

【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17年11月24日(2005.11.24)

【公表番号】特表2001-521504(P2001-521504A)

【公表日】平成13年11月6日(2001.11.6)

【出願番号】特願平10-541945

【国際特許分類第7版】

C 0 7 C 311/29

A 6 1 K 31/18

A 6 1 K 31/198

A 6 1 K 31/216

A 6 1 K 31/4164

A 6 1 K 31/42

A 6 1 K 31/4406

A 6 1 K 31/4409

A 6 1 K 31/443

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 P 1/02

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 13/00

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/04

A 6 1 P 43/00

C 0 7 C 323/59

C 0 7 C 323/60

C 0 7 D 213/32

C 0 7 D 213/68

C 0 7 D 233/54

C 0 7 D 261/08

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 413/12

【F I】

C 0 7 C 311/29

A 6 1 K 31/18

A 6 1 K 31/198

A 6 1 K 31/216

A 6 1 K 31/4164

A 6 1 K 31/42

A 6 1 K 31/4406

A 6 1 K 31/4409

A 6 1 K 31/443

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 P 1/02

A 6 1 P 9/10  
A 6 1 P 13/00  
A 6 1 P 17/00  
A 6 1 P 19/02  
A 6 1 P 19/10  
A 6 1 P 25/28  
A 6 1 P 27/02  
A 6 1 P 29/00 1 0 1  
A 6 1 P 35/00  
A 6 1 P 35/04  
A 6 1 P 43/00  
A 6 1 P 43/00 1 1 1  
C 0 7 C 323/59  
C 0 7 C 323/60  
C 0 7 D 213/32  
C 0 7 D 213/68  
C 0 7 D 233/54  
C 0 7 D 261/08  
C 0 7 D 405/12  
C 0 7 D 413/12

【手続補正書】

【提出日】平成17年3月30日(2005.3.30)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】補正の内容のとおり

【補正方法】変更

【補正の内容】

## 手 続 補 正 書

平成17年 3月30日

特許庁長官 殿



## 1. 事件の表示

平成10年 特許願 第541945号

## 2. 補正をする者

名 称 アグロン・ファーマシュウティカルズ・インコーポレーテッド

## 3. 代 理 人

住 所 東京都千代田区大手町二丁目2番1号 新大手町ビル 206区  
ユアサハラ法律特許事務所

電 話 3270-6641~6

氏 名 (8970) 弁理士 社 本 一 夫



## 4. 補正対象書類名

請求の範囲



## 5. 補正対象項目名

請求の範囲

## 6. 補正の内容

別紙の通り



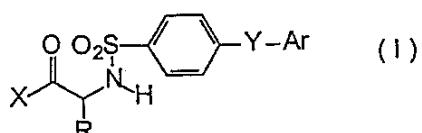
(別紙)

請求の範囲を下記の通り補正する。

『

## 請求の範囲

### 1. 式 I の化合物：



(式中、

YはOまたはSであり；

Arはアリール基またはヘテロアリール基であり；

Rは水素、アルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、または-C(O)R<sub>1</sub>であり、

ここでR<sub>1</sub>は水素、アルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基またはNR<sub>2</sub>R<sub>2</sub>であり、ここでR<sub>2</sub>およびR<sub>2</sub>'は独立して水素、アルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基またはヘテロアリール基であり；

Xは-NH-OHまたは-OHである)

またはその薬剤学的に許容しうるプロドラッグ、塩もしくは溶媒和物。

2. Arが、Y部分に対しパラ位において適切な置換基で置換されたアリール基である、請求項1記載の化合物またはその薬剤学的に許容しうるプロドラッグ、塩もしくは溶媒和物。

3. 適切な置換基がハロゲン、アルキル基、O-アルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、またはS-アルキル基である、請求項2記載の化合物またはその薬剤学的に許容しうるプロドラッグ、塩もしくは溶媒和物。

