

【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 2 月 2 日 (2006.2.2)

【公表番号】特表 2002-508326 (P2002-508326A)

【公表日】平成 14 年 3 月 19 日 (2002.3.19)

【出願番号】特願 2000-538696 (P2000-538696)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/422 (2006.01)

A 6 1 K 31/4375 (2006.01)

A 6 1 K 31/4525 (2006.01)

A 6 1 K 31/4545 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 471/08 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/422

A 6 1 K 31/4375

A 6 1 K 31/4525

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 471/04 1 1 4 A

C 0 7 D 471/08

C 0 7 D 487/04 1 3 7

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 12 月 7 日 (2005.12.7)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

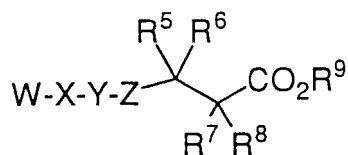
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 下記式の化合物および該化合物の医薬的に許容される塩。

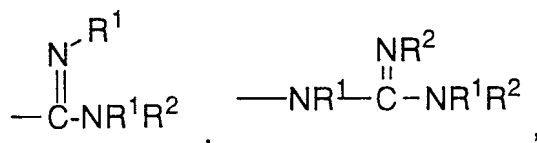
【化 1】



[式中、

W は

【化 2】



N、OおよびSからなる群から選択される0、1、2、3または4個のヘテロ原子を有する5員もしくは6員の単環式芳香環もしくは非芳香環系（該環において、環窒素原子は未置換であるかあるいは1個のR¹置換基で置換されており、環炭素原子は未置換であるかあるいは1個もしくは2個のR¹置換基で置換されている）、および

1以上の環が芳香族であり、N、OおよびSからなる群から選択される0、1、2、3または4個のヘテロ原子を有する9～14員が多環系（該多環系において、環窒素原子は未置換であるかあるいは1個のR¹置換基で置換されており、環炭素原子は未置換であるかあるいは1個もしくは2個のR¹置換基で置換されている）

から選択され；

Xは、-(CH₂)_v-(メチレン(CH₂)炭素原子は未置換であるかあるいは1個もしくは2個のR¹置換基で置換されている)；N、OおよびSからなる群から選択される0、1、2、3または4個のヘテロ原子を有する5員もしくは6員の単環式芳香環もしくは非芳香環系（該環において、環窒素原子は未置換であるかあるいは1個のR¹置換基で置換されており、環炭素原子は未置換であるかあるいは1個もしくは2個のR¹置換基で置換されている）からなる群から選択され；

Yは、

- (CH₂)_m - 、
- (CH₂)_m - O - (CH₂)_n - 、
- (CH₂)_m - NR⁴ - (CH₂)_n - 、
- (CH₂)_m - S - (CH₂)_n - 、
- (CH₂)_m - SO - (CH₂)_n - 、
- (CH₂)_m - SO₂ - (CH₂)_n - 、
- (CH₂)_m - O - (CH₂)_n - O - (CH₂)_p - 、
- (CH₂)_m - O - (CH₂)_n - NR⁴ - (CH₂)_p - 、
- (CH₂)_m - NR⁴ - (CH₂)_n - NR⁴ - (CH₂)_p - 、
- (CH₂)_m - O - (CH₂)_n - S - (CH₂)_p - 、

- (CH₂)_m - S - (CH₂)_n - S - (CH₂)_p - 、
 - (CH₂)_m - NR⁴ - (CH₂)_n - S - (CH₂)_p - 、
 - (CH₂)_m - NR⁴ - (CH₂)_n - O - (CH₂)_p - 、
 - (CH₂)_m - S - (CH₂)_n - O - (CH₂)_p - および
 - (CH₂)_m - S - (CH₂)_n - NR⁴ - (CH₂)_p -

からなる群から選択され；

YにおけるR⁴以外のメチレン(CH₂)炭素原子は1個もしくは2個のR³置換基によって置換されていても良く；

Zは、N、OおよびSからなる群から選択される0～6個のヘテロ原子を有する6～11員の芳香族もしくは非芳香族の単環式もしくは多環式の環系（該環系は、未置換であるか、1、2、3もしくは4個のオキソ置換基によって置換されており、未置換であるかR¹⁰、R¹¹、R¹²およびR¹³からなる群から独立に選択される1個以上の置換基によって置換されている）；ただし、Zはフェニルおよびピリジルではなく；

R¹およびR²はそれぞれ独立に、水素、ハロゲン、C₁₋₁₀アルキル、C₃₋₈シクロアルキル、C₃₋₈シクロヘテロアルキル、C₃₋₈シクロアルキルC₁₋₆アルキル、C₃₋₈シクロヘテロアルキルC₁₋₆アルキル、アリール、アリールC₁₋₈アルキル、アミノ、アミノC₁₋₈アルキル、C₁₋₃アシルアミノ、C₁₋₃アシルアミノC₁₋₈アルキル、(C₁₋₆アルキル)_pアミノ、(C₁₋₆アルキル)_pアミノC₁₋₈アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシC₁₋₆アルキル、ヒドロキシカルボニル、ヒドロキシカルボニルC₁₋₆アルキル、C₁₋₃アルコキシカルボニル、C₁₋₃アルコキシカルボニルC₁₋₆アルキル、ヒドロキシカルボニルC₁₋₆アルキルオキシ、水酸基、ヒドロキシC₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシC₁₋₆アルキル、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロエトキシ、C₁₋₈アルキル-S(O)_p-、(C₁₋₈アルキル)_pアミノカルボニル、C₁₋₈アルキルカルボニルアミノ、(C₁₋₈アルキル)_pアミノカルボニルオキシ、(アリールC₁₋₈アルキル)_pアミノ、(アリール)_pアミノ、アリールC₁₋₈アルキルスルホニルアミノおよびC₁₋₈アルキルスルホニルアミノからなる群から選択されるか；あるいは同一の炭素原子上にある場合に2個のR¹置換基が、それらが結合している炭素原子と一体となってカルボニル基を形成しており；

