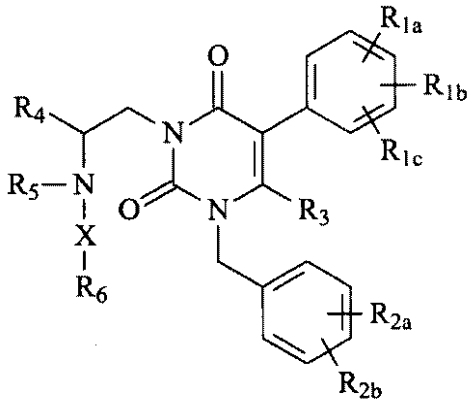
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成19年9月13日(2007.9.13)

【公表番号】特表2007-521309(P2007-521309A)
【公表日】平成19年8月2日(2007.8.2)
【年通号数】公開・登録公報2007-029
【出願番号】特願2006-518842(P2006-518842)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 239/54 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 405/04 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 403/12 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/505 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/506 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 13/08 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 15/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 15/08 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 5/24 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 5/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/20 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 239/54 ＣＳＰＺ
Ｃ０７Ｄ 405/04
Ｃ０７Ｄ 403/12
Ａ６１Ｋ 31/505
Ａ６１Ｋ 31/506
Ａ６１Ｐ 35/00
Ａ６１Ｐ 13/08
Ａ６１Ｐ 15/00
Ａ６１Ｐ 15/08
Ａ６１Ｐ 37/02
Ａ６１Ｐ 1/04
Ａ６１Ｐ 5/24
Ａ６１Ｐ 5/06
Ａ６１Ｐ 25/20

【手続補正書】
【提出日】平成19年6月15日(2007.6.15)
【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】
以下の構造：

【化１】



(I)

を有する化合物またはその立体異性体、プロドラッグ、もしくは薬学的に受容可能な塩であって、ここで：

R_{1a}、R_{1b}およびR_{1c}は、同じであるかまたは異なり、そして独立に、水素、ハロゲン、$C_{1\sim4}$アルキル、ヒドロキシまたはアルコキシであるか、またはR_{1a}およびR_{1b}は、一緒になって－ＯＣＨ$_2$Ｏ－または－ＯＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－を形成し；

R_{2a}およびR_{2b}は、同じであるかまたは異なり、そして独立に、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、または－ＳＯ$_2$ＣＨ$_3$であり；