4. Rがアルキル基である、請求項1記載の化合物またはその薬剤学的に許容しうるプロドラッグ、塩もしくは溶媒和物。

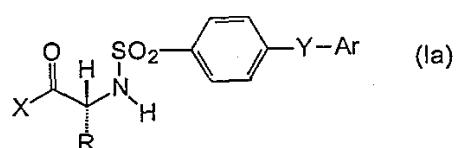
5. Rがアルキル基-(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-S-アルキルである、請求項4記載の化合物またはその薬剤学的に許容しうるプロドラッグ、塩もしくは溶媒和物。

6. Rがアルキル基-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-S-CH<sub>2</sub>-ヘテロアリールである、請求項5記載の化合物またはその薬剤学的に許容しうるプロドラッグ、塩もしくは溶媒和物。

7. YがOである、請求項1記載の化合物。

8. YがSである、請求項1記載の化合物。

9. 化合物が式Ia:



を有する、請求項1記載の化合物またはその薬剤学的に許容しうるプロドラッグ、塩もしくは溶媒和物。

10. 化合物が下記のものから選択される、請求項1記載の化合物:

2(S)-N-ヒドロキシ-3,3-ジメチル-2-[ (4-(4-フルオロフェノキシ)ベンゼンスルホニル)アミノ]ブタンアミド、

2(S)-N-ヒドロキシ-3,3-ジメチル-2-[ (4-(4-クロロフェノキシ)ベンゼンスルホニル)アミノ]ブタンアミド、

2(S)-N-ヒドロキシ-3-メチル-3-(ピリド-2-イル)メチルスルファニル-2-[ (4-(4-フルオロフェノキシ)ベンゼンスルホニル)アミノ]ブタンアミド、

2(S)-N-ヒドロキシ-3-メチル-3-(ピリド-2-イル)メチルスルファニル-2-[ (4-(4-プロモフェノキシ)ベンゼンスルホニル)アミノ]ブタンアミド、

N-[4-(4-プロモフェノキシ)ベンゼンスルホニル]-S-[(1-ベンジル-1H-イミダゾール-2-イル)メチル]-D-ペニシラミン、

N-[4-(4-ヨードフェノキシ)ベンゼンスルホニル]-S-[(ピリド-

2-イル) メチル] -D-ペニシラミン、

2 (S) -N-ヒドロキシー-3-メチル-3-(ピリド-2-イル) メチルスルファニル-2-[ (4-(4-ヨードフェノキシ)ベンゼンスルホニル) アミノ] ブタンアミド、

N-[4-(4-ブロモフェノキシ)ベンゼンスルホニル]-S-[(5-メチルイソオキサゾール-3-イル) メチル] -D-ペニシラミン、

2 (S) -N-ヒドロキシー-3-メチル-3-(5-メチルイソオキサゾール-3-イル) メチルスルファニル-2-[ (4-(4-フルオロフェノキシ)ベンゼンスルホニル) アミノ] ブタンアミド、

2 (S) -N-ヒドロキシー-3-メチル-3-(5-メチルイソオキサゾール-3-イル) メチルスルファニル-2-[ (4-(4-ブロモフェノキシ)ベンゼンスルホニル) アミノ] ブタンアミド、

2 (S) -N-ヒドロキシー-3-メチル-3-(ピリド-2-イル) メチルスルファニル-2-[ (4-(4-メチルフェノキシ)ベンゼンスルホニル) アミノ] ブタンアミド、

2 (S) -N-ヒドロキシー-3-メチル-3-(5-メチルイソオキサゾール-3-イル) メチルスルファニル-2-[ (4-(ピリド-4-イルオキシ)ベンゼンスルホニル) アミノ] ブタンアミド、

2 (S) -N-ヒドロキシー-3-メチル-3-(5-メチルイソオキサゾール-3-イル) メチルスルファニル-2-[ (4-{(ピリド-4-イル)スルファニル}ベンゼンスルホニル) アミノ] ブタンアミド、

