

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成18年7月13日(2006.7.13)

【公表番号】特表2006-505522(P2006-505522A)

【公表日】平成18年2月16日(2006.2.16)

【年通号数】公開・登録公報2006-007

【出願番号】特願2004-527723(P2004-527723)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 409/04 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/4184 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/4188 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/4439 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/454 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/496 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/5377 (2006.01)**  
**A 6 1 P 1/16 (2006.01)**  
**A 6 1 P 3/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 9/08 (2006.01)**  
**A 6 1 P 9/10 (2006.01)**  
**A 6 1 P 13/12 (2006.01)**  
**A 6 1 P 17/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 17/06 (2006.01)**  
**A 6 1 P 19/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 19/08 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/28 (2006.01)**  
**A 6 1 P 29/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 35/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 37/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**  
**C 0 7 D 409/14 (2006.01)**  
**C 0 7 D 491/056 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 D 409/04 C S P  
 A 6 1 K 31/4184  
 A 6 1 K 31/4188  
 A 6 1 K 31/4439  
 A 6 1 K 31/454  
 A 6 1 K 31/496  
 A 6 1 K 31/5377  
 A 6 1 P 1/16  
 A 6 1 P 3/00  
 A 6 1 P 9/08  
 A 6 1 P 9/10 1 0 1  
 A 6 1 P 13/12  
 A 6 1 P 17/02  
 A 6 1 P 17/06  
 A 6 1 P 19/02  
 A 6 1 P 19/08  
 A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 37/02  
 A 6 1 P 43/00 1 0 5  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1  
 C 0 7 D 409/14  
 C 0 7 D 491/056

## 【手続補正書】

【提出日】平成18年5月26日(2006.5.26)

## 【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

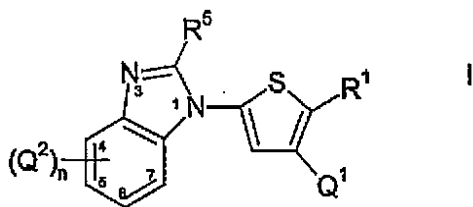
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(1)で表される化合物、あるいは薬剤として許容されるその塩、溶媒和物、または生理学的に機能的な誘導体。

【化1】



[ 式中、

$R^1$  は、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、 $-C(O)R^7$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-C(O)NR^7R^8$ 、 $-C(O)N(R^7)OR^8$ 、 $-C(O)N(R^7)-R^2-OR^8$ 、 $-C(O)N(R^7)-Ph$ 、 $-C(O)N(R^7)-R^2-Ph$ 、 $-C(O)N(R^7)C(O)R^8$ 、 $-C(O)N(R^7)CO_2R^8$ 、 $-C(O)N(R^7)C(O)NR^7R^8$ 、 $-C(O)N(R^7)S(O)_2R^8$ 、 $-R^2-OR^7$ 、 $-R^2-O-C(O)R^7$ 、 $-C(S)R^7$ 、 $-C(S)NR^7R^8$ 、 $-C(S)N(R^7)-Ph$ 、 $-C(S)N(R^7)-R^2-Ph$ 、 $-R^2-SR^7$ 、 $-C(=NR^7)NR^7R^8$ 、 $-C(=NR^7)N(R^8)-Ph$ 、 $-C(=NR^7)N(R^8)-R^2-Ph$ 、 $-R^2-NR^7R^8$ 、 $-CN$ 、 $-OR^7$ 、 $-S(O)_fR^7$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 、 $-S(O)_2N(R^7)-Ph$ 、 $-S(O)_2N(R^7)-R^2-Ph$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)-Ph$ 、 $-N(R^7)-R^2-Ph$ 、 $-N(R^7)-SO_2R^8$ 、およびHetからなる群から選択され、

Phはフェニルであり、ハロ、アルキル、 $-OH$ 、 $-R^2-OH$ 、 $-O$ -アルキル、 $-R^2-O$ -アルキル、 $-NH_2$ 、 $-N(H)$ アルキル、 $-N(アルキル)_2$ 、 $-CN$ 、および $-N_3$ からなる群から選択された置換基で1から3回置換されていてもよく、

