

【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16年11月18日(2004.11.18)

【公表番号】特表2000-502330(P2000-502330A)

【公表日】平成12年2月29日(2000.2.29)

【出願番号】特願平9-521405

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 241/04

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00

A 6 1 K 31/4409

A 6 1 K 31/50

A 6 1 K 31/535

A 6 1 K 31/54

A 6 1 K 31/541

C 0 7 D 213/68

C 0 7 D 213/70

C 0 7 D 265/30

C 0 7 D 279/12

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 417/12

C 0 7 F 7/18

【F I】

C 0 7 D 241/04

A 6 1 K 31/00 6 2 9

A 6 1 K 31/00 6 3 5

A 6 1 K 31/00 6 4 3 D

A 6 1 K 31/44 6 0 3

A 6 1 K 31/50

A 6 1 K 31/535

A 6 1 K 31/54

A 6 1 K 31/54 6 0 1

C 0 7 D 213/68

C 0 7 D 213/70

C 0 7 D 265/30

C 0 7 D 279/12

C 0 7 D 401/12 2 4 1

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 417/12 2 1 3

C 0 7 D 417/12 3 0 7

C 0 7 F 7/18 Q

【手続補正書】

【提出日】平成16年4月16日(2004.4.16)

【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16年 4月16日

適

特許庁長官 殿

## 1. 事件の表示

平成9年 特許願 第521405号

## 2. 補正をする者

名 称 アグロン・ファーマシュティカルズ・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

明 細 書

請求の範囲

## 5. 補正対象項目名

明 細 書

請求の範囲

## 6. 補正の内容

別紙の通り



(別紙)

I. 本願明細書中、下記の(1) - (8)を補正する。

(1) 第15頁下5行の「R<sub>1</sub>」を「R<sub>a</sub>」と補正する。

(2) 第15頁下4行の「R<sub>1</sub>」を「R<sub>a</sub>」と補正する。

(3) 第78頁第5行-第6行の「計算値：C, 53.70; H, 6.44; N, 6.71; S, 5.12」を、「計算値：C, 53.70; H, 6.44; C 1, 5.66; N, 6.71; O, 17.88; S, 5.12; Si, 4.48」と補正する。

(4) 第78頁第23行の「実測値：C, 5.54」を「実測値：C, 5.54」と補正する。

(5) 第84頁下4行の「元素分析：C<sub>17</sub>H<sub>17</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>Br」を「元素分析：C<sub>17</sub>H<sub>17</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>BrS<sub>2</sub>」と補正する。

(6) 第85頁第6行の「元素分析：C<sub>17</sub>H<sub>17</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>Br」を「元素分析：C<sub>17</sub>H<sub>17</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>FS<sub>2</sub>」と補正する。

(7) 第86頁第19行-第20行の「元素分析：C<sub>17</sub>H<sub>17</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>S<sub>2</sub>Fとして計算値：C, 47.66; H, 4.00; N, 6.54; S, 14.97」を「元素分析：C<sub>17</sub>H<sub>17</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>S<sub>2</sub>Fとして計算値：C, 47.66; H, 4.00; N, 6.54; S, 14.97; O, 22.4; F, 4.4」と補正する。

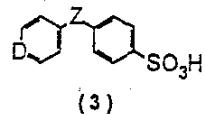
(8) 第88頁第11行-第12行の「計算値：C, 49.87; H, 3.94; N, 10.26; S, 7.83; 実測値：C, 49.84; H, 3.95; N, 10.18; S, 7.73」を、「計算値：C, 49.87; H, 3.94; F, 28.1.; N, 10.26; S, 7.83; 実測値：C, 49.84; H, 3.95; F, 28.3.; N, 10.18; S, 7.73」と補正する。

II. 特許請求の範囲を以下の通り補正する。

〔

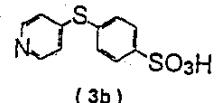
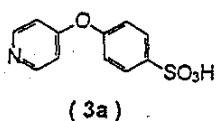
## 請求の範囲

## 1. 式3の化合物：



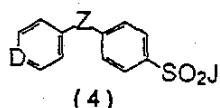
(式中、DはNまたはC-R<sub>16</sub>であり、ここでR<sub>16</sub>はヘテロアリール基であり、ZはOまたはSである) またはその塩もしくは溶媒和物。

## 2. 化合物が式3aもしくは3bの化合物：



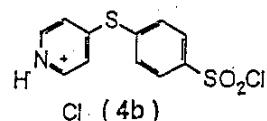
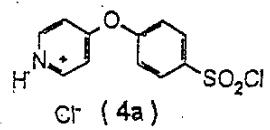
またはその塩もしくは溶媒和物である、請求項1記載の化合物。

## 3. 式4の化合物：



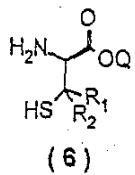
(式中、DはNまたはC-R<sub>16</sub>であり、ここでR<sub>16</sub>はアルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基またはヘテロアリール基であり、ZはOまたはSであり、Jはハロ基、1, 2-, 4-トリアゾリル、ベンゾトリアゾリルまたはイミダゾール-1-イルである) またはその塩もしくは溶媒和物。

## 4. 塩が式4aまたは4bの塩：



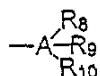
である、請求項3記載の塩。

## 5. 式6の化合物：

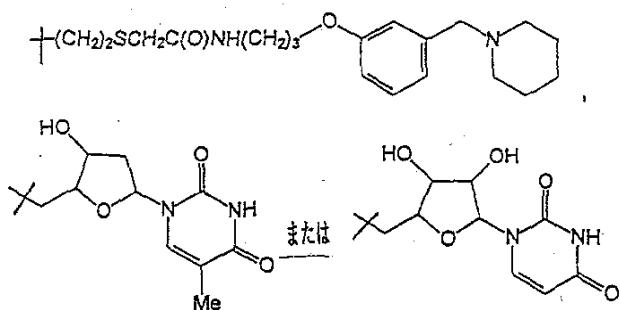


(式中、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>はそれぞれメチル基であり、

Qはシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、ヘテロシクロアルキル基、または次式の基：



であり、ここでAはCまたはS.iであり、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択される)またはその塩もしくは溶媒和物；  
ただし、式6の化合物、塩または溶媒和物はジエステルではなく、かつ  
Qはメチル、エチル、イソプロピル、n-ブチル、-CH<sub>2</sub>-フェニル、



ではない。

#### 6. AがCである場合、

R<sub>8</sub>はH、アルキル基、O-アルキル基、S-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、C≡NまたはC(O)R<sub>11</sub>であり、ここでR<sub>11</sub>はアルキル基、アリール基、シクロアルキル基、ヘテロアリール基、またはヘテロシクロアルキル基であり、

