

【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20年3月21日(2008.3.21)

【公表番号】特表2003-520271(P2003-520271A)

【公表日】平成15年7月2日(2003.7.2)

【出願番号】特願2001-553266(P2001-553266)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/42 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/4985 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/5383 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 239/48 (2006.01)

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/06 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 498/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 239/42 Z

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/4985

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/5383

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 31/551

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 9/08

A 6 1 P 9/10 1 0 1

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 35/04
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 C 0 7 D 239/48
 C 0 7 D 401/06
 C 0 7 D 401/12
 C 0 7 D 403/12
 C 0 7 D 405/06
 C 0 7 D 471/04 1 0 4 A
 C 0 7 D 471/04 1 2 0
 C 0 7 D 471/04 1 2 1
 C 0 7 D 498/04 1 1 2 Q

【手続補正書】

【提出日】平成20年1月18日(2008.1.18)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

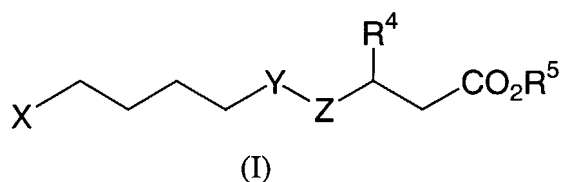
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記式(I)の化合物あるいは該化合物の製薬上許容される塩。

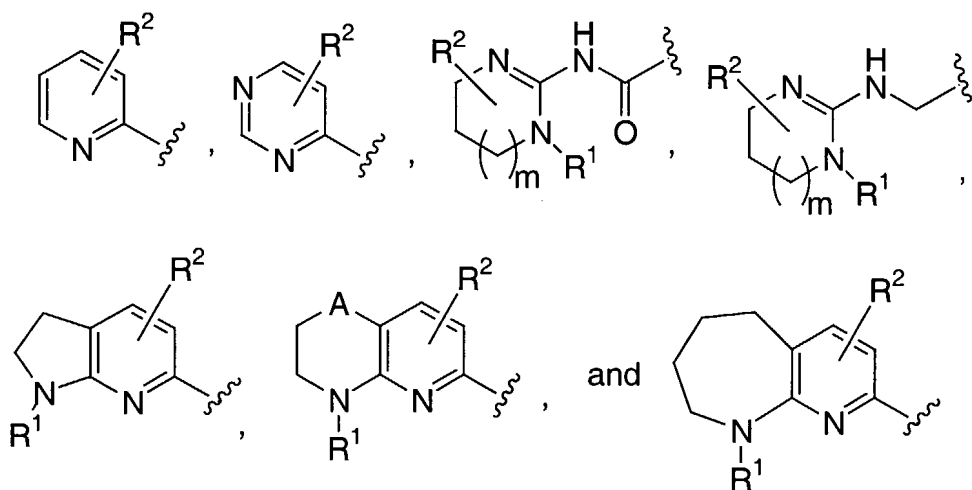
【化1】



[式中、

Xは、

【化2】



からなる群から選択され；

Y - Z は、 $-CH_2CH_2-$ または $-CONR^3-$ であり；

A は O または NR^1 であり；

m は 0 または 1 であり；

R^1 は、水素または C_{1-3} アルキルであり；

各非芳香環炭素原子は、未置換であるか、あるいは 1 個もしくは 2 個の R^2 置換基で独立に置換されており；各芳香環炭素原子は、未置換であるか、あるいは C_{1-8} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{3-8} シクロヘテロアルキル、 C_{3-8} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} シクロヘテロアルキル - C_{1-6} アルキル、アリール、アリール - C_{1-6} アルキル、アミノ、アミノ - C_{1-6} アルキル、 C_{1-3} アシルアミノ、 C_{1-3} アシルアミノ - C_{1-6} アルキル、(C_{1-6} アルキル) $_{1-2}$ アミノ、 C_{3-6} シクロアルキル - C_{0-2} アミノ、(C_{1-6} アルキル) $_{1-2}$ アミノ - C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ - C_{1-6} アルキル、ヒドロキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル - C_{1-6} アルキル、 C_{1-3} アルコキシカルボニル、 C_{1-3} アルコキシカルボニル - C_{1-6} アルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロエトキシ、 C_{1-8} アルキル - $S(O)_{0-2}$ 、(C_{1-8} アルキル) $_{0-2}$ アミノカルボニル、 C_{1-8} アルキルオキシカルボニルアミノ、(C_{1-8} アルキル) $_{1-2}$ アミノカルボニルオキシ、(アリール C_{1-3} アルキル) $_{1-2}$ アミノ、(アリール) $_{1-2}$ アミノ、アリール - C_{1-3} アルキルスルホニルアミノおよび C_{1-8} アルキルスルホニルアミノからなる群から選択される 1 個の R^2 置換基で独立に置換されており；

