

【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30年6月14日(2018.6.14)

【公開番号】特開2016-164177(P2016-164177A)

【公開日】平成28年9月8日(2016.9.8)

【年通号数】公開・登録公報2016-054

【出願番号】特願2016-77977(P2016-77977)

【国際特許分類】

C 07 D 213/82 (2006.01)  
A 61 K 31/455 (2006.01)  
A 61 K 31/69 (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 7/02 (2006.01)  
A 61 P 7/04 (2006.01)  
A 61 P 9/00 (2006.01)  
A 61 P 9/10 (2006.01)  
A 61 P 11/00 (2006.01)  
A 61 P 11/02 (2006.01)  
A 61 P 11/06 (2006.01)  
A 61 P 13/12 (2006.01)  
A 61 P 17/00 (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 25/04 (2006.01)  
A 61 P 25/28 (2006.01)  
A 61 P 27/02 (2006.01)  
A 61 P 29/00 (2006.01)  
A 61 P 31/04 (2006.01)  
A 61 P 31/12 (2006.01)  
A 61 P 31/14 (2006.01)  
A 61 P 31/20 (2006.01)  
A 61 P 33/06 (2006.01)  
A 61 P 35/00 (2006.01)  
A 61 P 35/02 (2006.01)  
A 61 P 37/06 (2006.01)  
A 61 P 37/08 (2006.01)  
A 61 P 43/00 (2006.01)  
C 07 F 5/02 (2006.01)

【F I】

C 07 D 213/82 C S P

A 61 K 31/455

A 6 1 K	31/69
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	7/02
A 6 1 P	7/04
A 6 1 P	9/00
A 6 1 P	9/10
A 6 1 P	9/10
	1 0 1
A 6 1 P	11/00
A 6 1 P	11/02
A 6 1 P	11/06
A 6 1 P	13/12
A 6 1 P	17/00
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
A 6 1 P	25/00
A 6 1 P	25/04
A 6 1 P	25/28
A 6 1 P	27/02
A 6 1 P	29/00
A 6 1 P	29/00
	1 0 1
A 6 1 P	31/04
A 6 1 P	31/12
A 6 1 P	31/14
A 6 1 P	31/20
A 6 1 P	33/06
A 6 1 P	35/00
A 6 1 P	35/02
A 6 1 P	37/06
A 6 1 P	37/08
A 6 1 P	43/00
	1 1 1
C 0 7 F	5/02
	C

## 【誤訳訂正書】

【提出日】平成30年4月19日(2018.4.19)

## 【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 4 8

【訂正方法】変更

## 【訂正の内容】

## 【0 0 4 8】

「ヘテロ環」(または「ヘテロシクロアルキル」または「ヘテロシクリル」)とは、非芳香族性飽和单環式または多環式環系を意味し、これは、3～10個の環原子(例えば、3～7個の環原子)、または5～10個の環原子を含み、ここで、その環系内の原子の1

個またはそれ以上は、炭素以外の元素（例えば、窒素、酸素または硫黄）の単独またはその組合せである。この環系には、隣接した酸素原子および／または硫黄原子は存在しない。好ましいヘテロ環またはヘテロシクリルアルキルの例としては、5～6個の環原子を有する環が挙げられる。そのヘテロ環またはヘテロシクリルアルキル骨格名の前のアザ、オキサまたはチアとの接頭語は、環原子として、少なくとも、窒素原子、酸素原子または硫黄原子がそれ存在していることを意味する。ヘテロ環またはヘテロシクリルアルキルの窒素原子または硫黄原子は、必要に応じて、対応するN-オキシド、S-オキシドまたはS,S-ジオキシドに酸化され得る。窒素原子は所望により4級化され得る。単環式ヘテロ環またはヘテロシクリルアルキル環の非限定的な例としては、ピペリジル、ピロリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、チアゾリジニル、1,3-ジオキソラニル、1,4-ジオキサニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチオフェン-イルおよびテトラヒドロチオピラニルが挙げられる。ヘテロシクリルは、非置換または置換であり得る。一様において、ヘテロシクリルは、非置換である。他の様において、ヘテロシクリルは、置換である。置換ヘテロシクリル環は、1個の置換基、1-2個の置換基、1-3個の置換基、または1-4個の置換基等で置換されていてよい。一様において、ヘテロシクリル環上に存在し得る置換基は、アシル(-C(=O)-R)、アルコキシ(-O-R)、アルキル、アリール、アルキルアミノ(-N(H)-Rおよび-N(R)R)、アルキルチオ(-S-R)、アミノ(-NH<sub>2</sub>)、アジド(-N<sub>3</sub>)、ボロニル(-B(R)Rまたは-B(OH)<sub>2</sub>または-B(OR)<sub>2</sub>)、カルボキシ(-C(=O)-OH)、アルコキシカルボニル(-C(=O)-OR)、アミノカルボニル(-C(=O)-NH<sub>2</sub>)、アミノスルホニル(-S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>)、アルキルアミノカルボニル(-C(=O)-N(H)Rおよび-C(=O)-N(R)R)、シアノ、ハロ(フルオロ、ブロモ、クロロ、ヨード)、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロシクリル、ヘテロアルキル、ヒドロキシル(-OH)、アシルオキシ(-O-C(=O)-R)、ケトン(-C(=O)-R)、置換ハロメチルケトン(-C(=O)-CH<sub>m</sub>X<sub>n</sub>、式中、m+n=3、X=F、Cl、Brである)、メルカプト(-SHおよび-S-R)、ならびにニトロ(-NO<sub>2</sub>)より選択される。一面において、ヘテロ環式環に結合する置換基または該置換基の一部であるR基は、約12個未満の炭素を有するアルキル基であり、他の面において、R基は、低級アルキル基である。

