

【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 18 年 4 月 20 日 (2006.4.20)

【公表番号】特表 2002-510671 (P2002-510671A)

【公表日】平成 14 年 4 月 9 日 (2002.4.9)

【出願番号】特願 2000-542291 (P2000-542291)

【国際特許分類】

**C 0 7 C 217/22 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/135 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/18 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/216 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/275 (2006.01)**

**A 6 1 P 3/14 (2006.01)**

**A 6 1 P 19/02 (2006.01)**

**A 6 1 P 19/10 (2006.01)**

**A 6 1 P 29/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

**C 0 7 C 255/37 (2006.01)**

**C 0 7 C 255/54 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 C 217/22

A 6 1 K 31/135

A 6 1 K 31/18

A 6 1 K 31/216

A 6 1 K 31/275

A 6 1 P 3/14

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 C 255/37

C 0 7 C 255/54

【手続補正書】

【提出日】平成 18 年 2 月 17 日 (2006.2.17)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

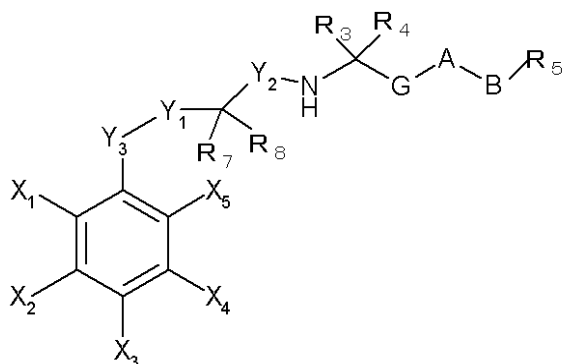
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 下記式 (I) :

【化 1】



式 (I)

[ 式中、

$Y_1$ は、共有結合、非置換または $C_{1-4}$ アルキルにより置換されている炭素原子4個までのアルキレンもしくはアルケニレン、またはOであり；

$Y_2$ は、非置換または $C_{1-4}$ アルキルもしくはハロアルキルにより置換されているメチレンであり；

$Y_3$ は、共有結合、またはO、S、N -  $R^{IV}$ または $C_{1-4}$ アルキレン - O、 $C_{1-4}$ アルキレン - S、 $C_{1-4}$ アルキレン - N -  $R^{IV}$ であり；

$R_3$ および $R_4$ は、独立して、メチルもしくはエチルであるか、または、一緒になってシクロプロピルを形成し；

$R_5$ は、非置換または、OH、ハロゲン、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $OSO_2R^{IV}$ 、CN、 $NO_2$ 、 $OCF_3$ 、 $CF_3$ 、 $CH_2CF_3$ 、 $(CH_2)_nCO_2R^{IV}$ およびO -  $(CH_2)_nCO_2R^{IV}$ （ここで、nは、0ないし3の整数であり、 $R^{IV}$ は、H、 $C_{1-4}$ アルキルおよび $C_{3-6}$ シクロアルキルからなる群から選択される）からなる群から選択されるいずれかの置換基で置換されているアリールもしくは縮合アリールまたはジヒドロもしくはテトラヒドロ縮合アリールであるか；または

$R_5$ は、非置換または、OH、 $OCH_3$ 、 $CH(CH_3)_2$ 、ハロゲン、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $OSO_2R^{IV}$ 、CN、 $NO_2$ 、 $OCF_3$ 、 $CF_3$ 、 $CH_2CF_3$ 、 $(CH_2)_nCO_2H$ 、 $(CH_2)_nCO_2R^{IV}$ およびO -  $(CH_2)_nCO_2R^{IV}$ からなる群から選択されるいずれかの置換基で置換されているヘテロアリールまたは縮合ヘテロアリールであり（ここで、ヘテロ環は、N、OまたはSを含有しており、芳香族、ジヒドロまたはテトラヒドロである）；

