

【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24年2月16日(2012.2.16)

【公表番号】特表2011-506490(P2011-506490A)

【公表日】平成23年3月3日(2011.3.3)

【年通号数】公開・登録公報2011-009

【出願番号】特願2010-538278(P2010-538278)

【国際特許分類】

C 07 C 235/38 (2006.01)

A 61 K 31/196 (2006.01)

A 61 K 31/167 (2006.01)

A 61 P 1/16 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

C 07 C 231/02 (2006.01)

C 07 C 231/12 (2006.01)

C 07 C 237/30 (2006.01)

【F I】

C 07 C 235/38 C S P

A 61 K 31/196

A 61 K 31/167

A 61 P 1/16

A 61 P 11/00

A 61 P 29/00

A 61 P 35/00

A 61 P 43/00 1 2 1

C 07 C 231/02

C 07 C 231/12

C 07 C 237/30

【手続補正書】

【提出日】平成23年12月19日(2011.12.19)

【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

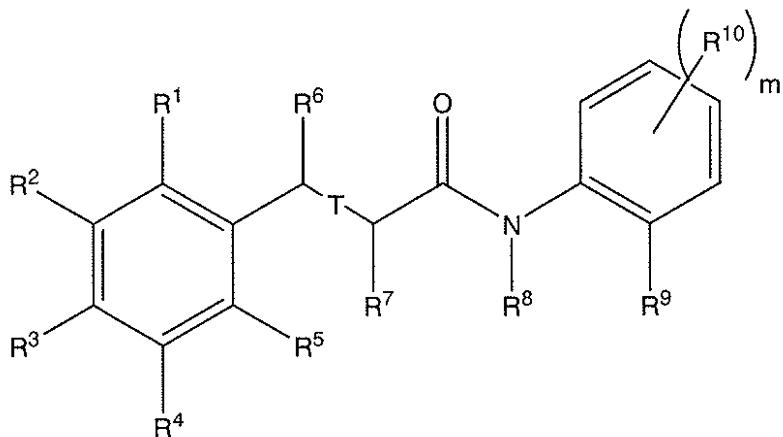
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I) :

【化38】



Tは、単結合、二重結合または三重結合であり；

R¹、R⁴、およびR⁵は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、OH、NO₂、CN、NH₂、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキル、任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニル、任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニル、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキル、任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキル、任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルケニル、任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂ヘテロシクロアルキル、任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリール、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアリール、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルオキシ、任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニルオキシ、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキルオキシ、任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキルオキシ、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂ヘテロシクロアルキルオキシ、任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリールオキシ、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアリールオキシ、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルアミノ、SR¹¹、SO₃H、SO₂NR¹¹R¹²、SO₂R¹¹、SONR¹¹R¹²、SOR¹¹、COR¹¹、COOH、COOR¹¹、CONR¹¹R¹²、NR¹¹COR¹²、NR¹¹COO¹²、NR¹¹SO₂R¹²、NR¹¹CONR¹²R¹³、NR¹¹R¹²、およびアシリルからなる群より選択され；

R²およびR³の少なくとも1つは、少なくとも1つのハロゲン原子を含むC₁-C₁₂アルキルオキシ、少なくとも1つのハロゲン原子を含むC₂-C₁₂アルケニルオキシ、少なくとも1つのハロゲン原子を含むC₂-C₁₂アルキニルオキシ、および少なくとも1つのハロゲン原子を含むC₃-C₁₂シクロアルキルオキシからなる群より選択され、R²またはR³の他方は、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルオキシ、任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニルオキシ、任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニルオキシおよび任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキルオキシからなる群より選択され；あるいは、R²およびR³は、一緒になって、-O-X-O-(ここで、Xは、少なくとも1つのハロゲン原子を含む任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルである)を形成し；

R⁶およびR⁷は、Tが単結合または二重結合であるときには存在するが、Tが三重結合であるときには存在せず、各R⁶およびR⁷は、独立して、H、NO₂、CN、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキル、任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニル、任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニル、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキル、任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキル、任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルケニル、任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂ヘテロシクロアルキル、任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂ヘテロシクロアルケニル、任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリール、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアリール、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルオキシ、任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニルオキシ、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキルオキシ、任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキルオキシ、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂ヘテロシクロアルキルオキシ、任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリールオキシ、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアリールオキシ、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルアミノ、SR¹¹、SO₃H、SO₂NR¹¹R¹²、SO₂R¹¹、SONR¹¹R¹²、SOR¹¹、COR¹¹、COOH、COOR¹¹、CONR¹¹R¹²、NR¹¹COR¹²、NR¹¹COO¹²、NR¹¹SO₂R¹²、NR¹¹CONR¹²R¹³、NR¹¹R¹²、およびアシリルからなる群より選択され；

任意に置換されていてもよい $C_6 - C_{18}$ アリール，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{18}$ ヘテロアリール，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ アルキルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_2 - C_{12}$ アルケニルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_2 - C_{12}$ アルキニルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{10}$ ヘテロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_3 - C_{12}$ シクロアルケニルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ ヘテロシクロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ ヘテロシクロアルケニルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_6 - C_{18}$ アリールオキシ，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{18}$ ヘテロアリールオキシ，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ アルキルアミノ， $S R^{11}$ ， $S O_3 H$ ， $S O_2 N R^{11} R^{12}$ ， $S O_2 R^{11}$ ， $S O N R^{11} R^{12}$ ， $S O R^{11}$ ， $C O R^{11}$ ， $C O O H$ ， $C O O R^{11}$ ， $C O N R^{11} R^{12}$ ， $N R^{11} C O R^{12}$ ， $N R^{11} C O O R^{12}$ ， $N R^{11} S O_2 R^{12}$ ， $N R^{11} C O N R^{12} R^{13}$ ， $N R^{11} R^{12}$ ，およびアシルからなる群より選択され； R^8 は， H ， N -保護基，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ アルキル，任意に置換されていてもよい $C_2 - C_{12}$ アルケニル，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{10}$ ヘテロアルキル，任意に置換されていてもよい $C_3 - C_{12}$ シクロアルキル，任意に置換されていてもよい $C_3 - C_{12}$ シクロアルケニル，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ ヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ ヘテロシクロアルケニル，任意に置換されていてもよい $C_6 - C_{18}$ アリール，および任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{18}$ ヘテロアリールからなる群より選択され； R^9 は $C O O H$ であり；