## 【誤訳訂正2】

### 【訂正対象書類名】特許請求の範囲

### 【訂正対象項目名】全文

## 【訂正方法】変更

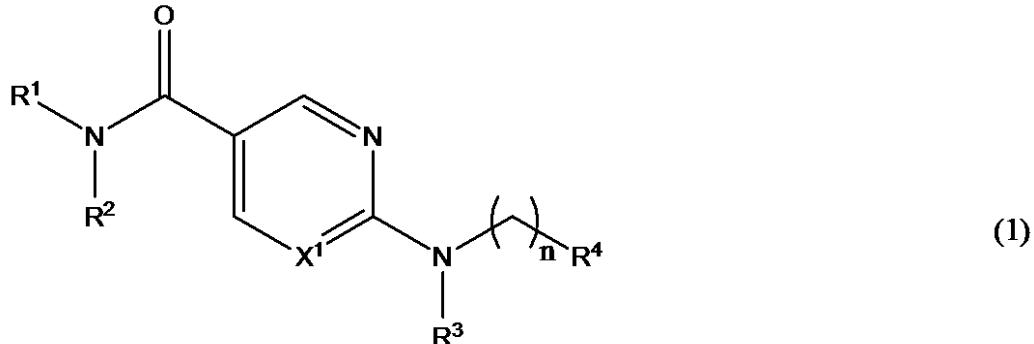
## 【訂正の内容】

## 【特許請求の範囲】

### 【請求項1】

式(1)：

## 【化 1】



〔式中、

R<sup>1</sup> は、水素、2-もししくは3-もししくは4-ハロ-フェニル、ヘテロアルキル、アル

キル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、およびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より選択され；

$R^2$  は、2-もしくは3-もしくは4-ハロ-フェニル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクロアルキルアルキル、アリールアルキル（ここで、このアリールアルキルのアルキル基は、1-18個の炭素原子を有する直鎖炭化水素鎖を含む）、およびヘテロアリール（ここで、このヘテロアリールは、非置換であるか、またはアシル、アルコキシ、アリール、アルキルアミノ、アルキルチオ、アミノ、アジド、ボロニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニル、アルキルアミノカルボニル、シアノ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロシクリル、ヘテロアルキル、ヒドロキシル、アシルオキシ、ケトン、置換ハロメチルケトン、メルカブト、およびニトロより選択される1個もしくはそれ以上の置換基で置換されている）からなる群より選択され；

$R^3$  は、水素、ヘテロアルキル、アルキル、アミノアルキル、アリール、アリールアルキル、カルボキシアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、およびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より選択され、

$R^4$  は、アミノアルキル、アリール、アリールアルキル（ここで、このアリールアルキルのアルキル基は、1-18個の炭素原子を有する直鎖炭化水素鎖を含む）、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクロアルキルアルキル、 $-B(R^5R^6)$ 、 $-BF_3^-M^+$ 、 $-R^7-B(R^5R^6)$ 、 $-R^7-BF_3^-M^+$ 、 $-C(O)-R^7$ 、 $-O-R^7$ 、 $-S(O)_y-R^7$ （ここで、 $y=0$ 、1または2である）、 $-P(O)-(R^5R^6)$ 、 $-N(R^8R^9)$ 、ホスホネート、およびホスフェートからなる群より選択され；

$R^7$  は、アルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より選択され；

$M^+$  は、第IまたはII族の金属元素であり；

$R^5$  および $R^6$  は、水素、ヒドロキシル、アリールオキシまたはアルコキシから独立して選択されるか、または $R^5$  および $R^6$  は共に、環状エステルまたは酸無水物を形成し；

