

【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 07 D 241/04

A 61 P 29/00

A 61 P 35/00

A 61 P 43/00

A 61 K 31/4409

A 61 K 31/50

A 61 K 31/535

A 61 K 31/54

A 61 K 31/541

C 07 D 213/68

C 07 D 213/70

C 07 D 265/30

C 07 D 279/12

C 07 D 401/12

C 07 D 403/12

C 07 D 417/12

C 07 F 7/18

【F I】

C 07 D 241/04

A 61 K 31/00 6 2 9

A 61 K 31/00 6 3 5

A 61 K 31/00 6 4 3 D

A 61 K 31/44 6 0 3

A 61 K 31/50

A 61 K 31/535

A 61 K 31/54

A 61 K 31/54 6 0 1

C 07 D 213/68

C 07 D 213/70

C 07 D 265/30

C 07 D 279/12

C 07 D 401/12 2 4 1

C 07 D 403/12

C 07 D 417/12 2 1 3

C 07 D 417/12 3 0 7

C 07 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



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・ファーマシューティカルズ・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

審査



(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_1 」を「 R_2 」と補正する。

(2) 第15頁下4行の「 R_1 」を「 R_2 」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, 55.4」と補正する。

(5) 第84頁下4行の「元素分析： $C_{17}H_{17}N_2O_2Br$ 」を「元素分析： $C_{17}H_{17}N_2O_2BrS_2$ 」と補正する。

(6) 第85頁第6行の「元素分析： $C_{17}H_{17}N_2O_2Br$ 」を「元素分析： $C_{17}H_{17}N_2O_2FS_2$ 」と補正する。

(7) 第86頁第19行-第20行の「元素分析： $C_{17}H_{17}N_2O_6S_2F$ として計算値：C, 47.66; H, 4.00; N, 6.54; S, 14.97」を「元素分析： $C_{17}H_{17}N_2O_6S_2F$ 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。

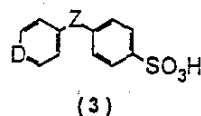
(8) 第88頁第11行-第12行の「計算値：C, 49.87; H, 3.94; N, 10.26; S, 7.83; 実測値：C, 49.84; H, 3.95; N, 10.18; S, 7.73」を、「計算値：C, 49.87; H, 3.94; F, 28.1.; N, 10.26; S, 7.83; 実測値：C, 49.84; H, 3.95; F, 28.3.; N, 10.18; S, 7.73」と補正する。

II. 特許請求の範囲を以下の通り補正する。

『

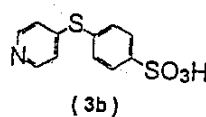
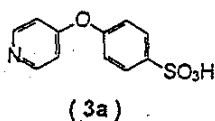
請 求 の 範 囲

1. 式 3 の 化 合 物 :



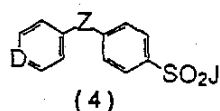
(式中、DはNまたはC-R₁₆であり、ここでR₁₆はヘテロアリール基であり、ZはOまたはSである) またはその塩もしくは溶媒和物。

2. 化合物が式 3 a もしくは 3 b の化合物 :



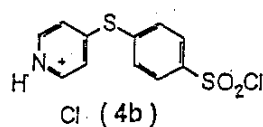
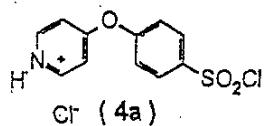
またはその塩もしくは溶媒和物である、請求項 1 記載の化合物。

3. 式 4 の 化 合 物 :



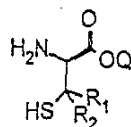
(式中、DはNまたはC-R₁₆であり、ここでR₁₆はアルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基またはヘテロアリール基であり、ZはOまたはSであり、Jはハロ基、1, 2, 4-トリアゾリル、ベンゾトリアゾリルまたはイミダゾール-1-イルである) またはその塩もしくは溶媒和物。

4. 塩が式 4 a または 4 b の塩 :



である、請求項 3 記載の塩。

5. 式 6 の 化 合 物 :



(6)

