

【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2004-529194(P2004-529194A)

【公表日】平成16年9月24日(2004.9.24)

【年通号数】公開・登録公報2004-037

【出願番号】特願2003-500044(P2003-500044)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 C 275/54

A 6 1 K 31/17

A 6 1 K 31/197

A 6 1 K 31/198

A 6 1 K 31/221

A 6 1 K 31/223

A 6 1 K 31/245

A 6 1 K 31/27

A 6 1 K 31/277

A 6 1 K 31/357

A 6 1 K 31/36

A 6 1 K 31/40

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/4045

A 6 1 K 31/433

A 6 1 K 31/4406

A 6 1 K 31/4409

A 6 1 K 31/445

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 K 31/5375

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 27/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 31/00

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 43/00

C 0 7 C 313/28

C 0 7 D 209/08

C 0 7 D 209/14  
 C 0 7 D 211/58  
 C 0 7 D 213/40  
 C 0 7 D 285/14  
 C 0 7 D 295/12  
 C 0 7 D 317/58  
 C 0 7 D 319/18  
 C 0 7 D 401/04

【 F I 】

C 0 7 C 275/54  
 A 6 1 K 31/17  
 A 6 1 K 31/197  
 A 6 1 K 31/198  
 A 6 1 K 31/221  
 A 6 1 K 31/223  
 A 6 1 K 31/245  
 A 6 1 K 31/27  
 A 6 1 K 31/277  
 A 6 1 K 31/357  
 A 6 1 K 31/36  
 A 6 1 K 31/40  
 A 6 1 K 31/404  
 A 6 1 K 31/4045  
 A 6 1 K 31/433  
 A 6 1 K 31/4406  
 A 6 1 K 31/4409  
 A 6 1 K 31/445  
 A 6 1 K 31/4545  
 A 6 1 K 31/5375  
 A 6 1 P 3/04  
 A 6 1 P 3/10  
 A 6 1 P 7/02  
 A 6 1 P 9/10  
 A 6 1 P 9/10 1 0 1  
 A 6 1 P 11/06  
 A 6 1 P 13/12  
 A 6 1 P 17/06  
 A 6 1 P 19/10  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 25/18  
 A 6 1 P 25/28  
 A 6 1 P 27/00  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 31/00  
 A 6 1 P 31/18  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 37/00  
 A 6 1 P 37/06  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1  
 C 0 7 C 313/28

C 0 7 D 209/08  
 C 0 7 D 209/14  
 C 0 7 D 211/58  
 C 0 7 D 213/40  
 C 0 7 D 285/14  
 C 0 7 D 295/12  
 C 0 7 D 317/58  
 C 0 7 D 319/18  
 C 0 7 D 401/04

Z

【手続補正書】

【提出日】平成17年5月9日(2005.5.9)

【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

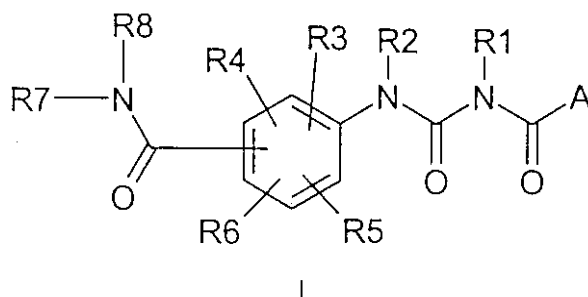
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I

【化1】



の化合物及びそれらの生理学的に許容される塩。

式中、

Aはフェニル、ナフチルであり、ここでフェニル又はナフチル基はF、Cl、Br、OH、CF<sub>3</sub>、NO<sub>2</sub>、CN、OCF<sub>3</sub>、O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、O-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニル、O-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキニル、S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、S-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニル、S-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキニル、SO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、SO<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキレン、(C<sub>0</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキレン-COOH、(C<sub>0</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキレン-COO-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-アルキル、(C<sub>0</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキレン-COO-(C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-アルケニル、CONH<sub>2</sub>、CONH-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、CON-[ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル]<sub>2</sub>、CONH-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>0</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキレン-NH<sub>2</sub>、(C<sub>0</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキレン-NH-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>0</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキレン-N-[ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル]<sub>2</sub>、NH-CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、NH-CO-フェニル、NH-SO<sub>2</sub>-フェニルにより3回まで置換されてよく、この場合フェニル環はF、Cl、CN、OH、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、COOH、COO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル又はCONH<sub>2</sub>により2回まで置換されてよく、

R1、R2は、互いに独立して、H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、COO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルであり、

