

【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9月17日(2009.9.17)

【公表番号】特表2009-508811(P2009-508811A)

【公表日】平成21年3月5日(2009.3.5)

【年通号数】公開・登録公報2009-009

【出願番号】特願2008-525273(P2008-525273)

【国際特許分類】

C 07 D 498/04 (2006.01)  
C 07 D 209/14 (2006.01)  
C 07 D 513/04 (2006.01)  
A 61 K 31/437 (2006.01)  
A 61 K 31/496 (2006.01)  
A 61 K 31/444 (2006.01)  
A 61 K 31/429 (2006.01)  
A 61 K 31/5377 (2006.01)  
A 61 K 31/498 (2006.01)  
C 07 D 401/04 (2006.01)  
C 07 D 405/14 (2006.01)  
C 07 D 413/14 (2006.01)  
C 07 D 413/04 (2006.01)  
A 61 K 31/551 (2006.01)  
A 61 K 31/4439 (2006.01)  
A 61 K 31/427 (2006.01)  
A 61 K 31/4184 (2006.01)  
C 07 D 235/18 (2006.01)  
C 07 D 471/04 (2006.01)  
A 61 K 31/4355 (2006.01)  
C 07 D 491/048 (2006.01)  
A 61 K 31/404 (2006.01)  
C 07 D 213/40 (2006.01)  
A 61 K 31/4418 (2006.01)  
A 61 K 31/381 (2006.01)  
C 07 D 215/12 (2006.01)  
A 61 K 31/47 (2006.01)  
C 07 D 487/04 (2006.01)  
A 61 K 31/519 (2006.01)  
C 07 D 333/20 (2006.01)  
A 61 P 3/02 (2006.01)  
A 61 P 3/04 (2006.01)  
A 61 P 3/06 (2006.01)  
A 61 P 3/10 (2006.01)  
A 61 P 7/00 (2006.01)  
A 61 P 7/02 (2006.01)  
A 61 P 7/04 (2006.01)  
A 61 P 7/06 (2006.01)  
A 61 P 9/00 (2006.01)  
A 61 P 9/06 (2006.01)  
A 61 P 9/08 (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 13/12 (2006.01)  
 A 6 1 P 15/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 17/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 13/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 13/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 19/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 21/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 21/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/08 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/14 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/16 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/28 (2006.01)  
 A 6 1 P 27/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 27/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 35/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 37/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 17/16 (2006.01)  
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)  
 C 0 7 C 237/40 (2006.01)  
 C 0 7 C 233/87 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4545 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4709 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/506 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/541 (2006.01)  
 C 0 7 D 307/22 (2006.01)  
 C 0 7 D 265/30 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/5383 (2006.01)  
 C 0 7 D 277/20 (2006.01)  
 C 0 7 D 277/30 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/426 (2006.01)  
 C 0 7 D 271/10 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4245 (2006.01)  
 C 0 7 D 263/58 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/423 (2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 D 498/04	1 0 5
C 0 7 D 209/14	C S P
C 0 7 D 513/04	3 4 3
A 6 1 K 31/437	
A 6 1 K 31/496	
A 6 1 K 31/444	
C 0 7 D 513/04	3 3 1
A 6 1 K 31/429	

A 6 1 K 31/5377  
A 6 1 K 31/498  
C 0 7 D 401/04  
C 0 7 D 405/14  
C 0 7 D 413/14  
C 0 7 D 413/04  
A 6 1 K 31/551  
A 6 1 K 31/4439  
A 6 1 K 31/427  
A 6 1 K 31/4184  
C 0 7 D 235/18  
C 0 7 D 471/04 1 0 7 K  
A 6 1 K 31/4355  
C 0 7 D 491/048  
A 6 1 K 31/404  
C 0 7 D 213/40  
A 6 1 K 31/4418  
A 6 1 K 31/381  
C 0 7 D 215/12  
A 6 1 K 31/47  
C 0 7 D 471/04 1 0 8 K  
C 0 7 D 487/04 1 4 4  
A 6 1 K 31/519  
C 0 7 D 333/20  
A 6 1 P 3/02  
A 6 1 P 3/04  
A 6 1 P 3/06  
A 6 1 P 3/10  
A 6 1 P 7/00  
A 6 1 P 7/02  
A 6 1 P 7/04  
A 6 1 P 7/06  
A 6 1 P 9/00  
A 6 1 P 9/06  
A 6 1 P 9/08  
A 6 1 P 9/10  
A 6 1 P 9/10 1 0 1  
A 6 1 P 9/10 1 0 3  
A 6 1 P 9/12  
A 6 1 P 11/00  
A 6 1 P 13/12  
A 6 1 P 15/06  
A 6 1 P 17/02  
A 6 1 P 13/02  
A 6 1 P 13/00  
A 6 1 P 19/02  
A 6 1 P 21/00  
A 6 1 P 21/04  
A 6 1 P 25/00  
A 6 1 P 25/02

A 6 1 P 25/08  
 A 6 1 P 25/14  
 A 6 1 P 25/16  
 A 6 1 P 25/28  
 A 6 1 P 27/02  
 A 6 1 P 27/06  
 A 6 1 P 25/02 1 0 1  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 35/04  
 A 6 1 P 37/06  
 A 6 1 P 17/16  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1  
 A 6 1 P 43/00 1 0 7  
 C 0 7 C 237/40  
 C 0 7 C 233/87  
 A 6 1 K 31/4545  
 A 6 1 K 31/4709  
 A 6 1 K 31/506  
 A 6 1 K 31/541  
 C 0 7 D 307/22  
 C 0 7 D 265/30  
 A 6 1 K 31/5383  
 C 0 7 D 277/30  
 A 6 1 K 31/426  
 C 0 7 D 271/10  
 A 6 1 K 31/4245  
 C 0 7 D 263/58  
 A 6 1 K 31/423

## 【手続補正書】

【提出日】平成21年8月3日(2009.8.3)

## 【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

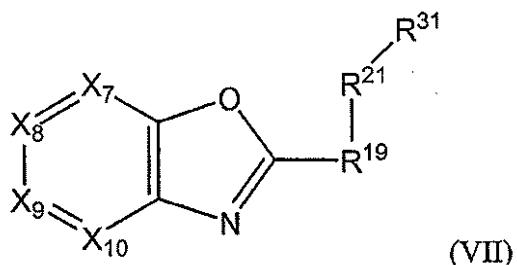
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式:

## 【数1】



の化合物、またはその塩であって、該式において、

$X_7$ 、 $X_8$ 、 $X_9$ および $X_{10}$ の各々は、N、CR<sup>2 0</sup>、またはCR<sub>1</sub>'から独立して選択され：

各R<sup>2 0</sup>は、Hまたは可溶化基から独立して選択され；

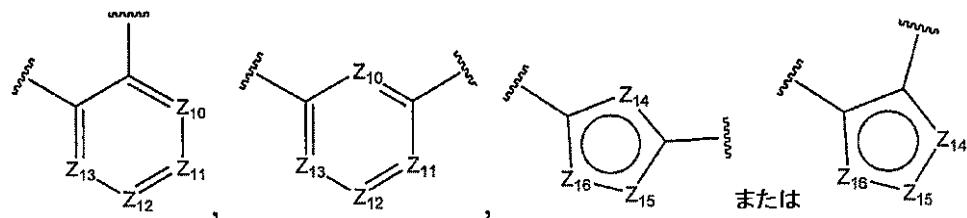
各R<sub>1</sub>'は、Hまたは必要に応じて置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから独立して選択され；

$X_7$ 、 $X_8$ 、 $X_9$ および $X_{10}$ のうちの1つはNであり、そして他のものはCR<sup>2 0</sup>またはCR<sub>1</sub>'から選択され；そして

0～1個のR<sup>2 0</sup>は可溶化基であり；

R<sup>1 9</sup>は：

【数2】



から選択され：

各Z<sub>10</sub>、Z<sub>11</sub>、Z<sub>12</sub>およびZ<sub>13</sub>は、N、CR<sup>2 0</sup>、またはCR<sub>1</sub>'から独立して選択され；そして

各Z<sub>14</sub>、Z<sub>15</sub>およびZ<sub>16</sub>は、N、NR<sub>1</sub>'、S、O、CR<sup>2 0</sup>、またはCR<sub>1</sub>'から独立して選択され：

Z<sub>10</sub>、Z<sub>11</sub>、Z<sub>12</sub>またはZ<sub>13</sub>のうちの0～2個は、Nであり；

Z<sub>14</sub>、Z<sub>15</sub>およびZ<sub>16</sub>のうちの少なくとも1個は、N、NR<sub>1</sub>'、SまたはOであり；

Z<sub>14</sub>、Z<sub>15</sub>およびZ<sub>16</sub>のうちの0～1個は、SまたはOであり；

Z<sub>14</sub>、Z<sub>15</sub>およびZ<sub>16</sub>のうちの0～2個は、NまたはNR<sub>1</sub>'であり；

0～1個のR<sup>2 0</sup>は可溶化基であり；

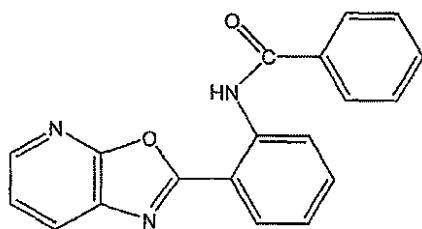
0～1個のR<sub>1</sub>'は、必要に応じて置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルであり；そして

R<sup>2 1</sup>は、-NR<sub>1</sub>'-C(O)-、-NR<sub>1</sub>'-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sub>1</sub>'-C(O)-NR<sub>1</sub>'-、-NR<sub>1</sub>'-C(S)-NR<sub>1</sub>'-、-NR<sub>1</sub>'-C(S)-NR<sub>1</sub>'-CR<sub>1</sub>'R<sub>1</sub>'-NR<sub>1</sub>'-、-NR<sub>1</sub>'-C(=NR<sub>1</sub>')-NR<sub>1</sub>'-、-C(O)-NR<sub>1</sub>'-、-C(O)-NR<sub>1</sub>'-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sub>1</sub>'-CR<sub>1</sub>'R<sub>1</sub>'-、-NR<sub>1</sub>'-C(O)-CR<sub>1</sub>'R<sub>1</sub>'-、-NR<sub>1</sub>'-S(O)<sub>2</sub>-NR<sub>1</sub>'-、-NR<sub>1</sub>'-C(O)-NR<sub>1</sub>'-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sub>1</sub>'-CR<sub>1</sub>'R<sub>1</sub>'-C(O)-NR<sub>1</sub>'-、-CR<sub>1</sub>'R<sub>1</sub>'-C(O)-NR<sub>1</sub>'-、-NR<sub>1</sub>'-C(O)-CR<sub>1</sub>'R<sub>1</sub>'=CR<sub>1</sub>'-CR<sub>1</sub>'R<sub>1</sub>'-、-NR<sub>1</sub>'-C(=N-CN)-NR<sub>1</sub>'-、-NR<sub>1</sub>'-C(O)-CR<sub>1</sub>'R<sub>1</sub>'-O-、-NR<sub>1</sub>'-S(O)<sub>2</sub>-CR<sub>1</sub>'R<sub>1</sub>'-、-NR<sub>1</sub>'-S(O)<sub>2</sub>-CR<sub>1</sub>'R<sub>1</sub>'-CR<sub>1</sub>'R<sub>1</sub>'-、-NR<sub>1</sub>'-C(O)-CR<sub>1</sub>'R<sub>1</sub>'-CR<sub>1</sub>'R<sub>1</sub>'-、-NR<sub>1</sub>'-C(S)-NR<sub>1</sub>'-CR<sub>1</sub>'R<sub>1</sub>'-CR<sub>1</sub>'R<sub>1</sub>'-、-NR<sub>1</sub>'-C(O)-CR<sub>1</sub>'R<sub>1</sub>'-CR<sub>1</sub>'R<sub>1</sub>'-、-NR<sub>1</sub>'-C(O)-O-または-NR<sub>1</sub>'-C(O)-CR<sub>1</sub>'R<sub>1</sub>'-から選択され；そして

R<sup>3 1</sup>は、必要に応じて置換された単環式アリールもしくは二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式ヘテロアリールもしくは二環式ヘテロアリールから選択され、ただし：

