

【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1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-505595(P2005-505595A)

【公表日】平成17年2月24日(2005.2.24)

【年通号数】公開・登録公報2005-008

【出願番号】特願2003-534423(P2003-534423)

【国際特許分類】

C 07 D 207/456 (2006.01)
A 61 K 31/337 (2006.01)
A 61 K 31/4015 (2006.01)
A 61 K 31/402 (2006.01)
A 61 K 31/4025 (2006.01)
A 61 K 31/4155 (2006.01)
A 61 K 31/4192 (2006.01)
A 61 K 31/4439 (2006.01)
A 61 K 31/454 (2006.01)
A 61 K 31/496 (2006.01)
A 61 K 31/506 (2006.01)
A 61 K 31/5377 (2006.01)
A 61 K 31/56 (2006.01)
A 61 K 39/395 (2006.01)
A 61 K 45/00 (2006.01)
A 61 P 1/02 (2006.01)
A 61 P 1/04 (2006.01)
A 61 P 1/16 (2006.01)
A 61 P 1/18 (2006.01)
A 61 P 3/10 (2006.01)
A 61 P 7/02 (2006.01)
A 61 P 9/00 (2006.01)
A 61 P 9/10 (2006.01)
A 61 P 9/12 (2006.01)
A 61 P 11/00 (2006.01)
A 61 P 11/06 (2006.01)
A 61 P 11/08 (2006.01)
A 61 P 11/10 (2006.01)
A 61 P 13/12 (2006.01)
A 61 P 17/02 (2006.01)
A 61 P 17/06 (2006.01)
A 61 P 19/02 (2006.01)
A 61 P 19/06 (2006.01)
A 61 P 19/10 (2006.01)
A 61 P 21/00 (2006.01)
A 61 P 25/00 (2006.01)
A 61 P 25/28 (2006.01)
A 61 P 27/02 (2006.01)
A 61 P 31/04 (2006.01)
A 61 P 31/18 (2006.01)
A 61 P 31/20 (2006.01)

| | | |
|----------------|---------------|------------------|
| A 6 1 P | 31/22 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 35/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 37/06 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 37/08 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 43/00 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 401/12 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 403/12 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 405/12 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 409/12 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 409/14 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 38/22 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 38/21 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 38/00 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 38/55 | (2006.01) |

【 F I 】

| | |
|---------|---------|
| C 0 7 D | 207/456 |
| A 6 1 K | 31/337 |
| A 6 1 K | 31/4015 |
| A 6 1 K | 31/402 |
| A 6 1 K | 31/4025 |
| A 6 1 K | 31/4155 |
| A 6 1 K | 31/4192 |
| A 6 1 K | 31/4439 |
| A 6 1 K | 31/454 |
| A 6 1 K | 31/496 |
| A 6 1 K | 31/506 |
| A 6 1 K | 31/5377 |
| A 6 1 K | 31/56 |
| A 6 1 K | 39/395 |
| A 6 1 K | 45/00 |
| A 6 1 P | 1/02 |
| A 6 1 P | 1/04 |
| A 6 1 P | 1/16 |
| A 6 1 P | 1/18 |
| A 6 1 P | 3/10 |
| A 6 1 P | 7/02 |
| A 6 1 P | 9/00 |
| A 6 1 P | 9/10 |
| A 6 1 P | 9/12 |
| A 6 1 P | 11/00 |
| A 6 1 P | 11/06 |
| A 6 1 P | 11/08 |
| A 6 1 P | 11/10 |
| 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 | 19/06 |
| A 6 1 P | 19/10 |
| A 6 1 P | 21/00 |

E

A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 31/04
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 31/20
 A 6 1 P 31/22
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 37/08
 A 6 1 P 43/00 1 2 1
 C 0 7 D 401/12
 C 0 7 D 403/12
 C 0 7 D 405/12
 C 0 7 D 409/12
 C 0 7 D 409/14
 A 6 1 K 37/24
 A 6 1 K 37/66 G
 A 6 1 K 37/02
 A 6 1 K 37/64
 C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成17年10月7日(2005.10.7)

【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

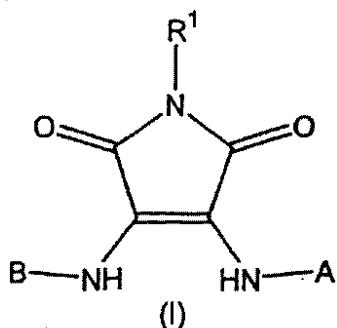
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物：

【化1】



またはその薬学的に許容できる塩または溶媒和物であり、ここで；

R¹は、下記からなる群：

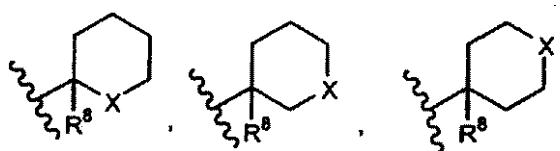
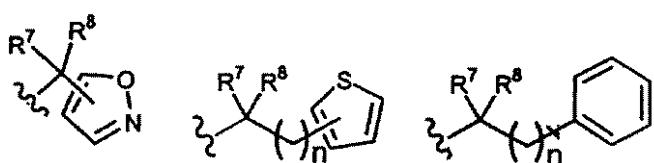
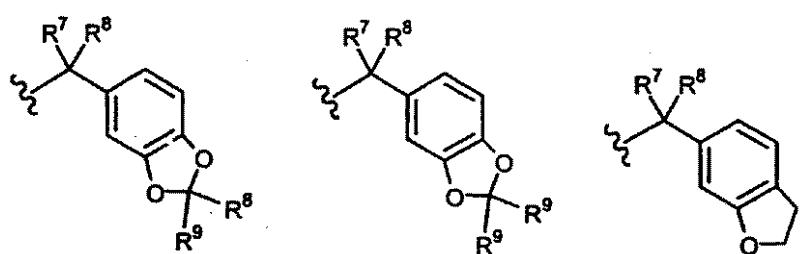
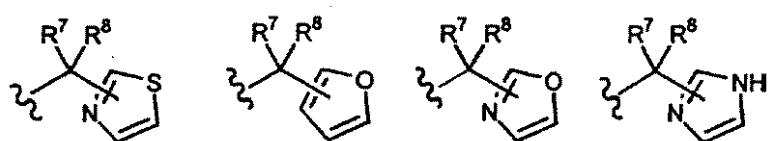
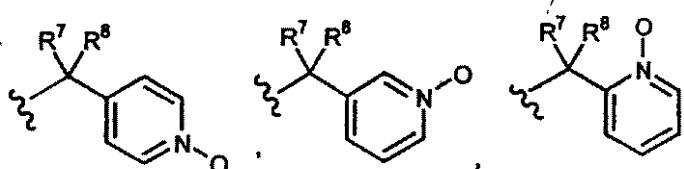
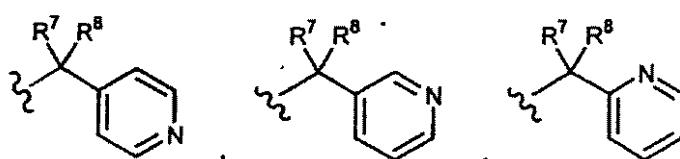
- a) H
- b) ハロゲン
- c) C F₃
- d) C O R¹ ³
- e) O H
- f) N R¹ ³ R¹ ⁴

- g) N O₂
- h) シアノ
- i) - S i (アルキル)
- j) - S i (アリール)
- k) S O₂ O R¹ R³
- l) C O₂ R¹ R³
- m) C O N R¹ R³ R¹ R⁴
- n) S O₂ N R¹ R³ R¹ R⁴
- o) S O₂ R¹ R³
- p) - O R¹ R³
- r) - N R¹ R³ R¹ R⁴
- s) - O (C = O) R¹ R³
- t) - O (C = O) N R¹ R³ R¹ R⁴
- u) - N R¹ R³ C O R¹ R⁴ および
- v) - N R¹ R³ C O₂ R¹ R⁴

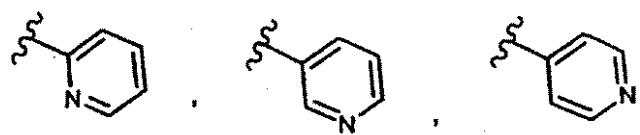
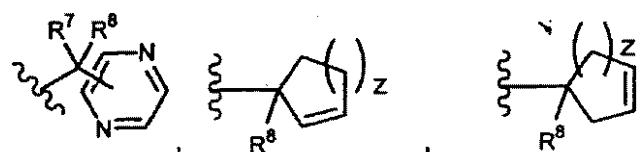
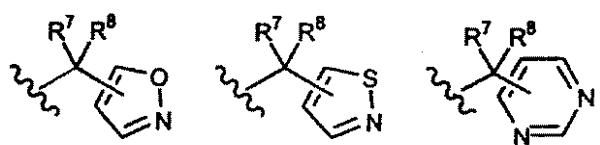
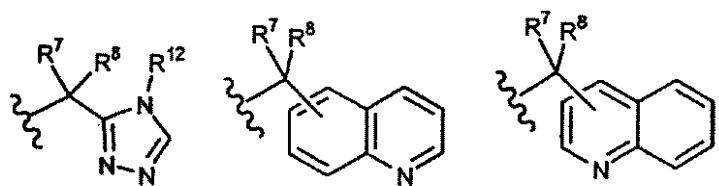
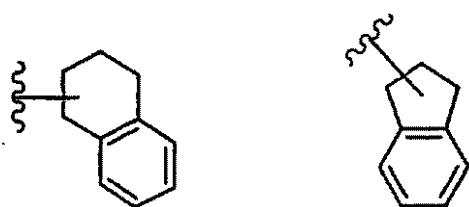
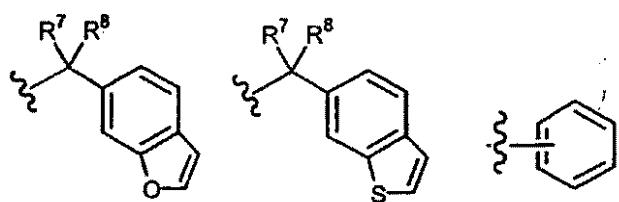
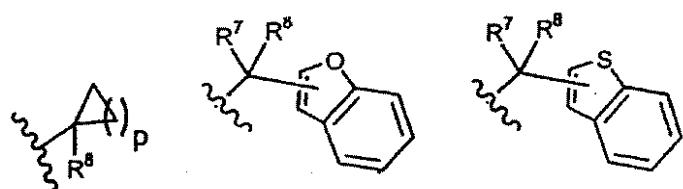
から選択された 1 個以上の置換基で適宜置換された H、アリール、ヘテロアリール、アルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、およびヘテロシクロアルキルアルキルから選択され： A は、

【化2】

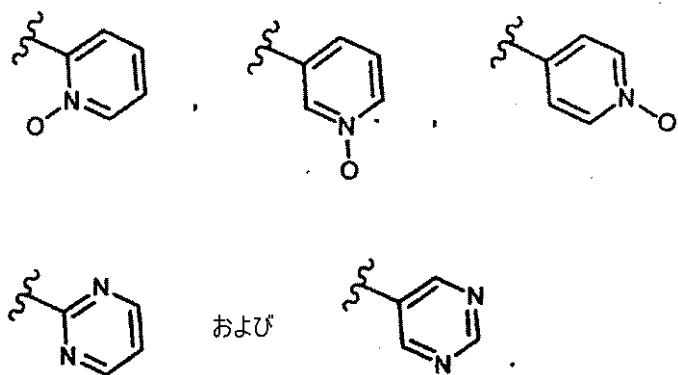
(1)



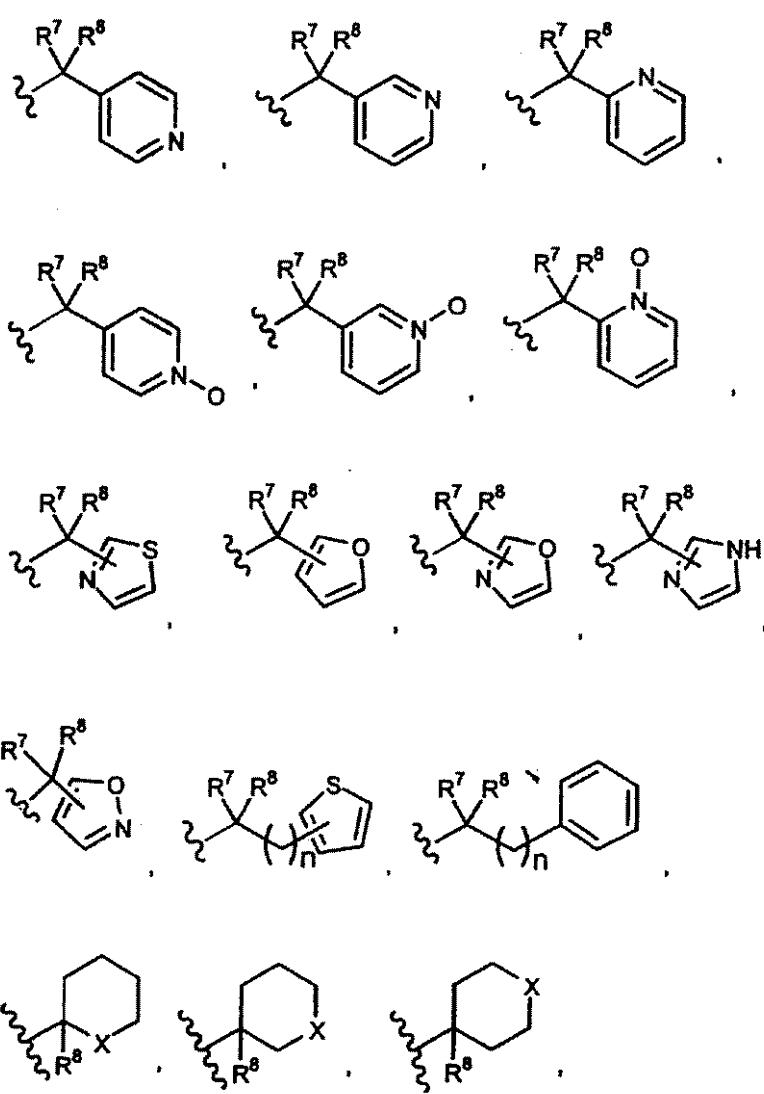
【化3】



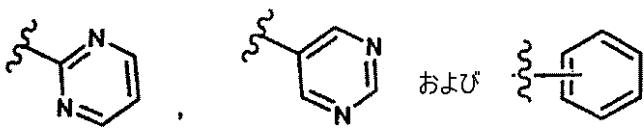
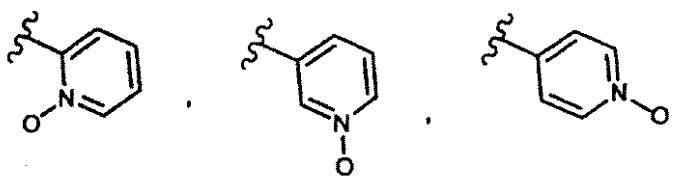
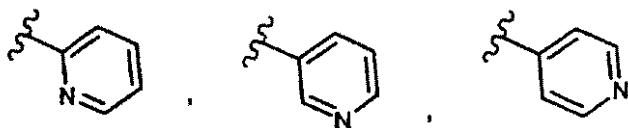
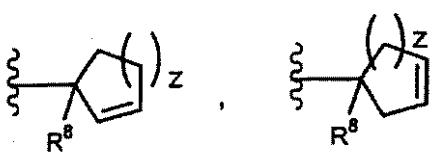
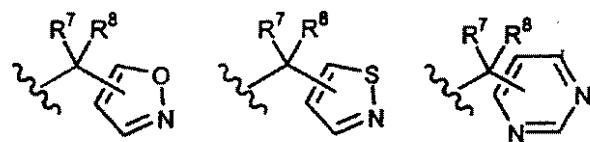
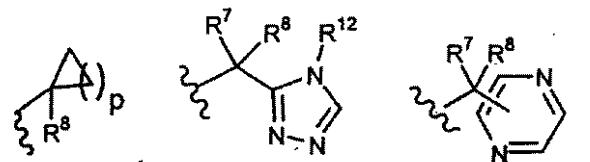
【化4】



(2)



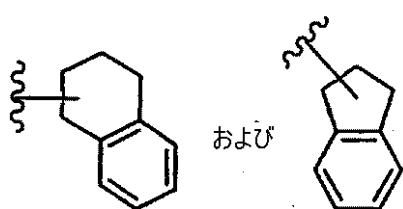
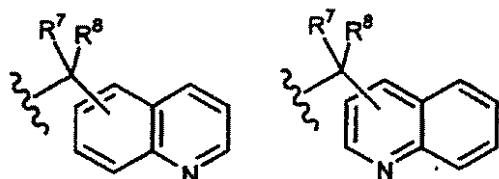
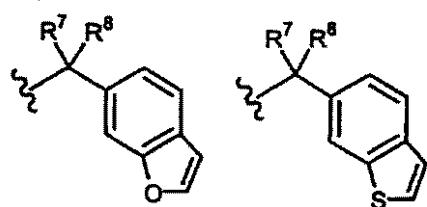
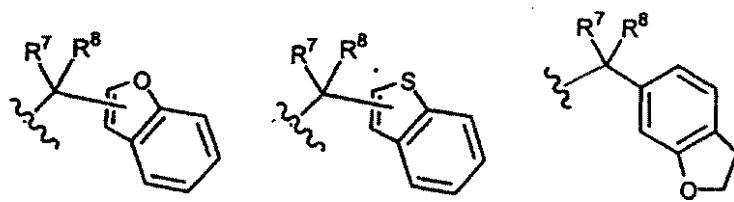
【化5】



からなる群より選択され、
ここで、上記A基の上記環は、R⁹基；

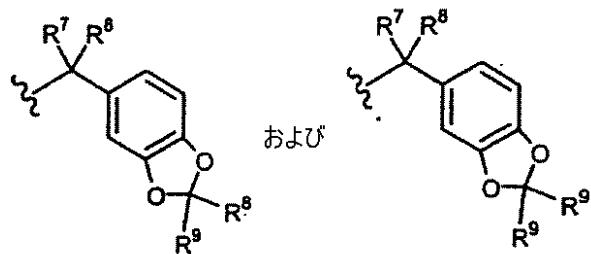
【化6】

(3)

(式中、上記A基の上記環の1個または両者は、R⁹基；

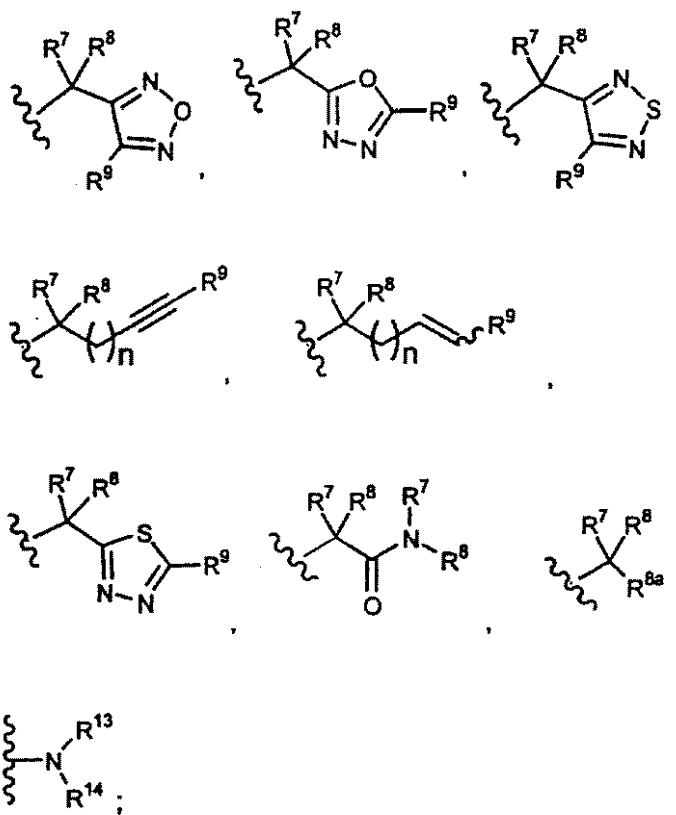
【化7】

(4)

(式中、上記A基の上記フェニル環は、R⁹基；および

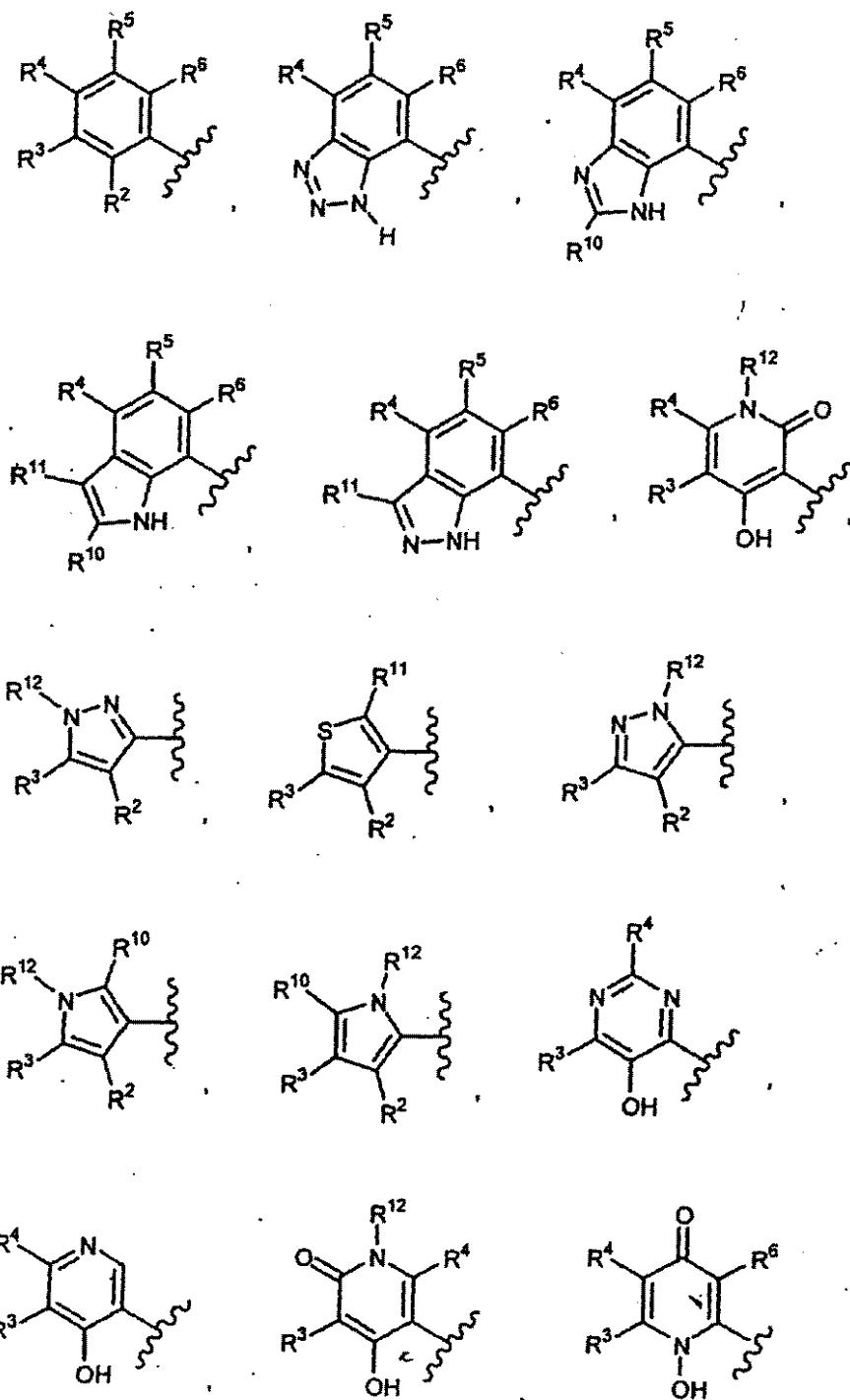
【化8】

(5)

