

【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7月20日(2006.7.20)

【公表番号】特表2002-543186(P2002-543186A)

【公表日】平成14年12月17日(2002.12.17)

【出願番号】特願2000-615390(P2000-615390)

【国際特許分類】

C 07 D 211/58	(2006.01)
A 61 K 31/4468	(2006.01)
A 61 K 31/454	(2006.01)
A 61 K 31/497	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
A 61 P 1/00	(2006.01)
A 61 P 11/06	(2006.01)
A 61 P 17/00	(2006.01)
A 61 P 17/06	(2006.01)
A 61 P 19/02	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 31/18	(2006.01)
A 61 P 37/00	(2006.01)
A 61 P 37/08	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
C 07 D 405/14	(2006.01)
C 07 D 413/14	(2006.01)
C 07 D 417/14	(2006.01)

【F I】

C 07 D 211/58	
A 61 K 31/4468	
A 61 K 31/454	
A 61 K 31/497	
A 61 K 31/506	
A 61 P 1/00	
A 61 P 11/06	
A 61 P 17/00	
A 61 P 17/06	
A 61 P 19/02	
A 61 P 29/00	1 0 1
A 61 P 31/18	
A 61 P 37/00	
A 61 P 37/08	
C 07 D 401/14	
C 07 D 405/14	
C 07 D 413/14	
C 07 D 417/14	

【誤訳訂正書】

【提出日】平成18年5月31日(2006.5.31)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】特許請求の範囲

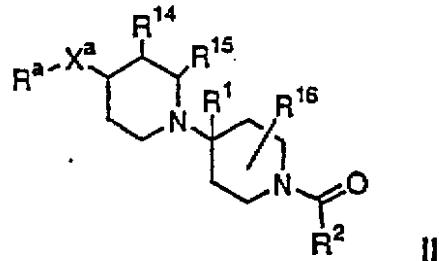
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

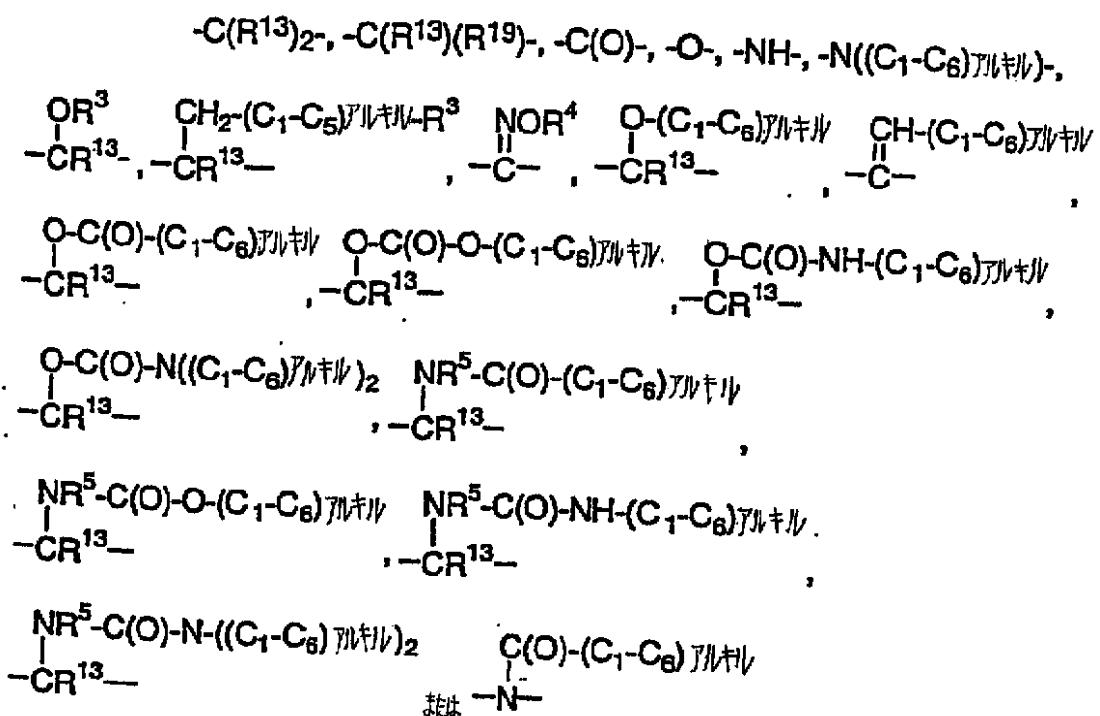
【請求項 1】 以下の構造式 I I :

