

【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19年7月19日(2007.7.19)

【公表番号】特表2006-527226(P2006-527226A)

【公表日】平成18年11月30日(2006.11.30)

【年通号数】公開・登録公報2006-047

【出願番号】特願2006-515869(P2006-515869)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/519	(2006.01)
C 0 7 D	495/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/30	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	15/08	(2006.01)
A 6 1 P	13/08	(2006.01)
A 6 1 P	17/10	(2006.01)
A 6 1 P	17/08	(2006.01)
A 6 1 P	17/14	(2006.01)
A 6 1 P	5/18	(2006.01)
A 6 1 P	13/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/10	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	27/12	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/519	
C 0 7 D	495/04	1 0 5 Z
C 0 7 D	495/04	C S P
A 6 1 P	25/30	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	15/08	
A 6 1 P	13/08	
A 6 1 P	17/10	
A 6 1 P	17/08	
A 6 1 P	17/14	
A 6 1 P	5/18	
A 6 1 P	13/00	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	17/00	

A 6 1 P 27/12

【手続補正書】

【提出日】平成19年5月31日(2007.5.31)

【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

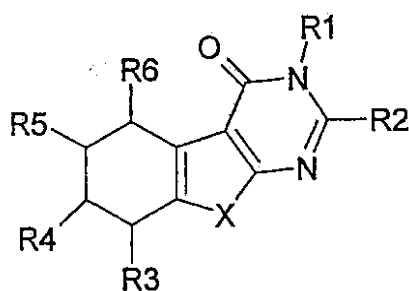
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

ステロイドホルモン依存性疾患または障害、好ましくは17 - ヒドロキシステロイドデヒドロゲナーゼ(17 - HSD)酵素の阻害を必要とする、最も好ましくは17 - HSD 1型、17 - HSD 2型または17 - HSD 3型酵素の阻害を必要とするステロイドホルモン依存性疾患または障害の治療および/または予防用の医薬組成物であって、活性剤としての、少なくとも1つの式(I)：

【化1】



(I)

[式中：

Xは、S、SOまたはSO₂であり；

R1およびR2は、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、シクロヘテロアルキル、置換シクロヘテロアルキル、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、シクロヘテロアルキル - アルキル、置換シクロヘテロアルキル - アルキルから成る群からそれぞれ選択され、その際、シクロヘテロアルキル - アルキルおよび置換シクロヘテロアルキル - アルキルのシクロヘテロアルキル成分はピロリジニル、テトラヒドロフリル、テトラヒドロチオフェニル、テトラヒドロピリジニル、ジオキソリル、アゼチジニル、チアゾリジニル、オキサゾリジニル、ピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、アゼパニル、ジアゼパニル、オキサゼパニル、チアゼパニル、ジヒドロ - 1H - ピロリルおよび1,3 - ジヒドロ - ベンゾイミダゾリルから成る群から選択されるか、

または、R2は、独立して、アシル、カルボキシルまたはアミドから選択してもよく、R1およびR2は、共に非置換アルキルであることはできず；

6員環の炭化水素鎖 - C(R3) - C(R4) - C(R5) - C(R6) - は、飽和であるか、または炭素原子間に1個または2個の二重結合を有し；

R3およびR4は、水素、オキソ、ハロゲンまたはジハロゲン、アシル、アルキル、置換アルキル、ヒドロキシル、カルボキシル、アミド、アミノ、ニトリル、チオ、アルコキシ、アシルオキシ、アリールオキシ、アルキルチオおよびアリールチオから成る群からそれぞれ選択され；

R5は、水素を表し；

R6は、水素またはハロゲンである]の化合物、および少なくとも1つの医薬的に許容される担体を含んで成る医薬組成物。

【請求項 2】

活性剤が、式 (I) で示され、式中、

R 1 および R 2 は、下記から成る群から個々に選択される：

- ・ $-C_1 \sim C_{12}$ アルキル：該アルキルは、直鎖、環状、分岐鎖または部分不飽和であってよく、該アルキルは、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ、チオール、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルチオ、アリールオキシ、アリールアシル、 $-CO-OR$ 、 $-O-CO-R$ 、ヘテロアリール-アシルオキシおよび $-N(R)_2$ から成る群から個々に選択される 3 個までの置換基によって任意に置換されていてよく；該アリール基は、フェニルまたはナフチルであり、3 個までのハロゲンによって任意に置換されていてよく；該ヘテロアリール基は、チエニル、フリルまたはピリジニルである；

- ・ アリールおよびアリール- $C_1 \sim C_{12}$ アルキル：該アリールは、フェニル、ピフェニル、ナフチル、インダニル、インデニルおよびフルオレニルから成る群から選択され；該アルキル成分は、1 個または 2 個のヒドロキシル基によって任意に置換されていてよく；該アリール成分は、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ、ニトロ、ニトリル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $-SO_2-N(R)_2$ および $C_1 \sim C_{12}$ アルキルスルホニルから成る群から個々に選択される 5 個までの置換基によって任意に置換されていてよく；または、該アリールは、隣接炭素原子に結合し、一緒になって飽和 5、6 または 7 員環系を形成する 2 個の基によって任意に置換されていてよく、該環系は、N または O のような 3 個までのヘテロ原子を任意に含有し、N 原子の数は 0 ~ 3 個であり、O 原子の数は 0 ~ 2 個であり；該環系は、オキソ基によって任意にさらに置換されていてよい；

- ・ ヘテロアリールおよびヘテロアリール- $C_1 \sim C_{12}$ アルキル：該ヘテロアリールは、ピロリル、チエニル、フリル、イミダゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、インドリル、キノリニル、イソキノリニル、ベンゾイミダゾリル、1, 3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾリル、ベンゾフランおよびベンゾ [b] チオフェンから成る群から選択され；該ヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $-CO-OR$ 、アリールおよびアリールオキシから成る群から個々に選択される 3 個までの置換基によって任意に置換されていてよく；該アリール基は、フェニルまたはナフチルから選択され、3 個までのハロゲン原子によって任意に置換されていてよい；

- ・ シクロヘテロアルキルおよびシクロヘテロアルキル- $C_1 \sim C_8$ アルキル：該シクロヘテロアルキル成分は、ピペリジニル、ピロリジニル、テトラヒドロフリル、ジオキサリル、モルホリニル、テトラヒドロチオフェニル、テトラヒドロピリジニル、アゼチジニル、チアゾリジニル、オキサゾリジニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、アゼパニル、ジアゼパニル、オキサゼパニル、ジヒドロ-1H-ピロリルおよび 1, 3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾリルから成る群から選択され；該シクロヘテロアルキル成分は、オキソ、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシおよびアリール- $C_1 \sim C_{12}$ アルキルから成る群から個々に選択される 2 個までの置換基によって任意に置換されていてよい；