該化合物は：

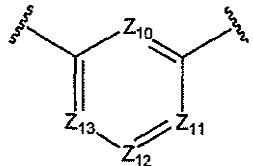
## 【数3】



ではなく；そして

$X_8$  および  $X_9$  が各々独立して  $CR^{2\ 0}$  または  $CR_1'$  から選択され、 $R^{1\ 9}$  が

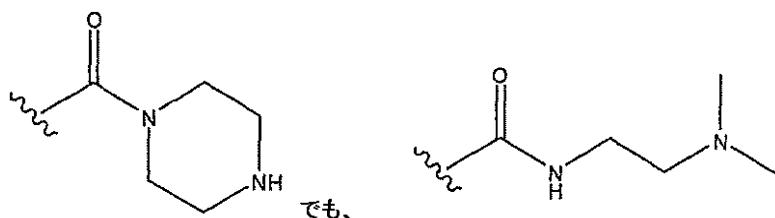
## 【数4】



であり、そして  $Z_{10}$ 、 $Z_{11}$ 、 $Z_{12}$  および  $Z_{13}$  の各々が  $CR^{2\ 0}$  、または  $CR_1'$  から独立して選択される場合：

- a)  $X_8$  および  $X_9$  のうちの少なくとも 1 個は、CH ではないか；または
- b)  $Z_{10}$ 、 $Z_{11}$ 、 $Z_{12}$  および  $Z_{13}$  のうちの少なくとも 1 個は、 $CR^{2\ 0}$  であり、ここで  $R^{2\ 0}$  は可溶化基であり、ただし、 $Z_{12}$  が  $CR^{2\ 0}$  でありかつ  $R^{2\ 0}$  が可溶化基である場合、該可溶化基は、 $-C(O)OC_2CH_3$  でも、 $-COOH$  でも、

## 【数5】



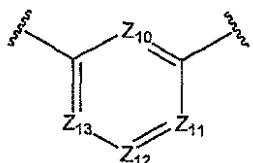
でもない、

化合物。

## 【請求項2】

$X_8$  および  $X_9$  が各々独立して  $CR^{2\ 0}$  または  $CR_1'$  から選択され、 $R^{1\ 9}$  が

## 【数6】



であり、そして  $Z_{10}$ 、 $Z_{11}$ 、 $Z_{12}$  および  $Z_{13}$  の各々が  $CR^{2\ 0}$  、または  $CR_1'$  から独立して選択される場合：

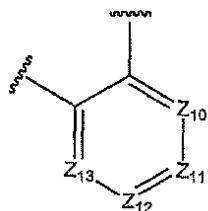
- a)  $X_8$  および  $X_9$  のうちの少なくとも 1 個は、CH ではないか；または
- b)  $Z_{10}$ 、 $Z_{11}$  および  $Z_{13}$  のうちの少なくとも 1 個は、 $CR^{2\ 0}$  であり、ここで  $R^{2\ 0}$  は可溶化基である、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

$R^{1\sim 9}$  が

【数 7】



であり、そして  $Z_{10}$ 、 $Z_{11}$ 、 $Z_{12}$  および  $Z_{13}$  の各々が  $CR^{2\sim 0}$  または  $CR_1'$  であり；  $X_8$  および  $X_9$  が  $CR^{2\sim 0}$  または  $CR_1'$  であり；  $R^{2\sim 1}$  が  $-NH-C(O)-$  であり； そして  $R^{3\sim 1}$  が必要に応じて置換されたフェニルである場合、 $R^{3\sim 1}$  は置換されたフェニルであるか、 $CR_1'$  部分における少なくとも 1 個の  $R_1'$  は、必要に応じて置換された  $C_1 \sim C_3$  の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルであるか、または  $CR^{2\sim 0}$  における少なくとも 1 個の  $R^{2\sim 0}$  は可溶化基であるか、あるいはこれらの組み合わせである、請求項 1 に記載の化合物。

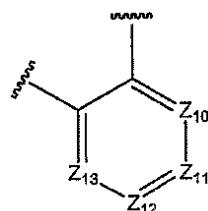
【請求項 4】

$R^{1\sim 9}$  が、フェニル、ピリジル、チエニルまたはフリルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

$R^{1\sim 9}$  が

【数 8】



であり、 $Z_{10}$ 、 $Z_{11}$ 、 $Z_{12}$  および  $Z_{13}$  の各々は、 $CR^{2\sim 0}$  または  $CR_1'$  から独立して選択され；そして

$R^{2\sim 1}$  が  $-NH-C(O)-$  であり；そして

$R^{3\sim 1}$  が置換されたフェニルである、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

$R^{3\sim 1}$  が、1 個～3 個の置換基で必要に応じて置換されており、該置換基は、 $-OCH_3$ 、 $-CH_3$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、ピラジンオキシまたは可溶化基から独立して選択される、請求項 5 に記載の化合物。

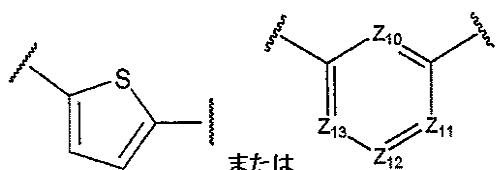
【請求項 7】

$R^{3\sim 1}$  が、3-メトキシ-4-((4-メチルピペラジン-1-イル)メチル)フェニル、3-メトキシ-4-モルホリノメチルフェニル、3-メトキシ-4-ジアミノメチルフェニル、3-メトキシ-4-((ピロリジン-1-イル)メチル)フェニル、3,4-ジメトキシフェニル、3,5-ジメトキシフェニル、2,3,4-トリメトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル、2-ジメチルアミノフェニル、3-ジメチルアミノフェニル、4-ジメチルアミノフェニル、または 3,5-ジメチルフェニルから選択される、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

$R^{1\sim 9}$  が

## 【数9】



から選択され：

$Z_{10}$ 、 $Z_{11}$ 、 $Z_{12}$ 、および $Z_{13}$ のうちの1つはNであり、そして他のものは、  
 $CR^{20}$ または $CR_1'$ から独立して選択され；

$R^{21}$ が、 $-NH-$ 、 $-NH-C(O)-$ 、 $-NH-C(O)-NH$ 、 $-NH-C(S)-NH$ 、 $-NH-S(O)_2-$ から選択され；そして

