

【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20年7月10日(2008.7.10)

【公表番号】特表2008-501691(P2008-501691A)

【公表日】平成20年1月24日(2008.1.24)

【年通号数】公開・登録公報2008-003

【出願番号】特願2007-515501(P2007-515501)

【国際特許分類】

C 0 7 C	235/06	(2006.01)
C 0 7 D	409/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/4025	(2006.01)
C 0 7 D	333/20	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
C 0 7 D	295/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/495	(2006.01)
C 0 7 D	471/20	(2006.01)
A 6 1 K	31/437	(2006.01)
C 0 7 D	409/14	(2006.01)
A 6 1 K	31/4439	(2006.01)
C 0 7 D	417/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/427	(2006.01)
A 6 1 K	31/404	(2006.01)
A 6 1 K	31/4035	(2006.01)
C 0 7 D	417/14	(2006.01)
A 6 1 K	31/165	(2006.01)
C 0 7 D	307/52	(2006.01)
C 0 7 D	405/12	(2006.01)
C 0 7 D	207/09	(2006.01)
A 6 1 K	31/40	(2006.01)
C 0 7 D	209/44	(2006.01)
C 0 7 D	217/14	(2006.01)
A 6 1 K	31/472	(2006.01)
A 6 1 K	31/381	(2006.01)
C 0 7 D	277/28	(2006.01)
A 6 1 K	31/421	(2006.01)
C 0 7 D	413/12	(2006.01)
C 0 7 D	263/32	(2006.01)
A 6 1 K	31/422	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	31/00	(2006.01)
A 6 1 P	7/08	(2006.01)
A 6 1 P	19/10	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	37/02	(2006.01)
A 6 1 P	31/18	(2006.01)



A 6 1 P 13/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 9/10 (2006.01)  
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 19/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 1/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 27/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 17/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 9/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 7/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 7/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/32 (2006.01)  
 C 0 7 D 401/14 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4709 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/5377 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4155 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4184 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/454 (2006.01)  
 C 0 7 D 277/22 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/426 (2006.01)  
 C 0 7 D 213/30 (2006.01)  
 C 0 7 D 317/64 (2006.01)  
 C 0 7 D 487/04 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/519 (2006.01)  
 C 0 7 D 495/04 (2006.01)  
 C 0 7 D 513/04 (2006.01)  
 C 0 7 D 471/04 (2006.01)  
 C 0 7 D 487/18 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/529 (2006.01)  
 C 0 7 D 487/08 (2006.01)  
 C 0 7 D 471/18 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/403 (2006.01)  
 C 0 7 C 235/10 (2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 C 235/06 C S P  
 C 0 7 D 409/12  
 A 6 1 K 31/4025  
 C 0 7 D 333/20  
 A 6 1 K 31/496  
 C 0 7 D 295/12 A  
 A 6 1 K 31/495  
 C 0 7 D 471/20  
 A 6 1 K 31/437  
 C 0 7 D 409/14  
 A 6 1 K 31/4439  
 C 0 7 D 417/12  
 A 6 1 K 31/427



A 6 1 K	31/404	
A 6 1 K	31/4035	
C 0 7 D	417/14	
A 6 1 K	31/165	
C 0 7 D	307/52	
C 0 7 D	405/12	
C 0 7 D	207/09	
A 6 1 K	31/40	
C 0 7 D	209/44	
C 0 7 D	217/14	
A 6 1 K	31/472	
A 6 1 K	31/381	
C 0 7 D	277/28	
A 6 1 K	31/421	
C 0 7 D	413/12	
C 0 7 D	263/32	
A 6 1 K	31/422	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	31/00	
A 6 1 P	7/08	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	31/18	
A 6 1 P	13/02	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	1/02	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	27/06	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	7/04	
A 6 1 P	7/02	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	25/32	
C 0 7 D	401/14	
A 6 1 K	31/4709	
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	31/4155	
A 6 1 K	31/4184	
A 6 1 K	31/454	



C 0 7 D 277/22  
 A 6 1 K 31/426  
 C 0 7 D 213/30  
 C 0 7 D 317/64  
 C 0 7 D 487/04 1 4 0  
 A 6 1 K 31/519  
 C 0 7 D 495/04 1 0 5 Z  
 C 0 7 D 513/04 3 2 5  
 C 0 7 D 487/04 1 3 8  
 C 0 7 D 471/04 1 0 4 H  
 C 0 7 D 471/04 1 1 7 N  
 C 0 7 D 471/04 1 1 3  
 C 0 7 D 487/04 1 4 6  
 C 0 7 D 487/18  
 A 6 1 K 31/529  
 C 0 7 D 487/08  
 C 0 7 D 471/18  
 A 6 1 K 31/403  
 C 0 7 C 235/10

## 【手続補正書】

【提出日】平成20年5月26日(2008.5.26)

## 【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

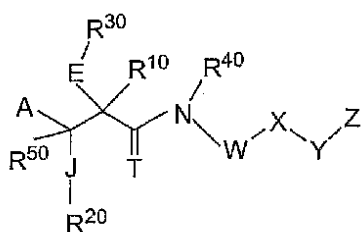
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物：

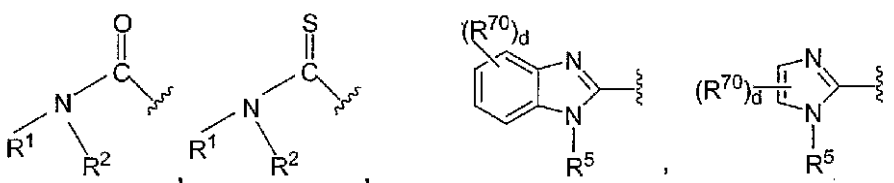
【化1】



式 (I)

あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物であって、ここで：Aは、以下からなる群から選択される：

【化2】

および -CO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>；



d は、0 ~ 4 である；

J は、O、S および  $NR^5$  からなる群から選択される；

E は、以下からなる群から選択される：O、S および  $NR^5$ ；

T は、O または S である；

$R^1$  および  $R^2$  は、同一または異なり、各々は、別個に、H、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアラルキル、およびヘテロアリールからなる群から選択される；あるいは、 $R^1$  および  $R^2$  は、 $R^1$  および  $R^2$  が結合して示されている N と一緒になって、4 員 ~ 8 員複素環を表わし、該複素環は、該 N を含む 1 個 ~ 3 個のヘテロ原子を有し、該複素環は、必要に応じて、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルまたはヘテロシクリルと縮合され、ここで、該アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアラルキル、ヘテロアリールおよび 4 員 ~ 8 員複素環の各々は、非置換であり得るか、または必要に応じて、別個に、同一または異なり得る 1 個またはそれ以上の部分で置換でき、各部分は、別個に、以下の  $R^{70}$  部分からなる群から選択される；

$R^{10}$  は、H、アルキル、およびフルオロアルキルからなる群から選択される；

$R^{20}$  は、H、アルキル、およびフルオロアルキルからなる群から選択される；

$R^{30}$  は、H またはアルキルであるか、あるいは、 $R^{30}$  および  $R^{40}$  は、 $R^{40}$  が式 I に結合して示されている N と一緒になって、結合されて、4 員 ~ 7 員複素環を形成し、ここで、該複素環は、非置換であるか、または必要に応じて、別個に、同一または異なり得る 1 個またはそれ以上の部分で置換されており、各部分は、別個に、以下の  $R^{70}$  部分からなる群から選択される；

$R^{40}$  は、H またはアルキルである；

$R^{50}$  は、H またはアルキルである；

W は、 $-(CR^{13})_n-$  であり、ここで、n は、0 ~ 5 または共有結合であるか、あるいは、2 個の  $R^{13}$  基は、縮合されて、3 員 ~ 8 員シクロアルキルを形成でき、ここで、該 3 員 ~ 8 員シクロアルキルは、非置換であり得るか、または必要に応じて、別個に、同一または異なり得る 1 個またはそれ以上の部分で置換でき、各部分は、別個に、以下の  $R^6$  部分からなる群から選択される；

X は、存在していないか存在しており、もし存在しているなら、X は、共有結合、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、およびヘテロアリールからなる群から選択され、ここで、該アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、およびヘテロアリールは、非置換であり得るか、または必要に応じて、別個に、同一または異なり得る 1 個またはそれ以上の部分で置換でき、各部分は、別個に、以下の  $R^{70}$  部分からなる群から選択される；

Y は、存在していないか存在しており、もし存在しているなら、Y は、共有結合、 $-[C(R^6)]_n-$ （ここで、n は、1 または 2 である）、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NR^1-$ 、 $-SO_v-$ （ここで、v は、1 ~ 2 である）、 $-SO_n(CR^6)_p-$ （ここで、n は、1 または 2 であり、そして p は、1 ~ 4 である）、 $-O(CR^6)_q-$  または  $-(CR^6)_qO-$ （ここで、q は、1 ~ 4 である）、 $-N(R^7)S(O)_n-$  または  $-S(O)_nN(R^7)-$ （ここで、n は、1 または 2 である）、および  $-N(R^7)C(O)-$  または  $-C(O)N(R^7)-$  からなる群から選択される；

Z は、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、およびヘテロアリールからなる群から選択され、該シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、およびヘテロアリールは、必要に応じて、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリールまたはシクロアルキルと縮合される；ここで、該アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、およびヘテロアリールの各々は、非置換であり得るか、または必要に応じて、別個に、同一または異なり得る 1 個またはそれ以上の部分で置換でき、各部分は、別個に、以下の  $R^{70}$  部分からなる群から選択される；

$R^5$  は、水素、アルキル、およびアルキルアリールからなる群から選択される；



各  $R^6$  は、同一または異なり、そして別個に、水素、ハロゲン、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)_q R^{15}$  (ここで、 $q$  は、1 ~ 2 である)、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アルコキシル、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アミノカルボニル、アルキルカルボニル、およびアルコキシカルボニルからなる群から選択される；

各  $R^7$  は、同一または異なり、そして別個に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、アルキルカルボニル、およびアルコキシカルボニルからなる群から選択され、ここで、該アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルの各々は、非置換であり得るか、または必要に応じて、別個に、同一または異なり得る 1 個またはそれ以上の部分で置換でき、各部分は、別個に、以下の  $R^{70}$  部分からなる群から選択される；

$R^{13}$  は、同一または異なり、そして別個に、水素、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR^{14}$ 、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アルケニル、アルキニル、アルキルアリール、アルキルアミノ、およびアルキルカルボニルからなる群から選択される；

$R^{14}$  は、アルキルである；

各  $R^{70}$  は、指示された H に対する置換基であり、同一または異なり、そして別個に、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ハロ、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)_q N(R^{15})(R^{16})$  (ここで、 $q$  は、1 ~ 2 である)、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-アルキル-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2 R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})S(O)_2 R^{16}$ 、 $-N(R^{17})S(O)_2 N(R^{16})(R^{15})$ 、 $-N(R^{17})S(O)N(R^{16})(R^{15})$ 、 $-N(R^{17})C(O)N(R^{16})(R^{15})$ 、 $-CH_2-N(R^{17})C(O)N(R^{16})(R^{15})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、および  $-S(O)_q R^{15}$  (ここで、 $q$  は、1 ~ 2 である) からなる群から選択される；ここで、該アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルケニルおよびアルキニルの各々は、別個に、非置換であるか、または 1 個 ~ 5 個の基で置換されており、別個に、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ ；および  $-N(R^{15})S(O)R^{16}$  からなる群から選択される；そして

各  $R^{15}$ 、 $R^{16}$  および  $R^{17}$  は、別個に、H、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、およびヘテロアリールからなる群から選択されるか、あるいは、 $R^{15}$  および  $R^{16}$  は、それらが結合して示されている N と一緒になって、結合されて、4 員 ~ 8 員複素環を形成し、ここで、該 4 員 ~ 8 員シクロアルキルは、非置換であり得るか、または必要に応じて、別個に、同一または異なり得る 1 個またはそれ以上の部分で置換でき、各部分は、別個に、以下の  $R^{75}$  部分からなる群から選択される；

各  $R^{75}$  は、別個に、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルケニルおよびアルキニルからなる群から選択され、ここで、該アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルケニルおよびアルキニルの各々は、非置換であるか、または 1 個 ~ 5 個の基で置換されており、該基は、別個に、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{19}$ 、 $-N(R^{19})_2$ 、 $-C(O)OR^{19}$ 、 $-C(O)N(R^{19})_2$ 、および  $-N(R^{19})S(O)R^{19}$  からなる群から選択される；そして

各  $R^{19}$  は、別個に、H、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、お



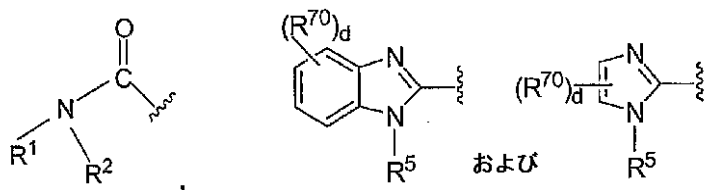
よびヘテロアリールからなる群から選択される、

化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物。

【請求項 2】

A が、以下からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物：

【化 3】



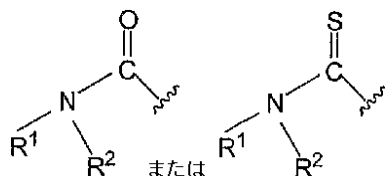
ここで、 $R^1$  および  $R^2$  は、 $R^1$  および  $R^2$  が結合して示されている N と一緒になって、4 員～8 員複素環を表わし、該複素環は、該 N を含む 1 個～3 個のヘテロ原子を有し、該複素環は、必要に応じて、 $R^{70}$  で置換されているか、あるいは、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、またはヘテロシクリルと縮合されており、ここで、4 員～8 員複素環は、非置換であり得るか、または必要に応じて、別個に、同一または異なり得る 1 個またはそれ以上の部分で置換でき、各部分は、別個に、 $R^{70}$  部分の群からなる群から選択される、

化合物。

【請求項 3】

A が、以下である、請求項 1 に記載の化合物：

【化 4】



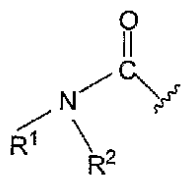
ここで、 $R^1$  および  $R^2$  は、同一または異なり、各々は、別個に、H、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアラルキル、およびヘテロアリールからなる群から選択される；ここで、該アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアラルキルおよびヘテロアリールは、非置換であり得るか、または必要に応じて、別個に、同一または異なり得る 1 個またはそれ以上の部分で置換でき、各部分は、別個に、 $R^{70}$  部分の群からなる群から選択される、

化合物。

【請求項 4】

A が、以下である、請求項 3 に記載の化合物：

【化 5】

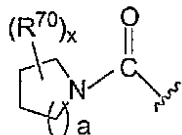


【請求項 5】

A が、以下である、請求項 2 に記載の化合物：



## 【化 6】



ここで、 $a$  は、 $0 \sim 4$  である；そして

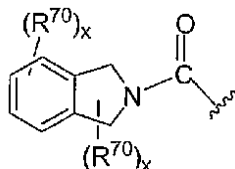
$x$  は、 $0 \sim 4$  である、

化合物。

## 【請求項 6】

A が、以下である、請求項 2 に記載の化合物：

## 【化 7】



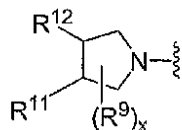
ここで、各  $x$  は、別個に、 $0 \sim 4$  である、

化合物。

## 【請求項 7】

環が、 $-NR^1R^2$  から形成され、そして該環が、以下である、請求項 2 に記載の化合物：

## 【化 8】



ここで、

各  $R^9$  は、指示された H に対する置換基であり、そして同一または異なり得、各々は、別個に、 $-OH$ 、 $-OR^{14}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、アルキル、アリール、ヘテロアリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびヘテロシクリルからなる群から選択され、ここで、該アルキル、アリール、ヘテロアリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびヘテロシクリルは、非置換であり得るか、または必要に応じて、別個に、同一または異なり得る 1 個またはそれ以上の部分で置換でき、各部分は、別個に、 $R^{70}$  部分の群から選択される；

$R^{11}$  および  $R^{12}$  は、各  $R^{11}$  および  $R^{12}$  が結合して示されている炭素と一緒にあって、縮合ヘテロアリールまたは縮合シクロアルキルであり、ここで、該縮合ヘテロアリールおよび縮合シクロアルキルは、非置換であり得るか、または必要に応じて、別個に、同一または異なり得る 1 個またはそれ以上の部分で置換でき、各部分は、別個に、 $R^{70}$  部分の群から選択される；そして

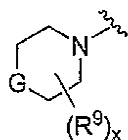
$x$  は、 $0 \sim 4$  であり、ここで、 $x$  は、1 より大きく、各  $R^9$  部分は、同一または異なり、各部分は、別個に、 $R^9$  部分の群から選択される、化合物。

## 【請求項 8】

環が、 $-NR^1R^2$  から形成され、そして該環が、以下である、請求項 2 に記載の化合物：



## 【化 9】



ここで、

各  $R^9$  は、指示された H に対する置換基であり、そして同一または異なり得、各々は、別個に、 $-OH$ 、 $-OR^{14}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、アルキル、アリール、ヘテロアリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびヘテロシクリルからなる群から選択され、ここで、該アルキル、アリール、ヘテロアリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびヘテロシクリルは、非置換であり得るか、または必要に応じて、別個に、同一または異なり得る 1 個またはそれ以上の部分で置換でき、各部分は、別個に、 $R^{70}$  部分の群から選択される；

$x$  は、 $0 \sim 4$  であり、そして  $x$  が 1 より大きいとき、各  $R^9$  部分は、同一または異なり得、各部分は、別個に、 $R^9$  部分の群から選択される；そして

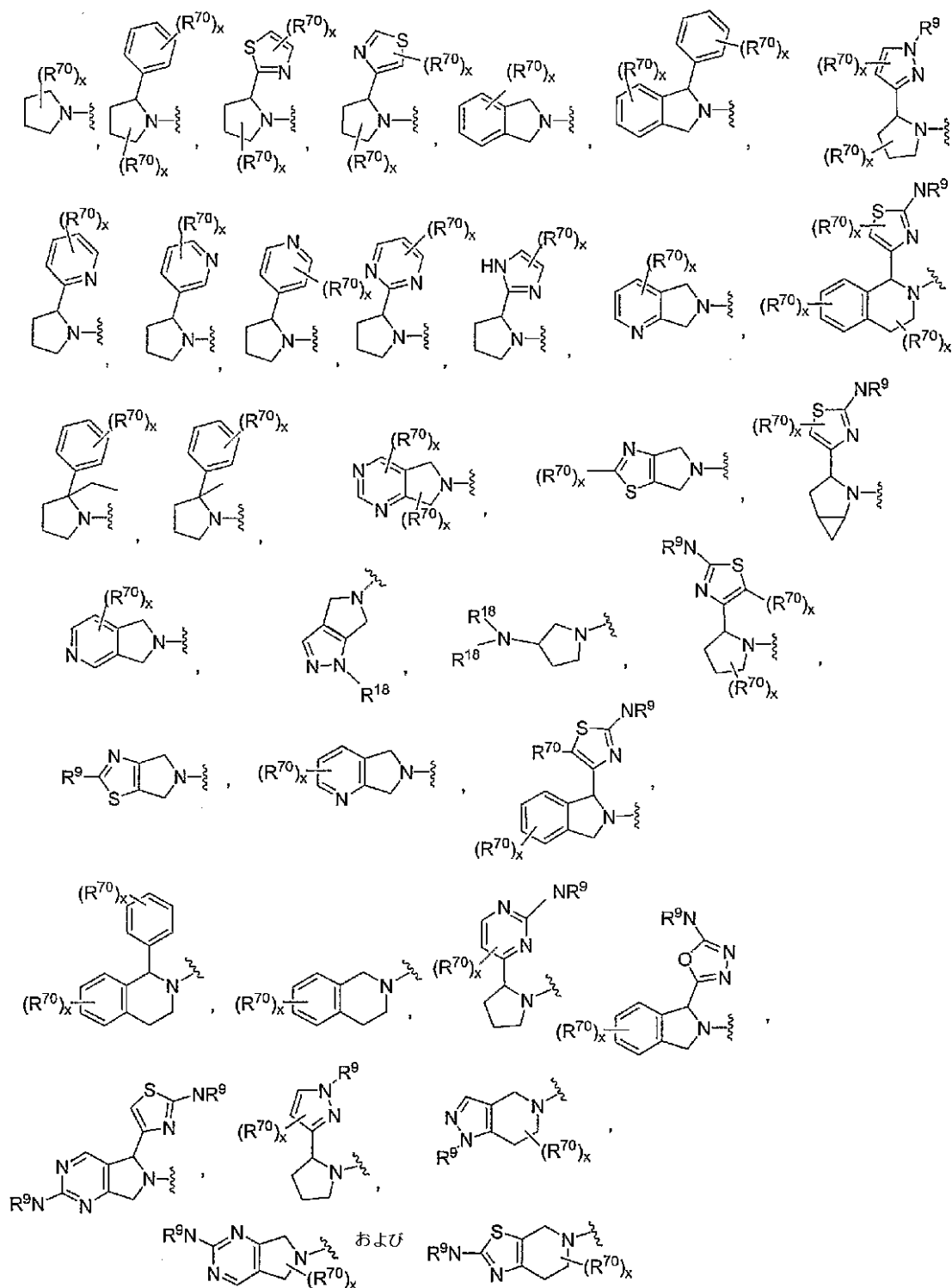
$G$  は、 $CH_2$ 、 $NR^7$ 、 $O$ 、 $S$ 、または  $SO_2$  からなる群から選択される、化合物。

## 【請求項 9】

環が、 $-NR^1R^2$  から形成され、そして該環が、以下である、請求項 2 に記載の化合物：



## 【化 10】



ここで、

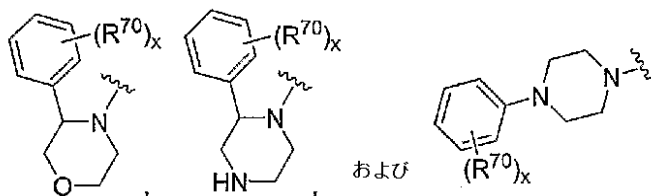
$x$  は、0 ~ 4 であり、そして  $x$  が 1 より大きいとき、各  $R^{70}$  部分は、同一または異なり得、各部分は、別個に、 $R^{70}$  部分の群から選択される；そして  
各  $R^{18}$  は、同一または異なり、そして別個に、H またはアルキルである、  
化合物。

## 【請求項 10】

環が、 $-NR^1R^2$  から形成され、そして該環が、以下からなる群から選択される、請求項 2 に記載の化合物：



## 【化 1 1】



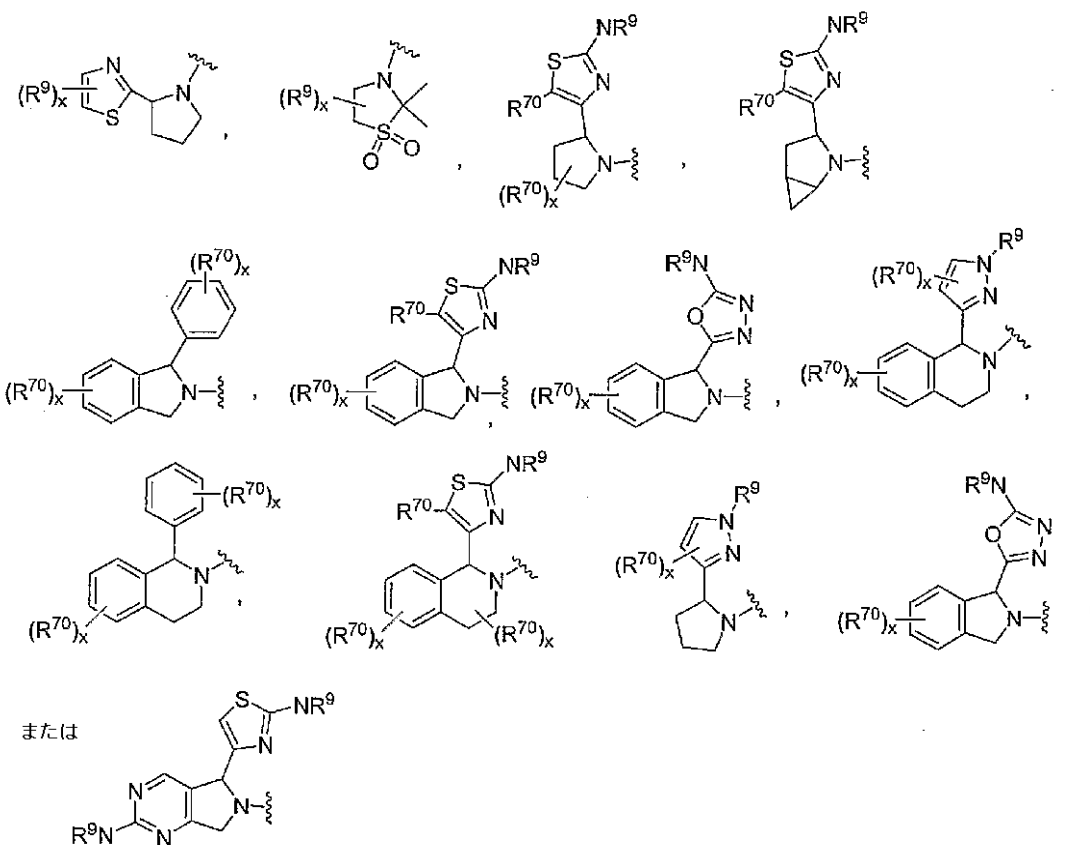
ここで、

$x$  は、0 ~ 4 であり、そして  $x$  が 1 より大きいとき、各  $R^{70}$  部分は、同一または異なり得、各部分は、別個に、 $R^{70}$  部分の群からなる群から選択される、化合物。

## 【請求項 1 1】

環が、 $-NR^1R^2$  から形成され、そして以下である、請求項 2 に記載の化合物：

## 【化 1 2】



ここで、

各  $R^9$  は、指示された H に対する置換基であり、そして同一または異なり得、各々は、別個に、 $-OH$ 、 $-OR^{14}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、アルキル、アリール、ヘテロアリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびヘテロシクリルからなる群から選択され、ここで、該アルキル、アリール、ヘテロアリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびヘテロシクリルは、非置換であり得るか、または必要に応じて、別個に、同一または異なり得る 1 個またはそれ以上の部分で置換でき、各部分は、別個に、 $R^{70}$  部分の群から選択される；そして

$x$  は、0 ~ 4 であり、そして  $x$  が 1 より大きいとき、各  $R^9$  部分は、同一または異なり得、各部分は、別個に、 $R^9$  部分の群から選択される、化合物。

## 【請求項 1 2】

J が、0 である、請求項 2 に記載の化合物。



## 【請求項 13】

E が、O である、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 14】

R<sup>10</sup> が、H またはアルキルである、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 15】

R<sup>20</sup> が、H である、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 16】

R<sup>30</sup> が、H である、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 17】

R<sup>40</sup> が、H である、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 18】

R<sup>50</sup> が、H である、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 19】

R<sup>13</sup> が、H またはアルキルである、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 20】

R<sup>13</sup> が、H または -CH<sub>3</sub> である、請求項 19 に記載の化合物。

## 【請求項 21】

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> が、R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> が結合して示されている N と一緒になって、4 員 ~ 6 員複素環を表わし、該複素環が、前記 N を含む 1 個 ~ 3 個のヘテロ原子を有し、該複素環が、必要に応じて、R<sup>70</sup> で置換されており、ここで、R<sup>70</sup> が、アリールである、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 22】

Y が、共有結合または - [ C ( R<sup>6</sup> )<sub>2</sub> ]<sub>n</sub> - であり、ここで、n が、1 ~ 2 である、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 23】

Y が、共有結合、-CH<sub>2</sub>-、-C(H)(OH)-、-C(O)- および -O- からなる群から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 24】

Y が、共有結合または -CH<sub>2</sub>- である、請求項 23 に記載の化合物。

## 【請求項 25】

Y が、共有結合である、請求項 24 に記載の化合物。

## 【請求項 26】

W が、- ( C R<sup>13</sup><sub>2</sub> )<sub>n</sub> - であり、ここで、n が、1 ~ 5 であり、そして各 R<sup>13</sup> が、H、またはアルキルである、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 27】

W が、-CH<sub>2</sub>-、-C(H)(CH<sub>3</sub>)-、-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>- および -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- からなる群から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 28】

W が、-CH<sub>2</sub>- または -C(H)(CH<sub>3</sub>)- である、請求項 27 に記載の化合物。

## 【請求項 29】

X が、アルキル、アリール、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールからなる群から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 30】

X が、フェニル、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピリジニル、チエニル、チアゾリル、オキサゾリル、イミダゾリルおよびピラゾリルからなる群から選択される、請求項 29 に記載の化合物。

## 【請求項 31】

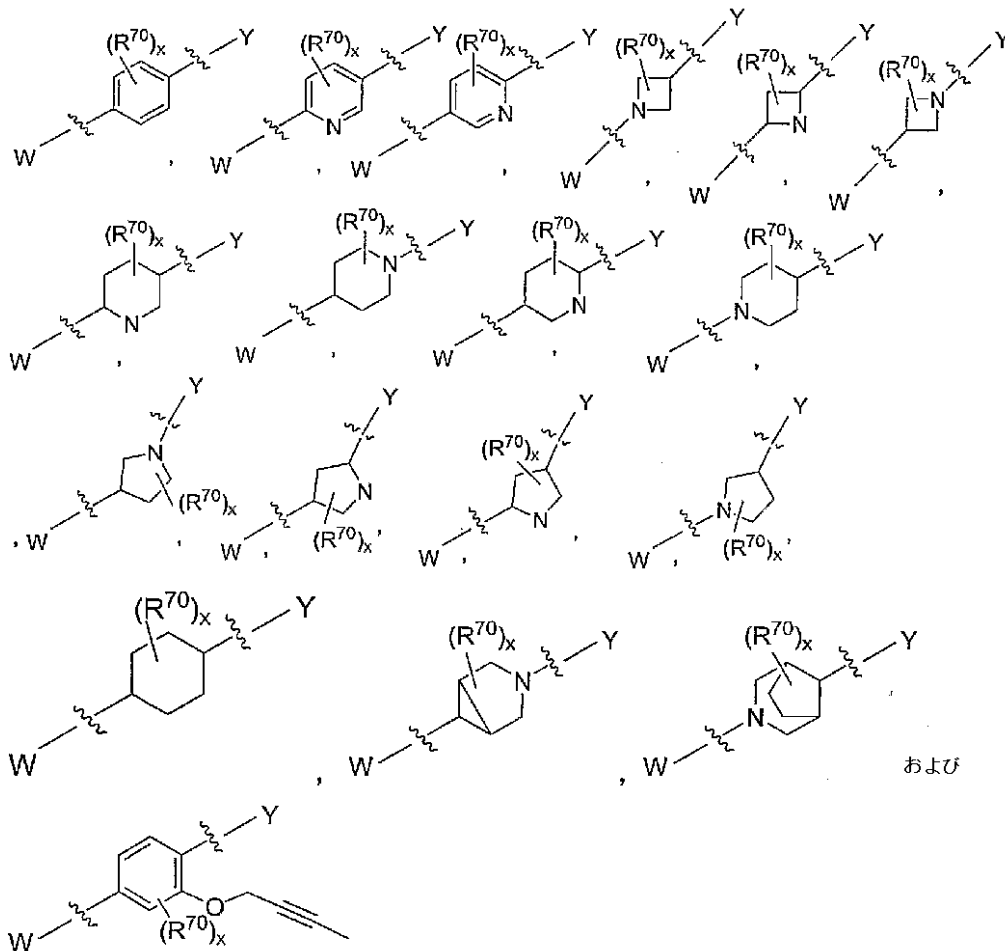
X が、フェニル、ピペリジニルおよびピリジニルからなる群から選択される、請求項 30 に記載の化合物。

## 【請求項 32】



X が、以下からなる群から選択される、請求項 29 に記載の化合物：

【化 13】



ここで、

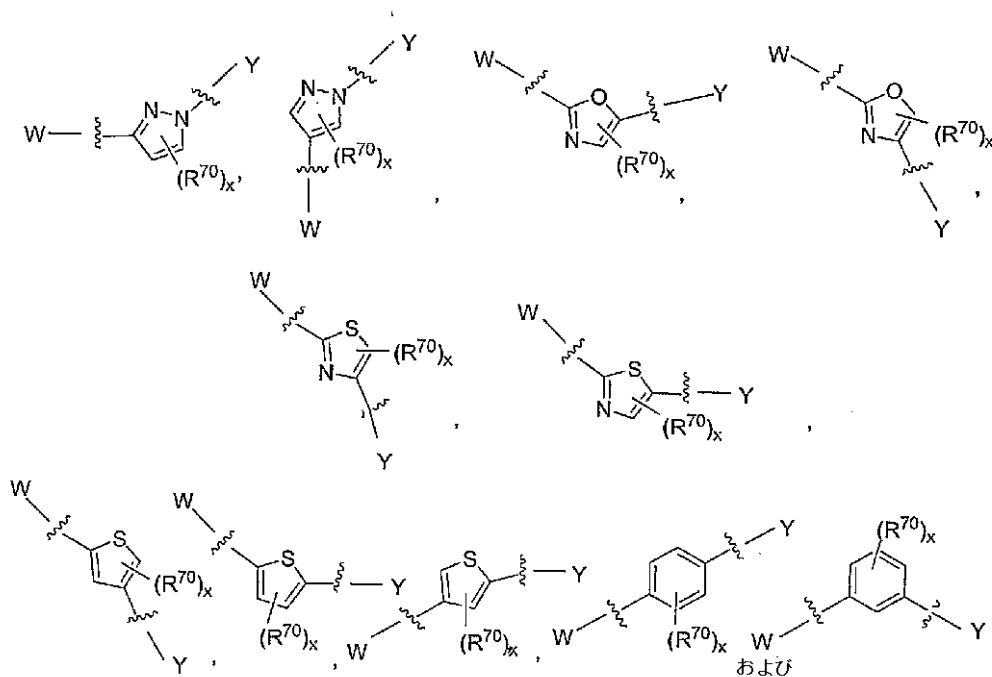
x は、0 ~ 4 であり、ここで、x は、1 より大きく、各 R<sup>70</sup> 部分は、同一または異なり得、各部分は、別個に、R<sup>70</sup> 部分の群から選択される、化合物。

【請求項 33】

X が、以下からなる群から選択される、請求項 29 に記載の化合物：



## 【化 1 4】



ここで、

x は、0 ~ 4 であり、そして x が 1 より大きいとき、各 R<sup>70</sup> 部分は、同一または異なり得、各部分は、別個に、R<sup>70</sup> 部分の群からなる群から選択される、化合物。

## 【請求項 3 4】

Z が、H、アリールおよびヘテロアリールからなる群から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 3 5】

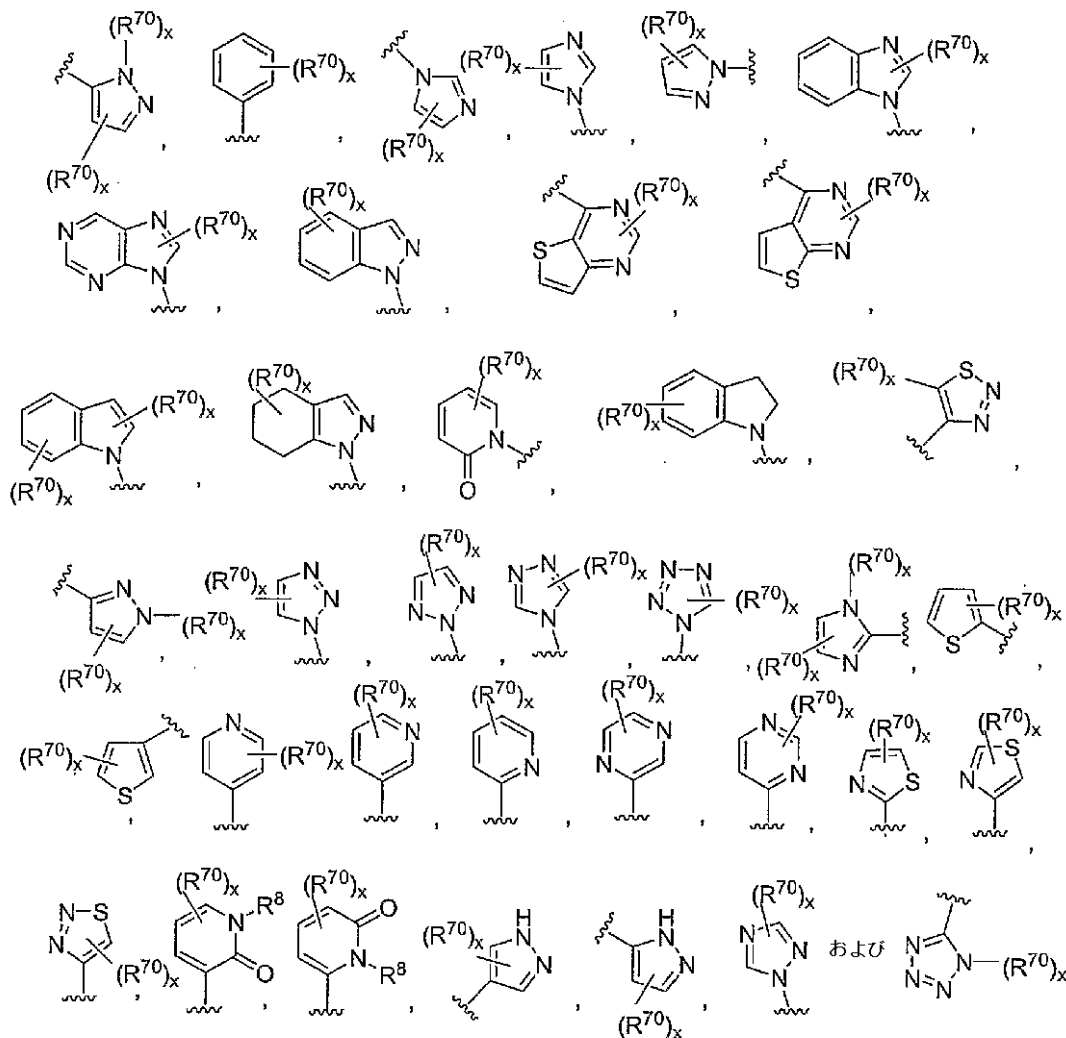
Z が、H、フェニル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、チアゾリル、チアジアゾリル、イミダゾリル、ピロリジニル、ピラジニル、トリアゾリル、テトラゾリルおよびテトラジニルからなる群から選択され、ここで、該フェニル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、ピラゾリル、チエニル、ピリジニル、チアゾリル、チアジアゾリル、イミダゾリル、ピロリジニル、ピラジニル、トリアゾリル、テトラゾリルおよびテトラジニルが、非置換であり得るか、または必要に応じて、別個に、同一または異なり得る 1 個またはそれ以上の部分で置換でき、各部分が、別個に、R<sup>70</sup> 部分からなる群から選択される、請求項 3 4 に記載の化合物。

## 【請求項 3 6】

Z が、以下からなる群から選択される、請求項 3 5 に記載の化合物：



## 【化 1 5】



ここで、

$x$  は、 $0 \sim 4$  であり、そして  $x$  が 1 より大きいとき、各  $R^{70}$  部分は、同一または異なり得、各部分は、別個に、 $R^{70}$  部分の群からなる群から選択される、化合物。

## 【請求項 37】

Z が、フェニルである、請求項 35 に記載の化合物。

## 【請求項 38】

前記フェニルが、少なくとも 1 個の置換基で置換されており、該置換基が、シアノ、アルコキシ、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシ、アリール、ヘテロアリール、アリールオキシ、アミノおよびテトラゾールからなる群から選択される、請求項 37 に記載の化合物。

## 【請求項 39】

Z が、チエニルである、請求項 35 に記載の化合物。

## 【請求項 40】

前記チエニルが、少なくとも 1 個の置換基で置換されており、該置換基が、シアノ、アルコキシ、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシ、アリール、ヘテロアリール、アリールオキシ、アミノおよびテトラゾールからなる群から選択される、請求項 39 に記載の化合物。

## 【請求項 41】

Z が、ピラゾリルである、請求項 35 に記載の化合物。

## 【請求項 42】



前記ピラゾリルが、少なくとも 1 個の置換基で置換されており、該置換基が、シアノ、アルコキシ、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシ、アリール、ヘテロアリール、アリーロキシ、アミノおよびテトラゾールからなる群から選択される、請求項 4 1 に記載の化合物。

【請求項 4 3】

Z が、ピリジニルである、請求項 3 5 に記載の化合物。

【請求項 4 4】

前記ピリジニルが、少なくとも 1 個の置換基で置換されており、該置換基が、シアノ、アルコキシ、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシ、アリール、ヘテロアリール、アリーロキシ、アミノおよびテトラゾールからなる群から選択される、請求項 4 3 に記載の化合物。

【請求項 4 5】

Z が、イミダゾリルである、請求項 3 5 に記載の化合物。

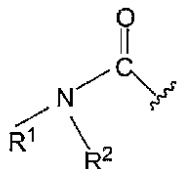
【請求項 4 6】

前記イミダゾリルが、少なくとも 1 個の置換基で置換されており、該置換基が、シアノ、アルコキシ、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシ、アリール、ヘテロアリール、アリーロキシ、アミノおよびテトラゾールからなる群から選択される、請求項 4 5 に記載の化合物。

【請求項 4 7】

A が、以下である、請求項 2 に記載の化合物：

【化 1 6】

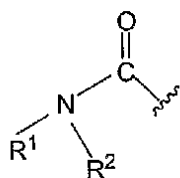


ここで、 $R^1$  および  $R^2$  は、 $R^1$  および  $R^2$  が結合して示されている N と一緒になって、4 員～8 員複素環を表わし、該複素環は、該 N を含む 1 個～3 個のヘテロ原子を有し、該複素環は、必要に応じて、1 個またはそれ以上の  $R^{70}$  で置換されているか、または必要に応じて、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、またはヘテロシクリルと縮合されており、ここで、該 4 員～8 員複素環は、非置換であり得るか、または必要に応じて、別個に、同一または異なり得る 1 個またはそれ以上の部分で置換でき、各部分は、別個に、 $R^{70}$  部分の群から選択される；E、J および T は、同一であり、そして O である； $R^{10}$  は、H またはアルキルである； $R^{20}$ 、 $R^{30}$ 、 $R^{40}$  および  $R^{50}$  は、同一であり、そして H である；W は、 $-(CR^{13}_2)_n-$  であり、ここで、n は、0～5 である；X は、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルからなる群から選択される；Y は、共有結合、 $-[C(R^6)_2]_n-$ （ここで、n は、1～2 である）、 $-O-$ 、 $-S-$ 、および  $-NR^1-$  からなる群から選択される；そして Z は、以下からなる群から選択される：



Chemical structures representing various substituted heterocyclic compounds, including pyrazoles, imidazoles, triazoles, tetrazoles, and fused ring systems, with substituents  $(R^{70})_x$  and  $R^8$ .

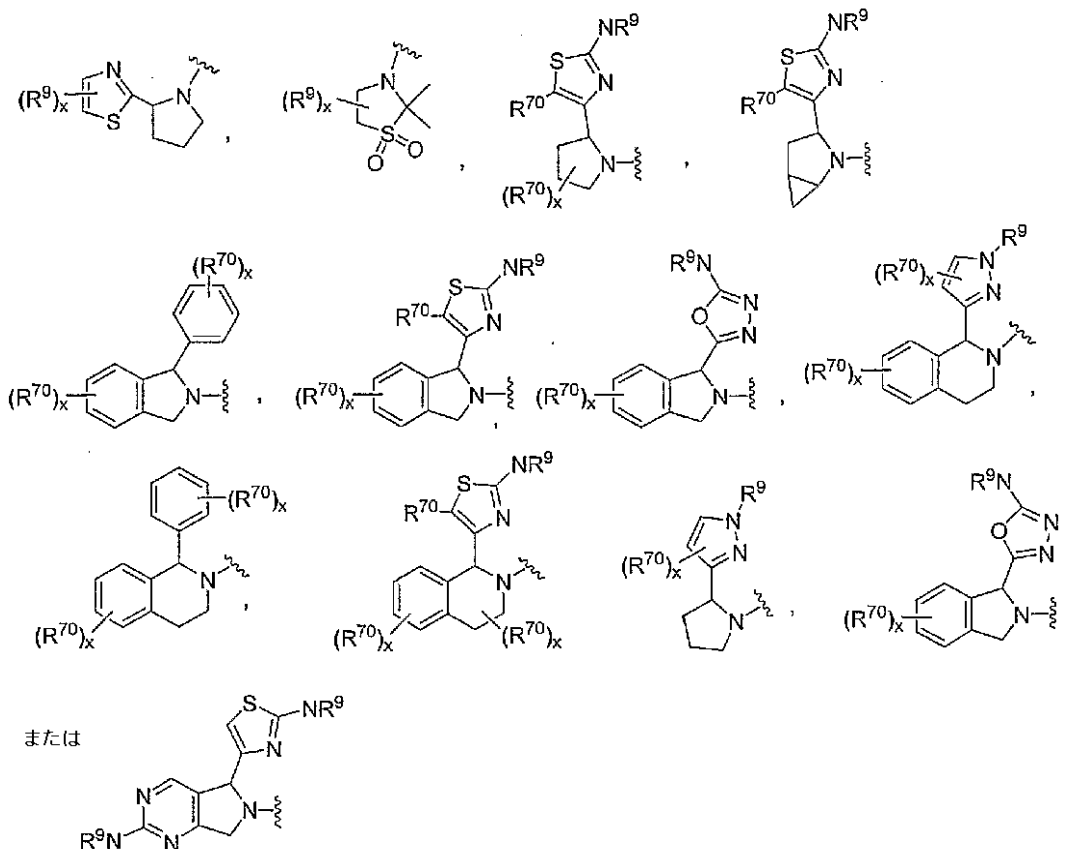
【化 1 8】



の前記 - N R<sup>1</sup> R<sup>2</sup> が、以下である、請求項 47 に記載の化合物：



## 【化 19】



ここで、

各  $R^9$  は、指示された H に対する置換基であり、そして同一または異なり得、各々は、別個に、 $-OH$ 、 $-OR^{14}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、アルキル、アリール、ヘテロアリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびヘテロシクリルからなる群から選択され、ここで、該アルキル、アリール、ヘテロアリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびヘテロシクリルは、非置換であり得るか、または必要に応じて、別個に、同一または異なり得る 1 個またはそれ以上の部分で置換でき、各部分は、別個に、 $R^{70}$  部分の群から選択される；そして

$x$  は、0 ~ 4 であり、そして  $x$  が 1 より大きいとき、各  $R^9$  部分は、同一または異なり得、各部分は、別個に、 $R^9$  部分の群から選択される、

化合物。

## 【請求項 49】

$X$  が、フェニル、ピペリジニル、ピリジニル、チエニル、チアゾリル、オキサゾリル、およびピラゾリルからなる群から選択される、請求項 47 に記載の化合物。

## 【請求項 50】

$X$  が、フェニル、ピペリジニル、チエニル、およびピリジニルからなる群から選択され、そして  $Y$  が、共有結合、 $-[C(R^6)_2]_n-$ （ここで、 $n$  は、1 ~ 2 である）および  $-O-$  からなる群から選択される、請求項 48 に記載の化合物。

## 【請求項 51】

$X$  が、ピペリジニルであり、 $Y$  が、共有結合であり、そして  $Z$  が、2 個の置換基を有するアリールまたはヘテロアリールであり、該置換基が、同一または異なり得、各部分が、別個に、シアノ、アルコキシ、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシ、アリール、ヘテロアリール、アリールオキシおよびアミノからなる群から選択される、請求項 48 に記載の化合物。

## 【請求項 52】

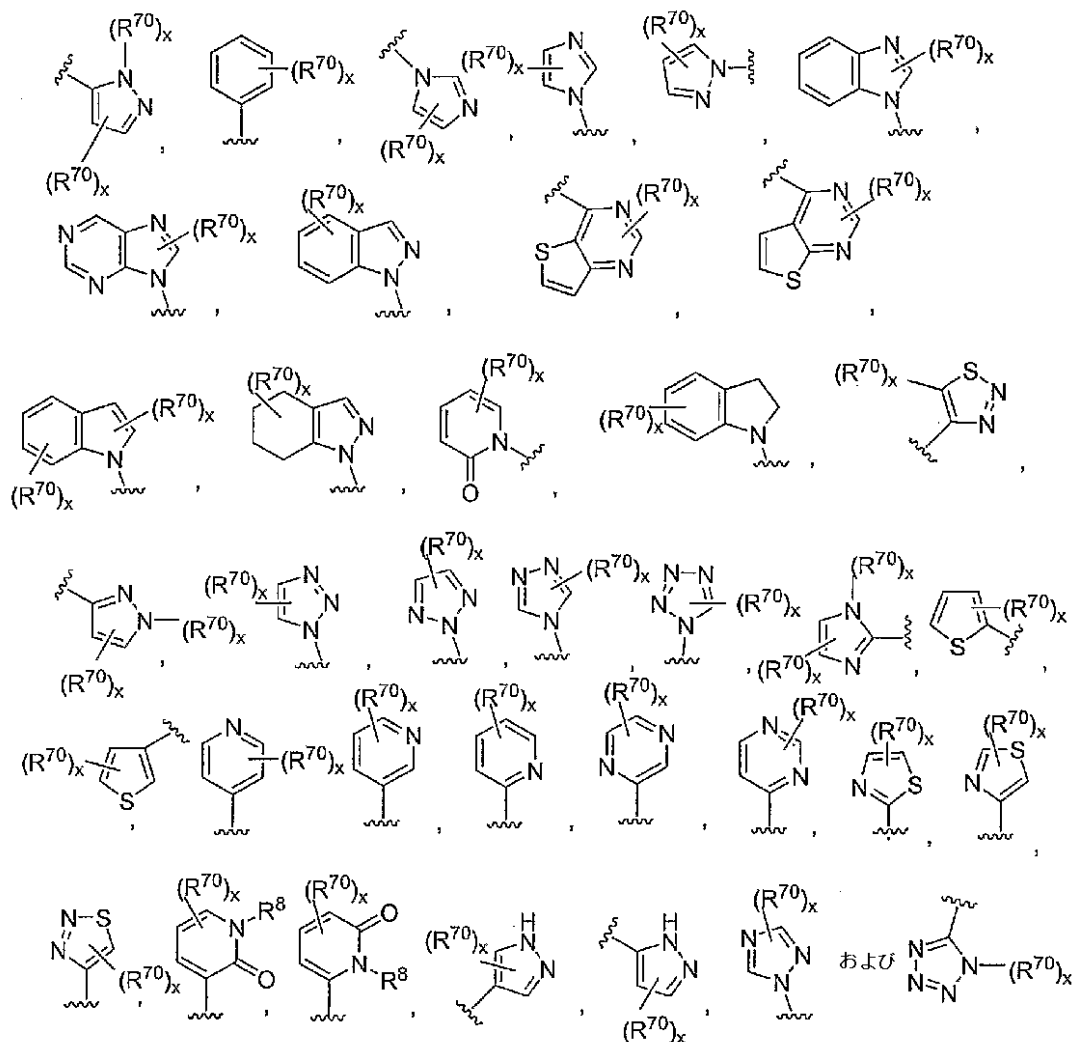
$W$  が、 $-CH_2-$ 、 $-C(H)CH_3-$ 、 $-C(CH_3)_2-$  からなる群から選択され、



【請求項 53】

【請求項 54】

【化 2 0】



【請求項 55】

X が、フェニル、ピペリジニル、ピリジニル、チエニル、チアゾリル、オキサゾリルおよびピラゾリルからなる群から選択される； Y が、 - O - 、 - S - 、 および - N R<sup>1</sup> - からなる群から選択される；そして Z が、以下からなる群から選択される、請求項 4 7 に記載の化合物：



Chemical structures representing various heterocyclic systems, including pyridine, imidazole, triazole, selenazole, thiazole, furan, pyrrole, indole, naphthalene, and their derivatives, substituted with  $(R^{70})_x$  groups.

W が、 $-(CR^1R^2)_n-$  であり、ここで、n が、1 または 2 である；X が、フェニル、ピペリジニル、ピリジニル、チエニル、チアゾリル、オキサゾリルおよびピラゾリルからなる群から選択される；Y が、共有結合であり、そして Z が、以下からなる群から選択される、請求項 47 に記載の化合物：



Chemical structures representing various substituted heterocyclic compounds, including pyrazoles, imidazoles, triazoles, tetrazoles, and fused ring systems, with substituents  $(R^{70})_x$  and  $R^8$ .

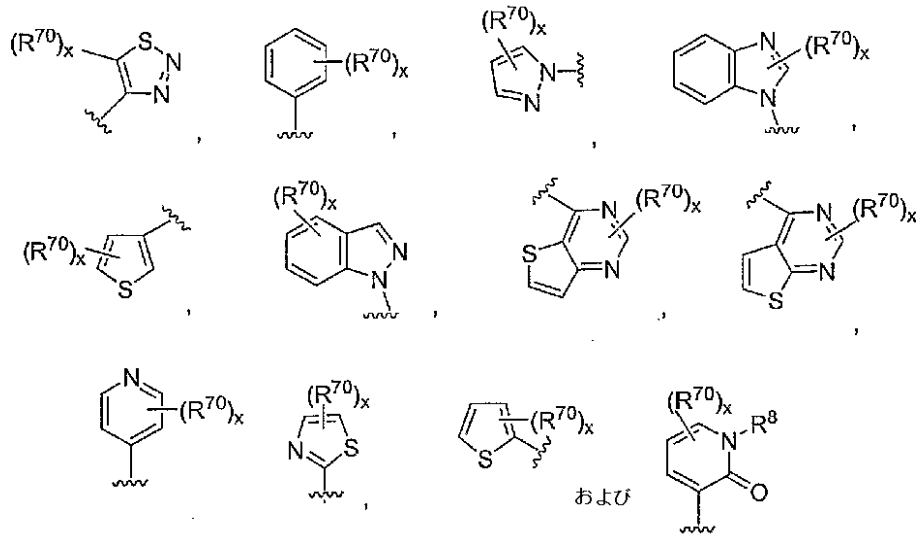
Z が、以下からなる群から選択される、請求項 53 に記載の化合物：

[illegible]

Z が、以下からなる群から選択される、請求項 54 に記載の化合物：



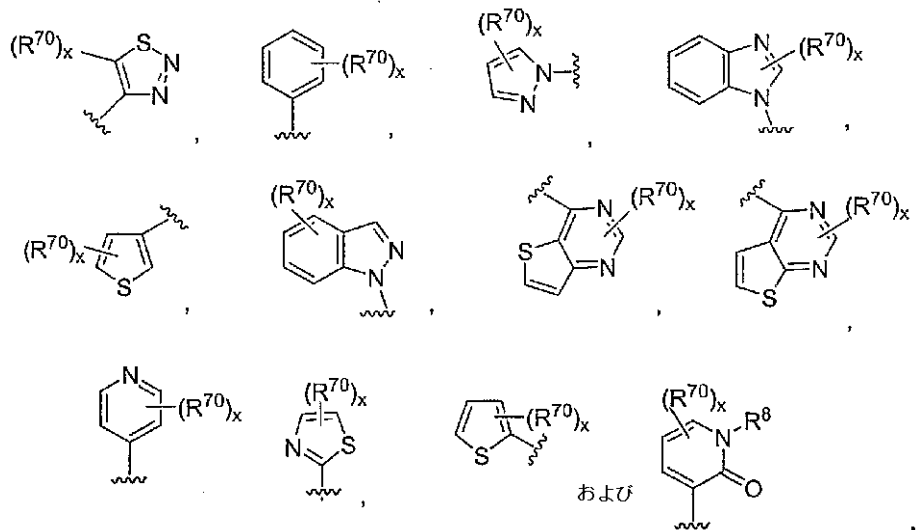
## 【化 2 4】



## 【請求項 5 9】

Z が、以下からなる群から選択される、請求項 5 5 に記載の化合物：

## 【化 2 5】

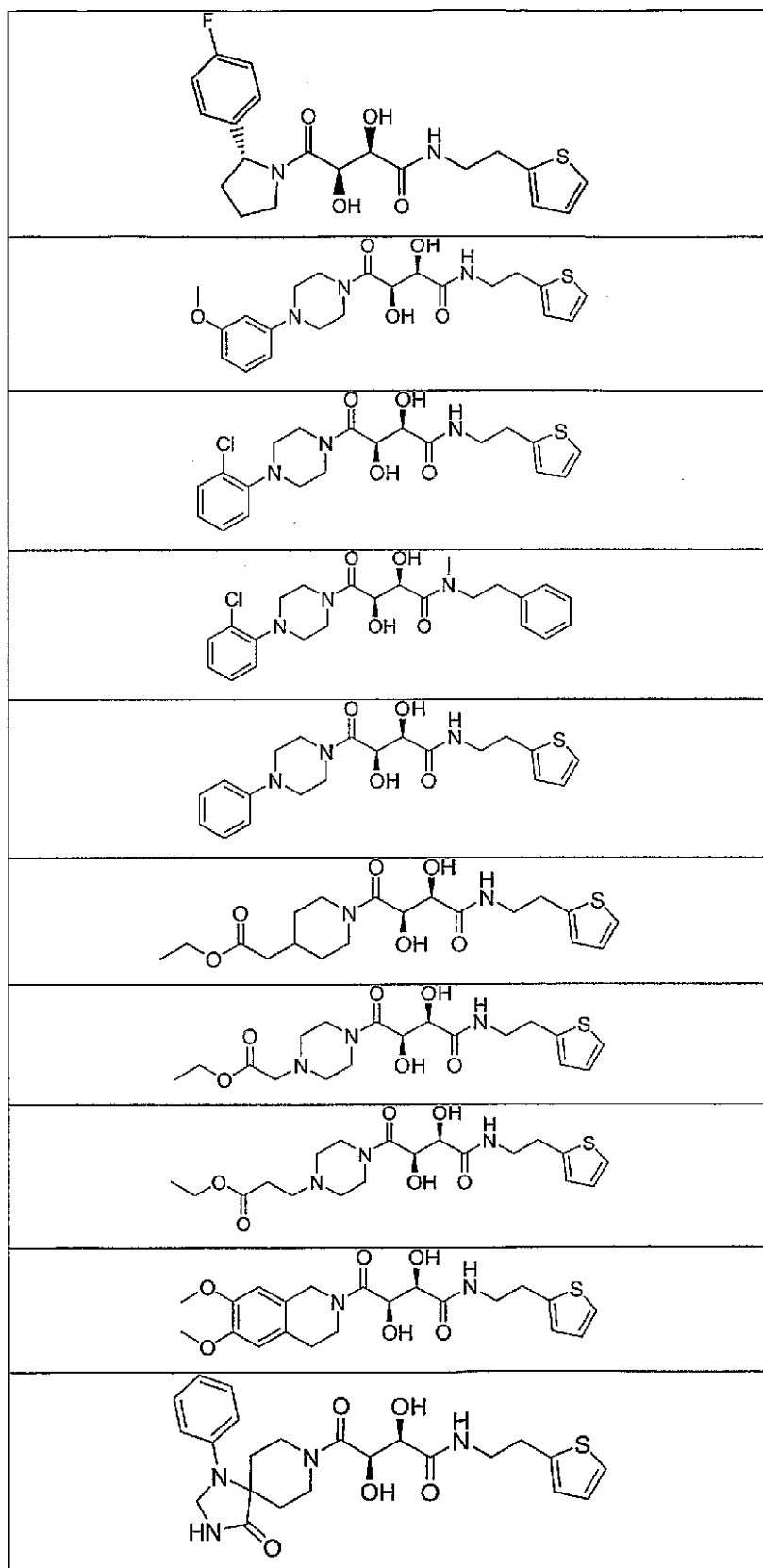


## 【請求項 6 0】

TACE、TNF-、MMPまたはそれらの組み合わせの阻害活性を示す化合物（該化合物の鏡像異性体、立体異性体および互変異性体を含めて）、および該化合物の薬学的に受容可能な塩または溶媒和物であって、該化合物は、以下で列挙された構造の化合物から選択される：



