

【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8月13日 (2009.8.13)

【公表番号】特表2008-500361 (P2008-500361A)

【公表日】平成20年1月10日 (2008.1.10)

【年通号数】公開・登録公報2008-001

【出願番号】特願2007-515304 (P2007-515304)

【国際特許分類】

C 07 H 19/16 (2006.01)

A 61 K 31/7076 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 9/06 (2006.01)

A 61 P 9/04 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 25/02 (2006.01)

A 61 P 25/04 (2006.01)

A 61 P 25/06 (2006.01)

A 61 P 25/08 (2006.01)

A 61 P 25/14 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 25/18 (2006.01)

A 61 P 25/20 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 25/22 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 21/04 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 17/02 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 P 11/06 (2006.01)

A 61 P 11/08 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

A 61 P 3/00 (2006.01)

A 61 P 37/06 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 31/18 (2006.01)

【 F I 】

C 07 H 19/16 C S P

A 61 K 31/7076

A 61 P 9/00

A 61 P 9/10 1 0 1

A 61 P 9/10 1 0 3

A 61 P 9/10

A 61 P 9/06

A 61 P 9/04

A 61 P 25/00

A 6 1 P 25/02
 A 6 1 P 25/04
 A 6 1 P 25/06
 A 6 1 P 25/08
 A 6 1 P 25/14
 A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 25/18
 A 6 1 P 25/20
 A 6 1 P 25/24
 A 6 1 P 25/22
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 21/04
 A 6 1 P 3/04
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 17/02
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 11/08
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 31/04
 A 6 1 P 3/00
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 31/18

【手続補正書】

【提出日】平成21年6月24日(2009.6.24)

【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

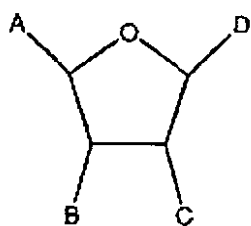
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

次式：

【化 1】



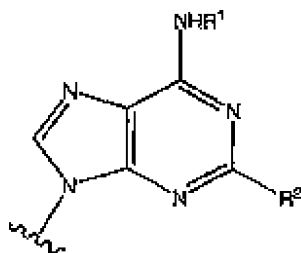
(式中、

A は -CH₂ONO₂ であり；

B および C は -OH であり；

D は

【化 2】



であり；

A および B は互いにトランス位にあり；

B および C は互いにシス位にあり；

C および D は互いにシス位にあるか、または互いにトランス位にあり；

R¹ は、ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、ヘキシル、イソヘキシル、ネオヘキシル、ヘプチル、イソヘプチル、ネオヘプチル、オクチル、イソオクチル、ネオオクチル、ノニル、イソノニル、ネオノニル、デシル、イソデシル、ネオデシル、-アリール、-3～7員単環式複素環、-8～12員二環式複素環、-C₃-C₈単環式シクロアルキル、-C₃-C₈単環式シクロアルケニル、-C₈-C₁₂二環式シクロアルキル、-C₈-C₁₂二環式シクロアルケニル、-(CH₂)_n-(C₃-C₈単環式シクロアルキル)、-(CH₂)_n-(C₃-C₈単環式シクロアルケニル)、-(CH₂)_n-(C₈-C₁₂二環式シクロアルキル)、-(CH₂)_n-(C₈-C₁₂二環式シクロアルケニル)、または-(CH₂)_n-アリールであり；

R² は、-H、-ハロ、-CN、-NHR⁴、-NHC(O)R⁴、-NHC(O)OR⁴、-NHC(O)NHR⁴、-NHNHC(O)R⁴、-NHNHC(O)OR⁴、-NHNHC(O)NHR⁴、または-NH-N=C(R⁶)R⁷であり；

R⁴ は、-C₁-C₁₅アルキル、-アリール、-(CH₂)_n-アリール、-(CH₂)_n-(3～7員単環式複素環)、-(CH₂)_n-(8～12員二環式複素環)、-(CH₂)_n-(C₃-C₈単環式シクロアルキル)、-(CH₂)_n-(C₃-C₈単環式シクロアルケニル)、-(CH₂)_n-(C₈-C₁₂二環式シクロアルキル)、-(CH₂)_n-(C₈-C₁₂二環式シクロアルケニル)、-C-C-(C₁-C₁₀アルキル)または-C-C-アリールであり；

R⁶ は、-C₁-C₁₀アルキル、-アリール、-(CH₂)_n-アリール、-(CH₂)_n-(3～7員単環式複素環)、-(CH₂)_n-(8～12員二環式複素環)、-(CH₂)_n-(C₃-C₈単環式シクロアルキル)、-(CH₂)_n-(C₃-C₈単環式シクロアルケニル)、-(CH₂)_n-(C₈-C₁₂二環式シクロアルキル)、-(CH₂)_n-(C₈-C₁₂二環式シクロアルケニル)、-フェニレン-(CH₂)_nCOOH、または-フェニレン-(CH₂)_nCOO-(C₁-C₁₀アルキル)であり；

R⁷ は、-H、C₁-C₁₀アルキル、-アリール、-(CH₂)_n-アリール、-(CH₂)_n-(3～7員単環式複素環)、-(CH₂)_n-(8～12員二環式複素環)、-(CH₂)_n-(C₃-C₈単環式シクロアルキル)、-(CH₂)_n-(C₃-C₈単環式シクロアルケニル)、-(CH₂)_n-(C₈-C₁₂二環式シクロアルケニル)、または-(CH₂)_n-(C₈-C₁₂二環式シクロアルキル)であり；かつ

