

【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21年7月2日(2009.7.2)

【公表番号】特表2008-540618(P2008-540618A)

【公表日】平成20年11月20日(2008.11.20)

【年通号数】公開・登録公報2008-046

【出願番号】特願2008-511739(P2008-511739)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/18	(2006.01)
A 6 1 K	31/4468	(2006.01)
A 6 1 K	31/5375	(2006.01)
A 6 1 K	31/40	(2006.01)
A 6 1 K	31/472	(2006.01)
A 6 1 K	31/4164	(2006.01)
A 6 1 K	31/381	(2006.01)
C 0 7 D	211/28	(2006.01)
C 0 7 D	295/08	(2006.01)
C 0 7 D	207/09	(2006.01)
C 0 7 D	217/02	(2006.01)
C 0 7 D	233/52	(2006.01)
C 0 7 D	233/24	(2006.01)
C 0 7 D	333/32	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/22	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(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	27/06	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/26	(2006.01)
A 6 1 P	9/04	(2006.01)
A 6 1 P	27/12	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	15/08	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
C 0 7 C	311/18	(2006.01)
C 0 7 C	311/17	(2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K	31/18	
A 6 1 K	31/4468	
A 6 1 K	31/5375	
A 6 1 K	31/40	
A 6 1 K	31/472	
A 6 1 K	31/4164	
A 6 1 K	31/381	
C 0 7 D	211/28	C S P
C 0 7 D	295/08	Z
C 0 7 D	207/09	
C 0 7 D	217/02	
C 0 7 D	233/52	
C 0 7 D	233/24	
C 0 7 D	333/32	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	25/24	
A 6 1 P	25/22	
A 6 1 P	43/00	1 0 5
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	35/04	
A 6 1 P	27/06	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	25/08	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/26	
A 6 1 P	9/04	
A 6 1 P	27/12	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	15/08	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
C 0 7 C	311/18	
C 0 7 C	311/17	

【 手続補正書 】

【 提出日 】 平成21年5月13日 (2009.5.13)

【 手続補正 1 】

【 補正対象書類名 】 特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

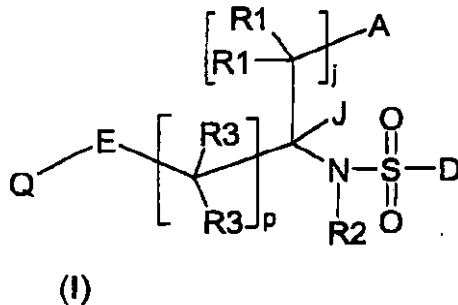
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

ソマトスタチン受容体サブタイプ1及び/又は4のアゴニスト又はアンタゴニストが有用であることが示唆されている哺乳動物の疾患又は症状を治療するための、以下の一般式 (I) :

【化1】



[式中、

Aが、NR⁶R⁶又はNR⁶-(C₁-C₃)アルキル-NR⁶R⁶であり、そして、上記(C₁-C₃)アルキルは、非置換であるか、若しくはR^aから選択される1~4個の基で置換されることができ；あるいは

Aが、0~2個の窒素を含む飽和又は不飽和の5又は6員環であり、上記の環が、非置換であるか、又はR⁶(R⁶がHである場合を除く)及び-(CH₂)_s-NR⁶R⁶から独立に選択される1~3個の基で置換されるか；あるいは

A及びJが、それらが結合する炭素原子と一緒に、1~2個の窒素を含む5~6員環を形成し、上記の環が、非置換であるか、又はR⁶又は-(CH₂)_s-NR⁶R⁶から独立に選択される1~3個の基で置換されるか；あるいは

A及びJが、それらが結合する炭素原子と一緒に、窒素を含まない5又は6員環を形成し、上記の環が、-(CH₂)_s-NR⁶R⁶、及びR⁶から独立に選択される0~2個の基で置換されるか；あるいは

A及びR²が、それらが結合する原子と一緒に、飽和の5又は6員環を形成し、上記の環が、-(CH₂)_s-NR⁶R⁶、及び(C₁-C₆)アルキルから独立に選択される0~3個の基で置換され；