$R^8$  および $R^9$  は、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より独立して選択されるか； $R^8$  および $R^9$  は、両方とも酸素であってニトロ基を形成するか；または、 $R^8$  および $R^9$  は、それらが結合する窒素と一体となって、ヘテロシクリルを形成し；

$X^1$  は、窒素であり；

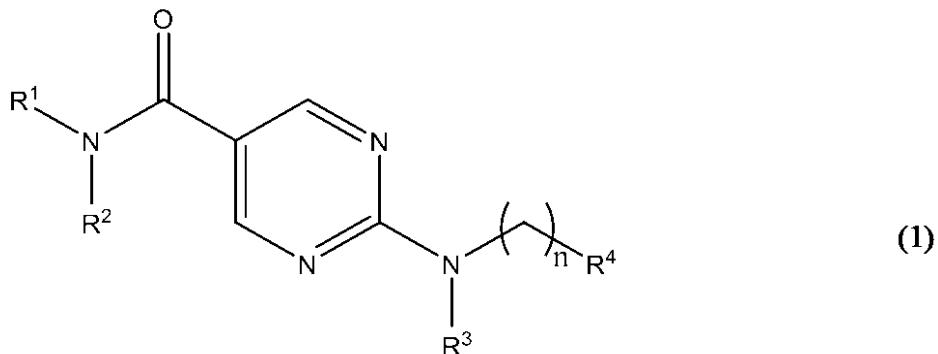
$n=1$  である】

で示される化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項2】

式(1)：

【化2】



[式中、

$R^1$  は、水素、2-もしくは3-もしくは4-ハロ-フェニル、ヘテロアルキル、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、およびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より選択され；

$R^2$  は、2-もしくは3-もしくは4-ハロ-フェニル、ヘテロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、およびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より選択され；

$R^3$  は、水素、ヘテロアルキル、アルキル、アミノアルキル、アリール、アリールアルキル、カルボキシアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、およびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より選択され、

$R^4$  は、アミノアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクロアルキルアルキル、-B( $R^5R^6$ )、-BF<sub>3</sub><sup>+</sup>、-R<sup>7</sup>-B( $R^5R^6$ )、-R<sup>7</sup>-BF<sub>3</sub><sup>+</sup>、-C(O)-R<sup>7</sup>、-O-R<sup>7</sup>、-S(O)<sub>y</sub>-R<sup>7</sup>（ここで、 $y = 0$ 、1または2である）、-P(O)-(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、-N(R<sup>8</sup>R<sup>9</sup>)、ホスホネート、ホスフェート、アリールアルキル（ここで、アリールアルキルのアルキル基は、1-18個の炭素原子を有する直鎖炭化水素鎖を含む）、およびアリール（ここで、このアリールは、非置換であるか、またはアシル、アルコキシ、アリール、アルキルアミノ、アルキルチオ、アミノ、アジド、ボロニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニル、アルキルアミノカルボニル、シアノ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロシクリル、ヘテロアルキル、ヒドロキシル、アシルオキシ、ケトン、置換ハロメチルケトン、メルカプト、およびニトロより選択される1個もしくはそれ以上の置換基で置換されている）からなる群より選択され；

$R^7$  は、アルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より選択され；

$M^+$  は、第IまたはII族の金属元素であり；

$R^5$  および $R^6$  は、水素、ヒドロキシル、アリールオキシまたはアルコキシから独立して選択されるか、または $R^5$  および $R^6$  は共に、環状エステルまたは酸無水物を形成し；

$R^8$  および $R^9$  は、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より独立して選択されるか； $R^8$  および $R^9$  は、両方とも酸素であってニトロ基を形成するか；または、 $R^8$  および $R^9$  は、それらが結合する窒素と一体となって、ヘテロシクリルを形成し；

$n = 1$  である]

で示される化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

## 【請求項 3】

$R^1$  が水素であり、 $R^2$  が 4 - フルオロフェニルである、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

$R^4$  が 4 - ジヒドロキシボリルフェニルである、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

$R^2$  がヘテロアリールであり、このヘテロアリールは、非置換であるか、またはアシル、アルコキシ、アリール、アルキルアミノ、アルキルチオ、アミノ、アジド、ボロニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニル、アルキルアミノカルボニル、シアノ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロシクリル、ヘテロアルキル、ヒドロキシル、アシルオキシ、ケトン、置換ハロメチルケトン、メルカプト、およびニトロより選択される 1 個もしくはそれ以上の置換基で置換されている、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 6】