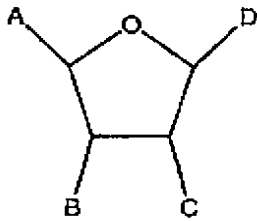
n はそれぞれ独立に 1～5 の整数である)

を有する化合物または薬学的に許容可能なその塩。

【請求項 2】

次式：

【化 3】



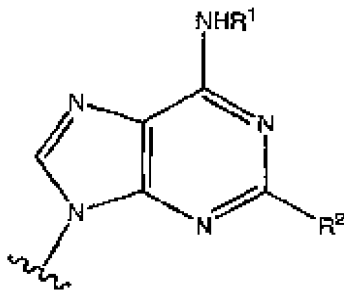
(式中、

A は - R³ であり；

B および C は - OH であり；

D は

【化 4】



であり；

A および B は互いにトランス位にあり；

B および C は互いにシス位にあり；

C および D は互いにシス位にあるか、または互いにトランス位にあり；

R¹ は、- H、- C₁ - C₁₀ アルキル、- アリール、- 3 ~ 7 員単環式複素環、- 8 ~ 12 員二環式複素環、- C₃ - C₈ 単環式シクロアルキル、- C₃ - C₈ 単環式シクロアルケニル、- C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルキル、- C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルケニル、- (CH₂)_n - (C₃ - C₈ 単環式シクロアルキル)、- (CH₂)_n - (C₃ - C₈ 単環式シクロアルケニル)、- (CH₂)_n - (C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルキル)、- (CH₂)_n - (C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルケニル)、または - (CH₂)_n - アリールであり；

R² は、- H、- ハロ、- CN、- NHR⁴、- OR⁴、- SR⁴、- NHC(O)R⁴、- NHC(O)OR⁴、- NHC(O)NHR⁴、- NHNHC(O)R⁴、- NHNHC(O)NHR⁴、- NHNHC(O)OR⁴、または - NH - N = C(R⁶)R⁷ であり；

R³ は、- CH₂ONO であり；

R⁴ は、- C₁ - C₁₅ アルキル、- アリール、- (CH₂)_n - アリール、- (CH₂)_n - (3 ~ 7 員単環式複素環)、- (CH₂)_n - (8 ~ 12 員二環式複素環)、- (CH₂)_n - (C₃ - C₈ 単環式シクロアルキル)、- (CH₂)_n - (C₃ - C₈ 単環式シクロアルケニル)、- (CH₂)_n - (C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルキル)、- (CH₂)_n - (C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルケニル)、- C - C - (C₁ - C₁₀ アルキル)、または - C - C アリールであり；

R⁶ は、- C₁ - C₁₀ アルキル、- アリール、- (CH₂)_n - アリール、- (CH₂)_n - (C₃ - C₈ 単環式シクロアルキル)、- (CH₂)_n - (C₃ - C₈ 単環式シクロアルケニル)、- (CH₂)_n - (C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルキル)、- (CH₂)_n - (C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルケニル)、- (CH₂)_n - (3 ~ 7 員単環式複素環)、- (CH₂)_n - (8 ~ 12 員二環式複素環)、- フェニレン - (CH₂)_n

COOH、または - フェニレン - (CH₂)_nCOO - (C₁ - C₁₀ アルキル) であり ;

R⁷ は、- H、C₁ - C₁₀ アルキル、- アリール、- (CH₂)_n - アリール、- (CH₂)_n - (C₃ - C₈ 単環式シクロアルキル)、- (CH₂)_n - (C₃ - C₈ 単環式シクロアルケニル)、- (CH₂)_n - (C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルキル)、- (CH₂)_n - (C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルケニル)、- (CH₂)_n - (3 ~ 7 員単環式複素環)、または - (CH₂)_n - (8 ~ 12 員二環式複素環) であり ; かつ

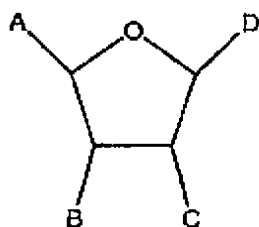
n はそれぞれ独立に 1 ~ 5 の整数である)

を有する化合物または薬学的に許容可能なその塩。

【請求項 3】

次式 :

【化 5】



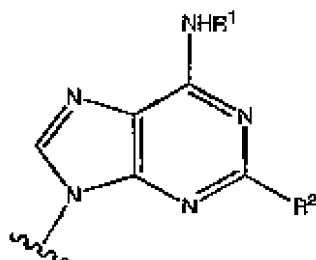
(式中、

A は - CH₂ONO₂ であり ;

B および C は - OH であり ;

D は

【化 6】



であり ;

A および B は互いにトランス位にあり ;

B および C は互いにシス位にあり ;

C および D は互いにシス位にあるか、または互いにトランス位にあり ;

R¹ は - C₃ - C₈ 単環式シクロアルキルであり ; かつ

R² は - H または - ハロである)

を有する化合物または薬学的に許容可能なその塩。

【請求項 4】

有効な量の、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容可能な該化合物の塩と、生理学的に許容可能な担体または賦形剤とを含んでなる組成物。

