

【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24年6月7日(2012.6.7)

【公表番号】特表2011-518193(P2011-518193A)

【公表日】平成23年6月23日(2011.6.23)

【年通号数】公開・登録公報2011-025

【出願番号】特願2011-505261(P2011-505261)

【国際特許分類】

C 0 7 C 255/46 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
A 6 1 K 31/122 (2006.01)
A 6 1 K 9/48 (2006.01)
A 6 1 K 9/20 (2006.01)
A 6 1 K 9/107 (2006.01)
A 6 1 K 9/127 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/02 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 19/02 (2006.01)
A 6 1 P 1/04 (2006.01)
A 6 1 P 9/00 (2006.01)
A 6 1 P 3/10 (2006.01)
A 6 1 P 3/04 (2006.01)
A 6 1 P 3/06 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 9/12 (2006.01)
A 6 1 P 13/12 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 21/00 (2006.01)
A 6 1 P 27/02 (2006.01)
A 6 1 P 17/00 (2006.01)
A 6 1 P 17/06 (2006.01)
A 6 1 P 17/02 (2006.01)
A 6 1 P 37/08 (2006.01)
A 6 1 P 25/28 (2006.01)
A 6 1 P 25/16 (2006.01)
A 6 1 P 25/24 (2006.01)
A 6 1 P 37/02 (2006.01)
A 6 1 K 31/695 (2006.01)
C 0 7 D 317/30 (2006.01)
A 6 1 K 31/357 (2006.01)
C 0 7 J 41/00 (2006.01)
A 6 1 K 31/565 (2006.01)
A 6 1 K 31/5685 (2006.01)
C 0 7 J 71/00 (2006.01)
A 6 1 K 31/58 (2006.01)
C 0 7 J 1/00 (2006.01)
C 0 7 J 53/00 (2006.01)
A 6 1 K 31/575 (2006.01)

C 0 7 C 253/30 (2006.01)

C 0 7 F 7/18 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 255/46

A 6 1 P 43/00 1 2 3

A 6 1 K 31/122

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/107

A 6 1 K 9/127

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 9/10 1 0 1

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 37/02

A 6 1 K 31/695

C 0 7 D 317/30 C S P

A 6 1 K 31/357

C 0 7 J 41/00

A 6 1 K 31/565

A 6 1 K 31/5685

C 0 7 J 71/00

A 6 1 K 31/58

C 0 7 J 1/00

C 0 7 J 53/00

A 6 1 K 31/575

C 0 7 C 253/30

C 0 7 F 7/18 U

【手続補正書】

【提出日】平成24年4月18日(2012.4.18)

【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

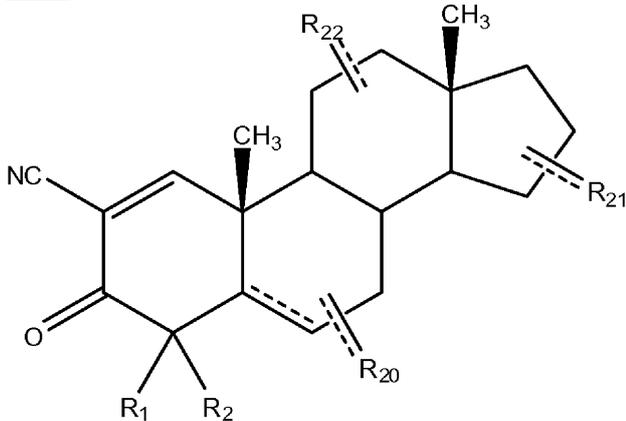
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記の式の化合物、またはその薬学的に許容される塩、互変異性体、アセタール、もしくはケタール：



式中、

R₁ および R₂ はそれぞれ独立に、

アルキル (C₁₋₂)、アルケニル (C₁₋₂)、アシルオキシ (C₁₋₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であるか；あるいは

R₁ および R₂ は一緒になってアルカンジイル (C₁₋₂)、またはアルケンジイル (C₁₋₂) であり；かつ

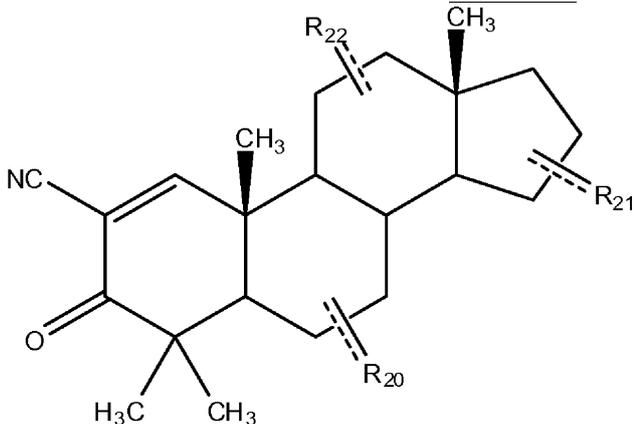
R₂₀、R₂₁、および R₂₂ はそれぞれ独立に、

水素、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、もしくはアミノ；または

アルキル (C₁₋₂)、アルケニル (C₁₋₂)、アルコキシ (C₁₋₂)、アルキルシリルオキシ (C₁₋₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型である。

【請求項2】

下記としてさらに定義される、請求項1記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、互変異性体、アセタール、もしくはケタール：



式中、R₂₀、R₂₁、および R₂₂ はそれぞれ独立に、

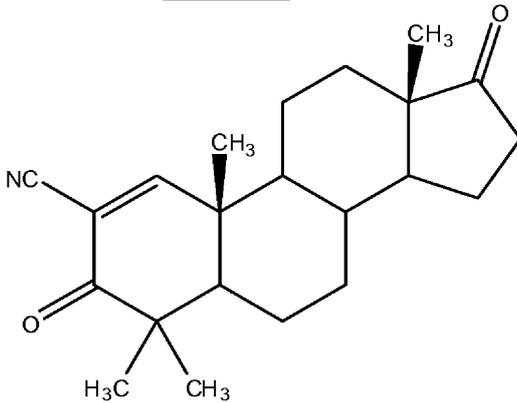
水素、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、もしくはアミノ；または

アルキル (C₁₋₂)、アルケニル (C₁₋₂)、アルコキシ (C₁₋₂)、アシルオキシ (C₁₋₂)、アルキルシリルオキシ (C₁₋₂)、もしくはこれらの基のいずれかの

置換型である。

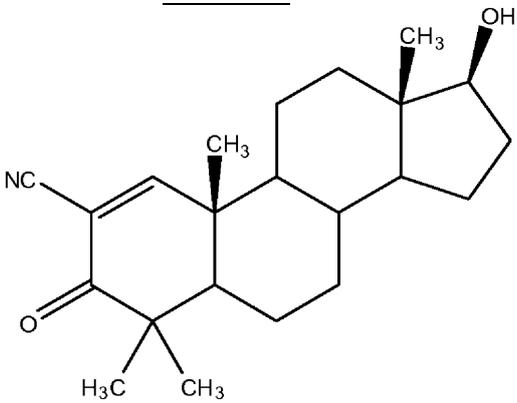
【請求項 3】

下記の式によってさらに定義される、請求項 1 記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、もしくは互変異性体：



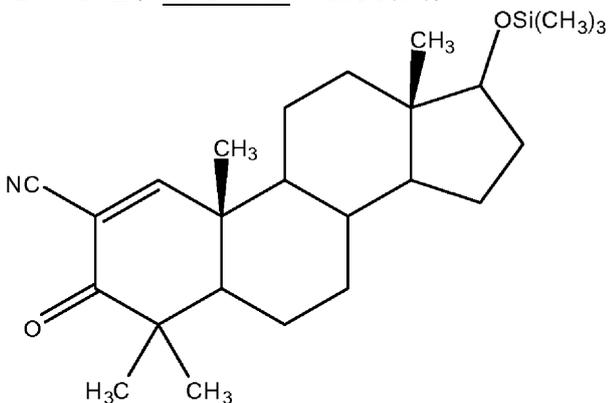
。 【請求項 4】

下記の式によってさらに定義される、請求項 1 記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、もしくは互変異性体：



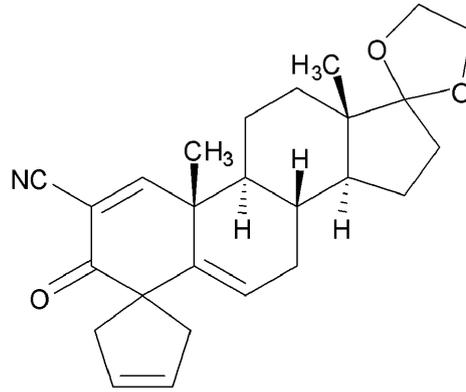
。 【請求項 5】

下記の式によってさらに定義される、請求項 1 記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、もしくは互変異性体：



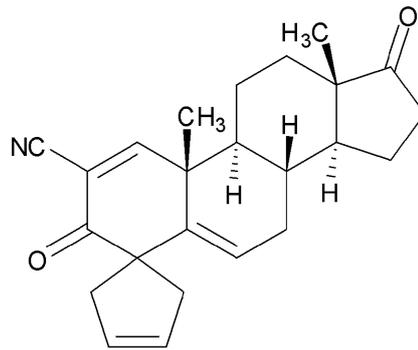
。 【請求項 6】

下記の式によってさらに定義される、請求項 1 記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、もしくは互変異性体：



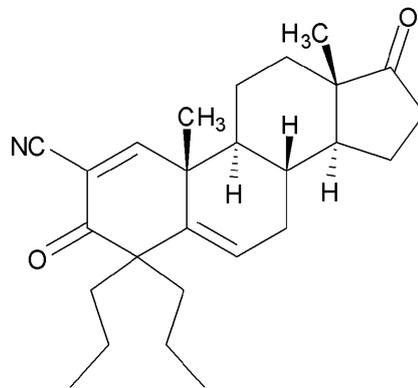
。【請求項 7】

下記の式によってさらに定義される、請求項 1 記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、もしくは互変異性体：



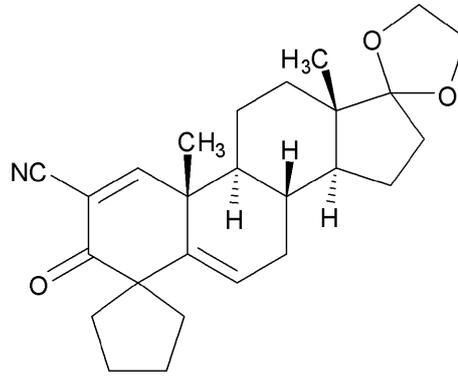
。【請求項 8】

下記の式によってさらに定義される、請求項 1 記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、もしくは互変異性体：



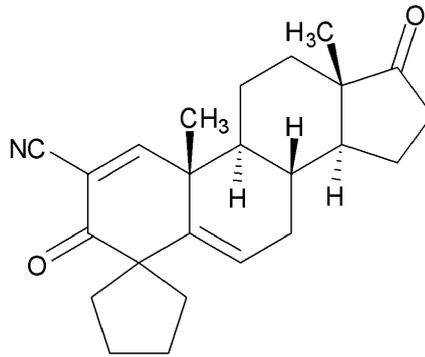
。【請求項 9】

下記の式によってさらに定義される、請求項 1 記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、もしくは互変異性体：



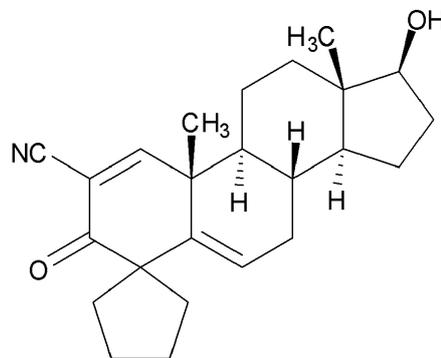
。【請求項 10】

下記の式によってさらに定義される、請求項 1 記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、もしくは互変異性体：



。【請求項 11】

下記の式によってさらに定義される、請求項 1 記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、もしくは互変異性体：



。【請求項 12】

請求項 1 ~ 11 のいずれか一項記載の化合物および薬学的に許容される担体を含む、薬学的組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0059

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0059】

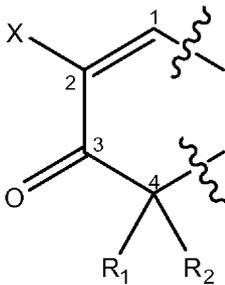
本開示の他の目的、特徴および利点は、以下の詳細な説明より明らかになるであろう。しかし、詳細な説明および具体的な実施例が、本発明の具体的な態様を示すが例示のみを目的として与えられるということを理解すべきである。これは、本発明の精神および範囲内の各種の変更および改変が、この詳細な説明より当業者には明らかになるためである。単に特定の化合物が1つの特定の一般式に帰することをもち、それが別の一般式にも属することができないことを意味するわけではないことに留意されたい。

[本発明1001]

