

【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12月2日(2005.12.2)

【公表番号】特表2001-517245(P2001-517245A)

【公表日】平成13年10月2日(2001.10.2)

【出願番号】特願平11-500938

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 217/26  
A 6 1 K 31/472  
A 6 1 K 38/00  
A 6 1 P 1/04  
A 6 1 P 9/10  
A 6 1 P 11/02  
A 6 1 P 11/06  
A 6 1 P 29/00  
C 0 7 K 5/078

【F I】

C 0 7 D 217/26  
A 6 1 K 31/472  
A 6 1 P 1/04  
A 6 1 P 9/10 1 0 1  
A 6 1 P 11/02  
A 6 1 P 11/06  
A 6 1 P 29/00  
C 0 7 K 5/078  
A 6 1 K 37/02

【手続補正書】

【提出日】平成17年4月6日(2005.4.6)

【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17年4月6日

特許庁長官 殿



1. 事件の表示 平成11年特許願第500938号

2. 補正をする者

名 称 メルク エンド カンパニー インコーポレーテッド

3. 代 理 人 東京都新宿区新宿1丁目1番11号 友泉新宿御苑ビル  
(郵便番号 160-0022) 電話 (03)3354-8623  
(6200) 弁理士 川 口 義 雄

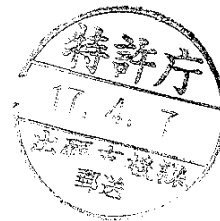


4. 補正命令の日付 自 発

5. 補正により増加する請求項の数 なし

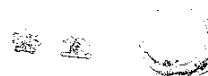
6. 補正対象書類名 請求の範囲

7. 補正対象項目名 請求の範囲



8. 補正の内容

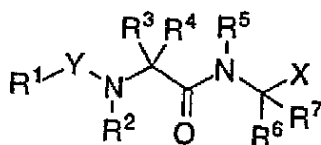
(1) 請求の範囲を別紙の通り補正する。



[別 紙]

請 求 の 範 囲

1. 下記式 I の化合物または該化合物の医薬的に許容される塩。



I

[式中、

R<sup>1</sup>は、

- 1) C<sub>1-10</sub>アルキル、
- 2) C<sub>2-10</sub>アルケニル、
- 3) C<sub>2-10</sub>アルキニル、
- 4) C<sub>y</sub>、
- 5) C<sub>y</sub>-C<sub>1-10</sub>アルキル、
- 6) C<sub>y</sub>-C<sub>2-10</sub>アルケニル、
- 7) C<sub>y</sub>-C<sub>2-10</sub>アルキニル

であり；

上記においてアルキル、アルケニルおよびアルキニルは、R<sup>a</sup>から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていても良く；C<sub>y</sub>は、R<sup>b</sup>から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていても良く；

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は独立に、

- 1) 水素または
- 2) R<sup>1</sup>から選択される基

であるか；あるいは

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>が、それらが結合している原子とともに、酸素、硫黄および窒素から独立に選択される0～2個の別のヘテロ原子を含む4～7員環を形成しており；該環は孤立しているかまたはベンゾ融合していることができ、R<sup>b</sup>から独立に

選択される 1～4 個の置換基で置換されていても良く；

$R^4$  および  $R^7$  は独立に、

- 1) 水素、
- 2)  $C_{1-10}$  アルキル、
- 3)  $C_{2-10}$  アルケニル、
- 4)  $C_{2-10}$  アルキニル、
- 5) アリール、
- 6) アリール  $C_{1-10}$  アルキル、
- 7) ヘテロアリールおよび
- 8) ヘテロアリール  $C_{1-10}$  アルキル

からなる群から選択され；

上記においてアルキル、アルケニルおよびアルキニルは、 $R^a$  から独立に選択される 1～4 個の置換基で置換されていても良く；アリールおよびヘテロアリールは、 $R^b$  から独立に選択される 1～4 個の置換基で置換されていても良いか；あるいは

