

【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 28 年 1 月 14 日 (2016.1.14)

【公表番号】特表 2015-510493 (P2015-510493A)

【公表日】平成 27 年 4 月 9 日 (2015.4.9)

【年通号数】公開・登録公報 2015-023

【出願番号】特願 2014-543573 (P2014-543573)

【国際特許分類】

C 07 D 413/04 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 K 31/42 (2006.01)

A 61 K 31/422 (2006.01)

C 12 N 15/09 (2006.01)

【F I】

C 07 D 413/04 C S P

A 61 P 43/00 1 0 5

A 61 P 3/10 Z N A

A 61 K 31/42

A 61 K 31/422

C 12 N 15/00 A

【手続補正書】

【提出日】平成 27 年 11 月 16 日 (2015.11.16)

【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

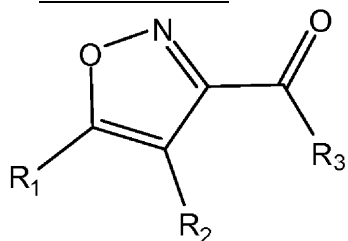
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

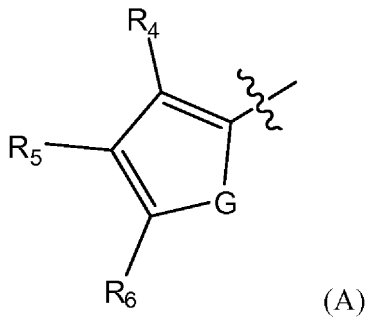
膵島細胞を式 (I) の化合物：



(I)

またはその薬学的に許容される塩と接触させる工程を含む、該細胞からのインスリンの産生および／または分泌を誘導するインビトロまたはエクスピボ方法であって、式中、

R₁ が、置換もしくは非置換フェニル、置換もしくは非置換チオフェニル、または式 (A)：



の置換基であり、

式中：

R_4 、 R_5 、および R_6 が各々独立して、

水素、ヒドロキシ、ハロ、シアノ、ニトロ；または

アルキル (C_{1-10})、アリール (C_{1-12})、アラルキル (C_{1-15})、ヘテロアリール (C_{1-12})、アシル (C_{1-10})、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンであり；

G が、 O 、 $-NH$ 、または S であり；

R_2 が：

水素、ヒドロキシ、ハロ、もしくはニトロ；または

アルキル (C_{1-10})、アルケニル (C_{1-10})、アルキニル (C_{1-10})、アルコキシ (C_{1-10})、アルケニルオキシ (C_{1-10})、アルキニルオキシ (C_{1-10})、アリール (C_{1-12})、アラルキル (C_{1-15})、アシル (C_{1-10})、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョン；または

$-C(O)R_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-OC(O)OR_7$ 、 $-C(O)NR_8R_9$ 、 $-OC(O)NR_8R_9$ 、 $-NR_8OR_9$ 、もしくは $-SO_3R_7$ であり；ここで

R_7 が、水素、アルキル (C_{1-10})、アリール (C_{1-12})、アラルキル (C_{1-15}) であり；

R_8 および R_9 が、各々独立して、水素、アルキル (C_{1-10})、アリール (C_{1-12})、アラルキル (C_{1-15}) であるか、または一体となってアルカンジイル (C_6) であり；

R_3 が、 $-NH-O-$ アルキル (C_{1-10})、 $-NHOH$ 、 $-OR_{10}$ 、または $-NR_{11}R_{12}$ であり、ここで、

R_{10} が、水素、置換もしくは非置換アルキル (C_{1-10})、置換もしくは非置換アルケニル (C_{1-10})、置換もしくは非置換アルキニル (C_{1-10})、置換もしくは非置換アリール (C_{1-12})、または置換もしくは非置換アラルキル (C_{1-15}) であり；

R_{11} および R_{12} が各々独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル (C_{1-10})、置換もしくは非置換アルケニル (C_{1-10})、置換もしくは非置換アルキニル (C_{1-10})、置換もしくは非置換アリール (C_{1-12})、または置換もしくは非置換アラルキル (C_{1-15}) であるか；あるいは

R_{11} および R_{12} が一体となって、アルカンジイル (C_6)、 $-CH_2CH_2NHCH_2CH_2-$ 、または $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$ を形成するか；あるいは