あるいは同一の非芳香族炭素原子上にある場合に、2 個の R^2 置換基が、それらが結合している炭素原子と一体となって、カルボニル基を形成しており；あるいは 2 個の R^2 置換基が、それらが結合している炭素原子と一体となって、3 ~ 6 員の飽和スピロ炭素環を形成しており；

R^3 は、水素または C_{1-4} アルキルであり；

R^4 は、アリールであって、そのアリール基が

- (1) フェニル、
- (2) ナフチル、
- (3) ピリジニル、
- (4) フリル、
- (5) チエニル、
- (6) ピロリル、
- (7) オキサゾリル、
- (8) チアゾリル、
- (9) イミダゾリル、
- (10) ピラゾリル、
- (11) イソオキサゾリル、
- (12) イソチアゾリル、
- (13) ピリミジニル、
- (14) ピラジニル、
- (15) ピリダジニル、
- (16) キノリル、
- (17) イソキノリル、
- (18) ベンズイミダゾリル、
- (19) ベンゾフリル、
- (20) ベンゾチエニル、
- (21) インドリル、
- (22) ベンゾチアゾリル、
- (23) ベンゾオキサゾリル、
- (24) ジヒドロベンゾフリル、

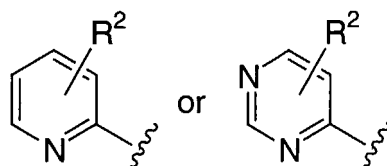
- (2 5) ベンゾ (1 , 3) ジオキソラニル、
 (2 6) ベンゾ (1 , 4) ジオキソラニルおよび
 (2 7) キノキサリニル

からなる群から選択されるもの；ならびにモノ、ジおよびトリ置換アリアルであって、前記置換基が独立に、水素、ヒドロキシ、ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル、ハロゲン、 C_{1-8} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、アリール、アリール C_{1-3} アルキル、アミノ、アミノ C_{1-6} アルキル、 C_{1-3} アシルアミノ、 C_{1-3} アシルアミノ - C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルキルアミノ、ジ (C_{1-6}) アルキルアミノ、 C_{1-6} アルキルアミノ - C_{1-6} アルキル、ジ (C_{1-6}) アルキルアミノ - C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルチオ、 C_{1-4} アルキルスルフィニル、 C_{1-4} アルキルスルホニル、 C_{1-4} アルコキシ - C_{1-6} アルキル、ヒドロキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル - C_{1-6} アルキル、 C_{1-5} アルコキシカルボニル、 C_{1-3} アルコキシカルボニル - C_{1-6} アルキル、 C_{1-5} アルキルカルボニルオキシ、シアノ、トリフルオロメチル、1, 1, 1 - トリフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロエトキシまたはニトロであり、あるいは2個の隣接する置換基が、それらが結合している炭素原子と一体となって、N、OおよびSからなる群から選択される1個もしくは2個のヘテロ原子を有する5員もしくは6員の飽和もしくは不飽和環を形成しており、環炭素原子がオキソまたは C_{1-3} アルキルで置換されていてもよいものであり；

R^5 は、水素または C_{1-3} アルキルである。]

【請求項2】 Xが

【化3】



からなる群から選択され；

Yが - CH_2CH_2 - であり；

R^2 、 R^4 および R^5 が請求項1で定義の通りである請求項1に記載の化合物。

【請求項3】 R^4 がモノもしくはジ置換された

フェニル、

ピリジニル、

キノリル、

ピリミジニル、

ピラジニル、

キノキサリニルもしくは

ジヒドロベンゾフリルであり；

前記置換基が独立に、水素、ヒドロキシ、ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル、ハロゲン、 C_{1-8} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、アリール、アリール C_{1-3} アルキル、アミノ、アミノ - C_{1-6} アルキル、 C_{1-3} アシルアミノ、 C_{1-3} アシルアミノ - C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルキルアミノ、ジ (C_{1-6}) アルキルアミノ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルキル、ジ (C_{1-6}) アルキルアミノ - C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルチオ、 C_{1-4} アルキルスルフィニル、 C_{1-4} アルキルスルホニル、 C_{1-4} アルコキシ - C_{1-6} アルキル、ヒドロキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル - C_{1-6} アルキル、 C_{1-5} アルコキシカルボニル、 C_{1-3} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキル、 C_{1-5} アルキルカルボニルオキシ、シアノ、トリフルオロメチル、1, 1, 1 - トリフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロ

エトキシまたはニトロであるか；あるいは2個の隣接する置換基が、それらが結合している炭素原子と一体となって、N、OおよびSからなる群から選択される1個もしくは2個のヘテロ原子を有する5員もしくは6員の飽和もしくは不飽和環を形成しており；環炭素原子はオキソまたはC₁₋₃アルキルで置換されていても良い請求項2に記載の化合物。

【請求項4】 R⁴が、モノもしくはジ置換された

ピリジニル、

キノリル、

ピリミジニル、

ピラジニル、

キノキサリニルまたは

ジヒドロベンゾフリルであり；

前記置換基が独立に、水素、ハロゲン、フェニル、C₁₋₄アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₁₋₃アルコキシ、アミノ、C₁₋₃アルキルアミノ、ジ(C₁₋₃)アルキルアミノ、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、1, 1, 1-トリフルオロエチル、トリフルオロメトキシまたはトリフルオロエトキシである請求項3に記載の化合物。

【請求項5】 R²が、

水素、

アミノ、

C₁₋₄アルキルアミノ、

C₃₋₆シクロアルキル-C₀₋₂アルキルアミノ、

シアノ、

C₁₋₄アルキル、

シクロプロピル、

アリールC₁₋₃アルキル、

C₁₋₄アシルアミノ、

C₁₋₄アルコキシ、

C₁₋₄アルキルチオ、

アミノカルボニル、

(C₁₋₆アルキル)₁₋₂アミノカルボニル、

C₁₋₄アルコキシカルボニル、

トリフルオロメチルおよび

トリフルオロメトキシ

からなる群から選択される請求項4に記載の化合物。

【請求項6】 R²が、

水素、

アミノ、

C₁₋₃アルキルアミノ、

C₃₋₆シクロアルキルメチルアミノ、

C₁₋₄アルキル、

シクロプロピル、

トリフルオロメチルおよび

トリフルオロメトキシ

からなる群から選択される請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

{ [5 - (2 , 4 - ジアミノピリミジン - 6 - イル) ペンタノイル] - (N - メチル) アミノ } - 3 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - プロパン酸；

{ [5 - (2 , 4 - ジアミノピリミジン - 6 - イル) ペンタノイル] - (N - メチル) アミノ - 3 (R) - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - プロパン酸；

{ [5 - (2 , 4 - ジアミノピリミジン - 6 - イル) ペンタノイル] - (N - メチル) アミノ - 3 (S) - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - プロパン酸；

{ [5 - (3 - アミノ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル) ペンタノイル] - (N - メチル) アミノ } - 3 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - プロパン酸 ;

{ [5 - (3 - アミノ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル) ペンタノイル] - (N - メチル) アミノ } - 3 (R) (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - プロパン酸 ;

{ [5 - (3 - アミノ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル) ペンタノイル] - (N - メチル) アミノ } - 3 (S) (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - プロパン酸 ;

3 - (5 - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 6 - イル - ペンタノイルアミノ) - 3 - (キノリン - 3 - イル) - プロピオン酸 ;

3 - (5 - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 6 - イル - ペンタノイルアミノ) - 3 (R) - (キノリン - 3 - イル) - プロピオン酸 ;

3 - (5 - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 6 - イル - ペンタノイルアミノ) - 3 (S) - (キノリン - 3 - イル) - プロピオン酸 ;

3 - (キノリン - 3 - イル) - 3 - (5 - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン - 6 - イル - ペンタノイルアミノ) - プロピオン酸 ;

3 (R) - (キノリン - 3 - イル) - 3 - (5 - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン - 6 - イル - ペンタノイルアミノ) - プロピオン酸 ;

3 (S) - (キノリン - 3 - イル) - 3 - (5 - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン - 6 - イル - ペンタノイルアミノ) - プロピオン酸 ;