(式中、 R_1 および R_2 はそれぞれメチル基であり、

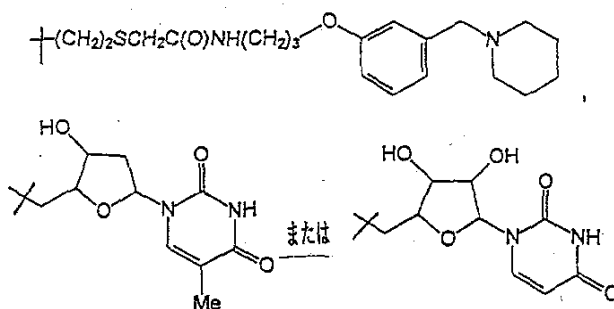
Q はシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、ヘテロシクロアルキル基、または次式の基：



であり、ここで A は C または Si であり、 R_8 、 R_9 および R_{10} 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、 $-CH_2-$ フェニル、



ではない。

6. 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；

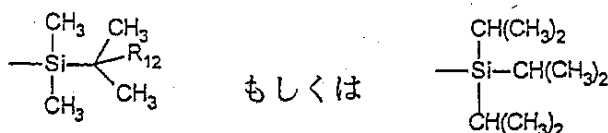
さらに、

AがSi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、

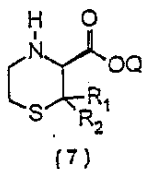
請求項5記載の化合物またはその塩もしくは溶媒和物。

7. Qが $C(CH_3)_3$ 、 $CH_2-CH=CH_2$ 、 $CH_2C\equiv N$ 、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_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Siであり、 R_8 、 R_9 および R_{10} 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、

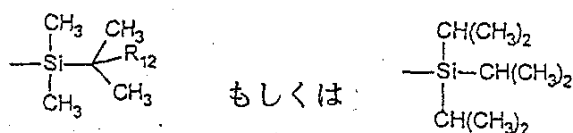
R_9 および R_{10} は独立して H、アルキル基およびアリール基から選択され、さらに、

A が Si 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、

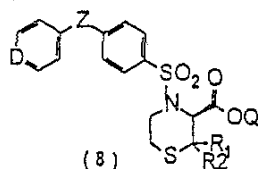
請求項 9 記載の化合物またはその塩もしくは溶媒和物。

11. Q が 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 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_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、

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Siであり、 R_8 、 R_9 および R_{10} 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_1 および R_2 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、

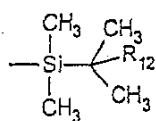
R_8 はH、アルキル基、O-アルキル基、S-アルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、 $C \equiv N$ または $C(O)R_{11}$ であり、ここで R_{11} はアルキル基、アリール基、シクロアルキル基、ヘテロアリール基、またはヘテロシクロアルキル基であり、

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Siである場合、

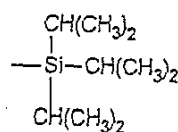
R_8 、 R_9 および R_{10} は独立してアルキル基、シクロアルキル基およびアリール基から選択される、

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_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：

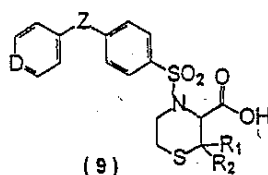


もしくは



(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、

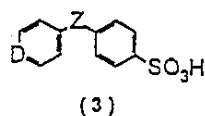
ZはOまたはSであり、

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)

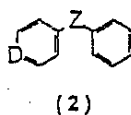
またはその塩もしくは溶媒和物。

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:



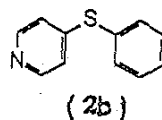
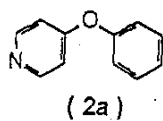
(式中、DはNまたは $C-R_{16}$ であり、ここで R_{16} はヘテロアリール基であり、ZはOまたはSである) またはその塩もしくは溶媒和物の製造方法であって、式2の化合物:



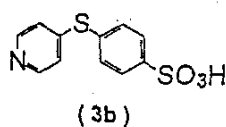
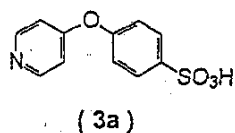
(式中、DおよびZは前記に定めたものである) またはその塩もしくは溶媒和物