【化 1】



によって表される化合物、またはその薬学的に受容可能な塩であって、ここで
(1) X^a は、以下：

【化 2】



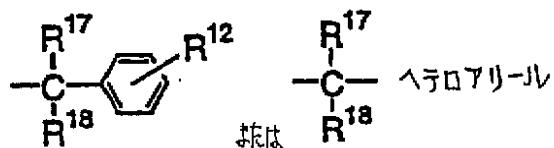
であり；

R^a は、R^{6a} - フェニル、R^{6a} - ピリジル、R^{6a} - チオフェニルまたはR⁶ - ナフチルであり；

R¹ は、水素、C₁ - C₆ アルキルまたはC₂ - C₆ アルケニルであり；

R² は、R⁷、R⁸、R⁹ - フェニル；R⁷、R⁸、R⁹ - 置換6員ヘテロアリール；R⁷、R⁸、R⁹ - 置換6員ヘテロアリールN - オキシド；R¹⁰、R¹¹ - 置換5員ヘテロアリール；ナフチル；フルオレニル；ジフェニルメチル

【化 3】



であり；

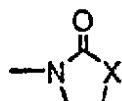
R^3 は、 R^{10} - フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピラジニルまたはチアゾリルであり；

R^4 は、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、フルオロ - $C_1 - C_6$ アルキル、シクロプロピルメチル、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2-O-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-CH_2C(O)-O-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-CH_2C(O)NH_2$ 、 $-CH_2C(O)-NH-(C_1 - C_6)$ アルキルまたは $-CH_2C(O)-N-(C_1 - C_6)$ アルキル $_2$ であり；

R^5 および R^{11} は、水素および $(C_1 - C_6)$ アルキルからなる群から独立して選択され；

R^6^a は、水素、ハロゲン、 $-CF_3$ 、 CF_3O- 、 $-CN$ 、 $-CF_3SO_2-$ 、 R^{12} - フェニル、 $-NHCOCF_3$ 、5 - 頁ヘテロアリールおよび

【化4】



からなる群から独立して選択される1~3個の置換基であり、ここで、Xは、 $-O-$ 、 $-NH-$ または $-N(CH_3)-$ であり；

R^6 は、 R^6^a および CH_3SO_2- からなる群から独立して選択され；

R^7 および R^8 は、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、ハロゲン、 $-NR^{20}R^{21}$ 、 $-OR$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCH_3$ 、 $-O-$ アシル、および $-OCF_3$ からなる群から独立して選択され；

R^9 は、 R^7 、水素、フェニル、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CH=NOR^{20}$ 、ピリジル、ピリジルN - オキシド、ピリミジニル、ピラジニル、 $-N(R^{20})CONR^{21}R^{22}$ 、 $-NHCONH$ (クロロ - $(C_1 - C_6)$ アルキル)、 $-NHCONH((C_3 - C_1)_0)$ - シクロアルキル ($C_1 - C_6$) アルキル)、 $-NHCO(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-NHCOCF_3$ 、 $-NHSO_2N((C_1 - C_6)_2$) アルキル)、 $-NHCO_2(C_1 - C_6)$ アルキル、 $C_3 - C_1_0$ シクロアルキル、 $-SR^{23}$ 、 $-SOR^{23}$ 、 $-SO_2R^{23}$ 、 $-SO_2NH(C_1 - C_6)$ アルキル)、 $-OSO_2(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-OSO_2CF_3$ 、ヒドロキシ ($C_1 - C_6$) アルキル、 $-CONR^0R^{21}$ 、 $-CON(CH_2CH_2-O-CH_3)_2$ 、 $-OCONH(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-CO_2R^{20}$ 、 $-Si(CH_3)_3$ または $-B(OC(CH_3)_2)_2$ であり；

R^{10} は、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-NH_2$ または R^{12} - フェニルであり；

R^{12} は、水素、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-CF_3$ 、 $-CO_2R^{20}$ 、 $-CN$ 、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシおよびハロゲンならなる群から独立して選択される、1~3個の置換基であり；

R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} および R^{16} は、水素および $(C_1 - C_6)$ アルキルからなる群から独立して選択され；

R^{17} および R^{18} は、水素および $C_1 - C_6$ アルキルからなる群から独立して選択されるか、または R^{17} および R^{18} は、一緒になつて $C_2 - C_5$ アルキレン基となり、そして該 R^{17} および R^{18} に結合する炭素は、3~6個の炭素原子のスピロ環を形成

し；

R^{1-9} は、 R^6 - フェニル、 R^6 - ヘテロアリール、 R^6 - ナフチル、 C_3-C_1 シクロアルキル、 (C_3-C_{10}) シクロアルキル (C_1-C_6) アルキルまたは (C_1-C_6) アルコキシ (C_1-C_6) アルキルであり；