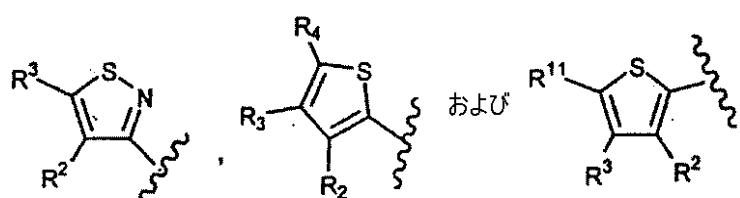


からなる群より各々独立して選択された1個乃至3個の置換基によって置換されている)
 からなる群より各々独立して選択された1個乃至6個の置換基によって置換されている)
 からなる群より各々独立して選択された1個乃至6個の置換基によって置換されており；
 Bは、

【化 9】



【化 10】



からなる群より選択され、

ここで、n は 0 乃至 6 であり；

p は 1 乃至 5 であり；

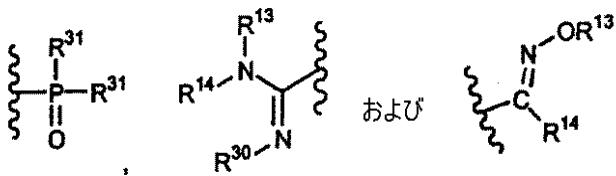
X は O、NH または S であり；

Z は 1 乃至 3 であり；

R² は、水素、OH、-C(O)OH、-SH、-SO₂NR¹³R¹⁴、-NHC(O)R¹³、-NH₂SO₂NR¹³R¹⁴、-NH₂SO₂R¹³、-NR¹³R¹⁴、-C(O)NR¹³R¹⁴、-C(O)NHO₂R¹³、-C(O)NR¹³OH、-S(O₂)OH、-OC(O)R¹³、無置換複素環酸性官能基、および置換複素環酸性官能基からなる群より選択され；ここで、上記置換複素環酸性官能基上には 1 個乃至 6 個の置換基があり、各置換基は、R⁹ 基からなる群より独立して選択され；

各 R³ および R⁴ は、水素、シアノ、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、-OH、-CF₃、-OCF₃、-NO₂、-C(O)R¹³、-C(O)OR¹³、-C(O)NH₂R¹⁷、-C(O)NR¹³R¹⁴、-SO_(t)NR¹³R¹⁴、-SO_(t)R¹³、-C(O)NR¹³OR¹⁴、無置換または置換アリール、無置換または置換ヘテロアリール、

【化 11】



からなる群より独立して選択され、

ここで、前記置換アリール基上には 1 個乃至 6 個の置換基があり各置換基は独立して、R⁹ 基からなる群より選択され；およびここで、上記置換ヘテロアリール基上には 1 個乃至 6 個の置換基があり、各置換基は R⁹ 基からなる群より選択され；

各 R⁵ および R⁶ は同一または異なり、水素、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、-CF₃、-OCF₃、-NO₂、-C(O)R¹³、-C(O)OR¹³、-C(O)NR¹³R¹⁴、-SO_(t)NR¹³R¹⁴、-C(O)NR¹³OR¹⁴、シアノ、無置換または置換アリール基、および無置換または置換ヘテロアリール基からなる群より独立して選択され；

ここで、前記置換アリール基上には 1 個乃至 6 個の置換基があり各置換基は独立して、R⁹ 基からなる群より選択され；およびここで、上記置換ヘテロアリール基上には 1 個乃至 6 個の置換基があり、各置換基は R⁹ 基からなる群より選択され；

各 R⁷ および R⁸ は、H、無置換または置換アルキル、無置換または置換アリール、無置換または置換ヘテロアリール、無置換または置換アリールアルキル、無置換または置換ヘテロアリールアルキル、無置換または置換シクロアルキル、-CO₂R¹³、-CONR¹³R¹⁴、アルキニル、アルケニルおよびシクロアルケニルからなる群より独立して選択され；そしてここで、前記置換 R⁷ および R⁸ 基上には 1 個以上の置換基があり、各置換基は独立して、

- a) ハロゲン
- b) -CF₃
- c) -COR¹³
- d) -OR¹³
- e) -NR¹³R¹⁴
- f) -NO₂
- g) -CN
- h) -SO₂OR¹³
- i) -Si(アルキル)₃、ここで、各アルキルは独立して選択される、
- j) -Si(アリール)₃、ここで、各アルキルは独立して選択される、
- k) -(R¹³)₂R¹⁴Si、ここで各 R¹³ は、独立して選択される、
- l) -CO₂R¹³、

- m) - C (O) N R¹ R³ R¹ R⁴
 n) - S O₂ N R¹ R³ R¹ R⁴
 o) - S O₂ R¹ R³
 p) - O C (O) R¹ R³
 q) - O C (O) N R¹ R³ R¹ R⁴
 r) - N R¹ R³ C (O) R¹ R⁴ および
 s) - N R¹ R³ C O₂ R¹ R⁴

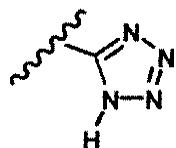
(フルオロアルキルは、ハロゲンで置換されたアルキル基の1個の非限定的例である)
からなる群より選択され；

R⁸ は、水素、アルキル、シクロアルキルおよびシクロアルキルアルキルからなる群
から選択され；

各R⁹ は、

- a) - R¹ R³
 b) ハロゲン
 c) - C F₃
 d) - C O R¹ R³
 e) - O R¹ R³
 f) - N R¹ R³ R¹ R⁴
 g) - N O₂
 h) - C N
 i) - S O₂ R¹ R³
 j) - S O₂ N R¹ R³ R¹ R⁴
 k) - N R¹ R³ C O R¹ R⁴
 l) - C O N R¹ R³ R¹ R⁴
 m) - N R¹ R³ C O₂ R¹ R⁴
 n) - C O₂ R¹ R³
 o)

【化12】



- p) 1個以上の-OH基によって置換されたアルキル、
 q) 1個以上の-NR¹ R³ R¹ R⁴基によって置換されたアルキル、および
 r) - N (R¹ R³) S O₂ R¹ R⁴

からなる群より独立して選択され；

各R¹ およびR¹ は、R¹ R³ 、ハロゲン、- C F₃ 、- O C F₃ 、- N R¹ R³ R¹
 R⁴ 、- N R¹ R³ C (O) N R¹ R³ R¹ R⁴ 、- OH 、- C (O) O R¹ R³ 、- SH 、- S O₂
 R¹ R³ R¹ R⁴ 、- S O₂ R¹ R³ 、- N H C (O) R¹ R³ 、- N H S O₂ N R¹ R³
 R¹ R⁴ 、- N H S O₂ R¹ R³ 、- C (O) N R¹ R³ R¹ R⁴ 、- C (O) N R¹ R³ O R¹ R⁴
 、- O C (O) R¹ R³ およびシアノからなる群より独立して選択され；

R¹ は、水素、- C (O) O R¹ R³ 、無置換または置換アリール、無置換または置換
 ヘテロアリール、無置換または置換アリールアルキル、無置換または置換シクロアルキル
 、無置換または置換アルキル、無置換または置換シクロアルキルアルキル、および無置換
 または置換ヘテロアリールアルキル基からなる群より選択され；ここで、置換基R¹ 上
 には1個乃至6個の置換基があり、各置換基は、独立してR⁹ 基からなる群より選択され
 ；

各R¹ R³ およびR¹ R⁴ は、H、無置換または置換アルキル、無置換または置換アリール
 、無置換または置換ヘテロアリール、無置換または置換アリールアルキル、無置換または

置換ヘテロアリールアルキル、無置換または置換シクロアルキル、無置換または置換シクロアルキルアルキル、無置換または置換複素環、無置換または置換フルオロアルキル、および無置換または置換ヘテロシクロアルキルアルキル（ここで、「ヘテロシクロアルキル」とは、複素環を意味する）からなる群より独立して選択され；ここで、前記置換R^{1~3}基およびR^{1~4}基上には1個乃至6個の置換基があり、各置換基は、アルキル、-CF₃、-OH、アルコキシ、アリール、アリールアルキル、フルオロアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、-N(R^{4~0})₂、-C(O)OR^{1~5}、-C(O)NR^{1~5}R^{1~6}、-S(O)_tNR^{1~5}R^{1~6}、-C(O)R^{1~5}、-SO₂R^{1~5}からなる群より独立して選択され、ただし、R^{1~5}は、H、ハロゲンおよび-NHC(O)NR^{1~5}R^{1~6}ではない；または、

R^{1~3}およびR^{1~4}はそれらが-C(O)NR^{1~3}R^{1~4}基および-SO₂NR^{1~3}R^{1~4}基において結合している窒素とともに、無置換または置換飽和複素環（好ましくは、3員乃至7員の複素環）を形成し、前記環は適宜、O、SおよびNR^{1~8}からなる群より選択された1個のさらなるヘテロ原子を含み；ここで、置換された環化R^{1~3}およびR^{1~4}基上に1個乃至3個の置換基があり各置換基は、アルキル、アリール、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アリールアルキル、フルオロアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アミノ、-C(O)OR^{1~5}、-C(O)NR^{1~5}R^{1~6}、-SO_tNR^{1~5}R^{1~6}、-C(O)R^{1~5}、-SO₂R^{1~5}からなる群より独立して選択され、ただし、R^{1~5}は、H、-NHC(O)NR^{1~5}R^{1~6}、-NHC(O)OR^{1~5}、ハロゲン、およびヘテロシクロアルケニル基ではない；

各R^{1~5}およびR^{1~6}は、H、アルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキルおよびヘテロアリールからなる群より独立して選択され；

R^{1~7}は、-SO₂アルキル、-SO₂アリール、-SO₂シクロアルキル、および-SO₂ヘテロアリールからなる群より選択され；

R^{1~8}は、H、アルキル、アリール、ヘテロアリール、-C(O)R^{1~9}、-SO₂R^{1~9}および-C(O)NR^{1~9}R^{2~0}からなる群より選択され；

各R^{1~9}およびR^{2~0}は、アルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群より独立して選択され；

R^{3~0}は、アルキル、シクロアルキル、-CN、-NO₂または-SO₂R^{1~5}からなる群より選択され、ただしR^{1~5}はHでなく；

各R^{3~1}は、無置換アルキル、無置換または置換アリール、無置換または置換ヘテロアリールおよび無置換または置換シクロアルキルからなる群より独立して選択され；ここで、上記置換R^{3~1}基上には、1個乃至6個の置換基があり、各置換基は、アルキル、ハロゲンおよび-CF₃からなる群より独立して選択され；

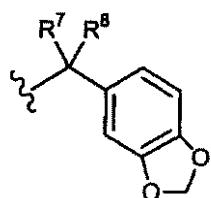
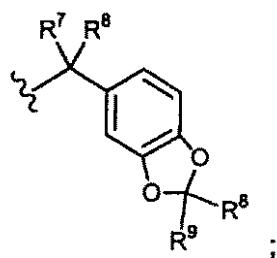
各R^{4~0}は、H、アルキルおよびシクロアルキルからなる群より独立して選択され；および

tは、0、1または2である、化合物。

【請求項2】

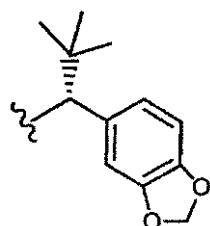
Aが下記：

【化13】



または

【化14】

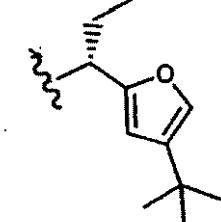
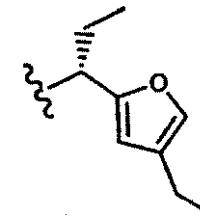
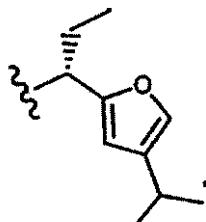
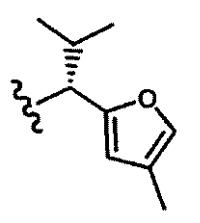
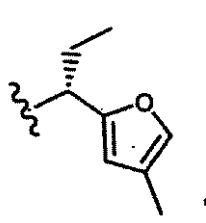
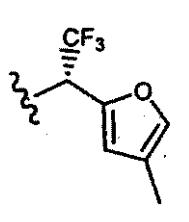
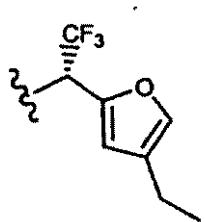
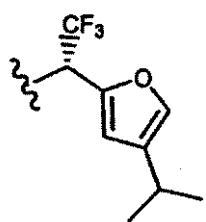


より選択され、ここで R⁷ が H であり、R⁸ がアルキルである、請求項 1 記載の化合物。

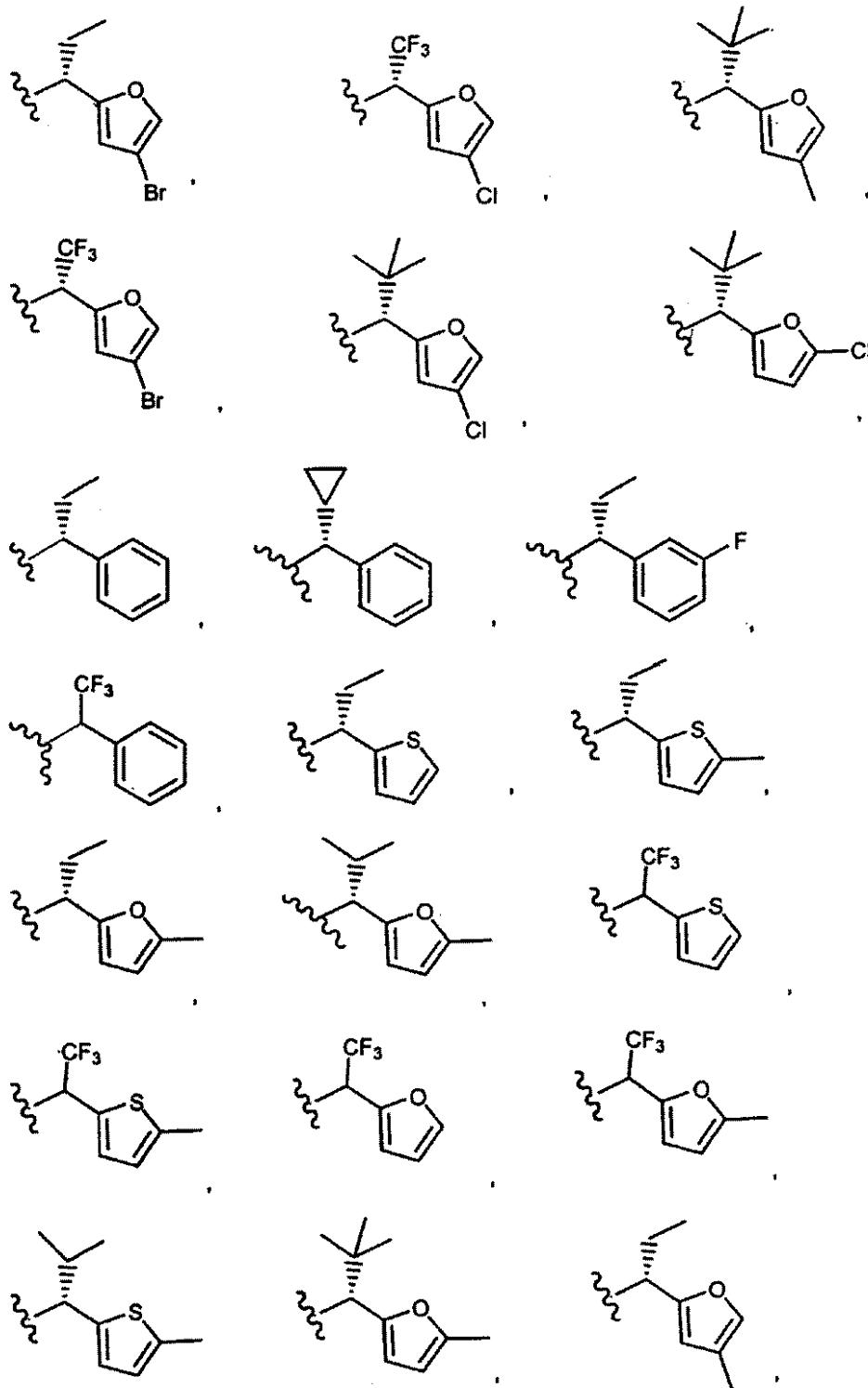
【請求項 3】

A が下記：

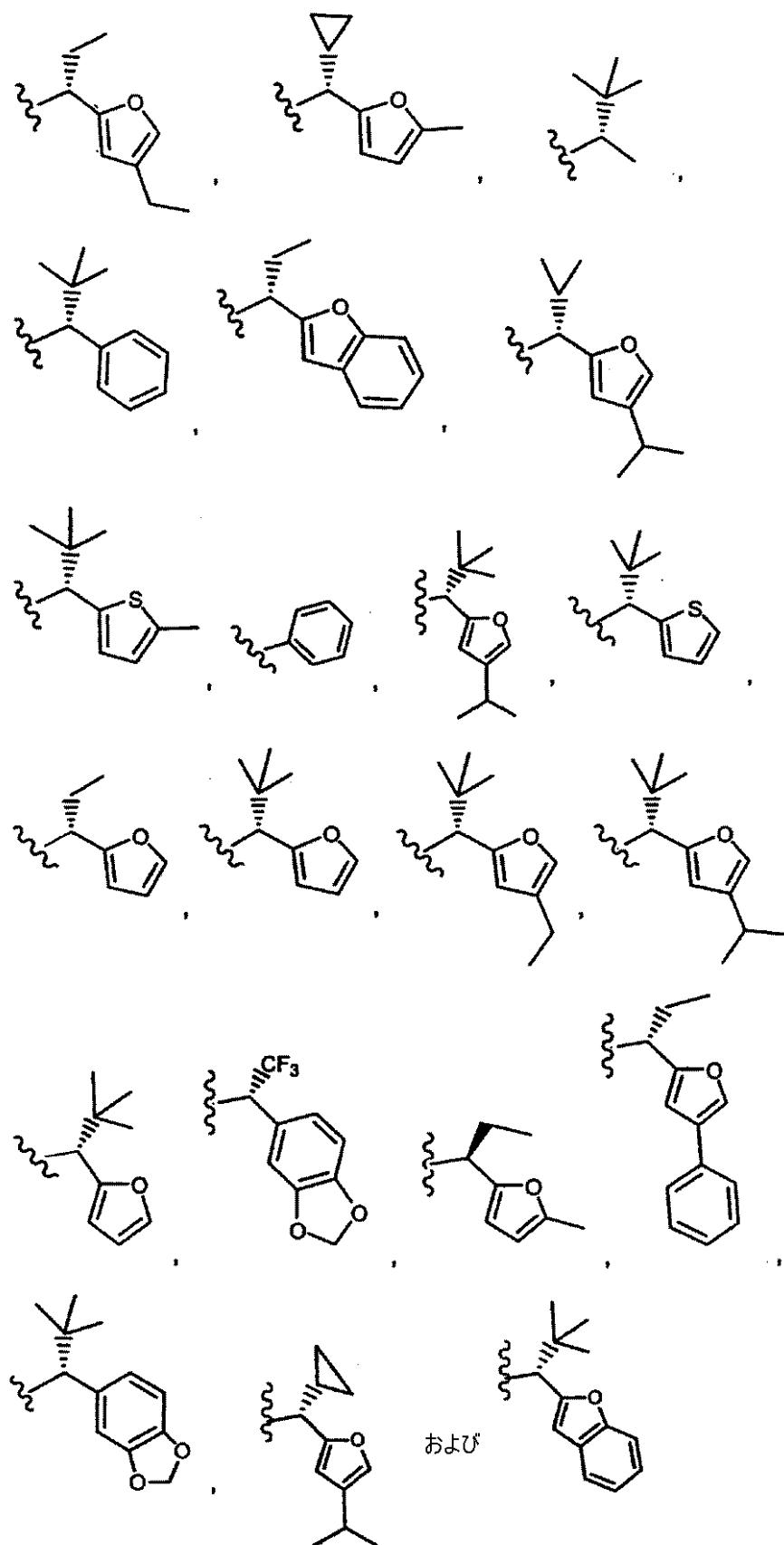
【化15】



【化16】



【化17】

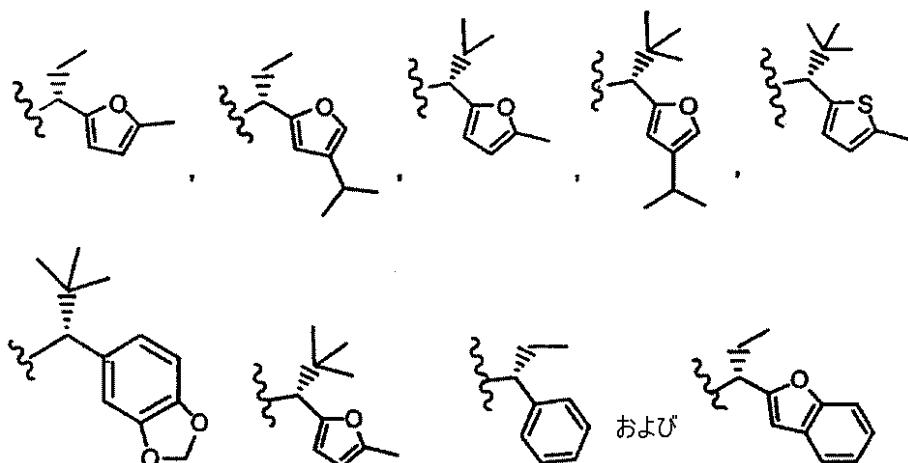


からなる群より選択される請求項1記載の化合物。

【請求項4】

Aが下記：

【化18】

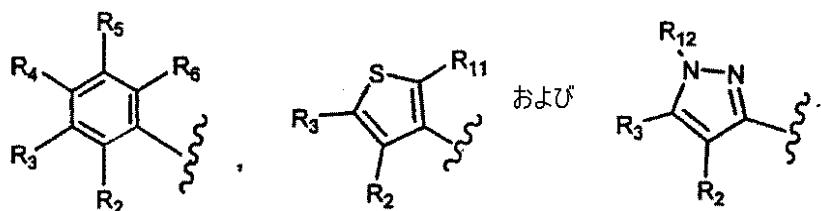


からなる群より選択される請求項1記載の化合物。

【請求項5】

Bが下記：

【化19】

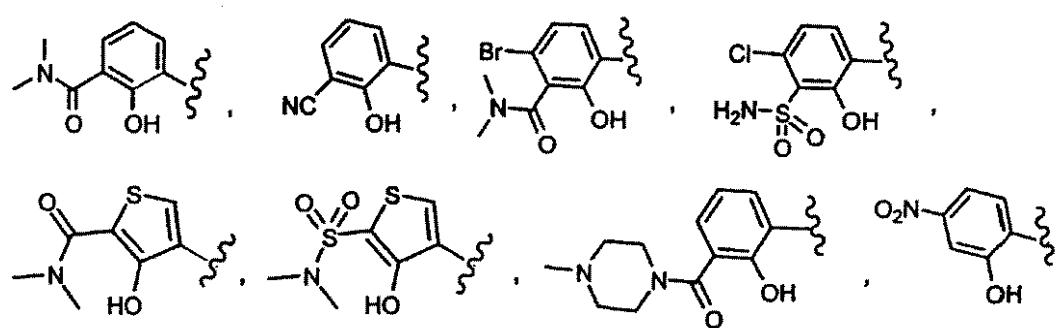


からなる群より選択される請求項1記載の化合物。

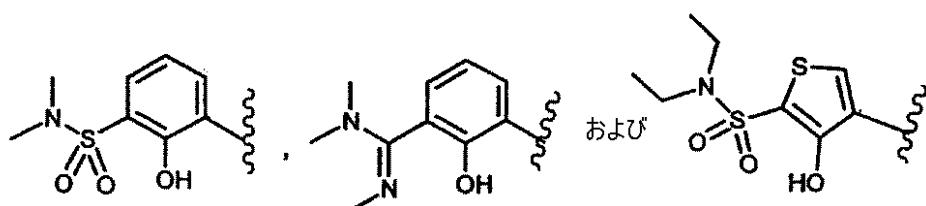
【請求項6】

Bが下記：

【化20】



【化21】

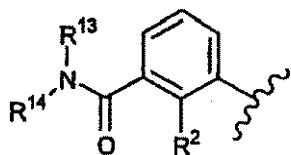
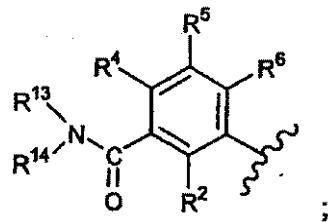