または、R 2 は、独立して、 $-CO-R$ 、 $-CO-O-R$ または $-CO-N(R)_2$ から選択してもよい；

R 3 および R 4 は、水素、オキソ、チオ、ハロゲンまたはジハロゲン、 $-CO-R$ 、好ましくは CHO 、 $-CO-O-R$ 、ニトリル、 $-CO-N(R)_2$ 、 $-O-CO-R$ 、 $-O-R$ 、 $-S-R$ 、 $-N(R)_2$ 、 $-C_1 \sim C_{12}$ アルキルから成る群から個々に選択され；該アルキルは、直鎖、環状、分岐鎖または部分不飽和であってよく；該アルキルは、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ、チオールおよび $-N(R)_2$ から成る群から個々に選択される 3 個までの置換基によって任意に置換されていてよい；

ここで、R は、水素、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、フェニル- $C_1 \sim C_4$ アルキルまたはフェニルを表し、該フェニル成分において、ハロゲン、ヒドロキシルおよび $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、好ましくはメトキシから成る群から選択される 3 個までの置換基によって任意に置換さ

れていてよい化合物である、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 3】

ステロイドホルモン依存性疾患または障害が、下記から成る群から選択される請求項 1 または 2 に記載の医薬組成物：乳癌、前立腺癌、卵巢癌、子宮癌、子宮体癌および子宮内膜増殖症、子宮内膜症、子宮頸線維腫、子宮平滑筋腫、腺筋症、月経困難症、月経過多、不正子宮出血、前立腺痛、良性前立腺増殖症、前立腺炎、アクネ、脂漏症、多毛症、男性ホルモン性脱毛症、性的早熟症、副腎増殖症、多嚢胞性卵巢症候群、泌尿器機能不全、骨粗鬆症、多発性硬化症、慢性関節リウマチ、アルツハイマー病、大腸癌、組織創傷、皮膚のシワおよび白内障。

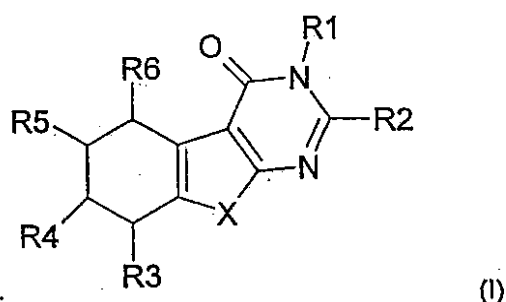
【請求項 4】

精子形成阻害用の又は男性用避妊薬としての使用のための請求項 1 又は 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

式 (I)：

【化 2】



[式中：

X は、S、SO または SO₂ であり；

R 1 および R 2 は、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、シクロヘテロアルキル、置換シクロヘテロアルキル、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、シクロヘテロアルキル - アルキル、置換シクロヘテロアルキル - アルキルから成る群からそれぞれ選択され、その際、シクロヘテロアルキル - アルキルおよび置換シクロヘテロアルキル - アルキルのシクロヘテロアルキル成分はピロリジニル、テトラヒドロフリル、テトラヒドロチオフエニル、テトラヒドロピリジニル、ジオキソリル、アゼチジニル、チアゾリジニル、オキサゾリジニル、ピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、アゼパニル、ジアゼパニル、オキサゼパニル、チアゼパニル、ジヒドロ - 1 H - ピロリルおよび 1, 3 - ジヒドロ - ベンゾイミダゾリルから成る群から選択されるか、

または、R 2 は、独立して、アシル、カルボキシルまたはアミドから選択してもよく、R 1 および R 2 は、共に非置換アルキルであることはできず、

全ての置換基 R 3、R 5 および R 6 が共に水素を表し、R 4 が水素またはメチルを表す場合、R 2 はメチルではなく；

R 3 および R 4 は、水素、オキソ、ハロゲンまたはジハロゲン、アシル、アルキル、置換アルキル、ヒドロキシル、カルボキシル、アミド、アミノ、ニトリル、チオ、アルコキシ、アシルオキシ、アリールオキシ、アルキルチオおよびアリールチオから成る群からそれぞれ選択され；

R 5 は、水素を表し；

R 6 は、水素またはハロゲンであり；

6 員環の炭化水素鎖 - C (R 3) - C (R 4) - C (R 5) - C (R 6) - は、飽和であるか、または炭素原子間に 1 個または 2 個の二重結合を有し；

全ての置換基 R 3、R 4、R 5 および R 6 が共に水素である場合、炭化水素鎖 - C (R

3) - C(R₄) - C(R₅) - C(R₆) - を含有する 6 員環は芳香環である] の化合物を含有する薬剤。

【請求項 6】

式 (I) で示され、式中、

R₁ および R₂ は、下記から成る群から個々に選択される：

- ・ - C₁ ~ C₁₂ アルキル：該アルキルは、直鎖、環状、分岐鎖または部分不飽和であってよく、該アルキルは、ヒドロキシル、C₁ ~ C₁₂ アルコキシ、チオール、C₁ ~ C₁₂ アルキルチオ、アリールオキシ、アリールアシル、- CO - OR、- O - CO - R、ヘテロアリール - アシルオキシおよび - N(R)₂ から成る群から個々に選択される 3 個までの置換基によって任意に置換されていてよく；該アリール基は、フェニルまたはナフチルであり、3 個までのハロゲンによって任意に置換されていてよく；該ヘテロアリール基は、チエニル、フリルまたはピリジニルである；

- ・ アリールおよびアリール - C₁ ~ C₁₂ アルキル：該アリールは、フェニル、ビフェニル、ナフチル、インダニル、インデニルおよびフルオレニルから成る群から選択され；該アルキル成分は、1 個または 2 個のヒドロキシル基によって任意に置換されていてよく；該アリール成分は、ハロゲン、ヒドロキシル、C₁ ~ C₁₂ アルコキシ、ニトロ、ニトリル、C₁ ~ C₁₂ アルキル、ハロゲン化 C₁ ~ C₁₂ アルキル、- SO₂ - N(R)₂ および C₁ ~ C₁₂ アルキルスルホニルから成る群から個々に選択される 5 個までの置換基によって任意に置換されていてよく；または、該アリールは、隣接炭素原子に結合し、一緒になって飽和 5、6 または 7 員環系を形成する 2 個の基によって任意に置換されていてよく、該環系は、N または O のような 3 個までのヘテロ原子を任意に含有し、N 原子の数は 0 ~ 3 個であり、O 原子の数は 0 ~ 2 個であり；該環系は、オキソ基によって任意にさらに置換されていてよい；