R^{10} は， H ，ハロゲン， $O H$ ， $N O_2$ ， $C N$ ， $N H_2$ ，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ アルキル，任意に置換されていてもよい $C_2 - C_{12}$ アルケニル，任意に置換されていてもよい $C_2 - C_{12}$ アルキニル，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{10}$ ヘテロアルキル，任意に置換されていてもよい $C_3 - C_{12}$ シクロアルキル，任意に置換されていてもよい $C_3 - C_{12}$ シクロアルケニル，任意に置換されていてもよい $C_2 - C_{12}$ ヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよい $C_2 - C_{12}$ ヘテロシクロアルケニル，任意に置換されていてもよい $C_6 - C_{18}$ アリール，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{18}$ ヘテロアリール，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ アルキルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_2 - C_{12}$ アルキニルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{10}$ ヘテロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_3 - C_{12}$ シクロアルケニルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ ヘテロシクロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ ヘテロシクロアルケニルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_6 - C_{18}$ アリールオキシ，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{18}$ ヘテロアリールオキシ，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ アルキルアミノ， $S R^{11}$ ， $S O_3 H$ ， $S O_2 N R^{11} R^{12}$ ， $S O_2 R^{11}$ ， $S O N R^{11} R^{12}$ ， $S O R^{11}$ ， $C O R^{11}$ ， $C O O H$ ， $C O O R^{11}$ ， $C O N R^{11} R^{12}$ ， $N R^{11} C O R^{12}$ ， $N R^{11} C O O R^{12}$ ， $N R^{11} S O_2 R^{12}$ ， $N R^{11} C O N R^{12} R^{13}$ ， $N R^{11} R^{12}$ ，およびアシルからなる群より選択され；

各 R^{11} ， R^{12} および R^{13} は，独立して， H ，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ アルキル，任意に置換されていてもよい $C_2 - C_{12}$ アルケニル，任意に置換されていてもよい $C_2 - C_{12}$ アルキニル，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{10}$ ヘテロアルキル，任意に置換されていてもよい $C_3 - C_{12}$ シクロアルキル，任意に置換されていてもよい $C_3 - C_{12}$ シクロアルケニル，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ ヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ ヘテロシクロアルケニル，任意に置換されていてもよい $C_6 - C_{18}$ アリール，および任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{18}$ ヘテロアリールからなる群より選択され；および

m は， 0 ， 1 ， 2 ， 3 ，および 4 からなる群より選択される整数である]

の化合物，またはその薬学的に許容しうる塩またはプロドラッグ。

【請求項 2】

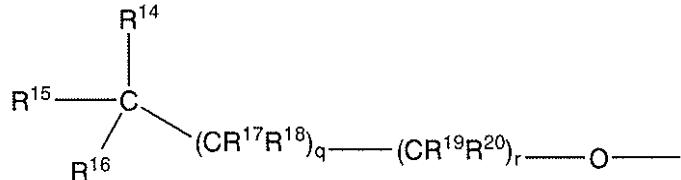
R^1 ， R^2 および R^5 の少なくとも1つは，少なくとも1つのハロゲン原子を含む $C_1 - C$

C_{1-12} アルキルオキシ，少なくとも1つのハロゲン原子を含む C_1-C_{12} アルケニルオキシ，および少なくとも1つのハロゲン原子を含む C_1-C_{12} アルキニルオキシからなる群より選択される，請求項1記載の化合物。

【請求項3】

R^1, R^2, R^3, R^4 ，および R^5 の少なくとも1つは，式(I)：

【化39】



[式中，

R^{14}, R^{15} ，および R^{16} は，それぞれ独立して，H，ハロゲン，OH，NO₂，CN，NH₂，任意に置換されていてもよい C_1-C_{12} アルキル，および任意に置換されていてもよい C_2-C_{12} アルケニルからなる群より選択され；

R^{17}, R^{18}, R^{19} ，および R^{20} は，それぞれ独立して，H，ハロゲン，OH，NO₂，CN，およびNH₂からなる群より選択され；

$R^{14}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, R^{18}, R^{19}$ ，および R^{20} の少なくとも1つはハロゲン原子であるかまたはこれを含み；

qは0，1，2，3，4，5，6，7，8，9，および10からなる群より選択される整数であり；および

rは0，1，2，3，4，5，6，7，8，9，および10からなる群より選択される整数である]

を有する，請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

qおよびrは0であり，および R^{14}, R^{15} ，および R^{16} の少なくとも2つはハロゲンである，請求項3記載の化合物。

【請求項5】

ハロゲンはフッ素である，請求項1-4のいずれかに記載の化合物。

【請求項6】

R^1, R^2, R^3, R^4 ，および R^5 の少なくとも1つは基-O-CHF₂である，請求項1-5のいずれかに記載の化合物。

【請求項7】

R^2 および R^3 の少なくとも1つは基-O-CHF₂である，請求項6記載の化合物。

【請求項8】

Tは二重結合または三重結合である，請求項1-7のいずれかに記載の化合物。

【請求項9】

R^{10} はハロゲンである，請求項1-8のいずれかに記載の化合物。

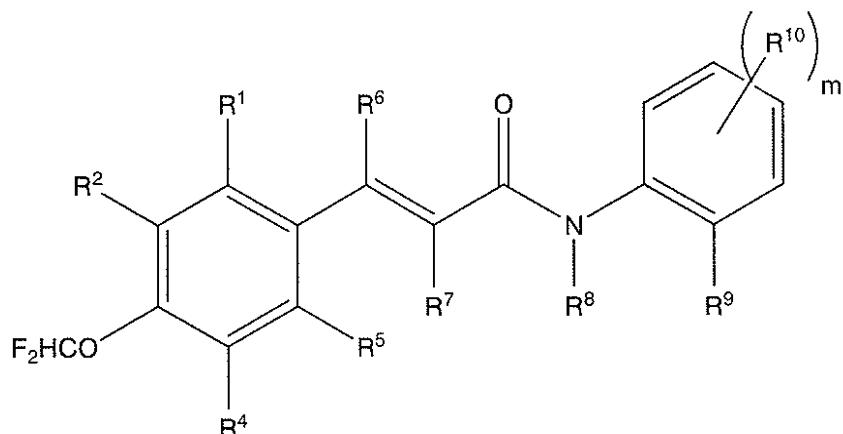
【請求項10】

mは1である、請求項1-9のいずれかに記載の化合物。

【請求項11】

式(I)

【化40】



[式中]

R¹, R⁴, および R⁵は, それぞれ独立して, H, ハロゲン, OH, NO₂, CN, NH₂, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキル, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニル, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニル, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキル, 任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキル, 任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルケニル, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂ヘテロシクロアルキル, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂ヘテロシクロアルケニル, 任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリール, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアルキルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂ヘテロシクロアルケニルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリールオキシ, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアルキルアミノ, SR¹¹, SO₃H, SO₂NR¹¹R¹², SO₂R¹¹, SONR¹¹R¹², SOR¹, COR¹¹, COOH, COOR¹¹, CONR¹¹R¹², NR¹¹COR¹², NR¹¹COOR¹², NR¹¹SOR¹², NR¹¹CONR¹²R¹³, NR¹¹R¹², およびアシリルからなる群より選択され; ただし, R¹, R², R³, R⁴, およびR⁵の少なくとも1つはハロゲン原子を含み;

R²は, 少なくとも1つのハロゲン原子を含む任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニルオキシおよび任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキルオキシからなる群より選択され;

R⁶およびR⁷は, それぞれ独立して, H, NO₂, CN, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキル, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニル, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニル, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキル, 任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルケニル, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂ヘテロシクロアルキル, 任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリール, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアルキルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂シクロアルケニル, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂ヘテロシクロアルケニル

ニルオキシ，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂ヘテロシクロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂ヘテロシクロアルケニルオキシ，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈アリールオキシ，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルアミノ，S R¹¹，S O₃H，S O₂N R¹¹R¹²，S O₂R¹¹，S O N R¹¹R¹²，S O R¹¹，C O R¹¹，C O O H，C O O R¹¹，C O N R¹¹R¹²，N R¹¹C O R¹²，N R¹¹C O O R¹²，N R¹¹S O₂R¹²，N R¹¹C O N R¹²R¹³，N R¹¹R¹²，およびアシルからなる群より選択され；