R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してH、アルキル基およびアリール基から選択され；

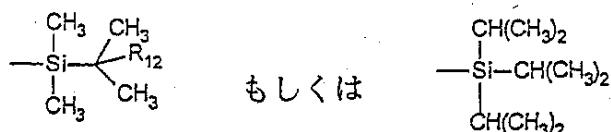
さらに、

AがS iである場合、

R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してアルキル基、シクロアルキル基およびアリール基から選択される。

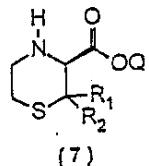
請求項5記載の化合物またはその塩もしくは溶媒和物。

7. QがC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>-CH=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>C≡N、または次式の基：



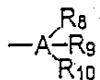
(式中、R<sub>12</sub>はCH<sub>3</sub>またはCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>である)である、請求項6記載の化合物またはその塩もしくは溶媒和物。

8. 式7の化合物：



(式中、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択されるか、またはR<sub>1</sub>とR<sub>2</sub>は一緒にシクロアルキル基もしくはヘテロシクロアルキル基を形成し、

Qはシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、ヘテロシクロアルキル基、または次式の基：



であり、ここでAはCまたはS iであり、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択される)

またはその塩もしくは溶媒和物。

9.  $R_1$  および  $R_2$  がそれぞれメチル基である、請求項 8 記載の化合物またはその塩もしくは溶媒和物。

### 10. AがCである場合、

$R_8$ はH、アルキル基、O-アルキル基、S-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、 $C \equiv N$ または $C(O)$ 、 $R_{11}$ であり、ここで $R_{11}$ はアルキル基、アリール基、シクロアルキル基、ヘテロアリール基、またはヘテロシクロアルキル基であり、

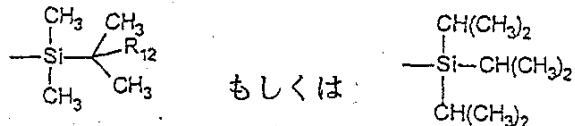
R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してH、アルキル基およびアリール基から選択され；さらに、

A が S<sub>i</sub> である場合、

$R_8$ 、 $R_9$ および $R_{10}$ は独立してアルキル基、シクロアルキル基およびアリール基から選択される、

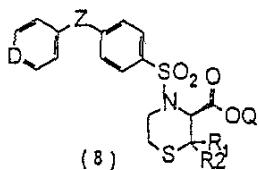
請求項9記載の化合物またはその塩もしくは溶媒和物。

11. Qが $\text{CH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 、 $\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{N}$ 、または次式の基：



(式中、R<sub>1,2</sub>はCH<sub>3</sub>またはCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>である)である、請求項10記載の化合物またはその塩もしくは溶媒和物。

## 12. 式8の化合物：



(式中、

DはNであり、

ZはOまたはSであり、

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択されるか、またはR<sub>1</sub>とR<sub>2</sub>は一緒にシクロアルキル基もしくはヘテロシクロアルキル基を形成し、

さらに、Qはシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、ヘテロシクロアルキル基、または次式の基：



であり、ここでAはCまたはS<sub>i</sub>であり、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択される)

またはその塩もしくは溶媒和物。

13. R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>がそれぞれメチル基である、請求項12記載の化合物またはその塩もしくは溶媒和物。

14. AがCである場合、

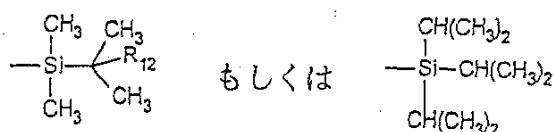
R<sub>8</sub>はH、アルキル基、O-アルキル基、S-アルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、C≡NまたはC(O)R<sub>11</sub>であり、ここでR<sub>11</sub>はアルキル基、アリール基、シクロアルキル基、ヘテロアリール基、またはヘテロシクロアルキル基であり、

R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してH、アルキル基およびアリール基から選択され；AがS<sub>i</sub>である場合、

R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してアルキル基、シクロアルキル基およびアリール基から選択される、

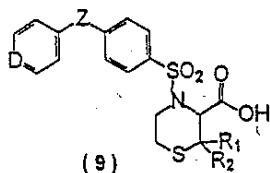
請求項13記載の化合物またはその塩もしくは溶媒和物。

15. QがCH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>-CH=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>C≡N、または次式の基：



(式中、 $R_{12}$ は $CH_3$ または $CH(CH_3)_2$ である)である、請求項14記載の化合物またはその塩もしくは溶媒和物。

16. 式9の化合物：



(式中、

$D$ はNであり、

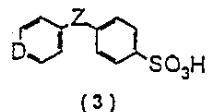
$Z$ はOまたはSであり、

$R_1$ および $R_2$ は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択されるか、または $R_1$ と $R_2$ は一緒にシクロアルキル基もしくはヘテロシクロアルキル基を形成する)

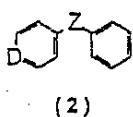
またはその塩もしくは溶媒和物。

17.  $R_1$ および $R_2$ がそれぞれメチル基である、請求項16記載の化合物またはその塩もしくは溶媒和物。

18. 式3の化合物：



(式中、 $D$ はNまたは $C-R_{16}$ であり、ここで $R_{16}$ はヘテロアリール基であり、 $Z$ はOまたはSである)またはその塩もしくは溶媒和物の製造方法であって、式2の化合物：



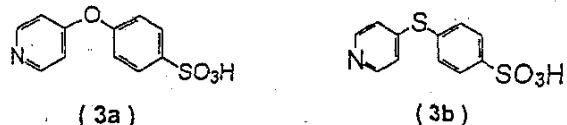
(式中、 $D$ および $Z$ は前記に定めたものである)またはその塩もしくは溶媒和物

を、式3の化合物またはその塩もしくは溶媒和物に、式3の化合物の形成に十分な条件下で変換する工程を含む方法。

### 19. 式2aもしくは2bの化合物：

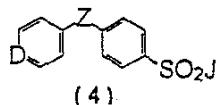


またはその塩もしくは溶媒和物を、式3aもしくは3bの化合物：

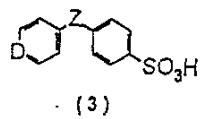


またはその塩もしくは溶媒和物に、式 3 a もしくは 3 b の化合物またはその塩もしくは溶媒和物の形成に十分な条件下で変換する工程を含む、請求項 1 8 記載の方法。

## 20. 式4の化合物：

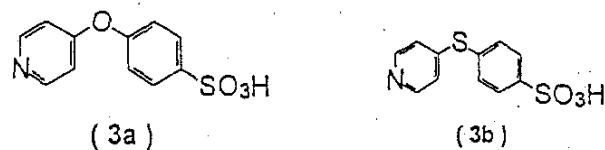


(式中、DはNまたはC—R<sub>16</sub>であり、ここでR<sub>16</sub>はアルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基またはヘテロアリール基であり、ZはOまたはSであり、Jはハロゲン、1, 2, 4-トリアゾリル、ベンゾトリアゾリルまたはイミダゾール-1-イルである)またはその塩もしくは溶媒和物の製造方法であって、式3の化合物：