R^{20} 、 R^{21} および R^{22} は、 H および C_1-C_6 アルキルからなる群から独立して選択され；そして

R^{23} は、 C_1-C_6 アルキルまたはフェニルであるか、あるいは
(2) X^a は、

【化5】

$-C(R^{13})(R^{19})-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-N((C_1-C_6)アルキル)-$ 、

OR^3 、 $CH_2-(C_1-C_5)アルキルR^3$ 、 NOR^{4a} 、 $O-C(O)-(C_1-C_6)アルキル$
 $-CR^{13}-$ 、 $-CR^{13}-$ 、 $-C-$ 、 $-CR^{13}-$

$O-C(O)-(C_1-C_6)アルキル$ 、 $O-C(O)-NH-(C_1-C_6)アルキル$
 $-CR^{13}-$ 、 $-CR^{13}-$ 、

$O-C(O)-N((C_1-C_6)アルキル)_2$ 、 $NR^5-C(O)-(C_1-C_6)アルキル$
 $-CR^{13}-$ 、 $-CR^{13}-$ 、

$NR^5-C(O)-O-(C_1-C_6)アルキル$ 、 $NR^5-C(O)-NH-(C_1-C_6)アルキル$
 $-CR^{13}-$ 、 $-CR^{13}-$ 、

$NR^5-C(O)-N((C_1-C_6)アルキル)_2$ 、 $C(O)-(C_1-C_6)アルキル$
 $-CR^{13}-$ 、
または $-N-$

R^a は、 R^{6b} - フェニル、 R^{6b} - ピリジルまたは R^{6b} - チオフェニルであり

；

R^{4a} は、 フルオロ - C_1-C_6 アルキル、 シクロプロピルメチル、 $-CH_2-CH_2-OH$ 、 $-CH_2-CH_2-O-(C_1-C_6)$ アルキル、 $-CH_2-C(O)-O-(C_1-C_6)$ アルキル、 $-CH_2-C(O)NH_2$ 、 $-CH_2-C(O)-NH-(C_1-C_6)$ アルキルまたは $-CH_2-C(O)-N((C_1-C_6)アルキル)_2$ であり；

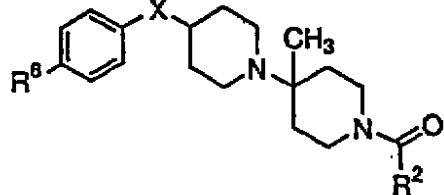
R^{6b} は、 CH_3SO_2 であり；そして

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} および R^{19} は、 (1) に定義される通りである、

化合物。

【請求項2】 以下の式：

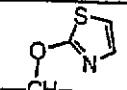
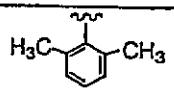
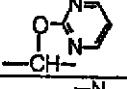
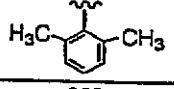
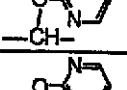
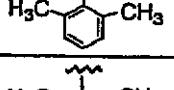
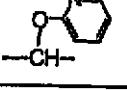
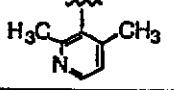
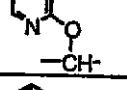
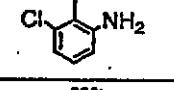
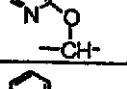
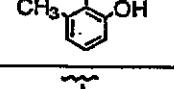
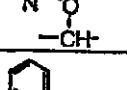
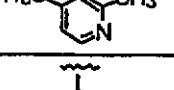
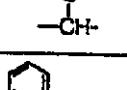
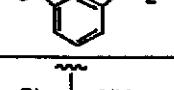
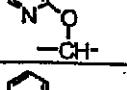
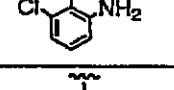
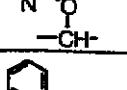
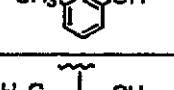
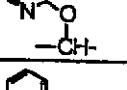
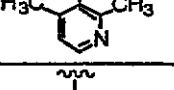
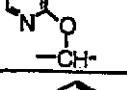
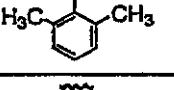
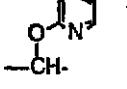
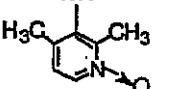
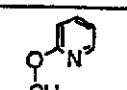
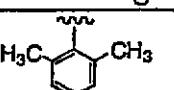
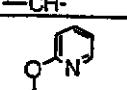
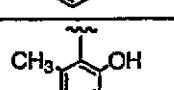
【化6】

