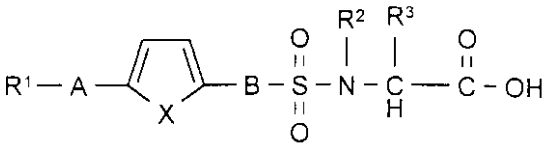
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成18年12月28日(2006.12.28)

【公表番号】特表2002-529447(P2002-529447A)
【公表日】平成14年9月10日(2002.9.10)
【出願番号】特願2000-580988(P2000-580988)
【国際特許分類】
*Ｃ０７Ｃ 311/19 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/198 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/404 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/5375 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 1/02 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 9/10 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 9/14 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 19/00 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 19/02 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 19/04 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 19/10 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 21/00 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 29/00 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 35/04 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｃ 303/40 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 209/04 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 295/12 (2006.01)*
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｃ 311/19
Ａ６１Ｋ 31/198
Ａ６１Ｋ 31/404
Ａ６１Ｋ 31/5375
Ａ６１Ｐ 1/02
Ａ６１Ｐ 9/10
Ａ６１Ｐ 9/14
Ａ６１Ｐ 19/00
Ａ６１Ｐ 19/02
Ａ６１Ｐ 19/04
Ａ６１Ｐ 19/10
Ａ６１Ｐ 21/00
Ａ６１Ｐ 29/00
Ａ６１Ｐ 35/04
Ｃ０７Ｃ 303/40
Ｃ０７Ｄ 209/04
Ｃ０７Ｄ 295/12 Ｚ
Ｃ０７Ｍ 7:00

【手続補正書】
【提出日】平成18年10月13日(2006.10.13)
【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

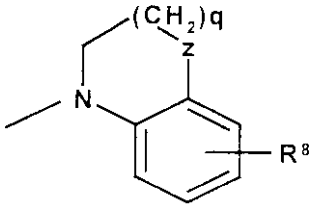
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】　式Ｉの化合物
【化１】



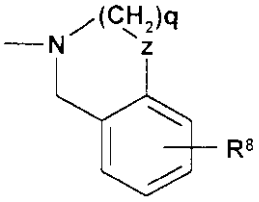
(I)

および／または式Ｉの化合物の立体異性体形態および／または式Ｉの化合物の生理的に許容される塩：式中、
$R^1$は、
１．フェニル、
２．以下の基でモノ－またはジ置換されたフェニル
2.1.　直鎖状、環状または分岐状である($C_1$～$C_6$)－アルキル、
2.2.　ヒドロキシル、
2.3.　($C_1$～$C_6$)－アルキル－Ｃ(Ｏ)－Ｏ－、
2.4.　($C_1$～$C_6$)－アルキル－Ｏ－、
2.5.　($C_1$～$C_6$)－アルキル－Ｏ－($C_1$～$C_4$)－アルキル－Ｏ－、
2.6.　ハロゲン、
2.7.　－$CF_3$、
2.8.　－ＣＮ、
2.9.　－$NO_2$、
2.10.　ＨＯ－Ｃ(Ｏ)－、
2.11.　($C_1$～$C_6$)－アルキル－Ｏ－Ｃ(Ｏ)－、
2.12.　メチレンジオキソ、
2.13.　$R^4$－($R^5$)Ｎ－Ｃ(Ｏ)－、
2.14.　$R^4$－($R^5$)Ｎ－、または
2.15.　以下の群からのヘテロ環状基：イソオキサゾリジン、モルホリン、イソチアゾリジン、チオモルホリン、ピラゾリジン、イミダゾリジン、ピペラジン、アゼチジン、ピロール、ピロリン、ピロリジン、ピリジン、アゼピン、ピペリジン、オキサゾール、イソオキサゾール、イミダゾール、ピラゾール、チアゾール、イソチアゾール、ジアゼピン、チオモルホリン、ピリミジンおよびピラジン(これらは非置換であるか、または$R^1$に関し２．１～２．１４に記載したように置換されている)、または
３．以下の３．１～３．１５の群からのヘテロ芳香族基（これらは非置換であるか、または$R^1$に関し２．１～２．１４に記載したように置換されている)
3.1.　ピロール、
3.2.　ピラゾール、
3.3.　イミダゾール、
3.4.　トリアゾール、
3.5.　チオフェン、
3.6.　チアゾール、
3.7.　オキサゾール、
3.8.　イソオキサゾール、
3.9.　ピリジン、
3.10.　ピリミジン、
3.11.　インドール、
3.12.　ベンゾチオフェン、
3.13.　ベンズイミダゾール、