R⁸は，H，N-保護基，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキル，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニル，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニル，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキル，任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルケニル，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂ヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリール，および任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアリールからなる群より選択され；R⁹はC O O Hであり；

R¹⁰は，H，ハロゲン，O H，N O₂，C N，N H₂，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキル，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニル，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニル，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキル，任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルケニル，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂ヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリール，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアリール，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニルオキシ，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルケニルオキシ，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂ヘテロシクロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈アリールオキシ，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアリールオキシ，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルアミノ，S R¹¹，S O₃H，S O₂N R¹¹R¹²，S O₂R¹¹，S O N R¹¹R¹²，S O R¹¹，C O R¹¹，C O O H，C O O R¹¹，C O N R¹¹R¹²，N R¹¹C O R¹²，N R¹¹C O O R¹²，N R¹¹S O₂R¹²，N R¹¹C O N R¹²R¹³，N R¹¹R¹²，およびアシルからなる群より選択され；

各R¹¹，R¹²およびR¹³は，独立して，H，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキル，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニル，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニル，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキル，任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルケニル，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂ヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリール，および任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアリールからなる群より選択され；および

mは，0，1，2，3，および4からなる群より選択される整数である]の化合物またはその薬学的に許容しうる塩またはプロドラッグ。

【請求項12】

R²は基-O-C H F₂である，請求項11記載の化合物。

【請求項13】

R²は，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルオキシおよび任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニルオキシからなる群より選択される，請求項11記載の化合物。

【請求項14】

R¹は基-O-C(H)F₂である、請求項11-13のいずれかに記載の化合物。

【請求項15】

R⁴は基-O-C(H)F₂である、請求項11-14のいずれかに記載の化合物。

【請求項16】

R⁵は基-O-C(H)F₂である、請求項11-15のいずれかに記載の化合物。

【請求項17】

R¹は、任意に置換されてもよいC₁-C₁₂アルキルオキシおよび任意に置換されてもよいC₂-C₁₂アルキニルオキシからなる群より選択される、請求項11-13および15-16のいずれかに記載の化合物。

【請求項18】

R⁴は、任意に置換されてもよいC₁-C₁₂アルキルオキシおよび任意に置換されてもよいC₂-C₁₂アルキニルオキシからなる群より選択される、請求項11-13および16-17のいずれかに記載の化合物。

【請求項19】

R⁵は、任意に置換されてもよいC₁-C₁₂アルキルオキシおよび任意に置換されてもよいC₂-C₁₂アルキニルオキシからなる群より選択される、請求項11-15および17-18のいずれかに記載の化合物。

【請求項20】

R⁶およびR⁷は、それぞれ独立して、H、および任意に置換されてもよいC₁-C₁₂アルキルからなる群より選択される、請求項11-19のいずれかに記載の化合物。

【請求項21】

R⁶はCH₃である、請求項11-20のいずれかに記載の化合物。

【請求項22】

R⁷はCH₃である、請求項11-21のいずれかに記載の化合物。

【請求項23】

R⁸はHである、請求項11-22のいずれかに記載の化合物。

【請求項24】

R¹⁰はハロゲンである、請求項11-23のいずれかに記載の化合物。

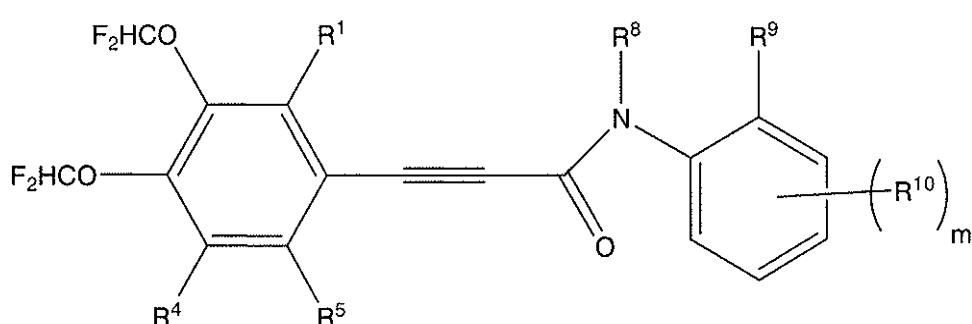
【請求項25】

mは1である、請求項24記載の化合物。

【請求項26】

式(V)：

【化41】



[式中、

R¹、R⁴、およびR⁵は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、OH、NO₂、CN、NH₂、任意に置換されてもよいC₁-C₁₂アルキル、任意に置換されてもよいC₂-C₁₂アルケニル、任意に置換されてもよいC₂-C₁₂アルキニル、任意に置換されてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキル、任意に置換されてもよいC₃-C₁₂シクロアルキル、任意に置換されてもよいC₃-C₁₂シクロアルケニル、任意に置換されてもよいC₂-C₁₂ヘテロシクロアルキル、任意に置換されてもよいC₂-C₁₂ヘテロシクロアルケニル、任意に置換されてもよいC₂-C₁₂ヘテロシク

ロアルケニル，任意に置換されていてもよいC₆ - C₁₈アリール，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₈ヘテロアリール，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂アルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルケニルオキシ，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルキニルオキシ，任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルケニルオキシ，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂ヘテロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₈アリールオキシ，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₈ヘテロアリールオキシ，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂アルキルアミノ，SR¹¹，SO₃H，SO₂NR¹¹R¹²，SO₂R¹¹，SONR¹¹R¹²，SOR¹，COR¹¹，COOH，COOR¹¹，CONR¹¹R¹²，NR¹¹COR¹²，NR¹¹COO R¹²，NR¹¹SO₂R¹²，NR¹¹CONR¹²R¹³，NR¹¹R¹²，およびアシルからなる群より選択され；ただし，R¹，R²，R³，R⁴，およびR⁵の少なくとも1つはハロゲン原子を含み；

R⁸は，H，N - 保護基，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂アルキル，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルケニル，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルキニル，任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルケニル，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂ヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂ヘテロシクロアルケニル，任意に置換されていてもよいC₆ - C₁₈アリール，および任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₈ヘテロアリールからなる群より選択され；

R⁹は，COOR¹¹，CONR¹¹R¹²，およびNR¹¹R¹²からなる群より選択され；

R¹⁰は，H，ハロゲン，OH，NO₂，CN，NH₂，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂アルキル，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルケニル，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルキニル，任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂ヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂ヘテロシクロアルケニル，任意に置換されていてもよいC₆ - C₁₈アリール，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₈ヘテロアリール，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂アルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルキニルオキシ，任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルケニルオキシ，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂ヘテロシクロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₆ - C₁₈アリールオキシ，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₈ヘテロアリールオキシ，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂アルキルアミノ，SR¹¹，SO₃H，SO₂NR¹¹R¹²，SO₂R¹¹，SONR¹¹R¹²，SOR¹¹，COR¹¹，COOH，COOR¹¹，CONR¹¹R¹²，NR¹¹COR¹²，NR¹¹COO R¹²，NR¹¹SO₂R¹²，NR¹¹CO NR¹²R¹³，NR¹¹R¹²，およびアシルからなる群より選択され；