$R^4$  がアリールであり、このアリールは、非置換であるか、またはアシル、アルコキシ、アリール、アルキルアミノ、アルキルチオ、アミノ、アジド、ボロニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニル、アルキルアミノカルボニル、シアノ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロシクリル、ヘテロアルキル、ヒドロキシル、アシルオキシ、ケトン、置換ハロメチルケトン、メルカプト、およびニトロより選択される 1 個もしくはそれ以上の置換基で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 7】

$R^2$  がアリールアルキルであり、このアリールアルキルのアルキル基は、1 - 18 個の炭素原子を有する直鎖炭化水素鎖を含む、請求項 2 に記載の化合物。

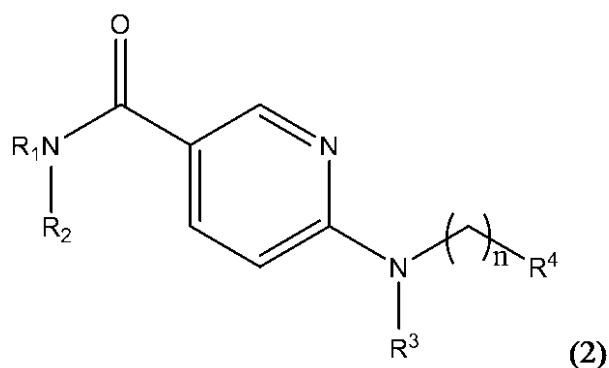
## 【請求項 8】

$R^4$  がアリールアルキルであり、このアリールアルキルのアルキル基は、1 - 18 個の炭素原子を有する直鎖炭化水素鎖を含む、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 9】

式(2)：

## 【化 3】



[式中、

$R^1$  は、水素、2 - もしくは 3 - もしくは 4 - ハロ - フェニル、ヘテロアルキル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、t - ブチル、n - ペンチル、ヘプチル、ノニル、デシル、不飽和アルキル、置換アルキル（ここで、この置換基の数は 1 - 4 個である）、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、および ヘテロシクロアルキルアルキル からなる群より選択され；

$R^2$  は、2 - もしくは 3 - もしくは 4 - ハロ - フェニル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、t - ブチル、n - ペンチル、ヘプチル、ノニル、デシル、不飽和アルキル、置換アルキル（ここで、この置換基の数は 1 - 4 個であり、置換基は、ヒドロ

キシ、アルキルアミノ、ボロニル、カルボキシ、ニトロおよびシアノからなる群より選択される)、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルまたはシクロアルキルアルキル(3-5または7-10個の炭素原子を含む単環または多環系を含むもの)、ヘテロシクリル、およびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より選択され、ここで、アリールまたはヘテロアリールは、非置換であるか、または-C(O)-R、-OR、アリール、-N(H)R、-N(R)R、-S-R、-N<sub>3</sub>、-B(R)R、-B(OH)<sub>2</sub>、-B(OR)<sub>2</sub>、-C(O)OH、-C(O)OR、-C(O)NH<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>、-C(O)N(H)R、-C(O)N(R)R、-SH、-S-R、-NO<sub>2</sub>、シアノ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロシクリル、ヘテロアルキル、-OH、-OC(O)R、-C(O)R、および-C(O)CH<sub>a</sub>X<sub>b</sub>(ここで、a+b=3であり、XはF、ClおよびBrからなる群より選択される)からなる群より選択される1個またはそれ以上の置換基により置換されており、ここで、Rは12個未満の炭素原子を有するアルキルであり;

R<sup>3</sup>は、水素、ヘテロアルキル、メチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、ヘプチル、ノニル、デシル、不飽和アルキル、置換アルキル(ここで、この置換基の数は1-4個である)、アミノアルキル、アリール、アリールアルキル、カルボキシアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクロアルキルアルキル、-B(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、-BF<sub>3</sub><sup>-</sup>M<sup>+</sup>、-R<sup>7</sup>-B(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、-R<sup>7</sup>-BF<sub>3</sub><sup>-</sup>M<sup>+</sup>、-C(O)-R<sup>7</sup>、-O-R<sup>7</sup>、-S(O)<sub>y</sub>-R<sup>7</sup>(ここで、y=0、1または2である)、-P(O)-(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、-N(R<sup>8</sup>R<sup>9</sup>)、カルボキシレート、アミン、ホスホネート、およびホスフェートからなる群より選択され;

