

【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21年9月17日(2009.9.17)

【公表番号】特表2009-503112(P2009-503112A)

【公表日】平成21年1月29日(2009.1.29)

【年通号数】公開・登録公報2009-004

【出願番号】特願2008-525240(P2008-525240)

【国際特許分類】

C 0 7 D 513/04 (2006.01)
 A 6 1 K 31/429 (2006.01)
 A 6 1 K 31/496 (2006.01)
 A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
 A 6 1 K 31/498 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)
 A 6 1 P 25/28 (2006.01)
 A 6 1 P 25/16 (2006.01)
 A 6 1 P 25/14 (2006.01)
 A 6 1 P 7/02 (2006.01)
 A 6 1 P 9/00 (2006.01)
 A 6 1 P 9/10 (2006.01)
 A 6 1 P 35/04 (2006.01)
 A 6 1 P 13/12 (2006.01)
 A 6 1 P 27/02 (2006.01)
 A 6 1 P 7/08 (2006.01)
 A 6 1 P 9/06 (2006.01)
 A 6 1 P 21/04 (2006.01)
 A 6 1 P 19/02 (2006.01)
 A 6 1 P 9/12 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 513/04 3 3 1
 C 0 7 D 513/04 C S P
 A 6 1 K 31/429
 A 6 1 K 31/496
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 K 31/498
 A 6 1 K 31/4439
 A 6 1 P 43/00 1 2 3
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 25/14
 A 6 1 P 7/02
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 35/04
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 7/08
 A 6 1 P 9/06

A 6 1 P 21/04

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 9/12

【手続補正書】

【提出日】平成21年8月3日(2009.8.3)

【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

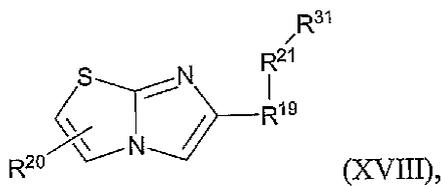
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式：

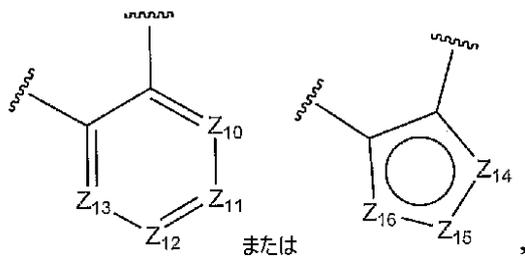
【数1d】



の化合物またはその塩であって、該式において、

R^{19} は、

【数2d】



から選択され；

Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} および Z_{13} は、それぞれ独立して、N、 CR^{20} または $CR_{1'}$ から選択され；

Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} は、それぞれ独立して、N、 $NR_{1'}$ 、S、O、 CR^{20} または $CR_{1'}$ から選択され、ここで

Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} または Z_{13} の0～2個は、Nであり；

Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} の少なくとも1個は、N、 $NR_{1'}$ 、OまたはSであり；

Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} の0～1個は、SまたはOであり；

Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} の0～2個は、Nまたは $NR_{1'}$ であり；

0～1個の R^{20} は、可溶化基であり；

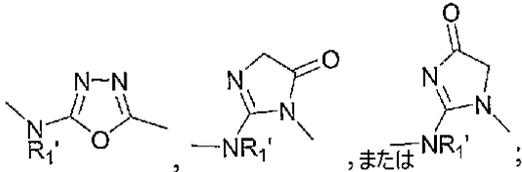
0～1個の $R_{1'}$ は、必要に応じて置換された $C_1 - C_3$ 直鎖または分岐状のアルキルであり；

各 R^{20} は、独立して、Hまたは可溶化基から選択され；

R^{21} は、 $-NR_{1'}$ -C(O)-、 $-NR_{1'}$ -S(O)₂-、 $-NR_{1'}$ -C(O)- $NR_{1'}$ -、 $-NR_{1'}$ -C(S)- $NR_{1'}$ -、 $-NR_{1'}$ -C(S)- $NR_{1'}$ - $CR_{1'}$ $R_{1'}$ -、 $-NR_{1'}$ -C(O)- $CR_{1'}$ $R_{1'}$ - $NR_{1'}$ -、 $-NR_{1'}$ -C(=NR_{1'})- $NR_{1'}$ -、 $-C(O)-NR_{1'}$ -、 $-C(O)-NR_{1'}$ -S(O)₂-、 $-NR_{1'}$ -、 $-CR_{1'}$ $R_{1'}$ -、 $-NR_{1'}$ -C(O)- $CR_{1'}$ =C