Gは、共有結合、 $CHR_6$ またはC -  $R_6$ であり（ここで、 $R_6$ は、H、OHまたはO（ケトンを形成する）である）；

$R_7$ は、H、OHまたはO -  $C_{1-4}$ アルキルであり；

$R_8$ は、Hまたは $C_{1-4}$ アルキルであるか；または $R_7$ および $R_8$ は、一緒になってケトンを形成し；

AおよびBは、独立して、結合、 $CH_2$ 、NH、O、SおよびC = Oからなる群から選択されるか（ただし、AまたはBのいずれかは、 $CH_2$ およびNHから選択される）；またはAおよびBは、一緒になって結合を形成するか；またはA - B基は、 $CH=CH$ またはC - Cを表し；

$X_1$ および $X_5$ は、独立して、H、ハロゲン、CN、 $NO_2$ 、 $C_{1-4}$ アルキル、シクロアルキル、 $CH_2$ -アリールおよび $CH_2$ -ヘテロアリールからなる群から選択され（ただし、 $X_1$ または $X_5$ のいずれかは、Hである）；

$X_2$ 、 $X_3$ および $X_4$ は、H、ハロゲン、O -  $C_{1-4}$ アルキル、O - アリール、O - ヘテロアリール、 $CH_2$ -アリール、 $CH_2$ -ヘテロアリール、アルキル、C(O)アリール、C(O)ヘテロアリール、 $CH(OH)$ アリール、 $CH(OH)$ ヘテロアリールおよびJ - Kからなる群から選択され；

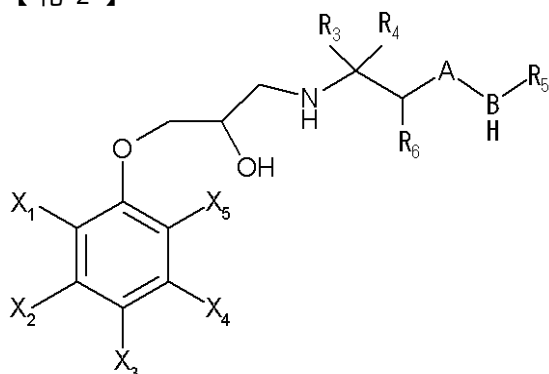
Jは、共有結合、非置換または、 $C_{1-4}$ アルキル、OH、O（ケトンを形成する）、アリール、ヘテロアリールおよび $NR'R''$ （ここで、 $R'$ および $R''$ は、独立して、H、アルキル、アリール、ヘテロアリール、C(O)アルキル、C(O)アリールおよびC(O)ヘテ

ロアリールからなる群から選択される) からなる群から選択される置換基により置換されている炭素原子 5 個までのアルキレン、O - アルキレンまたはアルケニレンであり；

K は、 $\text{CO}_2\text{R}^{\text{IV}}$ 、OH および CN からなる群から選択される ]  
で示される化合物ならびにその医薬上許容される塩および複合体。

【請求項 2】 式 ( I I )：

【化 2】



式 ( I I )

[ 式中、

$\text{R}_3$  および  $\text{R}_4$  は、独立して、メチルもしくはエチルであるか、または一緒になってシクロプロピルを形成し；

$\text{R}_5$  は、非置換または、OH、ハロゲン、 $\text{C}_{1-4}$  アルキル、 $\text{C}_{1-4}$  アルコキシ、 $\text{C}_{3-6}$  シクロアルキル、 $\text{OSO}_2\text{R}^{\text{IV}}$ 、CN、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{OCF}_3$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{CF}_3$  (ここで、 $\text{R}^{\text{IV}}$  は、H、 $\text{C}_{1-4}$  アルキル、 $\text{C}_{3-6}$  シクロアルキル、 $\text{C}_{3-6}$  シクロアルキルからなる群から選択される) からなる群から選択されるいずれかの置換基で置換されているアリールもしくは縮合アリールまたはジヒドロもしくはテトラヒドロ縮合アリールであるか；または