下記を含む化合物、またはその薬学的に許容される塩、エステル、水和物、溶媒和物、互変異性体、アセタール、ケタール、プロドラッグ、もしくは光学異性体：

a) 2から8つの5および/または6員環を有する有機化合物の基本骨格であって、ただしアルゲンタチン、ベツリン酸、ラノスタン、オレアノール酸、ボスウェル酸、グリシルレチン酸、ウルソール酸、または三環式ビス-エノンの基本骨格ではない、基本骨格；

b) 下記の式の構造単位：



式中、

1、2および3と番号付けされた炭素原子は5または6員環の一部であり；

Xはシアノまたは-C(O)R_aであり、ここでR_aは、

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノ、ヒドロキシアミノ、アジドもしくはメルカプト；または

アルキル (C₁₋₁₂)、アルケニル (C₂₋₁₂)、アルキニル (C₂₋₁₂)、アリール (C₆₋₁₂)、アラルキル (C₆₋₁₂)、ヘテロアリール (C₆₋₁₂)、ヘテロアラルキル (C₆₋₁₂)、アルコキシ (C₁₋₁₂)、アルケニルオキシ (C₂₋₁₂)、アルキニルオキシ (C₂₋₁₂)、アリールオキシ (C₆₋₁₂)、アラルコキシ (C₆₋₁₂)、ヘテロアリールオキシ (C₆₋₁₂)、ヘテロアラルコキシ (C₆₋₁₂)、アシルオキシ (C₁₋₁₂)、アルキルアミノ (C₁₋₁₂)、ジアルキルアミノ (C₁₋₁₂)、アルコキシアミノ (C₁₋₁₂)、アルケニルアミノ (C₂₋₁₂)、アルキニルアミノ (C₂₋₁₂)、アリールアミノ (C₆₋₁₂)、アラルキルアミノ (C₆₋₁₂)、ヘテロアリールアミノ (C₆₋₁₂)、ヘテロアラルキルアミノ (C₆₋₁₂)、アルキルスルホニルアミノ (C₁₋₁₂)、アミド (C₁₋₁₂)、アルキルシリルオキシ (C₁₋₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり；かつ

R₁およびR₂はそれぞれ独立に、

水素；または

アルキル (C₁₋₁₂)、アルケニル (C₂₋₁₂)、アルキニル (C₂₋₁₂)、アリール (C₆₋₁₂)、アラルキル (C₆₋₁₂)、ヘテロアリール (C₆₋₁₂)、ヘテロアラルキル (C₆₋₁₂)、アシル (C₁₋₁₂)、アルコキシ (C₁₋₁₂)、アリールオキシ (C₆₋₁₂)、アラルコキシ (C₆₋₁₂)、ヘテロアリールオキシ (C₆₋₁₂)、ヘテロアラルコキシ (C₆₋₁₂)、アシルオキシ (C₁₋₁₂)、アルキルアミノ (C₁₋₁₂)、ジアルキルアミノ (C₁₋₁₂)、アリールアミノ (C₆₋₁₂)、アラルキルアミノ (C₆₋₁₂)、ヘテロアリールアミノ (C₆₋₁₂)、ヘテロアラルキルアミノ (C₆₋₁₂)、アミド (C₁₋₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であるか；あるいは

R₁およびR₂は一緒になってアルカンジイル (C₁₋₁₂)、アルケンジイル (C₂₋₁₂)、アルカンジイル (C₁₋₁₂) またはアルケンジイル (C₂₋₁₂) である；ならびに

c) 炭素原子1、2、3または4以外の基本骨格の炭素原子に連結している0から8つの化学基であって、それぞれ独立に、

ヒドロキシ、ハロ、オキソ、アミノ、ヒドロキシアミノ、ニトロ、イミノ、シアノ、アジ

ド、メルカプト、もしくはチオ；または

アルキル_(C₁₋₁₂)、アルケニル_(C₁₋₁₂)、アルキニル_(C₁₋₁₂)、アリール_(C₁₋₁₂)、アラキル_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリール_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラキル_(C₁₋₁₂)、アシル_(C₁₋₁₂)、アルキリデン_(C₁₋₁₂)、アルコキシ_(C₁₋₁₂)、アルケニルオキシ_(C₁₋₁₂)、アルキニルオキシ_(C₁₋₁₂)、アリールオキシ_(C₁₋₁₂)、アラコキシ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールオキシ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラコキシ_(C₁₋₁₂)、アシルオキシ_(C₁₋₁₂)、アルキルアミノ_(C₁₋₁₂)、ジアルキルアミノ_(C₁₋₁₂)、アルコシアミノ_(C₁₋₁₂)、アルケニルアミノ_(C₁₋₁₂)、アルキニルアミノ_(C₁₋₁₂)、アリールアミノ_(C₁₋₁₂)、アラキルアミノ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールアミノ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラキルアミノ_(C₁₋₁₂)、アルキルスルホニルアミノ_(C₁₋₁₂)、アミド_(C₁₋₁₂)、アルキルイミノ_(C₁₋₁₂)、アルケニルイミノ_(C₁₋₁₂)、アルキニルイミノ_(C₁₋₁₂)、アリールイミノ_(C₁₋₁₂)、アラキルイミノ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールイミノ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラキルイミノ_(C₁₋₁₂)、アシルイミノ_(C₁₋₁₂)、アルキルチオ_(C₁₋₁₂)、アルケニルチオ_(C₁₋₁₂)、アルキニルチオ_(C₁₋₁₂)、アリールチオ_(C₁₋₁₂)、アラキルチオ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールチオ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラキルチオ_(C₁₋₁₂)、アシルチオ_(C₁₋₁₂)、チオアシル_(C₁₋₁₂)、アルキルスルホニル_(C₁₋₁₂)、アルケニルスルホニル_(C₁₋₁₂)、アルキニルスルホニル_(C₁₋₁₂)、アリールスルホニル_(C₁₋₁₂)、アラキルスルホニル_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールスルホニル_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラキルスルホニル_(C₁₋₁₂)、アルキルアンモニウム_(C₁₋₁₂)、アルキルスルホニウム_(C₁₋₁₂)、アルキルシリル_(C₁₋₁₂)、アルキルシリルオキシ_(C₁₋₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型である、化学基。

[本発明1002]

R₁およびR₂がそれぞれ独立に水素、アルキル_(C₁₋₈)または置換アルキル_(C₁₋₈)である、本発明1001の化合物。

[本発明1003]

R₁およびR₂がいずれも水素である、本発明1002の化合物。

[本発明1004]

R₁およびR₂がいずれもメチルである、本発明1002の化合物。

[本発明1005]

R₁およびR₂がいずれも水素ではない、本発明1001の化合物。

[本発明1006]

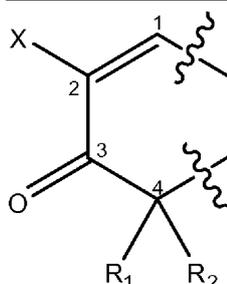
有機化合物がトリテルペノイドではない、本発明1001の化合物。

[本発明1007]

下記を含む化合物、またはその薬学的に許容される塩、エステル、水和物、溶媒和物、互変異性体、アセタール、ケタール、プロドラッグ、もしくは光学異性体；

a) 2から8つの環を有する天然物の基本骨格であって、ただし天然物はアルゲンタチン、ベツリン酸、ラノスタン、オレアノール酸、またはウルソール酸ではない、基本骨格；

b) 下記の式の構造単位；



式中、

1、2および3と番号付けされた炭素原子は6員環の一部であり；

Xはシアノ、フルオロアルキル_(C₁₋₈)、置換、フルオロアルキル_(C₁₋₈)、または-C(O)R_aであり、ここでR_aは、

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノ、ヒドロキシアミノ、アジドもしくはメルカプト；または

アルキル_(C₁₂)、アルケニル_(C₁₂)、アルキニル_(C₁₂)、アリール_(C₁₂)、アラルキル_(C₁₂)、ヘテロアリール_(C₁₂)、ヘテロアラルキル_(C₁₂)、アルコキシ_(C₁₂)、アルケニルオキシ_(C₁₂)、アルキニルオキシ_(C₁₂)、アリールオキシ_(C₁₂)、アラルコキシ_(C₁₂)、ヘテロアリールオキシ_(C₁₂)、ヘテロアラルコキシ_(C₁₂)、アシルオキシ_(C₁₂)、アルキルアミノ_(C₁₂)、ジアルキルアミノ_(C₁₂)、アルコキシアミノ_(C₁₂)、アルケニルアミノ_(C₁₂)、アルキニルアミノ_(C₁₂)、アリールアミノ_(C₁₂)、アラルキルアミノ_(C₁₂)、ヘテロアリールアミノ_(C₁₂)、ヘテロアラルキルアミノ_(C₁₂)、アルキルスルホニルアミノ_(C₁₂)、アミド_(C₁₂)、アルキルシリルオキシ_(C₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり；かつ

R₁およびR₂はそれぞれ独立に、
水素；または

アルキル_(C₁₂)、アルケニル_(C₁₂)、アルキニル_(C₁₂)、アリール_(C₁₂)、アラルキル_(C₁₂)、ヘテロアリール_(C₁₂)、ヘテロアラルキル_(C₁₂)、アシル_(C₁₂)、アルコキシ_(C₁₂)、アリールオキシ_(C₁₂)、アラルコキシ_(C₁₂)、ヘテロアリールオキシ_(C₁₂)、ヘテロアラルコキシ_(C₁₂)、アシルオキシ_(C₁₂)、アルキルアミノ_(C₁₂)、ジアルキルアミノ_(C₁₂)、アリールアミノ_(C₁₂)、アラルキルアミノ_(C₁₂)、ヘテロアリールアミノ_(C₁₂)、ヘテロアラルキルアミノ_(C₁₂)、アミド_(C₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であるか；あるいは

R₁およびR₂は一緒になってアルカンジイル_(C₁₂)、アルケンジイル_(C₁₂)、アルカンジイル_(C₁₂)またはアルケンジイル_(C₁₂)である；ならびに

c)炭素原子1、2、3または4以外の基本骨格の炭素原子に連結している0から8つの化学基であって、それぞれ独立に、

ヒドロキシ、ハロ、オキソ、アミノ、ヒドロキシアミノ、ニトロ、イミノ、シアノ、アジド、メルカプト、もしくはチオ；または

アルキル_(C₁₂)、アルケニル_(C₁₂)、アルキニル_(C₁₂)、アリール_(C₁₂)、アラルキル_(C₁₂)、ヘテロアリール_(C₁₂)、ヘテロアラルキル_(C₁₂)、アシル_(C₁₂)、アルキリデン_(C₁₂)、アルコキシ_(C₁₂)、アルケニルオキシ_(C₁₂)、アルキニルオキシ_(C₁₂)、アリールオキシ_(C₁₂)、アラルコキシ_(C₁₂)、ヘテロアリールオキシ_(C₁₂)、ヘテロアラルコキシ_(C₁₂)、アシルオキシ_(C₁₂)、アルキルアミノ_(C₁₂)、ジアルキルアミノ_(C₁₂)、アルコキシアミノ_(C₁₂)、アルケニルアミノ_(C₁₂)、アルキニルアミノ_(C₁₂)、アリールアミノ_(C₁₂)、アラルキルアミノ_(C₁₂)、ヘテロアリールアミノ_(C₁₂)、ヘテロアラルキルアミノ_(C₁₂)、アルキルスルホニルアミノ_(C₁₂)、アミド_(C₁₂)、アルキルイミノ_(C₁₂)、アルケニルイミノ_(C₁₂)、アルキニルイミノ_(C₁₂)、アリールイミノ_(C₁₂)、アラルキルイミノ_(C₁₂)、ヘテロアリールイミノ_(C₁₂)、ヘテロアラルキルイミノ_(C₁₂)、アシルイミノ_(C₁₂)、アルキルチオ_(C₁₂)、アルケニルチオ_(C₁₂)、アルキニルチオ_(C₁₂)、アリールチオ_(C₁₂)、アラルキルチオ_(C₁₂)、ヘテロアリールチオ_(C₁₂)、ヘテロアラルキルチオ_(C₁₂)、アシルチオ_(C₁₂)、チオアシル_(C₁₂)、アルキルスルホニル_(C₁₂)、アルケニルスルホニル_(C₁₂)、アルキニルスルホニル_(C₁₂)、アリールスルホニル_(C₁₂)、アラルキルスルホニル_(C₁₂)、ヘテロアリールスルホニル_(C₁₂)、ヘテロアラルキルスルホニル_(C₁₂)、アルキルアンモニウム_(C₁₂)、アルキルスルホニウム_(C₁₂)、アルキルシリル_(C₁₂)、アルキルシリルオキシ_(C₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型である、化学基。

[本発明1008]

R₁およびR₂がそれぞれ独立に水素、アルキル_(C₈)または置換アルキル_(C₈)である、本発明1007の化合物。

[本発明1009]