各R³は独立に、

水素、

アリール、

C₁₋₁₀アルキル、

アリール-(CH₂)_r-O-(CH₂)_s-、

アリール-(CH₂)_r-S(O)_p-(CH₂)_s-、

アリール-(CH₂)_r-C(O)-(CH₂)_s-、

アリール-(CH₂)_r-C(O)-N(R⁴)-(CH₂)_s-、

アリール-(CH₂)_r-N(R⁴)-C(O)-(CH₂)_s-、

アリール-(CH₂)_r-N(R⁴)-(CH₂)_s-、

ハロゲン、

水酸基、

オキソ、

トリフルオロメチル、

C₁₋₈アルキルカルボニルアミノ、

アリールC₁₋₅アルコキシ、

C₁₋₅アルコキシカルボニル、

(C₁₋₈アルキル)_pアミノカルボニル、

C₁₋₆アルキルカルボニルオキシ、

C₃₋₈シクロアルキル、

(C₁₋₆アルキル)_pアミノ、

アミノ C₁ - 6 アルキル、
 アリールアミノカルボニル、
 アリール C₁ - 5 アルキルアミノカルボニル、
 アミノカルボニル、
 アミノカルボニル C₁ - 6 アルキル、
 ヒドロキシカルボニル、
 ヒドロキシカルボニル C₁ - 6 アルキル、
 H C - C (C H₂)_t - 、
 C₁ - 6 アルキル - C - C (C H₂)_t - 、
 C₃ - 7 シクロアルキル - C - C - (C H₂)_t - 、
 アリール - C - C (C H₂)_t - 、
 C₁ - 6 アルキルアリール - C - C - (C H₂)_t - 、
 C H₂ = C H - (C H₂)_t - 、
 C₁ - 6 アルキル - C H = C H - (C H₂)_t - 、
 C₃ - 7 シクロアルキル - C H = C H - (C H₂)_t - 、
 アリール - C H = C H - (C H₂)_t - 、
 C₁ - 6 アルキルアリール - C H = C H - (C H₂)_t - 、
 C₁ - 6 アルキル - S O₂ - (C H₂)_t - 、
 C₁ - 6 アルキルアリール - S O₂ - (C H₂)_t - 、
 C₁ - 6 アルコキシ、
 アリール C₁ - 6 アルコキシ、
 アリール C₁ - 6 アルキル、
 (C₁ - 6 アルキル)_p アミノ C₁ - 6 アルキル、
 (アリール)_p アミノ、
 (アリール)_p アミノ C₁ - 6 アルキル、
 (アリール C₁ - 6 アルキル)_p アミノ、
 (アリール C₁ - 6 アルキル)_p アミノ C₁ - 6 アルキル、
 アリールカルボニルオキシ、
 アリール C₁ - 6 アルキルカルボニルオキシ、
 (C₁ - 6 アルキル)_p アミノカルボニルオキシ、
 C₁ - 8 アルキルスルホニルアミノ、
 アリールスルホニルアミノ、
 C₁ - 8 アルキルスルホニルアミノ C₁ - 6 アルキル、
 アリールスルホニルアミノ C₁ - 6 アルキル、
 アリール C₁ - 6 アルキルスルホニルアミノ、
 アリール C₁ - 6 アルキルスルホニルアミノ C₁ - 6 アルキル、
 C₁ - 8 アルコキシカルボニルアミノ、
 C₁ - 8 アルコキシカルボニルアミノ C₁ - 8 アルキル、
 アリールオキシカルボニルアミノ C₁ - 8 アルキル、
 アリール C₁ - 8 アルコキシカルボニルアミノ、
 アリール C₁ - 8 アルコキシカルボニルアミノ C₁ - 8 アルキル、
 C₁ - 8 アルキルカルボニルアミノ、
 C₁ - 8 アルキルカルボニルアミノ C₁ - 6 アルキル、
 アリールカルボニルアミノ C₁ - 6 アルキル、
 アリール C₁ - 6 アルキルカルボニルアミノ、
 アリール C₁ - 6 アルキルカルボニルアミノ C₁ - 6 アルキル、
 アミノカルボニルアミノ C₁ - 6 アルキル、
 (C₁ - 8 アルキル)_p アミノカルボニルアミノ、
 (C₁ - 8 アルキル)_p アミノカルボニルアミノ C₁ - 6 アルキル、
 (アリール)_p アミノカルボニルアミノ C₁ - 6 アルキル、

(アリアル C₁ - 8 アルキル)_p アミノカルボニルアミノ、
 (アリアル C₁ - 8 アルキル)_p アミノカルボニルアミノ C₁ - 6 アルキル、
 アミノスルホニルアミノ C₁ - 6 アルキル、
 (C₁ - 8 アルキル)_p アミノスルホニルアミノ、
 (C₁ - 8 アルキル)_p アミノスルホニルアミノ C₁ - 6 アルキル、
 (アリアル)_p アミノスルホニルアミノ C₁ - 6 アルキル、
 (アリアル C₁ - 8 アルキル)_p アミノスルホニルアミノ、
 (アリアル C₁ - 8 アルキル)_p アミノスルホニルアミノ C₁ - 6 アルキル、
 C₁ - 6 アルキルスルホニル、
 C₁ - 6 アルキルスルホニル C₁ - 6 アルキル、
 アリアルスルホニル C₁ - 6 アルキル、
 アリアル C₁ - 6 アルキルスルホニル、
 アリアル C₁ - 6 アルキルスルホニル C₁ - 6 アルキル、
 C₁ - 6 アルキルカルボニル、
 C₁ - 6 アルキルカルボニル C₁ - 6 アルキル、
 アリアルカルボニル C₁ - 6 アルキル、
 アリアル C₁ - 6 アルキルカルボニル、
 アリアル C₁ - 6 アルキルカルボニル C₁ - 6 アルキル、
 C₁ - 6 アルキルチオカルボニルアミノ、
 C₁ - 6 アルキルチオカルボニルアミノ C₁ - 6 アルキル、
 アリアルチオカルボニルアミノ C₁ - 6 アルキル、
 アリアル C₁ - 6 アルキルチオカルボニルアミノ、
 アリアル C₁ - 6 アルキルチオカルボニルアミノ C₁ - 6 アルキル、
 (C₁ - 8 アルキル)_p アミノカルボニル C₁ - 6 アルキル、
 (アリアル)_p アミノカルボニル C₁ - 6 アルキル、
 (アリアル C₁ - 8 アルキル)_p アミノカルボニルおよび
 (アリアル C₁ - 8 アルキル)_p アミノカルボニル C₁ - 6 アルキル

からなる群から選択されるか；あるいは同一の炭素原子上にある場合に 2 個の R³ 置換基が、それらが結合している炭素原子と一体となってカルボニル基またはシクロプロピル基を形成しており；

R³ におけるアルキル基は未置換であるかあるいは 1 ~ 3 個の R¹ 置換基によって置換されており；ただし、各 R³ の選択は、得られる化合物において、R³ が結合している 1 個もしくは複数の炭素原子自体が 1 個以下のヘテロ原子に結合するような形で行われ；