- ・ ヘテロアリールおよびヘテロアリール - C₁ ~ C₁₂ アルキル：該ヘテロアリールは、ピロリル、チエニル、フリル、イミダゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、インドリル、キノリニル、イソキノリニル、ベンゾイミダゾリル、1, 3 - ジヒドロ - ベンゾイミダゾリル、ベンゾフランおよびベンゾ [b] チオフエンから成る群から選択され；該ヘテロアリール基は、ハロゲン、C₁ ~ C₁₂ アルキル、ハロゲン化 C₁ ~ C₈ アルキル、- CO - OR、アリールおよびアリールオキシから成る群から個々に選択される 3 個までの置換基によって任意に置換されていてよく；該アリール基は、フェニルまたはナフチルから選択され、3 個までのハロゲン原子によって任意に置換されていてよい；

- ・ シクロヘテロアルキルおよびシクロヘテロアルキル - C₁ ~ C₈ アルキル：該シクロヘテロアルキル成分は、ピペリジニル、ピロリジニル、テトラヒドロフリル、ジオキサリル、モルホリニル、テトラヒドロチオフエニル、テトラヒドロピリジニル、アゼチジニル、チアゾリジニル、オキサゾリジニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、アゼパニル、ジアゼパニル、オキサゼパニル、ジヒドロ - 1 H - ピロリルおよび 1, 3 - ジヒドロ - ベンゾイミダゾリルから成る群から選択され；該シクロヘテロアルキル成分は、オキソ、C₁ ~ C₁₂ アルキル、ヒドロキシル、C₁ ~ C₁₂ アルコキシおよびアリール - C₁ ~ C₁₂ アルキルから成る群から個々に選択される 2 個までの置換基によって任意に置換されていてよい；

または、R₂ は、独立して、- CO - R、- CO - O - R または - CO - N(R)₂ から選択してもよい；

R₃ および R₄ は、水素、オキソ、チオ、ハロゲンまたはジハロゲン、- CO - R、好ましくは CHO、- CO - O - R、ニトリル、- CO - N(R)₂、- O - CO - R、- O - R、- S - R、- N(R)₂、- C₁ ~ C₁₂ アルキルから成る群から個々に選択され；該アルキルは、直鎖、環状、分岐鎖または部分不飽和であってよく；該アルキルは、ヒドロキシル、C₁ ~ C₁₂ アルコキシ、チオールおよび - N(R)₂ から成る群から個々に選択される 3 個までの置換基によって任意に置換されていてよい；

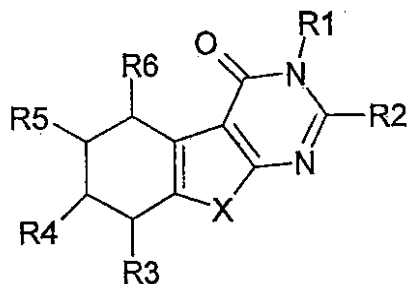
ここで、R は、水素、C₁ ~ C₁₂ アルキル、フェニル - C₁ ~ C₄ アルキルまたはフェニ

ルを表し、該フェニル成分において、ハロゲン、ヒドロキシルおよび $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、好ましくはメトキシから成る群から選択される 3 個までの置換基によって任意に置換されていてよい、請求項 5 に記載の薬剤。

【請求項 7】

式 (I) :

【化 3】



(I)

[式中 :

X は、S、SO または SO_2 であり ;

R 1 および R 2 は、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、シクロヘテロアルキル、置換シクロヘテロアルキル、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、シクロヘテロアルキル - アルキル、置換シクロヘテロアルキル - アルキルから成る群からそれぞれ選択され、その際、シクロヘテロアルキル - アルキルおよび置換シクロヘテロアルキル - アルキルのシクロヘテロアルキル成分はピロリジニル、テトラヒドロフリル、テトラヒドロチオフエニル、テトラヒドロピリジニル、ジオキソリル、アゼチジニル、チアゾリジニル、オキサゾリジニル、ピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、アゼパニル、ジアゼパニル、オキサゼパニル、チアゼパニル、ジヒドロ - 1 H - ピロリルおよび 1 , 3 - ジヒドロ - ベンゾイミダゾリルから成る群から選択されるか、

または、R 2 は、独立して、アシル、カルボキシルまたはアミドから選択してもよく、R 1 および R 2 は、共に非置換アルキルであることはできず、

全ての置換基 R 3、R 5 および R 6 が共に水素を表し、R 4 が水素またはメチルを表す場合、R 2 はメチルではなく ;

R 3 および R 4 は、水素、オキソ、ハロゲンまたはジハロゲン、アシル、アルキル、置換アルキル、ヒドロキシル、カルボキシル、アミド、アミノ、ニトリル、チオ、アルコキシ、アシルオキシ、アリールオキシ、アルキルチオおよびアリールチオから成る群からそれぞれ選択され ;

R 5 は、水素を表し ;

R 6 は、水素またはハロゲンであり ;

6 員環の炭化水素鎖 - C (R 3) - C (R 4) - C (R 5) - C (R 6) - は、飽和であるか、または炭素原子間に 1 個または 2 個の二重結合を有し ;

全ての置換基 R 3、R 4、R 5 および R 6 が共に水素である場合、炭化水素鎖 - C (R 3) - C (R 4) - C (R 5) - C (R 6) - を含有する 6 員環は芳香環である]

で示される新規化合物であって、(3 - ベンジル - 7 - tert - ブチル - 4 - オキソ - 3 , 4 , 5 , 6 , 7 , 8 - ヘキサヒドロ - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 - イル) - 酢酸メチルエステルまたは 2 , 3 - ジベンジル - 7 - tert - ブチル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 3 H - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - オンでないことを条件とする新規化合物。

【請求項 8】

式 (I) で示され、式中、

R 1 および R 2 は、下記から成る群から個々に選択される :

・ $-C_1 \sim C_{12}$ アルキル：該アルキルは、直鎖、環状、分岐鎖または部分不飽和であってよく、該アルキルは、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ、チオール、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルチオ、アリールオキシ、アリールアシル、 $-CO-OR$ 、 $-O-CO-R$ 、ヘテロアリール-アシルオキシおよび $-N(R)_2$ から成る群から個々に選択される 3 個までの置換基によって任意に置換されていてよく；該アリール基は、フェニルまたはナフチルであり、3 個までのハロゲンによって任意に置換されていてよく；該ヘテロアリール基は、チエニル、フリルまたはピリジニルである；

・ アリールおよびアリール- $C_1 \sim C_{12}$ アルキル：該アリールは、フェニル、ビフェニル、ナフチル、インダニル、インデニルおよびフルオレニルから成る群から選択され；該アルキル成分は、1 個または 2 個のヒドロキシル基によって任意に置換されていてよく；該アリール成分は、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ、ニトロ、ニトリル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $-SO_2-N(R)_2$ および $C_1 \sim C_{12}$ アルキルスルホニルから成る群から個々に選択される 5 個までの置換基によって任意に置換されていてよく；または、該アリールは、隣接炭素原子に結合し、一緒になって飽和 5、6 または 7 員環系を形成する 2 個の基によって任意に置換されていてよく、該環系は、N または O のような 3 個までのヘテロ原子を任意に含有し、N 原子の数は 0 ~ 3 個であり、O 原子の数は 0 ~ 2 個であり；該環系は、オキソ基によって任意にさらに置換されていてよい；