【請求項 5】

有効な量の、請求項 2 に記載の化合物または薬学的に許容可能な該化合物の塩と、生理学的に許容可能な担体または賦形剤とを含んでなる組成物。

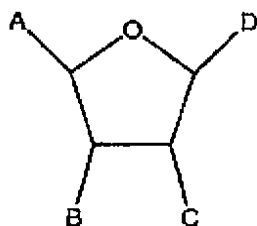
【請求項 6】

有効な量の、請求項 3 に記載の化合物または薬学的に許容可能な該化合物の塩と、生理学的に許容可能な担体または賦形剤とを含んでなる組成物。

【請求項 7】

心筋保護剤と、有効な量の次式を有する化合物または薬学的に許容可能な該化合物の塩と、生理学的に許容可能な担体または賦形剤とを含んでなる組成物。

【化 7】



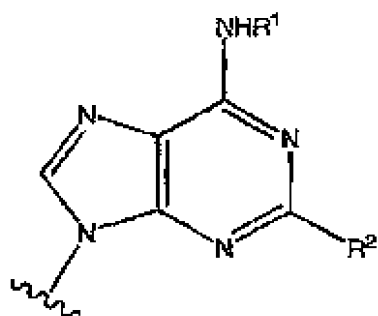
(式中、

A は $-\text{CH}_2\text{ONO}_2$ であり；

B および C は $-\text{OH}$ であり；

D は

【化 8】



であり；

A および B は互いにトランス位にあり；

B および C は互いにシス位にあり；

C および D は互いにシス位にあるか、または互いにトランス位にあり；

R^1 は、 $-\text{H}$ 、 $-\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキル、 $-\text{アリール}$ 、 $-\text{3} \sim \text{7}$ 員単環式複素環、 $-\text{8} \sim \text{12}$ 員二環式複素環、 $-\text{C}_3 - \text{C}_8$ 単環式シクロアルキル、 $-\text{C}_3 - \text{C}_8$ 単環式シクロアルケニル、 $-\text{C}_8 - \text{C}_{12}$ 二環式シクロアルキル、 $-\text{C}_8 - \text{C}_{12}$ 二環式シクロアルケニル、 $-(\text{CH}_2)_n - (\text{C}_3 - \text{C}_8 \text{ 単環式シクロアルキル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_n - (\text{C}_3 - \text{C}_8 \text{ 単環式シクロアルケニル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_n - (\text{C}_8 - \text{C}_{12} \text{ 二環式シクロアルキル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_n - (\text{C}_8 - \text{C}_{12} \text{ 二環式シクロアルケニル})$ 、または $-(\text{CH}_2)_n - \text{アリール}$ であり；

R^2 は、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NHR}^4$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{R}^4$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^4$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^4$ 、 $-\text{NHNHC}(\text{O})\text{R}^4$ 、 $-\text{NHNHC}(\text{O})\text{OR}^4$ 、 $-\text{NHNHC}(\text{O})\text{NHR}^4$ 、または $-\text{NH} - \text{N} = \text{C}(\text{R}^6)\text{R}^7$ であり；

R^4 は、 $-\text{C}_1 - \text{C}_{15}$ アルキル、 $-\text{アリール}$ 、 $-(\text{CH}_2)_n - \text{アリール}$ 、 $-(\text{CH}_2)_n - (\text{3} \sim \text{7} \text{ 員単環式複素環})$ 、 $-(\text{CH}_2)_n - (\text{8} \sim \text{12} \text{ 員二環式複素環})$ 、 $-(\text{CH}_2)_n - (\text{C}_3 - \text{C}_8 \text{ 単環式シクロアルキル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_n - (\text{C}_3 - \text{C}_8 \text{ 単環式シクロアルケニル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_n - (\text{C}_8 - \text{C}_{12} \text{ 二環式シクロアルキル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_n - (\text{C}_8 - \text{C}_{12} \text{ 二環式シクロアルケニル})$ 、 $-\text{C} - \text{C} - (\text{C}_1 - \text{C}_{10} \text{ アルキル})$ または $-\text{C} - \text{C} - \text{アリール}$ であり；

R^6 は、 $-\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキル、 $-\text{アリール}$ 、 $-(\text{CH}_2)_n - \text{アリール}$ 、 $-(\text{CH}_2)_n - (\text{3} \sim \text{7} \text{ 員単環式複素環})$ 、 $-(\text{CH}_2)_n - (\text{8} \sim \text{12} \text{ 員二環式複素環})$ 、 $-(\text{CH}_2)_n - (\text{C}_3 - \text{C}_8 \text{ 単環式シクロアルキル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_n - (\text{C}_3 - \text{C}_8 \text{ 単環式シクロアルケニル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_n - (\text{C}_8 - \text{C}_{12} \text{ 二環式シクロアルキル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_n - (\text{C}_8 - \text{C}_{12} \text{ 二環式シクロアルケニル})$ 、

(CH_2)_n - ($\text{C}_8 - \text{C}_{12}$ 二環式シクロアルケニル)、- (CH_2)_n - ($\text{C}_3 - \text{C}_8$ 単環式シクロアルケニル)、- フェニレン - (CH_2)_n COOH 、または - フェニレン - (CH_2)_n COO - ($\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキル) であり；