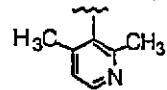
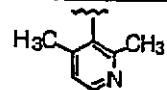
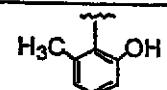
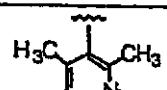
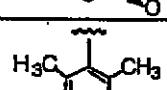
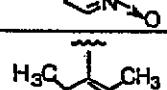
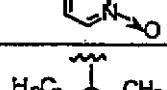
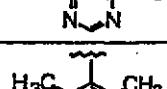
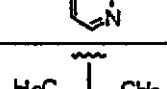
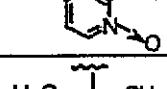
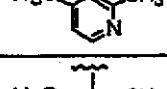
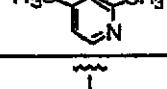
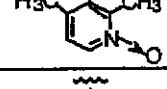
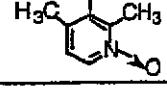
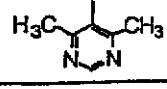


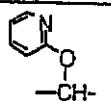
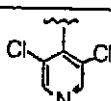
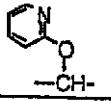
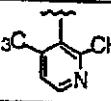
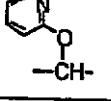
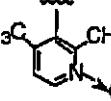
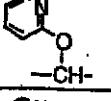
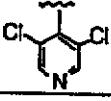
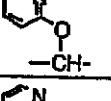
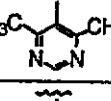
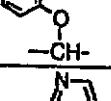
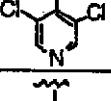
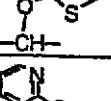
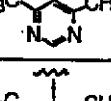
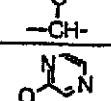
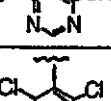
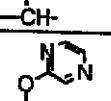
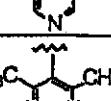
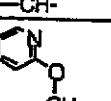
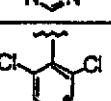
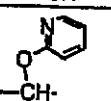
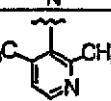
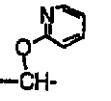
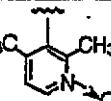
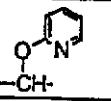
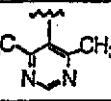
によって表される化合物からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物であって、ここで R^6 、 X および R^2 は、以下の表：

【表 1】

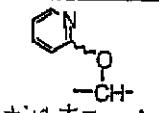
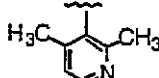
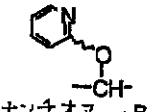
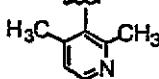
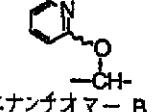
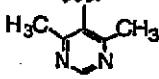
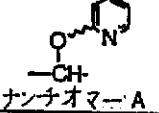
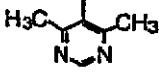
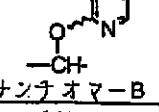
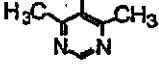
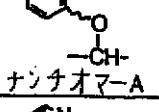
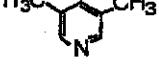
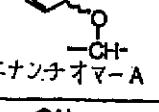
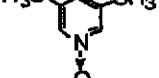
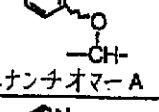
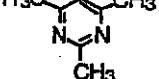
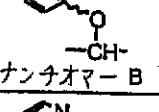
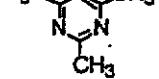
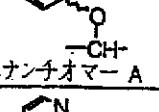
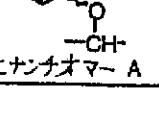
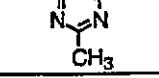
R^6	X	R^2
Br	$\begin{array}{c} \text{OCH}_2\text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}- \end{array}$	
Br	$\begin{array}{c} \text{OCOCH}_2\text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}- \end{array}$	
Br	$\begin{array}{c} \text{OCOOCH}_3 \\ \\ -\text{CH}- \end{array}$	
Br	$\begin{array}{c} \text{OCOCH}_3 \\ \\ -\text{CH}- \end{array}$	
Br	$\begin{array}{c} \text{OCONHCH}_3 \\ \\ -\text{CH}- \end{array}$	
Br	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{N} \\ \text{O} \\ \\ -\text{CH}- \end{array}$	
Br	$\begin{array}{c} \text{OCOCH}_2\text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}- \end{array}$	
Br	$\begin{array}{c} \text{OCOCH}_3 \\ \\ -\text{CH}- \end{array}$	
Br	$\begin{array}{c} \text{OCO}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}- \end{array}$	
Br	$\begin{array}{c} \text{OCOCH}_2\text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}- \end{array}$	