各 R⁴ は独立に、

水素、

アリアル、

アミノカルボニル、

C₃ - 8 シクロアルキル、

アミノ C₁ - 6 アルキル、

(アリアル)_p アミノカルボニル、

(アリアル C₁ - 5 アルキル)_p アミノカルボニル、

ヒドロキシカルボニル C₁ - 6 アルキル

C₁ - 8 アルキル、

アリアル C₁ - 6 アルキル、

(C₁ - 6 アルキル)_p アミノ C₂ - 6 アルキル、

(アリアル C₁ - 6 アルキル)_p アミノ C₂ - 6 アルキル、

C₁ - 8 アルキルスルホニル、

C₁ - 8 アルコキシカルボニル、

アリアルオキシカルボニル、

アリアル C₁ - 8 アルコキシカルボニル、

C_{1-8} アルキルカルボニル、
 アリールカルボニル、
 アリール C_{1-6} アルキルカルボニル、
 (C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニル、
 アミノスルホニル、
 C_{1-8} アルキルアミノスルホニル、
 (アリール)_p アミノスルホニル、
 (アリール C_{1-8} アルキル)_p アミノスルホニル、
 アリールスルホニル、
 アリール C_{1-6} アルキルスルホニル、
 C_{1-6} アルキルチオカルボニル、
 アリールチオカルボニルおよび
 アリール C_{1-6} アルキルチオカルボニル

からなる群から選択され；

R^4 におけるアルキル基は未置換であるかあるいは 1 ~ 3 個の R^1 置換基によって置換されており；

R^5 および R^6 はそれぞれ独立に、

水素、

C_{1-10} アルキル、

アリール、

アリール - $(CH_2)_r$ - O - $(CH_2)_s$ - 、

アリール - $(CH_2)_r$ - S(O)_p - $(CH_2)_s$ - 、

アリール - $(CH_2)_r$ - C(O) - $(CH_2)_s$ - 、

アリール - $(CH_2)_r$ - C(O) - N(R^4) - $(CH_2)_s$ - 、

アリール - $(CH_2)_r$ - N(R^4) - C(O) - $(CH_2)_s$ - 、

アリール - $(CH_2)_r$ - N(R^4) - $(CH_2)_s$ - 、

ハロゲン、

水酸基、

C_{1-8} アルキルカルボニルアミノ、

アリール C_{1-5} アルコキシ、

C_{1-5} アルコシカルボニル、

(C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニル、

C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ、

C_{3-8} シクロアルキル、

(C_{1-6} アルキル)_p アミノ、

アミノ C_{1-6} アルキル、

アリールアミノカルボニル、

アリール C_{1-5} アルキルアミノカルボニル、

アミノカルボニル、

アミノカルボニル C_{1-6} アルキル、

ヒドロキシカルボニル、

ヒドロキシカルボニル C_{1-6} アルキル、

H C - C(CH_2)_t - 、

C_{1-6} アルキル - C - C(CH_2)_t - 、

C_{3-7} シクロアルキル - C - C - (CH_2)_t - 、

アリール - C - C(CH_2)_t - 、

C_{1-6} アルキルアリール - C - C - (CH_2)_t - 、

$CH_2 = CH - (CH_2)_t - 、$

C_{1-6} アルキル - $CH = CH - (CH_2)_t - 、$

C_{3-7} シクロアルキル - $CH = CH - (CH_2)_t - 、$

アリール - $\text{CH} = \text{CH} - (\text{CH}_2)_t -$ 、
 C_{1-6} アルキルアリール - $\text{CH} = \text{CH} - (\text{CH}_2)_t -$ 、
 C_{1-6} アルキル - $\text{SO}_2 - (\text{CH}_2)_t -$ 、
 C_{1-6} アルキルアリール - $\text{SO}_2 - (\text{CH}_2)_t -$ 、
 C_{1-6} アルコキシ、
 アリール C_{1-6} アルコキシ、
 アリール C_{1-6} アルキル、
 (C_{1-6} アルキル)_p アミノ C_{1-6} アルキル、
 (アリール)_p アミノ、
 (アリール)_p アミノ C_{1-6} アルキル、
 (アリール C_{1-6} アルキル)_p アミノ、
 (アリール C_{1-6} アルキル)_p アミノ C_{1-6} アルキル、
 アリールカルボニルオキシ、
 アリール C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ、
 (C_{1-6} アルキル)_p アミノカルボニルオキシ、
 C_{1-8} アルキルスルホニルアミノ、
 アリールスルホニルアミノ、
 C_{1-8} アルキルスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリールスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリール C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ、
 アリール C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 C_{1-8} アルコキシカルボニルアミノ、
 C_{1-8} アルコキシカルボニルアミノ C_{1-8} アルキル、
 アリールオキシカルボニルアミノ C_{1-8} アルキル、
 アリール C_{1-8} アルコキシカルボニルアミノ、
 アリール C_{1-8} アルコキシカルボニルアミノ C_{1-8} アルキル、
 C_{1-8} アルキルカルボニルアミノ、
 C_{1-8} アルキルカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリールカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリール C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ、
 アリール C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アミノカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 (C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニルアミノ、
 (C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 (アリール)_p アミノカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 (アリール C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニルアミノ、
 (アリール C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アミノスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 (C_{1-8} アルキル)_p アミノスルホニルアミノ、
 (C_{1-8} アルキル)_p アミノスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 (アリール)_p アミノスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 (アリール C_{1-8} アルキル)_p アミノスルホニルアミノ、
 (アリール C_{1-8} アルキル)_p アミノスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 C_{1-6} アルキルスルホニル、
 C_{1-6} アルキルスルホニル C_{1-6} アルキル、
 アリールスルホニル C_{1-6} アルキル、
 アリール C_{1-6} アルキルスルホニル、
 アリール C_{1-6} アルキルスルホニル C_{1-6} アルキル、
 C_{1-6} アルキルカルボニル、
 C_{1-6} アルキルカルボニル C_{1-6} アルキル、

アリールカルボニル C_{1-6} アルキル、
 アリール C_{1-6} アルキルカルボニル、
 アリール C_{1-6} アルキルカルボニル C_{1-6} アルキル、
 C_{1-6} アルキルチオカルボニルアミノ、
 C_{1-6} アルキルチオカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリールチオカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリール C_{1-6} アルキルチオカルボニルアミノ、
 アリール C_{1-6} アルキルチオカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 (C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニル C_{1-6} アルキル、
 (アリール)_p アミノカルボニル C_{1-6} アルキル、
 (アリール C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニルおよび
 (アリール C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニル C_{1-6} アルキル

からなる群から選択されるか；あるいは R^5 と R^6 とが、それらが結合している炭素原子と一体となってカルボニル基を形成しており；

R^5 または R^6 におけるアルキル基は未置換であるかあるいは 1 ~ 3 個の R^1 置換基によって置換されており；ただし、 R^5 および R^6 それぞれの選択は、得られる化合物において、 R^5 および R^6 が結合している炭素原子自体が 1 個以下のヘテロ原子に結合するような形で行われ；