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：

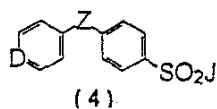


またはその塩もしくは溶媒和物を、式3aもしくは3bの化合物：

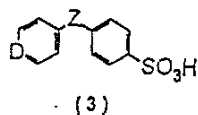


またはその塩もしくは溶媒和物に、式3aもしくは3bの化合物またはその塩もしくは溶媒和物の形成に十分な条件下で変換する工程を含む、請求項18記載の方法。

20. 式4の化合物：

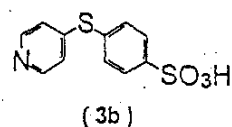
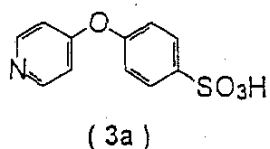


(式中、DはNまたはC-R₁₆であり、ここでR₁₆はアルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基またはヘテロアリール基であり、ZはOまたはSであり、Jはハロゲン、1, 2, 4-トリアゾリル、ベンゾトリアゾリルまたはイミダゾール-1-イルである) またはその塩もしくは溶媒和物の製造方法であって、式3の化合物：

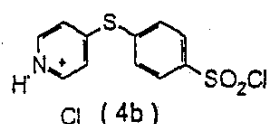
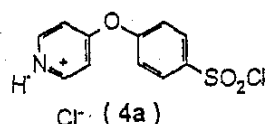


(式中、DおよびZは前記に定めたものである) またはその塩もしくは溶媒和物を、式4の化合物またはその塩もしくは溶媒和物に、式4の化合物またはその塩もしくは溶媒和物の形成に十分な条件下で変換する工程を含む方法。

21. 式3aもしくは3bの化合物：

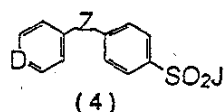


またはその塩もしくは溶媒和物を、式4aもしくは4bの塩：

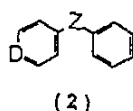


またはその溶媒和物に、式4aもしくは4bの化合物またはその塩もしくは溶媒和物の形成に十分な条件下で変換する工程を含む、請求項20記載の方法。

22. 式4の化合物：

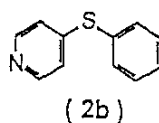
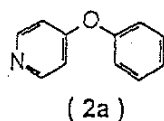


(式中、DはNまたはC-R₁₆であり、ここでR₁₆はアルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基またはヘテロアリール基であり、ZはOまたはSであり、Jはハロゲン、1, 2, 4-トリアゾリル、ベンゾトリアゾリルまたはイミダゾール-1-イルである) またはその塩もしくは溶媒和物の製造方法であって、式2の化合物：

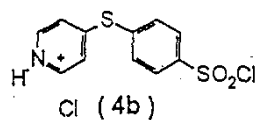
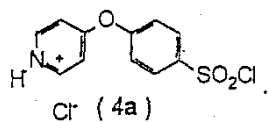


(式中、DおよびZは前記に定めたものである) またはその塩もしくは溶媒和物を、式4の化合物またはその塩もしくは溶媒和物に、式4の化合物またはその塩もしくは溶媒和物の形成に十分な条件下で変換する工程を含む方法。

23. 式2aもしくは2bの化合物：

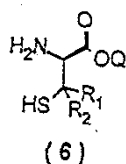


またはその塩もしくは溶媒和物を、式 4 a もしくは 4 b の塩：



またはその溶媒和物に、式 4 a もしくは 4 b 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 2 2 記載の方法。

