

【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11月16日(2006.11.16)

【公開番号】特開2000-169371(P2000-169371A)

【公開日】平成12年6月20日(2000.6.20)

【出願番号】特願平11-282282

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/385 (2006.01)
A 6 1 K 31/404 (2006.01)
A 6 1 K 31/4045 (2006.01)
A 6 1 K 31/405 (2006.01)
A 6 1 K 31/4178 (2006.01)
A 6 1 K 31/433 (2006.01)
A 6 1 K 31/4436 (2006.01)
A 6 1 K 31/4535 (2006.01)
A 6 1 K 31/496 (2006.01)
A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
A 6 1 K 31/541 (2006.01)
A 6 1 P 1/04 (2006.01)
A 6 1 P 1/16 (2006.01)
A 6 1 P 3/10 (2006.01)
A 6 1 P 9/00 (2006.01)
A 6 1 P 11/00 (2006.01)
A 6 1 P 13/12 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 25/28 (2006.01)
A 6 1 P 27/12 (2006.01)
A 6 1 P 31/12 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 39/06 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
C 0 7 D 339/04 (2006.01)
C 0 7 D 409/12 (2006.01)
C 0 7 D 417/12 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/385
A 6 1 K 31/404
A 6 1 K 31/4045
A 6 1 K 31/405
A 6 1 K 31/4178
A 6 1 K 31/433
A 6 1 K 31/4436
A 6 1 K 31/4535
A 6 1 K 31/496
A 6 1 K 31/5377
A 6 1 K 31/541
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 1/16
A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 27/12
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 39/06
 A 6 1 P 43/00
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 C 0 7 D 339/04
 C 0 7 D 409/12
 C 0 7 D 417/12

【手続補正書】

【提出日】平成18年9月29日(2006.9.29)

【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

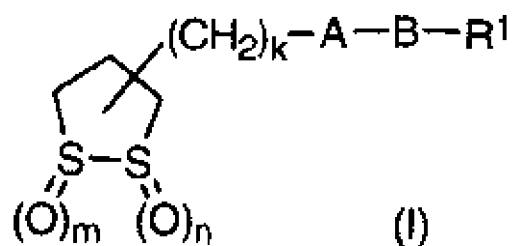
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記一般式（I）を有する化合物又はその薬理上許容される塩を含有する、グルタチオン還元酵素活性増強剤：

【化1】



{式中、

m及びnの一方は0、他方は0、1又は2を示し、

kは0又は1乃至12の整数を示し、

R¹は、水素原子、置換基群痰ッラ選択される基、或は置換基群瘠yび置換基群纒ッラ選択される1乃至3個の置換基で置換されていてもよく、酸素原子及び／又は硫黄原子が介在していてもよい炭素数1乃至12個のアルキル基を示し、

Aは、単結合、酸素原子、カルボニル基、又は-N(R²)-CO-、-N(R²)-CS-、-N(R²)-SO₂-、-CON(R²)-N(R³)-CO-、-CON(R²)-CO-、-CON(R²)-CS-、-CON(R²)-SO₂-、-O-CO-、-ON(R²)-CO-、-ON(R²)-SO₂-、-O-CON(R²)-N(R³)-CO-、-O-CON(R²)-CO-、-O-CON(R²)-SO₂-、-CO-O-、-CO-CO-、-CO-CON(R²)-N(R³)-CO-、-CO-CON(R²)-CO-、-CO-CON(R²)-SO₂-、-N(R²)-O-、-N(R²)-COCO-、-N(R²)-N(R³)-CO-、-N(R²)-N(R³)-SO₂-、-N(R²)-CON(R³)-N(R⁴)-CO-、-N(R²)-CON(R³)-CO-、-N(R²)-CON(R³)-SO₂-、若しくは、-N(R²)-CON(R³)-

$\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^4)\text{CO}-$ [式中、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、同一若しくは異なって、水素原子、炭素数1乃至12個を有するアルキル基、アラルキル基、アリール部分が置換基群竄うら選択される1乃至3個の基で置換されたアラルキル基、アシル基又は置換基群痰うら選択される1つの基を示す。]を有する基を示し、