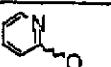
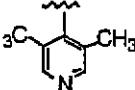
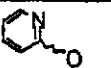
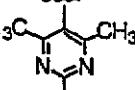
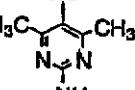
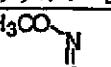
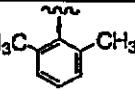
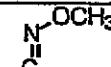
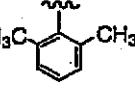
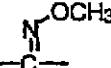
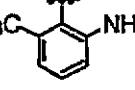
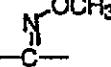
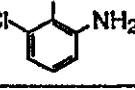
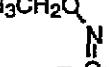
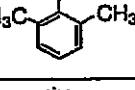
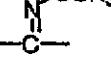
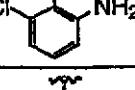
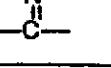
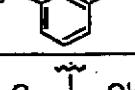
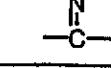
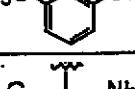
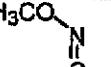
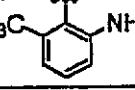
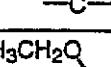
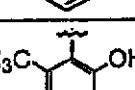
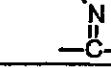
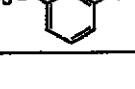
Br		
Br		
Br		
CH_3SO_2^-		
Br		
Br		
Br		
Br		
H_3CSO_2^-		
H_3CSO_2^-		
$\text{F}_3\text{C}-$		
H_3CSO_2^-		
H_3CSO_2^-		
$\text{F}_3\text{CO}-$		
$\text{F}_3\text{CO}-$		

F_3CO^-		
Br		
Br		
F_3CO^-		
Br		
Br		
H_3CSO_2^-		
H_3CSO_2^-		
H_3CSO_2^-		
H_3CSO_2^-		
H_3CSO_2^-		
H_3CSO_2^-		
H_3CSO_2^-		
F_3C^-		
F_3CO^-		

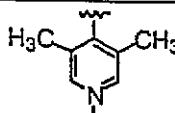
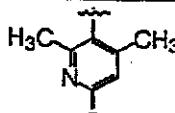
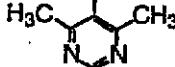
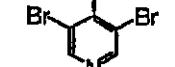
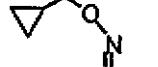
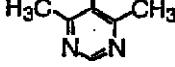
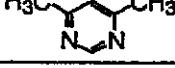
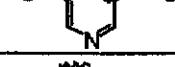
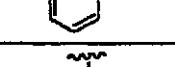
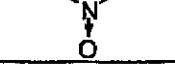
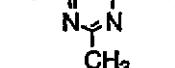
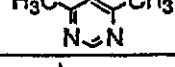
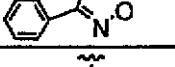
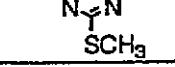
$\text{F}_3\text{CO}-$		
Cl		
Cl		
Cl		
Cl		
Br		
H_3CSO_2^-		
$\text{F}_3\text{C}-$		
H_3CSO_2^-		
H_3CSO_2^-		
$\text{F}_3\text{C}-$		
F		
F		
F		

Cl		
F		
Br		
F ₃ C-		
F ₃ C-		
F ₃ C-		
F		
Br		
Br		
エナンチオマー A		

Br	 エナンチオマー-A	
Br	 エナンチオマー-B	
Br	 エナンチオマー-B	
F ₃ CO-	 エナンチオマー-A	
F ₃ CO-	 エナンチオマー-B	
F ₃ CO-	 エナンチオマー-A	
F ₃ CO-	 エナンチオマー-A	
F ₃ CO-	 エナンチオマー-A	
F ₃ CO-	 エナンチオマー-B	
Cl	 エナンチオマー-A	
Cl	 エナンチオマー-A	

Cl	 エナンチオマー B	
Cl	 エナンチオマー B	
F ₃ CO ⁻	 エナンチオマー B	
Br	 Z-異性体	
Br	 E-異性体	
Br	 混合物E/Z	
Br	 混合物E/Z	
Br		
Br		
Br		
Br		
Br		
Br		
Br		

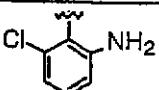
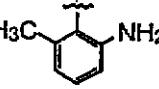
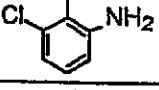
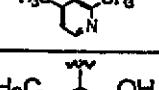
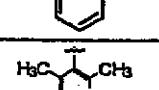
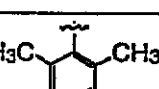
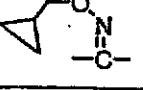
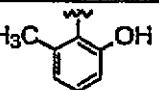
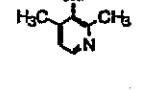
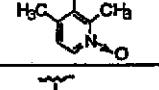
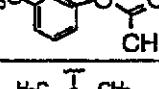
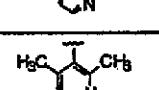
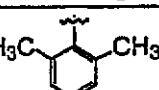
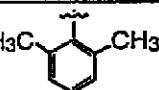
Br	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$ N —C—	
Br	H_3CO N —C—	
Br	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$ N —C—	
Br	H_3CO N —C—	
Br	OCH_2CH_3 N —C—	
Br	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$ N —C—	
Br	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$ N —C—	
Br	$\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ N —C—	
Br	$\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ N —C—	
Br	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$ N —C—	
Br	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$ N —C—	
Br	H_3CO N —C—	
Br	$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_2\text{O}$ N —C—	
Br	$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_2\text{O}$ N —C—	