Dが、アリール、ヘテロアリール、又はアリール-(C₁-C₂)-アルキルであり、且つ、非置換であるか、又はR^aから選択される1~7個の基で置換されることができ；

Eが、O、S、NR^b、又はCR^bR^bであり；

Jが、H又はメチルであるか；あるいは、Jが、Aと一緒に、スピロ環系の一部であり；

Qが、

1. アリール、
2. ヘテロアリール、又は
3. 式R⁴R⁵CH-の基、

であり、ここで、アリール又はヘテロアリールが、非置換であるか、若しくはR^aから選択される1~4個の置換基で置換され；

R¹が、独立に、R^aから選択される基であるか；あるいは

R¹及びR¹と一緒に、=Oを形成し；

R²が、

1. H、
2. (C₁-C₆) アルキル、
3. (C₂-C₆) アルケニル、
4. (C₃-C₇) シクロアルキル、又は
5. ベンジル

であるか；あるいは

R²が、Aと一緒に、環系の一部であり；

R³が、独立に、

1. H、
2. (C₁-C₆) アルキル、又は

EがNR^b若しくはCR^bR^bである場合に、R³とR^bが、それらが結合する原子の間に二重結合を形成することができ；

R⁴が、

1. H、
2. (C₁-C₆) アルキル、
3. (C₂-C₆) アルケニル、
4. (C₂-C₆) アルキニル、
5. Cy、
6. Cy-(C₁-C₆) アルキル、又は
7. Cy-(C₂-C₆) アルケニルであり、ここで、アルキル、アルケニル、アルキニル、及びCyが、それぞれ必要に応じて、R^aから選択される1~2個の置換基で置換され；

及びCyが、それぞれ必要に応じて、R^aから選択される1~2個の置換基で置換され；

R⁵が、

1. H、
2. (C₁-C₆) アルキル、
3. (C₂-C₆) アルケニル、
4. (C₂-C₆) アルキニル、
5. アリール、
6. アリール-(C₁-C₆) アルキル、
7. ヘテロアリール、
8. ヘテロアリール-(C₁-C₆) アルキル、
9. -OR^b、
10. -(CH₂)_k-OR^b、又は
11. -(CH₂)_kC(O)NHR^b、

であり、ここで、アリール及びヘテロアリールは、それぞれ必要に応じて、R^aから選択される1~2個の置換基で置換されるか；あるいは

R⁴及びR⁵が、それらが結合する原子と一緒に、N、O、及び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、そして、ここで、上記の環が、R^aから選択される1~3個の置換基で置換されてもよく；又は上記の環が、R^aから選択される1~3個の置換基で置換され得るアリール又はヘテロアリールに縮合されてもよく；

R⁶が、独立に、

1. H、
2. (C₁-C₆) アルキル、
3. (C₃-C₇) シクロアルキル、
4. (C₃-C₇) シクロアルキル(C₁-C₆) アルキル、又は
5. -C(=NR^b)NR^bR^b、

であり、ここで、記号R^bと一緒に、不飽和又は飽和の5又は6員環を形成することができ；あるいは

R⁶及びR⁶がそれらが結合する原子と一緒に、N、O、及びSから選択される1~3個のヘテロ原子を含む5~7員環を形成し、上記の環が非置換であるか、又は(C₁-C₆) アルキル若しくはハロゲンから独立に選択される1~4個の基で置換され；

R^aが、独立に、

1. H、
2. ハロゲン、
3. -OR^b、
4. -(C₁-C₆)アルキル-OR^b、
5. (C₁-C₆)アルキル、
6. -CF₃、
7. -NO₂、
8. -SR^b、
9. -NR^bR^b、
10. -CN、
11. -C(O)R^b、
12. (C₂-C₆)アルケニル、
13. (C₃-C₇)シクロアルキル、
14. -NR^bC(O)R^b、又は
15. -C(O)NHR^b、

であり；

R^bが、独立に、

1. 水素、
2. (C₁-C₆)アルキル、
3. Cy、又は
4. Cy-(C₁-C₄)アルキル、

であり；

pが、0～3の整数であり；

jが、0～4の整数であり；

kが、0～2の整数であり；

sが、0～2の整数である；そして

Cyが、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、又はヘテロアリールであり、但し、

a) EがCR^bR^b又はNR^bである場合、R₁及びR₁が一緒に=Oを形成できず、

b) Aがピロール又はピラゾールである場合、上述の環上の1～3個の置換基の1つが、-C(=NR^b)NR^bR^b、-(CH₂)_s-NR₆-C(=NR^b)NR^bR^b、又は-(CH₂)_s-NR₆R₆から選択されなければならない、

c) Aが窒素原子を含まない不飽和の6員環である場合、上述の環が、-C(=NR^b)NR^bR^b、-(CH₂)_s-NR₆-C(=NR^b)NR^bR^b、又は-(CH₂)_s-NR₆R₆から選択される1～3個の置換基で置換されなければならない、

d) Aが窒素原子を含まない飽和環である場合、環A上の1～3個の置換基の少なくとも1つが、-C(=NR^b)NR^bR^b、-(CH₂)_s-NR₆-C(=NR^b)NR^bR^b、又は-(CH₂)_s-NR₆R₆から選択されなければならない。]