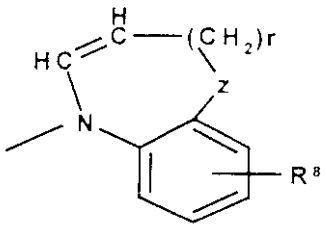
3.14. ベンズオキサゾールまたは
3.15. ベンゾチアゾール
であり、
$R^2$、$R^4$および$R^5$は、同一であるかまたは異なり、
１．水素原子、
２．($C_1$～$C_6$)－アルキル－、
３．ＨＯ－Ｃ(Ｏ)－($C_1$～$C_6$)－アルキル－、
４．フェニル－($CH_2$)$_n$－（ここで、フェニルは非置換であるか、または$R^1$に関し２．１.～２.１４.に記載したようにモノ－またはジ置換されており、ｎは０、１または２の整数である）、または
５．ピコリル、または
６．$R^4$および$R^5$は、環アミノ基と一緒になって４員環～７員環（ここで、場合によっては、炭素原子の１つは－Ｏ－、－Ｓ－または－ＮＨ－で置き換えられている）を形成し、
$R^3$は、
１．－($C_1$～$C_4$)－アルキル－Ｃ(Ｏ)－Ｎ($R^6$)－$R^7$（ここで、$R^6$および$R^7$は、これらが結合している窒素と一緒になって次の式IIａ、IIｂまたはIIｅの基を形成し、
【化２】



(IIa)

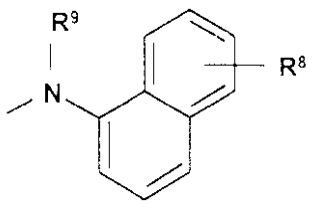


(IIe)

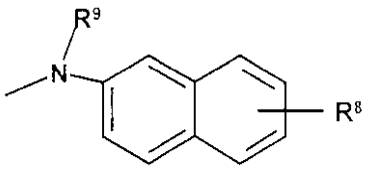


(IIb)

式IIａ、IIｂおよびIIｅにおいて、
ｑは、０、１または２の整数であり、
ｒは、０または１の整数であり、
Ｚは、炭素原子、窒素原子、酸素原子または硫黄原子、または共有結合であり、
$R^8$は、水素原子であるか、$R^1$に関し上記２.１～２.１４に記載した意味を有する）、
２．－($C_1$～$C_4$)－アルキル－Ｃ(Ｏ)－Ｙ（ここで、Ｙは次の式IIｃまたはIIｄの基であり、
【化３】



(IIc)



(IId)