R₁およびR₂がいずれも水素である、本発明1008の化合物。

[本発明1010]

R₁およびR₂がいずれもメチルである、本発明1008の化合物。

[本発明1011]

R₁およびR₂がいずれも水素ではない、本発明1007の化合物。

[本発明1012]

有機化合物がトリテルペノイドではない、本発明1007の化合物。

[本発明1013]

前記天然物がボスウェル酸またはグリシルレチン酸ではない、本発明1007の化合物。

[本発明1014]

前記天然物がトリテルペノイドではない、本発明1007の化合物。

[本発明1015]

Xが-CNまたは-C(=O)NHS(=O)₂CH₃である、本発明1007の化合物。

[本発明1016]

Xが-CNである、本発明1007の化合物。

[本発明1017]

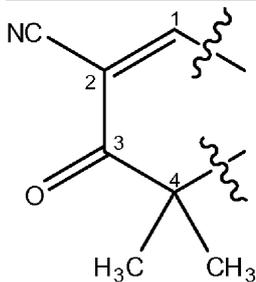
Xがフルオロアルキル(C₈)である、本発明1007の化合物。

[本発明1018]

Xが-CF₃である、本発明1017の化合物。

[本発明1019]

前記構造単位が下記としてさらに定義される、本発明1015の化合物：



。

[本発明1020]

前記天然物の基本骨格が2つの環を有する、本発明1019の化合物。

[本発明1021]

前記環が互いに原子の一重鎖で連結されている、本発明1020の化合物。

[本発明1022]

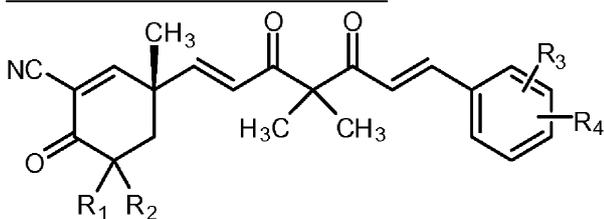
前記一重鎖のバックボーンが少なくとも1つの炭素-炭素二重結合をさらに含む、本発明1021の化合物。

[本発明1023]

前記天然物がクルクミンである、本発明1022の化合物。

[本発明1024]

下記の式によってさらに定義される、本発明1023の化合物、またはその薬学的に許容される塩、エステル、水和物、溶媒和物、互変異性体、アセタール、ケタール、プロドラッグ、もしくは光学異性体：



式中、

R₁およびR₂はそれぞれ独立に、

水素；または

アルキル(C₁₋₁₂)、アルケニル(C₂₋₁₂)、アルキニル(C₂₋₁₂)、アリール(C₆₋₁₂)、アラルキル(C₆₋₁₂)、ヘテロアリール(C₆₋₁₂)、ヘテロアラルキル(C₆₋₁₂)、アシル(C₁₋₁₂)、アルコ

キシ_(C₁₂)、アリールオキシ_(C₁₂)、アラルコキシ_(C₁₂)、ヘテロアリールオキシ_(C₁₂)、ヘテロアラルコキシ_(C₁₂)、アシルオキシ_(C₁₂)、アルキルアミノ_(C₁₂)、ジアルキルアミノ_(C₁₂)、アリールアミノ_(C₁₂)、アラルキルアミノ_(C₁₂)、ヘテロアリールアミノ_(C₁₂)、ヘテロアラルキルアミノ_(C₁₂)、アミド_(C₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であるか；あるいは

R₁およびR₂は一緒になってアルカンジイル_(C₁₂)、アルケンジイル_(C₁₂)、アルカンジイル_(C₁₂)またはアルケンジイル_(C₁₂)であり；かつ

R₃およびR₄はそれぞれ独立に、

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノ、ヒドロキシアミノ、ニトロ、シアノ、アジド、もしくはメルカプト；または

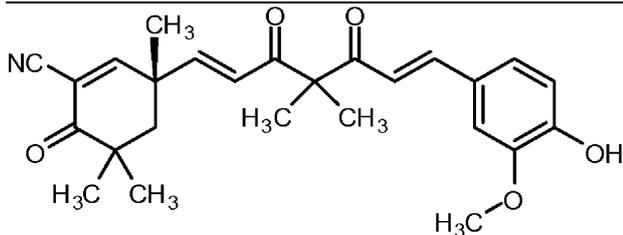
アルキル_(C₁₂)、アルケニル_(C₁₂)、アルキニル_(C₁₂)、アリール_(C₁₂)、アラルキル_(C₁₂)、ヘテロアリール_(C₁₂)、ヘテロアラルキル_(C₁₂)、アシル_(C₁₂)、アルコキシ_(C₁₂)、アルケニルオキシ_(C₁₂)、アルキニルオキシ_(C₁₂)、アリールオキシ_(C₁₂)、アラルコキシ_(C₁₂)、ヘテロアリールオキシ_(C₁₂)、ヘテロアラルコキシ_(C₁₂)、アシルオキシ_(C₁₂)、アルキルアミノ_(C₁₂)、ジアルキルアミノ_(C₁₂)、アルコキシアミノ_(C₁₂)、アルケニルアミノ_(C₁₂)、アルキニルアミノ_(C₁₂)、アリールアミノ_(C₁₂)、アラルキルアミノ_(C₁₂)、ヘテロアリールアミノ_(C₁₂)、ヘテロアラルキルアミノ_(C₁₂)、アミド_(C₁₂)、アルキルスルホニルアミノ_(C₁₂)、アルキルシリル_(C₁₂)、アルキルシリルオキシ_(C₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型である。

[本発明1025]

R₁およびR₂がいずれもメチルである、本発明1024の化合物。

[本発明1026]

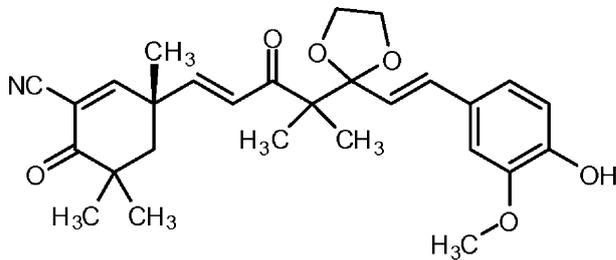
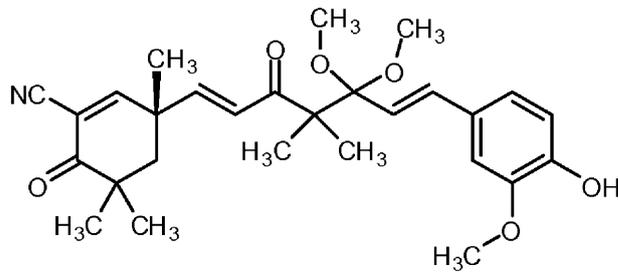
下記の式によってさらに定義される、本発明1024の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、溶媒和物、互変異性体、もしくは光学異性体：



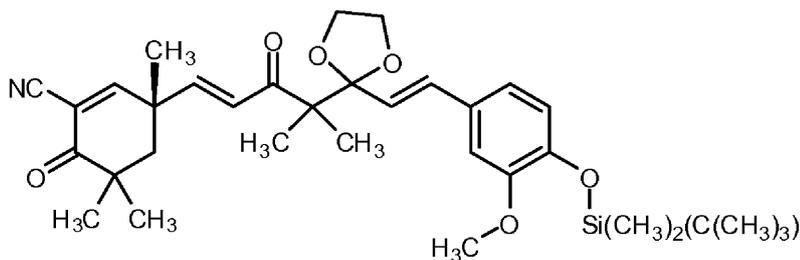
。

[本発明1027]

下記からなる群よりさらに選択される、本発明1024の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、溶媒和物、互変異性体、もしくは光学異性体：



および

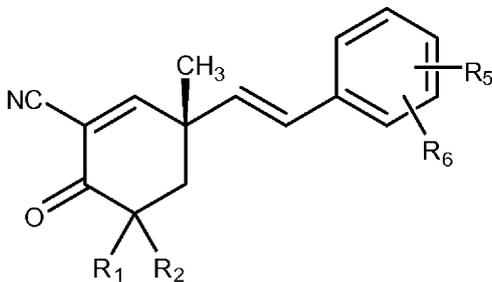


[本発明1028]

前記天然物がレスベラトロールである、本発明1022の化合物。

[本発明1029]

下記の式によってさらに定義される、本発明1028の化合物、またはその薬学的に許容される塩、エステル、水和物、溶媒和物、互変異性体、アセタール、ケタール、プロドラッグ、もしくは光学異性体：



式中、

R_1 および R_2 はそれぞれ独立に、

水素；または

アルキル (C_{1-12})、アルケニル (C_{2-12})、アルキニル (C_{2-12})、アリール (C_{6-12})、アラルキル (C_{6-12})、ヘテロアリール (C_{6-12})、ヘテロアラルキル (C_{6-12})、アシル (C_{1-12})、アルコキシ (C_{1-12})、アリールオキシ (C_{6-12})、アラルコキシ (C_{6-12})、ヘテロアリールオキシ (C_{6-12})、ヘテロアラルコキシ (C_{6-12})、アシルオキシ (C_{1-12})、アルキルアミノ (C_{1-12})、ジアルキルアミノ (C_{1-12})、アリールアミノ (C_{6-12})、アラルキルアミノ (C_{6-12})、ヘテロアリールアミノ (C_{6-12})、ヘテロアラルキルアミノ (C_{6-12})、アミド (C_{1-12})、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であるか；あるいは

R_1 および R_2 は一緒になってアルカンジイル (C_{1-12})、アルケンジイル (C_{2-12})、アルカンジイル (C_{1-12}) またはアルケンジイル (C_{2-12}) であり；かつ

R_5 および R_6 はそれぞれ独立に、

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノ、ヒドロキシアミノ、ニトロ、シアノ、アジド、もしくはメルカプト；または

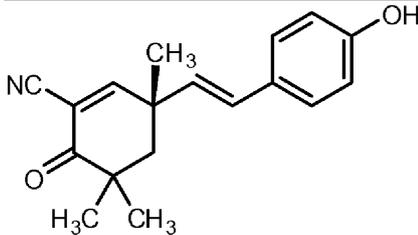
アルキル_(C₁₋₁₂)、アルケニル_(C₁₋₁₂)、アルキニル_(C₁₋₁₂)、アリール_(C₁₋₁₂)、アラルキル_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリール_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルキル_(C₁₋₁₂)、アシル_(C₁₋₁₂)、アルコキシ_(C₁₋₁₂)、アルケニルオキシ_(C₁₋₁₂)、アルキニルオキシ_(C₁₋₁₂)、アリールオキシ_(C₁₋₁₂)、アラルコキシ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールオキシ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルコキシ_(C₁₋₁₂)、アシルオキシ_(C₁₋₁₂)、アルキルアミノ_(C₁₋₁₂)、ジアルキルアミノ_(C₁₋₁₂)、アルコキシアミノ_(C₁₋₁₂)、アルケニルアミノ_(C₁₋₁₂)、アルキニルアミノ_(C₁₋₁₂)、アリールアミノ_(C₁₋₁₂)、アラルキルアミノ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールアミノ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルキルアミノ_(C₁₋₁₂)、アミド_(C₁₋₁₂)、アルキルシリル_(C₁₋₁₂)、アルキルシリルオキシ_(C₁₋₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型である。

[本発明1030]

R₁およびR₂がいずれもメチルである、本発明1029の化合物。

[本発明1031]

下記の式によってさらに定義される、本発明1029の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、溶媒和物、互変異性体、もしくは光学異性体：



[本発明1032]

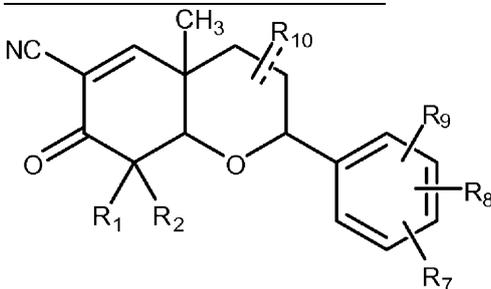
前記天然物の基本骨格が3つの環を有する、本発明1019の化合物。

[本発明1033]

前記天然物がガロカテコールである、本発明1032の化合物。

[本発明1034]

下記の式によってさらに定義される、本発明1033の化合物、またはその薬学的に許容される塩、エステル、水和物、溶媒和物、互変異性体、アセタール、ケタール、プロドラッグ、もしくは光学異性体：