各R¹¹，R¹²およびR¹³は，独立して，H，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂アルキル，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルケニル，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルキニル，任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルケニル，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂ヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₆ - C₁₈アリール，および任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₈ヘテロアリールからなる群より選択され；および

mは，0，1，2，3，および4からなる群より選択される整数である]の化合物またはその薬学的に許容しうる塩またはプロドラッグ。

【請求項 2 7】

R¹は基 - O - C H F₂であり，R⁴およびR⁵はHである，請求項 2 6記載の化合物。

【請求項 2 8】

R⁴は基 - O - C H F₂であり，R¹およびR⁵はHである，請求項 2 6記載の化合物。

【請求項 2 9】

R⁵は基 - O - C H F₂であり，R¹およびR⁴はHである，請求項 2 6記載の化合物。

【請求項 3 0】

R⁸はHである，請求項 2 6 - 2 7のいずれかに記載の化合物。

【請求項 3 1】

R⁹は，C O O R¹¹およびC O N R¹¹ R¹²からなる群より選択される，請求項 2 6 - 3 0のいずれかに記載の化合物。

【請求項 3 2】

R⁹は，C O O H，C O N H₂，およびC O N H C H₃からなる群より選択される，請求項 3 1記載の化合物。

【請求項 3 3】

R⁹はN R¹¹ R¹²である，請求項 2 6 - 3 0のいずれかに記載の化合物。

【請求項 3 4】

R⁹はN H₂である，請求項 3 3記載の化合物。

【請求項 3 5】

R¹⁰はハロゲンである，請求項 2 6 - 3 4のいずれかに記載の化合物。

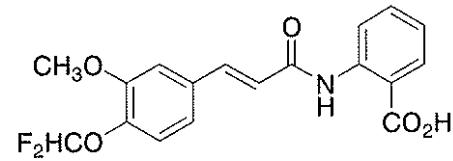
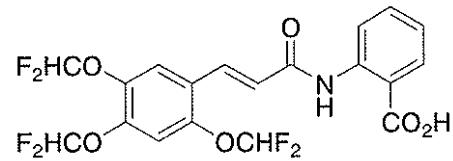
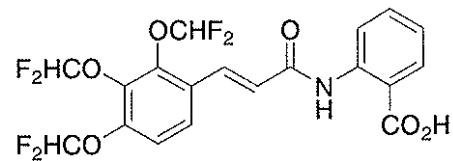
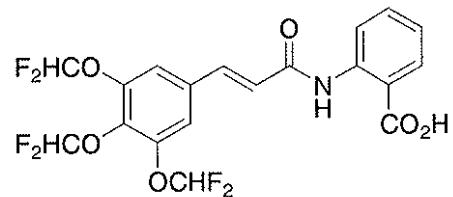
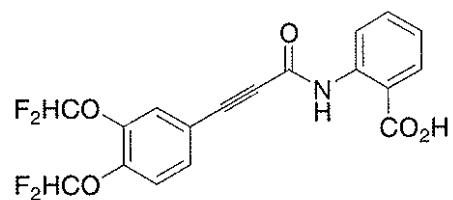
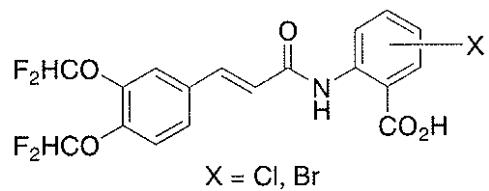
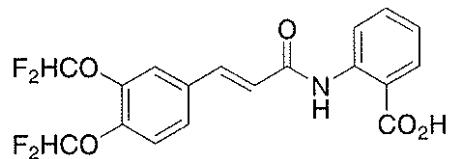
【請求項 3 6】

mは1である，請求項 3 5記載の化合物。

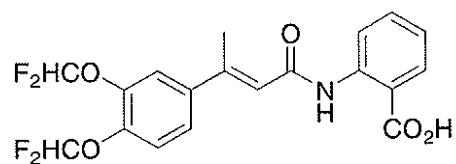
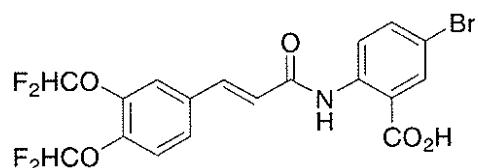
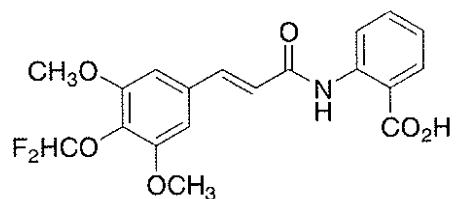
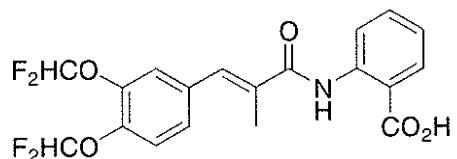
【請求項 3 7】

以下：

【化 4 2】



【化 4 3】

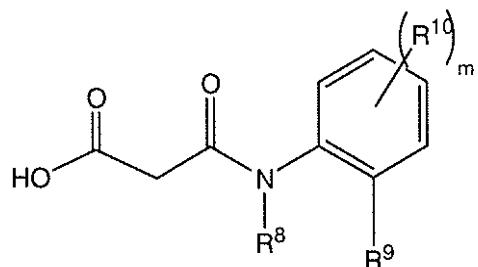


からなる群より選択される化合物またはその薬学的に許容しうる塩またはプロドラッグ。

【請求項 3 8】

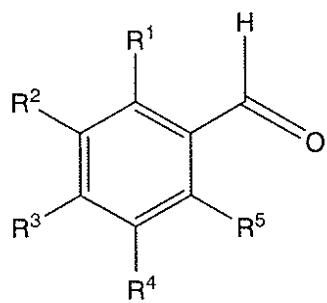
請求項 1 - 2 5 のいずれかに記載の化合物を製造する方法であって、式：

【化 4 4】



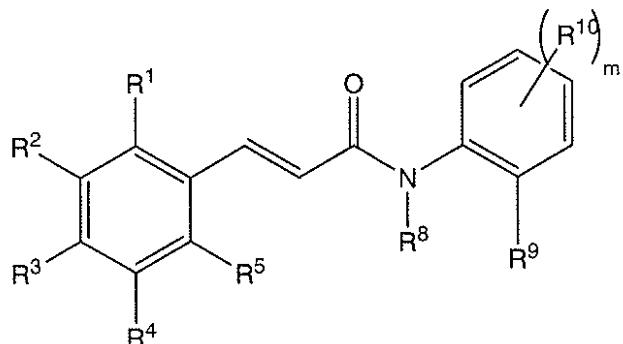
の化合物を、式：

【化 4 5】



の化合物と、式：

【化46】

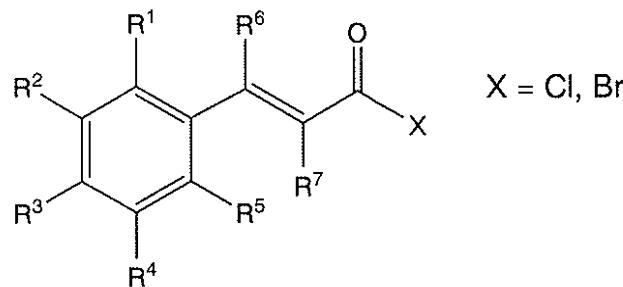


の化合物を生成する条件下で反応させることを含み、上記式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} および R^{13} は請求項1において定義したとおりである、方法。