$R_{1'} - , - NR_{1'} - S(O)_2 - NR_{1'} - , - NR_{1'} - C(O) - NR_{1'} - S$
 $(O)_2 - , - NR_{1'} - CR_{1'} R_{1'} - C(O) - NR_{1'} - , - CR_{1'} R_{1'} -$
 $C(O) - NR_{1'} - , - NR_{1'} - C(O) - CR_{1'} = CR_{1'} - CR_{1'} R_{1'} -$
 $, - NR_{1'} - C(=N-CN) - NR_{1'} - , - NR_{1'} - C(O) - CR_{1'} R_{1'} -$
 $- O - , - NR_{1'} - C(O) - CR_{1'} R_{1'} - CR_{1'} R_{1'} - O - , - NR_{1'} -$
 $S(O)_2 - CR_{1'} R_{1'} - , - NR_{1'} - S(O)_2 - CR_{1'} R_{1'} - CR_{1'} R$
 $_{1'} - , - NR_{1'} - C(O) - CR_{1'} R_{1'} - , - NR_{1'} - C(O) - CR_{1'} R$
 $'_1 - CR_{1'} R'_{1'} - , - NR_{1'} - C(S) - NR_{1'} - CR_{1'} R'_{1'} - CR_{1}'$
 $R'_{1'} - , - NR_{1'} - C(O) - O - ,$

【数 3 d】



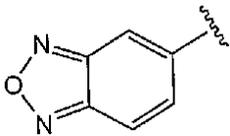
から選択され；

各 $R_{1'}$ は、独立して、H または必要に応じて置換された $C_1 - C_3$ 直鎖または分岐状のアルキルから選択され；そして

$R^{3'}$ は、必要に応じて置換された単環式または二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式または二環式ヘテロアリールであり、

ただし、 $R^{2'}$ が $- NR_{1'} - C(O) -$ の場合は、 $R^{3'}$ は、4-シアノフェニルでも

【数 4 d】

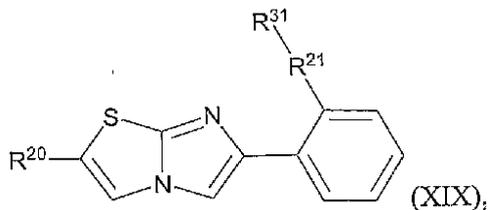


でもなく；および $R^{2'}$ が $- NR_{1'} - S(O)_2 -$ の場合は、 $R^{3'}$ は 4-メトキシフェニルでも 4-*t*-ブチルフェニルでもない、化合物またはその塩。

【請求項 2】

式：

【数 5 d】



を有する請求項 1 に記載の化合物であって、該式において、

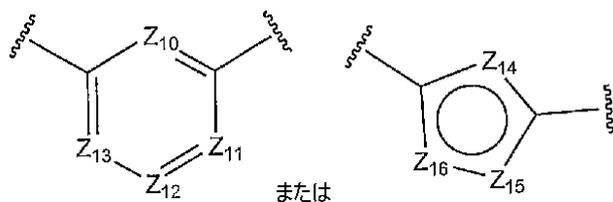
$R^{2'}$ は、水素または可溶化基から選択され；

$R^{2'}$ は、 $- NH - C(O) -$ または $- NH - C(O) - CH_2 -$ から選択され；そして

$R^{3'}$ は、必要に応じて置換された単環式または二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式または二環式ヘテロアリールから選択される、化合物。

【請求項 3】

【数 8 d】



から選択され；ここで、

Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} および Z_{13} は、それぞれ独立して、 N 、 CR^{20} または $CR_{1'}$ から選択され；

Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} は、それぞれ独立して、 N 、 $NR_{1'}$ 、 S 、 O 、 CR^{20} または $CR_{1'}$ から選択され； Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} または Z_{13} の 0 ~ 2 個は、 N であり；

Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} の少なくとも 1 個は、 N 、 $NR_{1'}$ 、 O または S であり；

Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} の 0 ~ 1 個は、 S または O であり；

Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} の 0 ~ 2 個は、 N または $NR_{1'}$ であり；

0 ~ 1 個の R^{20} は可溶化基であり；そして

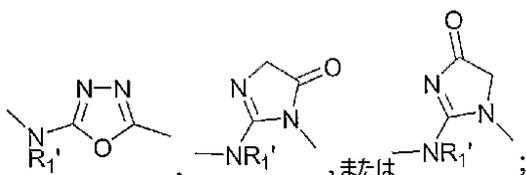
0 ~ 1 個の $R_{1'}$ は、必要に応じて置換された $C_1 - C_3$ 直鎖または分岐状のアルキルであり；