(式中、D および Z は前記に定めたものである) またはその塩もしくは溶媒和物を、式 4 の化合物またはその塩もしくは溶媒和物に、式 4 の化合物またはその塩もしくは溶媒和物の形成に十分な条件下で変換する工程を含む方法。

### 21. 式3 a もしくは 3 b の化合物：

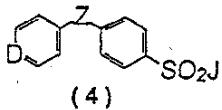


またはその塩もしくは溶媒和物を、式4aもしくは4bの塩：

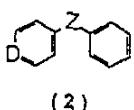


またはその溶媒和物に、式4aもしくは4bの化合物またはその塩もしくは溶媒和物の形成に十分な条件下で変換する工程を含む、請求項20記載の方法。

## 22. 式4の化合物：



(式中、DはNまたはC-R<sub>16</sub>であり、ここでR<sub>16</sub>はアルキル基、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、ZはOまたはSであり、Jはハロゲン、1, 2, 4-トリアゾリル、ベンゾトリアゾリルまたはイミダゾール-1-イルである)またはその塩もしくは溶媒和物の製造方法であって、式2の化合物；

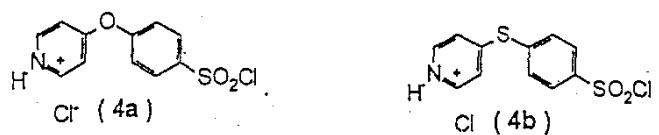


(式中、D および Z は前記に定めたものである) またはその塩もしくは溶媒和物を、式 4 の化合物またはその塩もしくは溶媒和物に、式 4 の化合物またはその塩もしくは溶媒和物の形成に十分な条件下で変換する工程を含む方法。

### 23. 式2aもしくは2bの化合物：

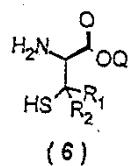


またはその塩もしくは溶媒和物を、式4aもしくは4bの塩：



またはその溶媒和物に、式4aもしくは4bの化合物またはその溶媒和物の形成に十分な条件下で変換する工程を含む、請求項22記載の方法。

24. 式6の化合物：

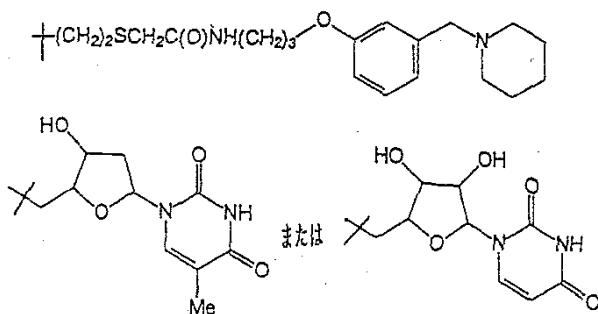


(式中、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>はそれぞれメチル基であり、

Qはシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、ヘテロシクロアルキル基、または次式の基：

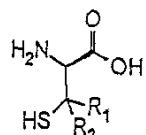


であり、ここでAはCまたはSであり、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択される) またはその塩もしくは溶媒和物であって；ただし、式6の化合物、塩または溶媒和物がジエステルではなく、かつQがメチル、エチル、イソプロピル、n-ブチル、-CH<sub>2</sub>-フェニル、



ではない化合物の製造方法であって、

式5の化合物：



(5)

(式中、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は前記に定めたものである) またはその塩もしくは溶媒和物を、式6の化合物またはその塩もしくは溶媒和物に、式6の化合物またはその塩もしくは溶媒和物の形成に十分な条件下で変換する工程を含む方法。

25. AがCである場合、

R<sub>8</sub>はH、アルキル基、O-アルキル基、S-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、C≡NまたはC(O)R<sub>11</sub>であり、ここでR<sub>11</sub>はアルキル基、アリール基、シクロアルキル基、ヘテロアリール基、またはヘテロシクロアルキル基であり、

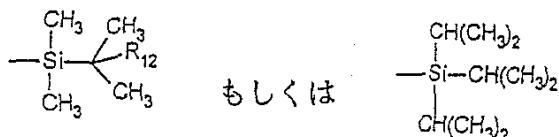
R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してH、アルキル基およびアリール基から選択され、ただしR<sub>9</sub>とR<sub>10</sub>が両方ともメチル基であることはなく；  
さらに、

AがS<sub>i</sub>である場合、

R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してアルキル基、シクロアルキル基およびアリール基から選択される、

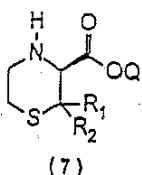
請求項24記載の方法。

26. QがC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>-CH=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>C≡N、または次式の基：



(式中、R<sub>12</sub>はCH<sub>3</sub>またはCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>である) またはその塩もしくは溶媒和物である、請求項25記載の方法。

## 27. 式7の化合物：



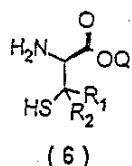
(式中、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択されるか、またはR<sub>1</sub>とR<sub>2</sub>は一緒にシクロアルキル基もしくはヘテロシクロアルキル基を形成し、

Qはシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、ヘテロシクロアルキル基、または次式の基：



であり、ここでAはCまたはSであり、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択される) またはその塩もしくは溶媒和物の製造方法であって、

## 式6の化合物：



(式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>およびQは前記に定めたものである) またはその塩もしくは溶媒和物を、式7の化合物またはその塩もしくは溶媒和物に、式7の化合物またはその塩もしくは溶媒和物の形成に十分な条件下で変換する工程を含む方法。

28. R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>がそれぞれメチル基である、請求項27記載の方法。

29. AがCである場合、

R<sub>8</sub>はH、アルキル基、O-アルキル基、S-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、C≡NまたはC(O)

$R_{11}$ であり、ここで $R_{11}$ はアルキル基、アリール基、シクロアルキル基、ヘテロアリール基、またはヘテロシクロアルキル基であり、

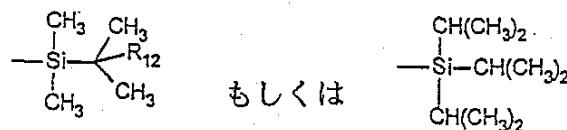
$R_9$ および $R_{10}$ は独立してH、アルキル基およびアリール基から選択され；さらに、

