

【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 0 7 D	207/456	(2006.01)
A 6 1 K	31/337	(2006.01)
A 6 1 K	31/4015	(2006.01)
A 6 1 K	31/402	(2006.01)
A 6 1 K	31/4025	(2006.01)
A 6 1 K	31/4155	(2006.01)
A 6 1 K	31/4192	(2006.01)
A 6 1 K	31/4439	(2006.01)
A 6 1 K	31/454	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
A 6 1 K	31/506	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 K	31/56	(2006.01)
A 6 1 K	39/395	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/02	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	1/18	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(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	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/08	(2006.01)
A 6 1 P	11/10	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	19/06	(2006.01)
A 6 1 P	19/10	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 P	31/18	(2006.01)
A 6 1 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

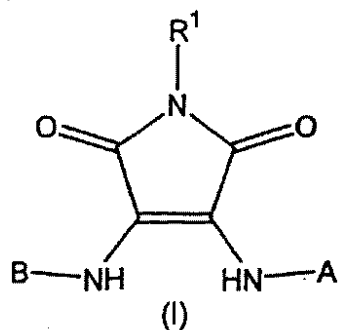
【補正の内容】

【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) CF₃d) COR^{1 3}

e) OH

f) NR^{1 3}R^{1 4}

g) NO_2

h) シアノ

i) - Si (アルキル)

j) - Si (アリール)

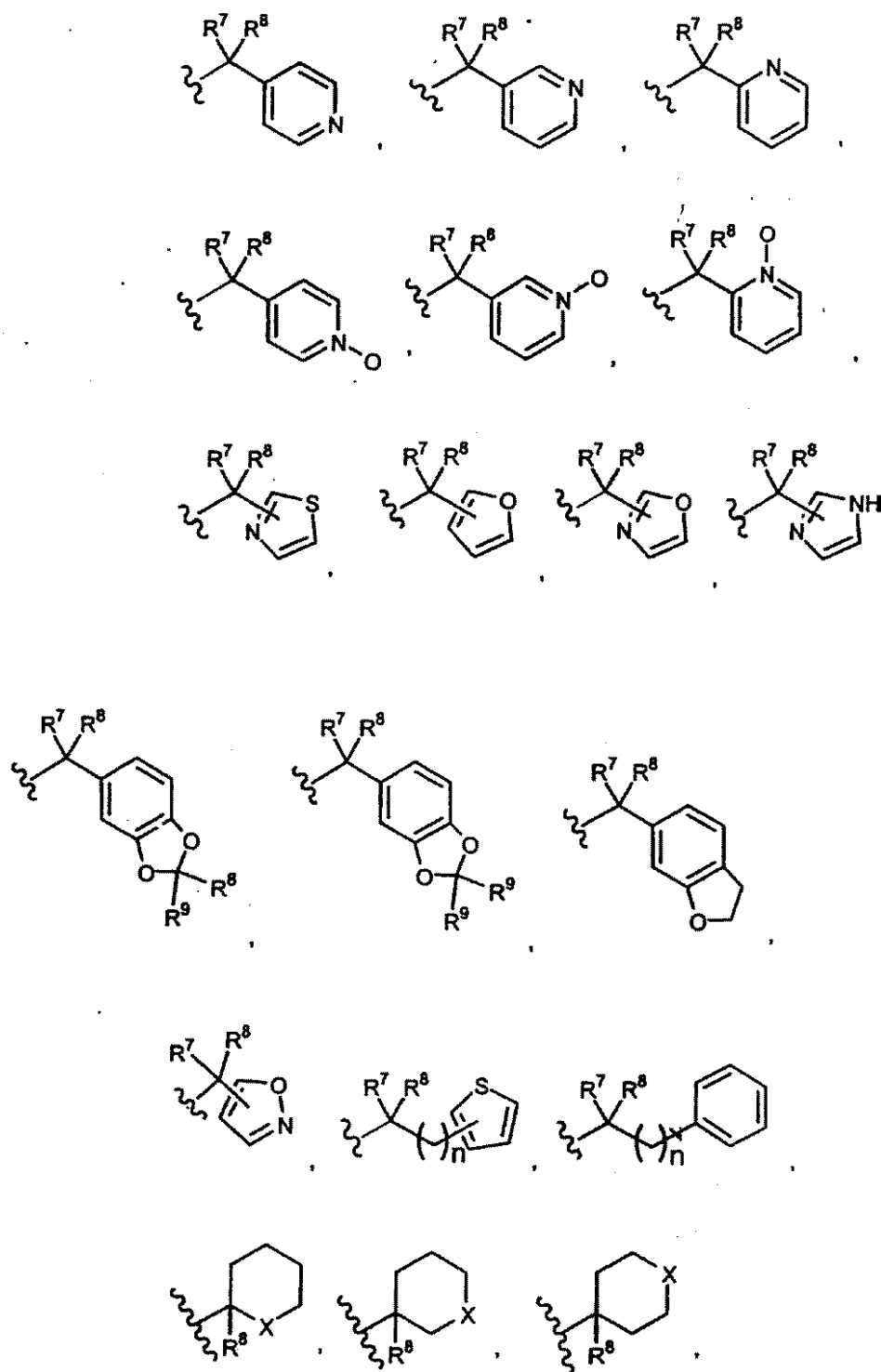
k) SO_2 OR^{1 3}l) CO_2 R^{1 3}m) CONR^{1 3} R^{1 4}n) SO_2 NR^{1 3} R^{1 4}o) SO_2 R^{1 3}p) - OR^{1 3}r) - NR^{1 3} R^{1 4}s) - O (C=O) R^{1 3}t) - O (C=O) NR^{1 3} R^{1 4}u) - NR^{1 3} COR^{1 4} およびv) - NR^{1 3} CO_2 R^{1 4}

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：

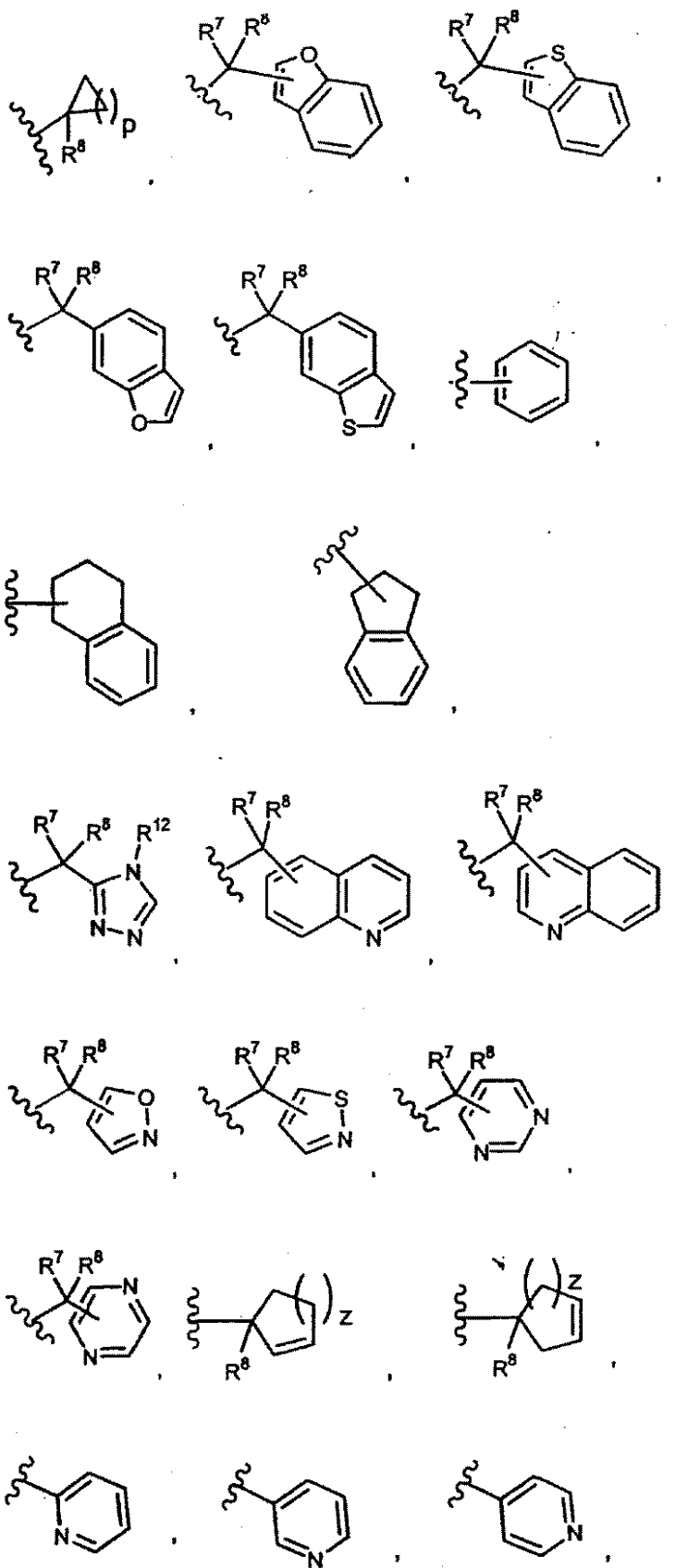
A は、

【化 2】

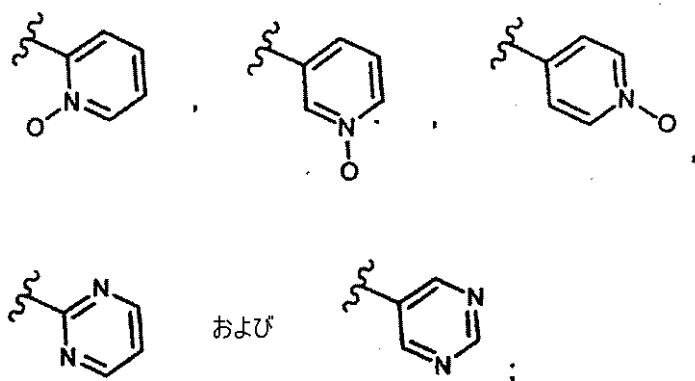
(1)



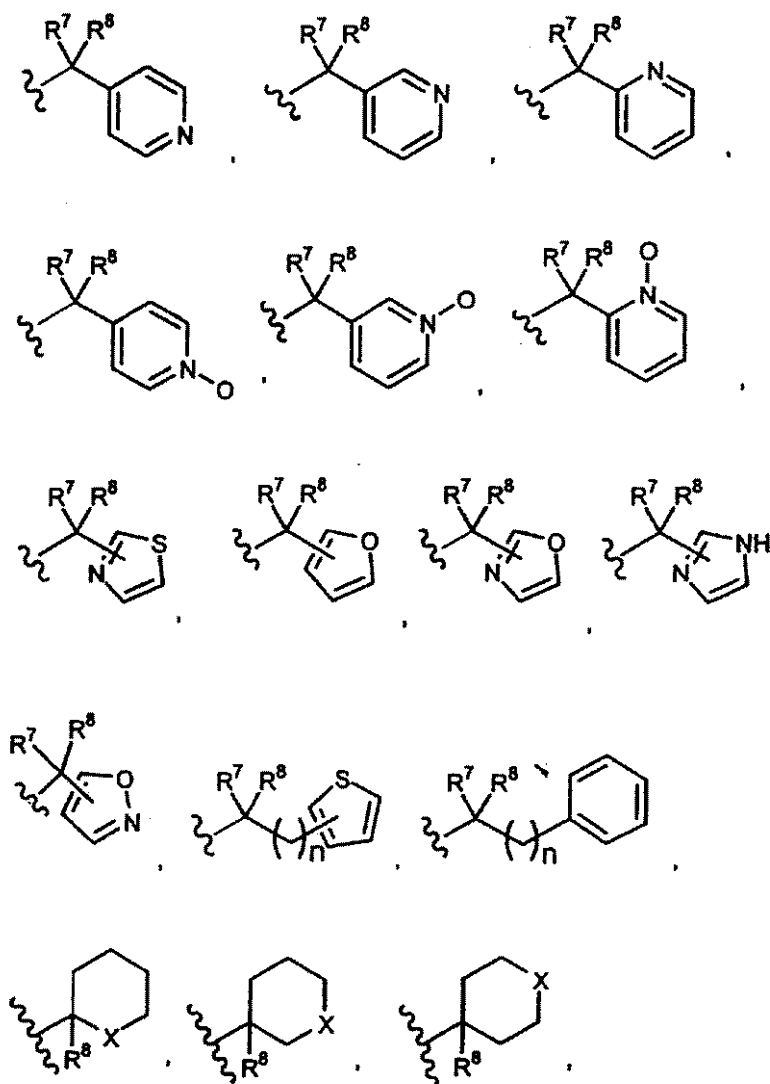
【化 3】



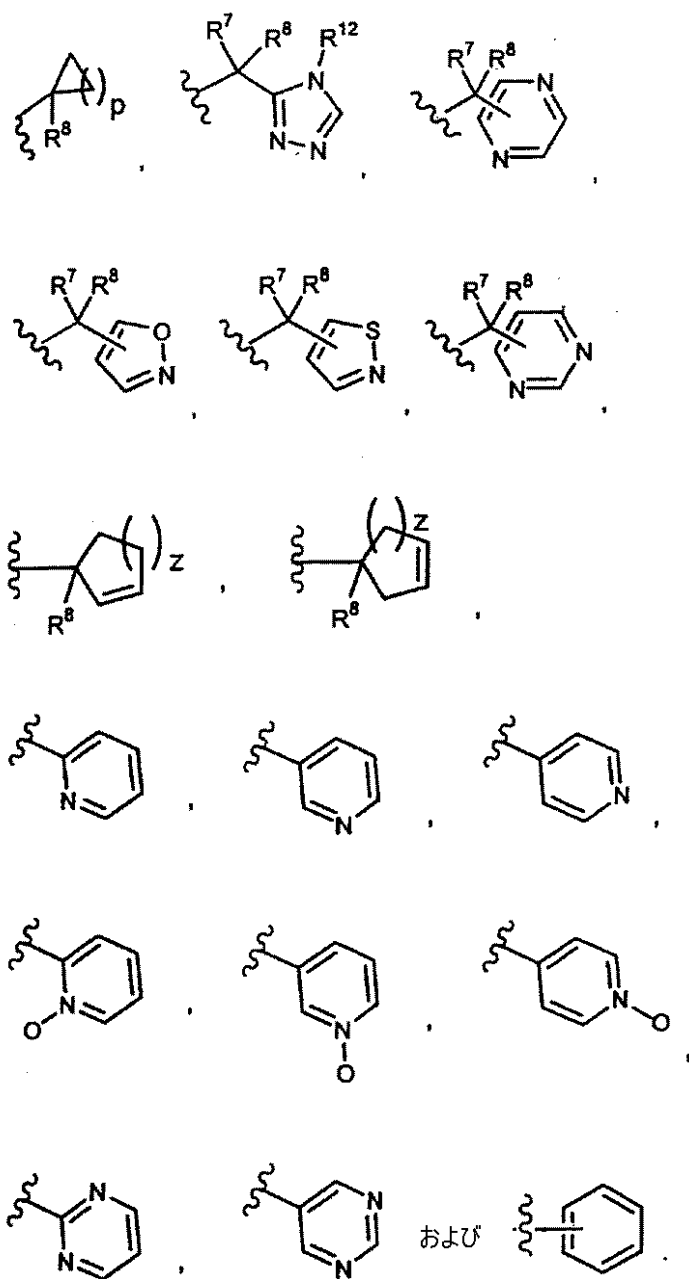
【化 4】



(2)



【化 5】

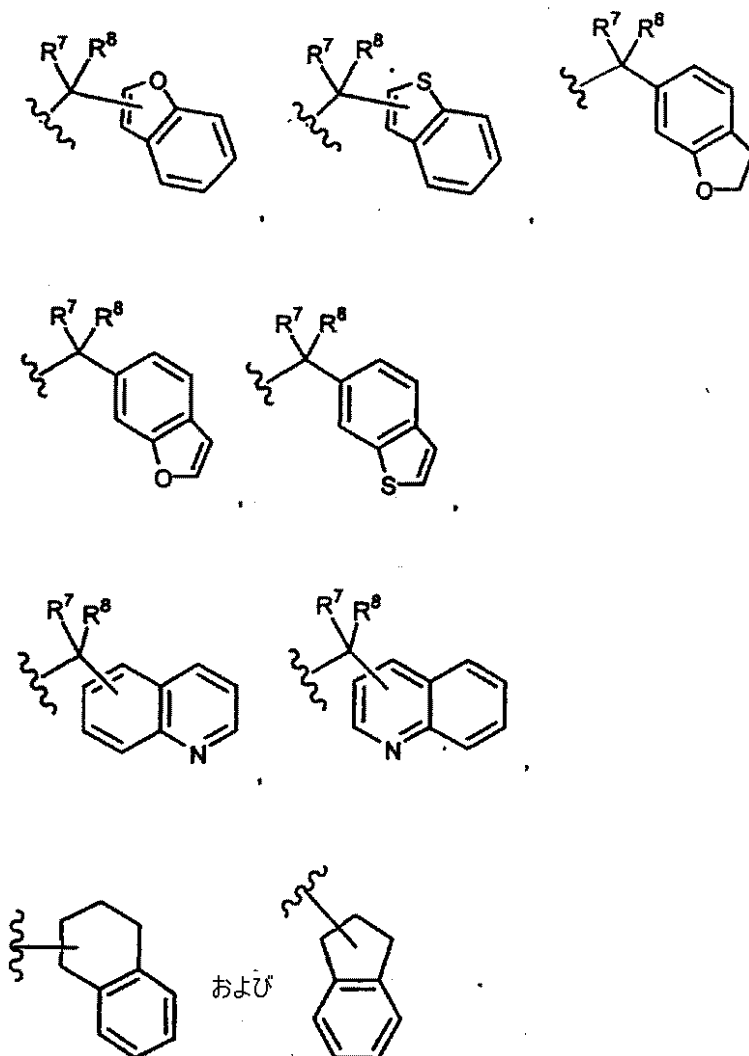


からなる群より選択され、

ここで、上記 A 基の上記環は、 R^9 基；

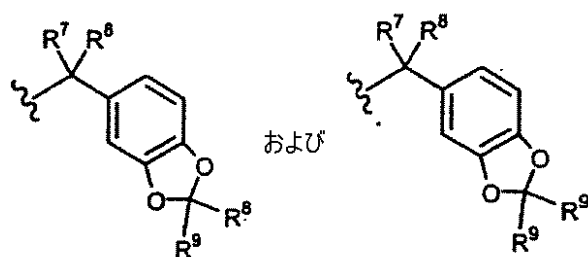
【化 6】

(3)

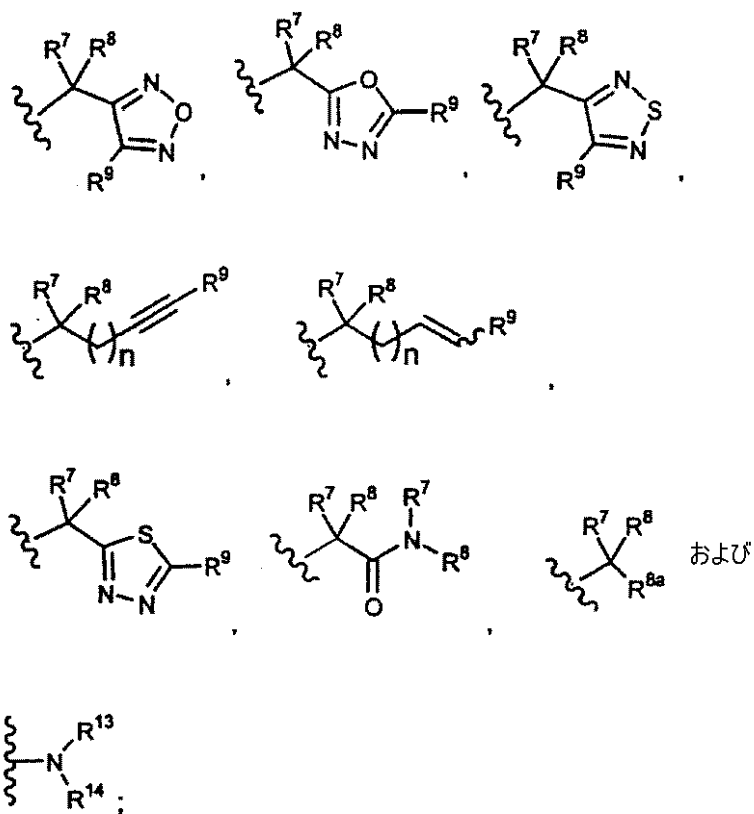
(式中、上記 A 基の上記環の 1 個または両者は、R⁹ 基；

【化 7】

(4)