$\text{R}_5$  は、非置換または、OH、 $\text{OCH}_3$ 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、ハロゲン、 $\text{C}_{1-4}$  アルキル、 $\text{C}_{1-4}$  アルコキシ、 $\text{C}_{3-6}$  シクロアルキル、CN、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{OCF}_3$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{CF}_3$  からなる群から選択されるいずれかの置換基で置換されているヘテロアリールまたは縮合ヘテロアリールであり (ここで、ヘテロ環は、N、O または S を含有しており、芳香族、ジヒドロまたはテトラヒドロである)；

$\text{R}_6$  は、H、OH または O (ケトンを形成する) であり；

A および B は、独立して、結合、 $\text{CH}_2$ 、NH、O、S および  $\text{C}=\text{O}$  からなる群から選択されるか (ただし、A または B のいずれかは、 $\text{CH}_2$  および NH から選択される)；または A および B は、一緒になって結合を形成するか；または A - B 基は、 $\text{CH}=\text{CH}$  または  $\text{C}-\text{C}$  を表し；

$\text{X}_1$  および  $\text{X}_5$  は、独立して、H、ハロゲン、CN、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{C}_{1-4}$  アルキル、シクロアルキル、 $\text{CH}_2$ -アリールおよび  $\text{CH}_2$ -ヘテロアリールからなる群から選択され (ただし、 $\text{X}_1$  または  $\text{X}_5$  のいずれかは、H である)；

$\text{X}_2$ 、 $\text{X}_3$  および  $\text{X}_4$  は、H、ハロゲン、O- $\text{C}_{1-4}$  アルキル、O-アリール、O-ヘテロアリール、 $\text{CH}_2$ -アリール、 $\text{CH}_2$ -ヘテロアリール、アルキル、 $\text{C}(\text{O})$ アリール、 $\text{C}(\text{O})$ ヘテロアリール、 $\text{CH}(\text{OH})$ アリールおよび  $\text{CH}(\text{OH})$ ヘテロアリールおよび J - K からなる群から選択され；

J は、共有結合、非置換または、 $\text{C}_{1-4}$  アルキル、OH、O (ケトン)、アリール、ヘテロアリールおよび  $\text{NR}'\text{R}''$  (ここで、 $\text{R}'$  および  $\text{R}''$  は、独立して、H、アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $\text{C}(\text{O})$ アルキル、 $\text{C}(\text{O})$ アリールおよび  $\text{C}(\text{O})$ ヘテロアリールからなる群から選択される) からなる群から選択される置換基により置換されている炭素原子 5 個までのアルキレン、O-アルキレンまたはアルケニレンであり；

K は、 $\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{CO}_2\text{R}^{\text{IV}}$ 、OH および CN からなる群から選択される ]  
で示される構造を有する請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】  $\text{R}_5$  が、非置換または、 $\text{OCH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、ハロゲン、 $\text{C}_{3-6}$  ヘテ

ロシクロアルキル、 $\text{CN}$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{OCF}_3$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{CF}_3$ からなる群から選択されるいずれかの置換基で置換されているアリールもしくは縮合アリールまたはジヒドロもしくはテトラヒドロアリールであるか；または $\text{R}_5$ が、非置換または、 $\text{OCH}_3$ 、ハロゲン、 $\text{C}_{1-4}$ アルキル、 $\text{CN}$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{OCF}_3$ 、 $\text{CF}_3$ 、および $\text{CH}_2\text{CF}_3$ からなる群から選択されるいずれかの置換基で置換されているヘテロアリールまたは縮合ヘテロアリールであり（ここで、ヘテロ環は、 $\text{N}$ 、 $\text{O}$ または $\text{S}$ を含有しており、芳香族、ジヒドロまたはテトラヒドロである）；