$R^3$ 、 $R^4$  およびそれらが結合している炭素とが一体となって、N、O および S から選択される 0～2 個のヘテロ原子を含む 3～7 員環を形成しており；

$R^5$  は、

- 1) 水素、
- 2)  $R^a$  から独立に選択される 1～4 個の置換基で置換されていても良い  $C_{1-10}$  アルキルまたは

3)  $R^b$  から独立に選択される 1～4 個の置換基で置換されていても良い  $C_y$  であり；

$R^6$  は、

- 1)  $Ar^1 - Ar^2 - C_{1-10}$  アルキル、
- 2)  $Ar^1 - Ar^2 - C_{2-10}$  アルケニル、
- 3)  $Ar^1 - Ar^2 - C_{2-10}$  アルキニル

であり；

上記において、 $Ar^1$  および  $Ar^2$  は独立にアリールまたはヘテロアリールであ

り；該基はそれぞれ、 $R^b$ から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていても良く；アルキル、アルケニルおよびアルキニルは、 $R^a$ から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていても良く；

$R^a$ は、

- 1)  $C_y$ 、
- 2)  $-OR^d$ 、
- 3)  $-NO_2$ 、
- 4) ハロゲン、
- 5)  $-S(O)_m R^d$ 、
- 6)  $-SR^d$ 、
- 7)  $-S(O)_2 OR^d$ 、
- 8)  $-S(O)_m NR^d R^e$ 、
- 9)  $-NR^d R^e$ 、
- 10)  $-O(CR^f R^g)_n NR^d R^e$ 、
- 11)  $-C(O) R^d$ 、
- 12)  $-CO_2 R^d$ 、
- 13)  $-CO_2(CR^f R^g)_n CONR^d R^e$ 、
- 14)  $-OC(O) R^d$ 、
- 15)  $-CN$ 、
- 16)  $-C(O) NR^d R^e$ 、
- 17)  $-NR^d C(O) R^e$ 、
- 18)  $-OC(O) NR^d R^e$ 、
- 19)  $-NR^d C(O) OR^e$ 、
- 20)  $-NR^d C(O) NR^d R^e$ 、
- 21)  $-CR^d(N-OR^e)$ 、
- 22)  $-CF_3$ または
- 23)  $-OCF_3$

であり；

$C_y$ は、 $R^c$ から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていても良く；

$R^b$ は、

- 1)  $R^a$ から選択される基、
- 2)  $C_{1-10}$ アルキル、
- 3)  $C_{2-10}$ アルケニル、
- 4)  $C_{2-10}$ アルキニル、
- 5) アリール $C_{1-10}$ アルキル、
- 6) ヘテロアリール $C_{1-10}$ アルキル

であり；

上記において、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリールは、 $R^c$ から独立に選択される基で置換されていても良く；

$R^c$ は、

- 1) ハロゲン、
- 2) アミノ、
- 3) カルボキシ、
- 4)  $C_{1-4}$ アルキル、
- 5)  $C_{1-4}$ アルコキシ、
- 6) アリール、
- 7) アリール $C_{1-4}$ アルキル、
- 8) 水酸基、
- 9)  $CF_3$ または
- 10) アリールオキシ

であり；

$R^d$ および $R^e$ は、水素、 $C_{1-10}$ アルキル、 $C_{2-10}$ アルケニル、 $C_{2-10}$ アルキニル、 $C_y$ および $C_yC_{1-10}$ アルキルから独立に選択され；上記において、アルキル、アルケニル、アルキニルおよび $C_y$ は、 $R^c$ から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていても良いか；あるいは

$R^d$ および $R^e$ がそれらの結合している原子と一体となって、酸素、硫黄および窒素から独立に選択される0～2個の別のヘテロ原子を含む5～7員の複素環を形成しており；

$R^f$ および $R^g$ は、水素、 $C_{1-10}$ アルキル、 $C_y$ および $C_y C_{1-10}$ アルキルから独立に選択されるか；あるいは