各 R^{20} は、独立して、 H または可溶化基から選択され；

R^{20a} は、独立して、 H または可溶化基から選択され；

R^{21} は、 $-NR_{1'}-C(O)-$ 、 $-NR_{1'}-S(O)_2-$ 、 $-NR_{1'}-C(O)-NR_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(S)-NR_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(S)-NR_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}R_{1'}-NR_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(=NR_{1'})-NR_{1'}-$ 、 $-C(O)-NR_{1'}-$ 、 $-C(O)-NR_{1'}-S(O)_2-$ 、 $-NR_{1'}-$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}=CR_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-S(O)_2-NR_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(O)-NR_{1'}-S(O)_2-$ 、 $-NR_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-C(O)-NR_{1'}-$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}-C(O)-NR_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}=CR_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(=N-CN)-NR_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}R_{1'}-O-$ 、 $-NR_{1'}-S(O)_2-CR_{1'}R_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-S(O)_2-CR_{1'}R_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}R_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}R_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(O)-O-$ 、

【数 9 d】

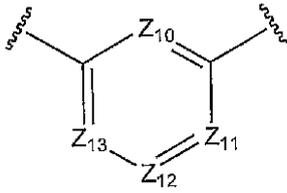


から選択され；

各 $R_{1'}$ は、独立して、 H または必要に応じて置換された $C_1 - C_3$ 直鎖または分岐状のアルキルから選択され；そして

R^{31} は、必要に応じて置換された単環式または二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式または二環式ヘテロアリールから選択され、 R^{19} が

【数 1 0 d】



であり、かつ Z₁₀、Z₁₁、Z₁₂ および Z₁₃ がそれぞれ CH の場合、R^{20a} は可溶化基である、
化合物またはその塩。

【請求項 9】

R¹⁹ は、フェニル、ピリジル、チエニルまたはフリルから選択される請求項 8 記載の化合物。

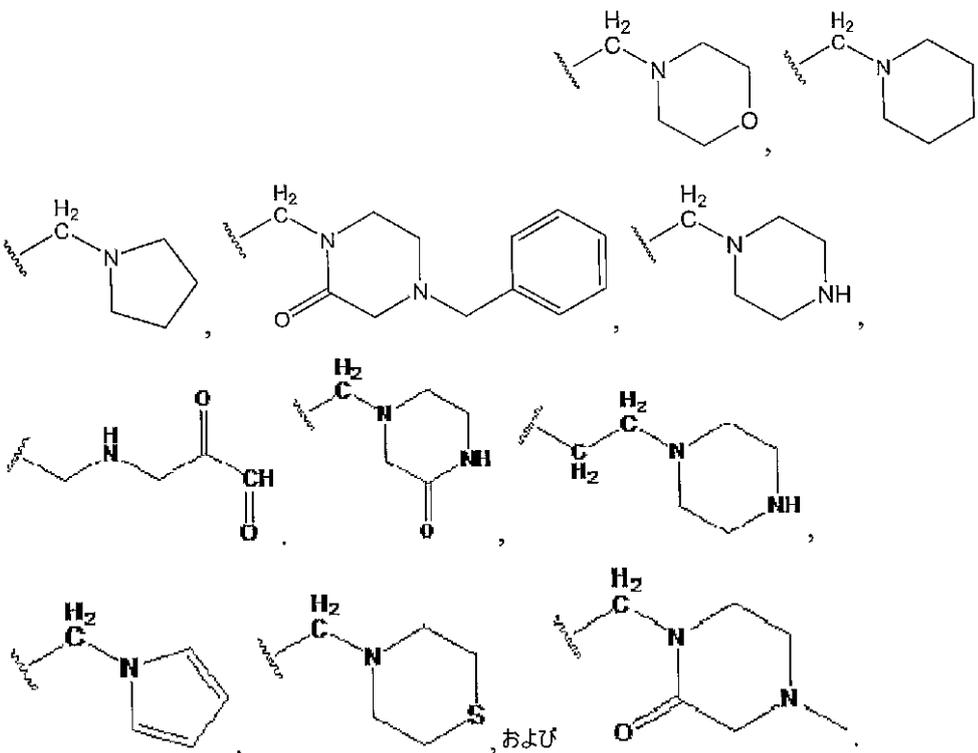
【請求項 10】

R¹⁹ は、必要に応じて置換されたフェニルである請求項 9 記載の化合物。

【請求項 11】

R^{20a} は、H、-CH₂-N(CH₃)₂、

【数 1 1 d】



から選択される請求項 8 記載の化合物。

【請求項 12】

R³¹ は、フェニル、ピラゾリル、フリル、ピリジル、ピリミジニル、チエニル、ナフチル、ベンゾピラゾリル、ベンゾフラニル、キノリニル、キノキサリニルまたはベンゾチエニルから選択され、そして R³¹ は、必要に応じて置換されている、請求項 8 記載の化合物。

