

【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5月12日(2005.5.12)

【公表番号】特表2001-516338(P2001-516338A)

【公表日】平成13年9月25日(2001.9.25)

【出願番号】特願平10-515702

【国際特許分類第7版】

C 0 7 C 317/44

C 0 7 C 317/46

【F I】

C 0 7 C 317/44

C 0 7 C 317/46

【手続補正書】

【提出日】平成16年8月31日(2004.8.31)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】補正の内容のとおり

【補正方法】変更

【補正の内容】

## 手続補正書

平成16年 8月31日 

特許庁長官殿

## 1. 事件の表示

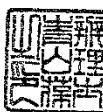
平成10年特許願第515702号

## 2. 補正をする者

氏名（名称） ファルマシア・アンド・アップジョン・カンパニー

## 3. 代理人

住所 〒540-0001  
 大阪府大阪市中央区城見1丁目3番7号 IMPビル  
 青山特許事務所  
 電話 06-6949-1261 FAX 06-6949-0361

氏名 弁理士 (6214) 青山 葵 

## 4. 補正対象書類名 請求の範囲

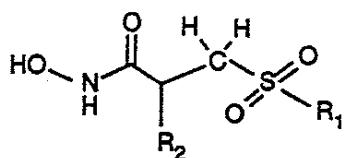
## 5. 補正対象項目名 請求の範囲

6. 補正の内容  
別紙のとおり。

(別紙)

## 請求の範囲

1. 式 I :



I

[式中

R<sub>1</sub>は

- a) C<sub>4-12</sub>アルキル、
- b) C<sub>4-12</sub>アルケニル、
- c) C<sub>4-12</sub>アルキニル、
- d) -(CH<sub>2</sub>)<sub>h</sub>-C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、
- e) -(CH<sub>2</sub>)<sub>h</sub>-アリール、
- f) C<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-CN  
または-N(C<sub>1-4</sub>アルキル)<sub>2</sub>で置換された-(CH<sub>2</sub>)<sub>h</sub>-アリール、
- g) -(CH<sub>2</sub>)<sub>h</sub>-het、または
- h) C<sub>1-4</sub>アルキルまたはハロで置換された-(CH<sub>2</sub>)<sub>h</sub>-hetであり；

R<sub>2</sub>は

- a) C<sub>1-12</sub>アルキル、
- b) 1~3のハロ、-CN、-NO<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-N(R<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>3</sub>または  
OHで置換されたC<sub>1-12</sub>アルキル、
- c) C<sub>2-12</sub>アルケニル、
- d) 1~3のハロ、-CN、-NO<sub>2</sub>または-CF<sub>3</sub>で置換されたC<sub>2-12</sub>アルケ  
ニル、

- e)  $C_{2-12}$ アルキニル、
- f) 1～3のハロ、-CN、-NO<sub>2</sub>または-CF<sub>3</sub>で置換された $C_{2-12}$ アルキニル、
- g) -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、
- h) 1～3のC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシまたはハロで置換された-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、
- i) -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-C<sub>3-8</sub>シクロアルケニル、
- j) 1～3のC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシまたはハロで置換された-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-C<sub>3-8</sub>シクロアルケニル、
- k) -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール、
- l) 1～3のC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、-CF<sub>3</sub>、-OH、-NO<sub>2</sub>、-CN、-N(R<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>3</sub>、-SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub>アルコキシ)、-C(=O)R<sub>3</sub>または-NC(=O)R<sub>3</sub>で置換された-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール、
- m) 1～5のハロで置換された-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール、
- n) -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-h e t、
- o) 1または2のC<sub>1-4</sub>アルキルまたはハロで置換された-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-h e t、
- p) -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-Q、
- q) 1～3のC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、ハロまたはフェニルで置換された-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-Q、
- r) 所望により-(CH<sub>2</sub>)<sub>i</sub>-鎖がC<sub>1-4</sub>アルキルまたはフェニルで置換されてもよく、これらの置換基が1～3のハロもしくはC<sub>1-4</sub>アルキルで置換されてもよい-(CH<sub>2</sub>)<sub>i</sub>-X-R<sub>4</sub>、または
- s) -(CH<sub>2</sub>)<sub>i</sub>CHR<sub>5</sub>R<sub>6</sub>であり；
- R<sub>3</sub>は
- a) H、
- b) C<sub>1-4</sub>アルキル、
- c) -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-フェニル、または
- d) 1～3のC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシまたはハロで置換された