$\text{R}_6$ が $\text{H}$ であり；

$\text{A}$ および $\text{B}$ が、独立して、結合、 $\text{CH}_2$ 、 $\text{NH}$ 、 $\text{O}$ 、 $\text{S}$ および $\text{C}=\text{O}$ からなる群から選択されるか（ただし、 $\text{A}$ または $\text{B}$ のいずれかは、 $\text{CH}_2$ および $\text{NH}$ から選択される）、または $\text{A}$ および $\text{B}$ が一緒になって結合を形成し；

$\text{X}_1$ および $\text{X}_5$ が、 $\text{Cl}$ 、 $\text{F}$ 、 $\text{CN}$ および $\text{NO}_2$ からなる群から選択され（ただし、 $\text{X}_1$ または $\text{X}_5$ のいずれかは、 $\text{H}$ である）；

$\text{X}_2$ 、 $\text{X}_3$ および $\text{X}_4$ が、独立して、 $\text{H}$ 、 $\text{F}$ 、 $\text{Cl}$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{O}$ -アリール、 $\text{O}$ -ヘテロアリール、 $\text{CH}_2$ -アリール、 $\text{CH}_2$ -ヘテロアリール、 $\text{C}(\text{O})$ アリール、 $\text{C}(\text{O})$ ヘテロアリール、 $\text{CH}(\text{OH})$ アリール、 $\text{CH}(\text{OH})$ ヘテロアリールおよび $\text{J}$ - $\text{K}$ からなる群から選択され；

$\text{J}$ が、共有結合、非置換または、 $\text{C}_{1-4}$ アルキル、アリール、ヘテロアリールもしくは $\text{NR}'\text{R}''$ （ここで、 $\text{R}'$ および $\text{R}''$ は、独立して、 $\text{H}$ 、アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $\text{C}(\text{O})$ アルキル、 $\text{C}(\text{O})$ アリールおよび $\text{C}(\text{O})$ ヘテロアリールからなる群から選択される）により置換されている炭素原子5個までのアルキレン、アルケニレンまたは $\text{O}$ -アルキレンであり；

$\text{K}$ が $\text{CO}_2\text{R}^{\text{IV}}$ である請求項2記載の化合物。

【請求項4】  $\text{R}_5$ が、非置換または、ハロゲン、 $\text{OCH}_3$ 、 $\text{CF}_3$ および $\text{C}_{1-4}$ アルキルからなる群から選択されるいずれかの置換基で置換されているフェニル、ナフチル、ヘテロアリールまたは縮合ヘテロアリールであり（ここで、ヘテロ環は、 $\text{N}$ 、 $\text{O}$ または $\text{S}$ を含有しており、芳香族、ジヒドロまたはテトラヒドロである）；

$\text{R}_6$ が $\text{H}$ であり；

$\text{A}$ および $\text{B}$ が、独立して、結合、 $\text{CH}_2$ および $\text{O}$ からなる群から選択されるか、または $\text{A}$ および $\text{B}$ が一緒になって結合を形成し；

$\text{X}_1$ および $\text{X}_5$ が、独立して、 $\text{Cl}$ 、 $\text{CN}$ または $\text{NO}_2$ であり（ただし、 $\text{X}_1$ または $\text{X}_5$ のいずれかは、 $\text{H}$ である）；

$\text{X}_2$ または $\text{X}_3$ または $\text{X}_4$ が $\text{H}$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{Cl}$ または $\text{J}$ - $\text{K}$ であり；

$\text{J}$ が、共有結合、非置換または、アリール、ヘテロアリールもしくは $\text{NR}'\text{R}''$ （ここで、 $\text{R}'$ および $\text{R}''$ は、 $\text{H}$ 、アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $\text{C}(\text{O})$ アルキル、 $\text{C}(\text{O})$ アリールおよび $\text{C}(\text{O})$ ヘテロアリールからなる群から選択される）により置換されている炭素原子5個までのアルキレンまたはアルケニレンであり；