からなる群より選択される請求項1記載の化合物。

【請求項7】

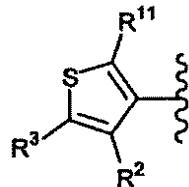
Bが下記：

【化22】



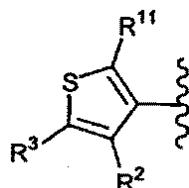
ここで R^2 は、-OH であり、 R^{13} および R^{14} は、独立して H およびアルキルからなる群より選択され；

【化23】



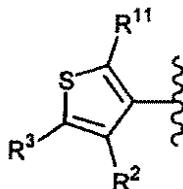
ここで R^{11} は、H であり；

【化24】



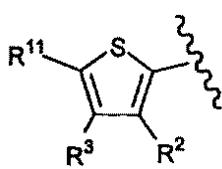
ここで R^2 は、-OH であり、 R^3 は $-C(O)NR^{13}R^{14}$ であり、そして R^{11} は H であり；

【化25】



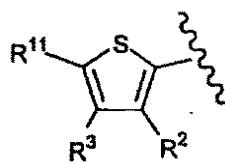
ここで R^2 は、-OH であり、 R^3 は $-S(O)NR^{13}R^{14}$ であり、そして R^{11} は H であり；

【化26】



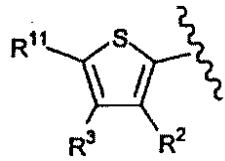
ここで R^{11} は、H であり；

【化27】



ここで R^2 は、-OH であり、 R^3 は $-C(O)NR^{1-3}R^{1-4}$ であり、そして R^{1-1} は H であり；または

【化28】



ここで R^2 は、-OH であり、 R^3 は $-S(O)_2NR^{1-3}R^{1-4}$ であり、そして R^{1-1} は H である；

から選択される請求項1記載の化合物。

【請求項8】

R^1 が、H、アルキル、アリールもしくはシクロアルキルから選択されるか；または R^1 が、H、メチル、フェニルもしくはシクロヘキシルから選択される請求項1記載の化合物。

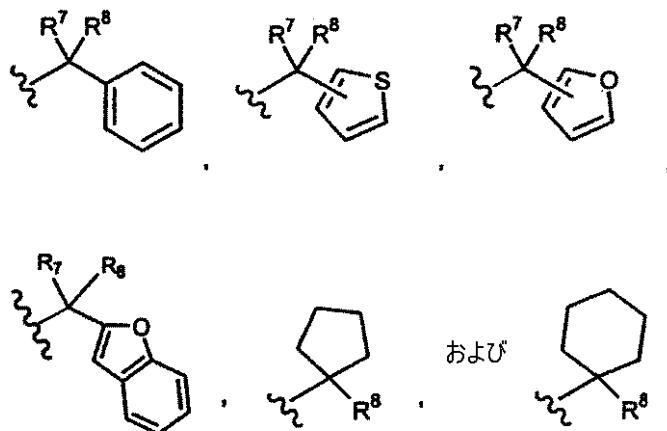
【請求項9】

請求項1記載の化合物であって、ここで、

(1) 式I中置換基Aは、下記からなる群より選択され：

【化29】

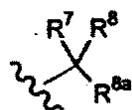
(a)



ここで、上記環は無置換であるか、または上記環が、H、F、Cl、Br、アルキル、シクロアルキルおよび $-CF_3$ からなる群より独立して選択された1個乃至3個の置換基によって置換されており； R^7 は、H、 $-CF_3$ 、 $-CF_2CH_3$ 、メチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピルおよび t -ブチルからなる群より選択され；および R^8 はHであり；および

【化30】

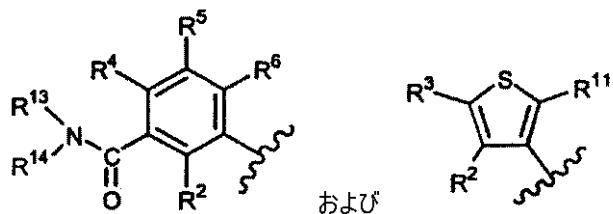
(b)



式中、R⁷は、H、-CF₃、-CF₂CH₃、メチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピル、およびt-ブチルからなる群より選択され；およびR⁸はHであり；およびR^{8a}は、式Iについて定義されたとおりであり；および

(2)式I中の置換基Bが下記からなる群より選択され：

【化31】



式中、

R²はH、OH、-NHCO(O)R¹⁻³および-NHSO₂R¹⁻³からなる群より選択され；

R³は、-C(O)NR¹⁻³R¹⁻⁴、-SO₂NR¹⁻³R¹⁻⁴、-NO₂、シアノ、-SO₂R¹⁻³；および-C(O)OR¹⁻³からなる群より選択され；

R⁴は、H、-NO₂、シアノ、-CH₃または-CF₃からなる群より選択され；

R⁵は、H、-CF₃、-NO₂、ハロゲンおよびシアノからなる群より選択され；そして

R⁶は、H、アルキルおよび-CF₃からなる群より選択され；

R¹⁻¹は、H、ハロゲンおよびアルキルからなる群より選択され；そして

各R¹⁻³およびR¹⁻⁴は、独立して、H、メチル、エチルおよびイソプロピルからなる群より選択され；

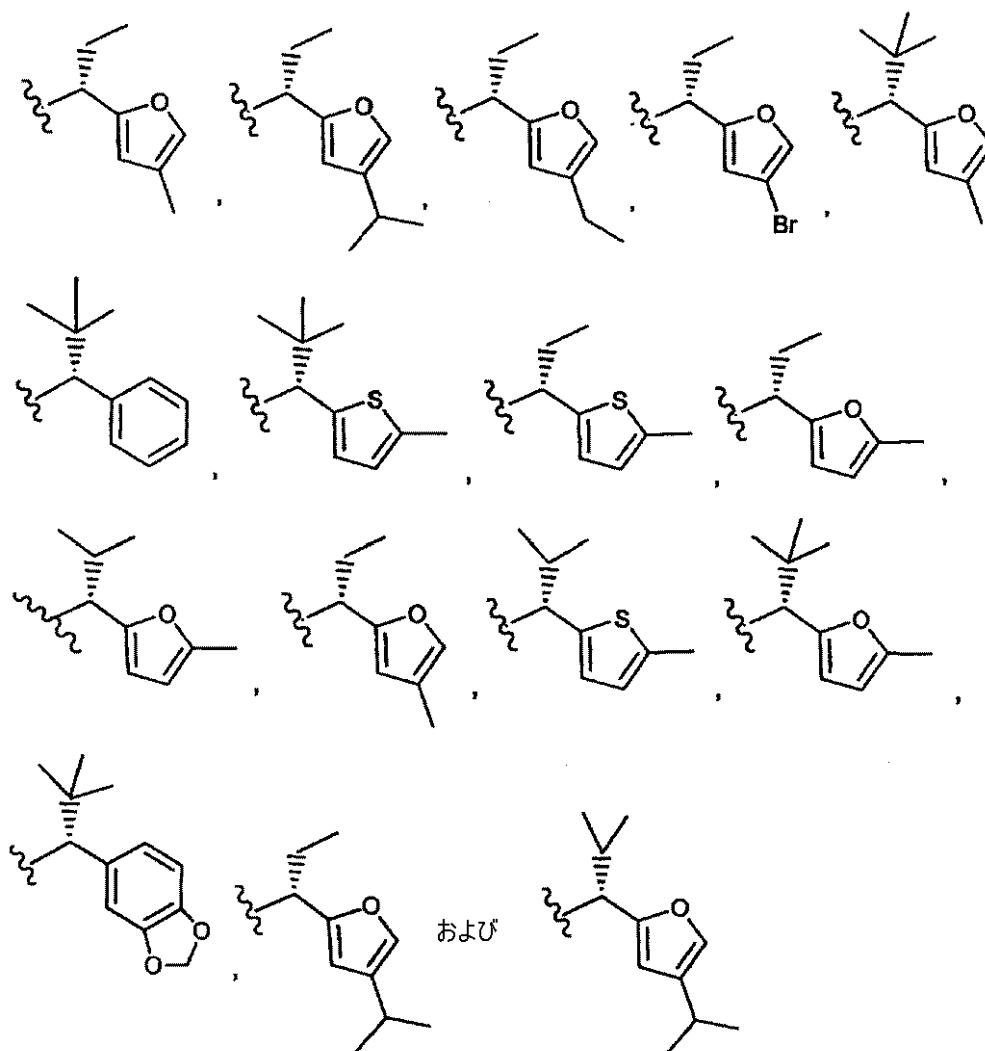
R¹⁻³およびR¹⁻⁴はそれらが基-NR¹⁻³R¹⁻⁴、-C(O)NR¹⁻³R¹⁻⁴、-S O₂NR¹⁻³R¹⁻⁴、-OC(O)NR¹⁻³R¹⁻⁴、-CONR¹⁻³R¹⁻⁴、-NR¹⁻³C(O)NR¹⁻³R¹⁻⁴、-SO₂NR¹⁻³R¹⁻⁴、-NHSO₂NR¹⁻³R¹⁻⁴中で結合している窒素とともに無置換または置換された飽和複素環（好ましくは3員乃至7員環）を形成し、前記環は適宜、O、SまたはNR¹⁻⁸から選択された1個のさらなるヘテロ原子を有し、ここで、R¹⁻⁸は、H、アルキル、アリール、ヘテロアリール、-C(O)R¹⁻⁹、-SO₂R¹⁻⁹および-C(O)NR¹⁻⁹R²⁻⁰から選択され、ここで、各R¹⁻⁹およびR²⁻⁰は、アルキル、アリールおよびヘテロアリールから独立して選択され；ここで、前記置換された環化R¹⁻³およびR¹⁻⁴基上に1個乃至3個の置換基があり、各置換基は、アルキル、アリール、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アリールアルキル、フルオロアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アミノ、-C(O)OR¹⁻⁵、-C(O)NR¹⁻⁵R¹⁻⁶、-SO₂NR¹⁻⁵R¹⁻⁶、-C(O)R¹⁻⁵、-SO₂R¹⁻⁵からなる群より独立して選択され、ただしここで、R¹⁻⁵は、H、-NHCO(O)NR¹⁻⁵R¹⁻⁶およびハロゲンではなく、およびここで各R¹⁻⁵およびR¹⁻⁶は、H、アルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキルおよびヘテロアリールからなる群より独立して選択される、化合物。

【請求項10】

請求項1記載の化合物であって、ここで：

(1)式Iの置換基Aは、以下：

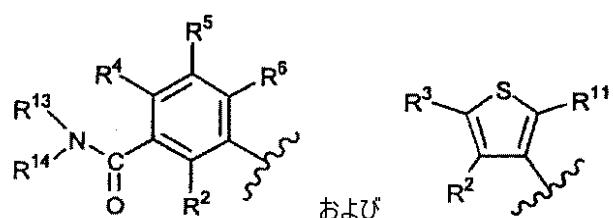
【化32】



からなる群より選択され；そして

式Iの置換基Bは、以下：

【化33】

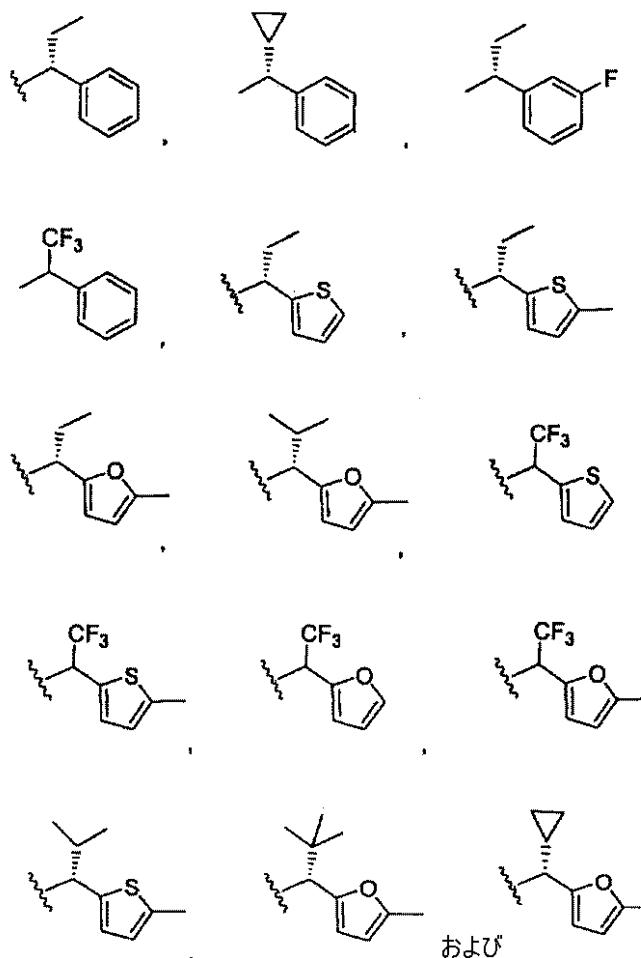


からなる群より選択され、ここで：

R²は、-OHであり；R³は、-SO₂NR¹R³ R¹R⁴ および-C(=O)NR¹R³ R¹R⁴ からなる群より選択され；R⁴は、H、-CF₃ および-CH₃ からなる群より選択され；R⁵は、Hおよびシアノからなる群より選択され；R⁶は、H、-CH₃ および-CF₃ からなる群より選択され；R¹R¹は、Hであり；そしてR¹R³ およびR¹R⁴は、独立してHおよびメチルからなる群より選択されるか；あるいは

(2) Aは、以下：

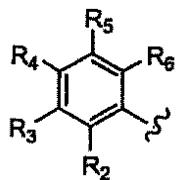
【化34】



から選択され；

そしてBは：

【化35】



であり、ここで

R²は、-OHであり；

R³は、CONR¹₃R¹₄であり；

R⁴は、H、CH₃およびCF₃からなる群より選択され；

R⁵は、Hおよびシアノであり；

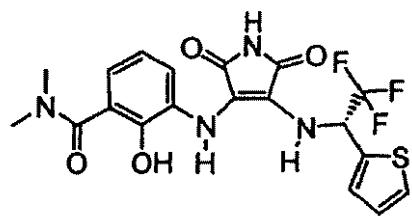
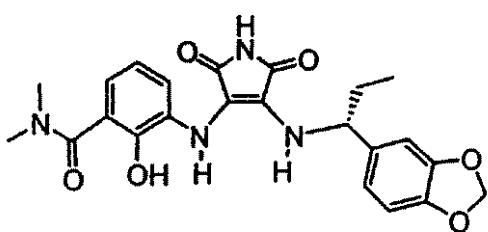
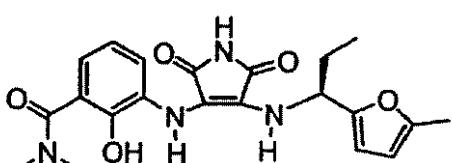
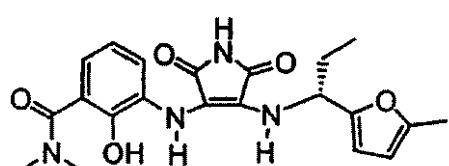
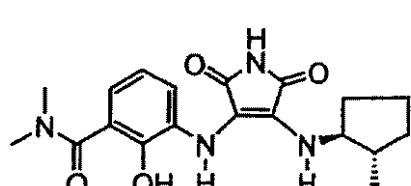
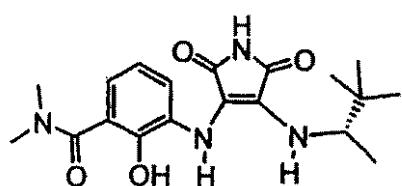
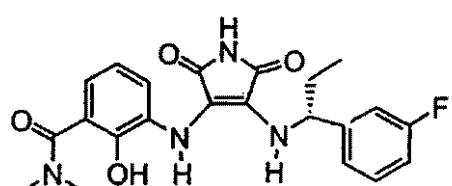
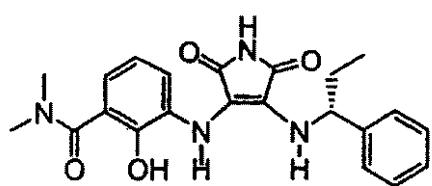
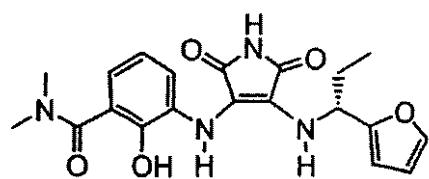
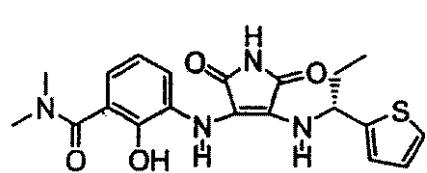
R⁶は、H、CH₃およびCF₃からなる群より選択され；

R¹₃およびR¹₄は、メチルである、化合物。

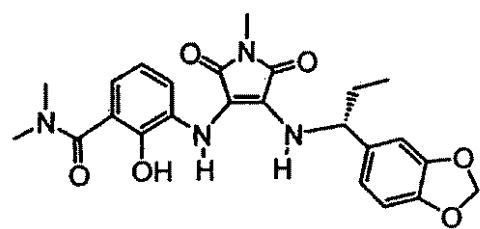
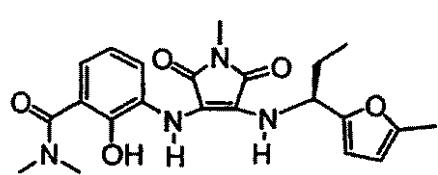
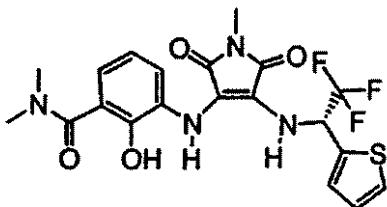
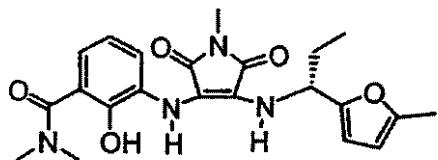
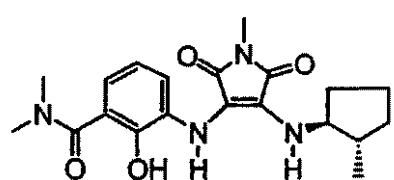
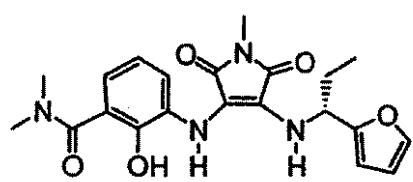
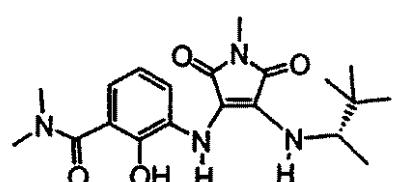
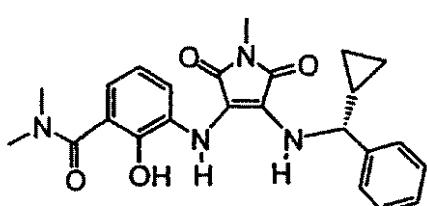
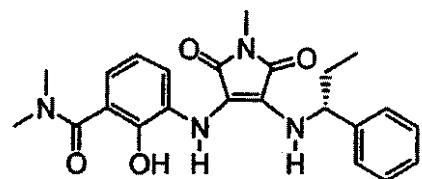
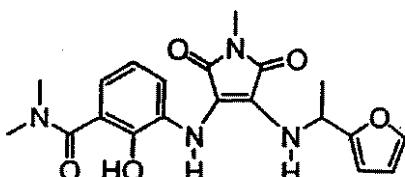
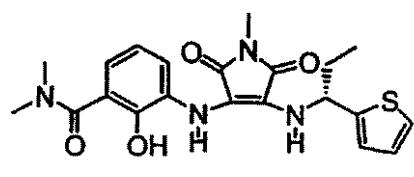
【請求項11】

下記：

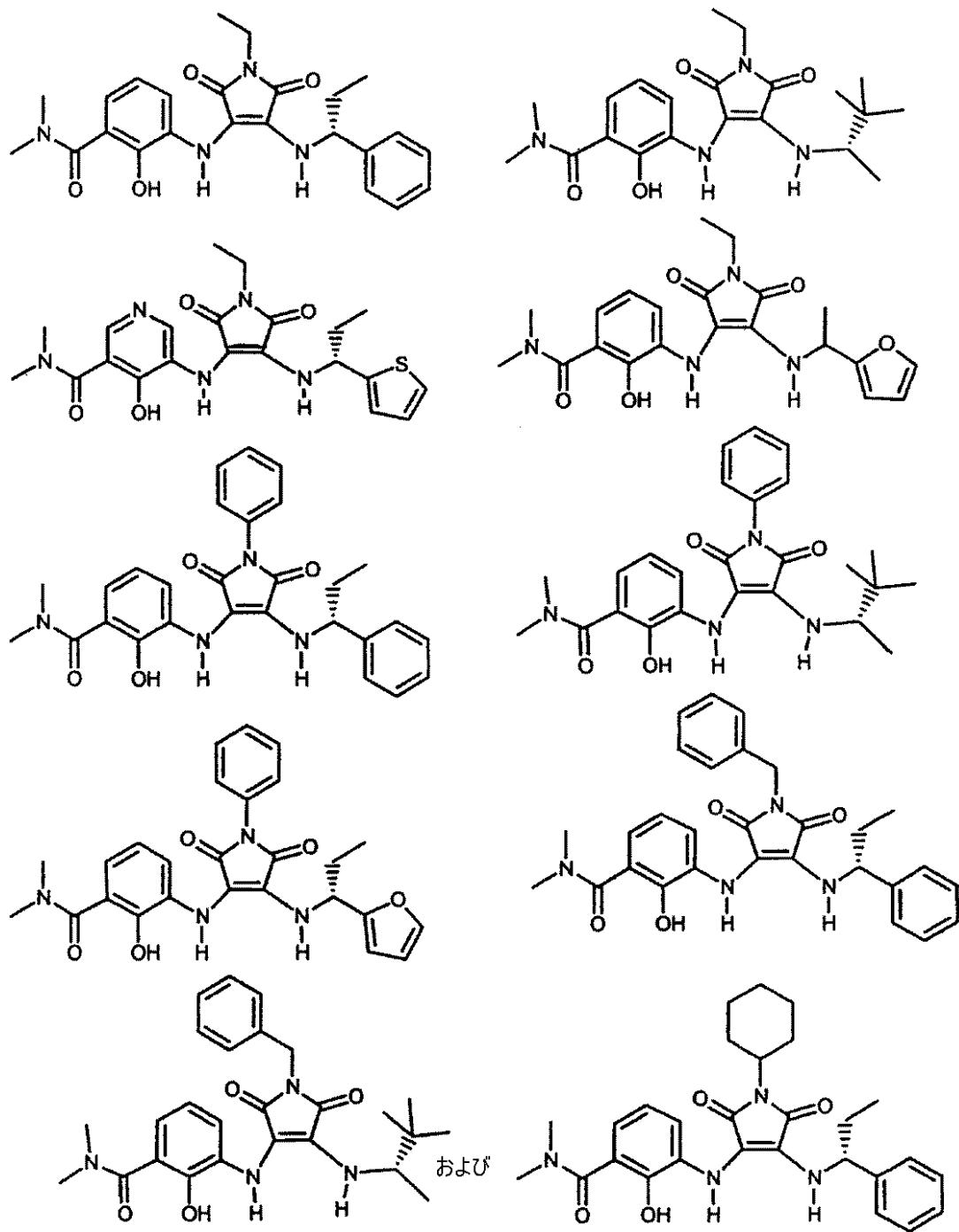
【化36】



【化37】



【化 3 8】

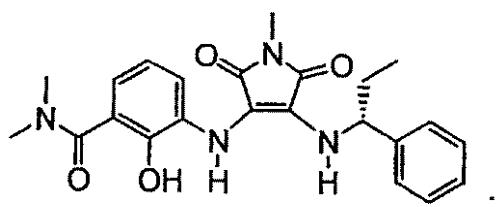
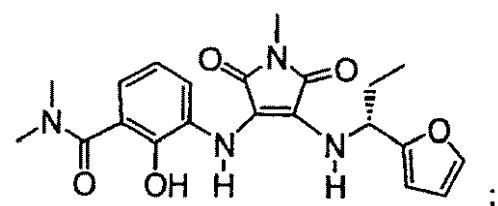
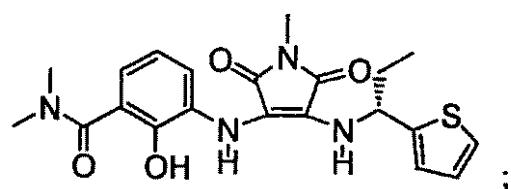


