

【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2005-508308(P2005-508308A)

【公表日】平成17年3月31日(2005.3.31)

【年通号数】公開・登録公報2005-013

【出願番号】特願2003-517034(P2003-517034)

【国際特許分類】

C 0 7 D 263/32 (2006.01)
A 6 1 K 31/155 (2006.01)
A 6 1 K 31/421 (2006.01)
A 6 1 K 31/422 (2006.01)
A 6 1 K 31/426 (2006.01)
A 6 1 K 31/427 (2006.01)
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
A 6 1 K 31/454 (2006.01)
A 6 1 K 31/64 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (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)
A 6 1 P 5/24 (2006.01)
A 6 1 P 9/00 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 9/12 (2006.01)
A 6 1 P 9/14 (2006.01)
A 6 1 P 15/00 (2006.01)
A 6 1 P 17/02 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/06 (2006.01)
A 6 1 P 39/06 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
C 0 7 C 59/72 (2006.01)
C 0 7 C 69/732 (2006.01)
C 0 7 C 69/736 (2006.01)
C 0 7 C 237/36 (2006.01)
C 0 7 D 277/24 (2006.01)
C 0 7 D 277/28 (2006.01)
C 0 7 D 413/04 (2006.01)
C 0 7 D 413/12 (2006.01)
C 0 7 D 417/04 (2006.01)
C 1 2 Q 1/02 (2006.01)
C 0 7 D 277/20 (2006.01)
C 0 7 D 277/30 (2006.01)
A 6 1 K 38/28 (2006.01)
C 0 7 B 57/00 (2006.01)
C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 263/32
A 6 1 K 31/155
A 6 1 K 31/421
A 6 1 K 31/422
A 6 1 K 31/426
A 6 1 K 31/427
A 6 1 K 31/4439
A 6 1 K 31/454
A 6 1 K 31/64
A 6 1 K 45/00
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 3/06
A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 5/24
A 6 1 P 9/00
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 9/12
A 6 1 P 9/14
A 6 1 P 15/00
A 6 1 P 17/02
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 37/06
A 6 1 P 39/06
A 6 1 P 43/00 1 0 5
A 6 1 P 43/00 1 1 1
C 0 7 C 59/72
C 0 7 C 69/732 Z
C 0 7 C 69/736
C 0 7 C 237/36
C 0 7 D 277/24
C 0 7 D 277/28
C 0 7 D 413/04
C 0 7 D 413/12
C 0 7 D 417/04
C 1 2 Q 1/02
C 0 7 D 277/30
A 6 1 K 37/26
C 0 7 B 57/00 3 5 0
C 0 7 B 61/00 3 0 0
C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成17年6月22日(2005.6.22)

【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

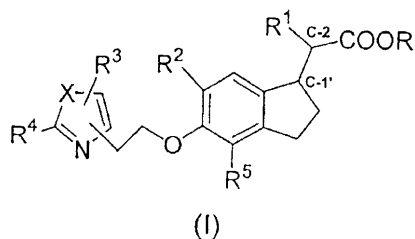
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

【化 1】



〔式中

RはHもしくはC₁－C₆アルキルであり、R¹はH、COOR、C₃－C₈シクロアルキル、または

それぞれ未置換でももしくはフルオロで置換されていてもよいC₁－C₆アルキル、C₂－C₆アルケニルもしくはC₁－C₆アルコキシ、メチレンジオキシフェニル、または未置換でももしくはR⁶で置換されていてもよいフェニルであり、

R²はH、ハロ、または未置換でももしくはC₁－C₆アルコキシ、オキソ、フルオロで置換されていてもよいC₁－C₆アルキルであるか、あるいは

R²はそれぞれが未置換でももしくはR⁶で置換されていてもよいフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピロリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニルもしくはモルホリニルであり、

R³はH、C₁－C₆アルキル、または未置換でももしくはR⁶で置換されていてもよいフェニルであり、

XはOもしくはSであり、

R⁴は、それらのいずれも未置換でももしくはフルオロ、オキソで置換されていてもよいC₁－C₆アルキルもしくはC₃－C₈シクロアルキル、または未置換でももしくはC₁－C₆アルコキシで置換されていてもよいC₁－C₆アルコキシ、または場合によってはR⁶で置換されたフェニルであるか、あるいは

それらのいずれもフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンズジオキサソリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは1, 4-ベンズジオキサニルで置換されていてもよく、

それらがそれぞれ未置換でもR⁶で置換されていてもよい、あるいは

C₁－C₆アルキルはまたC₃－C₈シクロアルキルで、または未置換でももしくはR⁶で置換されていてもよいフェノキシで、またはフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル

ル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾジオキサソリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは1, 4-ベンゾジオキサニルで置換されていてもよく、

それらはそれぞれ未置換でも R^6 で置換されていてもよい、あるいは

R^4 はフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾジオキサソリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは1, 4-ベンゾジオキサニルであり、

それらはそれぞれ未置換でもしくは R^6 で、またはフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピロリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾジオキサソリル、ジヒドロベンゾフラニル、インドリル、ピリミジニルもしくはフェノキシで置換されていてもよく、

それらはそれぞれ未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよい、

R^5 はH、ハロ、または場合によりオキソで置換された $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^6 はハロ、 CF_3 、場合によりオキソもしくはヒドロキシで置換された $C_1 - C_6$ アルキル、または場合によりフルオロで置換された $C_1 - C_6$ アルコキシである]

の化合物および医薬として許容できるその塩およびエステル。

【請求項2】

式中、

RがHもしくは $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^1 がH、 $COOR$ 、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、またはそれぞれ未置換でもしくはフルオロで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニルもしくは $C_1 - C_6$ アルコキシ、メチレンジオキシフェニル、または未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよいフェニルであり、

R^2 がH、ハロ、または未置換でもしくは $C_1 - C_6$ アルコキシ、オキソ、フルオロで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキルであるか、あるいは

R^2 がそれぞれが未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよいフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピロリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニルもしくはモルホリニルであり、

R^3 がH、 $C_1 - C_6$ アルキル、または未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよいフェニルであり、

XがOであり、

R^4 が、それらのいずれも未置換でもしくはフルオロ、オキソで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキルもしくは $C_3 - C_8$ シクロアルキル、または未置換でもしくは $C_1 - C_6$ アルコキシで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルコキシ、または場合によっては R^6 で置換されたフェニルであるか、あるいは

それらのいずれもフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフ

リル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾジオキサソリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは1, 4-ベンゾジオキサニルで置換されていてもよく、

それらがそれぞれ未置換でもR⁶で置換されていてもよく、あるいは

C₁ - C₆ アルキルがまたC₃ - C₈ シクロアルキルで、または未置換でもしくはR⁶で置換されていてもよいフェノキシで、またはフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾジオキサソリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは1, 4-ベンゾジオキサニルで置換されていてもよく、