$-(CH_2)_h$ -フェニルであり；

Xは

- a)  $-O-$ 、
- b)  $-S(=O)_j-$ 、
- c)  $-NR_7-$ 、
- d)  $-S(=O)_2NR_8-$ 、または
- e)  $-C(=O)-$ であり；

$R_4$ は

- a) H、
- b)  $C_{1-4}$ アルキル、
- c)  $-(CH_2)_h$ -フェニル、
- d) 1～3の $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、ハロ、 $-NO_2$ または $-CN$ で置換された $-(CH_2)_h$ -フェニル、または
- e)  $-(CH_2)_h-het$ であり；

$R_5$ は

- a)  $C_{1-4}$ アルキル、または
- b)  $-C(=O)R_3$ であり；

$R_6$ は

- a)  $-C(=O)R_3$ 、または
- b)  $-(CH_2)_hC(=O)R_3$ であり；

$R_7$ は

- a) H、
- b)  $C_{1-4}$ アルキル、
- c)  $-(CH_2)_h$ -フェニル、
- d) 1～3の $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシまたはハロで置換された $-(CH_2)_h$ -フェニル、
- e)  $-C(=O)-R_3$ 、
- f)  $-S(=O)_2R_3$ 、または

g)  $-C(=O)OR_3$  であり；

$R_3$  は

a)  $C_{1-4}$  アルキル、

b)  $-(CH_2)_h$  フェニル、または

c) 1～3 の  $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アルコキシまたはハロで置換された  
 $-(CH_2)_h$  フェニルであり；

ここに、アリールは炭素一環式または炭素二環式の芳香族基であり；

h e t は酸素、窒素および硫黄よりなる群から選択される 1～3 の原子を有する 5 員～10 員の不飽和複素環基であり；

Q は酸素、窒素および硫黄よりなる群から選択される 1 または 2 の原子を有する 5 員～10 員の飽和複素環基であり；

h は 0、1、2、3、4、5 または 6 であり；

i は 0、1、2、3、4、5、6、7、8、9 または 10 であって；

j は 0、1 または 2 である]

で示される化合物またはその医薬上許容される塩。

2.  $R_2$  が、

a) 1～3 のハロ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-N(R_3)_2$ 、 $-SR_3$  または  
 $OH$  で置換された  $C_{1-12}$  アルキル、

b)  $C_{2-12}$  アルケニル、

c) 1～3 のハロ、 $-CN$ 、 $-NO_2$  または  $-CF_3$  で置換された  $C_{2-12}$  アルケニル、

d)  $C_{2-12}$  アルキニル、

e) 1～3 のハロ、 $-CN$ 、 $-NO_2$  または  $-CF_3$  で置換された  $C_{2-12}$  アルキニル、

f) 1～3 の  $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アルコキシまたはハロで置換された  
 $-(CH_2)_h-C_{3-8}$  シクロアルキル、

g)  $-(CH_2)_h-C_{3-8}$  シクロアルケニル、

h) 1～3 の  $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アルコキシまたはハロで置換された

$-(CH_2)_h-C_{3-8}$ シクロアルケニル、

i) アリール、

j) 1~3のC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、-CF<sub>3</sub>、-OH、-NO<sub>2</sub>、-CN、-N(R<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>3</sub>、-SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub>アルコキシ)、-C(=O)R<sub>3</sub>または-N C(=O)R<sub>3</sub>で置換されたアリール、

k)  $-(CH_2)_h-het$ 、

l) 1または2のC<sub>1-4</sub>アルキルまたはハロで置換された $-(CH_2)_h-het$ 、

m)  $-(CH_2)_i-Q$ 、

n) 1~3のC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、ハロまたはフェニルで置換された $-(CH_2)_i-Q$ 、

o) 所望により $-(CH_2)_i$ -鎖がC<sub>1-4</sub>アルキルまたはフェニルで置換されてもよく、これらの置換基が1~3のハロもしくはC<sub>1-4</sub>アルキルで置換されてもよい $-(CH_2)_i-X-R_4$ 、または