からなる群より選択される請求項 1 記載の化合物。

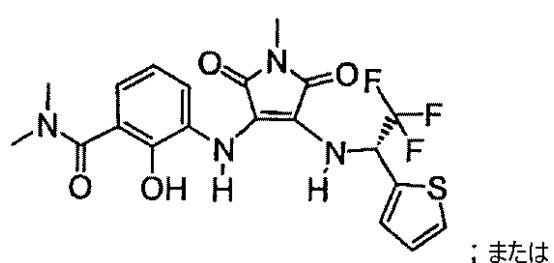
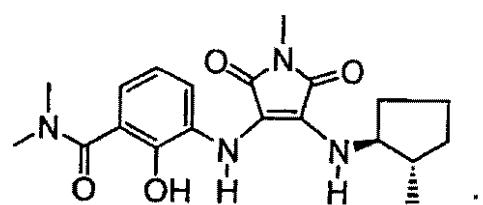
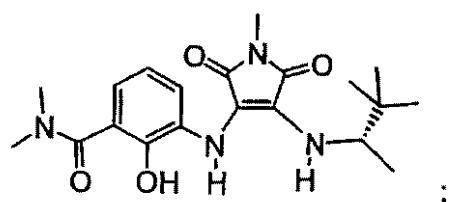
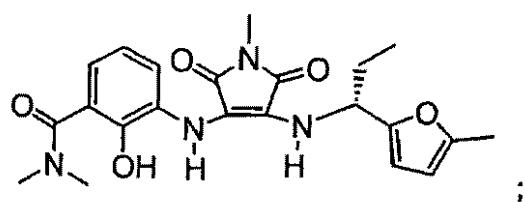
【請求項 1 2】