それらがそれぞれ未置換でもR⁶で置換されていてもよい、あるいは

R⁴ がフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾジオキサソリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは1, 4-ベンゾジオキサニルであり、

それらがそれぞれ未置換でもしくはR⁶で、またはフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピロリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾジオキサソリル、ジヒドロベンゾフラニル、インドリル、ピリミジニルもしくはフェノキシで置換されていてもよく、

それらがそれぞれ未置換でもしくはR⁶で置換されていてもよい、

R⁵ がH、ハロ、または場合によりオキソで置換されたC₁ - C₆ アルキルであり、

R⁶ がハロ、CF₃、場合によりオキソもしくはヒドロキシで置換されたC₁ - C₆ アルキル、または場合によりフルオロで置換されたC₁ - C₆ アルコキシである、
請求項1の化合物および医薬として許容できるその塩およびエステル。

【請求項3】

式中、

RがHもしくはC₁ - C₆ アルキルであり、

R¹ がH、COOR、C₃ - C₈ シクロアルキル、または

それぞれ未置換でももしくはフルオロで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニルもしくは $C_1 - C_6$ アルコキシ、メチレンジオキシフェニル、または未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよいフェニルであり、

R^2 が H、ハロ、または未置換でもしくは $C_1 - C_6$ アルコキシ、オキソ、フルオロで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキルであるか、あるいは

R^2 がそれぞれが未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよいフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピロリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニルもしくはモルホリニルであり、

R^3 が H、 $C_1 - C_6$ アルキル、または未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよいフェニルであり、

X が S であり、

R^4 が、それらのいずれも未置換でもしくはフルオロ、オキソで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキルもしくは $C_3 - C_8$ シクロアルキル、または未置換でもしくは $C_1 - C_6$ アルコキシで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルコキシ、または場合によっては R^6 で置換されたフェニルであるか、あるいは

それらのいずれもフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンズジオキサソリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは 1, 4-ベンズジオキサニルで置換されていてもよく、

それらがそれぞれ未置換でも R^6 で置換されていてもよく、あるいは

$C_1 - C_6$ アルキルがまた $C_3 - C_8$ シクロアルキルで、または未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよいフェノキシで、またはフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンズジオキサソリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは 1, 4-ベンズジオキサニルで置換されていてもよく、

それらがそれぞれ未置換でも R^6 で置換されていてもよい、あるいは

R^4 がフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンズジ

オキシリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは1, 4-ベンゾジオキサニルであり、

それらがそれぞれ未置換でもしくは R^6 で、またはフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピロリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾジオキシリル、ジヒドロベンゾフラニル、インドリル、ピリミジニルもしくはフェノキシで置換されていてもよく、

それらがそれぞれ未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよい、

R^5 がH、ハロ、または場合によりオキソで置換された $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^6 がハロ、 CF_3 、場合によりオキソもしくはヒドロキシで置換された $C_1 - C_6$ アルキル、または場合によりフルオロで置換された $C_1 - C_6$ アルコキシである、
請求項1の化合物および医薬として許容できるその塩およびエステル。

【請求項4】

式中、

RがHであり、

R^1 がH、 $COOR$ 、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、または

それぞれ未置換でもしくはフルオロで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニルもしくは $C_1 - C_6$ アルコキシ、メチレンジオキシフェニル、または未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよいフェニルであり、

R^2 がH、ハロ、または未置換でもしくは $C_1 - C_6$ アルコキシ、オキソ、フルオロで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^3 がHまたは $C_1 - C_6$ アルキル、または未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよいフェニルであり、

XがSであり、

R^4 がフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾジオキシリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは1, 4-ベンゾジオキサニルであり、

それらがそれぞれ未置換でもしくは R^6 で、またはフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピロリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾジオキシリル、ジヒドロベンゾフラニル、インドリル、ピリミジニルもしくはフェノキシで置換されていてもよく、

それらがそれぞれ未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよい、

R^5 がH、ハロ、または場合によりオキソで置換された $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^6 がハロ、 CF_3 、場合によりオキソもしくはヒドロキシで置換された $C_1 - C_6$ アルキル、または場合によりフルオロで置換された $C_1 - C_6$ アルコキシである、
請求項1の化合物および医薬として許容できるその塩およびエステル。

【請求項5】

式中、

RがHであり、

R^1 がH、COOR、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、または

それぞれ未置換でももしくはフルオロで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニルもしくは $C_1 - C_6$ アルコキシ、メチレンジオキシフェニル、または未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよいフェニルであり、

R^2 がH、ハロ、または未置換でもしくは $C_1 - C_6$ アルコキシ、オキソ、フルオロで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^3 がHまたは $C_1 - C_6$ アルキル、または未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよいフェニルであり、

XがOであり、

R^4 がフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾジオキサリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは1,4-ベンゾジオキサニルであり、

それらがそれぞれ未置換でもしくは R^6 で、またはフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピロリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾジオキサリル、ジヒドロベンゾフラニル、インドリル、ピリミジニルもしくはフェノキシで置換されていてもよく、

それらがそれぞれ未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよい、

R^5 がH、ハロ、または場合によりオキソで置換された $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^6 がハロ、 CF_3 、場合によりオキソもしくはヒドロキシで置換された $C_1 - C_6$ アルキル、または場合によりフルオロで置換された $C_1 - C_6$ アルコキシである、

請求項1の化合物および医薬として許容できるその塩およびエステル。

【請求項6】

式中、

RがHであり、

R^1 がH、COOR、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、または

それぞれ未置換でもしくはフルオロで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニルもしくは $C_1 - C_6$ アルコキシ、メチレンジオキシフェニル、または未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよいフェニルであり、

R^2 がそれぞれが未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよいフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピロリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニルもしくはモルホリニルであり、

R^3 がH、 $C_1 - C_6$ アルキル、または未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよいフェニルであり、

XがOであり、

R^4 が、それらのいずれも未置換でもしくはフルオロ、オキソで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキルもしくは $C_3 - C_8$ シクロアルキル、または未置換でもしくは $C_1 - C_6$ アルコキシで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルコキシ、または場合によって

は R^6 で置換されたフェニルであるか、あるいは

それらのいずれもフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾジオキサソリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは 1, 4-ベンゾジオキサニルで置換されていてもよく、

それらがそれぞれが未置換でも R^6 で置換されていてもよい、あるいは

$C_1 - C_6$ アルキルがまた $C_3 - C_8$ シクロアルキルで、または未置換でももしくは R^6 で置換されていてもよいフェノキシで、またはフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾジオキサソリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは 1, 4-ベンゾジオキサニルで置換されていてもよく、

それらがそれぞれ未置換でも R^6 で置換されていてもよい、あるいは

R^4 がフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾジオキサソリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは 1, 4-ベンゾジオキサニルであり、

