【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成24年12月6日(2012.12.6)

【公表番号】特表2012-506856(P2012-506856A)
【公表日】平成24年3月22日(2012.3.22)
【年通号数】公開・登録公報2012-012
【出願番号】特願2011-533170(P2011-533170)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 215/54 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 317/58 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/36 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 409/12 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/381 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 487/04 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/5025 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 405/12 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4196 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 491/052 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4188 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 261/08 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/42 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/519 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 319/20 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/55 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/167 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/422 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 413/04 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4439 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 239/47 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/513 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 405/04 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/506 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/47 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 401/12 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/496 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 261/14 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 235/14 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4184 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 39/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/32 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 39/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/08 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/12 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 29/00 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 45/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00 (2006.01)

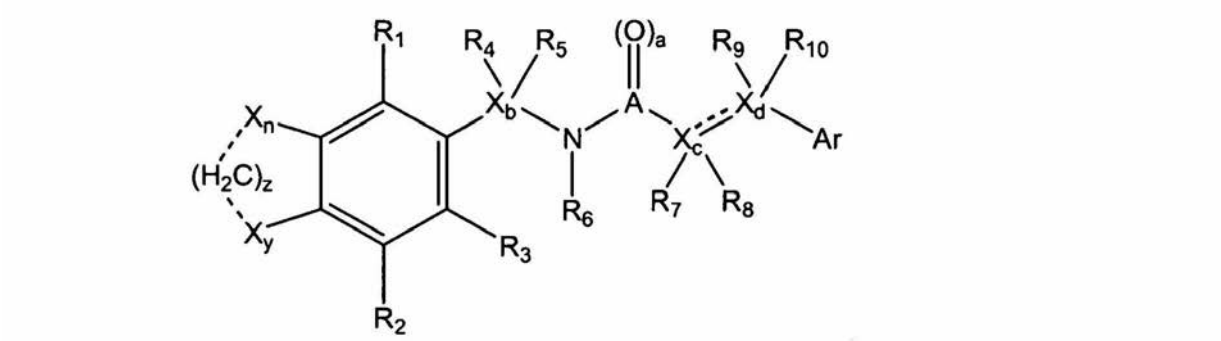
A 6 1 Q 11/00 (2006.01)
A 6 1 K 8/49 (2006.01)
A 6 1 K 8/42 (2006.01)
C 0 7 D 413/14 (2006.01)
C 0 7 C 233/29 (2006.01)
C 1 2 N 9/02 (2006.01)

【ＦＩ】

C 0 7 D 215/54 C S P
C 0 7 D 317/58 Z N A
A 6 1 K 31/36
C 0 7 D 409/12
A 6 1 K 31/381
C 0 7 D 487/04 1 4 0
A 6 1 K 31/5025
C 0 7 D 405/12
A 6 1 K 31/4196
C 0 7 D 491/052
A 6 1 K 31/4188
C 0 7 D 261/08
A 6 1 K 31/42
C 0 7 D 487/04 1 4 4
A 6 1 K 31/519
C 0 7 D 319/20
A 6 1 K 31/55
A 6 1 K 31/167
A 6 1 K 31/422
C 0 7 D 413/04
A 6 1 K 31/4439
C 0 7 D 239/47 Z
A 6 1 K 31/513
C 0 7 D 405/04
A 6 1 K 31/506
C 0 7 D 487/04 1 4 2
C 0 7 D 487/04 1 4 5
A 6 1 K 31/47
C 0 7 D 401/12
A 6 1 K 31/496
C 0 7 D 261/14
C 0 7 D 235/14
A 6 1 K 31/4184
A 6 1 P 39/02
A 6 1 P 25/32
A 6 1 P 39/06
A 6 1 P 25/08
A 6 1 P 17/02
A 6 1 P 27/02
A 6 1 P 27/12
A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 P 29/00
A 6 1 K 45/00

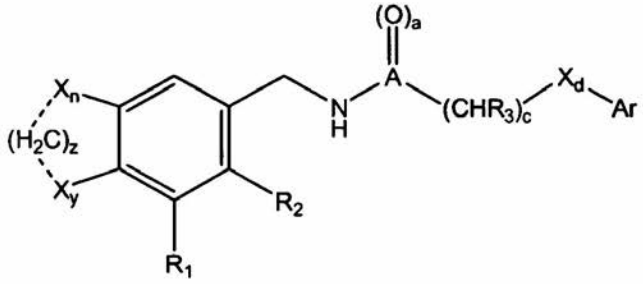
Ａ６１Ｐ　35/00
Ａ６１Ｑ　11/00
Ａ６１Ｋ　 8/49
Ａ６１Ｋ　 8/42
Ｃ０７Ｄ 413/14
Ｃ０７Ｃ 233/29
Ｃ１２Ｎ　 9/02

【手続補正書】
【提出日】平成24年10月17日(2012.10.17)
【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：
【化１】

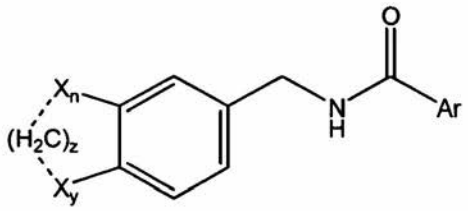


［式中、X_nおよびX_yはそれぞれ、独立して、Ｈ、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはハロゲン（例えば、Ｆ、Ｂｒ、Ｃｌ、もしくはＩ）であり、ｎは、整数０または１であり、ｙは、整数０または１であり、
－－－（点線）は、任意選択の結合であり、ｚは、整数０、１、または２であり、
－－－は、任意選択の二重結合であり、
R_1、R_2、R_3、R_4、R_5、R_6、R_7、R_8、R_9、およびR_{10}のそれぞれは、Ｈ；Ｃ；Ｎ；Ｏ；ハロ（例えば、ブロモ、フルオロ、クロロ、ヨード）；置換または非置換のフェニル基；脂肪族基、アルキル基；置換アルキル基；アルケニル基；アルキニル基；置換または非置換の環状基；置換または非置換のヘテロ環基；置換または非置換のアリール基；および置換または非置換のヘテロアリール基から独立して選択され、
Ａは、ＣまたはＳであり、Ａ＝Ｃであるとき、ａ＝１であり、Ａ＝Ｓであるとき、ａ＝２であり、
X_bは、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはＳであり、ｂは、整数０または１であり、
X_cは、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはＳであり、ｃは、整数０または１であり、
X_dは、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはＳであり、ｄは、整数０または１であり、
Ａｒは、置換アリール基、非置換アリール基、置換ヘテロアリール基、および非置換ヘテロアリール基から選択される］
で表される化合物、またはそのプロドラッグ、製薬上許容される塩、類似体、もしくは誘導体である化合物。
【請求項２】
以下：

