

【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2007-521308(P2007-521308A)

【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2006-518838(P2006-518838)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/54 (2006.01)

A 6 1 K 31/513 (2006.01)

A 6 1 P 5/24 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 239/54 C S P Z

A 6 1 K 31/513

A 6 1 P 5/24

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 17/02

【手続補正書】

【提出日】平成19年6月18日(2007.6.18)

【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

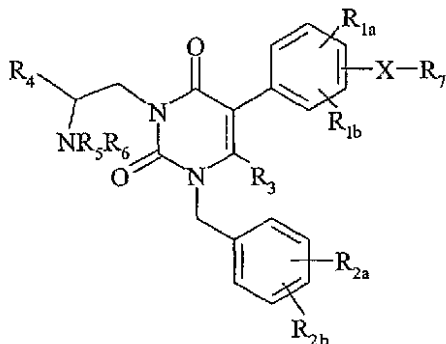
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の構造：

【化1】



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} および R_{1b} 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_{1-4} アルキル、またはアルコキシであり；

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 $-SO_2CH_3$ 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_{3-7} アルキルであり；

R_5 および R_6 は、同じであるかまたは異なり、そして独立に、水素または C_{1-4} アルキルであるか；または

R_5 およびそれが結合する窒素は、 R_4 およびそれが結合する炭素と一緒に、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリンまたは 2, 3 - ジヒドロ - 1H - イソインドールを形成し；

R_7 は、 $-COOH$ または酸同配体であり；そして

X は、 $-O-(C_{1-6}$ アルカンジイル) または $-O-(C_{1-6}$ アルカンジイル) - $O-(C_{1-6}$ アルカンジイル) であり、ここで各 (C_{1-6} アルカンジイル) は、必要に応じて 1 ~ 3 個の C_{1-4} アルキル基で置換されている、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_{1a} が、フルオロまたはクロロである、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R_{1a} が、水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

R_{2a} が、ハロゲンである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

R_{2b} が、トリフルオロメチル、ハロゲンまたは $-SO_2CH_3$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

R_3 が、水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

R_3 が、メチルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

R_4 が、フェニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

R_4 が、 C_{3-7} アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

C_{3-7} 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 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

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 13】

R_7 が、 $-COOH$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 14】

R_7 が、酸同配体である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 15】

X が、直鎖 C_{1-6} アルカンジイルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 16】

前記直鎖 C_{1-6} アルカンジイルが、 $-CH_2CH_2CH_2-$ である、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 17】

前記直鎖 C₁ - 6 アルカンジイルが、-CH₂CH₂CH₂CH₂- である、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 18】

前記直鎖 C₁ - 6 アルカンジイルが、-CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂- である、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 19】

X が、分枝 C₁ - 6 アルカンジイルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 20】

前記化合物が、3-[2(R)-アミノ-2-フェニルエチル]-5-(2-フルオロ-3-(4-ヒドロキシカルボニル)-1-ブトキシ)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)-アミノ-2-フェニルエチル]-5-(3-(5-ヒドロキシカルボニル)-1-ペントキシ)フェニル)-1-[2-フルオロ-6-クロロベンジル]-6-メチル-ピリミジン-2,4(1H,3H)-ジオン、3-[2(R)-アミノ-2-フェニルエチル]-5-(3-(5-ヒドロキシカルボニル)-1-ペントキシ)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)-メチルアミノ-2-フェニルエチル]-5-(2-フルオロ-3-(4-ヒドロキシカルボニル)-1-ブトキシ)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-[1-R-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン]メチル]-5-(3-(5-ヒドロキシカルボニル)-1-ペントキシ)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-[(1-R-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン)メチル]-5-(2-フルオロ-3-(4-ヒドロキシカルボニル)-1-ブトキシ)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-[(1-R-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン)メチル]-5-(2-フルオロ-3-(3-ヒドロキシカルボニル)-1-プロポキシ)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-[(1-R-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン)メチル]-5-(2-クロロ-3-(5-ヒドロキシカルボニル)-1-ペントキシ)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 21】

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 22】

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、有効量の請求項 1 に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項 23】

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組成物であって、有効量の請求項 21 に記載の薬学的組成物を含む、組成物。

【請求項 24】

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 23 に

記載の組成物。

【請求項 2 5】

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 2 4 に記載の組成物。

【請求項 2 6】

前記癌は、前立腺癌である、請求項 2 5 に記載の組成物。

【請求項 2 7】

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 2 3 に記載の組成物。

【請求項 2 8】

前記性ホルモン関連状態は、子宮内膜症である、請求項 2 7 に記載の組成物。

【請求項 2 9】

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 2 3 に記載の組成物。

【請求項 3 0】

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組成物であって、有効量の請求項 2 1 に記載の薬学的組成物を含む、組成物。

【請求項 3 1】

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組成物であって、有効量の請求項 2 1 に記載の薬学的組成物を含む、組成物。