

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成 21 年 5 月 14 日 (2009.5.14)

【公表番号】特表 2008-534558 (P2008-534558A)

【公表日】平成 20 年 8 月 28 日 (2008.8.28)

【年通号数】公開・登録公報 2008-034

【出願番号】特願 2008-503525 (P2008-503525)

【国際特許分類】

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/538 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 413/12 C S P

A 6 1 K 31/538

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 27/06

A 6 1 P 9/10 1 0 3

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 413/14

【手続補正書】

【提出日】平成 21 年 3 月 27 日 (2009.3.27)

【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

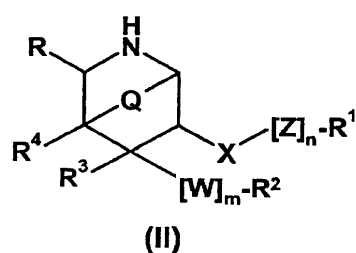
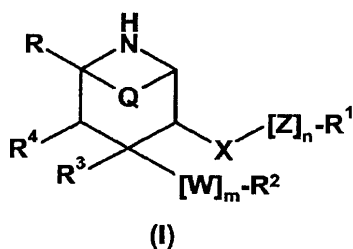
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (I) または (II) :

【化 1】



[ 式中、

R は、 $C_{2 \sim 8}$  - アルケニル、 $C_{1 \sim 8}$  - アルキル、 $C_{2 \sim 8}$  - アルキニル、 $C_{0 \sim 8}$  - アルキル - カルボニル - アミノ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル、 $C_{3 \sim 8}$  - シクロアルキル -  $C_{0 \sim 8}$  - アルキル、 $C_{1 \sim 8}$  - アルキル - スルホニル -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル、場合により N - モノまたは N、N - ジ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル化されたカルバモイル -  $C_{0 \sim 8}$  - アルキル、場合により O -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル化されたカルボキシル -  $C_{0 \sim 8}$  - アルキル、場合により N および / または N - モノ - 、ジ - 、もしくはトリ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル化されたウレイド -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキルあるいはヘテロシクリルカルボニル -  $C_{0 \sim 8}$  - アルキルであり、これらの基はそれぞれ置換されていてもよく、好ましくは 1 ~ 4 の  $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシ、 $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシ、 $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシカルボニル - (N -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル) - アミノ、 $C_{1 \sim 8}$  - アルキル、 $C_{1 \sim 8}$  - アルキル - カルボニル - (N -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル) - アミノ、 $C_{1 \sim 8}$  - アルキル - スルファニル、 $C_{1 \sim 8}$  - アルキル - スルフィニル、場合により一つもしくは 2 つのアリールまたは  $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシ基で置換されたアリール -  $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシ、場合により一つもしくは 2 つのアリールまたは  $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシ基で置換されたアリール、アリール - アミノ、シアノ、 $C_{3 \sim 8}$  - シクロアルコキシ、ハロゲン、ヘテロシクリル -  $C_{0 \sim 8}$  - アルキル、ヘテロシクリル -  $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシ、ヘテロシクリル -  $C_{0 \sim 8}$  - アルキル - アミノ、ヘテロシクリル - カルボニル、ヒドロキシル、場合により N - モノ - または N、N - ジ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル化されたアミノ、場合により N - モノ - または N、N - ジ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル化されたカルバモイル -  $C_{0 \sim 8}$  - アルキル、場合により N - モノ - または N、N - ジ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル化されたカルバモイルオキシ、場合により N - モノ - または N、N - ジ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル化されたスルファモイル、場合により N - アリール化または N - ヘテロシクリル - 置換されたカルバモイル、オキソ、トリフルオロメトキシまたはトリフルオロメチルで置換されており；

