

【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	

## 【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

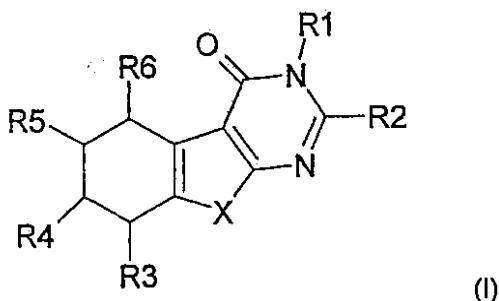
## 【補正の内容】

【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-HSD1型、17-HSD2型または17-HSD3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】



## [式中：

Xは、S、SOまたはSO<sub>2</sub>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、

R1およびR2は、下記から成る群から個々に選択される：

・ -C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>アルコキシ、チオール、C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>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)<sub>2</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>アルコキシ、ニトロ、ニトリル、C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>アルキル、ハロゲン化C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>アルキル、-SO<sub>2</sub>-N(R)<sub>2</sub>およびC<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>アルキル、ハロゲン化C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>アルキル、ヒドロキシル、C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>アルコキシおよびアリール-C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>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)<sub>2</sub>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)<sub>2</sub>、-O-CO-R、-O-R、-S-R、-N(R)<sub>2</sub>、-C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>アルコキシ、チオールおよび-N(R)<sub>2</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>アルキル、フェニル-C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>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、卵巣癌、子宮癌、子宮体癌および子宮内膜増殖症、子宮内膜症、子宮類線維腫、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、多囊胞性卵巣症候群、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。

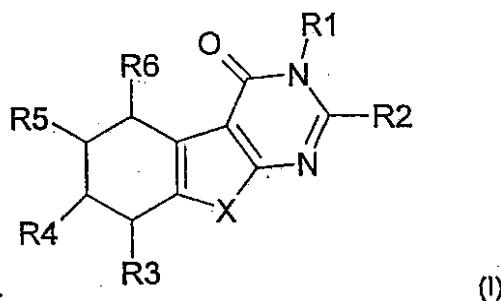
#### 【請求項4】

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  $SO_2$  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 - 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<sub>2</sub>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<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>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<sub>3</sub>、R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> が共に水素を表し、R<sub>4</sub> が水素またはメチルを表す場合、R<sub>2</sub> 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：

R6 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<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> が共に水素である場合、炭化水素鎖 - C(R)

3) - C (R<sub>4</sub>) - C (R<sub>5</sub>) - C (R<sub>6</sub>) - 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、

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は、下記から成る群から個々に選択される：

・ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> 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<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> アルコキシ、チオール、C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> 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)<sub>2</sub> 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<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> 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<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> アルコキシ、ニトロ、ニトリル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキル、ハロゲン化 C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキル、- SO<sub>2</sub> - N (R)<sub>2</sub> および C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> 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<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> 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<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキル、ハロゲン化 C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> 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<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> 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<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキル、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> アルコキシおよびアリール - C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> 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<sub>2</sub> は、独立して、- CO - R、- CO - O - R または - CO - N (R)<sub>2</sub> から選択してもよい；

R<sub>3</sub> および R<sub>4</sub> 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)<sub>2</sub>、- O - CO - R、- O - R、- S - R、- N (R)<sub>2</sub>、- C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> 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<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> アルコキシ、チオールおよび - N (R)<sub>2</sub> 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；

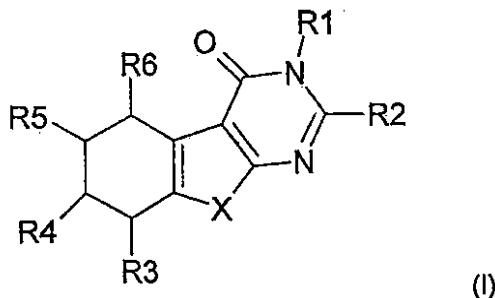
ここで、R は、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキル、フェニル - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルまたはフェニ

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<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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】



[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、R<sub>2</sub>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<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>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<sub>3</sub>、R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> が共に水素を表し、R<sub>4</sub> が水素またはメチルを表す場合、R<sub>2</sub> 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<sub>6</sub> 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<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>が共に水素である場合、炭化水素鎖 - C ( R<sub>3</sub> ) - C ( R<sub>4</sub> ) - C ( R<sub>5</sub> ) - C ( R<sub>6</sub> ) - 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 - t e r t - プチル - 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 - t e r t - プチル - 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<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>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<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルコキシ、チオール、C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>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)<sub>2</sub>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<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>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<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルコキシ、ニトロ、ニトリル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキル、ハロゲン化C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキル、- SO<sub>2</sub> - N(R)<sub>2</sub>およびC<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>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<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>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<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキル、ハロゲン化C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>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<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>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<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキル、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルコキシおよびアリール - C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>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<sub>2</sub>は、独立して、- CO - R、- CO - O - Rまたは- CO - N(R)<sub>2</sub>から選択してもよい；