2 4. 式 6 の化合物：

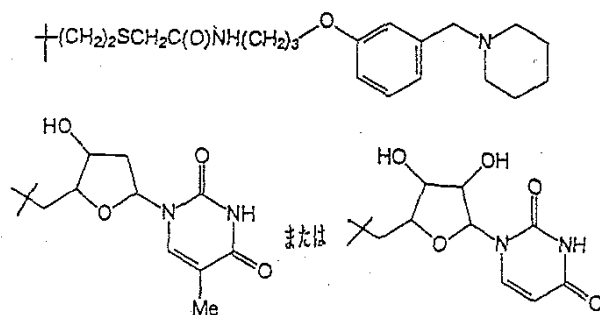


〈式中、 R_1 および R_2 はそれぞれメチル基であり、

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：

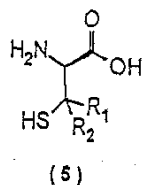


であり、ここで A は C または Si であり、 R_8 、 R_9 および R_{10} は独立して H および任意の適する有機部分から選択される）またはその塩もしくは溶媒和物であって；ただし、式 6 の化合物、塩または溶媒和物がジエステルではなく、かつ Q がメチル、エチル、イソプロピル、 n -ブチル、 $-CH_2-$ フェニル、



ではない化合物の製造方法であって、

式5の化合物：



(式中、 R_1 および R_2 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_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、ただし R_9 と R_{10} が両方ともメチル基であることはなく；

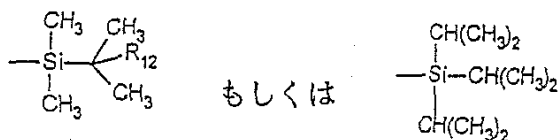
さらに、

AがSi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、

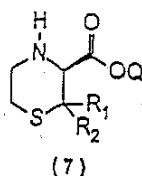
請求項24記載の方法。

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



(式中、 R_{12} は CH_3 または $CH(CH_3)_2$ である) 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：



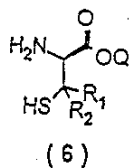
（式中、 R_1 および R_2 は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択されるか、または R_1 と R_2 は一緒にシクロアルキル基もしくはヘテロシクロアルキル基を形成し、

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Siであり、 R_8 、 R_9 および R_{10} 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_1 、 R_2 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_1 および R_2 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_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；

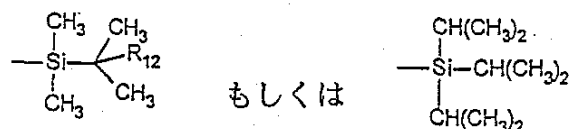
さらに、

AがSi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、

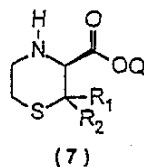
請求項28記載の方法。

30. Qが CH_3 、 CH_2CH_3 、 $CH(CH_3)_2$ 、 $C(CH_3)_3$ 、 $CH_2-CH=C$
 H_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：



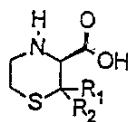
(式中、 R_1 および R_2 は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択されるか、または R_1 と R_2 は一緒にシクロアルキル基もしくはヘテロシクロアルキル基を形成し、

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Siであり、 R_8 、 R_9 および R_{10} 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_1 、 R_2 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。

32. R_1 および R_2 がそれぞれメチル基である、請求項31記載の方法。

33. 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、

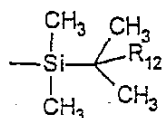
R_9 および R_{10} は独立してH、アルキル基およびアリール基から選択され；さらに、

AがSiである場合、

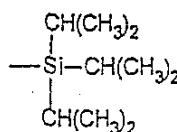
R_8 、 R_9 および R_{10} は独立してアルキル基、シクロアルキル基およびアリール基から選択される、

請求項32記載の方法。

34. Qが CH_3 、 CH_2CH_3 、 $CH(CH_3)_2$ 、 $C(CH_3)_3$ 、 $CH_2-CH=C H_2$ 、 $CH_2C \equiv N$ 、または次式の基：

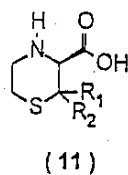


もしくは



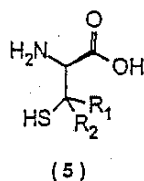
(式中、 $R_{1,2}$ は CH_3 または $CH(CH_3)_2$ である)である、請求項33記載の方法。

35. 式11の化合物：



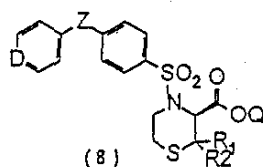
(式中、 R_1 および R_2 は独立してメチル基である)またはその塩もしくは溶媒和物の製造方法であって、