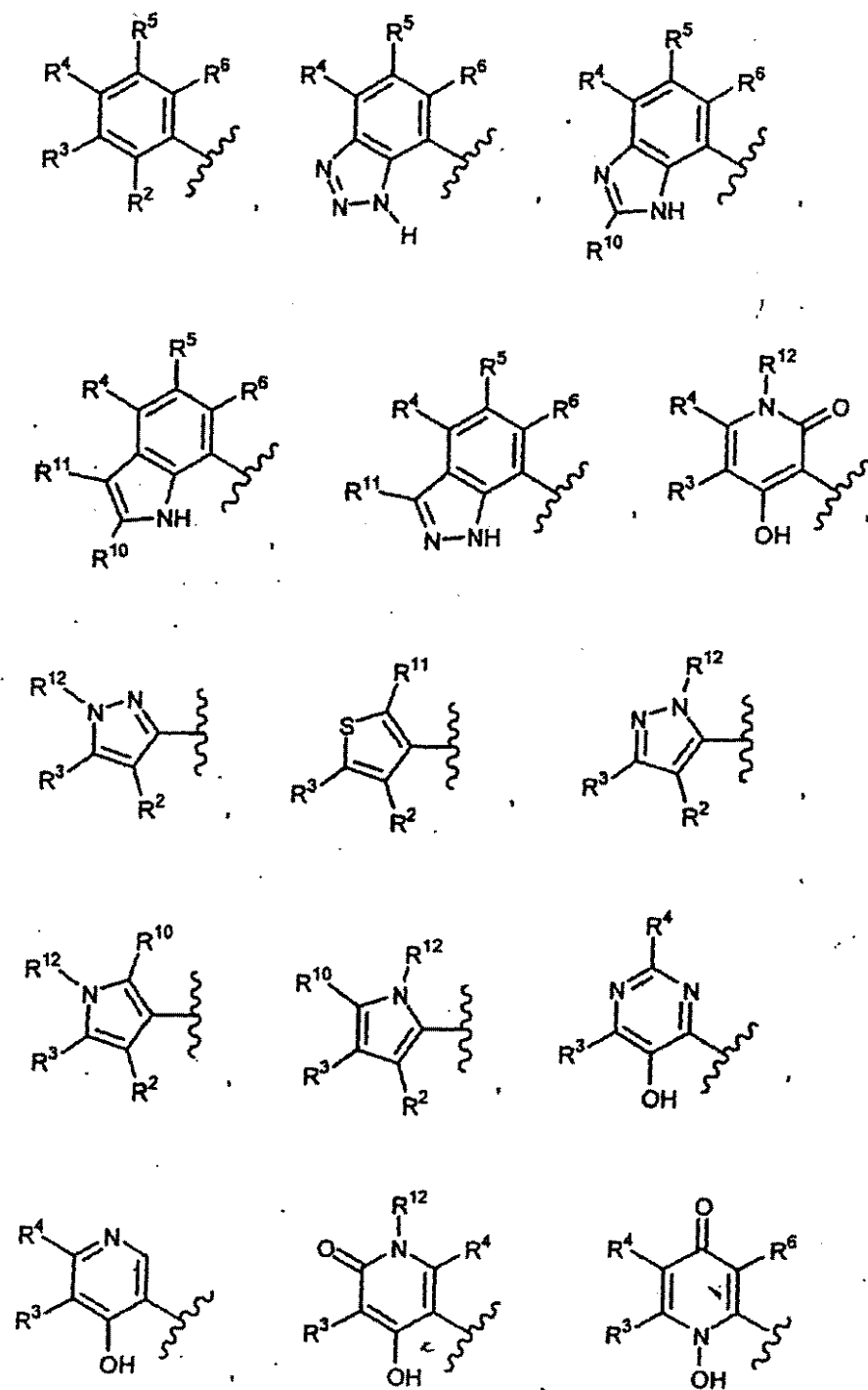
(式中、上記 A 基の上記フェニル環は、R⁹ 基；および

(5)

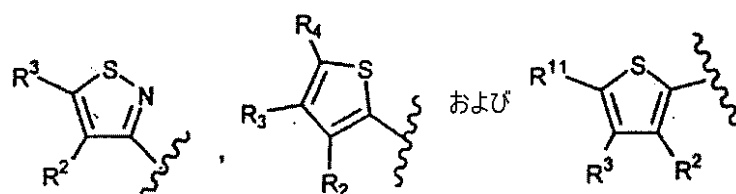


からなる群より各々独立して選択された 1 個乃至 3 個の置換基によって置換されている)
 からなる群より各々独立して選択された 1 個乃至 6 個の置換基によって置換されている)
 からなる群より各々独立して選択された 1 個乃至 6 個の置換基によって置換されており;
 B は、

【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；

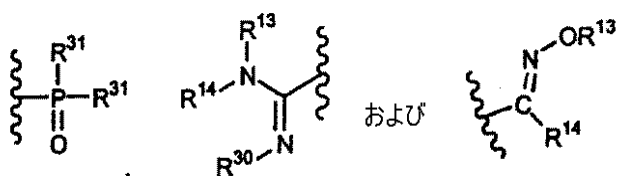
XはO、NHまたはSであり；

Zは1乃至3であり；

R^2 は、水素、OH、 $-C(O)OH$ 、 $-SH$ 、 $-SO_2NR^{13}R^{14}$ 、 $-NHC(O)R^{13}$ 、 $-NHSO_2NR^{13}R^{14}$ 、 $-NHSO_2R^{13}$ 、 $-NR^{13}R^{14}$ 、 $-C(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-C(O)NHOR^{13}$ 、 $-C(O)NR^{13}OH$ 、 $-S(O_2)OH$ 、 $-OC(O)R^{13}$ 、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、 R^9 基からなる群より独立して選択され；

各 R^3 および R^4 は、水素、シアノ、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、 $-OH$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(O)R^{13}$ 、 $-C(O)OR^{13}$ 、 $-C(O)NHR^{17}$ 、 $-C(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-SO(t)NR^{13}R^{14}$ 、 $-SO(t)R^{13}$ 、 $-C(O)NR^{13}OR^{14}$ 、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、 R^9 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 R^9 基からなる群より選択され；

各 R^5 および R^6 は同一または異なり、水素、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(O)R^{13}$ 、 $-C(O)OR^{13}$ 、 $-C(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-SO(t)NR^{13}R^{14}$ 、 $-C(O)NR^{13}OR^{14}$ 、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、 R^9 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 R^9 基からなる群より選択され；

各 R^7 および R^8 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、 $-CO_2R^{13}$ 、 $-CONR^{13}R^{14}$ 、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 R^7 および R^8 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) $-CF_3$

c) $-COR^{13}$

d) $-OR^{13}$

e) $-NR^{13}R^{14}$

f) $-NO_2$

g) $-CN$

h) $-SO_2OR^{13}$

i) $-Si(\text{アルキル})_3$ 、ここで、各アルキルは独立して選択される、

j) $-Si(\text{アリール})_3$ 、ここで、各アルキルは独立して選択される、

k) $-(R^{13})_2R^{14}Si$ 、ここで各 R^{13} は、独立して選択される、

l) $-CO_2R^{13}$ 、

- m) - C (O) N R ^{1 3} R ^{1 4}
 n) - S O ₂ N R ^{1 3} R ^{1 4}
 o) - S O ₂ R ^{1 3}
 p) - O C (O) R ^{1 3}
 q) - O C (O) N R ^{1 3} R ^{1 4}
 r) - N R ^{1 3} C (O) R ^{1 4} および
 s) - N R ^{1 3} C O ₂ R ^{1 4}

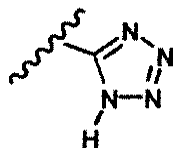
(フルオロアルキルは、ハロゲンで置換されたアルキル基の1個の非限定的例である)
 からなる群より選択され;

R ^{8 a} 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 R ⁹ は、

- a) - R ^{1 3}
 b) ハロゲン
 c) - C F ₃
 d) - C O R ^{1 3}
 e) - O R ^{1 3}
 f) - N R ^{1 3} R ^{1 4}
 g) - N O ₂
 h) - C N
 i) - S O ₂ R ^{1 3}
 j) - S O ₂ N R ^{1 3} R ^{1 4}
 k) - N R ^{1 3} C O R ^{1 4}
 l) - C O N R ^{1 3} R ^{1 4}
 m) - N R ^{1 3} C O ₂ R ^{1 4}
 n) - C O ₂ R ^{1 3}
 o)

【化12】



p) 1個以上の - O H 基によって置換されたアルキル、

q) 1個以上の - N R ^{1 3} R ^{1 4} 基によって置換されたアルキル、および

r) - N (R ^{1 3}) S O ₂ R ^{1 4}

からなる群より独立して選択され;

各 R ^{1 0} および R ^{1 1} は、R ^{1 3}、ハロゲン、- C F ₃、- O C F ₃、- N R ^{1 3} R ^{1 4}
⁴、- N R ^{1 3} C (O) N R ^{1 3} R ^{1 4}、- O H、- C (O) O R ^{1 3}、- S H、- S O
 (t) N R ^{1 3} R ^{1 4}、- S O ₂ R ^{1 3}、- N H C (O) R ^{1 3}、- N H S O ₂ N R ^{1 3}
 R ^{1 4}、- N H S O ₂ R ^{1 3}、- C (O) N R ^{1 3} R ^{1 4}、- C (O) N R ^{1 3} O R ^{1 4}
 、- O C (O) R ^{1 3} およびシアノからなる群より独立して選択され;

R ^{1 2} は、水素、- C (O) O R ^{1 3}、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 R ^{1 2} 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 R ⁹ 基からなる群より選択され
 ;

各 R ^{1 3} および R ^{1 4} 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^{13} 基および R^{14} 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、 $-CF_3$ 、 $-OH$ 、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、 $-N(R^{40})_2$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $-S(O)_tNR^{15}R^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-SO_2R^{15}$ からなる群より独立して選択され、ただし、 R^{15} は、 H 、ハロゲンおよび $-NHC(O)NR^{15}R^{16}$ ではない；または、

R^{13} および R^{14} はそれらが $-C(O)NR^{13}R^{14}$ 基および $-SO_2NR^{13}R^{14}$ 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^{18} 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^{13} および R^{14} 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、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $-S(O)_tNR^{15}R^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-SO_2R^{15}$ からなる群より独立して選択され、ただし、 R^{15} は、 H 、 $-NHC(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $-NHC(O)OR^{15}$ 、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^{15} および R^{16} 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^{17} は、 $-SO_2$ アルキル、 $-SO_2$ アリール、 $-SO_2$ シクロアルキル、および $-SO_2$ ヘテロアリールからなる群より選択され；

R^{18} は、 H 、アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-C(O)R^{19}$ 、 $-SO_2R^{19}$ および $-C(O)NR^{19}R^{20}$ からなる群より選択され；

各 R^{19} および R^{20} 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^{30} は、アルキル、シクロアルキル、 $-CN$ 、 $-NO_2$ または $-SO_2R^{15}$ からなる群より選択され、ただし R^{15} は H でなく；

各 R^{31} 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^{31} 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 $-CF_3$ からなる群より独立して選択され；

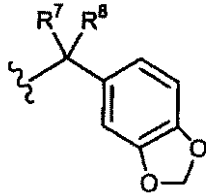
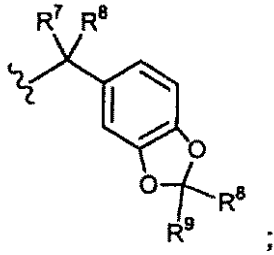
各 R^{40} は、 H 、アルキルおよびシクロアルキルからなる群より独立して選択され；および

t は、0、1 または 2 である、化合物。

【請求項 2】

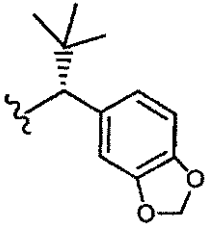
A が下記：

【化 1 3】



または

【化 1 4】

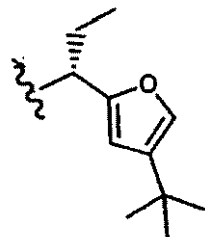
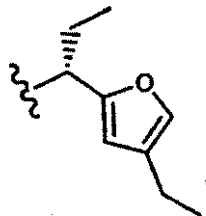
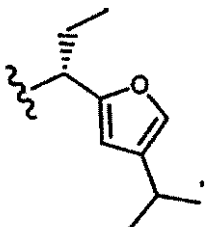
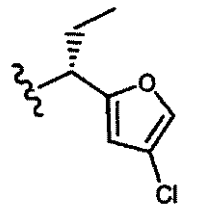
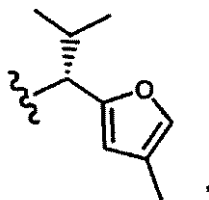
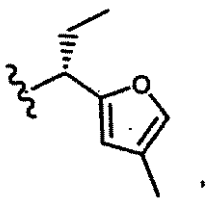
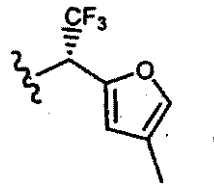
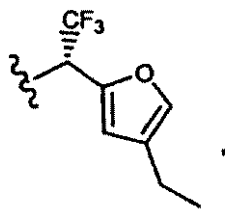
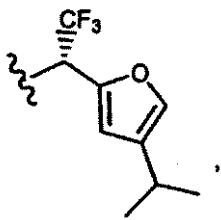


より選択され、ここで R^7 が H であり、 R^8 がアルキルである、請求項 1 記載の化合物。

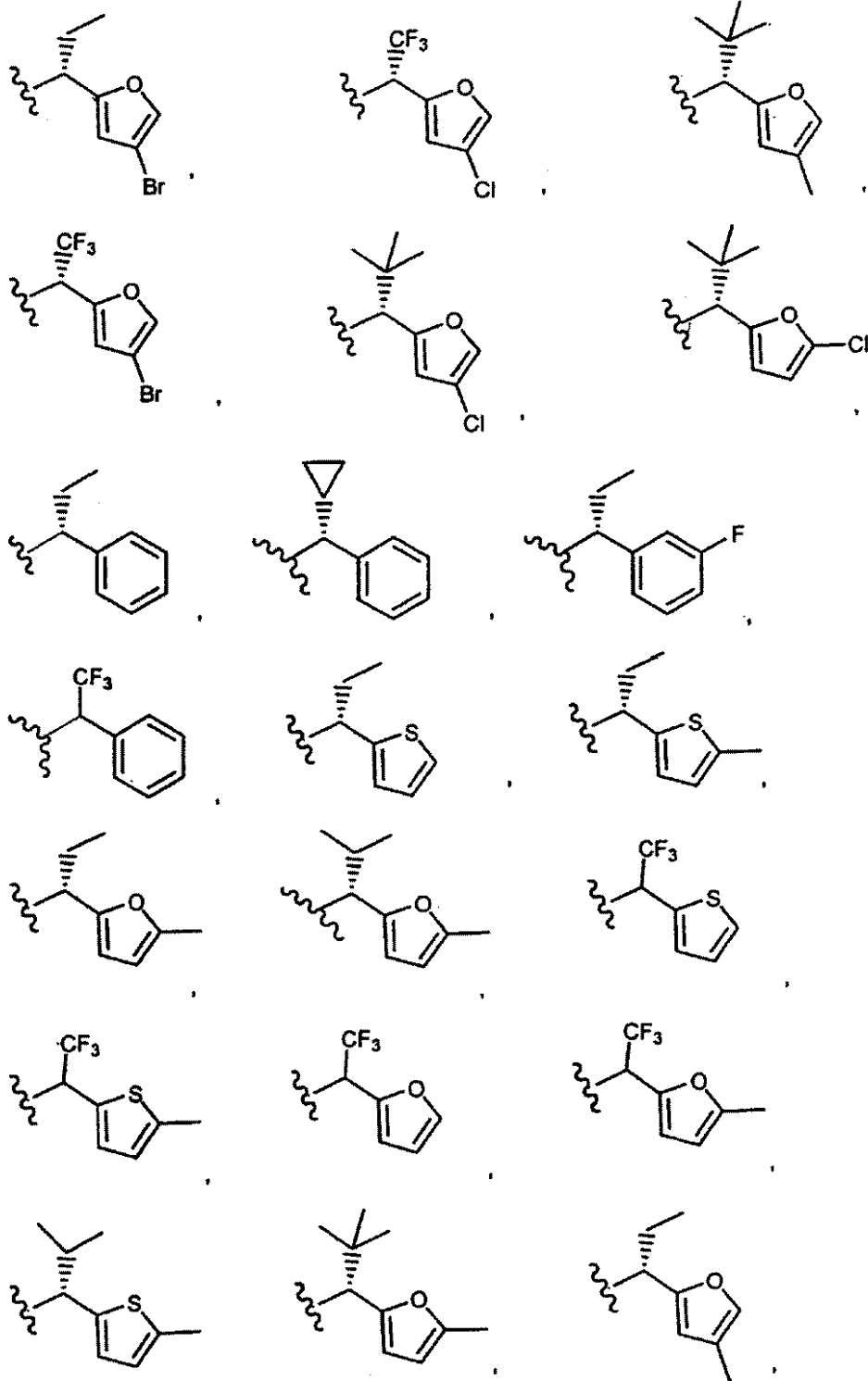
【請求項 3】

A が下記：

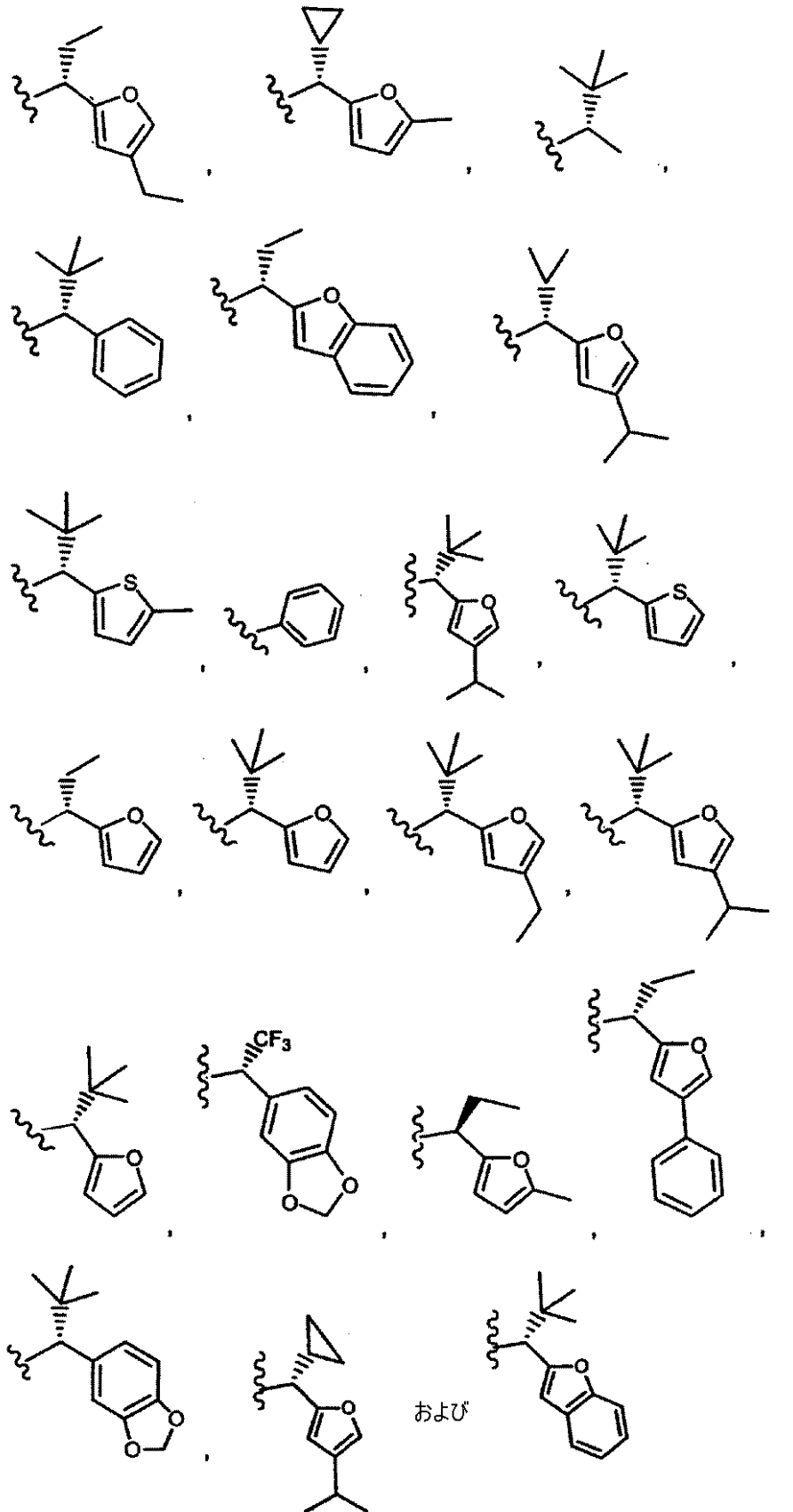
【化 1 5】



【化 16】



【化 17】

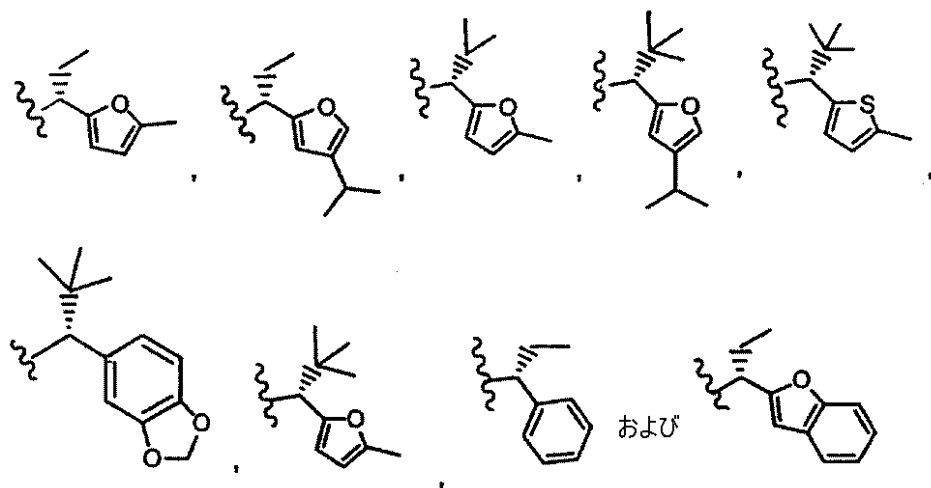


からなる群より選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 4】

A が下記：

【化 18】

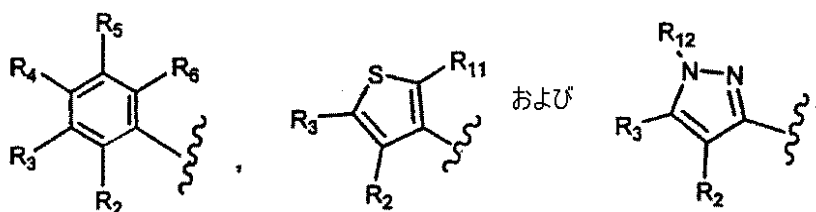


からなる群より選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 5】

B が下記：

【化 19】

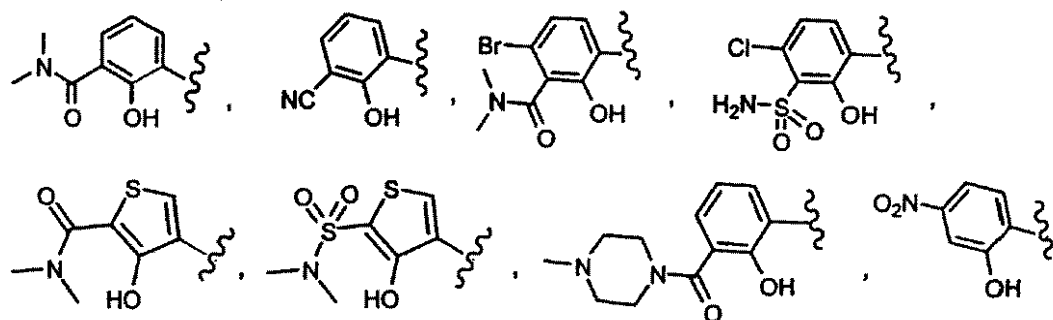


からなる群より選択される請求項 1 記載の化合物。

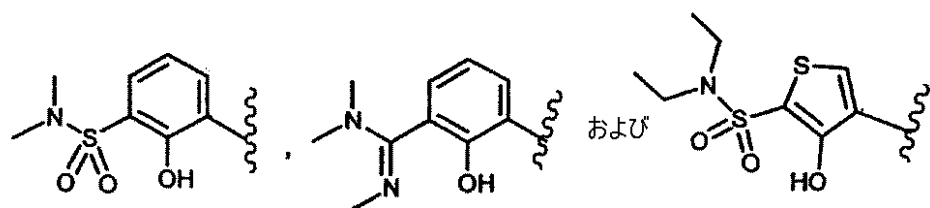
【請求項 6】

B が下記：

【化 20】



【化 21】

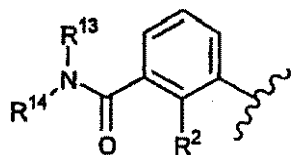
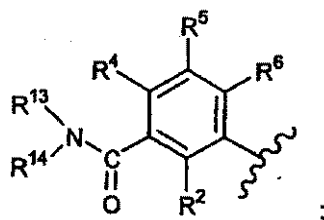