$R^f$ および $R^g$ がそれらの結合している炭素と一体となって、酸素、硫黄および窒素から独立に選択される0～2個のヘテロ原子を含む5～7員の環を形成しており；

$R^h$ は、

- 1) 水素、
- 2)  $C_{1-10}$ アルキル、
- 3)  $C_{2-10}$ アルケニル、
- 4)  $C_{2-10}$ アルキニル、
- 5) シアノ、
- 6) アリール、
- 7) アリール $C_{1-10}$ アルキル、
- 8) ヘテロアリール、
- 9) ヘテロアリール $C_{1-10}$ アルキルまたは
- 10)  $-SO_2R^i$

であり；

上記においてアルキル、アルケニルおよびアルキニルは、 $R^a$ から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていても良く；アリールおよびヘテロアリールはそれぞれ、 $R^b$ から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていても良く；

$R^i$ は、

- 1)  $C_{1-10}$ アルキル、
- 2)  $C_{2-10}$ アルケニル、
- 3)  $C_{2-10}$ アルキニルまたは
- 4) アリール

であり；

上記において、アルキル、アルケニル、アルキニルおよびアリールはそれぞれ、 $R^c$ から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていても良く；

$C_y$ は、シクロアルキル、複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

mは1～2の整数であり；

nは1～10の整数であり；

Xは、

- 1)  $-C(O)OR^d$ 、
- 2)  $-P(O)(OR^d)(OR^e)$ 、
- 3)  $-P(O)(R^d)(OR^e)$ 、
- 4)  $-S(O)_mOR^d$ 、
- 5)  $-C(O)NR^dR^h$ または
- 6) 5-テトラゾリル

であり；

Yは、

- 1)  $-C(O)-$ 、
- 2)  $-O-C(O)-$ 、
- 3)  $-NR^e-C(O)-$ 、
- 4)  $-S(O)_2-$ 、
- 5)  $-P(O)(OR^i)$ または
- 6)  $C(O)C(O)$

である。]

2.  $R^1$ が $C_{1-10}$ アルキル、アリール、アリールー $C_{1-10}$ アルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアリールー $C_{1-10}$ アルキルであり；アルキルは、 $R^a$ から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていても良く；アリールおよびヘテロアリールは、 $R^b$ から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていても良い、請求項1に記載の化合物。

3.  $R^2$ が水素、 $C_{1-10}$ アルキル、 $C_y$ または $C_y-C_{1-10}$ アルキルであるか；あるいは $R^2$ および $R^3$ が、それらが結合している原子とともに、酸素、硫黄および窒素から独立に選択される0～2個の別のヘテロ原子を含む4～7員環を形成しており；該環は孤立しているかまたはベンゾ融合していることができ、 $R^b$ から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていても良い請求項1に記載の化合物。

4.  $R^2$ および $R^3$ が、それらが結合している原子とともに、酸素、硫黄および窒素から独立に選択される0～2個の別のヘテロ原子を含む5～6員環を形成しており；該環は孤立しているかまたはベンゾ融合していることができ、 $R^b$ から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていても良い、請求項3に記載の化合物。

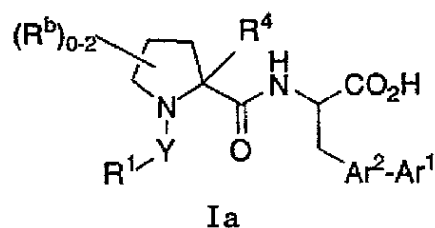
5.  $R^4$ が、H、 $C_{1-10}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アリール- $C_{1-10}$ アルキルまたはヘテロアリール- $C_{1-10}$ アルキルである請求項1に記載の化合物。

6.  $R^6$ が、 $Ar^1-Ar^2-C_{1-3}$ アルキルであり； $Ar^1$ および $Ar^2$ が、 $R^b$ から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていても良い請求項1に記載の化合物。

