



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,  
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

## (12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21), (22) Заявка: 2009102515/04, 26.06.2007

(30) Конвенционный приоритет:  
27.06.2006 JP 2006-177099

(43) Дата публикации заявки: 10.08.2010 Бюл. № 22

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную  
фазу: 27.01.2009(86) Заявка РСТ:  
JP 2007/063208 (26.06.2007)(87) Публикация РСТ:  
WO 2008/001931 (03.01.2008)

Адрес для переписки:  
129090, Москва, ул.Б.Спасская, 25, стр.3,  
ООО "Юридическая фирма Городисский и  
Партнеры", пат.пов. А.В.Мицу, рег.№ 364

(71) Заявитель(и):

ТАКЕДА ФАРМАСЬЮТИКАЛ  
КОМПАНИ ЛИМИТЕД (JP)

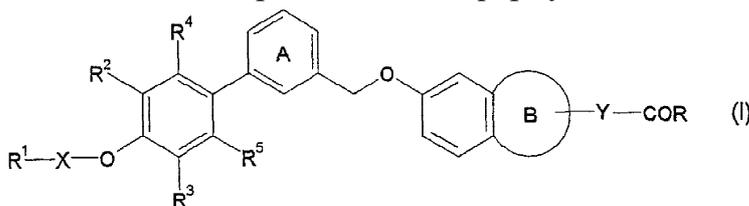
(72) Автор(ы):

ЯСУМА Цунео (JP),  
НЕГОРО Нобуюки (JP),  
ЯМАСИТА Масаюки (JP),  
ИТОУ Масахиро (JP)

## (54) КОНДЕНСИРОВАННЫЕ ЦИКЛИЧЕСКИЕ СОЕДИНЕНИЯ

## (57) Формула изобретения

1. Соединение, представленное формулой (I)



где

$R^1$  представляет собой  $R^6-SO_2-$  (где  $R^6$  представляет собой заместитель) или необязательно замещенную 1,1-диоксидотетрагидропиранильную группу;

X представляет собой связь или двухвалентную углеводородную группу;

$R^2$  и  $R^3$  являются одинаковыми или отличными друг от друга, и каждый представляет собой атом водорода, атом галогена, необязательно замещенную углеводородную группу или необязательно замещенную гидроксигруппу;

$R^4$  и  $R^5$  являются одинаковыми или отличными друг от друга, и каждый представляет собой  $C_{1-6}$  алкильную группу, необязательно замещенную гидроксигруппой (группами);

кольцо A представляет собой бензольное кольцо, необязательно дополнительно

имеющее заместитель(заместители), выбранный из группы, включающей атом галогена, необязательно замещенную углеводородную группу, необязательно замещенную гидроксигруппу и необязательно замещенную аминогруппу;

кольцо В представляет собой 5-7-членное кольцо;

Y представляет собой связь или  $\text{CH}_2$ ; и

R представляет собой необязательно замещенную гидроксигруппу, или его соль.

2. Соединение по п.1, где  $\text{R}^1$  представляет собой  $\text{R}^6\text{-SO}_2\text{-}$ , где  $\text{R}^6$  представляет собой заместитель.

3. Соединение по п.2, где  $\text{R}^6$  представляет собой  $\text{C}_{1-6}$  алкильную группу.

4. Соединение по п.1, где X представляет собой  $\text{C}_{1-6}$  алкиленовую группу.

5. Соединение по п.1, где  $\text{R}^2$  и  $\text{R}^3$  являются одинаковыми или отличными друг от друга, и каждый представляет собой атом водорода, атом галогена или  $\text{C}_{1-6}$  алкильную группу.

6. Соединение по п.1, где  $\text{R}^4$  и  $\text{R}^5$  являются одинаковыми или отличными друг от друга, и каждый представляет собой  $\text{C}_{1-6}$  алкильную группу.

7. Соединение по п.1, где кольцо А представляет собой незамещенное бензольное кольцо.

8. Соединение по п.1, где кольцо В представляет собой тетрагидрофуран.

9. Соединение по п.1, где Y представляет собой  $\text{CH}_2$ .

10. Соединение по п.1, где R представляет собой гидроксигруппу.