$R^{31}$ が、必要に応じて置換されたフェニル、必要に応じて置換されたナフチル、または必要に応じて置換されたヘテロアリールから選択され：

a)  $R^{21}$ が $-NH-S(O)_2-$ である場合：

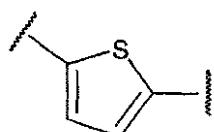
i)  $Z_{10}$ がNであるか；または

ii)  $Z_{11}$ がNであり、そして $R^{31}$ がハロフェニルもしくは2-メトキシ-5-メチルフェニルであるか；

のいずれかであり；

b)  $R^{31}$ が

## 【数10】



である場合、 $R^{31}$ は、4-ジメチルアミノフェニルでも、2,3,4-トリメトキシフェニルでも、3,5-ジメトキシフェニルでもなく；そして

c)  $R^{21}$ が $-NH-C(O)-NH$ であり、そして $Z_{10}$ がNである場合、 $R^{31}$ は4-ジメチルアミノフェニルではない、請求項1に記載の化合物。

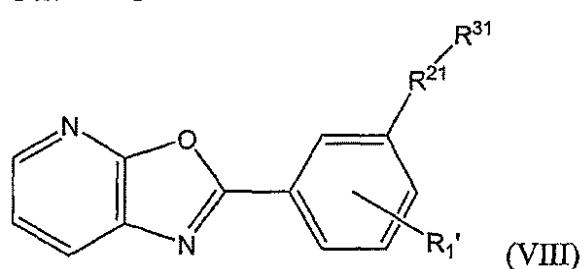
## 【請求項9】

$R^{31}$ が、必要に応じて置換されたフェニル、ベンゾチアゾリル、またはベンゾオキサゾリルから選択される、請求項8に記載の化合物。

## 【請求項10】

式：

## 【数11】



の化合物、またはその塩であって、該式において、

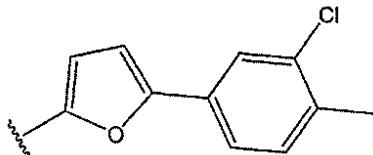
$R_1'$ は、Hまたは必要に応じて置換された $C_1 \sim C_3$ の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから選択され；

$R^{21}$ は、 $-NR_1'-C(O)-$ 、 $-NR_1'-S(O)_2-$ 、 $-NR_1'-C(O)-$

) - N R<sub>1</sub> ' - - N R<sub>1</sub> ' - C ( S ) - N R<sub>1</sub> ' - - N R<sub>1</sub> ' - C ( S ) - N R<sub>1</sub> ' - C R<sub>1</sub> ' R<sub>1</sub> ' - - N R<sub>1</sub> ' - C ( O ) - C R<sub>1</sub> ' R<sub>1</sub> ' - N R<sub>1</sub> ' - - N R<sub>1</sub> ' - C ( = N R<sub>1</sub> ') - N R<sub>1</sub> ' - - C ( O ) - N R<sub>1</sub> ' - - C ( O ) - N R<sub>1</sub> ' - S ( O )<sub>2</sub> - - N R<sub>1</sub> ' - - C R<sub>1</sub> ' R<sub>1</sub> ' - - N R<sub>1</sub> ' - C ( O ) - C R<sub>1</sub> ' = C R<sub>1</sub> ' - S ( O )<sub>2</sub> - - N R<sub>1</sub> ' - C R<sub>1</sub> ' R<sub>1</sub> ' - C ( O ) - N R<sub>1</sub> ' - - C R<sub>1</sub> ' R<sub>1</sub> ' - C ( O ) - N R<sub>1</sub> ' - - N R<sub>1</sub> ' - C ( O ) - C R<sub>1</sub> ' = C R<sub>1</sub> ' - C R<sub>1</sub> ' R<sub>1</sub> ' - - N R<sub>1</sub> ' - C ( = N - C N ) - N R<sub>1</sub> ' - - N R<sub>1</sub> ' - C ( O ) - C R<sub>1</sub> ' R<sub>1</sub> ' - O - - N R<sub>1</sub> ' - S ( O )<sub>2</sub> - C R<sub>1</sub> ' R<sub>1</sub> ' - - N R<sub>1</sub> ' - S ( O )<sub>2</sub> - C R<sub>1</sub> ' R<sub>1</sub> ' - C R<sub>1</sub> ' R<sub>1</sub> ' - - N R<sub>1</sub> ' - C ( O ) - C R<sub>1</sub> ' R<sub>1</sub> ' - C R<sub>1</sub> ' R<sub>1</sub> ' - - N R<sub>1</sub> ' - C ( S ) - N R<sub>1</sub> ' - C R<sub>1</sub> ' R<sub>1</sub> ' - C R<sub>1</sub> ' R<sub>1</sub> ' - - N R<sub>1</sub> ' - C ( O ) - O - または - N R<sub>1</sub> ' - C ( O ) - C R<sub>1</sub> ' R<sub>1</sub> ' - から選択され；そして

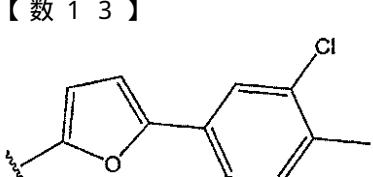
R<sup>3 1</sup> は、必要に応じて置換された単環式アリールもしくは二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式ヘテロアリールもしくは二環式ヘテロアリールから選択され、ただし：

R<sub>1</sub> ' がメチルであり、そして R<sup>2 1</sup> が - NH - C ( O ) - である場合、R<sup>3 1</sup> は、  
【数 1 2】



でも、1 - メトキシナフチル、2 - メトキシナフチルでも、非置換2 - チエニルでもなく；

R<sub>1</sub> ' がメチルであり、そして R<sup>2 1</sup> が - NH - C ( O ) - CH = CH - である場合、R<sup>3 1</sup> は、  
【数 1 3】



ではなく；

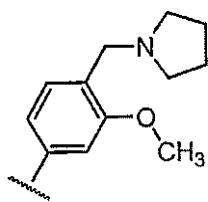
R<sub>1</sub> ' がメチルであり、そして R<sup>2 1</sup> が - NH - C ( O ) - CH - O - である場合、R<sup>3 1</sup> は、非置換ナフチルでも、2 - メトキシでも、4 - ニトロフェニルでも、4 - クロロ - 2 - メチルフェニルでも、4 - t - ブチルフェニルでもなく；そして