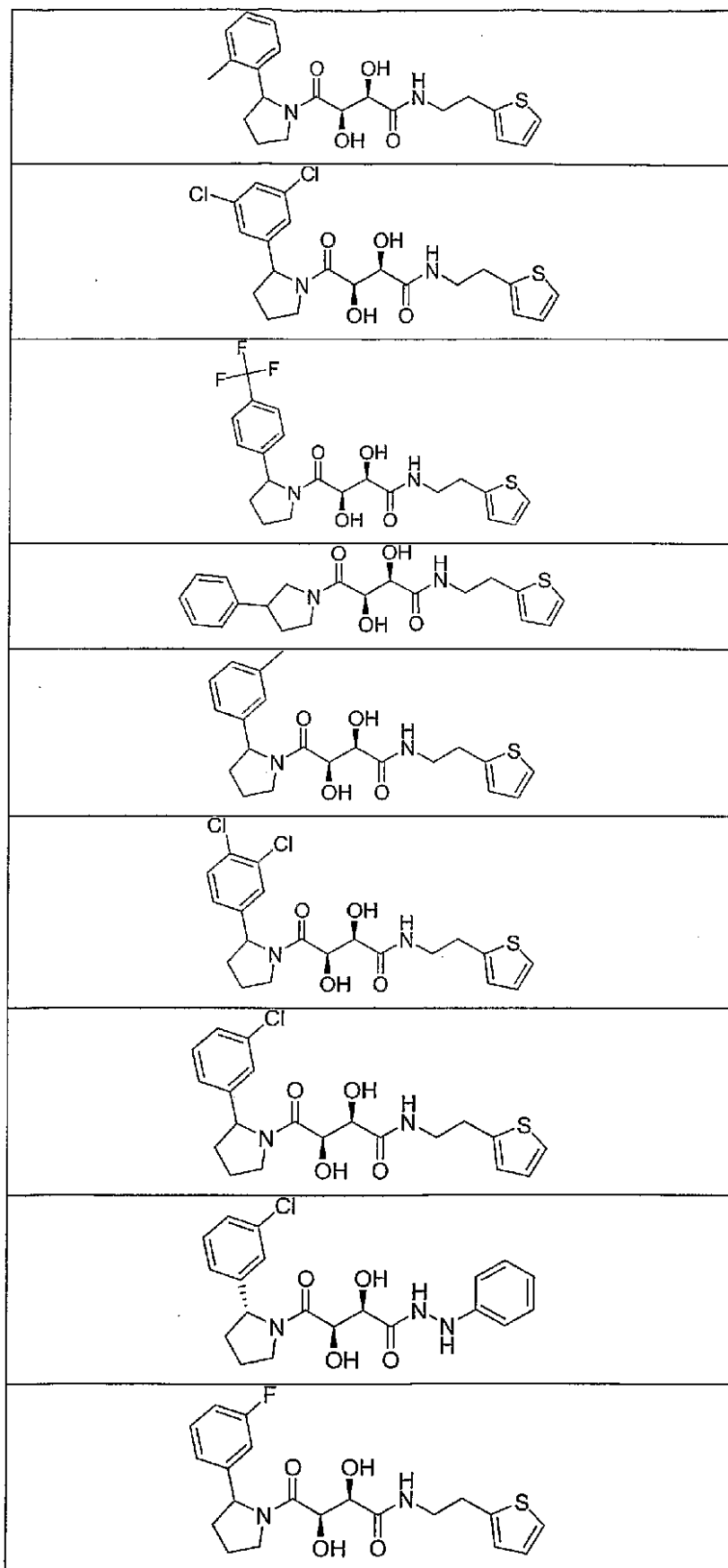
【化 2 6】



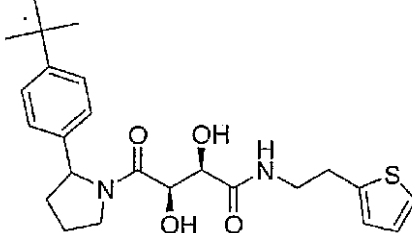
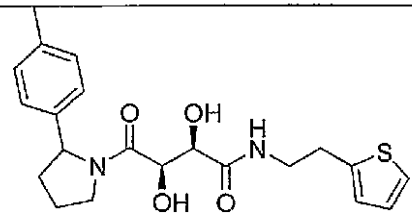
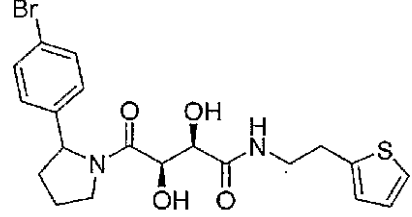
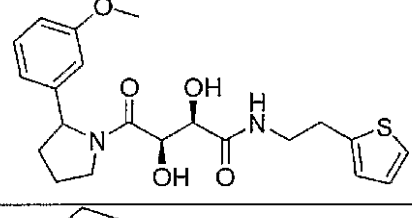
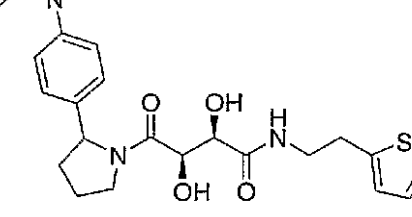
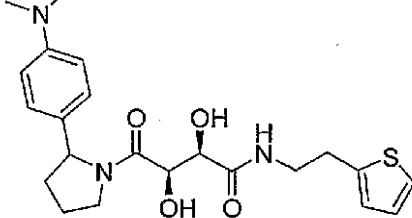
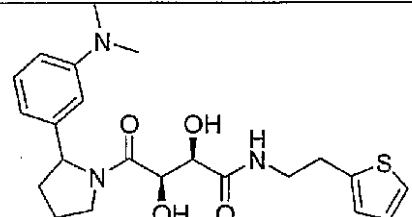





【化 2 8】

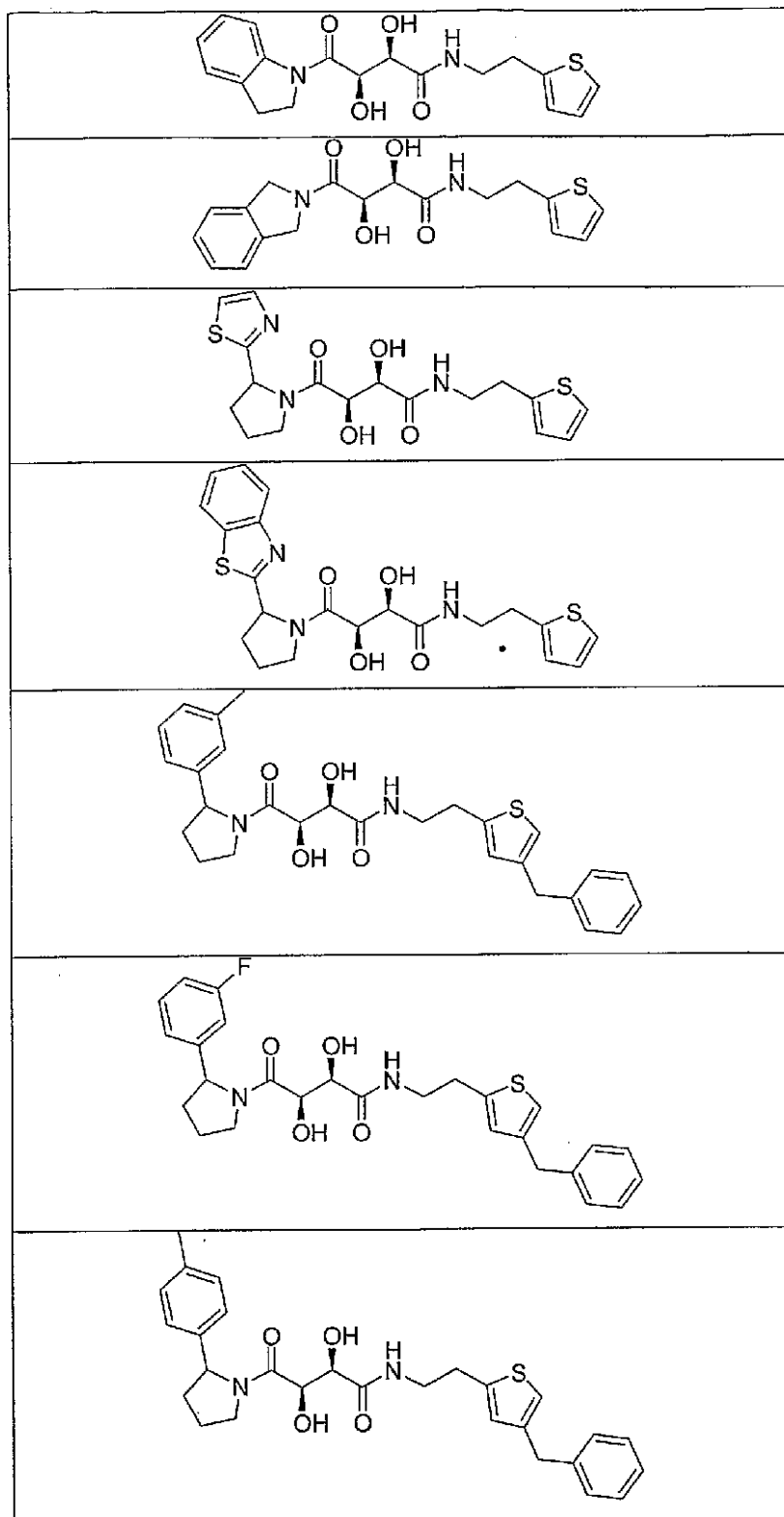




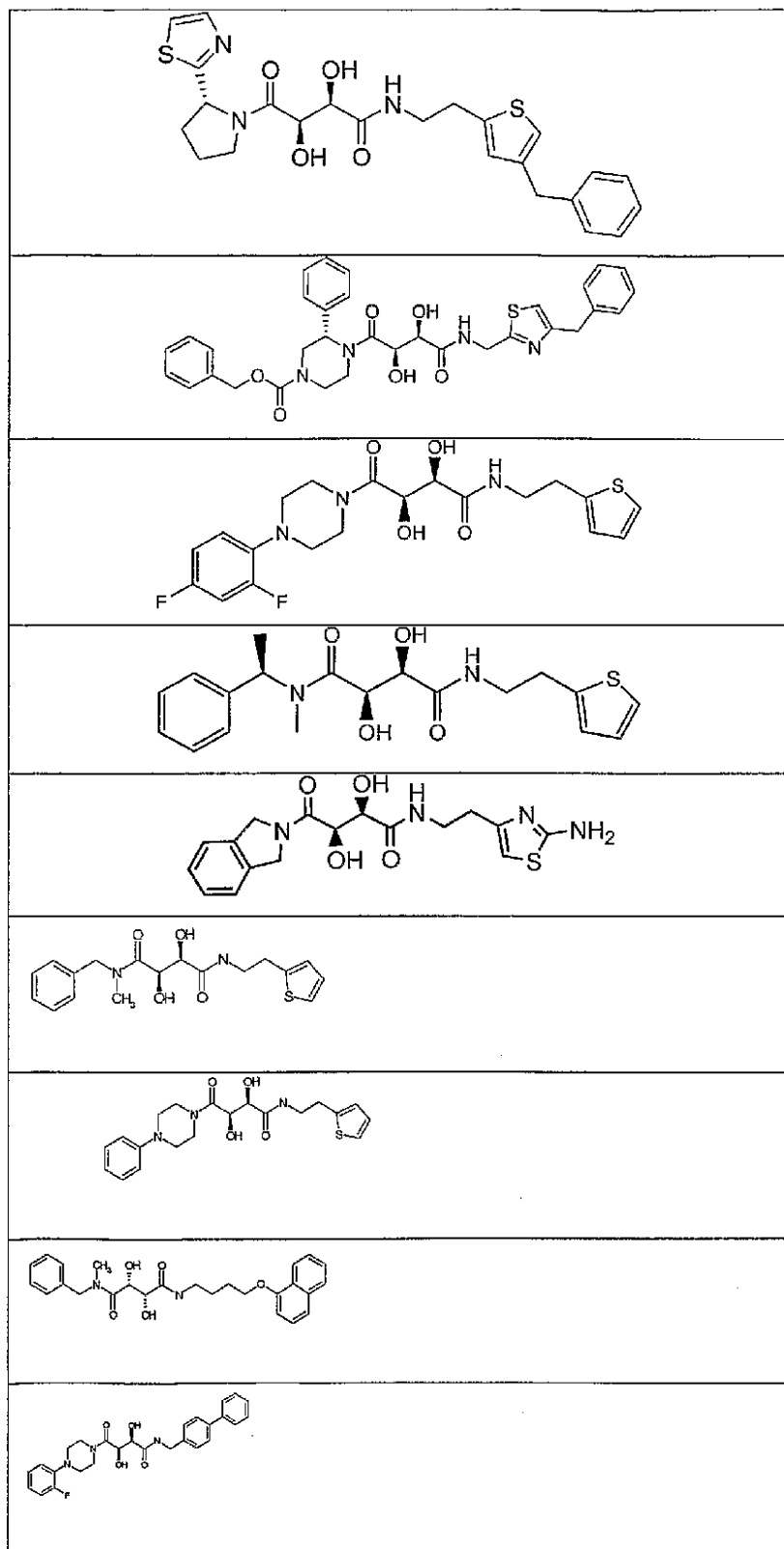


【化 3 0】



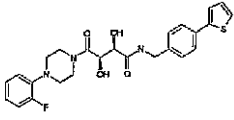
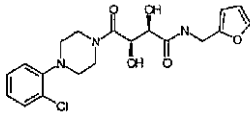
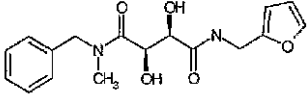
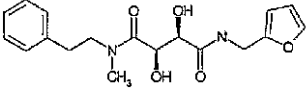
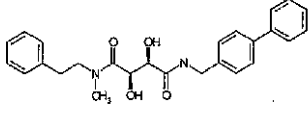
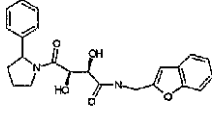
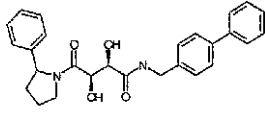
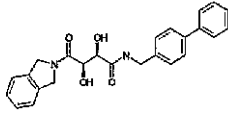
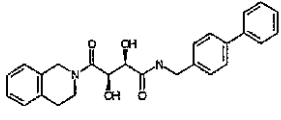


【化 3 1】



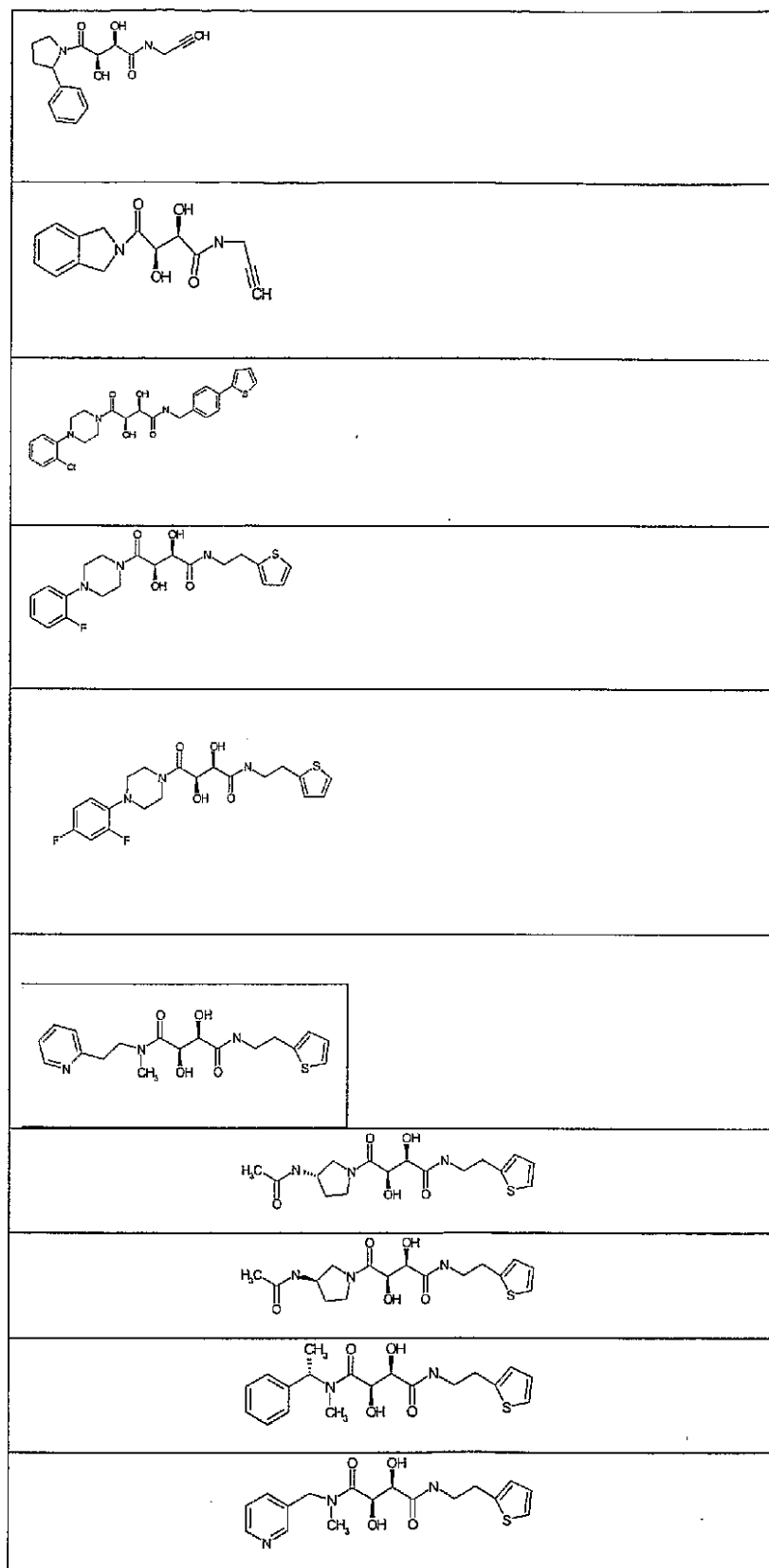


## 【化 3 2】

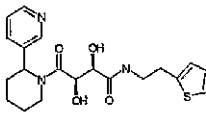
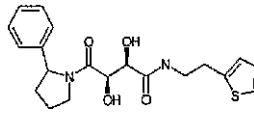
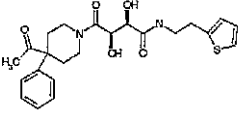
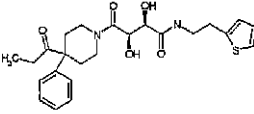
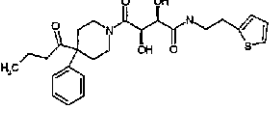
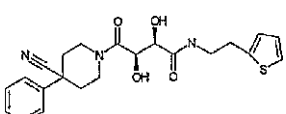
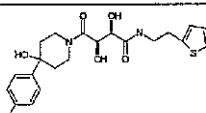
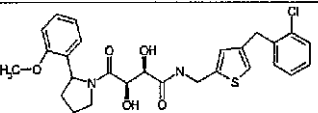
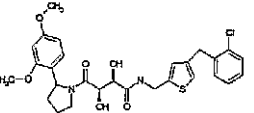


【化 3 3】



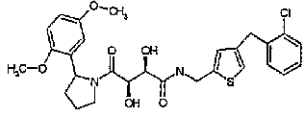
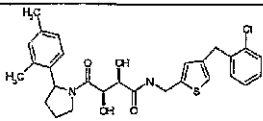
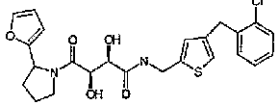
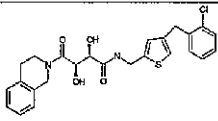
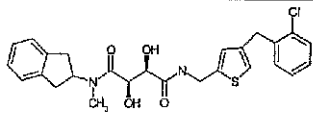
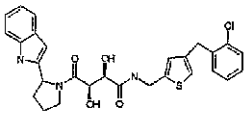
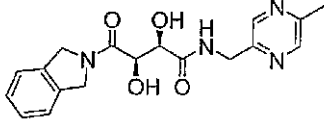
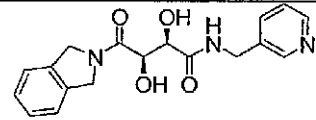
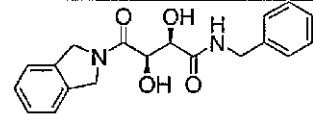
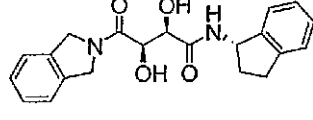
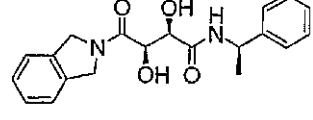


## 【化 3 4】

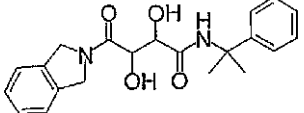
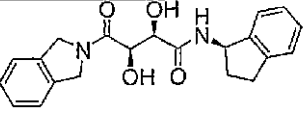
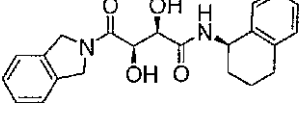
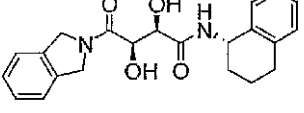
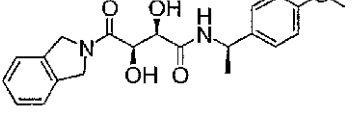
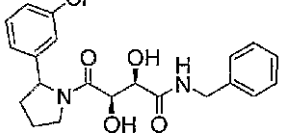
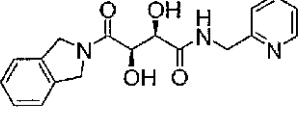
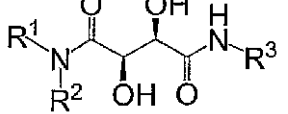
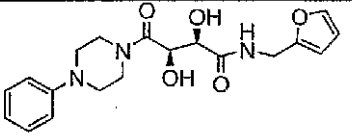
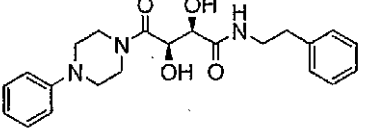
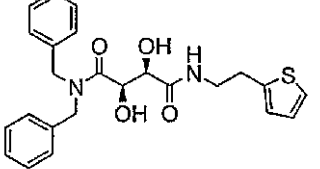


【化 3 5】

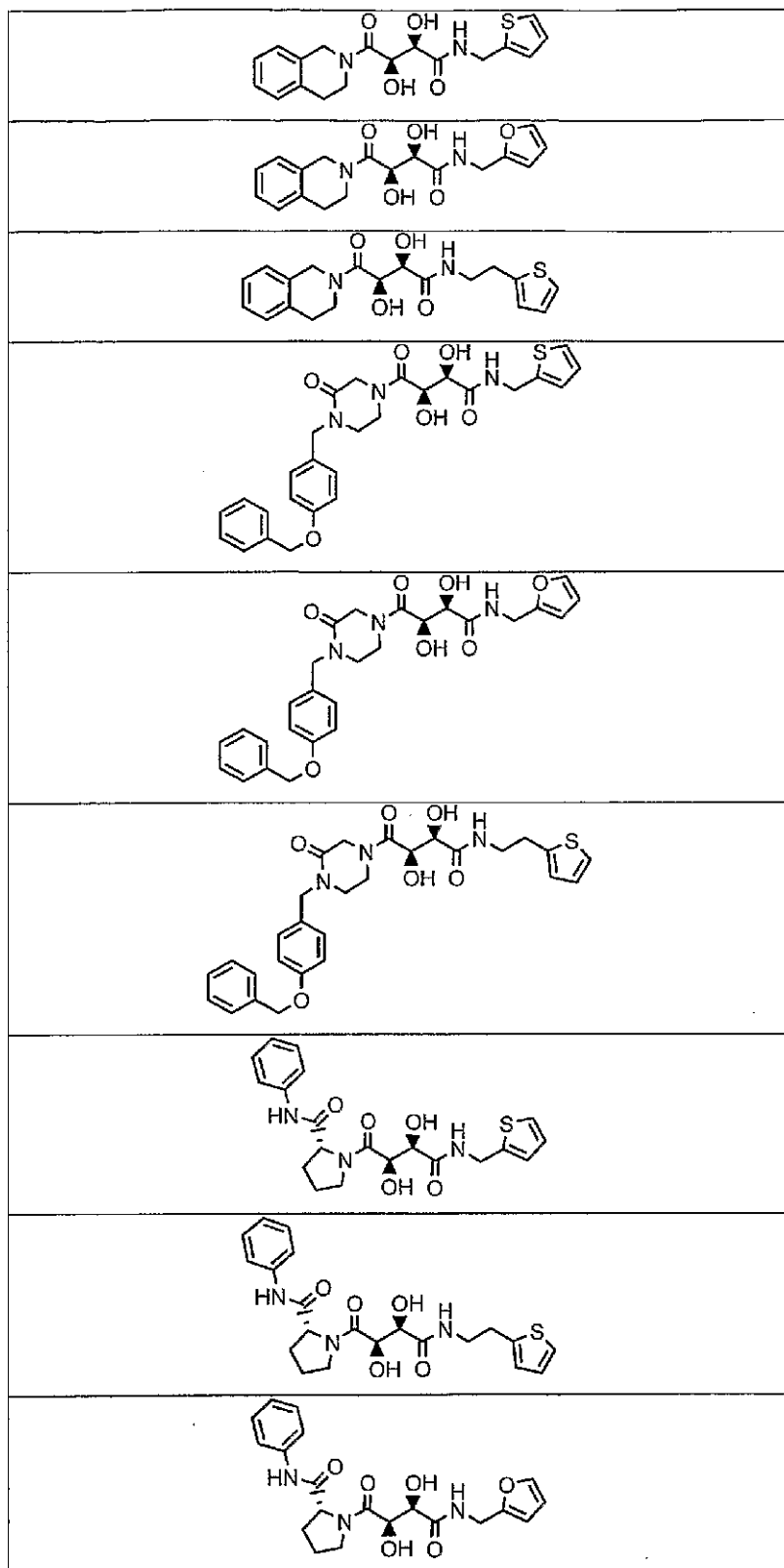


【化 3 6】








 $\begin{array}{c} \text{R}^1 \\   \\ \text{N} - \text{C}(=\text{O}) - \text{CH}(\text{OH}) - \text{CH}(\text{OH}) - \text{C}(=\text{O}) - \text{N} - \text{R}^3 \\   \\ \text{R}^2 \end{array}$ <p>(R1 = R2 = CH<sub>2</sub>Ph, R3 = CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(C<sub>4</sub>H<sub>4</sub>O))</p>




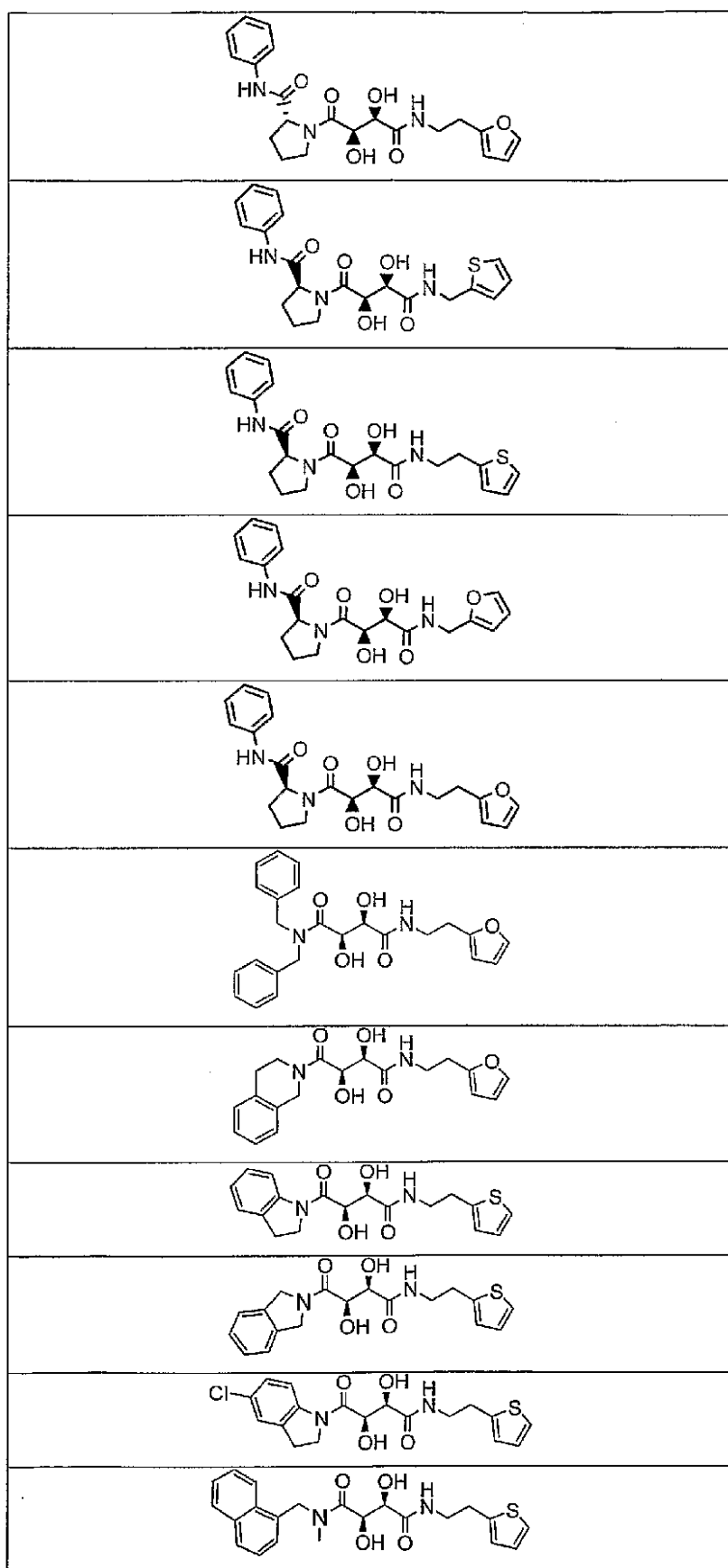


【化 3 7】



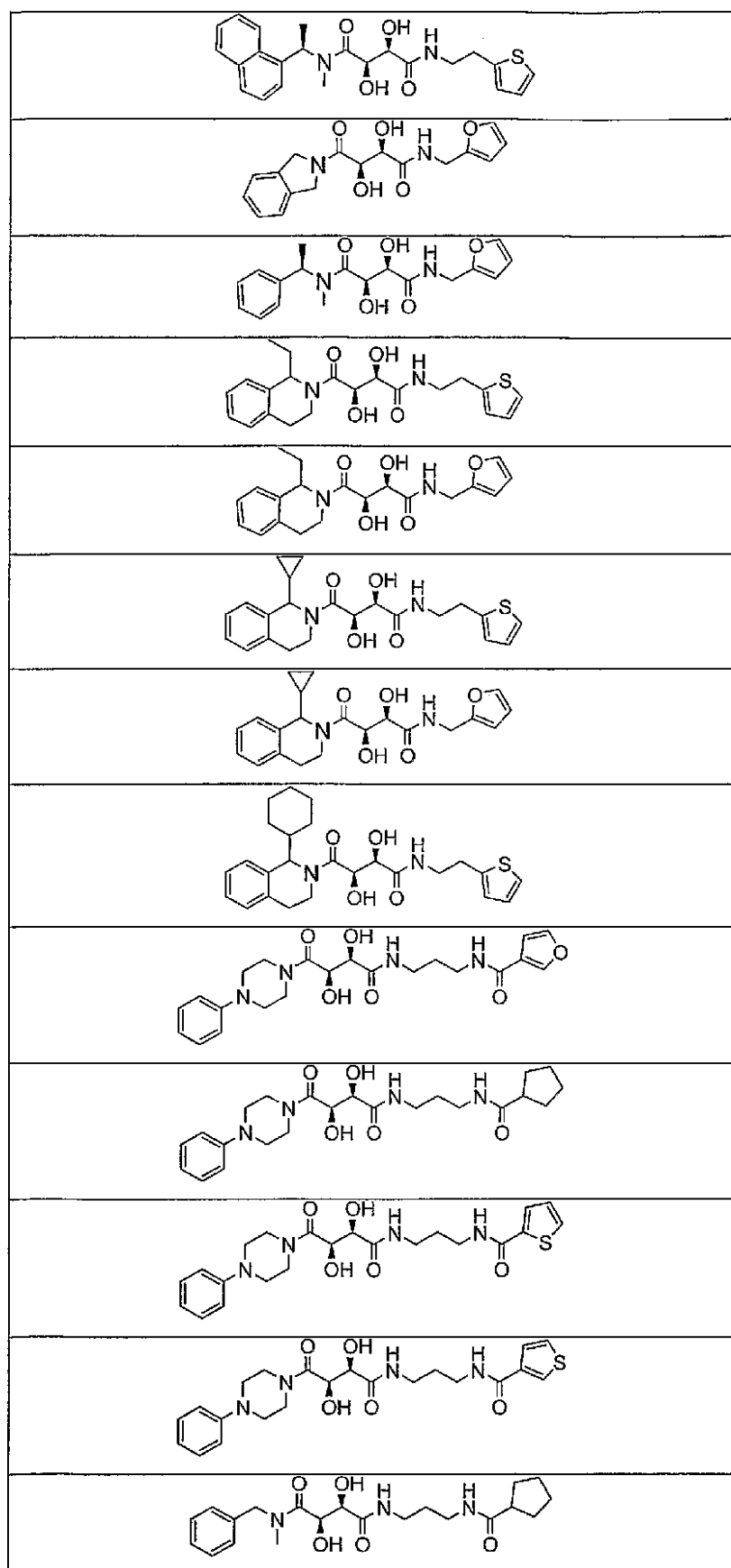


【化 3 8】



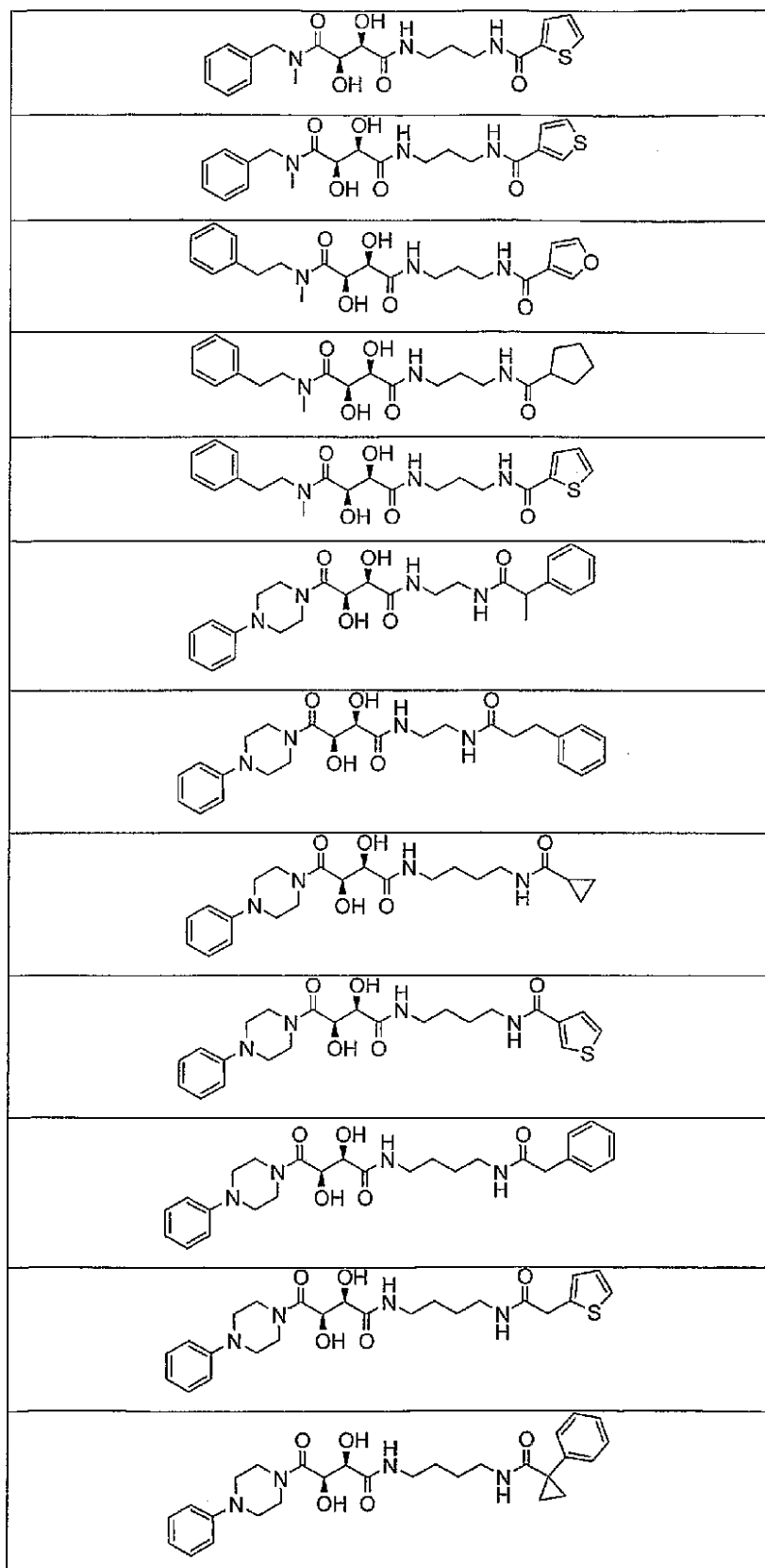


【化 3 9】



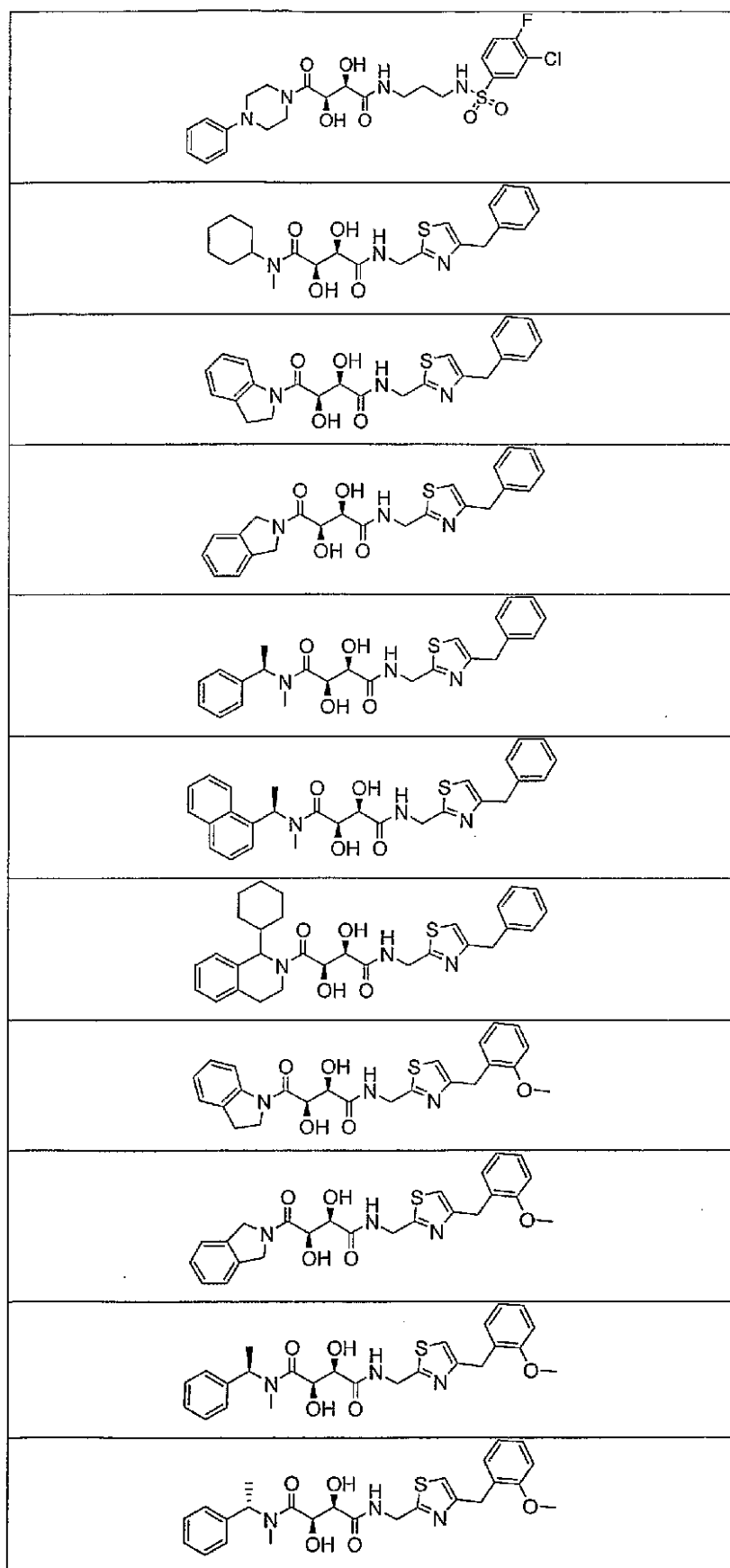


【化 4 0】



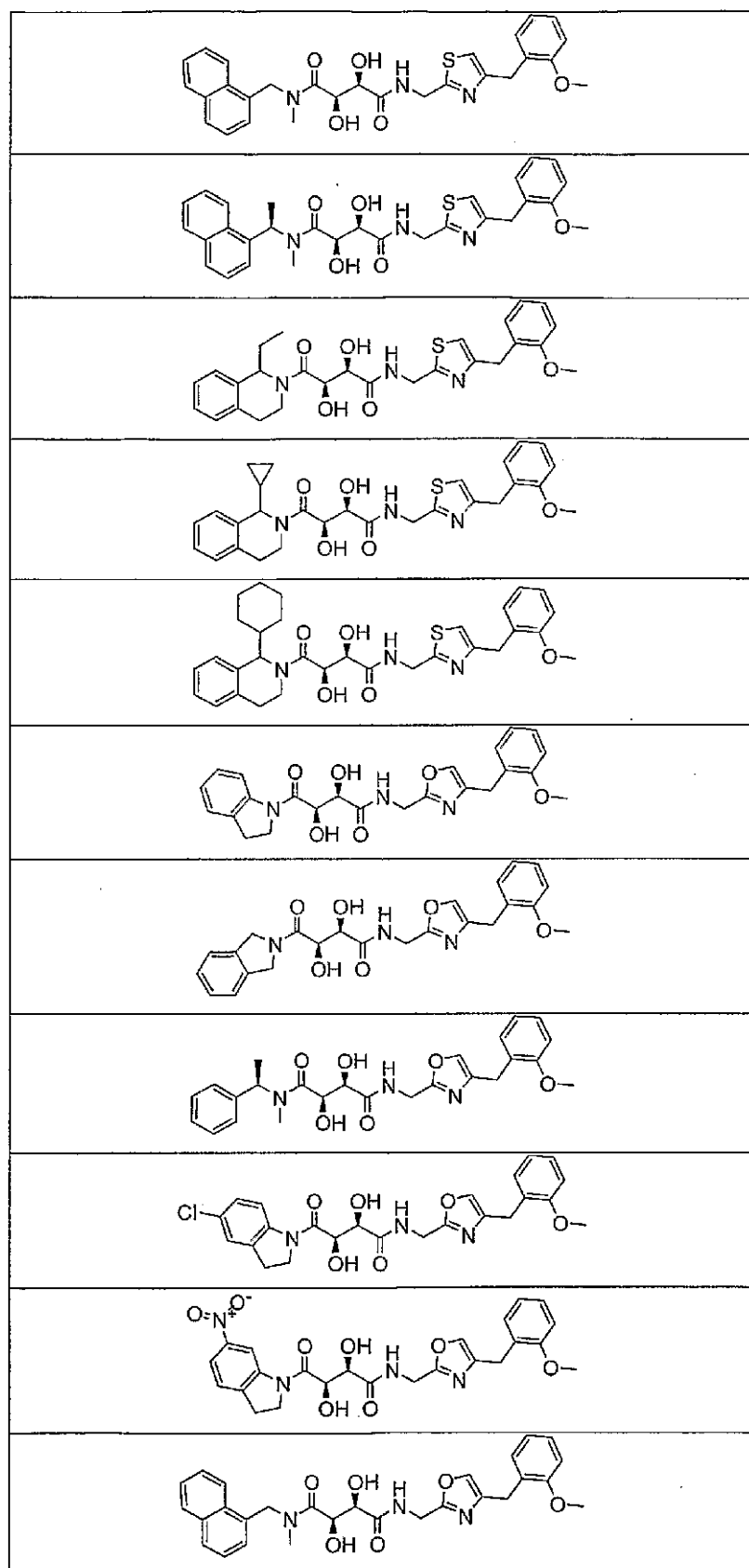


【化 4 1】



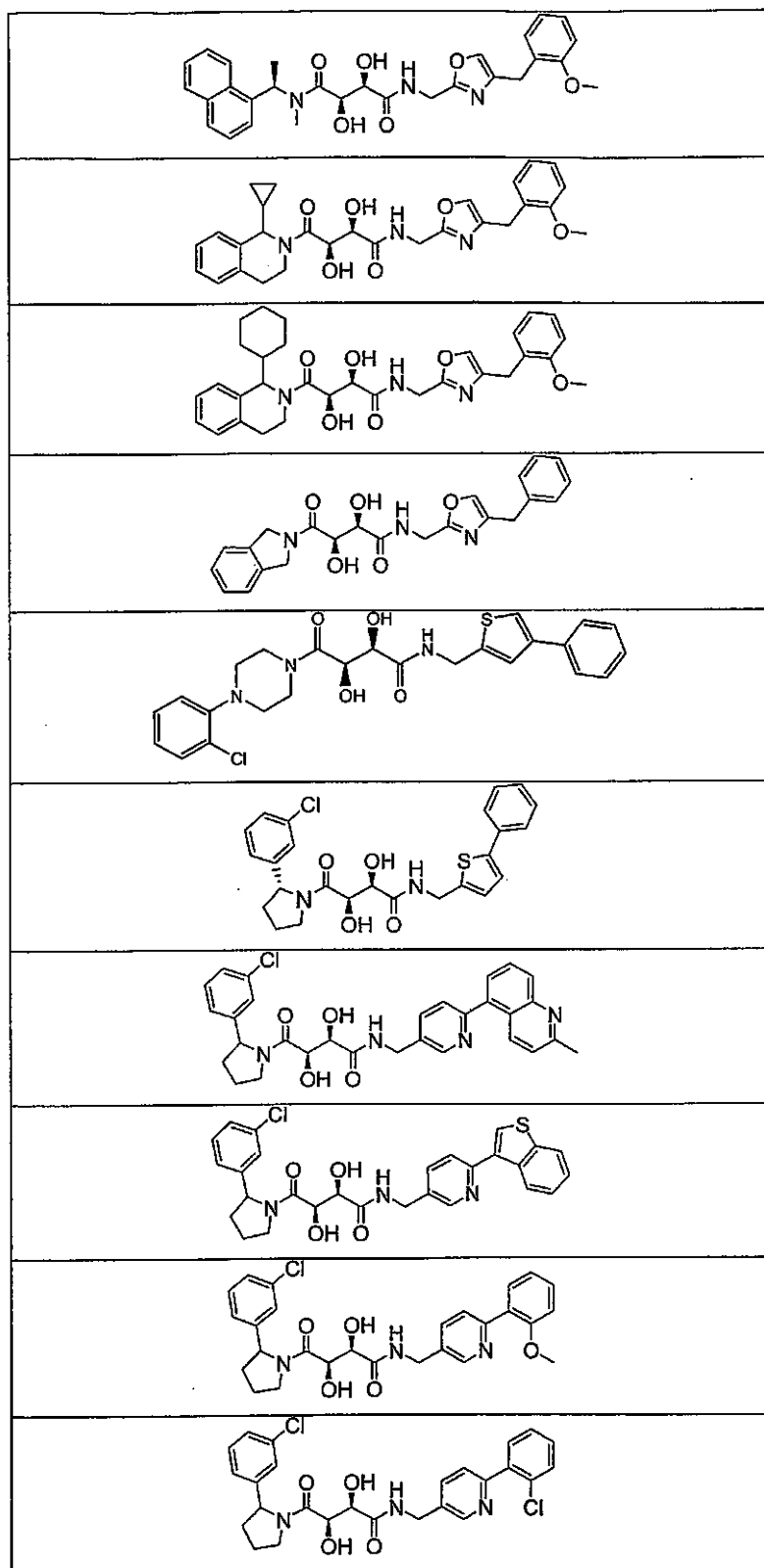


【化 4 2】



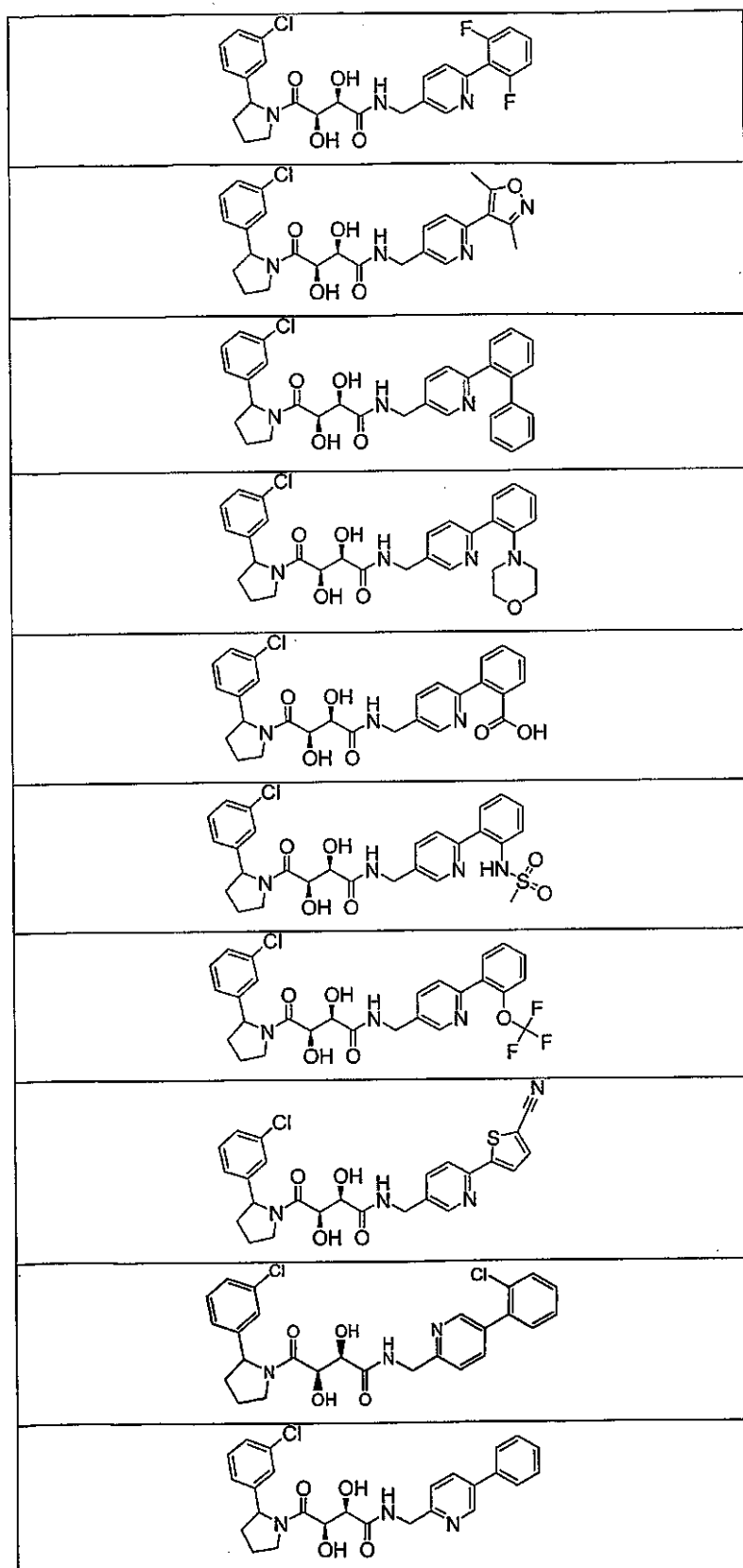


【化 4 3】



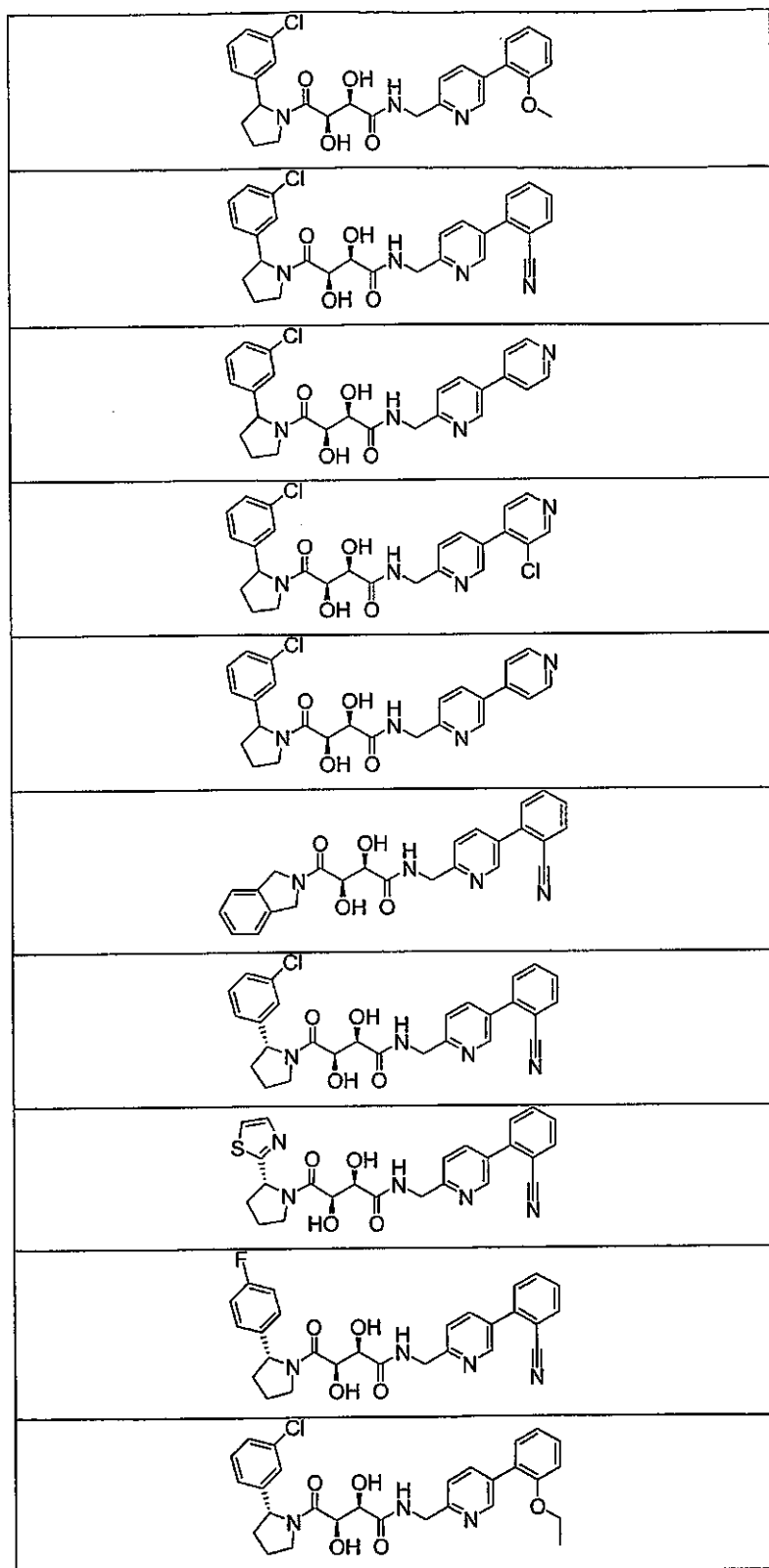


## 【化 4 4】



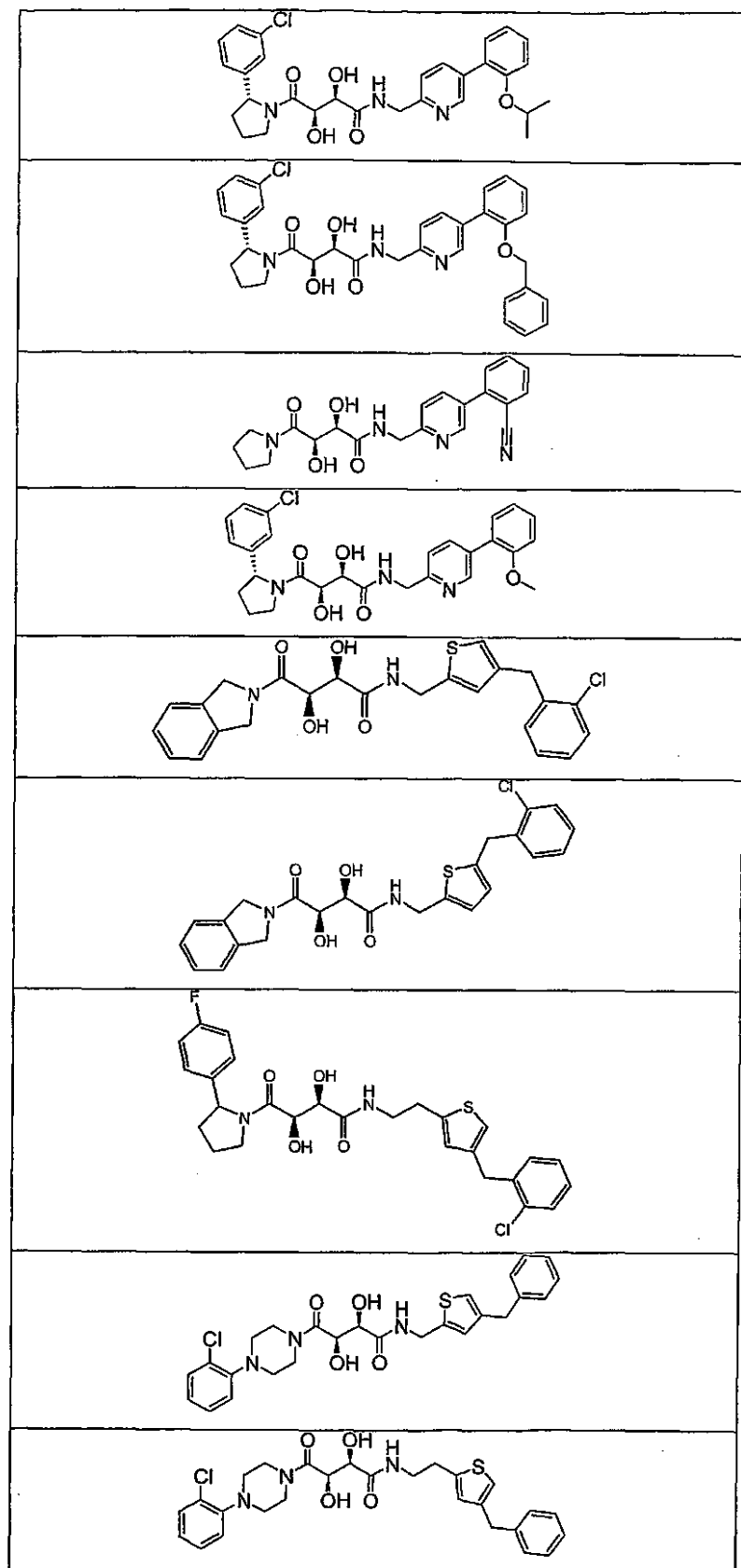


## 【化 4 5】

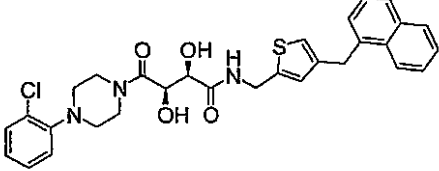
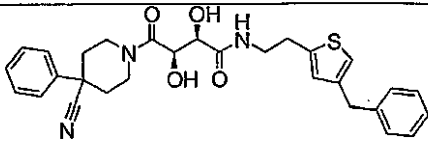
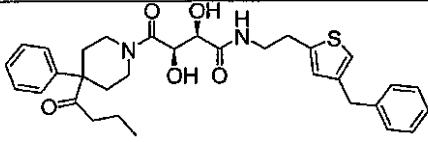
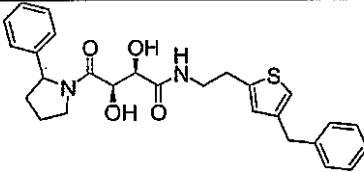
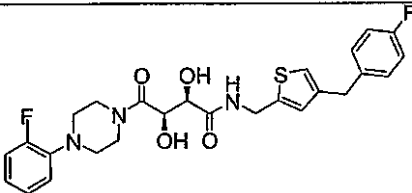
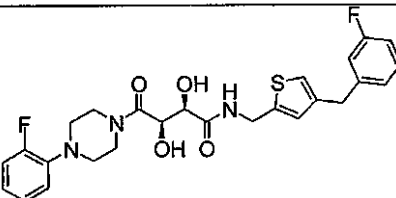
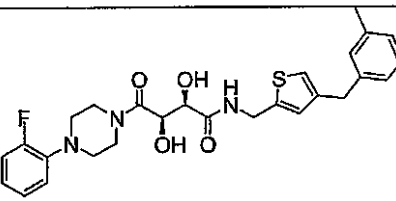
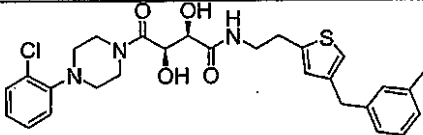