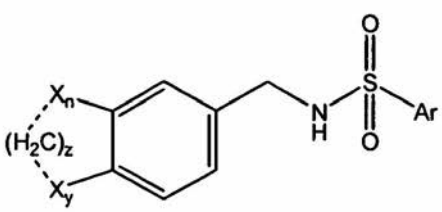
式Ｉａ：
【化２】



［式中、ｚは、整数０、１、または２であり、但し、１）Ｘ＝ハロゲンであり、－－－が結合ではないとき、ｚ＝０であり、２）ｚ＝０であるとき、Ｘ＝Ｏであり、－－－は結合ではなく、１個または複数の酸素原子（Ｘ）が存在し、酸素はメチル基と結合しており、
Ａ＝ＣまたはＳであり、Ａ＝Ｃであるとき、ａ＝１であり、Ａ＝Ｓであるとき、ａ＝２であり、
R_1、R_2、およびR_3はそれぞれ、Ｈ；ハロ；脂肪族基、アルキル基；置換アルキル基；置換または非置換のアルケニル基；および置換または非置換のアルキニル基から独立して選択され、
ｃは、整数０または１であり、
X_dは、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはＳであり、ｃは、整数０または１であり、
Ａｒは、置換アリール基、非置換アリール基、置換ヘテロアリール基、および非置換ヘテロアリール基から選択される］で表される化合物、そのプロドラッグ、製薬上許容される塩、類似体、及び誘導体；
式Ｉｂ：
【化３】



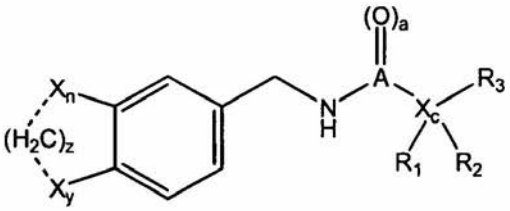
［式中、X_nおよびX_yはそれぞれ、独立して、Ｈ、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはハロゲンであり、ｎは、整数０または１であり、ｙは、整数０または１であり、
－－－（点線）は、任意選択の結合であり、
ｚは、整数０、１、または２であり、但し、１）Ｘ＝ハロゲンであり、－－－が結合ではないとき、ｚ＝０であり、２）ｚ＝０であるとき、Ｘ＝Ｏであり、－－－は結合ではなく、１個または複数の酸素原子（Ｘ）が存在し、酸素はメチル基と結合しており、
Ａｒは、置換アリール基、非置換アリール基、置換ヘテロアリール基、および非置換ヘテロアリール基から選択される］で表される化合物、そのプロドラッグ、製薬上許容される塩、類似体、及び誘導体；
式Ｉｃ：
【化４】



［式中、X_nおよびX_yはそれぞれ、独立して、Ｈ、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはハロゲンであり、ｎは、整数０または１であり、ｙは、整数０または１であり、
－－－（点線）は、任意選択の結合であり、
ｚは、整数０、１、または２であり、但し、１）Ｘ＝ハロゲンであり、－－－が結合ではないとき、ｚ＝０であり、２）ｚ＝０であるとき、Ｘ＝Ｏであり、－－－は結合ではなく、１個または複数の酸素原子（Ｘ）が存在し、酸素はメチル基と結合しており、
Ａｒは、置換アリール基、非置換アリール基、置換ヘテロアリール基、および非置換ヘテロアリール基から選択される］で表される化合物、そのプロドラッグ、製薬上許容される塩、類似体、及び誘導体；

式Ｉｄ：

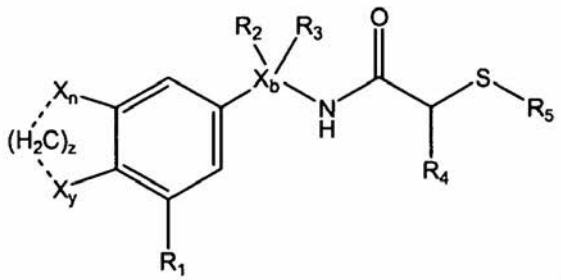
【化５】



［式中、X_nおよびX_yはそれぞれ、独立して、Ｈ、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはハロゲンであり、ｎは、整数０または１であり、ｙは、整数０または１であり、
－－－（点線）は、任意選択の結合であり、
ｚは、整数０、１、または２であり、但し、１）Ｘ＝ハロゲンであり、－－－が結合ではないとき、ｚ＝０であり、２）ｚ＝０であるとき、Ｘ＝Ｏであり、－－－は結合ではなく、１個または複数の酸素原子（Ｘ）が存在し、酸素はメチル基と結合しており、
Ａ＝ＣまたはＳであり、Ａ＝Ｃであるとき、ａ＝１であり、Ａ＝Ｓであるとき、ａ＝２であり、
X_cは、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはＳであり、ｃは、整数０または１であり、
R_1およびR_2はそれぞれ、Ｈ；ハロ（例えば、ブロモ、フルオロ、クロロ、ヨード）；脂肪族基、アルキル基；置換アルキル基；置換または非置換のアルケニル基；および置換または非置換のアルキニル基から独立して選択され、
R_3は、置換多環状基、非置換多環状基、置換ヘテロ多環状基、および非置換ヘテロ多環状基から選択される］で表される化合物、そのプロドラッグ、製薬上許容される塩、類似体、及び誘導体；

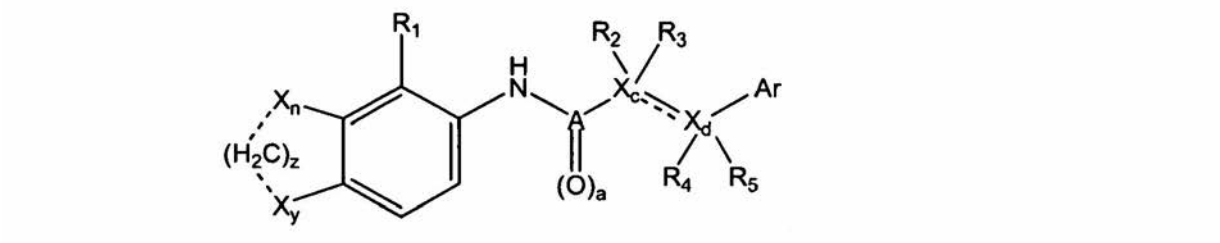
式Ｉｅ：

【化６】

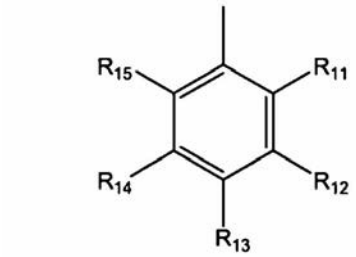


［式中、X_nおよびX_yはそれぞれ、独立して、Ｈ、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはハロゲンであり、ｎは、整数０または１であり、ｙは、整数０または１であり、
－－－（点線）は、任意選択の結合であり、
ｚは、整数０、１、または２であり、但し、１）Ｘ＝ハロゲンであり、－－－が結合ではないとき、ｚ＝０であり、２）ｚ＝０であるとき、Ｘ＝Ｏであり、－－－は結合ではなく、１個または複数の酸素原子（Ｘ）が存在し、酸素はメチル基と結合しており、
X_bは、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはＳであり、ｃは、整数０または１であり、