R<sup>1</sup> は、アリールまたはヘテロシクリルであり；

R<sup>2</sup> は、アセナフチル、シクロヘキシル、ジアジニル、フリル、イミダゾリル、ナフチル、オキサジアゾリル、オキサゾリル、フェニル、ピラジニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピロリル、オキソピリジニル、テトラゾリル、チエニルまたはトリアゾリルであり、これらの基はそれぞれ、1 ~ 3 の  $C_{1 \sim 8}$  - アルカノイルオキシ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル、 $C_{2 \sim 8}$  - アルケニルオキシ、 $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシ、 $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシ、 $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル、 $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル、 $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシカルボニル、 $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシカルボニルオキシ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル、 $C_{1 \sim 8}$  - アルキル、カルボキシ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル、 $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキルスルファニル、 $C_{1 \sim 8}$  - アルキルスルファニル、 $C_{1 \sim 8}$  - アルキルスルファニル -  $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシ、 $C_{1 \sim 8}$  - アルキルスルファニル -  $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル、 $C_{1 \sim 8}$  - アルキルスルファニル -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル、シアノ、シアノ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル、 $C_{3 \sim 8}$  - シクロアルキル -  $C_{0 \sim 6}$  - アルコキシ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルコキシ、 $C_{1 \sim 6}$  - アルコキシ -  $C_{0 \sim 6}$  - アルキル -  $C_{3 \sim 8}$  - シクロアルキル -  $C_{0 \sim 6}$  - アルコキシ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル、 $C_{3 \sim 8}$  - シクロアルキル -  $C_{0 \sim 6}$  - アルコキシ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル、ハロ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル、ハロゲン、ヒドロキシ -  $C_{1 \sim 8}$  - アルキル、ヒドロキシル、オキシド、トリフルオロメトキシまたはトリフルオロメチル基、あるいは  $C_{1 \sim 8}$  - アルキレンジオキシ基、および / または L<sub>1</sub> - T<sub>1</sub> - L<sub>2</sub> - T<sub>2</sub> - L<sub>3</sub> - T<sub>3</sub> - L<sub>4</sub> - T<sub>4</sub> - L<sub>5</sub> - U 基で置換されていてもよく；

L<sub>1</sub>、L<sub>2</sub>、L<sub>3</sub>、L<sub>4</sub> および L<sub>5</sub> は、それぞれ独立に結合、 $C_{1 \sim 8}$  - アルキレン、 $C_{2 \sim 8}$  - アルケニレンもしくは  $C_{2 \sim 8}$  - アルキニレン、 $C_{3 \sim 8}$  - シクロアルケンであるか、あるいは存在せず；

T<sub>1</sub>、T<sub>2</sub>、T<sub>3</sub> および T<sub>4</sub> はそれぞれ独立に

(a) 結合であるか、または存在しないか、あるいは下記基

(b) - CH(OH) -

- (c) - CH (OR<sup>6</sup>) -
- (d) - CH (NR<sup>5</sup> R<sup>6</sup>) -
- (e) - CO -
- (f) - CR<sup>7</sup> R<sup>8</sup> -
- (g) - O - または - NR<sup>6</sup> -
- (h) - S (O)<sub>0 ~ 2</sub> -
- (i) - SO<sub>2</sub> NR<sup>6</sup> -
- (j) - NR<sup>6</sup> SO<sub>2</sub> -
- (k) - CONR<sup>6</sup> -
- (l) - NR<sup>6</sup> CO -
- (m) - O - CO -
- (n) - CO - O -
- (o) - O - CO - O -
- (p) - O - CO - NR<sup>6</sup> -
- (q) - N (R<sup>6</sup>) - CO - N (R<sup>6</sup>) -
- (r) - N (R<sup>6</sup>) - CO - O -
- (s) ピロリジニレン、ピペリジニレンまたはピペラジニレン
- (t) - C (R<sup>1 1</sup>) (R<sup>1 2</sup>) -

のいずれかであり、

ここで、(b) ~ (t) から始まる結合は、結合がヘテロ原子から始まる場合には隣接する基の飽和または芳香族炭素原子に至り、そうでない場合には2つより多い(b) ~ (f) 基、3つの(g) ~ (h) 基および一つの(i) ~ (t) 基が存在し；