式IIｃおよびIIｄにおいて、
$R^8$は、水素原子であるか、$R^1$に関し上記２.１～２.１４に記載した意味を有し、
$R^9$は、

2.1 水素原子、
2.2 (C$_1$～C$_6$)－アルキル－、
2.3 HO－C(O)－(C$_1$～C$_6$)－アルキル－、
2.4 フェニル－(CH$_2$)$_n$－(ここで、フェニルは非置換であるか、またはR$^1$に関し２．１～２．１４に記載したようにモノ－またはジ置換されており、ｎは０、１または２の整数である)または
2.5 ピコリルである)、または
３．－(C$_1$～C$_4$)－アルキル－C(O)－N(R$^9$)－(CH$_2$)$_o$－N(R$^4$)－R$^5$（ここで、R$^9$は、上記の意味を有し、ｏは、２、３、４または５の整数であり、R$^4$およびR$^5$は、上記の意味を有する）であり、
Ａは、
ａ） 共有結合、
ｂ） －Ｏ－、
ｃ） －ＣＨ＝ＣＨ－または
ｄ） －Ｃ≡Ｃ－であり、
Ｂは、ａ） －(ＣＨ$_2$)$_m$－(ここで、ｍは０、１、２、３、４、５または６の整数である)、
ｂ） －Ｏ－(ＣＨ$_2$)$_p$(ここで、ｐは１～５の整数である)または
ｃ） －ＣＨ＝ＣＨ－であり、
Ｘは、－ＣＨ＝ＣＨ－、酸素原子または硫黄原子である。
【請求項２】 R$^1$が、
１．フェニルまたは
２．以下の基でモノ置換されたフェニル
2.1 (C$_1$～C$_6$)－アルキル－(ここで、アルキルは直鎖状、環状または分岐状である)、
2.2 －ＯＨ、
2.3 (C$_1$～C$_6$)－アルキル－C(O)－Ｏ－、
2.4 (C$_1$～C$_6$)－アルキル－Ｏ－、
2.5 (C$_1$～C$_6$)－アルキル－Ｏ－(C$_1$～C$_4$)－アルキル－Ｏ－、
2.6 ハロゲン、
2.7 －ＣＦ$_3$または
2.8 R$^4$－(R$^5$)Ｎ－
であり、
R$^2$、R$^4$およびR$^5$が、同一であるかまたは異なり、
１．水素原子、
２．(C$_1$～C$_6$)－アルキル－であるか、または
３．R$^4$およびR$^5$が、環アミノ基と一緒になって４員環～７員環（ここで、場合によっては、炭素原子の１つは－Ｏ－、－Ｓ－または－ＮＨ－で置き換えられている）を形成し、
R$^3$が、
１．－(C$_1$～C$_4$)－アルキル－C(O)－N(R$^6$)－R$^7$（ここで、R$^6$およびR$^7$は、これらが結合している窒素と一緒になって式IIａの基を形成し、式IIａにおいて、
ｑは、０または１の整数であり、
Ｚは、炭素原子、窒素原子、酸素原子または硫黄原子であり、
R$^8$は、水素原子であるか、R$^1$に関し上記２．１～２．８に記載した意味を有する）、
２．－(C$_1$～C$_4$)－アルキル－C(O)－Ｙ(ここで、Ｙは式IIｃまたはIIｄの基であり、
式IIｃおよびIIｄにおいて、
R$^8$は水素原子であるか、R$^1$に関し上記２．１～２．８に記載した意味を有し、
R$^9$は、水素原子である)、または

３．－($C_1$～$C_4$)－アルキル－Ｃ(Ｏ)－Ｎ($R^9$)－($CH_2$)$_o$－Ｎ($R^4$)－$R^5$（ここで、
$R^9$は、水素原子であり、
ｏは、２または３の整数であり、
$R^4$および$R^5$は、同一であるかまたは異なり、
１．水素原子、
２．($C_1$～$C_6$)－アルキル－であるか、または
３．$R^4$および$R^5$は、環アミノ基と一緒になって４員環～７員環を形成し、ここで、場合によっては、炭素原子の１つは－Ｏ－、－Ｓ－または－ＮＨ－で置き換えられている）であり、
Ａが、共有結合または－Ｏ－であり、
Ｂが、
ａ）－($CH_2$)$_m$－(ここで、ｍは０、１または２の整数である)、または
ｂ）－Ｏ－($CH_2$)$_p$（ここで、ｐは１または２の整数である）であり、
Ｘが、－ＣＨ＝ＣＨ－である、
請求項１に記載の式Ｉの化合物。