Hetは、N、O、およびSから選択された1、2、3、または4個のヘテロ原子を有する5～7員複素環、あるいはN、O、およびSから選択された1、2、3、または4個のヘテロ原子を有する5～6員ヘテロアリアルであり、ハロ、アルキル、オキソ、 $-OH$ 、 $-R^2-OH$ 、 $-O$ -アルキル、 $-R^2-O$ -アルキル、 $-NH_2$ 、 $-N(H)$ アルキル、 $-N(アルキル)_2$ 、 $-CN$ 、および $-N_3$ からなる群から選択された置換基でそれぞれ1から2回置換されていてもよく、

$Q^1$  は、式 $-(R^2)_a-(Y^1)_b-(R^2)_c-R^3$ の基であり、

a、b、およびcは、同じであるかまたは異なっており、それぞれ独立して0または1であって、aまたはbの少なくとも1つは1であり、

nは、0、1、2、3、または4であり、

$Q^2$  は、式 $-(R^2)_{aa}-(Y^2)_{bb}-(R^2)_{cc}-R^4$ の基であるか、あるいは

2つの隣接する $Q^2$ 基は、アルキル、アルケニル、 $-OR^7$ 、 $-S(O)_fR^7$ 、および $-NR^7R^8$ からなる群から選択され、それらが結合している炭素原子と共に、 $C_{5-6}$ シクロアルキル、 $C_{5-6}$ シクロアルケニル、フェニル、N、O、およびSから選択された1または2個のヘテロ原子を有

する5~7員複素環、あるいはN、O、およびSから選択された1または2個のヘテロ原子を有する5~6員ヘテロアリアルを形成し、

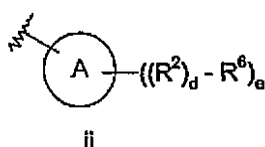
aa、bb、およびccは、同じであるかまたは異なっており、それぞれ独立して0または1であり、

$Y^1$  および  $Y^2$  はそれぞれ、同じであるかまたは異なっており、 $-O-$ 、 $-S(O)_f-$ 、 $-N(R^7)-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-OC(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(O)N(R^7)-$ 、 $-C(O)N(R^7)S(O)_2-$ 、 $-OC(O)N(R^7)-$ 、 $-OS(O)_2-$ 、 $-S(O)_2N(R^7)-$ 、 $-S(O)_2N(R^7)C(O)-$ 、 $-N(R^7)S(O)_2-$ 、 $-N(R^7)C(O)-$ 、 $-N(R^7)CO_2-$ 、および  $-N(R^7)C(O)N(R^7)-$  からなる群から独立して選択され、

$R^2$  はそれぞれ、同じであるかまたは異なっており、アルキレン、アルケニレン、およびアルキニレンからなる群から独立して選択され、

$R^3$  および  $R^4$  はそれぞれ、同じであるかまたは異なっており、H、ハロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、 $-C(O)R^7$ 、 $-C(O)NR^7R^8$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-C(S)R^7$ 、 $-C(S)NR^7R^8$ 、 $-C(=NR^7)R^8$ 、 $-C(=NR^7)NR^7R^8$ 、 $-CR^7=N-OR^7$ 、 $-OR^7$ 、 $-S(O)_fR^7$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)R^8$ 、 $-N(R^7)S(O)_2R^8$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N_3$ 、および式(ii)：

【化2】



(式中、

環Aは、 $C_{5-10}$ シクロアルキル、 $C_{5-10}$ シクロアルケニル、アリアル、N、O、およびSから選択された1、2、または3個のヘテロ原子を有する5~10員複素環、ならびにN、O、およびSから選択された1、2、または3個のヘテロ原子を有する5~10員ヘテロアリアルからなる群から選択され、