$\text{K}$ が $\text{CO}_2\text{R}^{\text{IV}}$ である請求項3記載の化合物。

【請求項5】  $(\text{R})-\text{N}-[2-\text{ヒドロキシ}-3-(2-\text{シアノ}-4-(2-\text{カルボエトキシエチル})フェノキシ)プロピル]-1,1-\text{ジメチル}-2-(2-\text{ナフチル})エチルアミン$ ；

$(\text{R})-\text{N}-[2-\text{ヒドロキシ}-3-(2-\text{シアノ}-4-(2-\text{カルボキシエチル})フェノキシ)プロピル]-1,1-\text{ジメチル}-2-(2-\text{ナフチル})エチルアミン$ ；

$(\text{R})-\text{N}-[2-\text{ヒドロキシ}-3-(2-\text{シアノ}-5-(3-\text{カルボエトキシプロピル})フェノキシ)プロピル]-1,1-\text{ジメチル}-2-(2-\text{ナフチル})エチルアミン$ ；

$(\text{R})-\text{N}-[2-\text{ヒドロキシ}-3-(2-\text{シアノ}-5-(3-\text{カルボキシプロピル})フェノキシ)プロピル]-1,1-\text{ジメチル}-2-(2-\text{ナフチル})エチルアミン$ ；

$(\text{R})-\text{N}-[2-\text{ヒドロキシ}-3-(2-\text{シアノ}-5-(2-\text{カルボエトキシエチル})フェノキシ)プロピル]-1,1-\text{ジメチル}-2-(2-\text{ナフチル})エチルアミン$ ；

$(\text{R})-\text{N}-[2-\text{ヒドロキシ}-3-(2-\text{シアノ}-5-(2-\text{カルボキシエチル})フェノキシ)プロピル]-1,1-\text{ジメチル}-2-(2-\text{ナフチル})エチルアミン$ ；

シ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (3 - カルボエトキシプロピル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (3 - カルボキシプロピル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 3 - (3 - カルボエトキシプロピル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 3 - (3 - カルボキシプロピル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 3 - (2 - カルボエトキシエチル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 3 - (2 - カルボキシエチル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (カルボエトキシメチル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (カルボキシメチル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 5 - (カルボエトキシメチル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 5 - (カルボキシメチル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (2 - カルボエトキシ - トランス - エチレン)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (2 - カルボキシ - トランス - エチレン)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(4 - (2 - フェニル - 2 - R, S - メトキシカルボニルエチル))フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(4 - (2 - フェニル - 2 - R, S - カルボキシエチル))フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(3 - ベンジル - 4 - メトキシカルボニルメチル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミノ] - 3 - [(3 - ベンジル - 4 - メトキシカルボニルメチル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミノ] - 3 - [(3 - ベンジル - 4 - カルボキシメチル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(3 - ベンジル - 4 - カルボキシメチル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(4 - (3 - ヒドロキシ)プロピル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(4 - (2 - ヒドロキシ)エチル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(4 - (2 - シアノ)エチル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 2 - [4 - [3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - 1, 1 - ジメチルエチルアミノ] - 2 - ヒドロキシプロポキシ]ベンゾイル安息香酸メチル ;

(R) - 2 - [4 - [3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - 1, 1 - ジメチルエチルアミノ] - 2 - ヒドロキシプロポキシ]ベンゾイル安息香酸 ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(4 - シアノメチル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(4 - シアノ)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(4 - メトキシカルボニルメチル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(2 - ニトロ - 4 - シアノ)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(2 - ニトロ - 4 - (ヒドロキシメチル))フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(2 - ニトロ - 4 - メトキシカルボニルメチル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(2 - ニトロ - 4 - カルボキシメチル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミノ] - 3 - [(4 - メトキシカルボニル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミノ] - 3 - [(4 - カルボキシ)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(2 - シアノ - 4 - エトキシカルボニルメチル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(2 - シアノ - 4 - カルボキシメチル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(4 - メトキシカルボニルエチル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