9 - (6 - メチルアミノ - ピリジン - 2 - イル) - 3 - (ピリミジン - 5 - イル) - ノナン酸 ;

9 - (6 - メチルアミノ - ピリジン - 2 - イル) - 3 (R) - (ピリミジン - 5 - イル) - ノナン酸 ;

9 - (6 - メチルアミノ - ピリジン - 2 - イル) - 3 (S) - (ピリミジン - 5 - イル) - ノナン酸 ;

9 - (2 , 4 - ジアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 - (キノリン - 3 - イル) - ノナン酸 ;

9 - (2 , 4 - ジアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (R) - (キノリン - 3 - イル) - ノナン酸 ;

9 - (2 , 4 - ジアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (S) - (キノリン - 3 - イル) - ノナン酸 ;

3 (2 - メチル - ピリミジン - 5 - イル) - 9 - (6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリド [2 , 3 - b] アゼピン - 2 - イル) - ノナン酸 ;

3 (R) - (2 - メチル - ピリミジン - 5 - イル) - 9 - (6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリド [2 , 3 - b] アゼピン - 2 - イル) - ノナン酸 ;

3 (S) - (2 - メチル - ピリミジン - 5 - イル) - 9 - (6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリド [2 , 3 - b] アゼピン - 2 - イル) - ノナン酸 ;

3 - ピリミジン - 5 - イル - 9 - (6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリド [2 , 3 - b] アゼピン - 2 - イル) - ノナン酸 ;

3 (R) - ピリミジン - 5 - イル - 9 - (6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリド [2 , 3 - b] アゼピン - 2 - イル) - ノナン酸 ;

3 (S) - ピリミジン - 5 - イル - 9 - (6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリド [2 , 3 - b] アゼピン - 2 - イル) - ノナン酸 ;

(2 - メチル - ピリミジン - 5 - イル) - 9 - (1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 2 - イルカルバモイル) - ノナン酸 ;

3 (R) - (2 - メチル - ピリミジン - 5 - イル) - 9 - (1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 2 - イルカルバモイル) - ノナン酸 ;

3 (S) - (2 - メチル - ピリミジン - 5 - イル) - 9 - (1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒ

[illegible]

リミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (4 - アミノ - 2 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (R) - (2 - メトキシピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (4 - アミノ - 2 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (S) - (2 - メトキシピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (4 - アミノ - 2 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 - (2 - エトキシピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (4 - アミノ - 2 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (R) - (2 - エトキシピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (4 - アミノ - 2 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (S) - (2 - エトキシピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (4 - アミノ - 2 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (4 - アミノ - 2 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (R) - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (4 - アミノ - 2 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (S) - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (4 - アミノ - 2 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 - (キノキサリン - 2 - イル) ノナン酸 ;

9 - (4 - アミノ - 2 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (R) - (キノキサリン - 2 - イル) ノナン酸 ;

9 - (4 - アミノ - 2 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (S) - (キノキサリン - 2 - イル) ノナン酸 ;

9 - (2 - アミノ - 4 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 - (2 - エトキシピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (2 - アミノ - 2 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (R) - (2 - エトキシピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (2 - アミノ - 4 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (S) - (2 - エトキシピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (4 - アミノ - 2 - アミノピリミジン - 6 - イル) - 3 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (4 - アミノ - 2 - アミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (R) - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (4 - アミノ - 2 - アミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (S) - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (2 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 - (2 - エトキシピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (2 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (R) - (2 - エトキシピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (2 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (S) - (2 - エトキシピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (6 - メチルアミノ - ピリジン - 2 - イル) - 3 - キノキサリン - 2 - イル - ノナン酸 ;

3 (R) - 9 - (6 - メチルアミノ - ピリジン - 2 - イル) - 3 - キノキサリン - 2 - イル - ノナン酸 ;

3 (S) - 9 - (6 - メチルアミノ - ピリジン - 2 - イル) - 3 - キノキサリン - 2 - イル - ノナン酸 ;

9 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [2 , 3 - b] ピリジン - 6 - イル) - 3 - (2 - メチル - ピリミジン - 5 - イル) - ノナン酸 ;

3 (R) - 9 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [2 , 3 - b] ピリジン - 6 - イル