AがS iである場合、

$R_8$ 、 $R_9$ および $R_{10}$ は独立してアルキル基、シクロアルキル基およびアリール基から選択される、

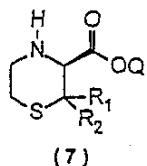
請求項28記載の方法。

30. Qが $CH_3$ 、 $CH_2CH_3$ 、 $CH(CH_3)_2$ 、 $C(CH_3)_3$ 、 $CH_2-CH=CH_2$ 、 $CH_2C\equiv N$ 、または次式の基：



(式中、 $R_{12}$ は $CH_3$ または $CH(CH_3)_2$ である)である、請求項29記載の方法。

31. 式7の化合物：



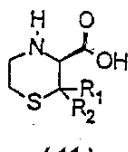
(式中、 $R_1$ および $R_2$ は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択されるか、または $R_1$ と $R_2$ は一緒にシクロアルキル基もしくはヘテロシクロアルキル基を形成し、

Qはシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、ヘテロシクロアルキル基、または次式の基：



であり、ここでAはCまたはS iであり、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択される) またはその塩もしくは溶媒和物の製造方法であって、

式11の化合物：



(11)

(式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>およびQは前記に定めたものである) またはその塩もしくは溶媒和物を、式7の化合物またはその塩もしくは溶媒和物に、式7の化合物またはその塩もしくは溶媒和物の形成に十分な条件下で変換する工程を含む方法。

3.2. R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>がそれぞれメチル基である、請求項3.1記載の方法。

3.3. AがCである場合、

R<sub>8</sub>はH、アルキル基、O-アルキル基、S-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、C≡NまたはC(O)R<sub>11</sub>であり、ここでR<sub>11</sub>はアルキル基、アリール基、シクロアルキル基、ヘテロアリール基、またはヘテロシクロアルキル基であり、

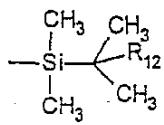
R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してH、アルキル基およびアリール基から選択され；さらに、

AがS iである場合、

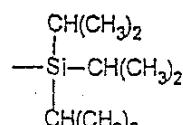
R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してアルキル基、シクロアルキル基およびアリール基から選択される、

請求項3.2記載の方法。

3.4. QがCH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>-CH=C<sub>H</sub><sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>C≡N、または次式の基：

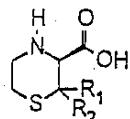


もしくは



(式中、R<sub>1,2</sub>はCH<sub>3</sub>またはCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>である)である、請求項33記載の方  
法。

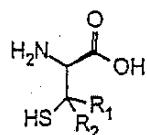
35. 式11の化合物：



(11)

(式中、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は独立してメチル基である)またはその塩もしくは溶媒和  
物の製造方法であって、

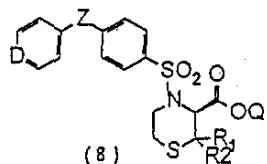
式5の化合物：



(5)

(式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>およびQは前記に定めたものである)またはその塩もしくは溶  
媒和物を、式11の化合物またはその塩もしくは溶媒和物に変換する工程を含む  
方法。

36. 式8の化合物：



(式中、

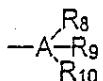
DはNまたはC—R<sub>16</sub>であり、ここでR<sub>16</sub>はアルキル基、シクロアルキル基、  
ヘテロシクロアルキル基、アリール基またはヘテロアリール基であり、

ZはOまたはSであり、

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択されるか、ま  
たはR<sub>1</sub>とR<sub>2</sub>は一緒にシクロアルキル基もしくはヘテロシクロアルキル基を形成

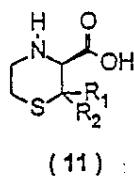
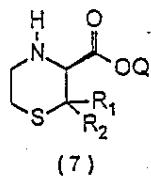
し、

さらに、Qはシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、ヘテロシクロアルキル基、または次式の基：

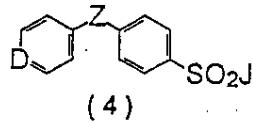


であり、ここでAはCまたはS iであり、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択される）またはその塩もしくは溶媒和物の製造方法であって、

式7または11の化合物：



（これらの式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>およびQは前記に定めたものである）またはその塩もしくは溶媒和物を、式4の化合物：



（式中、DおよびZは前記に定めたものであり、Jはハロゲン、1, 2, 4-トリアゾリル、ベンゾトリアゾリルまたはイミダゾール-1-イルである）またはその塩もしくは溶媒和物と、式8の化合物またはその塩もしくは溶媒和物の形成に十分な条件下で反応させる工程を含む方法。

37. R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>がそれぞれメチル基である、請求項36記載の方法。

38. AがCである場合、

R<sub>8</sub>はH、アルキル基、O-アルキル基、S-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、C≡NまたはC(O)R<sub>11</sub>であり、ここでR<sub>11</sub>はアルキル基、アリール基、シクロアルキル基、ヘテロ

アリール基、またはヘテロシクロアルキル基であり、

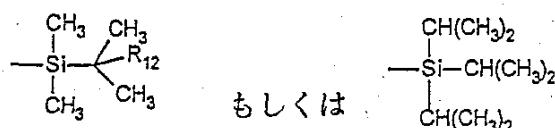
$R_9$  および  $R_{10}$  は独立して H、アルキル基およびアリール基から選択され；

AがS iである場合、

$R_8$ 、 $R_9$ および $R_{10}$ は独立してアルキル基、シクロアルキル基およびアリール基から選択される、

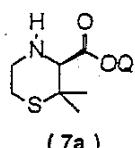
### 請求項 3 7 記載の方法。

39. Qが $\text{CH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 、 $\text{CH}_2-\text{CH}=\text{C}$   
 $\text{H}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{N}$ 、または次式の基：

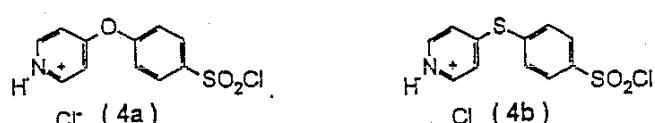


(式中、R<sub>12</sub>はCH<sub>3</sub>またはCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>である)である、請求項38記載の方  
法。

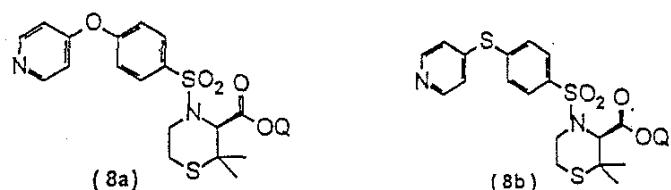
#### 40. 式7aの化合物:



またはその塩もしくは溶媒和物を、式4 a もしくは4 b の塩：



またはその溶媒和物と、式8aもしくは8bの化合物：



またはその塩もしくは溶媒和物の形成に十分な条件下で反応させる工程を含む、  
請求項 3 6 記載の方法。

#### 41. AがCである場合、

$R_8$ はH、アルキル基、O-アルキル基、S-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、 $C \equiv N$ または $C(O)$ である、ここで $R_{11}$ はアルキル基、アリール基、シクロアルキル基、ヘテロアリール基、またはヘテロシクロアルキル基であり、