によって表される化合物、あるいは、医薬として許容されるその塩又はエステルを含む医薬組成物。

【請求項2】

前記化合物がアゴニストである、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

前記化合物がアンタゴニストである、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項4】

前記化合物がsst₁選択性のものである、請求項1に記載の医薬組成物。

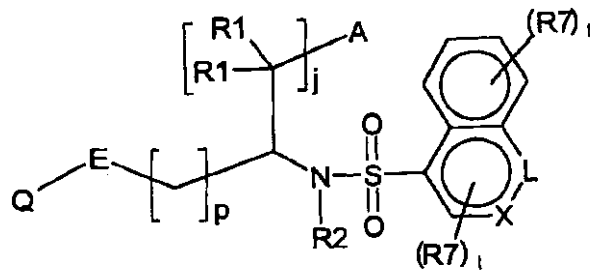
【請求項5】

前記化合物がsst₄選択性のものである、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項6】

前記式(1)によって表される化合物が、以下の式(II)：

【化2】



(II)

{ 式中、

A、E、Q、R1、R^a、R^b、p、及びjが、請求項1に規定されるとおりのものであり；

R2が、H又はCH₃であり；

R7が、独立に、

- 1) H、
- 2) ハロゲン、
- 3) -NO₂、
- 4) -NR^bR^b、
- 5) -CN、
- 6) -OR^b、
- 7) -SR^b、
- 8) -C(O)R^b、
- 9) (C₁-C₆) アルキル、
- 10) (C₂-C₆) アルケニル、
- 11) (C₃-C₇) シクロアルキル、又は
- 12) -CF₃、

であり；

Lが、C(R7)、S、又はNであり；

Xが、結合であるか、又はC(R7)であり；そして

tが、0~7の整数である。}によって表される化合物、あるいは、医薬として許容されるその塩又はエステルである、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項7】

Lが、CR7であり；

Xが、CHであり；

R7が、H、(C₁-C₄) アルキル、又はハロゲンから選択され；そして

t = 1である、請求項6に記載の医薬組成物。

【請求項8】

Eが、O又はNR^bであり；

R3が、Hであり；そして

pが、1又は2である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項9】

R1が、Hであり；

pが、1又は2であり；

jが、2又は3であり、そして

Aが、R6がH、(C₁-C₃) アルキル若しくは-C(=NH)NH₂から選択されるところのNR₆R₆である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

R1が、Hであり；

pが、1又は2であり；

jが、2又は3であり；

Aが、R6がH、(C₁-C₃)アルキル、又は-C(=NH)NH₂から選択されるところのNR₆R₆であり；

R7が、H、ハロゲン、又は-(C₁-C₃)アルキルであり；そして

tが、0又は1である、請求項6に記載の医薬組成物。

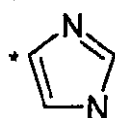
【請求項 11】

R1が、Hであり；

jが、0又は1であり；

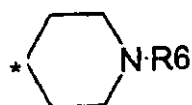
Aが、星印が結合点を意味するところの、

【化 3】



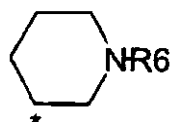
又は

【化 4】



又は

【化 5】



であり；そして

R6が、H、(C₁-C₃)アルキル、又は-C(=NH)NH₂である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

jが、1であり；

Aが、NR₆-(C₁-C₃)アルキル-NR₆R₆であり、且つ、R6が、独立に、H、(C₁-C₄)アルキル、シクロプロピル、又は-C(=NH)NH₂から選択される、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

R3が、Hであり；そして

pが、1である、請求項1～12のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記化合物が、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸(1-ベンジルオキシメチル-3-グ