Bは、単結合、又は $-\text{N}(\text{R}^5)-$ 、若しくは $-\text{N}(\text{R}^6)\text{N}(\text{R}^5)-$ [式中、 R^5 及び R^6 は、同一若しくは異なって、水素原子、炭素数1乃至12個を有するアルキル基、アラルキル基、アリール部分が置換基群竄うら選択される1乃至3個の基で置換されたアラルキル基、アシル基又は置換基群痰うら選択される1つの基を示し、更に、 R^5 は、 R^1 及びそれらが結合している窒素原子と共に5乃至7員環の複素環を形成していてもよい。]を示し、

更に、Aが、 $-\text{N}(\text{R}^2)\text{CO}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^2)\text{CS}-$ 、 $-\text{CON}(\text{R}^2)\text{N}(\text{R}^3)\text{CO}-$ 、 $-\text{CON}(\text{R}^2)\text{CO}-$ 、 $-\text{CON}(\text{R}^2)\text{CS}-$ 、 $-\text{O}-\text{CO}-$ 、 $-\text{ON}(\text{R}^2)\text{CO}-$ 、 $-\text{O}-\text{CON}(\text{R}^2)\text{N}(\text{R}^3)\text{CO}-$ 、 $-\text{O}-\text{CON}(\text{R}^2)\text{CO}-$ 、 $-\text{CO}-\text{CON}(\text{R}^2)\text{N}(\text{R}^3)\text{CO}-$ 、 $-\text{CO}-\text{CON}(\text{R}^2)\text{CO}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^2)\text{N}(\text{R}^3)\text{CO}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^2)\text{CON}(\text{R}^3)\text{N}(\text{R}^4)\text{CO}-$ 、又は $-\text{N}(\text{R}^2)\text{CON}(\text{R}^3)\text{CO}-$ [式中、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、前記と同意義を示す。]であり、Bが、単結合である場合、 R^1 は、前記の定義に加えて、基 OR^7 (式中、 R^7 は、低級アルキル基、低級アルケニル基、アラルキル基、アリール部分が置換基群竄うら選択される1乃至3個の基で置換されたアラルキル基又は置換基群痰うら選択される1つの基を示す。)であってもよく、

Aが、 $-\text{CON}(\text{R}^2)\text{SO}_2-$ 、 $-\text{ON}(\text{R}^2)\text{SO}_2-$ 、 $-\text{O}-\text{CON}(\text{R}^2)\text{SO}_2-$ 、 $-\text{CO}-\text{CO}-$ 、 $-\text{CO}-\text{CON}(\text{R}^2)\text{SO}_2-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^2)\text{COCO}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^2)\text{N}(\text{R}^3)\text{SO}_2-$ 、又は $-\text{N}(\text{R}^2)\text{CON}(\text{R}^3)\text{SO}_2-$ [式中、 R^2 及び R^3 は、前記と同意義を示す。]であり、且つ、Bが単結合である場合、並びに、Aが、酸素原子、 $-\text{CO}-\text{O}-$ 又は $-\text{N}(\text{R}^2)\text{O}-$ でなく、且つ、Bが $-\text{N}(\text{R}^5)-$ [式中、 R^5 は、前記と同意義を示す。]である場合、 R^1 は、前記の定義に加えて、水酸基又は基 OR^7 (式中、 R^7 は、前記と同意義を示す。)であってもよい。

但し、

Aが、酸素原子である場合、Bは単結合又は $-\text{N}(\text{R}^5)-$ [式中、 R^5 は、前記と同意義を示す。]であり、

Aが、 $-\text{CO}-\text{O}-$ 又は $-\text{N}(\text{R}^2)\text{O}-$ [式中、 R^2 は、前記と同意義を示す。]である場合、Bは単結合であり、

kが、4を示す場合、基 $-\text{ABR}^1$ は、カルボキシ基を示さない。}

[置換基群瘁_n

アリール基、複素環基、置換基群竄うら選択される1乃至3個の基で置換されたアリール基、置換基群竄うら選択される1乃至3個の基で置換された複素環基

[置換基群瘳_n

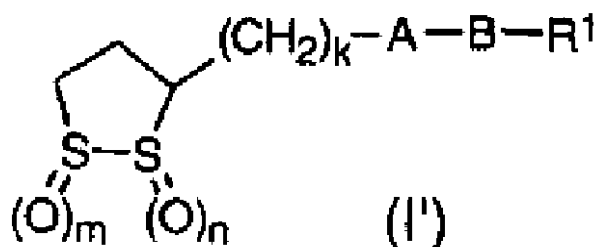
低級アルキル基、ハロゲン化低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、水酸基、カルボキシ基、窒素原子が置換されていてもよいカルバモイル基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子、ニトロ基、アミン残基、スルホ基、スルファモイル基、シアノ基、ヒドロキシ低級アルキル基