式5の化合物：



(式中、 R_1 、 R_2 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、

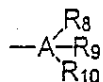
D は N または $C-R_{16}$ であり、ここで R_{16} はアルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基またはヘテロアリール基であり、

Z は O または S であり、

R_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

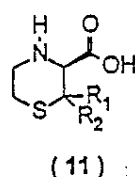
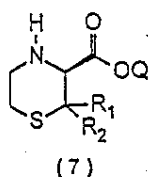
し、

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：

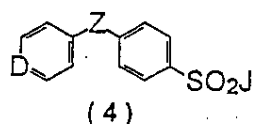


であり、ここでAはCまたはSiであり、 R_8 、 R_9 および R_{10} は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択される）またはその塩もしくは溶媒和物の製造方法であって、

式7または11の化合物：



（これらの式中、 R_1 、 R_2 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_1 および R_2 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_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、

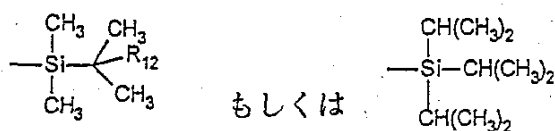
R_9 および R_{10} は独立して H、アルキル基およびアリール基から選択され；

A が Si 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、

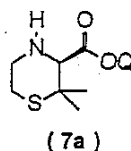
請求項 37 記載の方法。

39. 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：

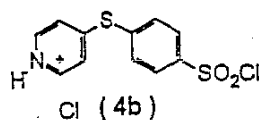
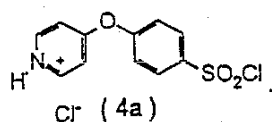


(式中、 R_{12} は CH_3 または $CH(CH_3)_2$ である) である、請求項 38 記載の方法。

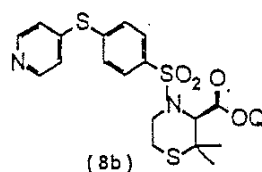
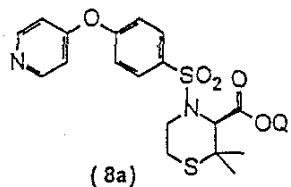
40. 式 7a の化合物：



またはその塩もしくは溶媒和物を、式 4a もしくは 4b 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36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 $C(O)R_{11}$ 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、

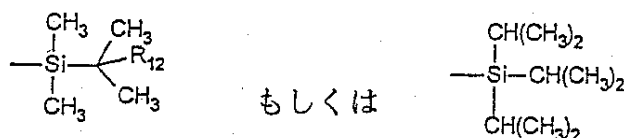
R_9 および R_{10} は独立してH、アルキル基およびアリール基から選択され；さらに、

AがSi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、

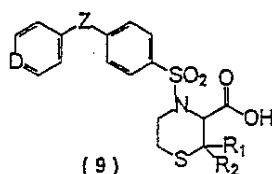
請求項40記載の方法。

42. 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：



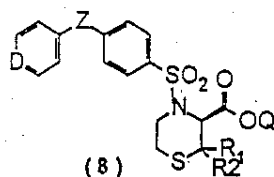
(式中、 R_{12} は CH_3 または $CH(CH_3)_2$ である)である、請求項41記載の方法。

43. 式9の化合物：



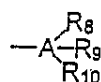
(式中、DはNであり、ZはOまたはSであり、 R_1 および R_2 は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択されるか、または R_1 と R_2 は一緒にシクロアル

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の製造方法であって、
式8の化合物：



(式中、D、Z、R₁およびR₂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Siであり、R₈、R₉およびR₁₀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. R₁およびR₂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、

R₈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)R₁₁であり、ここでR₁₁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、

R₉およびR₁₀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；

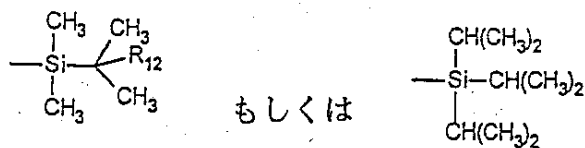
さらに、

AがSiである場合、

R₈、R₉およびR₁₀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、

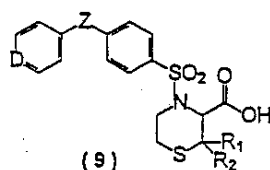
請求項44記載の方法。

46. Qが CH_3 、 CH_2CH_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：



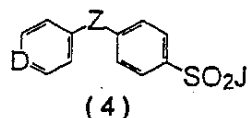
(式中、 R_{12} は CH_3 または $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ である)である、請求項45記載の方法。