R^7 は、- H 、 $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキル、- アリール、- (CH_2)_n - アリール、- (CH_2)_n - (3 ~ 7 員単環式複素環)、- (CH_2)_n - (8 ~ 12 員二環式複素環)、- (CH_2)_n - ($\text{C}_3 - \text{C}_8$ 単環式シクロアルキル)、- (CH_2)_n - ($\text{C}_3 - \text{C}_8$ 単環式シクロアルケニル)、- (CH_2)_n - ($\text{C}_8 - \text{C}_{12}$ 二環式シクロアルケニル)、または - (CH_2)_n - ($\text{C}_8 - \text{C}_{12}$ 二環式シクロアルキル) であり；かつ

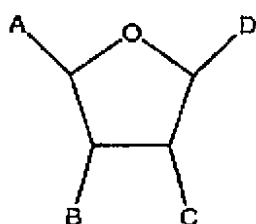
n はそれぞれ独立に 1 ~ 5 の整数であり、

前記心筋保護剤は、塩化カリウム、プロカイン、リドカイン、ノボカイン、ブピバカイン、ニコランジル、ピナシジル、ハロタン、*St. Thomas* 溶液、*Fremes* 溶液、2, 3 - ブタンジオンモノオキシム、またはエスモロールである。）

【請求項 8】

心筋保護剤と、有効な量の次式を有する化合物または薬学的に許容可能な該化合物の塩と、生理学的に許容可能な担体または賦形剤とを含んでなる組成物。

【化 9】



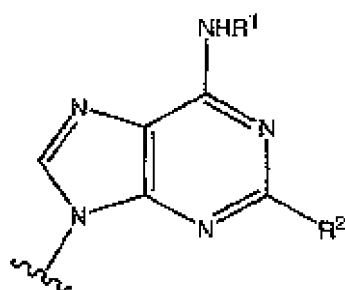
(式中、

A は - R^3 であり；

B および C は - OH であり；前記心筋保護剤は、塩化カリウム、プロカイン、リドカイン、ノボカイン、ブピバカイン、ニコランジル、ピナシジル、ハロタン、*St. Thomas* 溶液、*Fremes* 溶液、2, 3 - ブタンジオンモノオキシム、またはエスモロールである。

D は

【化 10】



であり；

A および B は互いにトランス位にあり；

B および C は互いにシス位にあり；

C および D は互いにシス位にあるか、または互いにトランス位にあり；

R^1 は、- H 、- $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキル、- アリール、- 3 ~ 7 員単環式複素環、- 8 ~ 12 員二環式複素環、- $\text{C}_3 - \text{C}_8$ 単環式シクロアルキル、- $\text{C}_3 - \text{C}_8$ 単環式シクロアルケニル、- $\text{C}_8 - \text{C}_{12}$ 二環式シクロアルキル、- $\text{C}_8 - \text{C}_{12}$ 二環式シクロアルケニル、- (CH_2)_n - ($\text{C}_3 - \text{C}_8$ 単環式シクロアルキル)、- (CH_2)_n - ($\text{C}_3 - \text{C}_8$ 単環式シクロアルケニル)、- (CH_2)_n - ($\text{C}_8 - \text{C}_{12}$ 二環式シクロアルキル)

ル)、 $-(CH_2)_n-(C_8-C_{12}$ 二環式シクロアルケニル)、または $-(CH_2)_n$ -アリールであり;

R^2 は、 $-H$ 、 $-H$ 口、 $-CN$ 、 $-NHR^4$ 、 $-OR^4$ 、 $-SR^4$ 、 $-NHC(O)R^4$ 、 $-NHC(O)OR^4$ 、 $-NHC(O)NHR^4$ 、 $-NHNHC(O)R^4$ 、 $-NHNHC(O)NHR^4$ 、 $-NHNHC(O)OR^4$ 、または $-NH-N=C(R^6)R^7$ であり;

R^3 は、 $-CH_2ONO$ または $-CH_2OSO_3H$ であり;

R^4 は、 $-C_1-C_{15}$ アルキル、 $-$ アリール、 $-(CH_2)_n$ -アリール、 $-(CH_2)_n$ - $(3\sim 7$ 員単環式複素環)、 $-(CH_2)_n$ - $(8\sim 12$ 員二環式複素環)、 $-(CH_2)_n$ - $(C_3-C_8$ 単環式シクロアルキル)、 $-(CH_2)_n$ - $(C_3-C_8$ 単環式シクロアルケニル)、 $-(CH_2)_n$ - $(C_8-C_{12}$ 二環式シクロアルキル)、 $-(CH_2)_n$ - $(C_8-C_{12}$ 二環式シクロアルケニル)、 $-C-C$ - $(C_1-C_{10}$ アルキル)、または $-C-C$ アリールであり;

R^6 は、 $-C_1-C_{10}$ アルキル、 $-$ アリール、 $-(CH_2)_n$ -アリール、 $-(CH_2)_n$ - $(C_3-C_8$ 単環式シクロアルキル)、 $-(CH_2)_n$ - $(C_3-C_8$ 単環式シクロアルケニル)、 $-(CH_2)_n$ - $(C_8-C_{12}$ 二環式シクロアルキル)、 $-(CH_2)_n$ - $(C_8-C_{12}$ 二環式シクロアルケニル)、 $-(CH_2)_n$ - $(3\sim 7$ 員単環式複素環)、 $-(CH_2)_n$ - $(8\sim 12$ 員二環式複素環)、 $-$ フェニレン- $(CH_2)_nCOOH$ 、または $-$ フェニレン- $(CH_2)_nCOO$ - $(C_1-C_{10}$ アルキル)であり;