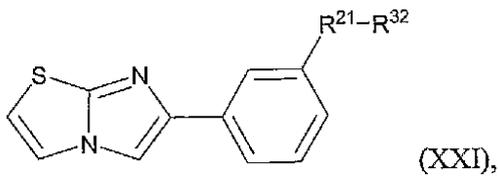
【請求項 13】

R²¹ は、-NH-C(O)-または-NH-C(O)-CH₂-から選択される請求項 8 記載の化合物。

【請求項 14】

式：

【数 1 2 d】



の化合物またはその塩であって、該式において、

R^{21} は、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(S)-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(S)-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(=NR_{1'})-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}=CR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}=CR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(=N-CN)-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-O-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-O-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(S)-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-O-$ 、

【数 1 3 d】



から選択され；

各 $R_{1'}$ は、独立して、H または必要に応じて置換された $C_1 - C_3$ 直鎖または分岐状のアルキルから選択され；そして

R^{32} は、必要に応じて置換された単環式または二環式ヘテロアリール、または必要に応じて置換された二環式アリールであり、

R^{21} が $-NH-C(O)-CH_2-$ の場合、 R^{32} は、非置換チエン-2-イルではなく；

R^{21} が $-NH-C(O)-$ の場合、 R^{32} は、フラン-2-イルでも、5-プロモフラン-2-イルでも、2-フェニル-4-メチルチアゾール-5-イルでもなく；

R^{21} が $-NH-S(O)_2-$ の場合、 R^{32} は、非置換ナフチルでも5-クロロチエン-2-イルでもない、

化合物またはその塩。

【請求項 1 5】

R^{32} は、ピロリル、ピラゾリル、ピラジニル、フリル、ピリジル、ピリミジニルまたはチエニルから選択され、 R^{32} は、必要に応じて置換され、そして必要に応じてベンゾ縮合される、請求項 1 4 記載の化合物。

【請求項 1 6】

R^{21} は、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(S)-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(S)-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、

- C(=NR₁') - NR₁' -、 - C(O) - NR₁' -、 - C(O) - NR₁' - S(O)₂ -、 - NR₁' -、 - CR₁' R₁' -、 - NR₁' - C(O) - CR₁' = CR₁' -、 - NR₁' - S(O)₂ - NR₁' -、 - NR₁' - C(O) - NR₁' - S(O)₂ -、 - NR₁' - CR₁' R₁' - C(O) - NR₁' -、 - CR₁' R₁' - C(O) - NR₁' -、 - NR₁' - C(O) - CR₁' = CR₁' - CR₁' R₁' -、 - NR₁' - C(=N-CN) - NR₁' -、 - NR₁' - C(O) - CR₁' R₁' - O -、 - NR₁' - S(O)₂ - CR₁' R₁' -、 - NR₁' - S(O)₂ - CR₁' R₁' - CR₁' R₁' -、 - NR₁' - C(O) - CR₁' R₁' -、 - NR₁' - C(O) - CR₁' R₁' - CR₁' R₁' -、 - NR₁' - C(S) - NR₁' - CR₁' R₁' - CR₁' R₁' -、 - NR₁' - C(O) - O -、

【数14d】



から選択され；

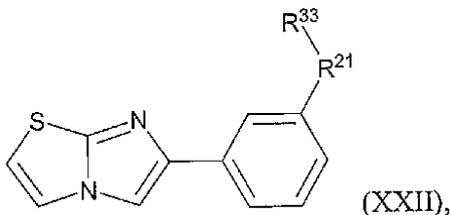
各 R₁' は、独立して、H または必要に応じて置換された C₁ - C₃ 直鎖または分岐状のアルキルから選択され；そして

R³² は、ベンゾフリル、メチルフリル、ベンゾチエニル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピラゾリルから選択され、該メチルフリル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニルまたはピラゾリルは、必要に応じて、ベンゾ縮合され、R³² は、必要に応じて置換されるか、またはさらに置換されている、請求項14記載の化合物。