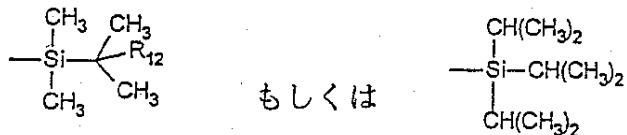
R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は独立してH、アルキル基およびアリール基から選択され；さらに、

AがS i である場合、

$R_8$ 、 $R_9$ および $R_{10}$ は独立してアルキル基、シクロアルキル基およびアリール基から選択される。

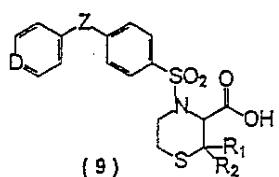
#### 請求項 4 0 記載の方法。

42. Qが $\text{CH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 、 $\text{CH}_2 - \text{CH} = \text{C}$   
 $\text{H}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{C} \equiv \text{N}$ 、または次式の基：



(式中、R<sub>1,2</sub>はCH<sub>3</sub>またはCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>である)である、請求項4 1記載の方  
法。

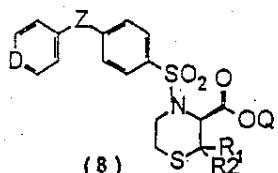
### 4.3. 式9の化合物：



(式中、DはNであり、ZはOまたはSであり、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択されるか、またはR<sub>1</sub>とR<sub>2</sub>は一緒にシクロアル

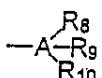
キル基もしくはヘテロシクロアルキル基を形成する) またはその塩もしくは溶媒和物の製造方法であって、

式8の化合物：



(式中、D、Z、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は前記に定めたものであり、

さらに、Qはシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、ヘテロシクロアルキル基、または次式の基：



であり、ここでAはCまたはS iであり、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択される) またはその塩もしくは溶媒和物を、式9の化合物またはその塩もしくは溶媒和物に、式9の化合物またはその塩もしくは溶媒和物の形成に十分な条件下で変換する工程を含む方法。

44. R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>がそれぞれメチル基である、請求項43記載の方法。

45. AがCである場合、

R<sub>8</sub>はH、アルキル基、O-アルキル基、S-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、C≡NまたはC(O)R<sub>11</sub>であり、ここでR<sub>11</sub>はアルキル基、アリール基、シクロアルキル基、ヘテロアリール基、またはヘテロシクロアルキル基であり、

R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してH、アルキル基およびアリール基から選択され；

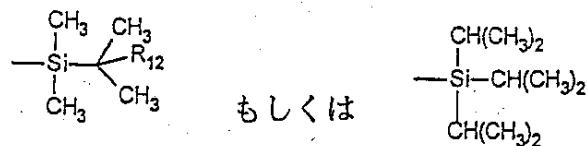
さらに、

AがS iである場合、

R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してアルキル基、シクロアルキル基およびアリール基から選択される、

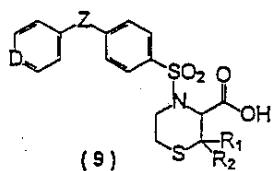
請求項4 4記載の方法。

4 6. QがCH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>—CH=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>C≡N、または次式の基：



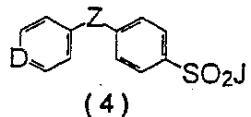
(式中、R<sub>12</sub>はCH<sub>3</sub>またはCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>である)である、請求項4 5記載の方法。

4 7. 式9の化合物：



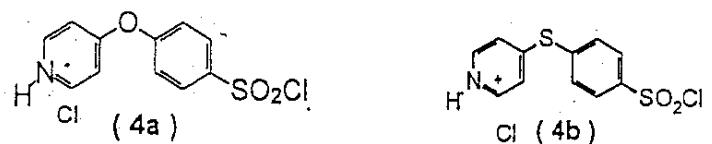
(式中、DはNであり、ZはOまたはSであり、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択されるか、またはR<sub>1</sub>とR<sub>2</sub>は一緒にシクロアルキル基もしくはヘテロシクロアルキル基を形成する)またはその塩もしくは溶媒和物の製造方法であって、

式4の化合物：



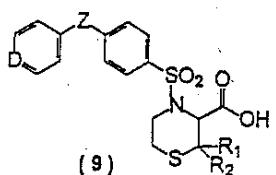
(式中、DおよびZは前記に定めたものであり、Jはハロゲン、1, 2, 4-トリアゾリル、ベンゾトリアゾリルまたはイミダゾール-1-イルである)またはその塩もしくは溶媒和物を、式9の化合物またはその塩もしくは溶媒和物に、式9の化合物またはその塩もしくは溶媒和物の形成に十分な条件下で変換する工程を含む方法。

4 8. 式4の塩が式4 aまたは4 bの塩：



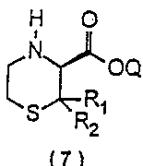
である、請求項47記載の方法。

#### 4.9. 式9の化合物：



(式中、DはNまたはC-R<sub>16</sub>であり、ここでR<sub>16</sub>はアルキル基、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、ZはOまたはSであり、さらに、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択されるか、またはR<sub>1</sub>とR<sub>2</sub>は一緒にシクロアルキル基もしくはヘテロシクロアルキル基を形成する)またはその塩もしくは溶媒和物の製造方法であって、

### 式 7 の化合物：



(式中、 $R_1$  および  $R_2$  は前記に定めたものであり、

Qはシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、ヘテロシクロアルキル基、または次式の基：



であり、ここでAはCまたはS<sub>i</sub>であり、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択される) またはその塩もしくは溶媒和物を、式9の化合物またはその塩もしくは溶媒和物に、式9の化合物の形成に十分な条件

下で変換する工程を含む方法。

50.  $R_1$  および  $R_2$  がそれぞれメチル基である、請求項 49 記載の方法。

51. D が N である、請求項 50 記載の方法。

52. A が C である場合、

$R_8$  は H、アルキル基、O-アルキル基、S-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、 $C \equiv N$  または  $C(O)$   $R_{11}$  であり、ここで  $R_{11}$  はアルキル基、アリール基、シクロアルキル基、ヘテロアリール基、またはヘテロシクロアルキル基であり、

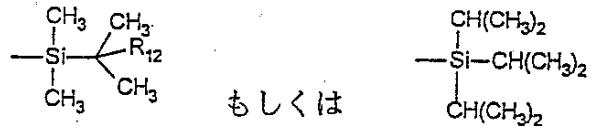
$R_9$  および  $R_{10}$  は独立して H、アルキル基およびアリール基から選択され；さらに、