それらがそれぞれ未置換でもしくは R^6 で、またはフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピロリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾジオキサソリル、ジヒドロベンゾピラニル、インドリル、ピリミジニルもしくはフェノキシで置換されていてもよく、

それらがそれぞれ未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよい、

R^5 が H、ハロ、または場合によりオキソで置換された $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^6 がハロ、 CF_3 、場合によりオキソもしくはヒドロキシで置換された $C_1 - C_6$ アルキル、または場合によりフルオロで置換された $C_1 - C_6$ アルコキシである、
請求項 1 の化合物および医薬として許容できるその塩およびエステル。

【請求項 7】

$C-1'$ が S 配置もしくは R 配置にある、請求項 1 の化合物。

【請求項 8】

C-1' および C-2 の配置が、C-1' が R であり、C-2 が R である；C-1' が R であり C-2 が S である；C-1' が S であり C-2 が S である；そして C-1' が S であり C-2 が R である、から成る群から選択される、請求項 1 の化合物。

【請求項 9】

5- {2- [2- (4-エチルフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} -2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸；

5- (2- {5-メチル-2- [4- (トリフルオロメチル) フェニル] -1, 3-オキサゾール-4-イル} エトキシ) -2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸；

5- {2- [5-メチル-2- (2-ナフチル) -1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} -2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸；

5- {2- [2- (4-tert-ブチルフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} -2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸；

5- {2- [2- (4-ブチルフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} -2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸；

5- {2- [2- (3, 4-ジメチルフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} -2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸；

5- {2- [2- (1-ベンゾチエン-2-イル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} -2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸；

5- {2- [2- (4-イソプロピルフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} -2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸；

5- [2- (2-シクロペンチル-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル) エトキシ] -2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸；

5- {2- [2- (3-フルオロ-4-メチルフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} -2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸；
および

5- {2- [2- (4-フルオロフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} -2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸；

から成る群から選択される請求項 1 の化合物。

【請求項 10】

C-1' が S 配置もしくは R 配置にある、請求項 9 の化合物。

【請求項 11】

2- (5- {2- [2- (4-エチルフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} -2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) プロパン酸；

2- (5- {2- [2- (3, 4-ジクロロフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} -2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) プロパン酸；

2- (5- (2- {5-メチル-2- [4-トリフルオロメチル) フェニル] -1, 3-オキサゾール-4-イル} エトキシ) -2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) プロパン酸；

2- (5- {2- [2- (4-メトキシフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} -2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) プロパン酸；

2- (5- {2- [2- (4-エチルフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} -2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) プロパン酸；

2- (5- {2- [2- (3, 4-ジメチルフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} -2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) プロパン酸；および

2- (5- {2- [2- (4-メトキシフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール

ル-4-イル] エトキシ} - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) プロパン酸 ;

から成る群から選択される請求項1の化合物。

【請求項12】

C-1' および C-2 の配置が、C-1' が R であり C-2 が R である ; C-1' が R であり C-2 が S である ; C-1' が S であり C-2 が S である ; および C-1' が S であり C-2 が R である ; から成る群から選択される、請求項11の化合物。

【請求項13】

5-[2-(5-メチル-2-フェニル-1, 3-オキサゾール-4-イル) エトキシ]-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-[2-(5-メチル-2-フェニル-1, 3-チアゾール-4-イル) エトキシ]-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-{2-[2-(4-メトキシフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-{2-[2-(3-メトキシフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-{2-[2-(1, 3-ベンゾジオキソール-5-イル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-{2-[5-メチル-2-(4-メチルフェニル)-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-{2-[2-(3-フルオロフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-{2-[2-(4-フルオロ-3-メチルフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-[2-(5-エチル-2-フェニル-1, 3-オキサゾール-4-イル) エトキシ]-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-{2-[2-(3, 4-ジクロロフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-{2-[2-(1, 1'-ビフェニル-4-イル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-{2-[2-(1, 3-ベンゾジオキソール-5-イル)-5-メチル-1, 3-チアゾール-4-イル] エトキシ}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-{2-[2-(4-メトキシフェニル)-5-メチル-1, 3-チアゾール-4-イル] エトキシ}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-(2-{5-メチル-2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]-1, 3-チアゾール-4-イル} エトキシ)-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-{2-[2-(4-シアノフェニル)-5-メチル-1, 3-チアゾール-4-イル] エトキシ}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-{2-[2-(4-イソプロピルフェニル)-5-メチル-1, 3-チアゾール-4-イル] エトキシ}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-{2-[2-(3-クロロフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-{2-[2-(4-シアノフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-{2-[2-(3-シアノフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5-{2-[2-(4-クロロフェニル)-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸 ;

5 - (2 - {5 - メチル - 2 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル} エトキシ) - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - {2 - [2 - (3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - {2 - [2 - (3, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - {2 - [2 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - {2 - [2 - (3, 4 - ジメチルフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - {2 - [2 - (4 - アセチルフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - {2 - [2 - (3 - アミノ - 4 - メチルフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸トリフルオロアセテート ;

5 - {2 - [2 - (2 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - {2 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - {2 - [2 - (4 - エトキシフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - {2 - [2 - (3, 4 - ジメトキシフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - {2 - [5 - メチル - 2 - (3 - メチルフェニル) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - (2 - {5 - メチル - 2 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル} エトキシ) - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - {2 - [2 - (3 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - {2 - [2 - (3, 5 - ジメチルフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - (2 - {5 - メチル - 2 - [4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル} エトキシ) - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - {2 - [2 - (3 - メトキシフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - {2 - [2 - (1, 1' - ビフェニル - 4 - イル) - 5 - メチル - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - {2 - [5 - エチル - 2 - (4 - エチルフェニル) - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - {2 - [5 - エチル - 2 - (4 - メチルフェニル) - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - {2 - [5 - エチル - 2 - (4 - メトキシフェニル) - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - (2 - {2 - [4' - (ヒドロキシメチル) - 1, 1' - ビフェニル - 4 - イル] - 5 - メチル - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル} エトキシ) - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル酢酸 ;

5 - (2 - {2 - [4 - (5 - アセチル - 2 - チエニル) フェニル] - 5 - メチル - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル} エトキシ) - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 -

イル酢酸；

5 - (2 - {2 - [3 - (1H-インドール-5-イル) フェニル] - 5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル} エトキシ) - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル酢酸；

(5 - {2 - [2 - (3-フルオロ-4-メチルフェニル) - 5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) 酢酸；および

(5 - {2 - [5-メチル-2 - (3-メチルフェニル) - 1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) 酢酸；

から成る群から選択される請求項1の化合物。

【請求項14】

C-1' がS配置もしくはR配置にある、請求項13の化合物。

【請求項15】

2 - {5 - [2 - (5-メチル-2-フェニル-1, 3-オキサゾール-4-イル) エトキシ] - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル} ブタン酸；