dはそれぞれ、0または1であり、

eは、0、1、2、3、または4であり、

$R^6$  はそれぞれ、同じであるかまたは異なっており、H、ハロ、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、Ph、Het、 $-CH(OH)-R^2-OH$ 、 $-C(O)R^7$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-CO_2-R^2-Ph$ 、 $-CO_2-R^2-Het$ 、 $-C(O)NR^7R^8$ 、 $-C(O)N(R^7)C(O)R^7$ 、 $-C(O)N(R^7)CO_2R^7$ 、 $-C(O)N(R^7)C(O)NR^7R^8$ 、 $-C(O)N(R^7)S(O)_2R^7$ 、 $-C(S)R^7$ 、 $-C(S)NR^7R^8$ 、 $-C(=NR^7)R^8$ 、 $-C(=NR^7)NR^7R^8$ 、 $-CR^7=N-OR^7$ 、 $=O$ 、 $-OR^7$ 、 $-OC(O)R^7$ 、 $-OC(O)Ph$ 、 $-OC(O)Het$ 、 $-OC(O)NR^7R^8$ 、 $-O-R^2-S(O)_2R^7$ 、 $-S(O)_fR^7$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 、 $-S(O)_2Ph$ 、 $-S(O)_2Het$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)R^8$ 、 $-N(R^7)CO_2R^8$ 、 $-N(R^7)-R^2-CO_2R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)-R^2-C(O)NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)Ph$ 、 $-N(R^7)C(O)Het$ 、 $-N(R^7)Ph$ 、 $-N(R^7)Het$ 、 $-N(R^7)C(O)NR^7-R^2-NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^7)Ph$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^7)Het$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^7)-R^2-Het$ 、 $-N(R^7)S(O)_2R^8$ 、 $-N(R^7)-R^2-S(O)_2R^8$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、および  $-N_3$  からなる群から独立して選択される)

で表される基からなる群からそれぞれ独立して選択され、

bは1であり、cは0であるように $Q^1$ が定義されるとき、 $R^3$ は、ハロ、 $-C(O)R^7$ 、 $-C(O)NR^7R^8$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-C(S)R^7$ 、 $-C(S)NR^7R^8$ 、 $-C(=NR^7)R^8$ 、 $-C(=NR^7)NR^7R^8$ 、 $-CR^7=N-OR^7$ 、 $-OR^7$ 、 $-S(O)_fR^7$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)R^8$ 、 $-N(R^7)S(O)_2R^8$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、および  $-N_3$  ではなく、

bbは1であり、ccは0であるように $Q^2$ が定義されるとき、 $R^4$ は、ハロ、 $-C(O)R^7$ 、 $-C(O)NR^7R^8$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-C(S)R^7$ 、 $-C(S)NR^7R^8$ 、 $-C(=NR^7)R^8$ 、 $-C(=NR^7)NR^7R^8$ 、 $-CR^7=N-OR^7$ 、 $-OR^7$ 、 $-S(O)_fR^7$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)R^8$ 、 $-N(R^7)S(O)_2R^8$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、および  $-N_3$  ではなく、

$R^5$  は、H、ハロ、アルキル、シクロアルキル、 $OR^7$ 、 $-S(O)_fR^7$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-NHC(O)R^7$ 、 $-NH C(O)NR^7R^8$ 、および  $-NHS(O)_2R^7$  からなる群から選択され、

fは、0、1、または2であり、

$R^7$  はそれぞれ、かつ  $R^8$  はそれぞれ、同じであるかまたは異なっており、H、アルキル、

アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、およびシクロアルケニルからなる群からそれぞれ独立して選択され、

$R^1$  が  $-CO_2CH_3$  であり、 $n$  が 0 であるとき、 $Q^1$  は、 $-OH$  ではない]

【請求項 2】

5-(5,6-ジメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)-3-{[2-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}チオフェン-2-カルボキサミド;

5-(5-(メチルオキシ)-6-{[2-(4-メチル-1-ピペラジニル)エチル]オキシ}-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)-3-([2-(トリフルオロメチル)フェニル]メチル)オキシ)-2-チオフェンカルボキサミド;

3-[1-(2-クロロフェニル)エトキシ]-5-(5,6-ジメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)チオフェン-2-カルボキサミド;

5-(5,6-ジメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)-3-[1-(2-メチルフェニル)エトキシ]チオフェン-2-カルボキサミド;

5-(5-アミノ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)-3-[1-(2-クロロフェニル)エトキシ]チオフェン-2-カルボキサミド;

5-{6-[(4-ピペリジニルメチル)オキシ]-1H-ベンズイミダゾール-1-イル}-3-([2-(トリフルオロメチル)フェニル]-メチル)オキシ)-2-チオフェンカルボキサミド;

