

【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20年12月25日 (2008.12.25)

【公表番号】特表2008-519826(P2008-519826A)

【公表日】平成20年6月12日 (2008.6.12)

【年通号数】公開・登録公報2008-023

【出願番号】特願2007-540808(P2007-540808)

【国際特許分類】

C 07 D 239/47 (2006.01)

A 61 K 31/506 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 7/06 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 9/12 (2006.01)

A 61 P 11/06 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 P 13/08 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

A 61 P 15/10 (2006.01)

A 61 P 19/04 (2006.01)

A 61 P 27/06 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 37/02 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 239/47 C S P Z

A 61 K 31/506

A 61 P 1/04

A 61 P 3/10

A 61 P 7/06

A 61 P 9/00

A 61 P 9/10

A 61 P 9/10 1 0 1

A 61 P 9/10 1 0 3

A 61 P 9/12

A 61 P 11/06

A 61 P 11/00

A 61 P 13/08

A 61 P 13/12

A 61 P 15/10

A 61 P 19/04

A 61 P 27/06

A 61 P 27/02

A 61 P 29/00

A 6 1 P 31/04  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 37/02  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

## 【手続補正書】

【提出日】平成20年10月31日(2008.10.31)

## 【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

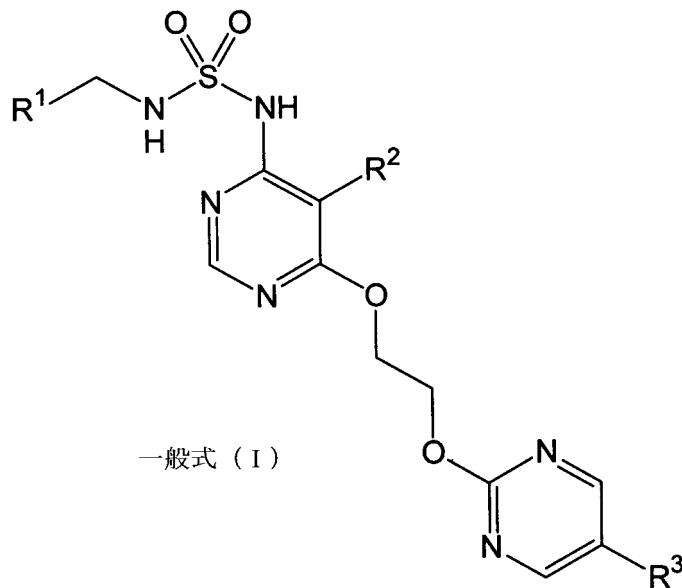
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式(1)の化合物、並びにこれらの光学的に純粋な鏡像異性体、ラセミ化合物などの鏡像異性体の混合物および薬学的に許容される塩：

【化 1】



式中、

$R^1$  は、 $-\text{CH}(\text{OH})-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_2\text{COOH}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{COOH}$ を表し；

$R^2$  は、4-プロモフェニル、4-クロロフェニル、4-メチルフェニル、2-メトキシフェノキシ、3-メトキシフェノキシ、2-クロロ-5-メトキシ-フェノキシを表し；

$R^3$  は、臭素または塩素を表す。

【請求項 2】

$R^1$  が $-\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{OH}$ を表し、かつ $R^2$ および $R^3$ が請求項1に記載の一般式(1)で定義されたとおりである、請求項1に記載の一般式(1)のスルファミド誘導体；

並びにこれらの光学的に純粋な鏡像異性体、ラセミ化合物などの鏡像異性体の混合物および薬学的に許容される塩。

【請求項 3】

$R^1$  が $-\text{CH}_2-\text{COOH}$ を表し、かつ $R^2$ および $R^3$ が請求項1に記載の一般式(1)で定義されたとおりである、請求項1に記載の一般式(1)のスルファミド誘導体；

並びにこれらの光学的に純粋な鏡像異性体、ラセミ化合物などの鏡像異性体の混合物および薬学的に許容される塩。

【請求項 4】

$R^2$ が4-プロモフェニルを表し、かつ $R^1$ および $R^3$ が請求項1に記載の一般式(1)で定義されたとおりである、請求項1に記載の一般式(1)のスルファミド誘導体；