R<sup>4</sup>は、ヘテロアルキル、イソプロピル、n-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、ヘプチル、ノニル、デシル、不飽和アルキル、アミノアルキル、ヘテロアリールアルキル、置換シクロアルキル、非置換シクロアルキル(ここで、該非置換シクロアルキルは5-7個の環炭素原子を有する)、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクロアルキルアルキル(ここで、該ヘテロシクロアルキルアルキルのヘテロ環は、ピペリジル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、チアゾリジニル、1,3-ジオキソラニル、1,4-ジオキサン二ル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチオフェニルおよびテトラヒドロチオピラニルからなる群より選択される)、-B(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、-BF<sub>3</sub><sup>-</sup>M<sup>+</sup>、-R<sup>7</sup>-B(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、-R<sup>7</sup>-BF<sub>3</sub><sup>-</sup>M<sup>+</sup>、-C(O)-R<sup>10</sup>、-O-R<sup>7</sup>、-S(O)<sub>y</sub>-R<sup>7</sup>(ここで、y=0、1または2である)、-P(O)-(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、-N(R<sup>8</sup>R<sup>9</sup>)、ホスホネート、ホスフェート、アリール(ここで、このアリールは、-C(O)-R、-OR、アルキル、アリール、-N(H)R、-N(R)R、-S-R、-NH<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、-B(R)R、-B(OH)<sub>2</sub>、-B(OR)<sub>2</sub>、-C(O)OH、-C(O)OR、-C(O)NH<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-C(O)N(H)R、-C(O)N(R)R、-SH、-S-R、-NO<sub>2</sub>、シアノ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロシクリル、ヘテロアルキル、-OH、-OC(O)R、-C(O)R、および-C(O)CH<sub>a</sub>X<sub>b</sub>(ここで、a+b=3であり、XはF、ClおよびBrからなる群より選択される)からなる群より選択される1個またはそれ以上の置換基により置換されており、ここで、Rは12個未満の炭素原子を有するアルキルである)、およびヘテロアリール(ここで、このヘテロアリールは、非置換であるか、またはアシル、アルコキシ、アリール、アルキルアミノ、アルキルチオ、アジド、ボロニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニル、アルキルアミノカルボニル、シアノ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロシクリル、ヘテロアルキル、ヒドロキシル、アシルオキシ、ケトン、置換ハロメチルケトン、メルカプト、およびニトロより選択される1個またはそれ以上の置換基により置換されているか、あるいはヘテロアリールは、ピリジル、ピラジニル、フラニル、チエニル、ピリミジニル、イソチアゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピラゾリル、フラザニル、ピロリル、ピラゾリル、トリアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、ピラジニル、ピリダジニル、キノキサリニ

ル、フタラジニル、イミダゾ[1,2-a]ピリジニル、イミダゾ[2,1-b]チアゾリル、ベンゾフラニル、インドリル、アザインドリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾチエニル、キノリニル、イミダゾリル、チエノピリジル、キナゾリニル、チエノピリミジル、ピロロピリジル、イミダゾピリジル、イソキノリニル、ベンゾアザインドリル、1,2,4-トリアジニル、ブテリン、4-アミノブテリン、およびベンゾチアゾリルからなる群より選択される)からなる群より選択され;

R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>は、水素、ヒドロキシル、アリールオキシまたはアルコキシから独立して選択されるか、またはR<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>は共に、環状エステルまたは酸無水物を形成し;

R<sup>7</sup>は、アルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より選択され;

R<sup>8</sup>は、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より選択され、R<sup>9</sup>は、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より選択されるか; R<sup>8</sup>およびR<sup>9</sup>は、両方とも酸素であってニトロ基を形成するか; または、R<sup>8</sup>およびR<sup>9</sup>は、それらが結合する窒素と一体となって、ヘテロシクリルを形成し;

R<sup>10</sup>は、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より選択され;

M<sup>+</sup>は、第IまたはII族の金属元素であり;

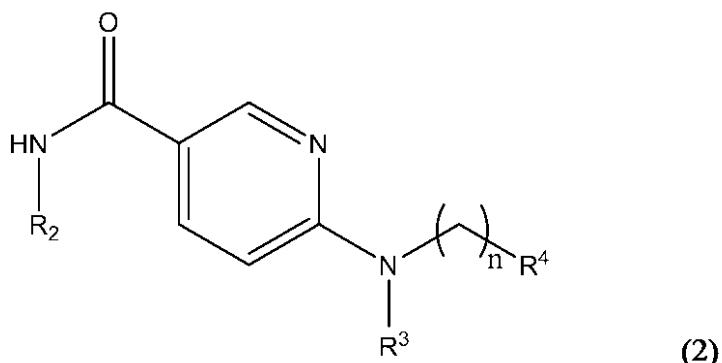
n = 1である]

で示される化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項10】

式(2):

【化4】



[式中、

R<sup>2</sup>は、2-もしくは3-もしくは4-ハロ-フェニルであり;