【請求項17】

式：

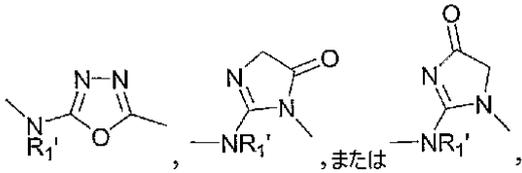
【数15d】



の化合物またはその塩であって、該式において、

R²¹ は、 - NR₁' - C(O) -、 - NR₁' - S(O)₂ -、 - NR₁' - C(O) - NR₁' -、 - NR₁' - C(S) - NR₁' -、 - NR₁' - C(S) - NR₁' - CR₁' R₁' -、 - NR₁' - C(O) - CR₁' R₁' - NR₁' -、 - NR₁' - C(=NR₁') - NR₁' -、 - C(O) - NR₁' -、 - C(O) - NR₁' - S(O)₂ -、 - NR₁' -、 - CR₁' R₁' -、 - NR₁' - C(O) - CR₁' = CR₁' -、 - NR₁' - S(O)₂ - NR₁' -、 - NR₁' - C(O) - NR₁' - S(O)₂ -、 - NR₁' - CR₁' R₁' - C(O) - NR₁' -、 - CR₁' R₁' - C(O) - NR₁' -、 - NR₁' - C(O) - CR₁' = CR₁' - CR₁' R₁' -、 - NR₁' - C(=N-CN) - NR₁' -、 - NR₁' - C(O) - CR₁' R₁' - O -、 - NR₁' - S(O)₂ - CR₁' R₁' -、 - NR₁' - S(O)₂ - CR₁' R₁' - CR₁' R₁' -、 - NR₁' - C(O) - CR₁' R₁' -、 - NR₁' - C(O) - CR₁' R₁' - CR₁' R₁' -、 - NR₁' - C(S) - NR₁' - CR₁' R₁' - CR₁' R₁' -、 - NR₁' - C(O) - O -、

【数 16 d】



から選択され；

各 $R_{1'}$ は、独立して、H または必要に応じて置換された $C_1 - C_3$ 直鎖または分岐状のアルキルから選択され；そして

R^{33} は、必要に応じて置換されたフェニルであり、ここで、

R^{21} が $-NR_{1'} - C(O) -$ の場合、 $R_{1'}$ は H でなく；

R^{21} が $-NH - C(O) - CH_2$ または $-NH - C(O) - CH_2 - O -$ の場合、 R^{33} は、非置換フェニルでも 4 - ハロフェニルでもなく；そして

R^{21} が $-NH - S(O)_2 -$ の場合、 R^{33} は、非置換フェニルでも、2, 4 - または 3, 4 - ジメチルフェニルでも、2, 4 - ジメチル - 5 - メトキシフェニルでも、2 - メトキシ - 3, 4 - ジクロロフェニルでも、2 - メトキシでも、5 - ブロモフェニル - 3, 4 - ジオキシエチレンフェニルでも、3, 4 - ジメトキシフェニルでも、3, 4 - ジクロロフェニルでも、3, 4 - ジメチルフェニルでも、3 - または 4 - メチルフェニルでも、4 - アルコキシフェニルでも、4 - フェノキシフェニルでも、4 - ハロフェニルでも、4 - ビフェニルでも、4 - アセチルアミノフェニルでもない、化合物またはその塩。

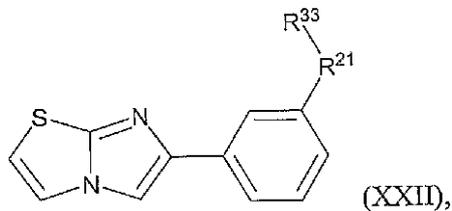
【請求項 18】

R^{21} は、 $-NH - C(O) -$ または $-NH - C(O) - CH_2 -$ から選択される請求項 17 記載の化合物。

【請求項 19】

式：

【数 17 d】



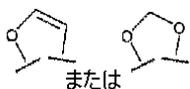
の化合物またはその塩であって、該式において、

R^{21} は、 $-NH - C(O) -$ または $-NH - C(O) - CH_2 -$ から選択され；そして

R^{33} は、

- a) 1 個の $-N(CH_3)_2$ 基；
- b) 3 位で 1 個の CN 基；
- c) 1 個の $-S(CH_3)$ 基；または
- d) 3 位および 4 位を