R^7 は、 $-H$ 、 C_1-C_{10} アルキル、 $-$ アリール、 $-(CH_2)_n$ -アリール、 $-(CH_2)_n$ - $(C_3-C_8$ 単環式シクロアルキル)、 $-(CH_2)_n$ - $(C_3-C_8$ 単環式シクロアルケニル)、 $-(CH_2)_n$ - $(C_8-C_{12}$ 二環式シクロアルキル)、 $-(CH_2)_n$ - $(C_8-C_{12}$ 二環式シクロアルケニル)、 $-(CH_2)_n$ - $(3\sim 7$ 員単環式複素環)、または $-(CH_2)_n$ - $(8\sim 12$ 員二環式複素環)であり;かつ

n はそれぞれ独立に $1\sim 5$ の整数であり、

前記心筋保護剤は、塩化カリウム、プロカイン、リドカイン、ノボカイン、プビバカイン、ニコランジル、ピナシジル、ハロタン、St. Thomas 溶液、Fremes 溶液、2, 3-ブタンジオンモノオキシム、またはエスモロールである。)

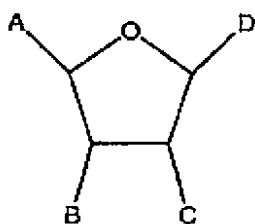
【請求項 9】

心筋保護剤と、有効な量の、請求項 3 に記載の化合物または薬学的に許容可能な該化合物の塩と、生理学的に許容可能な担体または賦形剤とを含んでなる組成物であって、前記心筋保護剤は、塩化カリウム、プロカイン、リドカイン、ノボカイン、プビバカイン、ニコランジル、ピナシジル、ハロタン、St. Thomas 溶液、Fremes 溶液、2, 3-ブタンジオンモノオキシム、またはエスモロールである組成物。

【請求項 10】

心筋保護剤と、有効な量の次式を有する化合物または薬学的に許容可能な該化合物の塩と、生理学的に許容可能な担体または賦形剤とを含んでなる組成物。

【化 11】



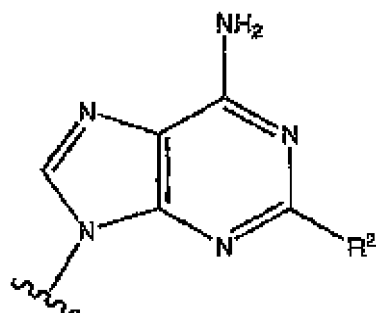
(式中、

A は $-CH_2ONO_2$ であり;

B および C は $-OH$ であり;

D は

【化 1 2】



であり；

A および B は互いにトランス位にあり；

B および C は互いにシス位にあり；

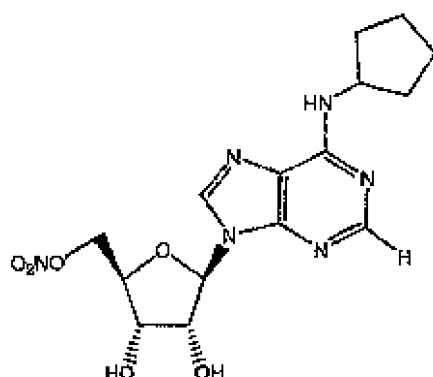
C および D は互いにシス位にあるか、または互いにトランス位にあり；

R² は - ハロである）

【請求項 1 1】

次式：

【化 1 3】



を有するかまたは薬学的に許容可能なその塩である、請求項 3 に記載の化合物または薬学的に許容可能な該化合物の塩。

【請求項 1 2】

請求項 1 1 に記載の化合物または薬学的に許容可能な該化合物の塩と、生理学的に許容可能な担体または賦形剤とを含んでなる組成物。

【請求項 1 3】

A および B は互いにトランス位にあり、B および C は互いにシス位にあり、C および D は互いにトランス位にある請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

R¹ が - C₃ - C₈ 単環式シクロアルキルである請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

R¹ がシクロペンチルである請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 6】

R² が - H または - ハロである請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 7】

A および B は互いにトランス位にあり、B および C は互いにシス位にあり、C および D は互いにトランス位にある請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 1 8】

R¹ が - C₃ - C₈ 単環式シクロアルキルである請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 19】

R^1 がシクロペンチルである請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 20】

R^2 が - H または - ハロである請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 21】

A および B は互いにトランス位にあり、B および C は互いにシス位にあり、C および D は互いにトランス位にある請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 22】

R^1 が - C_3 - C_8 単環式シクロアルキルである請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 23】

R^1 がシクロペンチルである請求項 3 に記載の化合物。

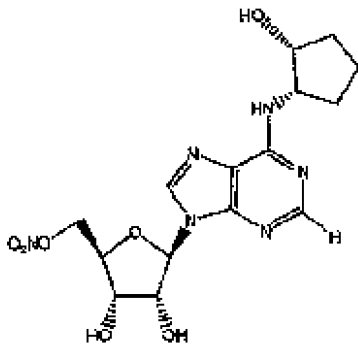
【請求項 24】

- C_3 - C_8 単環式シクロアルキルが 1 または複数のヒドロキシ置換基で置換されている請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 25】