7. XがC(O)OR<sup>d</sup>である請求項1に記載の化合物。

8. YがC(O)またはS(O)<sub>2</sub>である請求項1に記載の化合物。

9. 下記式Iaの構造を有する請求項1に記載の化合物。



[式中、

$R^1$ は、

1)  $C_{1-10}$ アルキル、

2)  $C_y$ または

3)  $C_y-C_{1-10}$ アルキル

であり；

上記においてアルキルは、 $R^a$ から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていても良く； $C_y$ は、 $R^b$ から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていても良く；

$R^4$ は、

1) 水素または

2) C<sub>1-3</sub>アルキル

であり；

A r<sup>1</sup>およびA r<sup>2</sup>は独立に、アリールまたはヘテロアリールであり；それらの基はそれぞれ、R<sup>b</sup>から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていても良く；

Yは、C (O) またはS O<sub>2</sub>であり；

R<sup>b</sup>は、請求項1で定義した通りである。]

10.

N - (3, 4 - ジメトキシベンゼンスルホニル) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリン - 3 (S) - カルボニル - (L) - ビフェニルアラニン；

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) - 4 - ビフェニルアラニン；

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) - 4 - (4 - フルオロフェニル) フェニルアラニン；

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) - 4 - (2' - チエニル) - フェニルアラニン；

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) - 4 - (3' - チエニル) - フェニルアラニン；

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) - 4 - (4' - トリフルオロメチルフェニル) - フェニルアラニン；

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) - 4 - (2' - メトキシフェニル) - フェニルアラニン；

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) - 4 - (2' - ホルミルフェニル) - フェニルアラニン；

N - (3 - フルオロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) - 4 - (3' - チエニル) フェニルアラニン；

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) - 4 - (2', 6' - ジフルオロフェニル) フェニルアラニン；

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) -

4 - (2' - ヒドロキシメチルフェニル) フェニルアラニン ;

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) -  
4 - (4' - メチルフェニル) フェニルアラニン ;

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) -  
4 - (2' - カルボキシフェニル) フェニルアラニン ;

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) -  
4 - (2' - メトキシカルボキシフェニル) フェニルアラニン ;

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) -  
4 - (3' - ホルミルフェニル) フェニルアラニン ;

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) -  
4 - (3' - アミノフェニル) フェニルアラニン ;

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) -  
4 - (2' - メチルフェニル) フェニルアラニン ;

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) -  
4 - (3' - アセトアミドフェニル) フェニルアラニン ;

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) -  
4 - (2' - フルオロフェニル) フェニルアラニン ;

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) -  
4 - (3' - カルボキシフェニル) フェニルアラニン ;

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) -  
4 - (3' - メトキシカルボニルフェニル) フェニルアラニン ;

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) -  
4 - (2' , 4' - ジクロロフェニル) フェニルアラニン ;

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) -  
4 - (2' - ホルミル - 3 - チエニル) フェニルアラニン ;

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチル -  
プロリル - (L) - 4 - (4' - フルオロフェニル) フェニルアラニン ;

N - (3, 5 - ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチル -  
プロリル - (L) - 4 - (2' - ホルミルフェニル) フェニルアラニン ;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) -メチル-  
 プロリル- (L) - 4 - (2' - (ヒドロキシメチル) フェニル) フェニルアラ  
 ニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) -メチル-  
 プロリル- (L) - 4 - (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) -メチル-  
 プロリル- (L) - 4 - (2' -ホルミルフェニル) フェニルアラニン;

N- (ベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) -メチル-プロリル- (L)  
 - 4 - (2' -メトキシフェニル) フェニルアラニン;