R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>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)<sub>2</sub>、- O - CO - R、- O - R、- S - R、- N(R)<sub>2</sub>、- C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>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<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルコキシ、チオールおよび-N(R)<sub>2</sub>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<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキル、フェニル - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>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<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>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<sub>3</sub>) - C(R<sub>4</sub>) - C(R<sub>5</sub>) - C(R<sub>6</sub>) - 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 (R<sub>3</sub>) - C (R<sub>4</sub>) - C (R<sub>5</sub>) - C (R<sub>6</sub>) - を含有する 6 員環が芳香環ではなく、置換基 R<sub>3</sub> ~ R<sub>6</sub> 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、R<sub>2</sub> が、

・ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> 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つてよく、ヒドロキシリル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシ、チオール、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルチオ、アリールオキシ、- CO - O - C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> 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 - C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> 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；該アリール成分は、ハロゲン、ヒドロキシリル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシ、ニトロ、ニトリル、ハロゲン化 C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、- SO<sub>2</sub> - N (R')<sub>2</sub> 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 - C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> 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<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、ハロゲン化 C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> 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')<sub>2</sub> ； および

・ - CO - O - R' ；

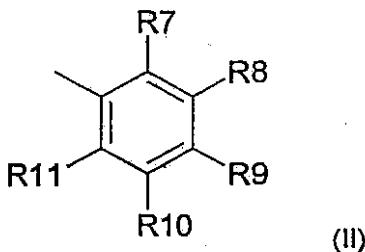
ここで、R' は、水素または C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルを表す、請求項 7 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。：

【請求項 12】

式 (I) で示され、式中、R<sub>2</sub> が、

i) 式 (II) ；

【化 4】



[式中、

R<sub>7</sub> は、水素、ハロゲン、ヒドロキシリルまたは C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルコキシ、好ましくはメトキシであり；

R<sub>8</sub> は、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルコキシ、好ましくはメトキシ、ヒドロキシリル、ニトリル、ハロゲンまたはハロゲン化 C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、好ましくはトリフルオロメチルであり；

R<sub>9</sub> は、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルコキシ、好ましくはメトキシ、ヒドロキシリル、ニトリル、ハロゲンまたは N, N - ジ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル - スルホンアミドであり；

R 10 は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、好ましくはトリフルオロメチルである；

R 11 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、ハロゲン化C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、好ましくはメチルまたはエチルを表す請求項10に記載の化合物。

### 【請求項13】

式(I)で示され、式中、R2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-ジプロピルスルホニアミド、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、ブロモチエニル、1-フェニル-5-トリフルオロメチル-4H-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12に記載の化合物。

### 【請求項14】

R2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13に記載の式(I)の化合物。

### 【請求項15】

式(I)で示され、式中、R1が、

- C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシ、チオール、-NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルチ

オ、アリールオキシ、アリールアシル、-CO-O-C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル：該アリール成分は、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<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、-SO<sub>2</sub>-N(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、ハロゲン化C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルおよび-CO-O-C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、ヒドロキシル、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルコキシおよびアリール-C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル：該アルキルは、-O-R"、-O-Ar、-O-CO-He  
 tAr、-CO-Ar、-CO-O-R"および-N(R")<sub>2</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>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<sub>2</sub>-R"、-SO<sub>2</sub>-N(R")<sub>2</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>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；

Het Ar 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 1-5 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-プロモ-2-メトキシベンジル、5-プロモ-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、プロモ-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 1-6 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-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る請求項 1-7 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、プロモ、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 1-9 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-CH<sub>3</sub> および -S-エチルから成る群から選択される請求項 2-0 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

ルキルを表す)から成る群から選択される請求項7~21のいずれか1つに記載の式(I)の化合物。

【請求項23】

R4が、水素、カルボニル、エトキシアシル、プロモ、ジプロモ、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22に記載の式(I)の化合物。

【請求項24】

R4が、水素、プロモおよびカルボニルから成る群から選択される請求項23に記載の式(I)の化合物。

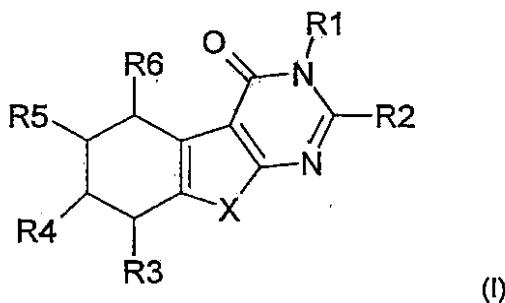
【請求項25】

R6が水素である請求項7~24のいずれか1つに記載の式(I)の化合物。

【請求項26】

下記のように定義される請求項8に記載の式(I):

【化5】



[式中、

Xは、S、SOまたはSO<sub>2</sub>であり;