式中、

R₁およびR₂はそれぞれ独立に、

水素；または

アルキル_(C₁₋₁₂)、アルケニル_(C₁₋₁₂)、アルキニル_(C₁₋₁₂)、アリール_(C₁₋₁₂)、アラルキル_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリール_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルキル_(C₁₋₁₂)、アシル_(C₁₋₁₂)、アルコキシ_(C₁₋₁₂)、アリールオキシ_(C₁₋₁₂)、アラルコキシ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールオキシ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルコキシ_(C₁₋₁₂)、アシルオキシ_(C₁₋₁₂)、アルキルアミノ_(C₁₋₁₂)、ジアルキルアミノ_(C₁₋₁₂)、アリールアミノ_(C₁₋₁₂)、アラルキルアミノ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールアミノ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルキルアミノ_(C₁₋₁₂)、アミド_(C₁₋₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であるか；あるいは

R₁およびR₂は一緒になってアルカンジイル(C₁₋₁₂)、アルケンジイル(C₁₋₁₂)、アルカンジイル(C₁₋₁₂)またはアルケンジイル(C₁₋₁₂)であり；

R₇、R₈およびR₉はそれぞれ独立に、

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノ、ヒドロキシアミノ、ニトロ、シアノ、アジド、もしくはメルカプト；または

アルキル(C₁₋₁₂)、アルケニル(C₁₋₁₂)、アルキニル(C₁₋₁₂)、アリール(C₁₋₁₂)、アラルキル(C₁₋₁₂)、ヘテロアリール(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルキル(C₁₋₁₂)、アシル(C₁₋₁₂)、アルコキシ(C₁₋₁₂)、アルケニルオキシ(C₁₋₁₂)、アルキニルオキシ(C₁₋₁₂)、アリールオキシ(C₁₋₁₂)、アラルコキシ(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールオキシ(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルコキシ(C₁₋₁₂)、アシルオキシ(C₁₋₁₂)、アルキルアミノ(C₁₋₁₂)、ジアルキルアミノ(C₁₋₁₂)、アルコキシアミノ(C₁₋₁₂)、アルケニルアミノ(C₁₋₁₂)、アルキニルアミノ(C₁₋₁₂)、アリールアミノ(C₁₋₁₂)、アラルキルアミノ(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールアミノ(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルキルアミノ(C₁₋₁₂)、アミド(C₁₋₁₂)、アルキルシリル(C₁₋₁₂)、アルキルシリルオキシ(C₁₋₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり；かつ

R₁₀は、

水素、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、アミノ、ヒドロキシアミノ、ニトロ、イミノ、シアノ、アジド、メルカプト、もしくはチオ；または

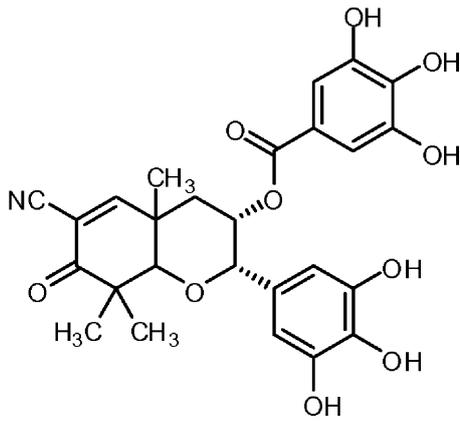
アルキル(C₁₋₁₂)、アルケニル(C₁₋₁₂)、アルキニル(C₁₋₁₂)、アリール(C₁₋₁₂)、アラルキル(C₁₋₁₂)、ヘテロアリール(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルキル(C₁₋₁₂)、アシル(C₁₋₁₂)、アルキリデン(C₁₋₁₂)、アルコキシ(C₁₋₁₂)、アルケニルオキシ(C₁₋₁₂)、アルキニルオキシ(C₁₋₁₂)、アリールオキシ(C₁₋₁₂)、アラルコキシ(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールオキシ(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルコキシ(C₁₋₁₂)、アシルオキシ(C₁₋₁₂)、アルキルアミノ(C₁₋₁₂)、ジアルキルアミノ(C₁₋₁₂)、アルコキシアミノ(C₁₋₁₂)、アルケニルアミノ(C₁₋₁₂)、アルキニルアミノ(C₁₋₁₂)、アリールアミノ(C₁₋₁₂)、アラルキルアミノ(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールアミノ(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルキルアミノ(C₁₋₁₂)、アルキルスルホニルアミノ(C₁₋₁₂)、アミド(C₁₋₁₂)、アルキルイミノ(C₁₋₁₂)、アルケニルイミノ(C₁₋₁₂)、アルキニルイミノ(C₁₋₁₂)、アリールイミノ(C₁₋₁₂)、アラルキルイミノ(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールイミノ(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルキルイミノ(C₁₋₁₂)、アシルイミノ(C₁₋₁₂)、アルキルチオ(C₁₋₁₂)、アルケニルチオ(C₁₋₁₂)、アルキニルチオ(C₁₋₁₂)、アリールチオ(C₁₋₁₂)、アラルキルチオ(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールチオ(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルキルチオ(C₁₋₁₂)、アシルチオ(C₁₋₁₂)、チオアシル(C₁₋₁₂)、アルキルスルホニル(C₁₋₁₂)、アルケニルスルホニル(C₁₋₁₂)、アルキニルスルホニル(C₁₋₁₂)、アリールスルホニル(C₁₋₁₂)、アラルキルスルホニル(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールスルホニル(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルキルスルホニル(C₁₋₁₂)、アルキルアンモニウム(C₁₋₁₂)、アルキルスルホニウム(C₁₋₁₂)、アルキルシリル(C₁₋₁₂)、アルキルシリルオキシ(C₁₋₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型である。

[本発明1035]

R₁およびR₂がいずれもメチルである、本発明1034の化合物。

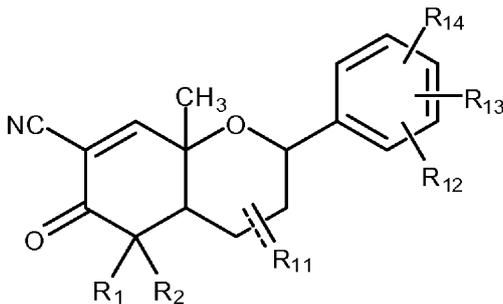
[本発明1036]

下記の式によってさらに定義される、本発明1034の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、溶媒和物、互変異性体、もしくは光学異性体；



。
[本発明1037]

下記の式によってさらに定義される、本発明1032の化合物、またはその薬学的に許容される塩、エステル、水和物、溶媒和物、互変異性体、アセタール、ケタール、プロドラッグ、もしくは光学異性体：



式中、

R_1 および R_2 はそれぞれ独立に、
水素；または

アルキル (C_{1-12})、アルケニル (C_{1-12})、アルキニル (C_{1-12})、アリール (C_{1-12})、アラルキル (C_{1-12})、ヘテロアリール (C_{1-12})、ヘテロアラルキル (C_{1-12})、アシル (C_{1-12})、アルコキシ (C_{1-12})、アリーロキシ (C_{1-12})、アラルコキシ (C_{1-12})、ヘテロアリーロキシ (C_{1-12})、ヘテロアラルコキシ (C_{1-12})、アシルオキシ (C_{1-12})、アルキルアミノ (C_{1-12})、ジアルキルアミノ (C_{1-12})、アリールアミノ (C_{1-12})、アラルキルアミノ (C_{1-12})、ヘテロアリールアミノ (C_{1-12})、ヘテロアラルキルアミノ (C_{1-12})、アミド (C_{1-12})、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であるか；あるいは

R_1 および R_2 は一緒になってアルカンジイル (C_{1-12})、アルケンジイル (C_{1-12})、アルカンジイル (C_{1-12}) またはアルケンジイル (C_{1-12}) であり；

R_{11} は、

水素、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、アミノ、ヒドロキシアミノ、ニトロ、イミノ、シアノ、アジド、メルカプト、もしくはチオ；または

アルキル (C_{1-12})、アルケニル (C_{1-12})、アルキニル (C_{1-12})、アリール (C_{1-12})、アラルキル (C_{1-12})、ヘテロアリール (C_{1-12})、ヘテロアラルキル (C_{1-12})、アシル (C_{1-12})、アルキリデン (C_{1-12})、アルコキシ (C_{1-12})、アルケニルオキシ (C_{1-12})、アルキニルオキシ (C_{1-12})、アリーロキシ (C_{1-12})、アラルコキシ (C_{1-12})、ヘテロアリーロキシ (C_{1-12})、ヘテロアラルコキシ (C_{1-12})、アシルオキシ (C_{1-12})、アルキルアミノ (C_{1-12})、ジアルキルアミノ (C_{1-12})、アルコキシアミノ (C_{1-12})、アルケニルアミノ (C_{1-12})、アルキニルアミノ (C_{1-12})、アリールアミノ (C_{1-12})、アラルキルアミノ (C_{1-12})、ヘテロアリールアミノ (C_{1-12})、ヘテロアラルキルアミノ (C_{1-12})、アルキルスルホニルアミノ (C_{1-12})、アミド (C_{1-12})、アルキルイミノ (C_{1-12})、アルケニルイミノ (C_{1-12})、アルキニルイミノ (C_{1-12})、アリールイミノ (C_{1-12})、アラルキルイミノ (C_{1-12})、ヘテロアリールイミノ (C_{1-12})、ヘテロアラルキルイミノ (C_{1-12})、アシルイミノ (C_{1-12})、アルキルチオ (C_{1-12})、アルケニ

ルチオ_(C₁₂)、アルキニルチオ_(C₁₂)、アリールチオ_(C₁₂)、アラルキルチオ_(C₁₂)、ヘテロアリールチオ_(C₁₂)、ヘテロアラルキルチオ_(C₁₂)、アシルチオ_(C₁₂)、チオアシル_(C₁₂)、アルキルスルホニル_(C₁₂)、アルケニルスルホニル_(C₁₂)、アルキニルスルホニル_(C₁₂)、アリールスルホニル_(C₁₂)、アラルキルスルホニル_(C₁₂)、ヘテロアリールスルホニル_(C₁₂)、ヘテロアラルキルスルホニル_(C₁₂)、アルキルアンモニウム_(C₁₂)、アルキルスルホニウム_(C₁₂)、アルキルシリル_(C₁₂)、アルキルシリルオキシ_(C₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり；かつ

R₁₂、R₁₃およびR₁₄はそれぞれ独立に、

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノ、ヒドロキシアミノ、ニトロ、シアノ、アジド、もしくはメルカプト；または

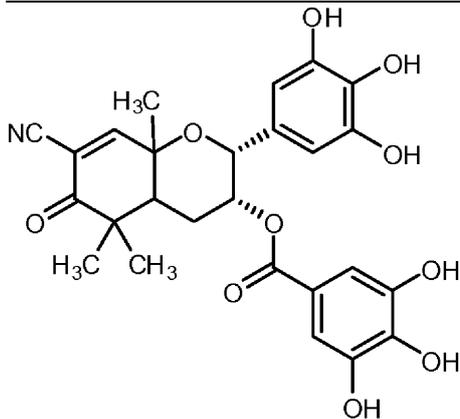
アルキル_(C₁₂)、アルケニル_(C₁₂)、アルキニル_(C₁₂)、アリール_(C₁₂)、アラルキル_(C₁₂)、ヘテロアリール_(C₁₂)、ヘテロアラルキル_(C₁₂)、アシル_(C₁₂)、アルコキシ_(C₁₂)、アルケニルオキシ_(C₁₂)、アルキニルオキシ_(C₁₂)、アリールオキシ_(C₁₂)、アラルコキシ_(C₁₂)、ヘテロアリールオキシ_(C₁₂)、ヘテロアラルコキシ_(C₁₂)、アシルオキシ_(C₁₂)、アルキルアミノ_(C₁₂)、ジアルキルアミノ_(C₁₂)、アルコキシアミノ_(C₁₂)、アルケニルアミノ_(C₁₂)、アルキニルアミノ_(C₁₂)、アリールアミノ_(C₁₂)、アラルキルアミノ_(C₁₂)、ヘテロアリールアミノ_(C₁₂)、ヘテロアラルキルアミノ_(C₁₂)、アミド_(C₁₂)、アルキルシリル_(C₁₂)、アルキルシリルオキシ_(C₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型である。

[本発明1038]

R₁およびR₂がいずれもメチルである、本発明1037の化合物。

[本発明1039]

下記の式によってさらに定義される、本発明1037の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、溶媒和物、互変異性体、もしくは光学異性体：



[本発明1040]

前記天然物の基本骨格が4つの環を有する、本発明1019の化合物。

[本発明1041]

前記天然物の基本骨格が5つの環を有する、本発明1019の化合物。

[本発明1042]

前記天然物がセラストールである、本発明1041の化合物。

[本発明1043]