Ｒ１、Ｒ２、Ｒ３およびＲ４はそれぞれ、Ｈ；ハロ（例えば、ブロモ、フルオロ、クロロ、ヨード）；脂肪族基、アルキル基；置換アルキル基；置換または非置換のアルケニル基；および置換または非置換のアルキニル基から独立して選択され、
Ｒ５は、置換多環状基、非置換多環状基、置換ヘテロ多環状基、および非置換ヘテロ多環状基から選択される］で表される化合物、そのプロドラッグ、製薬上許容される塩、類似体、及び誘導体；
及び
式Ｉｆ：
【化７】

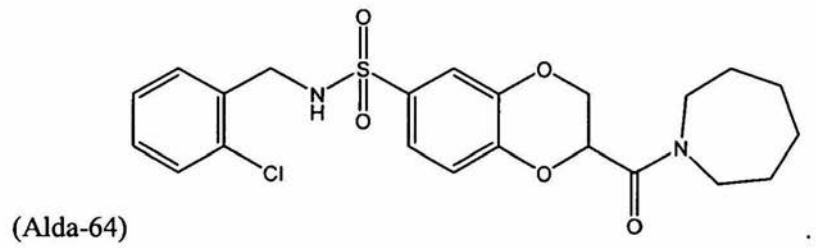


［式中、Ｘｎおよびｙはそれぞれ、独立して、Ｈ、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはハロゲン（例えば、Ｆ、Ｂｒ、Ｃｌ、もしくはＩ）であり、ｎは、整数０または１であり、ｙは、整数０または１であり、
－－－（点線）は、任意選択の結合であり、
ｚは、整数０、１、または２であり、但し、１）Ｘ＝ハロゲンであり、－－－が結合ではないとき、ｚ＝０であり、２）ｚ＝０であるとき、Ｘ＝Ｏであり、－－－は結合ではなく、１個または複数の酸素原子（Ｘ）が存在し、酸素はメチル基と結合しており、
－－－は、任意選択の二重結合であり、
Ａ＝ＣまたはＳであり、Ａ＝Ｃであるとき、ａ＝１であり、Ａ＝Ｓであるとき、ａ＝２であり、
Ｒ１、Ｒ２、Ｒ３、Ｒ４およびＲ５はそれぞれ、Ｈ；－ＯＨ；ハロ（例えば、ブロモ、フルオロ、クロロ、ヨード）；脂肪族基、アルキル基；置換アルキル基；置換または非置換のアルケニル基；および置換または非置換のアルキニル基から独立して選択され、
Ｘｃは、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはＳであり、ｃは、整数０または１であり、
Ｘｄは、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはＳであり、ｃは、整数０または１であり、
Ａｒは、置換アリール基、非置換アリール基、置換ヘテロアリール基、および非置換ヘテロアリール基から選択される］で表される化合物、そのプロドラッグ、製薬上許容される塩、類似体、及び誘導体から選択される、請求項１に記載の化合物。
【請求項３】
Ａｒが、式：
【化８】



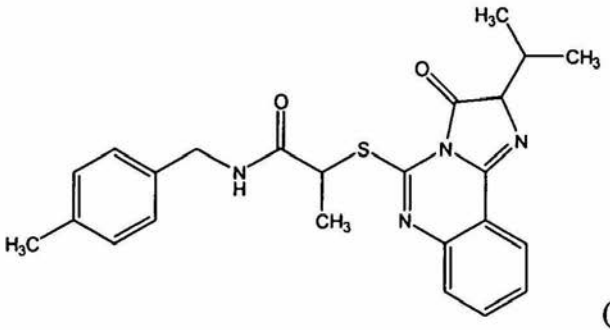
（式中、Ｒ１１～Ｒ１５はそれぞれ、Ｈ；ハロ；置換または非置換のフェニル基；脂肪族基、アルキル基；置換アルキル基；アルケニル基；アルキニル基；置換または非置換の環状基；置換または非置換のヘテロ環基；置換または非置換のアリール基；および置換または非置換のヘテロアリール基から独立して選択される）で表される、
Ａｒが、置換ナフタレン基である、又は、
Ａｒが、置換ピリジンオキシドである、請求項１に記載の化合物。

【請求項４】
以下：
【化９】



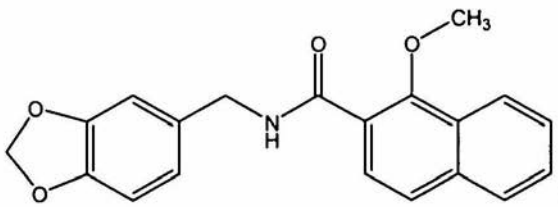
(Alda-64)

