

【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24年1月5日(2012.1.5)

【公表番号】特表2008-509950(P2008-509950A)

【公表日】平成20年4月3日(2008.4.3)

【年通号数】公開・登録公報2008-013

【出願番号】特願2007-526351(P2007-526351)

【国際特許分類】

C 07 D 417/12	(2006.01)
C 07 D 417/14	(2006.01)
A 61 K 31/427	(2006.01)
A 61 K 31/675	(2006.01)
A 61 K 31/454	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 37/06	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 9/08	(2006.01)
A 61 P 25/02	(2006.01)
A 61 P 13/08	(2006.01)
C 07 D 277/20	(2006.01)
C 07 D 277/56	(2006.01)
C 07 D 277/44	(2006.01)

【F I】

C 07 D 417/12	
C 07 D 417/14	
A 61 K 31/427	
A 61 K 31/675	
A 61 K 31/454	
A 61 K 31/5377	
A 61 P 43/00	1 2 3
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 35/00	
A 61 P 29/00	
A 61 P 37/06	
A 61 P 25/28	
A 61 P 25/00	
A 61 P 9/08	
A 61 P 25/02	1 0 1
A 61 P 13/08	
C 07 D 277/56	C S P
C 07 D 277/44	

【誤訳訂正書】

【提出日】平成23年11月11日(2011.11.11)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

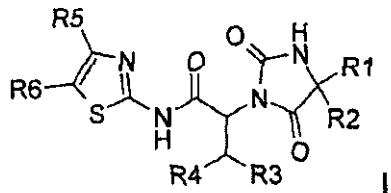
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物

【化1】



{式中：

R<sup>1</sup>は、置換若しくは非置換アリール又は置換若しくは非置換ヘテロアリール基から成る群から選択され；

R<sup>2</sup>は、水素であり；

R<sup>3</sup>は、アルキル基であり；

R<sup>4</sup>は、置換若しくは非置換アリール、ヒドロキシル、アルコキシ、置換アルコキシ又は置換若しくは非置換ヘテロアリール又はアルキル基から成る群から選択され；

R<sup>5</sup>は、COOR、COR、CON(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>、CHOHR又はS(O)<sub>n</sub>Rから成る群から選択され（式中、nは0～2であり、Rはアルキル又はアルコキシ基により置換されたアルキルである）；且つ

R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は、水素又はアルキル基から選択される}

任意に、それらのラセミ体、それらの光学異性体、それらのジアステレオマー又はそれらの混合物、

又は、それらの医薬として許容される塩。

【請求項2】

R<sup>1</sup>がフェニルであるか、或いは、置換基で置換されたフェニルであって、前記置換基は、以下：

ヒドロキシル；アルコキシ；置換アルコキシ；-P(=O)(O-アルキル)<sub>2</sub>；-NH-アルキル；-N(アルキル)<sub>2</sub>；-OHで任意に置換される、ヘテロシクリル；-S(O)<sub>2</sub>-アルキル；-NHCO(O)-アルキル；並びに、

-O-アルキルであって、アルキル基が、以下：

NH<sub>2</sub>；NH-アルキルであって、アルキル基が-O-メチルで任意に置換される、前記NH-アルキル；N(アルキル)<sub>2</sub>；ヒドロキシル；ヘテロシクリル；-O-アルキル；-COOH；オキソ；-C(O)-ヘテロシクリル；-C(O)-N(アルキル)<sub>2</sub>；-C(O)-NH-アルキルであって、アルキル基が-O-メチルで任意に置換される、前記-C(O)-NH-アルキル；及び-C(O)-NH<sub>2</sub>

から成る群から選択される置換基により1回又は2回任意に置換される、前記-O-アルキル；

から成る群から選択される、前記置換基で置換されたフェニルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R<sup>1</sup>が2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]ジオキシン-6-イルである、請求項1に

記載の化合物。

**【請求項 4】**

R<sup>3</sup>がメチル基である、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 5】**

R<sup>4</sup>が置換又は非置換アリールである、請求項1～4のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 6】**

R<sup>5</sup>がC ORであり、Rがメチル又はエチルである、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 7】**