R<sup>2 1</sup> が - NH - C ( O ) - である場合、R<sup>3 1</sup> は、必要に応じて置換されたフェニルではない、化合物。

#### 【請求項 1 1】

R<sup>2 1</sup> が - NH - C ( O ) - であり、そして R<sup>3 1</sup> が、非置換フェニル、2 - メトキシフェニル、3 - メトキシフェニル、2 , 3 , 4 - トリメトキシフェニル、3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル、2 , 4 - ジメトキシフェニル、3 , 5 - ジメトキシフェニル、2 - メチル - 3 - メトキシフェニル、2 - モルホリノフェニル、2 - メトキシ - 4 - メチルフェニル、2 - ジメチルアミノフェニル、4 - ジメチルアミノフェニル、または

【数14】

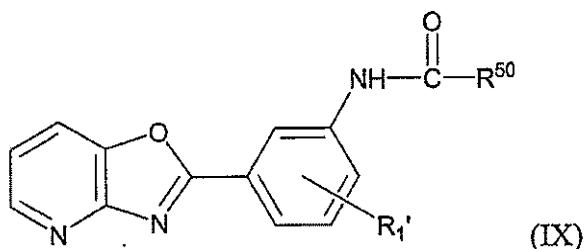


から選択される、請求項10に記載の化合物。

【請求項12】

式：

【数15】



(IX)

の化合物、またはその塩であって、該式において、

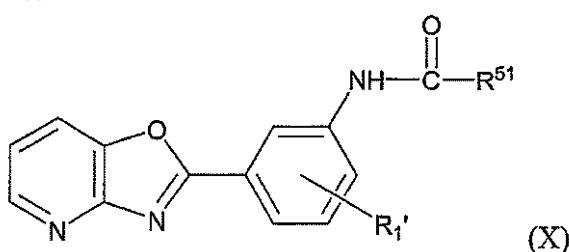
$R_1'$ は、Hまたは必要に応じて置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから選択され；そして

$R^{50}$ は、2,3-ジメトキシフェニル、フェノキシフェニル、2-メチル-3-メトキシフェニル、2-メトキシ-4-メチルフェニル、または1個～3個の置換基で置換されたフェニルから選択され、該置換基のうちの1つは、可溶化基であり；ただし、 $R^{50}$ は、可溶化基とニトロ基とで同時には置換されず、そして $R^{50}$ は、4-位のみで環状可溶化基で置換されず、そして2-位のみでモルホリノ基で置換されない、化合物。

【請求項13】

式：

【数16】



(X)

の化合物、またはその塩であって、該式において、

$R_1'$ は、Hまたは必要に応じて置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから選択され；そして

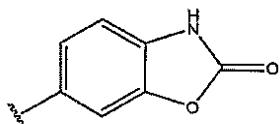
$R^{51}$ は、必要に応じて置換された单環式ヘテロアリール、必要に応じて置換された二環式ヘテロアリール、または必要に応じて置換されたナフチルから選択され、 $R^{51}$ は、クロロ-ベンゾ(b)チエニルでも、非置換ベンゾジオキソリルでも、非置換ベンゾフラニルでも、メチル-ベンゾフラニルでも、非置換フラニルでも、フェニルフリルでも、ブロモフリルでも、ニトロフリルでも、クロロフェニル-イソオキサゾリルでも、オキソベンゾピラニルでも、非置換ナフチルでも、メトキシナフチルでも、メチルナフチルでも、ハロナフチルでも、非置換チエニルでも、非置換ピリジニルでも、クロロピリジニルでも

ない、  
化合物。

## 【請求項 14】

$R^{5-1}$  が、ピラゾリル、チアゾリル、オキサゾリル、ピリミジニル、フリル、チエニル、ピリジル、イソオキサゾリル、インドリル、ベンゾピラゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、キノキサリニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、キノリニル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾトリアジニル、トリアジニル、ナフチル、または

## 【数 17】

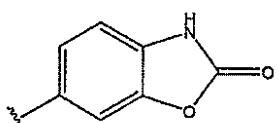


から選択され、そして  $R^{5-1}$  が必要に応じて置換されている、請求項 13 に記載の化合物。

## 【請求項 15】

$R^{5-1}$  が、ピラゾリル、チアゾリル、オキサゾリル、ピリミジニル、インドリル、ピラジニル、トリアジニル、または

## 【数 18】

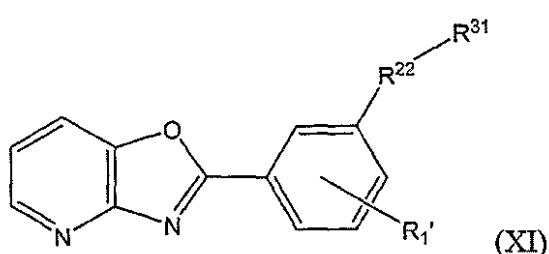


から選択され、そして  $R^{5-1}$  が必要に応じて置換されている、請求項 14 に記載の化合物。

## 【請求項 16】

式：

## 【数 19】



の化合物、またはその塩であって、該式において、

$R_1'$  は、H または必要に応じて置換された  $C_1 \sim C_3$  の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから選択され；

$R^{2-2}$  は、 $-NR^{2-3}-C(O)-$ 、 $-NR_1'-S(O)_2-$ 、 $-NR_1'-C(O)-$   
 $-NR_1'-$ 、 $-NR_1'-C(S)-NR_1'$ 、 $-NR_1'-C(S)-NR_1'$ 、  
 $-CR_1'R_1'$ 、 $-NR_1'-C(O)-CR_1'R_1'$ 、 $-NR_1'-NR_1'$ 、 $-NR_1'$ 、  
 $-C(=NR_1')-NR_1'$ 、 $-C(O)-NR_1'$ 、 $-C(O)-NR_1'-S$   
 $(O)_2-$ 、 $-NR_1'-CR_1'R_1'$ 、 $-NR_1'-C(O)-CR_1'$ 、 $=CR_1'R_1'$ 、  
 $-NR_1'-S(O)_2-NR_1'$ 、 $-NR_1'-C(O)-NR_1'$ 、 $-C(O)-NR_1'$ 、  
 $(O)_2-$ 、 $-NR_1'-CR_1'R_1'-C(O)-NR_1'$ 、 $-CR_1'R_1'-C(O)-$   
 $NR_1'$ 、 $-NR_1'-C(O)-CR_1'=CR_1'-CR_1'R_1'$ 、 $-$   
 $-NR_1'-C(=N-CN)-NR_1'$ 、 $-NR_1'-C(O)-CR_1'R_1'$ 、 $-O-$ 、  
 $-NR_1'-C(O)-CR_1'R_1'-CR_1'R_1'-O-$ 、 $-NR_1'-$