R_{11} および R_{12} が一体となってアルカンジイル (C_6) を形成する、方法。

【請求項 2】

R_1 が、式 (A) の置換基である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

G が S である、請求項 2 に記載の方法。

【請求項 4】

R_4 、 R_5 、および / または R_6 が水素である、請求項 3 に記載の方法。

【請求項 5】

R_2 が水素である、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 6】

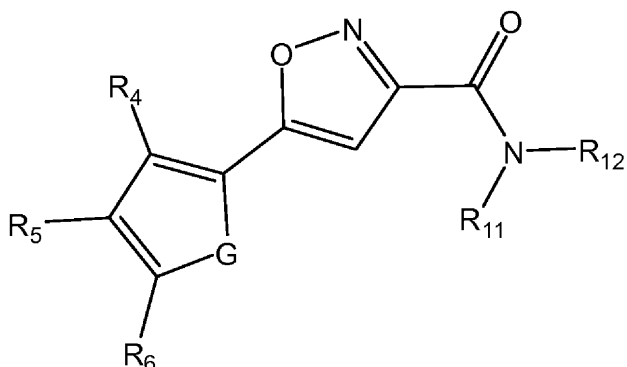
R_3 が $-NR_{11}R_{12}$ である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 7】

R_{12} または R_{13} が、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、またはシクロヘキシルである、請求項 6 に記載の方法。

【請求項 8】

式 (I) の化合物が、式 (II) の化合物：



(II)

またはその薬学的に許容される塩としてさらに定義され、
式中：

R_{11} および R_{12} が、両方とも水素であるか；あるいは

R_{11} が水素であり、かつ R_{12} が、置換もしくは非置換アルキル (C_{1-10})、置換もしくは非置換アルケニル (C_{1-10})、置換もしくは非置換アルキニル (C_{1-10})、またはベンジルであるか；あるいは

R_{11} および R_{12} が一体となって、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2NHCH_2CH_2-$ 、または $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$ であり；

R_4 、 R_5 、および R_6 が各々独立して：

水素、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ；または

アルキル (C_{1-10})、アリール (C_{1-12})、アラルキル (C_{1-15})、ヘテロアリール (C_{1-12})、アシル (C_{1-10})、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンであり；

G が、 O 、 NH または S である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 9】

G が S である、請求項 8 に記載の方法。

【請求項 10】

R_4 、 R_5 、または R_6 が水素である、請求項 9 に記載の方法。

【請求項 11】

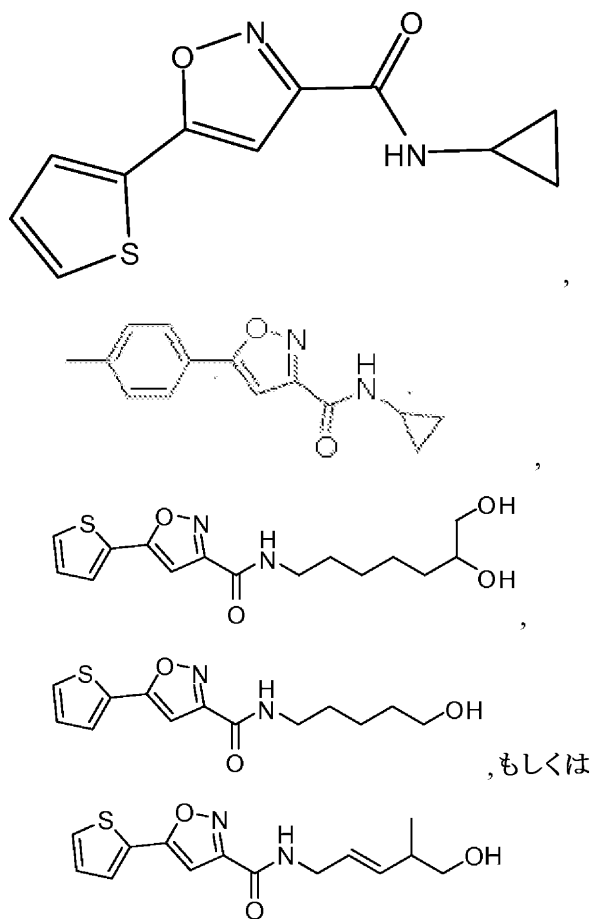
R_{11} が水素である、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 12】

R_{12} が、シクロプロピル、または脂肪族 (C_{1-10}) アルコール、または脂肪族 (C_{1-10}) ポリオールである、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 13】