前記天然物の基本骨格が6つの環を有する、本発明1019の化合物。

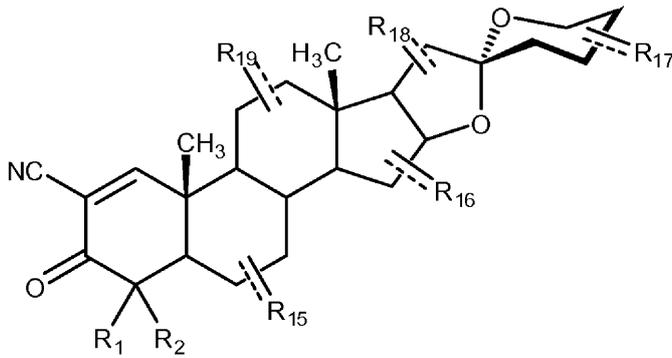
[本発明1044]

前記天然物がヘコゲニン、チゴゲニン、またはサルサボゲニンである、本発明1043の化合物。

[本発明1045]

下記の式によってさらに定義される、本発明1044の化合物、またはその薬学的に許容される塩、エステル、水和物、溶媒和物、互変異性体、アセタール、ケタール、プロドラッ

グ、もしくは光学異性体：



式中、

R_1 および R_2 はそれぞれ独立に、

水素；または

アルキル_(C₁₋₁₂)、アルケニル_(C₁₋₁₂)、アルキニル_(C₁₋₁₂)、アリール_(C₁₋₁₂)、アラルキル_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリール_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルキル_(C₁₋₁₂)、アシル_(C₁₋₁₂)、アルコキシ_(C₁₋₁₂)、アリーロキシ_(C₁₋₁₂)、アラルコキシ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリーロキシ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルコキシ_(C₁₋₁₂)、アシルオキシ_(C₁₋₁₂)、アルキルアミノ_(C₁₋₁₂)、ジアルキルアミノ_(C₁₋₁₂)、アリールアミノ_(C₁₋₁₂)、アラルキルアミノ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールアミノ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルキルアミノ_(C₁₋₁₂)、アミド_(C₁₋₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であるか；あるいは

R_1 および R_2 は一緒になってアルカンジイル_(C₁₋₁₂)、アルケンジイル_(C₁₋₁₂)、アルカンジイル_(C₁₋₁₂)またはアルケンジイル_(C₁₋₁₂)であり；かつ

R_{15} 、 R_{16} 、 R_{17} 、 R_{18} および R_{19} はそれぞれ独立に、

水素、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、アミノ、ヒドロキシアミノ、ニトロ、イミノ、シアノ、アジド、メルカプト、もしくはチオ；または

アルキル_(C₁₋₁₂)、アルケニル_(C₁₋₁₂)、アルキニル_(C₁₋₁₂)、アリール_(C₁₋₁₂)、アラルキル_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリール_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルキル_(C₁₋₁₂)、アシル_(C₁₋₁₂)、アルキリデン_(C₁₋₁₂)、アルコキシ_(C₁₋₁₂)、アルケニルオキシ_(C₁₋₁₂)、アルキニルオキシ_(C₁₋₁₂)、アリーロキシ_(C₁₋₁₂)、アラルコキシ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリーロキシ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルコキシ_(C₁₋₁₂)、アシルオキシ_(C₁₋₁₂)、アルキルアミノ_(C₁₋₁₂)、ジアルキルアミノ_(C₁₋₁₂)、アルコキシアミノ_(C₁₋₁₂)、アルケニルアミノ_(C₁₋₁₂)、アルキニルアミノ_(C₁₋₁₂)、アリールアミノ_(C₁₋₁₂)、アラルキルアミノ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールアミノ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルキルアミノ_(C₁₋₁₂)、アルキルスルホニルアミノ_(C₁₋₁₂)、アミド_(C₁₋₁₂)、アルキルイミノ_(C₁₋₁₂)、アルケニルイミノ_(C₁₋₁₂)、アルキニルイミノ_(C₁₋₁₂)、アリールイミノ_(C₁₋₁₂)、アラルキルイミノ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールイミノ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルキルイミノ_(C₁₋₁₂)、アシルイミノ_(C₁₋₁₂)、アルキルチオ_(C₁₋₁₂)、アルケニルチオ_(C₁₋₁₂)、アルキニルチオ_(C₁₋₁₂)、アリールチオ_(C₁₋₁₂)、アラルキルチオ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールチオ_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルキルチオ_(C₁₋₁₂)、アシルチオ_(C₁₋₁₂)、チオアシル_(C₁₋₁₂)、アルキルスルホニル_(C₁₋₁₂)、アルケニルスルホニル_(C₁₋₁₂)、アルキニルスルホニル_(C₁₋₁₂)、アリールスルホニル_(C₁₋₁₂)、アラルキルスルホニル_(C₁₋₁₂)、ヘテロアリールスルホニル_(C₁₋₁₂)、ヘテロアラルキルスルホニル_(C₁₋₁₂)、アルキルアンモニウム_(C₁₋₁₂)、アルキルスルホニウム_(C₁₋₁₂)、アルキルシリル_(C₁₋₁₂)、アルキルシリルオキシ_(C₁₋₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型である。

[本発明1046]

R_1 および R_2 がいずれもメチルである、本発明1045の化合物。

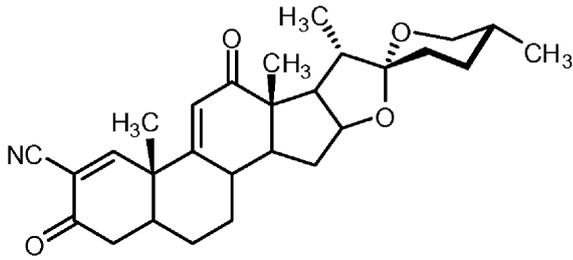
[本発明1047]

R_{17} がメチルである、本発明1045の化合物。

[本発明1048]

下記の式の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、溶媒和物、互変異性体

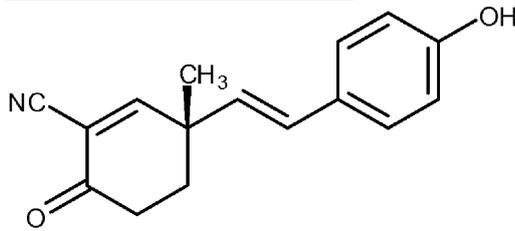
、もしくは光学異性体：



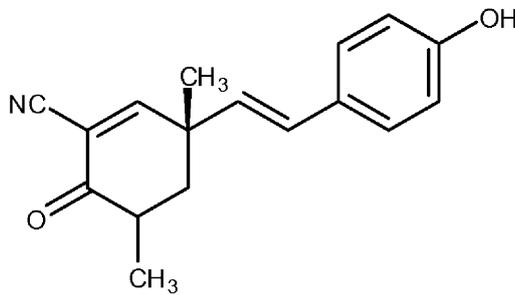
°

[本発明1049]

下記の式の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、溶媒和物、互変異性体、もしくは光学異性体：



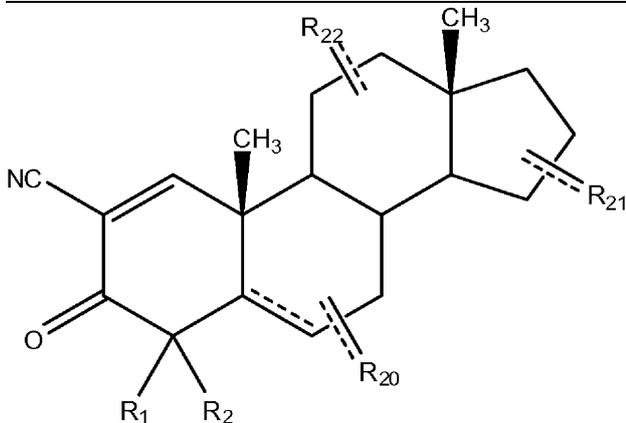
,または



°

[本発明1050]

下記の式の化合物、またはその薬学的に許容される塩、エステル、水和物、溶媒和物、互変異性体、アセタール、ケタール、プロドラッグ、もしくは光学異性体：



式中、

R₁およびR₂はそれぞれ独立に、

水素；または

アルキル (C₁₋₁₂)、アルケニル (C₂₋₁₂)、アルキニル (C₂₋₁₂)、アリール (C₆₋₁₂)、アラルキル (C₆₋₁₂)、ヘテロアリール (C₆₋₁₂)、ヘテロアラルキル (C₆₋₁₂)、アシル (C₁₋₁₂)、アルコキシ (C₁₋₁₂)、アリーロキシ (C₆₋₁₂)、アラルコキシ (C₆₋₁₂)、ヘテロアリーロキシ (C₆₋₁₂)、ヘテロアラルコキシ (C₆₋₁₂)、アシルオキシ (C₁₋₁₂)、アルキルアミノ (C₁₋₁₂)、ジ

アルキルアミノ_(C₁₂)、アリールアミノ_(C₁₂)、アラルキルアミノ_(C₁₂)、ヘテロアリールアミノ_(C₁₂)、ヘテロアラルキルアミノ_(C₁₂)、アミド_(C₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であるか；あるいは

R_1 および R_2 は一緒になってアルカンジイル_(C₁₂)、アルケンジイル_(C₁₂)、アルカンジイル_(C₁₂)またはアルケンジイル_(C₁₂)であり；かつ

R_{20} 、 R_{21} 、および R_{22} はそれぞれ独立に、

水素、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、アミノ、ヒドロキシアミノ、ニトロ、イミノ、シアノ、アジド、メルカプト、もしくはチオ；または

アルキル_(C₁₂)、アルケニル_(C₁₂)、アルキニル_(C₁₂)、アリール_(C₁₂)、アラルキル_(C₁₂)、ヘテロアリール_(C₁₂)、ヘテロアラルキル_(C₁₂)、アシル_(C₁₂)、アルキリデン_(C₁₂)、アルコキシ_(C₁₂)、アルケニルオキシ_(C₁₂)、アルキニルオキシ_(C₁₂)、アリールオキシ_(C₁₂)、アラルコキシ_(C₁₂)、ヘテロアリールオキシ_(C₁₂)、ヘテロアラルコキシ_(C₁₂)、アシルオキシ_(C₁₂)、アルキルアミノ_(C₁₂)、ジアルキルアミノ_(C₁₂)、アルコキシアミノ_(C₁₂)、アルケニルアミノ_(C₁₂)、アルキニルアミノ_(C₁₂)、アリールアミノ_(C₁₂)、アラルキルアミノ_(C₁₂)、ヘテロアリールアミノ_(C₁₂)、ヘテロアラルキルアミノ_(C₁₂)、アルキルスルホニルアミノ_(C₁₂)、アミド_(C₁₂)、アルキルイミノ_(C₁₂)、アルケニルイミノ_(C₁₂)、アルキニルイミノ_(C₁₂)、アリールイミノ_(C₁₂)、アラルキルイミノ_(C₁₂)、ヘテロアリールイミノ_(C₁₂)、ヘテロアラルキルイミノ_(C₁₂)、アシルイミノ_(C₁₂)、アルキルチオ_(C₁₂)、アルケニルチオ_(C₁₂)、アルキニルチオ_(C₁₂)、アリールチオ_(C₁₂)、アラルキルチオ_(C₁₂)、ヘテロアリールチオ_(C₁₂)、ヘテロアラルキルチオ_(C₁₂)、アシルチオ_(C₁₂)、チオアシル_(C₁₂)、アルキルスルホニル_(C₁₂)、アルケニルスルホニル_(C₁₂)、アルキニルスルホニル_(C₁₂)、アリールスルホニル_(C₁₂)、アラルキルスルホニル_(C₁₂)、ヘテロアリールスルホニル_(C₁₂)、ヘテロアラルキルスルホニル_(C₁₂)、アルキルアンモニウム_(C₁₂)、アルキルスルホニウム_(C₁₂)、アルキルシリル_(C₁₂)、アルキルシリルオキシ_(C₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型である。

[本発明1051]

R_1 および R_2 がいずれも水素である、本発明1050の化合物。

[本発明1052]

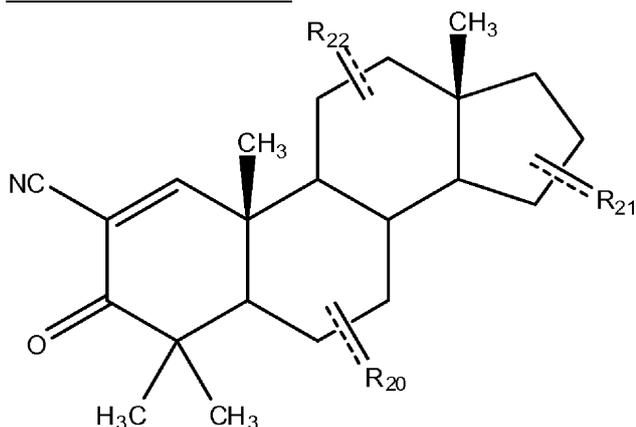
R_1 および R_2 が水素ではない、本発明1050の化合物。

[本発明1053]

R_1 および R_2 がいずれもメチルである、本発明1050の化合物。

[本発明1054]