・ ヘテロアリールおよびヘテロアリール- $C_1 \sim C_{12}$ アルキル：該ヘテロアリールは、ピロリル、チエニル、フリル、イミダゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、インドリル、キノリニル、イソキノリニル、ベンゾイミダゾリル、1, 3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾリル、ベンゾフランおよびベンゾ[*b*]チオフエンから成る群から選択され；該ヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $-CO-OR$ 、アリールおよびアリールオキシから成る群から個々に選択される 3 個までの置換基によって任意に置換されていてよく；該アリール基は、フェニルまたはナフチルから選択され、3 個までのハロゲン原子によって任意に置換されていてよい；

・ シクロヘテロアルキルおよびシクロヘテロアルキル- $C_1 \sim C_8$ アルキル：該シクロヘテロアルキル成分は、ピペリジニル、ピロリジニル、テトラヒドロフリル、ジオキサリル、モルホリニル、テトラヒドロチオフエニル、テトラヒドロピリジニル、アゼチジニル、チアゾリジニル、オキサゾリジニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、アゼパニル、ジアゼパニル、オキサゼパニル、ジヒドロ-1H-ピロリルおよび 1, 3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾリルから成る群から選択され；該シクロヘテロアルキル成分は、オキソ、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシおよびアリール- $C_1 \sim C_{12}$ アルキルから成る群から個々に選択される 2 個までの置換基によって任意に置換されていてよい；

または、R 2 は、独立して、 $-CO-R$ 、 $-CO-O-R$ または $-CO-N(R)_2$ から選択してもよい；

R 3 および R 4 は、水素、オキソ、チオ、ハロゲンまたはジハロゲン、 $-CO-R$ 、好ましくは CHO 、 $-CO-O-R$ 、ニトリル、 $-CO-N(R)_2$ 、 $-O-CO-R$ 、 $-O-R$ 、 $-S-R$ 、 $-N(R)_2$ 、 $-C_1 \sim C_{12}$ アルキルから成る群から個々に選択され；該アルキルは、直鎖、環状、分岐鎖または部分不飽和であってよく；該アルキルは、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ、チオールおよび $-N(R)_2$ から成る群から個々に選択される 3 個までの置換基によって任意に置換されていてよい；

ここで、R は、水素、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、フェニル- $C_1 \sim C_4$ アルキルまたはフェニルを表し、該フェニル成分において、ハロゲン、ヒドロキシルおよび $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、好ましくはメトキシから成る群から選択される 3 個までの置換基によって任意に置換されていてよい請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

炭化水素鎖 $-C(R_3)-C(R_4)-C(R_5)-C(R_6)-$ を含有する 6 員環が

芳香環である請求項 7 または 8 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 10】

炭化水素鎖 - C(R₃) - C(R₄) - C(R₅) - C(R₆) - を含有する 6 員環が芳香環ではなく、置換基 R₃ ~ R₆ の少なくとも 1 つが水素でない請求項 7 または 8 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 11】

式 (I) で示され、式中、R₂ が、

- ・ - C₁ ~ C₈ アルキル：該アルキルは、直鎖、環状、分岐鎖または部分不飽和であってよく、ヒドロキシル、C₁ ~ C₈ アルコキシ、チオール、C₁ ~ C₈ アルキルチオ、アリールオキシ、- CO - O - C₁ ~ C₈ アルキルおよび - O - CO - R' から成る群から個々に選択される 3 個までの置換基によって任意に置換されていてよく；該アリール基は、フェニルまたはナフチルであり、3 個までのハロゲンによって任意に置換されていてよい；

- ・ アリールおよびアリール - C₁ ~ C₈ アルキル：該アリールは、フェニル、ピフェニル、ナフチル、インダニル、インデニルおよびフルオレニルから成る群から選択され；該アリール成分は、ハロゲン、ヒドロキシル、C₁ ~ C₈ アルコキシ、ニトロ、ニトリル、ハロゲン化 C₁ ~ C₈ アルキル、- SO₂ - N(R')₂ から成る群から個々に選択される 5 個までの置換基によって任意に置換されていてよい；

- ・ ヘテロアリールおよびヘテロアリール - C₁ ~ C₈ アルキル：該ヘテロアリールは、ピロリル、チエニル、フリル、イミダゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、インドリル、キノリニル、イソキノリニル、ベンゾイミダゾリル、1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾリル、ベンゾフランおよびベンゾ[*b*]チオフエンから成る群から選択され；該ヘテロアリール基は、ハロゲン、C₁ ~ C₈ アルキル、ハロゲン化 C₁ ~ C₈ アルキル、アリールおよびアリールオキシから成る群から個々に選択される 3 個までの置換基によって任意に置換されていてよく；該アリール基は、フェニルまたはナフチルから選択され、3 個までのハロゲン原子によって任意に置換されていてよい；

- ・ - CO - R'；

- ・ - CO - N(R')₂；および

- ・ - CO - O - R'；

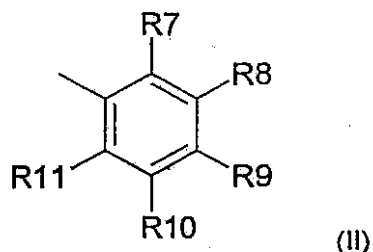
ここで、R' は、水素または C₁ ~ C₈ アルキルを表す、請求項 7 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 12】

式 (I) で示され、式中、R₂ が、

i) 式 (II)：

【化 4】



[式中、

R₇ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシルまたは C₁ ~ C₄ アルコキシ、好ましくはメトキシであり；

R₈ は、水素、C₁ ~ C₄ アルコキシ、好ましくはメトキシ、ヒドロキシル、ニトリル、ハロゲンまたはハロゲン化 C₁ ~ C₄ アルキル、好ましくはトリフルオロメチルであり；

R₉ は、水素、C₁ ~ C₄ アルコキシ、好ましくはメトキシ、ヒドロキシル、ニトリル、ハロゲンまたは N, N - ジ - C₁ ~ C₄ アルキル - スルホンアミドであり；

R 1 0 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、好ましくはメトキシ、ヒドロキシル、ニトリル、ハロゲンまたはハロゲン化 $C_1 \sim C_4$ アルキル、好ましくはトリフルオロメチルであり；

R 1 1 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシルまたは $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、好ましくはメトキシである] で示される残基；

または、i i)