【数 18 d】

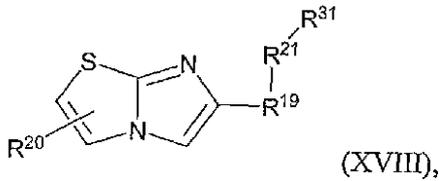


の架橋で置換されたフェニルである、化合物またはその塩。

【請求項 20】

式：

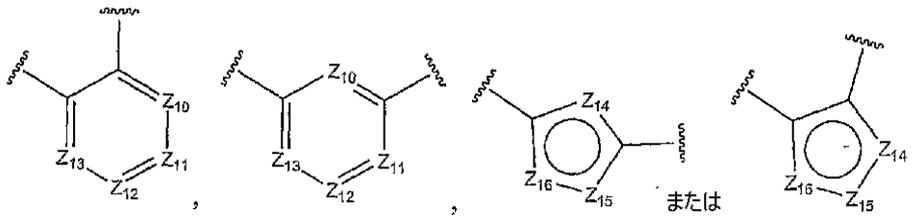
【数 19 d】



の化合物またはその塩を含む組成物であって、該式において、

R^{19} は、

【数 20 d】



から選択され；

各 Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} および Z_{13} は、独立して、N、 CR^{20} または $CR_{1'}$ から選択され；

各 Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} は、独立して、N、 $NR_{1'}$ 、S、O、 CR^{20} または $CR_{1'}$ から選択され；ここで、

0 ~ 2 個の Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} または Z_{13} は N であり；

少なくとも 1 個の Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} は、N、 $NR_{1'}$ 、S または O であり；

0 ~ 1 個の Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} は、S または O であり；

0 ~ 2 個の Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} は、N または $NR_{1'}$ であり；

0 ~ 1 個の R^{20} は可溶化基であり；および

0 ~ 1 個の $R_{1'}$ は、必要に応じて置換された $C_1 - C_3$ 直鎖または分岐状のアルキルであり；

各 R^{20} は、独立して、H または可溶化基から選択され；

R^{21} は、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(S)-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(S)-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(=NR_{1'})-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}=CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}=CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(=N-CN)-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-O-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-O-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(S)-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-O-$ 、

【数 2 1 d】



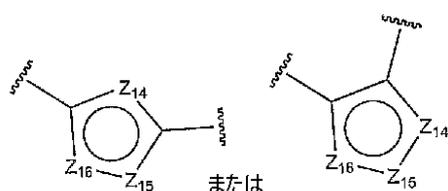
から選択され；

各 $R_{1'}$ は、独立して、H または必要に応じて置換された $C_1 - C_3$ 直鎖または分岐状のアルキルから選択され；そして

R^{31} は、必要に応じて置換された単環式または二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式または二環式ヘテロアリールから選択され、ただし、

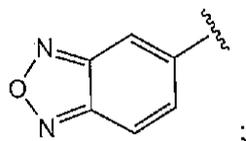
R^{19} が、

【数 2 2 d】



かつ、 R^{21} が $-NR_{1'} - C(O) -$ の場合、 R^{31} は、4 - シアノフェニルでも

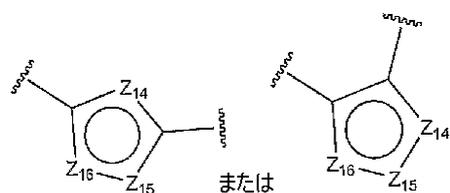
【数 2 3 d】



でもなく；

R^{19} が

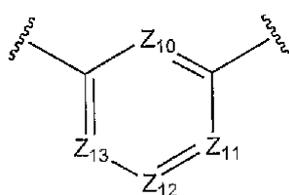
【数 2 4 d】



であり、 R^{21} が $-NR_{1'} - S(O)_2 -$ の場合、 R^{31} は、4 - メトキシフェニルでも 4 - t - ブチルフェニルでもなく；そして

R^{19} が

【数 2 5 d】



であり、 Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} および Z_{13} がそれぞれ CH であり、 R^{20} が H であり、かつ R^{21} が $-NHC(O) -$ である場合、 R^{31} は、必要に応じて置換されたフェニル

