

【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 17 年 12 月 22 日 (2005.12.22)

【公表番号】特表 2004-517100(P2004-517100A)

【公表日】平成 16 年 6 月 10 日 (2004.6.10)

【年通号数】公開・登録公報 2004-022

【出願番号】特願 2002-551544(P2002-551544)

【国際特許分類第 7 版】

C 07 D 277/24

A 61 K 31/426

A 61 P 1/14

A 61 P 3/04

A 61 P 3/06

A 61 P 3/10

A 61 P 9/00

A 61 P 9/04

A 61 P 29/00

A 61 P 43/00

C 07 D 277/20

C 07 D 277/26

C 07 D 277/58

【F I】

C 07 D 277/24

A 61 K 31/426

A 61 P 1/14

A 61 P 3/04

A 61 P 3/06

A 61 P 3/10

A 61 P 9/00

A 61 P 9/04

A 61 P 29/00

A 61 P 43/00 1 1 1

C 07 D 277/26

C 07 D 277/58

【手続補正書】

【提出日】平成 16 年 12 月 3 日 (2004.12.3)

【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

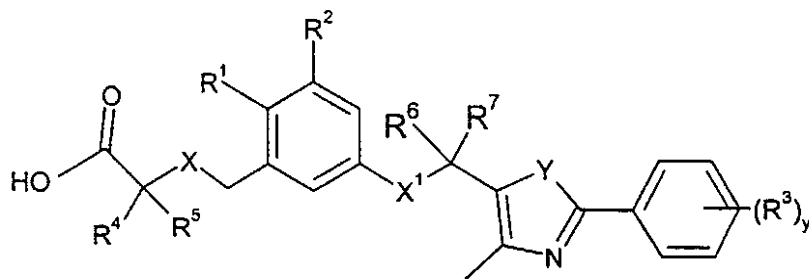
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

## 【化 1】



[ ここで :

XはOまたはSであり ;

X¹はOまたはSであり ;

YはSまたはOであり ;

R¹およびR²は独立にH、メチル、またはハロゲンであり ;

R⁴およびR⁵は独立にHまたはC₁-₃アルキルであるか、あるいはR⁴およびR⁵は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって3~5員のシクロアルキル環を形成していてもよく ;

R⁶およびR⁷は独立にH、C₁-₃アルキル、またはアリルであり ;

それぞれのR³は独立にハロゲン、C₁-₆直鎖もしくは分岐鎖アルキル、またはCF₃であり ;

yは0、1、2、3、4、または5である ]

の化合物ならびにその医薬的に許容される塩、溶媒和物および加水分解可能エステル。

## 【請求項 2】

hPPARアルファアゴニストである式 ( I ) の化合物。

## 【請求項 3】

選択的hPPARアルファアゴニストである請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

XがOである請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 5】

X¹がOである請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 6】

R¹およびR²の内の少なくとも1つがHである請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 7】

R¹およびR²のいずれもがHである請求項 6 に記載の化合物。

## 【請求項 8】

R⁶およびR⁷のいずれもがHである請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 9】

YがSである請求項 1 ~ 8 のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 10】

R⁴およびR⁵のいずれもがHであるか、またはR⁴およびR⁵のいずれもがCH₃である請求項 1 ~ 9 のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 11】

R⁴およびR⁵のいずれもがCH₃である請求項 10 に記載の化合物。

## 【請求項 12】

yが1または2である請求項 1 ~ 11 のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 13】

yが2である請求項 12 に記載の化合物。

## 【請求項 14】

R³置換基の内の1つがハロゲンである請求項 13 に記載の化合物。

## 【請求項 15】

前記R<sup>3</sup>置換基の内の1つがハロゲンであり、もう1つがCF<sub>3</sub>である請求項14に記載の化合物。

【請求項16】

yが1である請求項12に記載の化合物。

【請求項17】

前記R<sup>3</sup>置換基がパラの位置にある請求項16に記載の化合物。

【請求項18】

R<sup>3</sup>がCF<sub>3</sub>である請求項17に記載の化合物。

【請求項19】

2-メチル-2-[(3-[4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルフェニル)チアゾール-5-イル]メトキシ)ベンジルオキシ]プロピオン酸エチルエステル；

2-メチル-2-[(3-[4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルフェニル)チアゾール-5-イル]メトキシ)ベンジルオキシ]プロピオン酸；

2-[(3-[4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルフェニル)チアゾール-5-イル]メトキシ)ベンジル]チオ}酢酸メチルエステル；

2-[(3-[4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルフェニル)チアゾール-5-イル]メトキシ)ベンジル]チオ}酢酸；

2-[(3-[4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルフェニル)チアゾール-5-イル]メトキシ)ベンジルオキシ]酢酸エチルエステル；

2-[(3-[4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルフェニル)チアゾール-5-イル]メトキシ)ベンジルオキシ]酢酸；

2-メチル-2-[3-{1-[4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルフェニル)チアゾール-5-イル]エトキシ}ベンジルオキシ]プロピオン酸エチルエステル；

2-メチル-2-[3-{1-[4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルフェニル)チアゾール-5-イル]エトキシ}ベンジルオキシ]プロピオン酸；

2-メチル-2-[3-{1-メチル-1-[4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルフェニル)チアゾール-5-イル]エトキシ}ベンジルオキシ]プロピオン酸エチルエステル；

2-メチル-2-[3-{1-メチル-1-[4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルフェニル)チアゾール-5-イル]エトキシ}ベンジルオキシ]プロピオン酸；

2-メチル-2-[3-{1-[4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルフェニル)チアゾール-5-イル]プロピルオキシ}ベンジルオキシ]プロピオン酸エチル；

2-メチル-2-[3-{1-[4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルフェニル)チアゾール-5-イル]プロピルオキシ}ベンジルオキシ]プロピオン酸；

から選択される式(I)の化合物。

【請求項20】

治療用の請求項1～19のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項21】

請求項1～19のいずれか1項に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項22】

医薬的に許容される希釈剤または担体をさらに含む請求項21に記載の医薬組成物。

【請求項23】

hPPAR介在疾患または病状の治療用医薬を製造するための請求項1～19のいずれか1項に記載の化合物の使用。

【請求項24】

前記hPPAR介在疾患または病状が、異常脂血症、シンドロームX、心不全、高コレステロール血症、心臓血管疾患、II型糖尿病、I型糖尿病、インスリン抵抗、高脂血症、肥満症、神経性過食症および拒食症、ならびに炎症である請求項23に記載の使用。