R<sup>6</sup>が水素である、請求項1～6のいずれか一項に記載の化合物。

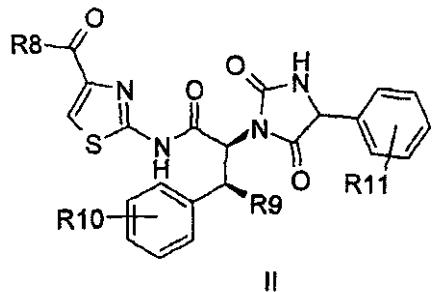
**【請求項 8】**

ヘテロシクリルが、ピペリジニル、モルホリノ、又はピロリジニルである、請求項1～7のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 9】**

式IIの化合物

**【化2】**



{式中、

R<sup>8</sup>は、水素；アルキル；シクロアルキル；-O-アルキル；NHアルキル又はN(アルキル)<sub>2</sub>であり；

R<sup>9</sup>は、アルキルであり；

R<sup>10</sup>は、水素；アルキル；置換アルキル又はハロゲンであり；

R<sup>11</sup>は、ヒドロキシリル；アルコキシ；置換アルコキシ；-P(O)(O-アルキル)<sub>2</sub>；-NH-アルキル；-N(アルキル)<sub>2</sub>；任意に-OHにより置換される、ヘテロシクリル；-S(O)<sub>2</sub>-アルキル；-NHCO(O)-アルキル；並びに、-O-アルキルであって、アルキル基が、以下：

NH<sub>2</sub>；NH-アルキルであって、アルキル基が-O-メチルで任意に置換される、前記NH-アルキル；N(アルキル)<sub>2</sub>；ヒドロキシリル；ヘテロシクリル；-O-アルキル；-COOH；オキソ；-C(O)-ヘテロシクリル；-C(O)-N(アルキル)<sub>2</sub>；-C(O)-NH-アルキルであって、アルキル基が-O-メチルで任意に置換される、前記-C(O)-NH-アルキル；及び-C(O)-NH<sub>2</sub>

から成る群から選択される置換基により1回又は2回任意に置換される、前記-O-アルキル

から成る群から選択される}

任意に、それらのラセミ体、それらの光学異性体、それらのジアステレオマー又はそれらの混合物、

又は、それらの医薬として許容される塩。

**【請求項 10】**

R<sup>9</sup>がメチルである、請求項9に記載の化合物。

## 【請求項 1 1】

$R^{10}$ が水素又はハロゲンである、請求項9、又は10に記載の化合物。

## 【請求項 1 2】

ハロゲンがフッ素又は塩素である、請求項1 1に記載の化合物。

## 【請求項 1 3】

ヘテロシクリルが、ピペリジニル、モルホリノ、又はピロリジニルである、請求項9～12のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 1 4】

以下のものから成る群から選択される化合物：

(2S, 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - [ (R) - 4 - (4 - メトキシ - フェニル) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル] - 3 - フェニル - プチルアミド；  
 (2S, 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - [ (R) - 4 - (4 - ヒドロキシ - フェニル) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル] - 3 - フェニル - プチルアミド；  
 (2S, 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - { (R) - 4 - [ 4 - (2 - ヒドロキシ - エトキシ) - フェニル] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - プチルアミド；  
 (2S, 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - { (R) - 4 - [ 4 - (2 - メトキシ - エトキシ) - フェニル] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - プチルアミド；  
 (2S, 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - { (R) - 4 - { 4 - [ 2 - (2 - メトキシ - エトキシ) - エトキシ] - フェニル } - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - プチルアミド；  
 (2S, 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - { (R) - 4 - [ 4 - (2 - エトキシ - エトキシ) - フェニル] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - プチルアミド；  
 (2S, 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - { (R) - 4 - [ 4 - (2 - ジメチルアミノ - エトキシ) - フェニル] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - プチルアミドトリフルオロ酢酸塩；  
 (2S, 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - { (R) - 4 - [ 4 - (2 - ジエチルアミノ - エトキシ) - フェニル] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - プチルアミドトリフルオロ酢酸塩；  
 (2S, 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - [ (R) - 4 - (4 - エトキシ - フェニル) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル] - 3 - フェニル - プチルアミド；  
 (2S, 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - { (S) - 4 - [ 4 - (2 - ジメチルアミノ - エトキシ) - フェニル] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - プチルアミドトリフルオロ酢酸塩；  
 (4 - { 1 - [ (1S, 2S) - 1 - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イルカルバモイル) - 2 - フェニル - プロピル] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 4 - イル } - フェニル) - ホスホン酸ジエチルエステル；  
 (2S, 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - [ 4 - (4 - ジメチルアミノ - フェニル) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - プチルアミド；  
 (2S, 3S) - 2 - [ (R) - 4 - (4 - メトキシ - フェニル) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - ペンタン酸(4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - アミド；  
 (2S, 3S) - 2 - [ (R) - 4 - (4 - メトキシ - フェニル) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - N - (4 - プロピオニル - チアゾール -