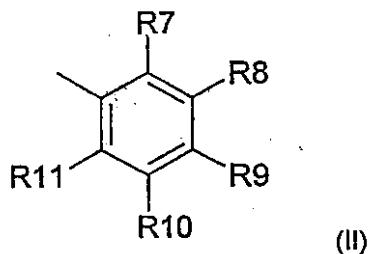
R1は、下記から成る群から選択され:

- ・ -C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル: 該アルキルは、直鎖、環状または分岐鎖であつてよい;
- ・ -C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル: 該アルキルは、-O-R"、-O-Ar、-O-CO-HeAr、-CO-Ar、-CO-O-R"および-N(R")<sub>2</sub>から成る群から個々に選択される1個または2個の置換基によつて置換されている;
- ・ アリールおよびアリール-C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>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つ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<sub>2</sub>-R"、-SO<sub>2</sub>-N(R")<sub>2</sub>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つ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、一緒になつて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個の基によつて、任意に置換されていてよく; 該環系は、オキソ基によつ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<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>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個の置換基によつ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<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、好ましくはメチル、および-C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>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つて任意に置換されていてよい;

R2は、下記から成る群から選択され:

i) 式(II) :

【化6】



[式中、

R7は、水素、ハロゲン、ヒドロキシルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、好ましくはメトキシであり；

R8は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル-スルホニアミドであり；

R10は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、好ましくはトリフルオロメチルであり；

R11は、水素、ハロゲン、ヒドロキシルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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、i i )

- C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、ハロゲン化C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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；

R3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；

R4は、水素、ヒドロキシルによって任意に置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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、

R1は、下記から成る群から選択され：

・ -C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>アルキル：該アルキルは、直鎖、環状または分岐鎖であつてよい；

・ -C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル：該アルキルは、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、ヒドロキシルおよび-O-CO-HまたはAr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-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル：該アリール成分は、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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；

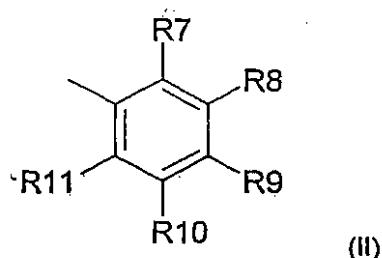
・ ヘテロアリール-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル：該ヘテロアリール成分は、ピリミジニル、フリル、ピリジニルおよびチエニルから成る群から選択され；該ヘテロアリール基は、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシおよびヒドロキシルから成る群から個々に選択される1個または2個の置換基によって任意に置換されていてよい；

・ シクロヘテロアルキル-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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；

R2は、下記から成る群から選択され：

i) 式(II)：

【化7】



[式中、

R7は、水素、ブロモ、クロロまたはフルオロであり；

R8は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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；

R9は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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；

R10は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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；

R11は、水素である]で示される残基；

および、i i)

・ -C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>アルキル：該アルキルは、直鎖、環状または分岐鎖あってよく、-O-CO-(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>)アルキルまたは-CO-O-(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>)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；

R3は、水素、オキソ、ヒドロキシル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、-O-CO-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルチオから成る群から選択され；

R4は、水素、ハロゲン、カルボニル、-CO-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルから成る群から選択され；

R6は、水素またはブロモである、請求項26に記載の新規化合物。

【請求項28】

式(I)で示され、式中、

R1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-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；

R<sub>2</sub>は、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、チエニルおよびプロピルから成る群から選択され；

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

R<sub>4</sub>は、水素、ブロモおよびカルボニルから成る群から選択され；

R<sub>6</sub>は、水素またはブロモである、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<sub>1</sub>は、直鎖、環状または分岐鎖-C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>アルキルであり；

R<sub>2</sub>は、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または2-クロロ-3,4,5-トリメトキシフェニルであり；

R<sub>3</sub>は、水素またはヒドロキシルであり；

R<sub>4</sub>は、水素であり；

R<sub>6</sub>は、水素またはブロモであり；

炭化水素鎖-C(R<sub>3</sub>)-C(R<sub>4</sub>)-C(R<sub>5</sub>)-C(R<sub>6</sub>)-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-3H-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-4H-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)-3H-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-ブロモ-2-メトキシベンジル)-8-ヒドロキシ-2-ブロピル-3H-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-ブロモ-2-メトキシベンジル)-4-オキソ-2-ブロピル-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-ブロモフラン-2-イルメチル)-8-ヒドロキシ-2-ブロピル-3H-ベンゾ[4,5]チエノ[2,3-d]ピリミジン-4-オン；

酢酸3-(5-ブロモフラン-2-イルメチル)-4-オキソ-2-ブロピル-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-ブロモ-3,4,5-トリメトキシフェニル)-3H-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 - ブロモ - 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 - ブロモ - 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 - ブロモ - 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 - H S D タイプ 1 、17 - H S D タイプ 2 または 17 - H S D 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、アケネ、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、多囊胞卵巣症候群、尿機能障、骨粗頑 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。