3-エトキシ-2 - {5 - [2 - (5-メチル-2-フェニル-1, 3-オキサゾール-4-イル) エトキシ] - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル} - 3-オキソプロパン酸；

2 - (5 - {2 - [5-メチル-2 - (4-メチルフェニル) - 1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) プロパン酸；

2 - (5 - {2 - [5-メチル-2 - (4-メチルフェニル) - 1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) ブタン酸；

4-メチル-2 - (5 - {2 - [5-メチル-2 - (4-メチルフェニル) - 1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) ペンタン酸；

2 - {5 - [2 - (5-エチル-2-フェニル-1, 3-オキサゾール-4-イル) エトキシ] - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル} ブタン酸；

2 - (5 - {2 - [2 - (4-クロロフェニル) - 5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) ブタン酸；

2 - (5 - {2 - [5-メチル-2 - (3-メチルフェニル) - 1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) ブタン酸；

2 - (5 - {2 - [2 - (4-メトキシフェニル) - 5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) ブタン酸；

2 - (5 - {2 - [2 - (3, 4-ジクロロフェニル) - 5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) ブタン酸；

2 - (5 - {2 - [5-メチル-2 - (2-ナフチル) - 1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) ブタン酸；

2 - (5 - {2 - [5-メチル-2 - (1-ナフチル) - 1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) ブタン酸；

2 - (5 - {2 - [2 - (4-フルオロフェニル) - 5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) ブタン酸；

2 - (5 - {2 - [2 - (3-クロロフェニル) - 5-メチル-1, 3-チアゾール-4-イル] エトキシ} - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) ブタン酸；

2 - (5 - {2 - [2-シクロペンチル-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) ブタン酸；

2 - (5 - {2 - [2-シクロヘキシル-5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) ブタン酸；

2 - (5 - {2 - [2 - (3-メトキシフェニル) - 5-メチル-1, 3-オキサゾール-4-イル] エトキシ} - 2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) ブタン酸；

2 - (5 - {2 - [2 - (4 - エチルフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

2 - (5 - {2 - [2 - (1 - ベンゾチエン - 2 - イル) - 5 - メチル - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

2 - [5 - (2 - {5 - メチル - 2 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル} エトキシ) - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル] ブタン酸 ;

2 - (5 - {2 - [2 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

2 - (5 - {2 - [2 - (3 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

2 - (5 - {2 - [2 - (4 - イソプロピルフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

2 - (5 - {2 - [2 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - 5 - メチル - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

2 - {6 - [2 - (2 - フェニル - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル) エトキシ] - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

2 - (5 - {2 - [2 - (3, 4 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

2 - [5 - (2 - {5 - メチル - 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル} エトキシ) - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

2 - (5 - {2 - [5 - メチル - 2 - (フェノキシメチル) - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

2 - (5 - {2 - [2 - (4 - フルオロ - 3 - メチルフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

2 - (5 - {2 - [2 - (3 - フルオロ - 4 - メチルフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

2 - (5 - {2 - [2 - (4 - ブチルフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

2 - (5 - {2 - [2 - (3, 4 - ジメチルフェニル) - 5 - メチル - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

2 - (5 - {2 - [5 - メチル - 2 - (4 - クロロフェノキシメチル) - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル] エトキシ} - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

2 - {6 - クロロ - 5 - [2 - (5 - メチル - 2 - フェニル - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル) エトキシ] - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

2 - {5 - [2 - (5 - メチル - 2 - フェニル - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル) エトキシ] - 6 - フェニル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

2 - {6 - (4 - クロロフェニル) - 5 - [2 - (5 - メチル - 2 - フェニル - 1, 3 - オキサゾール - 4 - イル) エトキシ] - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

2 - { 6 - (4 - メトキシフェニル) - 5 - [2 - (5 - メチル - 2 - フェニル - 1 , 3 - オキサゾール - 4 - イル) エトキシ] - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ; および

2 - (5 - { 2 - [2 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 - ベンゾフラン - 6 - イル) - 5 - メチル - 1 , 3 - オキサゾール - 4 - イル] エトキシ } - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) ブタン酸 ;

から成る群から選択される請求項 1 の化合物。

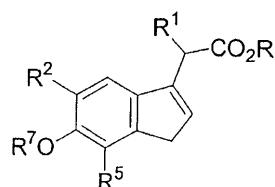
【請求項 16】

C - 1 ' および C - 2 の配置が、C - 1 ' が R であり C - 2 が R である ; C - 1 ' が R であり C - 2 が S である ; C - 1 ' が S であり C - 2 が S である ; および C - 1 ' が S であり C - 2 が R である ; から成る群から選択される、請求項 15 の化合物。

【請求項 17】

式 II

【化 2】



(II)

[式中、

R は H もしくは C₁ - C₆ アルキルであり、

R¹ は H、COOR、C₃ - C₈ シクロアルキル、またはそれぞれ未置換でももしくはフルオロで置換されていてもよい C₁ - C₆ アルキル、C₂ - C₆ アルケニルもしくは C₁ - C₆ アルコキシ、メチレンジオキシフェニル、または未置換でももしくは R⁶ で置換されていてもよいフェニルであり、

R² は H、ハロ、または未置換でももしくは C₁ - C₆ アルコキシ、オキソ、フルオロで置換されていてもよい C₁ - C₆ アルキルであるか、あるいは

R² がそれぞれが未置換でもしくは R⁶ で置換されていてもよいフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピロリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニルもしくはモルホリニルであり、

R³ は H、C₁ - C₆ アルキル、または未置換でもしくは R⁶ で置換されていてもよいフェニルであり、

R⁴ は、それらのいずれも未置換でもしくはフルオロ、オキソで置換されていてもよい C₁ - C₆ アルキルもしくは C₃ - C₈ シクロアルキル、または未置換でもしくは C₁ - C₆ アルコキシで置換されていてもよい C₁ - C₆ アルコキシ、または場合によっては R⁶ で置換されたフェニルであるか、あるいは

それらのいずれもフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンズジオキサリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、

ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは1, 4-ベンゾジオキサニルで置換されていてもよく、

それらがそれぞれが未置換でも R^6 で置換されていてもよい、あるいは

$C_1 - C_6$ アルキルはまた $C_3 - C_8$ シクロアルキルで、または未置換でももしくは R^6 で置換されていてもよいフェノキシで、またはフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジニル、ペペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾジオキサソリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは1, 4-ベンゾジオキサニルで置換されていてもよく、

それらはそれぞれ未置換でも R^6 で置換されていてもよい、あるいは

R^4 はフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジニル、ペペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾジオキサソリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは1, 4-ベンゾジオキサニルであり、

それらはそれぞれ未置換でもしくは R^6 で、またはフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジニル、ペペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾジオキサソリル、ジヒドロベンゾフラニル、インドリル、ピリミジニルもしくはフェノキシで置換されていてもよく、