47. 式9の化合物：



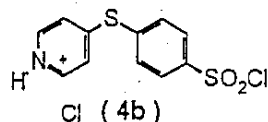
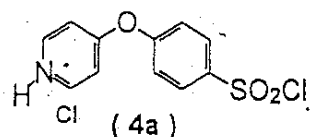
(式中、DはNであり、ZはOまたはSであり、 R_1 および R_2 は独立してHおよび任意の適する有機部分から選択されるか、または R_1 と R_2 は一緒にシクロアルキル基もしくはヘテロシクロアルキル基を形成する) またはその塩もしくは溶媒和物の製造方法であって、

式4の化合物：



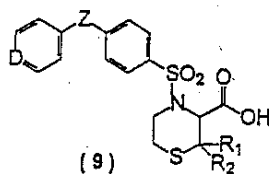
(式中、DおよびZは前記に定めたものであり、Jはハロゲン、1, 2, 4-トリアゾリル、ベンゾトリアゾリルまたはイミダゾール-1-イルである) またはその塩もしくは溶媒和物を、式9の化合物またはその塩もしくは溶媒和物に、式9の化合物またはその塩もしくは溶媒和物の形成に十分な条件下で変換する工程を含む方法。

48. 式4の塩が式4aまたは4bの塩：



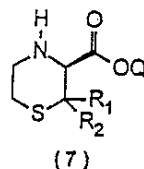
である、請求項47記載の方法。

49. 式9の化合物：



(式中、DはNまたはC-R₁₆であり、ここでR₁₆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、R₁およびR₂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R₁とR₂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、R₁およびR₂は前記に定めたものであり、

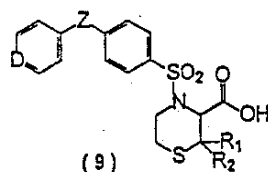
Qはシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、ヘテロシクロアルキル基、または次式の基：



であり、ここでAはCまたはSiであり、R₈、R₉およびR₁₀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

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の製造方法であって、

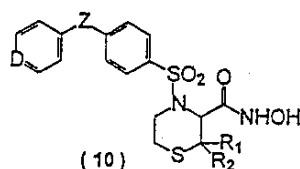
式9の化合物:



(式中、D、Z、 R_1 および R_2 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。

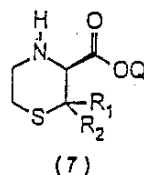
55. R_1 および R_2 がそれぞれメチル基である、請求項54記載の方法。

56. 式10の化合物:



(式中、DはNまたはC- R_{16} であり、ここで R_{16} 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_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Siであり、 R_8 、 R_9 および R_{10} 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。

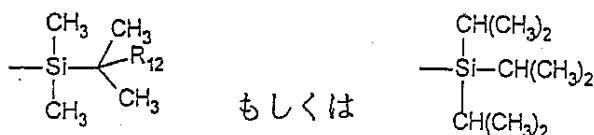
59. AがCである場合、

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Siである場合、

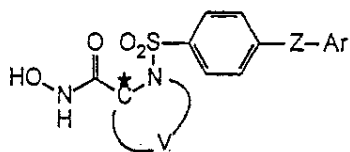
R_8 、 R_9 および R_{10} は独立してアルキル基、シクロアルキル基およびアリール基から選択される、
請求項58記載の方法。

60. 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、

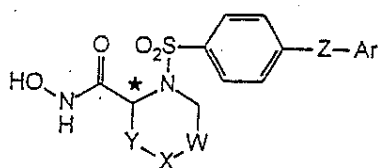
ZはOまたはSであり；

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_1R_2 、 $C=O$ 、 S 、 $S=O$ 、 SO_2 、 O 、 $N-R_3$ 、または $N^+(O^-)-R_4$ であり、これらにおいて