からなる群より選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 7】

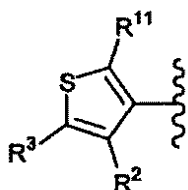
B が下記：

【化 2 2】



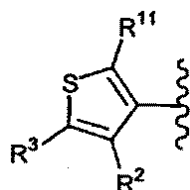
ここで R^2 は、 $-OH$ であり、 R^{13} および R^{14} は、独立して H およびアルキルからなる群より選択され；

【化 2 3】



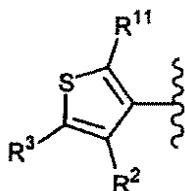
ここで R^{11} は、 H であり；

【化 2 4】



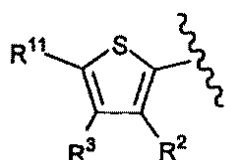
ここで R^2 は、 $-OH$ であり、 R^3 は $-C(O)NR^{13}R^{14}$ であり、そして R^{11} は H であり；

【化 2 5】



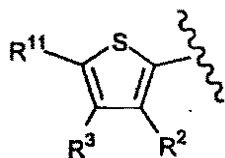
ここで R^2 は、 $-OH$ であり、 R^3 は $-S(O)_tNR^{13}R^{14}$ であり、そして R^{11} は H であり；

【化 2 6】



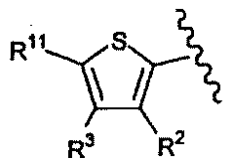
ここで R^{11} は、 H であり；

【化 2 7】



ここで R² は、-OH であり、R³ 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 2 8】



ここで R² は、-OH であり、R³ は -S(O)_tNR^{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】

R¹ 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

R¹ 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。

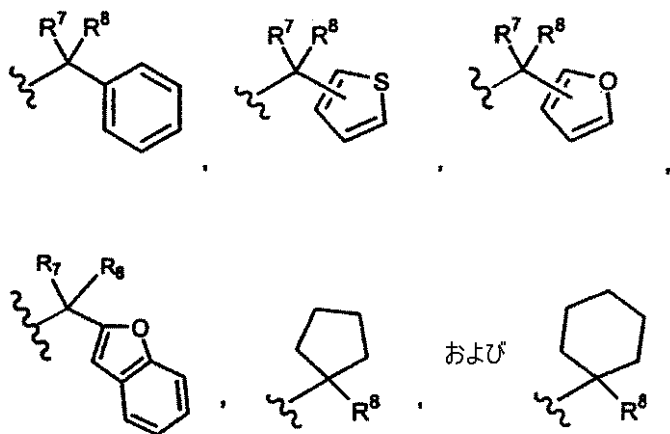
【請求項 9】

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 2 9】

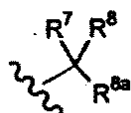
(a)



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 -CF₃ 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；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

【化 3 0】

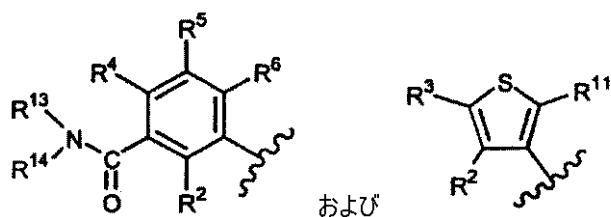
(b)



式中、 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 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 3 1】



式中、

R^2 は H 、 OH 、 $-NHC(O)R^{13}$ および $-NH SO_2 R^{13}$ からなる群より選択され；

R^3 は、 $-C(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-SO_2NR^{13}R^{14}$ 、 $-NO_2$ 、シアノ、 $-SO_2R^{13}$ ；および $-C(O)OR^{13}$ からなる群より選択され；

R^4 は、 H 、 $-NO_2$ 、シアノ、 $-CH_3$ または $-CF_3$ からなる群より選択され；

R^5 は、 H 、 $-CF_3$ 、 $-NO_2$ 、ハロゲンおよびシアノからなる群より選択され；そして

R^6 は、 H 、アルキルおよび $-CF_3$ からなる群より選択され；

R^{11} 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 R^{13} および R^{14} 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；

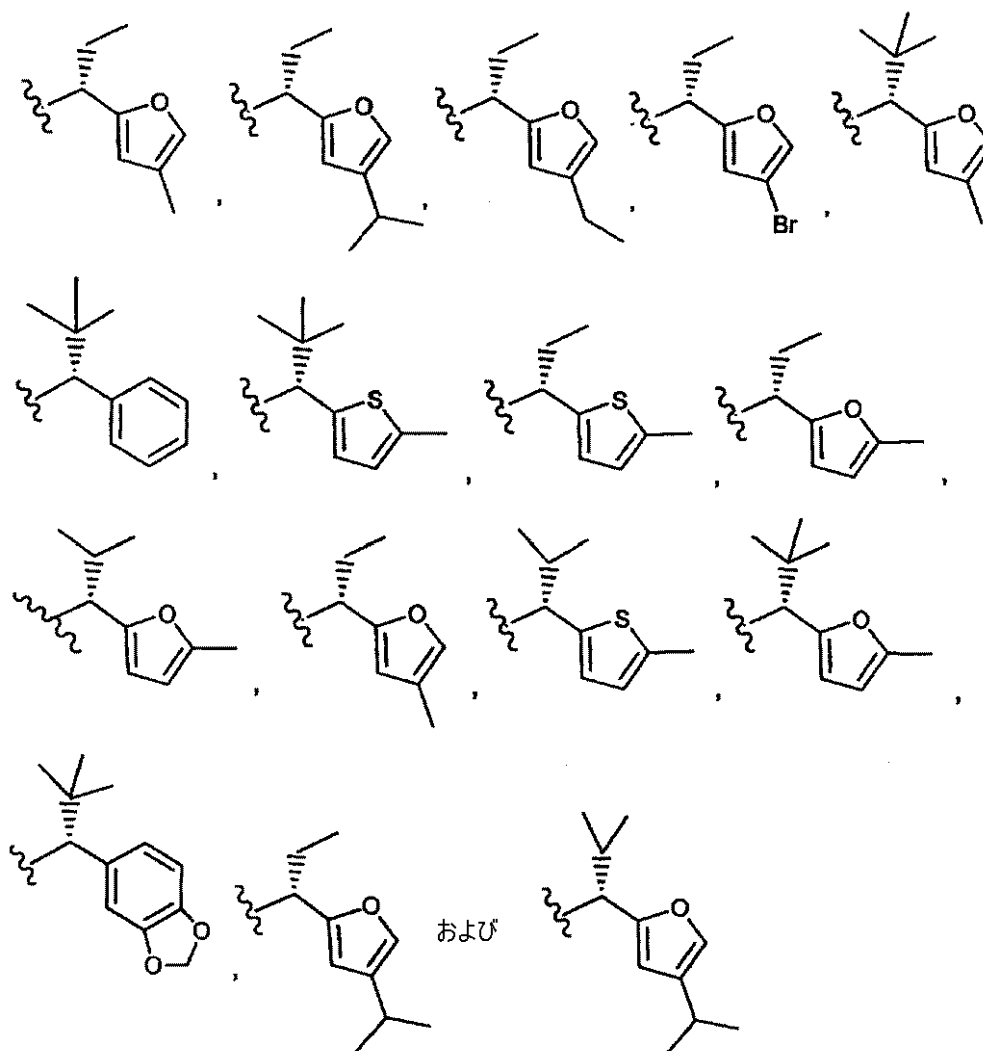
R^{13} および R^{14} はそれらが基 $-NR^{13}R^{14}$ 、 $-C(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-SO_2NR^{13}R^{14}$ 、 $-OC(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-CONR^{13}R^{14}$ 、 $-NR^{13}C(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-SO_tNR^{13}R^{14}$ 、 $-NH SO_2NR^{13}R^{14}$ 中で結合している窒素とともに無置換または置換された飽和複素環（好ましくは 3 員乃至 7 員環）を形成し、前記環は適宜、 O 、 S または NR^{18} から選択された 1 個のさらなるヘテロ原子を有し、ここで、 R^{18} は、 H 、アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-C(O)R^{19}$ 、 $-SO_2R^{19}$ および $-C(O)NR^{19}R^{20}$ から選択され、ここで、各 R^{19} および R^{20} 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 R^{13} および R^{14} 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、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $-SO_tNR^{15}R^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-SO_2R^{15}$ からなる群より独立して選択され、ただしここで、 R^{15} は、 H 、 $-NHC(O)NR^{15}R^{16}$ およびハロゲンではなく、およびここで各 R^{15} および R^{16} 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：

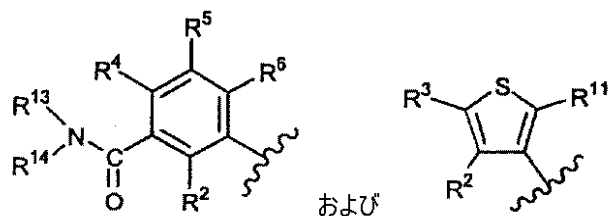
(1) 式 I の置換基 A は、以下：

【化 3 2】



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 3 3】



からなる群より選択され、ここで：

R² は、-OH であり；

R³ は、-SO₂NR^{1 3}R^{1 4} および -CONR^{1 3}R^{1 4} 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；

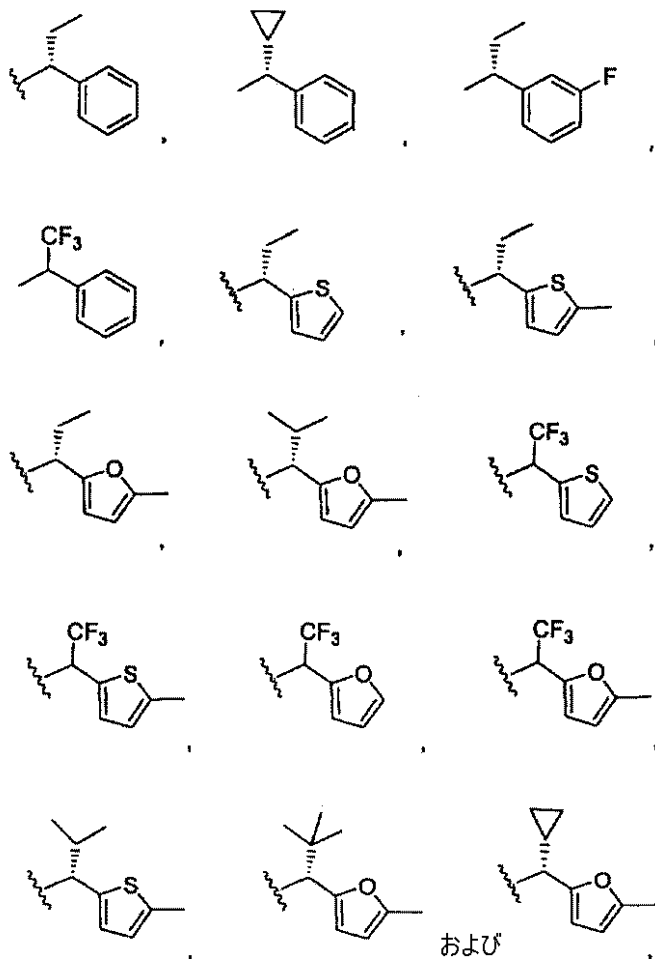
R⁶ は、H、-CH₃ および -CF₃ からなる群より選択され；

R^{1 1} は、H であり；そして

R^{1 3} および R^{1 4} 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：

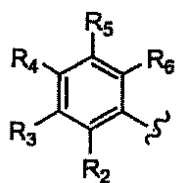
【化 3 4】



から選択され；

そして B は：

【化 3 5】



であり、ここで

R^2 は、 $-\text{OH}$ であり；

R^3 は、 $\text{CONR}^{13}\text{R}^{14}$ であり；

R^4 は、 H 、 CH_3 および CF_3 からなる群より選択され；

R^5 は、 H および シアノであり；

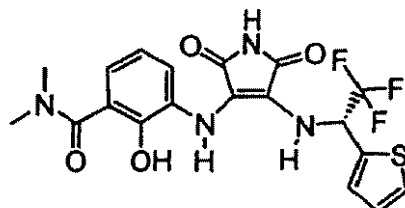
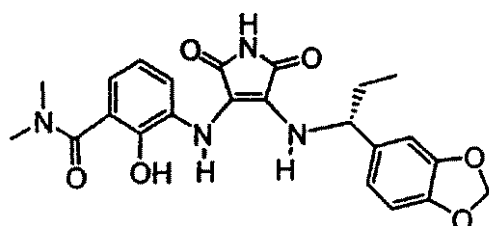
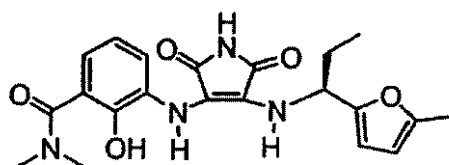
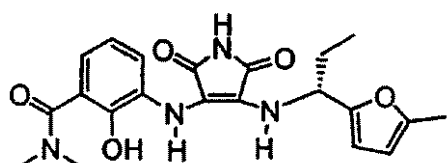
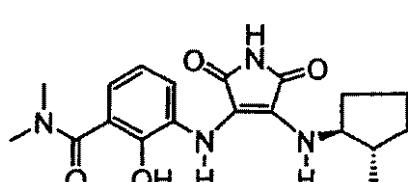
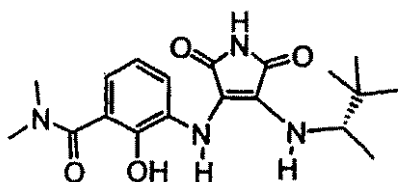
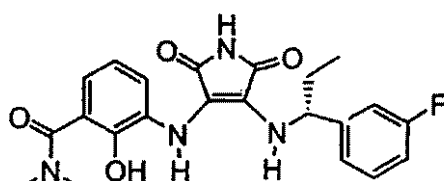
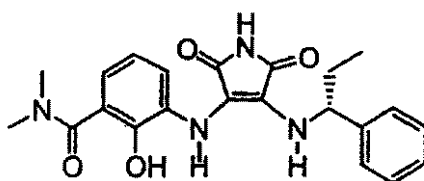
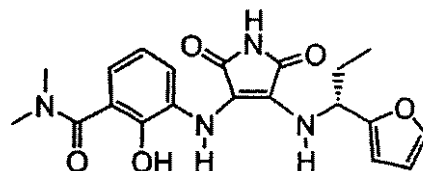
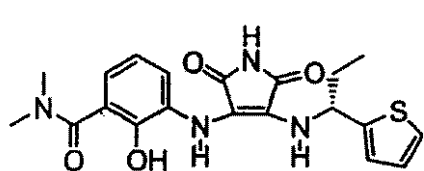
R^6 は、 H 、 CH_3 および CF_3 からなる群より選択され；

R^{13} および R^{14} は、メチルである、化合物。

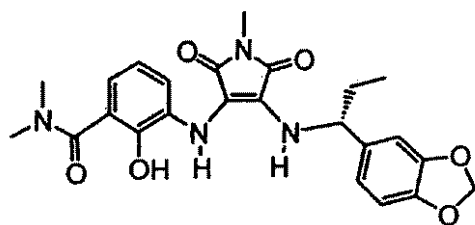
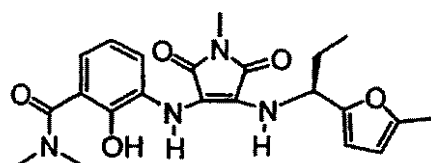
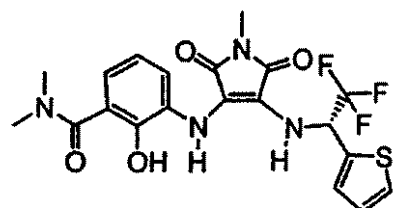
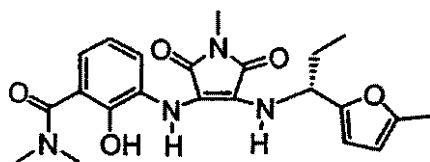
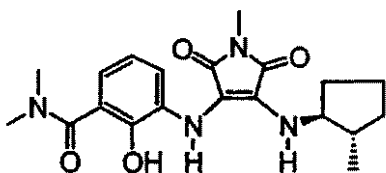
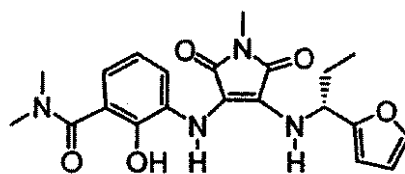
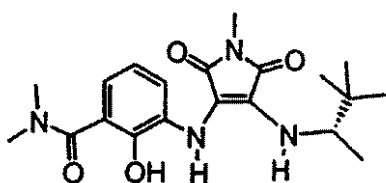
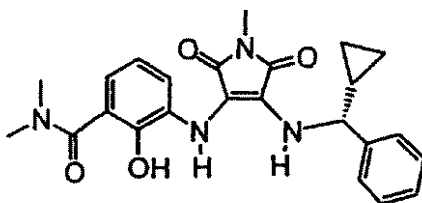
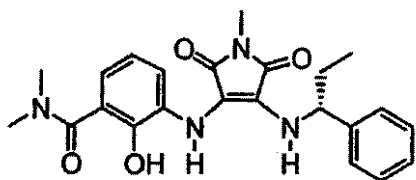
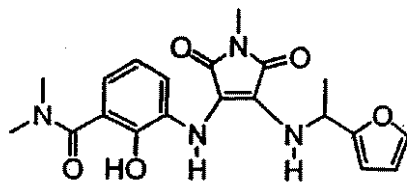
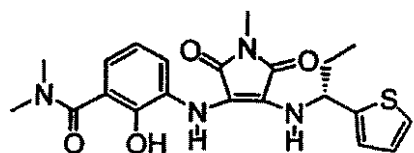
【請求項 11】

下記：

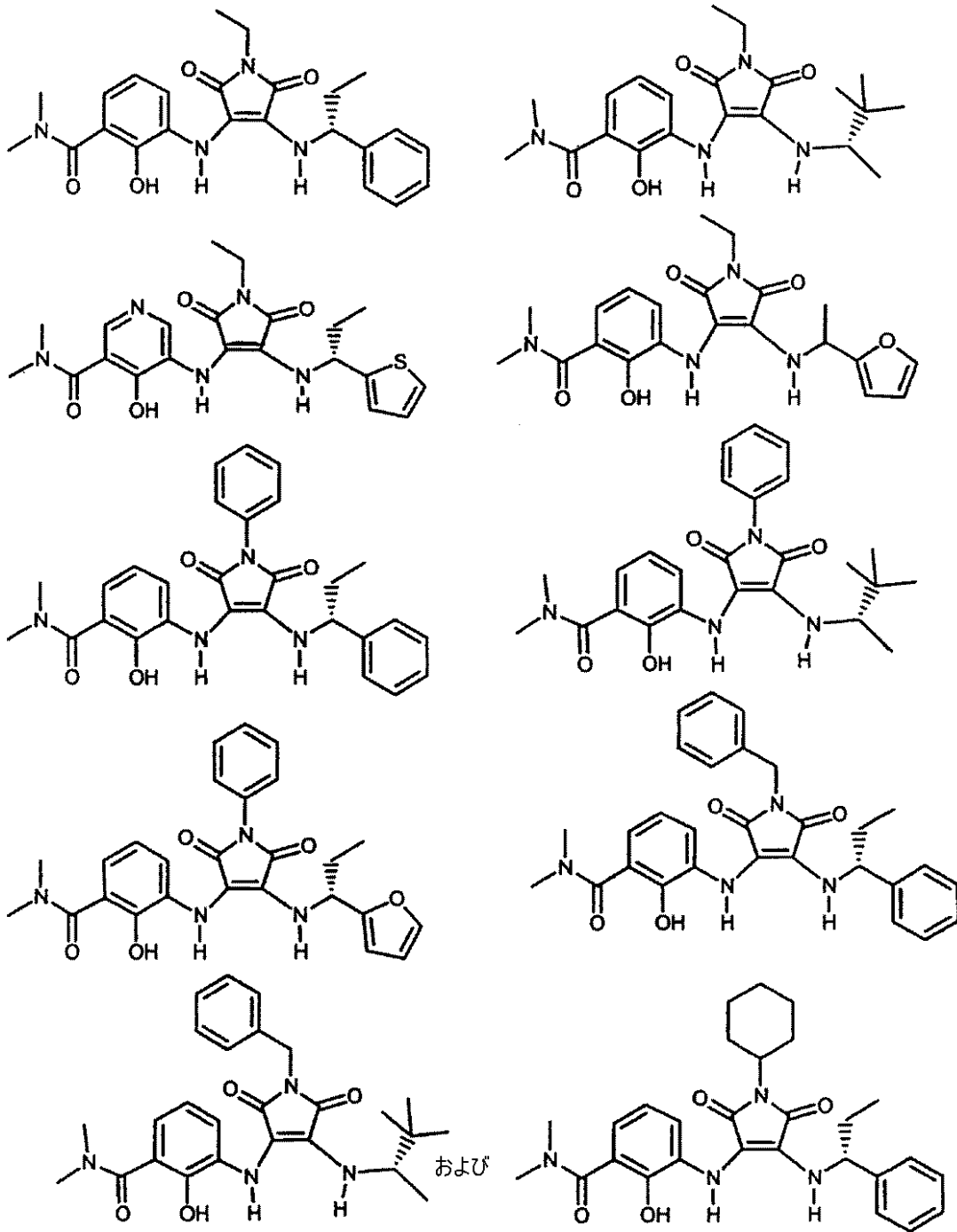
【化 3 6】



【化 3 7】



【化 3 8】

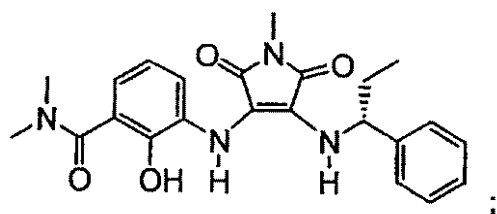
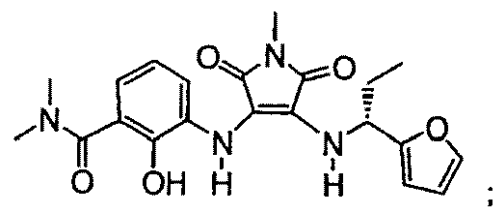
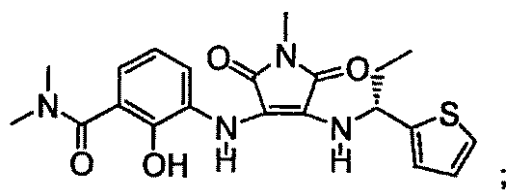