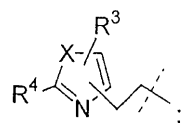
それらはそれぞれ未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよい、

R^5 はハロ、または場合によりオキソで置換された $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^6 はハロ、 CF_3 、場合によりオキソもしくはヒドロキシで置換された $C_1 - C_6$ アルキル、または場合によりフルオロで置換された $C_1 - C_6$ アルコキシであり、

R^7 はH、場合によりフェニルもしくはオキソで置換された $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ トリアルキルシリル、アリールアルキルシリル、 COR^8 、 $COOR^8$ 、または

【化3】



であり、

XはOもしくはSであり、

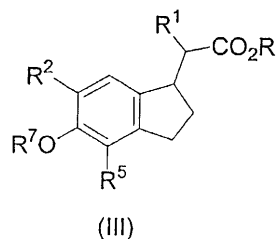
R^8 は $C_1 - C_6$ アルキル、または場合により $C_1 - C_6$ アルキル、ハロもしくはニトロで置換されたフェニルである]

の化合物およびその塩。

【請求項 18】

式 III

【化 4】



〔式中、

R は H もしくは $C_1 - C_6$ アルキルであり、 R^1 は H、 $COOR$ 、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、または

それぞれ未置換でももしくはフルオロで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニルもしくは $C_1 - C_6$ アルコキシ、メチレンジオキシフェニル、または未置換でももしくは R^6 で置換されていてもよいフェニルであり、

R^2 は H、ハロ、または未置換でももしくは $C_1 - C_6$ アルコキシ、オキソ、フルオロで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキルであるか、あるいは

R^2 がそれぞれが未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよいフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピロリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニルもしくはモルホリニルであり、

R^3 は H、 $C_1 - C_6$ アルキル、または未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよいフェニルであり、

R^5 はハロ、または場合によりオキソで置換された $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^6 はハロ、 CF_3 、場合によりオキソもしくはヒドロキシで置換された $C_1 - C_6$ アルキル、または場合によりフルオロで置換された $C_1 - C_6$ アルコキシであり、

R^7 は H、場合によりフェニルもしくはオキソで置換された $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ トリアルキルシリル、アリールアルキルシリル、または COR^8 、 $COOR^8$ であり、

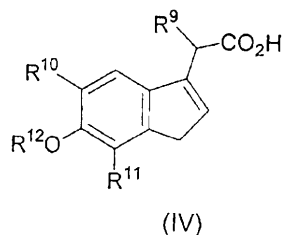
R^8 は $C_1 - C_6$ アルキル、または場合により $C_1 - C_6$ アルキル、ハロもしくはニトロで置換されたフェニルである〕

の化合物およびその塩。

【請求項 19】

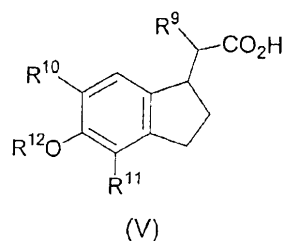
水素源および触媒の存在下における、式 I V

【化 5】



の化合物の立体特異的水素化の段階を含んで成る、式 V

【化 6】



の化合物の製法であって、
式中、

R^9 は、場合によりフルオロにより置換されたメトキシ、
それぞれ場合によりフルオロにより置換された $C_2 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルもしくは $C_4 - C_8$ シクロアルキル、メチレンジオキシフェニル、または場合により R^{13} で置換されたフェニルであり、

R^{10} は水素、フルオロ、場合によりフルオロ、オキソで置換されたメチル、あるいは未置換でもまたは $C_1 - C_6$ アルコキシ、オキソ、フルオロで、またはフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピロリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニルもしくはモルホリニルで置換されていてもよい $C_2 - C_6$ アルキルであり、

それらはそれぞれ未置換でももしくは R^{13} で置換されていてもよい、あるいは

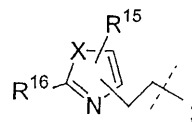
R^{10} はフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピロリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニルもしくはモルホリニルであり、

それらはそれぞれ未置換でもしくは R^{13} で置換されていてもよい、

R^{11} はハロ、または場合によりオキソで置換された $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^{12} は水素、場合によりフルオロもしくはオキソで置換されたメチル、場合によりフェニル、フルオロもしくはオキソで置換された $C_2 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ トリアルキルシリル、アリールアルキルシリル、 $CO R^{14}$ 、 $COOR^{14}$ もしくは

【化 7】



であり、

R^{13} はフルオロ、 CF_3 、場合によりヒドロキシもしくはオキソで置換された $C_1 - C_6$ アルキル、または場合によりフルオロで置換された $C_1 - C_6$ アルコキシであり、

R^{14} は $C_1 - C_6$ アルキル、または場合により $C_1 - C_6$ アルキルもしくはフルオロで置換されたフェニルであり、

R^{15} は水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、または R^{13} で置換されたフェニルであり、

R^{16} は場合によりフルオロ、オキソで、またはフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラ

ジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾジオキサソリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは1, 4-ベンゾジオキサニルで置換されたメチルであり、

それらはそれぞれ未置換でももしくは R^{1-3} で置換されていてもよい、あるいは

それらのどちらも未置換でもしくはフルオロ、メトキシで置換されていてもよい C_4-C_8 シクロアルキルもしくは C_2-C_6 アルキル、場合によりフェニルもしくは C_1-C_6 アルコキシ、オキソで、またはフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾジオキサソリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは1, 4-ベンゾジオキサニルで置換された C_2-C_6 アルコキシであり、

それらはそれぞれ未置換でもしくは R^{1-3} で置換されていてもよい、あるいは

C_4-C_8 シクロアルキルで、または未置換でもしくは R^6 で置換されていてもよいフェノキシで、またはフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾジオキサソリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは1, 4-ベンゾジオキサニルで置換されていてもよい C_2-C_6 アルキル、

それらはそれぞれ未置換でもしくは R^{1-3} で置換されていてもよい、あるいは

R^{1-6} はフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロチエニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾフリル、ジヒドロベンゾフリル、ベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾジオキサソリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノオキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルもしくは1, 4-ベンゾジオキサニルであり、

それらはそれぞれ未置換でもまたは R^{1-3} で、またはフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピロリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニル、モルホリニル、ベンゾジオキサソリル、ジヒドロベンゾフラニル、インド

リル、ピリミジニルもしくはフェノキシで置換されていてもよく、
それらはそれぞれ未置換でももしくは R^{1-3} で置換されていてもよい、そして
XはOもしくはSである。