以下の式：

【化39】

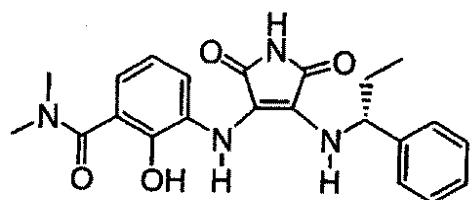


【化40】



; または

【化41】

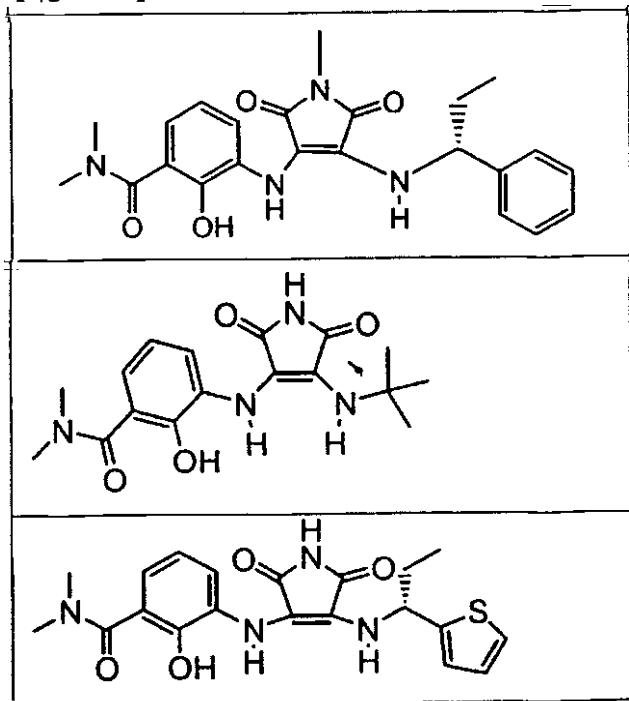


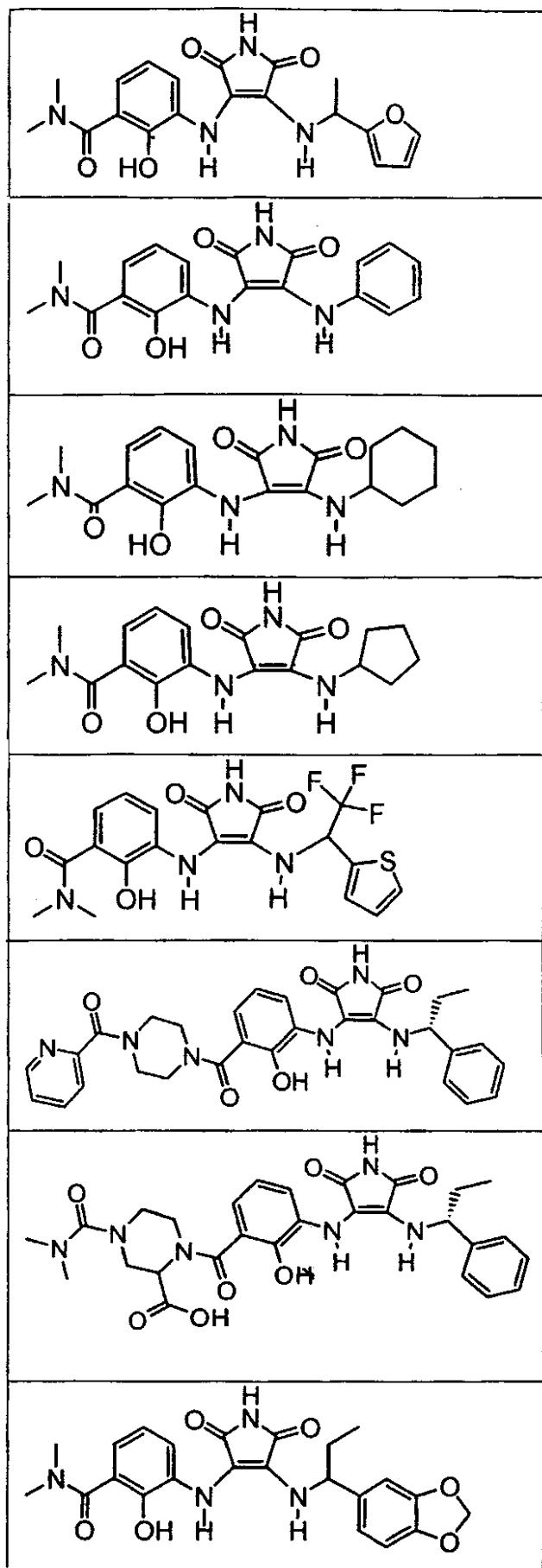
を有する請求項1記載の化合物。

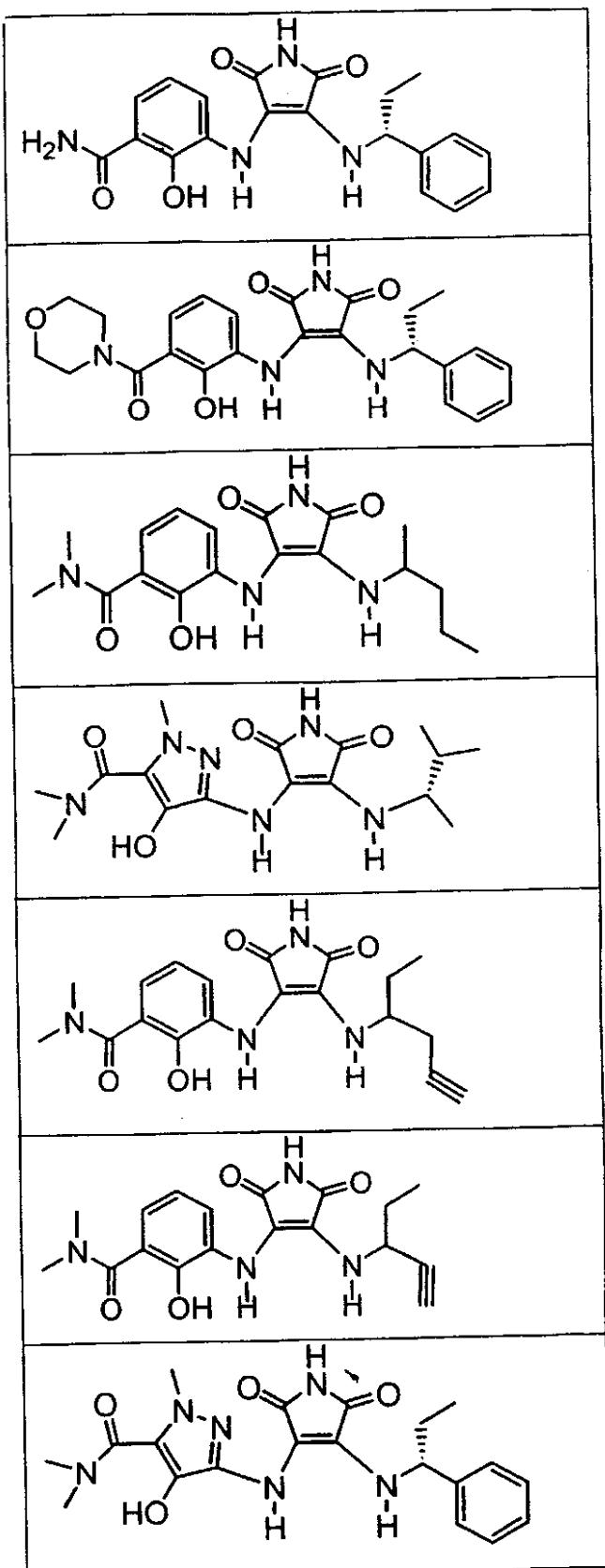
【請求項13】

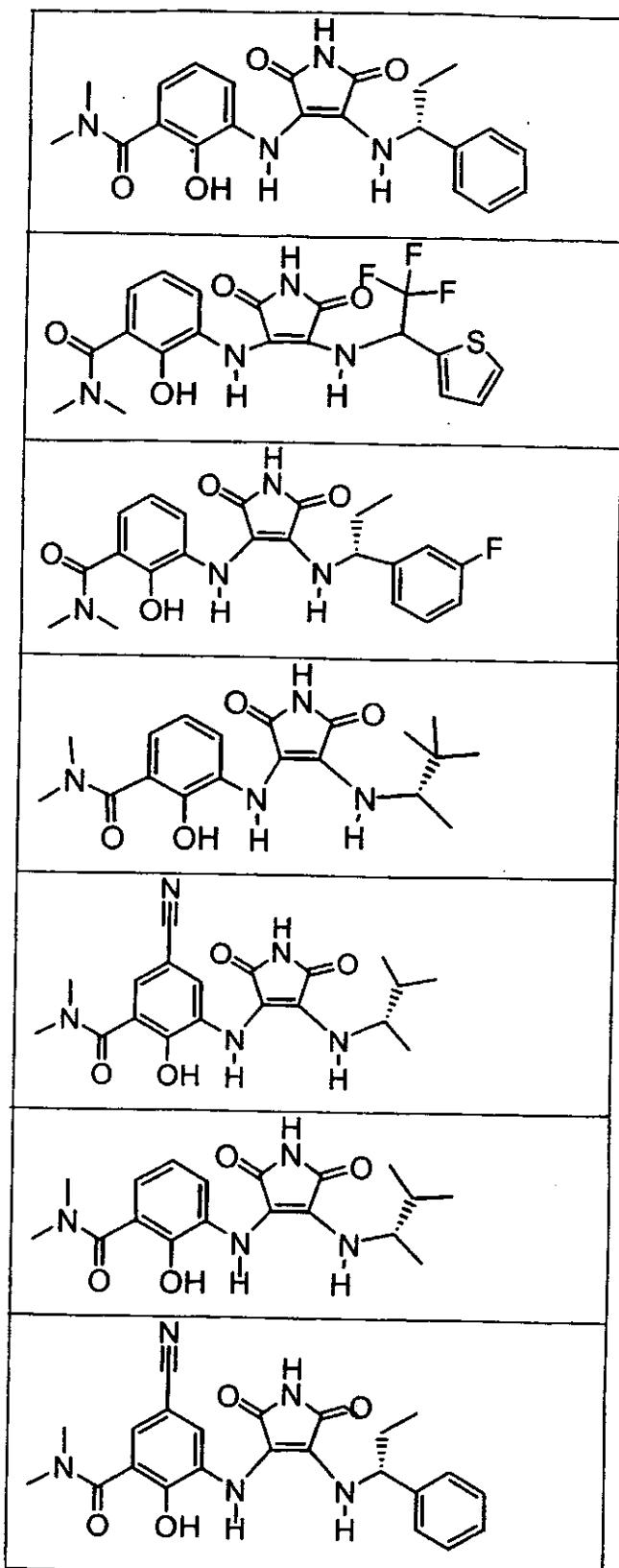
以下：

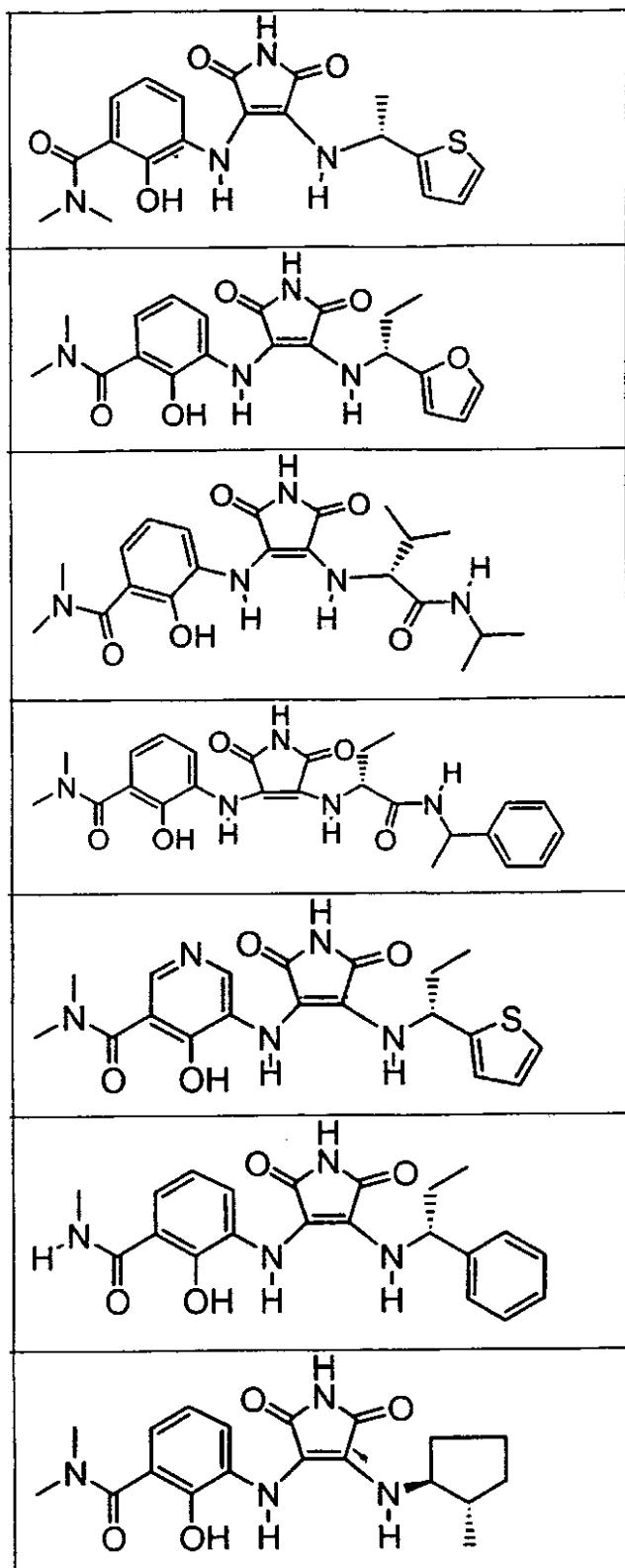
【化42】

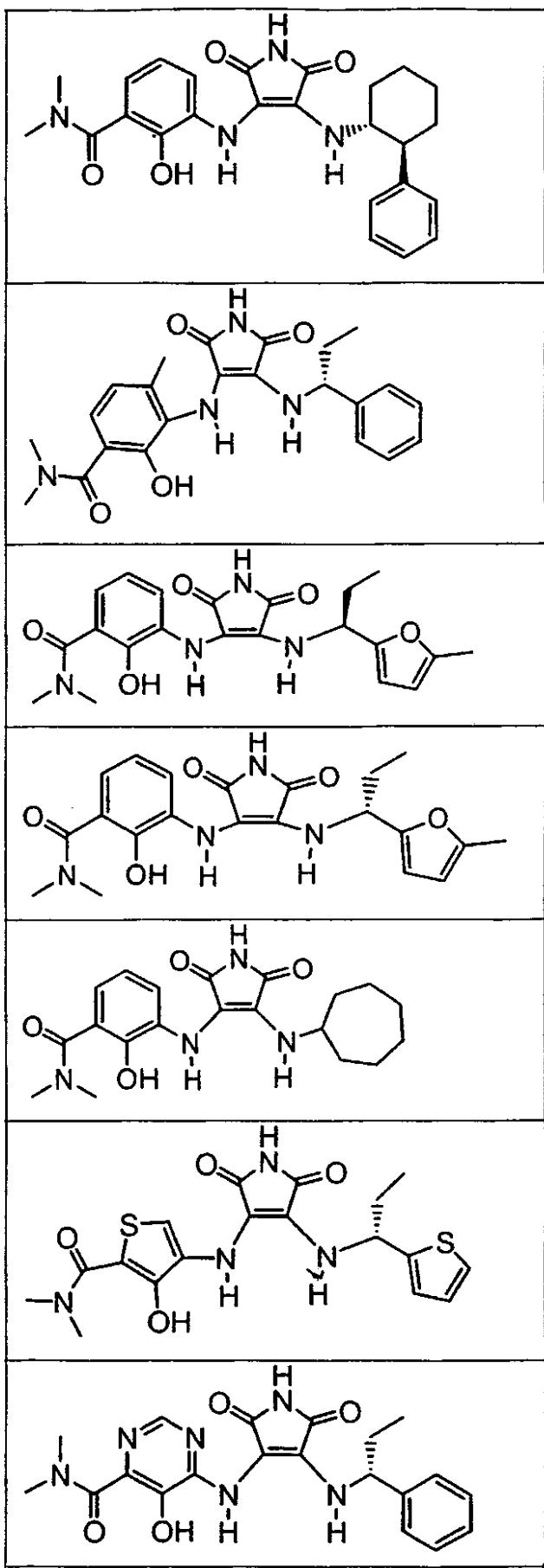


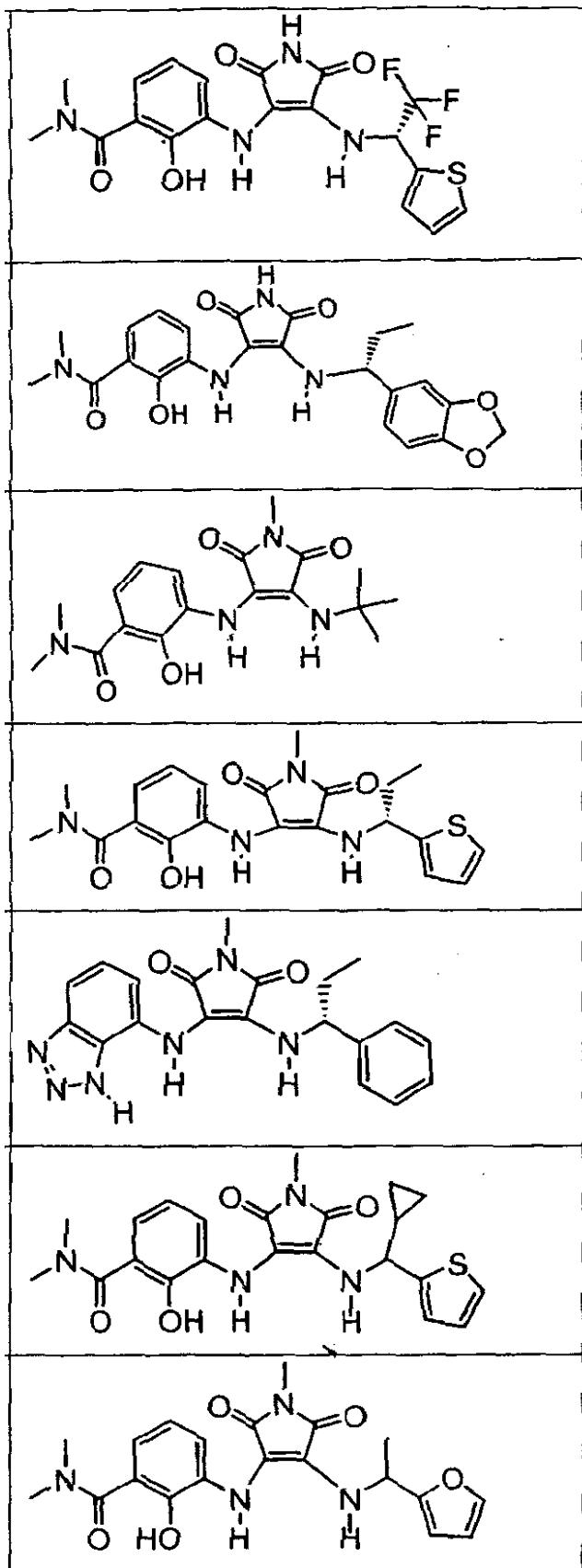


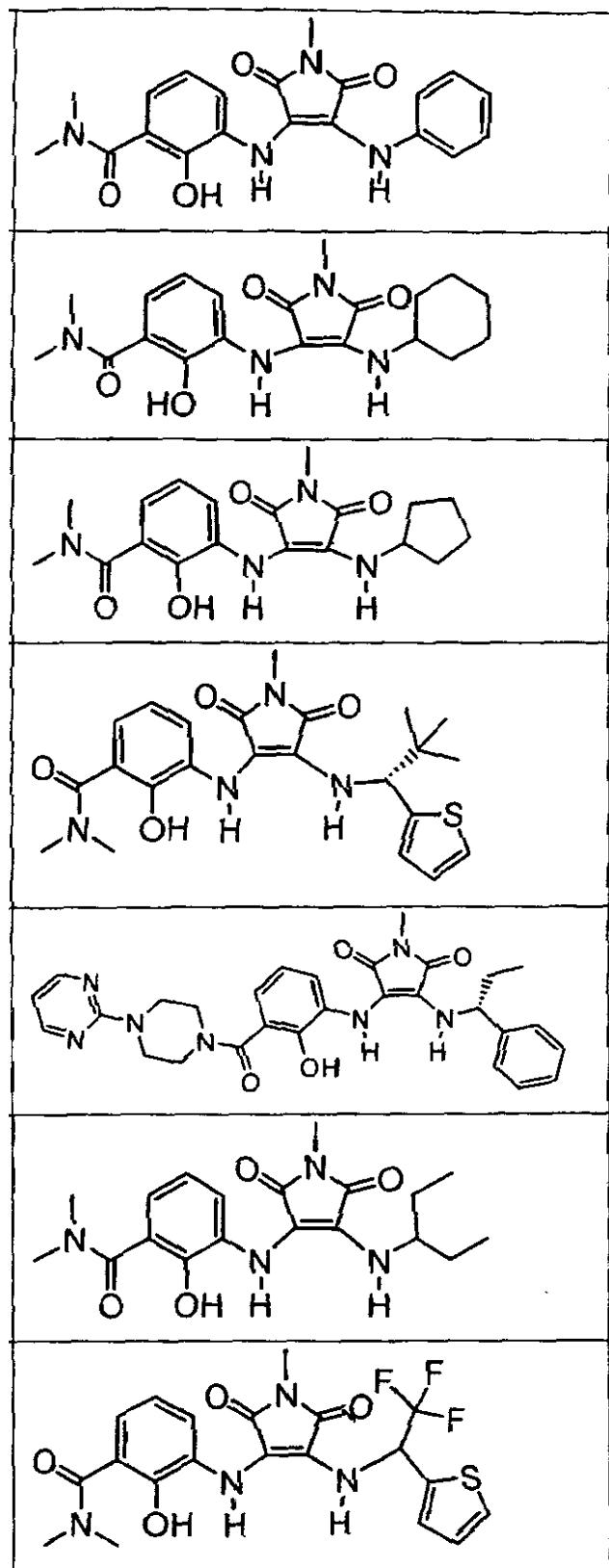


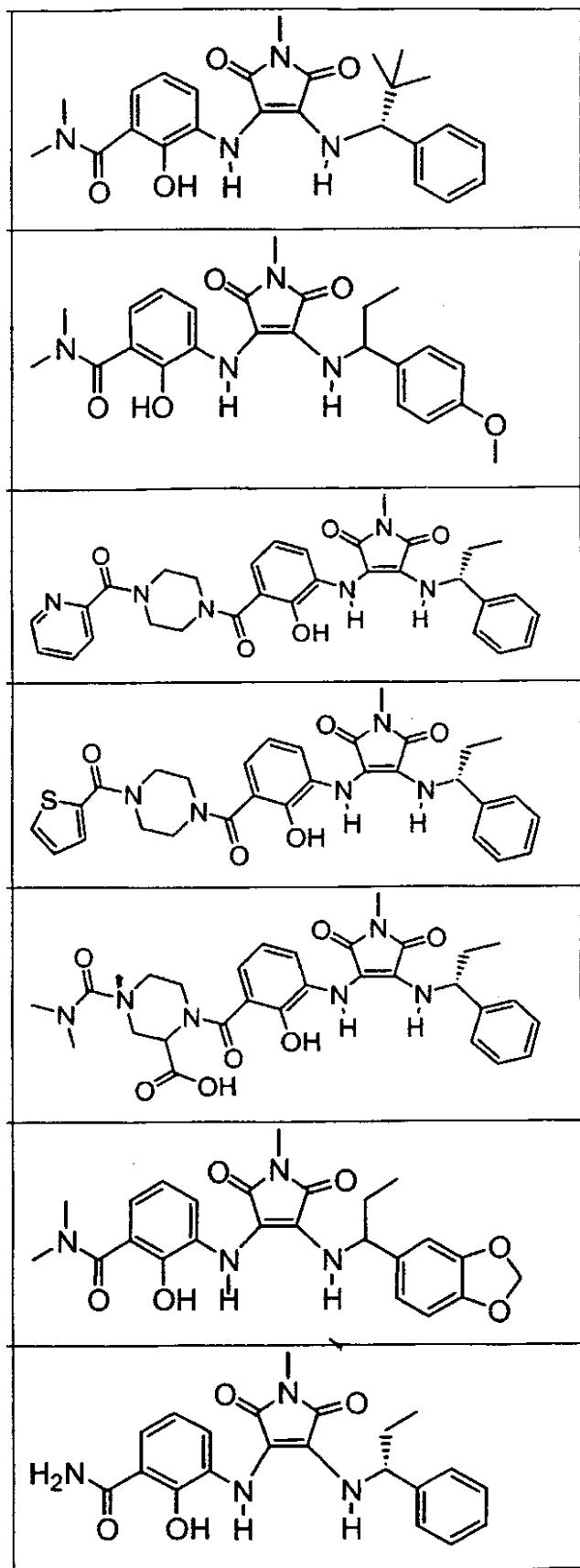


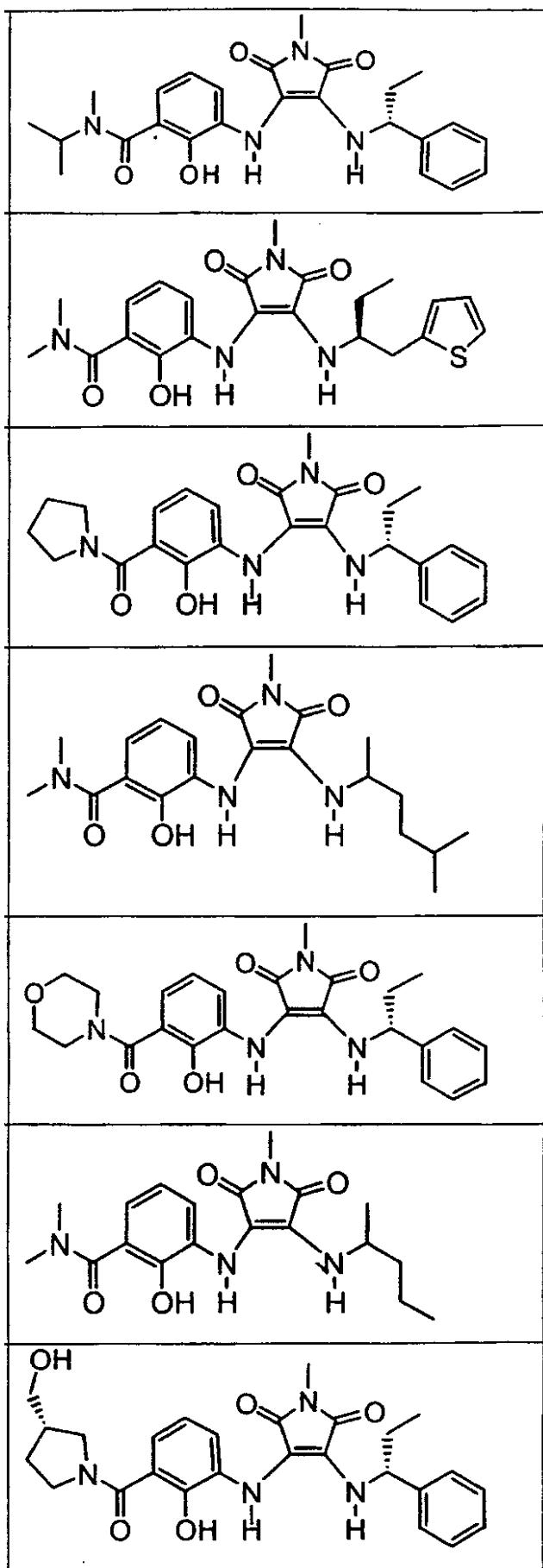