【請求項39】

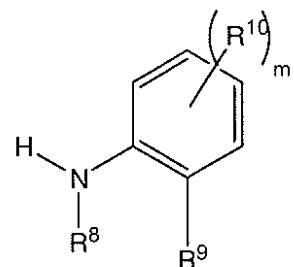
請求項1-25のいずれかに記載の化合物を製造する方法であって、式：

【化47】



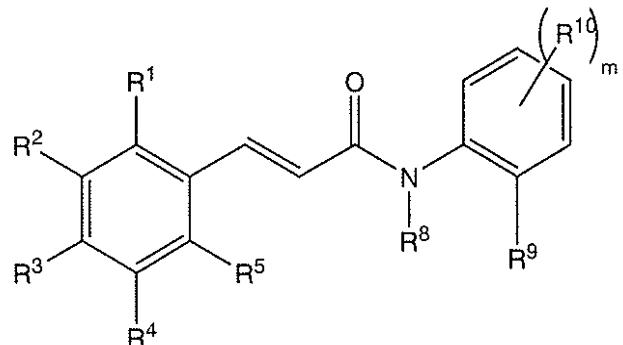
の化合物を、式：

【化48】



の化合物と、式：

【化49】

の化合物を生成する条件下で反応させることを含み、上記式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R

⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹²およびR¹³は請求項1において定義したとおりである, 方法。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0006

【補正方法】変更

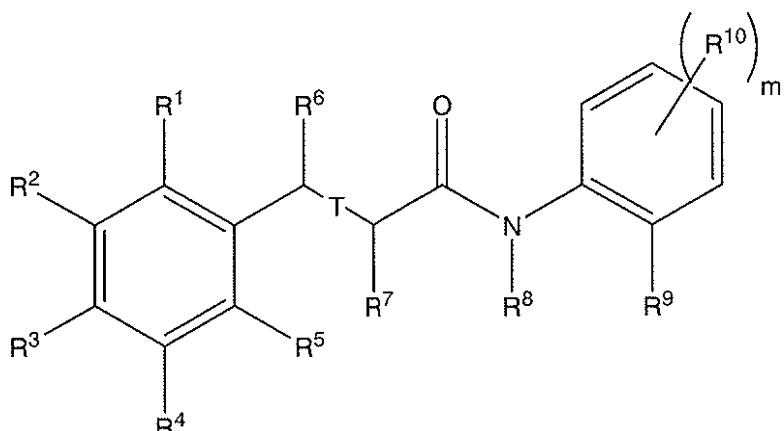
【補正の内容】

【0006】

概要

本発明は、式(I)：

【化1】



[式中、

- Tは、単結合、二重結合または三重結合であり；
 - R¹、R⁴、およびR⁵は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、OH、NO₂、CN、NH₂、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキル、任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニル、任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニル、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキル、任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキル、任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルケニル、任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂ヘテロシクロアルキル、任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリール、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアリール、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルオキシ、任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニルオキシ、任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニルオキシ、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキルオキシ、任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキルオキシ、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂ヘテロシクロアルキルオキシ、任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリールオキシ、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアリールオキシ、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルアミノ、SR¹¹、SO₃H、SO₂NR¹¹R¹²、SO₂R¹¹、SONR¹¹R¹²、SO¹¹、COR¹¹、COOH、COOR¹¹、CONR¹¹R¹²、NR¹¹COR¹²、NR¹¹CO¹²、NR¹¹SO₂R¹²、NR¹¹CONR¹²R¹³、NR¹¹R¹²、およびアシルからなる群より選択され；

R²およびR³の少なくとも1つは、少なくとも1つのハロゲン原子を含むC₁-C₁₂アルキルオキシ、少なくとも1つのハロゲン原子を含むC₂-C₁₂アルケニルオキシ、少なくとも1つのハロゲン原子を含むC₂-C₁₂アルキニルオキシ、および少なくとも1つのハロゲン原子を含むC₃-C₁₂シクロアルキルオキシからなる群より選択され、R²またはR³の他方は、任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルオキシ、任意に置換されてい

てもよいC₂-C₁₂アルケニルオキシ，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニルオキシおよび任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキルオキシからなる群より選択され；あるいは，R²およびR³は，一緒になって，-O-X-O-（ここで，Xは，少なくとも1つのハロゲン原子を含む任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルである）を形成し；

- R⁶およびR⁷は，Tが単結合または二重結合であるときには存在するが，Tが三重結合であるときには存在せず，各R⁶およびR⁷は，独立して，H，NO₂，CN，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキル，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニル，任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂アルキニル，任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂ヘテロアルキル，任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルケニル，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂ヘテロシクロアルケニル，任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリール，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアリール，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニルオキシ，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂ヘテロシクロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂ヘテロシクロアルケニルオキシ，任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリールオキシ，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアリールオキシ，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルアミノ，SR¹¹，SO₃H，SO₂NR¹¹R¹²，SO₂R¹¹，SONR¹¹R¹²，SOR¹¹，COR¹¹，COOH，COOR¹¹，CONR¹¹R¹²，NR¹¹COR¹²，NR¹¹COOR¹²，NR¹¹SO₂R¹²，NR¹¹CONR¹²R¹³，NR¹¹R¹²，およびアシルからなる群より選択され；

- R⁸は，H，N-保護基，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキル，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニル，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニル，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキル，任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルケニル，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂ヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリール，および任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアリールからなる群より選択され；

- R⁹はCOOHであり；

- R¹⁰は，H，ハロゲン，OH，NO₂，CN，NH₂，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキル，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニル，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニル，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキル，任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂ヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリール，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアリール，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニルオキシ，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂ヘテロシクロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリールオキシ，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアリールオキシ，任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルアミノ，SR¹¹，SO₃H，SO₂NR¹¹R¹²，SO₂R¹¹，SONR¹¹R¹²，SOR¹¹，COR¹¹，COOH，COOR

$\text{N}^{\text{R}^{11}}\text{C}\text{O}\text{R}^{12}$, $\text{N}^{\text{R}^{11}}\text{C}\text{O}\text{O}\text{R}^{12}$, $\text{N}^{\text{R}^{11}}\text{S}\text{O}_2\text{R}^{12}$, $\text{N}^{\text{R}^{11}}\text{C}\text{O}\text{N}\text{R}^{12}\text{R}^{13}$, $\text{N}^{\text{R}^{11}}\text{R}^{12}$, およびアシルからなる群より選択され;

- 各 R^{11} , R^{12} および R^{13} は, 独立して, H , 任意に置換されていてもよい C_{1-12} アルキル, 任意に置換されていてもよい C_{2-12} アルケニル, 任意に置換されていてもよい C_{2-12} アルキニル, 任意に置換されていてもよい C_{1-10} ヘテロアルキル, 任意に置換されていてもよい C_{3-12} シクロアルキル, 任意に置換されていてもよい C_{3-12} シクロアルケニル, 任意に置換されていてもよい C_{1-12} ヘテロシクロアルキル, 任意に置換されていてもよい C_{6-18} アリール, および任意に置換されていてもよい C_{1-18} ヘテロアリールからなる群より選択され; および