【請求項20】

水素化が塩基の存在下で実施される、請求項19の医薬組成物。

【請求項21】

式Vの前記化合物がシン形にある請求項19の医薬組成物。

【請求項22】

式IVの前記化合物がラセミ混合物である、請求項19の医薬組成物。

【請求項23】

式IVの前記化合物が鏡像異性体により濃厚化される (enantiomerically enriched)、請求項19の医薬組成物。

【請求項24】

式Vの前記化合物が少なくとも約40% deである、請求項23の医薬組成物。

【請求項25】

前記触媒が遷移金属基剤のホモジナスな触媒である、請求項19の医薬組成物。

【請求項26】

前記触媒が $ClRh[P(Ph)_3]_3$ (ウィルキンソンの触媒)、(1, 5-シクロオクタジエン)トリシクロヘキシルホスフィンピリジノイリジウム(I)ヘキサフルオロホスフェート、(1, 5-シクロオクタジエン)ビス(メチルジフェニルホスフィン)イリジウム(I)ヘキサフルオロホスフェート(クラブトリーの触媒 (Crabtree's catalyst))から成る群から選択される、請求項19の医薬組成物。

【請求項27】

前記塩基がモノ(C_1-C_6 アルキル)アミン、ジ(C_1-C_6 アルキル)アミン、トリ(C_1-C_6 アルキル)アミン、第四級アミン、無機塩基および場合により活性な塩基 (active bases)から成る群から選択される、請求項20の医薬組成物。

【請求項28】

前記水素源が水素ガスである、請求項19の医薬組成物。

【請求項29】

前記水素化が約大気圧から約1, 000 psiの水素圧下で実施される、請求項28の医薬組成物。

【請求項30】

前記水素化が約20 psiから約100 psiの水素圧下で実施される、請求項29の医薬組成物。

【請求項31】

分割剤 (resolving agents) による処理により式IVの化合物のジアステレオマー塩を形成すること、

結晶化溶媒による結晶化により前記ジアステレオマー塩を分離すること、

触媒および溶媒の存在下における水素化により分離されたジアステレオマー塩を還元すること、の段階を含んで成り、

ここで式Vおよび式IVの化合物は請求項19に定義されたようなものである、式Vの化合物の製法。

【請求項32】

鉍酸水溶液による処理により分離されたジアステレオマー塩から鏡像異性体を遊離する、
段階を更に含んで成る、請求項31の医薬組成物。

【請求項33】

前記還元段階が塩基の存在下で実施される、請求項31の医薬組成物。

【請求項34】

前記分割剤がキニン、シンコニン、(+)-アルファ-メチルベンジルアミンおよび(

ー) ーアルファーメチルベンジルアミンから成る群から選択される光学活性塩基である、請求項 31 もしくは 32 の医薬組成物。

【請求項 35】

前記結晶化溶媒がアセトニトリル、アセトン、t-ブタノール、2-プロパノール、エタノール、メタノールおよびそれらの混合物から成る群から選択される、請求項 31 もしくは 32 の医薬組成物。

【請求項 36】

水素化触媒および溶媒の存在下における水素化により式 I V の化合物を式 V の化合物に還元すること、

分割剤による処理により、式 V の化合物のジアステレオマー塩を形成すること、

結晶化溶媒中での結晶化によりジアステレオマー塩を分離すること、および

鉍酸水溶液による処理により分離された塩から個々の鏡像異性体を遊離すること、の段階を含んで成り、

ここで式 V および式 I V の化合物は請求項 19 に定義のとおりである、式 V の化合物の製法。

【請求項 37】

前記還元段階が塩基の存在下で実施される、請求項 36 の医薬組成物。

【請求項 38】

前記水素化触媒が $\text{C1Rh}[\text{P}(\text{Ph})_3]_3$ (ウィルキンソンの触媒)、(1, 5-シクロオクタジエン)トリシクロヘキシルホスフィンピリジノイリジウム(I)ヘキサフルオロホスフェート、(1, 5-シクロオクタジエン)ビス(メチルジフェニルホスフィン)イリジウム(I)ヘキサフルオロホスフェート(クラブトリーの触媒(Crabtree's catalysts))から成る群から選択される、請求項 36 もしくは 37 の医薬組成物。

【請求項 39】

前記分割剤がキニン、シンコニン、(+)-アルファーメチルベンジルアミンおよび(-)-アルファーメチルベンジルアミンから成る群から選択される、請求項 36 もしくは 37 の医薬組成物。

【請求項 40】

前記結晶化溶媒がアセトニトリル、アセトン、t-ブタノール、2-プロパノール、エタノール、メタノールおよびそれらの混合物から成る群から選択される、請求項 36 もしくは 37 の医薬組成物。

【請求項 41】

前記化合物のインシュリン感受性活性を決定する段階を含んで成る、糖尿病、糖尿病関連障害、肥満およびアテローム動脈硬化性疾患の処置に有用な化合物の同定法。

【請求項 42】

集密後 2~4 日まで細胞を生長させること、

分化培地で細胞を処理すること、および

インシュリン受容体結合活性をアッセイすること、

の段階を更に含んで成る請求項 41 の医薬組成物。

【請求項 43】

前記分化培地がインシュリン様成長因子(IGF-1)および試験化合物を含んで成る、請求項 42 の医薬組成物。

【請求項 44】

前記インシュリン様成長因子が約 $0.1 \mu\text{M}$ ~約 $1 \mu\text{M}$ の量で存在する、請求項 43 の医薬組成物。

【請求項 45】

前記細胞が 3T3-L1 細胞である、請求項 42 の医薬組成物。

【請求項 46】

医薬として許容できる担体と組み合わせて、有効量の請求項 1 の化合物または医薬とし

て許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物。

【請求項 47】

医薬として許容できる担体と組み合わせて、有効量の請求項 7 もしくは 8 の化合物または医薬として許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物。

【請求項 48】

医薬として許容できる担体と組み合わせて、有効量の請求項 9 の化合物または医薬として許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物。

【請求項 49】

医薬として許容できる担体と組み合わせて、有効量の請求項 10 の化合物または医薬として許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物。

【請求項 50】

医薬として許容できる担体と組み合わせて、有効量の請求項 11 の化合物または医薬として許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物。

【請求項 51】

医薬として許容できる担体と組み合わせて、有効量の請求項 12 の化合物または医薬として許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物。

【請求項 52】

医薬として許容できる担体と組み合わせて、有効量の請求項 13 の化合物または医薬として許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物。

【請求項 53】

医薬として許容できる担体と組み合わせて、有効量の請求項 14 の化合物または医薬として許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物。

【請求項 54】

医薬として許容できる担体と組み合わせて、有効量の請求項 15 の化合物または医薬として許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物。

【請求項 55】

医薬として許容できる担体と組み合わせて、有効量の請求項 16 の化合物または医薬として許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物。

【請求項 56】

医薬として許容できる担体および 1 種もしくは複数の血糖降下剤と組み合わせて、有効量の請求項 1 の化合物または医薬として許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物。