2 - イル ) - ブチルアミド ;

( 2 S , 3 S ) - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [ 1 , 4 ] ジオキシン - 6 - イル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド ;

( 2 S , 3 S ) - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 4 - エトキシ - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド ;

( 2 S , 3 S ) - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 4 - ヒドロキシ - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド ;

( 2 S , 3 S ) - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド ;

( 2 S , 3 S ) - 2 - { ( S ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド ;

( 2 S , 3 S ) - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - ヒドロキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド ;

( 2 S , 3 S ) - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - エトキシ ] - フェニル } - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ) - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド 及び

( 2 S , 3 S ) - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - エトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド 。

### 【請求項 15】

以下のものから成る群から選択される化合物 :

( 2 S , 3 S ) - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - エトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド ;

( 2 S , 3 S ) - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - ジメチルアミノ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミドトリフルオロ酢酸塩 ;

( 4 - { ( R ) - 2 , 5 - ジオキソ - 1 - [ ( 1 S , 2 S ) - 2 - フェニル - 1 - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イルカルバモイル ) - プロピル ] - イミダゾリジン - 4 - イル } - フエノキシメチル ) - ホスホン酸ジメチルエステル ;

( 2 S , 3 S ) - N - ( 4 - イソブチリル - チアゾール - 2 - イル ) - 2 - { 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - ブチルアミド ;

( 2 S , 3 S ) - N - ( 4 - イソブチリル - チアゾール - 2 - イル ) - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 4 - メトキシ - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - ブチルアミド ;

( 2 S , 3 S ) - 2 - { ( S ) - 4 - [ 4 - ( 2 - ジメチルアミノ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミドトリフルオロ酢酸塩 ;

( 2 S , 3 S ) - 2 - { 2 , 5 - ジオキソ - 4 - [ 4 - ( 2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ ) - フェニル ] - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド ;

( 2 S , 3 S ) - 2 - { 4 - [ 4 - ( 2 - モルホリン - 4 - イル - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロ

ピオニル - チアゾール - 2 - イル) - ブチルアミド ;  
 ( 2 S , 3 S ) - 3 - ( 3 - フルオロ - フェニル ) - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド ;  
 ( 2 S , 3 S ) - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 4 - メトキシ - 3 - メチル - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド ;  
 ( 2 S , 3 S ) - 2 - { ( S ) - 4 - [ 4 - ( 2 - ヒドロキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド ;  
 ( 2 S , 3 S ) - 2 - ( ( R ) - 2 , 5 - ジオキソ - 4 - フェニル - イミダゾリジン - 1 - イル ) - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド ;  
 ( 2 S , 3 S ) - 2 - [ 4 - ( 4 - ジメチルアミノ - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド ;  
 ( 2 S , 3 S ) - 2 - [ 4 - ( 4 - モルホリン - 4 - イル - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド ;  
 ( 2 S , 3 S ) - 2 - { 4 - [ 4 - ( 4 - ヒドロキシ - ピペリジン - 1 - イル ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド ;  
 ( 2 S , 3 S ) - 2 - ( 4 - { 4 - [ ( 2 - メトキシ - エチル ) - メチル - アミノ ] - フェニル } - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ) - 3 - フェニル - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド ;  
 ( 2 S , 3 S ) - N - ( 4 - シクロプロパンカルボニル - チアゾール - 2 - イル ) - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - ブチルアミド ;  
 ( 2 S , 3 S ) - 2 - { 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - メチル - ペンタン酸 ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - アミド ;  
 ( 2 S , 3 R ) - 3 - ベンジルオキシ - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - N - ( 4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル ) - ブチルアミド ;  
 ( 2 S , 3 S ) - N - [ 4 - ( 2 - メトキシ - アセチル ) - チアゾール - 2 - イル ] - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 4 - メトキシ - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - ブチルアミド ;  
 2 - { ( 2 S , 3 S ) - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [ 1 , 4 ] ジオキシン - 6 - イル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - ブチリルアミノ } - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル 及び  
 2 - [ ( 2 S , 3 S ) - 2 - ( ( R ) - 2 , 5 - ジオキソ - 4 - フェニル - イミダゾリジン - 1 - イル ) - 3 - フェニル - ブチリルアミノ ] - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル。