ルではなく、

該組成物は、発熱物質を含まない、
組成物。

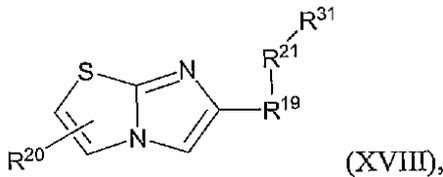
【請求項 2 1】

請求項 1 ~ 1 9 のいずれかの化合物を含む組成物であって、発熱物質を含まない組成物。

【請求項 2 2】

a) 式：

【数 2 6 d】

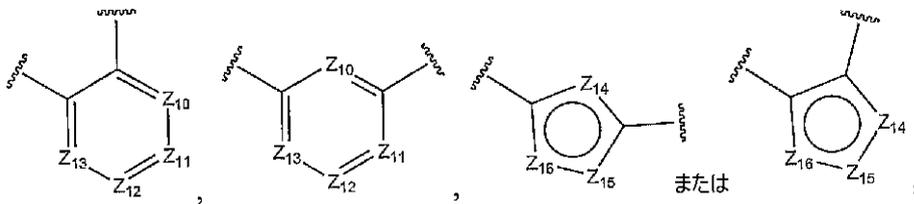


の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩またはプロドラッグと、

b) 薬学的に受容可能なキャリアまたは希釈剤とを含む薬学的組成物であって、該式において、

R^{19} は、

【数 2 7 d】



から選択され、

Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} および Z_{13} は、それぞれ独立して、N、 CR^{20} または $CR_{1'}$ から選択され；

Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} は、それぞれ独立して、N、 $NR_{1'}$ 、S、O、 CR^{20} または $CR_{1'}$ から選択され；ここで、

0 ~ 2 個の Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} または Z_{13} は、N であり；

少なくとも 1 個の Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} は、N、 $NR_{1'}$ 、S または O であり；

0 ~ 1 個の Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} は、S または O であり；

0 ~ 2 個の Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} は、N または $NR_{1'}$ であり；

0 ~ 1 個の R^{20} は、可溶化基であり；

0 ~ 1 個の $R_{1'}$ は、必要に応じて置換された $C_1 - C_3$ 直鎖または分岐状のアルキルであり；

各 R^{20} は、独立して、H または可溶化基から選択され；

R^{21} は、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(S)-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(S)-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(=NR_{1'})-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}=CR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}=CR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(=N-CN)-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-O-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-O-$ 、 $-NR_{1'}$ 、

$S(O)_2 - CR_{1'}R_{1'} -$ 、 $-NR_{1'} - S(O)_2 - CR_{1'}R_{1'} - CR_{1'}R_{1'} -$
 $R_{1'} -$ 、 $-NR_{1'} - C(O) - CR_{1'}R_{1'} -$ 、 $-NR_{1'} - C(O) - CR_{1'}R_{1'} -$
 $R_{1'} - CR_{1'}R_{1'} -$ 、 $-NR_{1'} - C(S) - NR_{1'} - CR_{1'}R_{1'} - CR_{1'}R_{1'} -$
 $R_{1'} -$ 、 $-NR_{1'} - C(O) - O -$ 、
 【数 28 d】



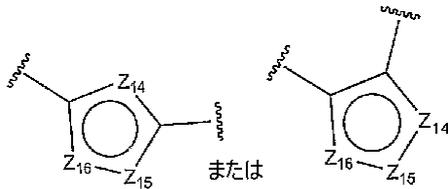
から選択され；

各 $R_{1'}$ は、独立して、H または必要に応じて置換された $C_1 - C_3$ 直鎖または分岐状のアルキルから選択され；そして

$R^{3'}$ は、必要に応じて置換された単環式または二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式または二環式ヘテロアリールから選択され、ただし、

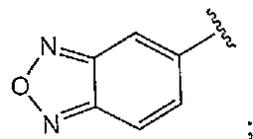
$R^{1'9}$ が

【数 29 d】



であり、かつ $R^{2'}$ が $-NR_{1'} - C(O) -$ の場合、 $R^{3'}$ は、4-シアノフェニルでも

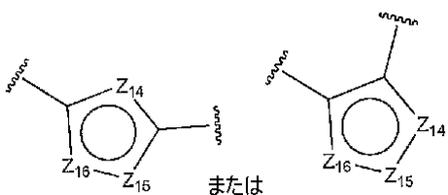
【数 30 d】



でもなく；

$R^{1'9}$ が

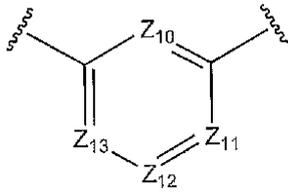
【数 31 d】



であり、かつ $R^{2'}$ が $-NR_{1'} - S(O)_2 -$ の場合、 $R^{3'}$ は、4-メトキシフェニルでも 4-t-ブチルフェニルでもなく；そして

$R^{1'9}$ が

【数 3 2 d】



であり、 Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} および Z_{13} が、それぞれ、CHであり、 R^{20} がHであり、および R^{21} が $-NHC(O)-$ の場合、 R^{31} は、必要に応じて置換されたフェニルではない、
薬学的組成物。