R<sup>3</sup>は、水素、ヘテロアルキル、アミノアルキル、アリール、アリールアルキル、カルボキシアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクロアルキルアルキル、カルボキシレート、アミン、ホスホネート、ホスフェート、-B(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、-BF<sub>3</sub>·M<sup>+</sup>、-R<sup>7</sup>-B(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、-R<sup>7</sup>BF<sub>3</sub>·M<sup>+</sup>、-C(O)R<sup>7</sup>、-OR<sup>7</sup>、-S(O)<sub>y</sub>R<sup>7</sup>(ここで、y = 0、1または2である)、-P(O)(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、および-N(R<sup>8</sup>R<sup>9</sup>)からなる群より選択され;

R<sup>4</sup>は、ヘテロアルキル、イソプロピル、n-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、ヘプチル、ノニル、デシル、不飽和アルキル、置換アルキル(ここで、この置換基の数は1-4個である)、アミノアルキル、ナフチル、インデニル、テトラヒドロナフチル、インダニル、アントラセニル、フルオレニル、置換アリール、アリールアルキル、ヘテロアリ

ール、ヘテロアリールアルキル、置換シクロアルキル、非置換シクロアルキル（ここで、この非置換シクロアルキルは5-7個の環炭素原子を有する）、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクロアルキルアルキル、カルボキシレート、アミン、ホスホネート、ホスフェート、-B(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、-BF<sub>3</sub><sup>-</sup>M<sup>+</sup>、-R<sup>7</sup>-B(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、-R<sup>7</sup>-BF<sub>3</sub><sup>-</sup>M<sup>+</sup>、-C(O)R<sup>10</sup>、-OR<sup>7</sup>、-S(O)<sub>y</sub>R<sup>7</sup>（ここで、y=0、1または2である）、-P(O)(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、および-N(R<sup>8</sup>R<sup>9</sup>)からなる群より選択され；

R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>は、水素、ヒドロキシル、アリールオキシまたはアルコキシから独立して選択されるか、またはR<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>は共に、環状エステルまたは酸無水物を形成し；

R<sup>7</sup>は、アルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より選択され；

R<sup>8</sup>およびR<sup>9</sup>は、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より独立して選択されるか；R<sup>8</sup>およびR<sup>9</sup>は、両方とも酸素であってニトロ基を形成するか；または、R<sup>8</sup>およびR<sup>9</sup>は、それらが結合する窒素と一体となって、ヘテロシクリルを形成し；

R<sup>10</sup>は、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より選択され；

M<sup>+</sup>は、第IまたはII族の金属元素であり；

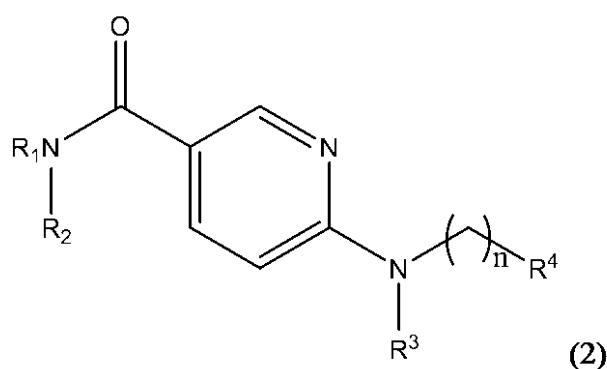
n=1である]

で示される化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項11】

式(2)：

【化5】



[式中、

R<sup>1</sup>は、2-もしくは3-もしくは4-ハロ-フェニル、ヘテロアルキル、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、およびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より選択され、ここで、アリールは、非置換であるか、または-C(O)R、-OR、アルキル、アリール、-N(H)R、-N(R)R、-S-R、-N<sub>3</sub>、-B(R)R、-B(OH)<sub>2</sub>、-B(OR)<sub>2</sub>、-C(O)OH、-C(O)OR、-C(O)NH<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>、-C(O)N(H)R、-C(O)N(R)R、-SH、-S-R、-NO<sub>2</sub>、シアノ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロシクリル、ヘテロアルキル、-OH、-OC(O)R、-C(O)R、および-C(O)CH<sub>a</sub>X<sub>b</sub>（ここで、a+b=3であり、XはF、ClおよびBrからなる群より選択される）からなる群より選択される1個またはそれ以上の置換基により置換されており、ここで、Rは1-2個未満の炭素原子を有するアルキルであり；