5-(6-(メチルオキシ)-5-{[3-(2-オキソ-1-ピロリジニル)プロピル]オキシ}-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)-3-([2-(トリフルオロメチル)フェニル]メチル)オキシ)-2-チオフェンカルボキサミド;

5-[6-{[3-(ジメチルアミノ)プロピル]オキシ}-5-(メチルオキシ)-1H-ベンズイミダゾール-1-イル]-3-([2-(トリフルオロメチル)フェニル]メチル)オキシ)-2-チオフェンカルボキサミド;

5-(5-(メチルオキシ)-6-{[2-(4-モルホリニル)エチル]オキシ}-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)-3-([2-(トリフルオロメチル)フェニル]メチル)オキシ)-2-チオフェンカルボキサミド;

5-[6-(2-モルホリン-4-イルエトキシ)-1H-ベンズイミダゾール-1-イル]-3-{[2-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}チオフェン-2-カルボキサミド;

5-[6-(2-ピロリジン-1-イルエトキシ)-1H-ベンズイミダゾール-1-イル]-3-{[2-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}チオフェン-2-カルボキサミド;

5-[5-フルオロ-6-(2-モルホリン-4-イルエトキシ)-1H-ベンズイミダゾール-1-イル]-3-{[2-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}チオフェン-2-カルボキサミド;

5-[6-(メチルスルホニル)-1H-ベンズイミダゾール-1-イル]-3-{[2-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}チオフェン-2-カルボキサミド;

3-[(3-プロモピリジン-4-イル)メトキシ]-5-(5,6-ジメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)チオフェン-2-カルボキサミド;

5-(5,6-ジメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)-3-{[2-(トリフルオロメトキシ)ベンジル]オキシ}チオフェン-2-カルボキサミド;

3-{[2-(ジフルオロメトキシ)ベンジル]オキシ}-5-(5,6-ジメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)チオフェン-2-カルボキサミド;

3-[(2-クロロピリジン-3-イル)メトキシ]-5-(5,6-ジメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)チオフェン-2-カルボキサミド;

5-(5,6-ジメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)-3-[(2-フルオロピリジン-3-イル)メトキシ]チオフェン-2-カルボキサミド;

3-[(2-アミノピリジン-4-イル)メトキシ]-5-(5,6-ジメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)チオフェン-2-カルボキサミド;

3-[(6-クロロ-1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)メトキシ]-5-(5,6-ジメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)チオフェン-2-カルボキサミド;

5-(5,6-ジメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)-3-[(2-ニトロベンジル)オキシ]チオフェン-2-カルボキサミド;

3-[(3-アミノベンジル)オキシ]-5-(5,6-ジメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)チオフェン-2-カルボキサミド;

5-(6-ブromo-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)-3-{[2-(トリフルオロメチル)ベンジル]-オキシ}チオフェン-2-カルボキサミド;

3-[(2,6-ジクロロベンジル)オキシ]-5-(5,6-ジメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)チオフェン-2-カルボキサミド;

3-[(2-ブromoベンジル)オキシ]-5-(5,6-ジメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)チオフェン-2-カルボキサミド;

5-(5,6-ジメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)-3-[(2-ホルミルベンジル)オキシ]チオフェン-2-カルボキサミド;

5-(1H-ベンズイミダゾール-1-イル)-3-{[2-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}チオフェン-2-カルボキサミド;

5-(1H-ベンズイミダゾール-1-イル)-3-[(2-ニトロベンジル)オキシ]チオフェン-2-カルボキサミド;

5-(6-メトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)-3-{[2-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}チオフェン-2-カルボキサミド;

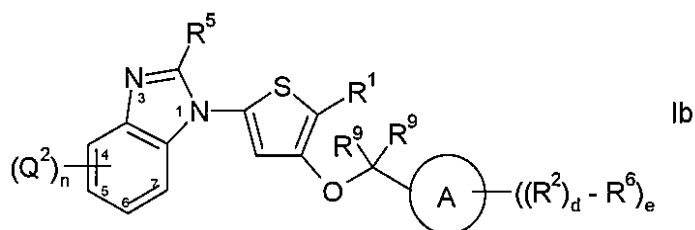
2-(アミノカルボニル)-5-(5,6-ジメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)チエン-3-イル 2-メチルベンゼンスルホネート