N- (3-クロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) -メチル-プロリ  
 ル- (L) - 4 - (2' -メチルチオフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) -メチル-  
 プロリル- (L) - 4 - (2' -メトキシフェニル) - 2-チエニル-アラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (D) - 2 (R) -メチル-  
 プロリル- (D) - 4 - (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (D) - 2 (R) -メチル-  
 プロリル- (L) - 4 - (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) -メチル-  
 プロリル- (L) - 4 - (2' -メトキシフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) -メチル-  
 プロリル- (L) - 4 - (2' -メチルチオフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 3 (R) -メチル-  
 プロリル- (L) - 4 - (2' -メトキシフェニル) フェニルアラニン・メチル  
 エステル;

N- (ベンゼンスルホニル) - (L) - 4 (R) -アミノ-プロリル- (L)  
 - 4 - (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (ベンゼンスルホニル) - (L) - 4 (S) -アミノ-プロリル- (L)  
 - 4 - (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) -メチル-

プロリル- (L) - 4 - (2' -トリフルオロメトキシフェニル) フェニルアラニン;

N- (ベンゼンスルホニル) - (L) - 4 (R) -ベンゾイルアミノ-プロリル- (L) - 4 - (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (ベンゼンスルホニル) - (L) - 4 (S) -ベンゾイルアミノ-プロリル- (L) - 4 - (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (ベンゼンスルホニル) - (L) - 4 (R) -フェニルアセチルアミノ-プロリル- (L) - 4 - (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (ベンゼンスルホニル) - (L) - 4 (S) -フェニルアセチルアミノ-プロリル- (L) - 4 - (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) -プロリル- (L) - N-メチル-4 - (2' -メトキシフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 3 (S) -メチル-プロリル- (L) - N-メチル-4 - (2' -メトキシフェニル) フェニルアラニン;

N- (3-フルオロベンゼンスルホニル) - (L) -プロリル- (L) - 4 - (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) -プロリル- (L) - 4 - (4' -フルオロ-2' -メトキシフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) -プロリル- (L) - 4 - (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) -プロリル- (L) - 4 - (2' -メチルチオ-フェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) -プロリル- (L) - 4 - (2' - (5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル-フェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) -プロリル- (L) - 4 - (2-メチル-5-トリフルオロメチル-ベンゾオキサゾール-7-イル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) - 4- (2-メチル-6- (5-トリフルオロメチル-テトラゾール-1-イル) -ベンゾオキサゾール-4-イル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) - 4- (2-メチル-5- (5-トリフルオロメチル-テトラゾール-1-イル) -ベンゾオキサゾール-7-イル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) - 4- (3-ピリジル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) - 4- (2-ピリジル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) - 4- (5-ピリミジニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) - 4- (3'-シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) - 4- (2-メチル-ベンゾオキサゾール-4-イル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) - 4- (6-アセトアミド-2-メチル-ベンゾオキサゾール-4-イル) フェニルアラニン;

N- (ベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル - (L) - 4- (2-ピリジル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 3 (S) -メチルプロリル - (L) - 4- (2'-シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (ベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) -メチルプロリル - (L) - 4- (2'-シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3-クロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) -メチルプロリル - (L) - 4- (2'-シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3-クロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) -メチルプロリル - (L) - 4- (5-ピリミジニル) フェニルアラニン;

N- (3-トリフルオロメチルベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチループロリル- (L) - 4- (2'-シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチループロリル- (L) - 4- (3-ピリジル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチループロリル- (L) - 4- (5-ピリミジニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチループロリル- (L) - 4- (3'-シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチループロリル- (L) - 4- (5'-フルオロ-2'-メトキシフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチループロリル- (L) - 4- (2'-メトキシ-5'-トリフルオロメチルフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチループロリル- (L) - 4- (2-ピリジル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチループロリル- (L) - 4- (3'-フルオロ-2'-シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチループロリル- (L) - 4- (2'-トリフルオロメチルスルホニルフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチループロリル- (L) - 4- (2-チアゾリル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチループロリル- (L) - 4- (5- (1H, 3H-ピリミジン-2, 4-ジオン) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチループロリル- (L) - 4- (4'-フルオロ-3'-シアノフェニル) フェニル