R^7 および R^8 はそれぞれ独立に、

水素、

C_{1-10} アルキル、

アリール、

アリール - $(CH_2)_r$ - O - $(CH_2)_s$ - 、

アリール - $(CH_2)_r$ - S(O)_p - $(CH_2)_s$ - 、

アリール - $(CH_2)_r$ - C(O) - $(CH_2)_s$ - 、

アリール - $(CH_2)_r$ - C(O) - N(R^4) - $(CH_2)_s$ - 、

アリール - $(CH_2)_r$ - N(R^4) - C(O) - $(CH_2)_s$ - 、

アリール - $(CH_2)_r$ - N(R^4) - $(CH_2)_s$ - 、

ハロゲン、

水酸基、

C_{1-8} アルキルカルボニルアミノ、

アリール C_{1-5} アルコキシ、

C_{1-5} アルコキシカルボニル、

(C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニル、

C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ、

C_{3-8} シクロアルキル、

(C_{1-6} アルキル)_p アミノ、

アミノ C_{1-6} アルキル、

アリールアミノカルボニル、

アリール C_{1-5} アルキルアミノカルボニル、

アミノカルボニル、

アミノカルボニル C_{1-6} アルキル、

ヒドロキシカルボニル、

ヒドロキシカルボニル C_{1-6} アルキル、

HC - C(CH_2)_t - 、

C_{1-6} アルキル - C - C(CH_2)_t - 、

C_{3-7} シクロアルキル - C - C - (CH_2)_t - 、

アリール - C - C(CH_2)_t - 、

C_{1-6} アルキルアリール - C - C - (CH_2)_t - 、

$CH_2 = CH - (CH_2)_t - 、$

C_{1-6} アルキル - $CH=CH-(CH_2)_t-$ 、
 C_{3-7} シクロアルキル - $CH=CH-(CH_2)_t-$ 、
 アリール - $CH=CH-(CH_2)_t-$ 、
 C_{1-6} アルキルアリール - $CH=CH-(CH_2)_t-$ 、
 C_{1-6} アルキル - $SO_2-(CH_2)_t-$ 、
 C_{1-6} アルキルアリール - $SO_2-(CH_2)_t-$ 、
 C_{1-6} アルコキシ、
 アリール C_{1-6} アルコキシ、
 アリール C_{1-6} アルキル、
 (C_{1-6} アルキル)_p アミノ C_{1-6} アルキル、
 (アリール)_p アミノ、
 (アリール)_p アミノ C_{1-6} アルキル、
 (アリール C_{1-6} アルキル)_p アミノ、
 (アリール C_{1-6} アルキル)_p アミノ C_{1-6} アルキル、
 アリールカルボニルオキシ、
 アリール C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ、
 (C_{1-6} アルキル)_p アミノカルボニルオキシ、
 C_{1-8} アルキルスルホニルアミノ、
 アリールカルボニルアミノ、
 アリールスルホニルアミノ、
 C_{1-8} アルキルスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリールスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリール C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ、
 アリール C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 C_{1-8} アルコキシカルボニルアミノ、
 C_{1-8} アルコキシカルボニルアミノ C_{1-8} アルキル、
 アリールオキシカルボニルアミノ C_{1-8} アルキル、
 アリール C_{1-8} アルコキシカルボニルアミノ、
 アリール C_{1-8} アルコキシカルボニルアミノ C_{1-8} アルキル、
 C_{1-8} アルキルカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリールカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリール C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ、
 アリール C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アミノカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリールアミノカルボニルアミノ、
 (C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニルアミノ、
 (C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 (アリール)_p アミノカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 (アリール C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニルアミノ、
 (アリール C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アミノスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 (C_{1-8} アルキル)_p アミノスルホニルアミノ、
 (C_{1-8} アルキル)_p アミノスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 (アリール)_p アミノスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 (アリール C_{1-8} アルキル)_p アミノスルホニルアミノ、
 (アリール C_{1-8} アルキル)_p アミノスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 C_{1-6} アルキルスルホニル、
 C_{1-6} アルキルスルホニル C_{1-6} アルキル、
 アリールスルホニル C_{1-6} アルキル、
 アリール C_{1-6} アルキルスルホニル、

アリール C_{1-6} アルキルスルホニル C_{1-6} アルキル、
 C_{1-6} アルキルカルボニル、
 C_{1-6} アルキルカルボニル C_{1-6} アルキル、
 アリールカルボニル C_{1-6} アルキル、
 アリール C_{1-6} アルキルカルボニル、
 アリール C_{1-6} アルキルカルボニル C_{1-6} アルキル、
 C_{1-6} アルキルチオカルボニルアミノ、
 C_{1-6} アルキルチオカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリールチオカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリール C_{1-6} アルキルチオカルボニルアミノ、
 アリール C_{1-6} アルキルチオカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 (C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニル C_{1-6} アルキル、
 (アリール)_p アミノカルボニル C_{1-6} アルキル、
 (アリール C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニル、
 (アリール C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニル C_{1-6} アルキルおよび
 C_{7-20} ポリシクリル C_{0-8} アルキルスルホニルアミノ

からなる群から選択され；

R^7 および R^8 におけるアルキル基は未置換であるかあるいは 1 ~ 3 個の R^1 置換基によって置換されており；ただし、 R^7 および R^8 それぞれの選択は、得られる化合物において、 R^7 および R^8 が結合している炭素原子自体が 1 個以下のヘテロ原子に結合するような形で行われ；