- $C_1 \sim C_8$ アルキル：該アルキルは、直鎖、環状、分岐鎖または部分不飽和であってよい；

- $C_1 \sim C_4$ アルキル：該アルキルは、下記から成る群から選択される 1 個または 2 個の置換基によって置換されている：

- $CO - O - R''$ ；

- $O - R''$ ；

- $O - Ar$ ：該 Ar は、ハロゲンによって任意に置換されているフェニルである；

- $O - CO - R''$ ；

フェニルまたはビフェニル：該フェニル成分において、3 個までの $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、好ましくはメトキシ基によって任意に置換されている；

- $CO - O - R''$ ；

- $CO - R''$ 、好ましくは $-CHO$ ；

- ナフチル；

- ヘテロアリール：該ヘテロアリールは、チエニル、フリル、ピリジニル、ベンゾチエニルおよびピラゾリルから成る群から選択され；該ヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_4$ アルキル、好ましくはトリフルオロメチル、フェニルおよびフェノキシから成る群から個々に選択される 1 個または 2 個の置換基によって任意に置換されていてよく；該フェニル基は、3 個までのハロゲンによって任意に置換されていてよい；

ここで、 R'' は、水素または $C_1 \sim C_4$ アルキル、好ましくはメチルまたはエチルを表す請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

式 (I) で示され、式中、 R_2 が、

フェニル、メトキシフェニル、トリメトキシフェニル、トリヒドロキシフェニル、3, 5 - ジヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル、2 - ブロモ - 3, 4, 5 - トリメトキシフェニル、2 - ブロモ - 5 - メトキシフェニル、2 - クロロ - 3, 4, 5 - トリメトキシフェニル、シアノフェニル、フルオロフェニル、ジ - トリフルオロメチルフェニル、ジフルオロフェニル、ジクロロフェニル、4 - N, N - ジプロピルスルホンアミド、メチル、シクロプロピル、シクロペンチルエチル、1 - エチルペンチル、2 - メチルプロパ - 1 - エニル、プロピル、ベンジル、フェネチル、ビフェニルメチル、ジメトキシベンジル、ナフチル、チエニル、フリル、ピリジニル、ベンゾチエニル、プロモチエニル、1 - フェニル - 5 - トリフルオロメチル - 4 H - ピラゾル - 4 - イル、2 - (4 - クロロ - フェノキシ) - ピリジン - 3 - イル、ヒドロキシメチル、アセチル - オキシメチル、メトキシメチル、メトキシ - アシル - メチル、エトキシ - アシル - メチル、エトキシ - アシル - エチル、1 - (3 - クロロ - フェノキシ) - 1 - メチル - エチル、カルボニルおよびメトキシアシルから成る群から選択される請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

R_2 が、メトキシフェニル、トリメトキシフェニル、2 - ブロモ - 3, 4, 5 - トリメトキシフェニル、2 - クロロ - 3, 4, 5 - トリメトキシフェニル、チエニルまたはプロピルである請求項 1 3 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 1 5】

式 (I) で示され、式中、 R_1 が、

・ - $C_1 \sim C_8$ アルキル：該アルキルは、直鎖、環状、分岐鎖または部分不飽和であってよく、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、チオール、 $-NH_2$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルキルチ

オ、アリールオキシ、アリールアシル、 $-CO-O-C_1\sim C_8$ アルキル、 $C_1\sim C_8$ アルキルアシルオキシ、ヘテロアリール-アシルオキシおよび $C_1\sim C_8$ アルキルアミノから成る群から個々に選択される3個までの置換基によって任意に置換されていてよく；該アリール基は、フェニルまたはナフチルであり、3個までのハロゲンによって任意に置換されていてよく；該ヘテロアリール基は、チエニル、フリルまたはピリジニルである；

- ・ アリールおよびアリール- $C_1\sim C_8$ アルキル：該アリール成分は、フェニル、ピフェニル、ナフチル、インダニル、インデニルおよびフルオレニルから成る群から選択され；該アルキル成分は1個または2個のヒドロキシル基によって任意に置換されていてよく；該アリール成分は、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1\sim C_8$ アルコキシ、 $C_1\sim C_8$ アルキルスルホニル、 $-SO_2-N(C_1\sim C_8\text{アルキル})_2$ 、 $C_1\sim C_8$ アルキル、ハロゲン化 $C_1\sim C_8$ アルキルから成る群から個々に選択される5個までの置換基によって任意に置換されていてよく；または、該アリールは、隣接炭素原子に結合し、一緒になって飽和5または6員環系を形成する2個の基によって任意に置換されていてよく、該環系は、NまたはOのような3個までのヘテロ原子を任意に含有し、N原子の数は0～3個であり、O原子の数は0～2個であり；該環系は、オキソ基によって任意にさらに置換されていてよい；

- ・ ヘテロアリールおよびヘテロアリール- $C_1\sim C_8$ アルキル：該ヘテロアリール成分は、キノリニル、チアゾリル、ピリミジニル、フリル、ピリジニル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、ピラジニル、インドリル、イソキノリニル、ベンゾイミダゾリル、1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾリル、ベンゾフランおよびベンゾ[*b*]チオフェンから成る群から選択され；該ヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1\sim C_8$ アルキルおよび $-CO-O-C_1\sim C_8$ アルキルから成る群から個々に選択される3個までの置換基によって任意に置換されていてよい；

- ・ シクロヘテロアルキルおよびシクロヘテロアルキル- $C_1\sim C_8$ アルキル：該シクロヘテロアルキル成分は、ピペリジニル、ピロリジニル、テトラヒドロフリル、ジオキソリル、モルホリニル、テトラヒドロチオフェニル、テトラヒドロピリジニル、アゼチジニル、チアゾリジニル、オキサゾリジニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、アゼパニル、ジアゼパニル、オキサゼパニル、ジヒドロ-1H-ピロリルおよび1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾリルから成る群から選択され；該シクロヘテロアルキル成分は、オキソ、 $C_1\sim C_8$ アルキル、ヒドロキシル、 $C_1\sim C_8$ アルコキシおよびアリール- $C_1\sim C_8$ アルキルから成る群から個々に選択される2個までの置換基によって任意に置換されていてよい、請求項7～14のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項16】

式(I)で示され、式中、R1が、

- ・ $-C_1\sim C_8$ アルキル：該アルキルは、直鎖、環状または分岐鎖であってよい；
- ・ $-C_1\sim C_4$ アルキル：該アルキルは、 $-O-R''$ 、 $-O-Ar$ 、 $-O-CO-HetAr$ 、 $-CO-Ar$ 、 $-CO-O-R''$ および $-N(R'')_2$ から成る群から個々に選択される1個または2個の置換基によって置換されている；

- ・ アリールおよびアリール- $C_1\sim C_4$ アルキル：該アリール成分は、フェニル、インダニルおよびフルオレニルから成る群から選択され；該アルキル成分はヒドロキシル基によって任意に置換されていてよく；該アリール成分は、ハロゲン、 $-O-R''$ 、 $-SO_2-R''$ 、 $-SO_2-N(R'')_2$ から成る群から個々に選択される3個までの置換基によって任意に置換されていてよく；または、該アリールは、隣接炭素原子に結合し、一緒になって2個までのO原子を任意に含有する飽和5または6員環系を形成する2個の基によって、任意に置換されていてよく；該環系は、オキソ基によって任意にさらに置換されていてよい；