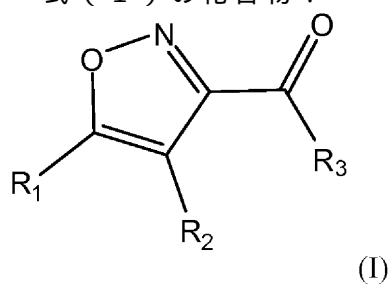
化合物が、以下：



またはその薬学的に許容される塩である、請求項 8 に記載の方法。

【請求項 14】

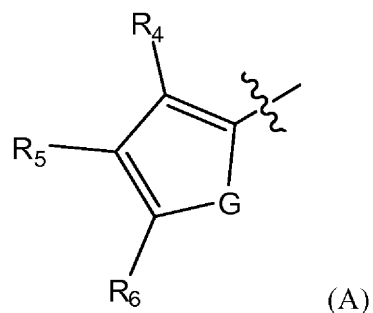
式 (I) の化合物：



またはその薬学的に許容される塩を含む、対象における糖尿病を処置するための薬学的組成物であって、

式中、

R_1 が、置換もしくは非置換フェニル、置換もしくは非置換チオフェニル、または式 (A)：



の置換基であり、

式中：

R₄、R₅、およびR₆が各々独立して、

水素、ヒドロキシ、ハロ、シアノ、ニトロ；または

アルキル (C₁₋₁₀)、アリール (C₁₋₁₂)、アラルキル (C₁₋₁₅)、ヘテロアリール (C₁₋₁₂)、アシル (C₁₋₁₀)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンであり；

Gが、O、-NH、またはSであり；

R₂が：

水素、ヒドロキシ、ハロ、もしくはニトロ；または

アルキル (C₁₋₁₀)、アルケニル (C₁₋₁₀)、アルキニル (C₁₋₁₀)、アルコキシ (C₁₋₁₀)、アルケニルオキシ (C₁₋₁₀)、アルキニルオキシ (C₁₋₁₀)、アリール (C₁₋₁₂)、アラルキル (C₁₋₁₅)、アシル (C₁₋₁₀)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョン；または

-C(O)R₇、-OC(O)R₇、-OC(O)OR₇、-C(O)NR₈R₉、-OC(O)NR₈R₉、-NR₈OR₉、もしくは-SO₃R₇であり；ここで

R₇が、水素、アルキル (C₁₋₁₀)、アリール (C₁₋₁₂)、アラルキル (C₁₋₁₅) であり；

R₈およびR₉が、各々独立して、水素、アルキル (C₁₋₁₀)、アリール (C₁₋₁₂)、アラルキル (C₁₋₁₅) であるか、または一体となってアルカンジイル (C₆) であり；

R₃が、-NH-O-アルキル (C₁₋₁₀)、-NHOH、-OR₁₀、または-NR₁₁R₁₂であり、ここで、

R₁₀が、水素、置換もしくは非置換アルキル (C₁₋₁₀)、置換もしくは非置換アルケニル (C₁₋₁₀)、置換もしくは非置換アルキニル (C₁₋₁₀)、置換もしくは非置換アリール (C₁₋₁₂)、または置換もしくは非置換アラルキル (C₁₋₁₅) であり；

R₁₁およびR₁₂が各々独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル (C₁₋₁₀)、置換もしくは非置換アルケニル (C₁₋₁₀)、置換もしくは非置換アルキニル (C₁₋₁₀)、置換もしくは非置換アリール (C₁₋₁₂)、または置換もしくは非置換アラルキル (C₁₋₁₅) であるか；あるいは

R₁₁およびR₁₂が一体となって、アルカンジイル (C₆)、-CH₂CH₂NHCH₂CH₂-、または-CH₂CH₂OCH₂CH₂-を形成するか；あるいは

R₁₁およびR₁₂が一体となってアルカンジイル (C₆) を形成する、薬学的組成物。

【請求項 15】

R₁が、式(A)の置換基である、請求項14に記載の薬学的組成物。

【請求項 16】

GがSである、請求項15に記載の薬学的組成物。

【請求項 17】

R₄、R₅、および/またはR₆が水素である、請求項16に記載の薬学的組成物。

【請求項 18】

R₂が水素である、請求項14～17のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 19】

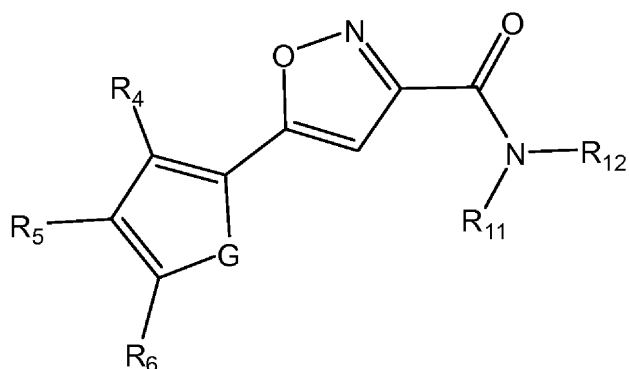
R₃が-NR₁₁R₁₂である、請求項14～18のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 20】