【化 4 6】

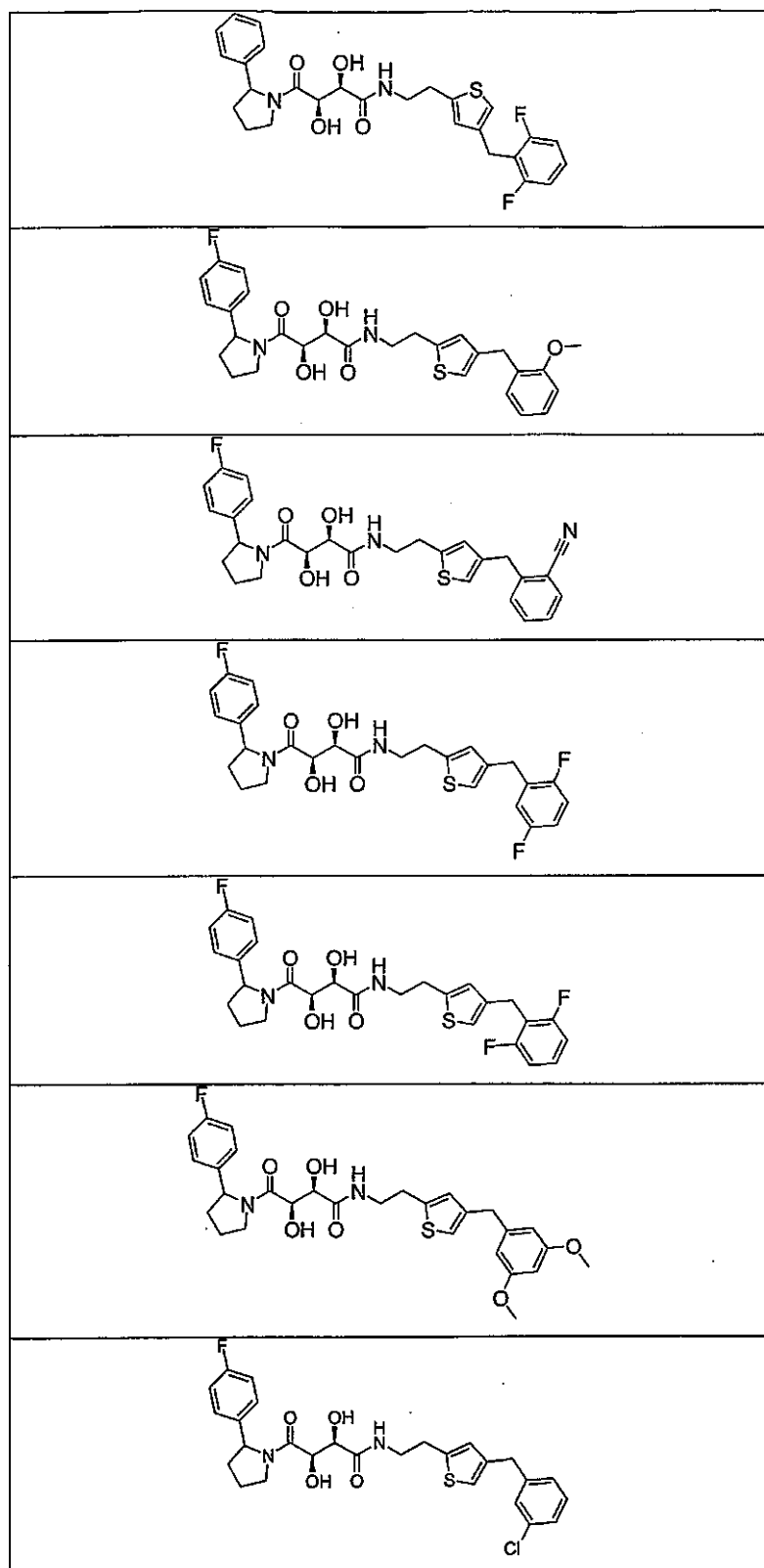




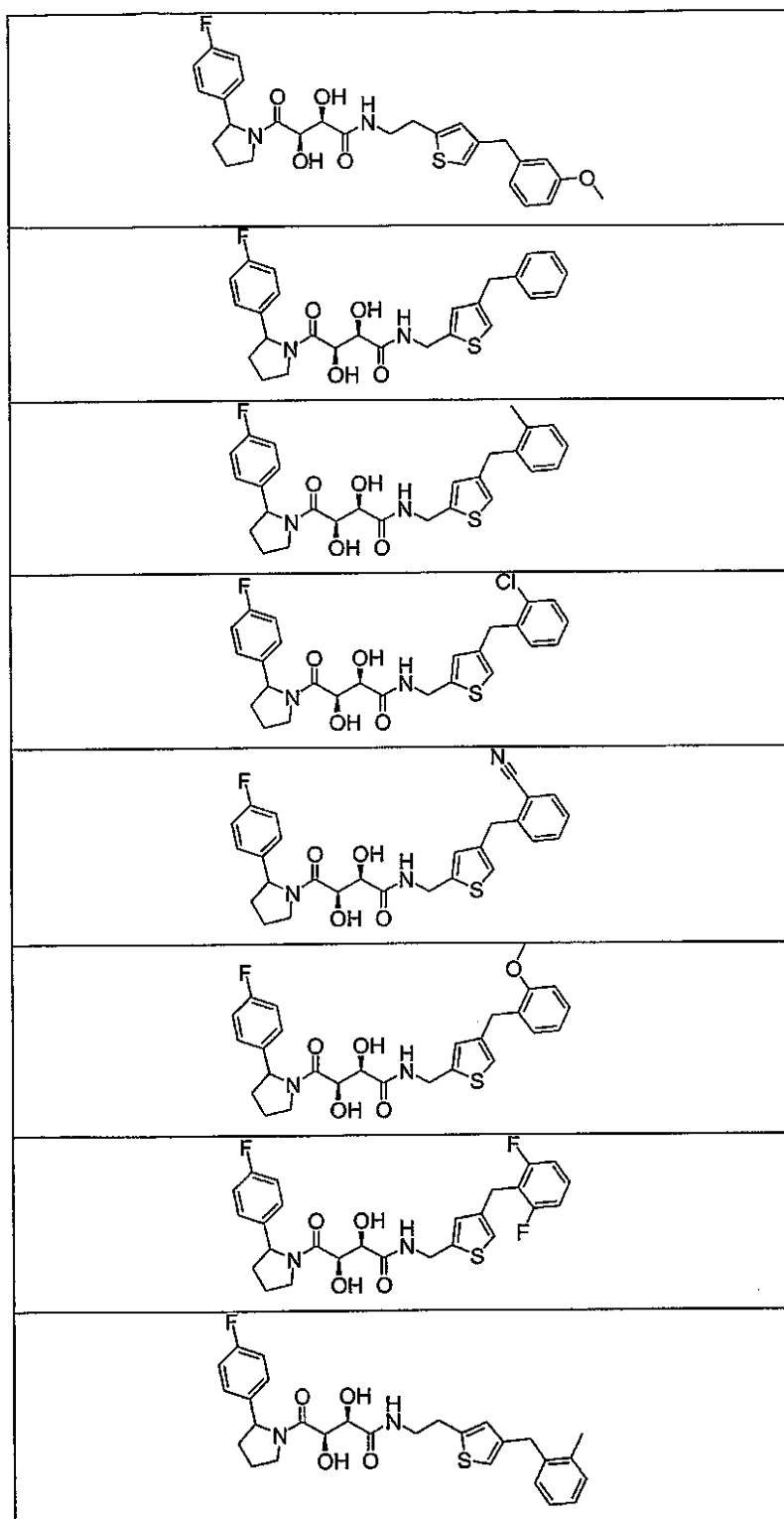


## 【化 4 8】



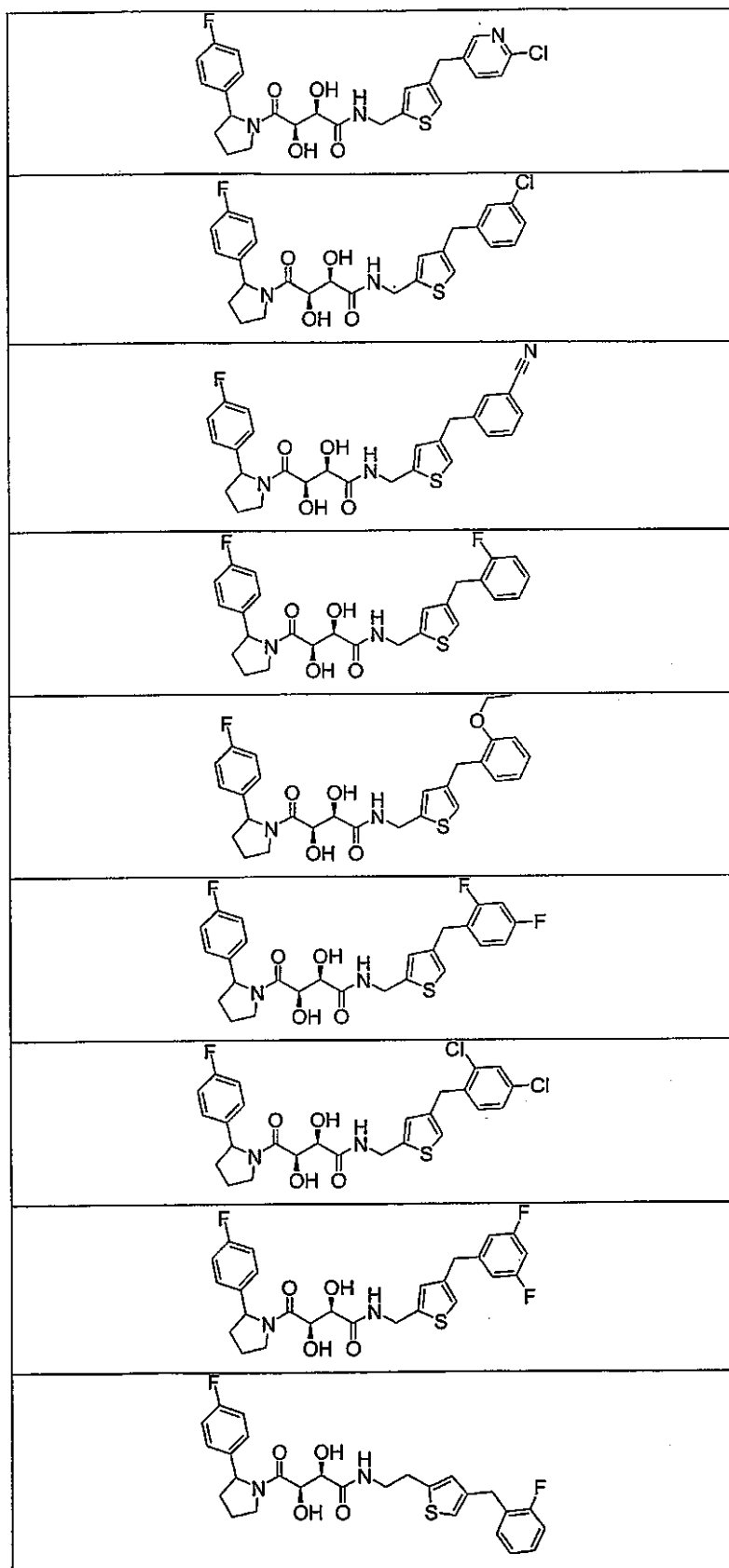


【化 4 9】



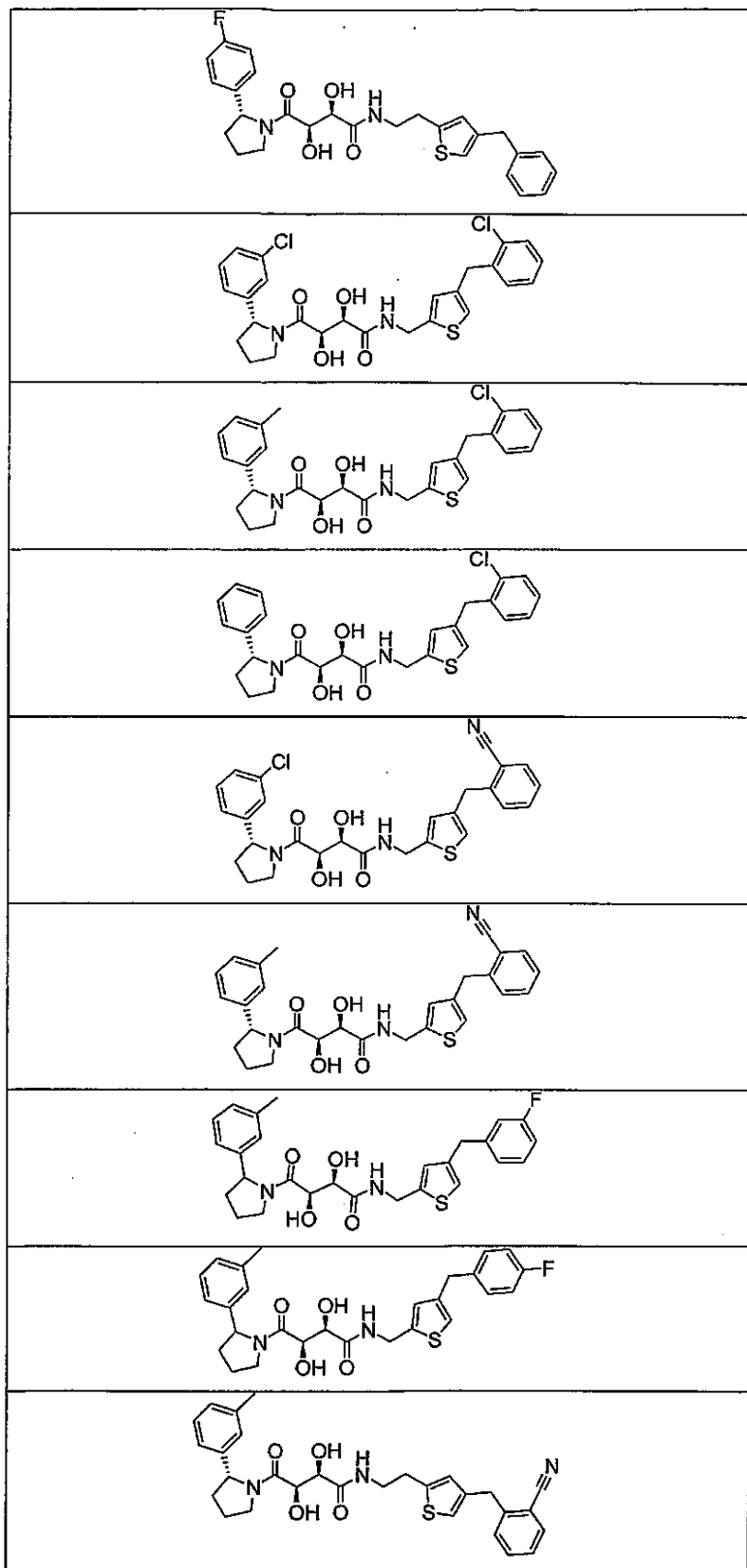


【化 5 0】



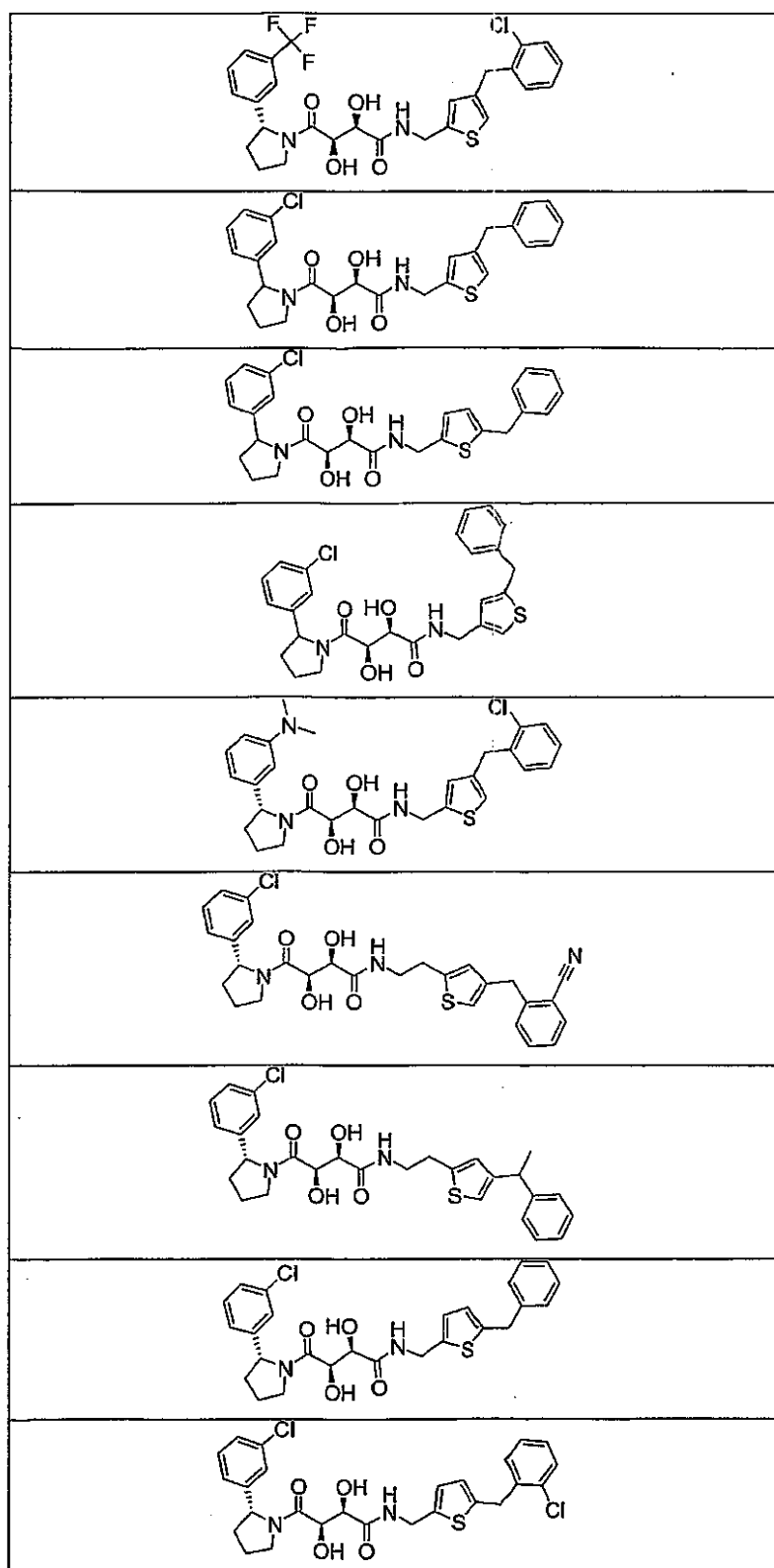


【化 5 1】



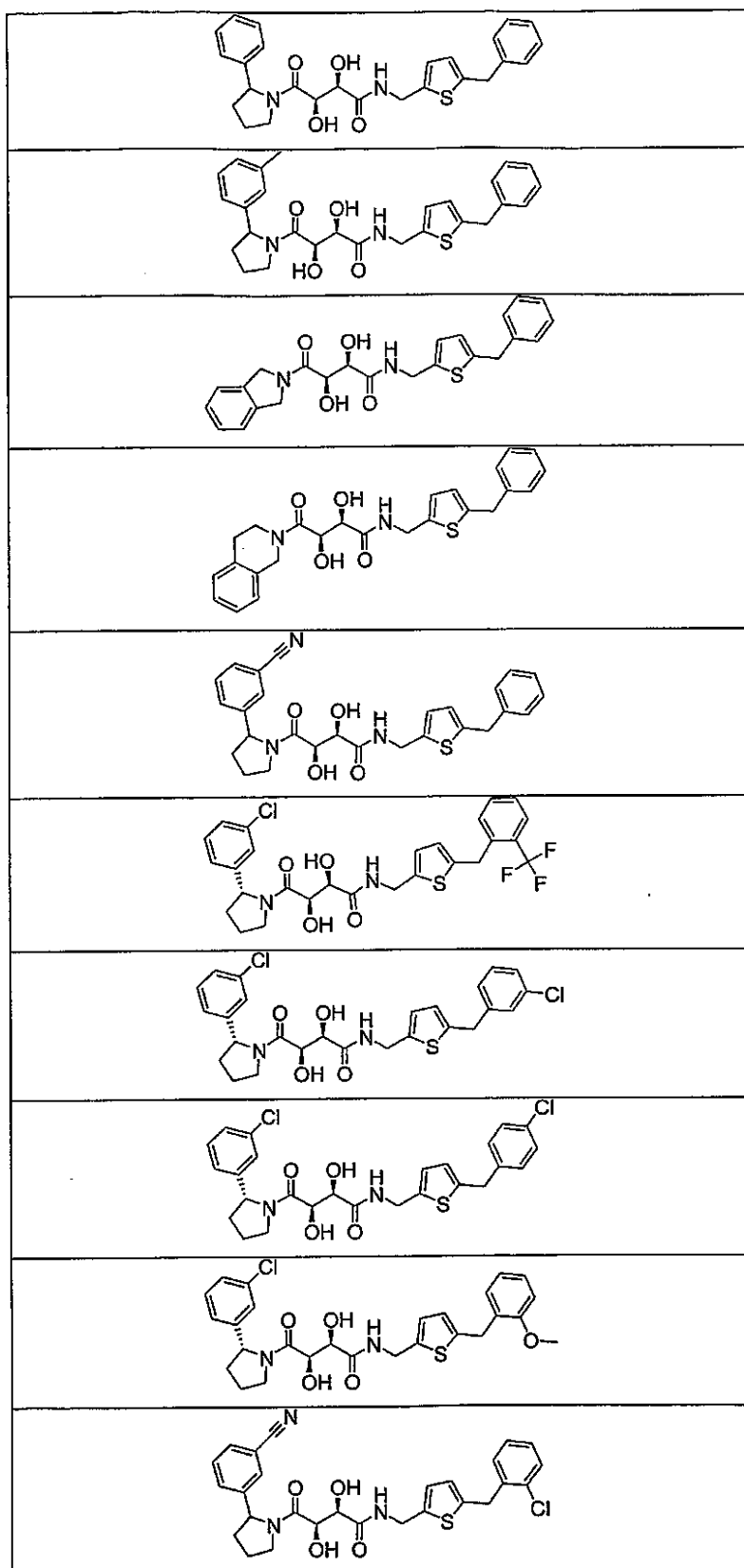


【化 5 2】



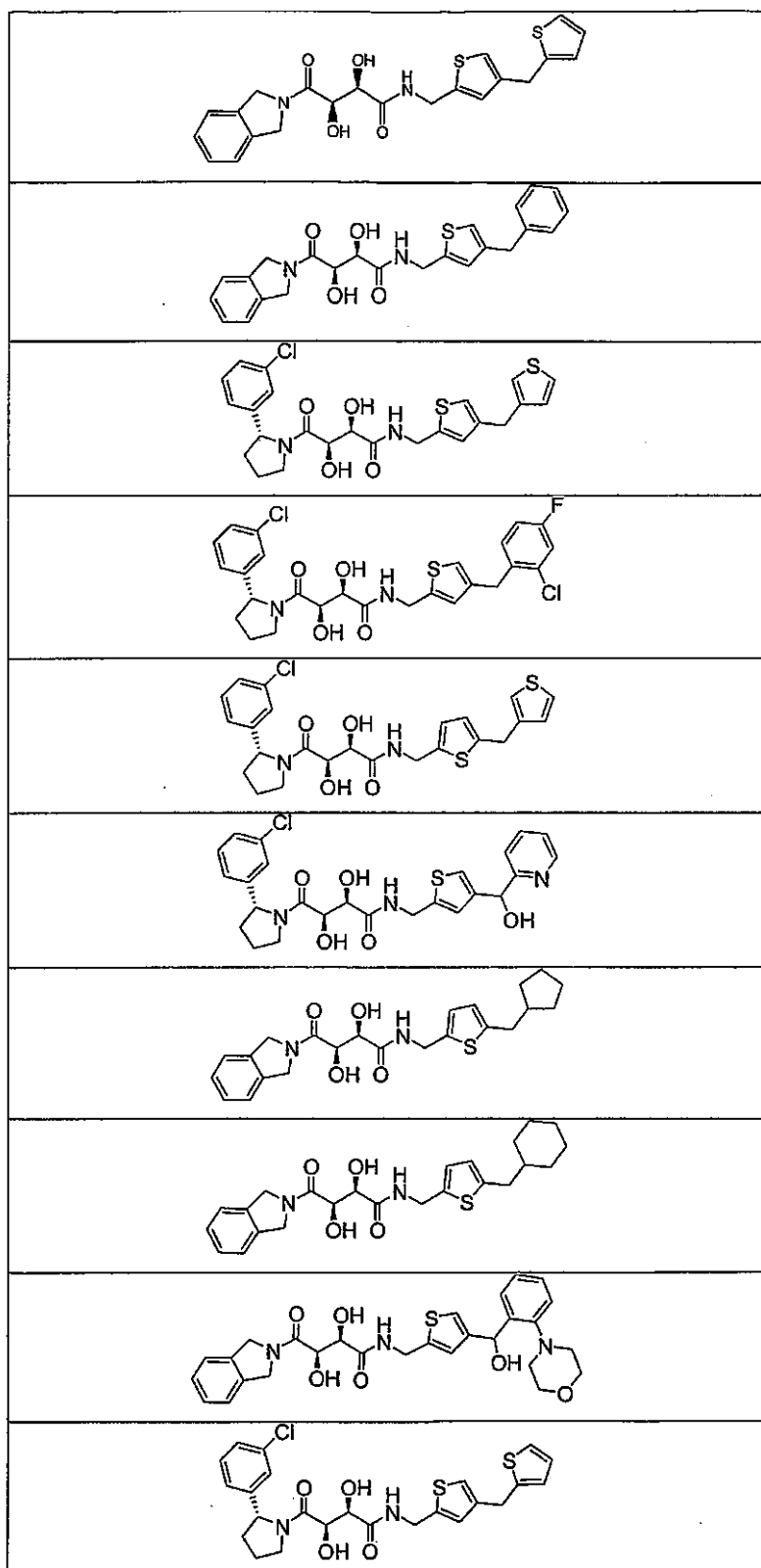


【化 5 3】



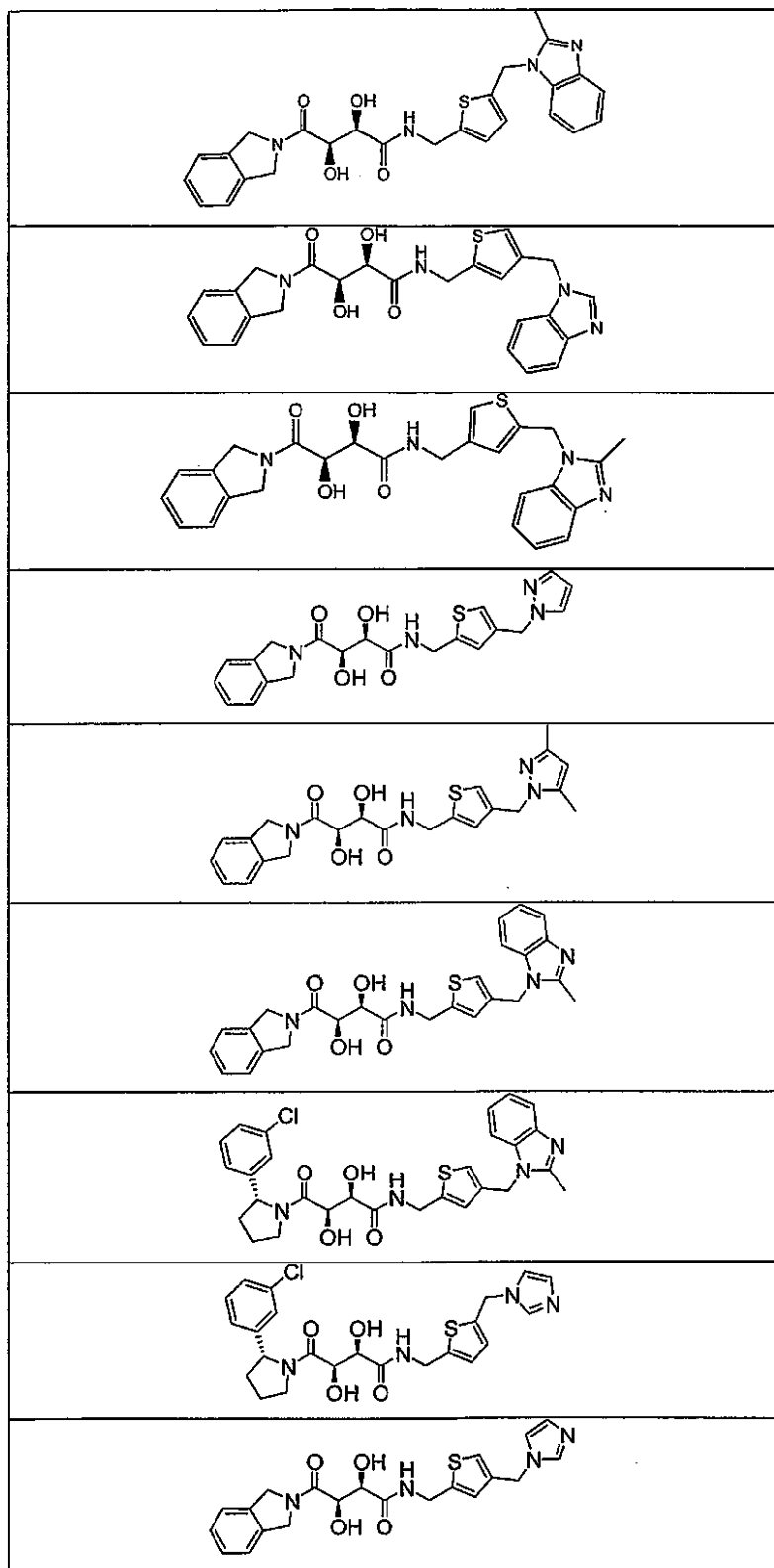


【化 5 4】



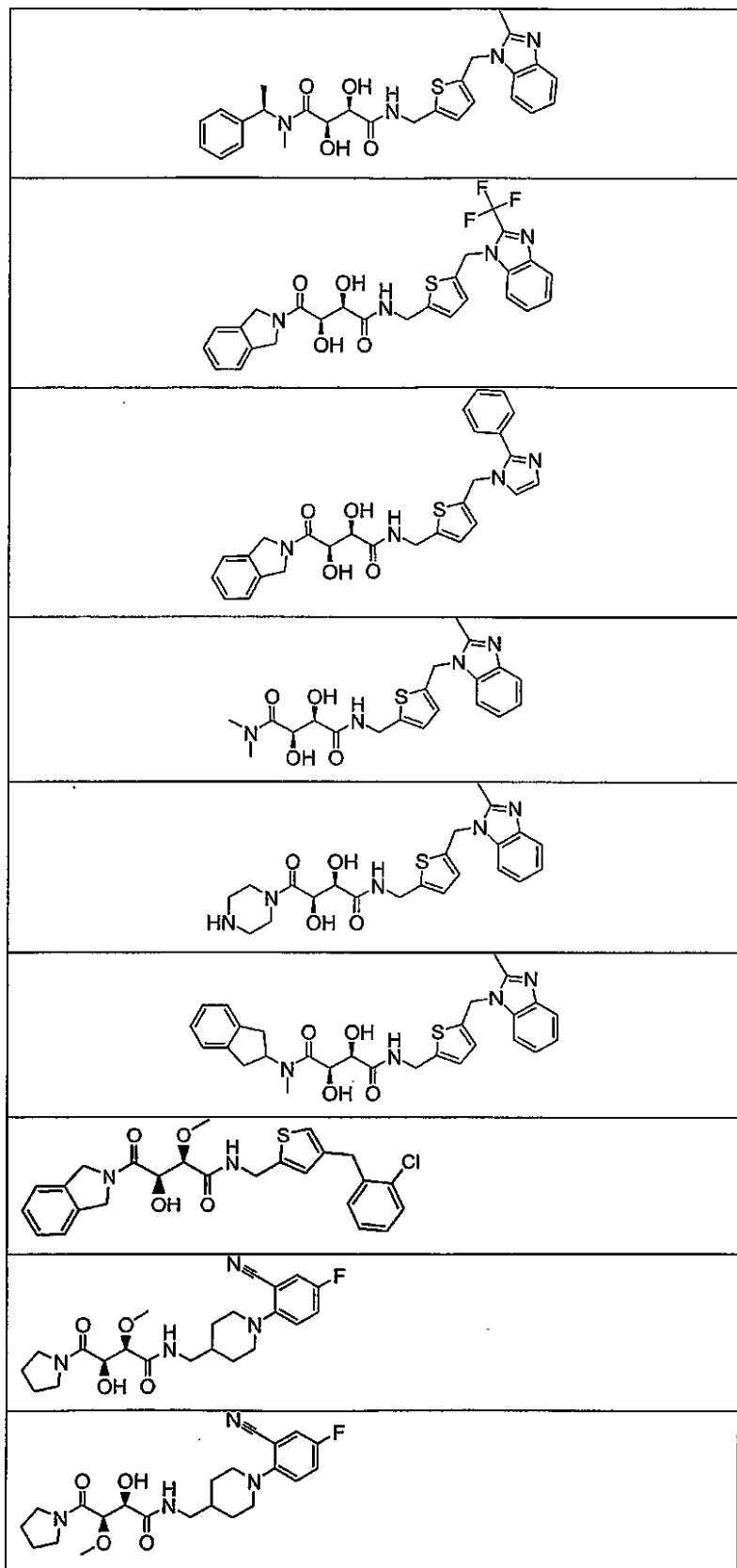


【化 5 5】



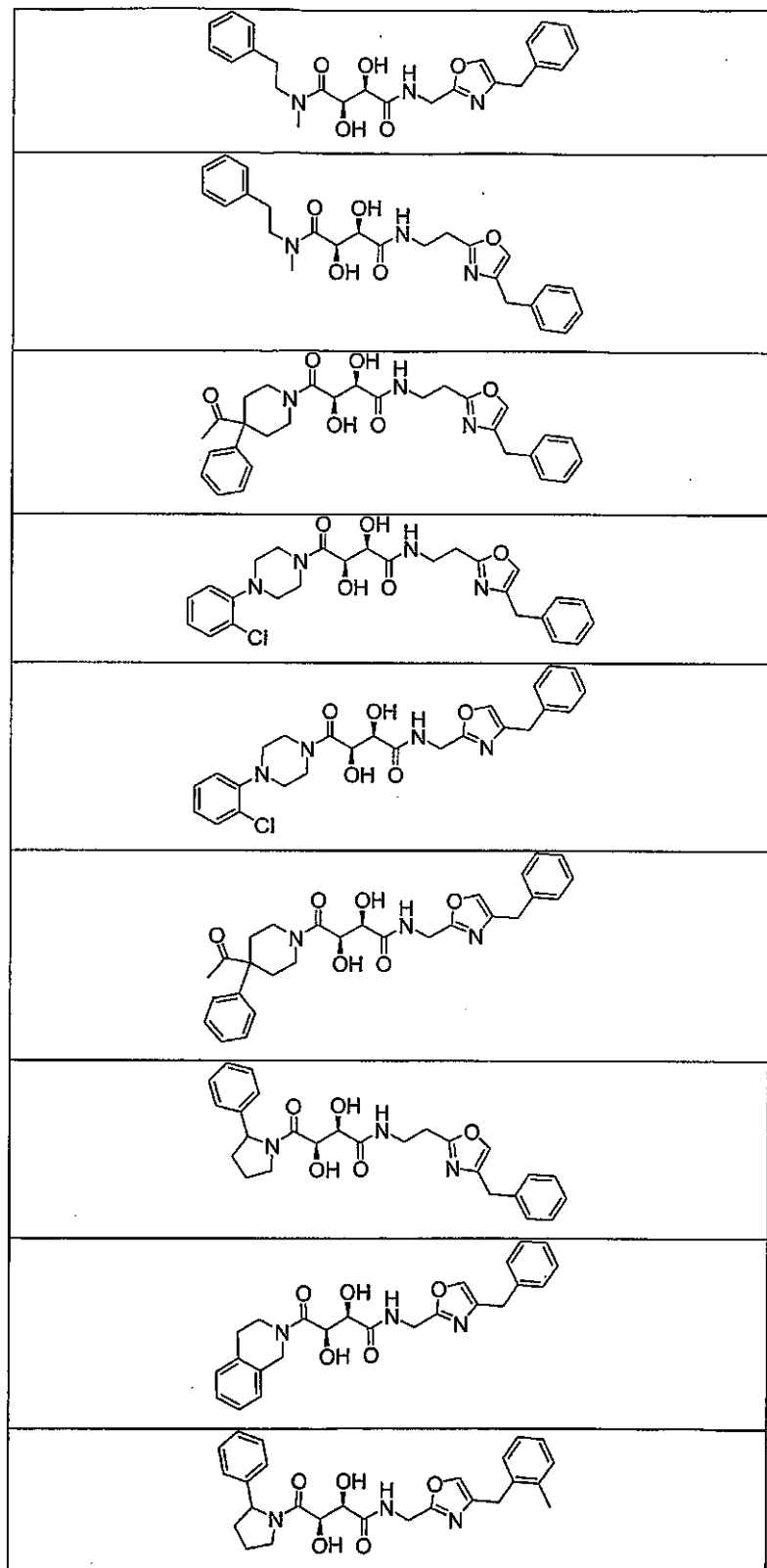


【化 5 6】



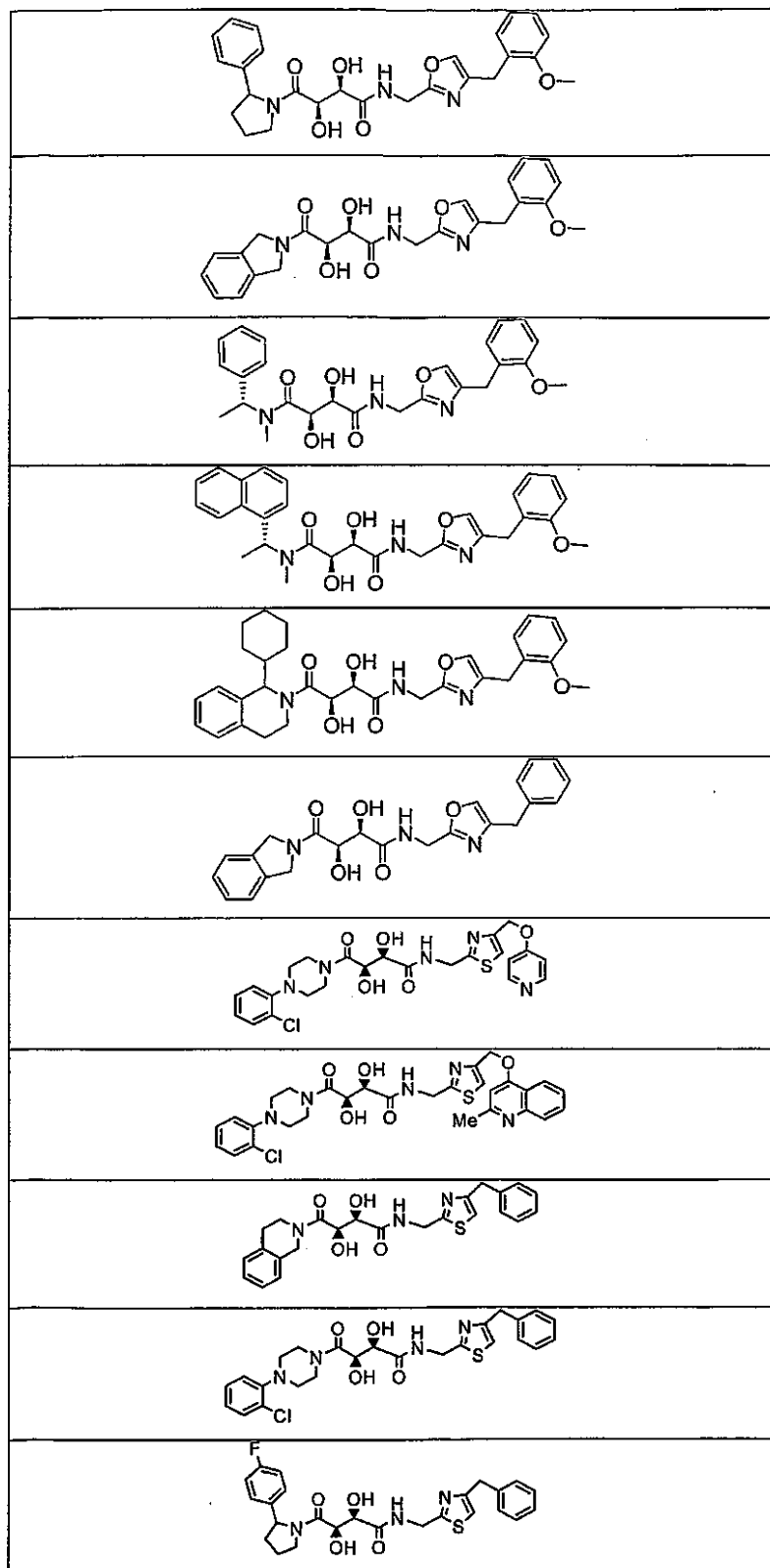


【化 5 7】



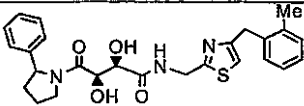
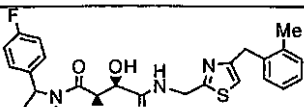
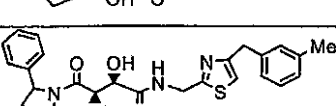
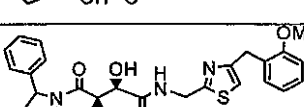
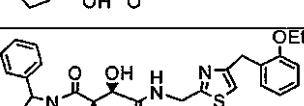
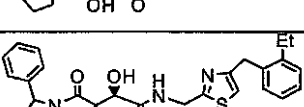
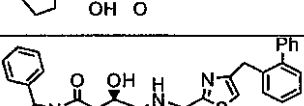
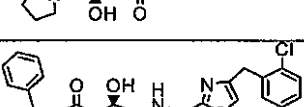
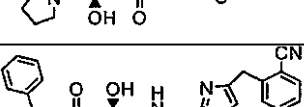
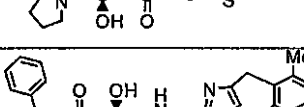
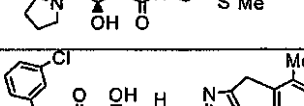
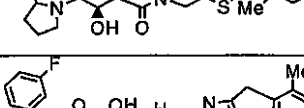
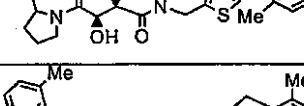


【化 5 8】



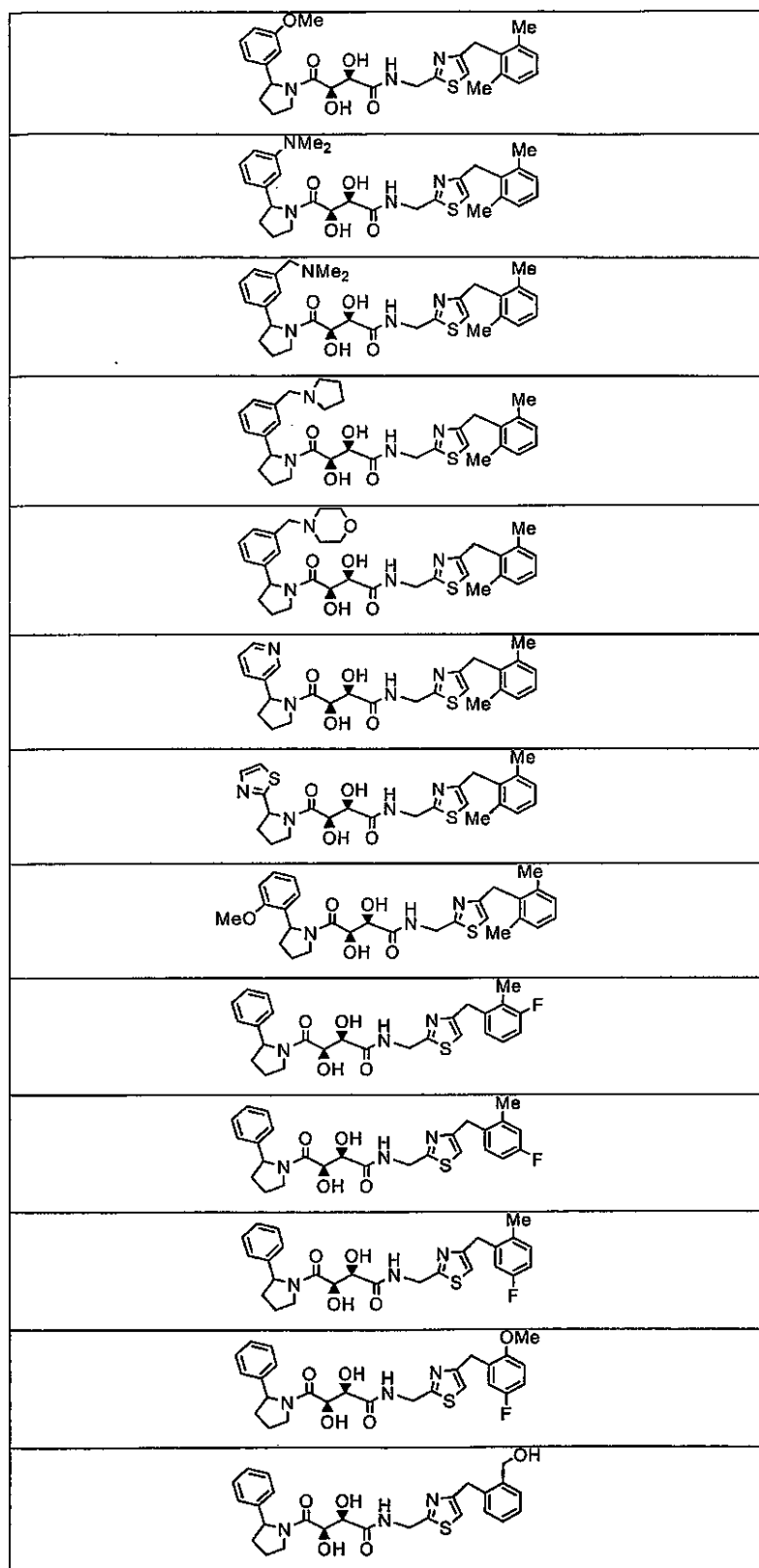


【化 5 9】

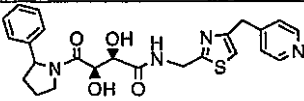
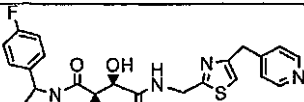
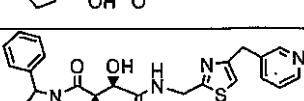
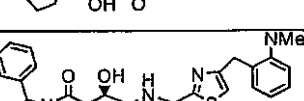
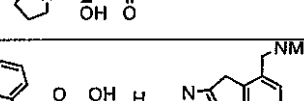
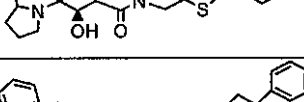
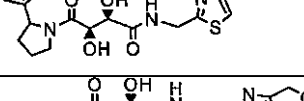
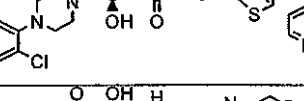
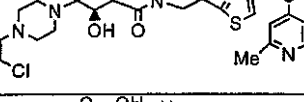
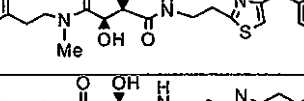
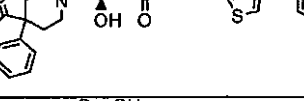
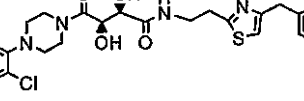
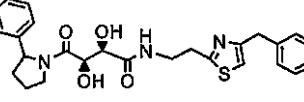
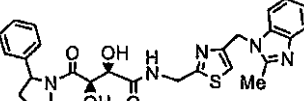