R<sup>2</sup>は、2-もしくは3-もしくは4-ハロ-フェニル、ヘテロアルキル、アルキル、

アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、およびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より選択され、ここで、アリールは、非置換であるか、または - C ( O ) R 、 - O R 、アルキル、アリール、 - N ( H ) R 、 - N ( R ) R 、 - S - R 、 - N<sub>3</sub> 、 - B ( R ) R 、 - B ( OH )<sub>2</sub> 、 - B ( OR )<sub>2</sub> 、 - C ( O ) OH 、 - C ( O ) OR 、 - C ( O ) NH<sub>2</sub> 、 - S ( O )<sub>2</sub> NH<sub>2</sub> 、 - C ( O ) N ( H ) R 、 - C ( O ) N ( R ) R 、 - SH 、 - S - R 、 - NO<sub>2</sub> 、シアノ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロシクリル、ヘテロアルキル、 - OH 、 - OC ( O ) R 、 - C ( O ) R 、および - C ( O ) CH<sub>a</sub> X<sub>b</sub> (ここで、a + b = 3 であり、X は F 、 Cl および Br からなる群より選択される) からなる群より選択される 1 個またはそれ以上の置換基により置換されており、ここで、R は 1 2 個未満の炭素原子を有するアルキルであり；

R<sup>3</sup> は、水素、ヘテロアルキル、アルキル、アミノアルキル、アリール、アリールアルキル、カルボキシアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクロアルキルアルキル、カルボキシレート、アミン、ホスホネート、およびホスフェートからなる群より選択され；

R<sup>4</sup> は、 - B ( R<sup>5</sup> R<sup>6</sup> ) 、 - BF<sub>3</sub> - M<sup>+</sup> 、 - R<sup>7</sup> - B ( R<sup>5</sup> R<sup>6</sup> ) 、 - R<sup>7</sup> - BF<sub>3</sub> - M<sup>+</sup> 、 - C ( O ) R<sup>10</sup> 、 - OR<sup>7</sup> 、 - S ( O )<sub>y</sub> R<sup>7</sup> (ここで、y = 0 、 1 または 2 である) 、 - P ( O ) ( R<sup>5</sup> R<sup>6</sup> ) 、 - N ( R<sup>8</sup> R<sup>9</sup> ) 、アリール (ここで、このアリールは、 - C ( O ) R 、 - OR 、アルキル、アリール、 - N ( H ) R 、 - N ( R ) R 、 - NH<sub>2</sub> 、 - S - R 、 - N<sub>3</sub> 、 - B ( R ) R 、 - B ( OH )<sub>2</sub> 、 - B ( OR )<sub>2</sub> 、 - C ( O ) OH 、 - C ( O ) OR 、 - C ( O ) NH<sub>2</sub> 、 - S ( O )<sub>2</sub> NH<sub>2</sub> 、 - C ( O ) N ( H ) R 、 - C ( O ) N ( R ) R 、 - SH 、 - S - R 、 - NO<sub>2</sub> 、シアノ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロシクリル、ヘテロアルキル、 - OH 、 - OC ( O ) R 、 - C ( O ) R 、または - C ( O ) CH<sub>a</sub> X<sub>b</sub> (ここで、a + b = 3 であり、X は F 、 Cl および Br からなる群より選択される) により置換されており、ここで、R は 1 2 個未満の炭素原子を有するアルキルである) 、およびヘテロシクリルからなる群より選択され；

R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は、水素、ヒドロキシル、アリールオキシまたはアルコキシから独立して選択されるか、または R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は共に、環状エステルまたは酸無水物を形成し；

R<sup>7</sup> は、アルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より選択され；

R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より独立して選択されるか； R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は、両方とも酸素であってニトロ基を形成するか；または、R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は、それらが結合する窒素と一体となって、ヘテロシクリルを形成し；

R<sup>10</sup> は、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロシクロアルキルアルキルからなる群より選択され；

M<sup>+</sup> は、第 I または II 族の金属元素であり；

n = 1 である]

で示される化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項 1 2】

R<sup>1</sup> が水素である、請求項 9 または 11 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

R<sup>4</sup> がアリール、 - B ( R<sup>5</sup> R<sup>6</sup> ) 、 - BF<sub>3</sub> - M<sup>+</sup> 、 - R<sup>7</sup> B ( R<sup>5</sup> R<sup>6</sup> ) 、または - R<sup>7</sup> - BF<sub>3</sub> - M<sup>+</sup> である、請求項 9 または 11 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

R<sup>7</sup> がアリールである、請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

$R^4$  がアリールであり、該アリールがハライド、-OHまたは- $B(R^5R^6)$ で置換されている、請求項9または11に記載の化合物。

【請求項16】

該アリールが- $B(R^5R^6)$ で置換されている、請求項15に記載の化合物。

【請求項17】

該アリールがフェニルであり、- $B(R^5R^6)$ が- $R^7B(OH)_2$ である、請求項16に記載の化合物。

【請求項18】

アリールがフェニルであり、- $B(R^5R^6)$ が

【化6】



である、請求項9または11に記載の化合物。

【請求項19】

請求項1～18のいずれかに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溶媒和物を有効成分として含む医薬組成物。