[置換基群縋_n

低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、水酸基、ニトロオキシ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子、スルホ基、スルファモイル基、アミン残基、窒素原子が置換されていてもよいカルバモイル基。

【請求項2】 請求項1において、一般式(I)が、下記一般式(I'):

【化2】



であるグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 3】 請求項 1 又は請求項 2 において、 m 及び n の一方が 0 であり、他方が 0 又は 1 であるグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 4】 請求項 1 又は請求項 2 において、 m 及び n が 0 であるグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 5】 請求項 1 乃至請求項 4 から選択されるいずれか一項において、 k が、0 又は 1 乃至 8 の整数であるグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 6】 請求項 1 乃至請求項 4 から選択されるいずれか一項において、 k が、2 乃至 6 の整数であるグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 7】 請求項 1 乃至請求項 4 から選択されるいずれか一項において、 k が、4 又は 5 であるグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 8】 請求項 1 乃至請求項 7 から選択されるいずれか一項において、 R^1 が、複素環基、置換基群 ω から選択される 1 乃至 3 個の基で置換された複素環基、置換基群 γ 及び置換基群 ϵ から選択される 1 乃至 3 個の置換基で置換されていてもよく、酸素原子及び／又は硫黄原子が介在していてもよい炭素数 1 乃至 12 個のアルキル基、水酸基或は炭素数 1 乃至 5 個のアルコキシ基であるグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 9】 請求項 1 乃至請求項 7 から選択されるいずれか一項において、 R^1 が、複素環基、置換基群 ω から選択される 1 乃至 3 個の基で置換された複素環基、或は置換基群 γ 及び置換基群 ϵ から選択される 1 乃至 3 個の置換基で置換されていてもよく、酸素原子及び／又は硫黄原子が介在していてもよい炭素数 1 乃至 12 個のアルキル基であるグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 10】 請求項 1 乃至請求項 7 から選択されるいずれか一項において、 R^1 が、水酸基又は炭素数 1 乃至 5 個のアルコキシ基であるグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 11】 請求項 1 乃至請求項 7 から選択されるいずれか一項において、 R^1 が、複素環基、置換基群 ω から選択される 1 乃至 3 個の基で置換された複素環基、炭素数 1 乃至 5 個のアルキル基、炭素数 3 乃至 8 個のアルコシカルボニル基、炭素数 2 乃至 7 個のカルボキシアルキル基、炭素数 2 乃至 5 個のヒドロキシアルキル基、複素環基又は炭素数 1 乃至 5 個のアルコキシ基であるグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 12】 請求項 1 乃至請求項 11 から選択されるいずれか一項において、 A が、カルボニル基、又は式 $-\text{CON}(\text{R}^2)\text{SO}_2-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^2)\text{CO}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^2)\text{CS}-$ 、 $-\text{CON}(\text{R}^2)\text{CO}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^2)\text{COCO}-$ 若しくは $-\text{N}(\text{R}^2)\text{SO}_2-$ [式中、 R^2 は、水素原子、炭素数 1 乃至 12 個のアルキル基又はベンジル基である。] を有する基であるグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 13】 請求項 1 乃至請求項 11 から選択されるいずれか一項において、 A が、カルボニル基、又は式 $-\text{CON}(\text{R}^2)\text{SO}_2-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^2)\text{CO}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^2)\text{CS}-$ 、 $-\text{CON}(\text{R}^2)\text{CO}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^2)\text{COCO}-$ 若しくは $-\text{N}(\text{R}^2)\text{SO}_2-$ [式中、 R^2 は、水素原子又は炭素数 1 乃至 12 個のアルキル基である。] を有する基であるグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 14】 請求項 1 乃至請求項 11 から選択されるいずれか一項において、 A が、カルボニル基、 $-\text{CONHSO}_2-$ 、 $-\text{CONCH}_3\text{SO}_2-$ 、 $-\text{NHCO}-$ 、 $-\text{NHC S}-$ 、 $-\text{CONHCO}-$ 、 $-\text{NHCOCO}-$ 又は $-\text{NHSO}_2-$ であるグルタチオン還元酵

