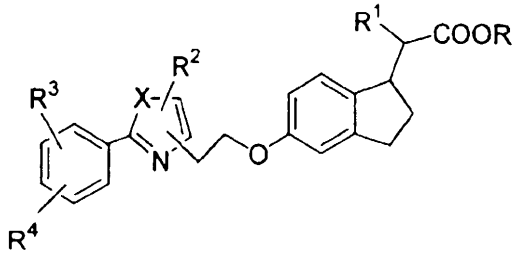
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成18年4月6日(2006.4.6)

【公表番号】特表2005-526834(P2005-526834A)
【公表日】平成17年9月8日(2005.9.8)
【年通号数】公開・登録公報2005-035
【出願番号】特願2003-586139(P2003-586139)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 263/32　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/421　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/422　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/426　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4439　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/454　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/496　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/506　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/5377　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/541　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 45/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/06　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/12　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 277/24　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 413/10　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 413/12　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 417/04　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 38/28　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 263/32　ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ 31/421
Ａ６１Ｋ 31/422
Ａ６１Ｋ 31/426
Ａ６１Ｋ 31/4439
Ａ６１Ｋ 31/454
Ａ６１Ｋ 31/496
Ａ６１Ｋ 31/506
Ａ６１Ｋ 31/5377
Ａ６１Ｋ 31/541
Ａ６１Ｋ 45/00
Ａ６１Ｐ 3/04
Ａ６１Ｐ 3/06
Ａ６１Ｐ 3/10
Ａ６１Ｐ 9/00
Ａ６１Ｐ 9/10
Ａ６１Ｐ 9/10　１０３
Ａ６１Ｐ 9/12

ＣＯ７Ｄ 277/24
ＣＯ７Ｄ 413/10
ＣＯ７Ｄ 413/12
ＣＯ７Ｄ 417/04
Ａ６１Ｋ 37/26
ＣＯ７Ｍ 7:00

【手続補正書】
【提出日】平成18年2月9日(2006.2.9)
【手続補正１】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】特許請求の範囲
【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】



(I)

{式中、
ＲおよびＲ[1]は、ＨまたはC_1－C_6アルキルであり、
Ｒ[2]は、Ｈ、C_1－C_6アルキルまたはフェニル（置換されていないか或はＲ[3]で置換されていてもよい）であり、
Ｒ[3]は、Ｈ、ハロ、NO_2、CF_3、２，３－メチレンジオキシ、３，４－メチレンジオキシ、C_1－C_6アルキルチオ、場合によりオキソもしくはヒドロキシで置換されていてもよいC_1－C_6アルキル、場合によりフルオロで置換されていてもよいC_1－C_6アルコキシ、または場合によりＨもしくはC_1－C_6アルキルで置換されていてもよいカルボキシであり、
Ｒ[4]は、C_3－C_8シクロアルキル、
C_2－C_6アルケニル、
NO_2、
CO_2R、
$N^+(R^5)_3$［ここで、Ｒ[5]は場合によりフェニルで置換されていてもよいC_1－C_6アルキルである］、
Ｎ－（Ｙ－Ｒ[6]）$_n$［ここで、ｎ＝１または２、Ｙは結合、－SO_2－、－SO_2NR^7－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＲ[7]－または－Ｃ（Ｏ）Ｏ－であり、Ｒ[6]はＨ、アリール、ベンジル、C_1－C_6アルコキシアルキル、C_1－C_6アルキル、ヘテロアリール（これらは各々がＲ[3]で置換されていてもよい）であるか、或はＹが結合の時には２つのＲ[6]基がこれらが結合しているＮ原子と一緒になって場合により追加的Ｎ、ＳまたはＯ原子を含有していてもよくかつ場合によりＮ（Ｒ[7]）$_2$または$N^+(R^5)_3$で置換されていてもよい３－７員の複素環式環を形成していてもよく、そしてＲ[7]はＨ、C_1－C_6アルキルまたはフェニル（Ｒ[3]で置換されている）である］、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、トリアジニル、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、ベンズイソキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾジオキソリル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサゾリニル、ジヒドロベンゾピラニル、ジヒドロベンゾチオピラニルまたは１，４－ベンゾジオキサニル［これらは各々が１個以上のR^8で置換されており、ここで、R^8はC_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_6アルケニル、NO_2、CO_2R、$N^+(R^7)_3$または$N-(Y-R^6)_n$（ここで、ｎ＝１または２）である］であり、
Ｘは、ＯまたはＳである}
で表される化合物およびこれの薬学的に受け入れられる塩およびエステル。

【請求項２】
Ｒ、R^1、R^2、R^3およびR^4が請求項１で定義した通りでありそしてＸがＯである請求項１記載の化合物。

【請求項３】
Ｒ、R^1、R^2およびR^3が請求項１で定義した通りであり、
R^4が$N-(Y-R^6)_n$［ここで、ｎ＝１または２、Ｙは結合であり、R^6はＨ、アリール、ベンジル、C_1－C_6アルコキシアルキル、C_1－C_6アルキル、ヘテロアリール（各々がR^3で置換されていてもよい）であるか、或はＹが結合の時には２つのR^6基がこれらが結合しているＮ原子と一緒になって場合により追加的Ｎ、ＳまたはＯ原子を含有していてもよくかつ場合により$N(R^7)_2$または$N^+(R^5)_3$で置換されていてもよい３－７員の複素環式環を形成していてもよく、そしてR^7はＨ、C_1－C_6アルキルまたはフェニル（R^3で置換されている）である］であり、そしてＸがＯである、請求項１記載の化合物。