【化１０】

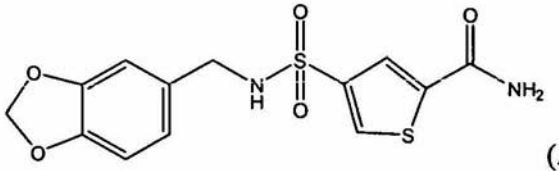


(Alda-66),

【化１１】

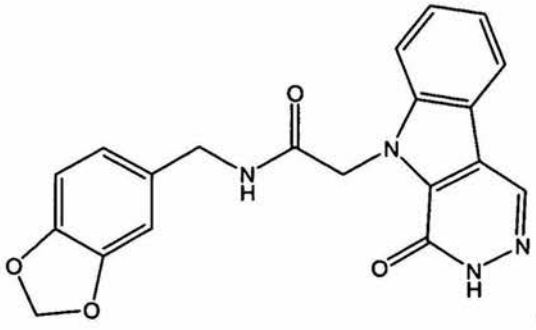


(Alda-52),

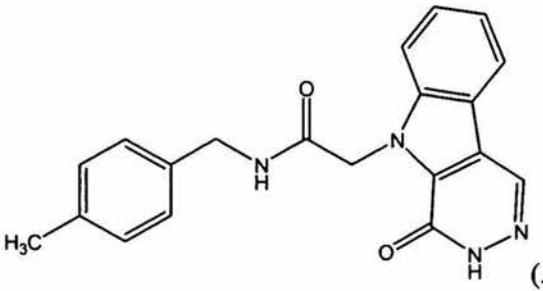


(Alda-59),

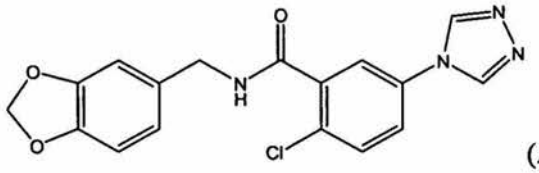
【化１２】



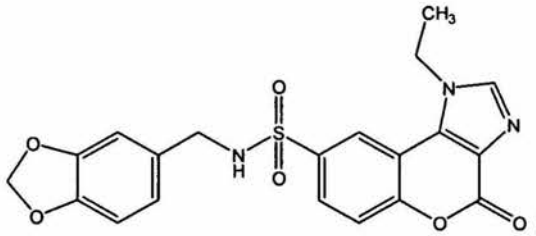
(Alda-72),



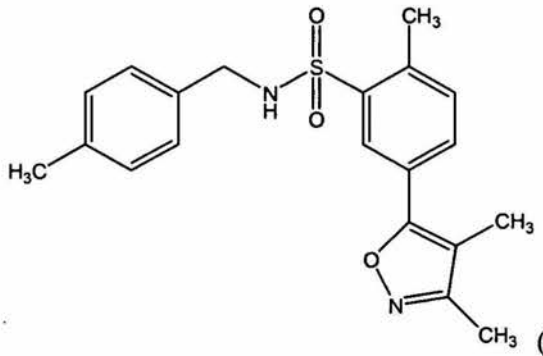
(Alda-71),



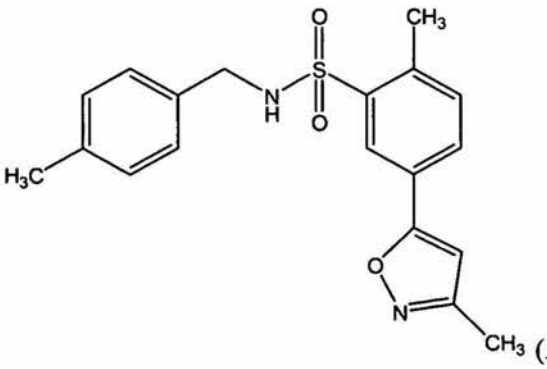
(Alda-53),



(Alda-54),

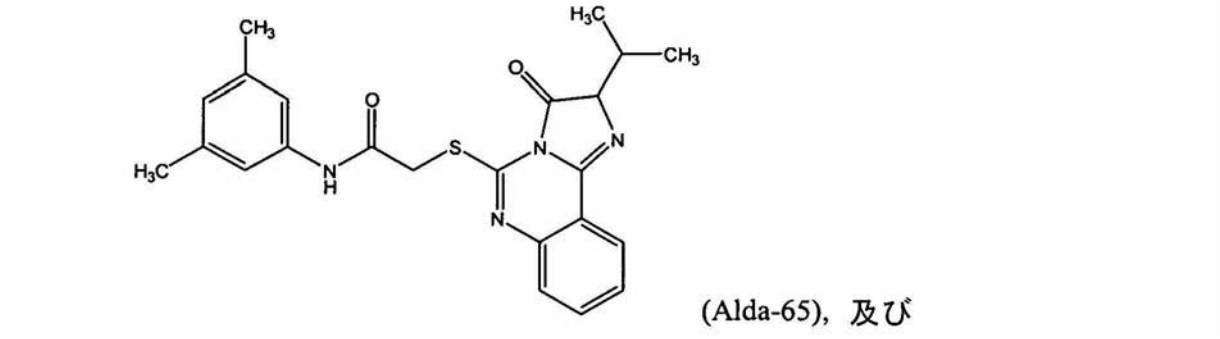


(Alda-61),



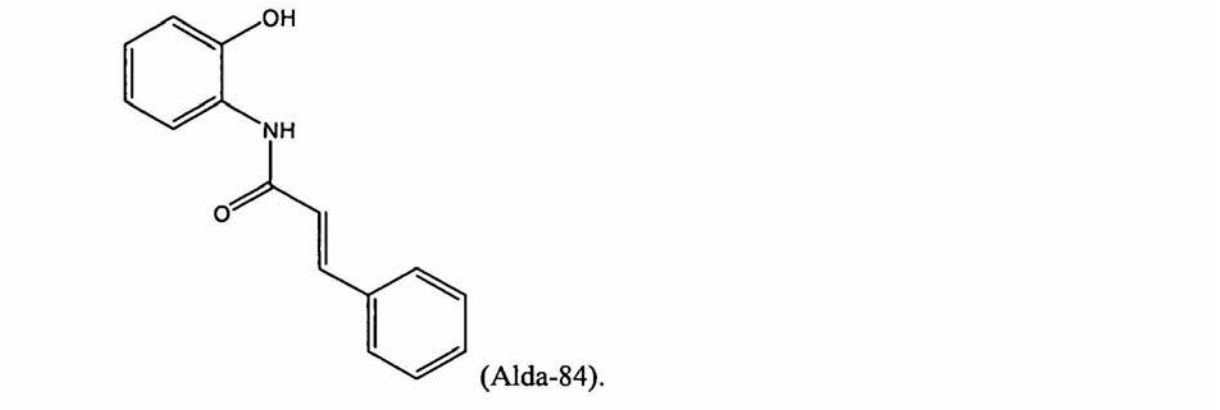
(Alda-60),

【化１３】



(Alda-65), 及び

【化１４】



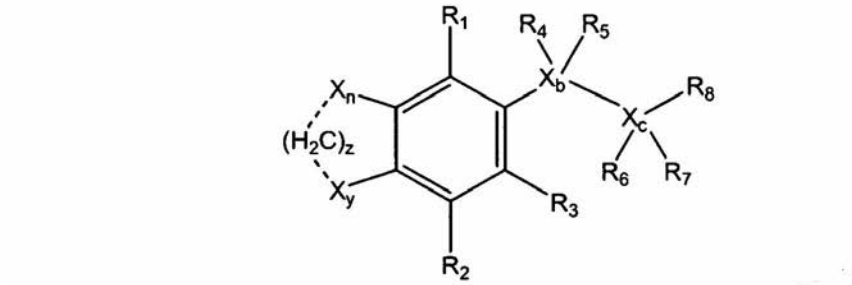
(Alda-84).