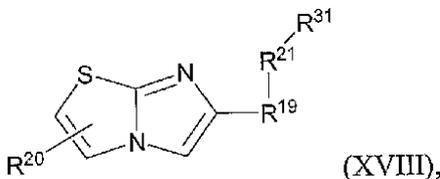
【請求項 2 3】

薬学的に受容可能なキャリアまたは希釈剤と、請求項 1 ~ 19 のいずれかに記載の化合物とを含む薬学的組成物。

【請求項 2 4】

被験体におけるインシュリン抵抗性、メタボリック症候群、糖尿病またはこれらの合併症を治療または予防するため、あるいは被験体におけるインシュリン感受性を増加させるための組成物であって、該組成物は、式：

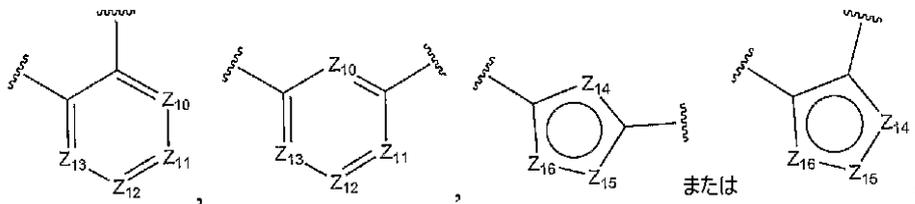
【数 5 4 d】



の化合物、あるいはまたはその薬学的に受容可能な塩またはプロドラッグを含む、該式において、

R^{19} は、

【数 5 5 d】



から選択され；

各 Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} および Z_{13} は、独立して、N、 CR^{20} または $CR_{1'}$ から選択され；

各 Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} は、独立して、N、 $NR_{1'}$ 、S、O、 CR^{20} または $CR_{1'}$ から選択され；ここで、

Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} または Z_{13} の 0 ~ 2 個は、N であり；

Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} の少なくとも 1 個は、N、 $NR_{1'}$ 、S または O であり；

Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} の 0 ~ 1 個は、S または O であり；

Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} の 0 ~ 2 個は、N または $NR_{1'}$ であり；

0 ~ 1 個の R^{20} は、可溶化基であり；そして

0 ~ 1 個の $R_{1'}$ は、必要に応じて置換された $C_1 - C_3$ 直鎖または分岐状のアルキルであり；

各 R^{20} は、独立して、H または可溶化基から選択され；

R^{21} は、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(S)-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(S)-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(=NR_{1'})-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}=CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-C(O)-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}=CR_{1'}-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(=N-CN)-NR_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-O-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-O-$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(S)-NR_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}$ 、 $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-O-$ 、

【数 56 d】



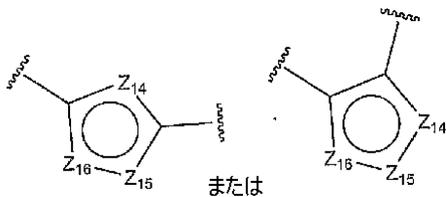
から選択され；

各 $R_{1'}$ は、独立して、H または必要に応じて置換された $C_1 - C_3$ 直鎖または分岐状のアルキルから選択され；

R^{31} は、必要に応じて置換された単環式または二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式または二環式ヘテロアリールであって、ただし、

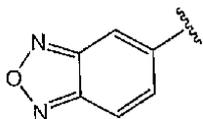
R^{19} が

【数 57 d】



であり、かつ R^{21} が $-NR_{1'}$ 、 $-C(O)-$ の場合、 R^{31} は 4-シアノフェニルでも

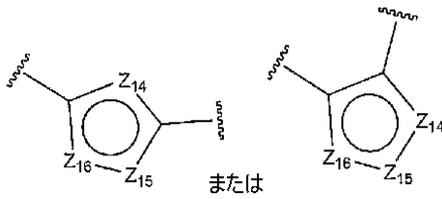
【数 58 d】



でもなく；

R^{19} が

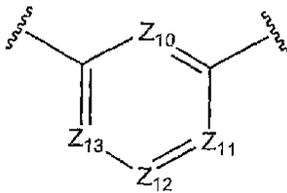
【数59d】



であり、かつ R^{21} が $-NR_{1'}$ 、 $-S(O)_2-$ の場合、 R^{31} は、4-メトキシフェニルでも4-*t*-ブチルフェニルでもなく；そして

R^{19} が

【数60d】



であり、 Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} および Z_{13} が、それぞれ、CHであり、 R^{20} がHであり、かつ R^{21} が $-NHC(O)-$ の場合、 R^{31} は、必要に応じて置換されたフェニルではない、

組成物。