アニジニル-プロピル)アミド、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸(4-アミノ-1-フェノキシ-メチルブチル)アミド、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸(4-アミノ-1-ベンジルオキシメチルブチル)アミド、4-メチルナフタレン-1-スルホン酸(2-ベンジルアミノ-1-ピペリジン-4-イルエチル)アミド、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸(4-イソプロピルアミノ-1-フェノキシメチルブチル)アミド、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸(4-アミノ-1-ベンジルスルファニルメチルブチル)アミド、(R)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸[1-(2-アミノエチルカルバモイル)-2-ベンジルオキシエチル]アミド、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸[1-(2-アミノエチルカルバモイル)-2-ベンジルスルファニルエチル]アミド、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸{2-ベンジルオキシ-1-[(2-ジメチルアミノエチルアミノ)メチル]エチル}アミド、(S)-N-(1-ベンジルオキシメチル-3-グアニジニルプロピル)-2,3,4,5,6-ペンタメチルベンゼンスルホンアミド、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸{4-イソプロピルアミノ-1-[(1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イルアミノ)メチル]ブチル}アミド、(R)-[4-メチルナフタレン-1-スルホン酸[1-(2-アミノエチル)-3-フェニルプロピル]アミド、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸[1-(ベンジルアミノ-メチル)-2-(1H-イミダゾール-4-イル)エチル]アミド、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸[2-(1H-イミダゾール-4-イル)-1-フェノキシメチル-エチル]アミド、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸[1-ベンジルオキシメチル-3-(4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-2-イルアミノ)プロピル]アミド、又は(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸[2-(1H-イミダゾール-4-イル)-1-フェニルアミノメチルエチル]アミドである、請求項1~13のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項15】

前記疾患又は症状が、鬱病、不安症、双極性障害、ADHD、血管新生、再狭窄、新生血管発芽、動脈硬化、糖尿病性血管症、糖尿病性網膜症、癌性腫瘍及び腫瘍転移、高い眼内圧、加齢性黄斑変性症、創傷治癒、急性型の神経原性及び非神経原性炎症、及び疼痛、並びに慢性炎症及び神経因性疼痛である、請求項1に記載の医薬組成物。

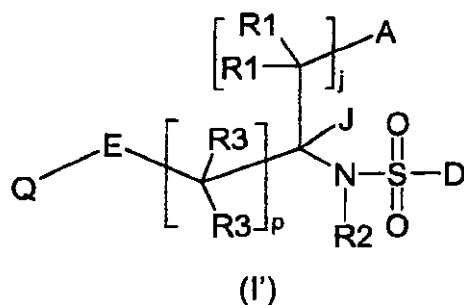
【請求項16】

sst₁及び/又はsst₄受容体を有する、健康な又は疾患の組織及び/又は臓器、例えば、脳、血管、又は腫瘍などの造影用の薬剤を製造するための、請求項1に記載の式(1)によって表される化合物の使用。

【請求項17】

以下の一般式(I'):

【化6】



[式中、

Aが、NR₆R₆又はNR₆-(C₁-C₃)アルキル-NR₆R₆であり、そして、上記(C₁-C₃)アルキルは、非置換であるか、若しくはR^aから選択される1~4個の基で置換されることができ；あるいは

Aが、0~2個の窒素を含む飽和又は不飽和の5又は6員環であり、上記の環が、非置換で

あるか、又はR6 (R6がHである場合を除く) 及び- (CH₂)_s-NR6R6から独立に選択される1~3個の基で置換されるか; あるいは

A及びJが、それらが結合する炭素原子と一緒に、1~2個の窒素を含む5~6員環を形成し、上記の環が、非置換であるか、又はR6又は- (CH₂)_s-NR6R6から独立に選択される1~3個の基で置換されるか; あるいは

A及びJが、それらが結合する炭素原子と一緒に、窒素を含まない5又は6員環を形成し、上記の環が、(CH₂)_s-NR6R6、及びR6から独立に選択される0~2個の基で置換されるか; あるいは

A及びR2が、それらが結合する原子と一緒に、飽和の5又は6員環を形成し、上記の環が、(CH₂)_s-NR6R6、及び(C₁-C₆) アルキルから独立に選択される0~3個の基で置換され;

Dが、アリール、ヘテロアリール、又はアリール-(C₁-C₂)-アルキルであり、且つ、非置換であるか、又はR^aから選択される1~7個の基で置換されることができ;

Eが、O、S、又はNR^bであり;

Jが、H又はメチルであるか; あるいは、Jが、Aと一緒に、スピロ環系の一部であり;