- m は, 0, 1, 2, 3, および 4 からなる群より選択される整数である] の化合物またはその薬学的に許容しうる塩またはプロドラッグを提供する。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0008

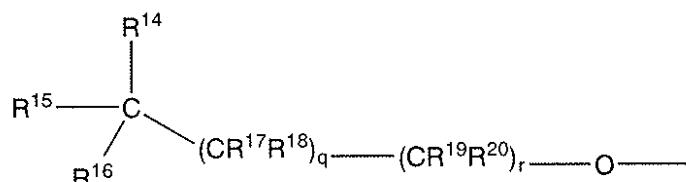
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0008】

ある態様においては, R^1 , R^2 および R^5 の少なくとも 1 つは, 少なくとも 1 つのハロゲン原子を含む C_{1-12} アルキルオキシ, 少なくとも 1 つのハロゲン原子を含む C_{1-12} アルケニルオキシ, および少なくとも 1 つのハロゲン原子を含む C_{1-12} アルキニルオキシからなる群より選択される。ある態様においては, C_{1-12} アルキルオキシ基は式(I) :

【化2】



[式中,

R^{14} , R^{15} , および R^{16} は, それぞれ独立して, H , ハロゲン, OH , NO_2 , CN , NH_2 , 任意に置換されていてもよい C_{1-12} アルキル, および任意に置換されていてもよい C_{2-12} アルケニルからなる群より選択され;

R^{17} , R^{18} , R^{19} , および R^{20} は, それぞれ独立して, H , ハロゲン, OH , NO_2 , CN , および NH_2 からなる群より選択され;

R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} , および R^{20} の少なくとも 1 つは, ハロゲン原子であるかまたはこれを含み;

q は, 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, および 10 からなる群より選択される整数であり; および

r は, 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, および 10 からなる群より選択される整数である]

のものである。

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0017

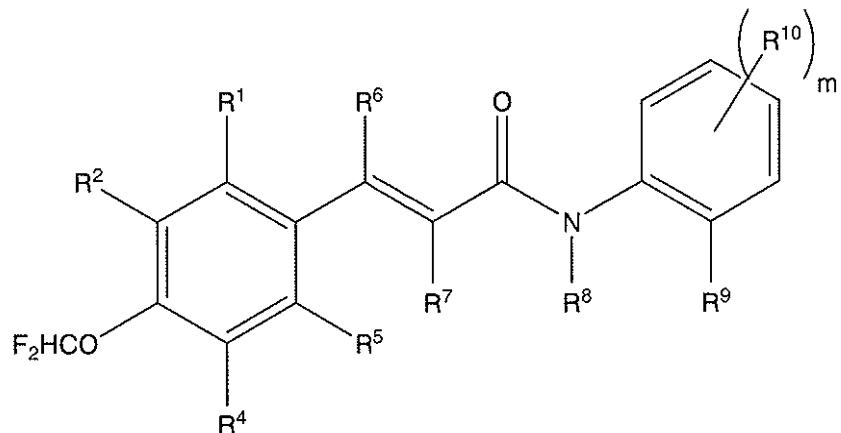
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0017】

別の観点においては, 本発明は, 式(I) :

【化 3】



〔式中，

- R¹, R⁴, および R⁵は, それぞれ独立して, H, ハロゲン, OH, NO₂, CN, NH₂, 任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂アルキル, 任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルケニル, 任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルキニル, 任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₀ヘテロアルキル, 任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルキル, 任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルケニル, 任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂ヘテロシクロアルキル, 任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂ヘテロシクロアルケニル, 任意に置換されていてもよいC₆ - C₁₈アリール, 任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₈ヘテロアリール, 任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂アルキルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルケニルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₀ヘテロアルキルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルキルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂ヘテロシクロアルキルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂ヘテロシクロアルケニルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₆ - C₁₈アリールオキシ, 任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₈ヘテロアリールオキシ, 任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂アルキルアミノ, SR¹¹, SO₃H, SO₂NR¹¹R¹², SO₂R¹¹, SONR¹¹R¹², SO₂R¹¹, COR¹¹, COOH, COOR¹¹, CONR¹¹R¹², NR¹¹COR¹², NR¹¹COOR¹², NR¹¹SO₂R¹², NR¹¹CONR¹²R¹³, NR¹¹R¹², およびアシルからなる群より選択され; ただし, R¹, R², R³, R⁴, および R⁵の少なくとも 1 つはハロゲン原子を含み;

- R^2 は、少なくとも 1 つのハロゲン原子を含む任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ アルキルオキシ、任意に置換されていてもよい $C_2 - C_{12}$ アルケニルオキシ、任意に置換されていてもよい $C_2 - C_{12}$ アルキニルオキシおよび任意に置換されていてもよい $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルオキシからなる群より選択され：

- R⁶およびR⁷は、それぞれ独立して、H、NO₂、CN、任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂アルキル、任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルケニル、任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルキニル、任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₀ヘテロアルキル、任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルキル、任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルケニル、任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂ヘテロシクロアルキル、任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂ヘテロシクロアルケニル、任意に置換されていてもよいC₆ - C₁₈アリール、任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₈ヘテロアリール、任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂アルキルオキシ、任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルケニルオキシ、任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルキニルオキシ、任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₀ヘテロアルキルオキシ、任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルキルオキシ、任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアル

ケニルオキシ，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂ヘテロシクロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂ヘテロシクロアルケニルオキシ，任意に置換されていてもよいC₆ - C₁₈アリールオキシ，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₈ヘテロアリールオキシ，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂アルキルアミノ，SR¹¹，SO₃H，SO₂NR¹¹R¹²，SO₂R¹¹，SONR¹¹R¹²，SOR¹¹，COR¹¹，COOH，COOR¹¹，CONR¹¹R¹²，NR¹¹COR¹²，NR¹¹COOR¹²，NR¹¹SO₂R¹²，NR¹¹CONR¹²R¹³，NR¹¹R¹²，およびアシルからなる群より選択され；

- R⁸は，H，N-保護基，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂アルキル，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルケニル，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルキニル，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₀ヘテロアルキル，任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルケニル，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂ヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₆ - C₁₈アリール，および任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₈ヘテロアリールからなる群より選択され；

- R⁹はCOOHであり；

- R¹⁰は，H，ハロゲン，OH，NO₂，CN，NH₂，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂アルキル，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルケニル，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルキニル，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₀ヘテロアルキル，任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルケニル，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂ヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₆ - C₁₈アリール，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₈ヘテロアリール，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂アルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルキニルオキシ，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₀ヘテロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂ヘテロシクロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよいC₆ - C₁₈アリールオキシ，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₈ヘテロアリールオキシ，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂アルキルアミノ，SR¹¹，SO₃H，SO₂NR¹¹R¹²，SO₂R¹¹，SONR¹¹R¹²，SOR¹¹，COR¹¹，COOH，COOR¹¹，CONR¹¹R¹²，NR¹¹COR¹²，NR¹¹COOR¹²，NR¹¹SO₂R¹²，NR¹¹CONR¹²R¹³，NR¹¹R¹²，およびアシルからなる群より選択され；