p)  $-(CH_2)_h-CHR_5R_6$ であり；

R<sub>3</sub>、X、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、アリール、hetおよびQが請求項1の定義に同じであり；

hが0、1、2、3、4、5または6であって；

iが1、2、3、4、5または6である請求項1記載の式Iで示される化合物。

3. R<sub>2</sub>が

a)  $-(CH_2)_h-het$ 、

b) 1または2のC<sub>1-4</sub>アルキルまたはハロで置換された $-(CH_2)_h-het$ 、

c)  $-(CH_2)_i-Q$ 、

d) 1~3のC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、ハロまたはフェニルで置換された $-(CH_2)_i-Q$ 、または

e) 所望により $-(CH_2)_i$ -鎖がC<sub>1-4</sub>アルキルまたはフェニルで置換されてもよく、これらの置換基が1~3のハロもしくはC<sub>1-4</sub>アルキルで置換されてもよい $-(CH_2)_i-X-R_4$ であり；

X、R<sub>4</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、アリール、hetおよびQが請求項1の定義に同じであ

り；

hが0、1、2、3、4、5または6であって；

iが1、2、3、4、5または6である請求項1記載の式Iで示される化合物。

4.  $R_1$ が

a)  $C_{4-8}$ アルキル、

b)  $-(CH_2)_h$ -フェニル、または

c)  $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、フルオロ、クロロまたはブロモで置換された $-(CH_2)_h$ -フェニルであり；

$R_2$ が

a) 所望により1～3の $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、フェニル、フルオロ、クロロまたはブロモで置換されていてもよい $-(CH_2)_h$ -ピリジル、キノリニル、ピロリル、チエニルもしくはチアゾリルまたはインドリル；

b) 所望により1～3の $C_{1-4}$ アルキル、フェニル、フルオロ、クロロまたはブロモで置換されていてもよい $-(CH_2)_h$ -ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリノ、4-チオモルホリニル、ブチロラクタミル、2-オキソ-オキサゾリジニルまたは2,4-ジオキソ-イミダゾリジニル；または

c)  $-(CH_2)_i-X-R_4$ であり；

Xが

a)  $-S(=O)_j-$ であり；

$R_4$ が

a)  $C_{1-8}$ アルキル、

b) フェニル、または

c)  $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシもしくはハロで置換されたフェニルであり；

hが0、1、2、3、4、5または6であり；

iが1、2、3、4、5または6であって；

jが0、1または2である

請求項1記載の式Iで示される化合物。

5.  $R_1$ が、*n*-ブチル、イソブチル、1-メチルプロピル、*tert*-ブチル、*n*-ペンチル、3-メチルブチル、*n*-ヘキシル、*n*-ヘプチル、*n*-オクチル、フェニル、4-メチルフェニル、4-エチルフェニル、4-*tert*-ブチルフェニル、4-クロロフェニル、4-イソプロピルフェニル、4-ブロモフェニル、4-フルオロフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、4-メトキシフェニル、4-エトキシフェニル、4-*n*-ブトキシフェニル、ベンジル、4-フェニルベンジル、2-、3-もしくは4-フルオロベンジル、2-、3-、4-クロロベンジル、2-、3-、4-ブロモベンジルおよび4-エトキシベンジルよりなる群から選択される請求項1記載の化合物。

6.  $R_1$ が、*n*-ブチル、*n*-ペンチル、*n*-ヘキシル、*n*-ヘプチル、*n*-オクチル、フェニル、4-メチルフェニル、4-エチルフェニル、4-クロロフェニル、4-ブロモフェニル、4-フルオロフェニル、4-メトキシフェニル、4-*n*-ブトキシフェニル、ベンジル、4-フルオロベンジル、4-クロロベンジル、4-ブロモベンジルおよび4-エトキシベンジルよりなる群から選択される請求項1記載の化合物。