からなる群より選択される請求項 1 記載の化合物。

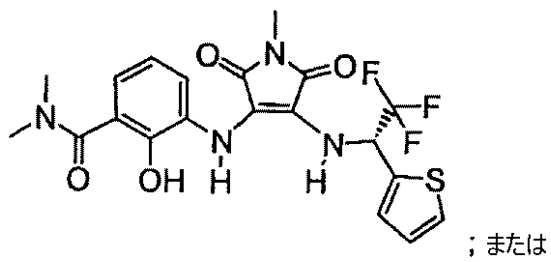
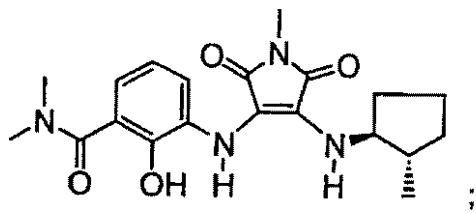
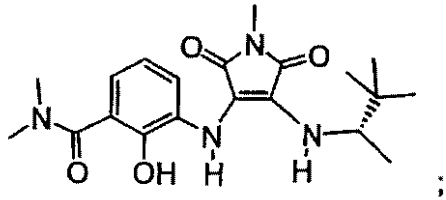
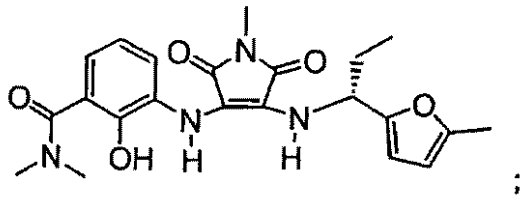
【請求項 1 2】

以下の式：

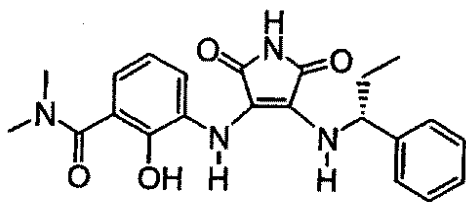
【化 3 9】



【化 4 0】



【化 4 1】

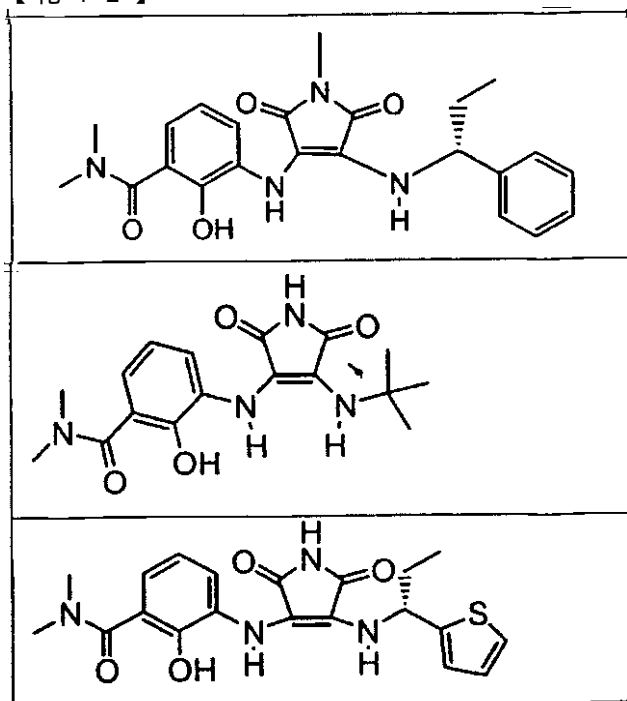


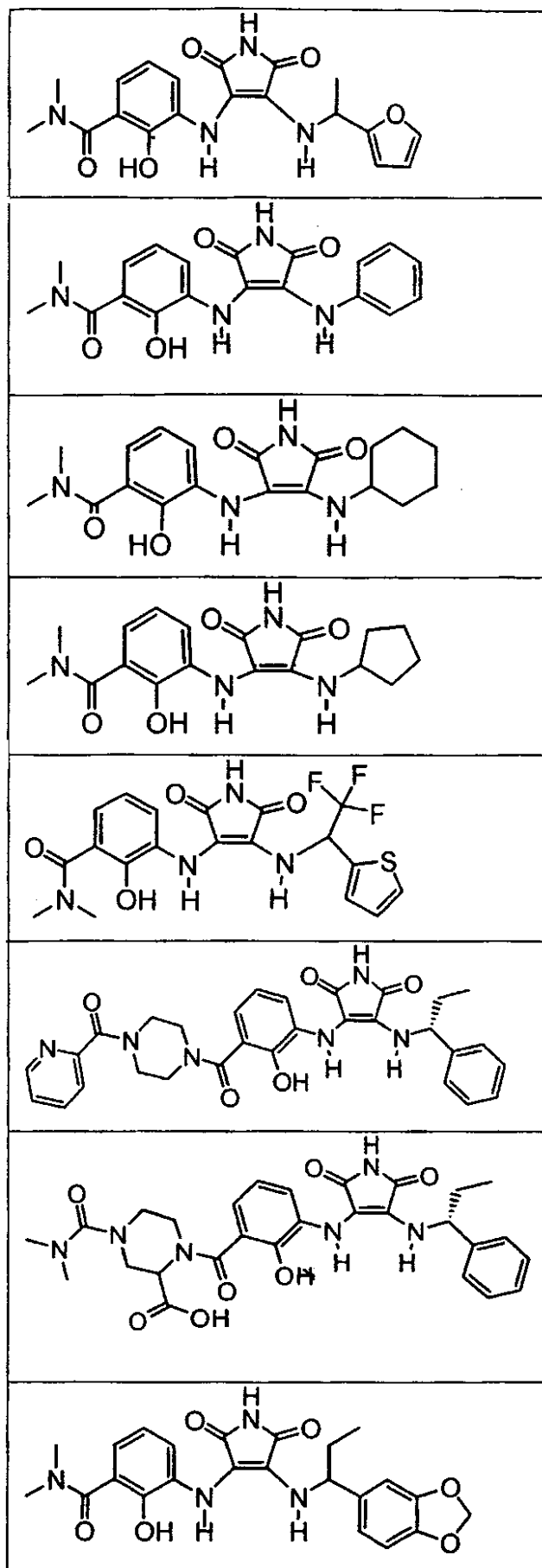
を有する請求項 1 記載の化合物。

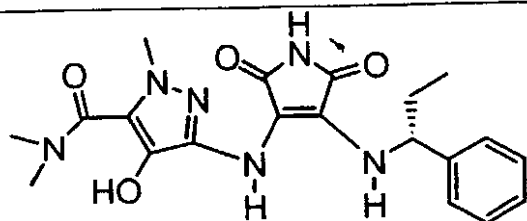
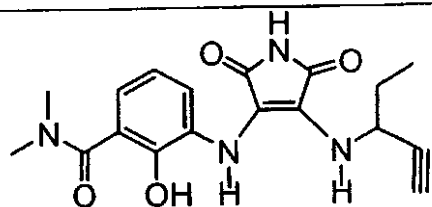
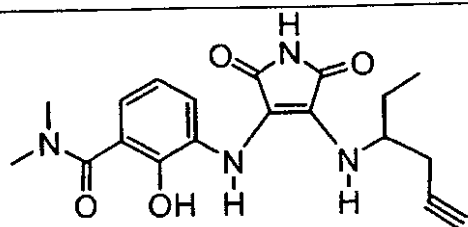
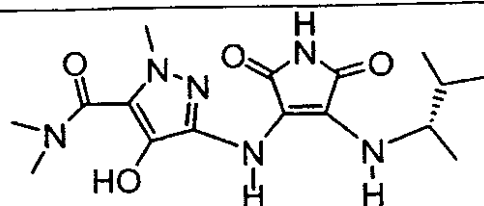
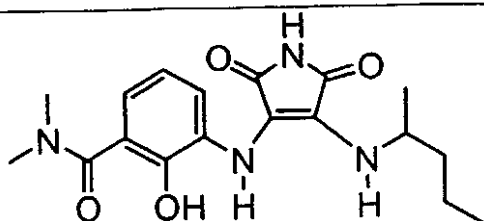
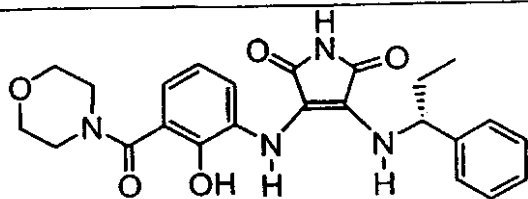
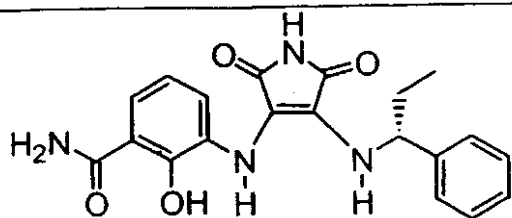
【請求項 1 3】