R_1 および R_2 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_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、

R_3 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。

63. 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、ヘテロシクロアルキル基、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62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。

64. 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、

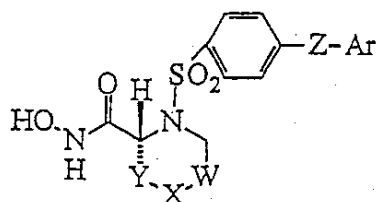
アリール基、ヘテロアリール基、 $C(O)-NR_{13}R_{14}$ 、 $C(O)-OR_{15}$ 、 $C(O)-SR_{15}$ 、 SO_2-R_{15} 、または $C(O)-R_{13}$ であり、

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、

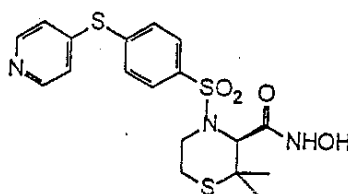
請求項62記載の化合物またはその薬剤学的に許容しうるプロドラッグ、塩もしくは溶媒和物。

65. 化合物が式：



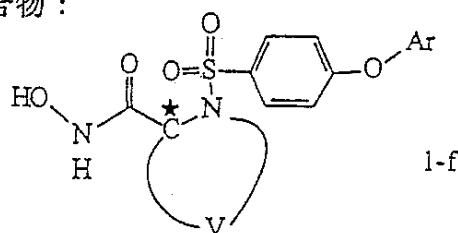
を有する、請求項62記載の化合物またはその薬剤学的に許容しうるプロドラッグ、塩もしくは溶媒和物。

66. 化合物が式：



を有する、請求項62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。

67. 式1-fの化合物：



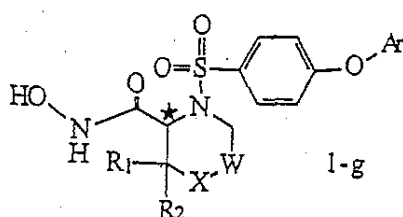
(式中、

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。

68. 式1-g:



(式中、

WおよびXは独立して、CH₂、C=O、S、S=O、O、N-R₃、およびN'(O)-R₄から選択され、

これらにおいてR₃は水素原子または適する置換基であり、

R₄はC₁~C₇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CH₂またはC=Oである場合はXはCH₂またはC=Oでなく；

R₁およびR₂は独立して水素原子、C₁~C₇アルキル基、-C(O)OR₁₇基もしくは-C(O)NR₁₇R₁₈基から選択され、

これらにおいてR₁₇は水素またはアルキル基であり、R₁₈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_1 と R_2 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その薬剤学的に許容しうる塩。

69. W が CH_2 であり、かつ X が S 、 $S=O$ 、 O 、 $N-R_3$ または $N'(O)-R_4$ である、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その薬剤学的に許容しうる塩。

70. R_3 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)、 $C(O)-R_{17}$ 基、 $C(O)O-R_{17}$ 基、 $C(O)NH-R_{17}$ 基、 $C(O)NR_{17}R_{18}$ 基、 SO_2-R_{19} 基(これらにおいて R_{17} および R_{18} 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_{19} 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69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。

71. W が S 、 O または $N-R_3$ であり、かつ X が CH_2 である、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。

72. W が $N-R_3$ であり、かつ X が $C=O$ である、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。

73. W が $C=O$ であり、かつ X が S 、 O または $N-R_3$ である、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。

74. 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。

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_2 、 $\text{C}=\text{O}$ 、 O 、 $\text{N}-\text{R}_3$ または $\text{N}^+(\text{O}^-)-\text{R}_4$ である場合はR-立体配置にあり、XがSまたは $\text{S}=\text{O}$ 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アー、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アー、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。

82. 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80記載の方法。

83. 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81記載の方法。

84. 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。

85. 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と接触させることを含む方法。

86. 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)-ピペラジーン-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)-ピペラジーン-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61記載の化合物。

87. 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86記載の化合物。

88. 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67記載の化合物。

89. 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－ブromo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61記載の化合物。』