#### 【請求項 1 6】

以下のものから成る群から選択される化合物 :

2 - { ( 2 S , 3 S ) - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 4 - メトキシ - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - ブチリルアミノ } - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル ;  
 2 - { ( 2 S , 3 S ) - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 4 - ヒドロキシ - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - ブチリルアミノ } - チアゾール

- 4 - カルボン酸メチルエステル；  
2 - ( ( 2 S , 3 S ) - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - ブチリルアミノ ) - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル；  
2 - ( ( 2 S , 3 S ) - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - ヒドロキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - ブチリルアミノ ) - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル；  
2 - { ( 2 S , 3 S ) - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 4 - イソプロポキシ - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - ブチリルアミノ } - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル；  
2 - { ( 2 S , 3 S ) - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 4 - メトキシ - 3 - メチル - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - ブチリルアミノ } - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル；  
2 - ( ( 2 S , 3 S ) - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( ジメトキシ - ホスホリルメトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - ブチリルアミノ ) - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル；  
2 - { ( 2 S , 3 S ) - 3 - ( 2 - メトキシ - フェニル ) - 2 - [ 4 - ( 4 - メトキシ - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - ブチリルアミノ } - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル；  
2 - ( ( 2 S , 3 S ) - 3 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - ブチリルアミノ ) - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル；  
2 - { ( 2 S , 3 S ) - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 4 - メトキシ - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - メチル - ペンタノイルアミノ } - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル；  
2 - [ ( 2 S , 3 S ) - 2 - ( ( R ) - 2 , 5 - ジオキソ - 4 - フェニル - イミダゾリジン - 1 - イル ) - 3 - メチル - ペンタノイルアミノ ] - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル；  
2 - ( ( 2 S , 3 S ) - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - メチル - ペンタノイルアミノ ) - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル；  
2 - { ( 2 S , 3 R ) - 3 - ヒドロキシ - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 4 - メトキシ - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - ブチリルアミノ } - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル；  
2 - ( ( 2 S , 3 R ) - 3 - ヒドロキシ - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - ブチリルアミノ ) - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル；  
2 - ( ( 2 S , 3 R ) - 3 - t e r t - ブトキシ - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - ブチリルアミノ ) - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル；  
2 - { ( 2 S , 3 R ) - 3 - メトキシ - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 4 - メトキシ - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - ブチリルアミノ } - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル；  
2 - ( ( 2 S , 3 R ) - 3 - メトキシ - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - ブチリルアミノ ) - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル；  
2 - ( ( 2 S , 3 R ) - 3 - ベンジルオキシ - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - ブチリルアミノ ) - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル；  
2 - ( ( 2 S , 3 R ) - 3 - ( 4 - クロロ - ベンジルオキシ ) - 2 - { ( R ) - 4 - [

4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - ブチリルアミノ ) - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル  
 2 - { ( 2 S , 3 R ) - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 4 - メトキシ - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - メチル - ペンタノイルアミノ } - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル  
 2 - ( ( 2 S , 3 R ) - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - メチル - ペンタノイルアミノ ) - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエステル ;  
 2 - ( ( 2 S , 3 R ) - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - メチル - ペンタノイルアミノ ) - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエстеrl ;  
 2 - { ( 2 S , 3 S ) - 2 - [ 4 - ( 4 - メタンスルホニル - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - ブチリルアミノ } - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエстеrl 及び  
 2 - { ( S ) - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 4 - メトキシ - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - メチル - 3 - フェニル - ブチリルアミノ } - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエстеrl 。

### 【請求項 17】

以下のものから成る群から選択される化合物 :