からなる群から選択された化合物、ならびに薬剤として許容されるその塩、溶媒和物、および生理学的に機能的な誘導体。

#### 【請求項3】

式(1b)で表される化合物、あるいは薬剤として許容されるその塩、溶媒和物、または生理学的に機能的な誘導体。

#### 【化3】



[式中、

R¹は、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、-C(O)R⁷、-CO₂R⁷、-C(O)NR⁷R⁸、-C(O)N(R⁷)OR⁸、-C(O)N(R⁷)-R²-OR⁸、-C(O)N(R⁷)-Ph、-C(O)N(R⁷)-R²-Ph、-C(O)N(R⁷)C(O)R⁸、-C(O)N(R⁷)CO₂R⁸、-C(O)N(R⁷)C(O)NR⁷R⁸、-C(O)N(R⁷)S(O)₂R⁸、-R²-OR⁷、-R²-O-C(O)R⁷、-C(S)R⁷、-C(S)NR⁷R⁸、-C(S)N(R⁷)-Ph、-C(S)N(R⁷)-R²-Ph、-R²-SR⁷、-C(=NR⁷)NR⁷R⁸、-C(=NR⁷)N(R⁸)-Ph、-C(=NR⁷)N(R⁸)-R²-Ph、-R²-NR⁷R⁸、-CN、-OR⁷、-S(O)ₓR⁷、-S(O)₂NR⁷R⁸、-S(O)₂N(R⁷)-Ph、-S(O)₂N(R⁷)-R²-Ph、-NR⁷R⁸、N(R⁷)-Ph、-N(R⁷)-R²-Ph、-N(R⁷)-SO₂R⁸およびHetからなる群から選択され、

Phはフェニルであり、ハロ、アルキル、-OH、-R²-OH、-O-アルキル、-R²-O-アルキル、-NH₂、-N(H)アルキル、-N(アルキル)₂、-CN、および-N₃からなる群から選択された置換基で1から3回置換されていてもよく、

Hetは、N、O、およびSから選択された1、2、3、または4個のヘテロ原子を有する5~7員複素環、あるいはN、O、およびSから選択された1、2、3、または4個のヘテロ原子を有する5~6員ヘテロアリアルであり、ハロ、アルキル、オキソ、-OH、-R²-OH、-O-アルキル、-R²-O-アルキル、-NH₂、-N(H)アルキル、-N(アルキル)₂、-CN、および-N₃からなる群から選択された置換基でそれぞれ1から2回置換されていてもよく、

nは、0、1、2、3、または4であり、

Q²は、式-(R²)ₐₐ-(Y²)ᵇᵇ-(R²)ᶜᶜ-R⁴の基であるか、あるいは

2つの隣接するQ²基は、アルキル、アルケニル、-OR⁷、-S(O)ₓR⁷、および-NR⁷R⁸からな

る群から選択され、それらが結合している炭素原子と共に、 $C_{5-6}$ シクロアルキル、 $C_{5-6}$ シクロアルケニル、フェニル、N、O、およびSから選択された1または2個のヘテロ原子を有する5~7員複素環、あるいはN、O、およびSから選択された1または2個のヘテロ原子を有する5~6員ヘテロアリアルを形成し、

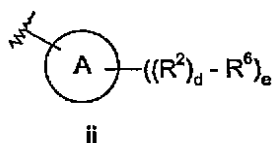
aa、bb、およびccは、同じであるかまたは異なっており、それぞれ独立して0または1であり、

$Y^2$ はそれぞれ、同じであるかまたは異なっており、 $-O-$ 、 $-S(O)_f-$ 、 $-N(R^7)-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-OC(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(O)N(R^7)-$ 、 $-C(O)N(R^7)S(O)_2-$ 、 $-OC(O)N(R^7)-$ 、 $-OS(O)_2-$ 、 $-S(O)_2N(R^7)-$ 、 $-S(O)_2N(R^7)C(O)-$ 、 $-N(R^7)S(O)_2-$ 、 $-N(R^7)C(O)-$ 、 $-N(R^7)CO_2-$ 、および $-N(R^7)C(O)N(R^7)-$ からなる群から独立して選択され、