【請求項４】
Ｒ、R^1、R^2およびR^3が請求項１で定義した通りであり、
R^4が$N-(Y-R^6)_n$［ここで、ｎ＝１または２、Ｙは結合または$-SO_2-$であり、R^6はＨ、アリール、ベンジル、C_1－C_6アルコキシアルキル、C_1－C_6アルキル、ヘテロアリール（各々がR^3で置換されていてもよい）であるか、或はＹが結合の時には２つのR^6基がこれらが結合しているＮ原子と一緒になって場合により追加的Ｎ、ＳまたはＯ原子を含有していてもよくかつ場合により$N(R^7)_2$または$N^+(R^5)_3$で置換されていてもよい３－７員の複素環式環を形成していてもよく、そしてR^7はＨ、C_1－C_6アルキルまたはフェニル（R^3で置換されている）である］であり、そしてＸがＯである、請求項１記載の化合物。

【請求項５】
Ｒ、R^1、R^2およびR^3が請求項１で定義した通りであり、
R^4が$N-(Y-R^6)_n$［ここで、ｎ＝１または２、Ｙは結合または$-C(O)-$であり、R^6はＨ、アリール、ベンジル、C_1－C_6アルコキシアルキル、C_1－C_6アルキル、ヘテロアリール（各々がR^3で置換されていてもよい）であるか、或はＹが結合の時には２つのR^6基がこれらが結合しているＮ原子と一緒になって場合により追加的Ｎ、ＳまたはＯ原子を含有していてもよくかつ場合により$N(R^7)_2$または$N^+(R^5)_3$で置換されていてもよい３－７員の複素環式環を形成していてもよく、そしてR^7はＨ、C_1－C_6アルキルまたはフェニル（R^3で置換されている）である］であり、そしてＸがＯである、請求項１記載の化合物。

【請求項６】
請求項１記載の化合物またはこれの薬学的に受け入れられる塩もしくはエステルを薬学的に受け入れられる担体と組み合わせて有効量で含んで成る薬剤組成物。

【請求項７】
請求項１記載の化合物またはこれの薬学的に受け入れられる塩もしくはエステルを薬学的に受け入れられる担体および１種以上の血糖降下薬と組み合わせて有効量で含んで成る薬剤組成物。
【請求項８】
前記血糖降下薬がインスリン、ビグアニジン、スルホニル尿素、インスリン分泌促進薬、α－グリコシダーゼ阻害薬およびβ$_3$－アドレナリン受容体作動薬から成る群から選択される請求項７記載の薬剤組成物。
【請求項９】
請求項１記載の化合物またはこれの薬学的に受け入れられる塩もしくはエステルを薬学的に受け入れられる担体およびＨＭＧ　ＣｏＡ還元酵素阻害薬、胆汁酸結合薬、フィブリックアシッド誘導体、高血圧を制限する薬剤および体重を制限する薬剤から成る群から選択される１種以上の薬剤と組み合わせて有効量で含んで成る薬剤組成物。
【請求項１０】
請求項１記載の化合物またはこれの塩もしくはエステルを不活性な担体と組み合わせて有効量で含んで成る組成物。
【請求項１１】
糖尿病または糖尿病関連障害の治療用組成物を調製するための、請求項１記載の化合物の使用。
【請求項１２】
前記糖尿病関連障害が高血糖症、インスリン過剰、耐糖能異常、空腹時血糖異常、異常脂質血症、トリグリセリド過剰血およびインスリン抵抗から成る群から選択される請求項１１記載の使用。
【請求項１３】
Ｘ症候群の治療用組成物を調製するための、請求項１記載の化合物の使用。
【請求項１４】
肥満症の治療用組成物を調製するための、請求項１記載の化合物の使用。
【請求項１５】
心疾患の治療用組成物を調製するための、請求項１記載の化合物の使用。
【請求項１６】
心疾患がアテローム性動脈硬化症、異常脂質血症、高コレステロール血症、低下したＨＤＬレベル、高血圧、冠状動脈性心臓病および冠動脈疾患から成る群から選択される請求項１５記載の使用。
【請求項１７】
糖尿病または糖尿病関連障害の治療用組成物を調製するための、請求項１記載の化合物の使用。
【請求項１８】
前記糖尿病関連障害が高血糖症、インスリン過剰、耐糖能異常、空腹時血糖異常、異常脂質血症、トリグリセリド過剰血およびインスリン抵抗から成る群から選択される請求項１７記載の使用。
【請求項１９】
Ｘ症候群の治療用組み合せ物を提供するための、請求項１記載の化合物と１種以上の血糖降下薬との組み合わせ使用。
【請求項２０】
糖尿病、Ｘ症候群または糖尿病関連障害の治療用組み合せ物を提供するための、請求項１記載の化合物とＨＭＧ　ＣｏＡ還元酵素阻害薬、胆汁酸結合薬、フィブリックアシッド誘導体、高血圧を制限する薬剤および体重を制限する薬剤から成る群から選択される１種以上の薬剤との組み合わせ使用。
【請求項２１】
請求項１記載の化合物と前記薬剤が単一の薬調剤の形態にある、請求項１７から２０の

いずれか１項記載の使用。