アラニン；

N-（3，5-ジクロロベンゼンスルホニル）-（L）-2（S）-メチル-  
プロリル-（L）-4-（2'-フルオロ-5'-シアノフェニル）フェニル  
アラニン；

N-（3，5-ジクロロベンゼンスルホニル）-（L）-2（S）-メチル-  
プロリル-（L）-4-（1-メチル-7-インドリル）フェニルアラニン；

N-（3，5-ジクロロベンゼンスルホニル）-（L）-2（S）-メチル-  
プロリル-（L）-4-（7-インドリル）フェニルアラニン；

N-（3，5-ジクロロベンゼンスルホニル）-（L）-2（S）-メチル-  
プロリル-（L）-4-（ベンゾチアゾール-4-イル）フェニルアラニン；

N-（3，5-ジクロロベンゼンスルホニル）-（L）-2（S）-メチル-  
プロリル-（L）-4-（ベンゾオキサゾール-4-イル）フェニルアラニン；

N-（3，5-ジクロロベンゼンスルホニル）-（L）-2（S）-メチル-  
プロリル-（L）-4-（2-メチル-ベンゾオキサゾール-4-イル）フェニ  
ルアラニン；

N-（3，5-ジクロロベンゼンスルホニル）-（L）-2（S）-メチル-  
プロリル-（L）-4-（2-トリフルオロメチル-ベンゾオキサゾール-4-  
イル）フェニルアラニン；

N-（3，5-ジクロロベンゼンスルホニル）-（L）-2（S）-メチル-  
プロリル-（L）-4-（2'-イソプロピルオキシフェニル）フェニルアラ  
ニン；

N-（3，5-ジクロロベンゼンスルホニル）-（L）-プロリル-（L）-  
4-（2'-（テトラゾール-5-イル）フェニル）フェニルアラニン；

N-（3，5-ジクロロベンゼンスルホニル）-（L）-プロリル-（L）-  
4-（2'-（2-メチル-テトラゾール-5-イル）フェニル）フェニルアラ  
ニン；

N-（3，5-ジクロロベンゼンスルホニル）-（L）-プロリル-（L）-  
4-（2'-（3-メチル-テトラゾール-5-イル）フェニル）フェニルアラ  
ニン；

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2'-アミノカルボニルフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2'-メチルアミノカルボニルフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2'-ジメチルアミノカルボニルフェニル) フェニルアラニン;

N- (ベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチル-プロリル- (L) - 4- (2'-カルボキシフェニル) フェニルアラニン;

N- (3-クロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチル-プロリル- (L) - 4- (2'-ジメチルアミノカルボニルフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチル-プロリル- (L) - 4- (2'-メチルアミノカルボニルフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチル-プロリル- (L) - 4- (2'-ジメチルアミノカルボニルフェニル) フェニルアラニン;

N- (1-ブタンスルホニル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2'-シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3-ブロモベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2'-シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (ベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2'-シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- ( $\alpha$ -トルエンスルホニル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2'-シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (フェニルアセチル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2'-シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3-ピリジンスルホニル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2'-シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (2-チエニルスルホニル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2'-

シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (ベンジルアミノカルボニル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3-フェニルプロピオニル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- 5-メチル- 3, 4-チアジアゾール- 2-イル) スルホニル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- ( (ベンゾチアジアゾール- 2-イル) スルホニル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- ( (1-メチル-イミダゾール- 4-イル) スルホニル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3-ヨードベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (メタンスルホニル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (トリフルオロメタンスルホニル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3-プロモベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチル-プロリル- (L) - 4- (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - (3-プロペニル) - プロリル- (L) - 4- (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジ (トリフルオロメチル) ベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチル-プロリル- (L) - 4- (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - プロリル-プロリル- (L) - 4- (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (メタンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチル-プロリル- (L) - 4- (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン;