$R^2$ はそれぞれ、同じであるかまたは異なっており、アルキレン、アルケニレン、およびアルキニレンからなる群から独立して選択され、

$R^4$ はそれぞれ、同じであるかまたは異なっており、H、ハロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、 $-C(O)R^7$ 、 $-C(O)NR^7R^8$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-C(S)R^7$ 、 $-C(S)NR^7R^8$ 、 $-C(=NR^7)R^8$ 、 $-C(=NR^7)NR^7R^8$ 、 $-CR^7=N-OR^7$ 、 $-OR^7$ 、 $-S(O)_fR^7$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)R^8$ 、 $-N(R^7)S(O)_2R^8$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N_3$ 、および式(ii)：

【化4】



(式中、

環Aは、 $C_{5-10}$ シクロアルキル、 $C_{5-10}$ シクロアルケニル、アリアル、N、O、およびSから選択された1、2、または3個のヘテロ原子を有する5~10員複素環、ならびにN、O、およびSから選択された1、2、または3個のヘテロ原子を有する5~10員ヘテロアリアルからなる群から選択され、

dはそれぞれ、0または1であり、

eは、0、1、2、3、または4であり、

$R^6$ はそれぞれ、同じであるかまたは異なっており、H、ハロ、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、Ph、Het、 $-CH(OH)-R^2-OH$ 、 $-C(O)R^7$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-CO_2-R^2-Ph$ 、 $-CO_2-R^2-Het$ 、 $-C(O)NR^7R^8$ 、 $-C(O)N(R^7)C(O)R^7$ 、 $-C(O)N(R^7)CO_2R^7$ 、 $-C(O)N(R^7)C(O)NR^7R^8$ 、 $-C(O)N(R^7)S(O)_2R^7$ 、 $-C(S)R^7$ 、 $-C(S)NR^7R^8$ 、 $-C(=NR^7)R^8$ 、 $-C(=NR^7)NR^7R^8$ 、 $-CR^7=N-OR^8$ 、 $=O$ 、 $-OR^7$ 、 $-OC(O)R^7$ 、 $-OC(O)Ph$ 、 $-OC(O)Het$ 、 $-OC(O)NR^7R^8$ 、 $-O-R^2-S(O)_2R^7$ 、 $-S(O)_fR^7$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 、 $-S(O)_2Ph$ 、 $-S(O)_2Het$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)R^8$ 、 $-N(R^7)CO_2R^8$ 、 $-N(R^7)-R^2-CO_2R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)-R^2-C(O)NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)Ph$ 、 $-N(R^7)C(O)Het$ 、 $-N(R^7)Ph$ 、 $-N(R^7)Het$ 、 $-N(R^7)C(O)NR^7-R^2-NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^7)Ph$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^7)Het$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^7)-R^2-Het$ 、 $-N(R^7)S(O)_2R^8$ 、 $-N(R^7)-R^2-S(O)_2R^8$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、および $-N_3$ からなる群から独立して選択される)

で表される基からなる群からそれぞれ独立して選択され、

bbは1であり、ccは0であるように $Q^2$ が定義されるとき、 $R^4$ は、ハロ、 $-C(O)R^7$ 、 $-C(O)NR^7R^8$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-C(S)R^7$ 、 $-C(S)NR^7R^8$ 、 $-C(=NR^7)R^8$ 、 $-C(=NR^7)NR^7R^8$ 、 $-CR^7=N-OR^7$ 、 $-OR^7$ 、 $-S(O)_fR^7$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)R^8$ 、 $-N(R^7)S(O)_2R^8$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、および $-N_3$ ではなく、

$R^5$ は、H、ハロ、アルキル、シクロアルキル、 $OR^7$ 、 $-S(O)_fR^7$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-NHC(O)R^7$ 、 $-NHC(O)NR^7R^8$ 、および $-NHS(O)_2R^7$ からなる群から選択され、

fは、0、1、または2であり、

$R^7$ はそれぞれ、かつ $R^8$ はそれぞれ、同じであるかまたは異なっており、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、およびシクロアルケニルからなる群からそれぞれ独立して選択され、

$R^9$ はそれぞれ、同じであるかまたは異なっており、H、ハロおよびアルキルから選択される]