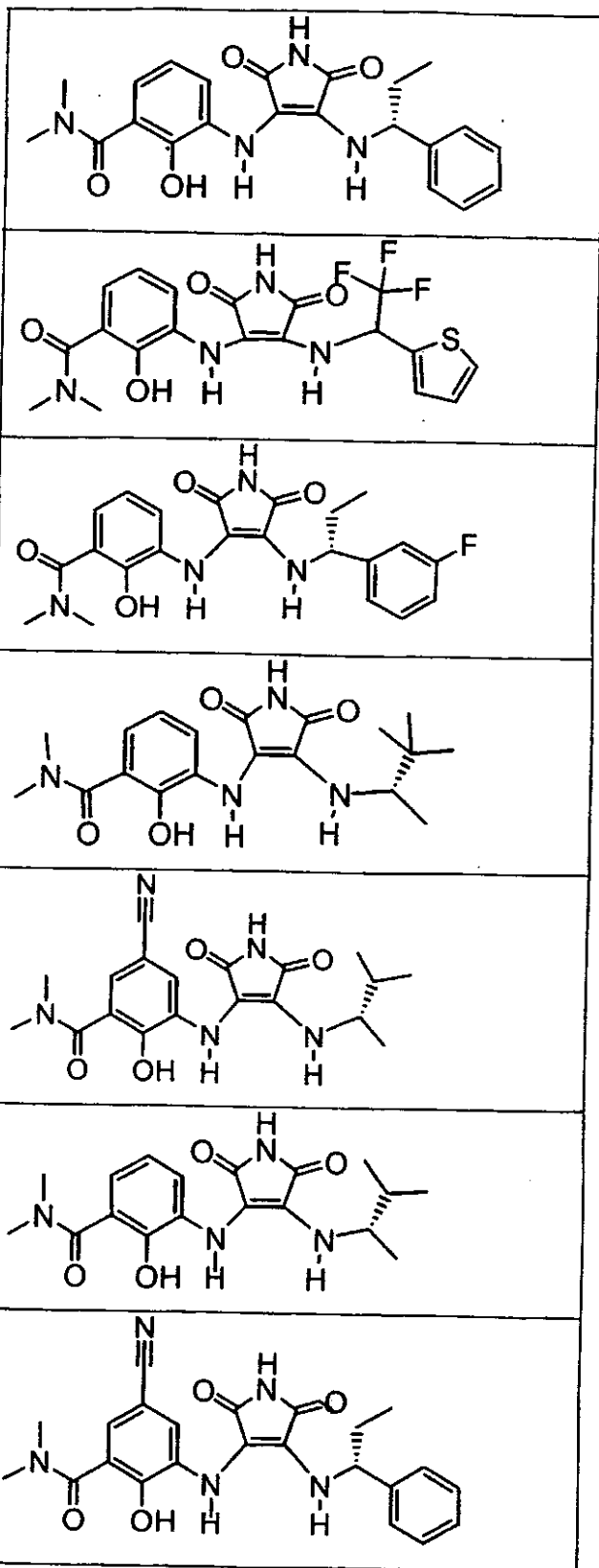
以下：

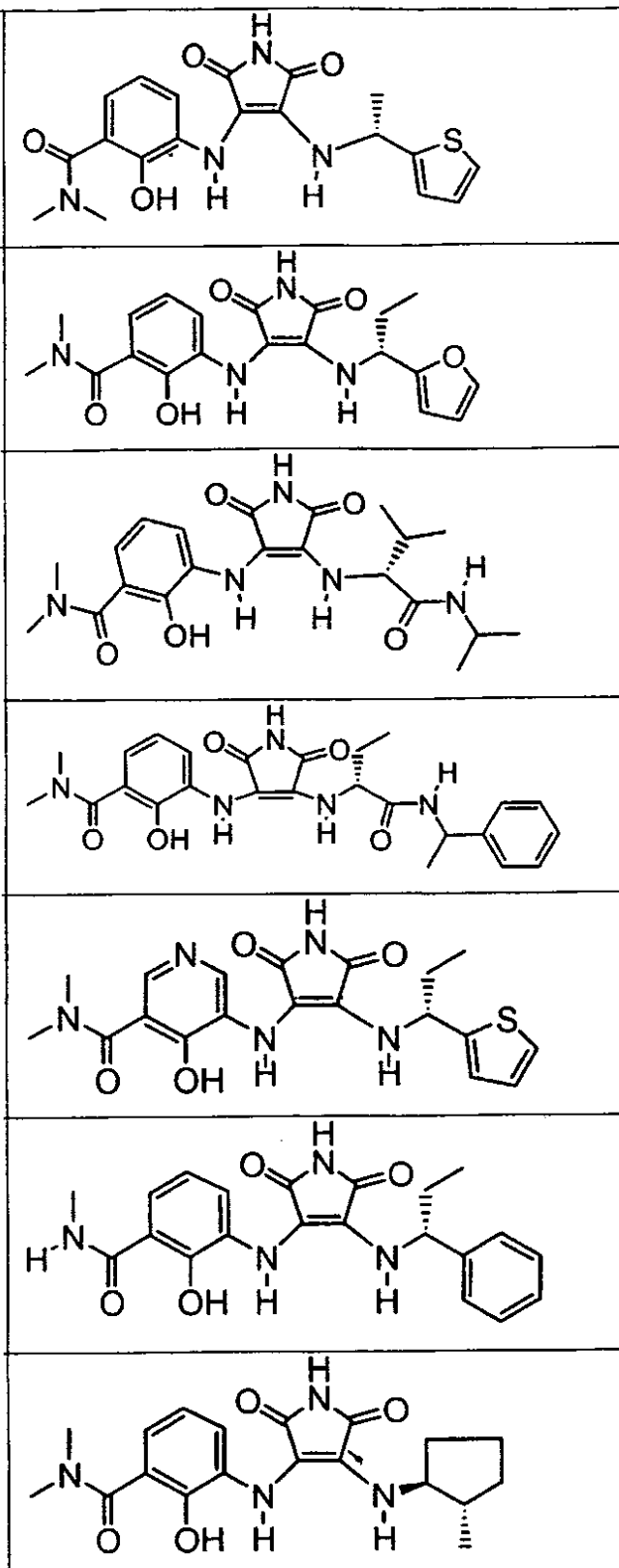
【化 4 2】

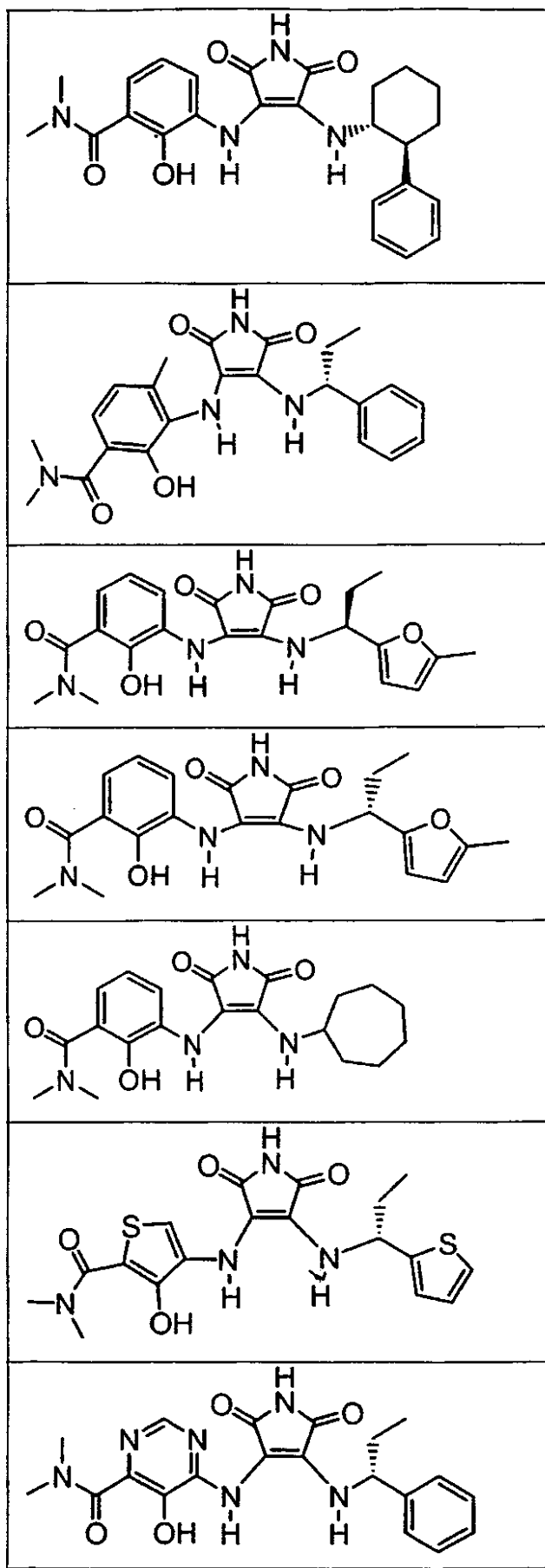


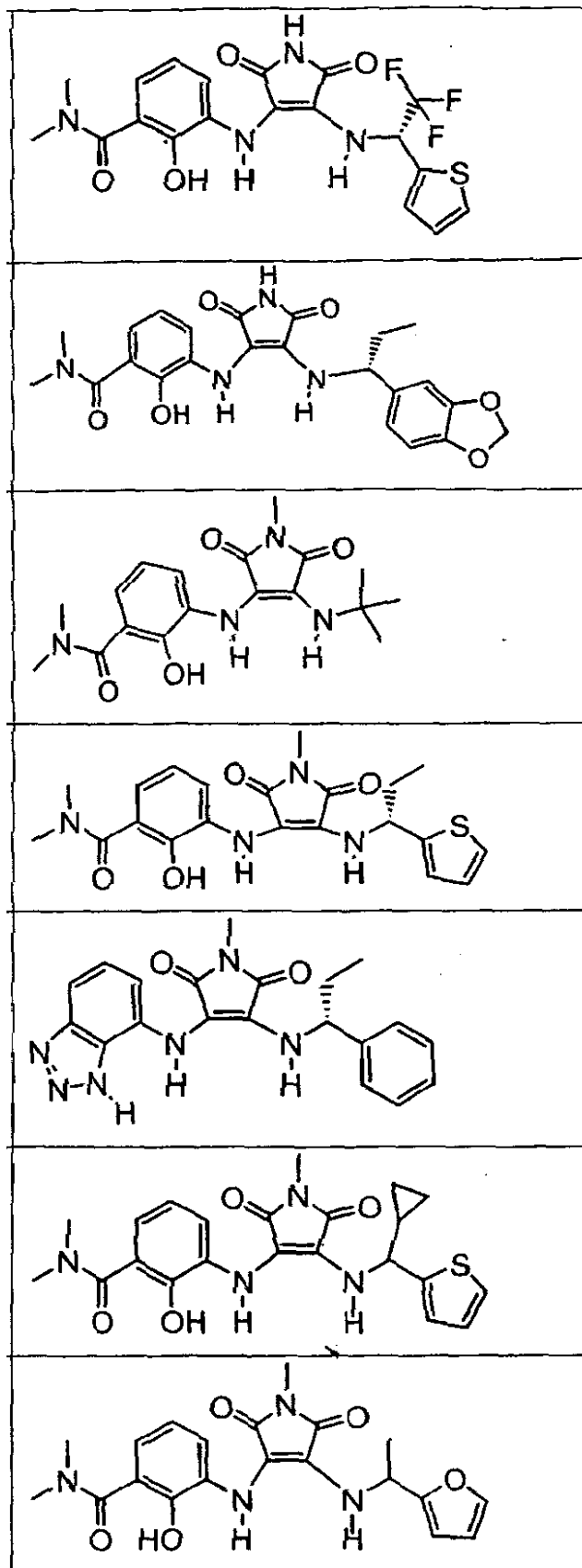


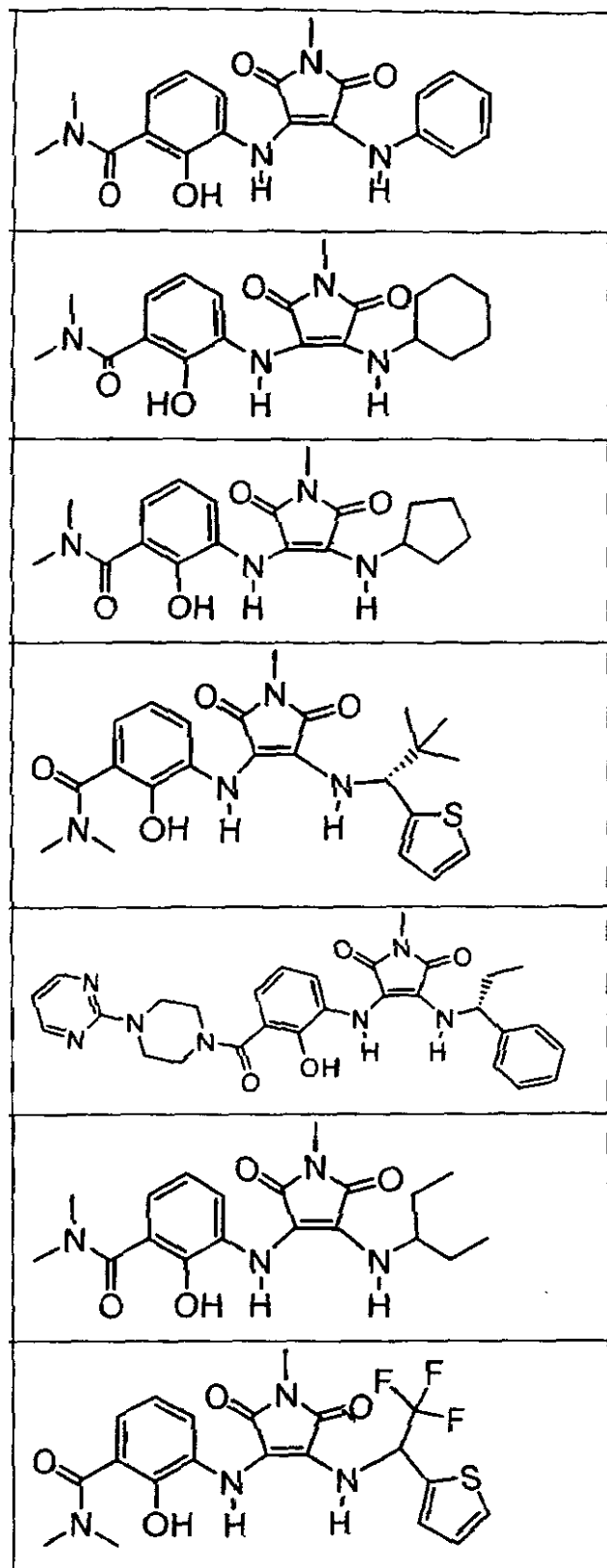


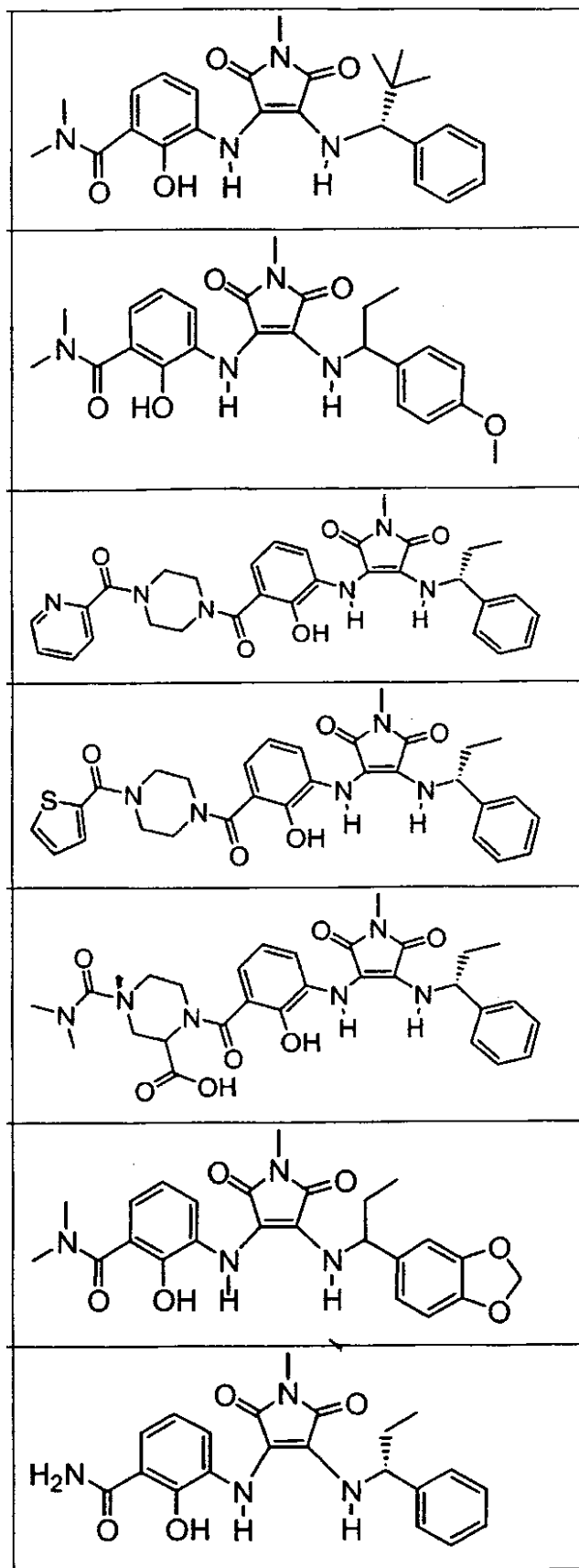


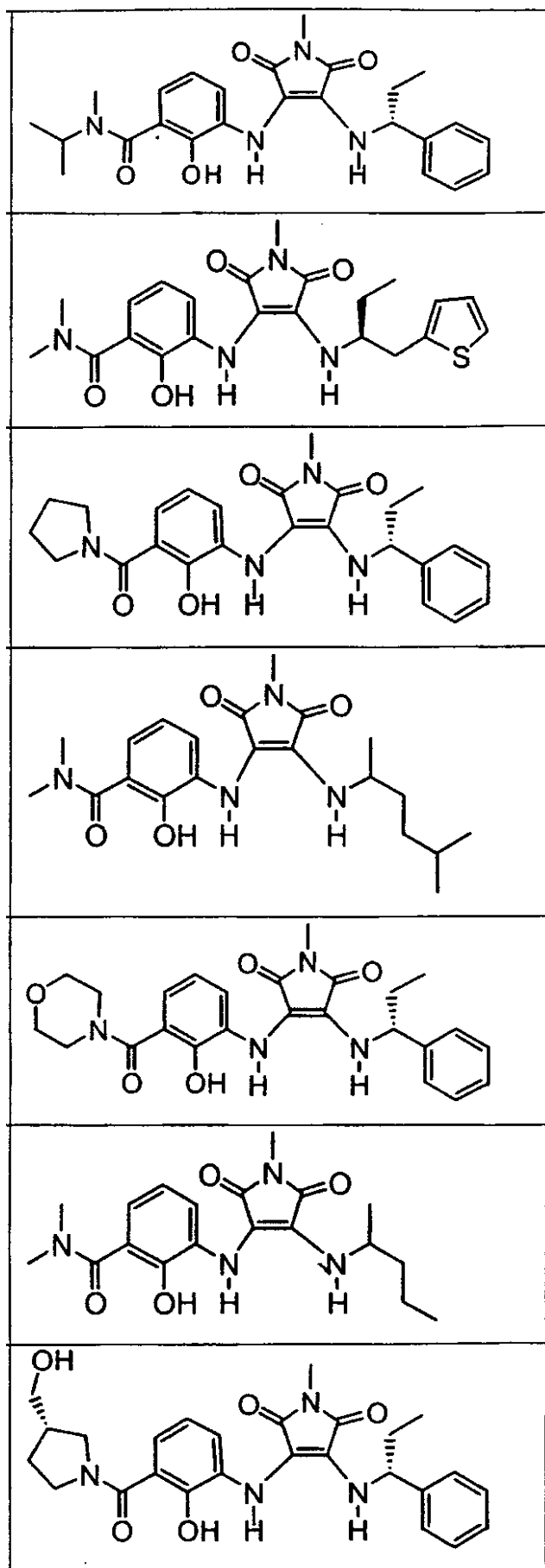


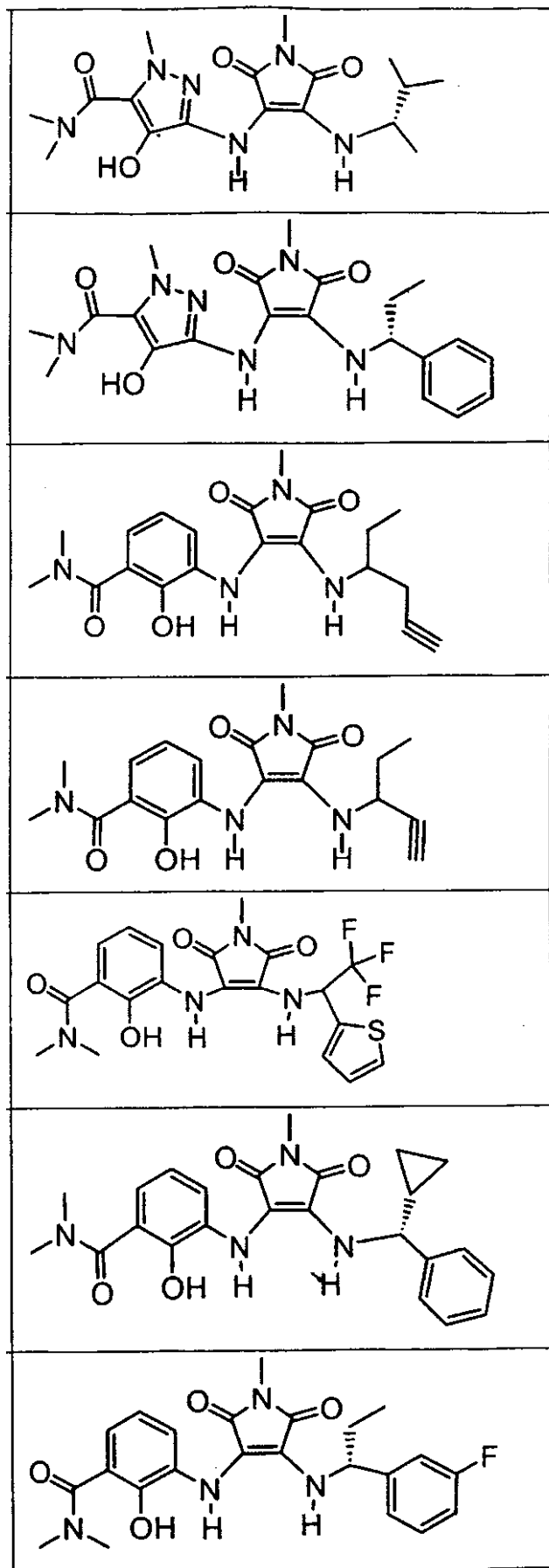


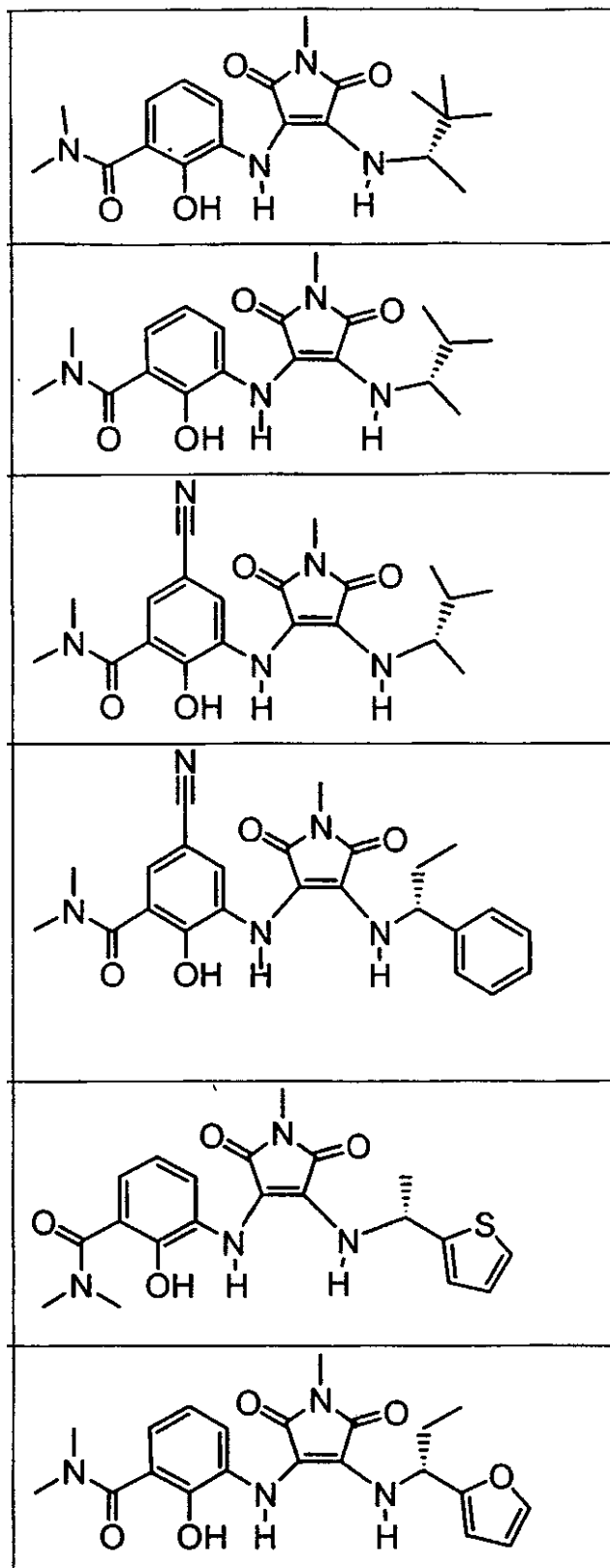


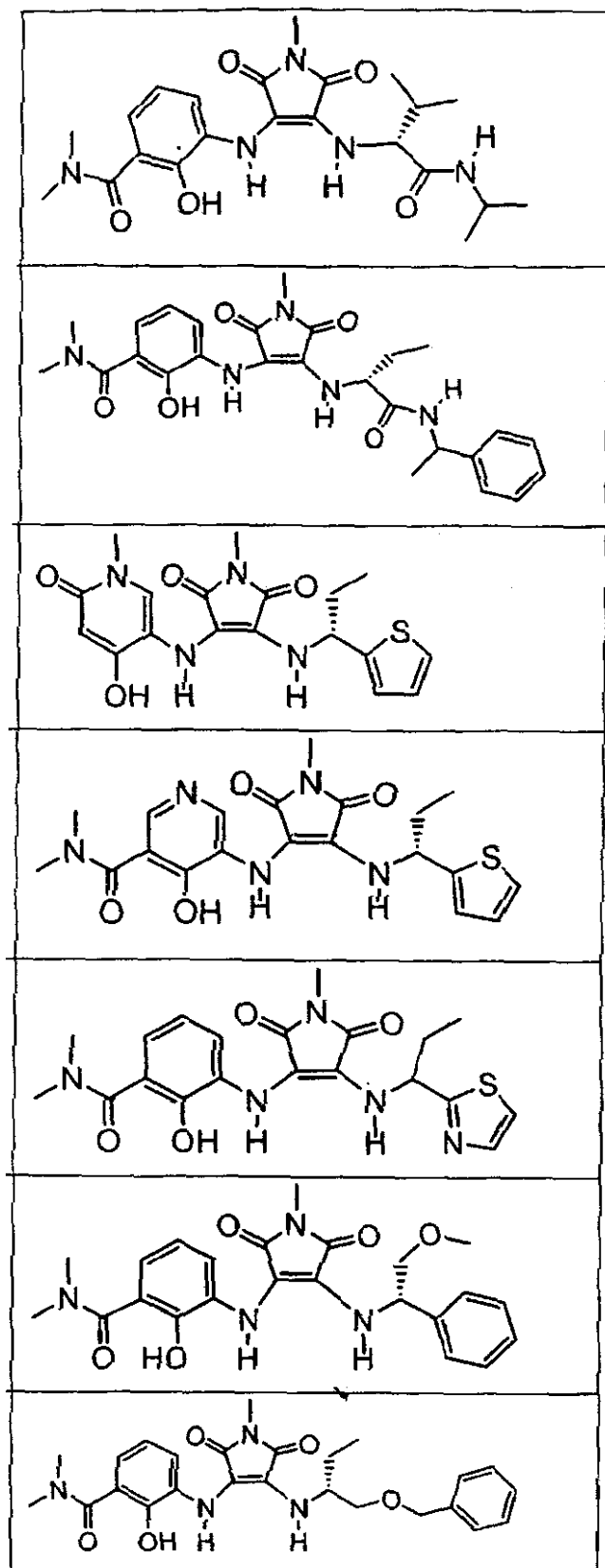


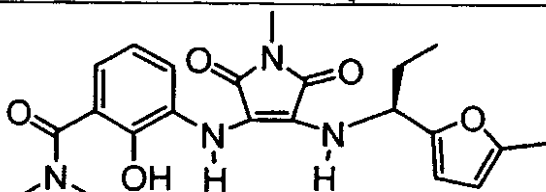
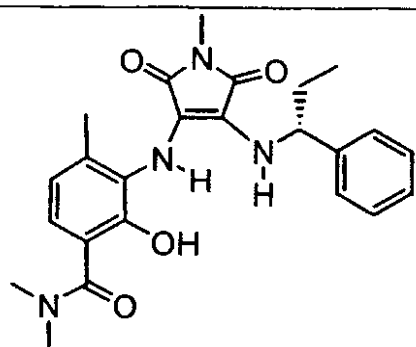
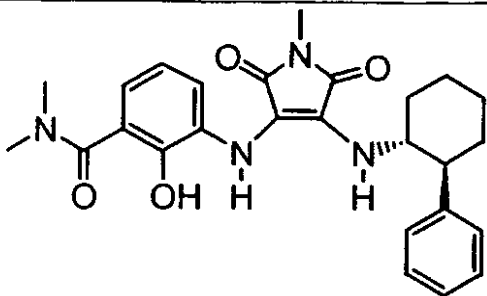
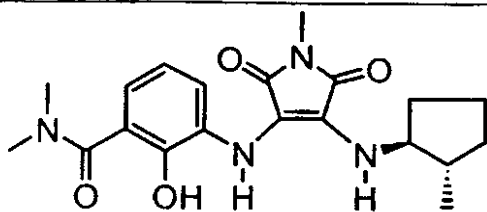
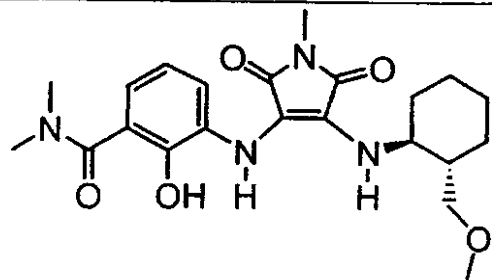
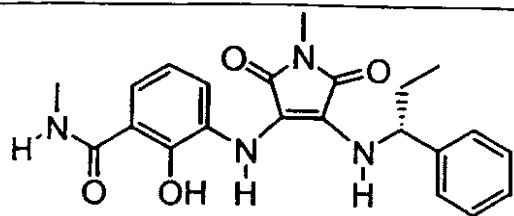