A が S i である場合、

$R_8$ 、 $R_9$  および  $R_{10}$  は独立してアルキル基、シクロアルキル基およびアリール基から選択される、

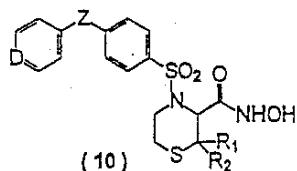
請求項 51 記載の方法。

53. Q が  $CH_3$ 、 $CH_2CH_3$ 、 $CH(CH_3)_2$ 、 $C(CH_3)_3$ 、 $CH_2-CH=CH_2$ 、 $CH_2C \equiv N$ 、または次式の基：



(式中、 $R_{12}$  は  $CH_3$  または  $CH(CH_3)_2$  である) である、請求項 52 記載の方法。

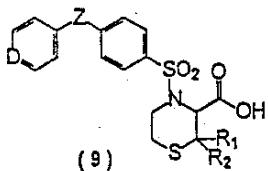
54. 式 10 の化合物：



(式中、D は N であり、Z は O または S であり、 $R_1$  および  $R_2$  は独立して H より

び任意の適する有機部分から選択されるか、またはR<sub>1</sub>とR<sub>2</sub>は一緒にシクロアルキル基もしくはヘテロシクロアルキル基を形成する) またはその塩もしくは溶媒和物の製造方法であって、

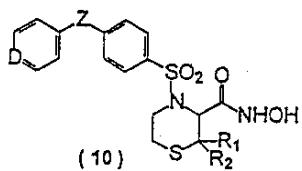
式9の化合物：



(式中、D、Z、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は前記に定めたものである) またはその塩もしくは溶媒和物を、式10の化合物またはその塩もしくは溶媒和物に、式10の化合物またはその塩もしくは溶媒和物の形成に十分な条件下で変換する工程を含む方法。

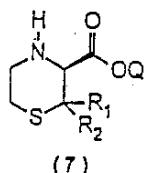
55. R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>がそれぞれメチル基である、請求項54記載の方法。

56. 式10の化合物：



(式中、DはNまたはC-R<sub>16</sub>であり、ここでR<sub>16</sub>はアルキル基、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、さらに、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択されるか、またはR<sub>1</sub>とR<sub>2</sub>は一緒にシクロアルキル基もしくはヘテロシクロアルキル基を形成する) またはその塩もしくは溶媒和物の製造方法であって、

式7の化合物：



(式中、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は前記に定めたものであり、

Qはシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、ヘテロシクロアルキル基、または次式の基：



であり、ここでAはCまたはS<sub>1</sub>であり、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択される)またはその塩もしくは溶媒和物を、式10の化合物またはその塩もしくは溶媒和物に、式10の化合物またはその塩もしくは溶媒和物の形成に十分な条件下で変換する工程を含む方法。

57.  $R_1$  および  $R_2$  がそれぞれメチル基である、請求項 56 記載の方法。

#### 58. DがNである、請求項57記載の方法。

### 59. AがCである場合、

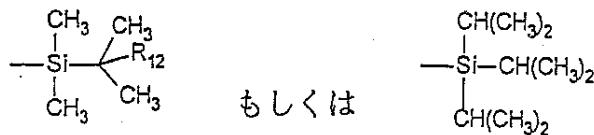
$R_8$ はH、アルキル基、O-アルキル基、S-アルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、 $C \equiv N$ または $C(O)$ 、 $R_{11}$ であり、ここで $R_{11}$ はアルキル基、アリール基、シクロアルキル基、ヘテロアリール基、またはヘテロシクロアルキル基であり、

$R_9$  および  $R_{10}$  は独立して H、アルキル基およびアリール基から選択され；  
 A が S<sub>i</sub> である場合、

$R_8$ 、 $R_9$ および $R_{10}$ は独立してアルキル基、シクロアルキル基およびアリール基から選択される。

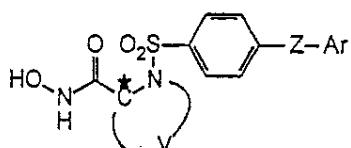
### 請求項 5 8 記載の方法。

60. Qが $\text{CH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 、 $\text{CH}_2 - \text{CH} = \text{C}$   
 $\text{H}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{C} \equiv \text{N}$ 、または次式の基：



(式中、R<sub>1,2</sub>はCH<sub>3</sub>またはCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>である)である、請求項59記載の方法。

## 6.1. 式1の化合物：



(式中、

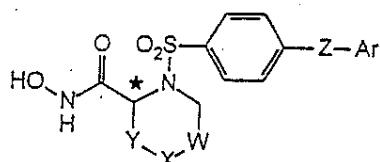
ZはOまたはSであり；

VはC\*およびNと一緒に6個の環原子を有する環を形成する二価の基であり、ここでC\*およびN以外の環原子はそれぞれ独立して、置換されていないか、または適する置換基で置換されており、これら他の環原子のうち少なくとも1個はO、NおよびSから選択される異種原子であり、残りは炭素原子であり；

(Arはアリールまたはヘテロアリール基である)

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。

## 6.2. 化合物が式1-a：



(式中、

W、XおよびYはそれぞれ互いに独立して、CR<sub>1</sub>R<sub>2</sub>、C=O、S、S=O、SO<sub>2</sub>、O、N-R<sub>3</sub>、またはN<sup>+(O)-</sup>R<sub>4</sub>であり、これらにおいて

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は独立してHおよび適する有機部分から選択されるか、またはR<sub>1</sub>とR<sub>2</sub>は一緒にシクロアルキル基もしくはヘテロシクロアルキル基を形成し、

R<sub>3</sub>は水素または適する有機部分であり、

$R_4$ はアルキル基であり、

ただし、W、XおよびYのうち全部ではなく少なくとも1つは $CR_1R_2$ および $C=O$ から選択される)

を有する、請求項6 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。

6 3.  $R_1$ および $R_2$ が独立して、H、アルキル基、シクロアルキル基、ヘテロジクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、 $OR_5$ 、 $SR_5$ 、 $NR_5R_6$ および $C(O)R_7$ から選択され、これらにおいて

$R_5$ はアルキル基、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 $C(O)NR_{13}R_{14}$ であり、

ここで $R_{13}$ および $R_{14}$ は独立してH、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、およびヘテロアリール基から選択されるか、または $R_{13}$ と $R_{14}$ はそれらが結合している窒素原子と一緒にヘテロシクロアルキル基を形成し、

$R_6$ はH、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、 $C(O)O-R_{15}$ 、 $C(O)S-R_{15}$ 、または $SO_2-R_{15}$ であり、