R<sup>3</sup> は、水素、ヒドロキシル、C<sub>1 ~ 8</sub> - アルコキシまたはC<sub>2 ~ 8</sub> - アルケニルオキシであり；

R<sup>4</sup> は、水素、C<sub>2 ~ 8</sub> - アルケニル、C<sub>1 ~ 8</sub> - アルコキシ、C<sub>1 ~ 8</sub> - アルコキシ - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキル、C<sub>1 ~ 8</sub> - アルコキシ - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルコキシ、C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキル、場合により(N - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキル) - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルコシカルボニル - アミノ - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルコキシ、場合により(N - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキル) - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキルカルボニル - アミノ - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルコキシ、場合により(N - モノ - またはN, N - ジ - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキル) - アミノ - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルコキシ、ベンジル、C<sub>3 ~ 8</sub> - シクロアルキルオキシ、C<sub>3 ~ 8</sub> - シクロアルキルオキシ - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルコキシ、ヘテロシクリル - C<sub>0 ~ 8</sub> - アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルコキシ、ヒドロキシ、ヒドロキシ - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルコキシ - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルコキシ、ヒドロキシ - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキル、オキソまたはR<sup>4 a</sup> - Z<sub>1</sub> - X<sub>1</sub> - 基であり、ここでR<sup>4 a</sup> は、

- (a) H -
- (b) C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキル -
- (c) C<sub>2 ~ 8</sub> - アルケニル -
- (d) ヒドロキシ - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキル -
- (e) ポリヒドロキシ - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキル -
- (f) C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキル - O - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキル -
- (g) アリール -
- (h) ヘテロシクリル -
- (i) アリールアルキル -
- (j) ヘテロシクリルアルキル -
- (k) アリールオキシアルキル -
- (l) ヘテロシクリルオキシアルキル -
- (m) (R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>) N - (CH<sub>2</sub>)<sub>1 ~ 3</sub> -
- (n) (R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>) N -
- (o) C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキル - S (O)<sub>0 ~ 2</sub> -
- (p) アリール - S (O)<sub>0 ~ 2</sub> -

- (q) ヘテロシクリル - S(O)<sub>0 ~ 2</sub> -  
 (r) HO - SO<sub>3</sub> - またはこの塩  
 (s) H<sub>2</sub>N - C(NH) - NH -  
 (t) NC -

であり、(n) ~ (t) から始まる結合は、隣接する基の炭素原子に至り、結合がヘテロ原子から始まる場合にはこの炭素原子は飽和されており；

Z<sup>1</sup> は、

- (a) 結合であるか、存在しないか、または下記基  
 (b) - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキレン -  
 (c) - C<sub>2 ~ 8</sub> - アルケニレン -  
 (d) - O - 、 - N(R<sup>1 1</sup>) - 、 - S(O)<sub>0 ~ 2</sub> -  
 (e) - CO -  
 (f) - O - CO -  
 (g) - O - CO - O -  
 (h) - O - CO - N(R<sup>1 1</sup>) -  
 (i) - N(R<sup>1 1</sup>) - CO - O -  
 (j) - CO - N(R<sup>1 1</sup>) -  
 (k) - N(R<sup>1 1</sup>) - CO -  
 (l) - N(R<sup>1 1</sup>) CO - N(R<sup>1 1</sup>) -  
 (m) - CH(OR<sup>9</sup>) -

のいずれかであり、(d) および (f) ~ (m) から始まる結合は、隣接する基の炭素原子に至り、結合がヘテロ原子から始まる場合にはこの炭素原子は飽和されており；

X<sup>1</sup> は、

- (a) 結合であるか、存在しないか、または下記基  
 (b) - O -  
 (c) - N(R<sup>1 1</sup>) -  
 (d) - S(O)<sub>0 ~ 2</sub> -  
 (e) - (CH<sub>2</sub>)<sub>1 ~ 3</sub> -