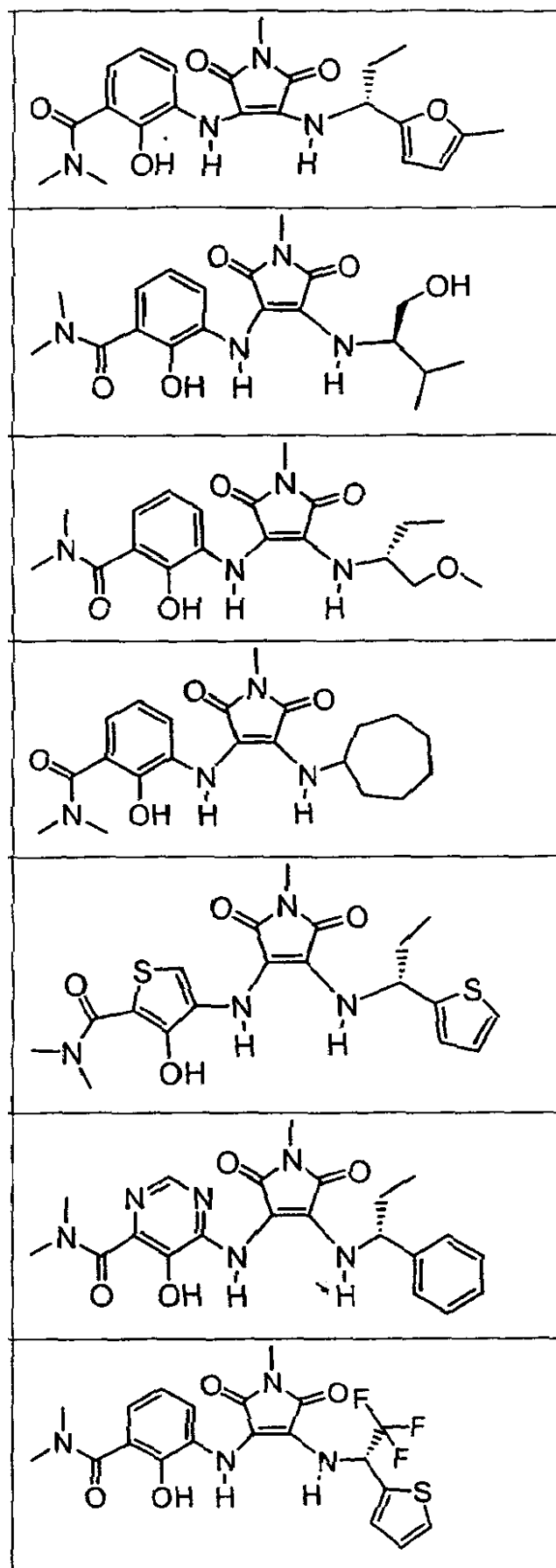


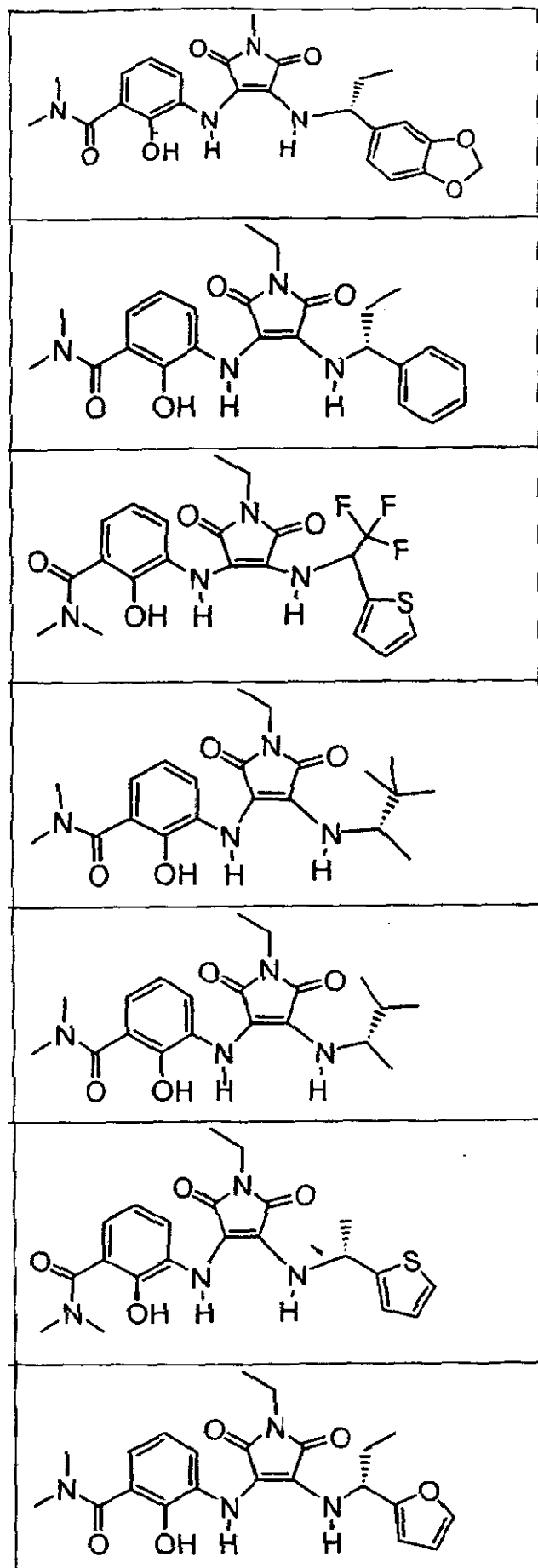


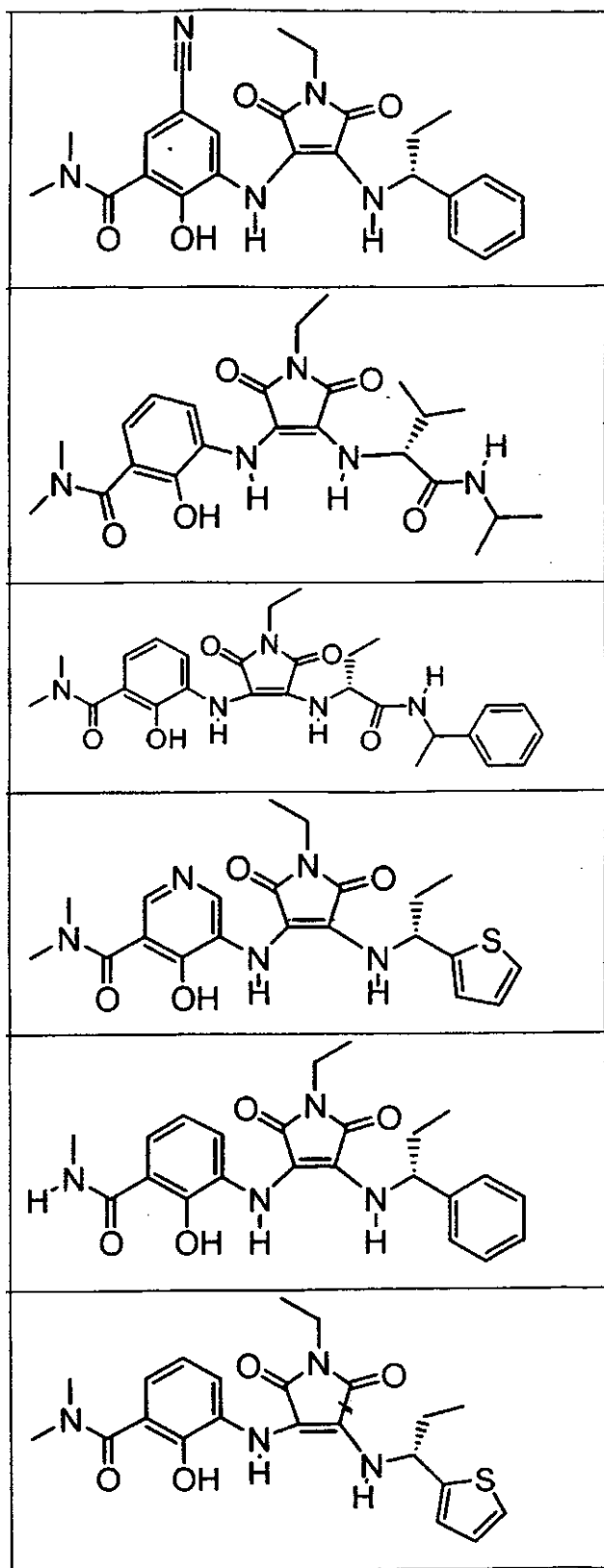


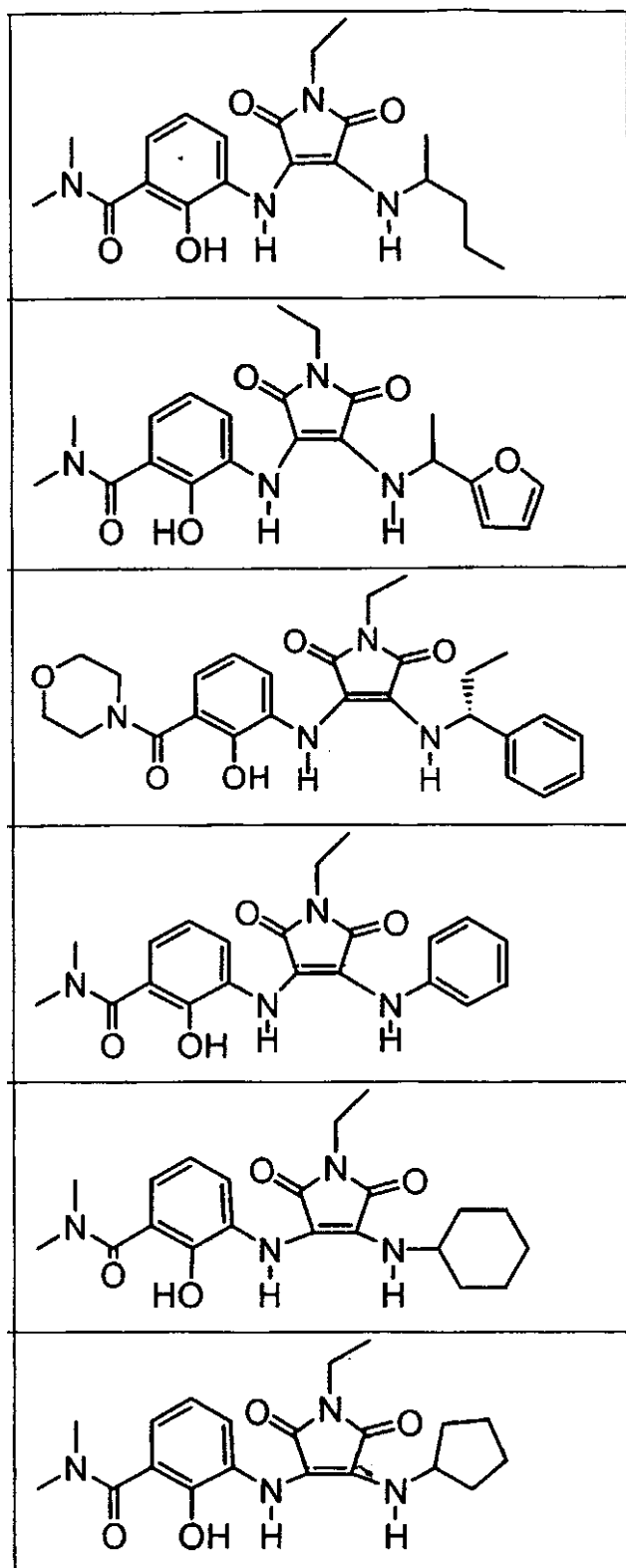


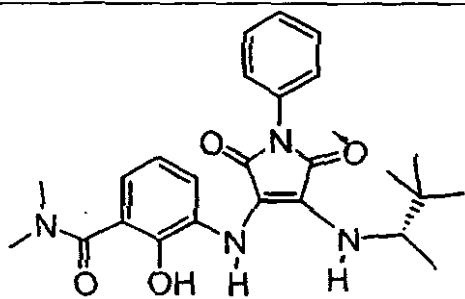
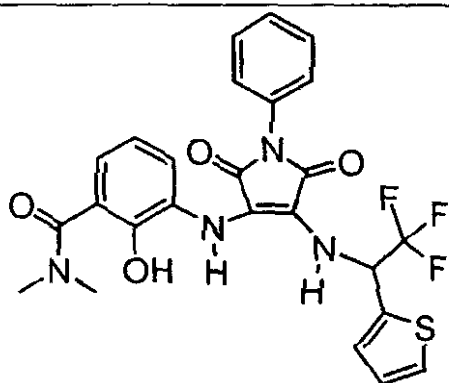
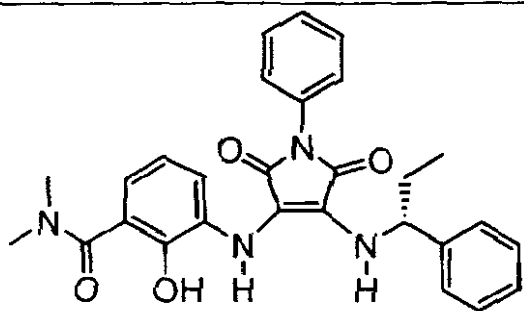
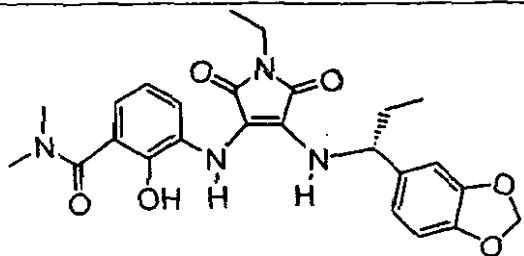
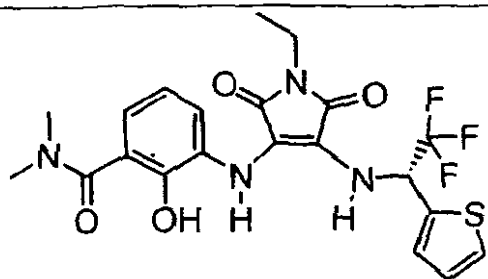