7.  $R_2$ が、メチル、1-シアノ-1-フェニルメチル、2-シアノエチル、2-フェニルエチル、2-ブロモ-2-フェニルエチル、2-ブロモエチル、プロピル、イソプロピル、3-クロロプロピル、3-ブロモプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、3-メチルブチル、1-メチルプロピル、*tert*-ブチル、*n*-ペンチル、3-メチルブチル、*n*-ヘキシル、*n*-ヘプチル、*n*-オクチル、*n*-ヘキサデシル、*n*-オクタデシル、2-プロペニル、2-プロピニル、3-ブテニル、4-ペンテニル、3-ブテニニル、4-ペンテニニル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘキシルメチル、2-シクロヘキシルエチル、4-シクロヘキシルブチル、ジメチルアミノエチル、ジメチルアミノプロピル、ジエチルアミノプロピル、フェニルアミノメチル、フェニル、4-メチルフェニル、4-クロロフェニル、4-ブロモフェニル、4-フルオロフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、2-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、4-ニトロフェニル、4-エトキシフェニル、ベンジル、4-メチルベンジル、2-フルオロ

ベンジル、3-フルオロベンジル、4-フルオロベンジル、2-クロロベンジル、3-クロロベンジル、4-クロロベンジル、2-ブロモベンジル、3-ブロモベンジル、4-ブロモベンジルおよび2-メチルベンジル、3-メチルベンジル、4-メチルベンジル、4-エトキシベンジル、4-ニトロベンジル、メチルカルボニル、1-メチルカルボニル メチル、2-フェニルカルボニル エチル、イソプロピルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、1, 1-エトキシカルボニル メチル、2, 2-エトキシカルボニル エチル、1, 2-エトキシカルボニル エチル、2-メトキシカルボニル プロピル、3-メトキシカルボニル プロピル、1-エトキシカルボニル メチル、1-エトキシカルボニル エチル、フェニルカルボニル、フェニルカルボニル メチル、ピリジルカルボニル メチル、ピリジルメチル、ピリジルエチル、キノリニルメチル、ピロリル メチル、インドリル メチル、チエニル、チアゾリル、チエニルメチル、チエニルエチル、ピペリジニル メチル、ピペラジニル メチル、モルホリノ メチル、モルホリノ エチル、モルホリノ プロピル、チオモルホリノ メチル、チオモルホリノ プロピル、4-メトキシベンゼンスルホニル メチル、3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)アミノ プロピル、3-ヒドロキシ、アミノ、3-フェノキシ プロピル、2-フェニル エチルオキシ、(4-ブロモベンゼンスルホニル)メチル、メチル-3-(1, 5, 5-トリメチルヒダントイン)、メチル-3-(1-ブチル-5, 5-ジメチルヒダントイン)、(4-メトキシベンゼンスルホニル)メチル、(4-クロロベンゼンスルホニル)メチル、(4-ブロモベンゼンスルホニル)メチル、(n-ブチルスルホニル)メチル、(n-オクチルスルホニル)メチル、3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)プロピル、(4-メチルベンゼンスルホニル)メチル、(ベンゼンスルホニル)メチル、メチル-3-(1-メチルヒダントイン)、メチル-3-(1-ブチルヒダントイン)およびメチル-3-(5, 5-ジメチルヒダントイン)よりなる群から選択される請求項1記載の化合物。

8.  $R_2$ が、(4-メトキシベンゼンスルホニル)メチル、(4-クロロベンゼンスルホニル)メチル、(4-ブロモベンゼンスルホニル)メチル、(n-ブチルスルホニル)メチル、(n-オクチルスルホニル)メチル、3-(4-メトキシベンゼン

スルホニル)プロピル、(4-メチルベンゼンゼンスルホニル)メチル、(ベンゼンスルホニル)メチル、メチル-3-(1-メチルヒダントイン)、メチル-3-(1-ブチルヒダントイン)およびメチル-3-(5,5-ジメチルヒダントイン)よりなる群から選択される請求項1記載の化合物。