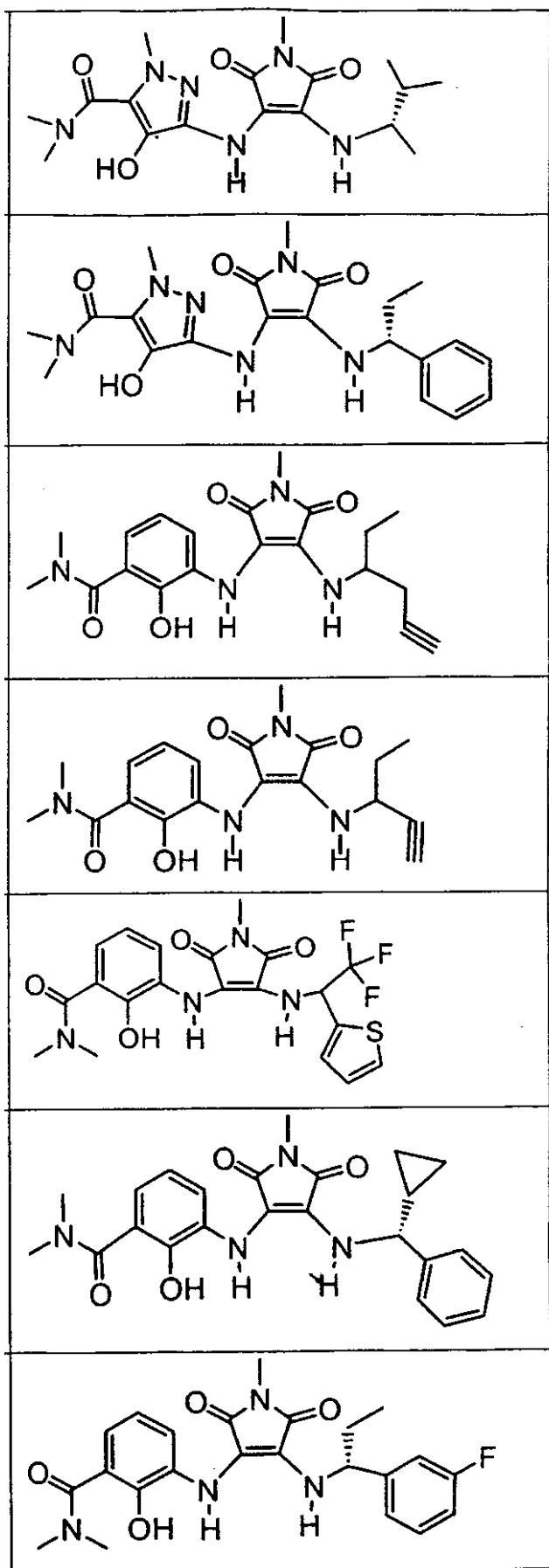


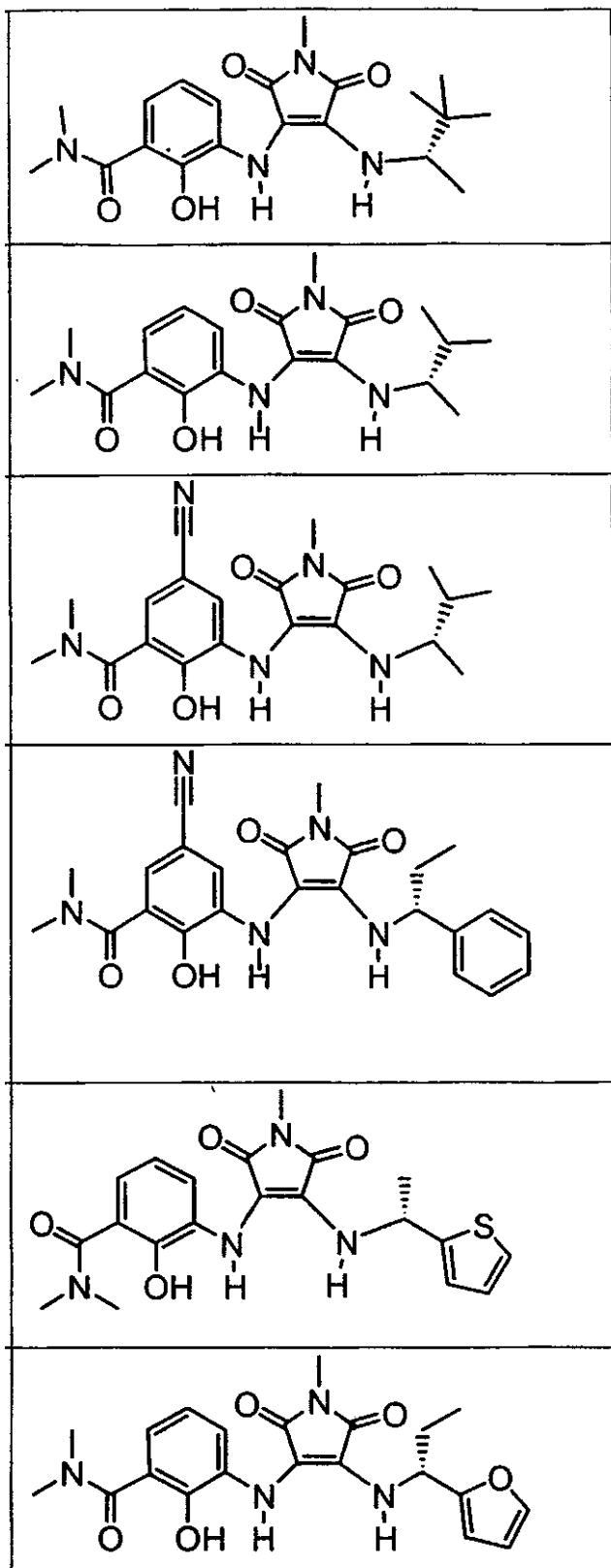


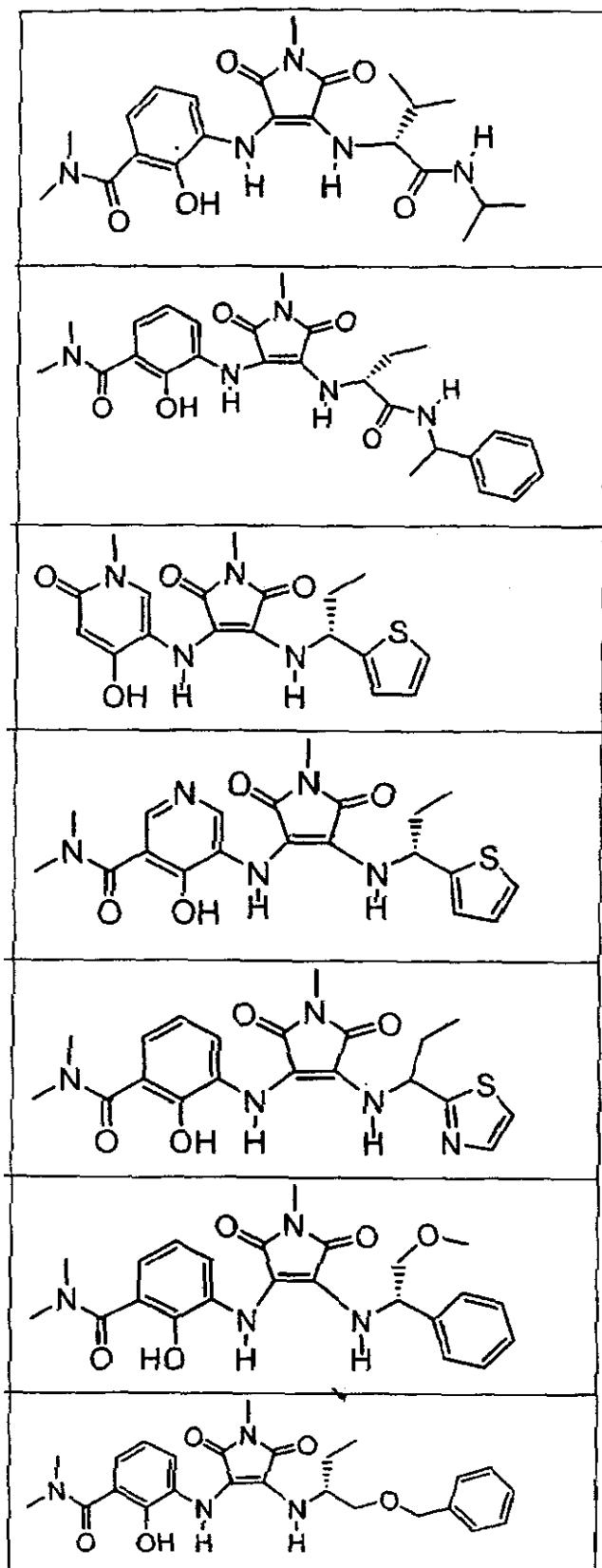


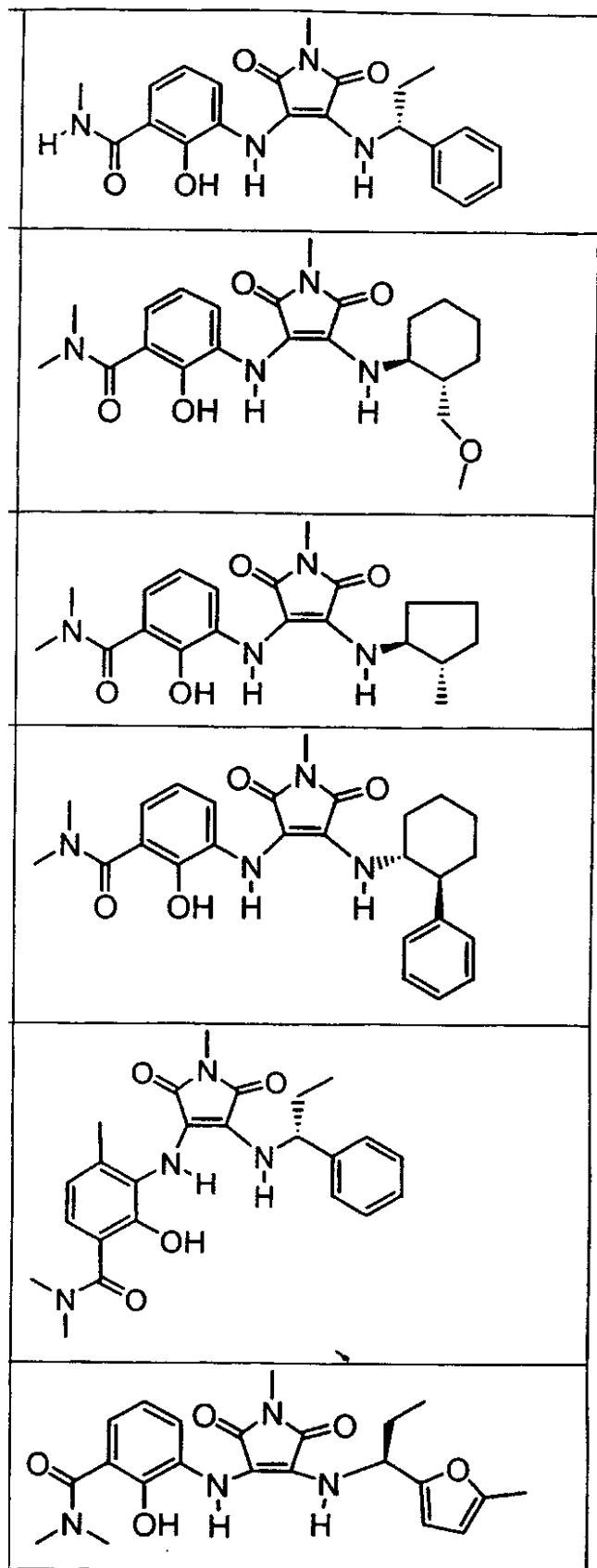


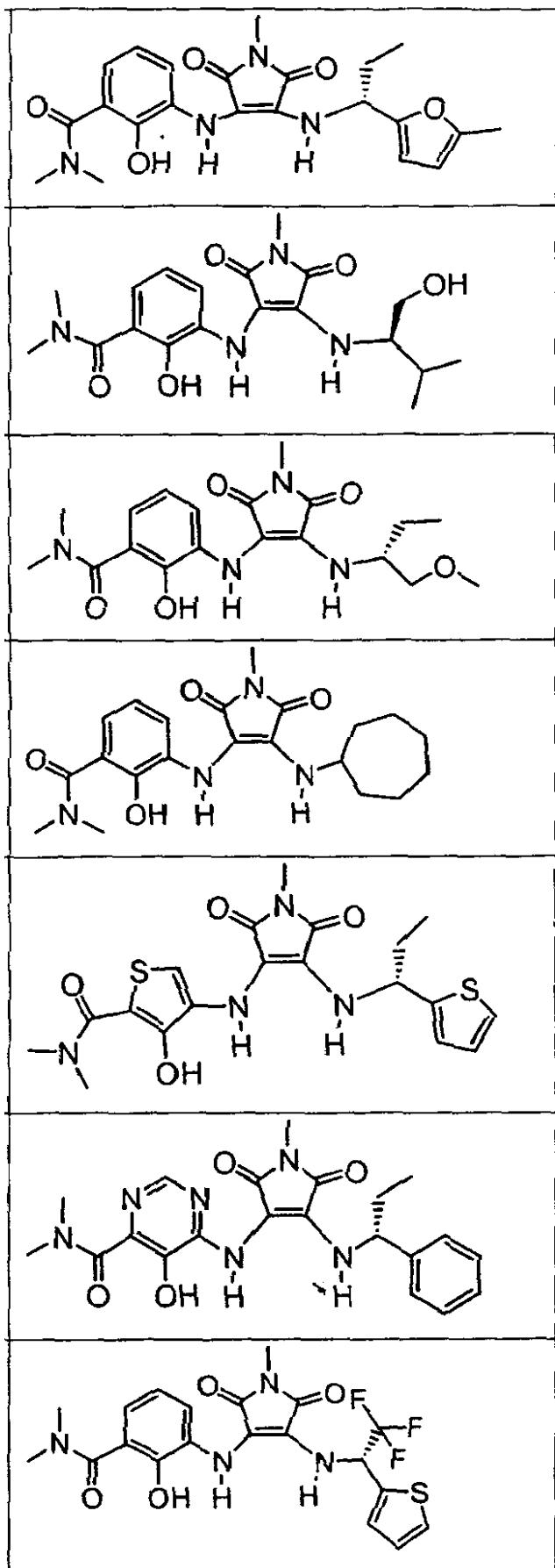


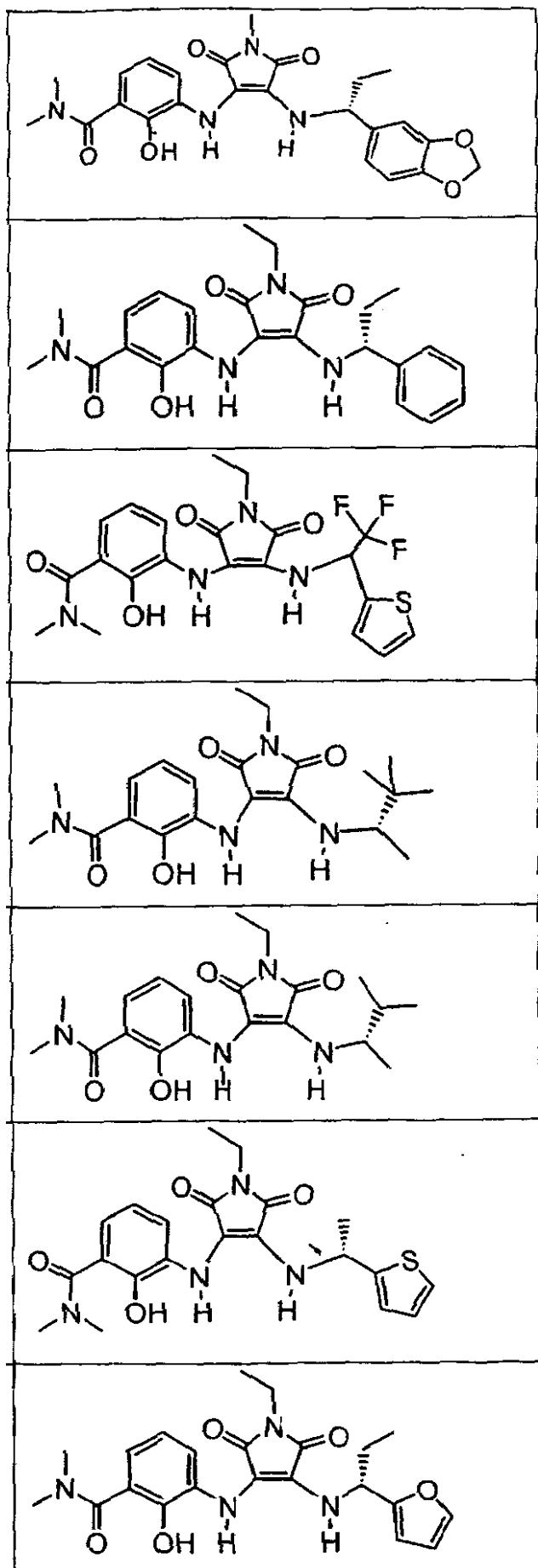


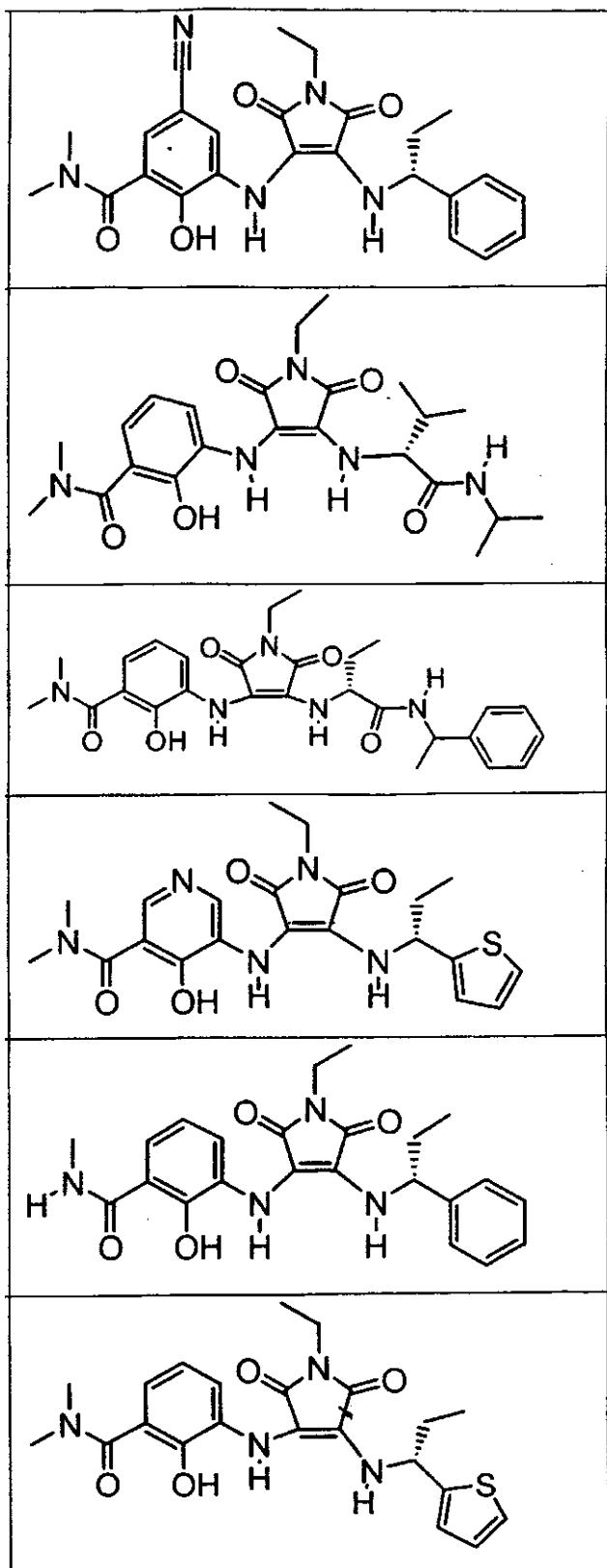


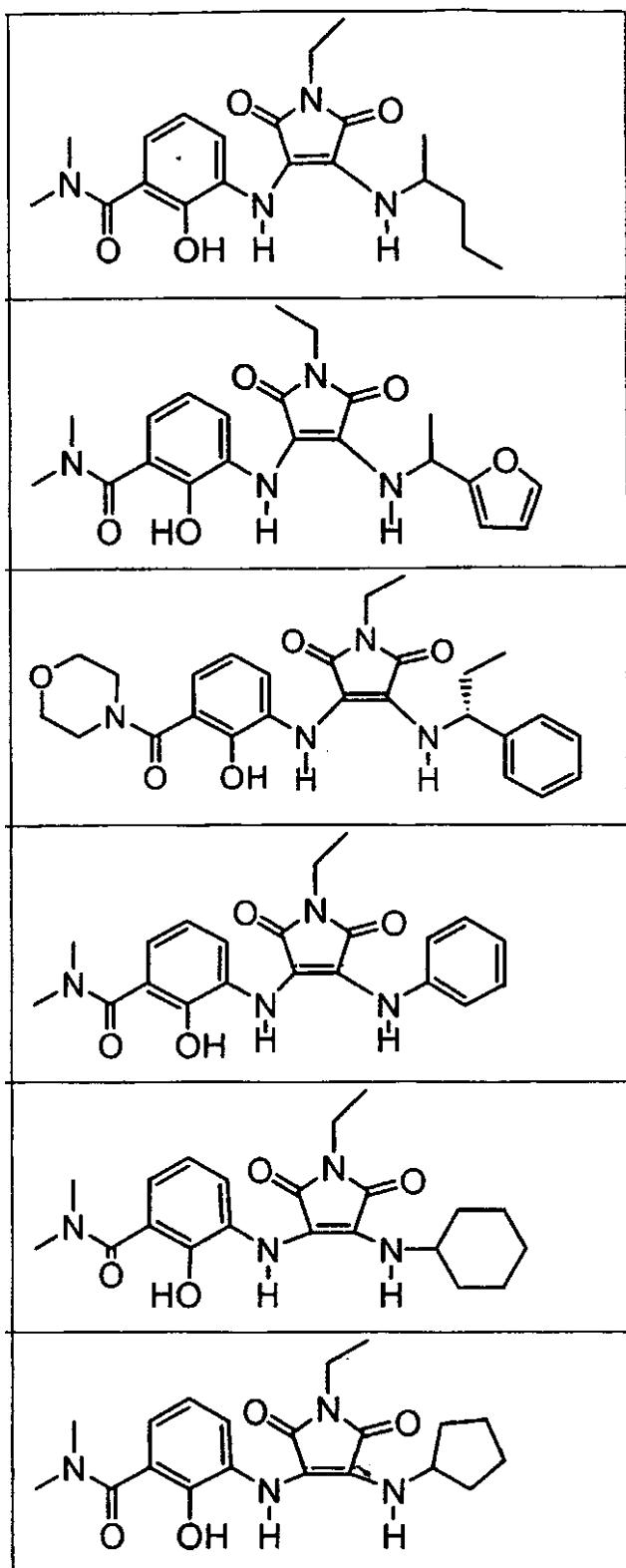


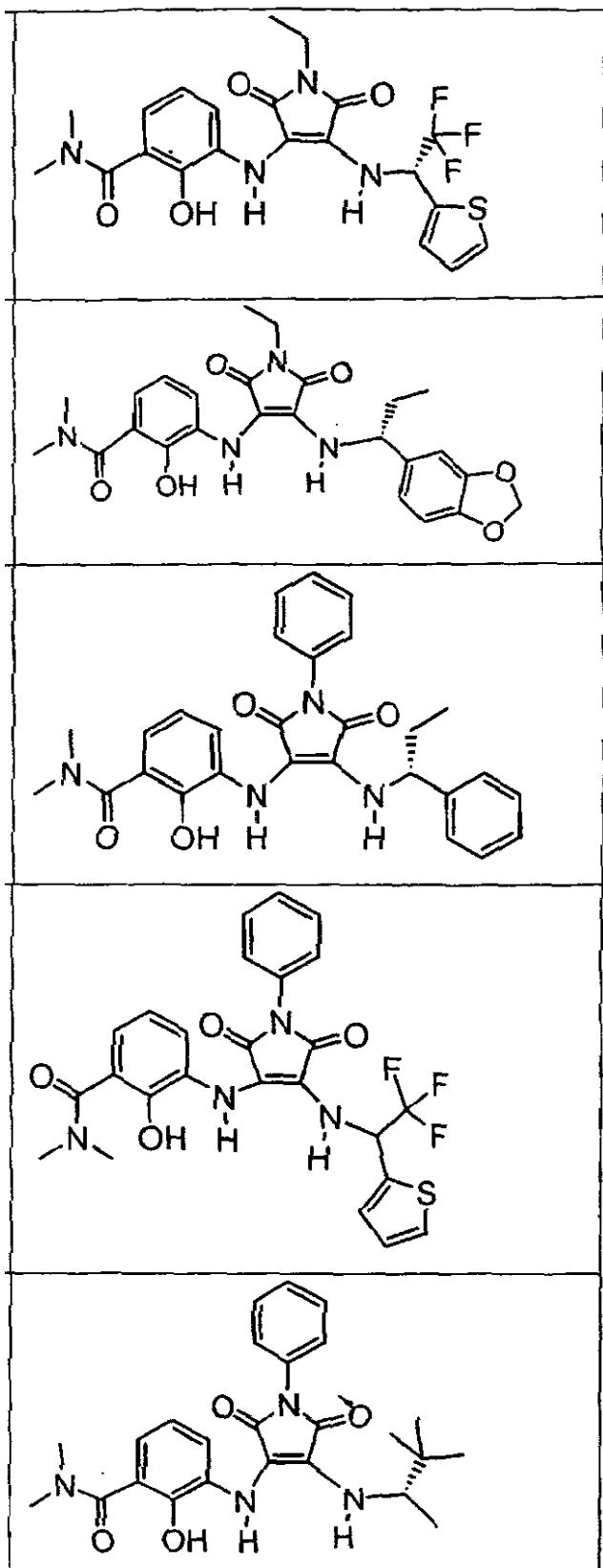


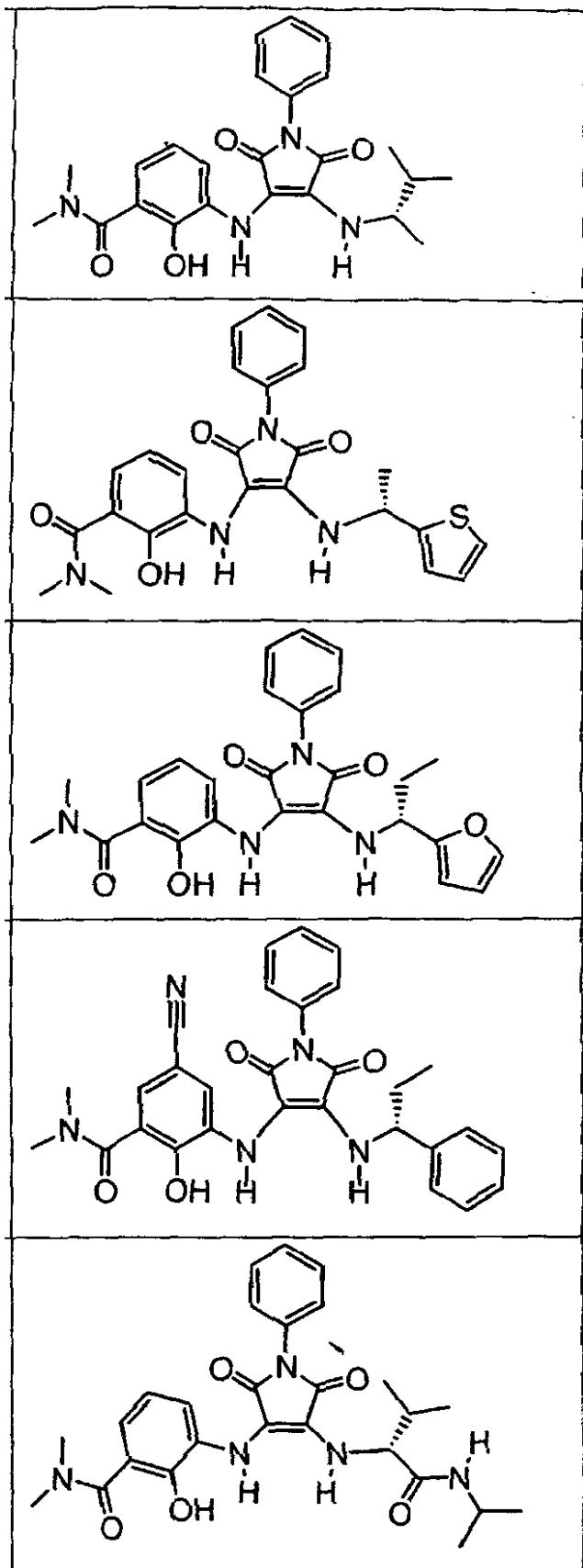


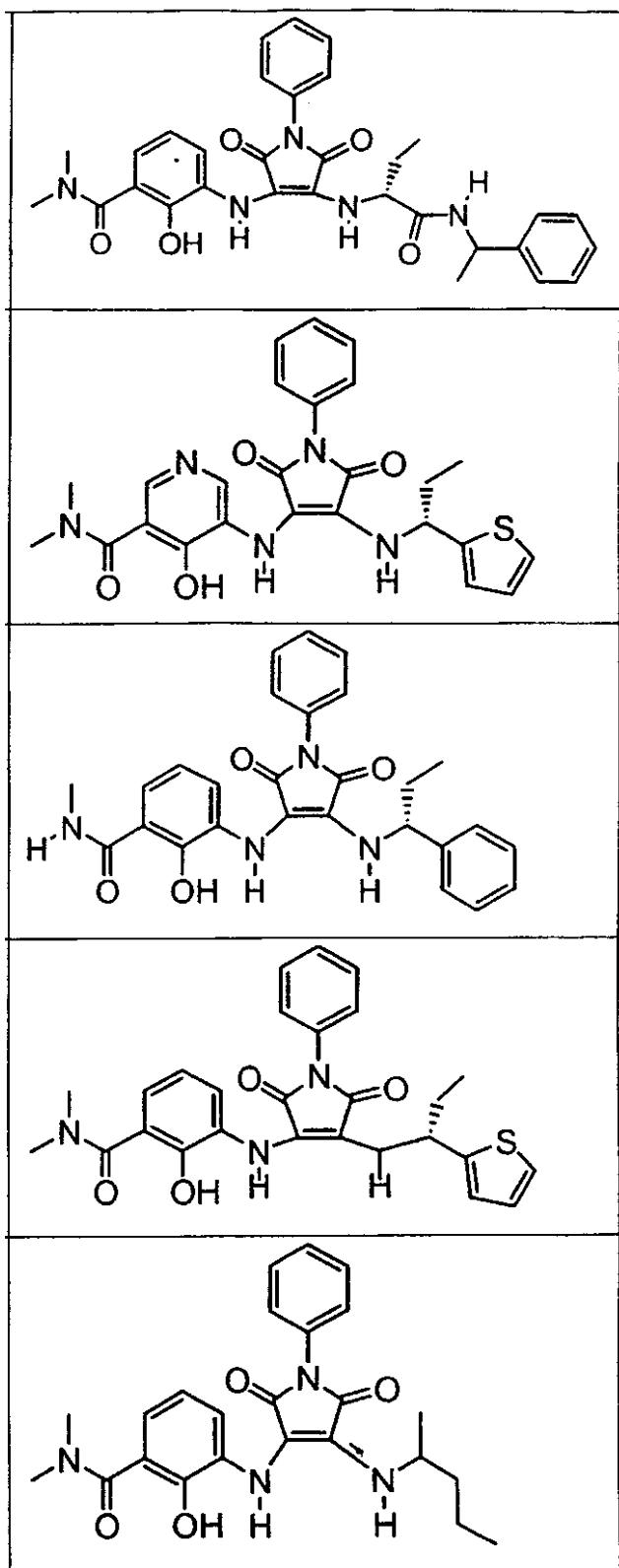


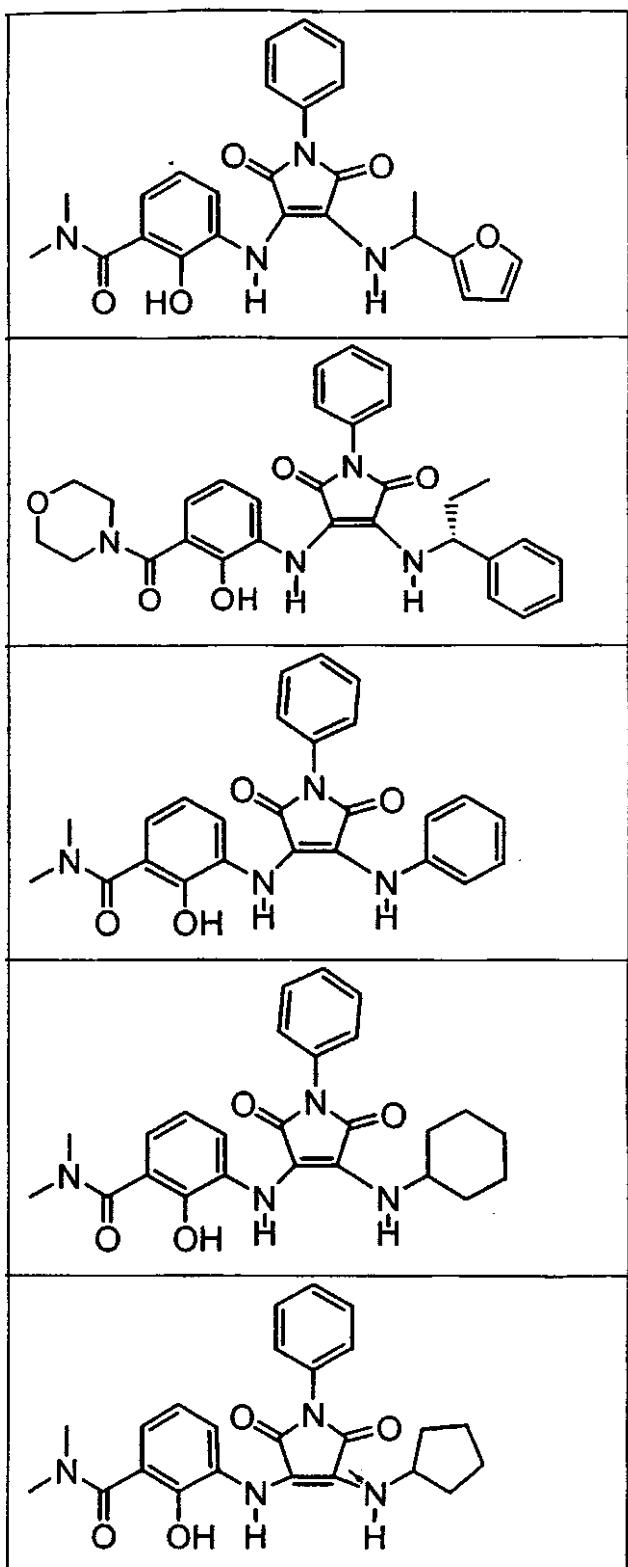