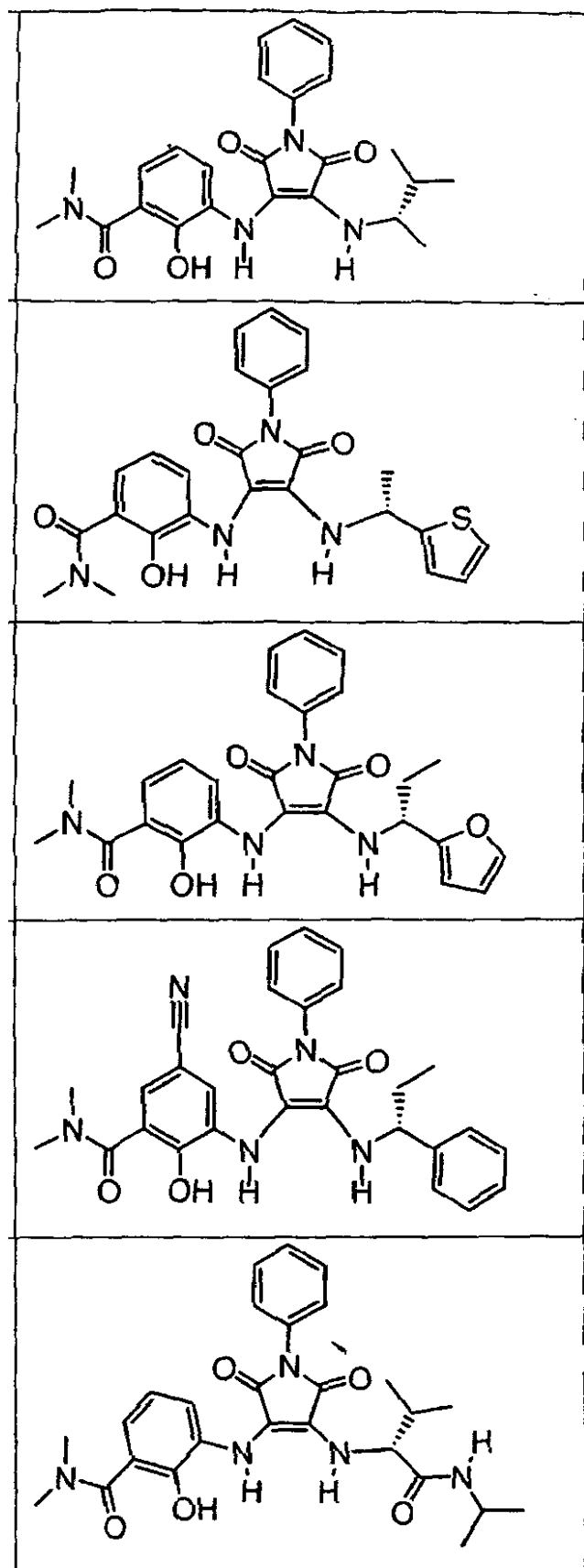


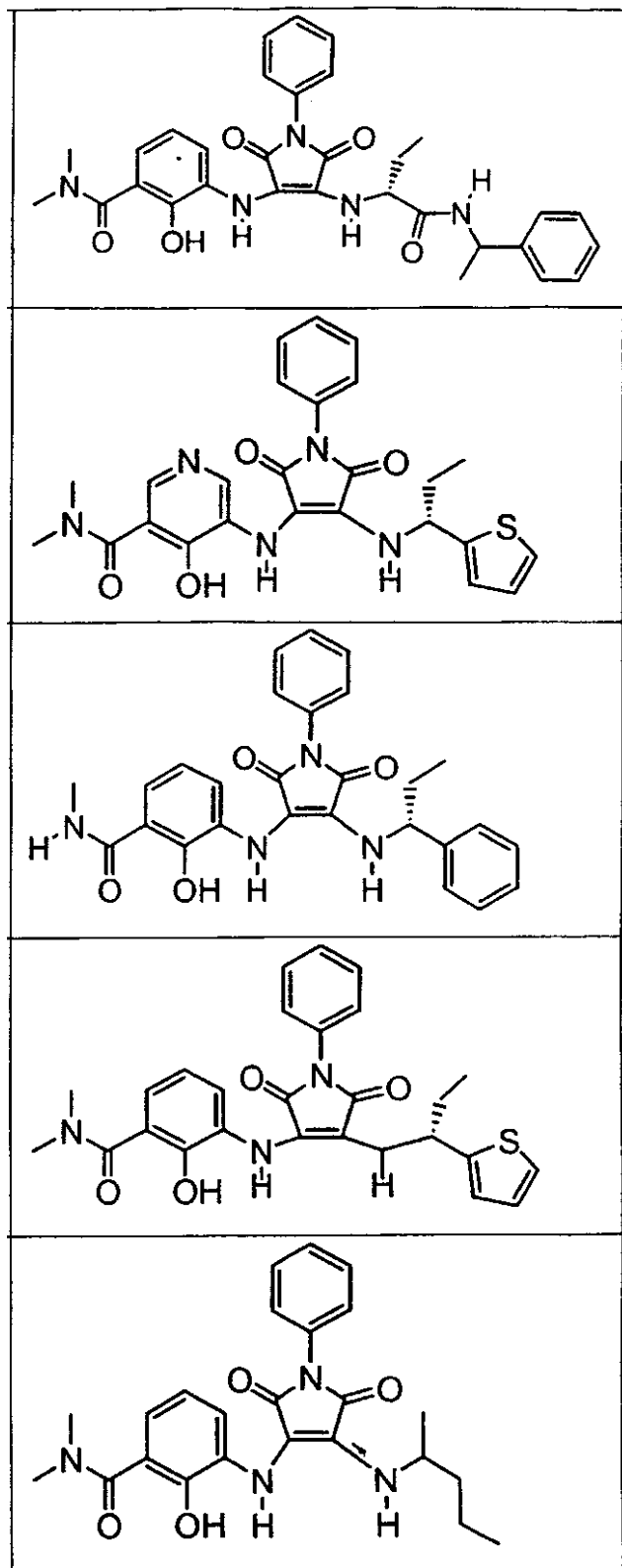


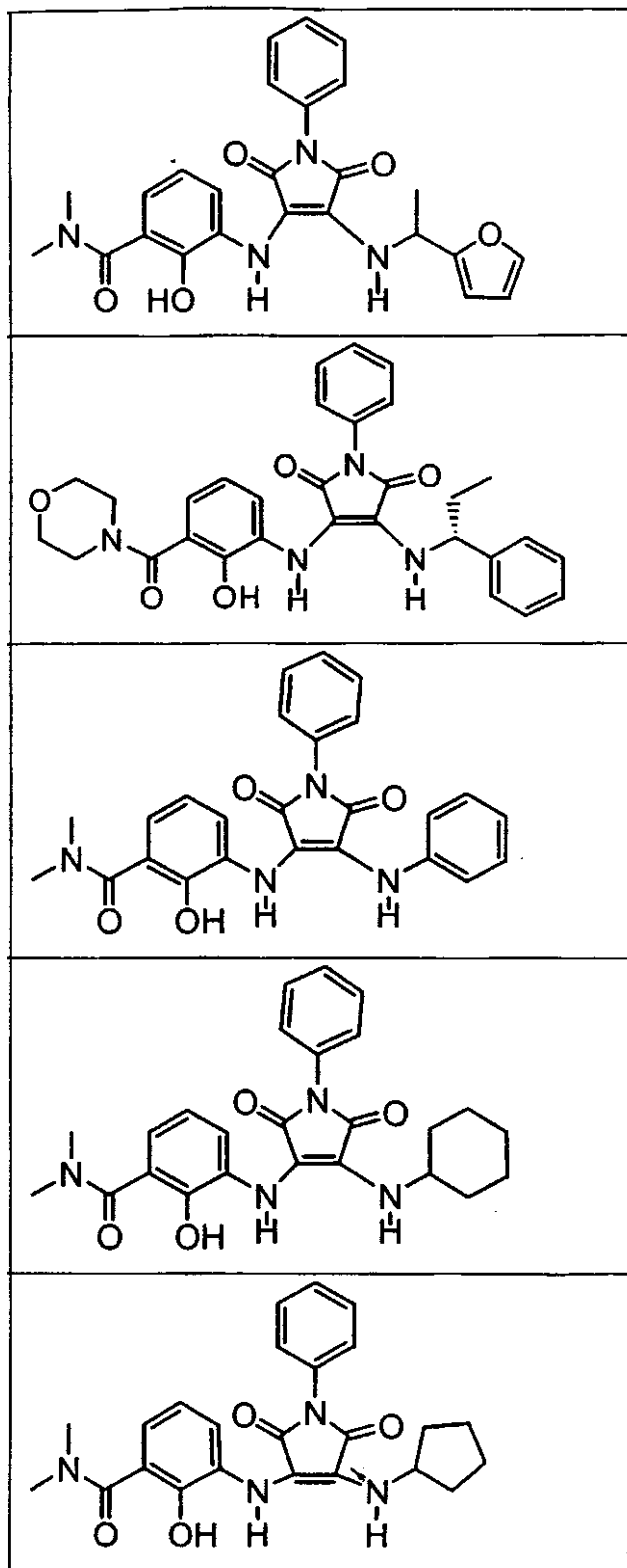


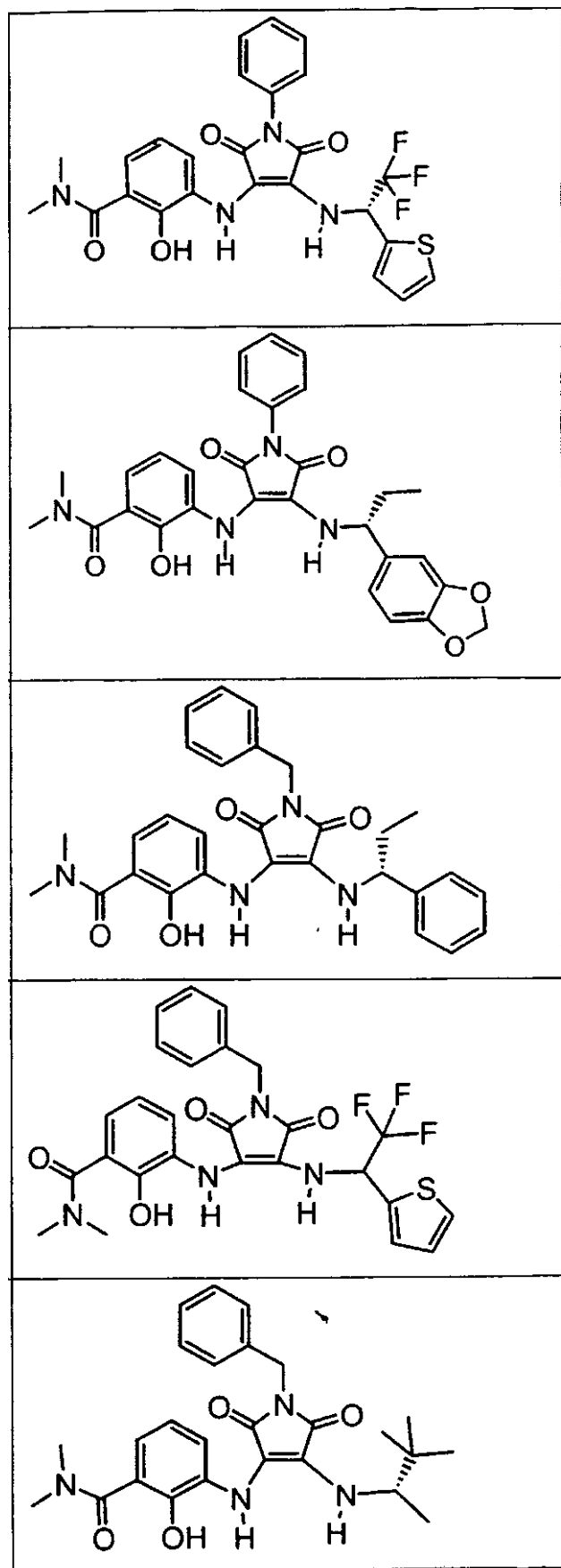


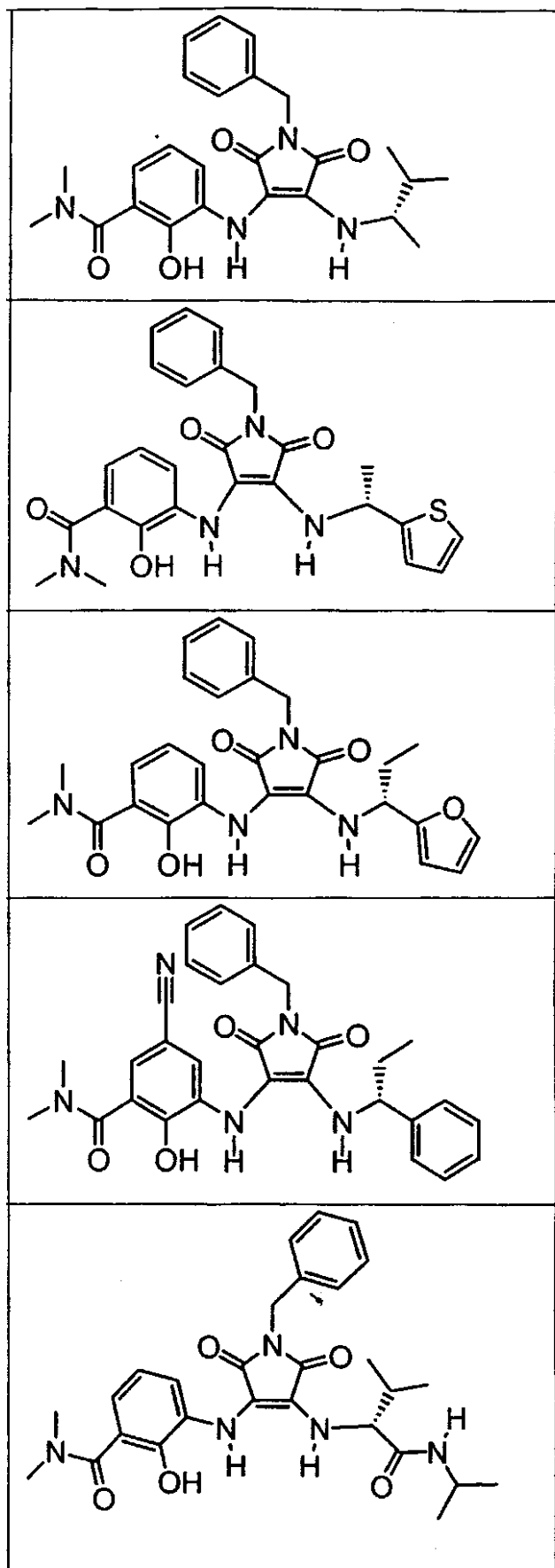


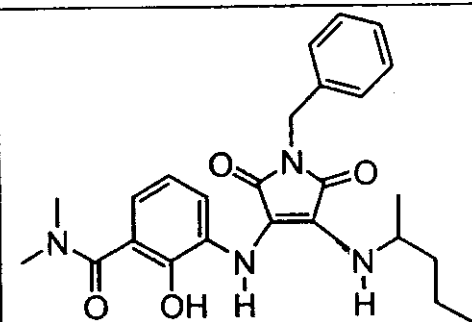
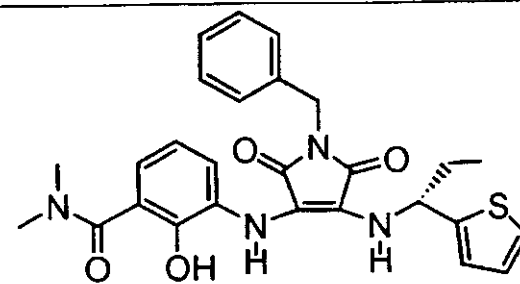
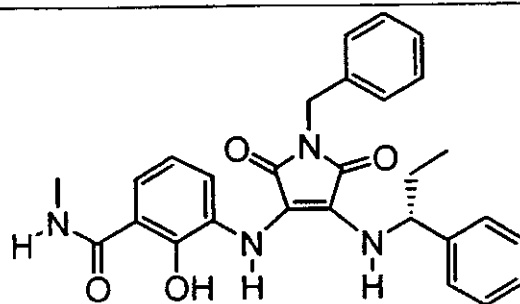
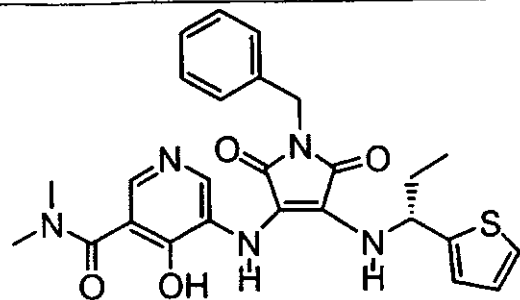
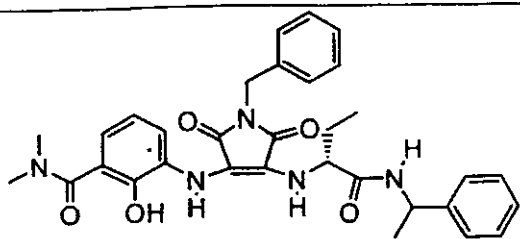


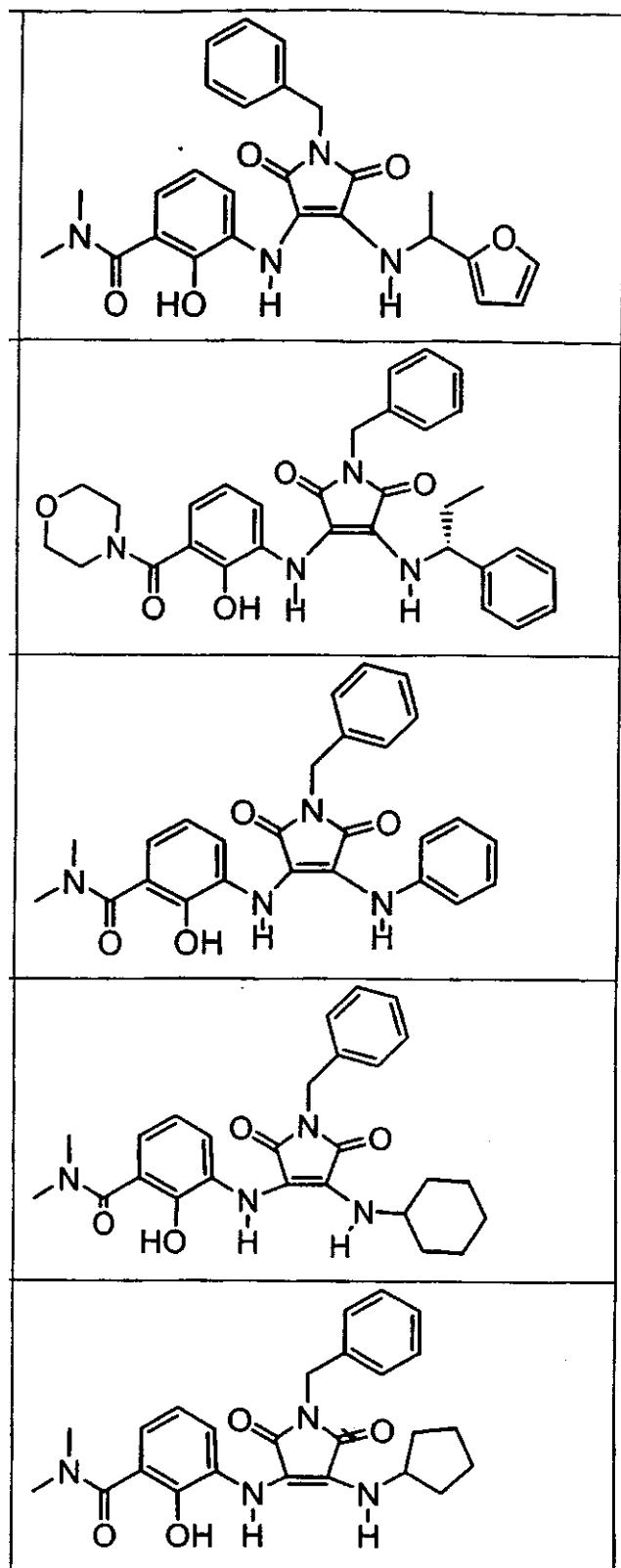


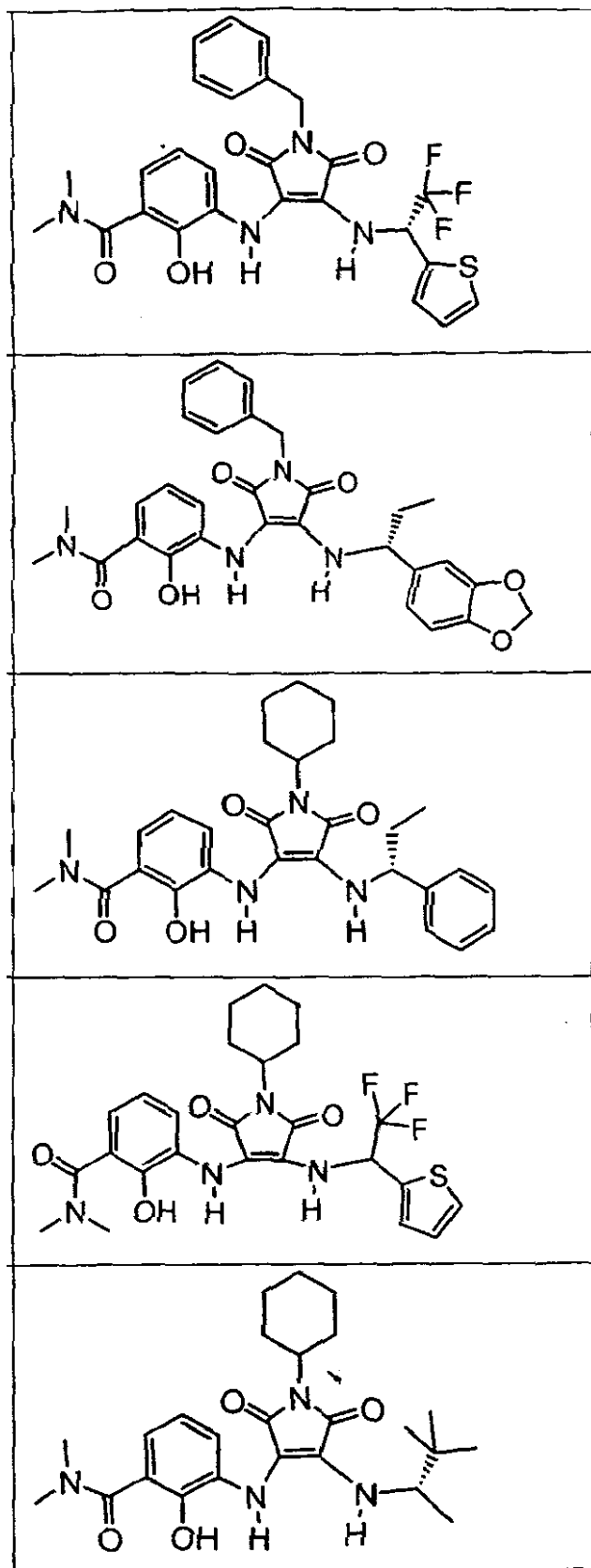


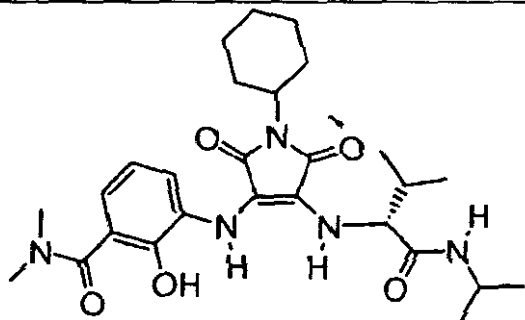
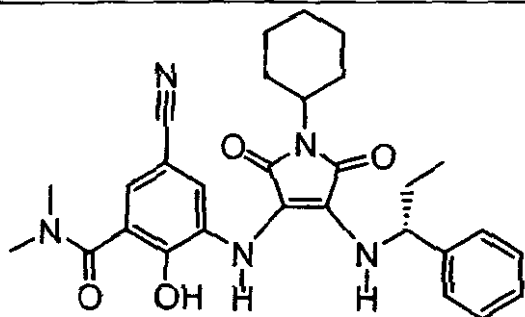
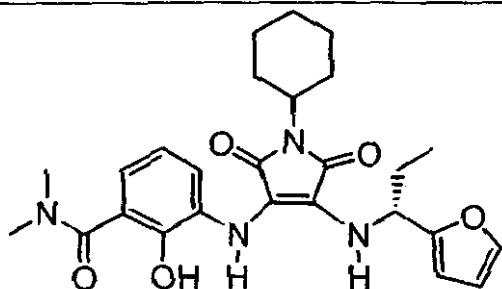
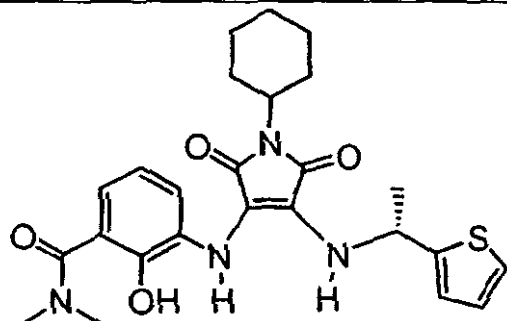
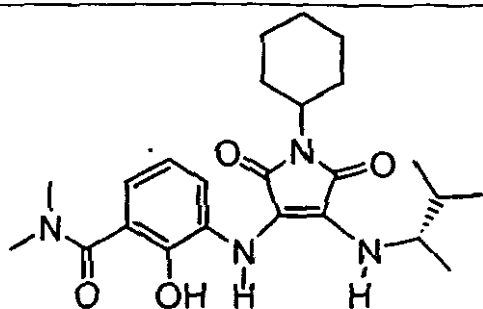


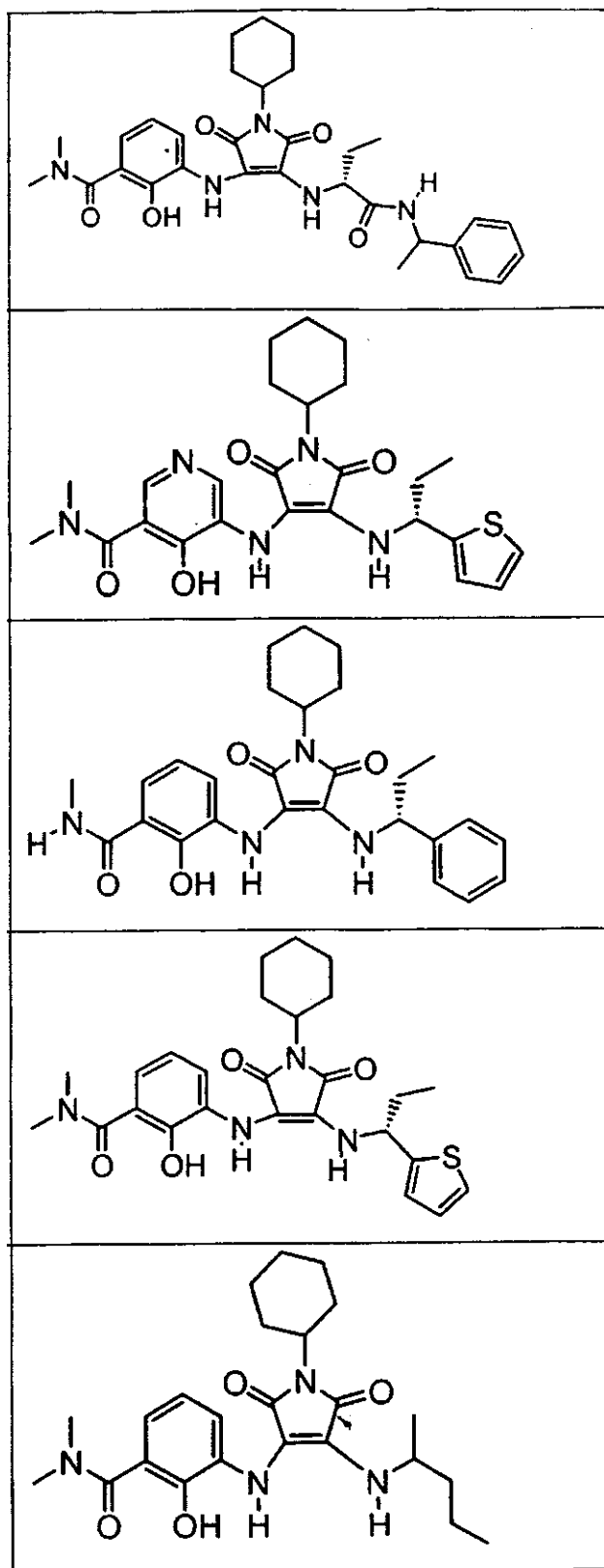


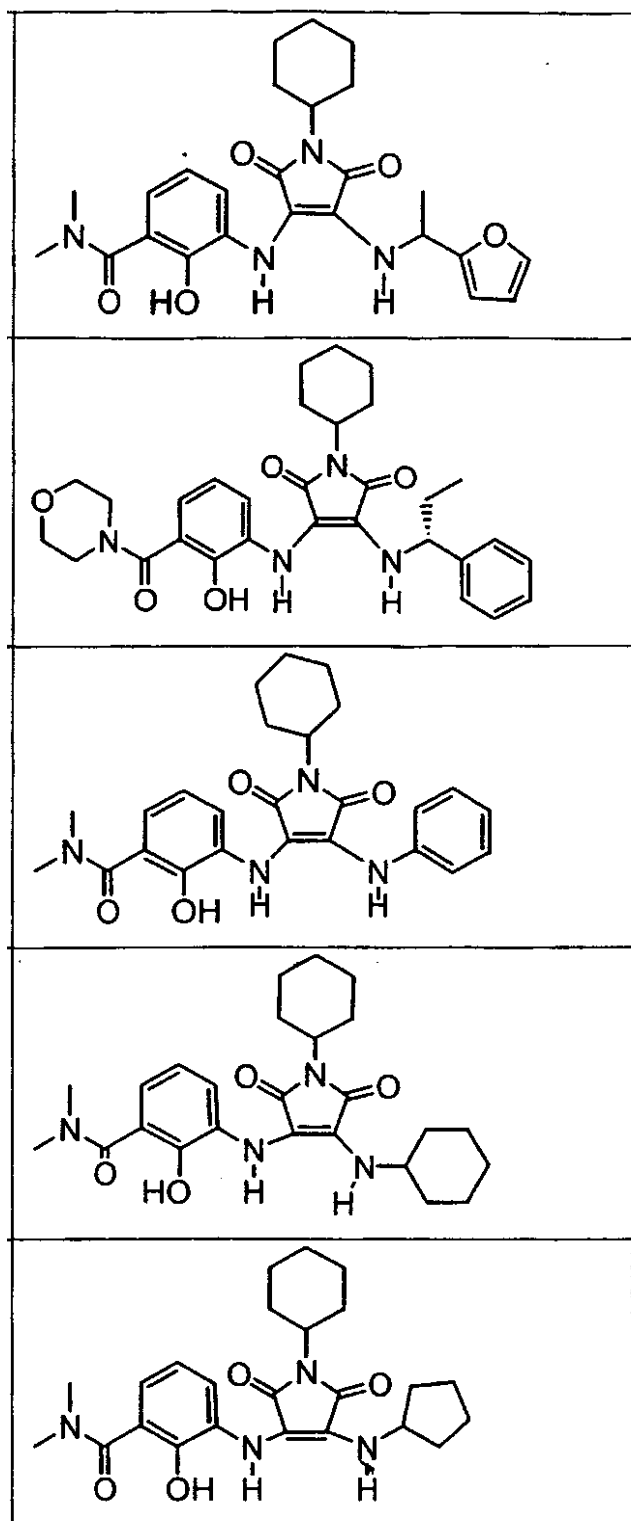


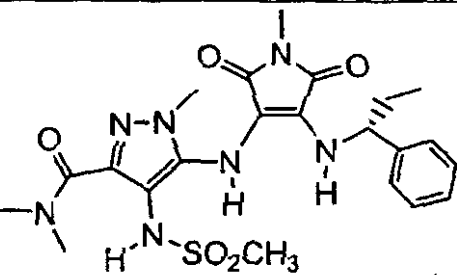
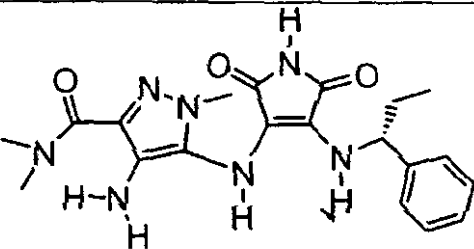
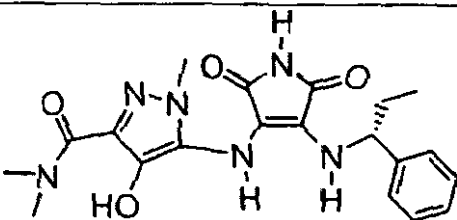
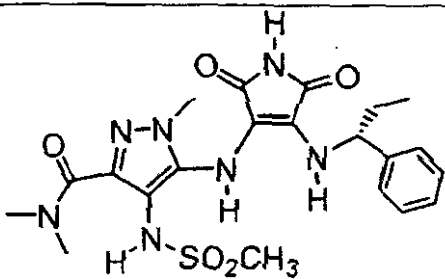
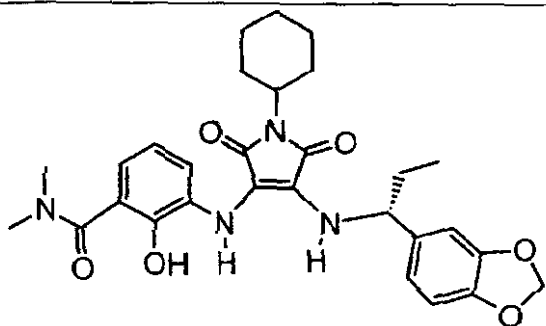
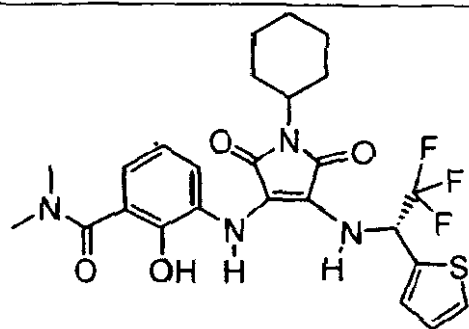