R^9 は、

水素、

C_{1-8} アルキル、

アリール、

アリール C_{1-8} アルキル

C_{1-8} アルキルカルボニルオキシ C_{1-4} アルキル、

アリール C_{1-8} アルキルカルボニルオキシ C_{1-4} アルキル、

C_{1-8} アルキルアミノカルボニルメチレンおよび

C_{1-8} ジアルキルアミノカルボニルメチレン

からなる群から選択され；

R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} および R^{13} はそれぞれ独立に、

水素、

C_{1-8} アルキル、

アリール、

ハロゲン、

水酸基、

オキソ、

アミノカルボニル、

C_{3-8} シクロアルキル、

アミノ C_{1-6} アルキル、

(アリール)_p アミノカルボニル、

ヒドロキシカルボニル、

(アリール C_{1-5} アルキル)_p アミノカルボニル、

ヒドロキシカルボニル C_{1-6} アルキル、

アリール C_{1-6} アルキル、

(C_{1-6} アルキル)_p アミノ C_{1-6} アルキル、

(アリール C_{1-6} アルキル)_p アミノ C_{2-6} アルキル、

C_{1-8} アルキルスルホニル、

C_{1-8} アルコキシカルボニル、

アリールオキシカルボニル、
 アリール C_{1-8} アルコキシカルボニル、
 C_{1-8} アルキルカルボニル、
 アリールカルボニル、
 アリール C_{1-6} アルキルカルボニル、
 (C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニル、
 アミノスルホニル、
 C_{1-8} アルキルアミノスルホニル、
 (アリール)_p アミノスルホニル、
 (アリール C_{1-8} アルキル)_p アミノスルホニル、
 C_{1-6} アルキルスルホニル、
 アリールスルホニル、
 アリール C_{1-6} アルキルスルホニル、
 アリール C_{1-6} アルキルカルボニル、
 C_{1-6} アルキルチオカルボニル、
 アリールチオカルボニル、
 アリール C_{1-6} アルキルチオカルボニル、
 アリール - (CH_2)_r - O - (CH_2)_s - 、
 アリール - (CH_2)_r - S(O)_p - (CH_2)_s - 、
 アリール - (CH_2)_r - C(O) - (CH_2)_s - 、
 アリール - (CH_2)_r - C(O) - N(R⁴) - (CH_2)_s - 、
 アリール - (CH_2)_r - N(R⁴) - C(O) - (CH_2)_s - 、
 アリール - (CH_2)_r - N(R⁴) - (CH_2)_s - 、
 HC - C(CH_2)_t - 、
 C_{1-6} アルキル - C - C(CH_2)_t - 、
 C_{3-7} シクロアルキル - C - C - (CH_2)_t - 、
 アリール - C - C(CH_2)_t - 、
 C_{1-6} アルキルアリール - C - C - (CH_2)_t - 、
 $CH_2 = CH - (CH_2)_t -$ 、
 C_{1-6} アルキル - $CH = CH - (CH_2)_t -$ 、
 C_{3-7} シクロアルキル - $CH = CH - (CH_2)_t -$ 、
 アリール - $CH = CH - (CH_2)_t -$ 、
 C_{1-6} アルキルアリール - $CH = CH - (CH_2)_t -$ 、
 C_{1-6} アルキル - SO₂ - (CH_2)_t - 、
 C_{1-6} アルキルアリール - SO₂ - (CH_2)_t - 、
 C_{1-8} アルキルカルボニルアミノ、
 アリール C_{1-5} アルコキシ、
 C_{1-5} アルコキシカルボニル、
 (C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニル、
 C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ、
 (C_{1-6} アルキル)_p アミノ、
 アミノカルボニル C_{1-6} アルキル、
 C_{1-6} アルコキシ、
 アリール C_{1-6} アルコキシ、
 (アリール)_p アミノ、
 (アリール)_p アミノ C_{1-6} アルキル、
 (アリール C_{1-6} アルキル)_p アミノ、
 (アリール C_{1-6} アルキル)_p アミノ C_{1-6} アルキル、
 アリールカルボニルオキシ、
 アリール C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ、

$(C_{1-6} \text{ アルキル})_p$ アミノカルボニルオキシ、
 C_{1-8} アルキルスルホニルアミノ、
 アリールスルホニルアミノ、
 C_{1-8} アルキルスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリールスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリール C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ、
 アリール C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 C_{1-8} アルコキシカルボニルアミノ、
 C_{1-8} アルコキシカルボニルアミノ C_{1-8} アルキル、
 アリールオキシカルボニルアミノ C_{1-8} アルキル、
 アリール C_{1-8} アルコキシカルボニルアミノ、
 アリール C_{1-8} アルコキシカルボニルアミノ C_{1-8} アルキル、
 C_{1-8} アルキルカルボニルアミノ、
 C_{1-8} アルキルカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリールカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリール C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ、
 アリール C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アミノカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 $(C_{1-8} \text{ アルキル})_p$ アミノカルボニルアミノ、
 $(C_{1-8} \text{ アルキル})_p$ アミノカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 $(\text{アリール})_p$ アミノカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 $(\text{アリール } C_{1-8} \text{ アルキル})_p$ アミノカルボニルアミノ、
 $(\text{アリール } C_{1-8} \text{ アルキル})_p$ アミノカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アミノスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 $(C_{1-8} \text{ アルキル})_p$ アミノスルホニルアミノ、
 $(C_{1-8} \text{ アルキル})_p$ アミノスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 $(\text{アリール})_p$ アミノスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 $(\text{アリール } C_{1-8} \text{ アルキル})_p$ アミノスルホニルアミノ、
 $(\text{アリール } C_{1-8} \text{ アルキル})_p$ アミノスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 C_{1-6} アルキルスルホニル、
 C_{1-6} アルキルスルホニル C_{1-6} アルキル、
 アリールスルホニル C_{1-6} アルキル、
 アリール C_{1-6} アルキルスルホニル、
 アリール C_{1-6} アルキルスルホニル C_{1-6} アルキル、
 C_{1-6} アルキルカルボニル、
 C_{1-6} アルキルカルボニル C_{1-6} アルキル、
 アリールカルボニル C_{1-6} アルキル、
 アリール C_{1-6} アルキルカルボニル、
 アリール C_{1-6} アルキルカルボニル C_{1-6} アルキル、
 C_{1-6} アルキルチオカルボニルアミノ、
 C_{1-6} アルキルチオカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリールチオカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 アリール C_{1-6} アルキルチオカルボニルアミノ、
 アリール C_{1-6} アルキルチオカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、
 $(C_{1-8} \text{ アルキル})_p$ アミノカルボニル C_{1-6} アルキル、
 $(\text{アリール})_p$ アミノカルボニル C_{1-6} アルキル、
 $(\text{アリール } C_{1-8} \text{ アルキル})_p$ アミノカルボニルおよび
 $(\text{アリール } C_{1-8} \text{ アルキル})_p$ アミノカルボニル C_{1-6} アルキル
 からなる群から選択され；
 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} および R^{13} におけるアルキル基は未置換であるかあるいは 1