2 - { ( 2 S , 3 R ) - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [ 1 , 4 ] ジオキシン - 6 - イル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - ブチリルアミノ } - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエстеrl ;  
 2 - { ( 2 S , 3 S ) - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 4 - アセチルアミノ - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - ブチリルアミノ } - チアゾール - 4 - カルボン酸メチルエSTErl ;  
 N - [ 4 - ( 1 - ヒドロキシ - 1 - メチル - エチル ) - チアゾール - 2 - イル ] - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 4 - メトキシ - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - ブチルアミド ;  
 ( 2 S , 3 S ) - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [ 1 , 4 ] ジオキシン - 6 - イル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - N - [ 4 - ( 1 - ヒドロキシ - プロピル ) - チアゾール - 2 - イル ] - 3 - フェニル - ブチルアミド ;  
 ( 2 S , 3 S ) - N - [ 4 - ( 1 - ヒドロキシ - エチル ) - チアゾール - 2 - イル ] - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 4 - メトキシ - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - ブチルアミド ;  
 2 - { ( 2 S , 3 S ) - 2 - [ ( R ) - 4 - ( 4 - メトキシ - フェニル ) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル - ブチリルアミノ } - チアゾール - 4 - カルボン酸ジメチルアミド ;  
 ( 2 S , 3 S ) - N - ( 4 - エチルスルファニル - チアゾール - 2 - イル ) - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - ブチルアミド ;  
 ( 2 S , 3 S ) - N - ( 4 - エタンスルフィニル - チアゾール - 2 - イル ) - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - ブチルアミド ;  
 ( 2 S , 3 S ) - N - ( 4 - エタンスルホニル - チアゾール - 2 - イル ) - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - ブチルアミド ;  
 ( 2 S , 3 S ) - N - [ 4 - ( 2 - ヒドロキシ - アセチル ) - チアゾール - 2 - イル ] - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - ブチルアミド ;  
 ( 2 S , 3 S ) - N - [ 4 - ( 2 - ヒドロキシ - アセチル ) - チアゾール - 2 - イル ] - 2 - { ( R ) - 4 - [ 4 - ( 2 - メトキシ - エトキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニル - ブチルアミド ;  
 ( 4 - ( R ) - 1 - [ ( 1 S , 2 S ) - 1 - ( 4 - アセチル - チアゾール - 2 - イルカ

ルバモイル) - 2 - フェニル - プロピル] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 4 - イル} - フエノキシ) - 酢酸メチルエステル;  
 (4 - { (R) - 2 , 5 - ジオキソ - 1 - [ (1S , 2S) - 2 - フェニル - 1 - (4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イルカルバモイル) - プロピル] - イミダゾリジン - 4 - イル} - フエノキシ) - 酢酸メチルエステル;  
 (4 - { 2 , 5 - ジオキソ - 1 - [ (1S , 2S) - 2 - フェニル - 1 - (4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イルカルバモイル) - プロピル] - イミダゾリジン - 4 - イル} - フエノキシ) - 酢酸;  
 (2S , 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - [ (R) - 4 - (4 - ジメチルカルバモイルメトキシ - フエニル) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル] - 3 - フェニル - ブチルアミド;  
 (2S , 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - [ (R) - 4 - (4 - メチルカルバモイルメトキシ - フエニル) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル] - 3 - フェニル - ブチルアミド;  
 (2S , 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - [ (R) - 4 - (4 - カルバモイルメトキシ - フエニル) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル] - 3 - フェニル - ブチルアミド及び  
 (2S , 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - [ (R) - 4 - { 4 - [ (2 - メトキシ - エチルカルバモイル) - メトキシ] - フエニル} - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル] - 3 - フェニル - ブチルアミド。

#### 【請求項 18】

以下のものから成る群から選択される化合物:

(2S , 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - [ (R) - 4 - { 4 - [ (2 - メトキシ - エチルカルバモイル) - メトキシ] - フエニル} - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル] - 3 - フェニル - ブチルアミド;

(2S , 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - [ (R) - 4 - { 4 - [ (2 - メトキシ - エチルカルバモイル) - メトキシ] - フエニル} - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル] - 3 - フェニル - ブチルアミド;

(2S , 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - { (R) - 4 - [ 4 - (2 - モルホリン - 4 - イル - 2 - オキソ - エトキシ) - フエニル] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル} - 3 - フェニル - ブチルアミド;

(2S , 3S) - N - (4 - アセチル - チアゾール - 2 - イル) - 2 - { (R) - 2 , 5 - ジオキソ - 4 - [ 4 - (2 - オキソ - 2 - ピロリジン - 1 - イル - エトキシ) - フエニル] - イミダゾリジン - 1 - イル} - 3 - フェニル - ブチルアミド;