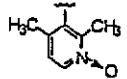
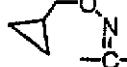
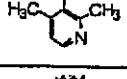
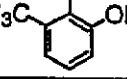
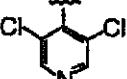
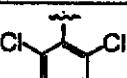
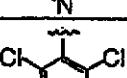
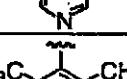
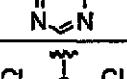
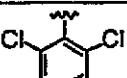
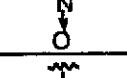
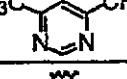
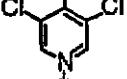
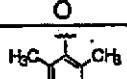
Br	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
Br	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
Br	$\text{H}_3\text{C}-\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
Br	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
Br		
Br	$\text{H}_3\text{C}-\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
Br	$\text{H}_3\text{CO}-\text{N}=\text{C}-$	
Br	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
Br	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
Br	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
F ₃ C-	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
Br	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
Br	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	

Br	<chem>CH3CH2O-N=C-</chem>	
Br	<chem>CH3O-N=C-</chem>	
Br	<chem>CH3CH2O-N=C-</chem>	
<chem>F3CO-</chem>	<chem>H3CO-N=C-</chem> Z-異性体	
<chem>F3CO-</chem>	<chem>H3CO-N=C-</chem> E-異性体	
Br	<chem>H3C-O-N=C-</chem>	
Br	<chem>H3C-O-N=C-</chem>	
Br	<chem>H3C-O-N=C-</chem>	

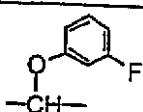
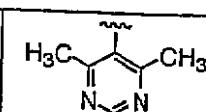
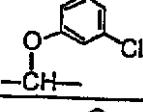
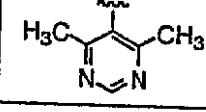
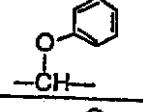
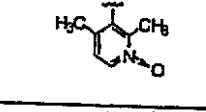
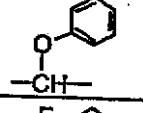
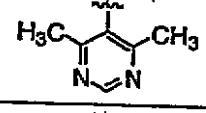
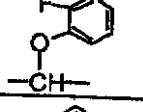
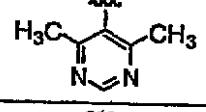
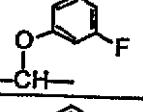
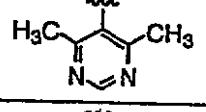
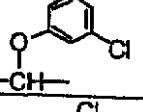
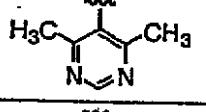
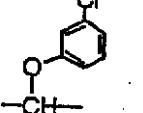
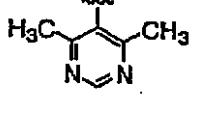
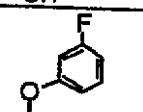
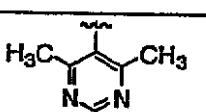
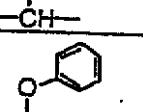
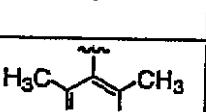
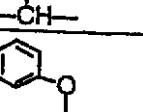
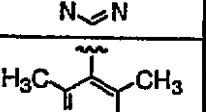
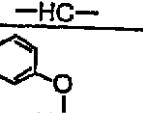
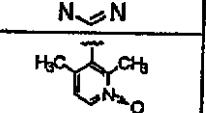
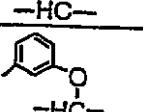
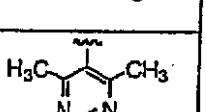
Br	<chem>CC(=O)OCCOC#N</chem>	<chem>C[C@H]1C[C@H]2C[C@H]1C[C@H]2C#N</chem>
Br	<chem>CC(=O)OCCOC#N</chem>	<chem>C[C@H]1C[C@H]2C[C@H]1C[C@H]2C</chem>
Br	<chem>CC1=NOCC1</chem>	<chem>C[C@H]1C[C@H]2C[C@H]1C[C@H]2C#N</chem>
F ₃ CO-	<chem>CC(=O)OC(F)(F)OC(F)(F)OC(F)(F)O</chem>	<chem>C[C@H]1C[C@H]2C[C@H]1C[C@H]2C#N</chem>
F ₃ CO-	<chem>CC(=O)OC(F)(F)OC(F)(F)OC(F)(F)O</chem>	<chem>C[C@H]1C[C@H]2C[C@H]1C[C@H]2C</chem>
F ₃ CO-	<chem>CC(=O)OC(F)(F)O</chem>	<chem>C[C@H]1C[C@H]2C[C@H]1C[C@H]2C</chem>
F ₃ CO-	<chem>CC(=O)OC(F)(F)OC(F)(F)O</chem>	<chem>C[C@H]1C[C@H]2C[C@H]1C[C@H]2CO</chem>
F ₃ CO-	<chem>CC(=O)OC(F)(F)OC(F)(F)O</chem>	<chem>C[C@H]1C[C@H]2C[C@H]1C[C@H]2C</chem>
F ₃ CO-	<chem>CC(=O)OC(F)(F)OC(F)(F)O</chem>	<chem>C[C@H]1C[C@H]2C[C@H]1C[C@H]2C</chem>
Cl	<chem>CC(=O)OCCCl</chem>	<chem>C[C@H]1C[C@H]2C[C@H]1C[C@H]2C</chem>
Cl	<chem>CC(=O)OC(F)(F)O</chem>	<chem>C[C@H]1C[C@H]2C[C@H]1C[C@H]2C</chem>
F ₃ C-	<chem>CC(=O)OC(F)(F)O</chem>	<chem>C[C@H]1C[C@H]2C[C@H]1C[C@H]2C</chem>
Cl	<chem>CC(=O)OCCCl</chem>	<chem>C[C@H]1C[C@H]2C[C@H]1C[C@H]2C</chem>
Cl	<chem>CC(=O)OCCCl</chem>	<chem>C[C@H]1C[C@H]2C[C@H]1C[C@H]2C</chem>