Qが、

1. フェニル、
2. ベンジル、又は
3. 式R4R5CH-の基、

であり、ここで、上記フェニル又はベンジルが、非置換であるか、若しくはR^aから選択される1~4個の置換基で置換され;

R1が、独立に、R^aから選択される基であり;

R2が、

1. H、
2. (C₁-C₆) アルキル、
3. (C₂-C₆) アルケニル、
4. (C₃-C₇) シクロアルキル、又は
5. ベンジル

であるか; あるいは

R2が、Aと一緒に、環系の一部であり;

R3が、独立に、

- 1) H、
- 2) (C₁-C₆) アルキル、又は

EがNR^bである場合に、R3とR^bが、それらが結合する原子の間に二重結合を形成することができ;

R4が、

1. H、
2. (C₁-C₆) アルキル、
3. (C₂-C₆) アルケニル、
4. (C₂-C₆) アルキニル、
5. Cy、
6. Cy-(C₁-C₆) アルキル、又は
7. Cy-(C₂-C₆) アルケニルであり、ここで、アルキル、アルケニル、アルキニル、及びCyが、それぞれ必要に応じて、R^aから選択される1~2個の置換基で置換され;

R5が、

1. H、
2. (C₁-C₆) アルキル、
3. (C₂-C₆) アルケニル、
4. (C₂-C₆) アルキニル、
5. アリール、

6. アリール- (C_1-C_6) アルキル、
7. ヘテロアリール、
8. ヘテロアリール- (C_1-C_6) アルキル、
9. $-OR^b$ 、
10. $-(CH_2)_k-OR^b$ 、又は
11. $-(CH_2)_kC(O)NHR^b$ 、

であり、ここで、アリール及びヘテロアリールは、それぞれ必要に応じて、 R^a から選択される1~2個の置換基で置換されるか；あるいは

$R4$ 及び $R5$ が、それらが結合する原子と一緒に、N、O、及び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、そして、ここで、上記の環が、 R^a から選択される1~3個の置換基で置換されてもよく；又は上記の環が、 R^a から選択される1~3個の置換基で置換される得るアリール又はヘテロアリールに縮合されてもよく；

$R6$ が、独立に、

1. H、
2. (C_1-C_6) アルキル、
3. (C_3-C_7) シクロアルキル、
4. (C_3-C_7) シクロアルキル (C_1-C_6) アルキル、又は
5. $-C(=NR^b)NR^bR^b$ 、

であり、ここで、記号 R^b と一緒に、不飽和又は飽和の5又は6員環を形成することができ；あるいは

$R6$ 及び $R6$ がそれらが結合する原子と一緒に、N、O、及びSから選択される1~3個のヘテロ原子を含む5~7員環を形成し、上記の環が非置換であるか、又は (C_1-C_6) アルキル若しくはハロゲンから独立に選択される1~4個の基で置換され；

R^a が、独立に、

1. H、
2. ハロゲン、
3. $-OR^b$ 、
4. (C_1-C_6) アルキル- OR^b 、
5. (C_1-C_6) アルキル、
6. $-CF_3$ 、
7. $-NO_2$ 、
8. $-SR^b$ 、
9. $-NR^bR^b$ 、
10. $-CN$ 、
11. $-C(O)R^b$ 、
12. (C_2-C_6) アルケニル、
13. (C_3-C_7) シクロアルキル、
14. $-NR^bC(O)R^b$ 、又は
15. $-C(O)NHR^b$ 、

であり；

R^b が、独立に、

1. 水素、
2. (C_1-C_6) アルキル、
3. Cy、又は
4. Cy- (C_1-C_4) アルキル、

であり；

p が、0~3の整数であり；

j が、0~4の整数であり；

k が、0~2の整数であり；

s が、0~2の整数である；そして

Cyが、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、又はヘテロアリールであり、
但し、

- a) Aが芳香族系を含む時、EがOであることはできず、
- b) EがNR^bであり、且つ、AがNR6R6である場合、p及びjが同時に1であることはできず、

c) Aがピロール又はピラゾールである場合、上記の環上の1～3個の置換基の1つが-C(=NR^b)NR^bR^b、-(CH₂)_s-NR6-C(=NR^b)NR^bR^b、又は-(CH₂)_s-NR6R6から選択されなければならない、