N - [2 R - ヒドロキシ - 3 - [[2 - ニトロ - 4 - [2 S - エトキシカルボニル - 2 - [メチルスルホニル]アミノ]フェノキシ]プロピル] - 1, 1 - ジメチル - 2 - [4 - メトキシフェニル]エチルアミン ;

N - [2 R - ヒドロキシ - 3 - [[2 - ニトロ - 4 - [2 S - メトキシカルボニル - 2 - [フタルイミド]フェノキシ]プロピル] - 1, 1 - ジメチル - 2 - [ナフチル]エチルアミン ;

N - [2 R - ヒドロキシ - 3 - [[2 - ニトロ - 4 - [2 S - カルボキシ - 2 - [[2 - カルボキシ]フェニル]カルボニル]アミノ]エチル]フェノキシ]プロピル] - 1, 1 - ジメチル - 2 - [ナフチル]エチルアミン ;

N - [2 R - ヒドロキシ - 3 - [[2 - ニトロ - 4 - [2 S - メトキシカルボニル - 2 - [[2 - カルボキシ]フェニル]カルボニル]アミノ]エチル]フェノキシ]プロピル] - 1, 1 - ジメチル - 2 - [ナフチル]エチルアミン ;

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミノ] - 3 - [(3 - (2 - アミノフェノキシ) - 4 - メトキシカルボニル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ; および

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミノ] - 3 - [(3 - (2 - アミノフェノキシ) - 4 - カルボキシ)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;

ならびにその医薬上許容される塩および複合体

からなる群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 6】 (R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (2 - カルボエトキシエチル)フェノキシ)プロピル] - 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (2 - カルボキシエチル)フェノキシ)プロピル] - 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 5 - (3 - カルボエトキシプロピル)フェノキシ)プロピル] - 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 5 - (3 - カルボキシプロピル)フェノ

キシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;  
 (R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 5 - (2 - カルボエトキシエチル)フェ  
 ノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;  
 (R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 5 - (2 - カルボキシエチル)フェノキ  
 シ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;  
 (R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (3 - カルボエトキシプロピル)フ  
 ェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;  
 (R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (3 - カルボキシプロピル)フェノ  
 キシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;  
 (R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 3 - (3 - カルボエトキシプロピル)フ  
 ェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;  
 (R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 3 - (3 - カルボキシプロピル)フェノ  
 キシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;  
 (R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 3 - (2 - カルボエトキシエチル)フェ  
 ノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;  
 (R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 3 - (2 - カルボキシエチル)フェノキ  
 シ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;  
 (R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (カルボエトキシメチル)フェノキ  
 シ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;  
 (R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (カルボキシメチル)フェノキシ)  
 プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;  
 (R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 5 - (カルボエトキシメチル)フェノキ  
 シ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;  
 (R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 5 - (カルボキシメチル)フェノキシ)  
 プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;  
 (R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (2 - カルボエトキシ - トランス  
 - エチレン)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン  
 ;  
 (R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (2 - カルボキシ - トランス - エ  
 チレン)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;  
 (R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミノ] - 3 - [(3 - (2 - ア  
 ミノフェノキシ) - 4 - メトキシカルボニル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;  
 (R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(4  
 - (2 - フェニル - 2 - R, S - メトキシカルボニルエチル))フェノキシ] - プロパン - 2  
 - オール ;  
 (R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(3  
 - ベンジル - 4 - メトキシカルボニルメチル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;  
 (R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミノ] - 3 - [(3 - ベンジ  
 ル - 4 - メトキシカルボニルメチル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;  
 (R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミノ] - 3 - [(3 - ベンジ  
 ル - 4 - カルボキシメチル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;  
 (R) - 2 - [4 - [3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - 1, 1 - ジメチルエチルアミノ]  
 - 2 - ヒドロキシプロポキシ]ベンゾイル安息香酸メチル ;  
 (R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(2  
 - シアノ - 4 - エトキシカルボニルメチル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;  
 (R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - メトキシフェニル)エチルアミノ] - 3 - [(2  
 - ニトロ - 4 - メトキシカルボニルメチル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;  
 (R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミノ] - 3 - [(4 - メトキ  
 シカルボニル)フェノキシ] - プロパン - 2 - オール ;  
 N - [2 R - ヒドロキシ - 3 - [[2 - ニトロ - 4 - [2 S - エトキシカルボニル - 2 - [

