

【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 0 7 D 277/24

A 6 1 K 31/426

A 6 1 P 1/14

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 43/00

C 0 7 D 277/20

C 0 7 D 277/26

C 0 7 D 277/58

【F I】

C 0 7 D 277/24

A 6 1 K 31/426

A 6 1 P 1/14

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 277/26

C 0 7 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

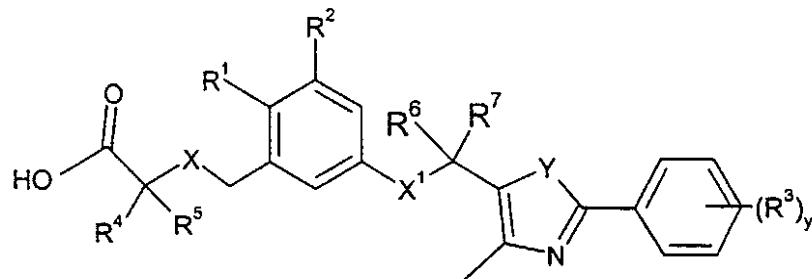
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

## 【化1】



[ここで：

Xは0またはSであり；

X<sup>1</sup>は0またはSであり；

YはSまたは0であり；

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は独立にH、メチル、またはハロゲンであり；R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>は独立にHまたはC<sub>1-3</sub>アルキルであるか、あるいはR<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>は、それらが結合している炭素原子と一緒にになって3~5員のシクロアルキル環を形成していてもよく；R<sup>6</sup>およびR<sup>7</sup>は独立にH、C<sub>1-3</sub>アルキル、またはアリルであり；それぞれのR<sup>3</sup>は独立にハロゲン、C<sub>1-6</sub>直鎖もしくは分岐鎖アルキル、またはCF<sub>3</sub>であり；ならびに

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0である請求項1~3のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項5】

X<sup>1</sup>が0である請求項1~4のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項6】

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>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】

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>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】

R<sup>6</sup>およびR<sup>7</sup>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】

R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>のいずれもがHであるか、またはR<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>のいずれもがCH<sub>3</sub>である請求項1~9のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項11】

R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>のいずれもがCH<sub>3</sub>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】

R<sup>3</sup>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-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]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。