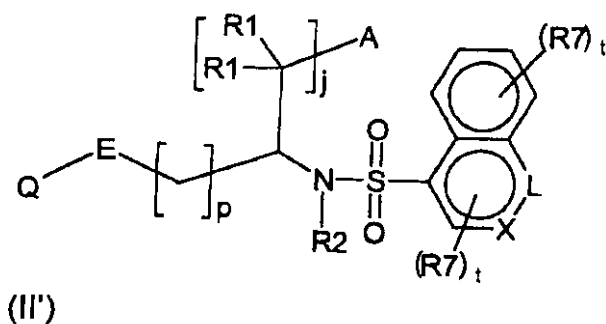
d) Aが窒素原子を含まない不飽和の6員環である場合、上述の環が-C(=NR^b)NR^bR^b、-(CH₂)_s-NR6-C(=NR^b)NR^bR^b、又は-(CH₂)_s-NR6R6から選択される1～3個の置換基で置換されなければならない、

e) Aが窒素原子を含まない飽和環である場合、環A上の1～3個の置換基の少なくとも1つが-C(=NR^b)NR^bR^b、-(CH₂)_s-NR6-C(=NR^b)NR^bR^b、又は-(CH₂)_s-NR6R6から選択されなければならない。]によって表される化合物、あるいは、医薬として許容されるその塩又はエステル。

【請求項 18】

以下の式(II'):

【化 7】



{ 式中、

A、E、Q、R¹、及びjが、請求項17に規定されるとおりのものであり；

R₂が、H又はCH₃であり；

R₇が、独立に、

- 1) H、
- 2) ハロゲン、
- 3) -NO₂、
- 4) -NR^bR^b、
- 5) -CN、
- 6) -OR^b、
- 7) -SR^b、
- 8) -C(O)R^b、
- 9) (C₁-C₆) アルキル、
- 10) (C₂-C₆) アルケニル、
- 11) (C₃-C₇) シクロアルキル、又は
- 12) CF₃、

であり；

R^bが、請求項1に規定されるとおりのものであり；

Lが、C(R₇)、S、又はNであり；

Xが、結合であるか又はC(R₇)であり；

pが、1又は2であり；

tが、0～7の整数である。}によって表される化合物である、請求項17に記載の化合物

。

【請求項19】

Eが、0又はNR^bである、請求項17に記載の化合物。

【請求項20】

Aが、R6がH、(C₁-C₄)アルキル、シクロプロピル、又は-C(=NH)NH₂から独立に選択されるところのNR₆R₆であり；そして

jが、2又は3である、請求項17に記載の化合物。

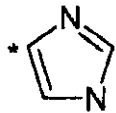
【請求項21】

R1が、Hであり；

jが、0又は1であり；そして

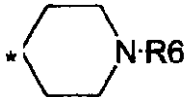
Aが、星印が結合点を意味するところの、

【化8】



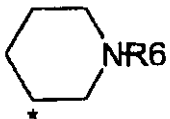
又は

【化9】



又は

【化10】



であり、そして、R6が、H、(C₁-C₃)アルキル、又は-C(=NH)NH₂である、請求項17に記載の化合物。

【請求項22】

Qが、非置換の又はR^aから選択される1～4個の置換基で置換されるフェニルあるいはベンジルであり、そして、R^aが請求項17に規定されたとおりのものである、請求項17に記載の化合物。

【請求項23】

Lが、C(R7)であり、tが、0又は1であり、Xが、CHであり、そして、R7が、H、(C₁-C₃)アルキル、又はハロゲンから選択される、請求項18に記載の化合物。

【請求項24】

Eが、0又はNR^bである、請求項18に記載の化合物。

【請求項 25】

Aが、NR₆R₆であり、そして、R₆が、H、(C₁-C₄)アルキル、シクロプロピル、又は-C(=NH)NH₂から独立に選択され；そして

jが、2又は3である、請求項18に記載の化合物。

【請求項 26】

Aが、NR₆-(C₁-C₃)アルキル-NR₆R₆であり、そして、R₆が、H、(C₁-C₄)アルキル、シクロプロピル、又は-C(=NH)NH₂から独立に選択され；そして

jが、1である、請求項18に記載の化合物。

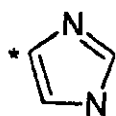
【請求項 27】

R₁が、Hであり；

jが、0又は1であり；そして

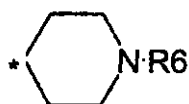
Aが、星印が結合点を意味するところの、

【化 1 1】



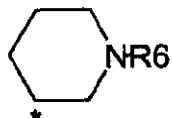
又は

【化 1 2】



又は

【化 1 3】



であり、そして、R₆が、H、(C₁-C₃)アルキル、又は-C(=NH)NH₂である、請求項18に記載の化合物。

【請求項 28】

Qが、非置換の又はR^aから選択される1~4個の置換基で置換されるフェニルあるいはベンジルであり、そして、ここで、R^aが請求項17に規定されるとおりのものである、請求項18に記載の化合物。