【化 60】



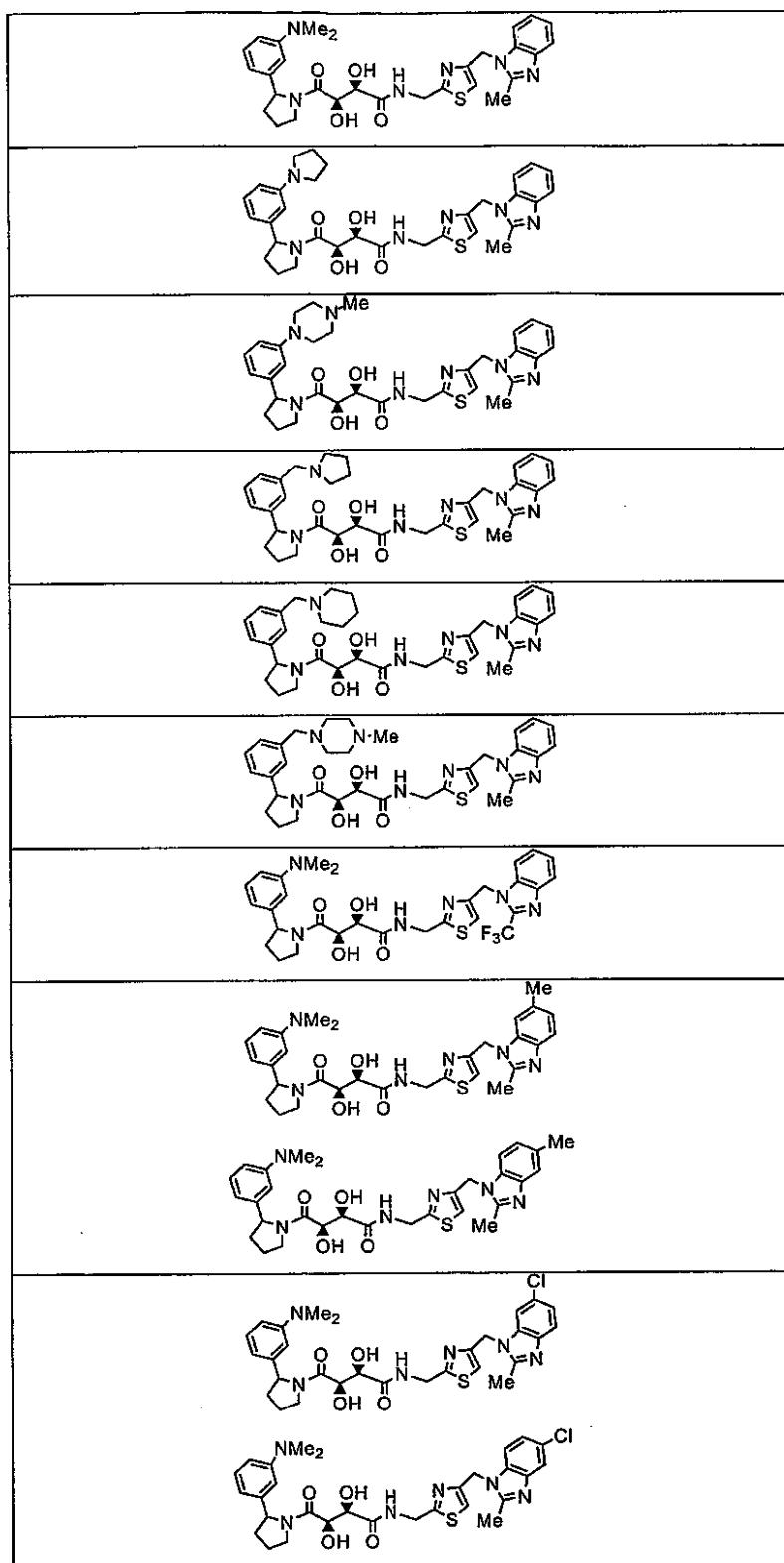


【化 6 1】

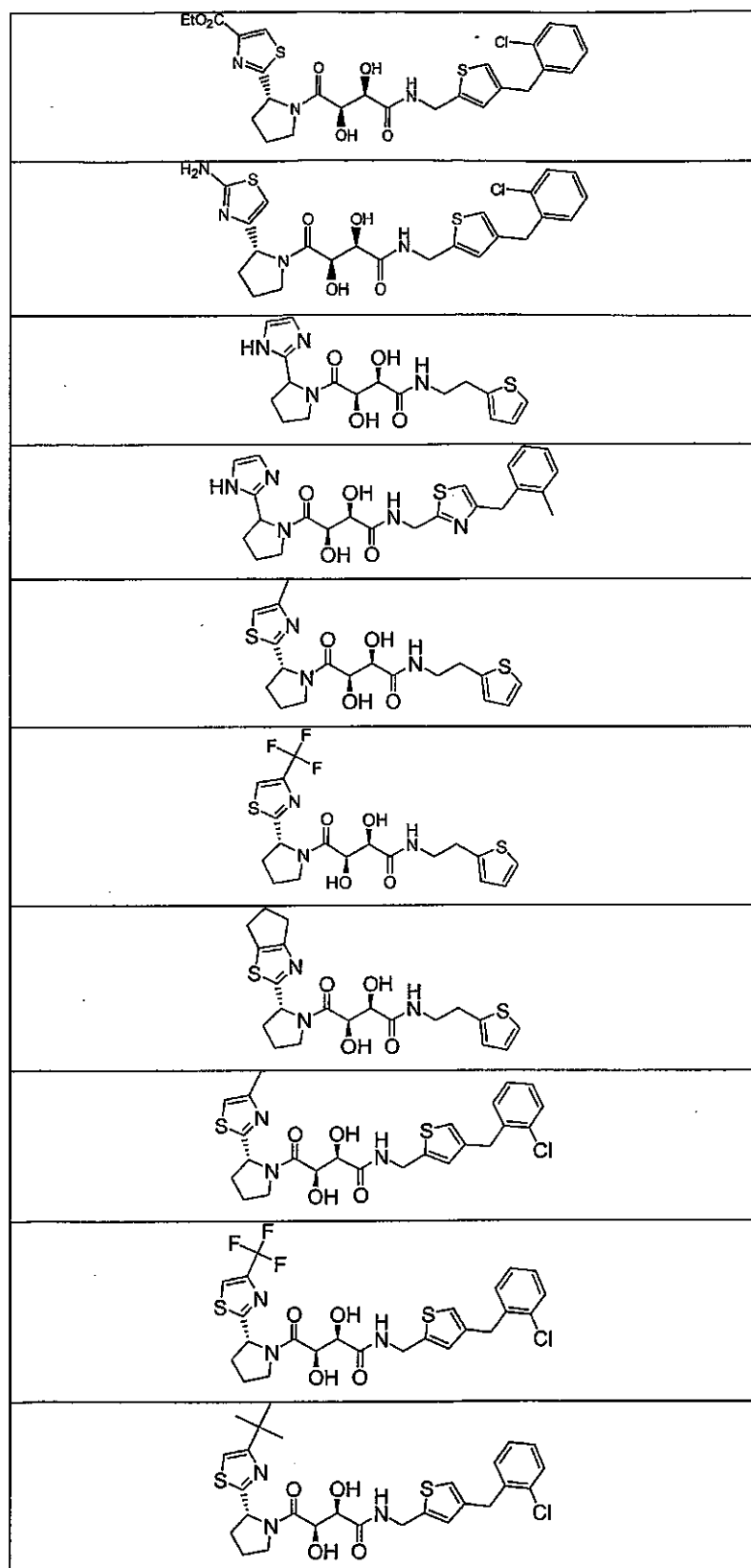


【化 6 2】



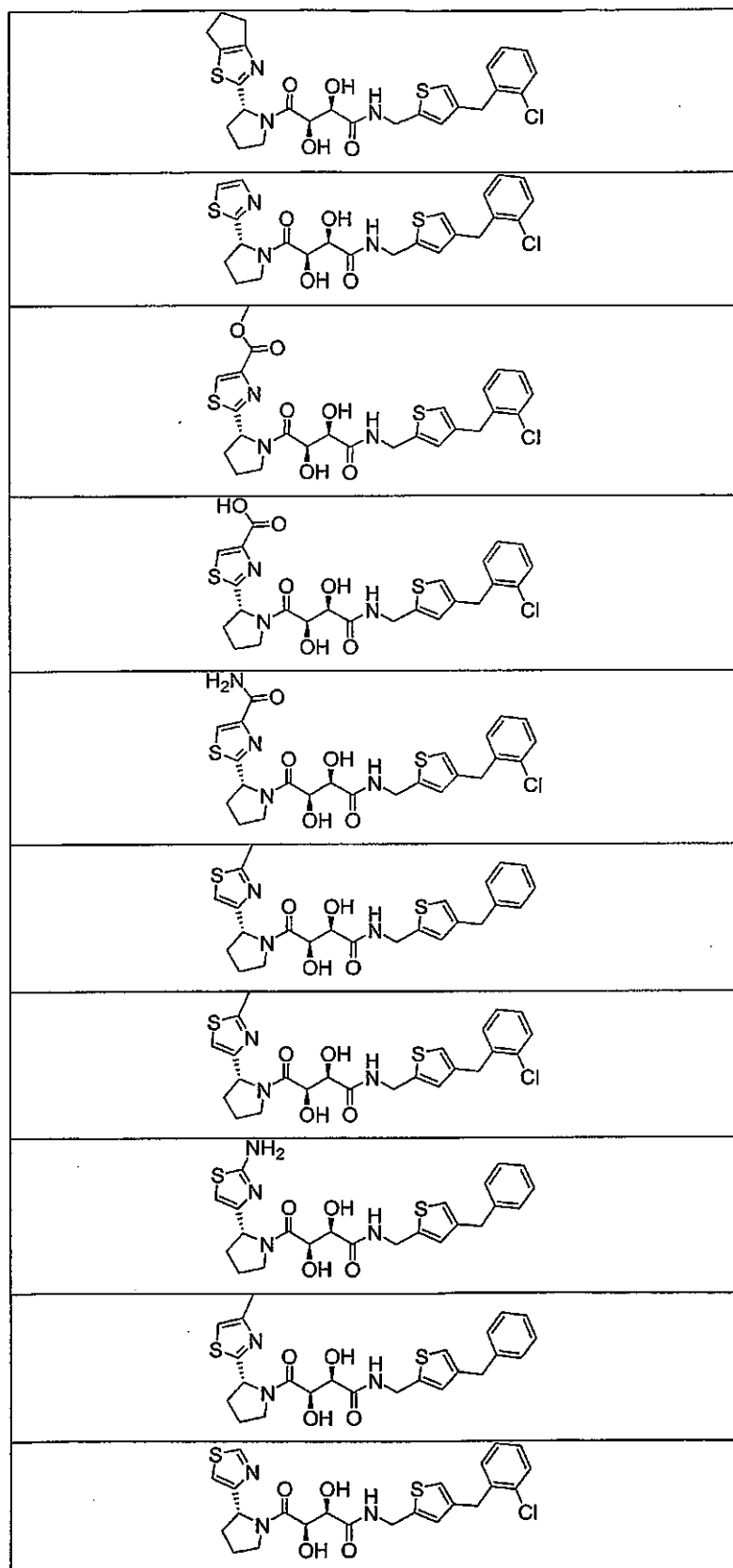


## 【化 6 3】



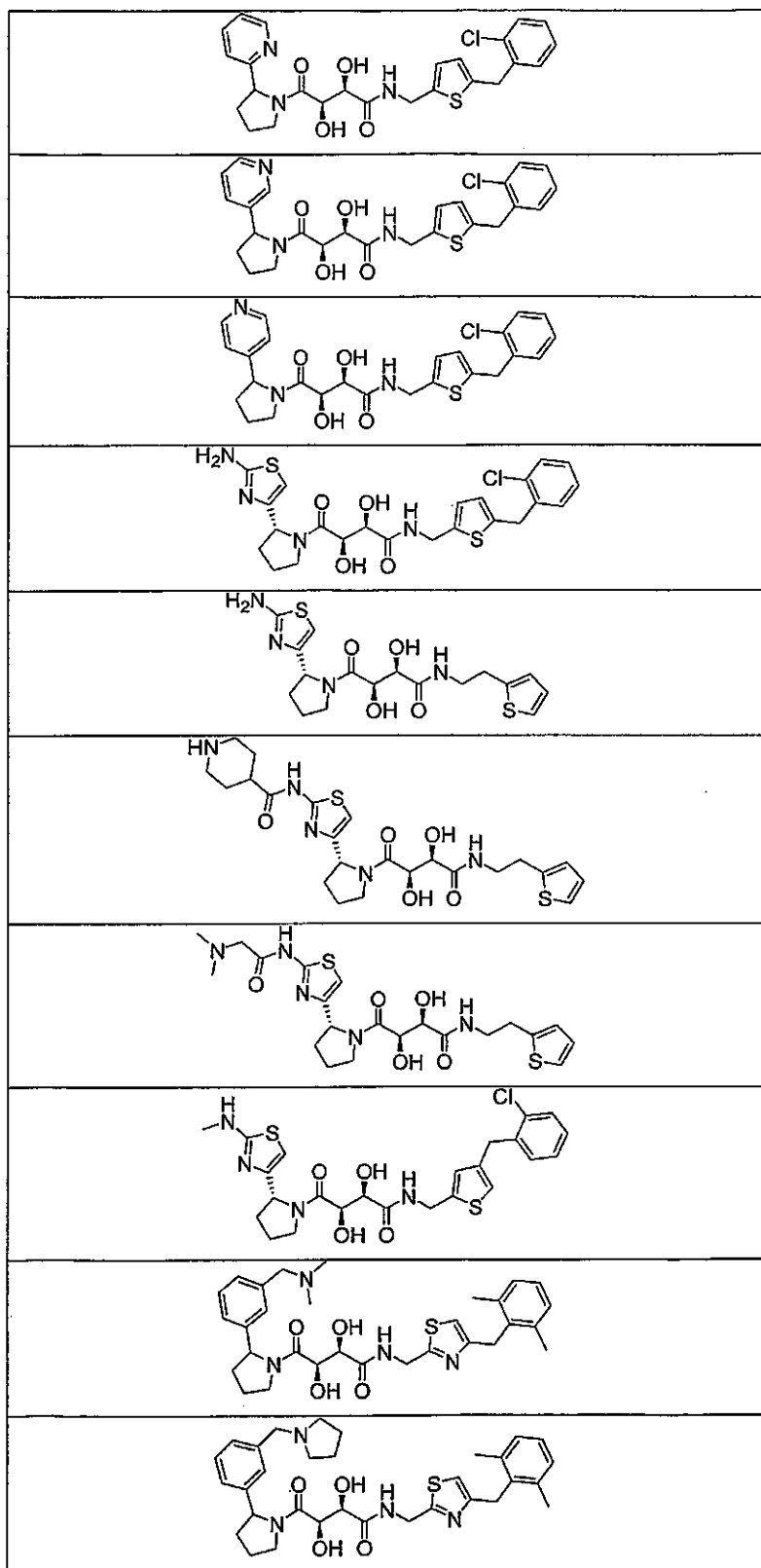


【化 6 4】



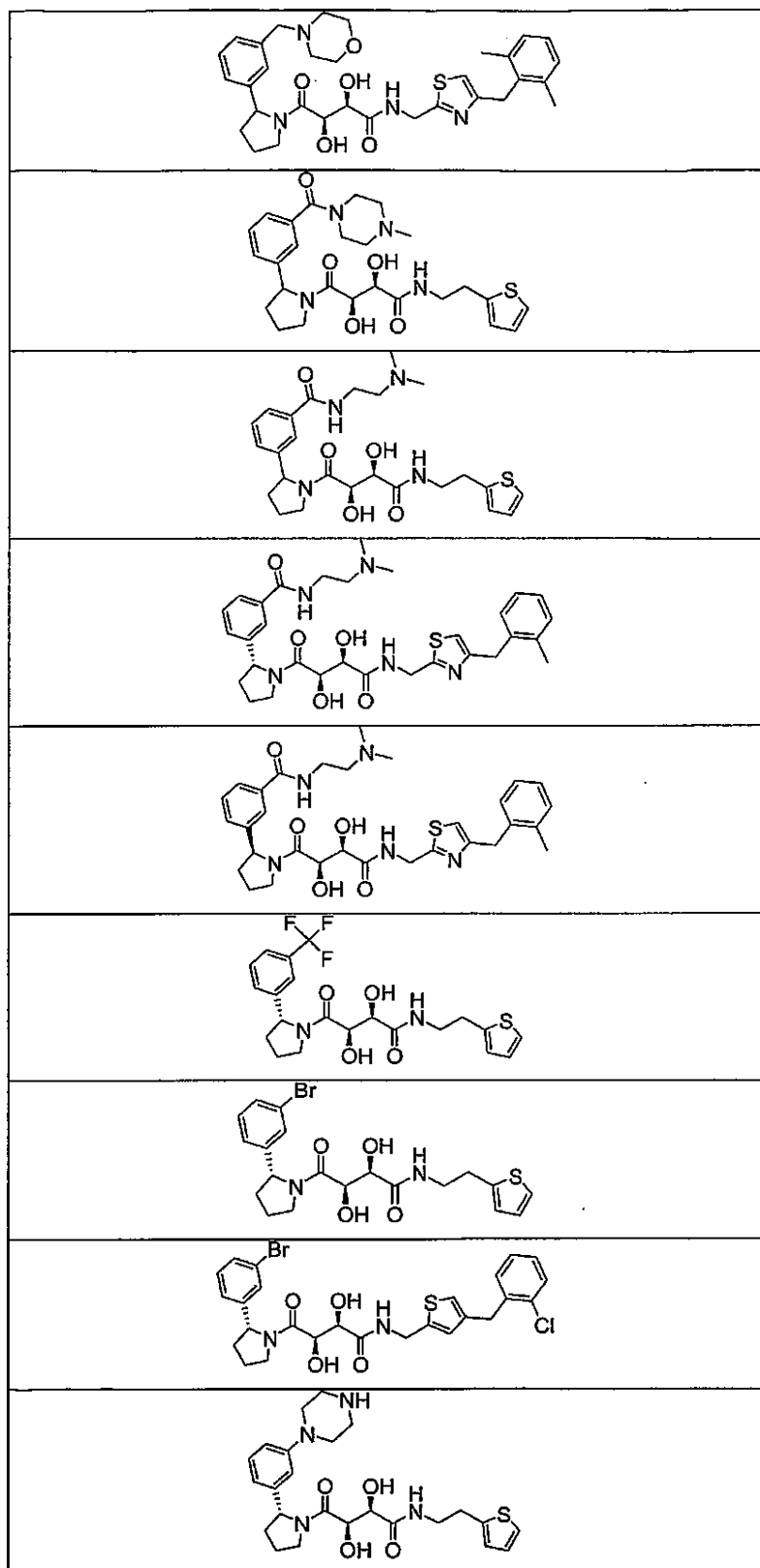


【化 6 5】



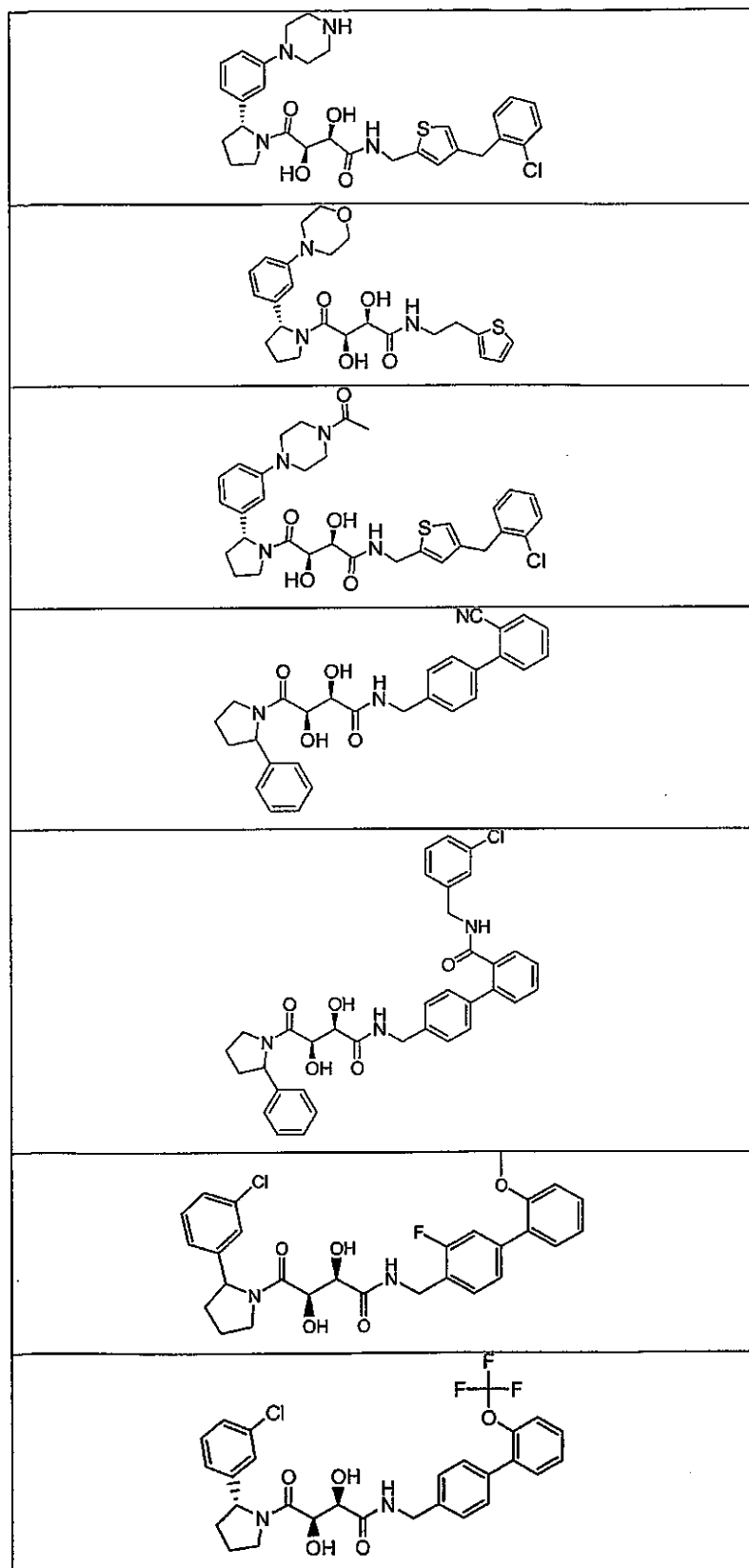


【化 6 6】



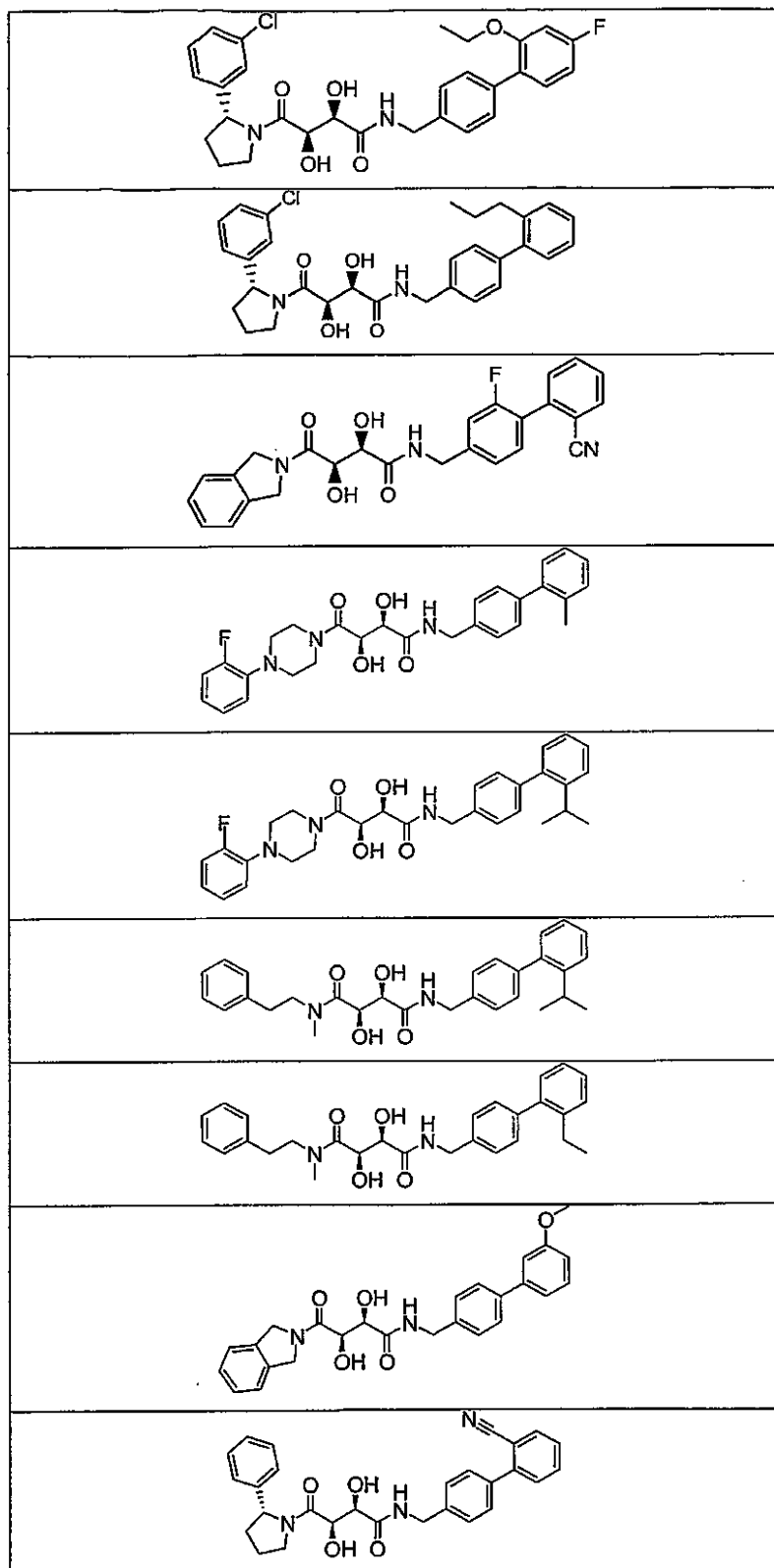


【化 6 7】





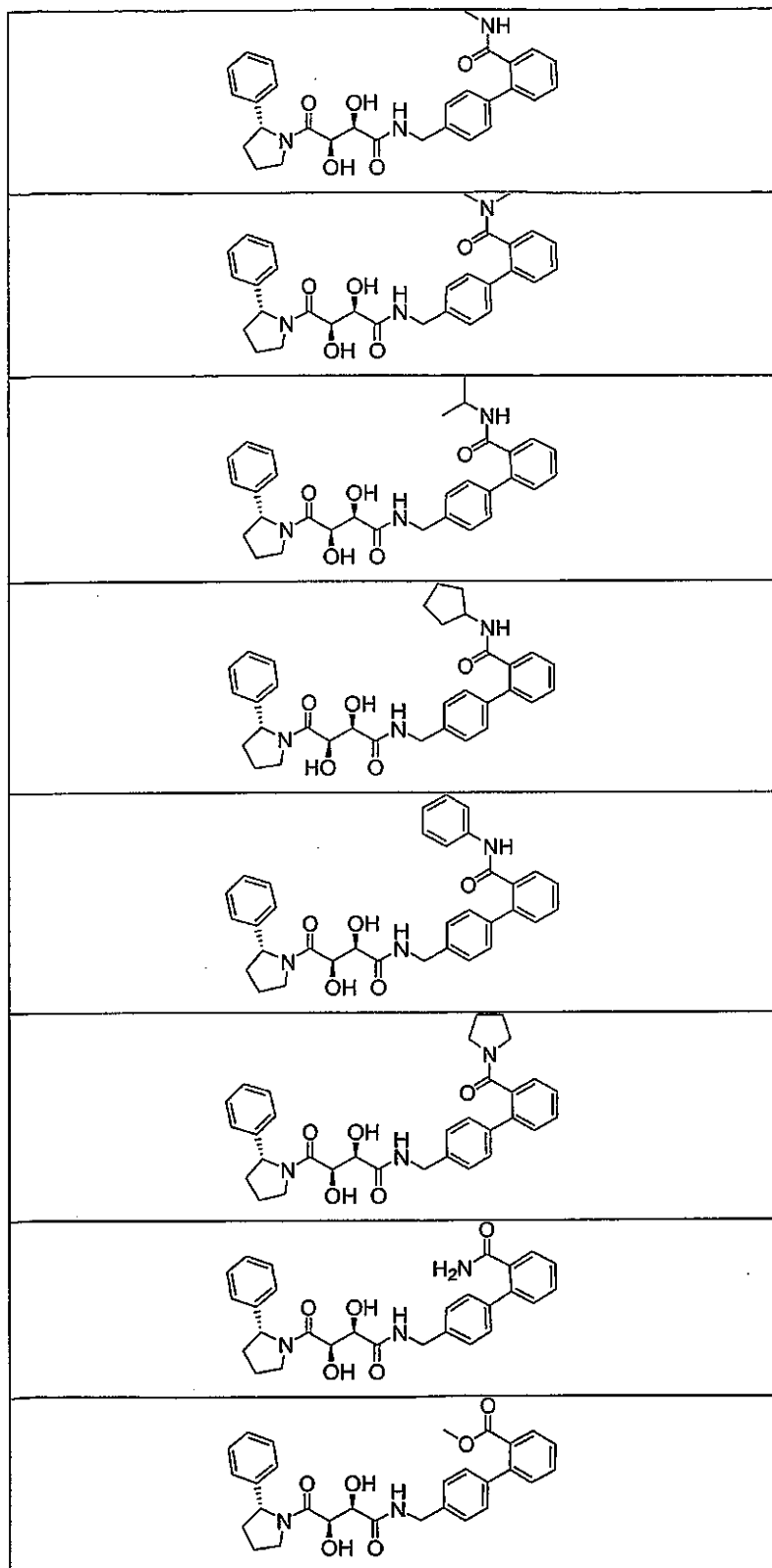
【化 6 8】





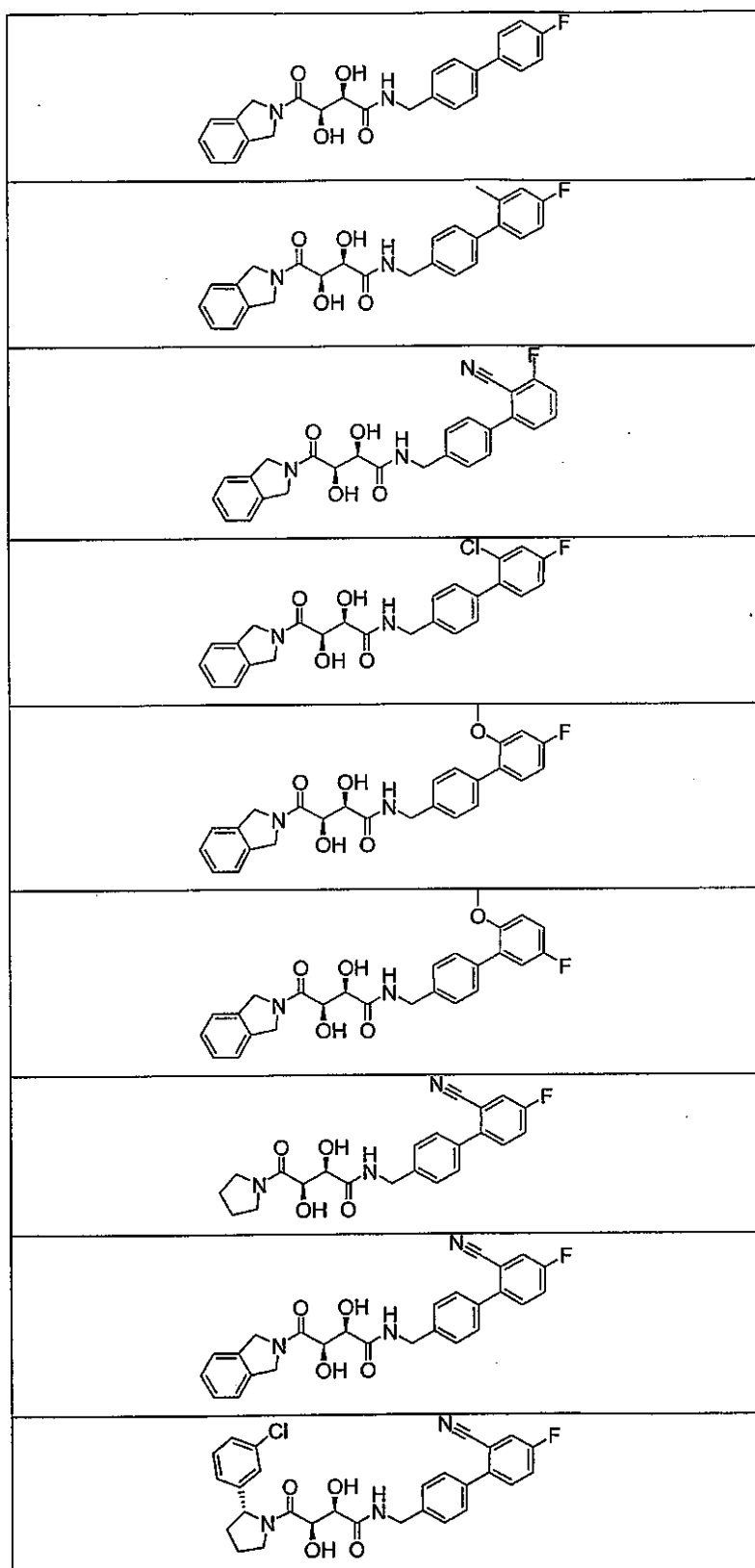



【化 7 0】



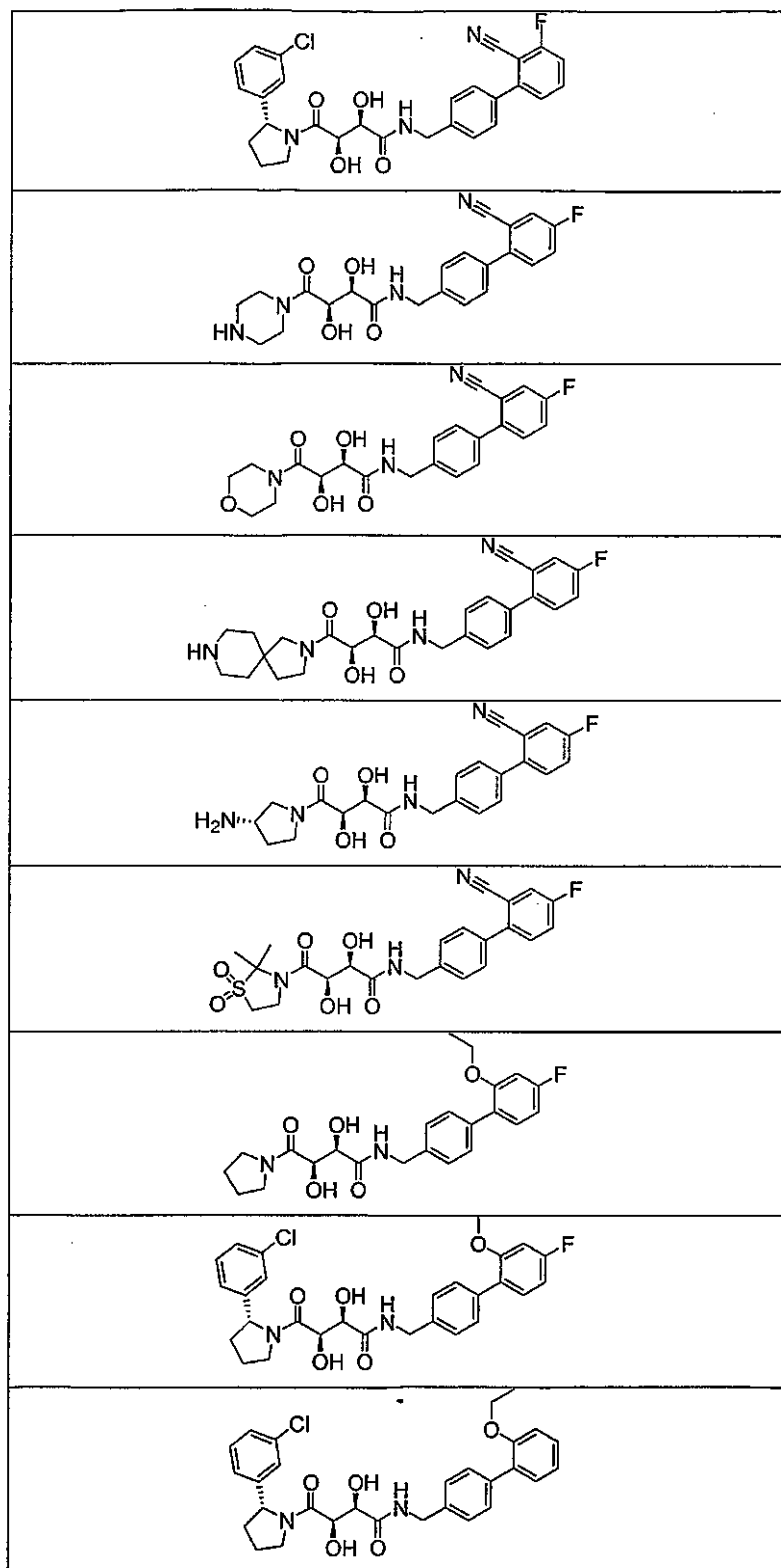


【化 7 1】



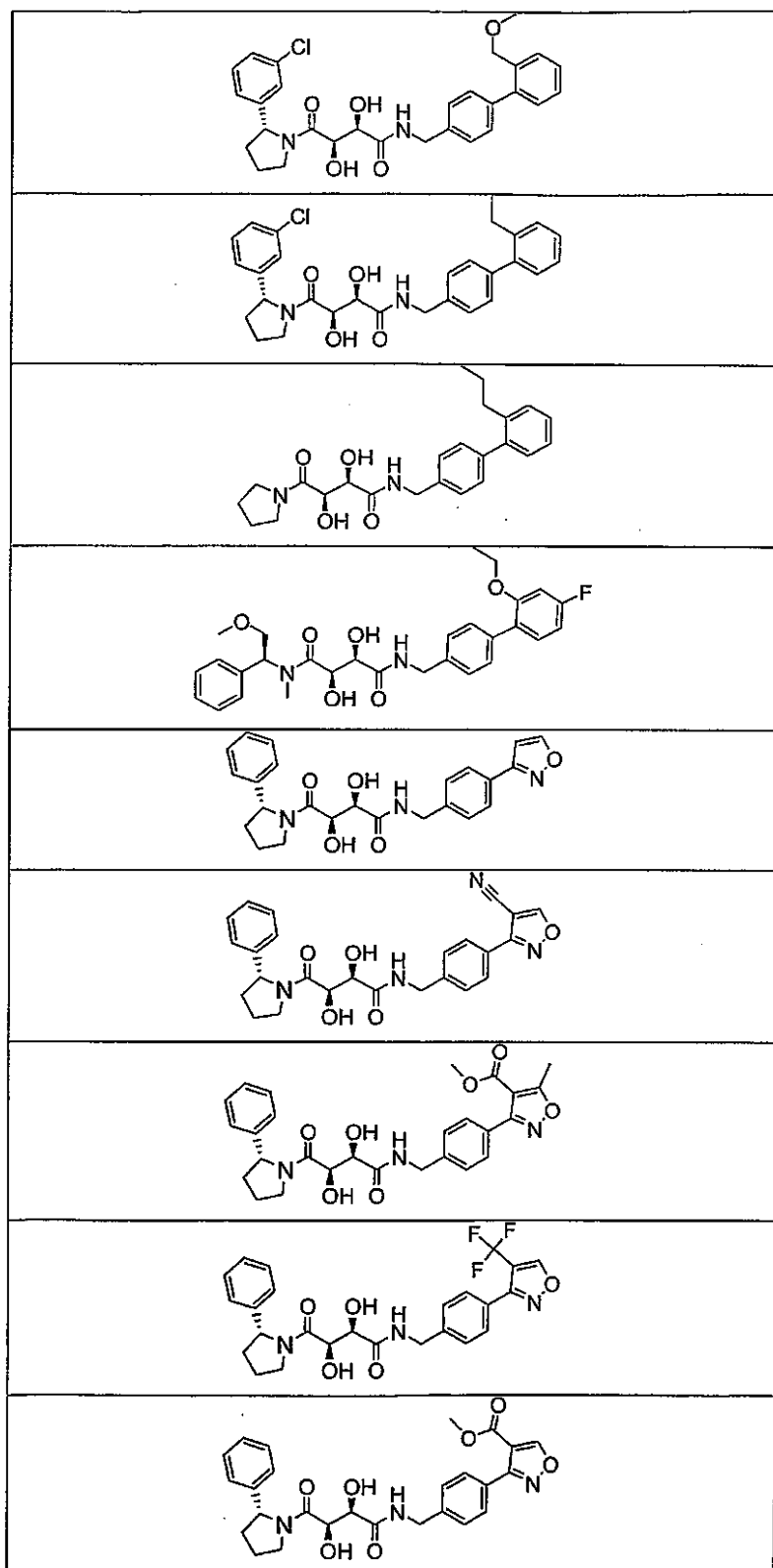


【化 7 2】



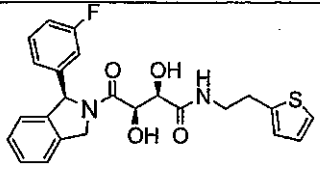
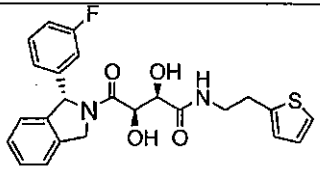
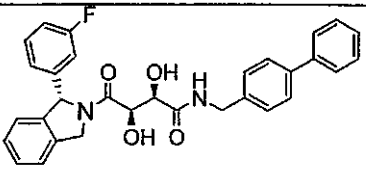
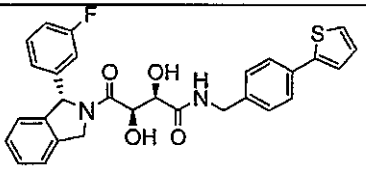
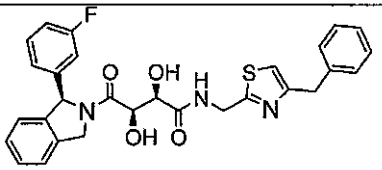
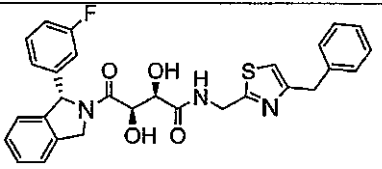
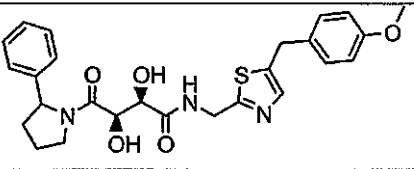
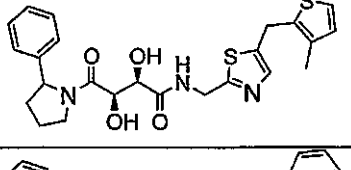
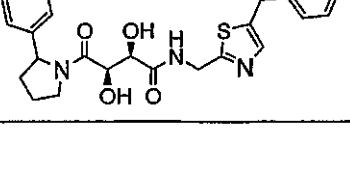


【化 7 3】



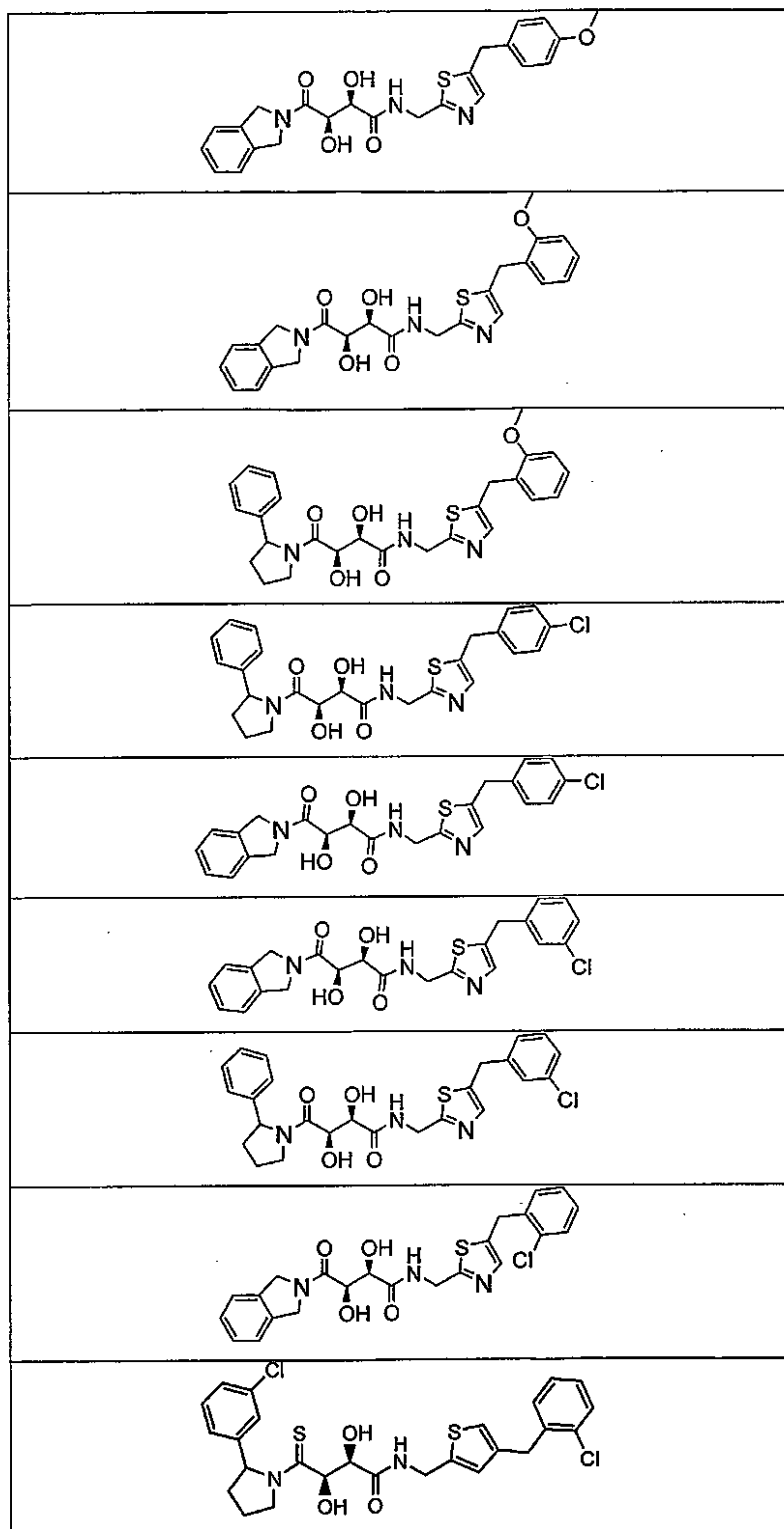


【化 7 4】

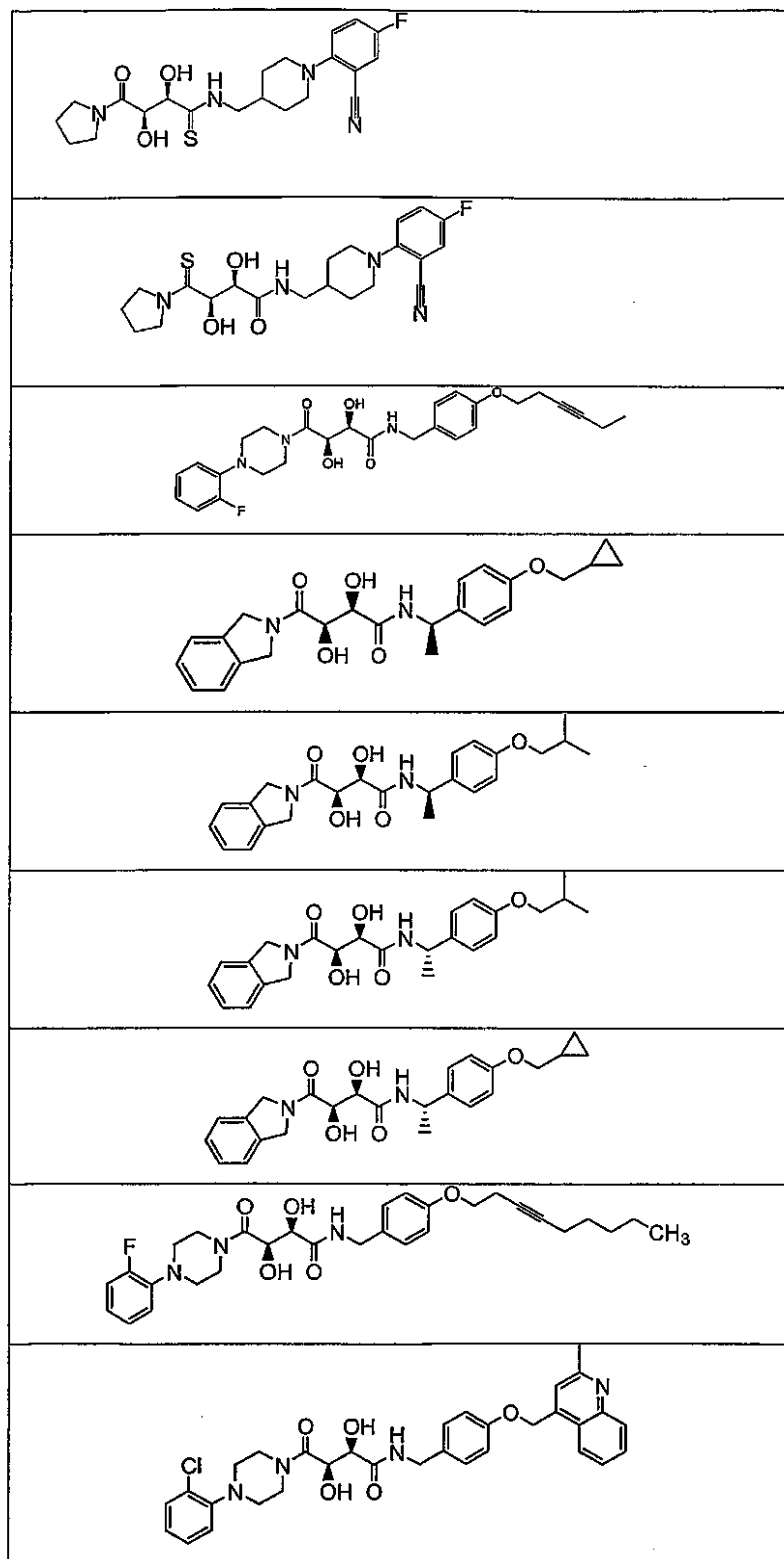


【化 7 5】



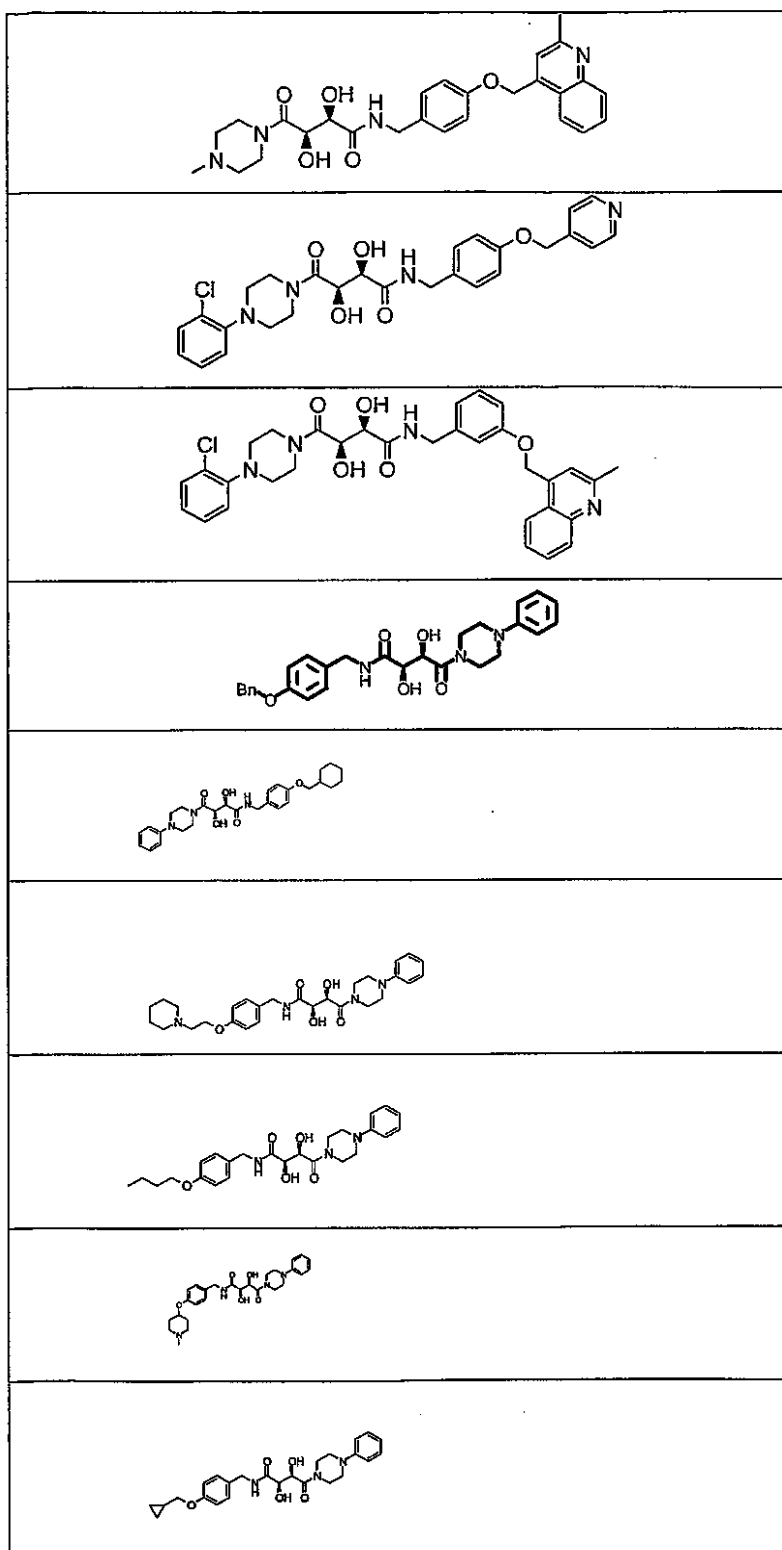


【化 7 6】



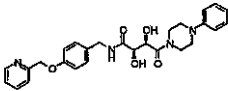
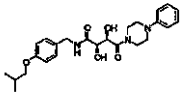
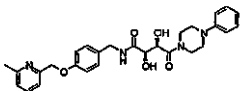
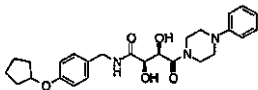
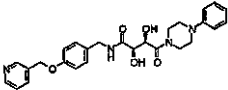
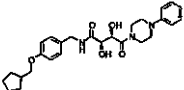
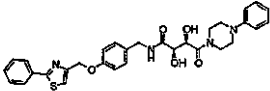
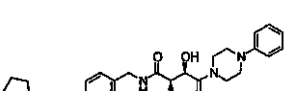
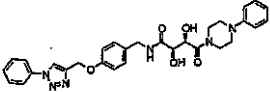
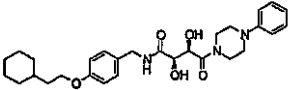


【化 7 7】

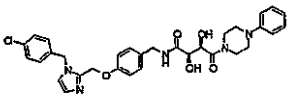
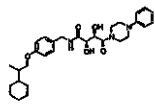
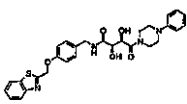
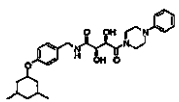
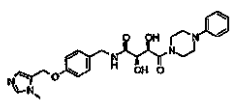
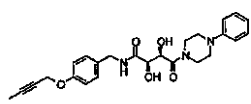
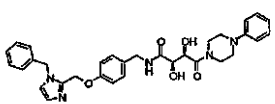
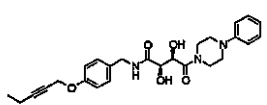
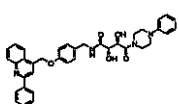




【化 7 8】

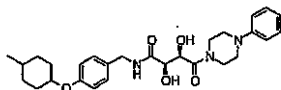
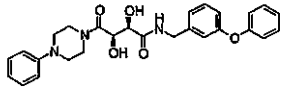
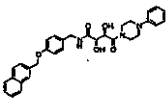
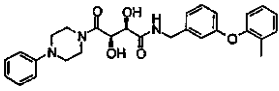
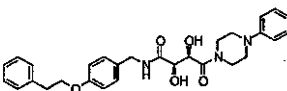
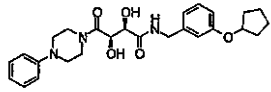
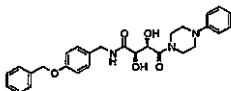
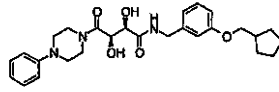
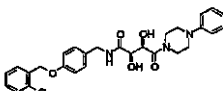













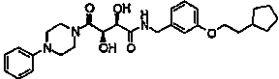
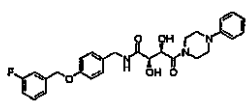
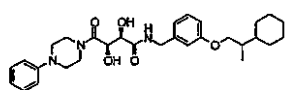
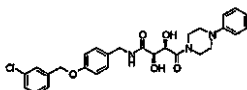
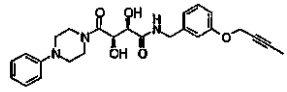
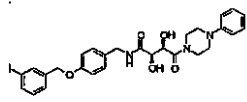
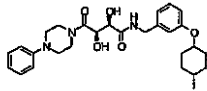
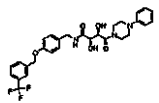
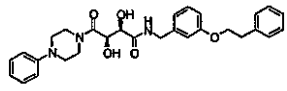


【化 8 0】

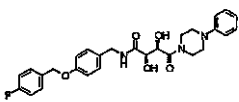
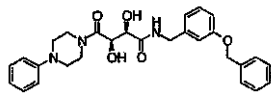
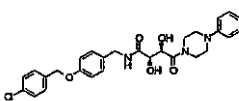
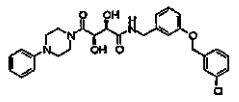
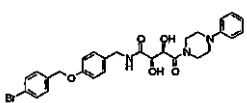
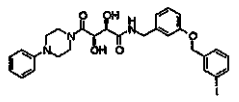
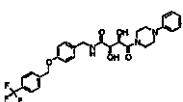
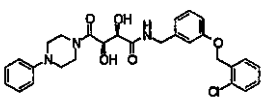
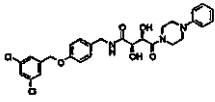


【化 8 1】

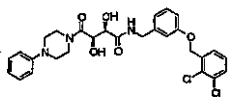
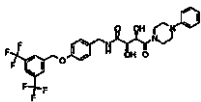
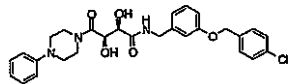
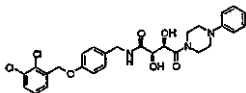
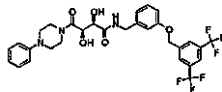
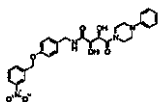
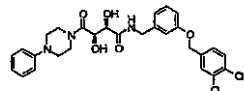
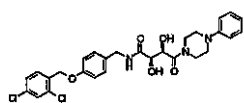
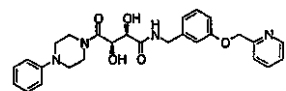


【化 8 2】

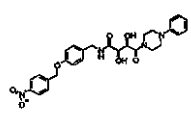
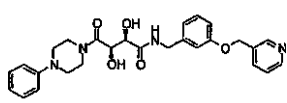
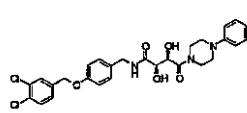
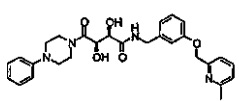
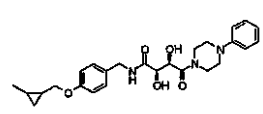
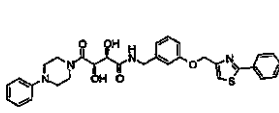
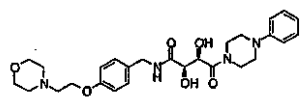
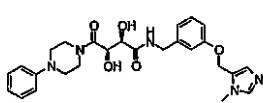
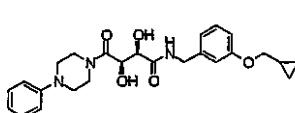


【化 8 3】

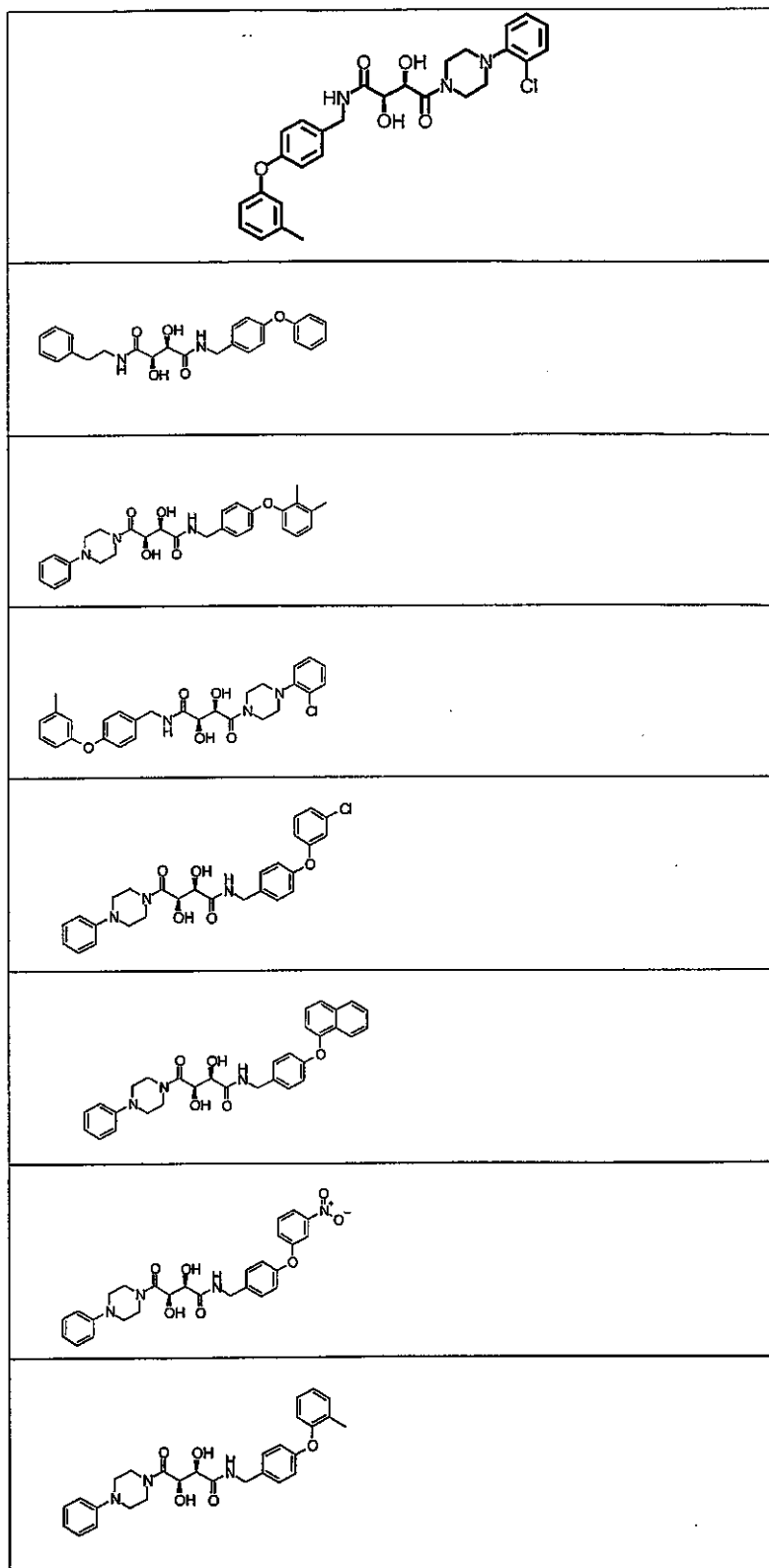


【化 8 4】

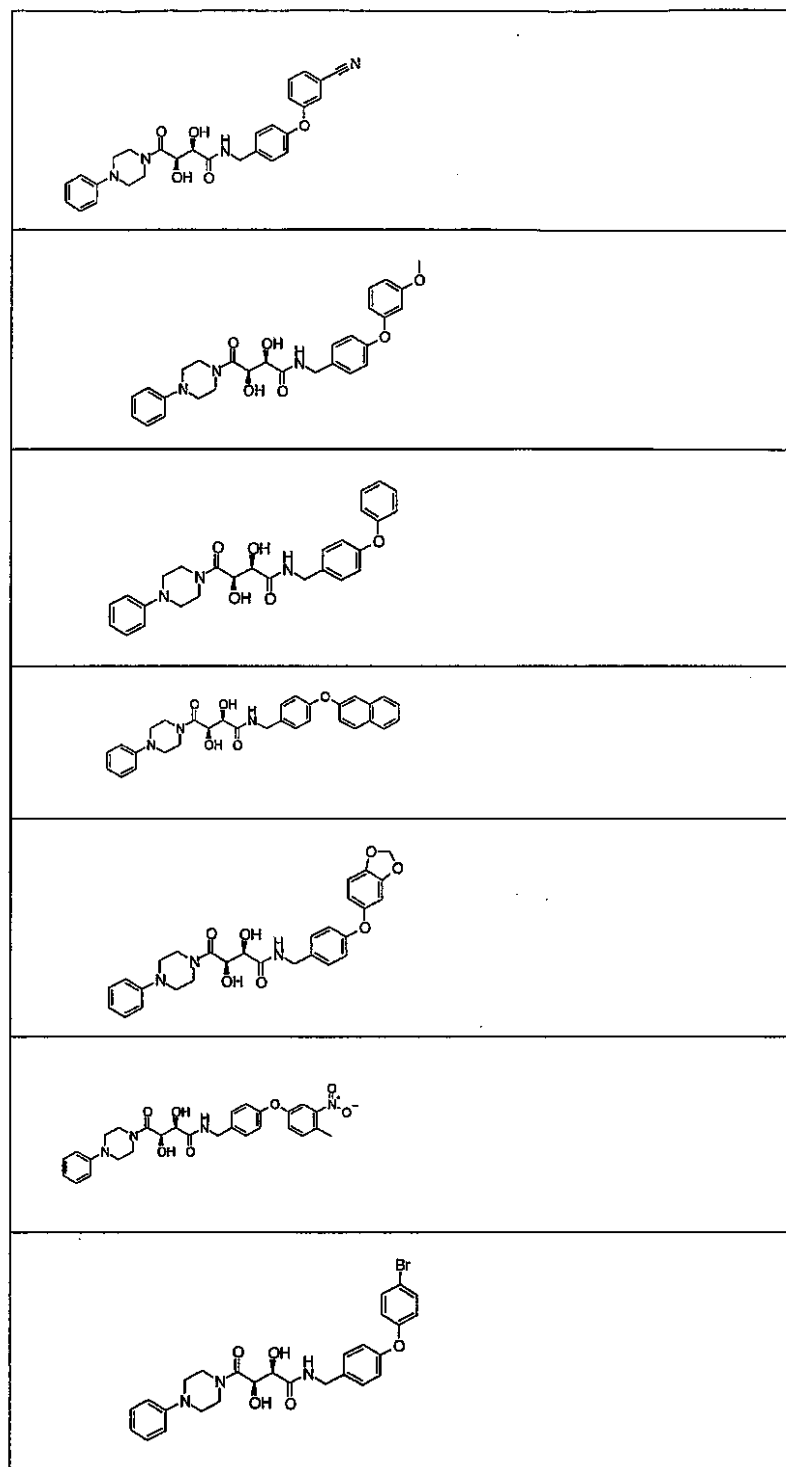


【化 8 5】



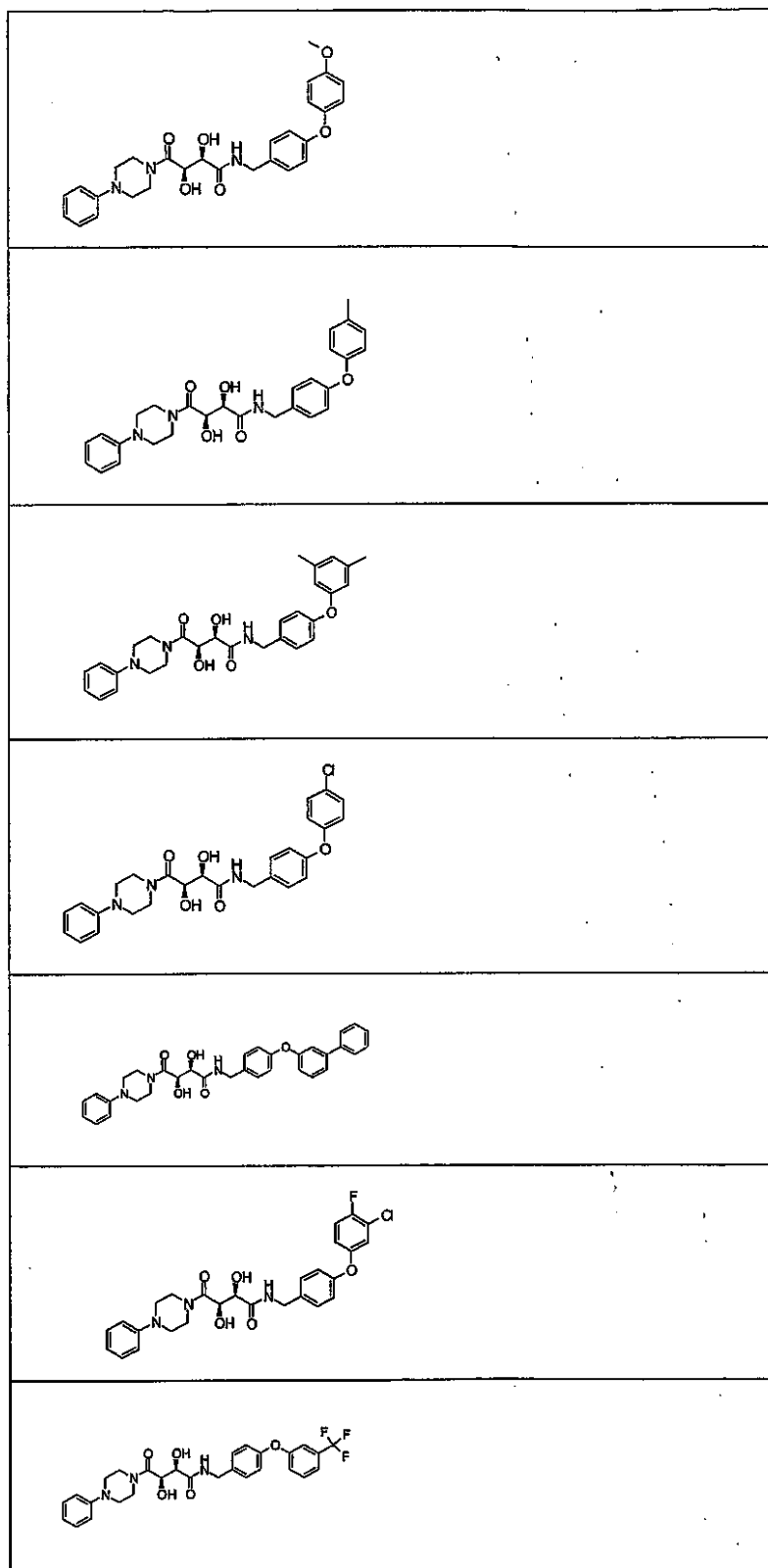


【化 8 6】



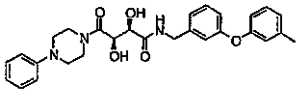
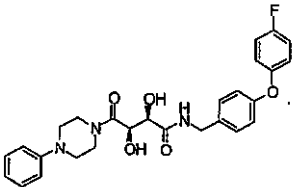
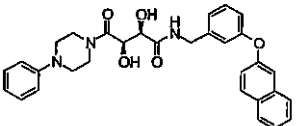
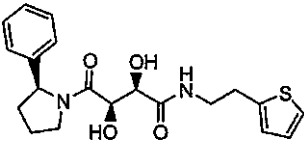
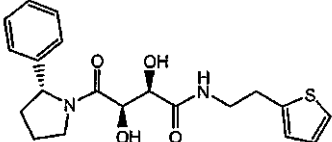
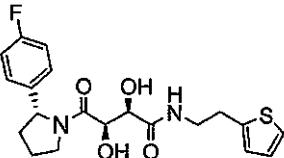
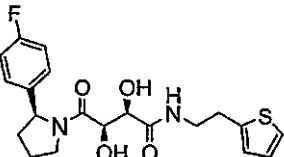
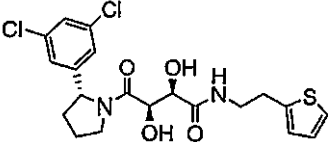