のいずれかであり；

あるいは式 (I) 中の R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> は、共に結合であり；

R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は、それぞれ独立に、水素、C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキル、C<sub>2 ~ 8</sub> - アルケニル、アリール - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキルもしくはアシルであり、またはそれらが結合されている窒素原子と共に 5 - もしくは 6 - 員ヘテロ環であり、これは追加の窒素、酸素もしくは硫黄原子または - SO - もしくは - SO<sub>2</sub> - 基を含んでもよく、追加の窒素原子は場合により C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキル基で置換されてもよく；

R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> は、それらが結合されている炭素原子と共に、一つまたは2つの - O - もしくは - S - 原子または - SO - もしくは - SO<sub>2</sub> - 基を有しても良い 3 ~ 7 - 員環であり；

R<sup>9</sup> は、水素、C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキル、C<sub>1 ~ 8</sub> - アルコキシ - C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキル、アシルまたはアリールアルキルであり；

R<sup>1 0</sup> は、カルボキシアルキル、アルコシカルボニルアルキル、アルキルまたは水素であり；

R<sup>1 1</sup> は、水素または C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキルであり；

R<sup>1 2</sup> は、水素または C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキルであり；

Q は、エチレンもしくは存在せず (式 (I))、またはエチレンもしくはメチレン (式 (II)) であり；

U は、水素、C<sub>1 ~ 8</sub> - アルキル、シアノ、場合により置換された C<sub>3 ~ 8</sub> - シクロアルキル、アリールまたはヘテロシクリルであり；

W は、酸素または硫黄であり；

X は、結合、酸素または硫黄であり、あるいは >CH - R<sup>1 1</sup>、>CHOR<sup>9</sup>、- O -

CO -、>CO、>C=NOR<sup>10</sup>、-O-CHR<sup>11</sup>-または-O-CHR<sup>11</sup>-CO-NR<sup>9</sup>-基であり、酸素または硫黄原子から始まる結合は、Z基の飽和炭素原子またはR<sup>1</sup>に至り；

Zは、C<sub>1</sub>～8-アルキレン、C<sub>2</sub>～8-アルケニレン、ヒドロキシ-C<sub>1</sub>～8-アルキリデン、-O-、-S-、-O-alk-、-S-alk-、-alk-O-、-alk-S-または-alk-NR<sup>9</sup>-であり、alkはC<sub>1</sub>～8-アルキレンであり；ここで

(a) Zが-O-または-S-である場合、Xは>CH-R<sup>11</sup>であり、R<sup>2</sup>がL1-T1-L2-T2-L3-T3-L4-T4-L5-U置換基を含んでいるか、あるいはR<sup>4</sup>が上記に定義の水素以外の置換基であり；

(b) Zが-O-alk-または-S-alk-である場合、Xは>CH-R<sup>11</sup>であり；および

(c) Xが結合である場合、ZはC<sub>2</sub>～8-アルケニレン、-alk-O-または-alk-S-であり；

mは、0または1であり；

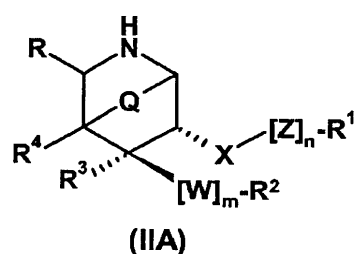
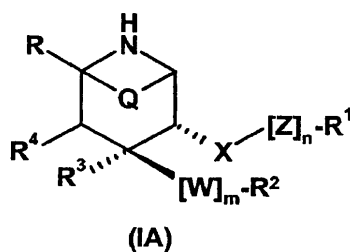
nは、0または1である]

で示される化合物またはその塩もしくはプロドラッグ、あるいは一つまたはそれ以上の原子がそれらの安定な非放射性同位元素で置き換えられている化合物。

【請求項2】

一般式(IA)または(IIA)：

【化2】



[式中、R、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、Q、W、X、Z、nおよびmはそれぞれ請求項1記載の式(I)または(II)に定義された通りである]で示される請求項1記載の化合物。