$S(O)_2 - CR_1' R_1' - - NR_1' - S(O)_2 - CR_1' R_1' - CR_1' R_1' - - NR_1' - C(S) - NR_1' - CR_1' R_1' - CR_1' R_1' - - NR_1' - C(O) - O -$  または  $- NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' -$  であり、 $R^{23}$  は必要に応じて置換された  $C_1 \sim C_3$  の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから選択され；そして

$R^{31}$  は、必要に応じて置換された単環式アリールもしくは二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式ヘテロアリールもしくは二環式ヘテロアリールから選択され、ただし：

$R^{22}$  が  $- NH - C(O) - CH = CH -$  である場合、 $R^{31}$  は、非置換フリルでも、5-(2-メチル-3-クロロフェニル)-フリルでも、2,4-ジクロロフェニルでも、3,5-ジクロロ-2-メトキシフェニルでも、3-ニトロフェニルでも、4-クロロフェニルでも、4-クロロ-3-ニトロフェニルでも、4-イソプロピルフェニルでも、4-メトキシフェニルでも、2-メトキシ-5-ブロモフェニルでも、非置換フェニルでもなく；

$R^{22}$  が  $- NH - C(O) - CH_2 -$  である場合、 $R^{31}$  は、3,4-ジメトキシフェニルでも、4-クロロフェニルでも、非置換フェニルでもなく；

$R^{22}$  が  $- NH - C(O) - CH_2 - O -$  である場合、 $R^{31}$  は、2,4-ジメチル-6-ニトロフェニルでも、2-ニトロフェニルでも、4-ニトロフェニルでも、4-シクロヘキシルフェニルでも、4-メトキシフェニルでも、非置換ナフチルでも、非置換フェニルでも、直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルもしくはハロから選択される置換基单独で一置換されたフェニルでも、二置換されたフェニルでも、三置換されたフェニルでもなく；

$R^{22}$  が  $- NH - C(O) - CH(CH_3) - O -$  である場合、 $R^{31}$  は、2,4-ジクロロフェニルでも、4-クロロフェニルでも、非置換フェニルでもなく；そして

$R^{22}$  が  $- NH - S(O)_2 -$  である場合、 $R^{31}$  は非置換フェニルではない、化合物。

#### 【請求項17】

$R^{22}$  が、 $- C(O) - NH -$ 、 $- NH -$  または  $- C(O) - NH - CH_3$  から選択される、請求項16に記載の化合物。

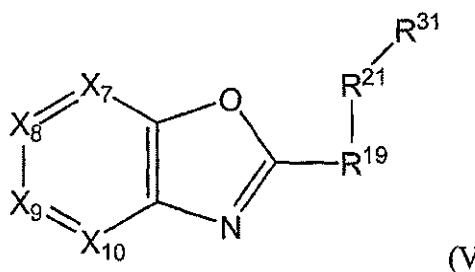
#### 【請求項18】

$R^{31}$  が、必要に応じて置換されたフェニル、ベンゾチアゾリル、キノキサリニル、またはベンゾオキサゾリルから選択される、請求項15に記載の化合物。

#### 【請求項19】

式：

#### 【数20】



の化合物、またはその塩を含有する組成物であって、該式において、

$X_7$ 、 $X_8$ 、 $X_9$  および  $X_{10}$  の各々は、 $N$ 、 $CR^{20}$ 、または  $CR_1'$  から独立して選択され：

各  $R^{20}$  は、 $H$  または可溶化基から独立して選択され；

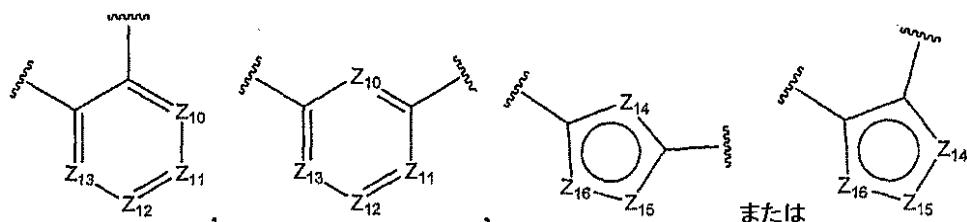
各  $R_1'$  は、 $H$  または必要に応じて置換された  $C_1 \sim C_3$  の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから独立して選択され；

$X_7$ 、 $X_8$ 、 $X_9$ および $X_{10}$ のうちの1つはNであり、そして他のものはCR<sup>2 0</sup>またはCR<sub>1'</sub>から選択され；そして

0~1個のR<sup>2 0</sup>は可溶化基であり；

R<sup>1 9</sup>は：

【数21】



から選択され：

各Z<sub>10</sub>、Z<sub>11</sub>、Z<sub>12</sub>およびZ<sub>13</sub>は、N、CR<sup>2 0</sup>、またはCR<sub>1'</sub>から独立して選択され；そして

各Z<sub>14</sub>、Z<sub>15</sub>およびZ<sub>16</sub>は、N、NR<sub>1'</sub>、S、O、CR<sup>2 0</sup>、またはCR<sub>1'</sub>から独立して選択され：

Z<sub>10</sub>、Z<sub>11</sub>、Z<sub>12</sub>またはZ<sub>13</sub>のうちの0~2個は、Nであり；

Z<sub>14</sub>、Z<sub>15</sub>およびZ<sub>16</sub>のうちの少なくとも1個は、N、NR<sub>1'</sub>、SまたはOであり；