【化 8 7】



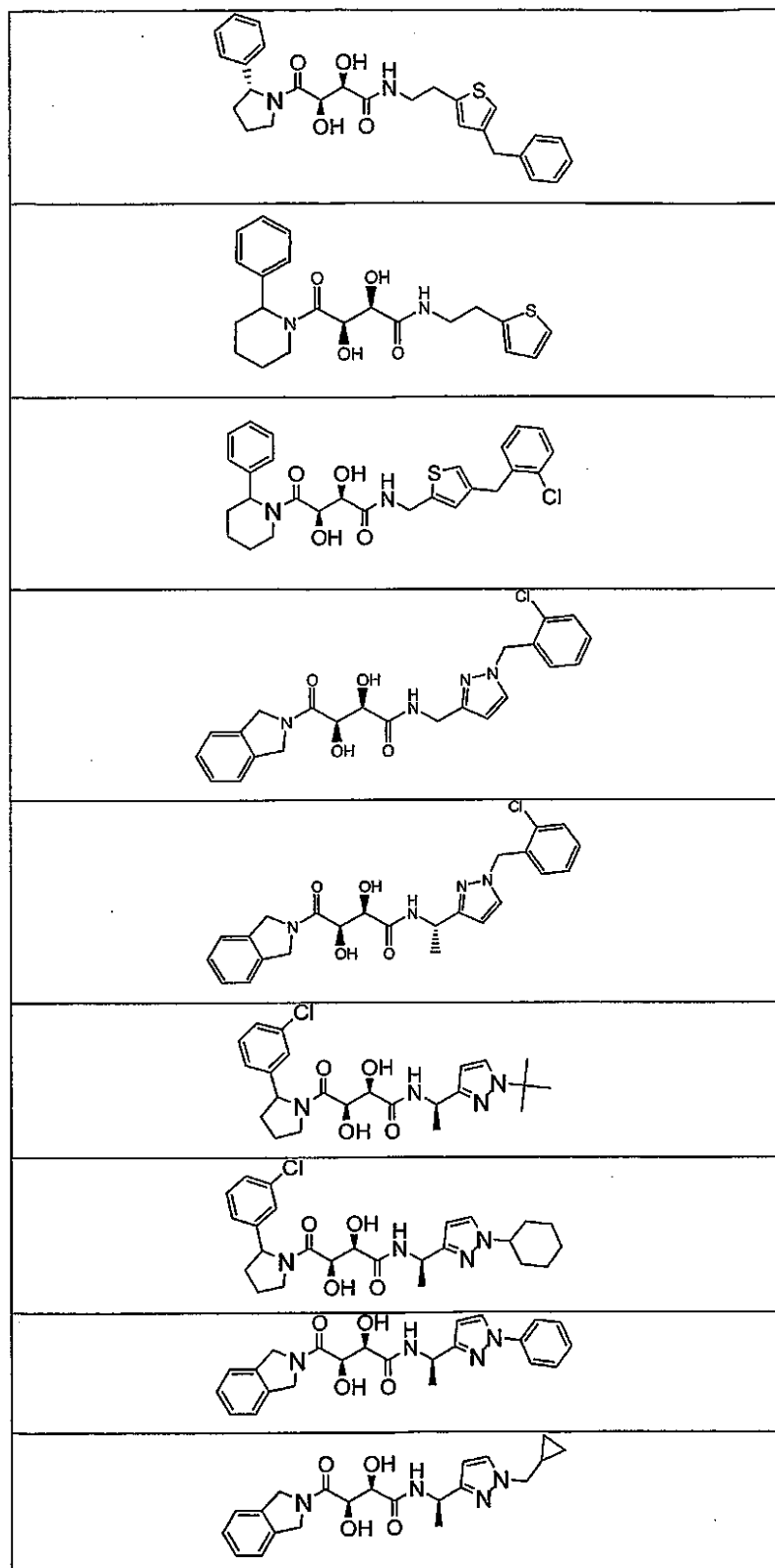


【化 8 8】

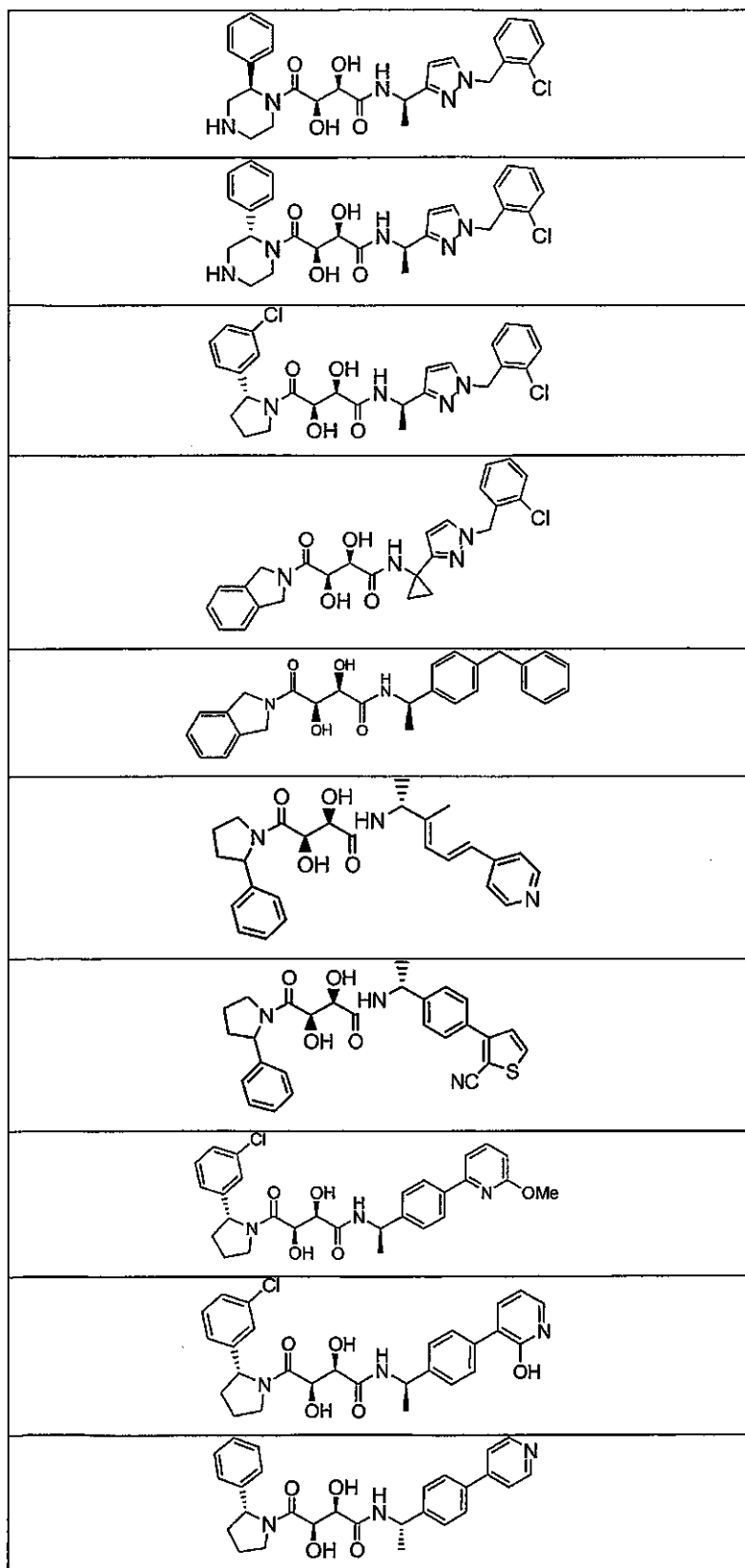


【化 8 9】



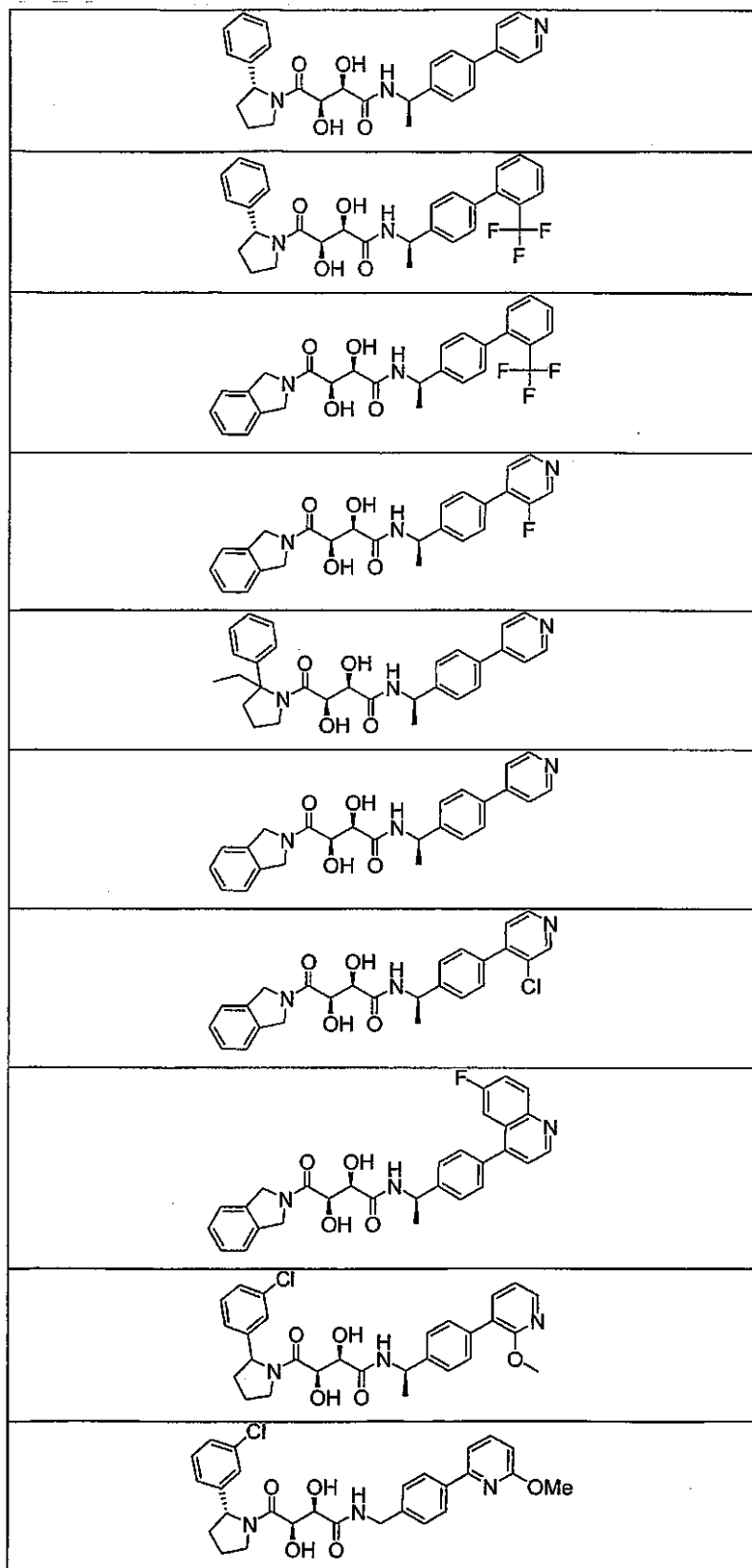


【化 9 0】



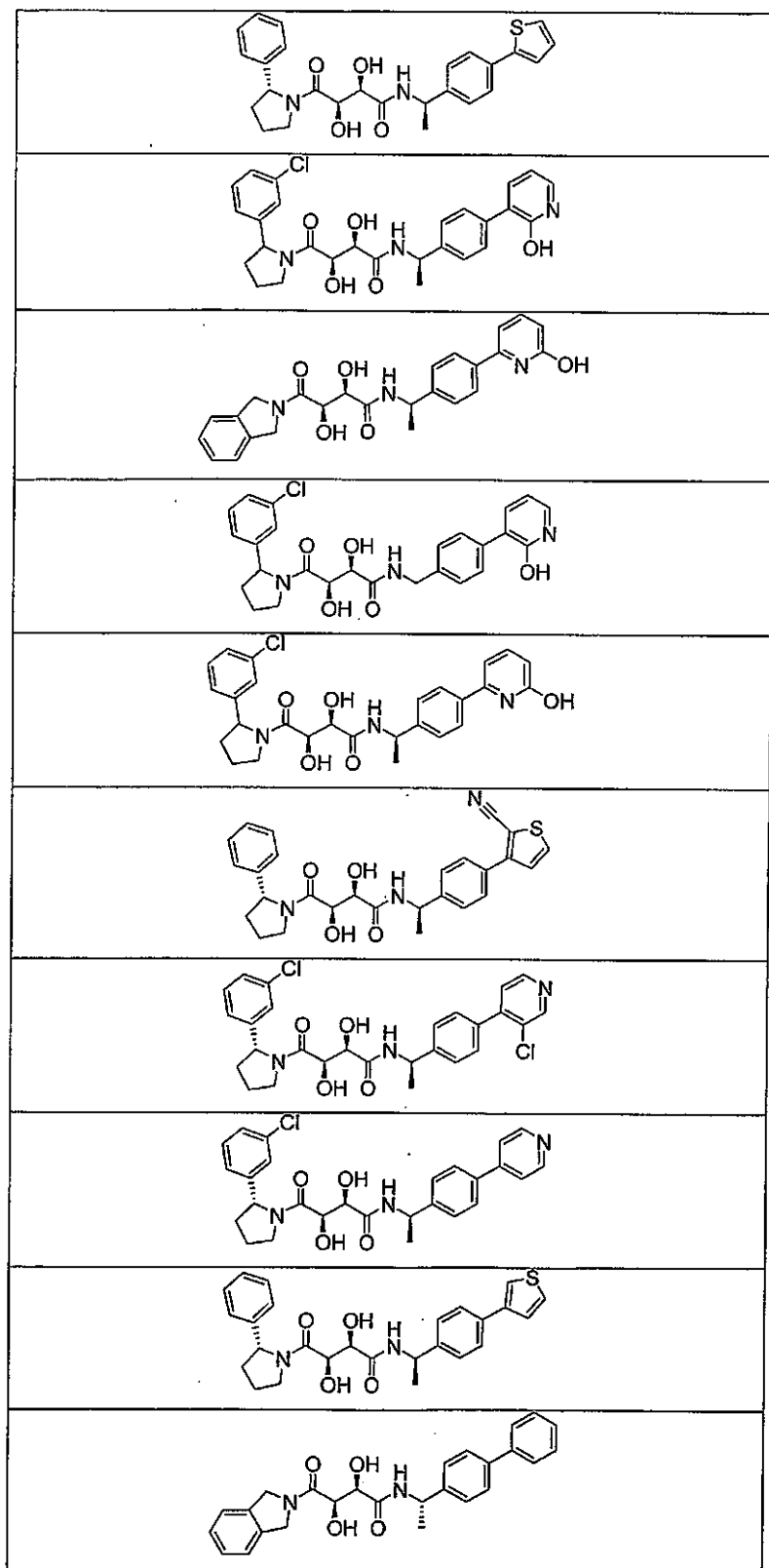


【化 9 1】



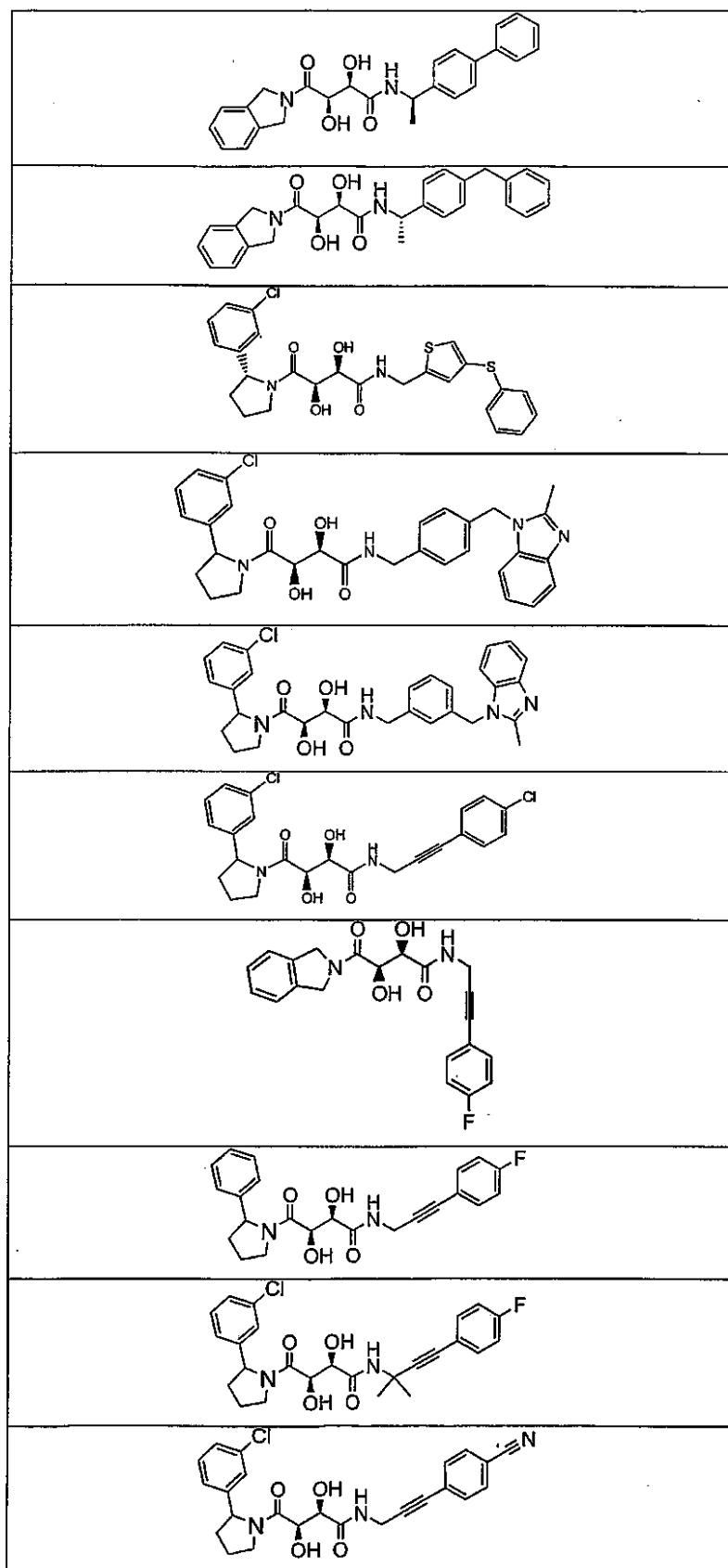


【化 9 2】



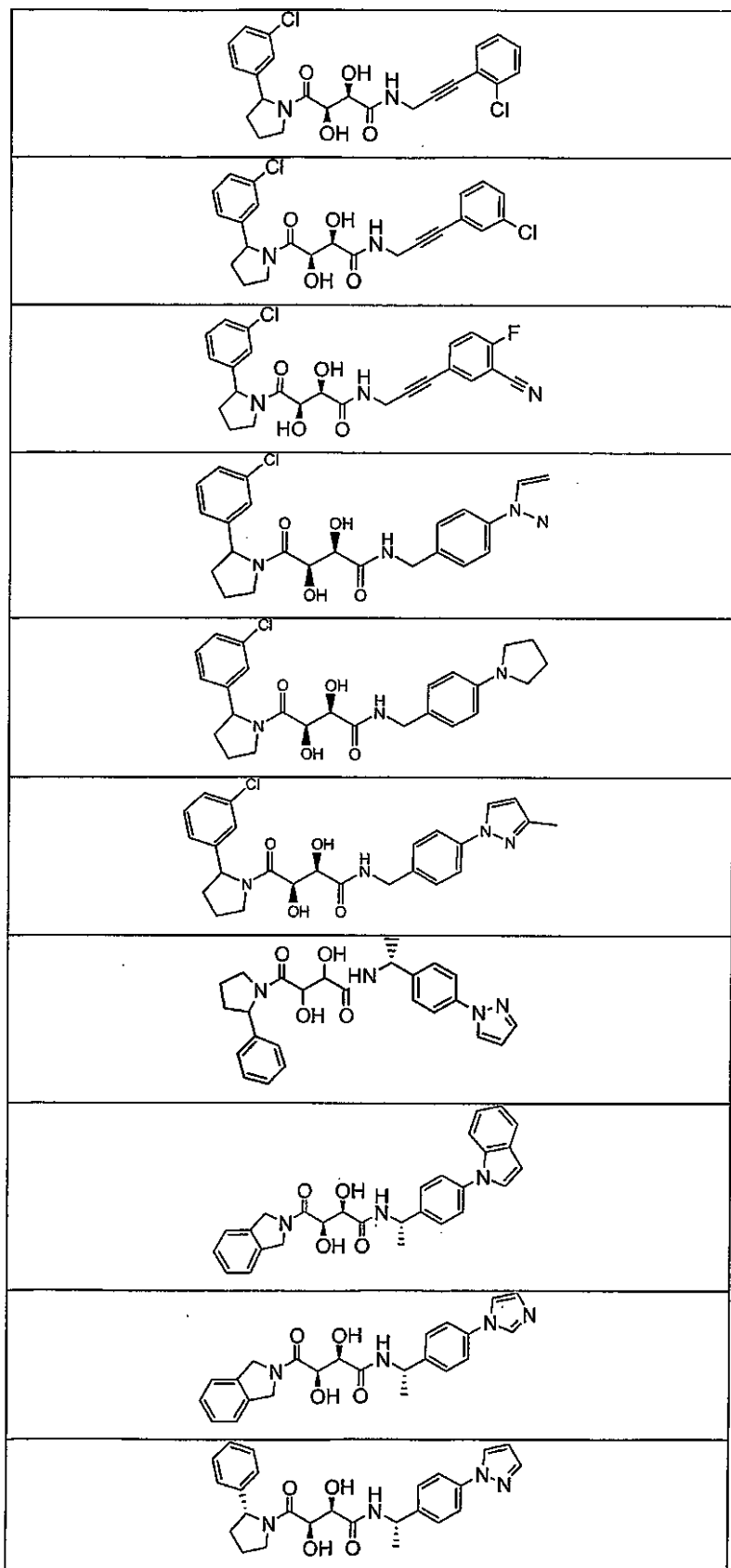


【化 9 3】



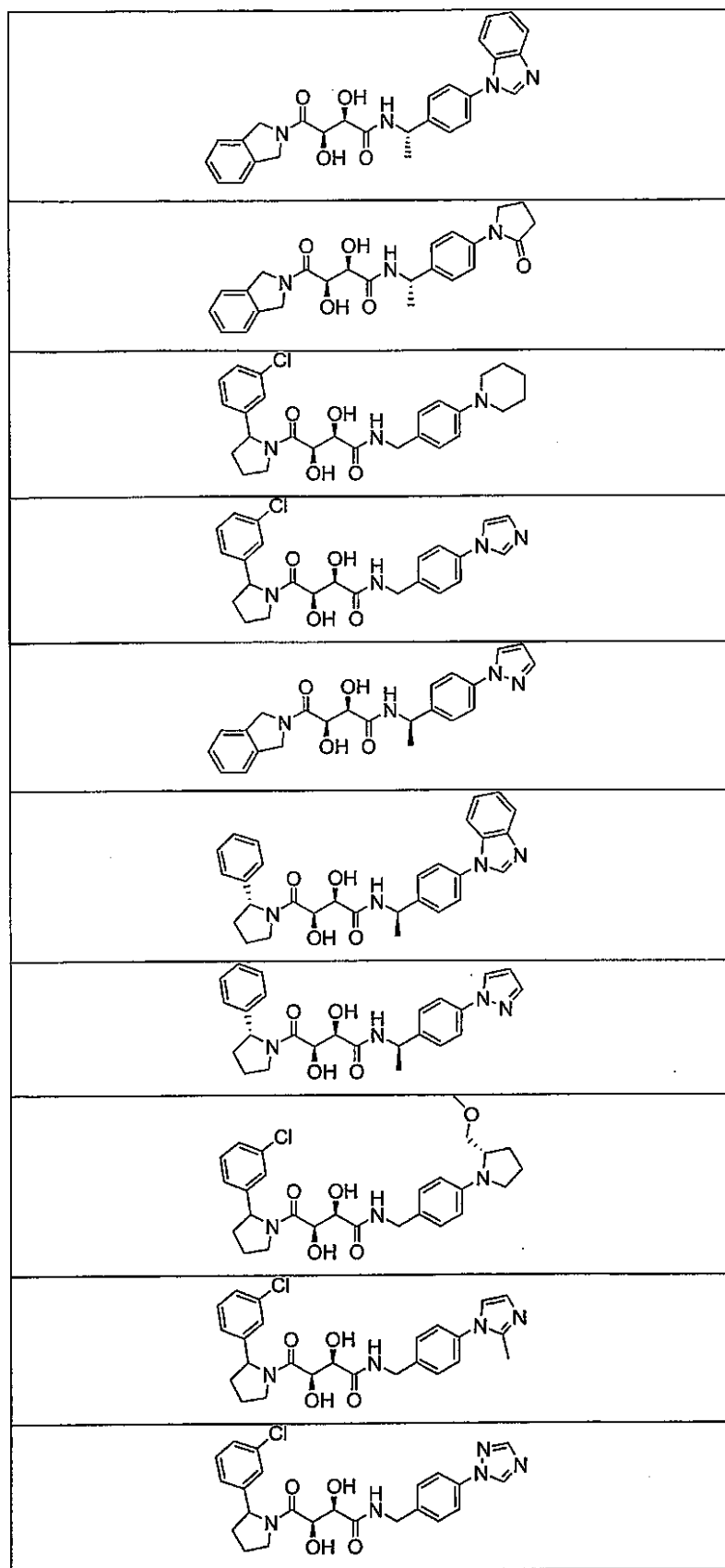


【化 9 4】



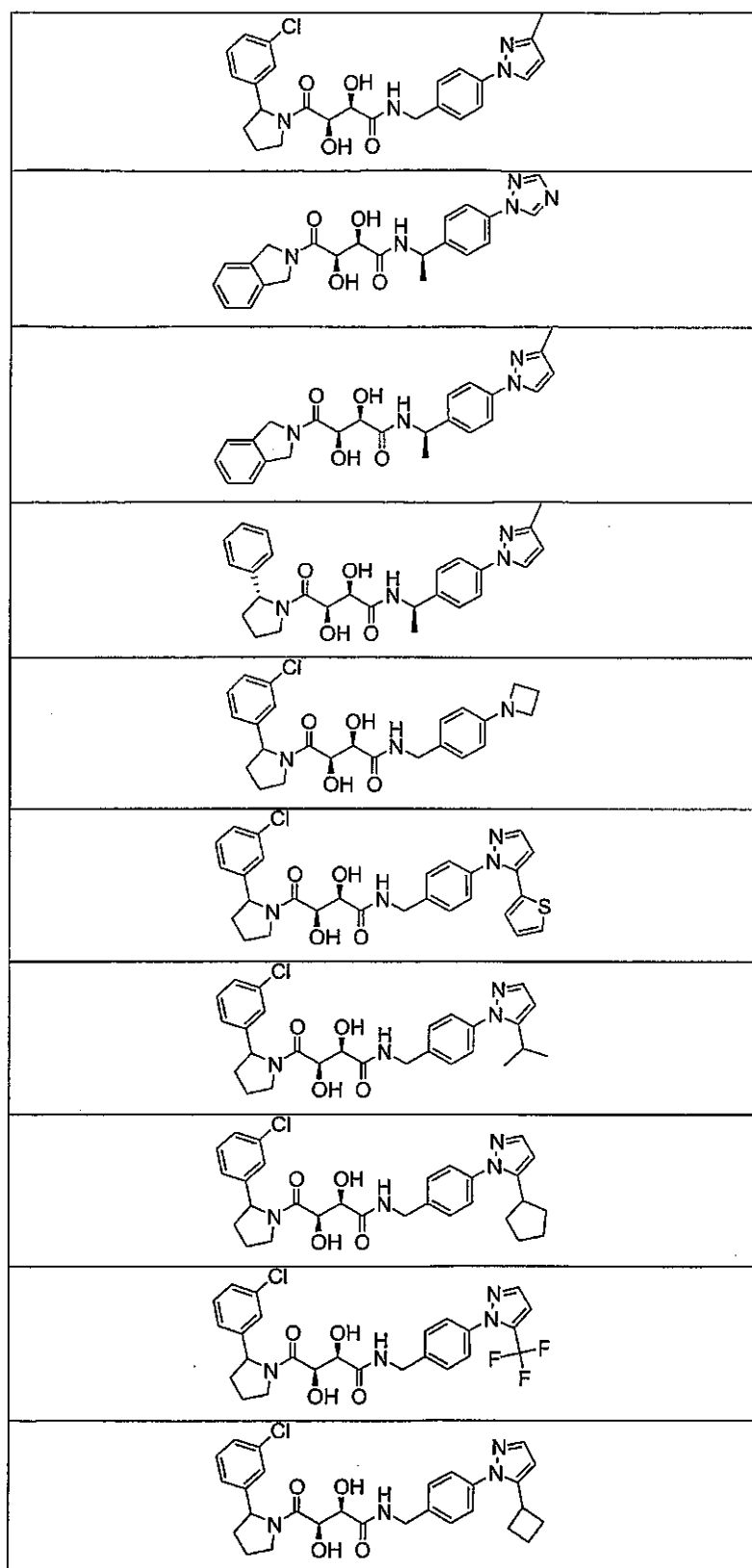


【化 9 5】



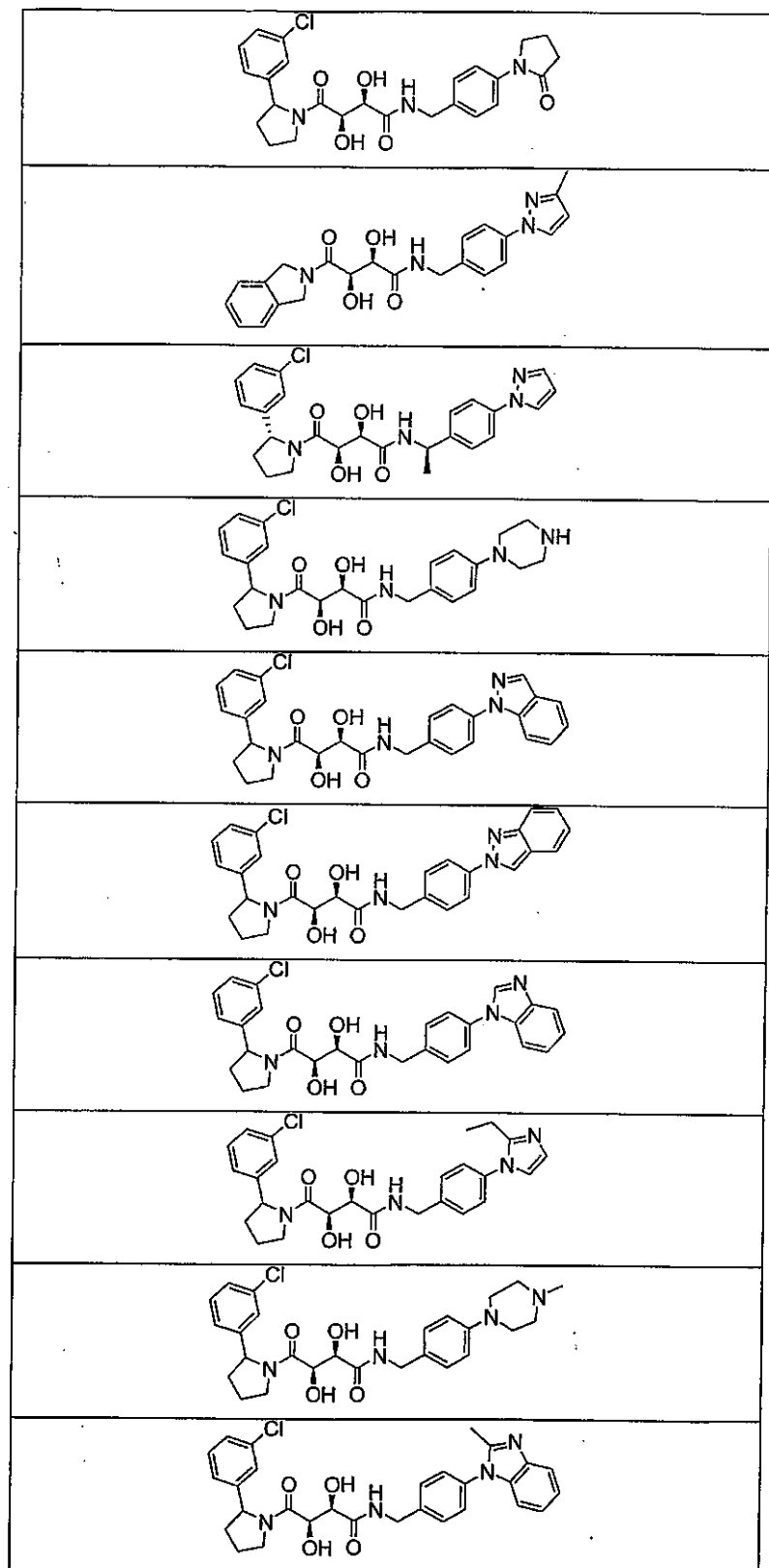


【化 9 6】



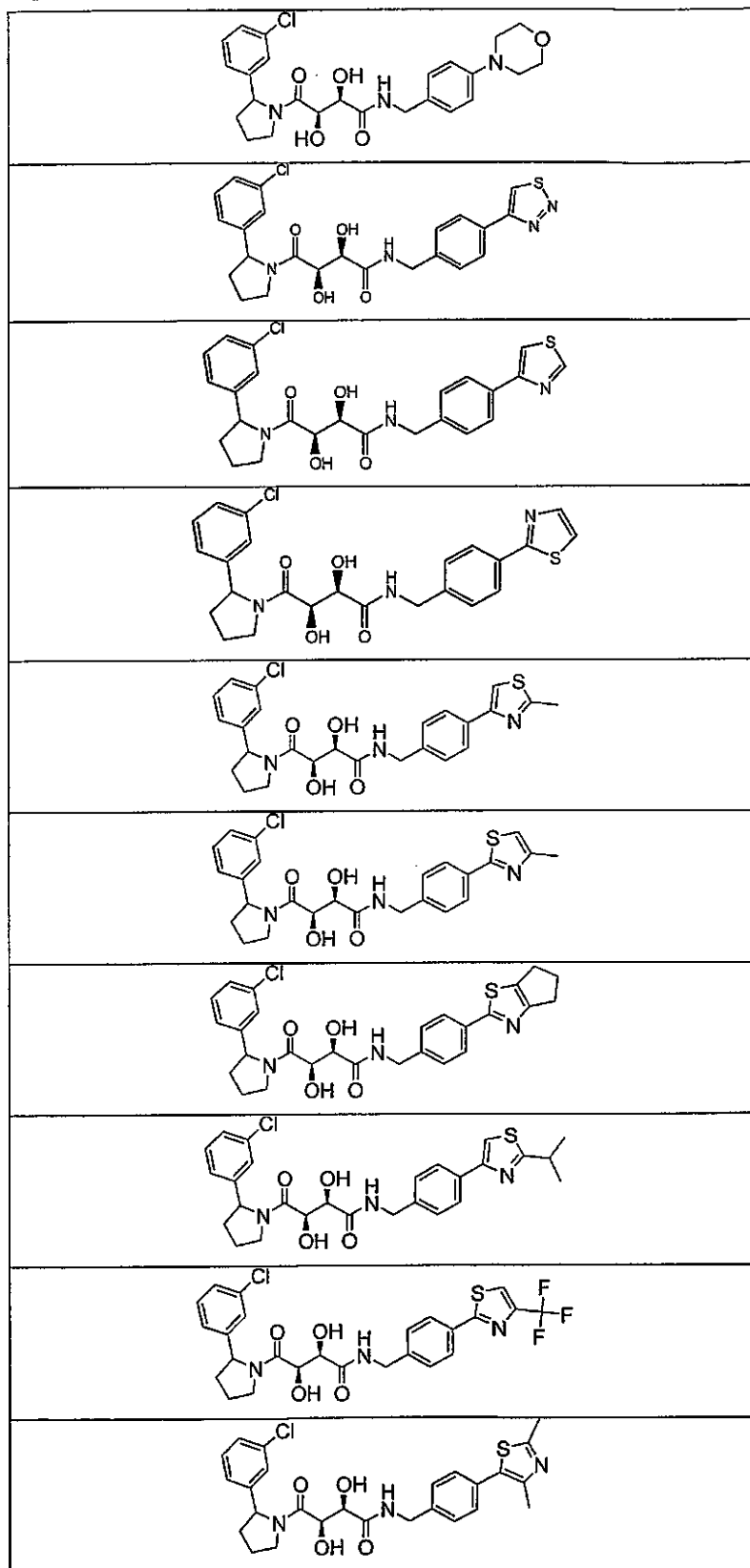


【化 97】



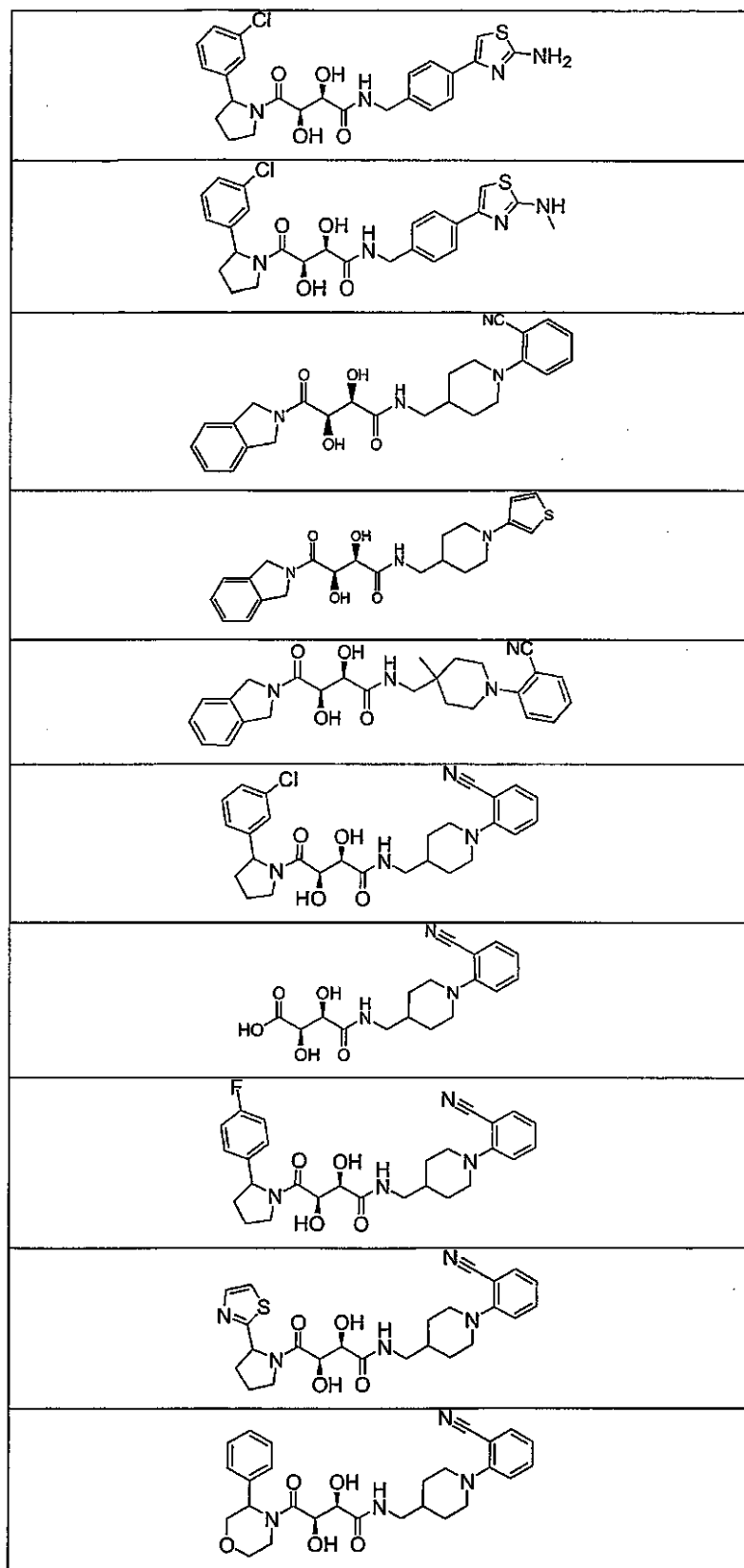


【化 9 8】



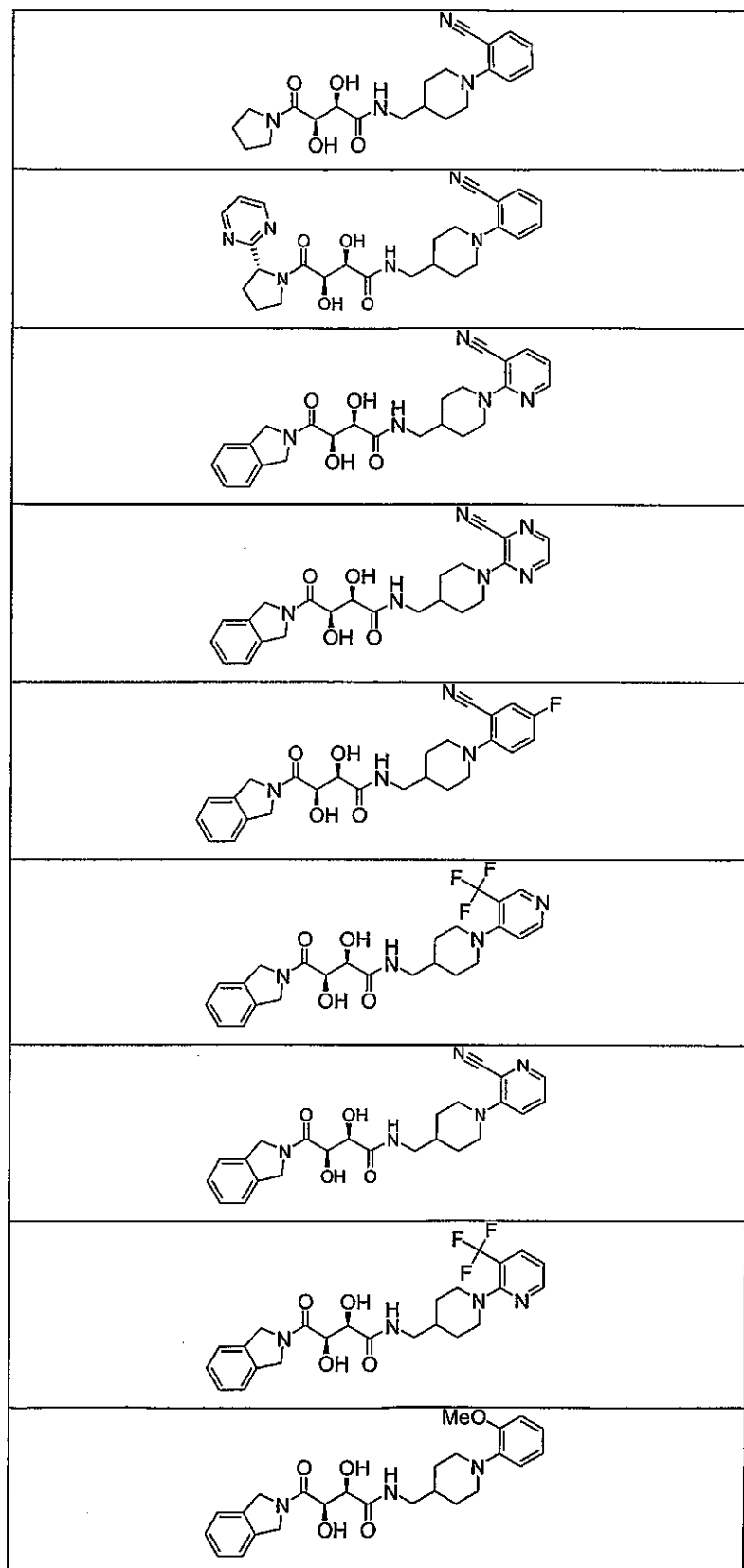


【化 9 9】



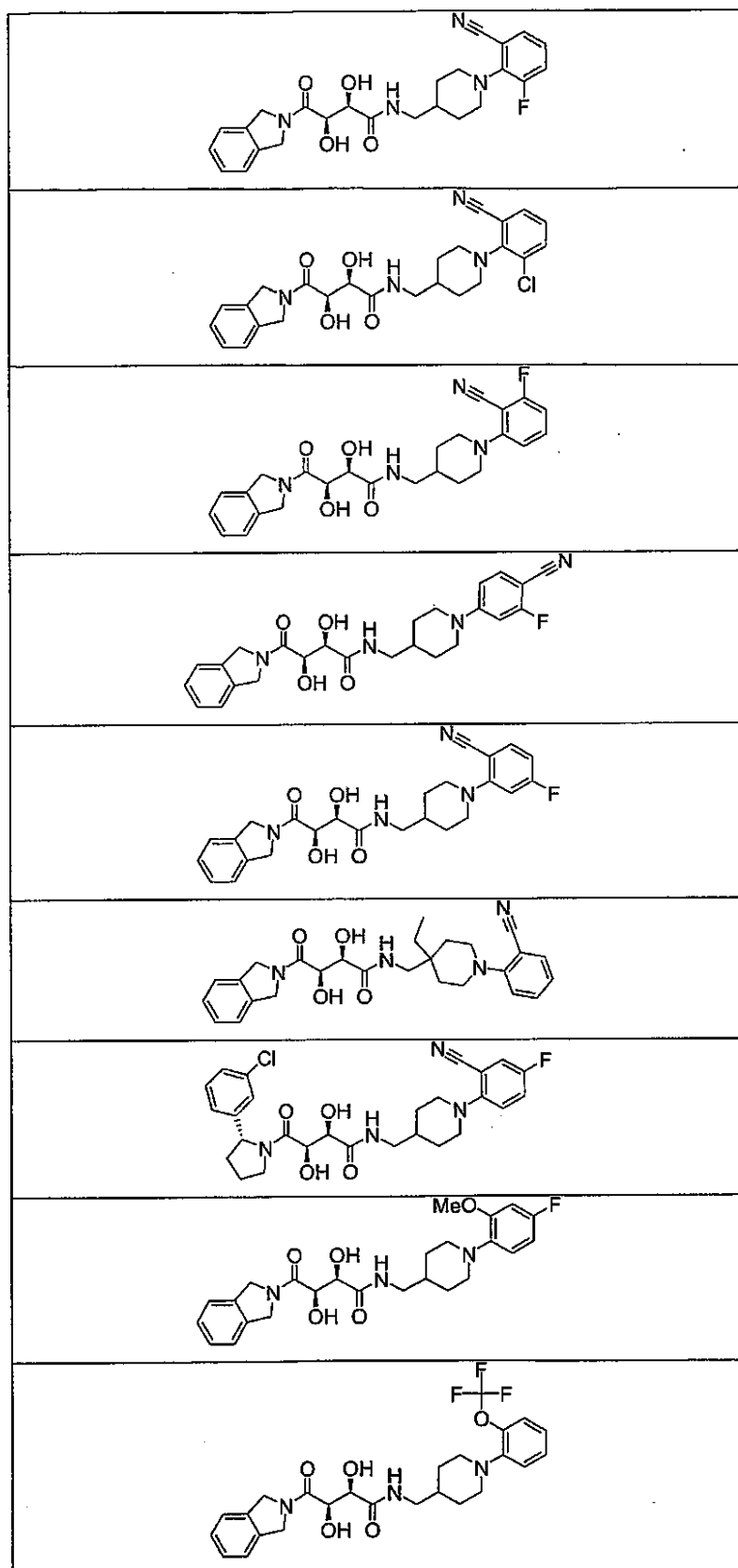


【化 1 0 0】



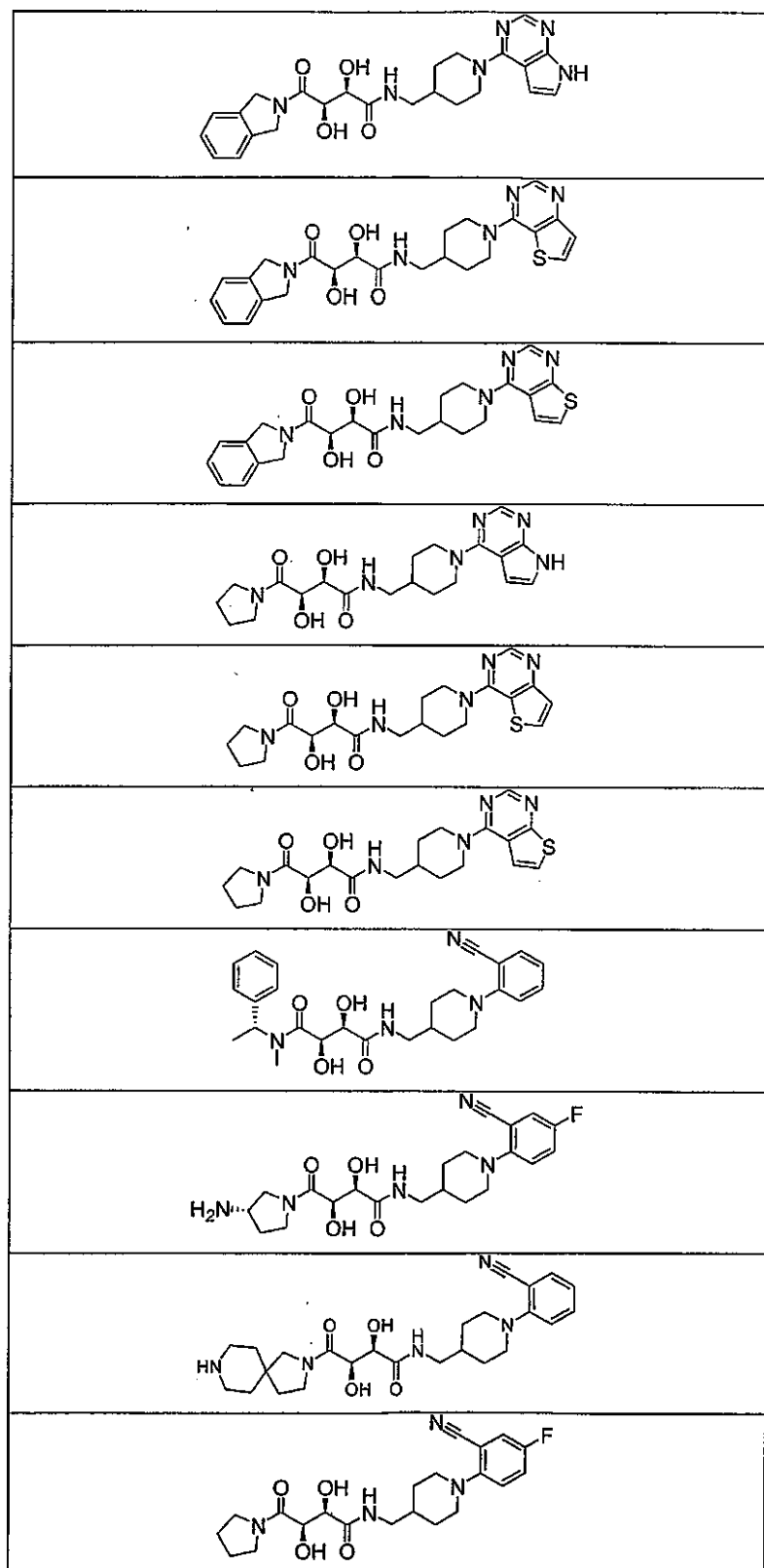


【化 1 0 1】



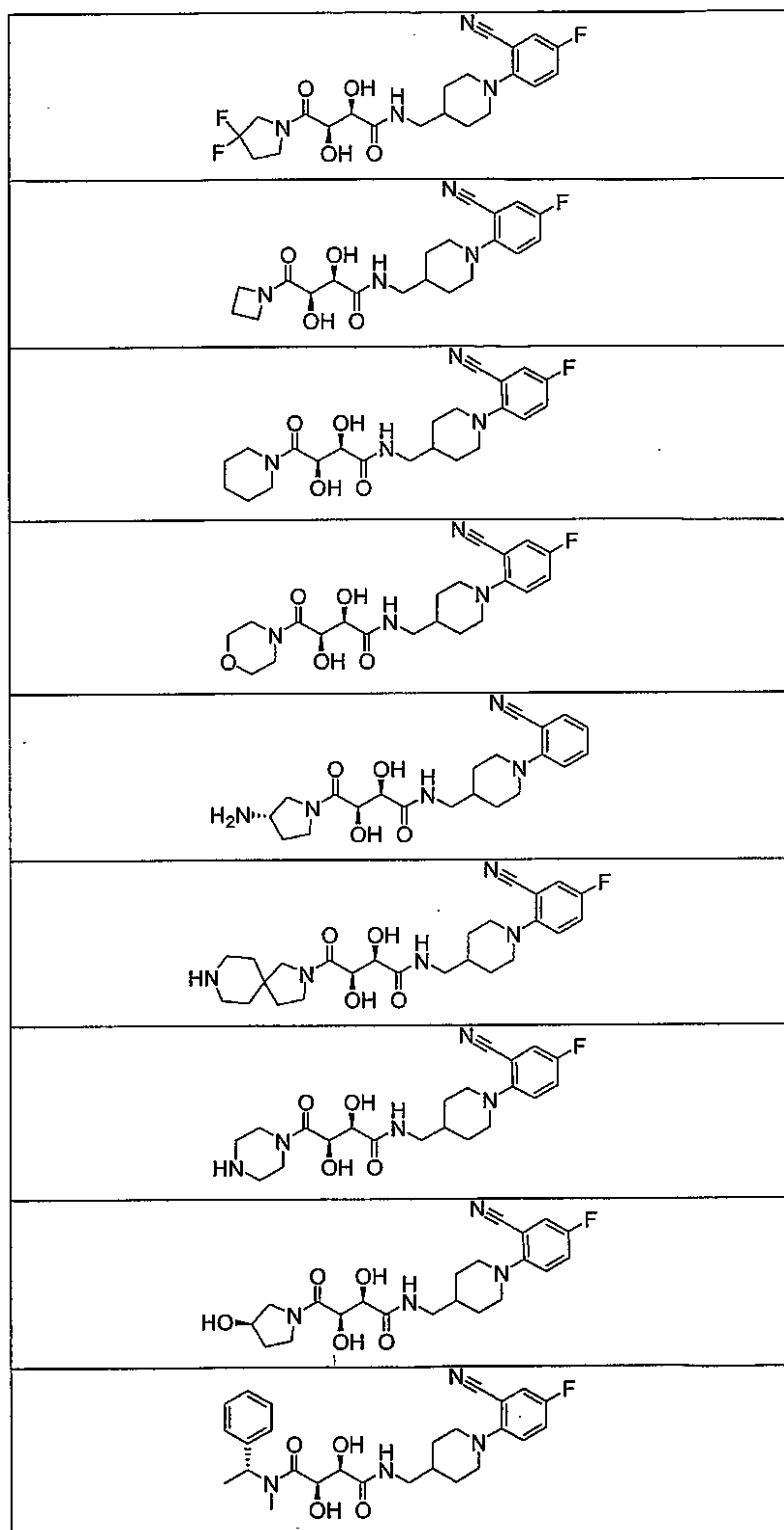


【化 1 0 2】



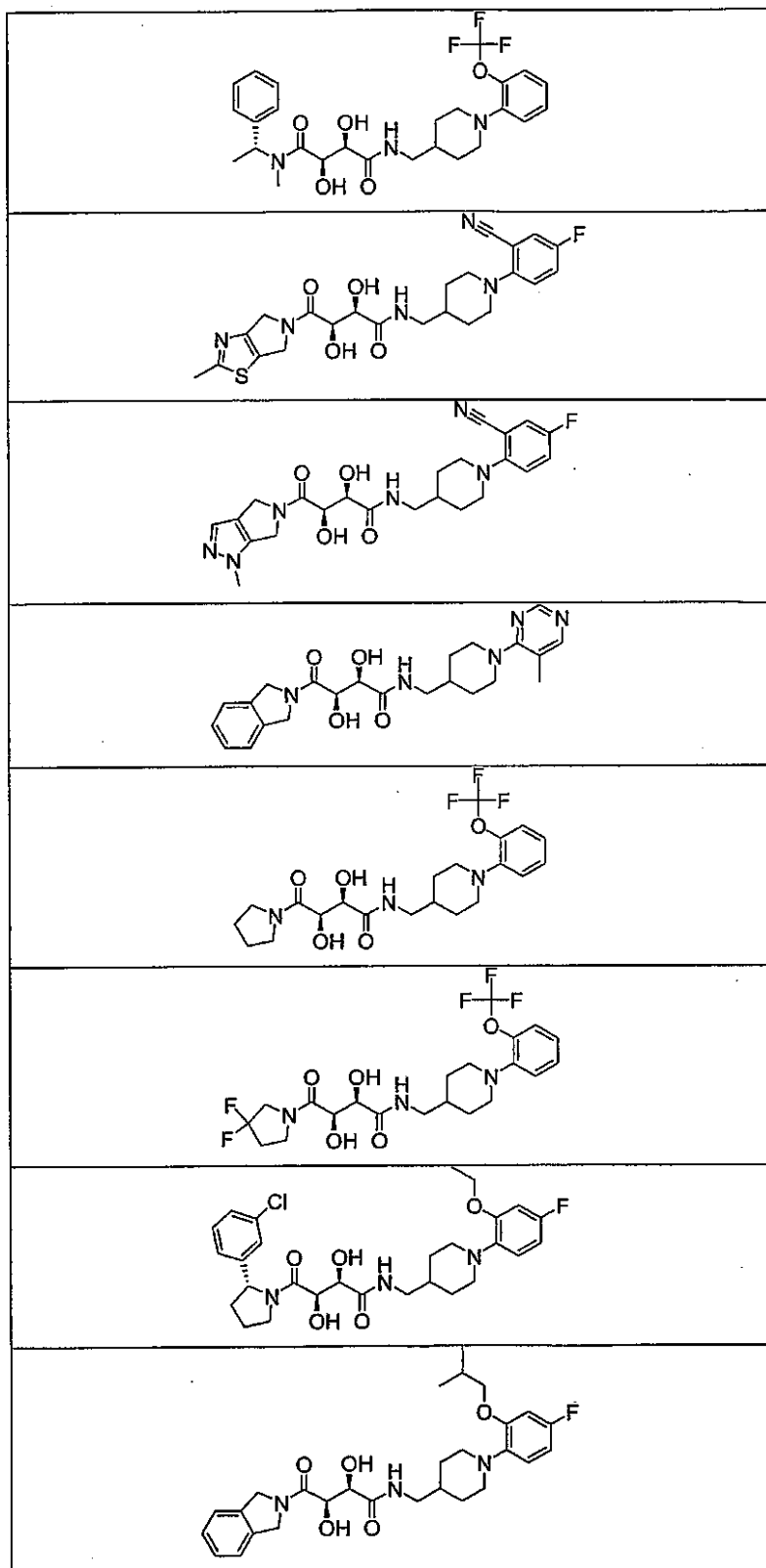


【化 1 0 3】



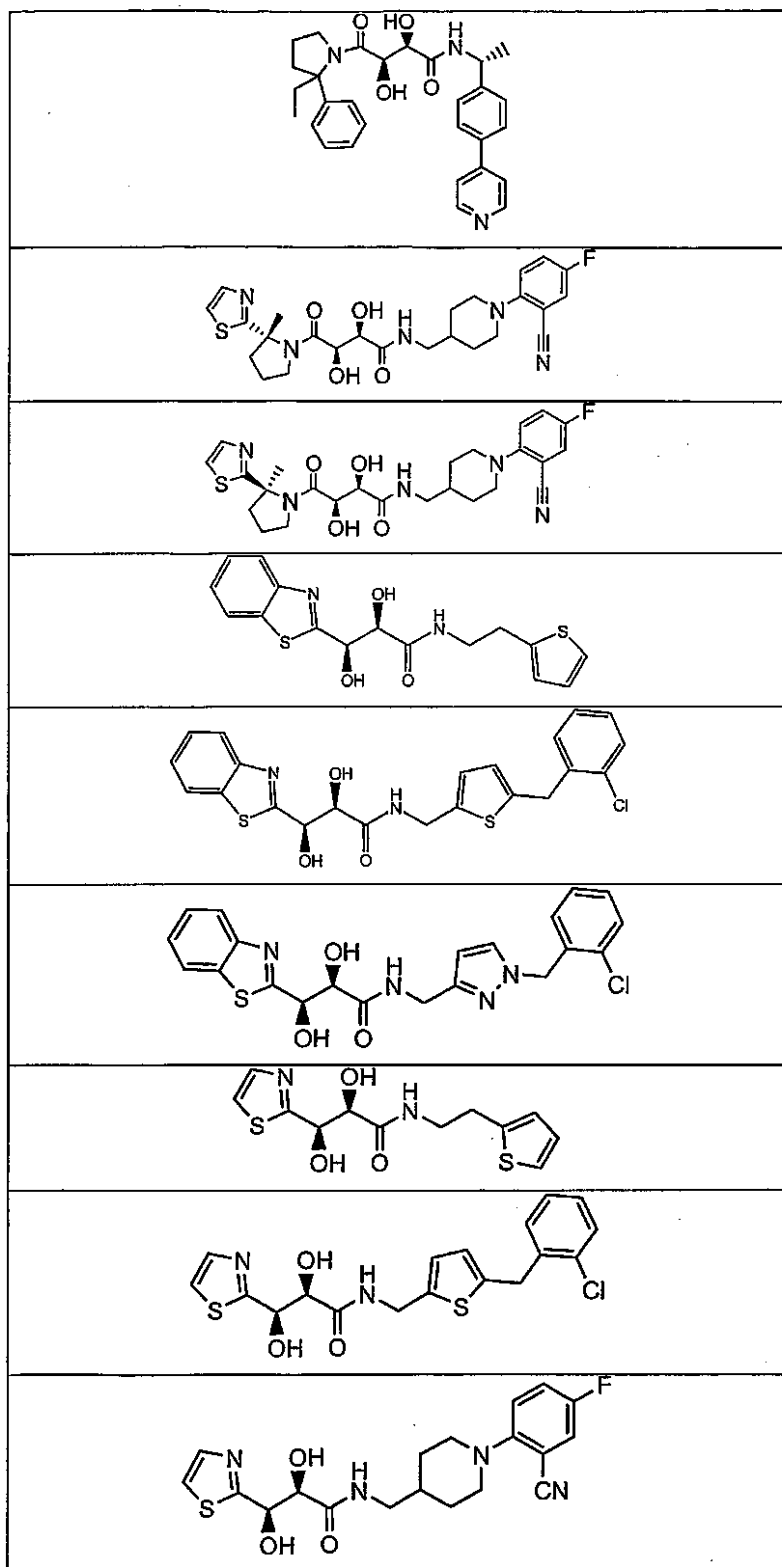


【化 1 0 4】



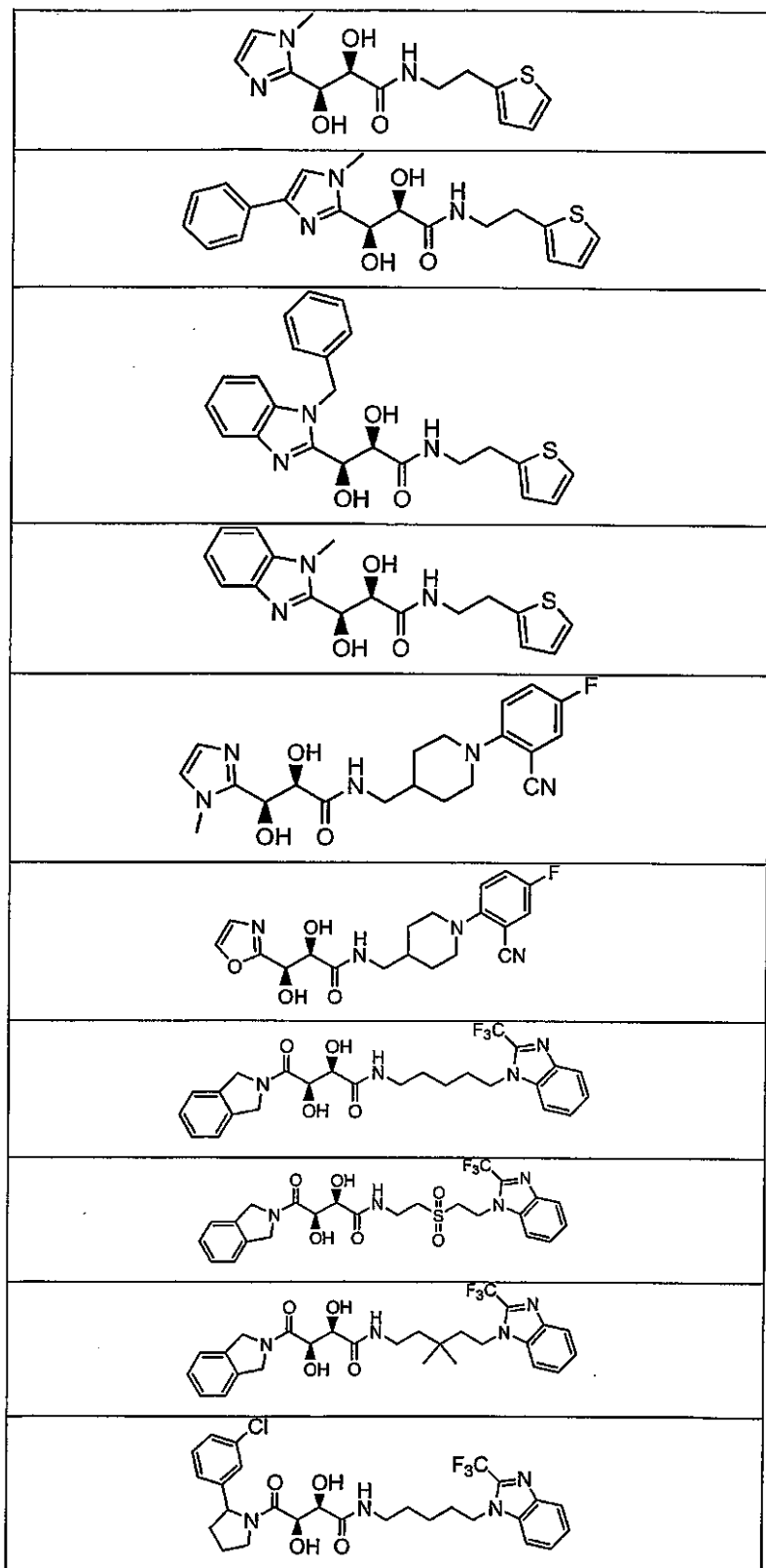


【化 1 0 5】



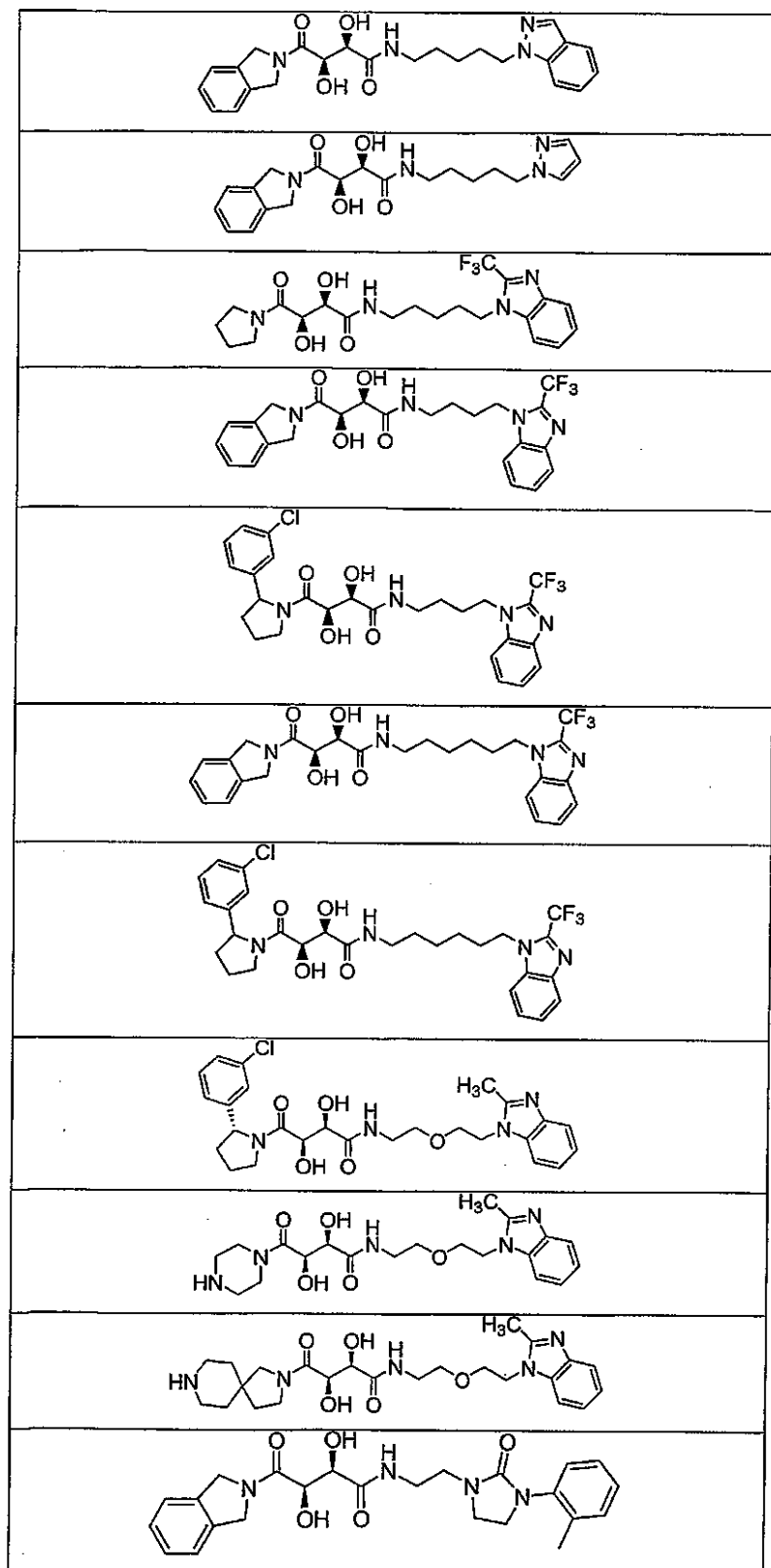


【化 1 0 6】



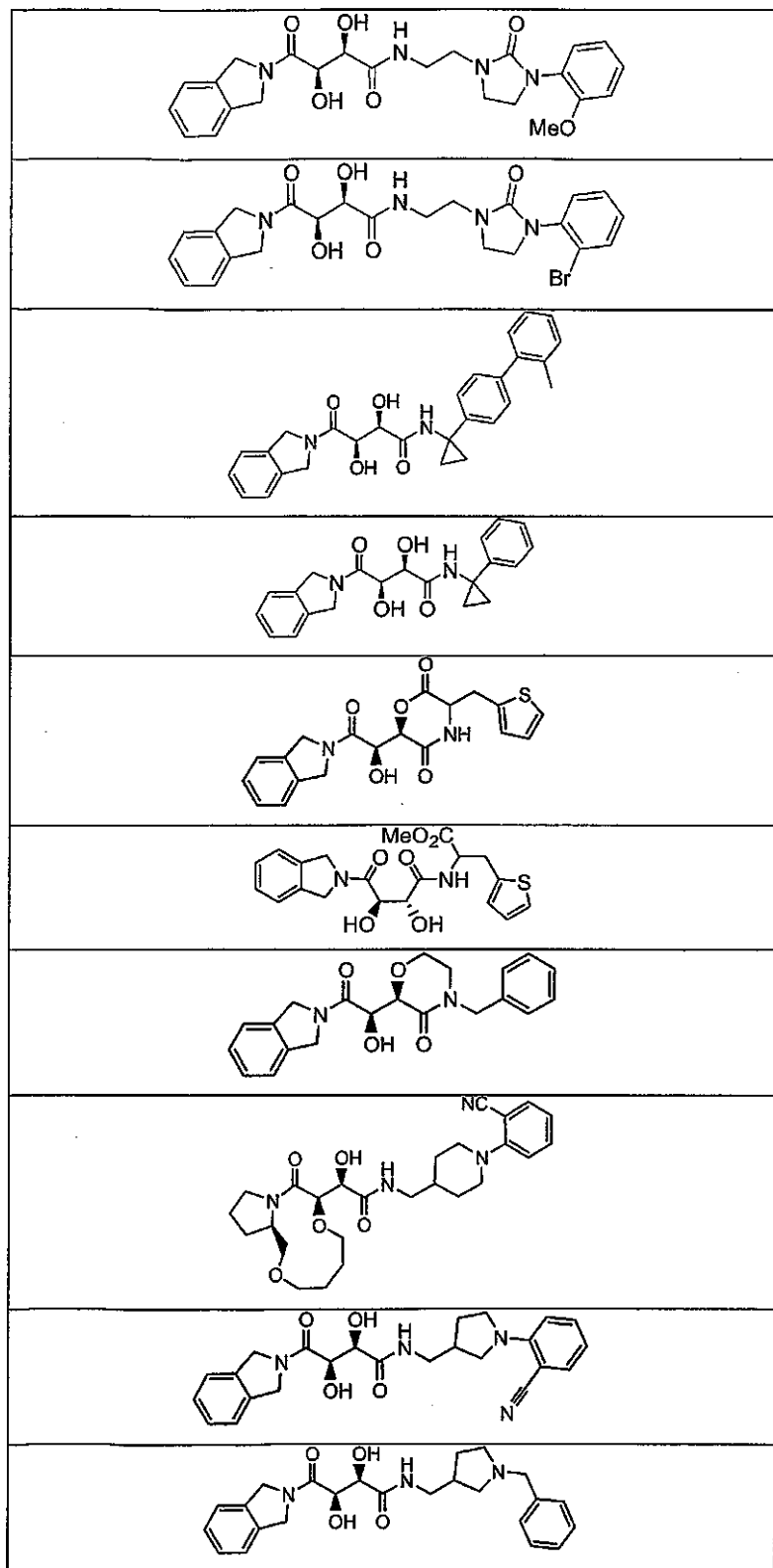


【化 1 0 7】



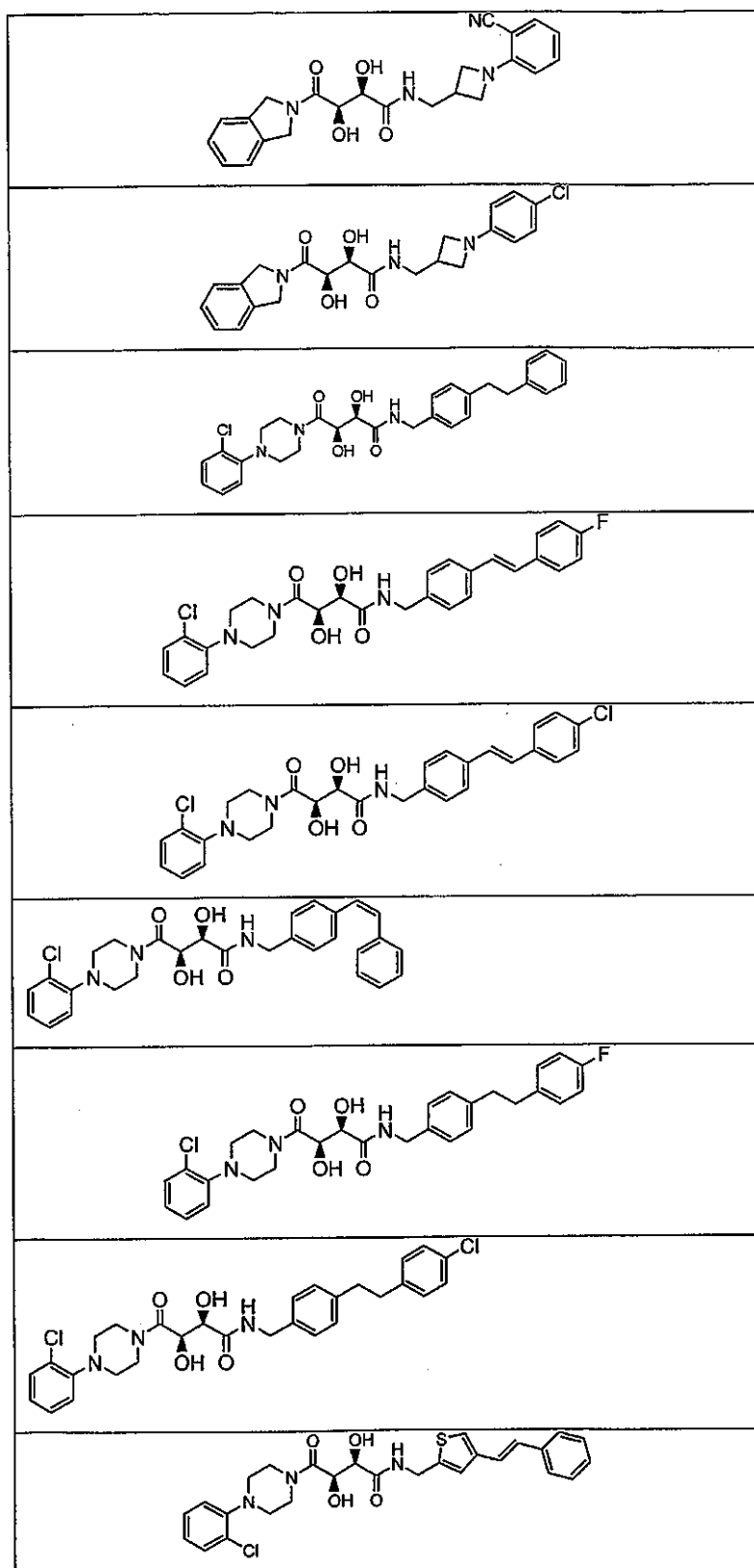


【化 108】



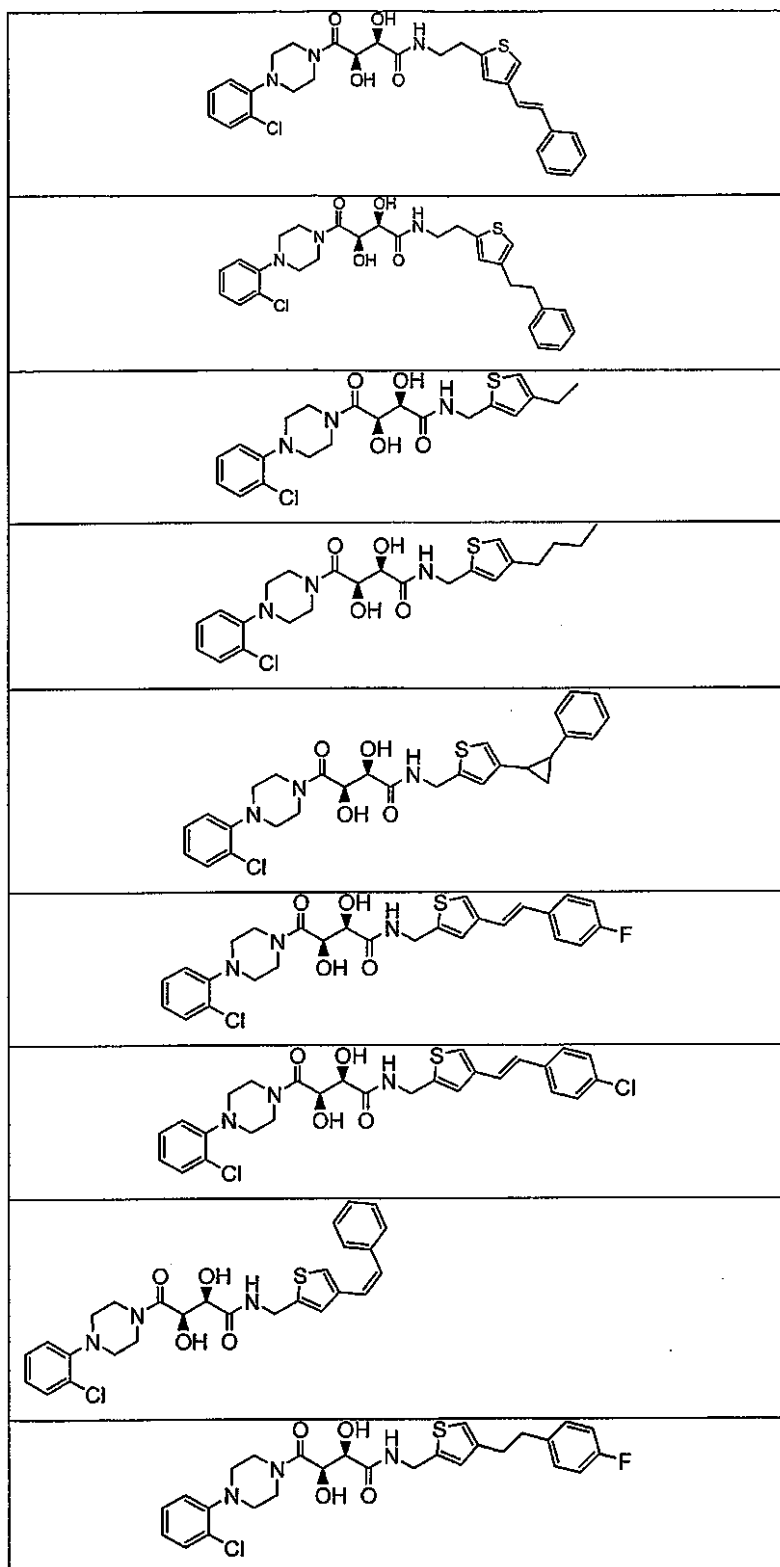


【化 1 0 9】



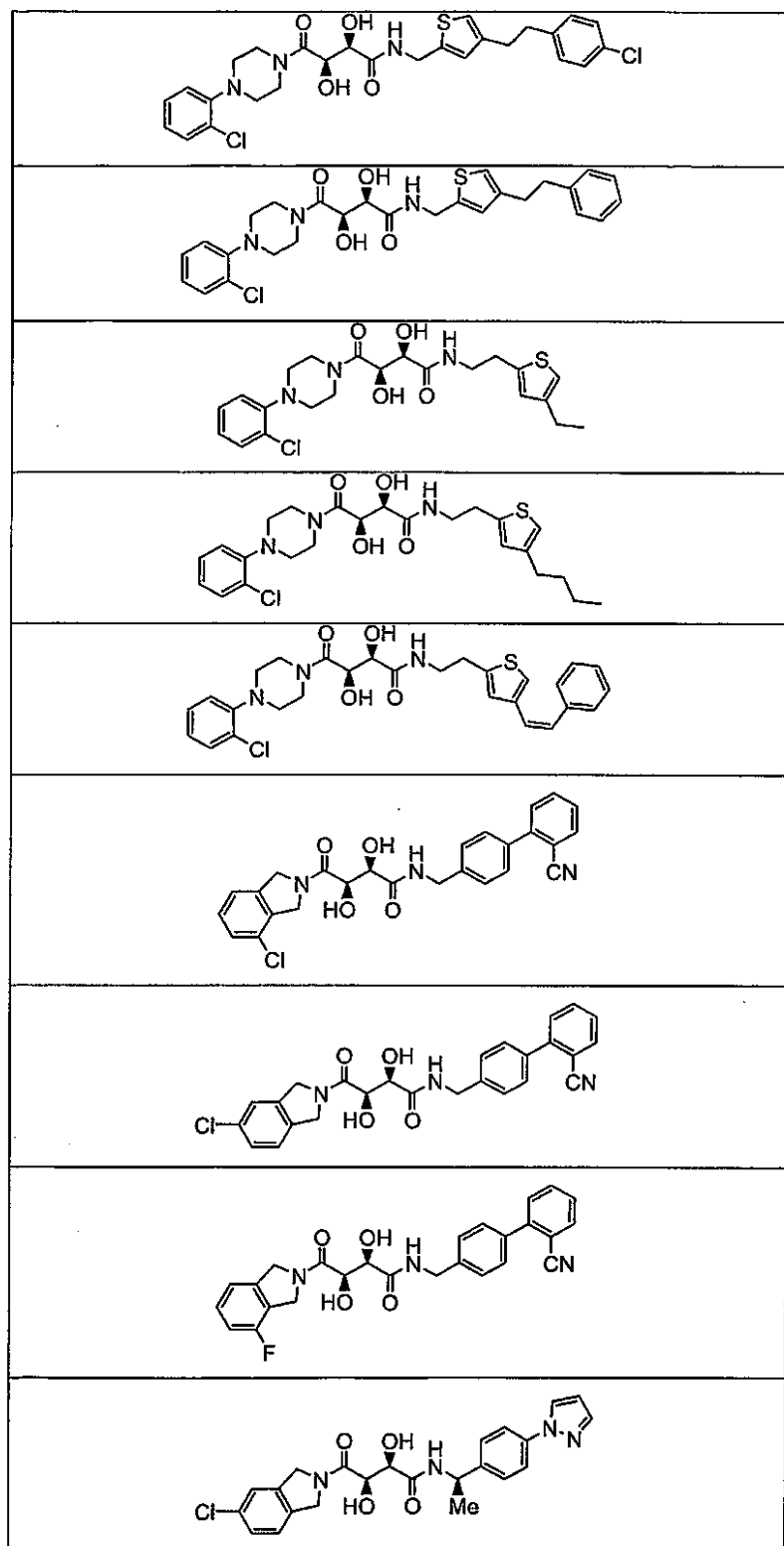


【化 1 1 0】



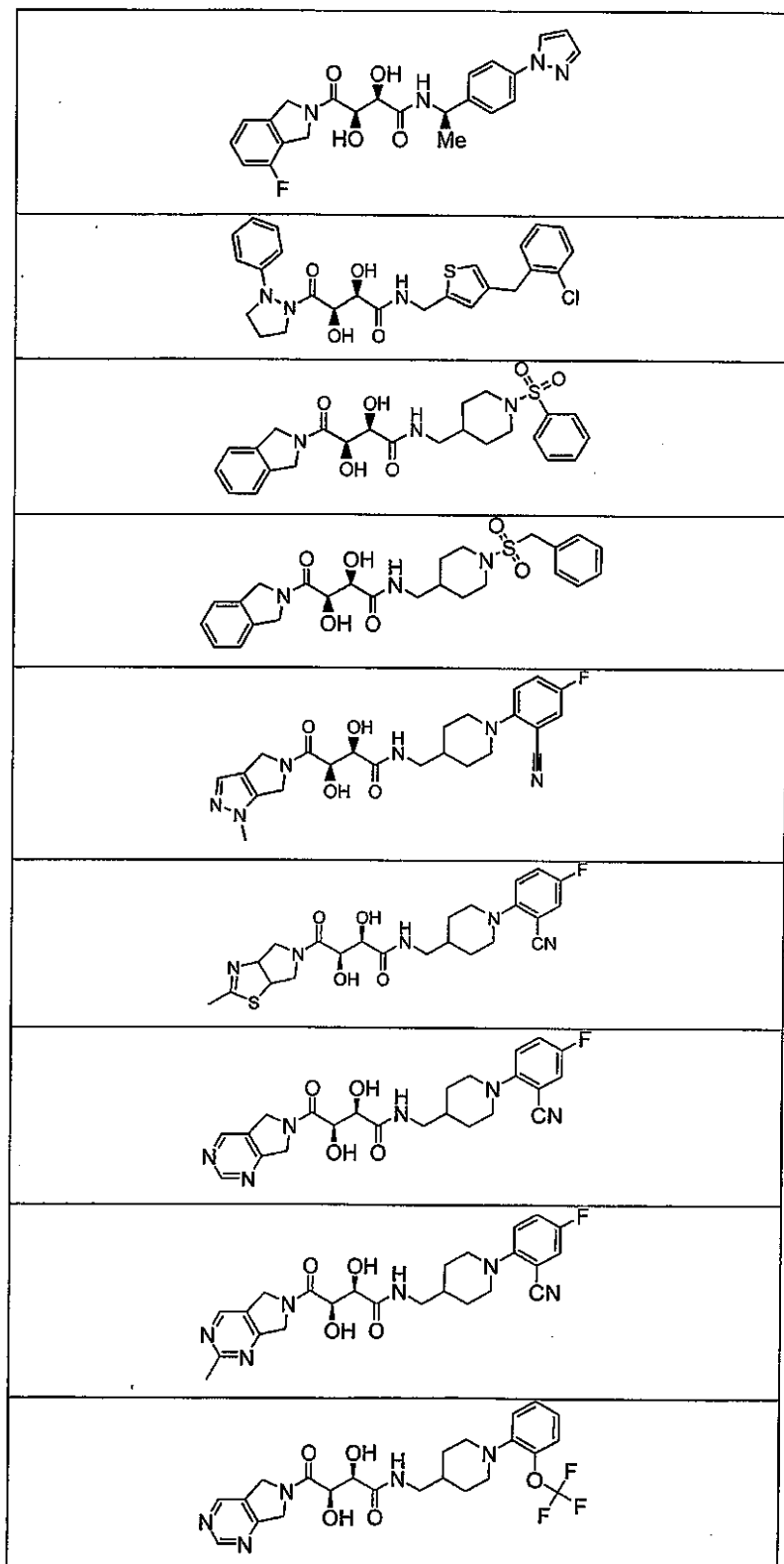