【請求項3】

請求項1または2記載の化合物であって、

Rは、C<sub>2</sub>～8-アルケニル、C<sub>1</sub>～8-アルキル、C<sub>2</sub>～8-アルキニル、C<sub>0</sub>～8-アルキル-カルボニル-アミノ-C<sub>1</sub>～8-アルキル、C<sub>3</sub>～8-シクロアルキル-C<sub>0</sub>～8-アルキル、C<sub>1</sub>～8-アルキル-スルホニル-C<sub>0</sub>～8-アルキル、場合によりN-モノまたはN、N-ジ-C<sub>1</sub>～8-アルキル化されたカルバモイル-C<sub>0</sub>～8-アルキル、場合によりO-C<sub>1</sub>～8-アルキル化されたカルボキシル-C<sub>0</sub>～8-アルキル、場合によりNおよび/またはN-モノ-、ジ-、もしくはトリ-C<sub>1</sub>～8-アルキル化されたウレイド-C<sub>0</sub>～8-アルキルあるいはヘテロシクリルカルボニル-C<sub>0</sub>～8-アルキルであり、これらの基はそれぞれ置換されていてもよく、好ましくは1～4のC<sub>1</sub>～8-アルコキシ、C<sub>1</sub>～8-アルコキシ-C<sub>1</sub>～8-アルコキシ、C<sub>1</sub>～8-アルコキシカルボニル-(N-C<sub>1</sub>～8-アルキル)-アミノ、C<sub>1</sub>～8-アルキル、C<sub>1</sub>～8-アルキル-カルボニル-(N-C<sub>1</sub>～8-アルキル)-アミノ、C<sub>1</sub>～8-アルキル-スルファニル、C<sub>1</sub>～8-アルキル-スルフィニル、場合により一つもしくは2つのアリールまたはC<sub>1</sub>～8-アルコキシ基で置換されたアリール-C<sub>0</sub>～8-アルコキシ、場合により一つもしくは2つのアリールまたはC<sub>1</sub>～8-アルコキシ基で置換されたアリール、アリール-アミノ、シアノ、C<sub>3</sub>～8-シクロアルコキシ、ハロゲン、ヘテロシクリル-C<sub>0</sub>

$\sim 8$  - アルキル、ヘテロシクリル -  $C_0 \sim 8$  - アルコキシ、ヘテロシクリル -  $C_0 \sim 8$  - アルキル - アミノ、ヘテロシクリル - カルボニル、ヒドロキシル、場合により N - モノ - または N, N - ジ -  $C_1 \sim 8$  - アルキル化されたアミノ、場合により N - モノ - または N, N - ジ -  $C_1 \sim 8$  - アルキル化されたカルバモイル -  $C_0 \sim 8$  - アルキル、場合により N - モノ - または N, N - ジ -  $C_1 \sim 8$  - アルキル化されたカルバモイルオキシ、場合により N - モノ - または N, N - ジ -  $C_1 \sim 8$  - アルキル化されたスルファモイル、場合により N -  $C_1 \sim 8$  - アルキル化された、N - アリール化されたまたは N - ヘテロシクリル - 置換されたカルバモイル、オキソ、トリフルオロメトキシまたはトリフルオロメチルで置換されており；