) - 3 - (2 - メチル - ピリミジン - 5 - イル) - ノナン酸 ;
 3 (S) - 9 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [2 , 3 - b] ピリジン - 6 - イル) - 3 - (2 - メチル - ピリミジン - 5 - イル) - ノナン酸 ; および
 3 - (2 - メチル - ピリミジン - 5 - イル) - 10 - (1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 2 - イルアミノ) - デカン酸

からなる群から選択される請求項 1 に記載の化合物あるいは該化合物の製薬上許容される塩。

【請求項 8】

{ [5 - (2 , 4 - ジアミノピリミジン - 6 - イル) ペンタノイル] - (N - メチル) アミノ - 3 (R) - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - プロパン酸 ;
 { [5 - (2 , 4 - ジアミノピリミジン - 6 - イル) ペンタノイル] - (N - メチル) アミノ - 3 (S) - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - プロパン酸 ;
 { [5 - (3 - アミノ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル) ペンタノイル] - (N - メチル) アミノ } - 3 (R) (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - プロパン酸 ;
 { [5 - (3 - アミノ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル) ペンタノイル] - (N - メチル) アミノ } - 3 (S) (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - プロパン酸 ;
 3 - (5 - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 6 - イル - ペンタノイルアミノ) - 3 (R) - (キノリン - 3 - イル) - プロピオン酸 ;
 3 - (5 - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 6 - イル - ペンタノイルアミノ) - 3 (S) - (キノリン - 3 - イル) - プロピオン酸 ;
 3 (R) - (キノリン - 3 - イル) - 3 - (5 - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン - 6 - イル - ペンタノイルアミノ) - プロピオン酸 ;
 3 (S) - (キノリン - 3 - イル) - 3 - (5 - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン - 6 - イル - ペンタノイルアミノ) - プロピオン酸 ;
 9 - (6 - メチルアミノ - ピリジン - 2 - イル) - 3 (R) - (ピリミジン - 5 - イル) - ノナン酸 ;
 9 - (6 - メチルアミノ - ピリジン - 2 - イル) - 3 (S) - (ピリミジン - 5 - イル) - ノナン酸 ;
 9 - (2 , 4 - ジアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (R) - (キノリン - 3 - イル) - ノナン酸 ;
 9 - (2 , 4 - ジアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (S) - (キノリン - 3 - イル) - ノナン酸 ;
 3 (R) - (2 - メチル - ピリミジン - 5 - イル) - 9 - (6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリド [2 , 3 - b] アゼピン - 2 - イル) ノナン酸 ;
 3 (S) - (2 - メチル - ピリミジン - 5 - イル) - 9 - (6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリド [2 , 3 - b] アゼピン - 2 - イル) - ノナン酸 ;
 3 (R) - ピリミジン - 5 - イル - 9 - (6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリド [2 , 3 - b] アゼピン - 2 - イル) - ノナン酸 ;
 3 (S) - ピリミジン - 5 - イル - 9 - (6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリド [2 , 3 - b] アゼピン - 2 - イル) - ノナン酸 ;
 3 (R) - (2 - メチル - ピリミジン - 5 - イル) - 9 - (1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 2 - イルカルバモイル) ノナン酸 ;
 3 (S) - (2 - メチル - ピリミジン - 5 - イル) - 9 - (1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 2 - イルカルバモイル) ノナン酸 ;
 9 - (6 - メチルアミノ - ピリジン - 2 - イル) - 3 (R) - (2 - メチル - ピリミジン - 5 - イル) - ノナン酸 ;
 9 - (6 - メチルアミノ - ピリジン - 2 - イル) - 3 (S) - (2 - メチル - ピリミジン - 5 - イル) - ノナン酸 ;

9 - (4 - アミノ - 2 - アミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (R) - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (4 - アミノ - 2 - アミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (S) - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (2 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (R) - (2 - エトキシピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

9 - (2 - エチルアミノピリミジン - 6 - イル) - 3 (S) - (2 - エトキシピリミジン - 5 - イル) ノナン酸 ;

3 (R) - 9 - (6 - メチルアミノ - ピリジン - 2 - イル) - 3 - キノキサリン - 2 - イル - ノナン酸 ;

3 (S) - 9 - (6 - メチルアミノ - ピリジン - 2 - イル) - 3 - キノキサリン - 2 - イル - ノナン酸 ;

3 (R) - 9 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [2 , 3 - b] ピリジン - 6 - イル) - 3 - (2 - メチル - ピリミジン - 5 - イル) - ノナン酸 ; および