【請求項20】

CXCケモカイン仲介疾患の処置用であり、CXCケモカイン仲介疾患が、グルタミン酸-ロイシン-アルギニン(ELR)-CXCケモカインの過剰產生、腫瘍、癌、肺疾患、多発性硬化症、関節リウマチ、乾癬および炎症からなる群から選択される、請求項19に記載の医薬組成物。

【請求項21】

疾患が、グルタミン酸-ロイシン-アルギニン(ELR)-CXCケモカインの過剰產生を含む、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項22】

疾患が腫瘍または癌である、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項23】

疾患が肺疾患であり、肺疾患がCOPD、喘息または囊胞性線維症である、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項24】

疾患が多発性硬化症である、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項25】

疾患が関節リウマチまたは乾癬である、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項26】

CXCケモカイン仲介疾患の処置に有用な他の医薬をさらに含むか、またはそれと組み合わせて投与される、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項27】

他の医薬が、疾患緩和抗リウマチ剤、非ステロイド性抗炎症剤、COX-2選択的阻害剤、COX-1阻害剤、免疫抑制剤、ステロイド、生物学的応答改変物質、またはCXC-R1および/またはCXC-R2ケモカイン仲介疾患の処置に有用な他の抗炎症剤または処置剤である、請求項26に記載の医薬組成物。

【請求項28】

CXCケモカイン仲介疾患が癌であり、他の医薬が、ゲムシタビン、パクリタキセル、5-フルオロウラシル、シクロホスファミド、テモゾロミド、およびビンクリスチンからなる群から選択される少なくとも1つの抗悪性腫瘍剤、または微小管作用剤、抗悪性腫瘍剤、抗血管形成剤、VEGF受容体キナーゼ阻害剤、VEGF受容体に対する抗体、インターフェロン、および放射線からなる群から選択される少なくとも1つの薬剤である、請

求項2\_6に記載の医薬組成物。

【請求項29】

C X Cケモカイン仲介疾患が肺疾患であり、肺疾患がC O P D、喘息または囊胞性線維症であり、他の医薬が、グルココルチコイド、5-リポキシゲナーゼ阻害剤、ベータ-2アドレナリン受容体アゴニスト、ムスカリンM1アンタゴニスト、ムスカリンM3アンタゴニスト、ムスカリンM2アゴニスト、N K 3アンタゴニスト、L T B 4アンタゴニスト、システイニルロイコトリエンアンタゴニスト、気管支拡張剤、P D E 4阻害剤、P D E 阻害剤、エラスターーゼ阻害剤、M M P 阻害剤、ホスホリパーゼA2阻害剤、ホスホリパーゼD阻害剤、ヒスタミンH1アンタゴニスト、ヒスタミンH3アンタゴニスト、ドーパミンアゴニスト、アデノシンA2アゴニスト、N K 1およびN K 2アンタゴニスト、G A B A - アゴニスト、ノシセプチニアゴニスト、去たん剤、粘液溶解剤、鬱血除去剤、抗酸化剤、抗I L - 8抗体、抗I L - 5抗体、抗I g E抗体、抗T N F抗体、I L - 10、接着分子阻害剤、および成長ホルモンからなる群から選択される、請求項2\_6に記載の医薬組成物。

【請求項30】

C X Cケモカイン仲介疾患が多発性硬化症であり、他の医薬が、グラチラマー酢酸、グルココルチコイド、メトトレキサート、アゾチオプリン、ミトキサントロン、C B 2 - 選択的阻害剤、シクロスボリン、レフルノミド、スルファサラジン、-メタゾン、-インターフェロン、グラチラマー酢酸塩、プレドニゾン、エタネルセプト、およびインフリキシマブからなる群から選択される少なくとも1つの化合物である、請求項2\_6に記載の医薬組成物。

【請求項31】

C X Cケモカイン仲介疾患が関節リウマチまたは乾癬であり、他の医薬が、C O X - 2阻害剤、C O X - 1阻害剤、免疫抑制剤、ステロイド、P D E 4阻害剤、抗T N F化合物、M M P 阻害剤、グルココルチコイド、ケモカイン阻害剤、およびC B 2 - 選択的薬剤からなる群から選択される少なくとも1つの化合物である、請求項2\_6に記載の医薬組成物。

【請求項32】

経口投与される、請求項1\_9～3\_1のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項33】

錠剤の形態である、請求項1\_9～3\_2のいずれかに記載の医薬組成物。