～ 3 個の R^1 置換基によって置換されており；

各 m は独立に 0 ～ 6 の整数であり；

各 n は独立に 0 ～ 6 の整数であり；

各 p は独立に 0 ～ 2 の整数であり；

各 r は独立に 1 ～ 3 の整数であり；

各 s は独立に 0 ～ 3 の整数であり；

各 t は 0 ～ 3 の整数であり；

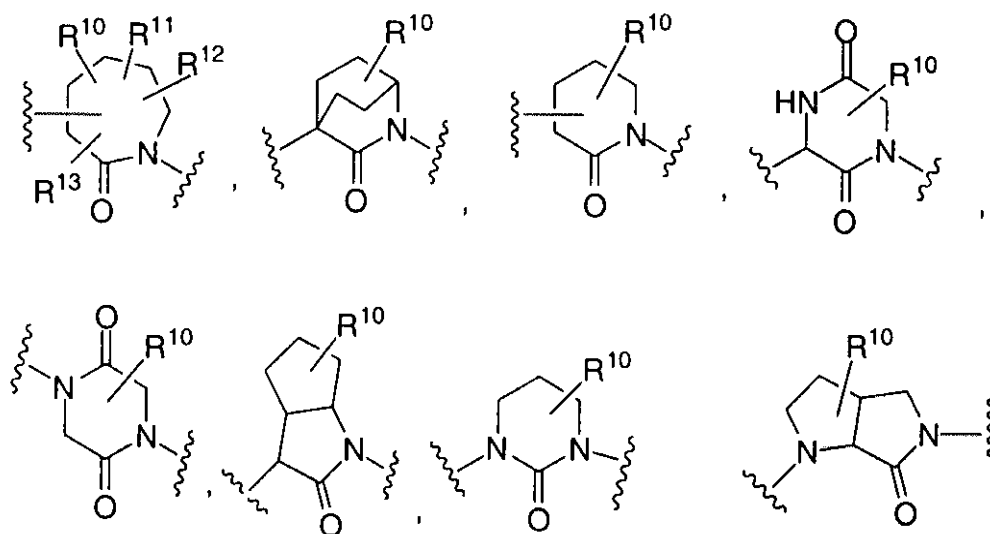
v は独立に 0 ～ 6 の整数である。]

【請求項 2】 W が、1 個もしくは 2 個の窒素原子を有する 6 員の単環式芳香環（該環において各炭素原子は未置換であるかあるいは 1 個の R^1 置換基で置換されている）、あるいは 1 以上の環が芳香族であり、N、O および S からなる群から選択される 0、1、2、3 または 4 個のヘテロ原子を有する 9 ～ 14 員の多環系（該多環系において、環窒素原子は未置換であるかあるいは 1 個の R^1 置換基で置換されており、環炭素原子は未置換であるかあるいは 1 個もしくは 2 個の R^1 置換基で置換されている）であり；

X が $-(CH_2)_v-$ であり、該基においてメチレン (CH_2) 炭素原子は未置換であるかあるいは 1 個もしくは 2 個の R^1 置換基で置換されており；

Z が

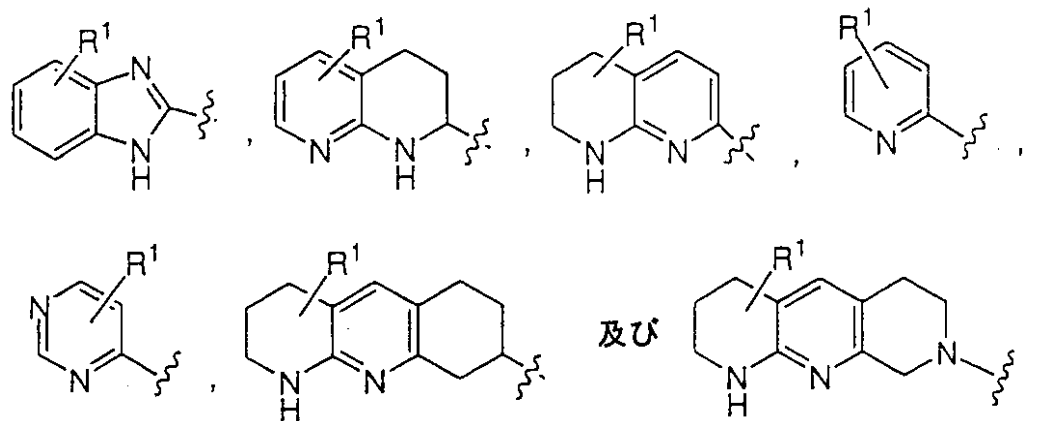
【化 3】



からなる群から選択される請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】 W が

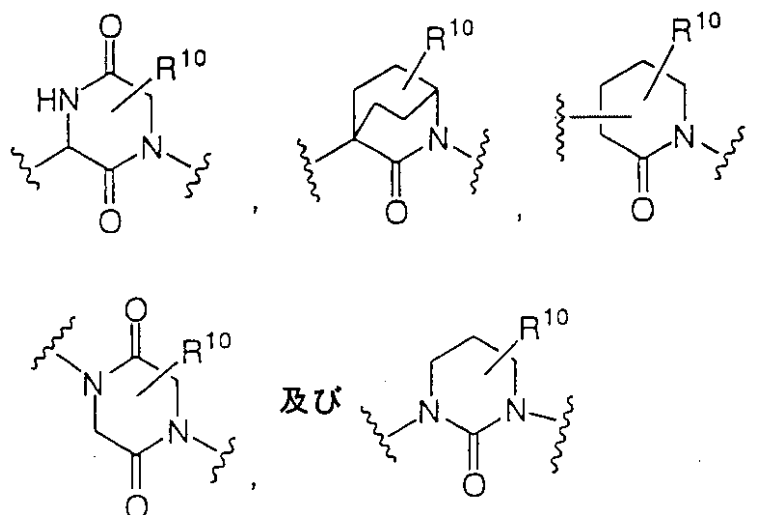
【化 4】



からなる群から選択され；

Z が

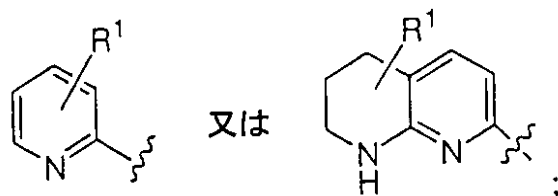
【化 5】



からなる群から選択される請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】 W が

【化 6】



であり；

X が $-(CH_2)_v-$ であり、該基においてメチレン (CH_2) 炭素原子は未置換であるかあるいは 1 個もしくは 2 個の R^1 置換基で置換されており；

Y が、

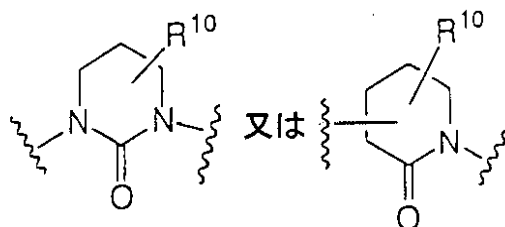
- $(CH_2)_m-$ 、
- $(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$ 、
- $(CH_2)_m-NR^4-(CH_2)_n-$ 、
- $(CH_2)_m-S-(CH_2)_n-$ 、
- $(CH_2)_m-SO-(CH_2)_n-$ 、
- $(CH_2)_m-SO_2-(CH_2)_n-$ 、
- $(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-O-(CH_2)_p-$ 、
- $(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-NR^4-(CH_2)_p-$ 、
- $(CH_2)_m-NR^4-(CH_2)_n-NR^4-(CH_2)_p-$ および
- $(CH_2)_m-NR^4-(CH_2)_n-O-(CH_2)_p-$