【請求項３】　$R^1$が、
１．フェニルまたは
２．以下の基でモノ置換されたフェニル
2.1.　塩素、
2.2.　臭素、
2.3.　フッ素、
2.4.　ピロリジンまたは
2.5.　モルホリン
であり、
$R^2$が、水素原子であり、
$R^3$が、
１．－($C_1$～$C_4$)－アルキル－Ｃ(Ｏ)－Ｎ($R^6$)－$R^7$（ここで、$R^6$および$R^7$は、これらが結合している窒素と一緒になって式IIａの基を形成し、式IIａにおいて、
ｑは、０または１の整数であり、
Ｚは、炭素原子であり、
$R^8$は、水素原子、塩素、臭素またはフッ素である）、
２．－($C_1$～$C_4$)－アルキル－Ｃ(Ｏ)－Ｙ（ここで、Ｙは式IIｃまたはIIｄの基であり、式IIｃおよびIIｄにおいて、$R^8$および$R^9$は、それぞれ水素原子である）、または
３．－($C_1$～$C_4$)－アルキル－Ｃ(Ｏ)－Ｎ($R^9$)－($CH_2$)$_o$－Ｎ($R^4$)－$R^5$（ここで、
$R^9$は、水素原子であり、
ｏは、２または３の整数であり、
$R^4$および$R^5$は、同一であるかまたは異なり、互いに独立して、
１．水素原子、
２．フェニルまたは
３．モルホリンである）
であり、
Ａが、共有結合または－Ｏ－であり、
Ｂが、共有結合であり、
Ｘが、－ＣＨ＝ＣＨ－である、
請求項１に記載の式Ｉの化合物。

【請求項４】　２－(ビフェニル－４－スルホニルアミノ)－４－(ナフタレン－１－イルカルバモイル)酪酸、２－(ビフェニル－４－スルホニルアミノ)－４－(ナフタレン－２－イル－カルバモイル)酪酸、２－(ビフェニル－４－スルホニルアミノ)－４－(２－フェニルアミノエチルカルバモイル)酪酸、２－(４′－クロロビフェニル－４－スルホニルアミノ)－４－(３－モルホリン－４－イル－プロピルカルバモイル)酪酸、４－(３－(４

－(ビフェニル－４－スルホニルアミノ)－４－カルボキシブチリルアミノ)プロピル)－モルホリン－４－イウムトリフルオロアセテート、２－(ビフェニル－４－スルホニルアミノ)－５－(２,３－ジヒドロインドール－１－イル)－５－オキソペンタン酸、５－(２,３－ジヒドロインドール－１－イル)－５－オキソ－２－(４′－ピロリジン－１－イル－ビフェニル－４－スルホニルアミノ)ペンタン酸、２－(４′－クロロビフェニル－４－スルホニルアミノ)－５－(２,３－ジヒドロインドール－１－イル)－５－オキソペンタン酸、２－(４′－ブロモビフェニル－４－スルホニルアミノ)－５－(２,３－ジヒドロインドール－１－イル)－５－オキソペンタン酸、２－(４′－クロロ－ビフェニル－４－スルホニルアミノ)－５－(５－フルオロ－２,３－ジヒドロインドール－１－イル)－５－オキソペンタン酸、２－(４′－ブロモビフェニル－４－スルホニルアミノ)－５－(５－フルオロ－２,３－ジヒドロインドール－１－イル)－５－オキソペンタン酸、５－(５－フルオロ－２,３－ジヒドロインドール－１－イル)－５－オキソ－２－(４′－ピロリジン－１－イル－ビフェニル－４－スルホニルアミノ)ペンタン酸、または５－(５－フルオロ－２,３－ジヒドロインドール－１－イル)－２－(４′－モルホリン－４－イル－ビフェニル－４－スルホニルアミノ)－５－オキソペンタン酸からなる群からの化合物である、請求項１または２に記載の式Ｉの化合物。

【請求項５】　２－アミノ－２－ヒドロキシメチル－１,３－プロパンジオール塩、トリメチルアミン塩、トリエチルアミン塩、エタノールアミン塩またはトリエタノールアミン塩である、請求項４に記載の式Ｉの化合物。

【請求項６】　有効量の、請求項１～５のいずれか１項に記載の式Ｉの化合物を、製剤上適した生理的に許容される賦形剤、添加剤および／または他の活性化合物および助剤と共に含有する医薬。