R 3、R 4、R 5、R 6 は、互いに独立して、H、F、Cl、Br、OH、CF<sub>3</sub>、NO<sub>2</sub>、CN、OCF<sub>3</sub>、O - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、O - (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニル、O - (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキニル、S - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、S - (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニル、S - (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキニル、SO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、SO<sub>2</sub> - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、SO<sub>2</sub> - NH<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - シクロアルキル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキレン、COOH、COO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、CO - NH<sub>2</sub>、CO - NH - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、CO - N - [(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル]<sub>2</sub>、CO - NH - (C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - シクロアルキル、NH<sub>2</sub>、NH - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、N - [(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル]<sub>2</sub>、NH - CO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、NH - CO - フェニル、NH - SO<sub>2</sub> - フェニルであり、ここでフェニル環はF、Cl、CN、OH、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、O - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、COOH、COO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル又はCO - NH<sub>2</sub>により2回まで置換されてよく、

R 7 はH、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、CO(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルであり、

R 8 はH、(C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>) - アルキル、ここでアルキルはOH、CF<sub>3</sub>、CN、COOH、COO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、CO - NH<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、NH - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、N - [(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル]<sub>2</sub>、NCO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、NCOO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、NCOO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニル、NCOO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキニル又はNCOO - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) - アリールにより3回まで置換されてよく；

(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - アリール、ここでmは0～6であってよく、そしてアリールはフェニル、O - フェニル、CO - フェニル、ベンゾ[1,3]ジオキソリル、ヘテロシクロアルキル、ピリジル、インドリル、ピペリジニル、テトラヒドロナフチル、ナフチル、2,3 - ジヒドロベンゾ[1,4]ジオキシニル、ベンゾ[1,2,5]チアジアゾリル、ピロリジニル、モルホリニルであってよく、この場合アリール基は1回又はそれ以上の回数R 9により置換されてよい；

であり、

R 9 はF、Cl、Br、OH、NO<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル - OH、O - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、S - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルフェニル、COOH、COO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルである。

#### 【請求項2】

A はフェニルであり、ここでフェニル基はF、Cl、Brにより3回まで置換されてよく、

R 1、R 2 はHであり、

R 3、R 4、R 5、R 6 は、互いに独立して、H、F、Cl、Br、NO<sub>2</sub>、O - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルであり、

R 7 はH、CH<sub>3</sub>であり、

R 8 はH、(C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>) - アルキル、ここでアルキルはOH、CF<sub>3</sub>、CN、COOH、COO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、CO - NH<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、NH - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、N - [(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル]<sub>2</sub>、NCO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、NCOO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、NCOO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニル、NCOO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキニル又はNCOO - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) - アリールにより3回まで置換されてよく；

(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - アリール、ここでmは0～6であってよく、そしてアリールはフェニル、O - フェニル、CO - フェニル、ベンゾ[1,3]ジオキソリル、ヘテロシクロアルキル、ピリジル、インドリル、ピペリジニル、テトラヒドロナフチル、ナフチル、2,3 - ジヒドロベンゾ[1,4]ジオキシニル、ベンゾ[1,2,5]チアジアゾリル、ピロリジニル、モルホリニルであってよく、そしてこの場合アリール基は1回又はそれ以上の回数R 9により置換されてよい；

であり、

R 9 は F、Cl、Br、OH、NO<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル - OH、O - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、S - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルフェニル、COOH、COO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルである、請求項 1 に記載の式 I の化合物及びそれらの生理学的に許容される塩。

【請求項 3】

A はフェニルであり、ここでフェニル基は F、Cl、Br により 3 回まで置換されてよく、

R 1、R 2 は H であり、

R 3、R 4、R 5、R 6 は、互いに独立して、H、F、Cl、Br、NO<sub>2</sub>、O - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルであり、

R 7 は H、CH<sub>3</sub> であり、

R 8 は (C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>) - アルキル、ここでアルキルは OH、CF<sub>3</sub>、CN、COOH、COO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、CO - NH<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、NH - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、N - [(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル]<sub>2</sub>、NCO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、NCOO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、NCOO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニル、NCOO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキニル又は NCOO - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) - アリールにより 3 回まで置換されてよく；

(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - アリール、ここで m は 0 ~ 6 であってよく、そしてアリールはフェニル、O - フェニル、CO - フェニル、ベンゾ [ 1, 3 ] ジオキソリル、ヘテロシクロアルキル、ピリジル、インドリル、ピペリジニル、テトラヒドロナフチル、ナフチル、2, 3 - ジヒドロベンゾ [ 1, 4 ] ジオキシニル、ベンゾ [ 1, 2, 5 ] チアジアゾリル、ピロリジニル、モルホリニルであってよく、そしてこの場合アリール基は 1 回又はそれ以上の回数 R 9 により置換されてよい；

であり、

R 9 は F、Cl、Br、OH、NO<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル - OH、O - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、S - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルフェニル、COOH、COO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルである、請求項 1 に記載の式 I の化合物及びそれらの生理学的に許容される塩。

【請求項 4】

II 型糖尿病の治療用医薬を製造するための請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の一つ又はそれ以上の化合物の使用。

【請求項 5】

血中ブドウ糖を低下させるための医薬を製造するための請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の一つ又はそれ以上の化合物の使用。