Z<sub>14</sub>、Z<sub>15</sub>およびZ<sub>16</sub>のうちの0~1個は、SまたはOであり；

Z<sub>14</sub>、Z<sub>15</sub>およびZ<sub>16</sub>のうちの0~2個は、NまたはNR<sub>1'</sub>であり；

0~1個のR<sup>2 0</sup>は可溶化基であり；

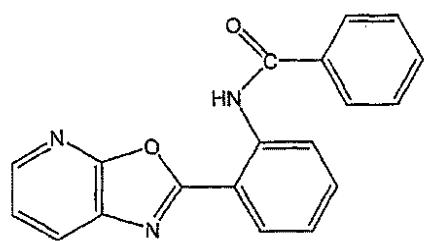
0~1個のR<sub>1'</sub>は、必要に応じて置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルであり；そして

R<sup>2 1</sup>は、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-、-NR<sub>1'</sub>-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-NR<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(S)-NR<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(S)-NR<sub>1'</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-NR<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(=NR<sub>1'</sub>)-NR<sub>1'</sub>-、-C(O)-NR<sub>1'</sub>-、-C(O)-NR<sub>1'</sub>-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-CR<sub>1'</sub>-NR<sub>1'</sub>-S(O)<sub>2</sub>-NR<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-CR<sub>1'</sub>-NR<sub>1'</sub>-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-C(O)-NR<sub>1'</sub>-、-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-C(O)-NR<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(=N-CN)-NR<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-CR<sub>1'</sub>-R<sub>1'</sub>-O-、-NR<sub>1'</sub>-S(O)<sub>2</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(S)-NR<sub>1'</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-O-または-NR<sub>1'</sub>-C(O)-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-から選択され；そして

R<sup>3 1</sup>は、必要に応じて置換された单環式アリールもしくは二環式アリール、または必要に応じて置換された单環式ヘテロアリールもしくは二環式ヘテロアリールから選択され

、ただし、該化合物は：

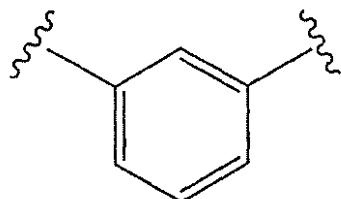
【数22】



ではなく、

 $R^{19}$  が

【数23】



であり、そして  $R^{21}$  が -NHCO- である場合、 $R^{31}$  は必要に応じて置換されたフェニルではなく、

該組成物が発熱性物質を含まない、

組成物。

【請求項20】

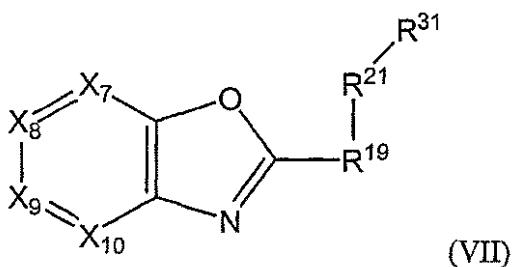
請求項1～18のいずれか1項に記載の化合物を含有する組成物であって、該組成物が発熱性物質を含まない、組成物。

【請求項21】

薬学的組成物であって：

a.式：

【数24】



の化合物、またはその塩であって、該式において、

$X_7$ 、 $X_8$ 、 $X_9$  および  $X_{10}$  の各々は、N、CR<sup>20</sup>、またはCR<sub>1'</sub>から独立して選択され：

各  $R^{20}$  は、H または可溶化基から独立して選択され；

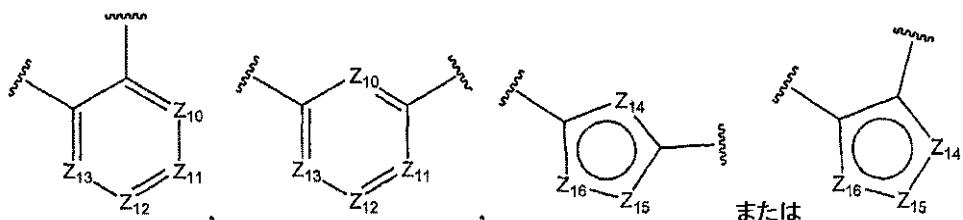
各  $R_{1'}$  は、H または必要に応じて置換された C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから独立して選択され；

$X_7$ 、 $X_8$ 、 $X_9$  および  $X_{10}$  のうちの 1 つは N であり、そして他のものは CR<sup>20</sup> または CR<sub>1'</sub> から選択され；そして

0～1個の  $R^{20}$  は可溶化基であり；

$R^{19}$  は：

## 【数25】



から選択され：

各  $Z_{10}$ 、 $Z_{11}$ 、 $Z_{12}$  および  $Z_{13}$  は、N、CR<sup>2 0</sup>、またはCR<sub>1'</sub>から独立して選択され；そして

各  $Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  は、N、NR<sub>1'</sub>、S、O、CR<sup>2 0</sup>、またはCR<sub>1'</sub>から独立して選択され：

$Z_{10}$ 、 $Z_{11}$ 、 $Z_{12}$  または  $Z_{13}$  のうちの0~2個は、Nであり；

$Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  のうちの少なくとも1個は、NR<sub>1'</sub>、SまたはOであり；

$Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  のうちの0~1個は、SまたはOであり；

$Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  のうちの0~2個は、NまたはNR<sub>1'</sub>であり；

0~1個のR<sup>2 0</sup>は可溶化基であり；

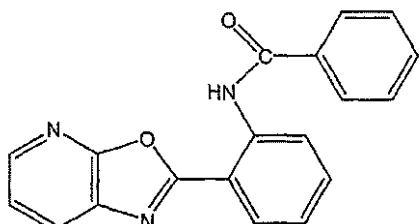
0~1個のR<sub>1'</sub>は、必要に応じて置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルであり；そして

R<sup>2 1</sup>は、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-、-NR<sub>1'</sub>-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-NR<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(S)-NR<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(S)-NR<sub>1'</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-NR<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(=NR<sub>1'</sub>)-NR<sub>1'</sub>-、-C(O)-NR<sub>1'</sub>-、-C(O)-NR<sub>1'</sub>-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(R<sub>1'</sub>)R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-CR<sub>1'</sub>=C(R<sub>1'</sub>)R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-S(O)<sub>2</sub>-NR<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-NR<sub>1'</sub>-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(R<sub>1'</sub>)R<sub>1'</sub>-C(O)-NR<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-CR<sub>1'</sub>=C(R<sub>1'</sub>)R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(=N-CN)-NR<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-O-、-NR<sub>1'</sub>-S(O)<sub>2</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-S(O)<sub>2</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(S)-NR<sub>1'</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-O-または-NR<sub>1'</sub>-C(O)-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-から選択され；そして