前記化合物が

【化 14】

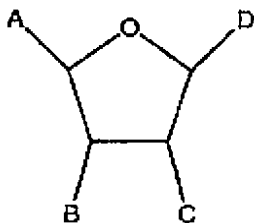


である請求項 24 に記載の化合物。

【請求項 26】

次式：

【化 15】



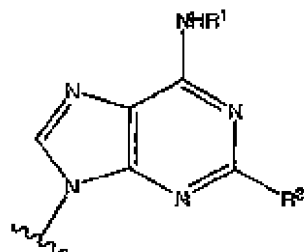
(式中、

A は - CH_2ONO_2 であり；

B および C は - OH であり；

D は

【化 16】



であり；

A および B は互いにトランス位にあり；

B および C は互いにシス位にあり；

C および D は互いにシス位にあるか、または互いにトランス位にあり；

R^1 は、- H、- C_{10} アルキル、- アリール、- 3 ~ 7 員単環式複素環、- 8 ~ 12 員二環式複素環、- C_3 - C_8 単環式シクロアルキル、- C_3 - C_8 単環式シクロアルケニル、- C_8 - C_{12} 二環式シクロアルキル、- C_8 - C_{12} 二環式シクロアルケニル、- $(CH_2)_n$ - (C_3 - C_8 単環式シクロアルキル)、- $(CH_2)_n$ - (C_3 - C_8 単環式シクロアルケニル)、- $(CH_2)_n$ - (C_8 - C_{12} 二環式シクロアルキル)、- $(CH_2)_n$ - (C_8 - C_{12} 二環式シクロアルケニル)、または - $(CH_2)_n$ - アリールであり；

R^2 は、- H、- ハロ、- CN、- NHR^4 、- $NHC(O)R^4$ 、- $NHC(O)OR^4$ 、- $NHC(O)NHR^4$ 、- $NHNHC(O)R^4$ 、- $NHNHC(O)OR^4$ 、- $NHNHC(O)NHR^4$ 、または - $NH-N=C(R^6)R^7$ であり；

R^4 は、- C_{15} アルキル、- アリール、- $(CH_2)_n$ - アリール、- $(CH_2)_n$ - (3 ~ 7 員単環式複素環)、- $(CH_2)_n$ - (8 ~ 12 員二環式複素環)、- $(CH_2)_n$ - (C_3 - C_8 単環式シクロアルキル)、- $(CH_2)_n$ - (C_3 - C_8 単環式シクロアルケニル)、- $(CH_2)_n$ - (C_8 - C_{12} 二環式シクロアルキル)、- $(CH_2)_n$ - (C_8 - C_{12} 二環式シクロアルケニル)、- $C-C$ - (C_{10} アルキル) または - $C-C$ - アリールであり；

R^6 は、- C_{10} アルキル、- アリール、- $(CH_2)_n$ - アリール、- $(CH_2)_n$ - (3 ~ 7 員単環式複素環)、- $(CH_2)_n$ - (8 ~ 12 員二環式複素環)、- $(CH_2)_n$ - (C_3 - C_8 単環式シクロアルキル)、- $(CH_2)_n$ - (C_3 - C_8 単環式シクロアルケニル)、- $(CH_2)_n$ - (C_8 - C_{12} 二環式シクロアルキル)、- $(CH_2)_n$ - (C_8 - C_{12} 二環式シクロアルケニル)、- $(CH_2)_n$ - (C_3 - C_8 単環式シクロアルケニル)、- フェニレン - $(CH_2)_n$ COOH、または - フェニレン - $(CH_2)_n$ COO - (C_{10} アルキル) であり；

R^7 は、- H、 C_{10} アルキル、- アリール、- $(CH_2)_n$ - アリール、- $(CH_2)_n$ - (3 ~ 7 員単環式複素環)、- $(CH_2)_n$ - (8 ~ 12 員二環式複素環)、- $(CH_2)_n$ - (C_3 - C_8 単環式シクロアルキル)、- $(CH_2)_n$ - (C_3 - C_8 単環式シクロアルケニル)、- $(CH_2)_n$ - (C_8 - C_{12} 二環式シクロアルケニル)、または - $(CH_2)_n$ - (C_8 - C_{12} 二環式シクロアルキル) であり；かつ

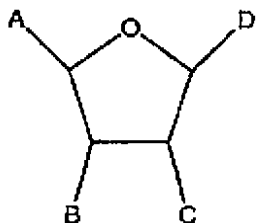
n はそれぞれ独立に 1 ~ 5 の整数である)

を有する化合物または薬学的に許容可能なその塩。

【請求項 27】

次式：

【化 17】



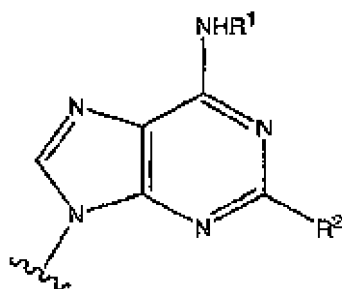
(式中、

A は - R³ であり；

B および C は - OH であり；

D は

【化 18】



であり；

A および B は互いにトランス位にあり；

B および C は互いにシス位にあり；

C および D は互いにシス位にあるか、または互いにトランス位にあり；

R¹ は、- H、- C₁ - C₁₀ アルキル、- アリール、- 3 ~ 7 員単環式複素環、- 8 ~ 12 員二環式複素環、- C₃ - C₈ 単環式シクロアルキル、- C₃ - C₈ 単環式シクロアルケニル、- C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルキル、- C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルケニル、- (CH₂)_n - (C₃ - C₈ 単環式シクロアルキル)、- (CH₂)_n - (C₃ - C₈ 単環式シクロアルケニル)、- (CH₂)_n - (C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルキル)、- (CH₂)_n - (C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルケニル)、または - (CH₂)_n - アリールであり；