メチルスルホニル]アミノ]フェノキシ]プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - [4 - メトキシフェニル]エチルアミン ;

N - [2 R - ヒドロキシ - 3 - [[2 - ニトロ - 4 - [2 S - メトキシカルボニル - 2 - [フタルイミド]フェノキシ]プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - [ナフチル]エチルアミン ; および

N - [2 R - ヒドロキシ - 3 - [[2 - ニトロ - 4 - [2 S - メトキシカルボニル - 2 - [[2 - カルボキシ]フェニル]カルボニル]アミノ]エチル]フェノキシ]プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - [ナフチル]エチルアミン ; ならびに

その医薬上許容される塩および複合体

からなる群から選択される請求項 5 記載の化合物。

【請求項 7】 (R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (2 - カルボエトキシエチル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (2 - カルボキシエチル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 5 - (3 - カルボエトキシプロピル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 5 - (3 - カルボキシプロピル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 5 - (2 - カルボエトキシエチル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 5 - (2 - カルボキシエチル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (3 - カルボエトキシプロピル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (3 - カルボキシプロピル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 3 - (3 - カルボエトキシプロピル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 3 - (3 - カルボキシプロピル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 3 - (2 - カルボエトキシエチル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 3 - (2 - カルボキシエチル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (カルボエトキシメチル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (カルボキシメチル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 5 - (カルボエトキシメチル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 5 - (カルボキシメチル)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (2 - カルボエトキシ - トランス - エチレン)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ;

(R) - N - [2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - シアノ - 4 - (2 - カルボキシ - トランス - エチレン)フェノキシ)プロピル]- 1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミン ; および

(R) - 1 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (2 - ナフチル)エチルアミノ] - 3 - [(3 - (2 - ア



ミノフェノキシ)-4-メトキシカルボニル)フェノキシ]-プロパン-2-オール；ならびに

その医薬上許容される塩および複合体  
からなる群から選択される請求項6記載の化合物。

【請求項8】 請求項1記載の化合物および医薬上許容される担体を含む、異常な骨またはミネラルホメオスタシスにより特徴付けられる疾患または障害の治療用医薬組成物。

【請求項9】 カルシウム受容体を拮抗する方法であって、かかる拮抗作用を必要とする、ヒトを除く対象に有効量の請求項1記載の化合物を投与することを含む方法。

【請求項10】 異常な骨またはミネラルホメオスタシスにより特徴付けられる疾患または障害の治療方法であって、かかる治療を必要とする、ヒトを除く対象に有効量の請求項1記載の化合物を投与することを含む治療方法。

【請求項11】 骨またはミネラル疾患または障害が、骨肉種、歯周疾患、骨折治癒機転、変形性関節症、慢性関節リウマチ、パジェット病、体液性高カルシウム血症、悪性疾患および骨粗鬆症からなる群から選択される請求項9記載の方法。

【請求項12】 骨またはミネラル疾患または障害が骨粗鬆症である請求項10記載の方法。

【請求項13】 血清中副甲状腺レベルを増加させる方法であって、かかる処置を必要とする、ヒトを除く対象に有効量の請求項1記載の化合物を投与することを含む方法。

【請求項14】 異常な骨またはミネラルホメオスタシスにより特徴付けられる疾患または障害の治療用薬剤の製造における式(I)で示される化合物の使用。