$R^1$  は、アリールまたはヘテロシクリルであり；

$R^2$  は、フェニル、シクロヘキシル、テトラゾリル、ナフチルまたはアセナフチルであり、これらの基はそれぞれ、非置換であるか、あるいは置換されていてもよく、好ましくは 1 ~ 3 の  $C_1 \sim 8$  - アルカノイルオキシ -  $C_1 \sim 8$  - アルキル、 $C_2 \sim 8$  - アルケニルオキシ、 $C_1 \sim 8$  - アルコキシ、 $C_1 \sim 8$  - アルコキシ -  $C_1 \sim 8$  - アルコキシ、 $C_1 \sim 8$  - アルコキシ -  $C_1 \sim 8$  - アルコキシ -  $C_1 \sim 8$  - アルコキシ、 $C_1 \sim 8$  - アルコキシ -  $C_1 \sim 8$  - アルコキシ -  $C_1 \sim 8$  - アルコキシ、 $C_1 \sim 8$  - アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim 8$  - アルコキシカルボニルオキシ -  $C_1 \sim 8$  - アルキル、 $C_1 \sim 8$  - アルキル、カルボキシ -  $C_1 \sim 8$  - アルキル、 $C_1 \sim 8$  - アルコキシ -  $C_1 \sim 8$  - アルキルスルファニル、 $C_1 \sim 8$  - アルキルスルファニル、 $C_1 \sim 8$  - アルキルスルファニル -  $C_1 \sim 8$  - アルコキシ、 $C_1 \sim 8$  - アルキルスルファニル -  $C_1 \sim 8$  - アルコキシ -  $C_1 \sim 8$  - アルキル、 $C_1 \sim 8$  - アルキルスルファニル -  $C_1 \sim 8$  - アルキル、シアノ、シアノ -  $C_1 \sim 8$  - アルキル、 $C_3 \sim 8$  - シクロアルキル -  $C_0 \sim 6$  - アルコキシ -  $C_1 \sim 8$  - アルコキシ、 $C_1 \sim 6$  - アルコキシ -  $C_0 \sim 6$  - アルキル -  $C_3 \sim 8$  - シクロアルキル -  $C_0 \sim 6$  - アルコキシ -  $C_1 \sim 8$  - アルキル、 $C_3 \sim 8$  - シクロアルキル -  $C_0 \sim 6$  - アルコキシ -  $C_1 \sim 8$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim 8$  - アルキル、ハロゲン、ヒドロキシ -  $C_1 \sim 8$  - アルキル、ヒドロキシル、オキシド、トリフルオロメトキシまたはトリフルオロメチル基、あるいは  $C_1 \sim 8$  - アルキレンジオキシ基、および / または L1 - T1 - L2 - T2 - L3 - T3 - L4 - T4 - L5 - U 基で置換されていてもよく；あるいはナフチルまたはアセナフチルであり；

L1、L2、L3、L4 および L5 は、それぞれ独立に結合、 $C_1 \sim 8$  - アルキレン、 $C_2 \sim 8$  - アルケニレンもしくは  $C_2 \sim 8$  - アルキニレン、 $C_3 \sim 8$  - シクロアルケンであるか、あるいは存在せず；

T1、T2、T3 および T4 は、それぞれ独立に

(a) 結合であるか、または存在しないか、あるいは下記基

(b) - CH(OH) -

(c) - CH(OR<sup>6</sup>) -

(d) - CH(NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>) -

(e) - CO -

(f) - CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> -

(g) - O - または - NR<sup>6</sup> -

(h) - S(O)<sub>0~2</sub> -

(i) - SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup> -

(j) - NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub> -

(k) - CONR<sup>6</sup> -

(l) - NR<sup>6</sup>CO -

(m) - O - CO -

(n) - CO - O -

(o) - O - CO - O -

(p) - O - CO - NR<sup>6</sup> -

(q) - N(R<sup>6</sup>) - CO - N(R<sup>6</sup>) -

(r) - N(R<sup>6</sup>) - CO - O -

(s) ピロリジニレン、ピペリジニレンまたはピペラジニレン

(t) - C(R<sup>1 1</sup>)(R<sup>1 2</sup>) -

のいずれかであり、

ここで、(b) ~ (t) から始まる結合は、結合がヘテロ原子から始まる場合には隣接する基の飽和または芳香族炭素原子に至り、そうでない場合には2つより多い(b) ~ (f) 基、3つの(g) ~ (h) 基および一つの(i) ~ (t) 基が存在し；

R<sup>3</sup> は、水素、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシまたはC<sub>2</sub> ~ 8 - アルケニルオキシであり；

R<sup>4</sup> は、水素、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、場合により(N - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル) - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシカルボニル - アミノ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ、場合により(N - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル) - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキルカルボニル - アミノ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ、場合により(N - モノ - またはN, N - ジ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル) - アミノ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ、C<sub>3</sub> ~ 8 - シクロアルキルオキシ、C<sub>3</sub> ~ 8 - シクロアルキルオキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ、ヘテロシクリル - C<sub>0</sub> ~ 8 - アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ、ヒドロキシ、オキソまたはヒドロキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシであり；