から選択される、請求項１に記載の化合物。

【請求項５】

式ＩＩ：

【化１５】



［式中、X_nおよびX_yはそれぞれ、独立して、Ｈ、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはハロゲンであり、ｎは、整数０または１であり、ｙは、整数０または１であり、

－－－（点線）は、任意選択の結合であり、ｚは、整数０、１、または２であり、

R_1～R_7はそれぞれ、Ｈ；ハロ（例えば、ブロモ、フルオロ、クロロ、ヨード）；置換または非置換のフェニル基；脂肪族基、アルキル基；置換アルキル基；アルケニル基；アルキニル基；置換または非置換の環状基；置換または非置換のヘテロ環基；置換または非置換のアリール基；および置換または非置換のヘテロアリール基から独立して選択され、

X_bは、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはＳであり、ｂは、整数０または１であり、

X_cは、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはＳであり、ｃは、整数０または１であり、

R_8は、置換または非置換のフェニル基；脂肪族基、アルキル基；置換アルキル基；アルケニル基；アルキニル基；置換または非置換の環状基；置換または非置換のヘテロ環基；置換または非置換のアリール基；置換または非置換のヘテロアリール基；置換または非置換の二環状基；置換または非置換のヘテロ二環状基；置換または非置換の多環状基；および置換または非置換のヘテロ多環状基から選択される］

で表される化合物、またはそのプロドラッグ、製薬上許容される塩、類似体、もしくは誘導体である化合物。

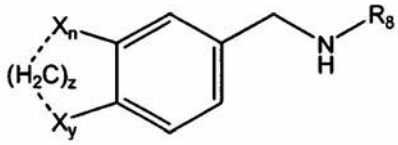
【請求項６】

R_8が、置換ピロリジン－２－オン基、置換ピロロ［２，３－ｄ］ピリミジン基、置換ピラゾロ［３，４－ｄ］ピリミジン基、置換ピラジン－２－オン基、または置換４，５，６，７－テトラヒドロ－テトラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン基である、請求項５に記載の化合物。

【請求項７】

式ＩＩａ：

【化１６】



［式中、X_nおよびX_yはそれぞれ、独立して、Ｈ、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはハロゲンであり、ｎは、整数０または１であり、ｙは、整数０または１であり、

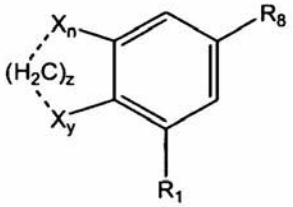
－－－（点線）は、任意選択の結合であり、

ｚは、整数０、１、または２であり、但し、１）Ｘ＝ハロゲンであり、－－－が結合ではないとき、ｚ＝０であり、２）ｚ＝０であるとき、Ｘ＝Ｏであり、－－－は結合ではなく、１個または複数の酸素原子（Ｘ）が存在し、酸素はメチル基と結合しており、

R_8は、置換アリール基、非置換アリール基、置換ヘテロアリール基、および非置換ヘテロアリール基から選択される］で表される化合物、そのプロドラッグ、製薬上許容される塩、類似体、及び誘導体；

式ＩＩｂ：

【化１７】



［式中、X_nおよびX_yはそれぞれ、独立して、Ｈ、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはハロゲンであり、ｎは、整数０または１であり、ｙは、整数０または１であり、

－－－（点線）は、任意選択の結合であり、

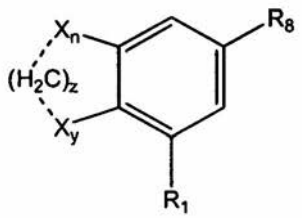
ｚは、整数０、１、または２であり、但し、１）Ｘ＝ハロゲンであり、－－－が結合ではないとき、ｚ＝０であり、２）ｚ＝０であるとき、Ｘ＝Ｏであり、－－－は結合ではなく、１個または複数の酸素原子（Ｘ）が存在し、酸素はメチル基と結合しており、

R_1は、Ｈ；ハロ（例えば、ブロモ、フルオロ、クロロ、ヨード）；脂肪族基、アルキル基；置換アルキル基；置換または非置換のアルケニル基；および置換または非置換のアルキニル基から選択され、

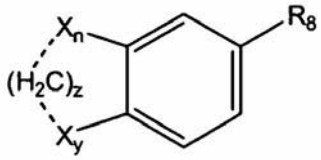
R_8は、置換環状基、非置換環状基、置換ヘテロ環基、および非置換ヘテロ環基から選択される］で表される化合物、そのプロドラッグ、製薬上許容される塩、類似体、及び誘導体；

式ＩＩｃ：

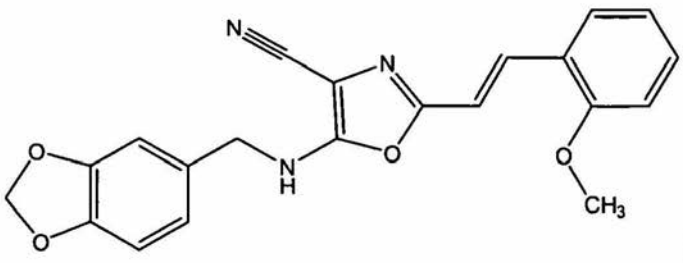
【化１８】



［式中、X_nおよびX_yはそれぞれ、独立して、Ｈ、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはハロゲンであり、ｎは、整数０または１であり、ｙは、整数０または１であり、
－－－（点線）は、任意選択の結合であり、
ｚは、整数０、１、または２であり、但し、１）Ｘ＝ハロゲンであり、－－－が結合ではないとき、ｚ＝０であり、２）ｚ＝０であるとき、Ｘ＝Ｏであり、－－－は結合ではなく、１個または複数の酸素原子（Ｘ）が存在し、酸素はメチル基と結合しており、
R_1は、Ｈ；ハロ；脂肪族基、アルキル基；置換アルキル基；置換または非置換のアルケニル基；および置換または非置換のアルキニル基から選択され、
R_8は、置換二環状基、非置換二環状基、置換ヘテロ二環状基、および非置換ヘテロ二環状基から選択される］で表される化合物、そのプロドラッグ、製薬上許容される塩、類似体、及び誘導体；
及び
式ＩＩｄ：
【化１９】

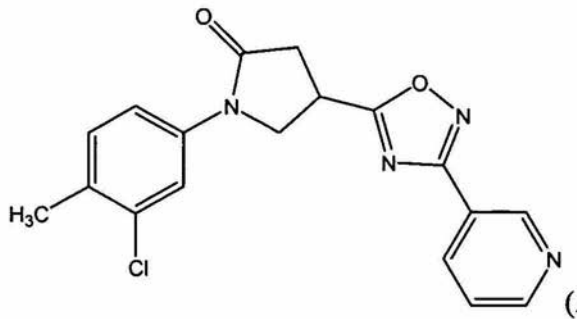


［式中、X_nおよびX_yはそれぞれ、独立して、Ｈ、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはハロゲンであり、ｎは、整数０または１であり、ｙは、整数０または１であり、
－－－（点線）は、任意選択の結合であり、
ｚは、整数０、１、または２であり、但し、１）Ｘ＝ハロゲンであり、－－－が結合ではないとき、ｚ＝０であり、２）ｚ＝０であるとき、Ｘ＝Ｏであり、－－－は結合ではなく、１個または複数の酸素原子（Ｘ）が存在し、酸素はメチル基と結合しており、
R_8は、置換アリール基、非置換アリール基、置換ヘテロアリール基、および非置換ヘテロアリール基から選択される］で表される化合物、そのプロドラッグ、製薬上許容される塩、類似体、及び誘導体
から選択され、任意に、
【化２０】

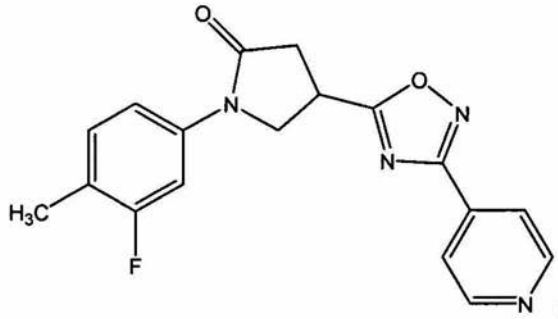


(Alda-58).