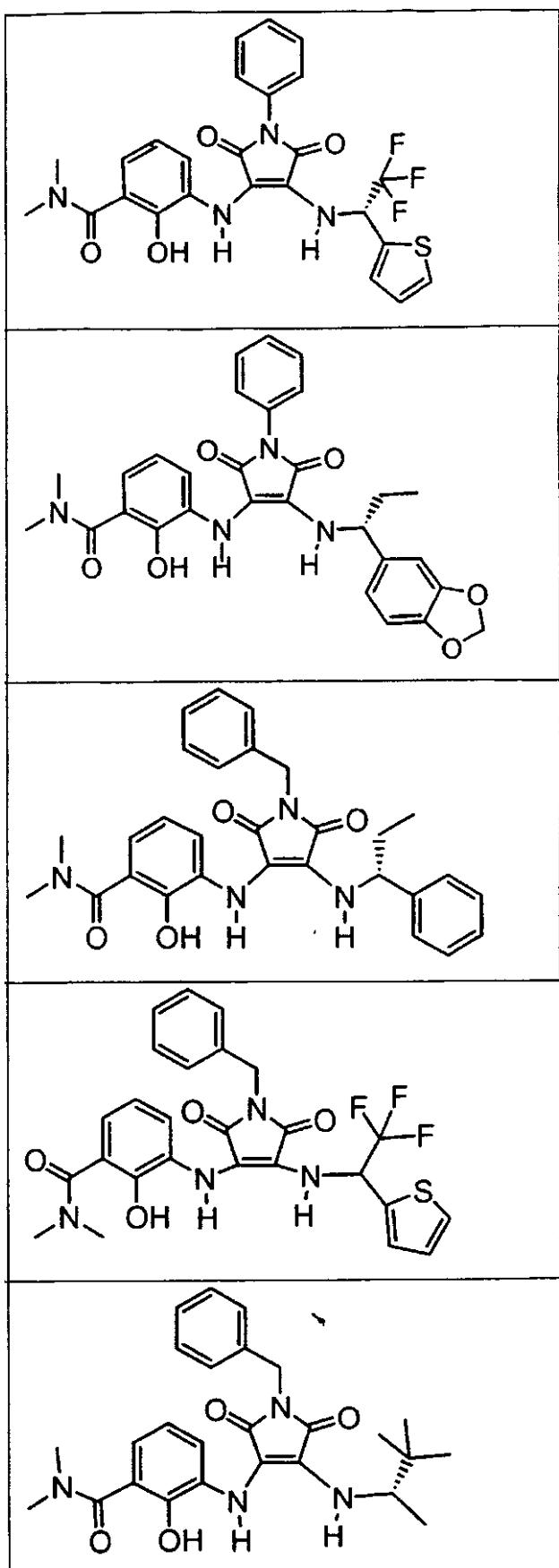


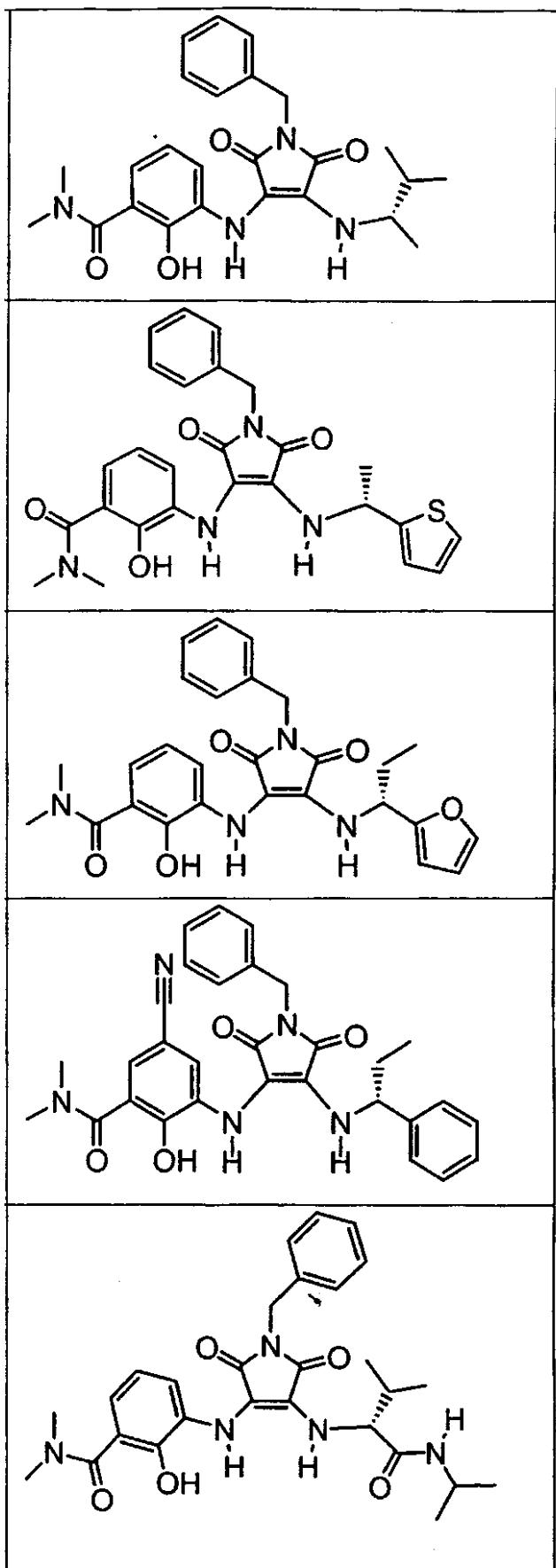


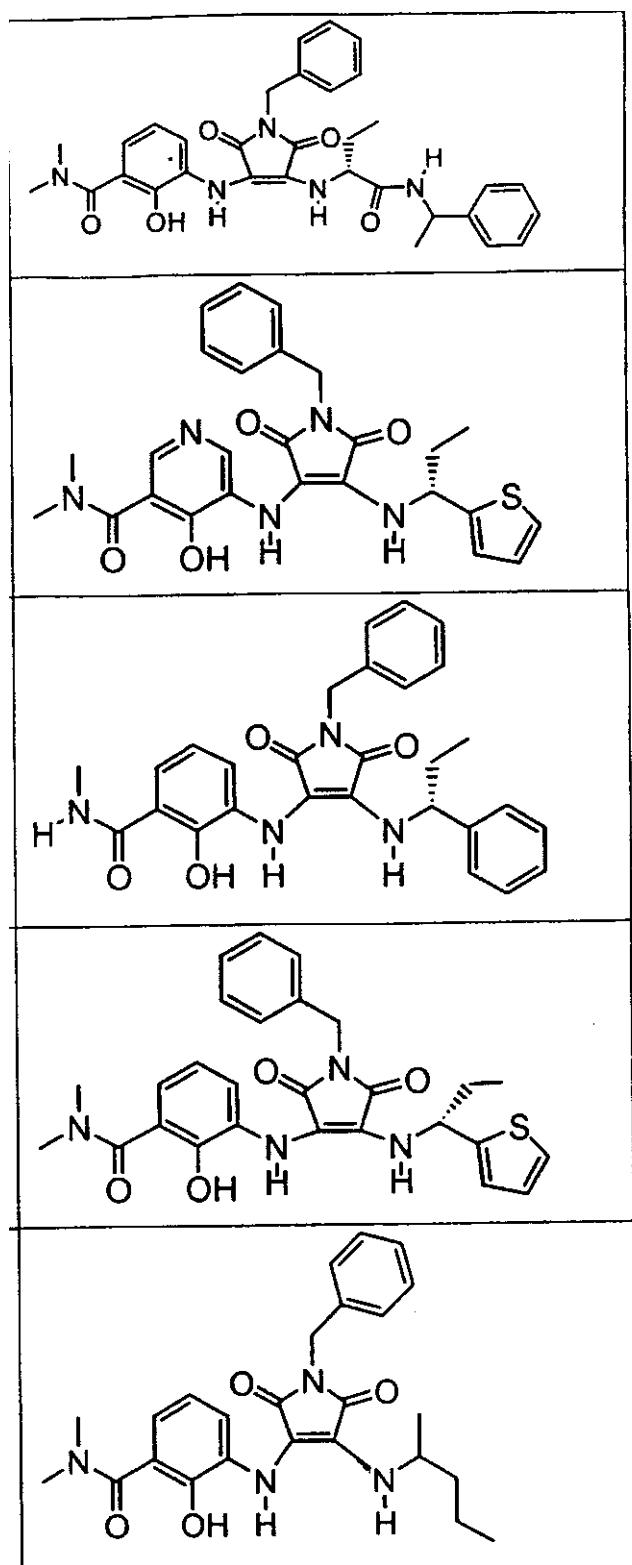


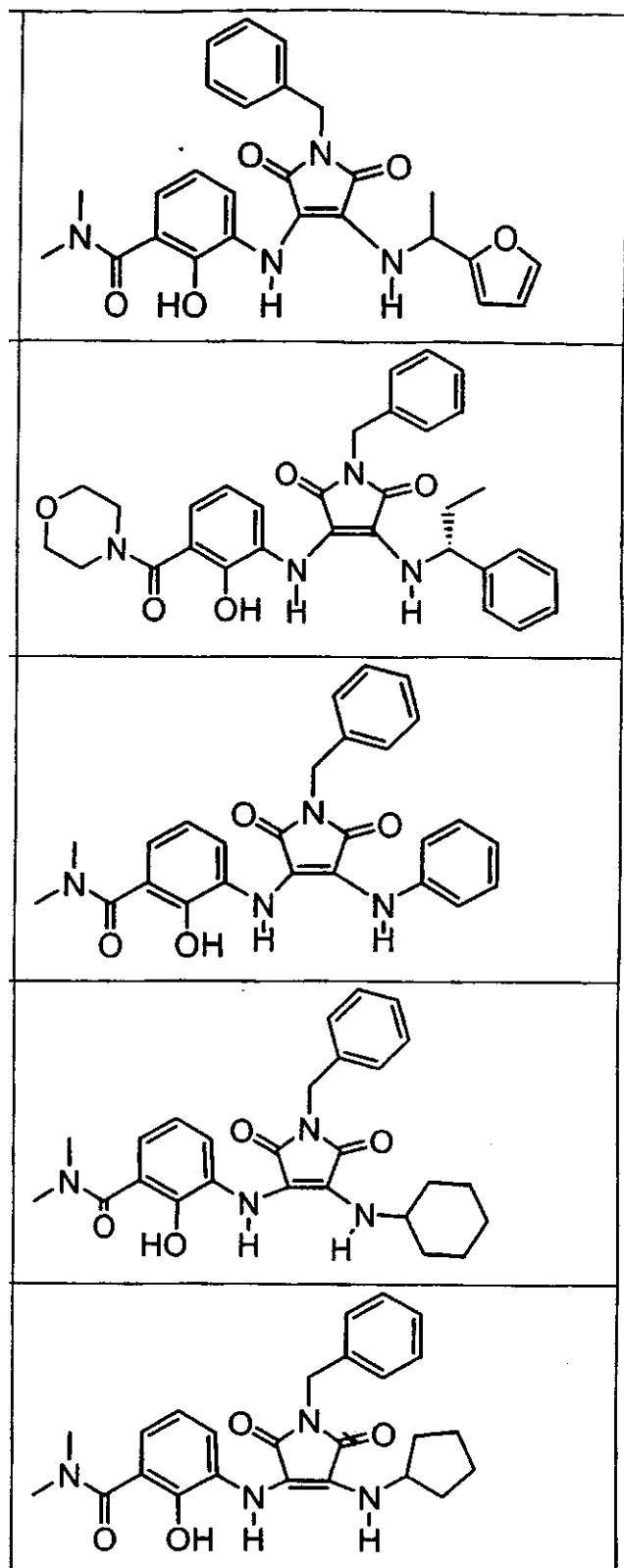


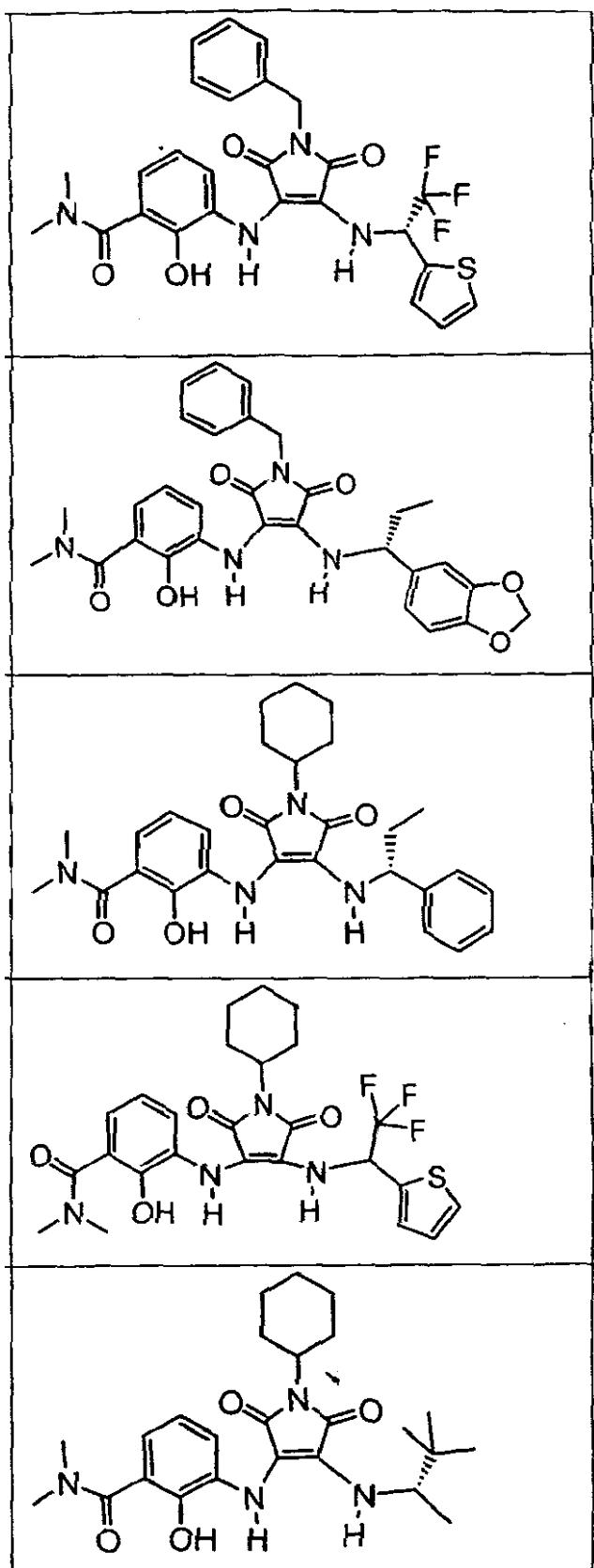


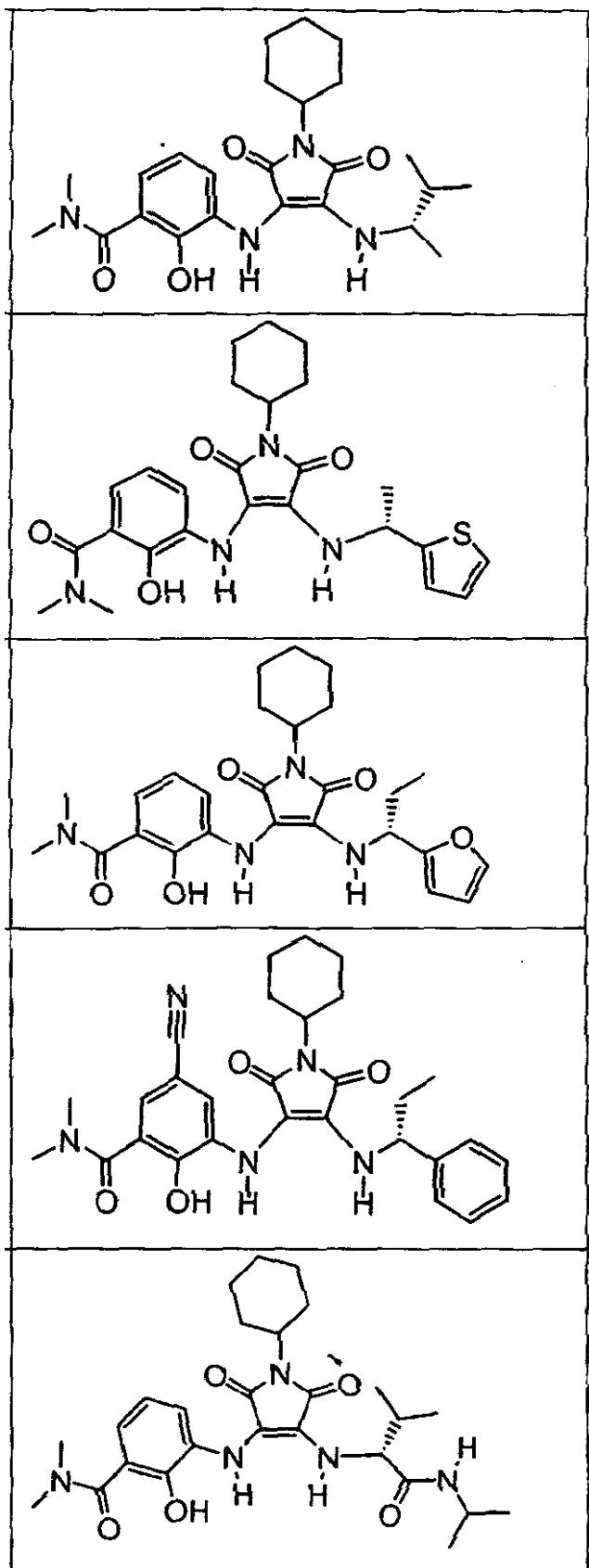


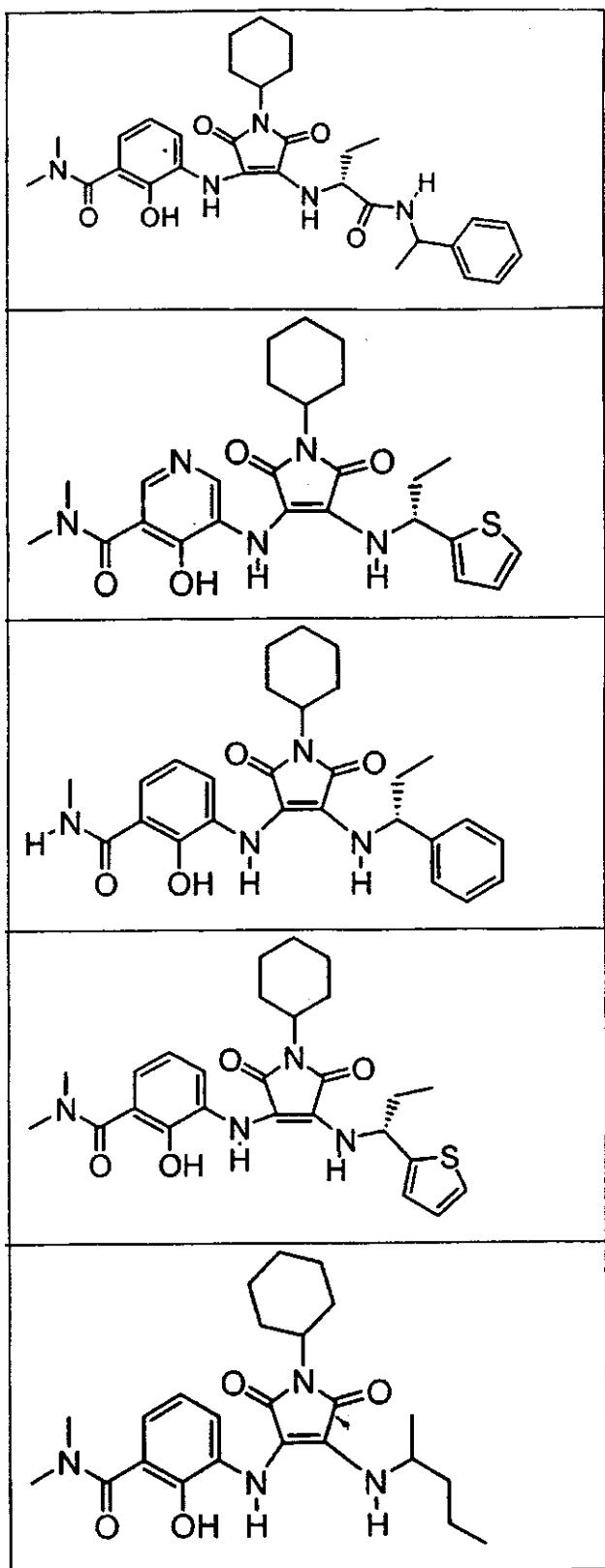


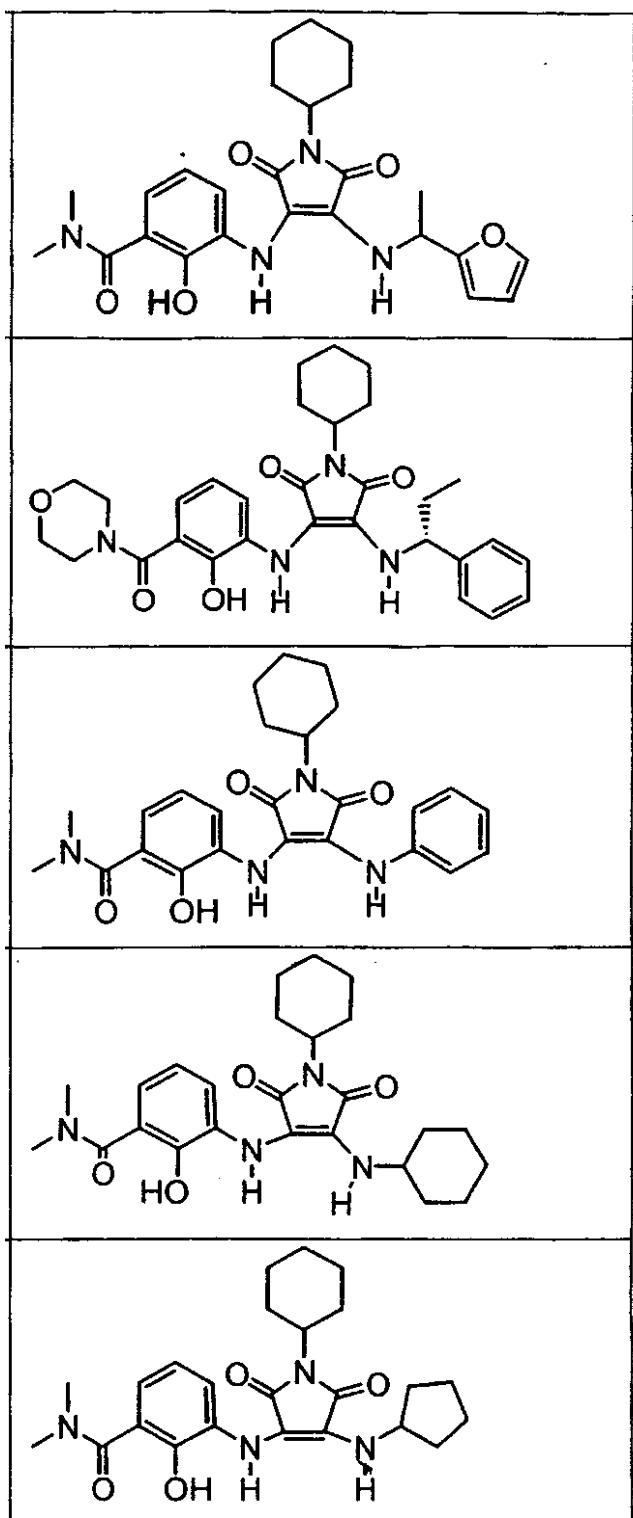


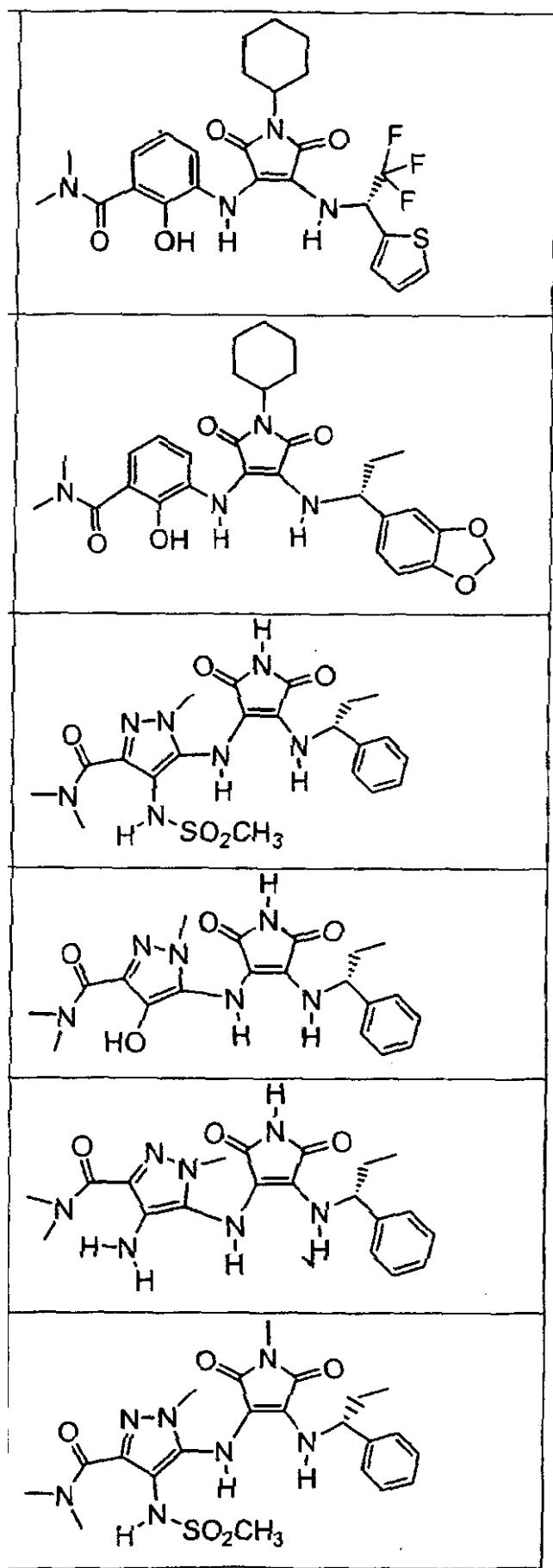


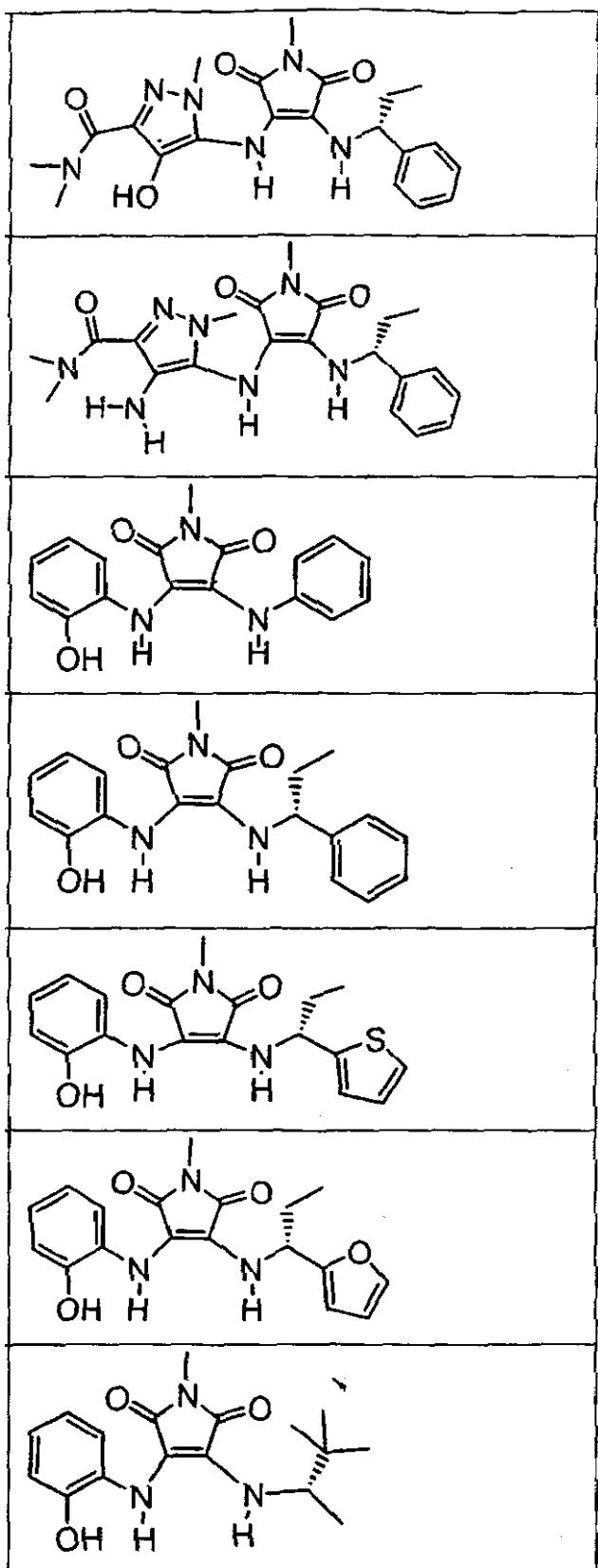


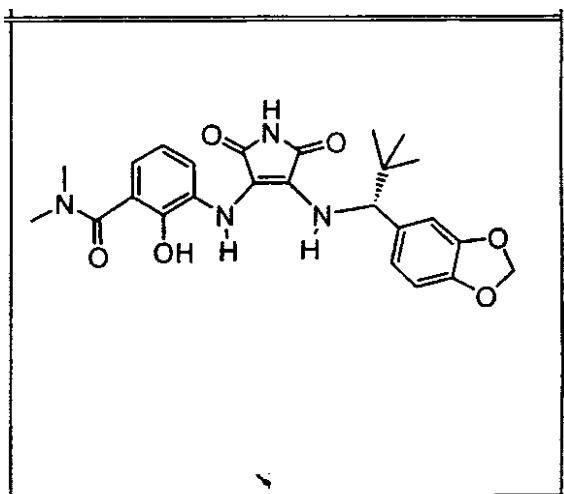
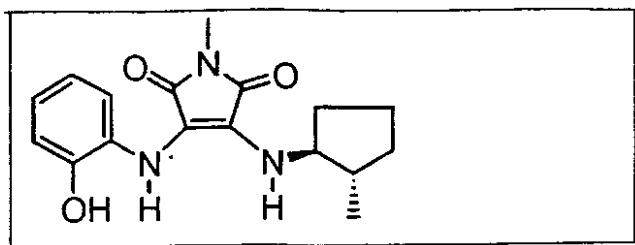