R<sup>5</sup> およびR<sup>6</sup> は、それぞれ独立に、水素、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキルもしくはアシルであり、または、それらが結合されている窒素原子と共に5 - もしくは6 - 員ヘテロ環であり、追加の窒素、酸素もしくは硫黄原子を含んでも良く；

R<sup>7</sup> およびR<sup>8</sup> は、それらが結合されている炭素原子と共に3 ~ 7 - 員環であり、一つまたは2つの - O - もしくは - S - 原子を有しても良く；

R<sup>9</sup> は、水素、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、アシルまたはアリールアルキルであり；

U は、水素、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、C<sub>3</sub> ~ 8 - シクロアルキル、シアノ、アリールまたはヘテロシクリルであり；

Q は、エチレンもしくは存在せず(式(I))、またはエチレンもしくはメチレン(式(II))であり；

X は、結合、酸素、硫黄、あるいは>CHR<sup>1 1</sup>、>CHOR<sup>9</sup>、-O-CO-、>COまたは-O-CH-R<sup>1 1</sup>-CO-NR<sup>9</sup>-基であり；

W は、R<sup>3</sup> が水素である場合、酸素または硫黄であり；

Z は、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキレンまたは - alk - O - であり；

ここで、X が結合である場合、Z は - alk - O - であり；

n は、0 または 1 であり；

m は、0 または 1 である]

である化合物またはその薬剤学的に使用可能な塩。

#### 【請求項4】

請求項1 ~ 3のいずれか一項記載の化合物であって、R<sup>2</sup> が、C<sub>2</sub> ~ 8 - アルケニルオキシ、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル - アミノ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル - スルファニル、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキルスルファニル、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキルスルファニル - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキルスルファニル - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキルスルファニル - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、C<sub>3</sub> ~ 8 - シクロアルキルスルファニル - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキルスルホニル - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、C<sub>3</sub> ~ 8 - シクロアルキル - C<sub>0</sub> ~ 6 - アルコキシ、C<sub>3</sub> ~ 8 - シクロアルキル - C<sub>0</sub> ~ 6 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ、C<sub>3</sub> ~ 8 - シクロアルキル - C<sub>0</sub> ~ 6 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、C<sub>1</sub> ~ 6 - アルコキシ - C<sub>0</sub> ~ 6 - アルキル - C<sub>3</sub> ~ 8 - シクロアルキル - C<sub>0</sub> ~ 6 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、C<sub>3</sub> ~ 8 - シクロアルキル - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキルアミノ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、ハロゲ

ン、ヘテロシクリル - C<sub>0</sub> ~ 6 - アルコキシ、ヘテロシクリル - C<sub>0</sub> ~ 6 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキルアミノ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、N - (ハロ - フェニル) ピロリジニルオキシ、N - (ハロ - フェニル) ピロリジニルオキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシベンジルオキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシフェノキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシフェノキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシフェニル - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ、ハロベンジルオキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ、ハロフェノキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ、ハロフェノキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、ハロフェノキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキル、ハロフェニル - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシまたは C<sub>1</sub> ~ 8 - アルキルベンジルオキシ - C<sub>1</sub> ~ 8 - アルコキシによりそれぞれ置換されるフェニルまたはハロフェニルであって、少なくとも一つの置換基が、R<sup>2</sup> から分子の他の部分への結合に対してパラ - 位にある化合物。

【請求項 5】

m が 0 である、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 6】

請求項 1 ~ 5 のいずれか一項記載の式 (I)、(IA)、(II) または (IIA) で示される化合物を含む医薬製剤。

【請求項 7】

高血圧、心不全、緑内障、心筋梗塞、腎不全、再狭窄または脳卒中の治療または予防の請求項 6 記載の医薬製剤。

【請求項 8】

医薬、好ましくは高血圧、心不全、緑内障、心筋梗塞、腎不全、再狭窄または脳卒中の治療または予防のための医薬の製造のための、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項記載の式 (I)、(IA)、(II) または (IIA) で示される化合物の使用。