- ・ ヘテロアリールおよびヘテロアリール- $C_1\sim C_4$ アルキル：該ヘテロアリール成分は、キノリニル、チアゾリル、ピリミジニル、フリル、ピリジニル、ピラジニルおよびチエニルから成る群から選択され；該ヘテロアリール基は、ハロゲン、 $-C_1\sim C_4$ アルキルおよび $-CO-O-R''$ から成る群から個々に選択される1個または2個の置換基によって任意に置換されていてよい；

・ シクロヘテロアルキルおよびシクロヘテロアルキル - $C_1 \sim C_4$ アルキル：該シクロヘテロアルキル成分は、ピペリジニル、モルホリニル、ピロリジニル、テトラヒドロフリルおよびジオキソリルから成る群から選択され；該シクロヘテロアルキル成分は、オキソ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、好ましくはメチル、および - $C_1 \sim C_4$ アルキル - Ar、好ましくはベンジルまたはフェネチルから成る群から個々に選択される2個までの置換基によって任意に置換されていてよい；

ここで、

Ar は、ハロゲンまたはメトキシで任意に置換されたフェニルを表し；

HetAr は、チエニル、フリル、ピリジニルを表し；

R は、水素または $C_1 \sim C_4$ アルキル、好ましくはメチルまたはエチルを表すから成る群から選択される請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 17】

式 (I) で示され、式中、R1 が、シクロプロピル、ブチル、イソブチル、3 - メチルブチル、シクロヘキシル、ベンジル、フェネチル、2 - ヒドロキシ - 2 - フェニル - エチル、メトキシベンジル、5 - ブロモ - 2 - メトキシベンジル、5 - ブロモ - 2 - ヒドロキシベンジル、3, 4 - ジクロロベンジル、3, 4 - ジヒドロキシベンジル、4 - メチルスルホニルベンジル、4 - アミノスルホニルフェネチル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラニル、ベンゾ [1, 3] ジオキソリル、フェニル、フルオレニル、インダニル、3 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロベンゾフラニル、キノリニル、メチル - チアゾリル、2 - メトキシアシル - ピラジニル、フリルメチル、ピリジニルメチル、チエニルエチル、チエニルメチル、ピリジニルエチル、ブロモ - フリルメチル、ベンジルピペリジニル、モルホリニルエチル、2 - オキソ - ピロリジニルプロピル、テトラヒドロフリルメチル、2, 2 - ジメチル - [1, 3] ジオキソラン - 4 - イルメチル、ヒドロキシエチル、メトキシエチル、2 - オキソ - 2 - フェニル - エチル、メトキシ - アシル - プロピル、フェノキシエチル、チオフェン - 2 - カルボン酸エチルエステルおよびジメチルアミノエチルから成る群から選択される請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 18】

式 (I) で示され、式中、R1 が、イソブチル、3 - メチルブチル、ベンジル、テトラヒドロフリルメチル、フリルメチル、5 - ブロモ - フラン - 2 - イルメチル、5 - ブロモ - 2 - メトキシベンジル、チオフェン 2 - カルボン酸エチルエステルおよびメトキシエチルから成る群から選択される請求項 17 に記載の化合物。

【請求項 19】

式 (I) で示され、式中、R3 が、水素、オキソ、- O - R'、- O - Ar、- O - CO - R'、ハロゲン、チオ、- S - R' および - S - Ar；ここで、R' は、水素または $C_1 \sim C_8$ アルキルを表し；

Ar は、ハロゲン、ヒドロキシおよびメトキシから成る群から選択される1個またはそれ以上の置換基によって任意に置換されているフェニルを表すから成る群から選択される請求項 7 ~ 18 のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項 20】

R3 が、水素、ヒドロキシル、オキソ、クロロ、ブロモ、フェノキシ、フェニルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオおよび - O - CO - $C_1 \sim C_4$ アルキルから成る群から選択される請求項 19 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 21】

R3 が、ヒドロキシル、オキソ、- O - CO - CH₃ および - S - エチルから成る群から選択される請求項 20 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 22】

R4 が、水素、ヒドロキシルによって任意に置換された $C_1 \sim C_8$ アルキル、- CO - R'、- CO - O - R'、ハロゲンおよびジハロゲン（ここで R' は水素または $C_1 \sim C_8$ アルキル）から成る群から選択される請求項 21 に記載の式 (I) の化合物。

ルキルを表す) から成る群から選択される請求項 7 ~ 2 1 のいずれか 1 つに記載の式 (I) の化合物。

【請求項 2 3】

R 4 が、水素、カルボニル、エトキシアシル、ブromo、ジブromo、クロロ、ジクロロ、ヒドロキシメチルおよびメチルから成る群から選択される請求項 2 2 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 2 4】

R 4 が、水素、ブromoおよびカルボニルから成る群から選択される請求項 2 3 に記載の式 (I) の化合物。

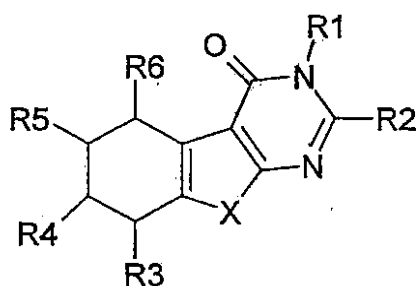
【請求項 2 5】

R 6 が水素である請求項 7 ~ 2 4 のいずれか 1 つに記載の式 (I) の化合物。

【請求項 2 6】

下記のように定義される請求項 8 に記載の式 (I) :

【化 5】



(I)

[式中、

X は、S、S O または S O₂ であり；

R 1 は、下記から成る群から選択され：

- ・ - C₁ ~ C₈ アルキル：該アルキルは、直鎖、環状または分岐鎖であってよい；
- ・ - C₁ ~ C₄ アルキル：該アルキルは、- O - R"、- O - A r、- O - C O - H e t A r、- C O - A r、- C O - O - R" および - N (R")₂ から成る群から個々に選択される 1 個または 2 個の置換基によって置換されている；
- ・ アリールおよびアリール - C₁ ~ C₄ アルキル：該アリール成分は、フェニル、インダニルおよびフルオレニルから成る群から選択され；該アルキル成分はヒドロキシル基によって任意に置換されていてよく；該アリール成分は、ハロゲン、- O - R"、- S O₂ - R"、- S O₂ - N (R")₂ から成る群から個々に選択される 3 個までの置換基によって任意に置換されていてよく；または、該アリールは、隣接炭素原子に結合し、一緒になって 2 個までの O 原子を任意に含有する飽和 5 または 6 員環系を形成する 2 個の基によって、任意に置換されていてよく；該環系は、オキソ基によって任意にさらに置換されていてよい；