3 (S) - 9 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [2 , 3 - b] ピリジン - 6 - イル) - 3 - (2 - メチル - ピリミジン - 5 - イル) - ノナン酸

からなる群から選択される請求項 7 に記載の化合物あるいは該化合物の製薬上許容される塩。

【請求項 9】 請求項 1 に記載の化合物および製薬上許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 10】

a) 有機ビスホスホン酸化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくはエステル ;

b) エストロゲン受容体調節剤 ;

c) アンドロゲン受容体調節剤 ;

d) 細胞障害性薬剤 / 抗癌剤 ;

e) 基質金属プロテイナーゼ阻害剤 ;

f) 表皮由来、線維芽細胞由来または血小板由来の成長因子の阻害剤 ;

g) V E G F 阻害剤 ;

h) 成長因子または成長因子受容体に対する抗体 ;

i) F l k - 1 / K D R、F l t - 1、T c k / T i e - 2 または T i e - 1 の阻害剤 ;

j) カテプシン K 阻害剤 ;

k) 成長ホルモン分泌促進剤 ;

l) 破骨細胞プロトン A T P a s e 阻害薬 ;

m) ウロキナーゼプラスミノーゲン活性化物質 (u - P A) 阻害薬 ;

n) 腫瘍特異抗体 - インターロイキン - 2 融合蛋白 ;

o) H M G - C o A レダクターゼ阻害薬 ; および

p) ファルネシル蛋白トランスフェラーゼ阻害薬もしくはゲラニルゲラニルトランスフェラーゼ阻害薬またはファルネシル / ゲラニルゲラニルトランスフェラーゼ二重阻害薬 ;
ならびにそれらの混合物

からなる群から選択される有効成分をさらに含む請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 11】 前記有効成分が、

a) 有機ビスホスホン酸化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくはエステル ;

b) エストロゲン受容体調節剤 ;

c) アンドロゲン受容体調節剤 ;

d) カテプシン K 阻害剤 ;

e) H M G - C o A レダクターゼ阻害薬 ; および

f) 破骨細胞プロトン A T P a s e 阻害薬 ;

ならびにそれらの混合物からなる群から選択される請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】 前記有機ビスホスホン酸化合物またはその製薬上許容される塩も

しくはエステルが、アレンドロン酸モノナトリウム・3水和物である請求項11に記載の組成物。

【請求項13】 処置を必要とする哺乳動物において αv インテグリン受容体拮抗効果を誘発するための請求項9に記載の組成物。

【請求項14】 前記 αv インテグリン受容体拮抗効果が $\alpha v \beta 3$ 拮抗効果である請求項13に記載の組成物。

【請求項15】 前記 $\alpha v \beta 3$ 拮抗効果が、骨吸収、再狭窄、血管新生、糖尿病性網膜症、黄斑変性、炎症性関節炎、癌および転移性腫瘍成長の阻害からなる群から選択される請求項14に記載の組成物。

【請求項16】 前記 $\alpha v \beta 3$ 拮抗効果が骨吸収阻害である請求項15に記載の組成物。

【請求項17】 処置を必要とする哺乳動物において骨粗鬆症を治療または予防するための請求項9に記載の組成物。

【請求項18】 前記 αv インテグリン受容体拮抗効果が $\alpha v \beta 5$ 拮抗効果である請求項12に記載の組成物。

【請求項19】 前記 $\alpha v \beta 5$ 拮抗効果が、再狭窄、血管新生、糖尿病性網膜症、黄斑変性、炎症性関節炎、癌および転移性腫瘍成長の阻害からなる群から選択される請求項18に記載の組成物。

【請求項20】 前記 αv インテグリン受容体拮抗効果が $\alpha v \beta 3 / \alpha v \beta 5$ 二重拮抗効果である請求項13に記載の組成物。

【請求項21】 前記 $\alpha v \beta 3 / \alpha v \beta 5$ 二重拮抗効果が、骨吸収、再狭窄、血管新生、糖尿病性網膜症、黄斑変性、炎症性関節炎、癌および転移性腫瘍成長の阻害からなる群から選択される請求項20に記載の組成物。

【請求項22】 処置を必要とする哺乳動物において αv インテグリン受容体の拮抗が介在する状態を治療または予防するための請求項9に記載の組成物。

【請求項23】 処置を必要とする哺乳動物において転移性腫瘍成長を治療するための、放射線療法と併用される、請求項9に記載の組成物。