からなる群から選択され；

Y における R^4 以外のメチレン (CH_2) 炭素原子が 1 個もしくは 2 個の R^3 置換基によって置換されていても良く；

Z が

【化 7】



である請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】 Y が、 $(CH_2)_m$ 、 $(CH_2)_m - S - (CH_2)_n$ および $(CH_2)_m - NR^4 - (CH_2)_n$ からなる群から選択され；Y における R^4 以外のメチレン (CH_2) 炭素原子が 1 個もしくは 2 個の R^3 置換基によって置換されていても良く；
m および n が 0 ~ 3 の整数であり；
v が 0 である請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】 各 R^3 が独立に、

水素、

フッ素、

トリフルオロメチル、

アリール、

C_{1-8} アルキル、

アリール C_{1-6} アルキル、

水酸基、

オキソ、

アリールアミノカルボニル、

アリール C_{1-5} アルキルアミノカルボニル、

アミノカルボニル

および

アミノカルボニル C_{1-6} アルキル

からなる群から選択され；

各 R^4 が独立に、

水素、

アリール、

C_{3-8} シクロアルキル、

C_{1-8} アルキル、

C_{1-8} アルキルカルボニル、

アリールカルボニル、

C_{1-6} アルキルスルホニル、

アリールスルホニル、

アリール C_{1-6} アルキルスルホニル、

アリール C_{1-6} アルキルカルボニル、

C_{1-8} アルキルアミノカルボニル、

アリール C_{1-5} アルキルアミノカルボニル、

アリール C_{1-8} アルコキシカルボニルおよび

C_{1-8} アルコキシカルボニル

からなる群から選択される請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】 R^6 、 R^7 および R^8 がそれぞれ水素であり、 R^5 が

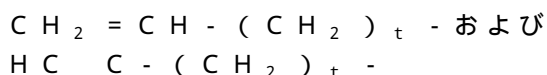
水素、

アリール、

C_{1-8} アルキル、

アリール - $C - C - (CH_2)_t -$ 、

アリール C_{1-6} アルキル、



からなる群から選択される請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】 R^9 が水素、メチルおよびエチルからなる群から選択される請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】 R^9 が水素である請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】 R^5 、 R^6 および R^8 がそれぞれ水素であり、 R^7 が、

水素、

アリール、

C_{1-8} アルキルカルボニルアミノ、

C_{1-8} アルキルスルホニルアミノ、

アリールカルボニルアミノ、

アリールスルホニルアミノ、

C_{1-8} アルキルスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、

アリールスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、

アリール C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ、

アリール C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、

C_{1-8} アルコキシカルボニルアミノ、

C_{1-8} アルコキシカルボニルアミノ C_{1-8} アルキル、

アリール オキシカルボニルアミノ C_{1-8} アルキル、

アリール C_{1-8} アルコキシカルボニルアミノ、

アリール C_{1-8} アルコキシカルボニルアミノ C_{1-8} アルキル、

C_{1-8} アルキルカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、

アリールカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、

アリール C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ、

アリール C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、

アミノカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、

(C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニルアミノ、

(C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、

(アリール)_p アミノカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、

アリールアミノカルボニルアミノ、

(アリール C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニルアミノ、

(アリール C_{1-8} アルキル)_p アミノカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、

アミノスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、

(C_{1-8} アルキル)_p アミノスルホニルアミノ、

(C_{1-8} アルキル)_p アミノスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、

(アリール)_p アミノスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、

(アリール C_{1-8} アルキル)_p アミノスルホニルアミノ、

(アリール C_{1-8} アルキル)_p アミノスルホニルアミノ C_{1-6} アルキル、

C_{1-6} アルキルチオカルボニルアミノ、

C_{1-6} アルキルチオカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、

アリールチオカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル、

アリール C_{1-6} アルキルチオカルボニルアミノおよび

アリール C_{1-6} アルキルチオカルボニルアミノ C_{1-6} アルキル

からなる群から選択される請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 11】 R^7 が、

水素、

アリール、

C_{1-8} アルキルカルボニルアミノ、

アリール C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ、

アリールカルボニルアミノ、
 $C_1 - 8$ アルキルスルホニルアミノ、
 アリール $C_1 - 6$ アルキルスルホニルアミノ、
 アリールスルホニルアミノ、
 $C_1 - 8$ アルコキシカルボニルアミノ、
 アリール $C_1 - 8$ アルコキシカルボニルアミノ、
 アリールアミノカルボニルアミノ、
 ($C_1 - 8$ アルキル)_p アミノカルボニルアミノ、
 (アリール $C_1 - 8$ アルキル)_p アミノカルボニルアミノ、
 ($C_1 - 8$ アルキル)_p アミノスルホニルアミノおよび
 (アリール $C_1 - 8$ アルキル)_p アミノスルホニルアミノ

からなる群から選択される請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】 R^9 が水素、メチルおよびエチルからなる群から選択される請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】 R^9 が水素である請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 14】

3 (S) - (2, 3 - ジヒドロ - ベンゾフラン - 6 - イル) - 3 - {2 - オキソ - 3 - [3 - (5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ [1, 8] ナフチリジン - 2 - イル) - プロピル] - テトラヒドロ - ピリミジン - 1 - イル} - プロピオン酸エチル；

3 (S) - (3 - フルオロフェニル) - 3 - (2 - オキソ - 3 (S または R) - [3 - (5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ [1, 8] ナフチリジン - 2 - イル) - プロピル] - ペリジン - 1 - イル) - プロピオン酸エチル；

3 (S) - (3 - フルオロフェニル) - 3 - (2 - オキソ - 3 (R または S) - [3 - (5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ [1, 8] ナフチリジン - 2 - イル) - プロピル] - ペリジン - 1 - イル) - プロピオン酸エチル；

3 (S) - (2, 3 - ジヒドロ - ベンゾフラン - 6 - イル) - 3 - {2 - オキソ - 3 - [3 - (5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ [1, 8] ナフチリジン - 2 - イル) - プロピル] - テトラヒドロ - ピリミジン - 1 - イル) - プロピオン酸；