ここで $R_{15}$ はアルキル基、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、

$R_7$ は $OH$ 、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、 $O$ -アルキル基、 $NR_{13}R_{14}$ 、または $O-R_{15}$ であり、これらにおいて $R_{13}$ 、 $R_{14}$ および $R_{15}$ は独立して、前記に定めたものであり、

あるいは $R_1$ と $R_2$ が一緒にシクロアルキル基またはヘテロシクロアルキル基を形成した、

請求項6 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。

6 4.  $R_3$ が水素、アルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、

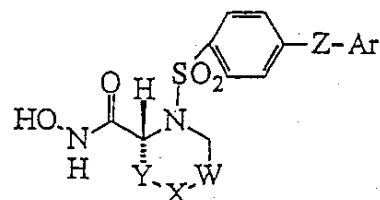
アリール基、ヘテロアリール基、 $C(O)-NR_{13}R_{14}$ 、 $C(O)-OR_{15}$ 、 $C(O)-SR_{15}$ 、 $SO_2-R_{15}$ 、または $C(O)-R_{13}$ であり、

これらにおいて $R_{13}$ および $R_{14}$ は独立してH、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、およびヘテロアリール基から選択されるか、または $R_{13}$ と $R_{14}$ はそれらが結合している窒素原子と一緒にヘテロシクロアルキル基を形成し、

$R_{15}$ はアルキル基、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る、

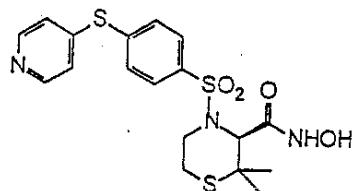
請求項6 2記載の化合物またはその薬剤学的に許容しうるプロドラッグ、塩もしくは溶媒和物。

#### 6 5. 化合物が式：



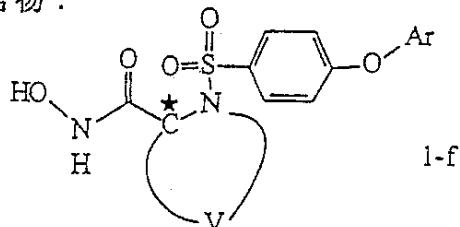
を有する、請求項6 2記載の化合物またはその薬剤学的に許容しうるプロドラッグ、塩もしくは溶媒和物。

#### 6 6. 化合物が式：



を有する、請求項6 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。

#### 6 7. 式1-fの化合物：



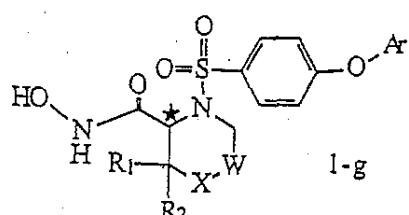
(式中、

VはC\*およびNと一緒に6個の環原子を有する環を形成する二価の基であり、ここでC\*およびN以外の環原子はそれぞれ独立して、置換されていないか、または適する置換基で置換されており、これら他の環原子のうち少なくとも1個はO、NおよびSから選択される異種原子であり、残りは炭素原子であり；

Arは単環式アリール基または単環式ヘテロアリール基である)

またはその薬剤学的に許容しうるプロドラッグもしくは薬剤学的に許容しうる塩。

#### 6.8. 式1-g：



(式中、

WおよびXは独立して、CH<sub>2</sub>、C=O、S、S=O、O、N-R<sub>3</sub>、およびN'(O)-R<sub>4</sub>から選択され、

これらにおいてR<sub>3</sub>は水素原子または適する置換基であり、

R<sub>4</sub>はC<sub>1</sub>～C<sub>7</sub>アルキル基であり、ここでアルキル基は不飽和を含まない炭素原子および水素原子の直鎖または分枝鎖の一価の基であり、これは所望により1個またはそれ以上の適する置換基で置換されていてもよく、ただしWがCH<sub>2</sub>またはC=Oである場合はXはCH<sub>2</sub>またはC=Oでなく；

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は独立して水素原子、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub>アルキル基、-C(O)OR<sub>17</sub>基もしくは-C(O)NR<sub>17</sub>R<sub>18</sub>基から選択され、

これらにおいてR<sub>17</sub>は水素またはアルキル基であり、R<sub>18</sub>はアルキル基であり、ここでアルキル基はそれぞれ、不飽和を含まない炭素原子および水素原子の直鎖もしくは分枝鎖の一価の基であり、これは所望により1個もしくはそれ以上の適する置換基で置換されていてもよく、

またはR<sub>1</sub>とR<sub>2</sub>は一緒に単環式シクロアルキル基もしくは単環式ヘテロシクロアルキル基を形成する)、

を有する、請求項6 7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もしくはその薬剤学的に許容しうる塩。

6 9. WがCH<sub>2</sub>であり、かつXがS、S=O、O、N-R<sub>3</sub>またはN'(O)-R<sub>4</sub>である、請求項6 8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もしくはその薬剤学的に許容しうる塩。

7 0. R<sub>3</sub>が水素原子、アルキル基(ここでアルキル基は不飽和を含まない炭素原子および水素原子の直鎖または分枝鎖の一価の基であり、これは所望により1個もしくはそれ以上の適する置換基で置換されていてもよい)、C(O)-R<sub>17</sub>基、C(O)O-R<sub>17</sub>基、C(O)NH-R<sub>17</sub>基、C(O)NR<sub>17</sub>R<sub>18</sub>基、SO<sub>2</sub>-R<sub>19</sub>基(これらにおいてR<sub>17</sub>およびR<sub>18</sub>はそれぞれ独立してアルキル基であり、ここでアルキル基は不飽和を含まない炭素原子および水素原子の直鎖または分枝鎖の一価の基であり、これは所望により1個もしくはそれ以上の適する置換基で置換されていてもよく、R<sub>19</sub>は前記に定めた単環式アリール基またはアルキル基である)である、請求項6 9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もしくは薬剤学的に許容しうる塩。

7 1. WがS、OまたはN-R<sub>3</sub>であり、かつXがCH<sub>2</sub>である、請求項6 8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もしくは薬剤学的に許容しうる塩。

7 2. WがN-R<sub>3</sub>であり、かつXがC=Oである、請求項6 8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もしくは薬剤学的に許容しうる塩。

7 3. WがC=Oであり、かつXがS、OまたはN-R<sub>3</sub>である、請求項6 8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もしくは薬剤学的に許容しうる塩。

7 4. Arが、置換されていないか、またはパラ位において適する置換基で置換された単環式アリール基である、請求項6 8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もしくは薬剤学的に許容しうる塩。

75. アリール基のパラ位における適する置換基が、ハロゲン原子、O-アルキル基（ここでアルキル基は不飽和を含まない炭素原子および水素原子の直鎖または分枝鎖の一価の基であり、これは所望により1個もしくはそれ以上の適する置換基で置換されていてもよい）、または単環式ヘテロアリール基である、請求項74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もしくは薬剤学的に許容しうる塩。