(2S , 3S) - 2 - [ (R) - 4 - (4 - ジメチルカルバモイルメトキシ - フエニル) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル] - 3 - フェニル - N - (4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル) - ブチルアミド;

(2S , 3S) - 2 - [ (R) - 4 - (4 - メチルカルバモイルメトキシ - フエニル) - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル] - 3 - フェニル - N - (4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル) - ブチルアミド;

(2S , 3S) - 2 - [ (R) - 4 - { 4 - [ (2 - メトキシ - エチルカルバモイル) - メトキシ] - フエニル} - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル] - 3 - フェニル - N - (4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル) - ブチルアミド;

(2S , 3S) - 2 - { (R) - 4 - [ 4 - (2 - モルホリン - 4 - イル - 2 - オキソ - エトキシ) - フエニル] - 2 , 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イル} - 3 - フェニル - N - (4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル) - ブチルアミド;

(2S , 3S) - 2 - { (R) - 2 , 5 - ジオキソ - 4 - [ 4 - (2 - オキソ - 2 - ピロリジン - 1 - イル - エトキシ) - フエニル] - イミダゾリジン - 1 - イル} - 3 - フェニル - N - (4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル) - ブチルアミド;

(2S , 3S) - 2 - { (R) - 2 , 5 - ジオキソ - 4 - [ 4 - (2 - オキソ - 2 - ピロリジン - 1 - イル - エトキシ) - フエニル] - イミダゾリジン - 1 - イル} - 3 - フェニル - N - (4 - プロピオニル - チアゾール - 2 - イル) - ブチルアミド;

(2S , 3S) - 2 - { (R) - 4 - (2 - アゼチジン - 1 - イル - 2 - オキソ

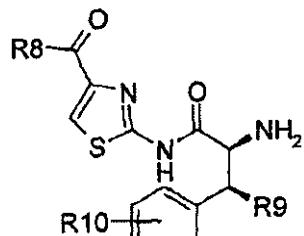
-エトキシ) -フェニル] -2 , 5 -ジオキソ -イミダゾリジン -1 -イル} -3 -フェニル -N - (4 -プロピオニル -チアゾール -2 -イル) -ブチルアミド及び  
(2S, 3S) -N - (4 -シクロプロパンカルボニル -チアゾール -2 -イル) -2 -[ (R) -4 - (4 -メチルカルバモイルメトキシ -フェニル) -2 , 5 -ジオキソ -イミダゾリジン -1 -イル] -3 -フェニル -ブチルアミド。

## 【請求項 19】

以下の工程により、請求項9に記載の式IIの化合物を製造するための方法：

a ) 式17の化合物

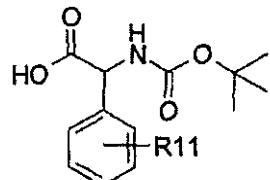
## 【化3】



17

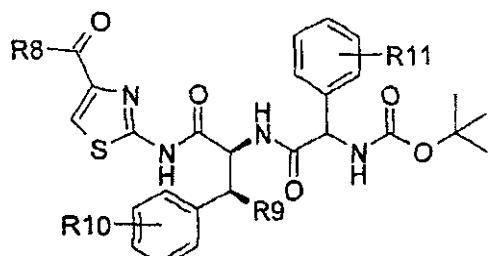
を、以下の式の化合物と反応させ

## 【化4】



式18の化合物を得る

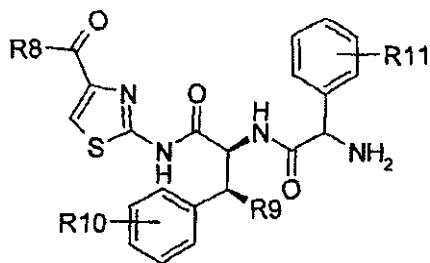
## 【化5】



18

b ) 式18の当該化合物を更にCF3CO2Hと反応させてtert -ブチルカルバメート保護基を除去し、式19の化合物を得る

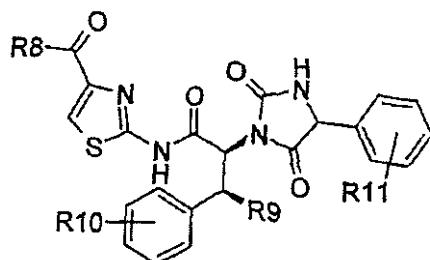
【化6】



19

c) 式19の当該化合物を、更に、ジクロロメタン、テトラヒドロフラン及びテトラヒドロフランとトルエンの混合物から選択される溶媒中で、ジホスゲン及びジイソプロピルエチルアミンと反応させ、式IIの化合物を得る