- 各R¹¹，R¹²およびR¹³は，独立して，H，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂アルキル，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルケニル，任意に置換されていてもよいC₂ - C₁₂アルキニル，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₀ヘテロアルキル，任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₃ - C₁₂シクロアルケニル，任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₂ヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいC₆ - C₁₈アリール，および任意に置換されていてもよいC₁ - C₁₈ヘテロアリールからなる群より選択され；および

- mは，0，1，2，3，および4からなる群より選択される整数である]の化合物またはその薬学的に許容しうる塩またはプロドラッグを提供する。

【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0030

【補正方法】削除

【補正の内容】

【手続補正6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0031

【補正方法】削除

【補正の内容】

【手続補正7】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0034

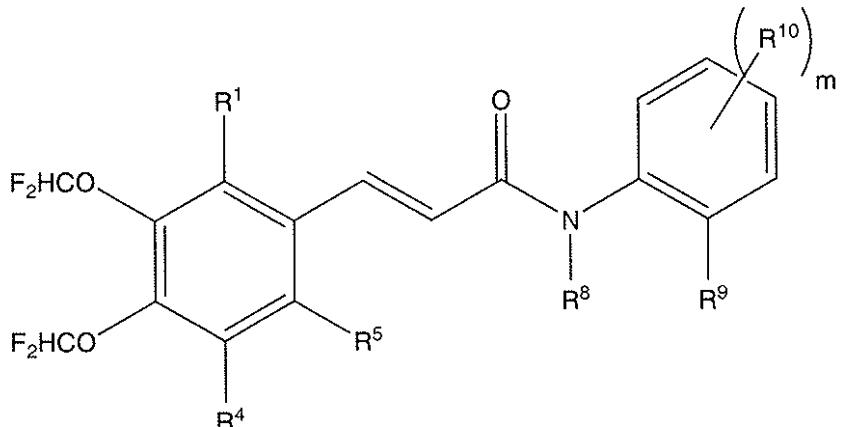
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0034】

別の観点においては、本発明は、式(IV)：

【化4】



[式中、

R¹, R⁴, および R⁵は、それぞれ独立して、H, ハロゲン, OH, NO₂, CN, NH₂, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキル, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニル, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニル, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキル, 任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキル, 任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルケニル, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂ヘテロシクロアルキル, 任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリール, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアリール, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂ヘテロシクロアルキルオキシ, 任意に置換されていてもよいC₆-C₁₈アリールオキシ, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₈ヘテロアリールオキシ, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキルアミノ, SR¹¹, SO₃H, SO₂NR¹¹R¹², SO₂R¹¹, SONR¹¹R¹², SOR¹, COR¹¹, COOH, COOR¹¹, CONR¹¹R¹², NR¹¹COR¹², NR¹¹COO R¹², NR¹¹SO₂R¹², NR¹¹CONR¹²R¹³, NR¹¹R¹², およびアシリルからなる群より選択され; R¹, R², R³, R⁴, および R⁵の少なくとも1つはハロゲン原子を含み;

R⁸は、H, N-保護基, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₂アルキル, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルケニル, 任意に置換されていてもよいC₂-C₁₂アルキニル, 任意に置換されていてもよいC₁-C₁₀ヘテロアルキル, 任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルキル, 任意に置換されていてもよいC₃-C₁₂シクロアルケニル, 任

意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ ヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ ヘテロシクロアルケニル，任意に置換されていてもよい $C_6 - C_{18}$ アリール，および任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{18}$ ヘテロアリールからなる群より選択され；
 R^9 は COOH であり；

R^{10} は，H，ハロゲン，OH，NO₂，CN，NH₂，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ アルキル，任意に置換されていてもよい $C_2 - C_{12}$ アルケニル，任意に置換されていてもよい $C_2 - C_{12}$ アルキニル，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{10}$ ヘテロアルキル，任意に置換されていてもよい $C_3 - C_{12}$ シクロアルキル，任意に置換されていてもよい $C_3 - C_{12}$ シクロアルケニル，任意に置換されていてもよい $C_2 - C_{12}$ ヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよい $C_6 - C_{18}$ アリール，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{18}$ ヘテロアリール，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ アルキルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_2 - C_{12}$ アルキニルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{10}$ ヘテロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_3 - C_{12}$ シクロアルケニルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ ヘテロシクロアルキルオキシ，任意に置換されていてもよい $C_6 - C_{18}$ アリールオキシ，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{18}$ ヘテロアリールオキシ，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ アルキルアミノ，SR¹¹，SO₃H，SO₂NR¹¹R¹²，SO₂R¹¹，SONR¹¹R¹²，SOR¹¹，COR¹¹，COOH，COOR¹¹，CONR¹¹R¹²，NR¹¹COR¹²，NR¹¹COOR¹²，NR¹¹SO₂R¹²，NR¹¹COR¹²，NR¹¹R¹³，およびアシルからなる群より選択され；

各 R^{11} ， R^{12} および R^{13} は，独立して，H，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ アルキル，任意に置換されていてもよい $C_2 - C_{12}$ アルケニル，任意に置換されていてもよい $C_2 - C_{12}$ アルキニル，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{10}$ ヘテロアルキル，任意に置換されていてもよい $C_3 - C_{12}$ シクロアルキル，任意に置換されていてもよい $C_3 - C_{12}$ シクロアルケニル，任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{12}$ ヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよい $C_6 - C_{18}$ アリール，および任意に置換されていてもよい $C_1 - C_{18}$ ヘテロアリールからなる群より選択され；および

m は，0，1，2，3，および 4 からなる群より選択される整数である】

の化合物またはその薬学的に許容しうる塩またはプロドラッグを提供する。

【手続補正 8】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0102

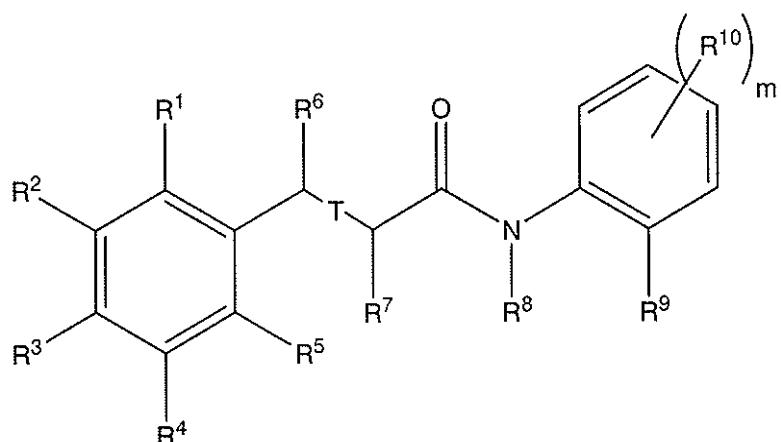
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0102】

本発明の化合物は，式(I)：

【化 8】



式 (I)

[式中 , T , R¹ , R² , R³ , R⁴ , R⁵ , R⁶ , R⁷ , R⁸ , R⁹ , R¹⁰ , R¹¹ , R¹² , R¹³ , m , および n は , 上で定義したとおりである]