76. “\*”で表示した炭素原子は、XがCH<sub>2</sub>、C=O、O、N-R<sub>3</sub>またはN<sup>+</sup>(O<sup>-</sup>)-R<sub>4</sub>である場合はR-立体配置にあり、XがSまたはS=Oである場合はS-立体配置にある、請求項68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もしくは薬剤学的に許容しうる塩。

77. アリール基のパラ位における適する置換基が、フッ素、塩素、メトキシ基またはイミダゾリル基である、請求項75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もしくは薬剤学的に許容しうる塩。

78. (a) 療法上有効な量の、請求項61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、ベヒクルまたは賦形剤を含む薬剤組成物。

79. (a) 療法上有効な量の、請求項67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もしくは薬剤学的に許容しうる塩；および

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

80. 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方法であって、それを必要とする哺乳動物に療法上有効な量の、請求項61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を投与することを含む方法。

81. 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方法であって、それを必要とする哺乳動物に療法上有効な量の、請求項67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もしくは薬剤学的に

許容しうる塩を投与することを含む方法。

8.2. 哺乳動物の疾病状態が腫瘍の増殖、侵入もしくは転移、または関節炎である、請求項8.0記載の方法。

8.3. 哺乳動物の疾病状態が腫瘍の増殖、侵入もしくは転移、または関節炎である、請求項8.1記載の方法。

8.4. メタロプロテイナーゼ活性を阻害する方法であって、メタロプロテイナーゼを有効量の請求項6.1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もしくは薬剤学的に許容しうる塩と接触させることを含む方法。

8.5. メタロプロテイナーゼ活性を阻害する方法であって、メタロプロテイナーゼを有効量の請求項6.7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もしくは薬剤学的に許容しうる塩と接触させることを含む方法。

8.6. 2(R)-N-ヒドロキシ-1-(4-(4-クロロフェノキシ)ベンゼンスルホニル)-4-(メタンスルホニル)-ピペラジン-2-カルボキサミド；2(R)-N-ヒドロキシ-1-(4-(4-フルオロフェノキシ)ベンゼンスルホニル)-4-(メタンスルホニル)-ピペラジン-2-カルボキサミド；および3(S)-N-ヒドロキシ-4-(4-((ピリド-4-イル)オキシ)ベンゼンスルホニル)-2,2-ジメチル-テトラヒドロ-2H-1,4-チアジン-3-カルボキサミド；ならびにその薬剤学的に許容しうる塩および薬剤学的に許容しうるプロドラッグから選択される、請求項6.1記載の化合物。

8.7. 3(S)-N-ヒドロキシ-4-(4-((ピリド-4-イル)オキシ)ベンゼンスルホニル)-2,2-ジメチル-テトラヒドロ-2H-1,4-チアジン-3-カルボキサミド；またはその薬剤学的に許容しうる塩もしくは薬剤学的に許容しうるプロドラッグである、請求項8.6記載の化合物。

8.8. Vの4個の環原子のうち2個以下の原子がO、NおよびSから選択される、請求項6.7記載の化合物。

8.9. 化合物が

3(S)-N-ヒドロキシ-4-(4-(4-イミダゾール-1-イル)フェノキシ)ベンゼンスルホニル-2,2-ジメチル-テトラヒドロ-2H-チアジン

– 3 –カルボキサミド、

3(S)–N–ヒドロキシ–4–(4–(4–フルオロフェノキシ)ベンゼンスルホニル–2, 2–ジメチル–テトラヒドロ–2H–チアジン–3–カルボキサミド、

3(S)–N–ヒドロキシ–4–(4–(4–イミダゾール–2–イル)フェノキシ)ベンゼンスルホニル–2, 2–ジメチル–テトラヒドロ–2H–チアジン–3–カルボキサミド、

3(S)–N–ヒドロキシ–4–(4–(4–クロロフェノキシ)ベンゼンスルホニル–2, 2–ジメチル–テトラヒドロ–2H–チアジン–3–カルボキサミド、

2(R)–3, 3–ジメチル–N–ヒドロキシ–1–(4–(4–クロロフェノキシ)ベンゼンスルホニル)–ピペラジン–2–カルボキサミド、

2(R)–3, 3–ジメチル–N–ヒドロキシ–1–(4–(4–フルオロフェノキシ)ベンゼンスルホニル)–ピペラジン–2–カルボキサミド、

2(R)–3, 3–ジメチル–N–ヒドロキシ–1–(4–(4–プロモフェノキシ)ベンゼンスルホニル)–ピペラジン–2–カルボキサミド、

2(R)–1–(4–(4–クロロフェノキシ)ベンゼンスルホニル)–N–ヒドロキシ–3, 3, 4–トリメチルピペラジン–2–カルボキサミド、

2(R)–1–(4–(4–フルオロフェノキシ)ベンゼンスルホニル)–N–ヒドロキシ–3, 3, 4–トリメチルピペラジン–2–カルボキサミド、

3(S)–N–ヒドロキシ–4–(4–(4–クロロフェニルスルファニル)ベンゼンスルホニル–2, 2–ジメチル–テトラヒドロ–2H–チアジン–3–カルボキサミド、

3(S)–N–ヒドロキシ–4–(4–(4–フルオロフェニルスルファニル)ベンゼンスルホニル–2, 2–ジメチル–テトラヒドロ–2H–チアジン–3–カルボキサミド、

2(R)–3, 3–ジメチル–N–ヒドロキシ–1–(4–(4–フルオロフェニルスルファニル)ベンゼンスルホニル)–ピペラジン–2–カルボキサミド、

2(R)-3, 3-ジメチル-N-ヒドロキシ-1-(4-(4-クロロフェニルスルファニル)ベンゼンスルホニル)-ピペラジン-2-カルボキサミド、

2(R)-1-(4-(4-フルオロフェニルスルファニル)ベンゼンスルホニル)-N-ヒドロキシ-3, 3, 4-トリメチルピペラジン-2-カルボキサミド、

2(R)-1-(4-(4-クロロフェニルスルファニル)ベンゼンスルホニル)-N-ヒドロキシ-3, 3, 4-トリメチルピペラジン-2-カルボキサミド、

2(R), 3(S)-N-ヒドロキシ-4-(4-(ピリド-4-イル)オキシ)ベンゼンスルホニル)-2-メチル-テトラヒドロ-2H-チアジン-3-カルボキサミド、および

2(R), 3(S)-N-ヒドロキシ-4-(4-(ピリド-4-イル)スルファニル)ベンゼンスルホニル)-2-メチル-テトラヒドロ-2H-チアジン-3-カルボキサミド；

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から選択される、請求項6 1記載の化合物。