11. Соединение по п.1, выбранное из группы, включающей

[(3S)-6-({4'-[(4-гидрокси-1,1-диоксидотетрагидро-2H-тиопиран-4-ил)метокси]-2',6'-диметилбифенил-3-ил}метокси)-2,3-дигидро-1-бензофуран-3-ил]уксусную кислоту,

[(3S)-6-({2',6'-диметил-4'-[3-(метилсульфонил)пропокси]бифенил-3-ил}метокси)-2,3-дигидро-1-бензофуран-3-ил]уксусную кислоту,

[(3S)-6-({3'-фтор-2',6'-диметил-4'-[3-(метилсульфонил)пропокси]бифенил-3-ил}метокси)-2,3-дигидро-1-бензофуран-3-ил]уксусную кислоту,

[(3S)-6-({3'-хлор-2',6'-диметил-4'-[3-(метилсульфонил)пропокси]бифенил-3-ил}метокси)-2,3-дигидро-1-бензофуран-3-ил]уксусную кислоту,

[(3S)-6-({3',5'-дихлор-2',6'-диметил-4'-[3-(метилсульфонил)пропокси]бифенил-3-ил}метокси)-2,3-дигидро-1-бензофуран-3-ил]уксусную кислоту, и

[(3S)-6-({2',6'-диэтил-4'-[3-(метилсульфонил)пропокси]бифенил-3-ил}метокси)-2,3-дигидро-1-бензофуран-3-ил]уксусную кислоту.

12. Пролекарство соединения по п.1.

13. Модулятор функции рецептора GPR40, включающий соединение по п.1 или его пролекарство.

14. Фармацевтическое средство, включающее соединение по п.1 или его пролекарство.

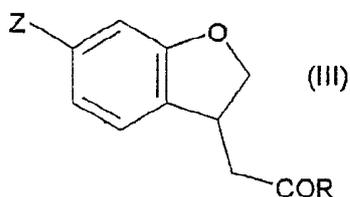
15. Фармацевтическое средство по п.14, которое представляет собой средство для профилактики или лечения диабета.

16. Способ профилактики или лечения диабета у млекопитающего, который включает введение млекопитающему эффективного количества соединения по п.1 или его пролекарства.

17. Применение соединения по п.1 или его пролекарства для получения средства для профилактики или лечения диабета.

18. (6-Гидрокси-2,3-дигидро-1-бензофуран-3-ил)уксусная кислота или ее соль.

19. Способ получения оптически активной формы соединения, представленного формулой (III)

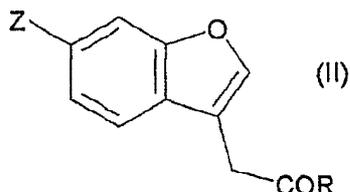


где

Z представляет собой атом галогена или необязательно замещенную гидроксигруппу; и

R представляет собой необязательно замещенную гидроксигруппу, или его соли,

который включает реакцию асимметричного восстановления соединения, представленного формулой (II)



где каждый символ имеет значение, определенное выше, или его соли.

20. [(3S)-6-({4'-[(4-Гидрокси-1,1-диокситетрагидро-2H-тиопиран-4-ил)метокси]-2',6'-диметилбифенил-3-ил}метокси)-2,3-дигидро-1-бензофуран-3-ил]уксусная кислота или ее соль.

21. [(3S)-6-({2',6'-Диметил-4'-[3-(метилсульфонил)пропокси]бифенил-3-ил}метокси)-2,3-дигидро-1-бензофуран-3-ил]уксусная кислота или ее соль.

22. [(3S)-6-({3'-Фтор-2',6'-диметил-4'-[3-(метилсульфонил)пропокси]бифенил-3-ил}метокси)-2,3-дигидро-1-бензофуран-3-ил]уксусная кислота или ее соль.

23. [(3S)-6-({3'-Хлор-2',6'-диметил-4'-[3-(метилсульфонил)пропокси]бифенил-3-ил}метокси)-2,3-дигидро-1-бензофуран-3-ил]уксусная кислота или ее соль.

24. [(3S)-6-({3',5'-Дихлор-2',6'-диметил-4'-[3-(метилсульфонил)пропокси]бифенил-3-ил}метокси)-2,3-дигидро-1-бензофуран-3-ил]уксусная кислота или ее соль.

25. [(3S)-6-({2',6'-Диэтил-4'-[3-(метилсульфонил)пропокси]бифенил-3-ил}метокси)-2,3-дигидро-1-бензофуран-3-ил]уксусная кислота или ее соль.