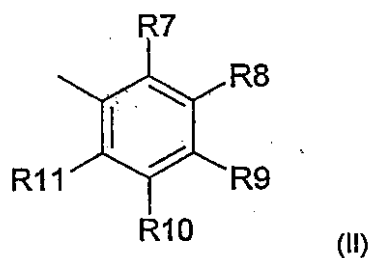
・ ヘテロアリールおよびヘテロアリール - C₁ ~ C₄ アルキル：該ヘテロアリール成分は、キノリニル、チアゾリル、ピリミジニル、フリル、ピリジニル、ピラジニルおよびチエニルから成る群から選択され；該ヘテロアリール基は、ハロゲン、- C₁ ~ C₄ アルキルおよび - C O - O - R" から成る群から個々に選択される 1 個または 2 個の置換基によって任意に置換されていてよい；

・ シクロヘテロアルキルおよびシクロヘテロアルキル - C₁ ~ C₄ アルキル：該シクロヘテロアルキル成分は、ピペリジニル、モルホリニル、ピロリジニル、テトラヒドロフリルおよびジオキソリルから成る群から選択され；該シクロヘテロアルキル成分は、オキソ、C₁ ~ C₄ アルキル、好ましくはメチル、および - C₁ ~ C₄ アルキル - A r、好ましくはベンジルまたはフェネチルから成る群から個々に選択される 2 個までの置換基によって任意に置換されていてよい；

R 2 は、下記から成る群から選択され：

i) 式 (II) :

【化 6】



[式中、

R 7 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシルまたは $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、好ましくはメトキシであり；

R 8 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、好ましくはメトキシ、ヒドロキシル、ニトリル、ハロゲンまたはハロゲン化 $C_1 \sim C_4$ アルキル、好ましくはトリフルオロメチルであり；

R 9 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、好ましくはメトキシ、ヒドロキシル、ニトリル、ハロゲンまたは N, N - ジ - $C_1 \sim C_4$ アルキル - スルホンアミドであり；

R 10 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、好ましくはメトキシ、ヒドロキシル、ニトリル、ハロゲンまたはハロゲン化 $C_1 \sim C_4$ アルキル、好ましくはトリフルオロメチルであり；

R 11 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシルまたは $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、好ましくはメトキシである] で示される残基；

および、ii)

- $C_1 \sim C_8$ アルキル：該アルキルは、直鎖、環状、分岐鎖または部分不飽和であってよい；

- $C_1 \sim C_4$ アルキル：該アルキルは、下記から成る群から選択される 1 個または 2 個の置換基によって置換されている：- CO - O - R"；- O - R"；- O - Ar（ここで、Ar はハロゲンによって任意に置換されているフェニルである）；- O - CO - R"；および、- フェニルまたはビフェニル（該フェニル成分において、3 個までの $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、好ましくはメトキシ基によって任意に置換されている）；

- CO - O - R"；

- CO - R"、好ましくは - CHO；

- ナフチル；および

- ヘテロアリール：該ヘテロアリールは、チエニル、フリル、ピリジニル、ベンゾチエニルおよびピラゾリルから成る群から選択され；該ヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_4$ アルキル、好ましくはトリフルオロメチル、フェニルおよびフェノキシから成る群から個々に選択される 1 個または 2 個の置換基によって任意に置換されていてよく；該フェニル基は、3 個までのハロゲンによって任意に置換されていてよい；

R 3 は、水素、オキソ、- O - R"、- O - Ar、- O - CO - R"、ハロゲン、チオ、- S - R"および - S - Ar から成る群から選択され；

R 4 は、水素、ヒドロキシルによって任意に置換された $C_1 \sim C_4$ アルキル、- CO - R"、- CO - O - R"、ハロゲンおよびジハロゲンから成る群から選択され；

ここで、

Ar は、ハロゲン、ヒドロキシルまたはメトキシから成る群から選択される 1 個またはそれ以上の置換基によって任意に置換されたフェニルを表し；

HetAr は、チエニル、フリル、ピリジニルを表し；

R" は、水素または $C_1 \sim C_4$ アルキル、好ましくはメチルまたはエチルを表す] の新規化合物。

【請求項 27】

式 (I) で示され、式中、

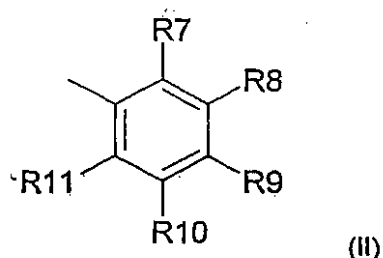
R 1 は、下記から成る群から選択され：

- ・ - C₃ ~ C₈アルキル：該アルキルは、直鎖、環状または分岐鎖であってよい；
- ・ - C₁ ~ C₄アルキル：該アルキルは、C₁ ~ C₄アルコキシ、ヒドロキシルおよび - O - C O - H e t A r から成る群から個々に選択される 1 個または 2 個の置換基によって置換されている；
- ・ フェニル - C₁ ~ C₄アルキル：該アリール成分は、ハロゲン、C₁ ~ C₄アルコキシおよびヒドロキシルから成る群から個々に選択される 3 個までの置換基によって任意に置換されていてよい；
- ・ ヘテロアリール - C₁ ~ C₄アルキル：該ヘテロアリール成分は、ピリミジニル、フリル、ピリジニルおよびチエニルから成る群から選択され；該ヘテロアリール基は、ハロゲン、C₁ ~ C₄アルコキシおよびヒドロキシルから成る群から個々に選択される 1 個または 2 個の置換基によって任意に置換されていてよい；
- ・ シクロヘテロアルキル - C₁ ~ C₄アルキル：該シクロヘテロアルキル成分は、テトラヒドロフリル、ピペリジニル、モルホリニルおよびピロリジニルから成る群から選択される；

R 2 は、下記から成る群から選択され：

i) 式 (I I)：

【化 7】



[式中、

R 7 は、水素、ブロモ、クロロまたはフルオロであり；

R 8 は、水素、C₁ ~ C₄アルコキシ、好ましくはメトキシ、またはヒドロキシルであり；

R 9 は、水素、C₁ ~ C₄アルコキシ、好ましくはメトキシ、またはヒドロキシルであり；

R 1 0 は、水素、C₁ ~ C₄アルコキシ、好ましくはメトキシ、またはヒドロキシルであり；

R 1 1 は、水素である] で示される残基；

および、i i)

・ - C₃ ~ C₆アルキル：該アルキルは、直鎖、環状または分岐鎖あつてよく、- O - C O - (C₁ ~ C₄) アルキルまたは - C O - O - (C₁ ~ C₄) アルキル基によって任意に置換されている；