Cl	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{C}-$	$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
Cl	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{C}-$	$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{C}-$	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
Cl	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
Cl	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{CO}-$	$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{C}-$	$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{CO}-$	$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{C}-$	$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
E異性体		

$\text{F}_3\text{C}-$	$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{C}-$	$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{CO}-$	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{C}-$	$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{C}-$	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{CO}-$	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{CO}-$		
$\text{F}_3\text{CO}-$	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{C}-$	$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ E異性体	
$\text{F}_3\text{CO}-$	$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{CO}-$	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{C}-$	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{C}-$	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{CO}-$	$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ E異性体	
$\text{F}_3\text{CO}-$	$\text{H}_3\text{CO}(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	

$\text{F}_3\text{CO-}$	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}_\text{N}-\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{CO-}$		
$\text{F}_3\text{CO-}$		
$\text{F}_3\text{CO-}$	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}_\text{N}-\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{CO-}$	$\text{CH}_3\text{O}_\text{N}-\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{CO-}$	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}_\text{N}-\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{CO-}$	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}_\text{N}-\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{CO-}$	$\text{CH}_3\text{O}_\text{N}-\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{CO-}$	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}_\text{N}-\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{CO-}$	$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_2\text{O}_\text{N}-\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{CO-}$	$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_2\text{O}_\text{N}-\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{CO-}$	$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_2\text{O}_\text{N}-\text{C}-$	
Br	$\text{CH}_3\text{O}_\text{N}-\text{C}-$	
$\text{F}_3\text{C-}$	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}_\text{N}-\text{C}-$	

Br	-CH ₂ -	
CH ₃ SO ₂ ⁻		
Br		
Br		
F		
F		
F		

Br		
Cl		
F ₃ C-		
CH ₃ SO ₂ -		
CH ₃ SO ₂ -		
F ₃ CO-		
F ₃ CO-		
CH ₃ SO ₂ -		
CH ₃ SO ₂ -		
F ₃ C-		
F ₃ CO-		
F ₃ CO-		
F ₃ C-		