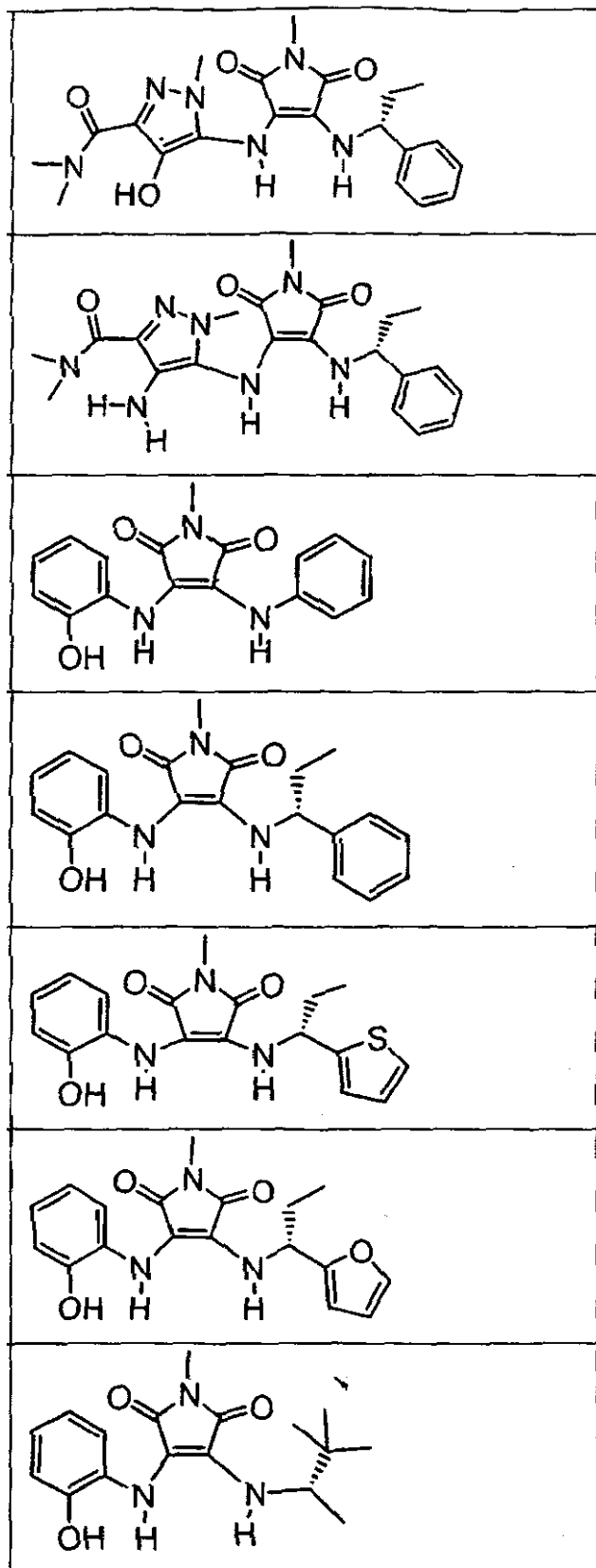


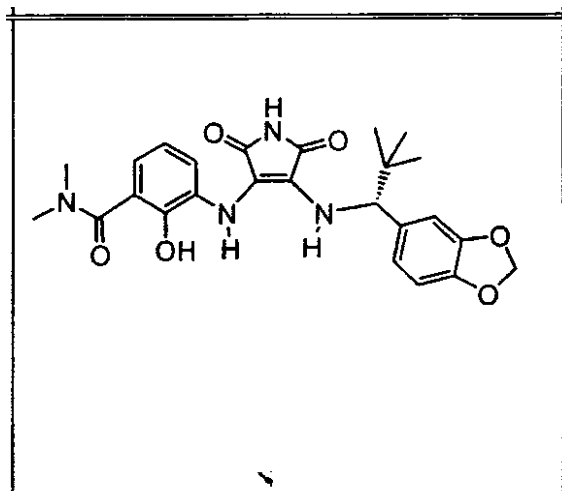
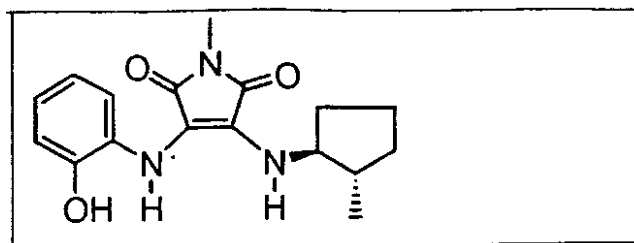


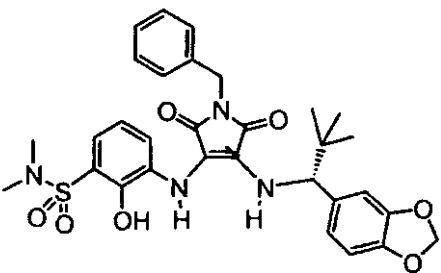
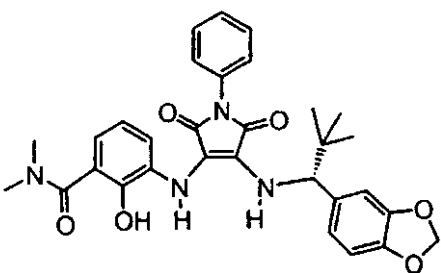
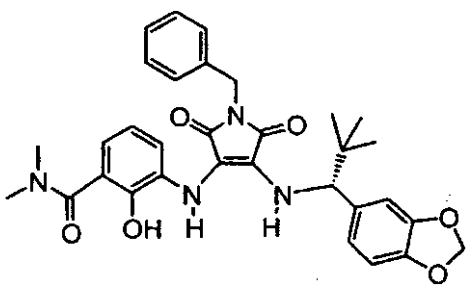
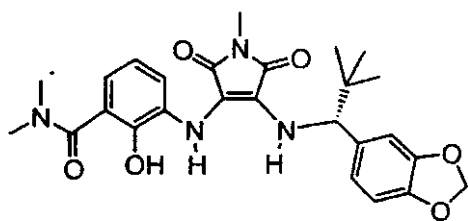


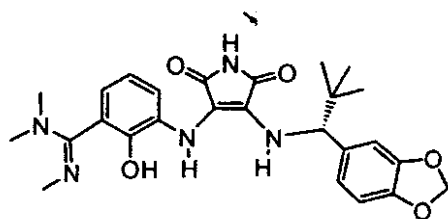
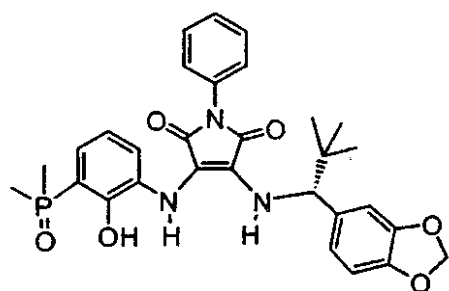
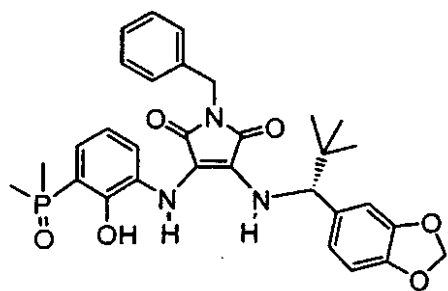
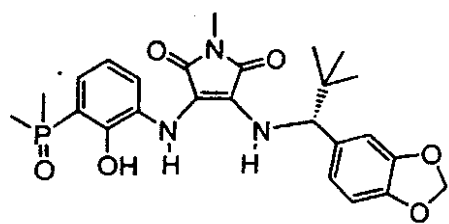


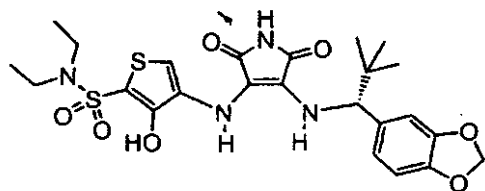
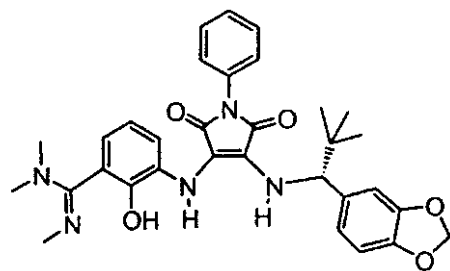
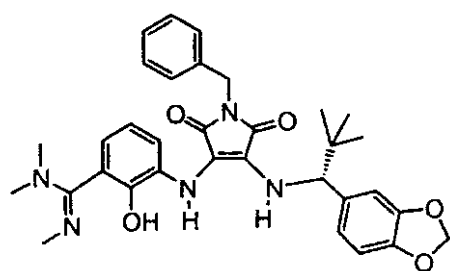
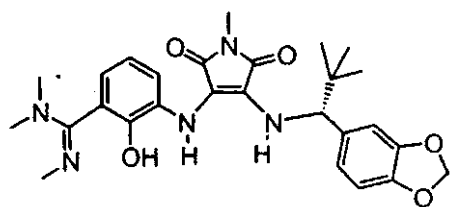


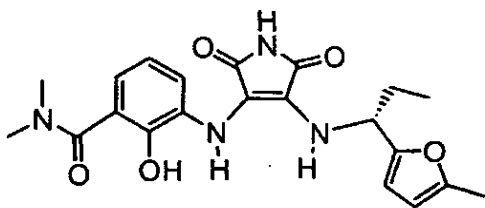
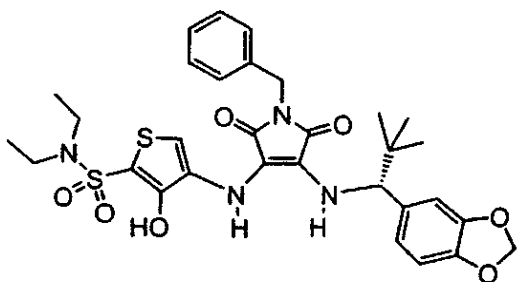
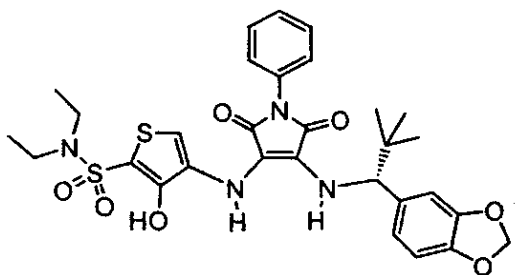
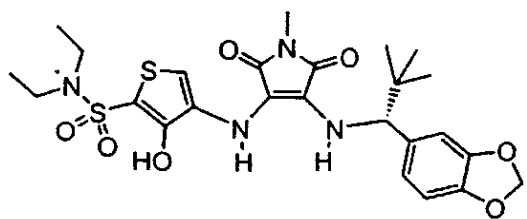


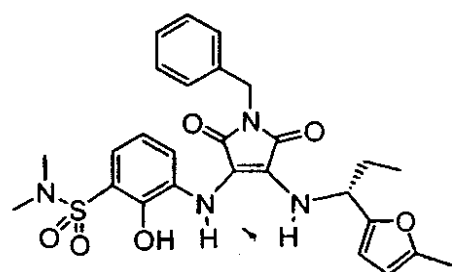
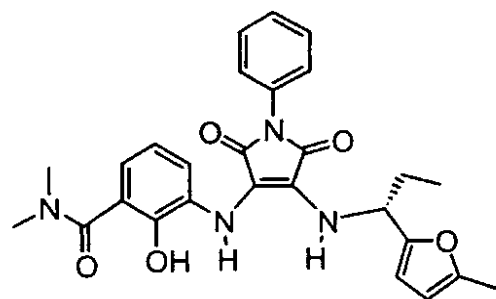
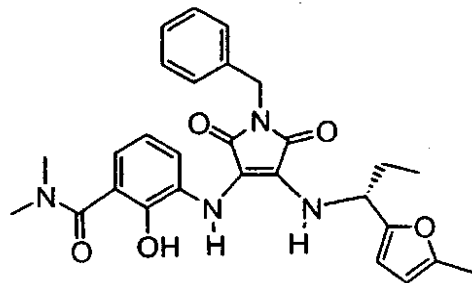
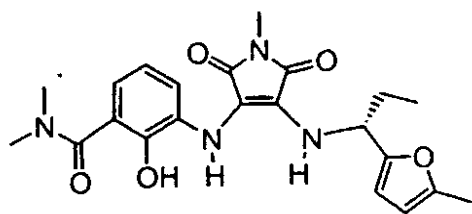


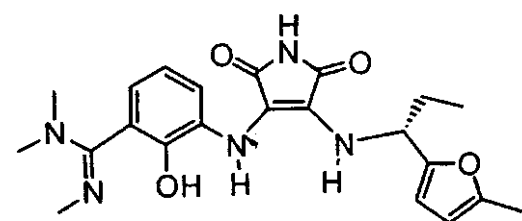
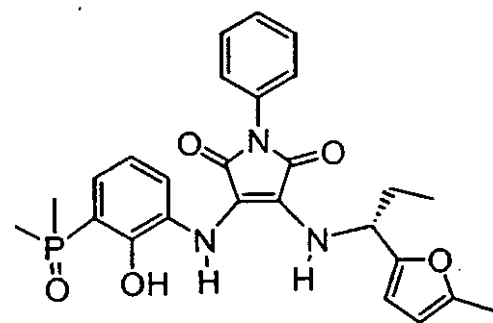
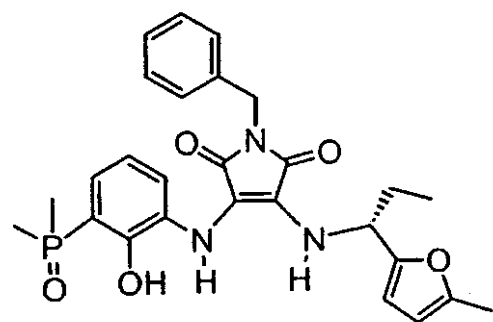
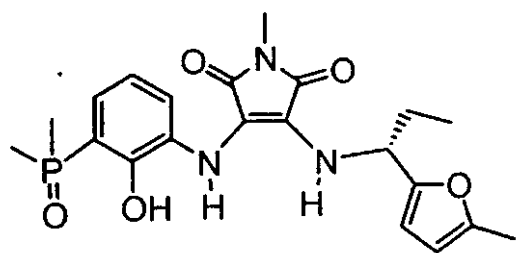


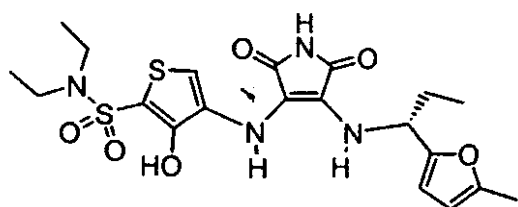
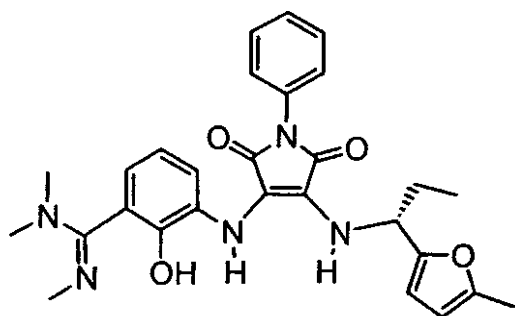
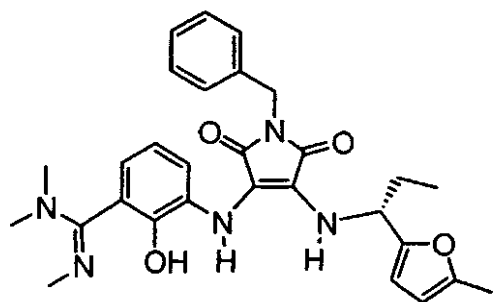
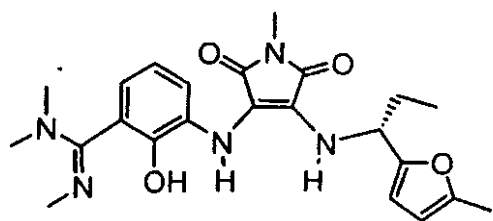


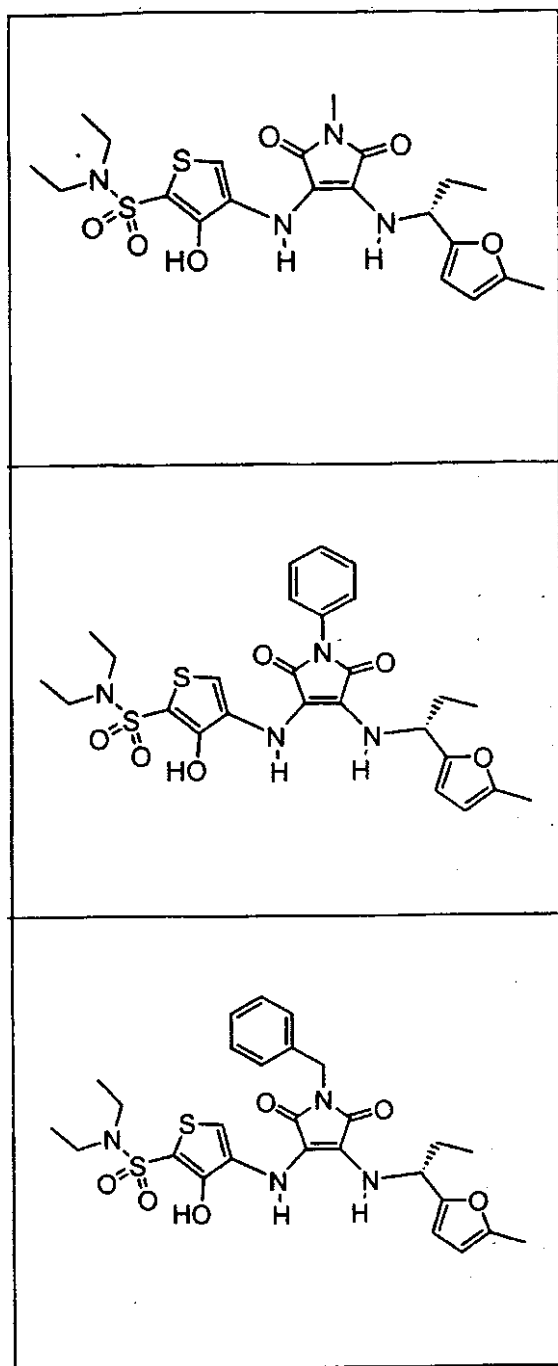












から構成された群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 14】

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 15】

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、エンドトキシンショック、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、嚢胞性線維症、早産、咳、そう痒、多臓器不全、外傷、過労、捻挫、打撲、乾

癰性関節炎、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、急性および慢性肝炎、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、湿潤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、挫傷、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、狼そう、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、マリマスタット、AG3340、Col-3、ネオバスタット、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、ピタキシン、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、マリマスタット、AG3340、Col-3、ネオバスタット、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

F 抗体、EMD 121974、CAI、インタロイキン - 12、IM862、血小板第 4 因子、ピタキシン、アンギオスタチン、スラミン、TNP - 470、PTK - 787、ZD - 6474、ZD - 101、Bay 129566、CGS 27023A、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。