

【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19年1月25日(2007.1.25)

【公表番号】特表2006-509816(P2006-509816A)

【公表日】平成18年3月23日(2006.3.23)

【年通号数】公開・登録公報2006-012

【出願番号】特願2004-560183(P2004-560183)

【国際特許分類】

C 0 7 C 279/04 (2006.01)
A 6 1 K 9/08 (2006.01)
A 6 1 K 9/10 (2006.01)
A 6 1 K 9/107 (2006.01)
A 6 1 K 9/127 (2006.01)
A 6 1 K 9/14 (2006.01)
A 6 1 K 9/20 (2006.01)
A 6 1 K 9/28 (2006.01)
A 6 1 K 9/48 (2006.01)
A 6 1 K 9/50 (2006.01)
A 6 1 K 31/155 (2006.01)
A 6 1 K 31/4453 (2006.01)
A 6 1 K 31/495 (2006.01)
A 6 1 K 47/40 (2006.01)
A 6 1 P 3/04 (2006.01)
A 6 1 P 3/06 (2006.01)
A 6 1 P 3/10 (2006.01)
C 0 7 C 279/12 (2006.01)
C 0 7 D 295/20 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 279/04
A 6 1 K 9/08
A 6 1 K 9/10
A 6 1 K 9/107
A 6 1 K 9/127
A 6 1 K 9/14
A 6 1 K 9/20
A 6 1 K 9/28
A 6 1 K 9/48
A 6 1 K 9/50
A 6 1 K 31/155
A 6 1 K 31/4453
A 6 1 K 31/495
A 6 1 K 47/40
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 3/06
A 6 1 P 3/10
C 0 7 C 279/12 C S P
C 0 7 D 295/20 A
C 0 7 D 295/20 Z

【手続補正書】

【提出日】平成18年11月30日(2006.11.30)

【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

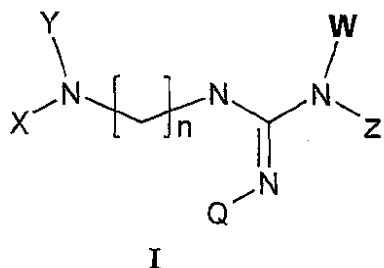
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(1)の化合物：

【化1】



[式中、

Zは以下から選択され得る：H；飽和または不飽和、直鎖または分枝状のアルキル、それは1から7の炭素原子からなり、アルコキシおよびハロゲンで置換されていてもよい；アリールまたはヘテロアリール、それは単環式または二環式であり、窒素、酸素および硫黄から選択される1以上のヘテロ原子を含んでおり、それはハロゲン、NO₂、OH、アルキルおよびアルコキシで置換されていてもよく、それはハロゲンで置換されていてもよい；アリールアルキルまたはヘテロアリールアルキル、ここで、飽和または不飽和アルキル残基は1から7の炭素原子からなり、それは単環式または二環式であり、窒素、酸素および硫黄から選択される1以上のヘテロ原子を含んでおり、それはハロゲン、NO₂、OH、カルボキシ、アルキルおよびアルコキシで置換されていてもよく、それはハロゲンで置換されていてもよい；またはWと共に、環を形成し得、それは1以上のヘテロ原子を含んでいてもよい；

WはHに該当し得るか、またはZと共に、環を形成し得、それは1以上のヘテロ原子を含んでいてもよい；

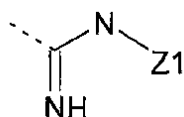
n= 0-10；

Qは上記列挙のZ基から選択され得る；

XおよびYは同一かまたは異なり得、上記列挙のZ基から選択され得る；

更に、Xは以下の型の置換アミノ-イミノであり得る：

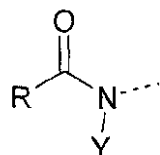
【化2】



式中、Z1は上記列挙のZ基から選択され得る；または

XはR-CO基であり得、窒素と共に、以下の基を形成し得る：

【化3】



式中、Rは上記列挙のZ基から選択され得るかまたは-OZかまたは-NZである；

n = 0であるとき、X-N-Y基はHで置換され得る]；

またはその薬理的に許容される塩、ラセミ混合物、単一のエナンチオマー、立体異性体または幾何異性体または互変異性体、

但し、式(1)の化合物は、N-(4-アミノブチル)-N'-(, -ジメチルアリル)グアニジンメタンスルホネート(ST2369)またはN-(, -ジメチルアリル)グアニジンメタンスルホネート(ST2527)ではない。