下記としてさらに定義される、本発明1050の化合物、またはその薬学的に許容される塩、エステル、水和物、溶媒和物、互変異性体、アセタール、ケタール、プロドラッグ、もしくは光学異性体：



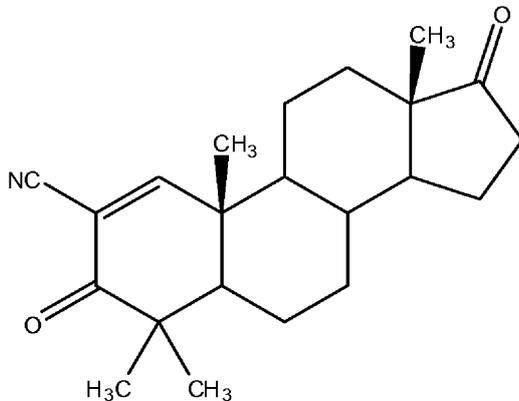
式中、 R_{20} 、 R_{21} 、および R_{22} はそれぞれ独立に、

水素、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、アミノ、ヒドロキシアミノ、ニトロ、イミノ、シアノ、アジド、メルカプト、もしくはチオ；または

アルキル_(C₁₂)、アルケニル_(C₁₂)、アルキニル_(C₁₂)、アリール_(C₁₂)、アラルキル_(C₁₂)、ヘテロアリール_(C₁₂)、ヘテロアラルキル_(C₁₂)、アシル_(C₁₂)、アルキリデン_(C₁₂)、アルコキシ_(C₁₂)、アルケニルオキシ_(C₁₂)、アルキニルオキシ_(C₁₂)、アリールオキシ_(C₁₂)、アラルコキシ_(C₁₂)、ヘテロアリールオキシ_(C₁₂)、ヘテロアラルコキシ_(C₁₂)、アシルオキシ_(C₁₂)、アルキルアミノ_(C₁₂)、ジアルキルアミノ_(C₁₂)、アルコシアミノ_(C₁₂)、アルケニルアミノ_(C₁₂)、アルキニルアミノ_(C₁₂)、アリールアミノ_(C₁₂)、アラルキルアミノ_(C₁₂)、ヘテロアリールアミノ_(C₁₂)、ヘテロアラルキルアミノ_(C₁₂)、アルキルスルホニルアミノ_(C₁₂)、アミド_(C₁₂)、アルキルイミノ_(C₁₂)、アルケニルイミノ_(C₁₂)、アルキニルイミノ_(C₁₂)、アリールイミノ_(C₁₂)、アラルキルイミノ_(C₁₂)、ヘテロアリールイミノ_(C₁₂)、ヘテロアラルキルイミノ_(C₁₂)、アシルイミノ_(C₁₂)、アルキルチオ_(C₁₂)、アルケニルチオ_(C₁₂)、アルキニルチオ_(C₁₂)、アリールチオ_(C₁₂)、アラルキルチオ_(C₁₂)、ヘテロアリールチオ_(C₁₂)、ヘテロアラルキルチオ_(C₁₂)、アシルチオ_(C₁₂)、チオアシル_(C₁₂)、アルキルスルホニル_(C₁₂)、アルケニルスルホニル_(C₁₂)、アルキニルスルホニル_(C₁₂)、アリールスルホニル_(C₁₂)、アラルキルスルホニル_(C₁₂)、ヘテロアリールスルホニル_(C₁₂)、ヘテロアラルキルスルホニル_(C₁₂)、アルキルアンモニウム_(C₁₂)、アルキルスルホニウム_(C₁₂)、アルキルシリル_(C₁₂)、アルキルシリルオキシ_(C₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型である。

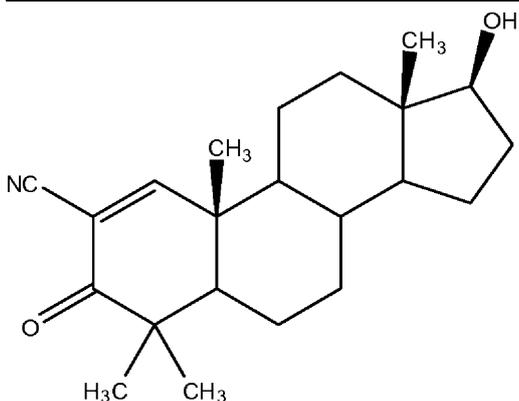
[本発明1055]

下記の式によってさらに定義される、本発明1054の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、溶媒和物、互変異性体、もしくは光学異性体：



[本発明1056]

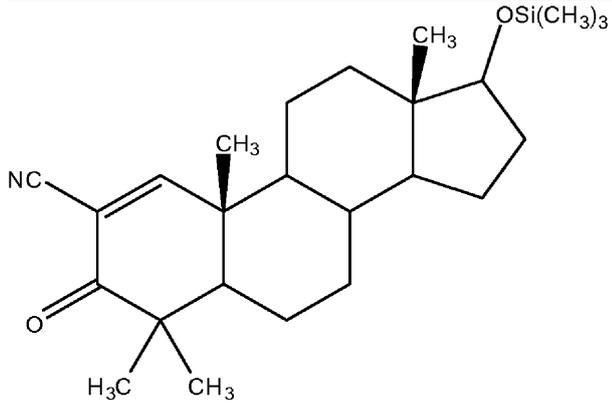
下記の式によってさらに定義される、本発明1054の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、溶媒和物、互変異性体、もしくは光学異性体：



[本発明1057]

下記の式によってさらに定義される、本発明1054の化合物、またはその薬学的に許容さ

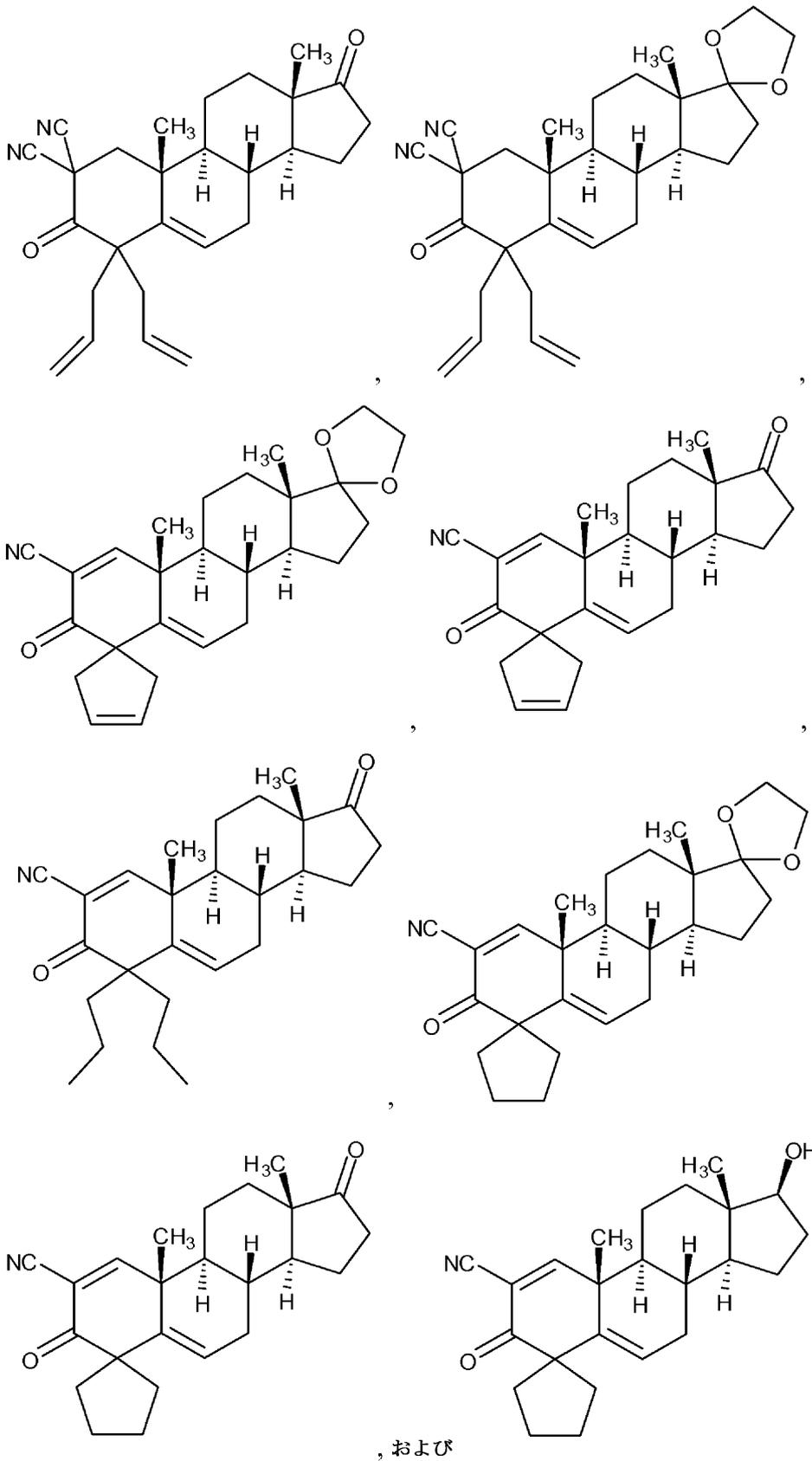
れる塩、水和物、溶媒和物、互変異性体、もしくは光学異性体：



°

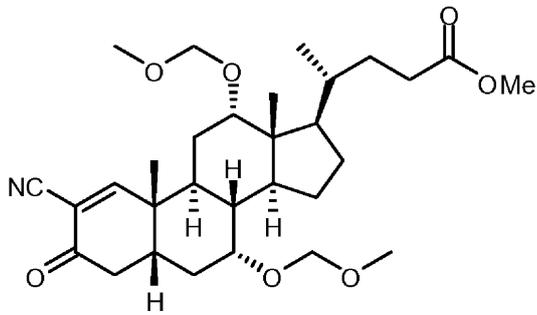
[本発明1058]

下記からなる群よりさらに選択される、本発明1050の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、溶媒和物、互変異性体、もしくは光学異性体：



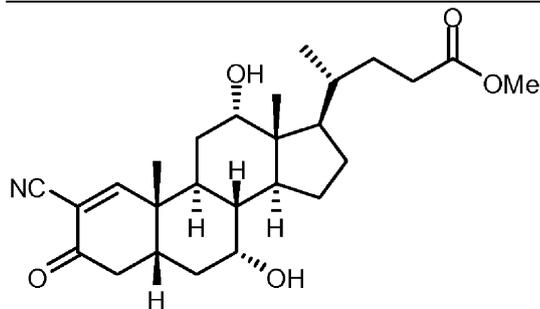
○
[本発明1059]

下記としてさらに定義される、本発明1050の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、溶媒和物、互変異性体、もしくは光学異性体：



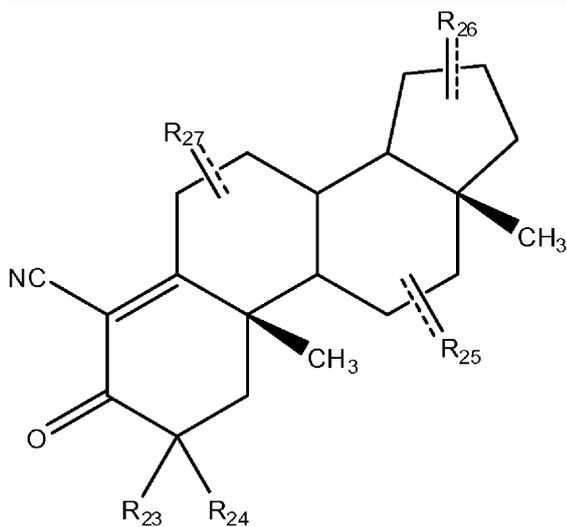
。
[本発明1060]

下記としてさらに定義される、本発明1050の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、溶媒和物、互変異性体、もしくは光学異性体：



。
[本発明1061]

下記の式の化合物、またはその薬学的に許容される塩、エステル、水和物、溶媒和物、互変異性体、アセタール、ケタール、プロドラッグ、もしくは光学異性体：



式中、

R₂₃およびR₂₄はそれぞれ独立に、

水素、アルキル(C₈)もしくは置換アルキル(C₈)であるか；または

R₂₃およびR₂₄は一緒になってアルカンジイル(C₁₂)、アルケンジイル(C₁₂)、アルカンジイル(C₁₂)またはアルケンジイル(C₁₂)であり；

R₂₅、R₂₆およびR₂₇はそれぞれ独立に、

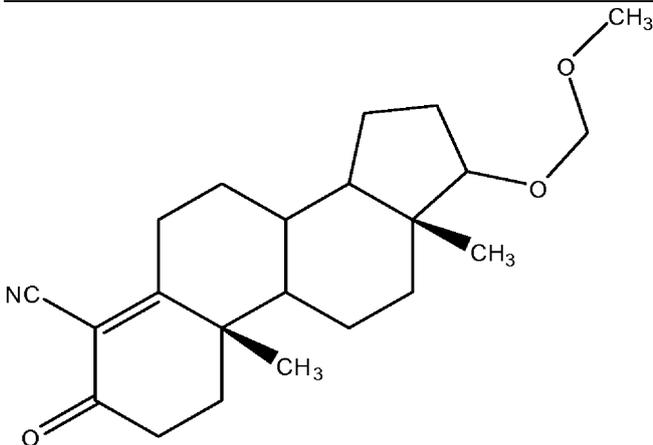
水素、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、アミノ、ヒドロキシアミノ、ニトロ、イミノ、シアノ、アジド、メルカプト、もしくはチオ；または