3 (S) - (3 - フルオロフェニル) - 3 - (2 - オキソ - 3 (S または R) - [3 - (5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ [1, 8] ナフチリジン - 2 - イル) - プロピル] - ペリジン - 1 - イル) - プロピオン酸；

3 (S) - (3 - フルオロフェニル) - 3 - (2 - オキソ - 3 (R または S) - [3 - (5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ [1, 8] ナフチリジン - 2 - イル) - プロピル] - ペリジン - 1 - イル) - プロピオン酸

からなる群から選択される請求項 6 に記載の化合物ならびに該化合物の医薬的に許容される塩。

【請求項 15】

3 (S) - (2, 3 - ジヒドロ - ベンゾフラン - 6 - イル) - 3 - {2 - オキソ - 3 - [3 - (5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ [1, 8] ナフチリジン - 2 - イル) - プロピル] - テトラヒドロ - ピリミジン - 1 - イル) - プロピオン酸；

3 (S) - (3 - フルオロフェニル) - 3 - (2 - オキソ - 3 (S または R) - [3 - (5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ [1, 8] ナフチリジン - 2 - イル) - プロピル] - ペリジン - 1 - イル) - プロピオン酸；

3 (S) - (3 - フルオロフェニル) - 3 - (2 - オキソ - 3 (R または S) - [3 - (5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ [1, 8] ナフチリジン - 2 - イル) - プロピル] - ペリジン - 1 - イル) - プロピオン酸

からなる群から選択される請求項 14 に記載の化合物ならびに該化合物の医薬的に許容される塩。

【請求項 16】 請求項 1 に記載の化合物と医薬的に許容される担体とを含む医薬組成物。

【請求項 17】 請求項 1 に記載の化合物と医薬的に許容される担体とを組み合わせることで製造される医薬組成物。

【請求項 18】 請求項 1 に記載の化合物と医薬的に許容される担体とを組み合わせる段階を有する医薬組成物の製造方法。

【請求項 19】

a) 有機ビスホスホン酸化合物または該化合物の医薬的に許容される塩もしくはエステル；

b) エストロゲン受容体調節剤；

c) 細胞毒剤 / 抗増殖剤；

d) 基質金属プロテイナーゼ阻害剤；

e) 表皮由来、線維芽細胞由来または血小板由来の成長因子の阻害剤；

f) VEGF 阻害剤；

g) Flk - 1 / KDR、Flt - 1、Tck / Tie - 2 または Tie - 1 の阻害剤；

h) カテプシン K 阻害剤；および

i) ファルネシル蛋白トランスフェラーゼ阻害薬もしくはゲラニルゲラニルトランスフェラーゼ阻害薬またはファルネシル / ゲラニルゲラニルトランスフェラーゼ二重阻害薬などのプレニル化阻害薬；ならびにそれらの混合物

からなる群から選択される有効成分をさらに含む請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 20】

前記有効成分が、

a) 有機ビスホスホン酸化合物または該化合物の医薬的に許容される塩もしくはエステル；

b) エストロゲン受容体調節剤；および

c) カテプシン K 阻害剤；ならびに

それらの混合物

からなる群から選択される請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 21】 前記有機ビスホスホン酸化合物または該化合物の医薬的に許容される塩もしくはエステルが、アレンドロン酸モノナトリウム・3水和物である請求項 20 に記載の化合物。

【請求項 22】 前記有効成分が、

a) 細胞毒剤 / 抗増殖剤；

b) 基質金属プロテイナーゼ阻害剤；

c) 表皮由来、線維芽細胞由来または血小板由来の成長因子の阻害剤；

d) VEGF 阻害剤；

e) Flk - 1 / KDR、Flt - 1、Tck / Tie - 2 または Tie - 1 の阻害剤；ならびに

それらの混合物

からなる群から選択される請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 23】 処置を必要とする哺乳動物でインテグリン受容体拮抗効果を誘発する方法であって、治療上有効量の請求項 1 に記載の化合物を該哺乳動物に投与する段階を有してなる方法。

【請求項 24】 前記インテグリン受容体拮抗効果が v 3 拮抗効果である請求項 23 に記載の方法。

【請求項 25】 v 3 拮抗効果が、骨吸収、再狭窄、血管形成、糖尿病性網膜症、黄斑変性、炎症、ウイルス疾患および腫瘍成長の阻害からなる群から選択される請求項 24 に記載の方法。

【請求項 26】 v 3 拮抗効果が骨吸収阻害である請求項 25 に記載の方法。

【請求項 27】 前記インテグリン受容体拮抗効果が v 5 拮抗効果である請求項 23 に記載の方法。

【請求項 28】 v 5 拮抗効果が、再狭窄、血管形成、糖尿病性網膜症、黄斑変性、炎症および腫瘍成長の阻害からなる群から選択される請求項 27 に記載の方法。

【請求項 29】 前記インテグリン受容体拮抗効果が v 3 / v 5 二重拮抗効果である請求項 23 に記載の方法。

【請求項 30】 v 3 / v 5 二重拮抗効果が、骨吸収、再狭窄、血管形成、糖尿病性網膜症、黄斑変性、炎症、ウィルス疾患および腫瘍成長の阻害からなる群から選択される請求項 29 に記載の方法。

【請求項 31】 前記インテグリン受容体拮抗効果が v 6 拮抗効果である請求項 23 に記載の方法。

【請求項 32】 v 6 拮抗効果が、血管形成、炎症応答および創傷治癒からなる群から選択される請求項 31 に記載の方法。

【請求項 33】 処置を必要とする哺乳動物においてインテグリン受容体拮抗効果を誘発する方法であって、該哺乳動物に治療上有効量の請求項 16 に記載の組成物を投与する段階を有してなる方法。

【請求項 34】 処置を必要とする哺乳動物におけるインテグリン受容体の拮抗が介在する状態の治療または予防方法であって、該哺乳動物に治療上有効量の請求項 16 に記載の組成物を投与する段階を有してなる方法。

【請求項 35】 処置を必要とする哺乳動物における骨吸収阻害方法であって、該哺乳動物に治療上有効量の請求項 16 に記載の組成物を投与する段階を有してなる方法。

【請求項 36】 処置を必要とする哺乳動物における骨吸収阻害方法であって、該哺乳動物に治療上有効量の請求項 20 に記載の組成物を投与する段階を有してなる方法。

【請求項 37】 処置を必要とする哺乳動物における腫瘍成長の治療方法であって、該哺乳動物に治療上有効量の請求項 22 に記載の組成物を投与する段階を有してなる方法。

【請求項 38】 処置を必要とする哺乳動物における腫瘍成長の治療方法であって、該哺乳動物に対して、放射線療法との併用で、治療上有効量の請求項 1 に記載の化合物を投与する段階を有してなる方法。