【請求項 29】

Lが、C(R₇)であり、tが、0又は1であり、Xが、CHであり、そして、R₇が、H、(C₁-C₃)アルキル、又はハロゲンから選択される、請求項25に記載の化合物。

【請求項 30】

Eが、0又はNR^bである、請求項25に記載の化合物。

【請求項 31】

Qが、非置換の又はR^aから選択される1~4個の置換基で置換されるフェニルあるいはベンジルであり、そして、ここで、R^aが請求項17で規定されるとおりのものである、請求項25に記載の化合物。

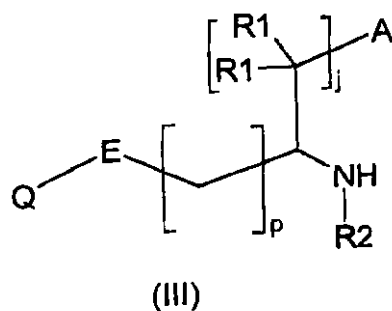
【請求項32】

前記化合物が、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸(1-ベンジルオキシメチル-3-グアニジニル-プロピル)アミド、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸(4-アミノ-1-フェノキシ-メチルブチル)アミド、(S)-4-メチル-ナフタレン-1-スルホン酸(4-アミノ-1-ベンジルオキシメチルブチル)アミド[J-2607]、4-メチルナフタレン-1-スルホン酸(2-ベンジリアミノ-1-ピペリジン-4-イルエチル)アミド、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸(4-イソプロピルアミノ-1-フェノキシメチルブチル)アミド、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸(4-アミノ-1-ベンジルスルファニルメチルブチル)アミド、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸{2-ベンジルオキシ-1-[(2-ジメチルアミノエチルアミノ)メチル]エチル}アミド、(S)-N-(1-ベンジルオキシメチル-3-グアニジニルプロピル)-2,3,4,5,6-ペンタメチルベンゼンスルホンアミド、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸{4-イソプロピルアミノ-1-[(1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イルアミノ)メチル]ブチル}アミド、(R)-[4-メチルナフタレン-1-スルホン酸[1-(2-アミノエチル)-3-フェニルプロピル]アミド、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸[1-(ベンジリアミノ-メチル)-2-(1H-イミダゾール-4-イル)エチル]アミド、(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸[1-ベンジルオキシメチル-3-(4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-2-イルアミノ)プロピル]アミド、又は(S)-4-メチルナフタレン-1-スルホン酸[2-(1H-イミダゾール-4-イル)-1-フェニルアミノメチルエチル]アミドである、請求項17~31のいずれか1項に記載の式(I')によって表される化合物。

【請求項33】

以下の式(III)：

【化14】

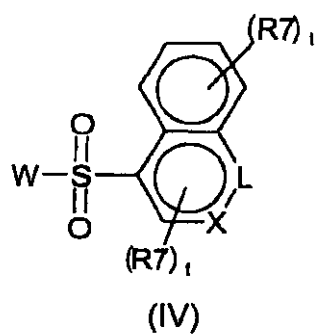


{ 式中、

A、E、Q、R¹、p、及びjが、請求項18に規定されるとおりのものであり；そして

R²が、H、アルキル、シクロアルキル、又は保護基である。}によって表されるアミド化したアミノ酸を、以下の式(IV)：

【化 1 5】



{ 式中、Wが、OH、又はハロゲン、特に、Cl若しくはBrである。 } によって表されるスルホニル酸誘導体と反応させるステップであって、式 (III) 及び (IV) によって表される化合物が必要に応じて保護される前記ステップを含む、請求項18に記載の化合物の製造方法。

【請求項 3 4】

医薬として許容される希釈剤、担体及び / 又は賦形剤と一緒に、有効成分として請求項17に記載の式 (I') によって表される化合物を含む医薬組成物。