【化 1 1 1】



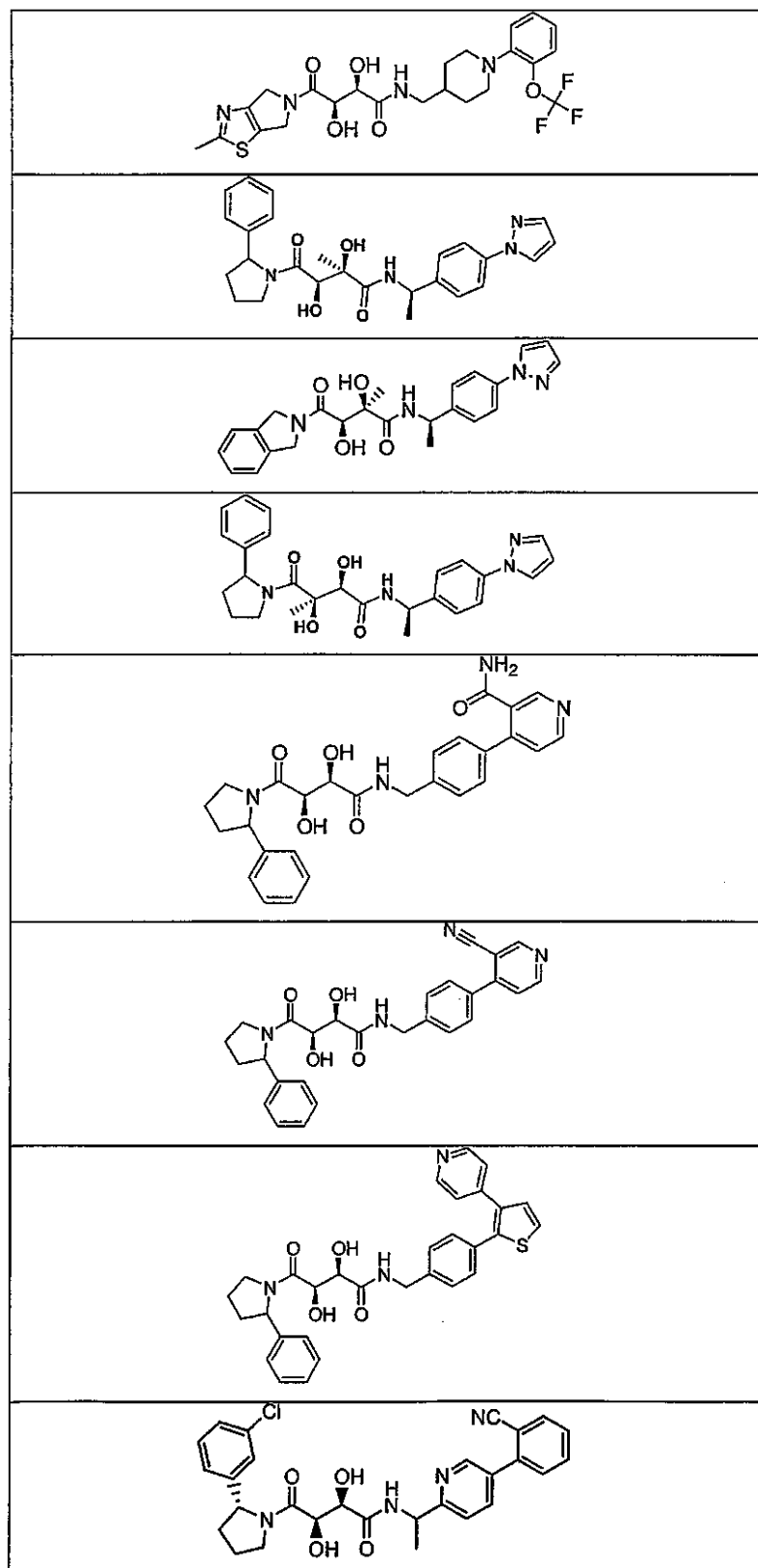


## 【化 1 1 2】



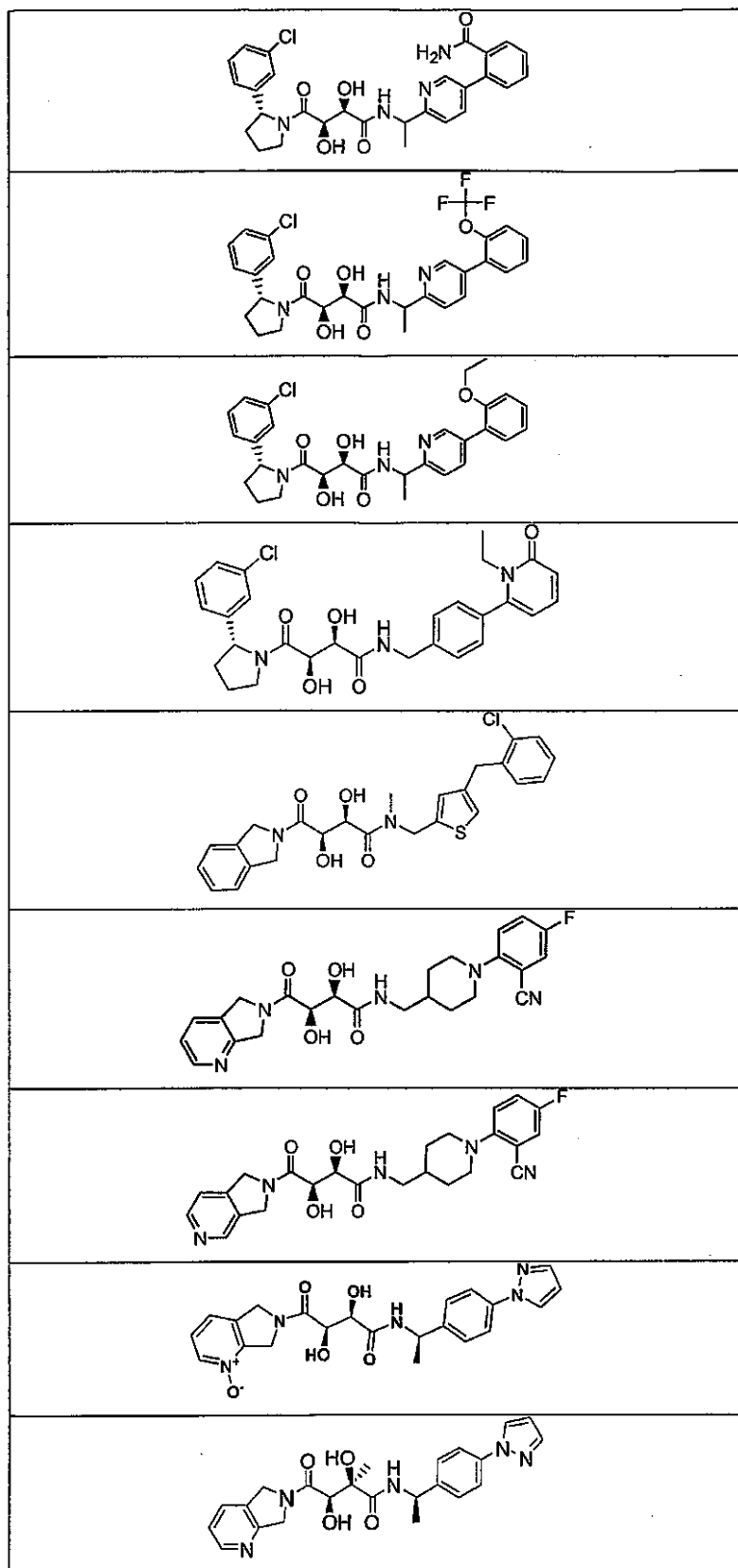


【化 1 1 3】



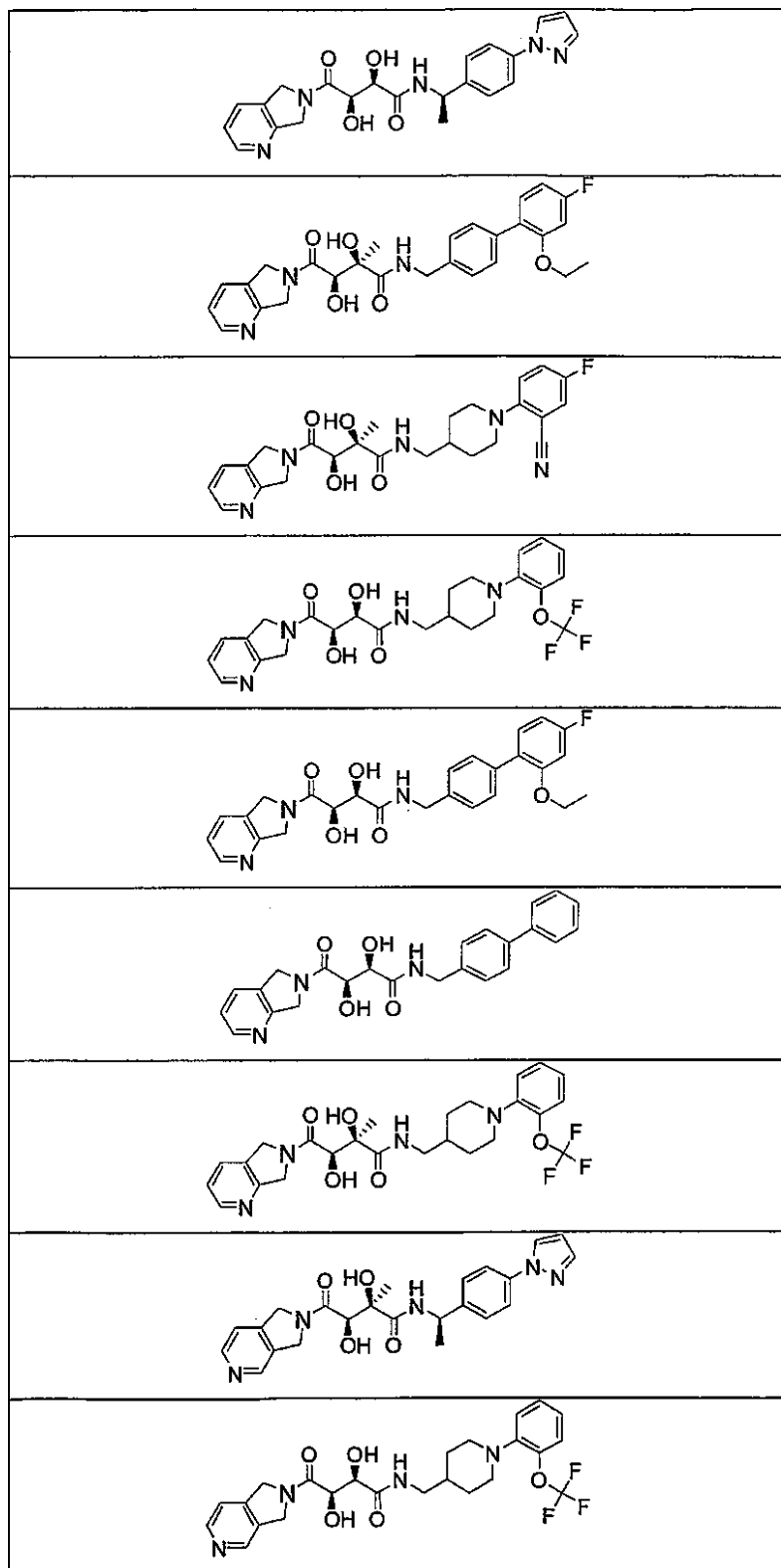


【化 1 1 4】



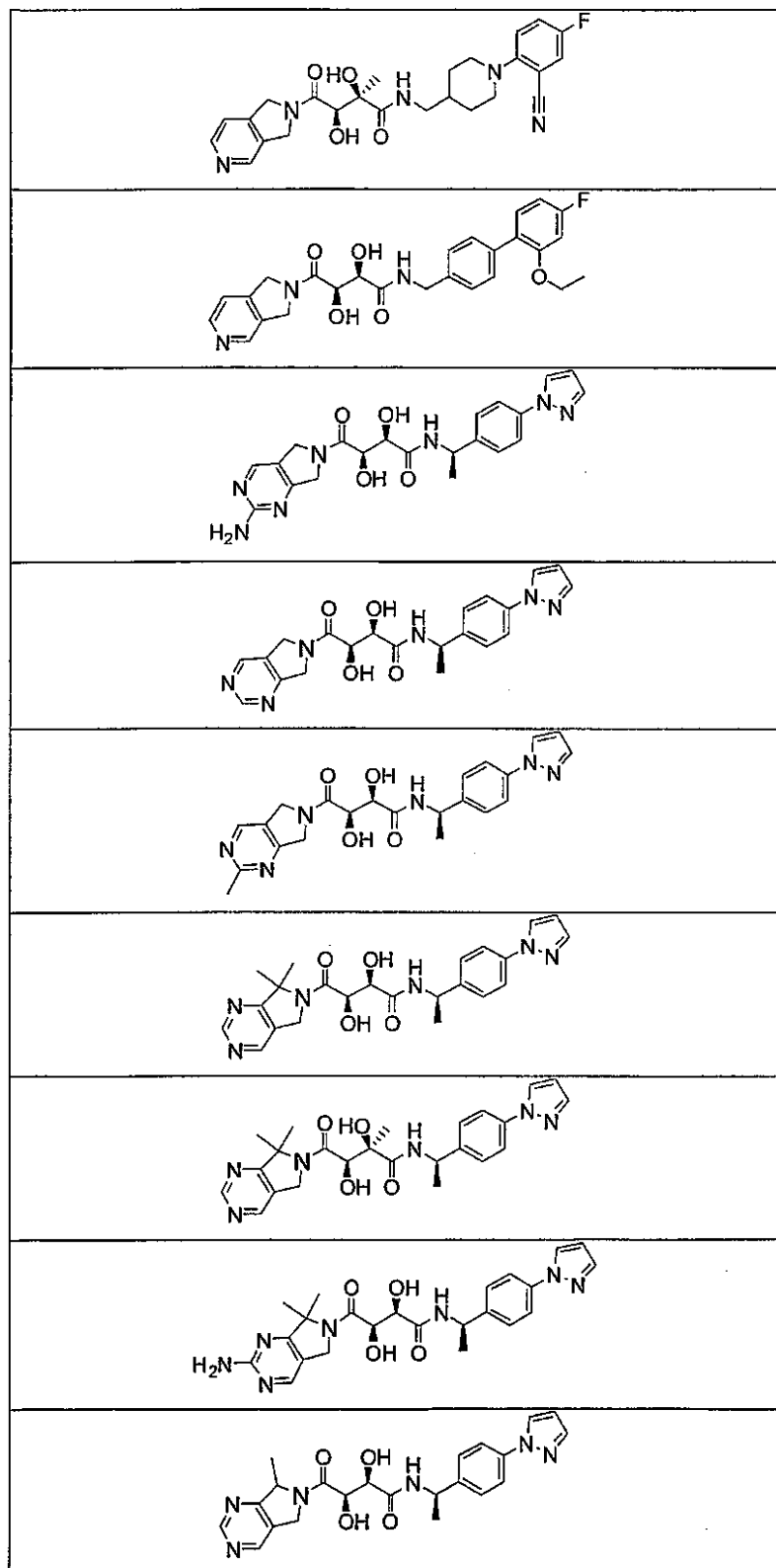


【化 1 1 5】





【化 1 1 6】

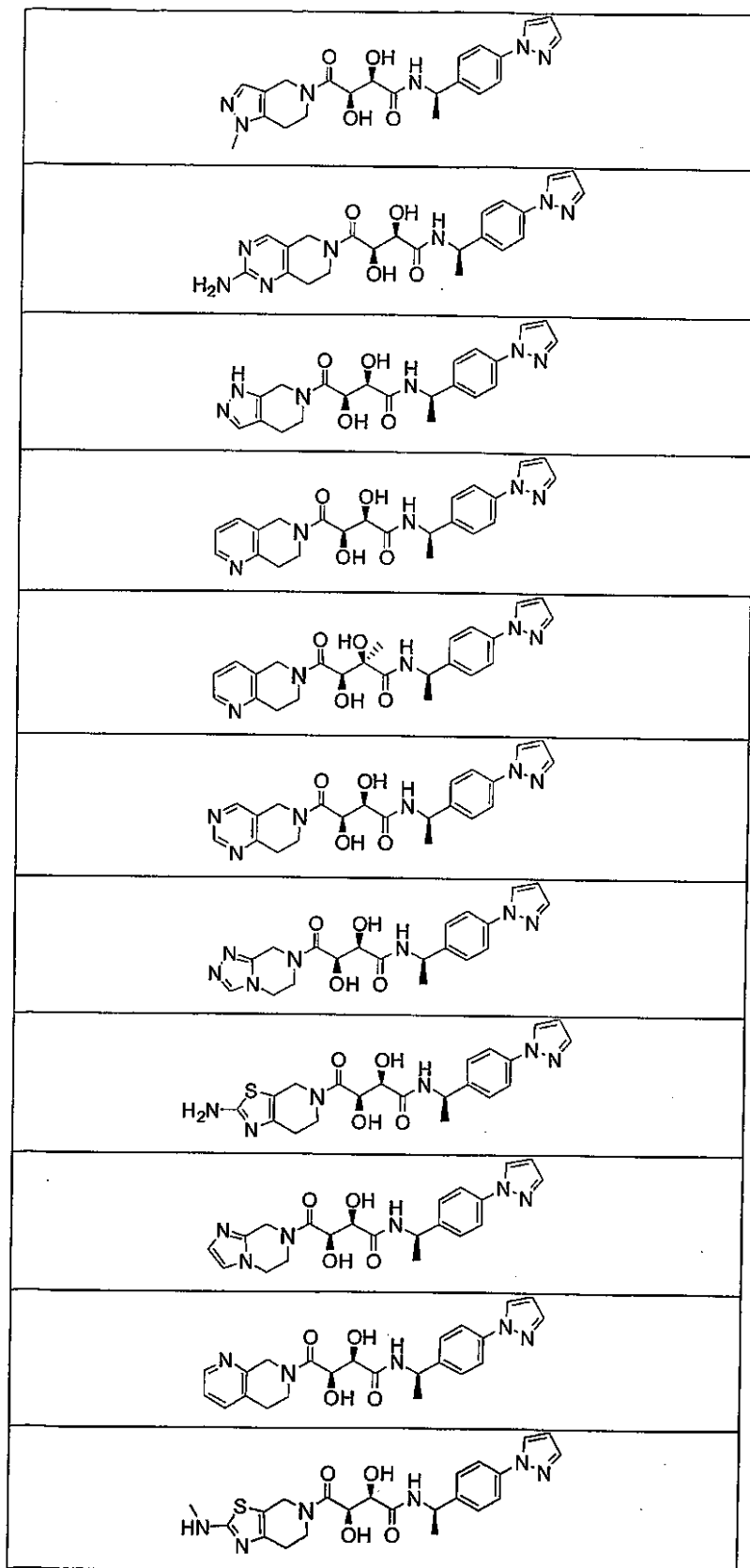




 Chemical structure 1
 Chemical structure 2
 Chemical structure 3
 Chemical structure 4
 Chemical structure 5
 Chemical structure 6
 Chemical structure 7

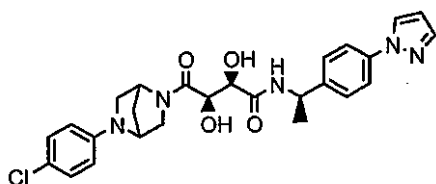
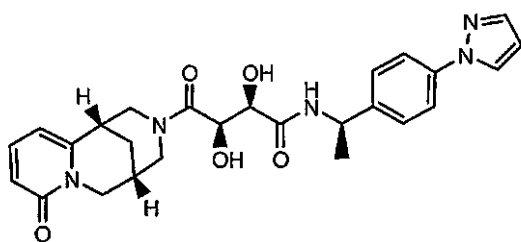
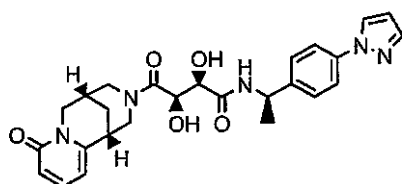
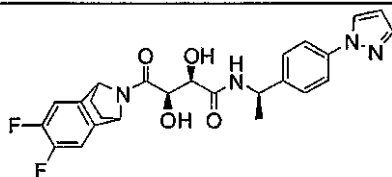
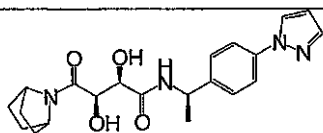
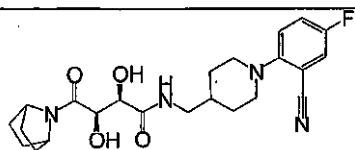
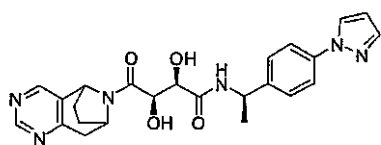


【化 1 1 8】



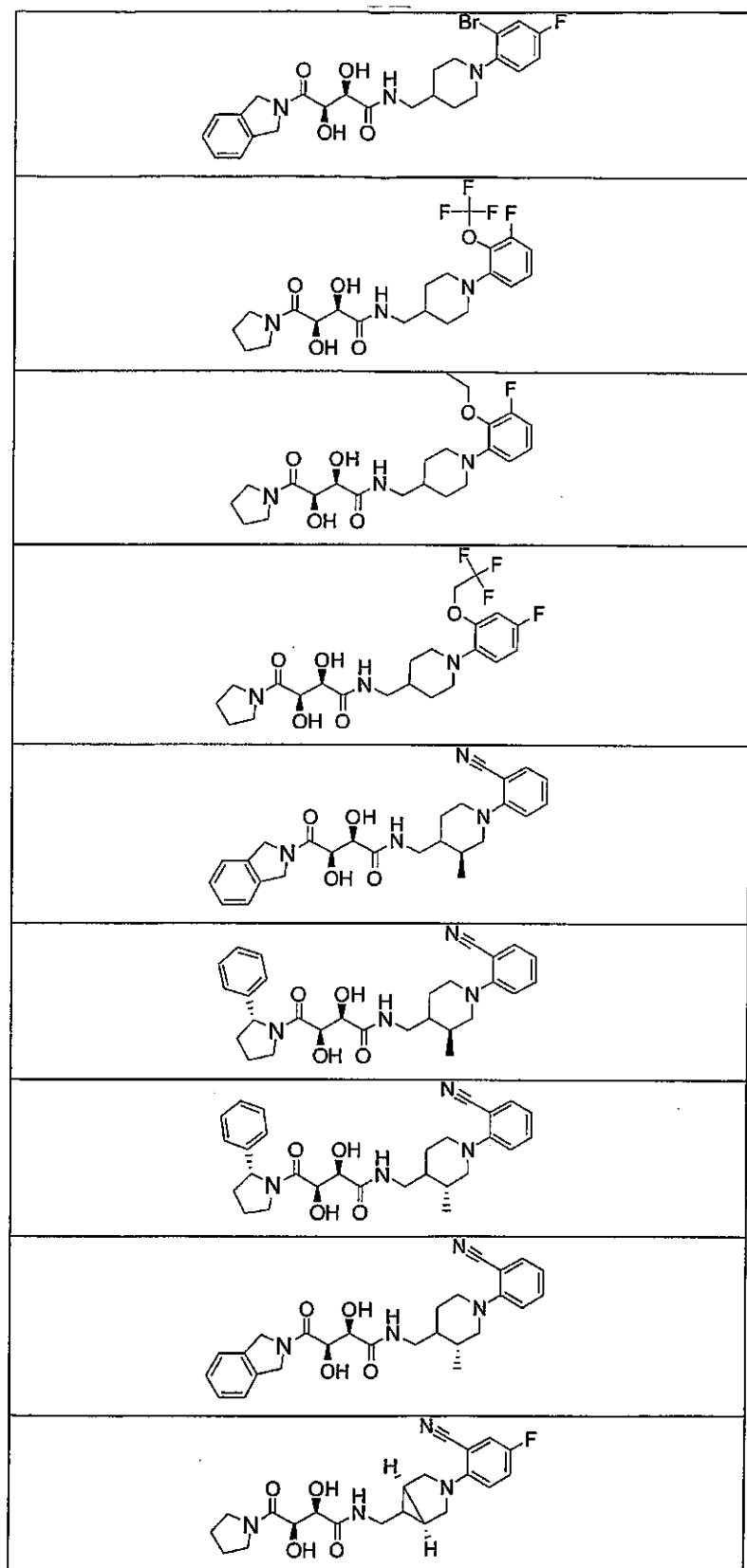


【化 1 1 9】



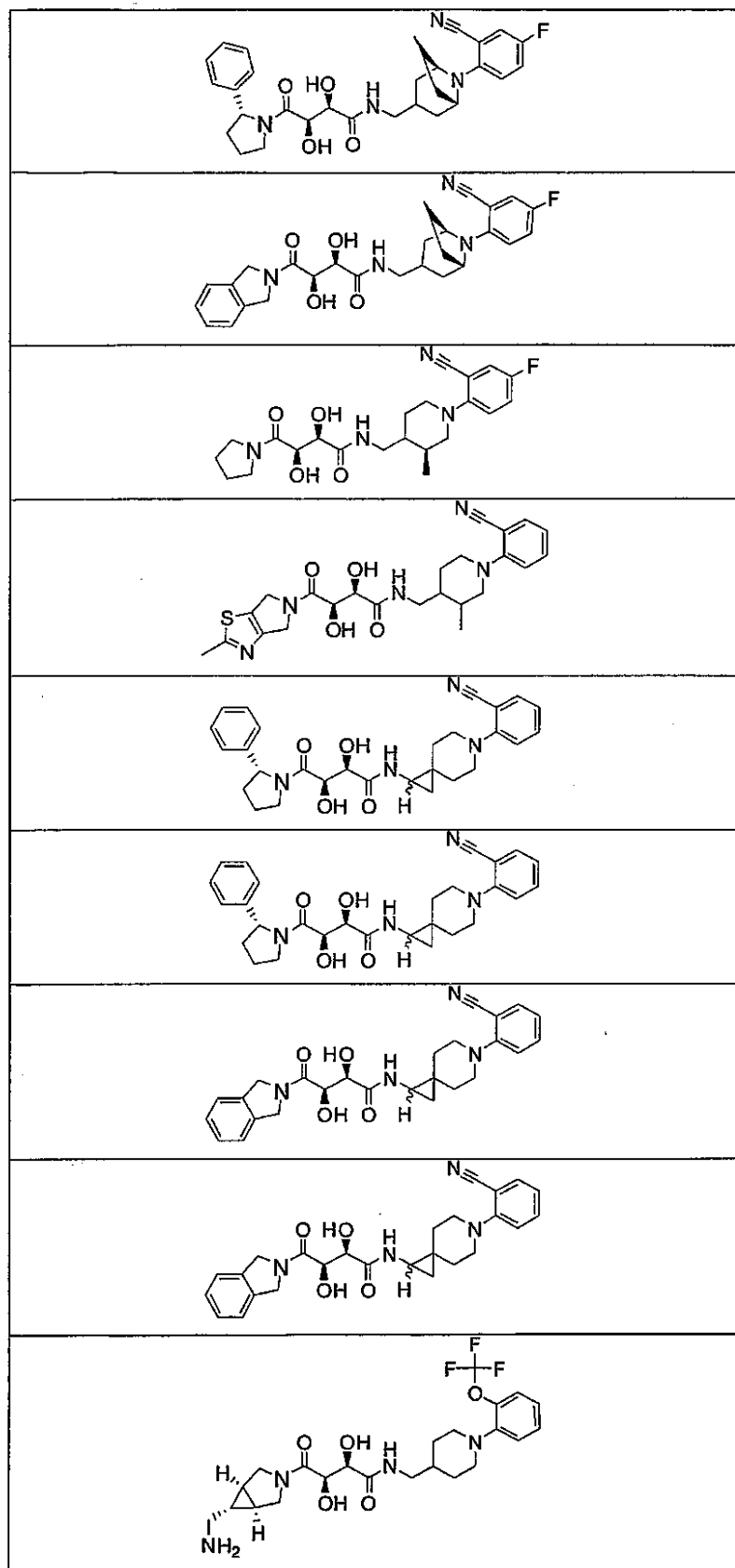


【化 1 2 0】



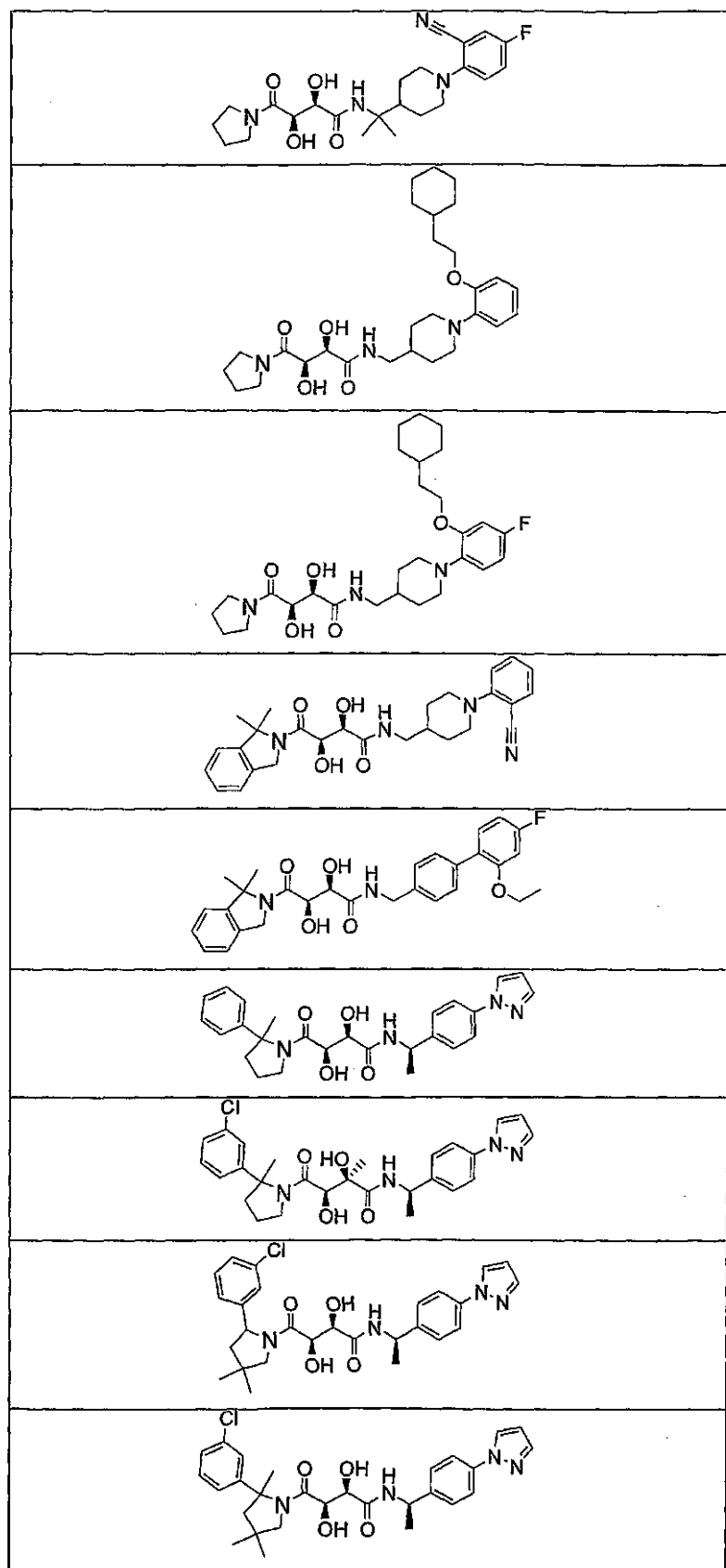


【化 1 2 1】



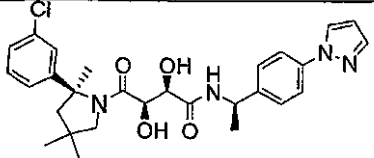
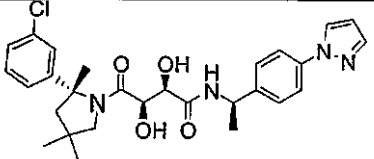
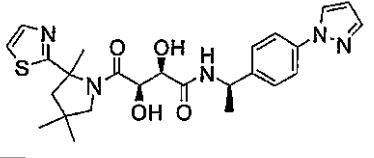
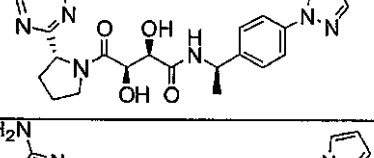
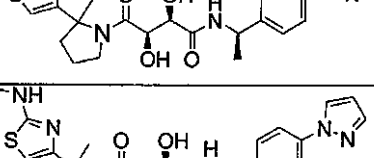
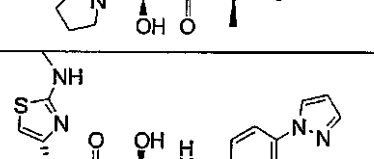
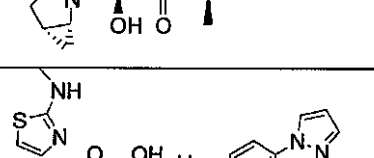
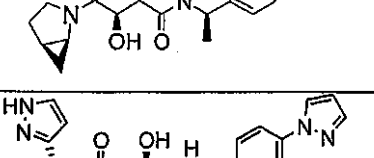
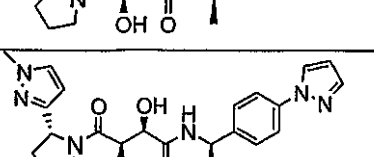