素活性増強剤。

【請求項 15】 請求項 1 乃至請求項 14 から選択されるいずれか一項において、B が、単結合又は式 $-N(R^5)-$ 若しくは $-N(R^6)N(R^5)-$ [式中、 R^5 及び R^6 は、同一又は異なって水素原子、炭素数 1 乃至 12 個のアルキル基又はベンジル基を示す。] を有する基であるグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 16】 請求項 1 乃至請求項 14 から選択されるいずれか一項において、B が、単結合又は式 $-N(R^5)-$ 若しくは $-N(R^6)N(R^5)-$ [式中、 R^5 及び R^6 は、同一又は異なって水素原子又は炭素数 1 乃至 12 個のアルキル基を示す。] を有する基であるグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 17】 請求項 1 乃至請求項 14 から選択されるいずれか一項において、B が、単結合、 $-NH-$ 、 $-NCH_3-$ 又は $-NHNCH_3-$ であるグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 18】 請求項 1 において、

$N-[5-(1, 2-ジチオラン-3-イル)ペンタノイル]メタンスルホンアミド、$
 $3-[4-(1, 2-ジチオラン-3-イル)ブチル]ウレイド酢酸$ メチルエステル

、
 $2(S)-\{3-[4-(1, 2-ジチオラン-3-イル)ブチル]ウレイド\}$ プロピオン酸、

$2(S)-\{3-[4-(1, 2-ジチオラン-3-イル)ブチル]ウレイド\}$ プロピオン酸 メチルエステル、

$3-[4-(1, 2-ジチオラン-3-イル)ブチル]-1-メチルウレイド酢酸$ エチルエステル、若しくは

$N-[5-(1, 2-ジチオラン-3-イル)ペンチル]メタンスルホンアミド$ 又はその薬理上許容される塩を含有するグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 19】 酸化ストレスによって起こる疾患の予防剤又は治療剤として用いられる、請求項 1 乃至請求項 18 から選択されるいずれか一項に記載のグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 20】 放射線による障害の予防剤又は治療剤として用いられる、請求項 1 乃至請求項 19 から選択されるいずれか一項に記載のグルタチオン還元酵素活性増強剤。

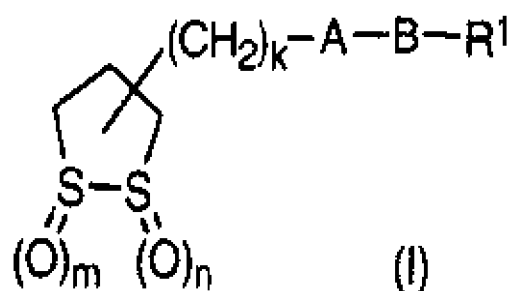
【請求項 21】 抗癌剤による中毒の予防剤又は治療剤として用いられる、請求項 1 乃至請求項 19 から選択されるいずれか一項に記載のグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 22】 白内障の予防剤又は治療剤として用いられる、請求項 1 乃至請求項 19 から選択されるいずれか一項に記載のグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 23】 糖尿病の予防剤又は治療剤として用いられる、請求項 1 乃至請求項 19 から選択されるいずれか一項に記載のグルタチオン還元酵素活性増強剤。

【請求項 24】 下記一般式 (I) を有する化合物又はその薬理上許容される塩：

【化 3】



{ 式中、

m及びnの一方は0、他方は0、1又は2を示し、

kは0又は1乃至12の整数を示し、

R^1 は、水素原子、置換基群痰ッラ選択される基、或は置換基群瘠yび置換基群纏ッラ選択される1乃至3個の置換基で置換されていてもよく、酸素原子及び／又は硫黄原子が介在していてもよい炭素数1乃至12個のアルキル基を示し、

