

【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 F A X 06-6949-0361

氏名

弁理士 (6214) 青山 葆



4. 補正対象書類名 請求の範囲

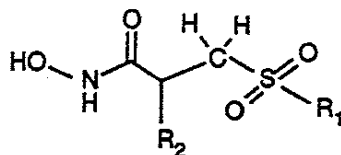
5. 補正対象項目名 請求の範囲

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_1 は

- a) C_{4-12} アルキル、
- b) C_{4-12} アルケニル、
- c) C_{4-12} アルキニル、
- d) $-(CH_2)_h-C_{3-8}$ シクロアルキル、
- e) $-(CH_2)_h$ -アリール、
- f) C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$
または $-N(C_{1-4}アルキル)_2$ で置換された $-(CH_2)_h$ -アリール、
- g) $-(CH_2)_h-het$ 、または
- h) C_{1-4} アルキルまたはハロで置換された $-(CH_2)_h-het$ であり；

 R_2 は

- a) C_{1-12} アルキル、
- b) 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、
- c) C_{2-12} アルケニル、
- d) 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、

- e) C_{2-12} アルキニル、
 - f) 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、
 - g) $-(CH_2)_h-C_{3-8}$ シクロアルキル、
 - 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 $-(CH_2)_h-C_{3-8}$ シクロアルキル、
 - i) $-(CH_2)_h-C_{3-8}$ シクロアルケニル、
 - j) 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、
 - k) $-(CH_2)_h$ -アリール、
 - l) 1～3の C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 $-CF_3$ 、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N(R_3)_2$ 、 $-SR_3$ 、 $-SO_2(C_{1-4}$ アルコキシ)、 $-C(=O)R_3$ または $-NC(=O)R_3$ で置換された $-(CH_2)_h$ -アリール、
 - m) 1～5のハロで置換された $-(CH_2)_h$ -アリール、
 - n) $-(CH_2)_h$ -het、
 - o) 1または2の C_{1-4} アルキルまたはハロで置換された $-(CH_2)_h$ -het、
 - p) $-(CH_2)_h-Q$ 、
 - q) 1～3の C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ハロまたはフェニルで置換された $-(CH_2)_h-Q$ 、
 - r) 所望により $-(CH_2)_i$ -鎖が C_{1-4} アルキルまたはフェニルで置換されていてもよく、これらの置換基が1～3のハロもしくは C_{1-4} アルキルで置換されていてもよい $-(CH_2)_i-X-R_4$ 、または
 - s) $-(CH_2)_i-CHR_5R_6$ であり；
- R_3 は
- a) H、
 - b) C_{1-4} アルキル、
 - c) $-(CH_2)_h$ -フェニル、または
 - 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

—(CH₂)_h—C₃₋₈シクロアルケニル、

i) アリール、

j) 1～3のC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、—CF₃、—OH、—NO₂、
—CN、—N(R₃)₂、—SR₃、—SO₂(C₁₋₄アルコキシ)、—C(=O)R₃
または—NC(=O)R₃で置換されたアリール、

k) —(CH₂)_h—h e t、

l) 1または2のC₁₋₄アルキルまたはハロで置換された—(CH₂)_h—h e t、

m) —(CH₂)_i—Q、

n) 1～3のC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、ハロまたはフェニルで置換された—(CH₂)_i—Q、

o) 所望により—(CH₂)_i—鎖がC₁₋₄アルキルまたはフェニルで置換されていてもよく、これらの置換基が1～3のハロもしくはC₁₋₄アルキルで置換されていてもよい—(CH₂)_i—X—R₄、または

p) —(CH₂)_hCHR₅R₆であり；

R₃、X、R₄、R₅、R₆、R₇、R₈、アリール、h e t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. R₂が

a) —(CH₂)_h—h e t、

b) 1または2のC₁₋₄アルキルまたはハロで置換された—(CH₂)_h—h e t、

c) —(CH₂)_i—Q、

d) 1～3のC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、ハロまたはフェニルで置換された—(CH₂)_i—Q、または

e) 所望により—(CH₂)_i—鎖がC₁₋₄アルキルまたはフェニルで置換されていてもよく、これらの置換基が1～3のハロもしくはC₁₋₄アルキルで置換されていてもよい—(CH₂)_i—X—R₄であり；

X、R₄、R₇、R₈、アリール、h e t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-ブテニル、4-ペンテニル、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、ピリジリエチル、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、チエニリエチル、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-ブトキシベンゼンスルホニル)メチル、メチルー3-(1,5,5-トリメチルヒダントイン)、メチルー3-(1-ブチルー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、メチルー3-(1-メチルヒダントイン)、メチルー3-(1-ブチルヒダントイン)およびメチルー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-メトキシベンゼンスルホニル)メチル]-3-フェニル-プロピオンアミド、

(2) *N*-ヒドロキシ 2-[(ベンゼンスルホニル)メチル]-3-フェニル-プロピオンアミド、

(3) *N*-ヒドロキシ 2-[(ベンゼンスルホニル)メチル]-プロピオンアミド、

(4) *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)-プロピオンアミド、

(5) *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)-プロピオンアミド、

(6) *N*-ヒドロキシ-2-[(4-ブromoベンゼンスルホニル)メチル]-3-(4-ブromoベンゼンスルホニル)-プロピオンアミド、

(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)-プロピオンアミド、

(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)-プロピオンアミド、

(9) *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)-プロピオンアミド、

(10) *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)-プロピオンアミド、

(11) *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)-ペンタンアミド、

(12) *N*-ヒドロキシ-2-[(*n*-オクチルスルホニル)メチル]-3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)-プロピオンアミド、

(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)-プロピオンアミド、

(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)-プロピオンアミド、

(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)-プロピオンアミド、

(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)-プロピオンアミド、

(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)-プロピオンアミド、

(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)-プロピオンアミド、

(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)-プロピオンアミド、

(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-ブ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-(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、

(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)-プロピオンアミド、

(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)-プロピオンアミド、

(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)-プロピオンアミド、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)-プロピオン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)-プロピオンアミド、
- (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)-プロピオンアミド、
- (3) *N*-ヒドロキシ-2-[(4-ブromoベンゼンスルホニル)メチル]-3-(4-ブromoベンゼンスルホニル)-プロピオンアミド、
- (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)-プロピオンアミド、
- (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)-プロピオンアミド、
- (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)-プロピオンアミド、
- (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)-プロピオンアミド、
- (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)-ペンタンアミド、
- (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)-プロピオンアミド、
- (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)-プロピオンアミド、
- (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)-プロピオンアミド、
- (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)-プロピオンアミド、
- (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)-プロピオンアミド、
- (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)-プロピオンアミド、

(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。

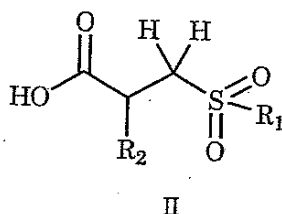
14. 結合組織分解に関係する疾病が、変形性関節症、慢性関節リウマチ、敗血性関節炎、および骨粗鬆症のごときオステオペニア、(浸潤性または増殖性の)腫瘍転移、歯周炎、歯肉炎、角膜表皮性潰瘍、または胃潰瘍である請求項13記載の医薬組成物。

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_1 および R_2 は請求項1記載の式Iの定義に同じ]
で示される化合物。