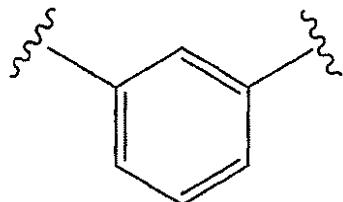
R<sup>3 1</sup>は、必要に応じて置換された単環式アリールもしくは二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式ヘテロアリールもしくは二環式ヘテロアリールから選択され、

ただし、該化合物は：

## 【数26】



ではなく、  
 $R^{19}$  が  
【数 27】



であり、そして  $R^{21}$  が -NHCO(=O)- である場合、 $R^{31}$  は、必要に応じて置換されたフェニルではない、

化合物；ならびに  
b. 薬学的に受容可能なキャリアまたは希釈剤、  
を含有する、薬学的組成物。

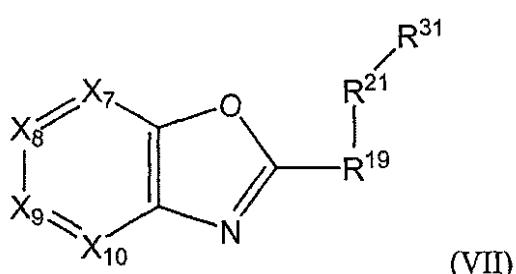
【請求項 22】

薬学的に受容可能なキャリアまたは希釈剤および請求項 1～18 のいずれか 1 項に記載の化合物を含有する、薬学的組成物。

【請求項 23】

インスリン抵抗性、メタボリック症候群、糖尿病、もしくはその合併症を処置もしくは予防するため、または被験体におけるインスリン感受性を増加させるための組成物であって、該組成物は、式：

【数 39】



の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩もしくはプロドラッグを含有し、該式において：

$X_7$ 、 $X_8$ 、 $X_9$  および  $X_{10}$  の各々は、N、CR<sup>20</sup>、または CR<sub>1'</sub> から独立して選択され：

各  $R^{20}$  は、H または可溶化基から独立して選択され；

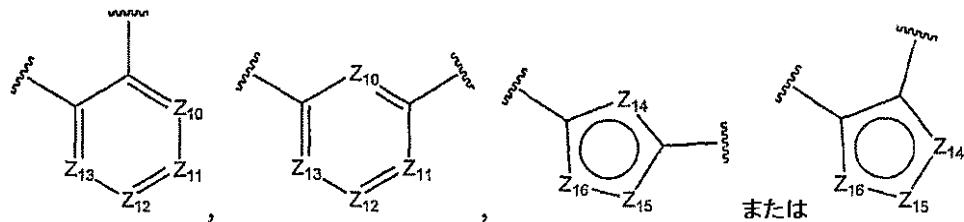
各  $R_{1'}$  は、H または必要に応じて置換された C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから独立して選択され；

$X_7$ 、 $X_8$ 、 $X_9$  および  $X_{10}$  のうちの 1 つは N であり、そして他のものは CR<sup>20</sup> または CR<sub>1'</sub> から選択され；そして

0～1 個の  $R^{20}$  は可溶化基であり；

$R^{19}$  は：

【数40】



または

から選択され：

各  $Z_{10}$ 、 $Z_{11}$ 、 $Z_{12}$  および  $Z_{13}$  は、N、CR<sup>2 0</sup>、またはCR<sub>1'</sub>から独立して選択され；そして

各  $Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  は、N、NR<sub>1'</sub>、S、O、CR<sup>2 0</sup>、またはCR<sub>1'</sub>から独立して選択され：

$Z_{10}$ 、 $Z_{11}$ 、 $Z_{12}$  または  $Z_{13}$  のうちの0~2個は、Nであり；

$Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  のうちの少なくとも1個は、NR<sub>1'</sub>、SまたはOであり；

$Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  のうちの0~1個は、SまたはOであり；

$Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  のうちの0~2個は、NまたはNR<sub>1'</sub>であり；

0~1個のR<sup>2 0</sup>は可溶化基であり；

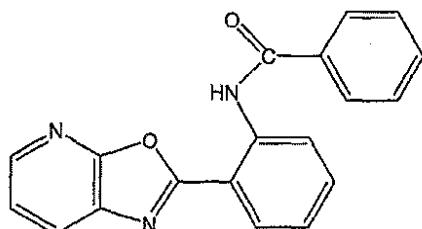
0~1個のR<sub>1'</sub>は、必要に応じて置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルであり；そして

R<sup>2 1</sup>は、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-、-NR<sub>1'</sub>-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-NR<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(S)-NR<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(S)-NR<sub>1'</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-NR<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(=NR<sub>1'</sub>)-NR<sub>1'</sub>-、-C(O)-NR<sub>1'</sub>-、-C(O)-NR<sub>1'</sub>-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(R<sub>1'</sub>)R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-CR<sub>1'</sub>=C(R<sub>1'</sub>)R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-S(O)<sub>2</sub>-NR<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-NR<sub>1'</sub>-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(R<sub>1'</sub>)R<sub>1'</sub>-C(O)-NR<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-CR<sub>1'</sub>=C(R<sub>1'</sub>)R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(=N-CN)-NR<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-C(R<sub>1'</sub>)R<sub>1'</sub>-O-、-NR<sub>1'</sub>-S(O)<sub>2</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-S(O)<sub>2</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(S)-NR<sub>1'</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-、-NR<sub>1'</sub>-C(O)-O-または-NR<sub>1'</sub>-C(O)-CR<sub>1'</sub>R<sub>1'</sub>-から選択され；そして

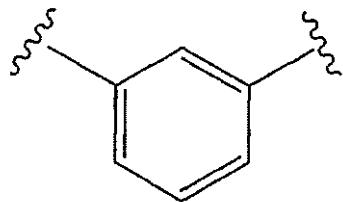
R<sup>3 1</sup>は、必要に応じて置換された単環式アリールもしくは二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式ヘテロアリールもしくは二環式ヘテロアリールから選択され、

ただし、該化合物は：

【数41】



ではなく、  
R<sup>1~9</sup> が  
【数42】



であり、そして R<sup>2~1</sup> が - N H C ( O ) - である場合、R<sup>3~1</sup> は、必要に応じて置換されたフェニルではない、  
組成物。