R² は、- H、- ハロ、- CN、- NHR⁴、- OR⁴、- SR⁴、- NHC(O)R⁴、- NHC(O)OR⁴、- NHC(O)NHR⁴、- NHNHC(O)R⁴、- NHNHC(O)NHR⁴、- NHNHC(O)OR⁴、または - NH - N = C(R⁶)R⁷ であり；

R³ は、- CH₂OSO₃H であり；

R⁴ は、- C₁ - C₁₅ アルキル、- アリール、- (CH₂)_n - アリール、- (CH₂)_n - (3 ~ 7 員単環式複素環)、- (CH₂)_n - (8 ~ 12 員二環式複素環)、- (CH₂)_n - (C₃ - C₈ 単環式シクロアルキル)、- (CH₂)_n - (C₃ - C₈ 単環式シクロアルケニル)、- (CH₂)_n - (C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルキル)、- (CH₂)_n - (C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルケニル)、- C - C - (C₁ - C₁₀ アルキル)、または - C - C アリールであり；

R⁶ は、- C₁ - C₁₀ アルキル、- アリール、- (CH₂)_n - アリール、- (CH₂)_n - (C₃ - C₈ 単環式シクロアルキル)、- (CH₂)_n - (C₃ - C₈ 単環式シクロアルケニル)、- (CH₂)_n - (C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルキル)、- (CH₂)_n - (C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルケニル)、- (CH₂)_n - (3 ~ 7 員単環式複素環)、- (CH₂)_n - (8 ~ 12 員二環式複素環)、- フェニレン - (CH₂)_n

COOH、または - フェニレン - (CH₂)_nCOO - (C₁ - C₁₀ アルキル) であり；

R⁷ は、- H、C₁ - C₁₀ アルキル、- アリール、- (CH₂)_n - アリール、- (CH₂)_n - (C₃ - C₈ 単環式シクロアルキル)、- (CH₂)_n - (C₃ - C₈ 単環式シクロアルケニル)、- (CH₂)_n - (C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルキル)、- (CH₂)_n - (C₈ - C₁₂ 二環式シクロアルケニル)、- (CH₂)_n - (3 ~ 7 員単環式複素環)、または - (CH₂)_n - (8 ~ 12 員二環式複素環) であり；かつ

n はそれぞれ独立に 1 ~ 5 の整数である)