並びにこれらの光学的に純粋な鏡像異性体、ラセミ化合物などの鏡像異性体の混合物および薬学的に許容される塩。

【請求項5】

$R^3$ が臭素を表し、かつ $R^1$ および $R^2$ が請求項1に記載の一般式(1)で定義されたとおりである、請求項1に記載の一般式(1)のスルファミド誘導体；

並びにこれらの光学的に純粋な鏡像異性体、ラセミ化合物などの鏡像異性体の混合物および薬学的に許容される塩。

【請求項6】

$R^1$ が $-\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{OH}$ または $-\text{CH}_2-\text{COOH}$ を表し、 $R^2$ が4位においてハロゲンで置換されたフェニルを表し、かつ $R^3$ が上記一般式(1)で定義されたとおりである、請求項1に記載の一般式(1)のスルファミド誘導体；

並びにこれらの光学的に純粋な鏡像異性体、ラセミ化合物などの鏡像異性体の混合物および薬学的に許容される塩。

【請求項7】

$R^1$ が $-\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{OH}$ を表し、かつ $R^2$ が4-プロモフェニルを表し、かつ $R^3$ が請求項1に記載の一般式(1)で定義されたとおりである、請求項1に記載の一般式(1)のスルファミド誘導体；

並びにこれらの光学的に純粋な鏡像異性体、ラセミ化合物などの鏡像異性体の混合物および薬学的に許容される塩。

【請求項8】

$R^1$ が $-\text{CH}_2-\text{COOH}$ を表し、かつ $R^2$ が4-プロモフェニルを表し、かつ $R^3$ が上記一般式(1)で定義されたとおりである、請求項1に記載の一般式(1)のスルファミド誘導体；

並びにこれらの光学的に純粋な鏡像異性体、ラセミ化合物などの鏡像異性体の混合物および薬学的に許容される塩。

【請求項9】

3-ヒドロキシプロピルスルファミン酸{5-(4-プロモフェニル)-6-[2-(5-プロモピリミジン-2-イルオキシ)-エトキシ]-ピリミジン-4-イル}-アミド、

2-ヒドロキシカルボニルエチルスルファミン酸{5-(4-プロモフェニル)-6-[2-(5-プロモピリミジン-2-イルオキシ)-エトキシ]-ピリミジン-4-イル}アミドからなる群より選択される、請求項1～8のいずれか1項に記載のスルファミド誘導体。

【請求項10】

高血圧症治療、冠状動脈疾患、心不全、腎臓および心筋虚血、腎不全、脳虚血、痴呆、片頭痛、クモ膜下出血、レイノー症候群、門脈圧亢進症、肺性高血圧、アテローム性動脈硬化症、バルーンまたはステント血管形成術後の再狭窄の予防、炎症、肺線維症、結合組織病、胃および十二指腸潰瘍、指潰瘍、癌、前立腺肥大症、勃起障害、聴覚損失、黒内障、慢性気管支炎、喘息、グラム陰性敗血症、ショック、鎌状赤血球貧血、糸球体腎炎、腎臓痛、緑内障、血管もしくは心臓外科手術における、または臓器移植後の合併症、並びにシクロスポリンの合併症、糖尿病合併症の治療および予防のための医薬として使用するための、請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項11】

高血圧症治療、冠状動脈疾患、心不全、腎臓および心筋虚血、腎不全、脳虚血、痴呆、片頭痛、クモ膜下出血、レイノー症候群、門脈圧亢進症、肺性高血圧、アテローム性動脈硬化症、バルーンまたはステント血管形成術後の再狭窄の予防、炎症、肺線維症、結合組織病、胃および十二指腸潰瘍、指潰瘍、癌、黒色腫、前立腺癌、前立腺肥大症、勃起障害、聴覚損失、黒内障、慢性気管支炎、喘息、グラム陰性敗血症、ショック、鎌状赤血球貧血、糸球体腎炎、腎臓痛、緑内障、糖尿病合併症の治療および予防、血管もしくは心臓外科手術における、または臓器移植後の合併症、並びにシクロスポリンの合併症の治療のための医薬組成物の製造のための活性成分としての、請求項1～9のいずれか1項に記載の1つ

または複数の化合物の使用。

【請求項 12】

請求項10又は11において請求した疾患治療のための、請求項1～9に記載のいずれか1項において請求した少なくとも1つの化合物と薬学的に許容される賦形剤とを含む医薬組成物。