請求項13の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体及び1種もしくはそれより多い血糖降下薬と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

**【請求項 28】**

該血糖降下薬がインスリン、ビグアニジン、スルホニルウレア、インスリン分泌促進薬、 $\alpha$ -グリコシダーゼ阻害剤及び $\beta_3$ -アドレナリン受容体アゴニストより成る群から選ばれる請求項27の製薬学的組成物。

**【請求項 29】**

有効量の請求項14の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体及び1種もしくはそれより多い血糖降下薬と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

**【請求項 30】**

該血糖降下薬がインスリン、ビグアニジン、スルホニルウレア、インスリン分泌促進薬、 $\alpha$ -グリコシダーゼ阻害剤及び $\beta_3$ -アドレナリン受容体アゴニストより成る群から選ばれる請求項29の製薬学的組成物。

**【請求項 31】**

有効量の請求項1の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体ならびにHMG CoAレダクターゼ阻害剤、胆汁酸結合剤、フィブリノ酸(fibrin acid)誘導体及び高血圧を調節する薬剤より成る群から選ばれる1種もしくはそれより多い薬剤と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

**【請求項 32】**

有効量の請求項10の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、

製薬学的に許容され得る担体ならびにHMG-CoAレダクターゼ阻害剤、胆汁酸結合剤、フィブリン酸誘導体及び高血圧を調節する薬剤より成る群から選ばれる1種もしくはそれより多い薬剤と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

【請求項33】

有効量の請求項12の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体ならびにHMG-CoAレダクターゼ阻害剤、胆汁酸結合剤、フィブリン酸誘導体及び高血圧を調節する薬剤より成る群から選ばれる1種もしくはそれより多い薬剤と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

【請求項34】

有効量の請求項13の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体ならびにHMG-CoAレダクターゼ阻害剤、胆汁酸結合剤、フィブリン酸誘導体及び高血圧を調節する薬剤より成る群から選ばれる1種もしくはそれより多い薬剤と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

【請求項35】

有効量の請求項14の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体ならびにHMG-CoAレダクターゼ阻害剤、胆汁酸結合剤、フィブリン酸誘導体及び高血圧を調節する薬剤より成る群から選ばれる1種もしくはそれより多い薬剤と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

【請求項36】

有効量の請求項1の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体ならびに熱発生、脂肪分解、腸運動性、脂肪吸収及び満腹を調節する薬剤より成る群から選ばれる1種もしくはそれより多い薬剤と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

【請求項37】

有効量の請求項10の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体ならびに熱発生、脂肪分解、腸運動性、脂肪吸収及び満腹を調節する薬剤より成る群から選ばれる1種もしくはそれより多い薬剤と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

【請求項38】

有効量の請求項12の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体ならびに熱発生、脂肪分解、腸運動性、脂肪吸収及び満腹を調節する薬剤より成る群から選ばれる1種もしくはそれより多い薬剤と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

【請求項39】

有効量の請求項13の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体ならびに熱発生、脂肪分解、腸運動性、脂肪吸収及び満腹を調節する薬剤より成る群から選ばれる1種もしくはそれより多い薬剤と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

【請求項40】

有効量の請求項14の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体ならびに熱発生、脂肪分解、腸運動性、脂肪吸収及び満腹を調節する薬剤より成る群から選ばれる1種もしくはそれより多い薬剤と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

【請求項41】

有効量の請求項1の化合物あるいはその塩又はエステルを不活性担体と組み合わせて含んでなる組成物。

【請求項42】

有効量の請求項10の化合物あるいはその塩又はエステルを不活性担体と組み合わせて含んでなる組成物。

【請求項43】

有効量の請求項 1 2 の化合物あるいはその塩又はエステルを不活性担体と組み合わせて含んでなる組成物。

【請求項 4 4】

有効量の請求項 1 3 の化合物あるいはその塩又はエステルを不活性担体と組み合わせて含んでなる組成物。

【請求項 4 5】

有効量の請求項 1 4 の化合物あるいはその塩又はエステルを不活性担体と組み合わせて含んでなる組成物。