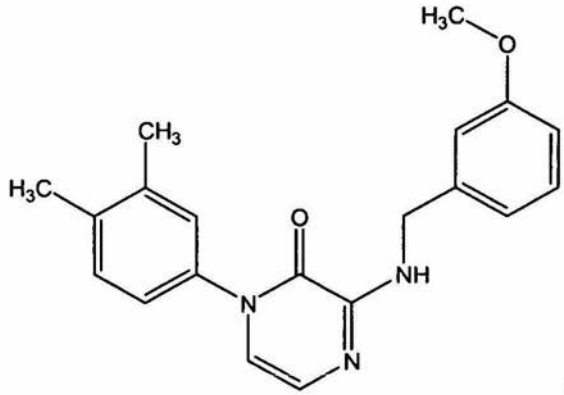
【化２１】



(Alda-69),

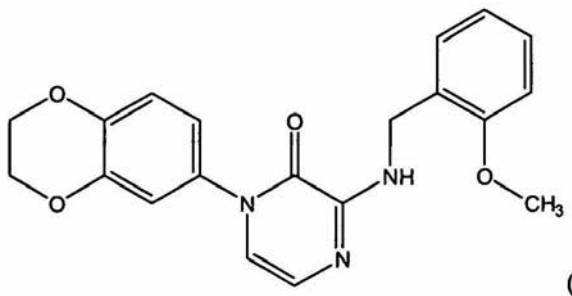


(Alda-70),



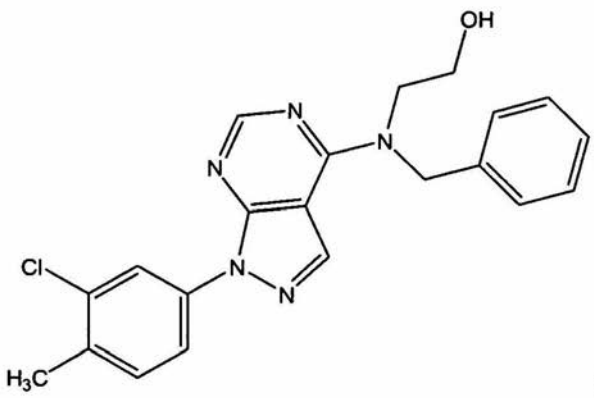
(Alda-62),

【化２２】



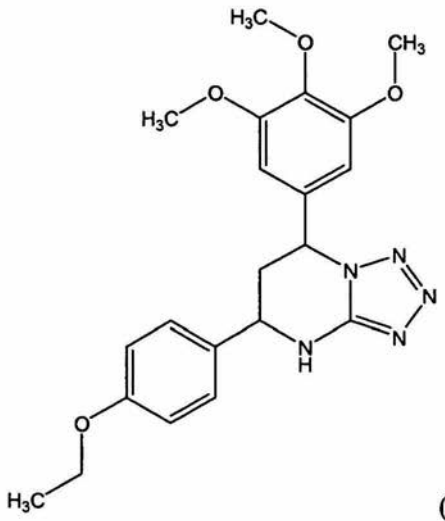
(Alda-63).

【化２３】

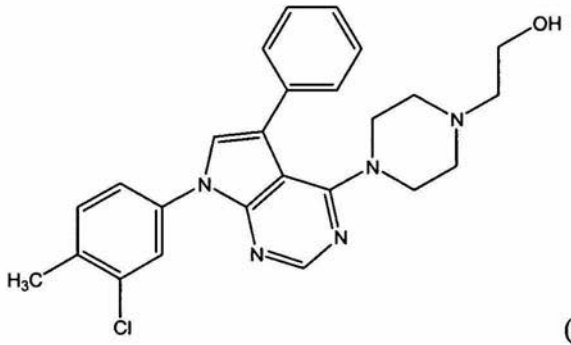


(Alda-67),

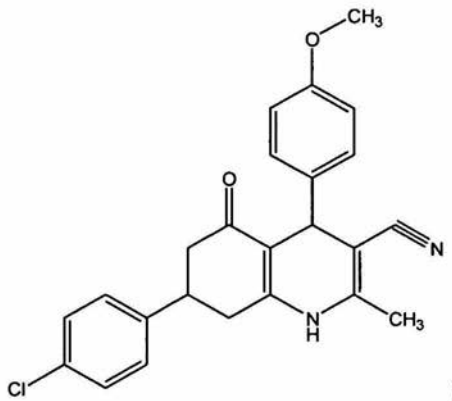
【化２４】



(Alda-68),

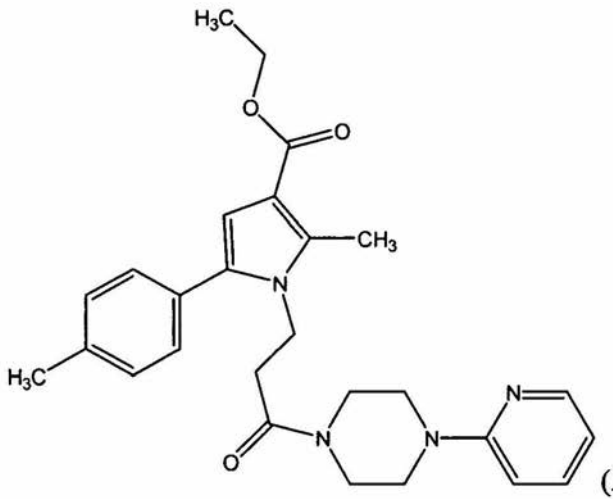


(Alda-73),

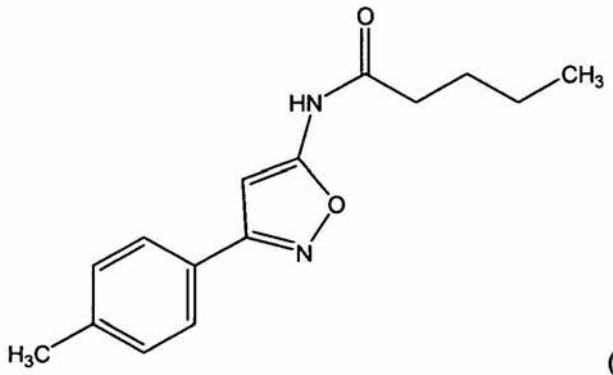


(Alda-83).