- 9.(1)  $N$ -ヒドロキシ-2-[ $(4$ -メトキシベンゼンゼンスルホニル)メチル]-3-フェニループロピオニアミド、
- (2)  $N$ -ヒドロキシ-2-[ $(\text{ベンゼンスルホニル})\text{メチル}$ ]-3-フェニループロピオニアミド、
- (3)  $N$ -ヒドロキシ-2-[ $(\text{ベンゼンスルホニル})\text{メチル}$ ]-プロピオニアミド、
- (4)  $N$ -ヒドロキシ-2-[ $(4$ -メトキシベンゼンゼンスルホニル)メチル]-3-(4-メトキシベンゼンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、
- (5)  $N$ -ヒドロキシ-2-[ $(4$ -クロロベンゼンゼンスルホニル)メチル]-3-(4-クロロベンゼンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、
- (6)  $N$ -ヒドロキシ-2-[ $(4$ -ブロモベンゼンゼンスルホニル)メチル]-3-(4-ブロモベンゼンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、
- (7)  $N$ -ヒドロキシ-2-[ $(n$ -ブチルスルホニル)メチル]-3-( $n$ -ブチルスルホニル)-プロピオニアミド、
- (8)  $N$ -ヒドロキシ-2-[ $(n$ -オクチルスルホニル)メチル]-3-( $n$ -オクチルスルホニル)-プロピオニアミド、
- (9)  $N$ -ヒドロキシ-2-[ $(4$ -メチルベンゼンゼンスルホニル)メチル]-3-(4-メチルベンゼンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、
- (10)  $N$ -ヒドロキシ-2-[ $(\text{ベンゼンスルホニル})\text{メチル}$ ]-3-(ベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、
- (11)  $N$ -ヒドロキシ-2-[ $(4$ -メトキシベンゼンゼンスルホニル)メチル]-5-(4-メトキシベンゼンゼンスルホニル)-ペンタニアミド、
- (12)  $N$ -ヒドロキシ-2-[ $(n$ -オクチルスルホニル)メチル]-3-(4-メトキシベンゼンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、
- (13)  $N$ -ヒドロキシ-2-[メチル-3-(1-メチルヒダントイン)]-3-

(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、

(14)  $N$ -ヒドロキシ-2-[メチル-3-(1-ブチルヒダントイン)]-3-

(4-ブトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、

(15)  $N$ -ヒドロキシ-2-[メチル-3-(1-ブチルヒダントイン)]-3-

(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、

(16)  $N$ -ヒドロキシ-2-[メチル-3-(5,5-ジメチルヒダントイン)]

-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、

(17)(+)- $N$ -ヒドロキシ-2-[ $(n$ -オクチルスルホニル)メチル]-3-

(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、

(18)(-)- $N$ -ヒドロキシ-2-[ $(n$ -オクチルスルホニル)メチル]-3-

(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、

(19)(+)- $N$ -ヒドロキシ-2-[メチル-3-(1-メチルヒダントイン)]

-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、

(20)(-)- $N$ -ヒドロキシ-2-[メチル-3-(1-メチルヒダントイン)]

-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、

(21)(+)- $N$ -ヒドロキシ-2-[メチル-3-(1-ブチルヒダントイン)]

-3-(4-ブトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、

(22)(-)- $N$ -ヒドロキシ-2-[メチル-3-(1-ブチルヒダントイン)]

-3-(4-ブトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、

(23)(+)- $N$ -ヒドロキシ-2-[メチル-3-(1-ブチルヒダントイン)]

-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、

(24)(-)- $N$ -ヒドロキシ-2-[メチル-3-(1-ブチルヒダントイン)]

-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、

(25)(+)- $N$ -ヒドロキシ-2-[メチル-3-(5,5-ジメチルヒダント  
イン)]-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、または

(26)(-)- $N$ -ヒドロキシ-2-[メチル-3-(5,5-ジメチルヒダント  
イン)]-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミドである請求