【請求項 57】

前記血糖降下剤がインシュリン、ビグアニジン、スルホニル尿素、インシュリン分泌促進剤、 α -グシコシダーゼ阻害剤および β_3 -アドレナリン受容体アゴニストから成る群から選択される、請求項 56 の医薬組成物。

【請求項 58】

医薬として許容できる担体および 1 種もしくは複数の血糖降下剤と組み合わせて、有効量の請求項 9 の化合物または医薬として許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物。

【請求項 59】

前記血糖降下剤がインシュリン、ビグアニジン、スルホニル尿素、インシュリン分泌促進剤、 α -グシコシダーゼ阻害剤および β_3 -アドレナリン受容体アゴニストから成る群から選択される、請求項 58 の医薬組成物。

【請求項 60】

医薬として許容できる担体および 1 種もしくは複数の血糖降下剤と組み合わせて、有効量の請求項 11 の化合物または医薬として許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物。

【請求項 61】

前記血糖降下剤がインシュリン、ビグアニジン、スルホニル尿素、インシュリン分泌促

進剤、 α -グシコシダーゼ阻害剤および β_3 -アドレナリン受容体アゴニストから成る群から選択される、請求項60の医薬組成物。

【請求項62】

医薬として許容できる担体および1種もしくは複数の血糖降下剤と組み合わせて、有効量の請求項13の化合物または医薬として許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物。

【請求項63】

前記血糖降下剤がインシュリン、ビッグアニジン、スルホニル尿素、インシュリン分泌促進剤、 α -グシコシダーゼ阻害剤および β_3 -アドレナリン受容体アゴニストから成る群から選択される、請求項62の医薬組成物。

【請求項64】

医薬として許容できる担体および1種もしくは複数の血糖降下剤と組み合わせて、有効量の請求項15の化合物または医薬として許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物。

【請求項65】

前記血糖降下剤がインシュリン、ビッグアニジン、スルホニル尿素、インシュリン分泌促進剤、 α -グシコシダーゼ阻害剤および β_3 -アドレナリン受容体アゴニストから成る群から選択される、請求項64の医薬組成物。

【請求項66】

医薬として許容できる担体および、HMG CoA還元酵素阻害剤、胆汁酸結合剤、フィブリン酸誘導体、高血圧調節剤および体重調節剤から成る群から選択される1種もしくは複数の薬剤と組み合わせて、有効量の請求項1の化合物または医薬として許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物。

【請求項67】

不活性担体と組み合わせた有効量の請求項1の化合物またはその塩もしくはエステルを含んで成る組成物。

【請求項68】

不活性担体と組み合わせた有効量の請求項9の化合物またはその塩もしくはエステルを含んで成る組成物。

【請求項69】

不活性担体と組み合わせた有効量の請求項11の化合物またはその塩もしくはエステルを含んで成る組成物。

【請求項70】

不活性担体と組み合わせた有効量の請求項13の化合物またはその塩もしくはエステルを含んで成る組成物。

【請求項71】

不活性担体と組み合わせた有効量の請求項15の化合物またはその塩もしくはエステルを含んで成る組成物。

【請求項72】

請求項1の化合物を有効成分として含んで成る、糖尿病を処置するための医薬組成物。

【請求項73】

請求項1の化合物を有効成分として含んで成る、症候群Xを処置するための医薬組成物。

【請求項74】

請求項1の化合物を有効成分として含んで成る、糖尿病関連障害を処置するための医薬組成物。

【請求項75】

糖尿病関連障害が高血糖、高インシュリン血症、糖耐性障害、空腹時血糖障害、異脂血症、高トリグリセリド血症およびインシュリン抵抗性、から成る群から選択される、請求項74の医薬組成物。

【請求項 76】

請求項 1 の化合物を有効成分として含んで成る、肥満を処置するための医薬組成物。

【請求項 77】

請求項 1 の化合物を有効成分として含んで成る、心臓血管疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 78】

心臓血管疾患がアテローム性動脈硬化性疾患、異脂血症、高コレステロール血症、低 HDL レベル、高血圧、冠状血管心疾患および冠状動脈疾患から成る群から選択される、請求項 77 の医薬組成物。

【請求項 79】

請求項 1 の化合物を有効成分として含んで成る、脳血管疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 80】

請求項 1 の化合物を有効成分として含んで成る、末梢血管疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 81】

請求項 1 の化合物を有効成分として含んで成る、狼瘡 (lupus) を処置するための医薬組成物。

【請求項 82】

請求項 1 の化合物を有効成分として含んで成る、多発性嚢胞卵巣疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 83】

請求項 1 の化合物を有効成分として含んで成る、発癌および過形成症を処置するための医薬組成物。

【請求項 84】

1 種もしくは複数の血糖降下剤と組み合わせた、請求項 1 の化合物を有効成分として含んで成る、糖尿病を処置するための医薬組成物。

【請求項 85】

1 種もしくは複数の血糖降下剤と組み合わせた、請求項 1 の化合物を有効成分として含んで成る、症候群 X を処置するための医薬組成物。

【請求項 86】

1 種もしくは複数の血糖降下剤と組み合わせた、請求項 1 の化合物を有効成分として含んで成る、糖尿病関連障害を処置するための医薬組成物。

【請求項 87】

糖尿病関連障害が高血糖症、高インシュリン血症、糖耐性障害、空腹時血糖障害、異脂血症、高トリグリセリド血症およびインシュリン抵抗性、から成る群から選択される、請求項 86 の医薬組成物。

【請求項 88】

式 I の化合物および 1 種もしくは複数の血糖低下剤が単一の医薬投与調製物として投与されるものである、請求項 84～87 のいずれか 1 項の医薬組成物。

【請求項 89】

HMG CoA 還元酵素阻害剤、胆汁酸結合剤、フィブリン酸誘導体、高血圧調節剤および体重調節剤から成る群から選択される 1 種もしくは複数の薬剤と組み合わせて、請求項 1 の化合物を有効成分として含んで成る、糖尿病、症候群 X もしくは糖尿病関連障害を処置するための医薬組成物。

【請求項 90】

糖尿病関連障害が高血糖症、高インシュリン血症、糖耐性障害、空腹時血糖障害、異脂血症、高トリグリセリド血症およびインシュリン抵抗性、から成る群から選択される、請求項 89 の医薬組成物。

【請求項 91】

請求項 9 の化合物を 有効成分として含んで成る、糖尿病を処置するための医薬組成物。

【請求項 9 2】

請求項 9 もしくは 1 1 の化合物を 有効成分として含んで成る、症候群 X を処置するための医薬組成物。

【請求項 9 3】

請求項 9 もしくは 1 1 の化合物を 有効成分として含んで成る、糖尿病関連障害を処置するための医薬組成物。

【請求項 9 4】

糖尿病関連障害が高血糖症、高インシュリン血症、糖耐性障害、空腹時血糖障害、異脂血症、高トリグリセリド血症およびインシュリン抵抗性、から成る群から選択される、請求項 9 3 の 医薬組成物。