【化7】



{式中、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>及びR<sup>11</sup>は、請求項9で与えられた意味を有する}。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0010

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0010】

R<sup>1</sup>がフェニルであるか、或いは、置換基で置換されたフェニルであって、前記置換基は、以下：

ヒドロキシル；アルコキシ；置換アルコキシ；-P(=O)(O-アルキル)<sub>2</sub>；-NH-アルキル；-N(アルキル)<sub>2</sub>；-OHで任意に置換される、ヘテロシクリル（好ましくは、ピペリジニル、モルホリノ又はピロリジニル）；-S(=O)<sub>2</sub>-アルキル；-NHC(=O)-アルキル；並びに、

-O-アルキルであって、アルキル基が、以下：

NH<sub>2</sub>；NH-アルキルであって、アルキル基が-O-メチルで任意に置換される、前記NH-アルキル；N(アルキル)<sub>2</sub>；ヒドロキシル；ヘテロシクリル（好ましくは、ピペリジニル、モルホリノ又はピロリジニル）；-O-アルキル；-COOH；オキソ；-C(=O)-ヘテロシクリル（好ましくは、ピペリジニル、モルホリノ又はピロリジニル）；-C(=O)-N(アルキル)<sub>2</sub>；-C(=O)-NH-アルキルであって、アルキル基が-O-メチルで任意に置換される、前記-C(=O)-NH-アルキル；及び-C(=O)-NH<sub>2</sub>

から成る群から選択される置換基により1回又は2回任意に置換される、前記-O-アル

キル

から成る群から選択される、前記置換基で置換されたフェニルである、式 I の化合物が好ましい。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0020

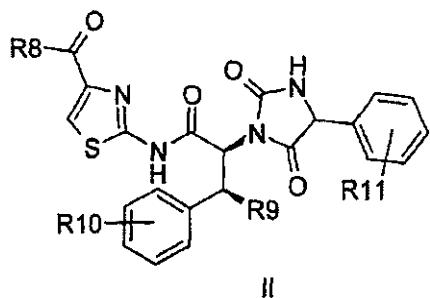
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0020】

式の化合物

【化4】



{ 式中、

R<sup>8</sup>は、水素；アルキル；シクロアルキル；-O-アルキル；NHアルキル又はN(アルキル)<sub>2</sub>であり；

R<sup>9</sup>は、アルキル、好ましくはメチルであり；

R<sup>10</sup>は、水素；アルキル；置換アルキル又はハロゲン、好ましくは水素又は好ましくはフルオロ若しくはクロロの群から選択されるハロゲンであり；

R<sup>11</sup>は、ヒドロキシリル；アルコキシ；置換アルコキシ；-P(O)(O-アルキル)<sub>2</sub>；-NH-アルキル；-N(アルキル)<sub>2</sub>；ヘテロシクリルであって、任意に-OHにより置換される、前記ヘテロシクリル(好ましくは、ピペリジニル、モルホリノ又はピロリジニル)；-S(O)<sub>2</sub>-アルキル；-NHCO(O)-アルキル；並びに、

-O-アルキルであって、アルキル基が、以下：

NH<sub>2</sub>；NH-アルキルであって、アルキル基が-O-メチルで任意に置換される、前記NH-アルキル；N(アルキル)<sub>2</sub>；ヒドロキシリル；ヘテロシクリル(好ましくは、ピペリジニル、モルホリノ又はピロリジニル)；-O-アルキル；-COOH；オキソ；-C(O)-ヘテロシクリル(好ましくは、ピペリジニル、モルホリノ又はピロリジニル)；-C(O)-N(アルキル)<sub>2</sub>；-C(O)-NH-アルキルであって、アルキル基が-O-メチルにより任意に置換される、前記-C(O)-NH-アルキル；及び-C(O)-NH<sub>2</sub>

から成る群から選択される置換基により1回又は2回任意に置換される、前記-O-アルキル

から成る群から選択される}

任意に、それらのラセミ酸塩、それらの光学異性体、それらのジアステレオマー又はそれらの混合物、

又は、それらの医薬として許容される塩又はエステル又はプロドラッグも好ましい。