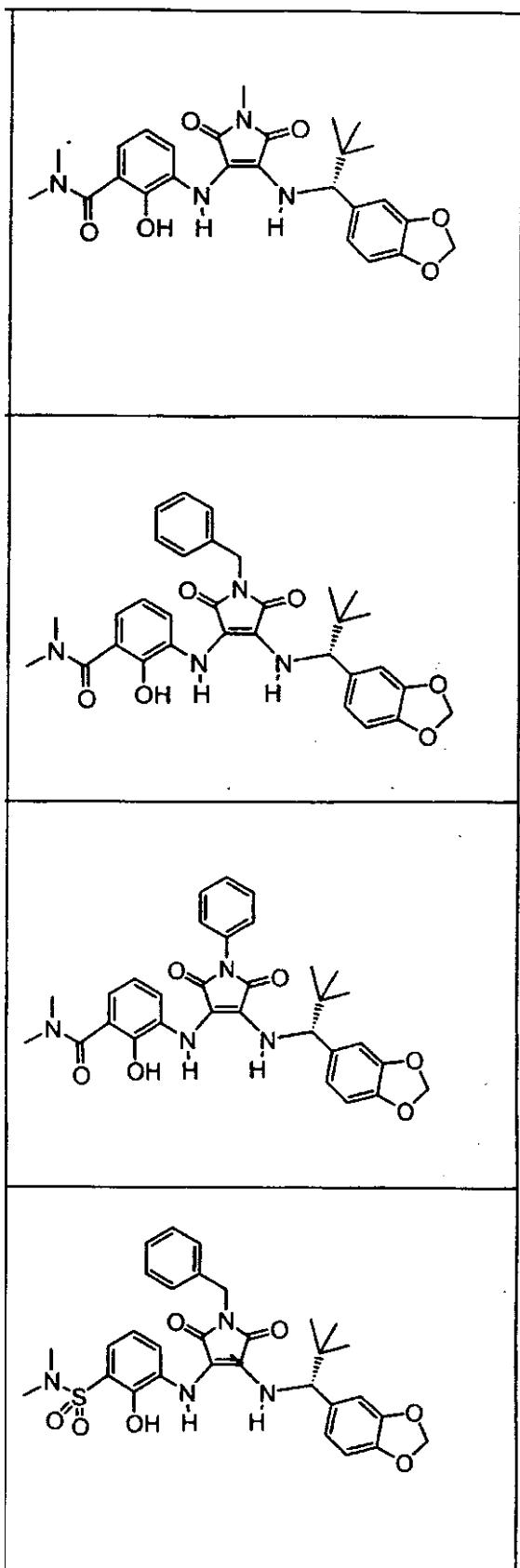


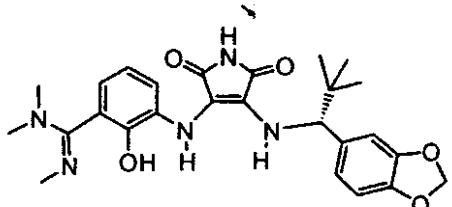
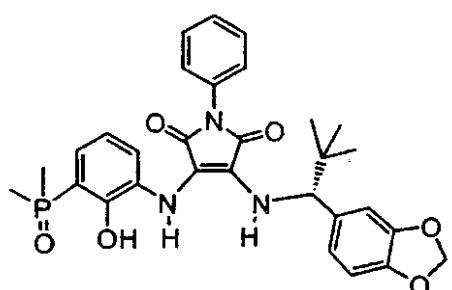
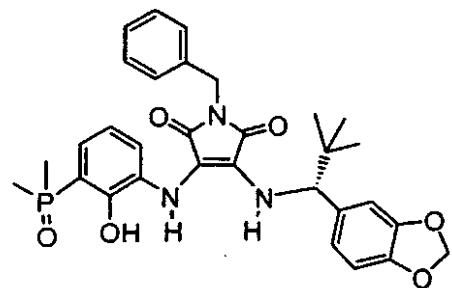
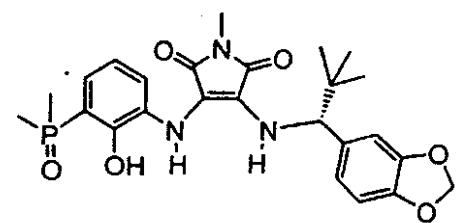


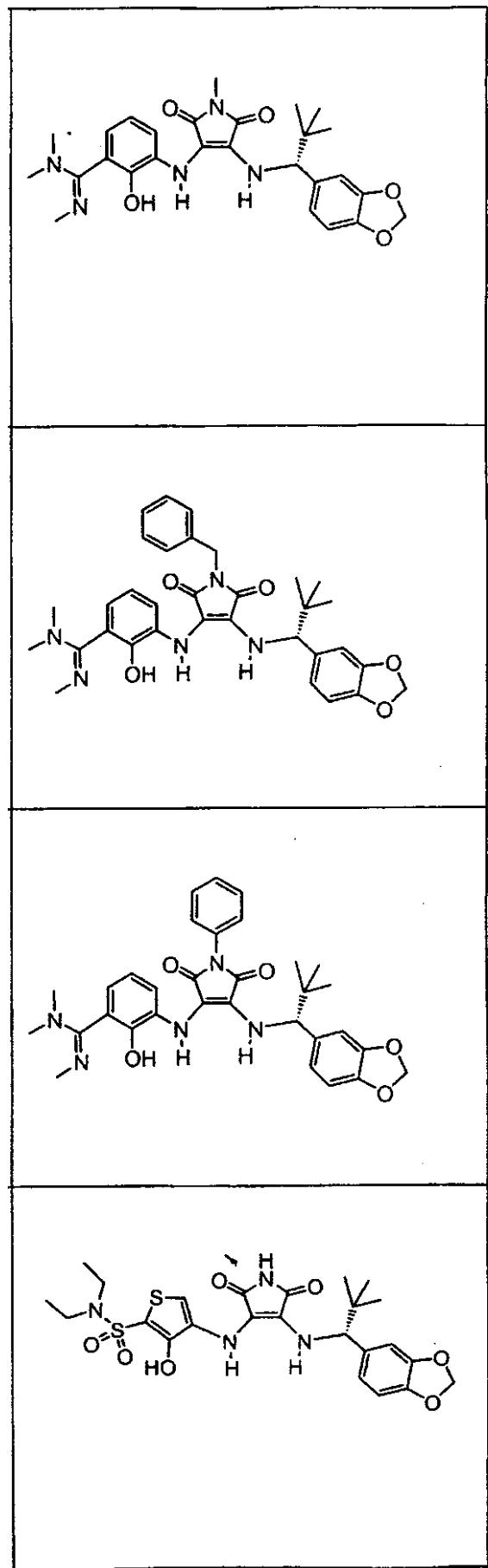


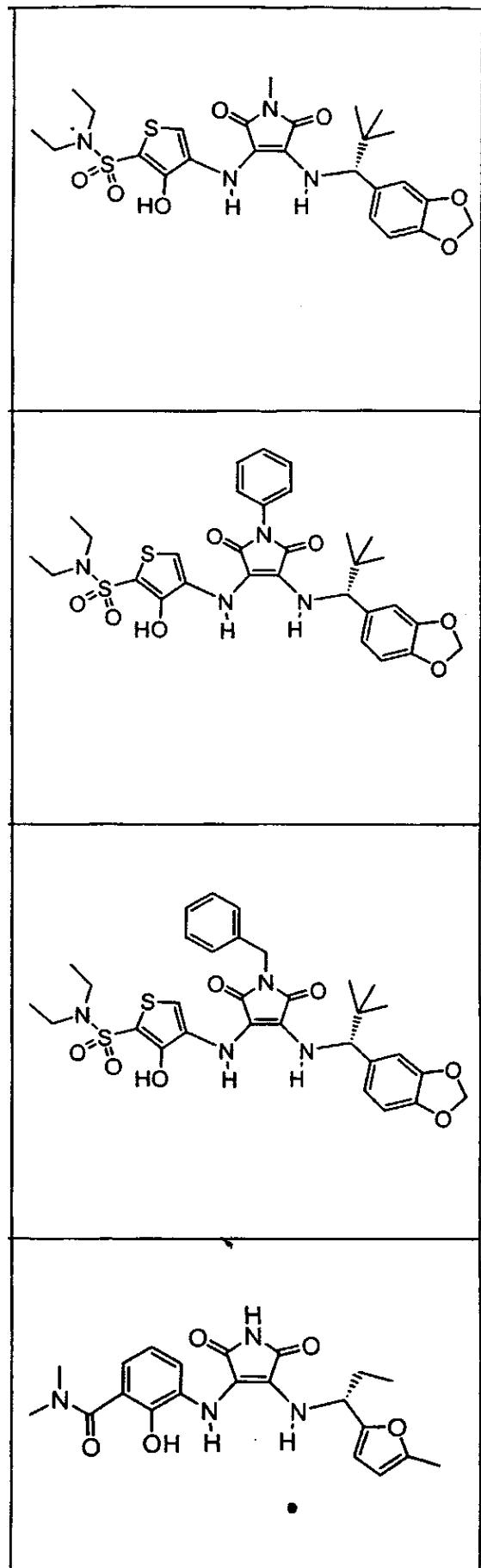


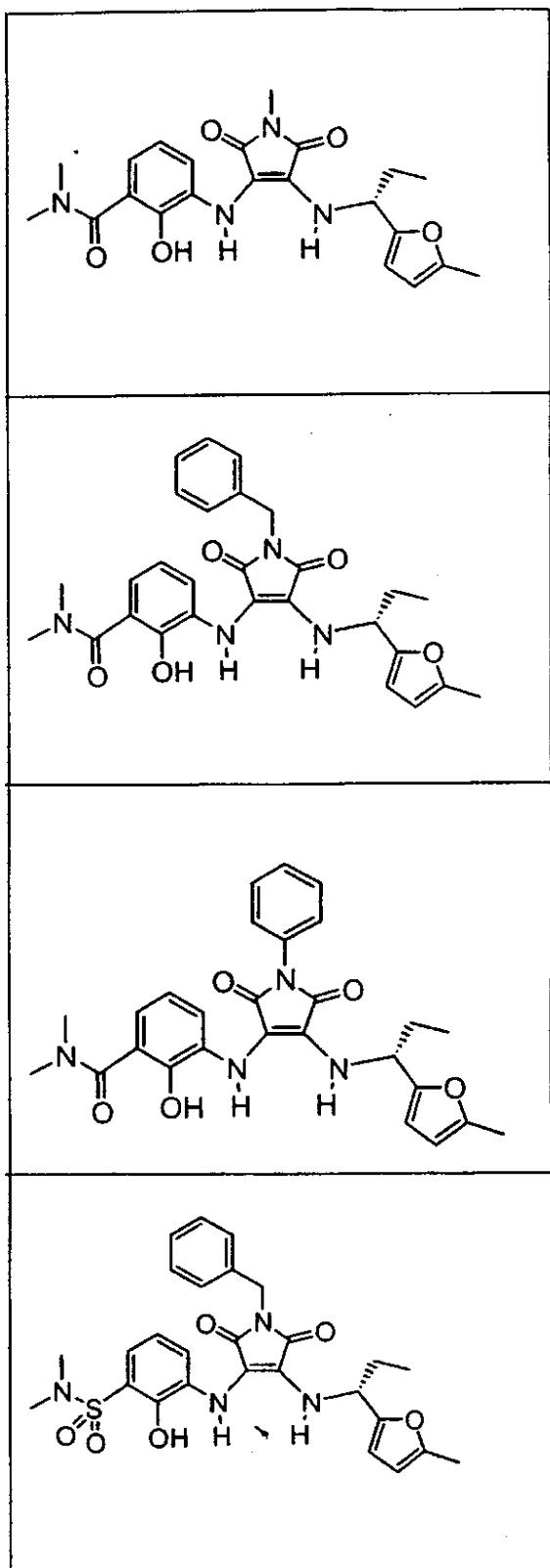


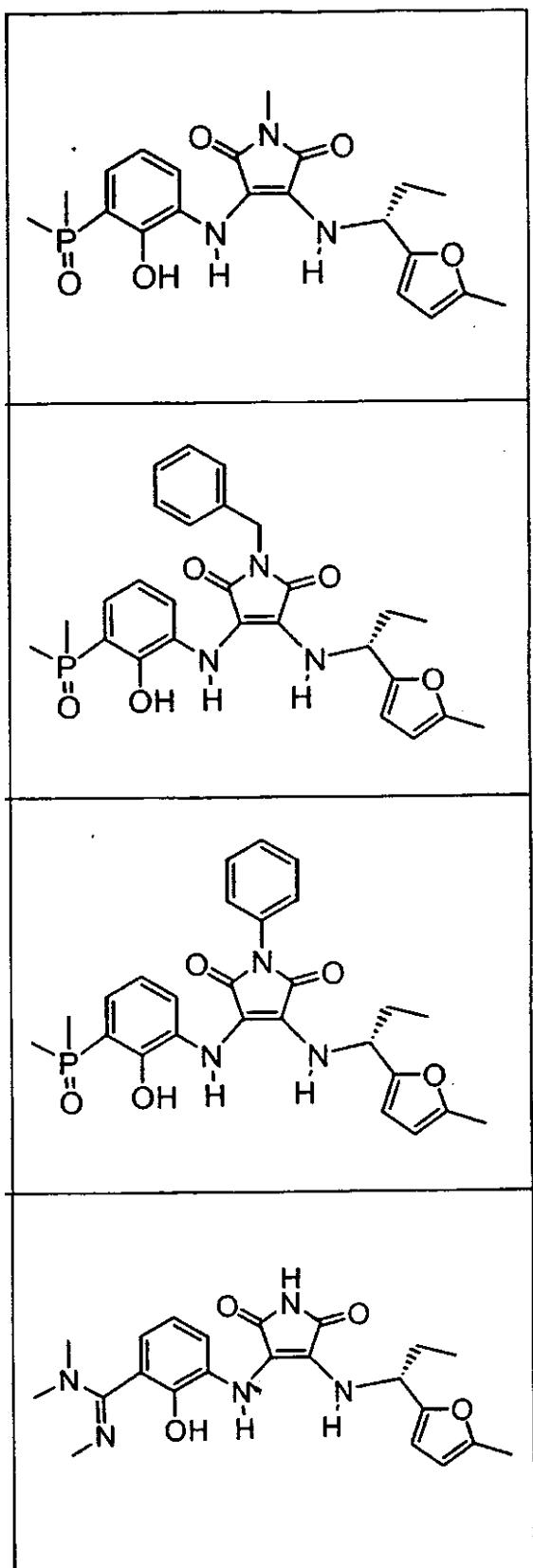


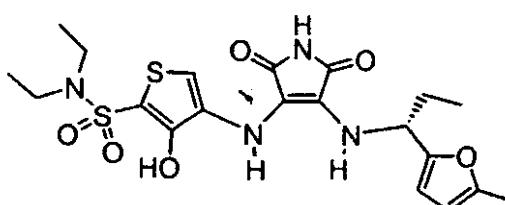
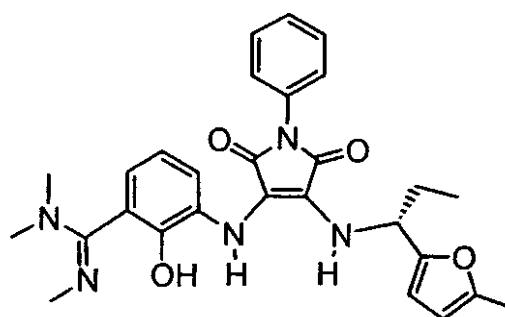
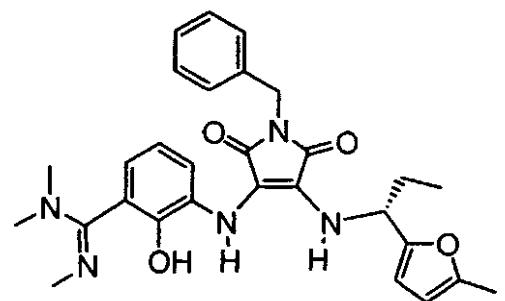
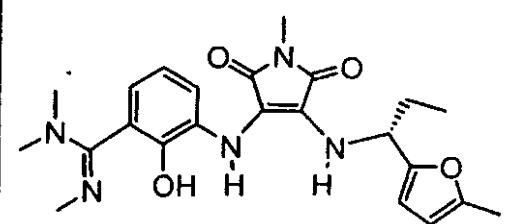


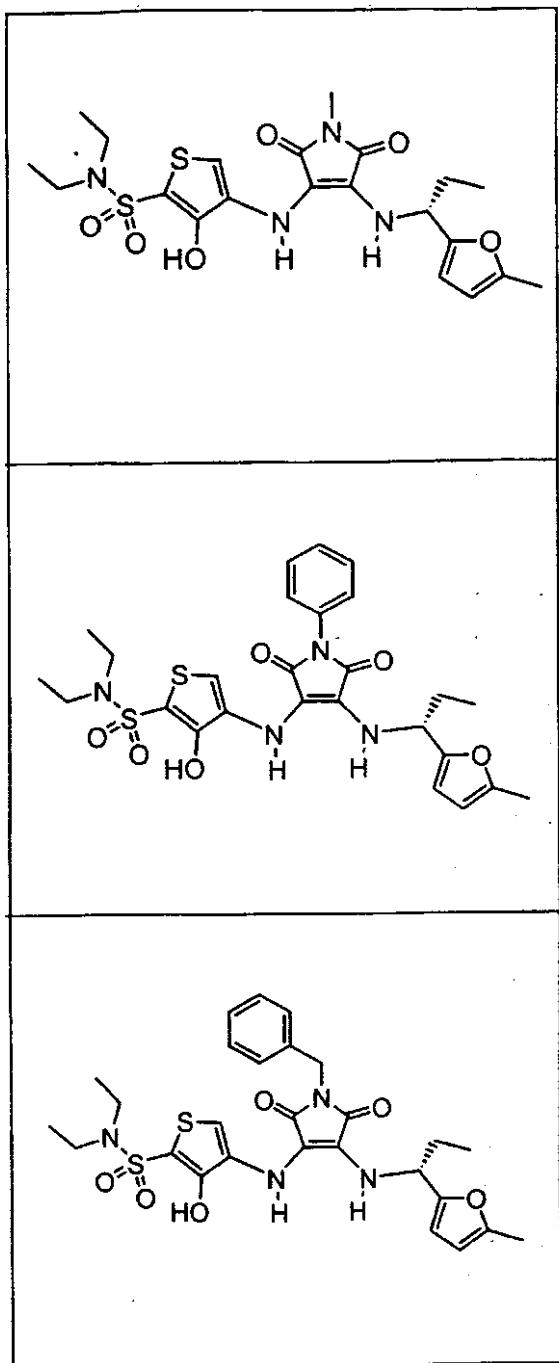












から構成された群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 4】

請求項 1 記載の化合物およびそのための薬学的に許容できる担体を含む薬剤組成物。

【請求項 1 5】

ケモカイン媒介疾患を処置するための請求項 1 に記載の化合物を含む薬学的組成物であって、該ケモカイン媒介疾患が、以下：

乾癬、アトピー性皮膚炎、喘息、COPD、成人呼吸器疾患、関節炎、炎症性腸疾患、クローン病、潰瘍性大腸炎、敗血症性ショック、エンドドキシンショック、グラム陰性菌敗血症、トキシックショック症候群、卒中、心および腎の再灌流傷害、糸球体腎炎、血栓症、アルツハイマー病、対宿主性移植片反応、同種移植片拒絶、マラリア、急性呼吸窮迫症候群、遅延型過敏反応、アテローム性動脈硬化症、大脳および心虚血、変形性関節症、多発性硬化症、再狭窄 (restenosis)、新脈管形成、骨粗しょう症、歯肉炎、呼吸器ウイルス類、ヘルペスウイルス、肝炎ウイルス類、HIV、カポジ肉腫関連ウイルス、髄膜炎、囊胞性線維症、早産、咳、そう痒、多臓器不全、外傷、過労、捻挫、打撲、乾

癤性関節炎、ヘルペス、脳炎、CNS脈管炎、外傷性脳傷害、CNS腫瘍類、くも膜下出血、術後損傷、間質性肺実質炎、過敏症、結晶（結石）誘発関節炎、急性および慢性膵炎、急性アルコール性肝炎、壊死性腸炎、慢性静脈洞炎、新脈管形成眼疾患、眼炎症、未熟児網膜症、糖尿病性網膜症、湿润タイプ優先の黄斑変性および角膜新生血管形成、多発性筋炎、脈管炎、挫瘍、消化管および十二指腸潰瘍、セリアック病、食道炎、舌炎、気流障害、気道応答過敏症、気管支拡張症、細気管支炎、閉塞性細気管支炎、慢性気管支炎、肺性心、咳、呼吸困難、気腫、高炭酸ガス症、過膨張、低酸素血症、高酸素症誘発炎症、低酸素症、外科手術による肺容量低下、肺線維症、肺高血圧、右心室肥大、連続携行式腹膜透析（CAPD）関連腹膜炎、顆粒球エールリヒア症、サルコイド肉腫、小気道疾患、換気・灌流不適合、ぜん鳴、風邪、痛風、アルコール性肝疾患、狼瘍、熱傷治療、歯周炎、移植再灌流傷害および早期移植からなる群より選択される、方法。

【請求項16】

癌を治療するための請求項1記載の化合物を含む薬学的組成物；あるいは

癌を治療するための、少なくとも1種の公知の抗癌剤および/または放射線療法をともなう使用のための請求項1記載の化合物を含む薬学的組成物；あるいは

癌を治療するための、少なくとも1種の公知の抗癌剤および/または放射線療法をともなう使用のための請求項1記載の化合物を含む薬学的組成物であって、該抗癌剤がアルキル化剤、代謝拮抗物類、天然物類およびそれらの誘導体類、ホルモン類、抗ホルモン剤類、抗新脈管形成剤類およびステロイド類（合成アナログを含む）、および化学合成物類から構成された群から選択される、薬学的組成物。

【請求項17】

新脈管形成を阻害するための請求項1記載の化合物を含む薬学的組成物；あるいは

新脈管形成を阻害するための、少なくとも1種の公知の抗新脈管形成化合物をともなう使用のための請求項1記載の化合物を含む薬学的組成物；あるいは

新脈管形成を阻害するための、少なくとも1種の公知の抗新脈管形成化合物をともなう使用のための請求項1記載の化合物を含む薬学的組成物であって、該公知の抗新脈管形成化合物が、マリマstatt、AG3340、Col-3、ネオバstatt、BMS-275291、サリドマイド、スクアラミン、エンドスタチン、SU-5416、SU-6668、インタフェロン-、抗VEGF抗体、EMD121974、CAI、インタロイキン-12、IM862、血小板第4因子、ビタキシン、アンギオスタチン、スラミン、TNP-470、PTK-787、ZD-6474、ZD-101、Bay129566、CGS27023A、VEGFレセプターキナーゼ阻害剤類、タキソテレおよびタキソールからなる群より選択される、薬学的組成物；あるいは

新脈管形成を阻害するための請求項1記載の化合物を含む薬学的組成物であって、前記腫瘍タイプがメラノーマ、消化管腫瘍または非小細胞肺癌である薬学的組成物；あるいは

新脈管形成を阻害するための、少なくとも1種の公知の抗癌剤および/または放射線療法をともなう使用のための請求項1記載の化合物を含む薬学的組成物；あるいは

新脈管形成を阻害するための、少なくとも1種の公知の抗癌剤および/または放射線療法をともなう使用のための請求項1記載の化合物を含む薬学的組成物であって、該抗癌剤がアルキル化剤、代謝拮抗物類、天然物類およびそれらの誘導体類、ホルモン類、抗ホルモン剤類、抗新脈管形成剤類およびステロイド類（合成アナログを含む）、および化学合成物類から構成された群から選択される、薬学的組成物；あるいは

新脈管形成を阻害するための、少なくとも1種の公知の抗癌剤および/または放射線療法をともなう使用のための請求項1記載の化合物を含む薬学的組成物であって、該抗癌剤がアルキル化剤、代謝拮抗物類、天然物類およびそれらの誘導体類、ホルモン類、抗ホルモン剤類、抗新脈管形成剤類およびステロイド類（合成アナログを含む）、および化学合成物類から構成された群から選択され、該抗新脈管形成剤が、マリマstatt、AG3340、Col-3、ネオバstatt、BMS-275291、サリドマイド、スクアラミン、エンドスタチン、SU-5416、SU-6668、インタフェロン-、抗VEG

F抗体、EMD121974、CAI、インタロイキン-12、IM862、血小板第4因子、ビタキシン、アンギオスタチン、スラミン、TNP-470、PTK-787、ZD-6474、ZD-101、Bay129566、CGS27023A、VEGFレセプター-キナーゼ阻害剤類、タキソテレおよびタキソールからなる群より選択される、薬学的組成物。