Aは、単結合、酸素原子、カルボニル基、又は $-N(R^2)CO-$ 、 $-N(R^2)CS-$ 、 $-N(R^2)SO_2-$ 、 $-CON(R^2)N(R^3)CO-$ 、 $-CON(R^2)CO-$ 、 $-CON(R^2)CS-$ 、 $-CON(R^2)SO_2-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-ON(R^2)CO-$ 、 $-ON(R^2)SO_2-$ 、 $-O-CON(R^2)N(R^3)CO-$ 、 $-O-CON(R^2)CO-$ 、 $-O-CON(R^2)SO_2-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-CO-CO-$ 、 $-CO-CON(R^2)N(R^3)CO-$ 、 $-CO-CON(R^2)CO-$ 、 $-CO-CON(R^2)SO_2-$ 、 $-N(R^2)O-$ 、 $-N(R^2)COCO-$ 、 $-N(R^2)N(R^3)CO-$ 、 $-N(R^2)N(R^3)SO_2-$ 、 $-N(R^2)CON(R^3)N(R^4)CO-$ 、 $-N(R^2)CON(R^3)CO-$ 、 $-N(R^2)CON(R^3)SO_2-$ 、若しくは、 $-N(R^2)CON(R^3)SO_2N(R^4)CO-$ [式中、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、同一若しくは異なって、水素原子、炭素数1乃至12個を有するアルキル基、アラルキル基、アリール部分が置換基群竄ッラ選択される1乃至3個の基で置換されたアラルキル基、アシル基又は置換基群痰ッラ選択される1つの基を示す。]を有する基を示し、

Bは、単結合、又は $-N(R^5)-$ 、若しくは $-N(R^6)N(R^5)-$ [式中、 R^5 及び R^6 は、同一若しくは異なって、水素原子、炭素数1乃至12個を有するアルキル基、アラルキル基、アリール部分が置換基群竄ッラ選択される1乃至3個の基で置換されたアラルキル基、アシル基又は置換基群痰ッラ選択される1つの基を示し、更に、 R^5 は、 R^1 及びそれらが結合している窒素原子と共に5乃至7員環の複素環を形成していてもよい。]を示し、

更に、Aが、 $-N(R^2)CO-$ 、 $-N(R^2)CS-$ 、 $-CON(R^2)N(R^3)CO-$ 、 $-CON(R^2)CO-$ 、 $-CON(R^2)CS-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-ON(R^2)CO-$ 、 $-O-CON(R^2)N(R^3)CO-$ 、 $-O-CON(R^2)CO-$ 、 $-CO-CON(R^2)N(R^3)CO-$ 、 $-CO-CON(R^2)CO-$ 、 $-N(R^2)N(R^3)CO-$ 、 $-N(R^2)CON(R^3)N(R^4)CO-$ 、又は $-N(R^2)CON(R^3)CO-$ [式中、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、前記と同意義を示す。]であり、Bが、単結合である場合、 R^1 は、前記の定義に加えて、基 OR^7 (式中、 R^7 は、低級アルキル基、低級アルケニル基、アラルキル基、アリール部分が置換基群竄ッラ選択される1乃至3個の基で置換されたアラルキル基又は置換基群痰ッラ選択される1つの基を示す。)であってもよく、

Aが、 $-CON(R^2)SO_2-$ 、 $-ON(R^2)SO_2-$ 、 $-O-CON(R^2)SO_2-$ 、 $-CO-CO-$ 、 $-CO-CON(R^2)SO_2-$ 、 $-N(R^2)COCO-$ 、 $-N(R^2)N(R^3)SO_2-$ 、又は $-N(R^2)CON(R^3)SO_2-$ [式中、 R^2 及び R^3 は、前記と同意義を示す。]であり、且つ、Bが単結合である場合、並びに、Aが、酸素原子、 $-CO-O-$ 又は $-N(R^2)O-$ でなく、且つ、Bが $-N(R^5)-$ [式中、 R^5 は、前記と同意義を示す。]である場合、 R^1 は、前記の定義に加えて、水酸基又は基 OR^7 (式中、 R^7 は、前記と同意義を示す。)であってもよい。