を有する化合物または薬学的に許容可能なその塩。

【請求項 28】

有効な量の請求項 26 に記載の化合物または薬学的に許容可能な該化合物の塩と、生理学的に許容可能な担体または賦形剤とを含んでなる組成物。

【請求項 29】

有効な量の請求項 27 に記載の化合物または薬学的に許容可能な該化合物の塩と、生理学的に許容可能な担体または賦形剤とを含んでなる組成物。

【請求項 30】

A および B は互いにトランス位にあり、B および C は互いにシス位にあり、C および D は互いにトランス位にある請求項 26 に記載の化合物。

【請求項 31】

R¹ が - C₃ - C₈ 単環式シクロアルキルである請求項 26 に記載の化合物。

【請求項 32】

R¹ がシクロペンチルである請求項 31 に記載の化合物。

【請求項 33】

A および B は互いにトランス位にあり、B および C は互いにシス位にあり、C および D は互いにトランス位にある請求項 27 に記載の化合物。

【請求項 34】

R¹ が - C₃ - C₈ 単環式シクロアルキルである請求項 27 に記載の化合物。

【請求項 35】

R¹ がシクロペンチルである請求項 34 に記載の化合物。

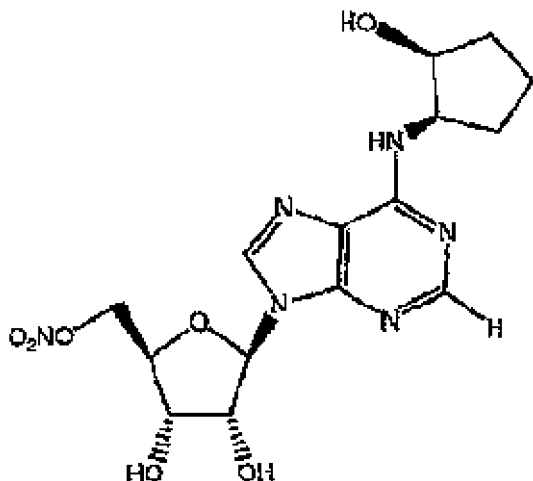
【請求項 36】

R² が - H または - ハロである請求項 27 に記載の化合物。

【請求項 37】

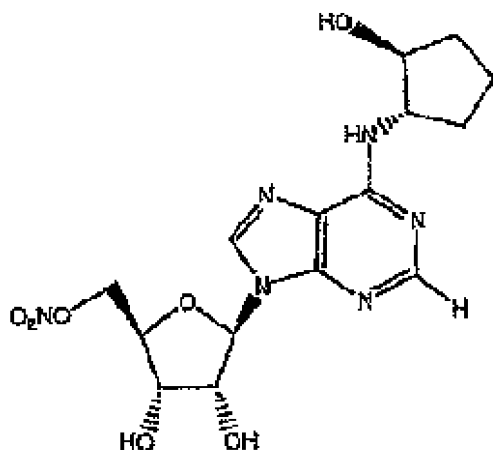
前記化合物が

【化 19】



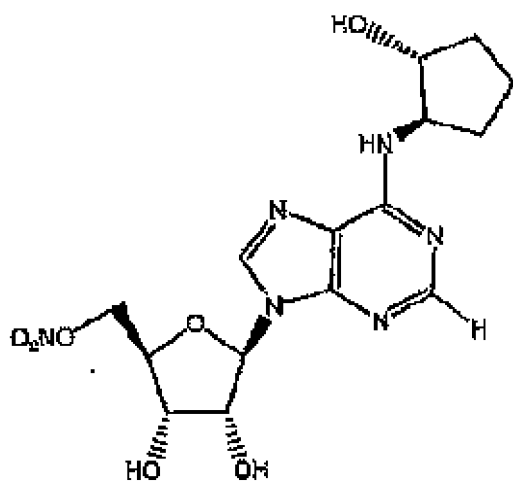
である請求項 24 に記載の化合物。

【請求項 38】
前記化合物が
【化 20】



である請求項 24 に記載の化合物。

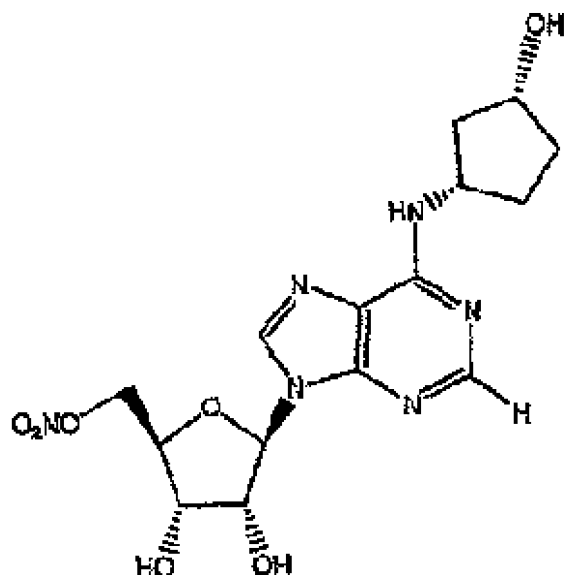
【請求項 39】
前記化合物が
【化 21】



である請求項 24 に記載の化合物。

【請求項 40】
前記化合物が

【化 2 2】

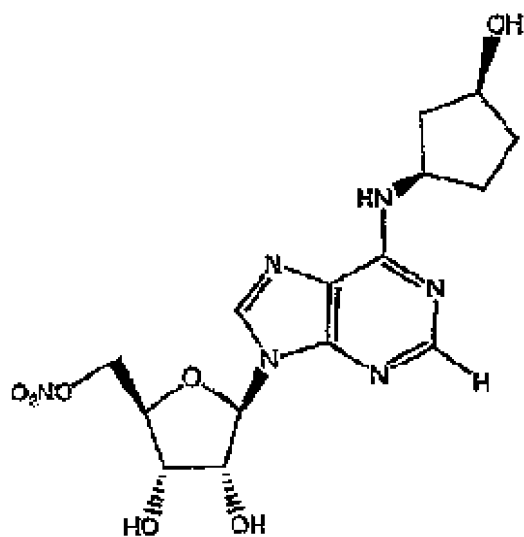


である請求項 2 4 に記載の化合物。

【請求項 4 1】

前記化合物が

【化 2 3】

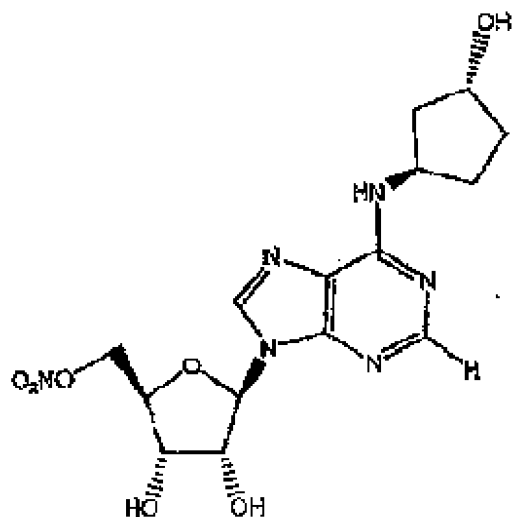


である請求項 2 4 に記載の化合物。

【請求項 4 2】

前記化合物が

【化 2 4】

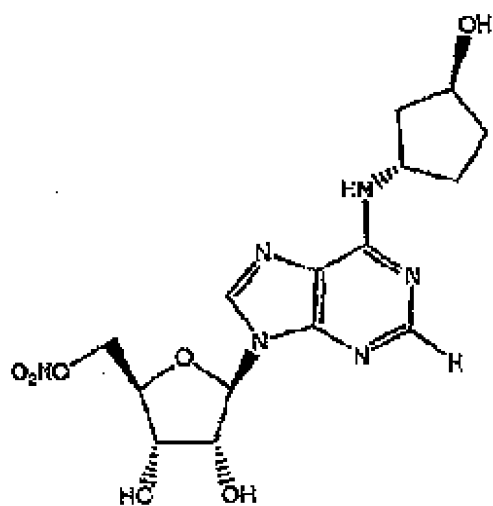


である請求項 2 4 に記載の化合物。

【請求項 4 3】

前記化合物が

【化 2 5】



である請求項 2 4 に記載の化合物。