【請求項 9 5】

請求項 9 もしくは 1 1 の化合物を 有効成分として含んで成る、肥満を処置するための医薬組成物。

【請求項 9 6】

請求項 9 もしくは 1 1 の化合物を 有効成分として含んで成る、心臓血管疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 9 7】

心臓血管疾患がアテローム性動脈硬化疾患、異脂血症、高コレステロール血症、低 H D L レベル、高血圧、冠状血管心疾患および冠状動脈疾患から成る群から選択される、請求項 9 6 の 医薬組成物。

【請求項 9 8】

請求項 9 もしくは 1 1 の化合物を 有効成分として含んで成る、脳血管疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 9 9】

請求項 9 もしくは 1 1 の化合物を 有効成分として含んで成る、末梢血管疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 0 0】

請求項 9 もしくは 1 1 の化合物を 有効成分として含んで成る、踰躅を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 0 1】

請求項 9 もしくは 1 1 の化合物を 有効成分として含んで成る、多発性嚢胞卵巣疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 0 2】

請求項 9 もしくは 1 1 の化合物を 有効成分として含んで成る、発癌および過形成症を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 0 3】

1 種もしくは複数の血糖低下剤と組み合わせて請求項 9 もしくは 1 1 の化合物を 有効成分として含んで成る、糖尿病を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 0 4】

1 種もしくは複数の血糖低下剤と組み合わせて請求項 9 もしくは 1 1 の化合物を 有効成分として含んで成る、症候群 X を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 0 5】

1 種もしくは複数の血糖低下剤と組み合わせて請求項 9 もしくは 1 1 の化合物を 有効成分として含んで成る、糖尿病関連障害を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 0 6】

糖尿病関連障害が高血糖症、高インシュリン血症、糖耐性障害、空腹時血糖障害、異脂血症、高トリグリセリド血症およびインシュリン抵抗性、から成る群から選択される、請求項 1 0 5 の 医薬組成物。

【請求項 1 0 7】

請求項 1 3 の化合物を有効成分として含んで成る、糖尿病を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 0 8】

請求項 1 3 の化合物を有効成分として含んで成る、症候群 X を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 0 9】

請求項 1 3 の化合物を有効成分として含んで成る、糖尿病関連障害を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 1 0】

糖尿病関連障害が高血糖症、高インシュリン血症、糖耐性障害、空腹時血糖障害、異脂血症、高トリグリセリド血症およびインシュリン抵抗性、から成る群から選択される、請求項 1 0 9 の医薬組成物。

【請求項 1 1 1】

請求項 1 3 の化合物を有効成分として含んで成る、肥満を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 1 2】

請求項 1 3 の化合物を有効成分として含んで成る、心臓血管疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 1 3】

心臓血管疾患がアテローム性動脈硬化疾患、異脂血症、高コレステロール血症、低 H D L レベル、高血圧症、冠状血管心疾患および冠状動脈疾患から成る群から選択される、請求項 1 1 2 の医薬組成物。

【請求項 1 1 4】

請求項 1 3 の化合物を有効成分として含んで成る、脳血管疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 1 5】

請求項 1 3 の化合物を有効成分として含んで成る、末梢血管疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 1 6】

請求項 1 3 の化合物を有効成分として含んで成る、踰躰を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 1 7】

請求項 1 3 の化合物を有効成分として含んで成る、多発性嚢胞性卵巣疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 1 8】

請求項 1 3 の化合物を有効成分として含んで成る、発癌および過形成症を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 1 9】

1 種もしくは複数の血糖降下剤と組み合わせて請求項 1 3 の化合物を有効成分として含んで成る、糖尿病を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 2 0】

1 種もしくは複数の血糖降下剤と組み合わせて請求項 1 3 の化合物を有効成分として含んで成る、症候群 X を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 2 1】

1 種もしくは複数の血糖降下剤と組み合わせて請求項 1 3 の化合物を有効成分として含んで成る、糖尿病関連障害を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 2 2】

糖尿病関連障害が高血糖症、高インシュリン血症、糖耐性障害、空腹時血糖障害、異脂血症、高トリグリセリド血症およびインシュリン抵抗性、から成る群から選択される、請求項 1 2 1 の医薬組成物。

【請求項 1 2 3】

請求項 1 5 の化合物を有効成分として含んで成る、糖尿病を処置するための医薬組成物。

。

【請求項 1 2 4】

請求項 1 5 の化合物を有効成分として含んで成る、症候群 X を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 2 5】

請求項 1 5 の化合物を有効成分として含んで成る、糖尿病関連障害を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 2 6】

糖尿病関連障害が高血糖症、高インシュリン血症、糖耐性障害、空腹時血糖障害、異脂血症、高トリグリセリド血症およびインシュリン抵抗性、から成る群から選択される、請求項 1 2 5 の医薬組成物。

【請求項 1 2 7】

請求項 1 5 の化合物を有効成分として含んで成る、肥満を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 2 8】

請求項 1 5 の化合物を有効成分として含んで成る、心臓血管疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 2 9】

心臓血管疾患がアテローム性動脈硬化疾患、異脂血症、高コレステロール血症、低 HDL レベル、高血圧症、冠状血管心疾患および冠状動脈疾患から成る群から選択される、請求項 1 2 8 の医薬組成物。

【請求項 1 3 0】

請求項 1 5 の化合物を有効成分として含んで成る、脳血管疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 3 1】

請求項 1 5 の化合物を有効成分として含んで成る、末梢血管疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 3 2】

請求項 1 5 の化合物を有効成分として含んで成る、踰躰を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 3 3】

請求項 1 5 の化合物を有効成分として含んで成る、多発性嚢胞性卵巣疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 3 4】

請求項 1 5 の化合物を有効成分として含んで成る、発癌および過形成症を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 3 5】

1 種もしくは複数の血糖降下剤と組み合わせて請求項 1 5 の化合物を有効成分として含んで成る、糖尿病を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 3 6】

1 種もしくは複数の血糖降下剤と組み合わせて請求項 1 5 の化合物を有効成分として含んで成る、症候群 X を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 3 7】

1 種もしくは複数の血糖降下剤と組み合わせて請求項 1 5 の化合物を有効成分として含んで成る、糖尿病関連障害を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 3 8】

糖尿病関連障害が高血糖症、高インシュリン血症、糖耐性障害、空腹時血糖障害、異脂血症、高トリグリセリド血症およびインシュリン抵抗性、から成る群から選択される、請求項 1 3 7 の医薬組成物。

【請求項 1 3 9】

請求項 4 1 の医薬組成物により同定された化合物を有効成分として含んで成る、糖尿病、症候群 X もしくは糖尿病関連疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 1 4 0】

糖尿病関連障害が高血糖症、高インシュリン血症、糖耐性障害、空腹時血糖障害、異脂血症、高トリグリセリド血症およびインシュリン抵抗性、から成る群から選択される、請求項 1 3 9 の医薬組成物。