但し、

Aが、酸素原子である場合、Bは単結合又は $-N(R^5)-$ [式中、 R^5 は、前記と同意義を示す。]であり、

Aが、 $-CO-O-$ 又は $-N(R^2)O-$ [式中、 R^2 は、前記と同意義を示す。]である場合、Bは単結合であり、

kが、4を示す場合、基 $-ABR^1$ は、カルボキシル基を示さない。}

[置換基群瘠n

アリール基、複素環基、置換基群竄ッラ選択される1乃至3個の基で置換されたアリール基、置換基群竄ッラ選択される1乃至3個の基で置換された複素環基

[置換基群瘠n

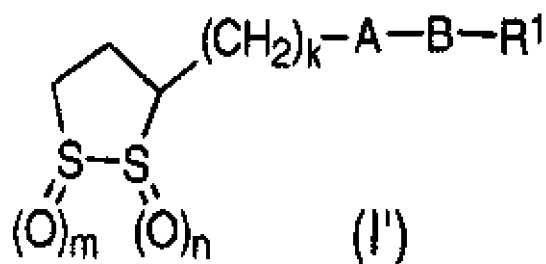
低級アルキル基、ハロゲン化低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、水酸基、カルボキシ基、窒素原子が置換されていてもよいカルバモイル基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子、ニトロ基、アミン残基、スルホ基、スルファモイル基、シアノ基、ヒドロキシ低級アルキル基

[置換基群鏈_n]

低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、水酸基、ニトロオキシ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子、スルホ基、スルファモイル基、アミン残基、窒素原子が置換されていてもよいカルバモイル基。

【請求項 2 5】 請求項 2 4 において、一般式 (I) が、下記一般式 (I') :

【化 4】



である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 2 6】 請求項 2 4 又は請求項 2 5 において、A が、カルボニル基、又は式 $\text{—CON(R}^2\text{)SO}_2\text{—}$ 、 $\text{—N(R}^2\text{)CO—}$ 、 $\text{—N(R}^2\text{)CS—}$ 、 $\text{—CON(R}^2\text{)CO—}$ 、 $\text{—N(R}^2\text{)COCO—}$ 若しくは $\text{—N(R}^2\text{)SO}_2\text{—}$ [式中、 R^2 は、水素原子又は炭素数 1 乃至 12 個のアルキル基である。] を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 2 7】 請求項 2 4 又は請求項 2 5 から選択されるいずれか一項において、A が、カルボニル基、 $\text{—CONHSO}_2\text{—}$ 、 $\text{—CONCH}_3\text{SO}_2\text{—}$ 、 —NHCO— 、 —NHC S— 、 —CONHCO— 、 —NHCOCO— 又は $\text{—NHSO}_2\text{—}$ である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 2 8】 請求項 2 4 又は請求項 2 7 から選択されるいずれか一項において、B が、単結合又は式 $\text{—N(R}^5\text{)—}$ 若しくは $\text{—N(R}^6\text{)N(R}^5\text{)—}$ [式中、 R^5 及び R^6 は、同一又は異なって水素原子、炭素数 1 乃至 12 個のアルキル基又はベンジル基を示す。] を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 2 9】 請求項 2 4 又は請求項 2 7 から選択されるいずれか一項において、B が、単結合又は式 $\text{—N(R}^5\text{)—}$ 若しくは $\text{—N(R}^6\text{)N(R}^5\text{)—}$ [式中、 R^5 及び R^6 は、同一又は異なって水素原子又は炭素数 1 乃至 12 個のアルキル基を示す。] を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 3 0】 請求項 2 4 又は請求項 2 7 から選択されるいずれか一項において、B が、単結合、 —NH— 、 $\text{—NCH}_3\text{—}$ 又は $\text{—NHNCH}_3\text{—}$ である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 3 1】 請求項 2 4 において、

$\text{N—[5—(1, 2—ジチオラン—3—イル)ペンタノイル]メタンスルホンアミド}$ 、
 $\text{3—[4—(1, 2—ジチオラン—3—イル)ブチル]ウレイド酢酸}$ メチルエステル

、
 $\text{2(S)—\{3—[4—(1, 2—ジチオラン—3—イル)ブチル]ウレイド\}プロピオン酸}$ 、

$\text{2(S)—\{3—[4—(1, 2—ジチオラン—3—イル)ブチル]ウレイド\}プロピ$

オン酸 メチルエステル、

3 - [4 - (1 , 2 - ジチオラン - 3 - イル) ブチル] - 1 - メチルウレイド酢酸 エチルエステル、若しくは

N - [5 - (1 , 2 - ジチオラン - 3 - イル) ペンチル] メタンスルホンアミド又はその薬理上許容される塩。