【請求項2】

Z基は、1から7の炭素原子を含み得る飽和または不飽和アルキルである、請求項1の化合物。

【請求項3】

Z基はアリアルアルキルであり、アリアルは1以上のハロゲン原子で置換されていてもよい、請求項1の化合物。

【請求項4】

該アリアルに結合し該アリアルアルキル基を形成する該アルキルは1から5までの範囲の数の炭素原子からなる、請求項3の化合物。

【請求項5】

XおよびYは水素に該当し、nは4-7である、請求項1の化合物。

【請求項6】

以下からなる群から選択される請求項1の化合物：

i. N-(6-アミノヘキシル)-N'-(, -ジメチルアリル)グアニジンメタンスルホネート(ST2370)；

ii. N-(4-アミノブチル)-N'-(3-フェニルプロピル)グアニジン(ST2521)；

iii. N-(4-アミノブチル)-N'-(4-フルオロベンジル)グアニジンジクロロヒドレート(ST2524)；

iv. N-アリル-N'-(4-アミノブチル)グアニジンジクロロヒドレート(ST2525)；

v. 1,4-ビス-[N-(, -ジメチルアリル)グアニジノ]-ブタンジメタンスルホネート(ST2526)；

vi. N-(4-フルオロフェニル)-N'-(6-アミノエシル)-4-メチル-1-ピペラジノカルボキシイミダミド(ST2601)；

vii. N-(4-フルオロフェニル)-N'-(6-アミノエシル)-1-ピペリジノカルボキシイミダミド(ST2602)；

viii. N-(4-フルオロフェニル)-N'-(4-アミノブチル)-4-メチル-1-ピペラジノカルボキシイミダミド(ST2658)；

ix. N-(, -ジメチルアリル)-N'-(5-アミノペンチル)グアニジンメタンスルホネート(ST2574)；

x. N-(, -ジメチルアリル)-N'-(7-アミノ ブチル)グアニジンメタンスルホネート(ST2575)。

【請求項7】

医薬としての請求項1 - 6の化合物。

【請求項8】

請求項1 - 6の少なくとも1つの化合物を、1以上の医薬的に許容されるビヒクルおよび/または賦形剤との混合物として含む、医薬組成物。

【請求項9】

錠剤、硬または軟カプセル、パウダー；溶液、懸濁液、シロップ、即時の液体製剤用の固形形、エマルジョン、リポソーム製剤、有効成分の制御放出用の形、適当な層で被覆した錠剤、マイクロカプセル化パウダー、シクロデキストリンとの複合体、またはデポー注入またはインプラントを含む皮下用のものの形を含むデポー形である、請求項8の組成物。

【請求項10】

経口的にまたは非経口的に投与し得る、請求項9の組成物。

【請求項 1 1】

請求項 1 - 6 の少なくとも 1 つの化合物を含む、血清-グルコース-低下性および血清-脂質-低下性作用を有する、医薬組成物。

【請求項 1 2】

II型糖尿病を含む糖尿病、およびその合併症、症候群X、種々のインスリン耐性型、高脂血症および肥満の予防および治療のための、請求項 1 - 6 の少なくとも 1 つの化合物を含む医薬組成物。

【請求項 1 3】

化合物が以下からなる群から選択される、請求項 1 1 または 1 2 の医薬組成物：

- i. N-(6-アミノヘキシル)-N'-(, -ジメチルアリル)グアニジンメタンスルホネート (ST2370)；
- ii. N-(4-アミノブチル)-N'-(3-フェニルプロピル)グアニジン (ST2521)；
- iii. N-(4-アミノブチル)-N'-(4-フルオロベンジル)グアニジンジクロロヒドレート (ST2524)；
- iv. N-アリル-N'-(4-アミノブチル)グアニジンジクロロヒドレート (ST2525)；
- v. 1,4-ビス-[N-(, -ジメチルアリル)グアニジノ]-ブタンジメタンスルホネート (ST2526)；
- vi. N-(4-アミノブチル)-N'-(, -ジメチルアリル)グアニジンメタンスルホネート (ST2369)；
- vii. N-(, -ジメチルアリル)グアニジンメタンスルホネート (ST2527)；
- viii. N-(4-フルオロフェニル)-N'-(6-アミノエシル)-)-4-メチル-1-ピペラジノカルボキシイミダミド (ST 2601)；
- ix. N-(4-フルオロフェニル)-N'-(6-アミノエシル)-1-ピペリジノカルボキシイミダミド (ST 2602)；
- x. N-(4-フルオロフェニル)-N'-(4-アミノブチル)-4-メチル-1-ピペラジノカルボキシイミダミド (ST2658)；
- xi. N-(, -ジメチルアリル)-N'-(5-アミノペンチル)グアニジンメタンスルホネート (ST2574)；
- xii. N-(, -ジメチルアリル)-N'-(7-アミノヘブチル)グアニジンメタンスルホネート (ST2575)。