【化 1 2 2】



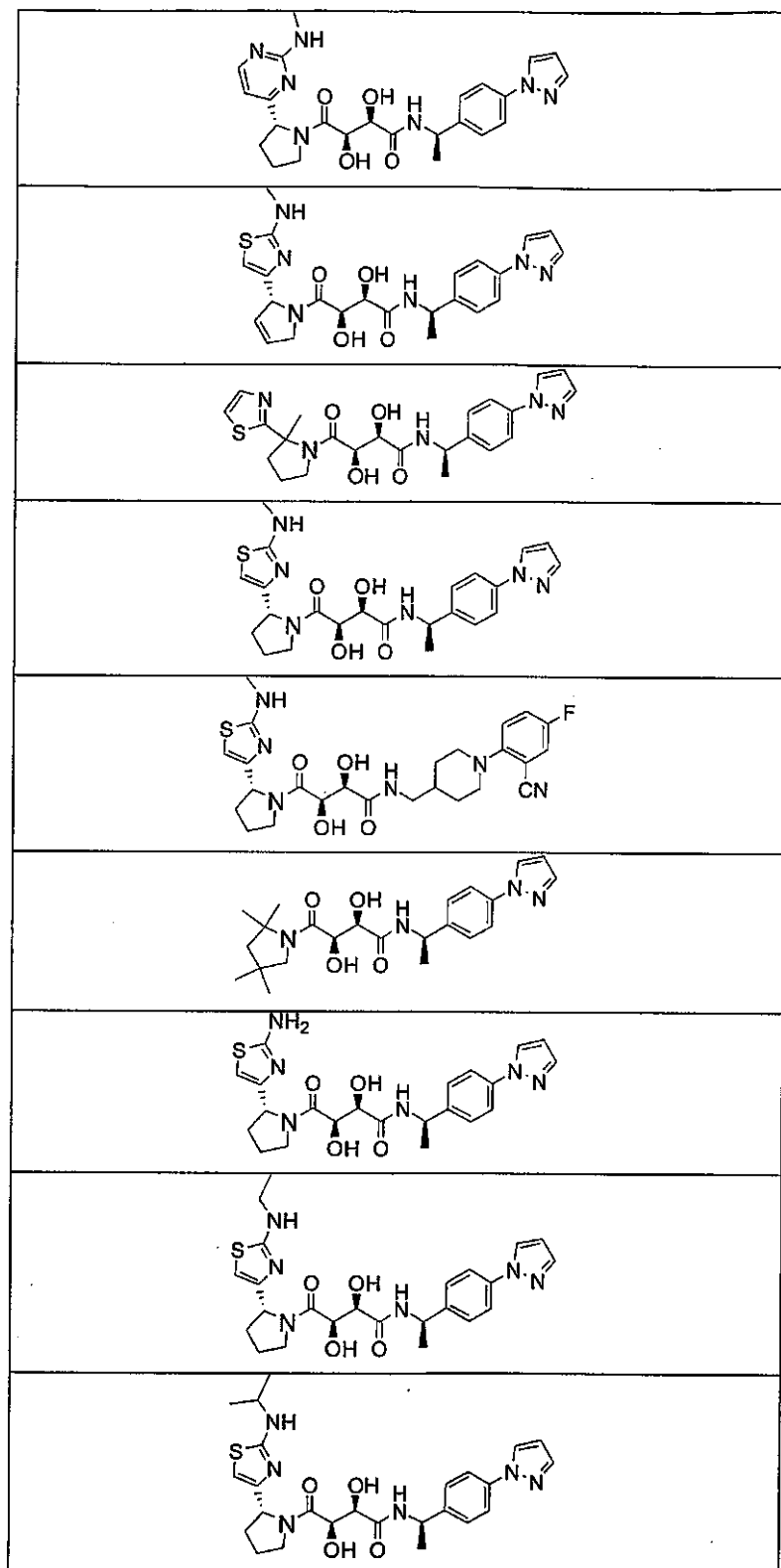


## 【化 1 2 3】

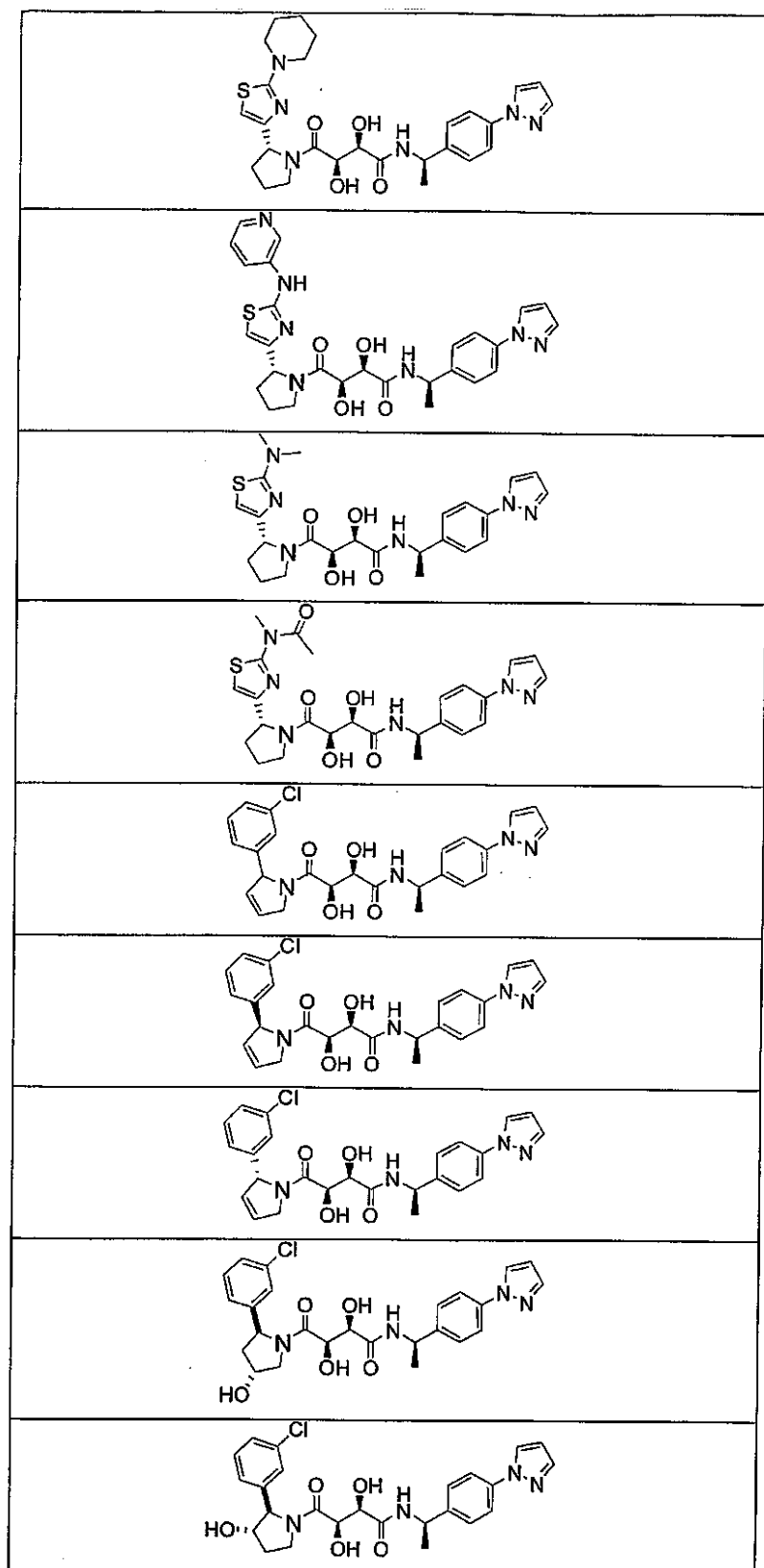


【化 1 2 4】



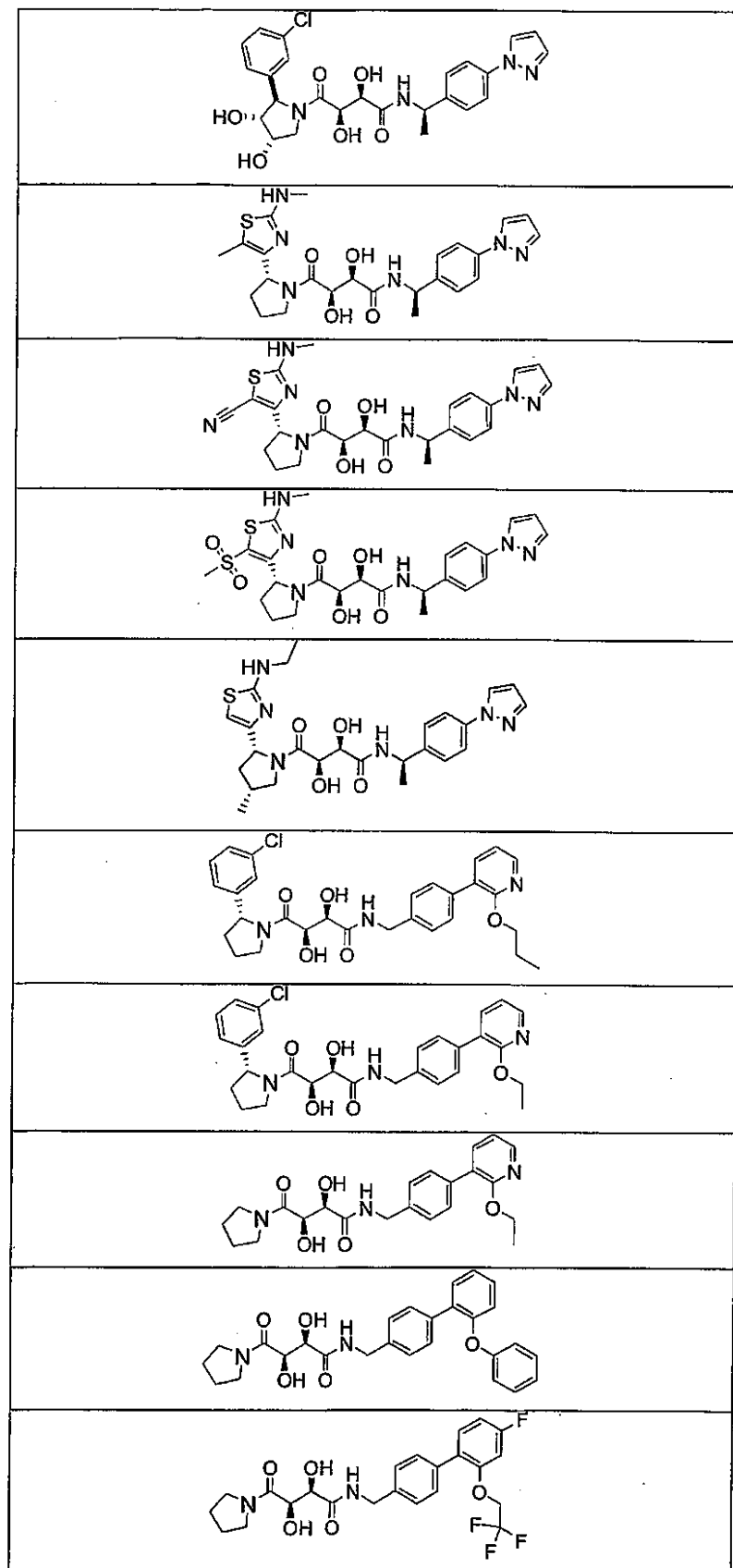


【化 1 2 5】



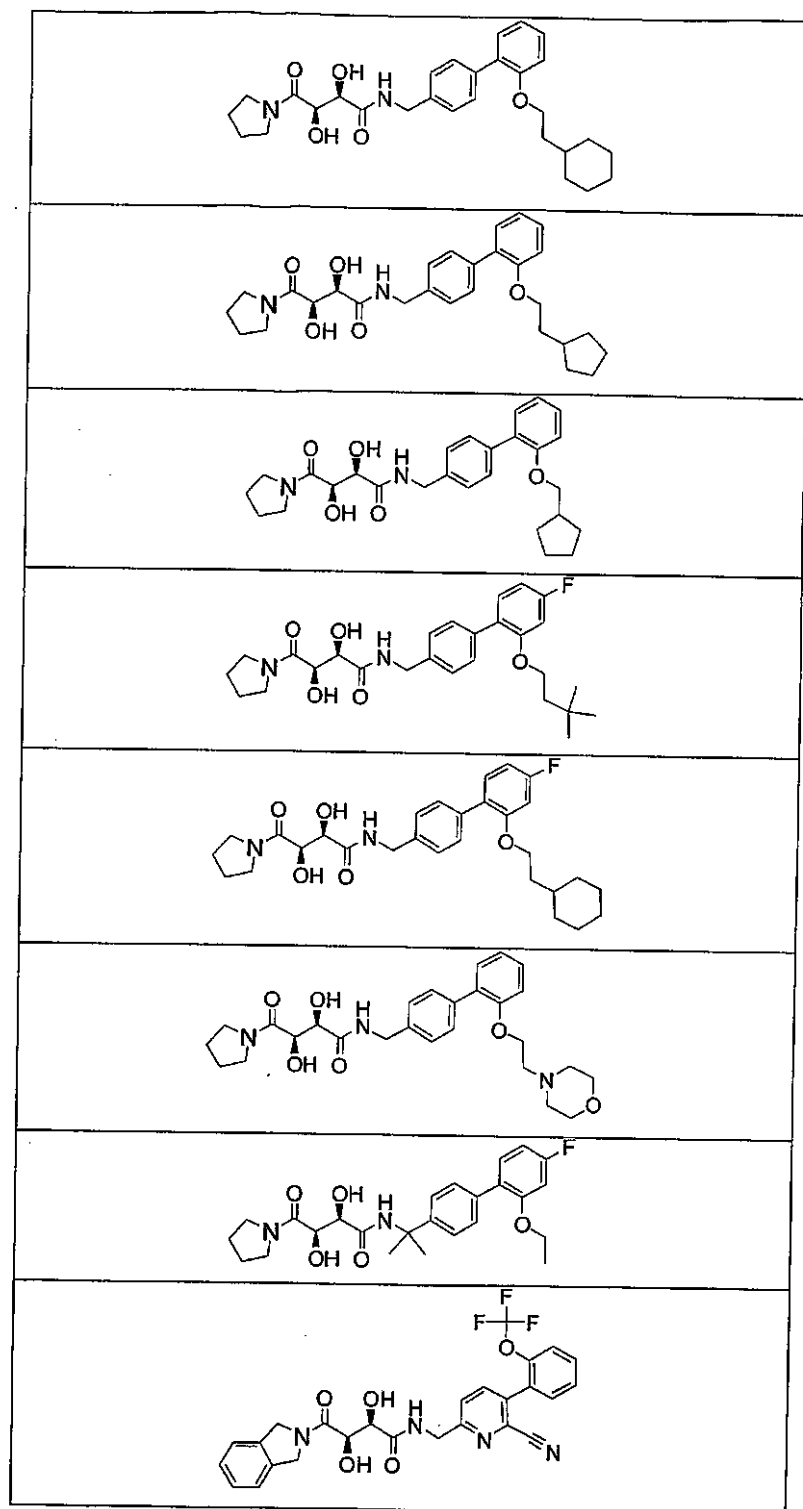


【化 1 2 6】



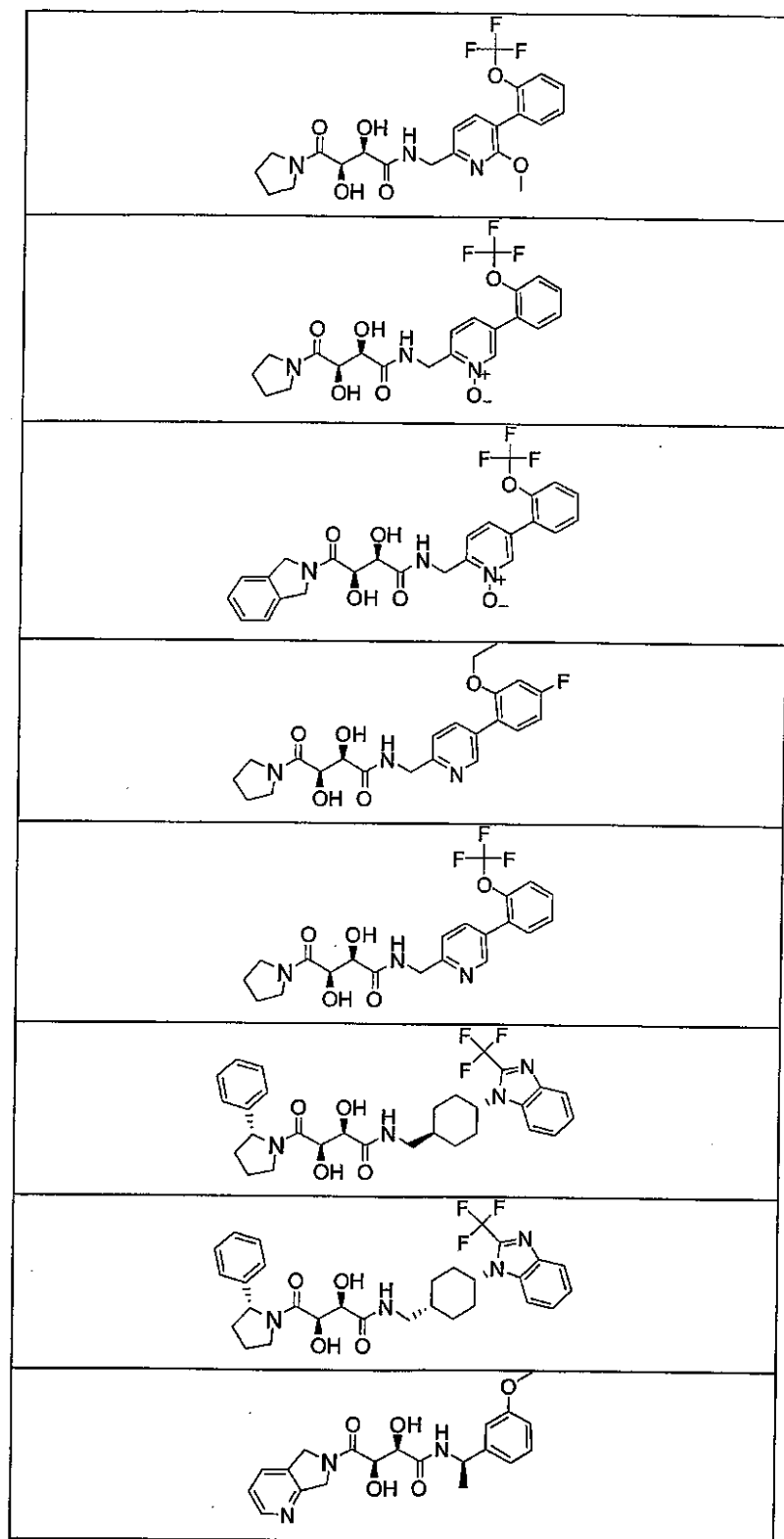


【化 1 2 7】



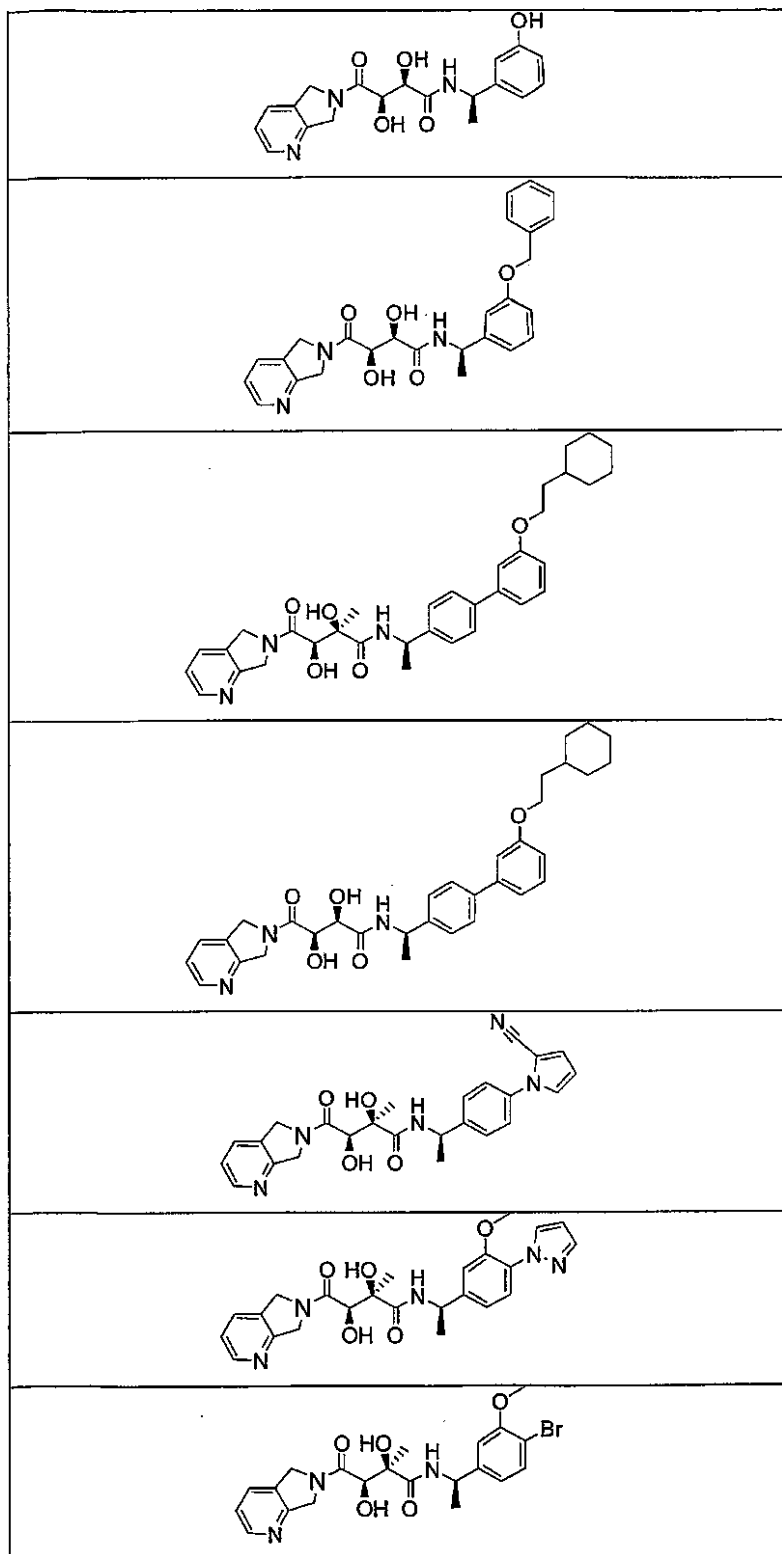


【化 1 2 8】



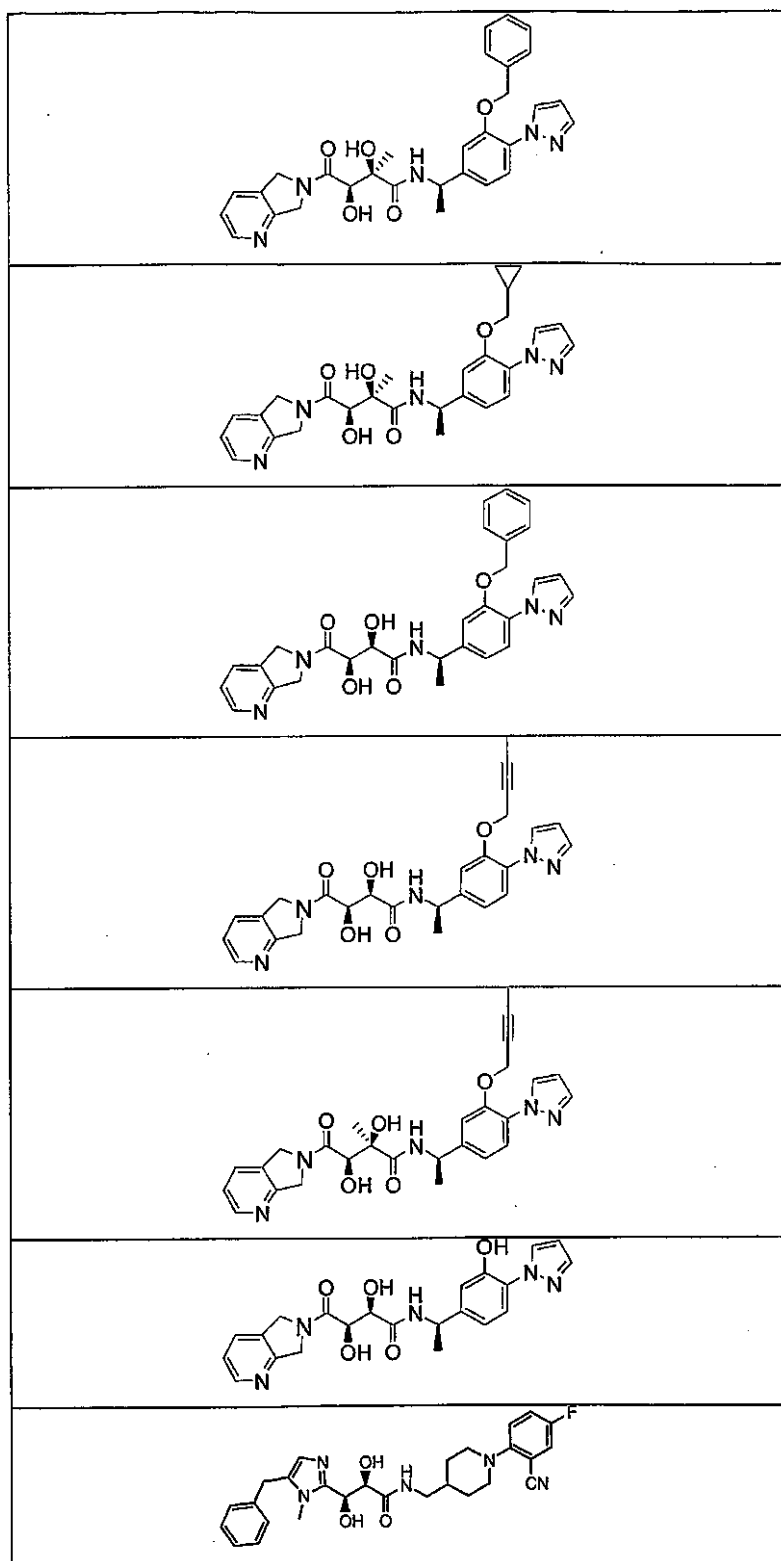


【化 1 2 9】



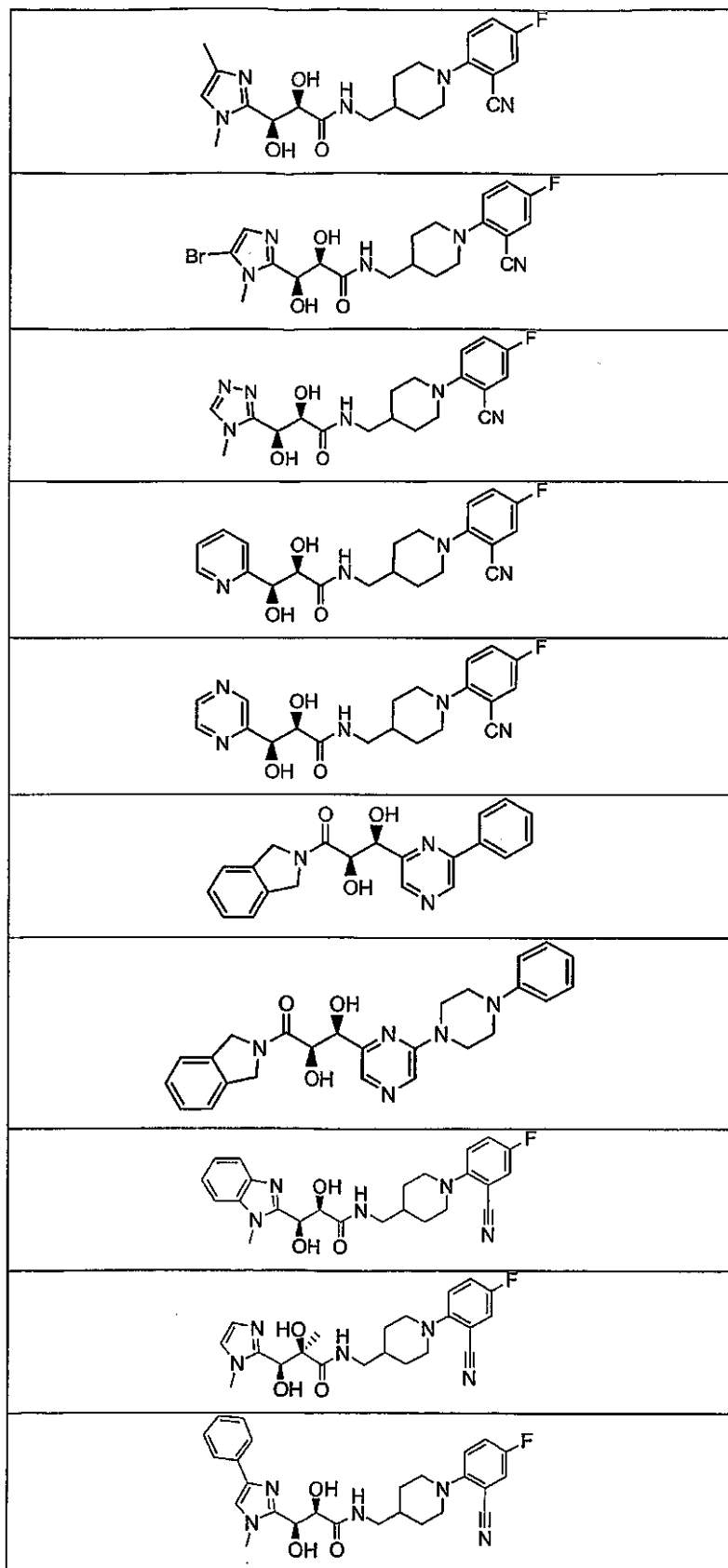


【化 1 3 0】



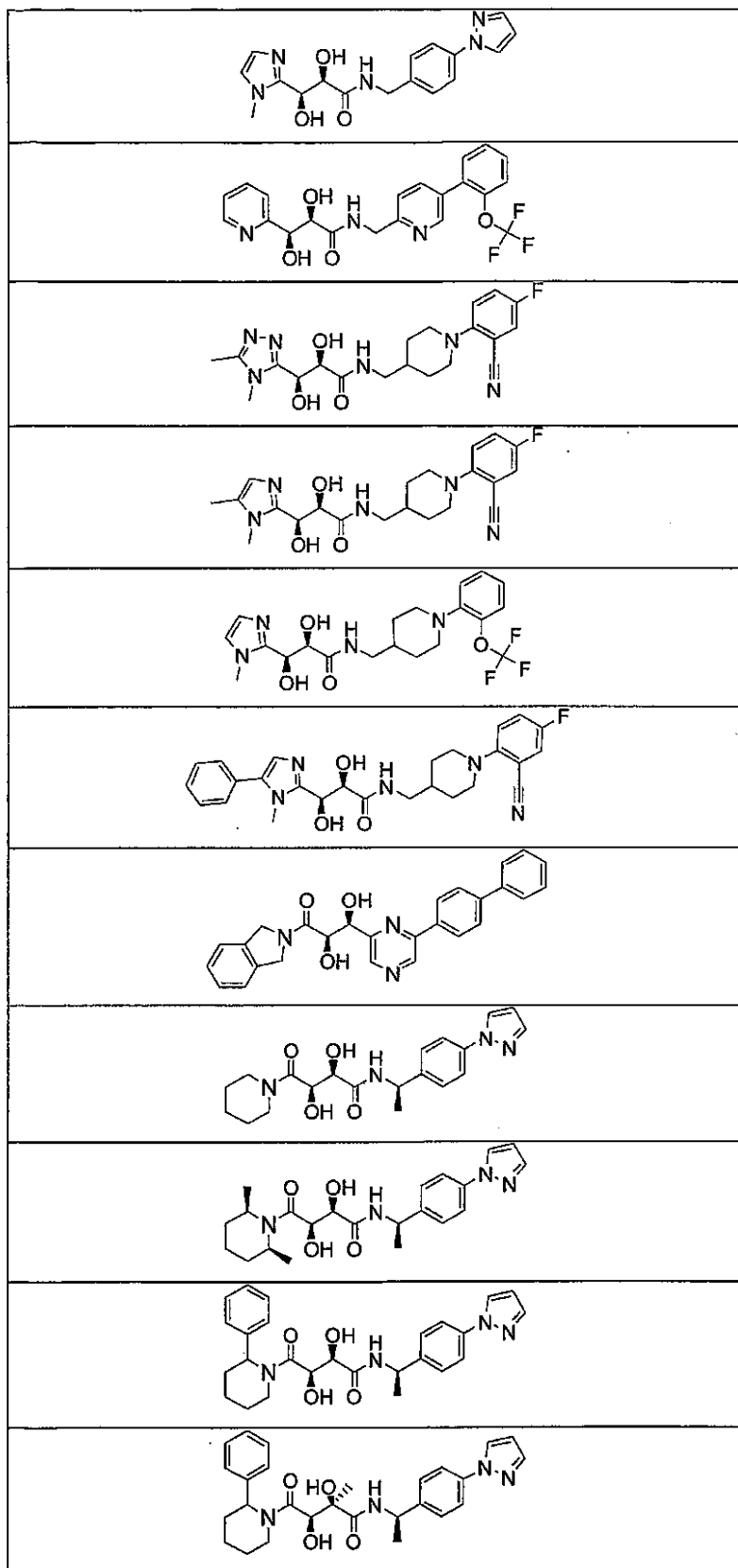


【化 1 3 1】



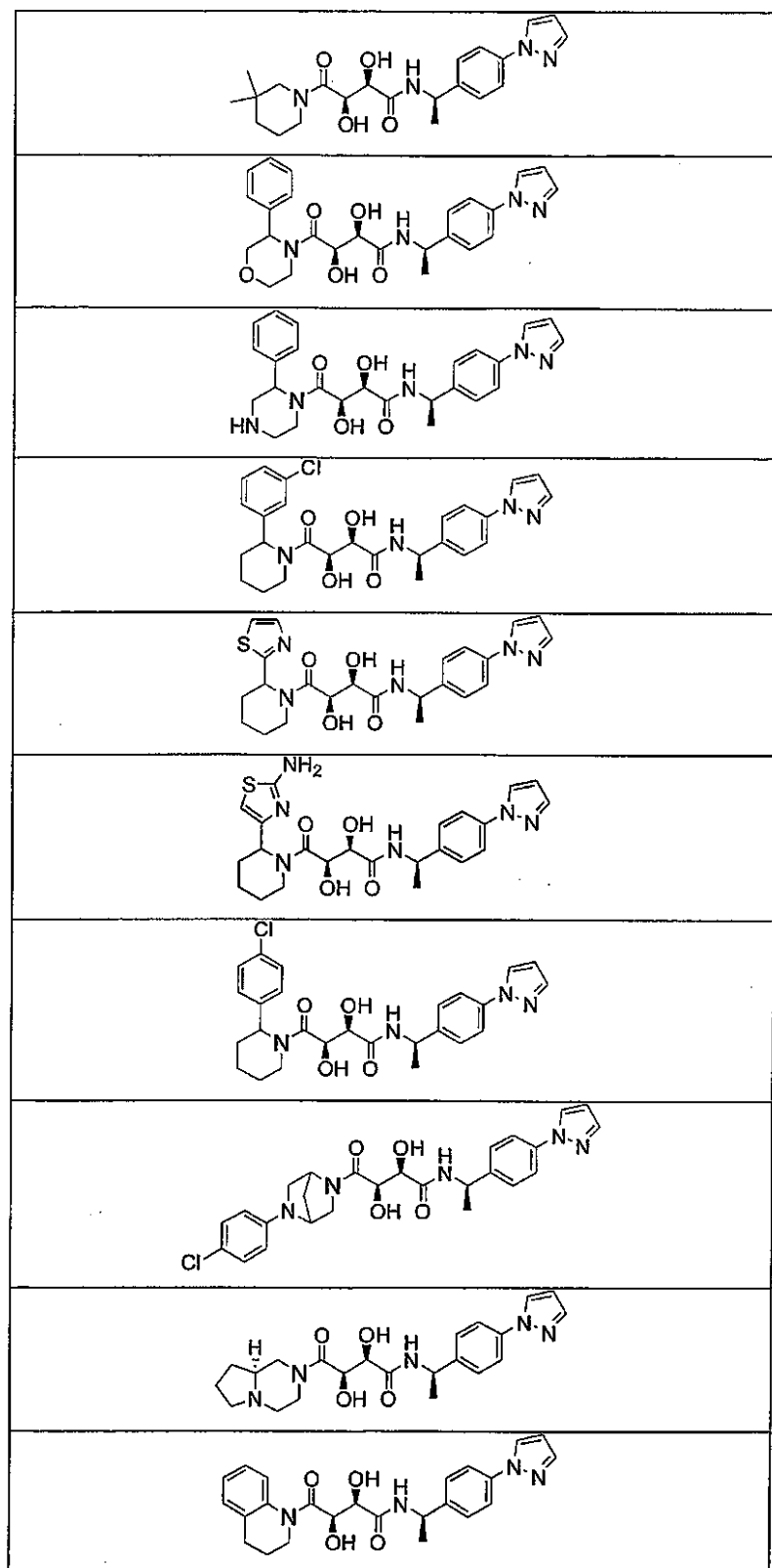


【化 1 3 2】



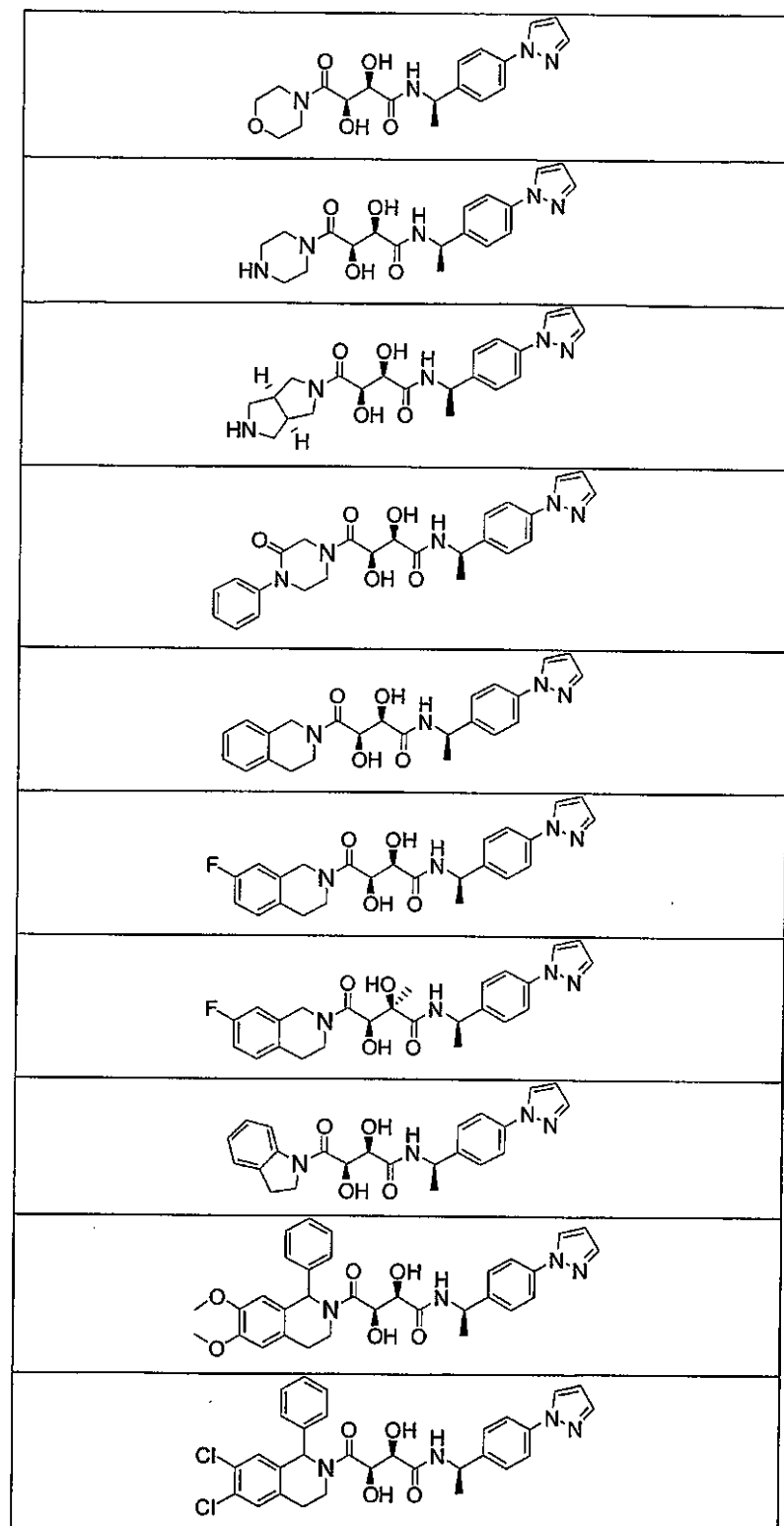


【化 1 3 3】



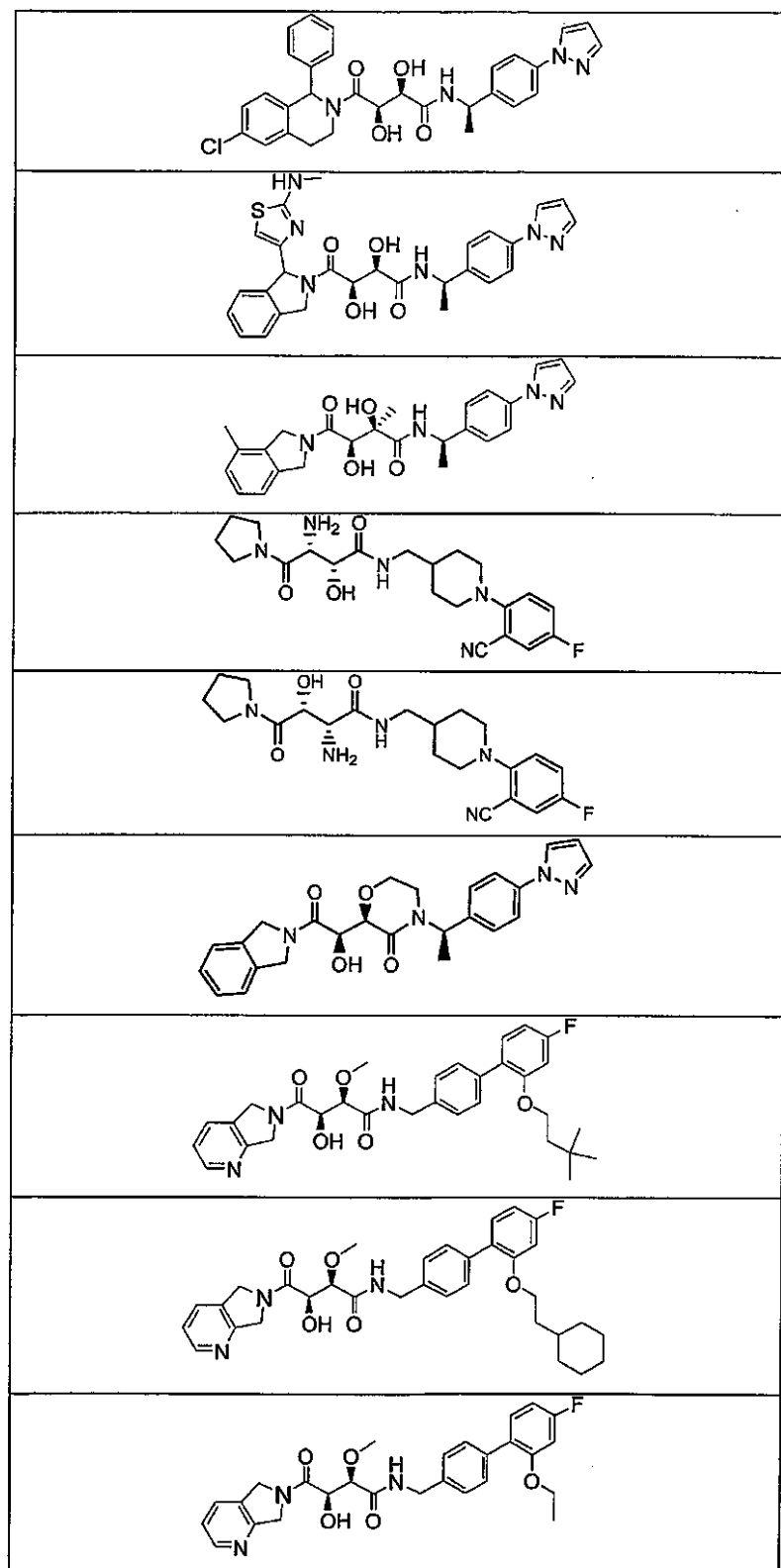


【化 1 3 4】



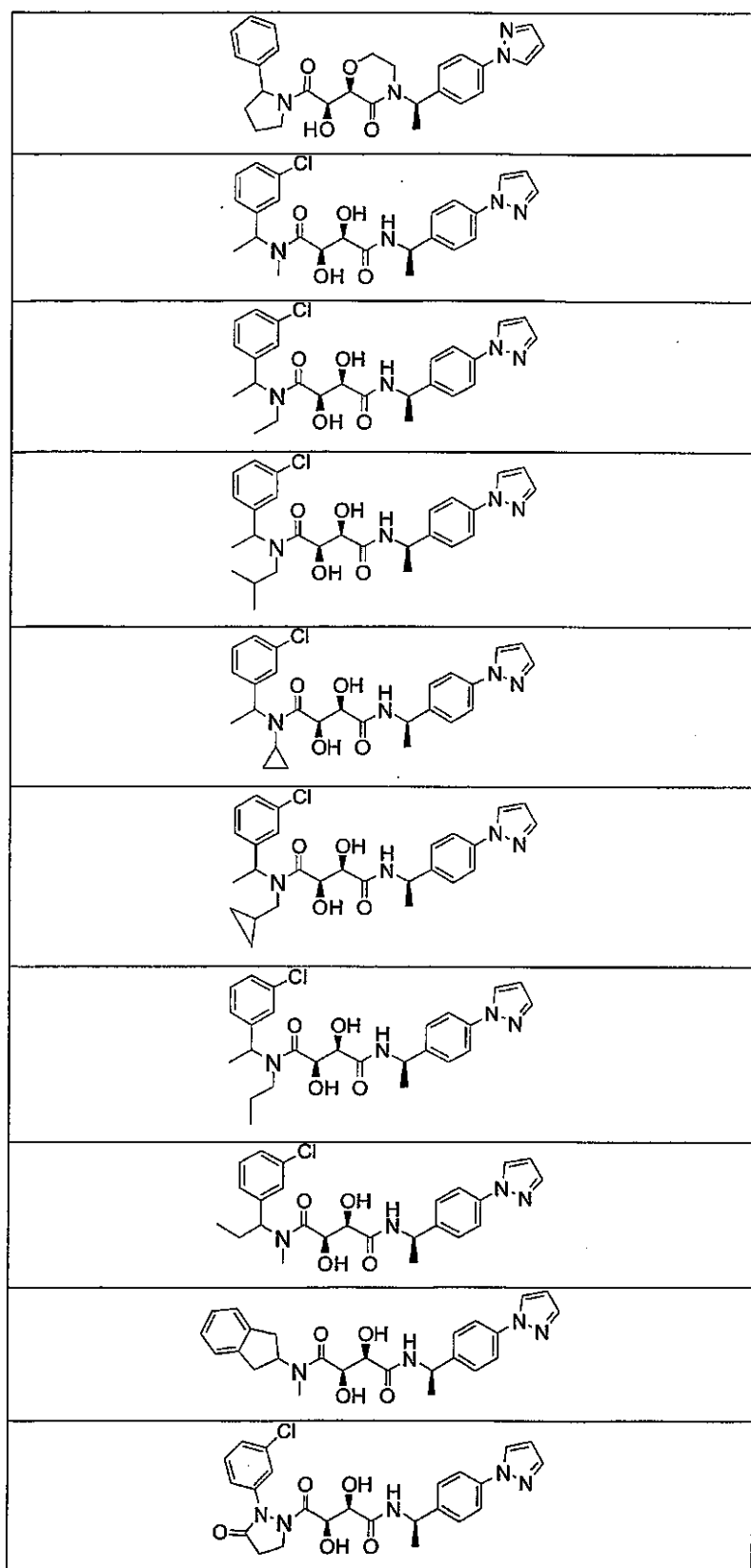


【化 1 3 5】



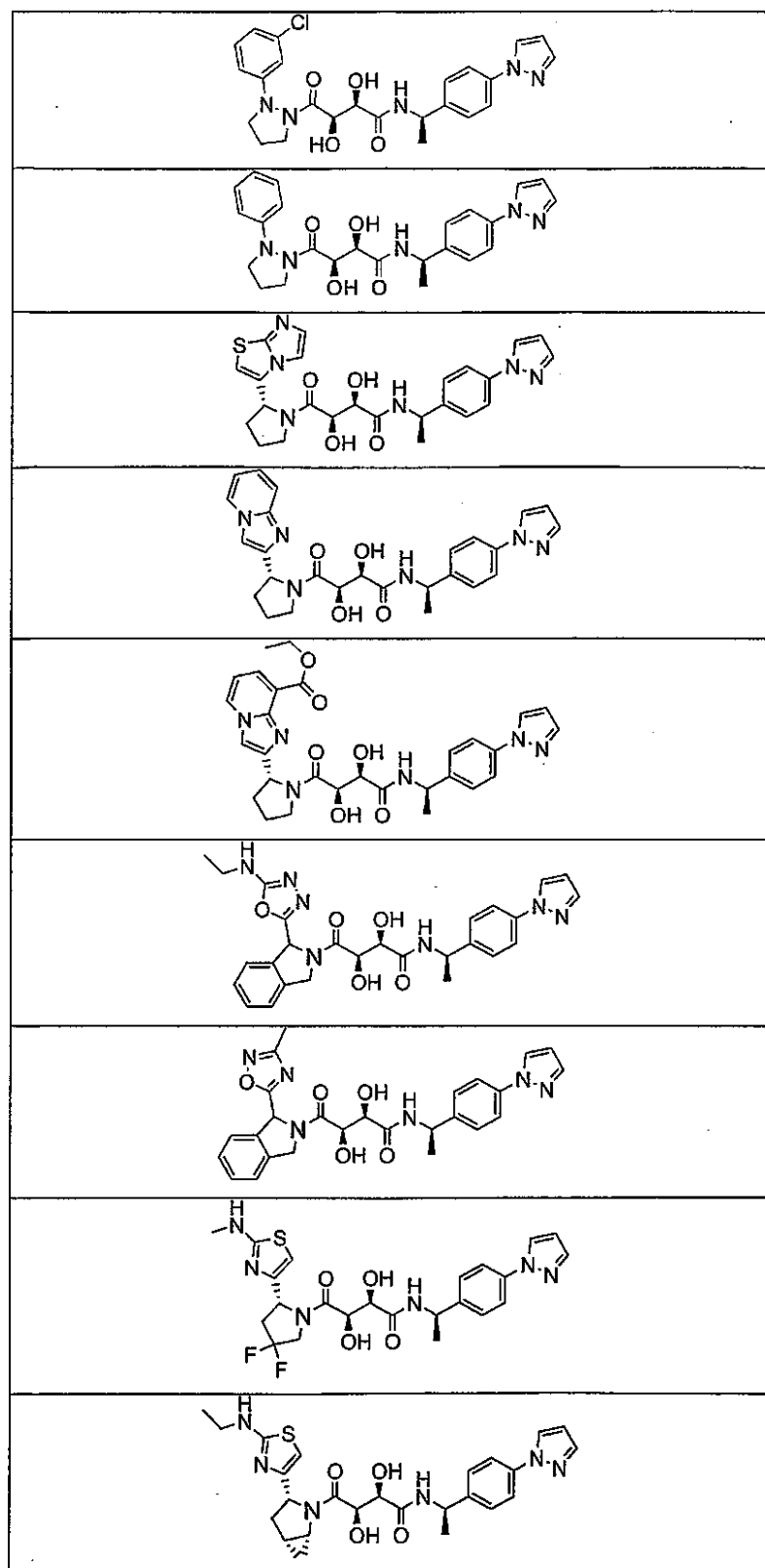


【化 1 3 6】



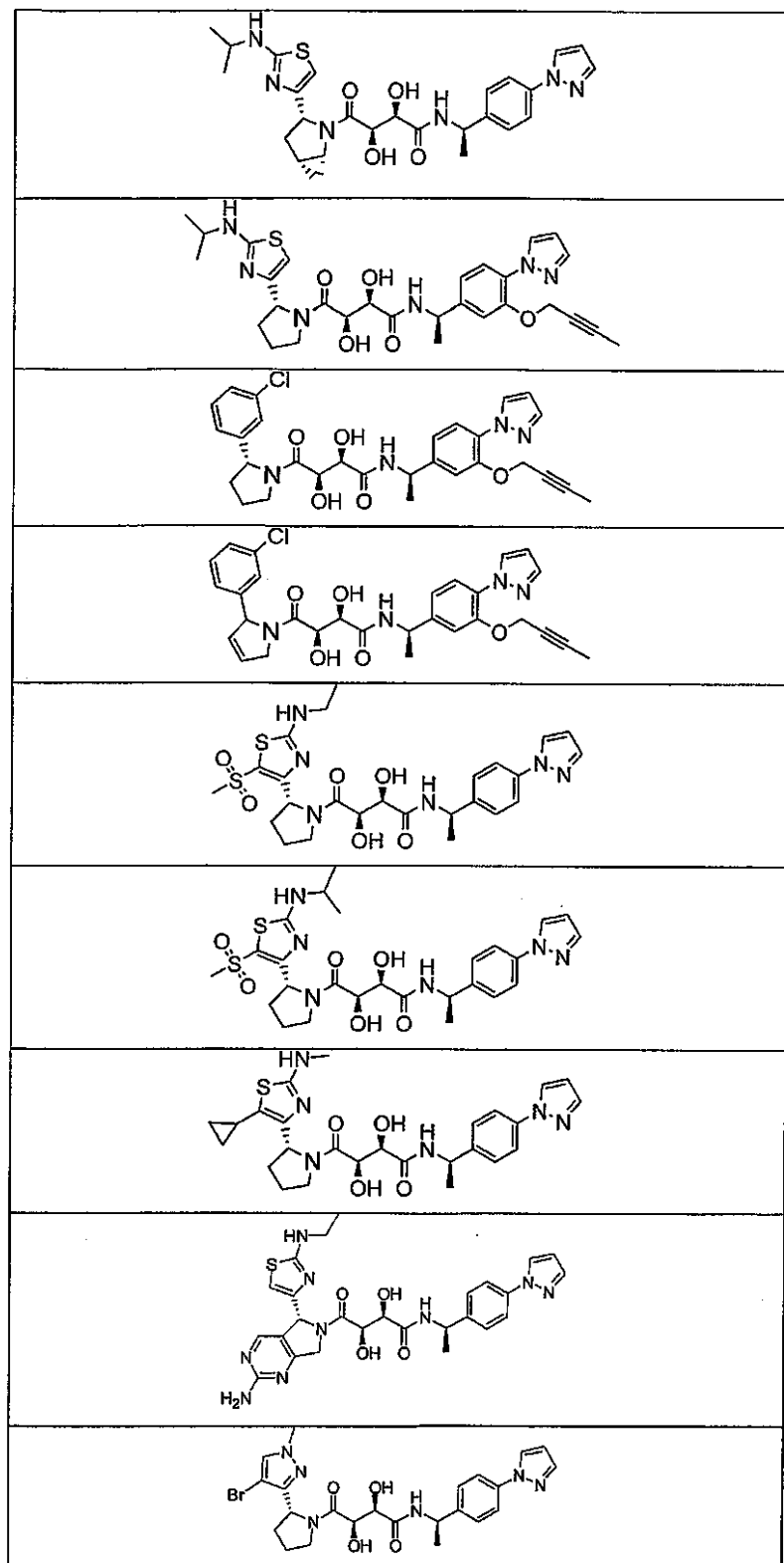


【化 1 3 7】



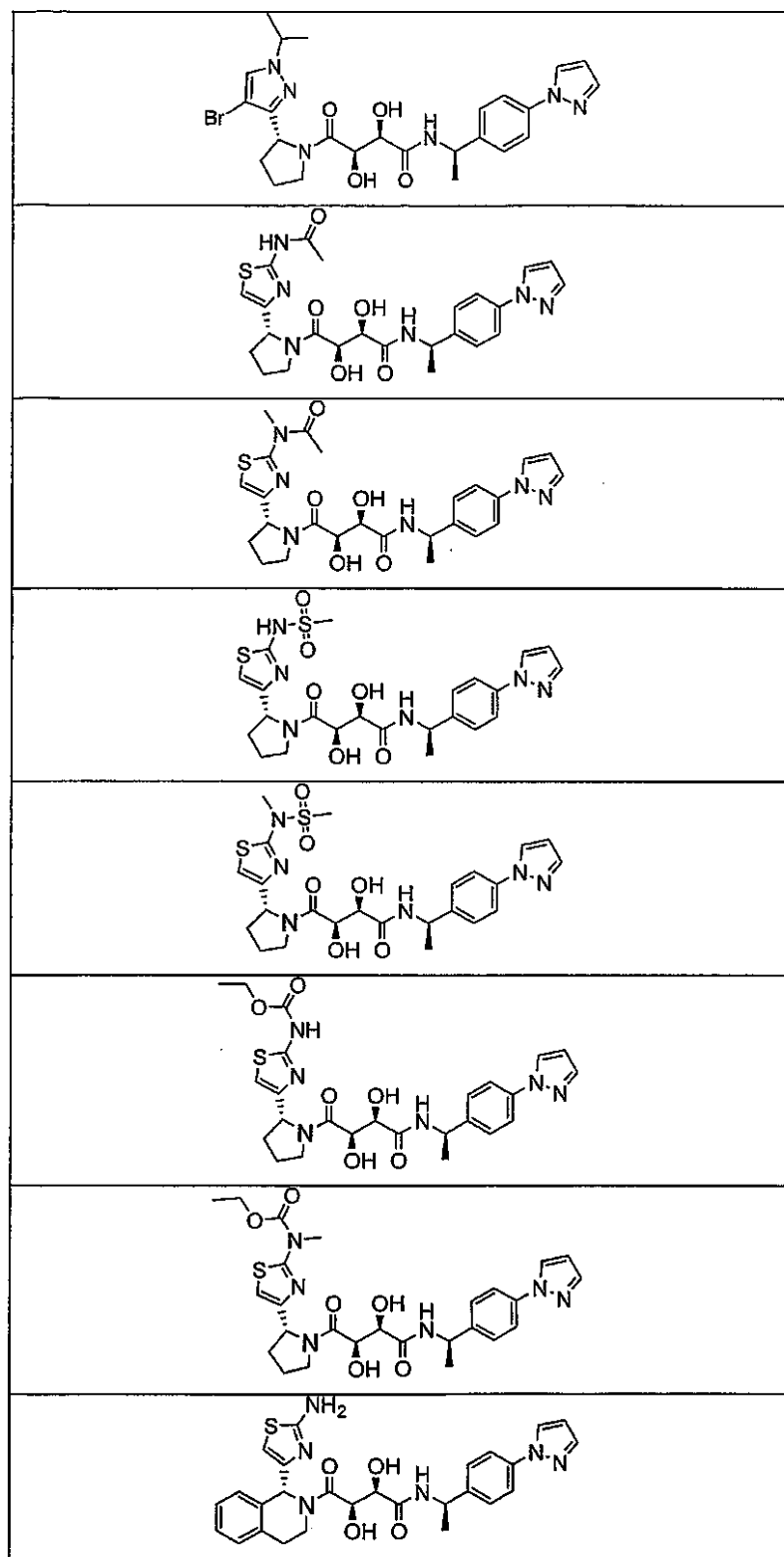


【化 1 3 8】

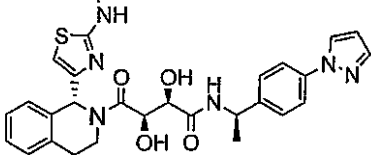
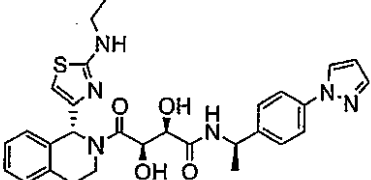
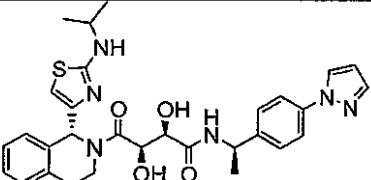
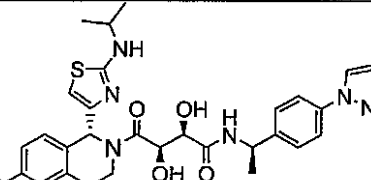
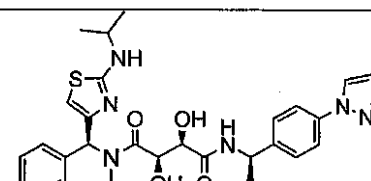
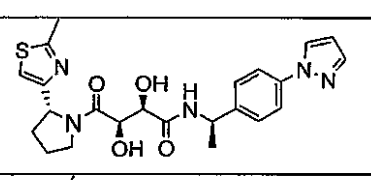
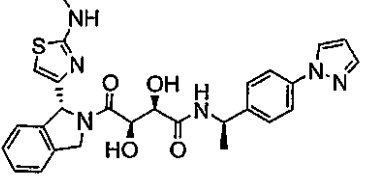
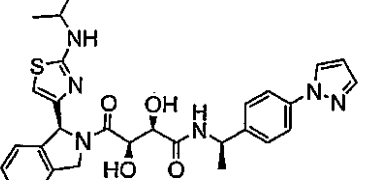




【化 1 3 9】

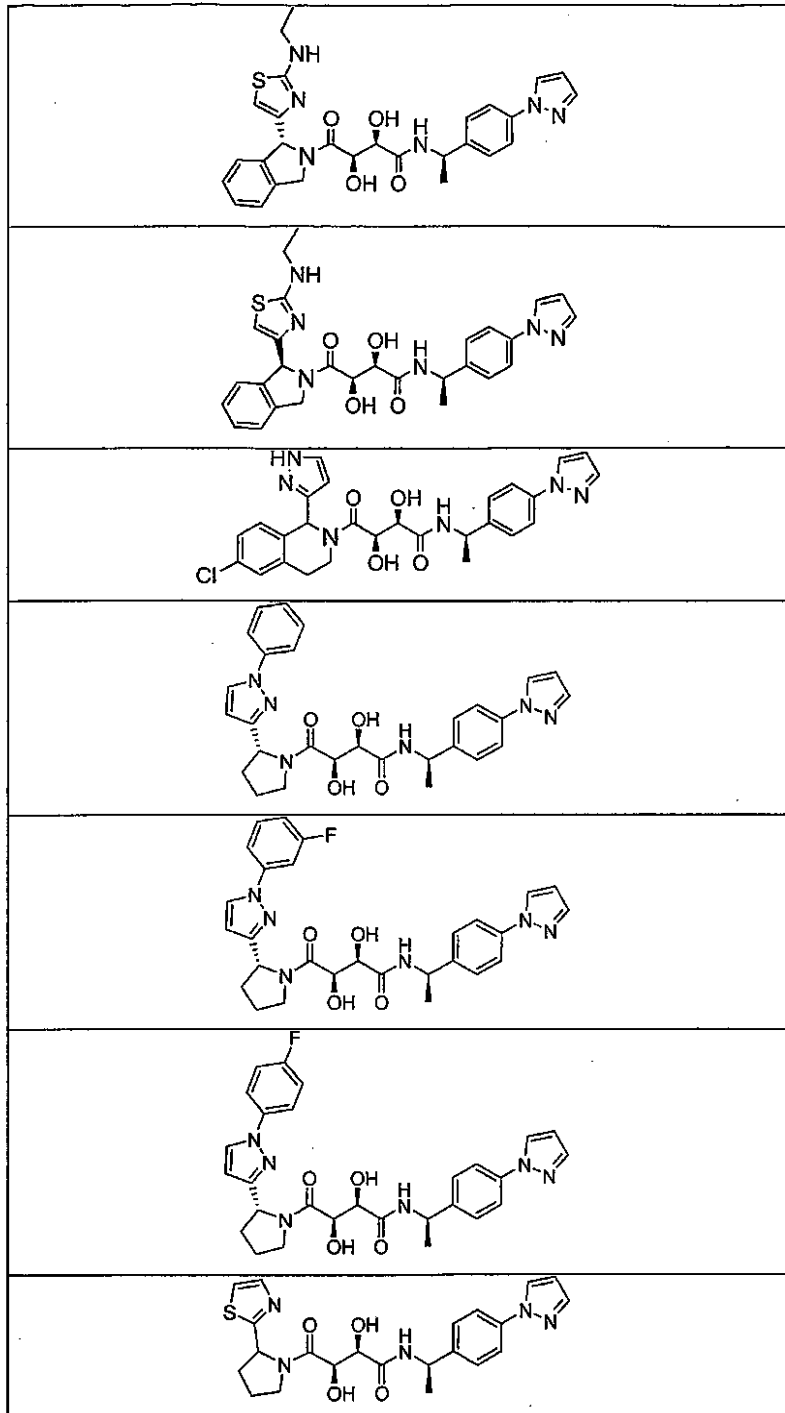






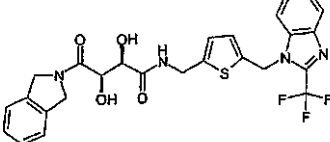
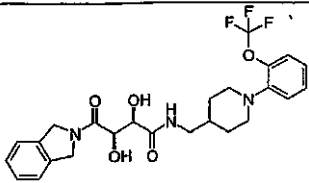
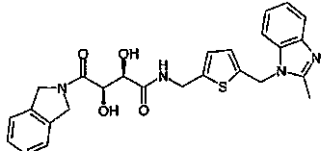
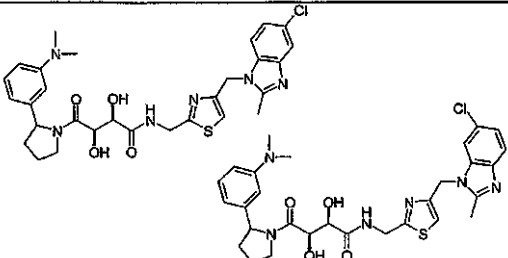
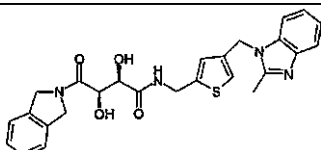
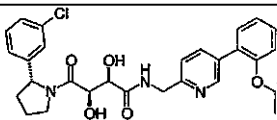
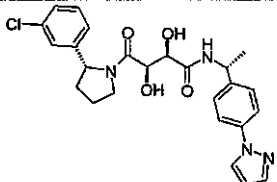
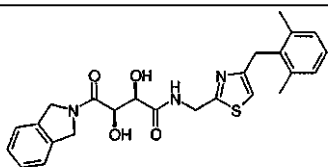
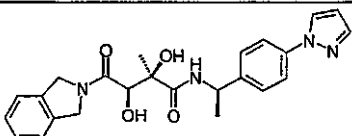
## 【化 1 4 1】



## 【請求項 6 1】

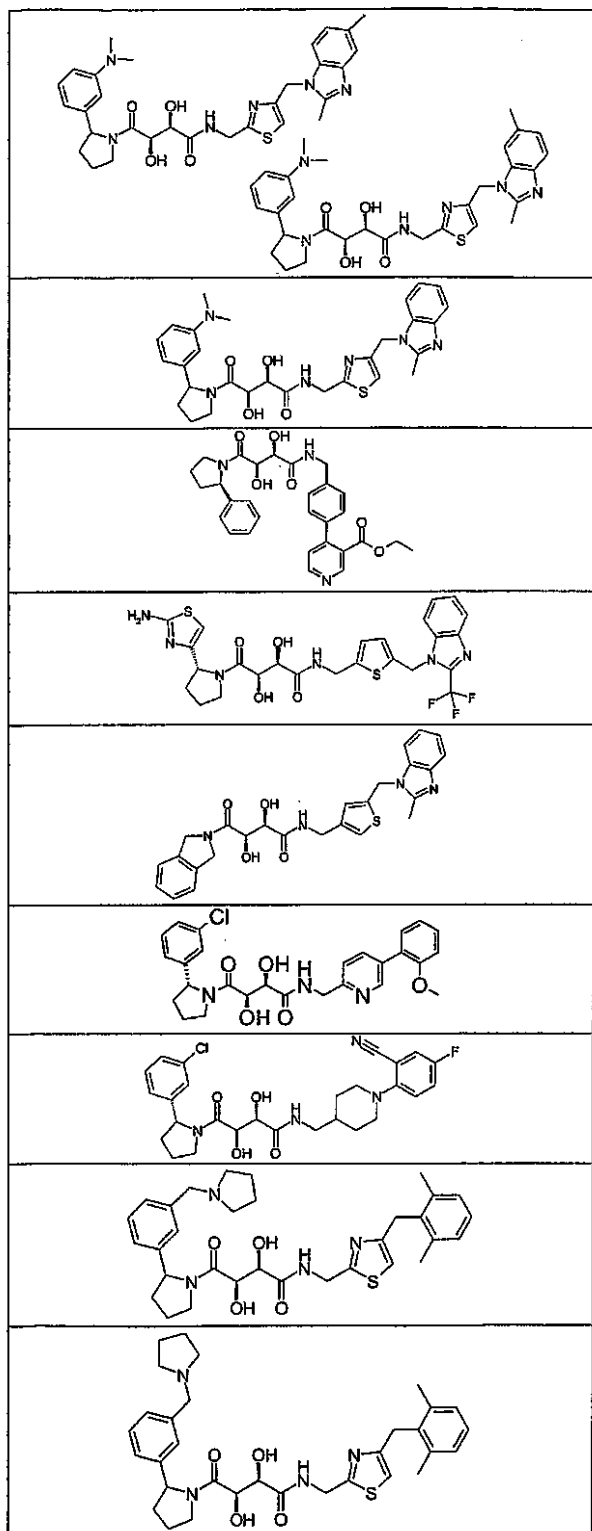
前記化合物が、以下で列挙された構造の化合物から選択される、請求項 6 0 に記載の化合物：