・ - ヘテロアリール：該ヘテロアリールは、チエニル、フリル、ピリジニル、ベンゾチエニルおよびピラゾリルから成る群から選択しうる；

R 3 は、水素、オキソ、ヒドロキシル、C₁ ~ C₄アルコキシ、- O - C O - C₁ ~ C₄アルキルおよび C₁ ~ C₄アルキルチオから成る群から選択され；

R 4 は、水素、ハロゲン、カルボニル、- C O - C₁ ~ C₄アルキルから成る群から選択され；

R 6 は、水素またはブロモである、請求項 2 6 に記載の新規化合物。

【請求項 2 8】

式 (I) で示され、式中、

R 1 は、イソブチル、3 - メチルブチル、ベンジル、テトラヒドロフリルメチル、フリ

ルメチル、5 - プロモ - フラン - 2 - イルメチル、5 - プロモ - 2 - メトキシベンジル、チオフェン - 2 - カルボン酸エチルエステルおよびメトキシエチルから成る群から選択され；

R 2 は、メトキシフェニル、トリメトキシフェニル、2 - プロモ - 3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル、2 - クロロ - 3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル、チエニルおよびプロピルから成る群から選択され；

R 3 は、ヒドロキシル、オキソ、 $-O-CO-CH_3$ および $-S-$ エチルから成る群から選択され；

R 4 は、水素、プロモおよびカルボニルから成る群から選択され；

R 6 は、水素またはプロモである、請求項 27 に記載の新規化合物。

【請求項 29】

式 (I) で示され、式中、

R 1 は、直鎖、環状または分岐鎖 - $C_3 \sim C_8$ アルキルであり；

R 2 は、トリメトキシフェニル、2 - プロモ - 3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニルまたは 2 - クロロ - 3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニルであり；

R 3 は、水素またはヒドロキシルであり；

R 4 は、水素であり；

R 6 は、水素またはプロモであり；

炭化水素鎖 - $C(R3) - C(R4) - C(R5) - C(R6) -$ を含有する 6 員環が芳香環である、請求項 27 に記載の新規化合物。

【請求項 30】

X が S を表す請求項 7 ~ 29 のいずれか 1 つに記載の式 (I) の化合物。

【請求項 31】

式 (I) で示され、式中、

3 - ベンジル - 8 - エチルスルファニル - 2 - (p - メトキシフェニル) - 4 - オキソ - 3 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 - カルボアルデヒド；

3 - ベンジル - 2 - (p - メトキシフェニル) - 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 - カルボアルデヒド；

3 - ベンジル - 8 - エチルスルファニル - 2 - (p - メトキシフェニル) - 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 - カルボアルデヒド；

3 - ベンジル - 8 - ヒドロキシ - 2 - チオフェン - 2 - イル - 3 H - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - オン；

チオフェン - 2 - カルボン酸 2 - (8 - ヒドロキシ - 4 - オキソ - 2 - チオフェン - 2 - イル - 4 H - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 3 - イル) - エチルエステル；

3 - ブチル - 8 - ヒドロキシ - 2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル) - 3 H - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - オン；

3 - ベンジル - 3 - (5 - プロモ - 2 - メトキシベンジル) - 8 - ヒドロキシ - 2 - プロピル - 3 H - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - オン；

酢酸 3 - ベンジル - 3 - (5 - プロモ - 2 - メトキシベンジル) - 4 - オキソ - 2 - プロピル - 3 , 4 - ジヒドロ - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 8 - イルエステル；

3 - (5 - プロモフラン - 2 - イルメチル) - 8 - ヒドロキシ - 2 - プロピル - 3 H - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - オン；

酢酸 3 - (5 - プロモフラン - 2 - イルメチル) - 4 - オキソ - 2 - プロピル - 3 , 4 - ジヒドロ - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 8 - イルエステル；

8 - ヒドロキシ - 3 - イソブチル - 2 - (2 - プロモ - 3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル) - 3 H - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - オン；

3 - ベンジル - 2 - (2 - クロロ - 3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル) - 8 - ヒドロキシ - 3 H - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - オン ;

7 - プロモ - 3 - (2 - メチルブチル) - 2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 3 H , 5 H - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 , 8 - ジオン ;

8 - ヒドロキシ - 3 - (2 - メチルブチル) - 2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル) - 3 H - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - オン ;

5 - プロモ - 3 - イソブチル - 2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 3 H , 5 H - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 , 8 - ジオン ;

2 - (2 - クロロ - 3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル) - 8 - ヒドロキシ - 3 - (テトラヒドロフラン - 2 - イルメチル) - 3 H - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - オン ;

2 - (2 - クロロ - 3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル) - 8 - ヒドロキシ - 3 - (2 - メチルブチル) - 3 H - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - オン ;

7 - プロモ - 8 - ヒドロキシ - 3 - (2 - メトキシエチル) - 2 - チオフェン - 2 - イル - 3 H - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - オン ;

3 - ブチル - 8 - ヒドロキシ - 2 - (2 - メトキシ - フェニル) - 3 H - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - オン ; および

3 - ブチル - 2 - (2 , 4 - ジフルオロ - フェニル) - 8 - ヒドロキシ - 3 H - ベンゾ [4 , 5] チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - オン ;

またはそれらの生理学的に許容される塩

から成る群から選択される請求項 7 に記載の新規化合物。

【請求項 3 2】

活性剤として、請求項 7 から 3 1 までの何れか 1 項に記載の式 (I I) の化合物の少なくとも 1 つ、および、少なくとも 1 つの製剤学的に認容性の担体を含むステロイドホルモン依存性疾患または障害の治療または予防のための医薬組成物。

【請求項 3 3】

上記ステロイドホルモン依存性疾患または障害が、17 - ヒドロキシステロイドデヒドロゲナ - ゼ酵素、好ましくは、17 - HSD タイプ 1、17 - HSD タイプ 2 または 17 - HSD タイプ 3 の抑制を必要とする疾患または障害である、請求項 3 2 記載の医薬組成物。

【請求項 3 4】

上記ステロイドホルモン依存性疾患または障害が、乳がん、前立腺がん腫、卵巣がん、子宮がん、子宮内膜がん、子宮内膜肥厚化、子宮内膜症、子宮平滑筋腫、子宮腺筋症、月経困難症、月経過多、不正子宮出血、プロスタジニア、良性前立腺肥大症、前立腺炎、アクネ、脂漏症、男性型多毛症、アンドロゲン脱毛症、性早熟症、腎臓肥大、多嚢胞卵巣症候群、尿機能障、骨粗頽A多発性硬化症、関節リウマチ、アルツハイマー病、結腸がん、組織損傷、皮膚の皺および白内障からなる群から選択される、請求項 3 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 5】

精子形成阻害用の又は男性用避妊薬としての、請求項 3 2 に記載の医薬組成物。