の化合物である。基 R¹ , R² , R³ , R⁴ または R⁵ の少なくとも 1 つはハロゲン原子を含む。

【手続補正 9】

【補正対象書類名】明細書

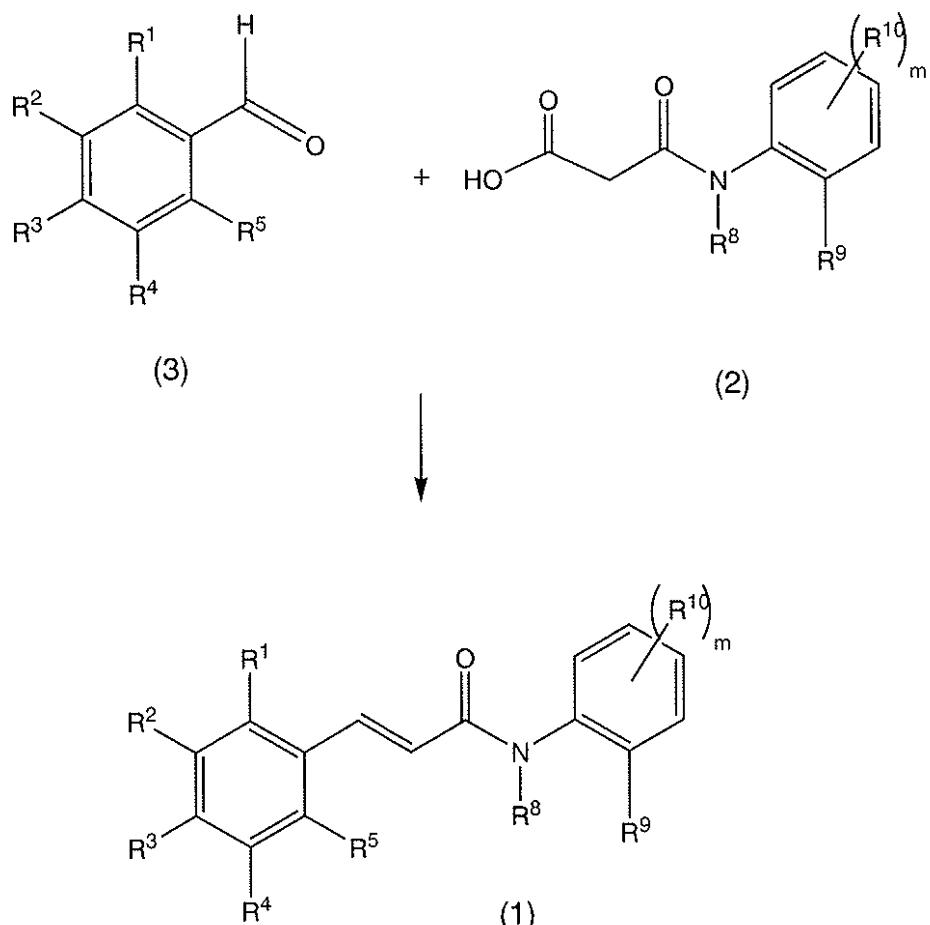
【補正対象項目名】0 1 0 9

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 0 9】

【化14】



スキーム1

【手続補正10】

【補正対象書類名】明細書

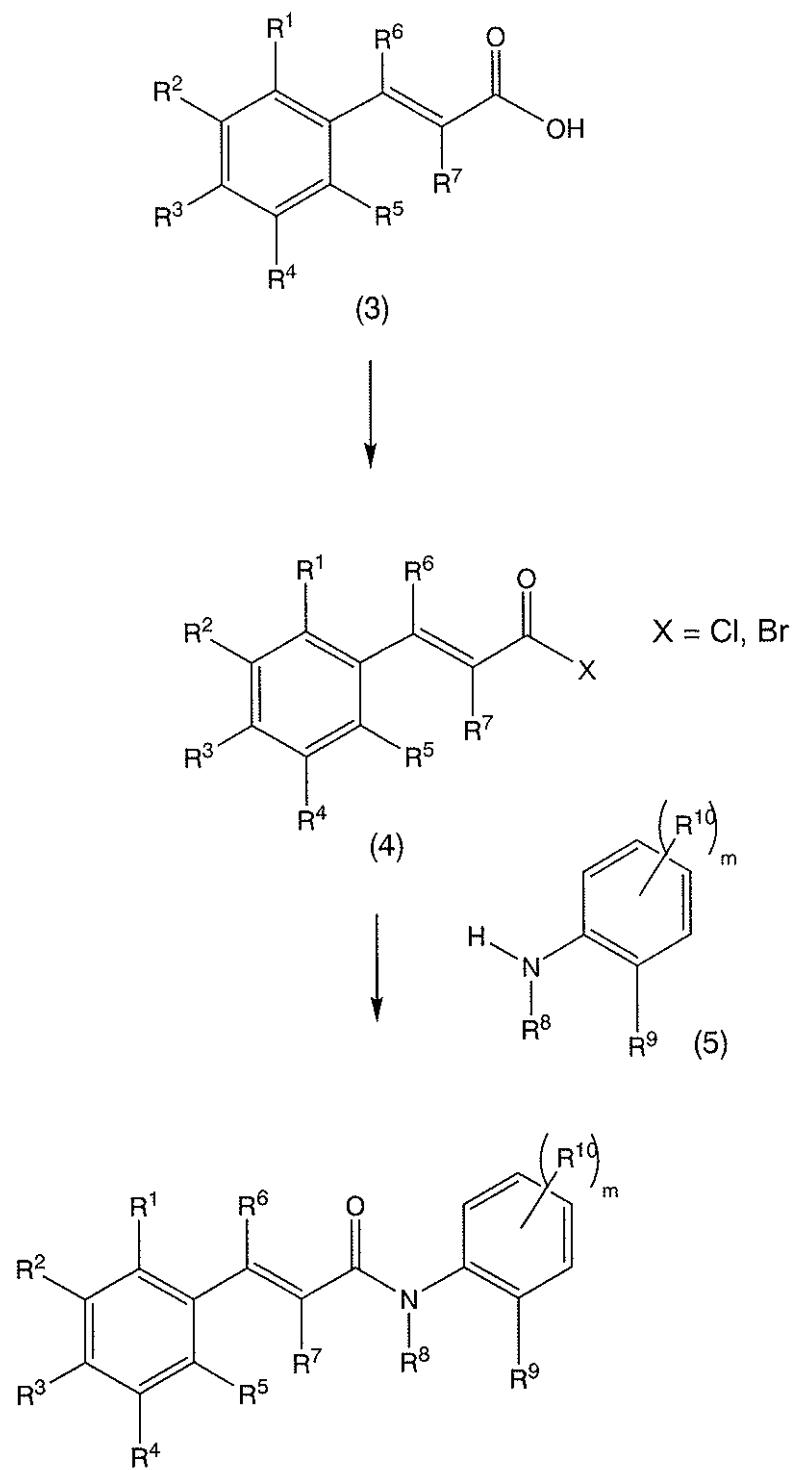
【補正対象項目名】0 1 1 3

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 1 3】

【化15】



スキーム2