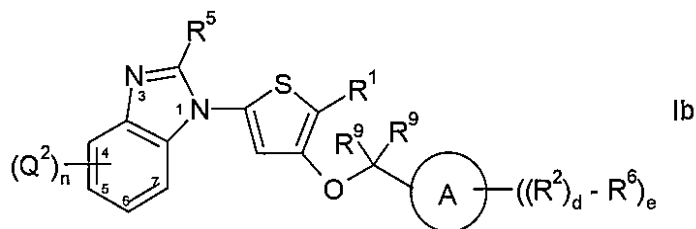
【請求項4】

請求項3に記載の化合物のR-異性体。

【請求項5】

式(1b)で表される化合物、あるいは薬剤として許容されるその塩。

【化5】



[ 式中、

$R^1$ は、 $-C(=O)NH_2$ であり、

$R^9$ はそれぞれ、同じであるかまたは異なっており、H、ハロおよびアルキルから選択され、

環Aは、フェニルであり、

dは、0であり、

eは、1であり、

$R^6$ は、トリフルオロメチルであり、

nは1であり、 $Q^2$ は、C-6にあり、

$R^5$ は、Hであり、

fは、0、1、または2であり、

$R^7$ はそれぞれ、かつ $R^8$ はそれぞれ、同じであるかまたは異なっており、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびシクロアルケニルからそれぞれ独立して選択され、および

$Q^2$ は、式 $-(R^2)_{aa}-(Y^2)_{bb}-(R^2)_{cc}-R^4$ の基であり、

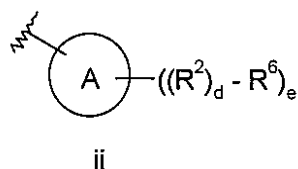
aaは、0であり、

bbは、0であり、

ccは、1であり、及び $(R^2)_{cc}$ は、 $C_{1-3}$ アルキレンであり、および

$R^4$ は、式(ii)

【化6】



( 式中、

環Aは、モルホリン、ピペリジン、ピペラジン、フェニル、ピロリジノン、イミダゾリジノンおよびピロリジンからなる群から選択され、

dは、0であり、

eは、1であり、および

$R^6$ は、H、ハロ、アルキル、 $=O$ 、 $-OR^7$ 、 $-S(O)_f R^7$ 、 $-S(O)_2 NR^7 R^8$ 及び $-NR^7 R^8$ からなる群から選択される)の基である]

【請求項6】

動物において感受性新生物の治療に用いるための請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物を含む医薬組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0008

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0008】

(式中、

環Aは、 $C_{5-10}$ シクロアルキル、 $C_{5-10}$ シクロアルケニル、アリール、N、O、およびSから選択された1、2、または3個のヘテロ原子を有する5~10員複素環、ならびにN、O、およびSから選択された1、2、または3個のヘテロ原子を有する5~10員ヘテロアリールからなる群から選択され、

dはそれぞれ、0または1であり、

eは、0、1、2、3、または4であり、

$R^6$ はそれぞれ、同じであるかまたは異なっており、H、ハロ、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、Ph、Het、 $-CH(OH)-R^2-OH$ 、 $-C(O)R^7$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-CO_2-R^2-Ph$ 、 $-CO_2-R^2-Het$ 、 $-C(O)NR^7R^8$ 、 $-C(O)N(R^7)C(O)R^7$ 、 $-C(O)N(R^7)CO_2R^7$ 、 $-C(O)N(R^7)C(O)NR^7R^8$ 、 $-C(O)N(R^7)S(O)_2R^7$ 、 $-C(S)R^7$ 、 $-C(S)NR^7R^8$ 、 $-C(=NR^7)R^8$ 、 $-C(=NR^7)NR^7R^8$ 、 $-CR^7=N-OR^8$ 、 $=O$ 、 $-OR^7$ 、 $-OC(O)R^7$ 、 $-OC(O)Ph$ 、 $-OC(O)Het$ 、 $-OC(O)NR^7R^8$ 、 $-O-R^2-S(O)_2R^7$ 、 $-S(O)_fR^7$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 、 $-S(O)_2Ph$ 、 $-S(O)_2Het$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)R^8$ 、 $-N(R^7)CO_2R^8$ 、 $-N(R^7)-R^2-CO_2R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)-R^2-C(O)NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)Ph$ 、 $-N(R^7)C(O)Het$ 、 $-N(R^7)Ph$ 、 $-N(R^7)Het$ 、 $-N(R^7)C(O)NR^7-R^2-NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^7)Ph$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^7)Het$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^7)-R^2-Het$ 、 $-N(R^7)S(O)_2R^8$ 、 $-N(R^7)-R^2-S(O)_2R^8$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、および $-N_3$ からなる群から独立して選択される)