【化２５】



(Alda-56), 及び



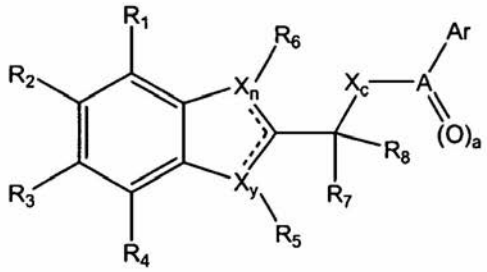
(Alda-57).

から選択される、請求項５に記載の化合物。

【請求項８】

式ＩＩＩ：

【化２６】



［式中、X_nおよびX_yはそれぞれ、独立して、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはＳであり、ｎは、整数０、１または２であり、ｙは、整数０、１または２であり、

－－－は、任意選択の二重結合であり、

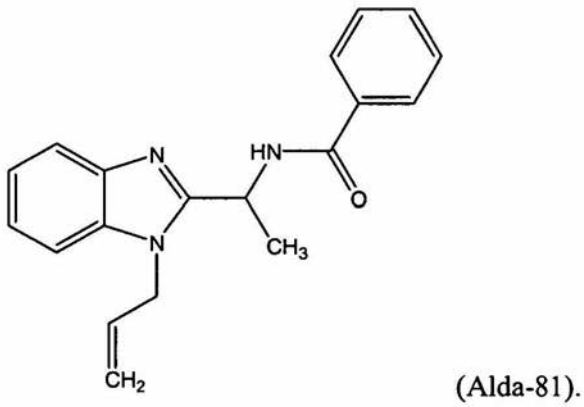
R_1、R_2、R_3、R_4、R_5、R_6、R_7およびR_8のそれぞれは、Ｈ；Ｃ；Ｎ；Ｏ；ハロ（例えば、ブロモ、フルオロ、クロロ、ヨード）；置換または非置換のフェニル基；脂肪族基、アルキル基；置換アルキル基；アルケニル基；アルキニル基；置換または非置換の環状基；置換または非置換のヘテロ環基；置換または非置換のアリール基；および置換または非置換のヘテロアリール基から独立して選択され、

Ａは、ＣまたはＳであり、Ａ＝Ｃであるとき、ａ＝１であり、Ａ＝Ｓであるとき、ａ＝２であり、

X_cは、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはＳであり、ｃは、整数０または１であり、

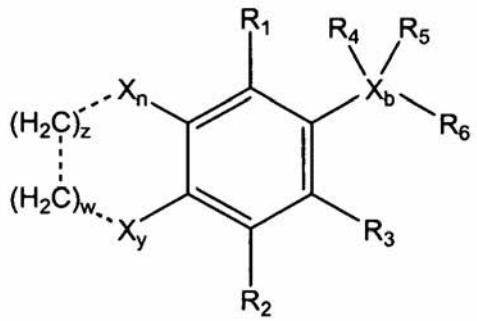
Ａｒは、置換または非置換のフェニル基；脂肪族基、アルキル基；置換アルキル基；アルケニル基；アルキニル基；置換または非置換の環状基；置換または非置換のヘテロ環基

；置換または非置換のアリール基；置換または非置換のヘテロアリール基；置換または非置換の二環状基；置換または非置換のヘテロ二環状基；置換または非置換の多環状基；および置換または非置換のヘテロ多環状基から選択される］
で表される化合物、またはそのプロドラッグ、製薬上許容される塩、類似体、もしくは誘導体である化合物。
【請求項９】
構造：
【化２７】



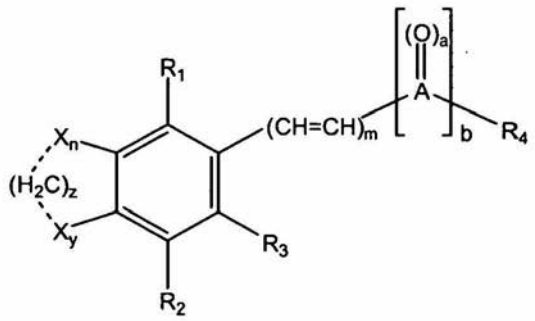
(Alda-81).

を有する、請求項８に記載の化合物。
【請求項１０】
式ＩＶ：
【化２８】



［式中、X_nおよびX_yはそれぞれ、独立して、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはＳであり、ｎは、整数０、１または２であり、ｙは、整数０、１または２であり、
－－－（点線）は、任意選択の結合であり、
ｚは、整数０または１であり、但し、１）Ｘ＝ハロゲンであり、－－－が結合ではないとき、ｚ＝０であり、２）ｚ＝０であるとき、Ｘ＝Ｏであり、－－－は結合ではなく、１個または複数の酸素原子（Ｘ）が存在し、酸素はメチル基と結合しており、
ｗは、整数０または１であり、但し、１）Ｘ＝ハロゲンであり、－－－が結合ではないとき、ｗ＝０であり、２）ｗ＝０であるとき、Ｘ＝Ｏであり、－－－は結合ではなく、１個または複数の酸素原子（Ｘ）が存在し、酸素はメチル基と結合しており、
R_1、R_2、R_3、R_4、およびR_5のそれぞれは、Ｈ；Ｃ；Ｎ；Ｏ；ハロ（例えば、ブロモ、フルオロ、クロロ、ヨード）；置換または非置換のアルコキシル基、置換または非置換のアミン基、置換または非置換のフェニル基；脂肪族基、アルキル基；置換アルキル基；アルケニル基；アルキニル基；置換または非置換の環状基；置換または非置換のヘテロ環基；置換または非置換のアリール基；および置換または非置換のヘテロアリール基から独立して選択され、
X_bは、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはＳであり、ｂは、整数０または１であり、
R_6は、置換または非置換のフェニル基；脂肪族基、アルキル基；置換アルキル基；ア

ルケニル基；アルキニル基；置換または非置換の環状基；置換または非置換のヘテロ環基；置換または非置換のアリール基；置換または非置換のヘテロアリール基；置換または非置換の二環状基；置換または非置換のヘテロ二環状基；置換または非置換の多環状基；および置換または非置換のヘテロ多環状基から選択される］
で表される化合物、またはそのプロドラッグ、製薬上許容される塩、類似体、もしくは誘導体である化合物。
【請求項１１】
式Ｖ：
【化２９】