項1記載の化合物。

10. (1) *N*-ヒドロキシ-2-[(4-メトキシベンゼンスルホニル)メチル]-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、  
 (2) *N*-ヒドロキシ-2-[(4-クロロベンゼンスルホニル)メチル]-3-(4-クロロベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、  
 (3) *N*-ヒドロキシ-2-[(4-プロモベンゼンスルホニル)メチル]-3-(4-プロモベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、  
 (4) *N*-ヒドロキシ-2-[(*n*-ブチルスルホニル)メチル]-3-(*n*-ブチルスルホニル)-プロピオニアミド、  
 (5) *N*-ヒドロキシ-2-[(*n*-オクチルスルホニル)メチル]-3-(*n*-オクチルスルホニル)-プロピオニアミド、  
 (6) *N*-ヒドロキシ-2-[(4-メチルベンゼンスルホニル)メチル]-3-(4-メチルベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、  
 (7) *N*-ヒドロキシ-2-[(ベンゼンスルホニル)メチル]-3-(ベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、  
 (8) *N*-ヒドロキシ-2-[(4-メトキシベンゼンスルホニル)メチル]-5-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-ペンタニアミド、  
 (9) *N*-ヒドロキシ-2-[(*n*-オクチルスルホニル)メチル]-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、  
 (10) *N*-ヒドロキシ-2-[メチル-3-(1-メチルヒダントイン)]-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、  
 (11) *N*-ヒドロキシ-2-[メチル-3-(1-ブチルヒダントイン)]-3-(4-ブトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、  
 (12) *N*-ヒドロキシ-2-[メチル-3-(1-ブチルヒダントイン)]-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、  
 (13) *N*-ヒドロキシ-2-[メチル-3-(5,5-ジメチルヒダントイン)]-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、  
 (14) (+)-*N*-ヒドロキシ-2-[(*n*-オクチルスルホニル)メチル]-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオニアミド、

- (15)(-)-*N*-ヒドロキシ-2-[(*n*-オクチルスルホニル)メチル]-3-  
(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオンアミド、
- (16)(+)-*N*-ヒドロキシ-2-[メチル-3-(1-メチルヒダントイン)]  
-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオンアミド、
- (17)(-)-*N*-ヒドロキシ-2-[メチル-3-(1-メチルヒダントイン)]  
-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオンアミド、
- (18)(+)-*N*-ヒドロキシ-2-[メチル-3-(1-ブチルヒダントイン)]  
-3-(4-ブトキシベンゼンスルホニル)-プロピオンアミド、
- (19)(-)-*N*-ヒドロキシ-2-[メチル-3-(1-ブチルヒダントイン)]  
-3-(4-ブトキシベンゼンスルホニル)-プロピオンアミド、
- (20)(+)-*N*-ヒドロキシ-2-[メチル-3-(1-ブチルヒダントイン)]  
-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオンアミド、
- (21)(-)-*N*-ヒドロキシ-2-[メチル-3-(1-ブチルヒダントイン)]  
-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオンアミド、
- (22)(+)-*N*-ヒドロキシ-2-[メチル-3-(5,5-ジメチルヒダント  
イン)]-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオンアミド、または
- (23)(-)-*N*-ヒドロキシ-2-[メチル-3-(5,5-ジメチルヒダント  
イン)]-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオンアミドである請求  
項1記載の化合物。

11. 有効量の請求項1記載の化合物と医薬上許容される担体とを含む、それを必要とする患者における過剰なマトリックスメタロプロテイナーゼを阻害するための医薬組成物。

12. マトリックスメタロプロテイナーゼがストロメリシン、コラゲナーゼおよびゼラチナーゼを含む請求項11記載の医薬組成物。

13. 有効量の請求項1記載の化合物と医薬上許容される担体とを含む、それを必要とする患者における結合組織分解が関与する疾病を治療するための医薬組成物。

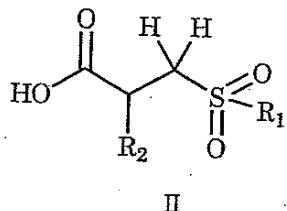
14. 結合組織分解に関する疾病が、変形性関節症、慢性関節リウマチ、敗血性関節炎、および骨粗鬆症のごときオステオペニア、(浸潤性または増殖性の)腫瘍転移、歯周炎、歯肉炎、角膜表皮性潰瘍、または胃潰瘍である請求項13記載の医薬組成物。

15. 有効量の請求項1記載の化合物が、医薬組成物中で経口、非経口または局所投与される請求項11記載の医薬組成物。

16. 有効量の請求項1記載の化合物が、医薬組成物中で経口、非経口または局所投与される請求項13記載の医薬組成物。

17. 該化合物が、約0.1～約100mg/kg体重/日の量で投与される請求項11または13記載の医薬組成物。

18. 式II:



[式中、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は請求項1記載の式Iの定義に同じ]  
で示される化合物。