で表される基からなる群からそれぞれ独立して選択され、

bは1であり、cは0であるように $Q^1$ が定義されるとき、 $R^3$ は、ハロ、 $-C(O)R^7$ 、 $-C(O)NR^7R^8$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-C(S)R^7$ 、 $-C(S)NR^7R^8$ 、 $-C(=NR^7)R^8$ 、 $-C(=NR^7)NR^7R^8$ 、 $-CR^7=N-OR^7$ 、 $-OR^7$ 、 $-S(O)_fR^7$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)R^8$ 、 $-N(R^7)S(O)_2R^8$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、および $-N_3$ ではなく、

bbは1であり、ccは0であるように $Q^2$ が定義されるとき、 $R^4$ は、ハロ、 $-C(O)R^7$ 、 $-C(O)NR^7R^8$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-C(S)R^7$ 、 $-C(S)NR^7R^8$ 、 $-C(=NR^7)R^8$ 、 $-C(=NR^7)NR^7R^8$ 、 $-CR^7=N-OR^7$ 、 $-OR^7$ 、 $-S(O)_fR^7$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)R^8$ 、 $-N(R^7)S(O)_2R^8$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、および $-N_3$ ではなく、

$R^5$ は、H、ハロ、アルキル、シクロアルキル、 $OR^7$ 、 $-S(O)_fR^7$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-NHC(O)R^7$ 、 $-NH C(O)NR^7R^8$ 、および $-NHS(O)_2R^7$ からなる群から選択され、

fは、0、1、または2であり、

$R^7$ はそれぞれ、かつ $R^8$ はそれぞれ、同じであるかまたは異なっており、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、およびシクロアルケニルからなる群からそれぞれ独立して選択され、

$R^1$ が $-CO_2CH_3$ であり、nが0であるとき、 $Q^1$ は、 $-OH$ ではない。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0591

【補正方法】変更

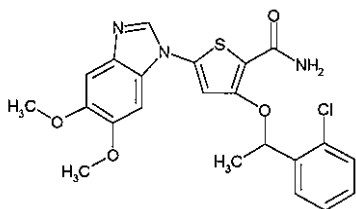
【補正の内容】

【0591】

(実施例126)

3-[1-(2-クロロフェニル)エトキシ]-5-(5,6-ジメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)チオフェン-2-カルボキサミド

## 【化 1 9 4】



## 【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 6 7 8

【補正方法】変更

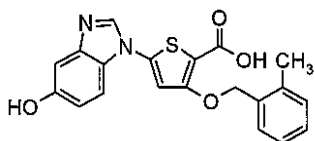
【補正の内容】

【0 6 7 8】

( 実施例 1 4 1 )

5-(5-(ヒドロキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)-3-[(2-メチルベンジル)オキシ]-チオフェン-2-カルボン酸

【化 2 3 7】



## 【手続補正 5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 6 8 0

【補正方法】変更

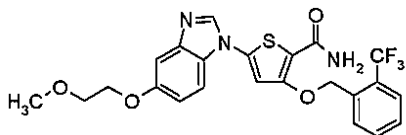
【補正の内容】

【0 6 8 0】

( 実施例 1 4 2 )

5-[5-(2-メトキシエトキシ)-1H-ベンズイミダゾール-1-イル]-3-[(2-メチルベンジル)オキシ]チオフェン-2-カルボキサミド

【化 2 3 8】



## 【手続補正 6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 7 1 3

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 7 1 3】

( 実施例 1 5 2 )

5-(5,6-ジメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)-3-ヒドロキシチオフェン-2-カルボキサミドトリフルオロ酢酸塩

【化 2 5 4】