アルキル(C₁₂)、アルケニル(C₁₂)、アルキニル(C₁₂)、アリール(C₁₂)、アラルキル(C₁₂)、ヘテロアリール(C₁₂)、ヘテロアラルキル(C₁₂)、アシル(C₁₂)、アルキリデン(C₁₂)、アルコキシ(C₁₂)、アルケニルオキシ(C₁₂)、アルキニルオキシ(C₁₂)、アリールオキシ(C₁₂)、アラルコキシ(C₁₂)、ヘテロアリールオキシ(C₁₂)、へ

テロアラロキシ(C₁₂)、アシルオキシ(C₁₂)、アルキルアミノ(C₁₂)、ジアルキルアミノ(C₁₂)、アルコシアミノ(C₁₂)、アルケニルアミノ(C₁₂)、アルキニルアミノ(C₁₂)、アリールアミノ(C₁₂)、アラルキルアミノ(C₁₂)、ヘテロアリールアミノ(C₁₂)、ヘテロアラルキルアミノ(C₁₂)、アルキルスルホニルアミノ(C₁₂)、アミド(C₁₂)、アルキルイミノ(C₁₂)、アルケニルイミノ(C₁₂)、アルキニルイミノ(C₁₂)、アリールイミノ(C₁₂)、アラルキルイミノ(C₁₂)、ヘテロアリールイミノ(C₁₂)、ヘテロアラルキルイミノ(C₁₂)、アシルイミノ(C₁₂)、アルキルチオ(C₁₂)、アルケニルチオ(C₁₂)、アルキニルチオ(C₁₂)、アリールチオ(C₁₂)、アラルキルチオ(C₁₂)、ヘテロアリールチオ(C₁₂)、ヘテロアラルキルチオ(C₁₂)、アシルチオ(C₁₂)、チオアシル(C₁₂)、アルキルスルホニル(C₁₂)、アルケニルスルホニル(C₁₂)、アルキニルスルホニル(C₁₂)、アリールスルホニル(C₁₂)、アラルキルスルホニル(C₁₂)、ヘテロアリールスルホニル(C₁₂)、ヘテロアラルキルスルホニル(C₁₂)、アルキルアンモニウム(C₁₂)、アルキルスルホニウム(C₁₂)、アルキルシリル(C₁₂)、アルキルシリルオキシ(C₁₂)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型である。

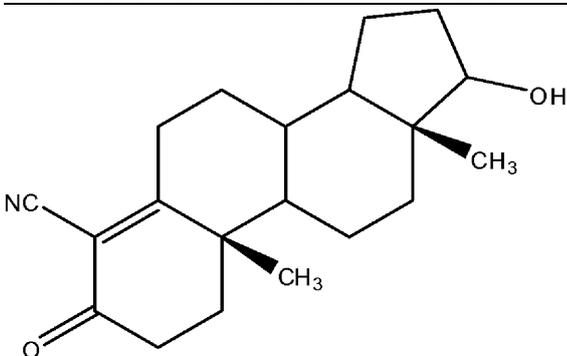
[本発明1062]

下記の式によってさらに定義される、本発明1061の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、溶媒和物、互変異性体、もしくは光学異性体：



[本発明1063]

下記としてさらに定義される、本発明1061の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、溶媒和物、互変異性体、もしくは光学異性体：



[本発明1064]

下記からなる群より選択される化合物：

(S)-3-((1E,6E)-7-(4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル)-4,4-ジメチル-3,5-ジオキソヘプタ-1,6-ジエニル)-3,5,5-トリメチル-6-オキソシクロヘックス-1-エンカルボニトリル、
(S)-3-((1E,6E)-7-(4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル)-5,5-ジメトキシ-4,4-ジメチル-3-オキソヘプタ-1,6-ジエニル)-3,5,5-トリメチル-6-オキソシクロヘックス-1-エンカルボ

ニトリル、

(S)-3-((E)-4-(2-(4-ヒドロキシ-3-メトキシステリル)-1,3-ジオキソラン-2-イル)-4-メチル-3-オキソペンタ-1-エニル)-3,5,5-トリメチル-6-オキソシクロヘキサ-1-エンカルボニトリル、

(S)-3-((E)-4-(2-(4-(tert-ブチルジメチルシリルオキシ)-3-メトキシステリル)-1,3-ジオキソラン-2-イル)-4-メチル-3-オキソペンタ-1-エニル)-3,5,5-トリメチル-6-オキソシクロヘキサ-1-エンカルボニトリル、

(S,E)-3-(4-ヒドロキシステリル)-3,5,5-トリメチル-6-オキソシクロヘキサ-1-エンカルボニトリル、

3,4,5-トリヒドロキシ安息香酸(2S,3S)-6-シアノ-4a,8,8-トリメチル-7-オキソ-2-(3,4,5-トリヒドロキシフェニル)-3,4,4a,7,8,8a-ヘキサヒドロ-2H-クロメン-3-イル、および
3,4,5-トリヒドロキシ安息香酸(2R,3R)-7-シアノ-5,5,8a-トリメチル-6-オキソ-2-(3,4,5-トリヒドロキシフェニル)-3,4,4a,5,6,8a-ヘキサヒドロ-2H-クロメン-3-イル。

[本発明1065]

下記からなる群より選択される化合物：

(S,E)-3-(4-ヒドロキシステリル)-3-メチル-6-オキソシクロヘキサ-1-エンカルボニトリル、および

(3S)-3-(4-ヒドロキシステリル)-3,5-ジメチル-6-オキソシクロヘキサ-1-エンカルボニトリル。

[本発明1066]

下記からなる群より選択される化合物：

(10S,13S)-4,4,10,13-テトラメチル-3,17-ジオキソ-4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17-テトラデカヒドロ-3H-シクロペンタ[a]フェナントレン-2-カルボニトリル、

(10S,13S,17S)-17-ヒドロキシ-4,4,10,13-テトラメチル-3-オキソ-4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17-テトラデカヒドロ-3H-シクロペンタ[a]フェナントレン-2-カルボニトリル、および

(10S,13S)-4,4,10,13-テトラメチル-3-オキソ-17-(トリメチルシリルオキシ)-4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17-テトラデカヒドロ-3H-シクロペンタ[a]フェナントレン-2-カルボニトリル。

[本発明1067]

下記からなる群より選択される化合物：

(10S,13R)-17-(メトキシメトキシ)-10,13-ジメチル-3-オキソ-2,3,6,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17-テトラデカヒドロ-1H-シクロペンタ[a]フェナントレン-4-カルボニトリル、および

(10S,13R)-17-ヒドロキシ-10,13-ジメチル-3-オキソ-2,3,6,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17-テトラデカヒドロ-1H-シクロペンタ[a]フェナントレン-4-カルボニトリル。

[本発明1068]

薬学的に許容される塩の形である、本発明1007～1063のいずれかの化合物。

[本発明1069]

塩ではない、本発明1007～1063のいずれかの化合物。

[本発明1070]

エステル₂の形である、本発明1007～1024、1028～1029、1032～1034、1024、1040～1047、1054、および1061のいずれかの化合物。

[本発明1071]

前記エステルが前記式のヒドロキシ基とビオチンのカルボン酸基との間の縮合反応から生じる、本発明1070の化合物。

[本発明1072]

立体異性体の混合物として存在する、本発明1007～1063のいずれかの化合物。

[本発明1073]

単一の立体異性体として存在する、本発明1007～1063のいずれかの化合物。

[本発明1074]

マクロファージにおけるIFN-誘導性NO産生を阻害するのに有効であり、さらに約0.2 μ M未満のIC₅₀値を有する、本発明1007~1026、1028~1029、1032~1034、1024、1040~1048、1054~1057、1061、1064および1066のいずれかの化合物。

[本発明1075]

活性成分として本発明1007~1067のいずれかの化合物および薬学的に許容される担体を含む、薬学的組成物。

[本発明1076]

経口、脂肪内(intraadiposally)、動脈内、関節内、頭蓋内、皮内、病変内(intralesionally)、筋肉内、鼻腔内、眼内、心膜内、腹腔内、胸膜内(intrapleurally)、前立腺内、直腸内、くも膜下腔内、気管内、腫瘍内、臍内、腔内、静脈内、小胞内、硝子体内、リボソーム、局部、粘膜、経口、非経口、直腸、結膜下、皮下、舌下、局所、経類、経皮、経膈、クリーム中、脂質組成物中、カテーテルにより、洗浄により、持続注入により、注入により、吸入により、注射により、局部送達により、限局性灌流により、標的細胞を直接浸漬して、またはその任意の組み合わせからなる群より選択される経路による投与に適合している、本発明1075の薬学的組成物。

[本発明1077]

経口送達用に調剤する、本発明1076の組成物。

[本発明1078]

硬もしくは軟カプセル剤、錠剤、シロップ剤、懸濁剤、カシェ剤、またはエリキシル剤として調剤する、本発明1077の組成物。

[本発明1079]

軟カプセル剤がゼラチンカプセル剤である、本発明1078の組成物。

[本発明1080]

保護コーティングをさらに含む、本発明1077の組成物。

[本発明1081]

吸収を遅延させる剤をさらに含む、本発明1077の組成物。

[本発明1082]

溶解性または分散性を増強する剤をさらに含む、本発明1077の組成物。

[本発明1083]

化合物をリボソーム、油水乳剤(oil and water emulsion)または水油乳剤(water and oil emulsion)中に分散させる、本発明1075の組成物。

[本発明1084]

本発明1007~1067のいずれかの薬学的に有効な化合物を対象に投与する段階を含む治療方法。

[本発明1085]

対象がヒトである、本発明1084の方法。

[本発明1086]

処置を必要としている対象を同定する段階をさらに含む、本発明1084の方法。

[本発明1087]

対象におけるがんを処置する方法であって、対象に本発明1007~1067のいずれかの化合物の薬学的有効量を投与する段階を含む、方法。

[本発明1088]

がんが癌腫、肉腫、リンパ腫、白血病、黒色腫、中皮腫、多発性骨髄腫、または精上皮腫である、本発明1087の方法。

[本発明1089]

がんが膀胱、血液、骨、脳、乳房、中枢神経系、結腸、子宮内膜、食道、尿生殖路、頭部、喉頭、肝臓、肺、頸部、卵巣、膵臓、前立腺、脾臓、小腸、大腸、胃、または精巣のガンである、本発明1087の方法。

[本発明1090]

対象が霊長類である、本発明1087の方法。

[本発明1091]

対象がヒトである、本発明1087の方法。

[本発明1092]

処置を必要としている対象を同定する段階をさらに含む、本発明1087の方法。

[本発明1093]

対象ががんの家族歴または患者歴を有する、本発明1092の方法。

[本発明1094]

対象ががんの症状を有する、本発明1087の方法。

[本発明1095]

化合物を局部投与する、本発明1087の方法。

[本発明1096]

化合物を直接腫瘍内注射により、または腫瘍脈管構造内への注射により投与する、本発明1095の方法。

[本発明1097]

化合物を全身投与する、本発明1087の方法。

[本発明1098]

化合物を静脈内、動脈内、筋肉内、腹腔内、皮下または経口投与する、本発明1097の方法。

[本発明1099]

薬学的有効量が0.1~1000mg/kgである、本発明1087の方法。

[本発明1100]

薬学的有効量を1日当たり単回で投与する、本発明1099の方法。

[本発明1101]

薬学的有効量を1日当たり2回以上で投与する、本発明1099の方法。

[本発明1102]

化合物をエクスピボでのパージ(purging)中に腫瘍細胞を接触させることにより投与する、本発明1087の方法。

[本発明1103]

- a)腫瘍細胞において細胞毒性を誘導すること；
- b)腫瘍細胞を死滅させること；
- c)腫瘍細胞においてアポトーシスを誘導すること；
- d)腫瘍細胞において分化を誘導すること；または
- e)腫瘍細胞において増殖を阻害すること

を含む、本発明1087の方法。

[本発明1104]

腫瘍細胞が白血病細胞である、本発明1103の方法。

[本発明1105]