R_3は、水素またはメチルであり；

R_4は、フェニルまたは$C_{3\sim7}$アルキルであり；

R_5は、水素または$C_{1\sim4}$アルキルであり；

R_6は、－ＣＯＯＨまたは酸同配体であり；ならびに

Ｘは、必要に応じて１～３個の$C_{1\sim6}$アルキル基で置換されている$C_{1\sim6}$アルカンジイルである、化合物。

【請求項２】

R_{1a}が、ハロゲンである、請求項１に記載の化合物。

【請求項３】

R_{1b}が、アルコキシである、請求項１に記載の化合物。

【請求項４】

R_{1b}が、メトキシである、請求項３に記載の化合物。

【請求項５】

R_{1c}が、ハロゲンである、請求項１に記載の化合物。

【請求項６】

R_{1c}が、フルオロまたはクロロである、請求項５に記載の化合物。

【請求項７】

R_{2a}が、ハロゲンである、請求項１に記載の化合物。

【請求項８】

R_{2b}が、水素、ハロゲンまたは－ＳＯ$_2$ＣＨ$_3$である、請求項１に記載の化合物。

【請求項９】

R_3が、水素である、請求項１に記載の化合物。

【請求項１０】

R_3が、メチルである、請求項１に記載の化合物。

【請求項１１】

R_4が、フェニルである、請求項１に記載の化合物。

【請求項１２】

R_4が、$C_{3\sim7}$アルキルである、請求項１に記載の化合物。

【請求項１３】

$C_{3\sim7}$アルキルが、シクロペンチルまたはシクロヘキシルである、請求項１２に記載の化合物。
【請求項１４】
R_5が、Ｈまたはメチルである、請求項１に記載の化合物。
【請求項１５】
R_6が、－ＣＯＯＨである、請求項１に記載の化合物。
【請求項１６】
R_6が、酸同配体である、請求項１に記載の化合物。
【請求項１７】
前記酸同配体が、テトラゾール－５－イルである、請求項１６に記載の化合物。
【請求項１８】
Ｘが、直鎖$C_{1\sim6}$アルカンジイルである、請求項１に記載の化合物。
【請求項１９】
前記直鎖$C_{1\sim6}$アルカンジイルが、$-CH_2CH_2CH_2-$である、請求項１８に記載の化合物。
【請求項２０】
R_4が、フェニルである、請求項１９に記載の化合物。
【請求項２１】
R_{1a}およびR_{2a}が、ハロゲンである、請求項２０に記載の化合物。
【請求項２２】
R_3が、メチルである、請求項２１に記載の化合物。
【請求項２３】
R_3が、水素である、請求項２１に記載の化合物。
【請求項２４】
Ｘが、分枝$C_{1\sim6}$アルカンジイルである、請求項１に記載の化合物。
【請求項２５】
前記化合物が、３－［２（Ｒ）－｛ヒドロキシカルボニルプロピル－アミノ｝－２－フェニルエチル］－５－（２－フルオロ－３－メトキシフェニル）－１－［２－フルオロ－６－（トリフルオロメチル）ベンジル］－６－メチル－ピリミジン－２，４（１Ｈ，３Ｈ）－ジオン、３－［２（Ｒ）－｛ヒドロキシカルボニルプロピル－アミノ｝－２－フェニルエチル］－５－（３－イソプロピルフェニル）－１－［２－フルオロ－６－（トリフルオロメチル）ベンジル］－６－メチル－ピリミジン－２，４（１Ｈ，３Ｈ）－ジオン、３－［２（Ｒ）－｛ヒドロキシカルボニルプロピル－アミノ｝－２－（シクロヘキシル）エチル］－５－（２－フルオロ－３－メトキシフェニル）－１－［２－フルオロ－６－（トリフルオロメチル）ベンジル］－６－メチル－ピリミジン－２，４（１Ｈ，３Ｈ）－ジオン、または３－［２（Ｒ）－｛２－［１－（５－テトラゾイル）プロピル］－アミノ｝－２－フェニルエチル］－５－（２－フルオロ－３－メトキシフェニル）－１－［２－フルオロ－６－メチルスルホニルベンジル］－６－メチルピリミジン－２，４（１Ｈ，３Ｈ）－ジオンである、請求項１に記載の化合物。
【請求項２６】
前記化合物が、３－［２（Ｒ）－｛ヒドロキシカルボニルプロピル－アミノ｝－２－フェニルエチル］－５－（２－クロロフェニル）－１－［２－フルオロ－６－（トリフルオロメチル）ベンジル］－ピリミジン－２，４（１Ｈ，３Ｈ）－ジオン、３－［２（Ｒ）－｛ヒドロキシカルボニルプロピル－アミノ｝－２－フェニルエチル］－５－（２－フルオロ－３－メトキシフェニル）－１－［２－フルオロ－６－（トリフルオロメチル）ベンジル］－ピリミジン－２，４（１Ｈ，３Ｈ）－ジオン、３－［２（Ｒ）－｛ヒドロキシカルボニルプロピル－アミノ｝－２－フェニルエチル］－５－（２－クロロ－３－メチルフェニル）－１－［２－フルオロ－６－（トリフルオロメチル）ベンジル］－ピリミジン－２，４（１Ｈ，３Ｈ）－ジオン、３－［２（Ｒ）－｛ヒドロキシカルボニルプロピル－アミノ｝－２－フェニルエチル］－５－（２－クロロフェニル）－１－［２－フルオロ－６－（

メチルスルホニル）ベンジル］－ピリミジン－２，４（１Ｈ，３Ｈ）－ジオン、３－［２（Ｒ）－｛ヒドロキシカルボニルプロピル－アミノ｝－２－フェニルエチル］－５－（２－クロロ－３－メトキシフェニル）－１－［２－フルオロ－６－（トリフルオロメチル）ベンジル］－ピリミジン－２，４（１Ｈ，３Ｈ）－ジオン、または３－［２（Ｒ）－｛ヒドロキシカルボニルプロピル－アミノ｝－２－（イソブチル）エチル］－５－（２－クロロ－３－メトキシフェニル）－１－［２－フルオロ－６－（トリフルオロメチル）ベンジル］－ピリミジン－２，４（１Ｈ，３Ｈ）－ジオンである、請求項１に記載の化合物。

【請求項２７】

請求項１に記載の化合物および薬学的に受容可能なキャリアまたは希釈剤を含む、薬学的組成物。

【請求項２８】

性腺刺激ホルモン放出ホルモンの拮抗を必要としている被験体において、性腺刺激ホルモン放出ホルモンに拮抗するための組成物であって、該組成物は、有効量の請求項１に記載の化合物を含有する、組成物。

【請求項２９】

性ホルモン関連状態の処置を必要としている被験体の性ホルモン関連状態を処置するための請求項２７に記載の組成物であって、該組成物は、有効量で存在する、組成物。

【請求項３０】

前記性ホルモン関連状態は、癌、良性前立腺肥大または子宮筋腫である、請求項２９に記載の組成物。

【請求項３１】

前記癌は、前立腺癌、子宮癌、乳癌または下垂体前葉腺腫である、請求項３０に記載の組成物。

【請求項３２】

前記癌は、前立腺癌である、請求項３１に記載の組成物。

【請求項３３】

前記性ホルモン関連状態は、子宮内膜症、多嚢胞性卵巣疾患、子宮線維平滑筋腫または性的早熟症である、請求項２９に記載の組成物。

【請求項３４】

前記性ホルモン関連状態は、子宮内膜症である、請求項３３に記載の組成物。

【請求項３５】

前記性ホルモン関連状態は、子宮線維平滑筋腫である、請求項２９に記載の組成物。

【請求項３６】

不妊症の処置を必要としている被験体の不妊症を処置するための請求項２７に記載の組成物であって、該組成物は、有効量で存在する、組成物。

【請求項３７】

エリテマトーデス、過敏性腸症候群、月経前症候群、多毛症、低身長または睡眠障害の処置を必要としている被験体のエリテマトーデス、過敏性腸症候群、月経前症候群、多毛症、低身長または睡眠障害を処置するための請求項２７に記載の組成物であって、該組成物は、有効量で存在する、組成物。