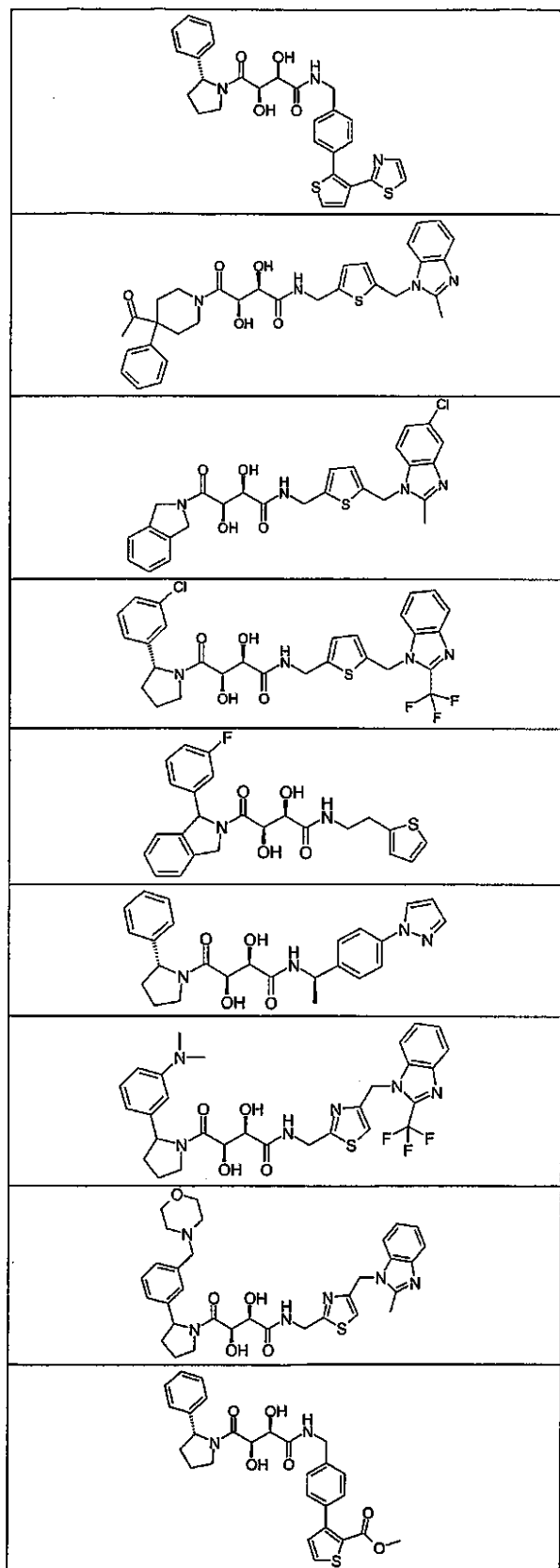


## 【化 1 4 3】



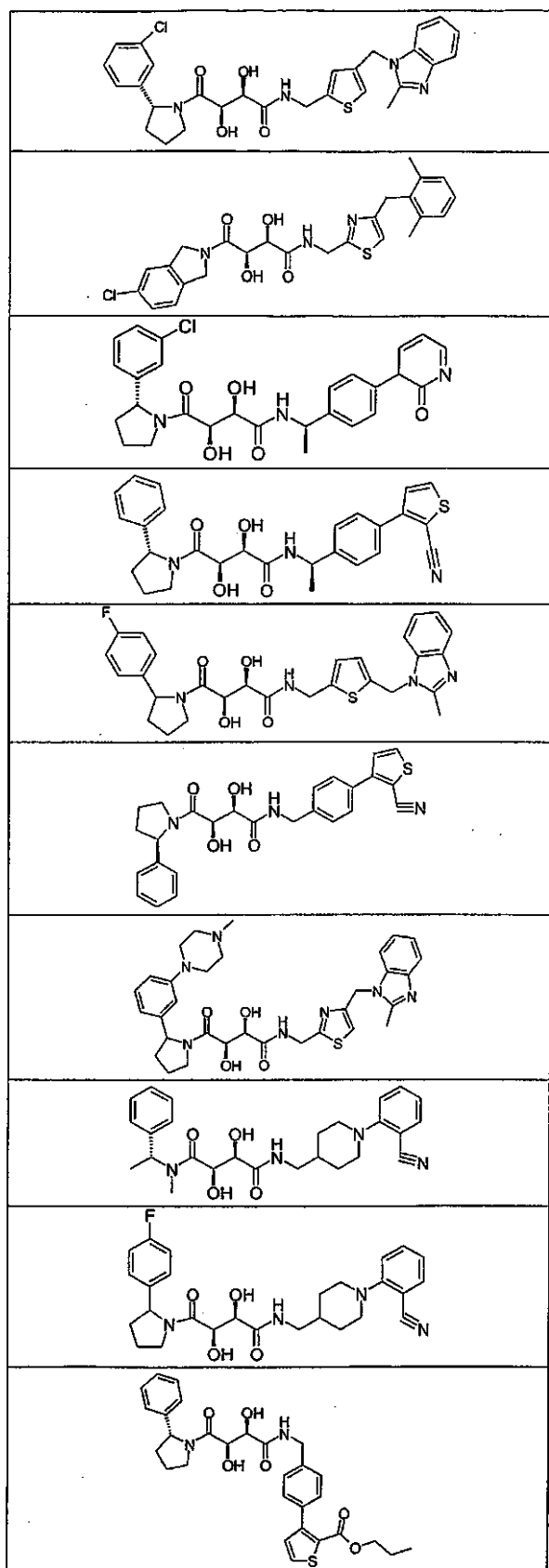


## 【化 1 4 4】



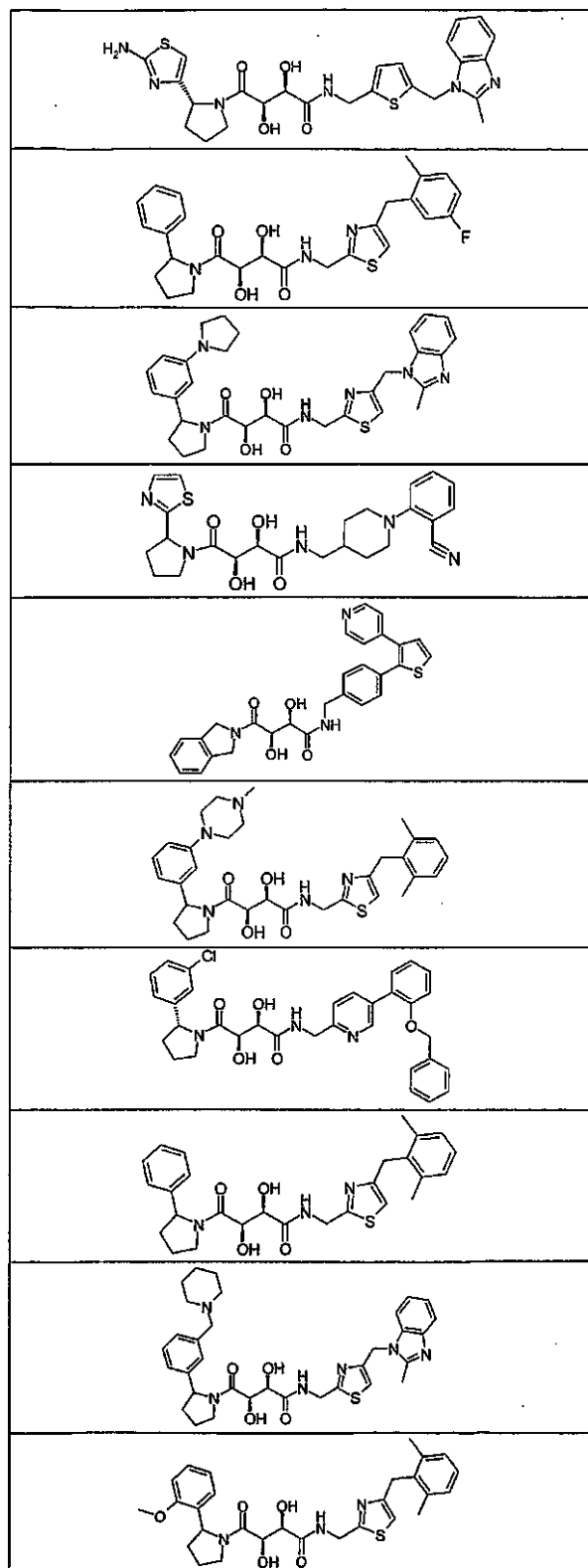


## 【化 1 4 5】



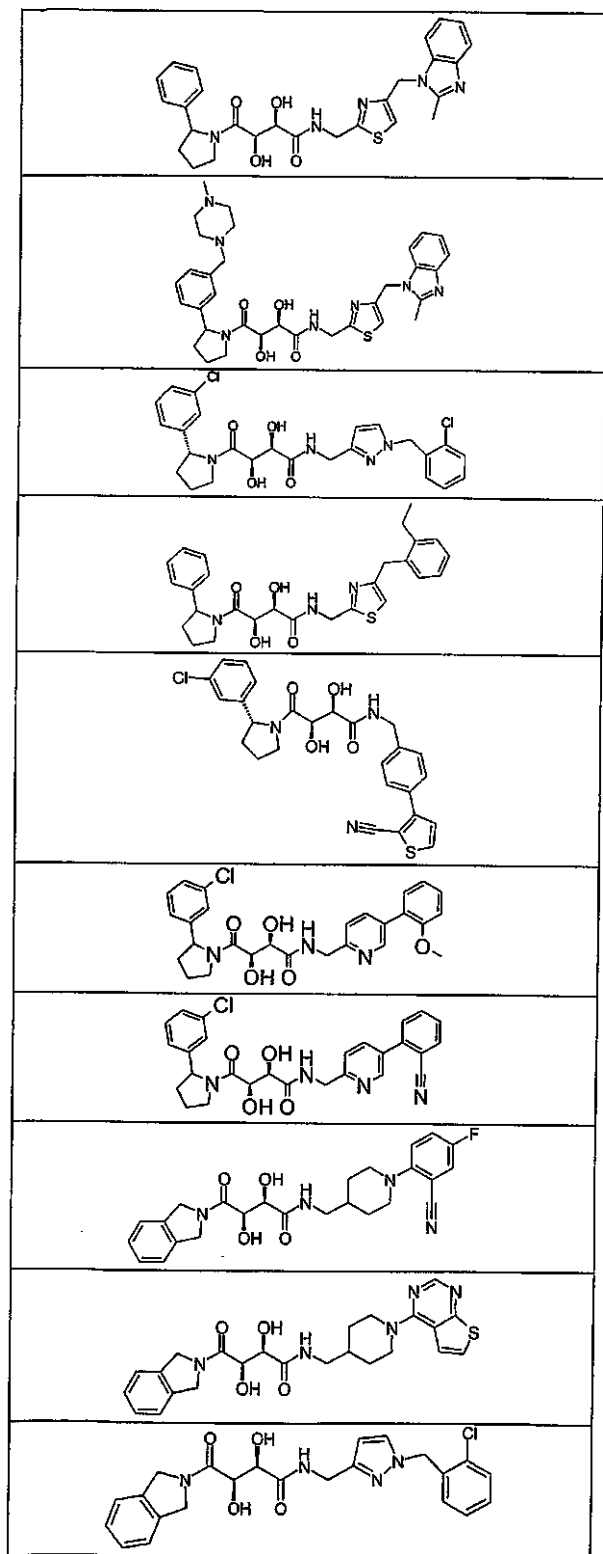


## 【化 1 4 6】



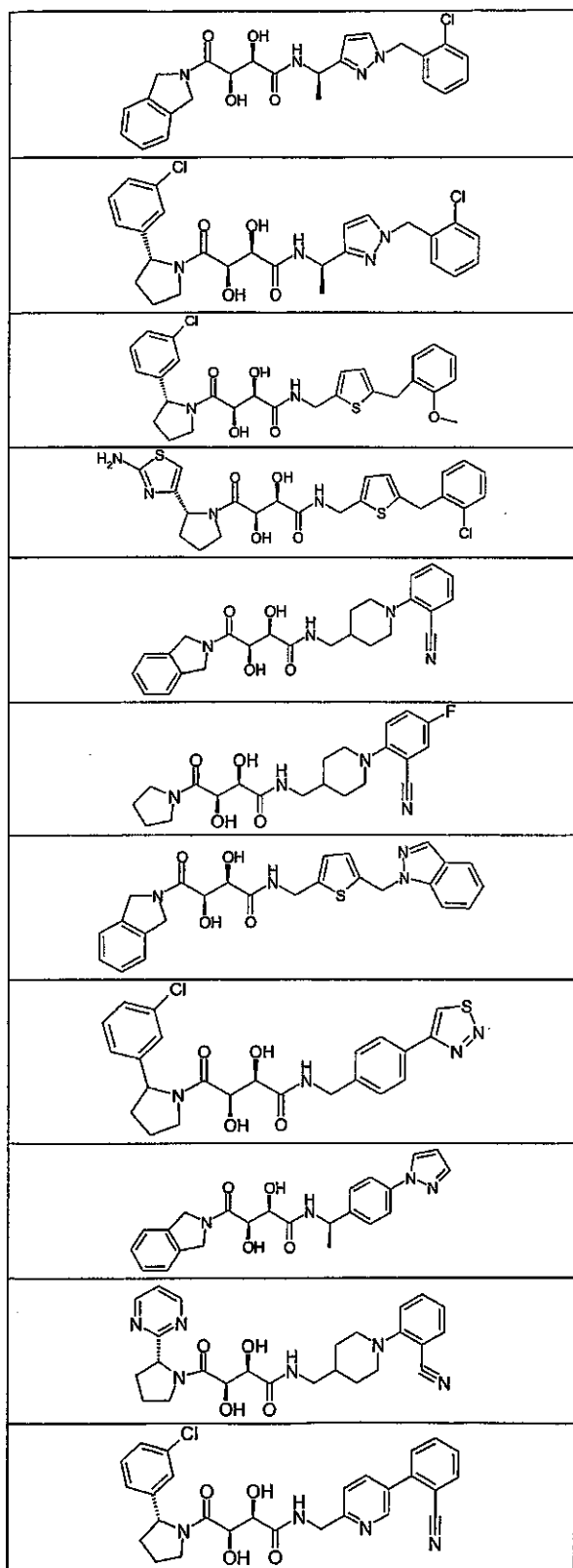


## 【化 1 4 7】



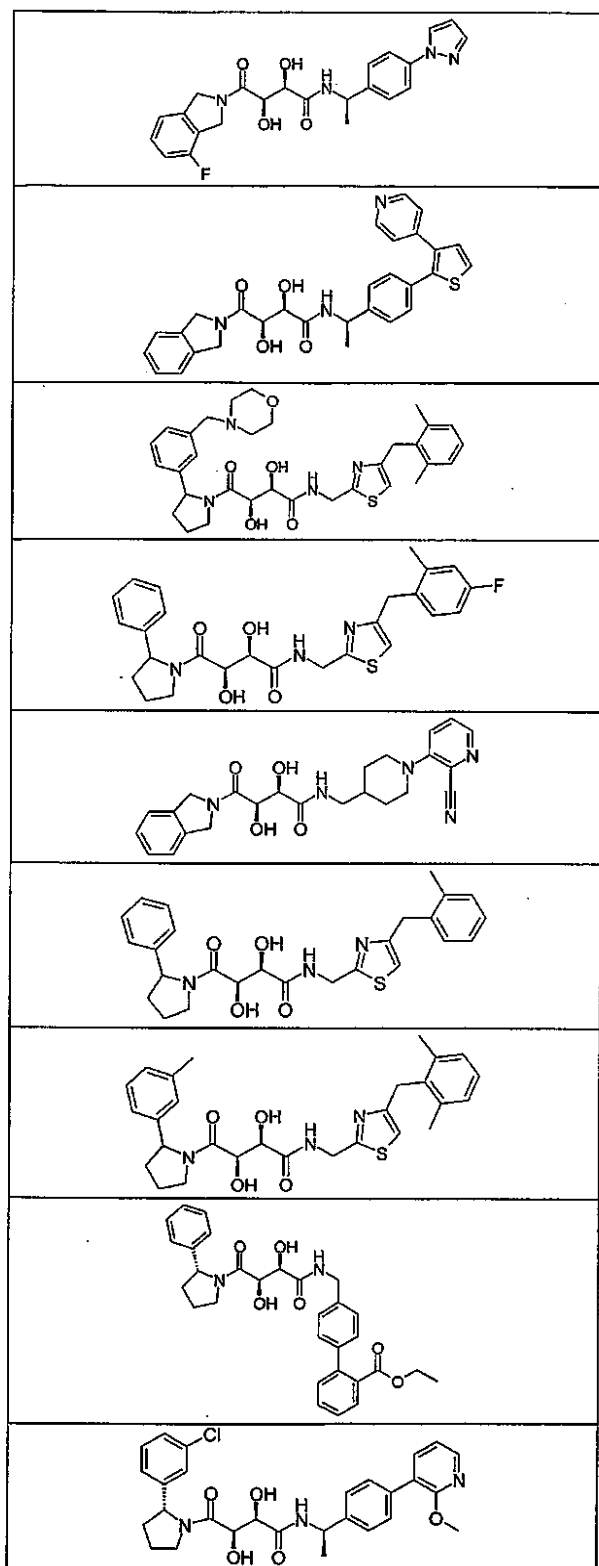


## 【化 1 4 8】



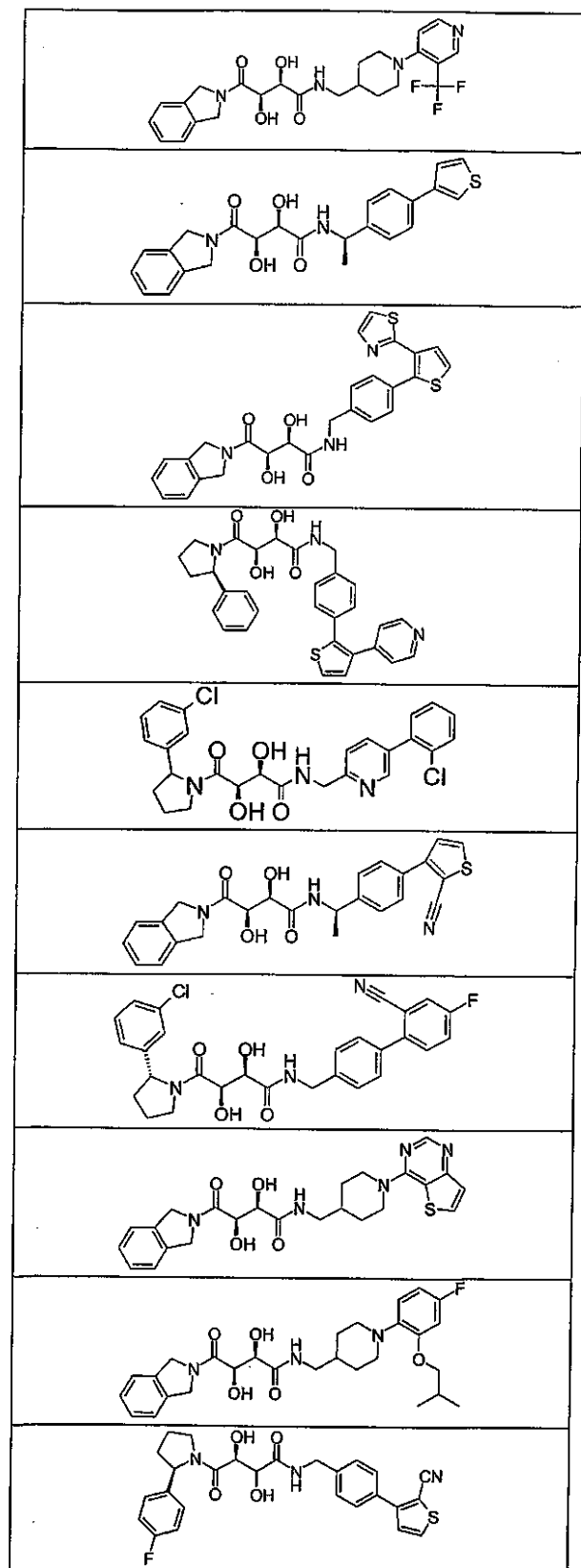


## 【化 1 4 9】



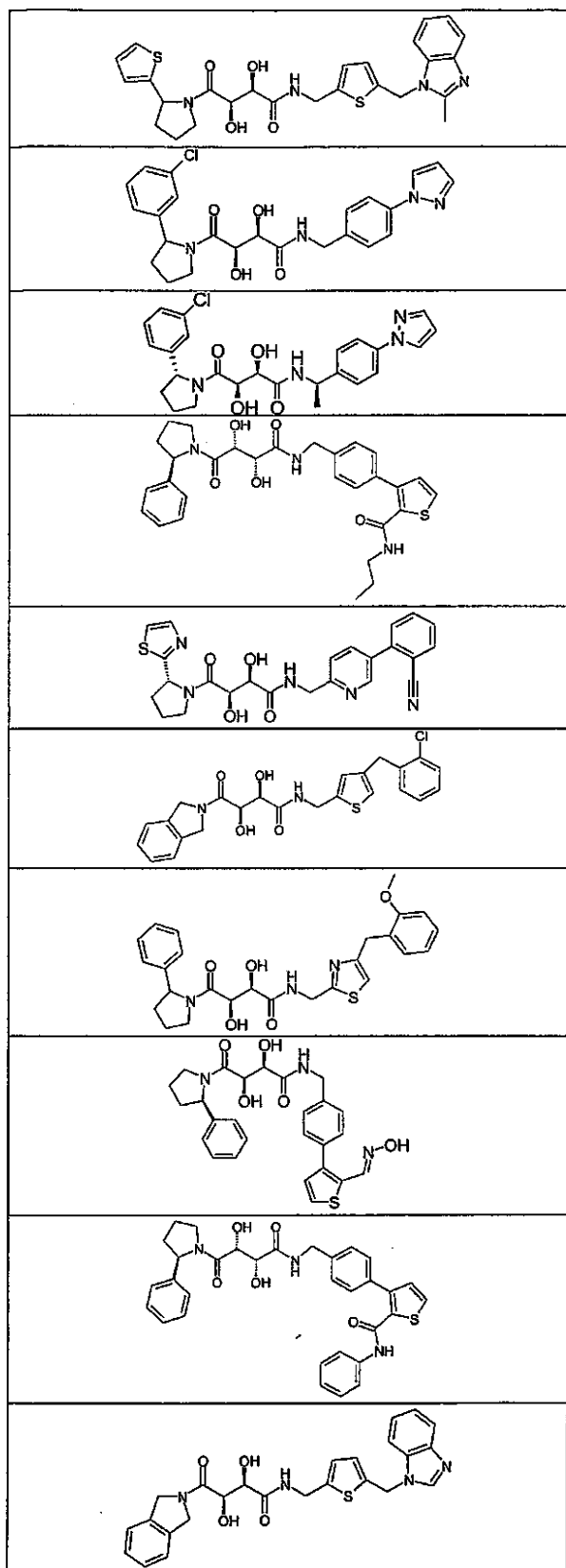


【化 1 5 0】



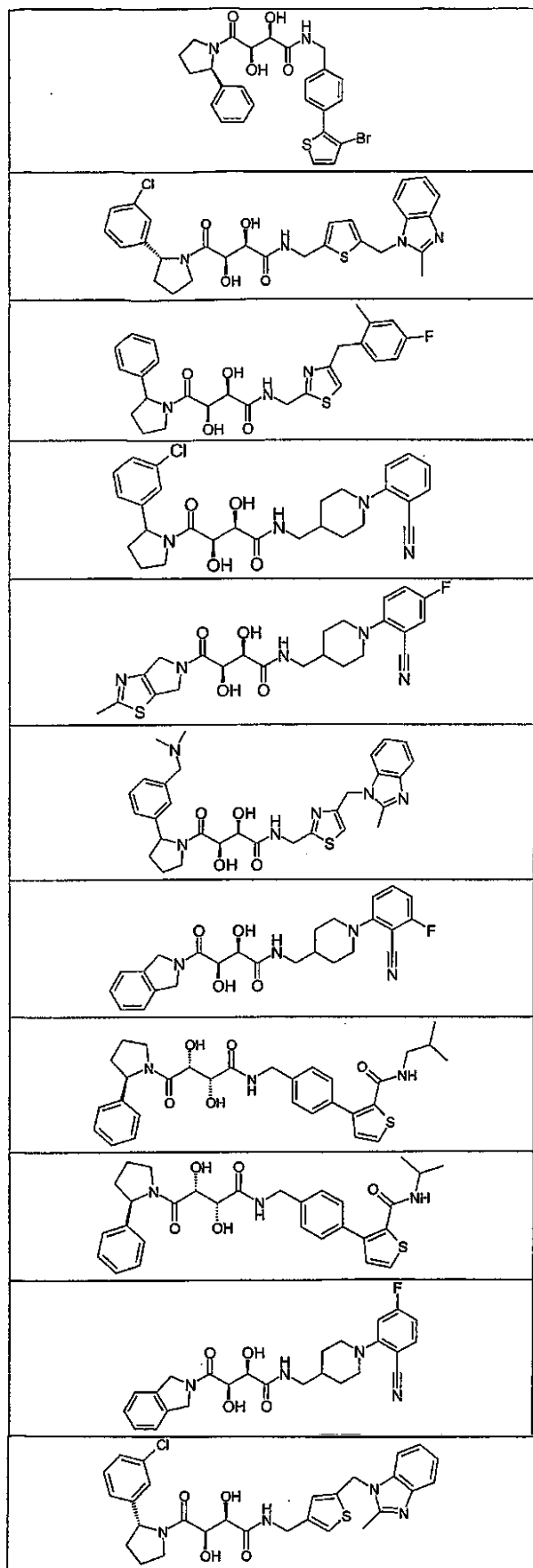


## 【化 1 5 1】



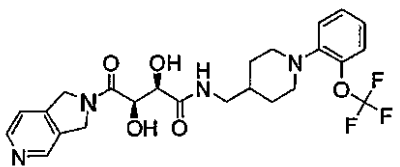
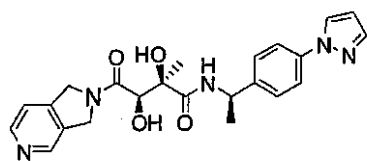
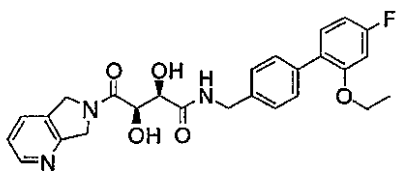
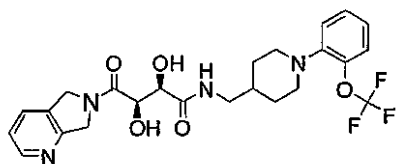
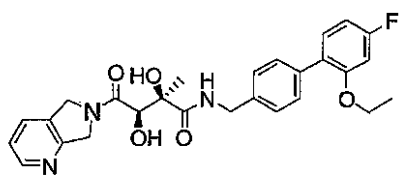
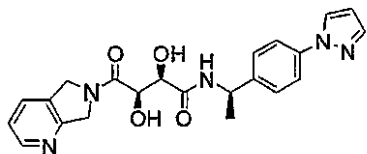
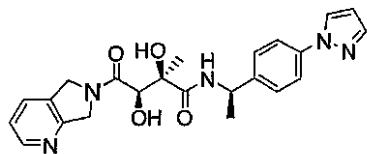
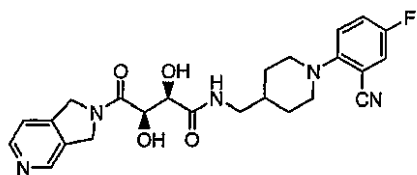


## 【化 1 5 2】



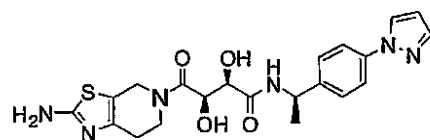
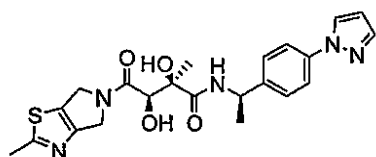
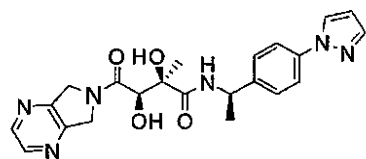
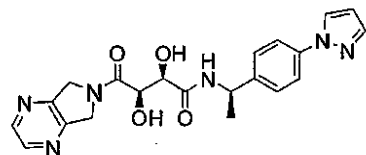
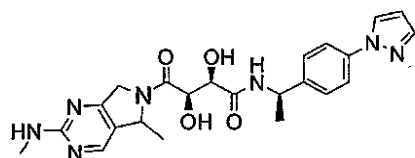
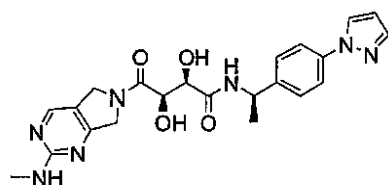
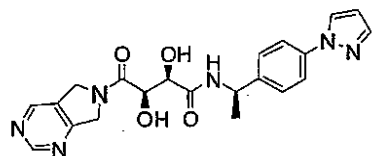
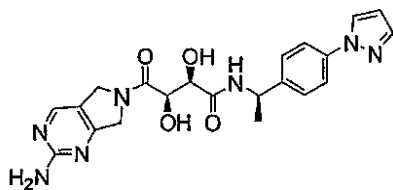
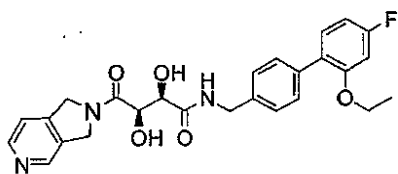


【化 1 5 3】



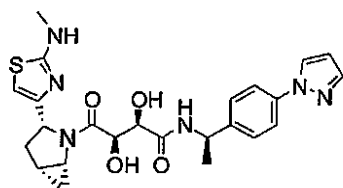
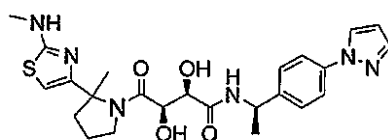
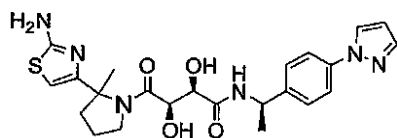
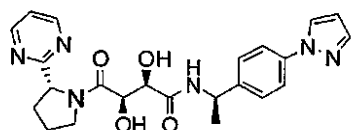
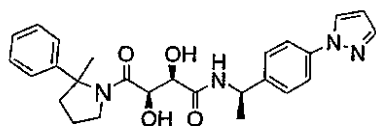
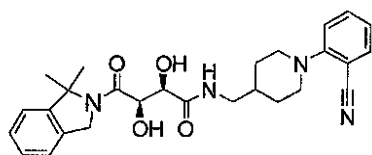
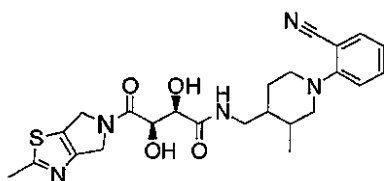
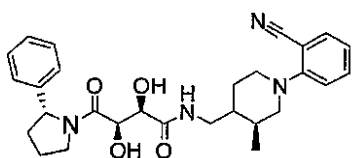
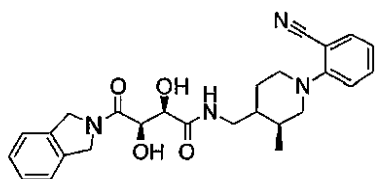
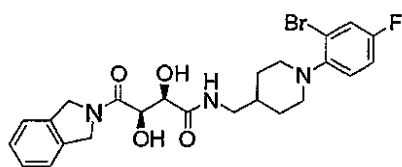


【化 1 5 4】



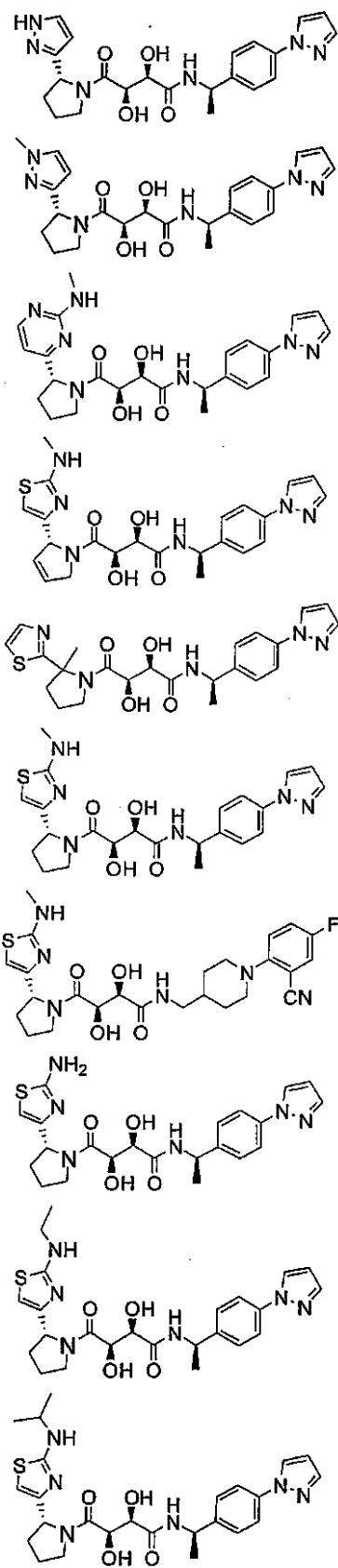


【化 1 5 5】



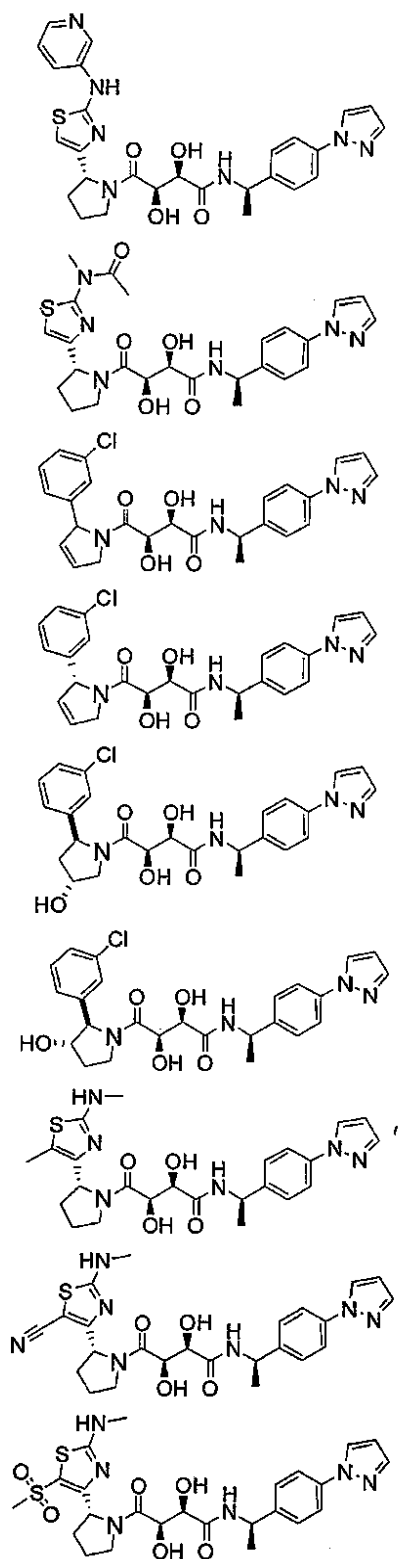


## 【化 1 5 6】



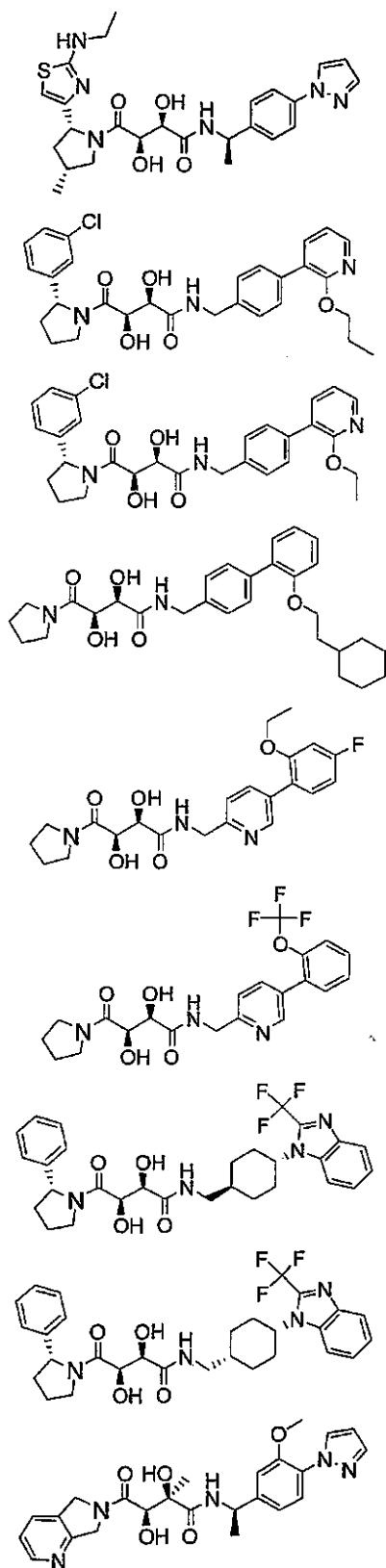


## 【化 1 5 7】



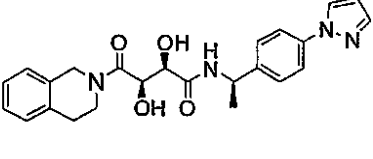
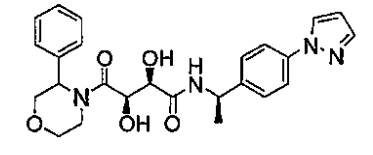
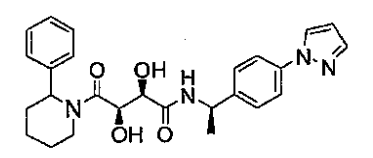
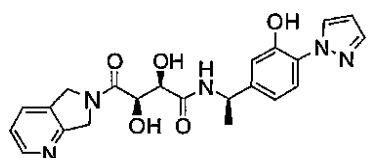
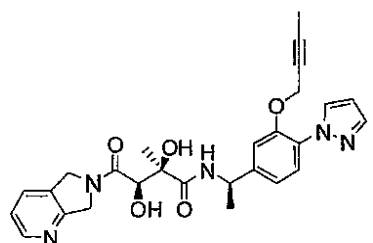
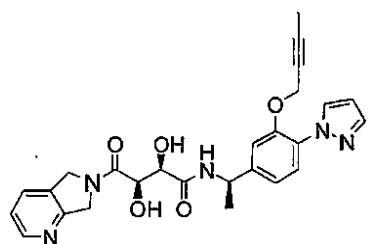
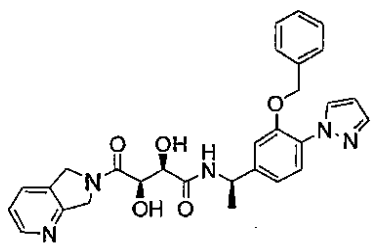
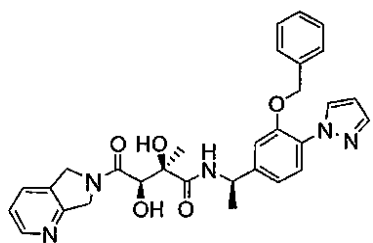


## 【化 1 5 8】



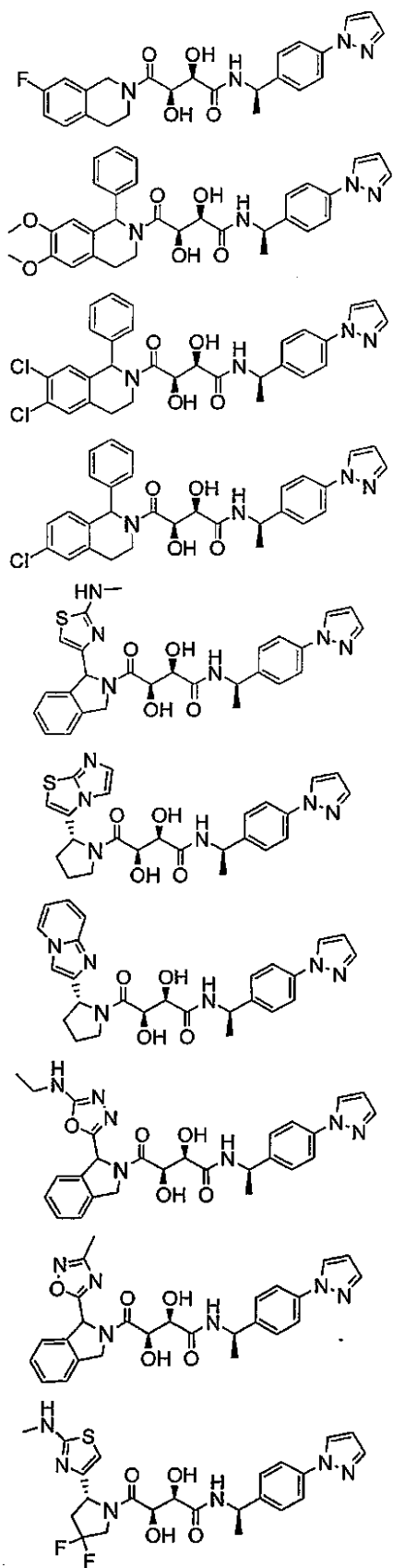


【化 1 5 9】





【化 1 6 0】

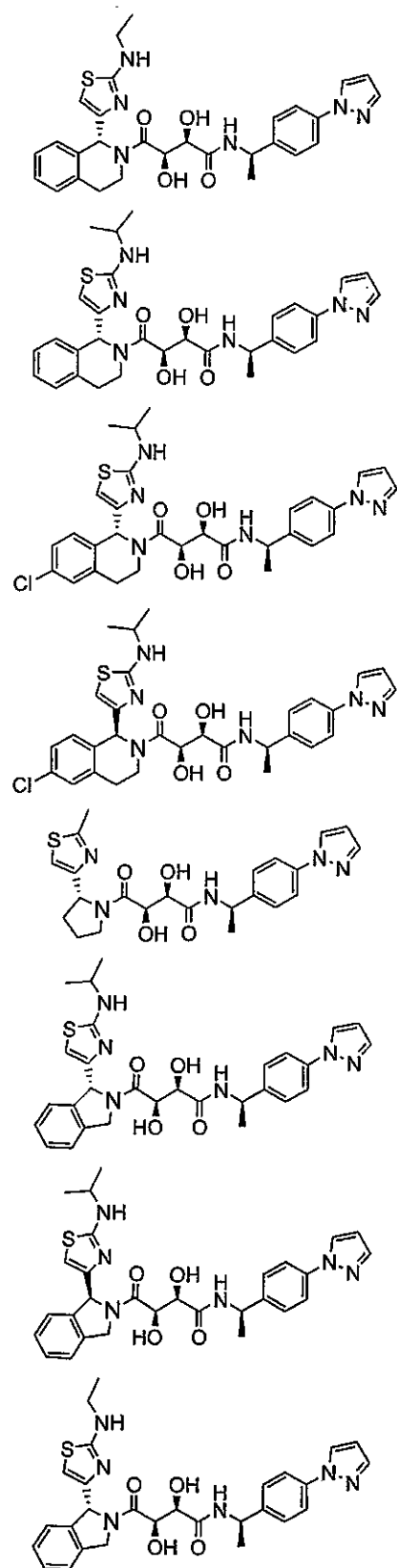






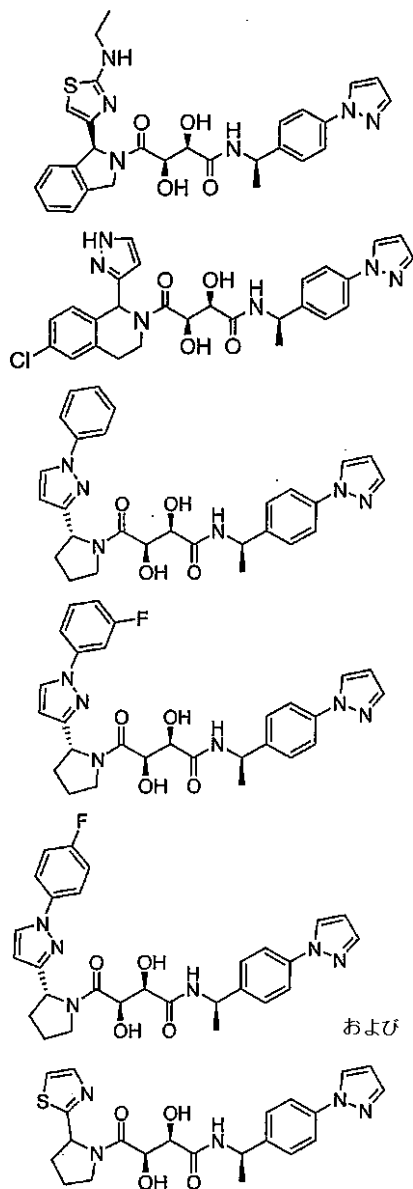


## 【化 1 6 2】





## 【化 1 6 3】

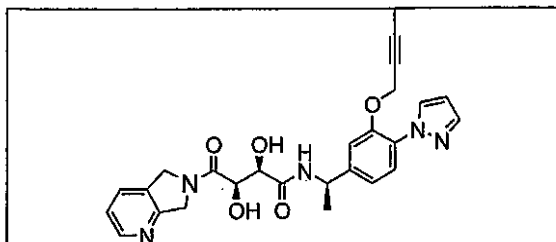


および

## 【請求項 6 2】

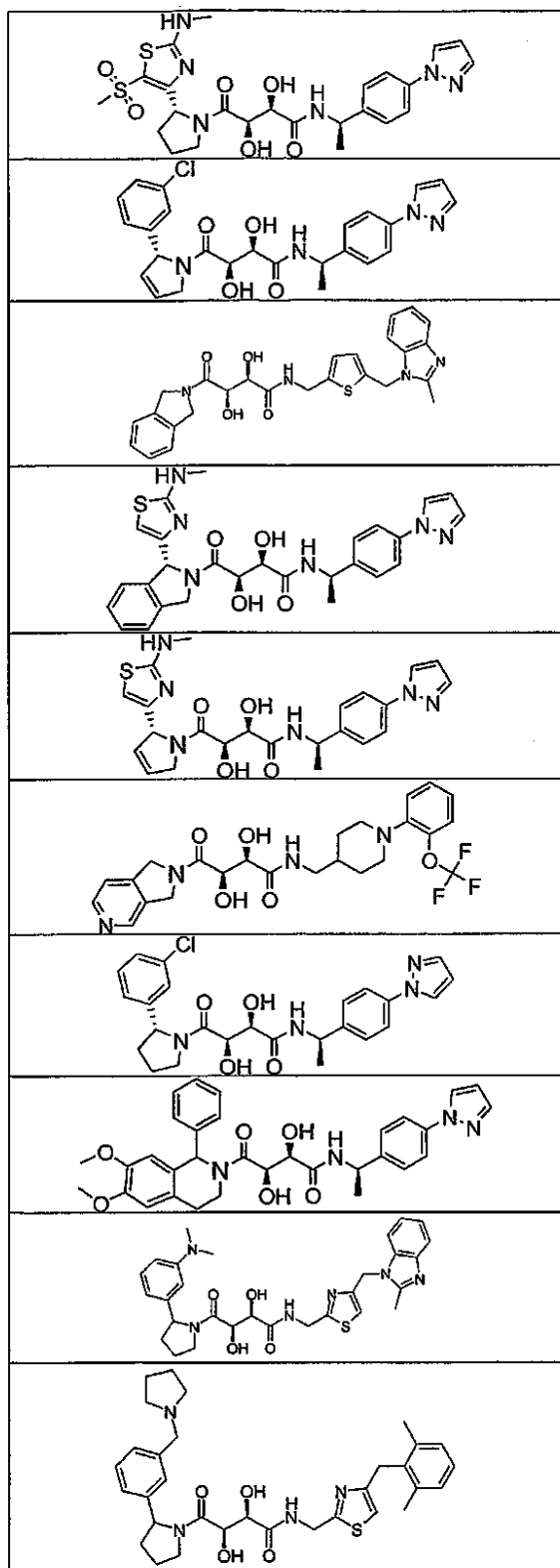
前記化合物が、以下で列挙された構造の化合物から選択される、請求項 6 1 に記載の化合物：

## 【化 1 6 4】



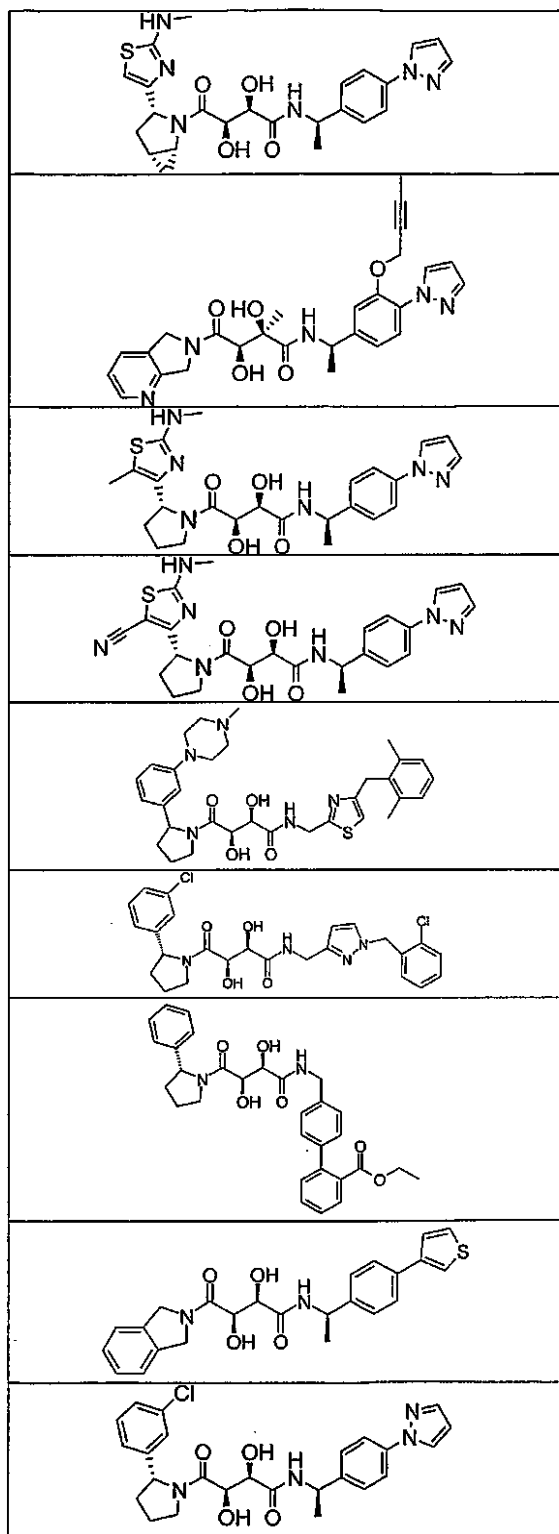


【化 1 6 5】



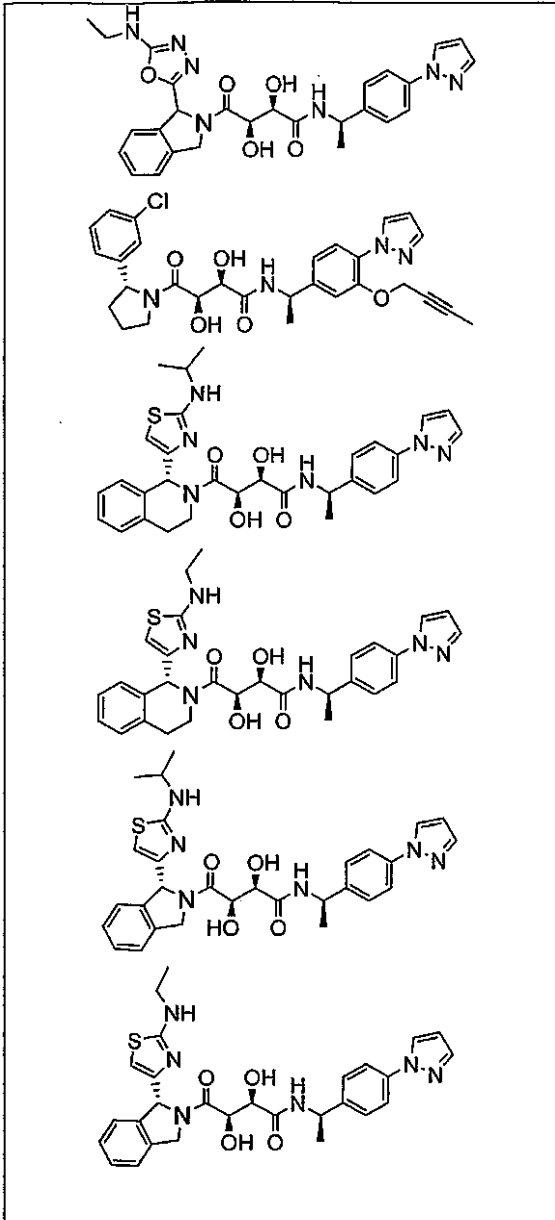


## 【化 1 6 6】





## 【化 1 6 7】



## 【請求項 6 3】

活性成分として、請求項 1 に記載の少なくとも 1 種の化合物を含有する、薬学的組成物。

## 【請求項 6 4】

少なくとも 1 種の薬学的に受容可能な担体をさらに含有する、請求項 1 に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 6 5】

腫瘍壊死因子 - 変換酵素 (TACE)、腫瘍壊死因子 (TNF - )、マトリックスメタロプロテイナーゼ (MMP)、ディスインテグリンおよびマトロプロテアーゼ (ADAM) またはそれらの任意の組み合わせに関連した障害を治療するための薬学的組成物であって、請求項 1 に記載の少なくとも 1 種の化合物の治療有効量を含有する、薬学的組成物。

## 【請求項 6 6】

TACE、TNF - 、MMP、ADAM またはそれらの任意の組み合わせに関連した障害を治療する医薬を製造するための、請求項 1 に記載の化合物の使用。

## 【請求項 6 7】

TACE、TNF - 、MMP、ADAM またはそれらの任意の組み合わせに関連した障



害を治療する医薬組成物を調製する方法であって、請求項 1 に記載の少なくとも 1 種の化合物と少なくとも 1 種の薬学的に受容可能な担体とを密接に接触させる工程を包含する、方法。

【請求項 68】

被験体における T A C E、T N F - 、M M P、A D A M またはそれらの任意の組み合わせに関連した障害を治療する薬学的組成物であって、請求項 1 に記載の少なくとも 1 種の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、溶媒和物または異性体の治療有効量を含む、組成物。

【請求項 69】

精製した形態の請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 70】

被験体における T A C E、M M P、T N F - 、アグレカナーゼ、またはそれらの任意の組み合わせに関連した病気または疾患を治療するための薬学的組成物であって、請求項 1 に記載の少なくとも 1 種の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、溶媒和物または異性体の治療有効量を含む、薬学的組成物。

【請求項 71】

前記アグレカナーゼが、アグレカナーゼ 1 またはアグレカナーゼ 2 である、請求項 70 に記載の薬学的組成物。

【請求項 72】

被験体における関節リウマチ、骨関節炎、歯周病、歯肉炎、角膜潰瘍、二次転移による固形腫瘍増殖および腫瘍浸潤、血管新生緑内障、炎症性腸疾患、多発性硬化症および乾癬からなる群から選択される病気または疾患を治療するための薬学的組成物であって、請求項 1 に記載の少なくとも 1 種の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、溶媒和物または異性体の治療有効量を含む、薬学的組成物。

【請求項 73】

被験体における発熱、心血管病、出血、凝血、悪液質、拒食症、アルコール依存症、急性期応答、急性伝染病、ショック、移植片対宿主反応、自己免疫疾患および H I V 感染からなる群から選択される病気または疾患を治療するための薬学的組成物であって、請求項 1 に記載の少なくとも 1 種の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、溶媒和物または異性体の治療有効量を含む、薬学的組成物。

【請求項 74】

被験体における敗血症ショック、血行動態ショック、敗血症症候群、虚血後再灌流傷害、マラリア、放線菌感染、髄膜炎、乾癬、鬱血性心不全、線維疾患、悪液質、移植片拒絶、癌（例えば、癌性 T - 細胞リンパ腫）、血管形成が関与している疾患、自己免疫疾患、皮膚炎症疾患、炎症性腸疾患（例えば、クローン病および大腸炎）、骨および関節リウマチ、強直性脊椎炎、乾癬性関節炎、成人スティル病、尿道炎、ウェジナー肉芽腫症、ベーチェット病、シェーグレン症候群、サルコイドーシス、多発性筋炎、皮膚筋炎、多発性硬化症、坐骨神経症、複合性局所疼痛症候群、放射線障害、過酸素症肺胞傷害、歯周病、H I V、インシュリン非依存性糖尿病、全身性紅斑性狼瘡、緑内障、サルコイドーシス、特発性肺線維症、気管支肺異形成症、網膜症、強皮症、骨粗鬆症、腎虚血、心筋梗塞、脳卒中、脳虚血、腎炎、肝炎、糸球体腎炎、特発性線維化肺胞炎、乾癬、移植片拒絶、アトピー性皮膚炎、血管炎、アレルギー、季節性アレルギー性鼻炎、可逆性気道閉塞、成人性呼吸窮迫症候群、喘息、慢性閉塞性肺疾患（C O P D）および気管支炎からなる群から選択される病気または疾患を治療するための薬学的組成物であって、請求項 1 に記載の少なくとも 1 種の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、溶媒和物または異性体の治療有効量を含む、薬学的組成物。

【請求項 75】

C O P D に関連した病気または疾患を治療するための薬学的組成物であって、請求項 1 に記載の少なくとも 1 種の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、溶媒和物または異性体の治療有効量を含む、薬学的組成物。



## 【請求項 76】

関節リウマチに関連した病気または疾患を治療するための薬学的組成物であって、請求項 1 に記載の少なくとも 1 種の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、溶媒和物または異性体の治療有効量を含む、薬学的組成物。

## 【請求項 77】

クローン病に関連した病気または疾患を治療するための薬学的組成物であって、請求項 1 に記載の少なくとも 1 種の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、溶媒和物または異性体の治療有効量を含む、薬学的組成物。

## 【請求項 78】

乾癬に関連した病気または疾患を治療するための薬学的組成物であって、請求項 1 に記載の少なくとも 1 種の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、溶媒和物または異性体の治療有効量を含む、薬学的組成物。

## 【請求項 79】

強直性脊椎炎に関連した病気または疾患を治療するための薬学的組成物であって、請求項 1 に記載の少なくとも 1 種の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、溶媒和物または異性体の治療有効量を含む、薬学的組成物。

## 【請求項 80】

坐骨神経症に関連した病気または疾患を治療するための薬学的組成物であって、請求項 1 に記載の少なくとも 1 種の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、溶媒和物または異性体の治療有効量を含む、薬学的組成物。

## 【請求項 81】

複合性局所疼痛症候群に関連した病気または疾患を治療するための薬学的組成物であって、請求項 1 に記載の少なくとも 1 種の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、溶媒和物または異性体の治療有効量を含む、薬学的組成物。

## 【請求項 82】

乾癬性関節炎に関連した病気または疾患を治療する方法であって、該方法は、以下の工程を包含する：このような治療を必要とする該被験体に、請求項 1 に記載の少なくとも 1 種の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、溶媒和物または異性体の治療有効量を投与する工程。

## 【請求項 83】

多発性硬化症に関連した病気または疾患を治療するための薬学的組成物であって、アボネックス（登録商標）、ベタセロン、コパキソンまたは多発性硬化症治療用に指定された他の化合物からなる群から選択される化合物と併用して、請求項 1 に記載の少なくとも 1 種の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、溶媒和物または異性体の治療有効量を含む、薬学的組成物。

## 【請求項 84】

疾患修飾性抗リウマチ薬（DMARDs）、NSAIDs、COX-2 阻害剤、COX-1 阻害剤、免疫抑制薬、生物学的応答調節物質（BRM）、抗炎症薬および H1 アンタゴニストからなる群から選択される少なくとも 1 種の医薬の治療有効量とともに使用するのに適している、請求項 71 に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 85】

DMARDs、NSAIDs、COX-2 阻害剤、COX-1 阻害剤、免疫抑制薬、BRMs、抗炎症薬および H1 アンタゴニストからなる群から選択される少なくとも 1 種の医薬の治療有効量とともに使用するのに適している、請求項 73 に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 86】

DMARDs、NSAIDs、COX-2 阻害剤、COX-1 阻害剤、免疫抑制薬、BRMs、抗炎症薬および H1 アンタゴニストからなる群から選択される少なくとも 1 種の医薬の治療有効量とともに使用するのに適している、請求項 75 に記載の薬学的組成物。