2 (S) -N-ヒドロキシー-3-メチル-3-(1H-イミダゾール-4-イル) メチルスルファニル-2-[ (4-(4-ブロモフェノキシ)ベンゼンスルホニル) アミノ] ブタンアミド、

2 (S) -N-ヒドロキシー-3-メチル-3-(1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル) メチルスルファニル-2-[ (4-(4-ブロモフェノキシ)ベンゼンスルホニル) アミノ] ブタンアミド、

2 (S) -N-ヒドロキシー-3-メチル-3-(1-メチル-1H-イミダゾール-4-イル) メチルスルファニル-2-[ (4-(4-ブロモフェノキシ)ベ

ンゼンスルホニル) アミノ] ブタンアミド、

2 (S)-N-ヒドロキシ-3-メチル-3-(4-メチル-4H-[1, 2, 4]-トリアゾール-3-イル) メチルスルファニル-2-[(4-(4-ブロモフェノキシ) ベンゼンスルホニル) アミノ] ブタンアミド、

2 (S)-N-ヒドロキシ-3-メチル-3-(1-メチル-4H-[1, 2, 4]-トリアゾール-3-イル) メチルスルファニル-2-[(4-(4-ブロモフェノキシ) ベンゼンスルホニル) アミノ] ブタンアミド、

2 (S)-N-ヒドロキシ-3-メチル-3-メチルスルファニル-2-[(4-(4-クロロフェノキシ) ベンゼンスルホニル) アミノ] ブタンアミド；  
ならびにその薬剤学的に許容しうるプロドラッグ、塩類および溶媒和物。

11. (a) 療法上有効な量の請求項1記載の化合物、またはその薬剤学的に許容しうるプロドラッグ、塩もしくは溶媒和物；および

(b) 薬剤学的に許容しうるキャリヤー、希釈剤、ビヒクルまたは賦形剤を含む薬剤組成物。

12. メタロプロテイナーゼ活性により仲介される哺乳動物の疾病状態を処置するための、請求項11に記載の薬剤組成物。

13. 哺乳動物の疾病状態が腫瘍の増殖、侵入または転移である、請求項12記載の薬剤組成物。

14. 哺乳動物の疾病状態が骨関節症、慢性関節リウマチ、骨粗しょう症、歯周炎または歯肉炎である、請求項12記載の薬剤組成物。

15. 哺乳動物の疾病状態が慢性皮膚創傷、角膜潰瘍形成または変性性皮膚障害である、請求項12記載の薬剤組成物。

16. 哺乳動物の疾病状態が多発性硬化症または発作である、請求項12記載の薬剤組成物。

17. 哺乳動物の疾病状態がアテローム性動脈硬化症、糸球体疾患またはアルツハイマー病である、請求項12記載の薬剤組成物。

18. 哺乳動物の疾病状態が望ましくない血管形成を特色とする、請求項12記載の薬剤組成物。

19. 哺乳動物の疾病状態が糖尿病性網膜症、黄斑変性、血管線維腫または血

管腫である、請求項 1 2 記載の薬剤組成物。

2 0 . 哺乳動物の疾病状態がマトリックスメタロプロテイナーゼ活性により仲介される、請求項 1 2 記載の薬剤組成物。

2 1 . 哺乳動物の疾病状態が TNF -  $\alpha$  変換酵素活性により仲介される、請求項 1 2 記載の薬剤組成物。

2 2 . 少なくとも 1 種類のメタロプロテイナーゼの活性をインヒトロで阻害する方法であって、その少なくとも 1 種類のメタロプロテイナーゼを有効量の請求項 1 記載の化合物、またはその薬剤学的に許容しうるプロドラッグ、塩もしくは溶媒和物と接触させることを含む方法。

2 3 . 少なくとも 1 種類のメタロプロテイナーゼがマトリックスメタロプロテイナーゼである、請求項 2 2 記載の方法。

2 4 . 少なくとも 1 種類のメタロプロテイナーゼが TNF -  $\alpha$  変換酵素である、請求項 2 2 記載の方法。』