N- (アセチル) - (L) - プロリル- (L) - 4- (2' -シアノフェニル)

フェニルアラニン；

N-（アセチル）-（L）-2（S）-メチル-プロリル-（L）-4-（2'-シアノフェニル）フェニルアラニン；

N-（3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル）-（L）-2（S）-メチル-ピペコリル-（L）-4-（2'-シアノフェニル）フェニルアラニン；

N-（2-ナフタレンスルホニル）-（L）-2（S）-メチル-プロリル-（L）-4-（2'-シアノフェニル）フェニルアラニン；

N-（メタンスルホニル）-（L）-4（R）-アミノ-プロリル-（L）-4-（2'-シアノフェニル）フェニルアラニン；

N-（イソプロパンスルホニル）-（L）-4（R）-アミノ-プロリル-（L）-4-（2'-シアノフェニル）フェニルアラニン；

N-（t-ブタンスルホニル）-（L）-プロリル-（L）-4-（2'-シアノフェニル）フェニルアラニン；

N-（3-トリフルオロメチルベンゼンスルホニル）-（L）-2（S）-メチル-プロリル-（L）-4-（2'-メトキシフェニル）フェニルアラニン；

N-（3-クロロベンゼンスルホニル）-（L）-2（S）-メチル-プロリル-（L）-4-（2'-メトキシフェニル）フェニルアラニン；

N-（3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル）-（L）-2（S）-メチル-プロリル-（L）-4-（2-ピリジル-N-オキシド）フェニルアラニン；

N-N-（3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル）-（L）-2（S）-メチル-プロリル-（L）-4-（3-ピリジル-N-オキシド）フェニルアラニン；

N-（3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル）-（L）-プロリル-（L）-4-（2'-メチルスルフィニルフェニル）フェニルアラニン；

N-（3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル）-（L）-プロリル-（L）-4-（2'-メチルスルホニルフェニル）フェニルアラニン；

N-（3-クロロベンゼンスルホニル）-（L）-2（S）-メチル-プロリル-（L）-4-（2'-メチルスルホニルフェニル）フェニルアラニン；

N-（3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル）-（L）-2（S）-メチル-プロリル-（L）-4-（2'-メチルスルホニルフェニル）フェニルアラニン；

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - 2 (S) - メチル-  
 プロリル- (L) - 4- (3-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イ  
 ル) - フェニルアラニン;

N- (3, 5-ジクロロベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル- (L) -  
 4- (3-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル) - フェニルアラ  
 ニン;

N- (ベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル- 2 (S) - アミノ- 3 (R)  
 - (4- (2' -シアノ) ビフェニル) 酪酸;

N- (ベンゼンスルホニル) - (L) - プロリル- 2 (S) - アミノ- 3 (S)  
 - (4- (2' -シアノ) ビフェニル) 酪酸;

N- (ベンゼンスルホニル) - (L) - 4 (R) - N- (N' , N' -ジメチ  
 ルホルムアミジノ) - プロリル- (L) - (4- (2' -シアノフェニル) フェ  
 ニルアラニン; および

N- (ベンゼンスルホニル) - (L) - 4 (R) - ジメチルアミノ- プロリル  
 - (L) - (4- (2' -シアノフェニル) フェニルアラニン

からなる群から選択される化合物。

1 1. 哺乳動物での細胞接着が介在する疾患、障害、状態または症状の治療の  
 ための医薬の製造における請求項1に記載の化合物の使用。

1 2. 哺乳動物での喘息、アレルギー性鼻炎、多発性硬化症、アテローム性動  
 脈硬化症、炎症性大腸疾患または炎症の治療のための医薬の製造における請求項  
 1に記載の化合物の使用。

1 3. 請求項1に記載の化合物と医薬的に許容される担体とを含有する医薬組  
 成物。