［式中、X_nおよびX_yはそれぞれ、独立して、Ｃ、Ｎ、Ｏ、またはＳであり、ｎは、整数０、１または２であり、ｙは、整数０、１または２であり、
－－－（点線）は、任意選択の結合であり、
ｚは、整数０または１であり、但し、１）Ｘ＝ハロゲンであり、－－－が結合ではないとき、ｚ＝０であり、２）ｚ＝０であるとき、Ｘ＝Ｏであり、－－－は結合ではなく、１個または複数の酸素原子（Ｘ）が存在し、酸素はメチル基と結合しており、
R_1、R_2およびR_3のそれぞれは、Ｈ；Ｃ；Ｎ；Ｏ；ハロ（例えば、ブロモ、フルオロ、クロロ、ヨード）；置換または非置換のアルコキシル基、置換または非置換のアミン基、置換または非置換のフェニル基；脂肪族基、アルキル基；置換アルキル基；アルケニル基；アルキニル基；置換または非置換の環状基；置換または非置換のヘテロ環基；置換または非置換のアリール基；および置換または非置換のヘテロアリール基から独立して選択され、
ｍは、１～１０の整数であり、
Ａは、ＣまたはＳであり、Ａ＝Ｃであるとき、ａ＝１であり、Ａ＝Ｓであるとき、ａ＝２であり、
ｂは、整数０または１であり、
R_4は、ヒドロキシル基、置換または非置換のフェニル基；脂肪族基、アルキル基；置換アルキル基；アルケニル基；アルキニル基；置換または非置換の環状基；置換または非置換のヘテロ環基；置換または非置換のアリール基；置換または非置換のヘテロアリール基；置換または非置換の二環状基；置換または非置換のヘテロ二環状基；置換または非置換の多環状基；および置換または非置換のヘテロ多環状基から選択される］
で表される化合物、またはそのプロドラッグ、製薬上許容される塩、類似体、もしくは誘導体である化合物。
【請求項１２】
Ａｌｄａ－１０１、Ａｌｄａ－１０２、Ａｌｄａ－１０３、Ａｌｄａ－１０４ａ、Ａｌｄａ－１０４ｂ、Ａｌｄａ－１０５、Ａｌｄａ－１０６、Ａｌｄａ－１０８、Ａｌｄａ－１０９、Ａｌｄａ－１１０、Ａｌｄａ－１１１、またはＡｌｄａ－１１２である、請求項１１に記載の化合物。
【請求項１３】
請求項１から１２のいずれか一項に記載の化合物と、製薬上許容される添加剤とを含み、任意に、経口送達用に製剤される、皮膚への局所送達用に製剤される、眼への送達用に製剤される、全身送達用に製剤される、注射用に製剤される、経皮的送達用に製剤される、

連続的送達用に製剤される、移植可能なポンプによる送達用に製剤される、気道への送達用に製剤される、医薬組成物。
【請求項１４】
ｉ）アルデヒドが、生体アルデヒドまたは異種アルデヒドである場合に、個体において毒性レベルで存在するアルデヒドのレベルを毒性レベル未満に減少させる方法であって、
場合によっては、生体アルデヒドが、アセトアルデヒド、マロンジアルデヒド（ＭＤＡ）、３，４－ジヒドロキシフェイルアセトアルデヒド（ＤＯＰＡＬ）、３，４－ジヒドロキシフェニルグリコールアルデヒ（ＤＯＰＥＧＡＬ）、ヘキサナール、アクロレイン、グリオキサール、クロトンアルデヒド、ｔｒａｎｓ－２－ノネナール、４－オキソ－２－ノネナール、または４－ヒドロキシ－２－ノネナール（ＨＮＥ）である、及び／又は
異種アルデヒドが、摂取または吸入される環境アルデヒドである方法；
ｉｉ）アルコール不耐性、アルコール嗜癖、またはアルコール乱用障害を治療する方法；
ｉｉｉ）必要とする個体において急性または慢性のフリーラジカル関連疾患を治療する方法であって、場合によっては、急性のフリーラジカル関連疾患が、癲癇発作又は皮膚への光損傷である方法；
ｉｖ）個体において眼の障害を治療する方法であって、場合によっては、眼の障害が、加齢性白内障、続発性白内障、外傷性白内障、先天性白内障、加齢黄斑変性症、または放射線白内障である方法；
ｖ）個体において上皮細胞への放射線誘発損傷を治療する方法であって、放射線誘発損傷が、放射線皮膚炎をもたらす方法；
ｖｉ）個体が頭頸部癌を発生させる可能性を減少させる方法であって、個体が、噛みビンロウの習慣的使用者である方法；及び
ｖｉｉ）個体が口腔癌または肺癌を発生させる可能性を減少させる方法であって、場合によっては、組成物が経口的に投与される又は気道に投与される方法；
から選択される方法で使用するための、請求項１３に記載の組成物。
【請求項１５】
個体において上皮細胞への放射線誘発損傷を治療する方法で使用される場合、前記組成物が、個体の皮膚に又は個体の粘膜に局所的に投与される、請求項１４に記載の組成物。
【請求項１６】
個体において上皮細胞への放射線誘発損傷を治療する方法で使用される場合、前記組成物が、個体が電離放射線に曝露される前に投与される、個体が電離放射線に曝露された後に投与される、又は個体が電離放射線に曝露される前および後の両方で投与される、請求項１４に記載の組成物。
【請求項１７】
個体が口腔癌または肺癌を発生させる可能性を減少させる方法で使用される場合、前記組成物が、練り歯磨き、歯磨きジェル、歯磨き粉、口内リンス剤、チューインガム、またはロゼンジ剤である、請求項１４に記載の組成物。
【請求項１８】
ａ）請求項１３に記載の組成物と
ｂ）癌化学療法剤または電離放射線との有効量を組み合わせてなる、個体における癌の治療に使用するためのキット。
【請求項１９】
ａ）請求項１３に記載の組成物と、
ｂ）癌化学療法剤または電離放射線との有効量を組み合わせてなり、化学療法剤が、アルキル化剤、ニトロソ尿素、代謝拮抗剤、抗腫瘍抗生物質、植物（ビンカ）アルカロイド、またはステロイドホルモンである、請求項１８に記載のキット。
【請求項２０】
ａ）請求項１３に記載の組成物と、
ｂ）癌化学療法剤または電離放射線との有効量を組み合わせてなり、電離放射線が、外照射療法または近接照射療法によって投与される、請求項１８に記載のキット。

【請求項２１】
ＡＬＤＨ２のＥ４８７に対応するアミノ酸において少なくとも１つのＥ→Ｋの置換を含み、対応する野生型ＡＬＤＨポリペプチドの酵素活性の約７０％未満を示す、変異体アルデヒドデヒドロゲナーゼ（ＡＬＤＨ）ポリペプチド。