腫瘍細胞が膀胱がん細胞、乳がん細胞、肺がん細胞、結腸がん細胞、前立腺がん細胞、肝臓がん細胞、膵臓がん細胞、胃がん細胞、精巣がん細胞、脳がん細胞、卵巣がん細胞、リンパがん細胞、皮膚がん細胞、脳がん細胞、骨がん細胞、または軟部組織がん細胞である、本発明1103の方法。

[本発明1106]

第2の薬物の薬学的有効量の投与、放射線療法、遺伝子治療、および手術からなる群より選択される処置をさらに含む、本発明1087の方法。

[本発明1107]

(1)腫瘍細胞を第2の薬物と接触させる前に腫瘍細胞を化合物と接触させる段階、(2)腫瘍細胞を化合物と接触させる前に腫瘍細胞を第2の薬物と接触させる段階、または(3)腫瘍細胞を化合物および第2の薬物と同時に接触させる段階をさらに含む、本発明1106の方法。

[本発明1108]

第2の薬物が抗生物質、抗炎症薬、抗新生物薬、抗増殖薬、抗ウイルス薬、免疫調節薬、または免疫抑制薬である、本発明1106の方法。

[本発明1109]

第2の薬物がアルキル化剤、アンドロゲン受容体モジュレーター、細胞骨格破壊剤、エストロゲン受容体モジュレーター、ヒストンデアセチラーゼ阻害剤、HMG-CoAレダクターゼ阻害剤、プレニルタンパク質トランスフェラーゼ阻害剤、レチノイド受容体モジュレーター、トポイソメラーゼ阻害剤、またはチロシンキナーゼ阻害剤である、本発明1106の方法。

[本発明1110]

第2の薬物が5-アザシチジン、5-フルオロウラシル、9-cis-レチノイン酸、アクチノマイシンD、アリトレチノイン、all-trans-レチノイン酸、アナマイシン(annamycin)、アキシチニブ、ベリノスタット(belinostat)、ベパシズマブ、ベキサロテン、ボスチニブ、ブスルファン、カベシタピン、カルボプラチン、カルムスチン、CD437、セジラニブ、セツキシマブ、クロラムブシル、シスプラチン、シクロホスファミド、シタラピン、ダカルバジン、ダサチニブ、ダウノルビシン、デシタピン、ドセタキセル、ドラスタチン-10、ドキシフルリジン、ドキシソルビシン、ドキシソルビシン、エビルピシン、エルロチニブ、エトポシド、エトポシド、ゲフィチニブ、ゲムシタピン、ゲムツズマブ、オゾガマイシン、ヘキサメチルメラミン、イダルビシン、イホスファミド、イマチニブ、イリノテカン、イソトレチノイン、イクサベピロン、ラパチニブ、LBH589、ロムスチン、メクロレタミン、メルファラン、メルカプトプリン、メトトレキセート、マイトマイシン、ミトキサントロン、MS-275、ネラチニブ、ニロチニブ、ニトロソウレア、オキサリプラチン、パクリタキセル、プリカマイシン、プロカルバジン、セマキサニブ(semaxanib)、セムスチン、酪酸ナトリウム、フェニル酢酸ナトリウム、ストレプトゾトシン、スベロイルアニリドヒドロキサム酸、スニチニブ、タモキシフェン、テニポシド、チオテパ(thiopeta)、チオグアニン、トボテカン、TRAIL、トラスツズマブ、トレチノイン、トリコスタチンA、バルプロ酸、バルビシン、バンデタニブ、ピンブラスチン、ピンクリスチン、ピンデシン、またはビノレルピンである、本発明1106の方法。

[本発明1111]

対象における炎症性成分をともなう疾患を処置または予防する方法であって、対象に本発明1007~1067のいずれかの化合物の薬学的有効量を投与する段階を含む、方法。

[本発明1112]

疾患が狼蒼または関節リウマチである、本発明1111の方法。

[本発明1113]

疾患が炎症性腸疾患である、本発明1111の方法。

[本発明1114]

炎症性腸疾患がクローン病または潰瘍性大腸炎である、本発明1113の方法。

[本発明1115]

炎症性成分をともなう疾患が心血管疾患である、本発明1111の方法。

[本発明1116]

炎症性成分をともなう疾患が糖尿病である、本発明1111の方法。

[本発明1117]

糖尿病が1型糖尿病である、本発明1116の方法。

[本発明1118]

糖尿病が2型糖尿病である、本発明1116の方法。

[本発明1119]

薬学的有効量が糖尿病に随伴する1つまたは複数の合併症も有効に処置する、本発明1116の方法。

[本発明1120]

合併症が肥満、高血圧、アテローム性動脈硬化症、冠動脈心疾患、脳卒中、末梢血管疾

患、高血圧、腎症、神経障害、筋壊死、網膜症およびメタボリックシンドローム(シンドロームX)からなる群より選択される、本発明1119の方法。

[本発明1121]

炎症性成分をともなう疾患がメタボリックシンドローム(シンドロームX)である、本発明1111の方法。

[本発明1122]

炎症性成分をともなう疾患が皮膚疾患である、本発明1111の方法。

[本発明1123]

投与が局所または経口である、本発明1122の方法。

[本発明1124]

皮膚疾患が乾癬、ざ瘡、またはアトピー性皮膚炎である、本発明1122の方法。

[本発明1125]

対象における心血管疾患を処置または予防する方法であって、対象に本発明1007~1067のいずれかの化合物の薬学的有効量を投与する段階を含む、方法。

[本発明1126]

心血管疾患がアテローム性動脈硬化症、心筋症、先天性心疾患、うっ血性心不全、心筋炎、リウマチ性心疾患、弁疾患、冠動脈疾患、心内膜炎、または心筋梗塞である、本発明1125の方法。

[本発明1127]

第2の薬物の薬学的有効量を投与する段階をさらに含む、本発明1125の方法。

[本発明1128]

第2の薬物がコレステロール低下薬、抗高脂血症薬、カルシウムチャネル遮断薬、降圧薬、またはHMG-CoAレダクターゼ阻害剤である、本発明1127の方法。

[本発明1129]

第2の薬物がアムロジピン、アスピリン、エゼチミブ、フェロジピン、ラシジピン、レルカニジピン、ニカルジピン、ニフェジピン、ニモジピン、ニソルジピンまたはニトレンジピンである、本発明1128の方法。

[本発明1130]

第2の薬物がアテノロール、ブシンドロール、カルベジロール、クロニジン、ドキサゾシン、インドラミン、ラベタロール、メチルドパ、メトプロロール、ナドロール、オクスプレノロール、フェノキシベンザミン、フェントラミン、ピンドロール、プラゾシン、プロプラノロール、テラゾシン、チモロールまたはトラゾリンである、本発明1128の方法。

[本発明1131]

第2の薬物がスタチンである、本発明1127の方法。

[本発明1132]

スタチンがアトルバスタチン、セリバスタチン、フルバスタチン、ロバスタチン、メバスタチン、ピタバスタチン、プラバスタチン、ロスバスタチンまたはシンバスタチンである、本発明1131の方法。

[本発明1133]

対象における神経変性疾患を処置または予防する方法であって、対象に本発明1007~1067のいずれかの化合物の薬学的有効量を投与する段階を含む、方法。

[本発明1134]

前記神経変性疾患がパーキンソン病、アルツハイマー病、多発性硬化症(MS)、ハンチントン病および筋萎縮性側索硬化症からなる群より選択される、本発明1133の方法。

[本発明1135]

前記神経変性疾患がアルツハイマー病である、本発明1134の方法。

[本発明1136]

前記神経変性疾患がMSである、本発明1134の方法。

[本発明1137]

MSが一次進行型、再発寛解型、二次進行型または進行再発型である、本発明1136の方法

。

[本発明1138]

処置が対象の脳または脊髄におけるニューロンの脱髄を抑制する、本発明1136の方法。

[本発明1139]

処置が炎症性脱髄を抑制する、本発明1138の方法。

[本発明1140]

処置が対象の脳または脊髄におけるニューロン軸索の切断を抑制する、本発明1136の方法。

[本発明1141]

処置が対象の脳または脊髄における神経突起の切断を抑制する、本発明1136の方法。

[本発明1142]

処置が対象の脳または脊髄におけるニューロンのアポトーシスを抑制する、本発明1136の方法。

[本発明1143]

処置が対象の脳または脊髄におけるニューロン軸索の再ミエリン化を刺激する、本発明1136の方法。

[本発明1144]

処置がMS発作後に損失した機能を回復させる、本発明1136の方法。

[本発明1145]

処置が新しいMS発作を予防する、本発明1136の方法。

[本発明1146]

処置がMS発作によって起こる能力障害を予防する、本発明1136の方法。

[本発明1147]

対象が霊長類である、本発明1136の方法。

[本発明1148]

霊長類がヒトである、本発明1147の方法。

[本発明1149]

対象におけるiNOS遺伝子の過剰発現によって特徴づけられる障害を処置または予防する方法であって、対象に本発明1007～1067のいずれかの化合物の薬学的有効量を投与する段階を含む、方法。

[本発明1150]

対象の細胞におけるIFN-誘導性一酸化窒素産生を阻害する方法であって、該対象に本発明1007～1067のいずれかの化合物の薬学的有効量を投与する段階を含む、方法。

[本発明1151]

対象におけるCOX-2遺伝子の過剰発現によって特徴づけられる障害を処置または予防する方法であって、対象に本発明1007～1067のいずれかの化合物の薬学的有効量を投与する段階を含む、方法。

[本発明1152]

対象における腎/腎臓疾患(RKD)を処置する方法であって、対象に本発明1007～1067のいずれかの化合物の薬学的有効量を投与する段階を含む、方法。

[本発明1153]

RKDが毒性傷害に起因する、本発明1152の方法。

[本発明1154]

毒性傷害が造影剤または薬物に起因する、本発明1153の方法。

[本発明1155]

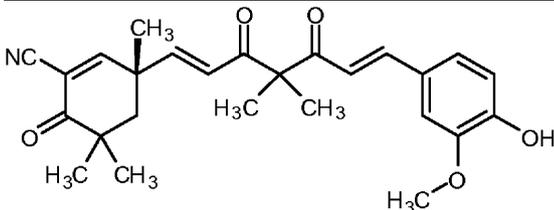
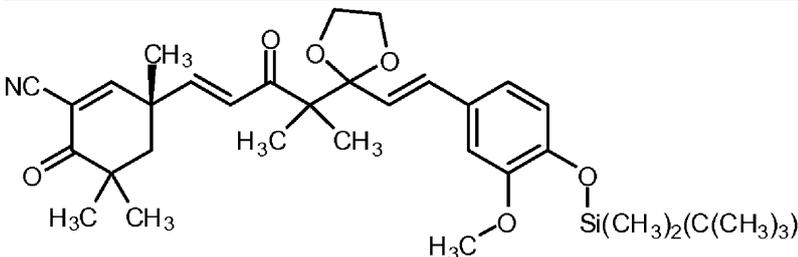
薬物が化学療法薬である、本発明1154の方法。

[本発明1156]

RKDが虚血/再灌流傷害に起因する、本発明1152の方法。

[本発明1157]

RKDが糖尿病または高血圧に起因する、本発明1152の方法。

[本発明1158]RKDが自己免疫疾患に起因する、本発明1152の方法。[本発明1159]RKDが慢性RKDである、本発明1152の方法。[本発明1160]RKDが急性RKDである、本発明1152の方法。[本発明1161]対象が透析を受けたことがあるか、または受けている、本発明1152の方法。[本発明1162]対象が腎臓移植を受けたか、または受ける候補である、本発明1152の方法。[本発明1163]対象が霊長類である、本発明1152の方法。[本発明1164]霊長類がヒトである、本発明1163の方法。[本発明1165]対象がウシ、ウマ、イヌ、ネコ、ブタ、マウス、ラットまたはモルモットである、本発明1152の方法。[本発明1166]対象における糸球体濾過率またはクレアチニンクリアランスを改善する方法であって、対象に本発明1007～1067のいずれかの化合物の薬学的有効量を投与する段階を含む、方法。[本発明1167]下記のとおりである第1の化合物を製造する方法であって：下記の式の化合物を酸と反応させる段階を含む、方法：[本発明1168]本発明1007～1067のいずれかの化合物；ならびに化合物を投与すべき疾患状態、化合物の保存情報、投薬情報、および化合物をいかに投与するかについての説明を示すものからなる群より選択される1つまたは複数の形の情報を含む説明書を含むキット。[本発明1169]化合物を複数回用量の形で含む、本発明1168のキット。[本発明1170]本発明1007～1067のいずれかの化合物；および包装材料を含む製造品。

[本発明1171]

包装材料が化合物を収容するための容器を含む、本発明1170の製造品。

[本発明1172]

容器が、化合物を投与すべき疾患状態、保存情報、投薬情報、および/または化合物をいかに投与するかについての説明からなる群の1つまたは複数のメンバーを示すラベルを含む、本発明1171の製造品。

[本発明1173]

化合物を複数回用量の形で含む、本発明1170の製造品。