R₁₂またはR₁₃が、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、またはシクロヘキシルである、請求項19に記載の薬学的組成物。

【請求項 21】

式(I)の化合物が、式(II)の化合物：



(II)

またはその薬学的に許容される塩としてさらに定義され、
式中：

R₁₁ および R₁₂ が、両方とも水素であるか；あるいは

R₁₁ が水素であり、かつ R₁₂ が、置換もしくは非置換アルキル (C₁₋₁₀)、置換もしくは非置換アルケニル (C₁₋₁₀)、置換もしくは非置換アルキニル (C₁₋₁₀)、またはベンジルであるか；あるいは

R₁₁ および R₁₂ が一体となって、-CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂NHCH₂CH₂CH₂-, または -CH₂CH₂OCH₂CH₂- であり；

R₄、R₅、および R₆ が各々独立して：

水素、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ；または

アルキル (C₁₋₁₀)、アリール (C₁₋₁₂)、アラルキル (C₁₋₁₅)、ヘテロアリール (C₁₋₁₂)、アシル (C₁₋₁₀)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンであり；

G が、O、NH、または S である、請求項 14 に記載の薬学的組成物。

【請求項 22】

G が S である、請求項 21 に記載の薬学的組成物。

【請求項 23】

R₄、R₅、または R₆ が水素である、請求項 22 に記載の薬学的組成物。

【請求項 24】

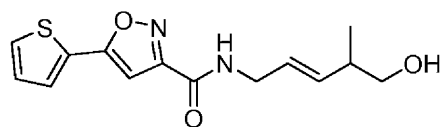
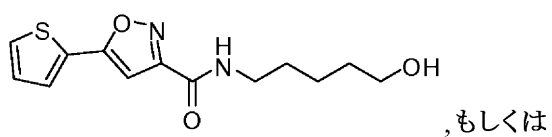
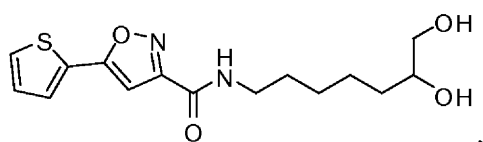
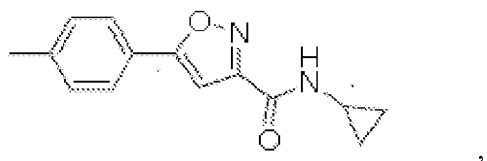
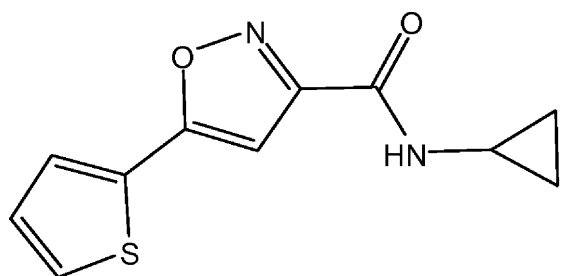
R₁₁ が水素である、請求項 14 ~ 23 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 25】

R₁₂ が、シクロプロピル、または脂肪族 (C₁₋₁₀) アルコール、または脂肪族 (C₁₋₁₀) ポリオールである、請求項 14 ~ 24 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 26】

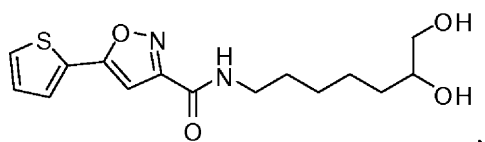
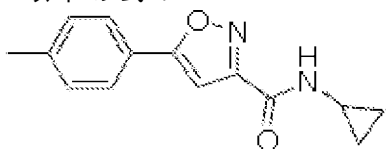
化合物が、以下：



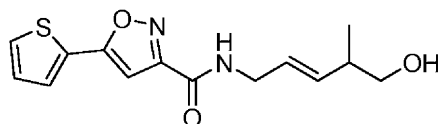
またはその薬学的に許容される塩である、請求項 2 1 に記載の薬学的組成物。

【請求項 2 7】

以下の式：



または



を有する化合物。