H		
F ₃ CO-		

エナンチオマー-II

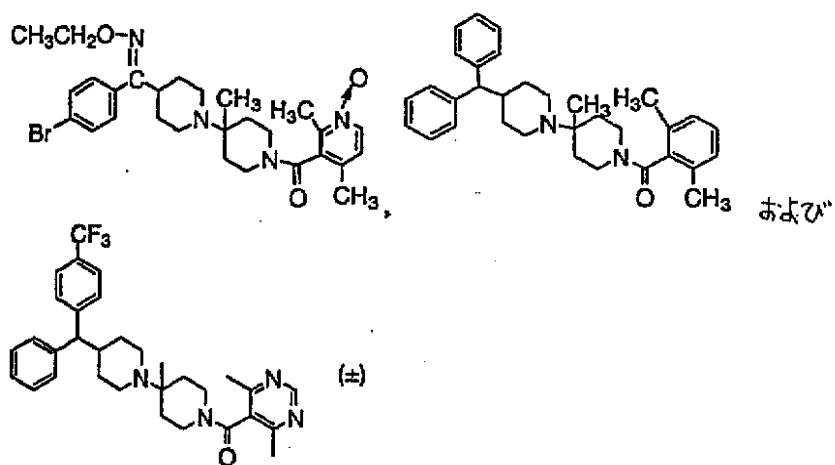
エナンチオマー-II

エナンチオマー-II

において定義される通りである、化合物。

【請求項3】 以下：

【化7】



からなる群から選択される、化合物。

【請求項4】 ヒト免疫不全ウイルス、固体の器官移植片拒絶、対宿主性移植片病、関節炎、慢性関節リウマチ、炎症性腸疾患、アトピー性皮膚炎、乾癬、ぜん息、アレルギーまたは多発性硬化症の処置のための薬学的組成物であって、該組成物は、請求項1に記載のCCR5アンタゴニストの有効量を薬学的に受容可能なキャリアと組み合わせて含む、薬学的組成物。

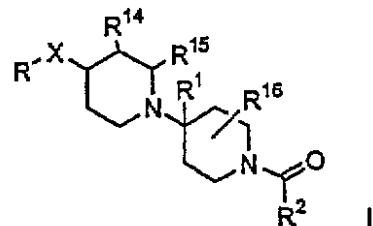
【請求項5】 ヒト免疫不全ウイルス、固体の器官移植片拒絶、対宿主性移植片病、関節炎、慢性関節リウマチ、炎症性腸疾患、アトピー性皮膚炎、乾癬、ぜん息、アレルギーまたは多発性硬化症の処置のための医薬の調製のための請求項1に記載の化合物の使用。

【請求項6】 ヒト免疫不全ウイルスの処置において有用な1つ以上の抗ウイルス剤または他の薬剤と組み合わせた使用についての医薬の調製のための請求項1に記載の化合

物の使用。

【請求項 7】ヒト免疫不全ウイルス、固体の器官移植片拒絶、対宿主性移植片病、関節炎、慢性関節リウマチ、炎症性腸疾患、アトピー性皮膚炎、乾癬、ぜん息、アレルギーまたは多発性硬化症の処置のための医薬の調製のための構造式 I の CCR5 アンタゴニストの使用であって、ここで、CCR5 アンタゴニストは、以下の構造式 I；

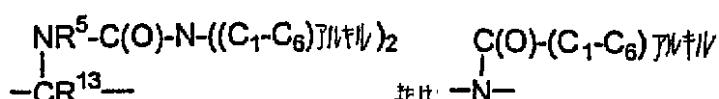
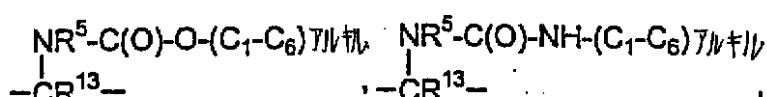
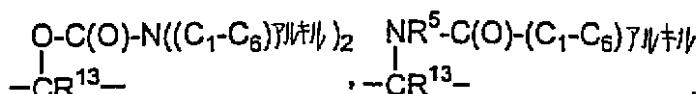
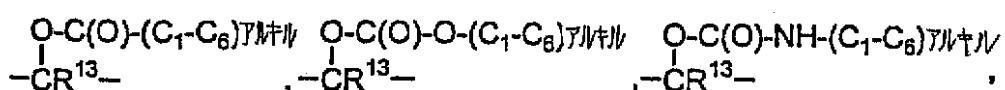
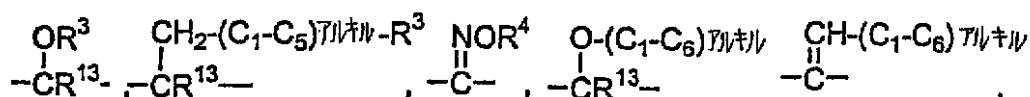
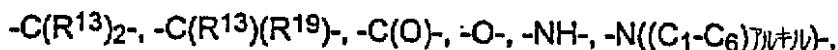
【化 8】



またはその薬学的に受容可能な塩によって表わされ、ここで、

X は、以下：

【化 9】



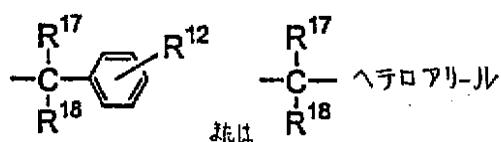
であり；

R は、R⁶ - フェニル、R⁶ - ピリジル、R⁶ - チオフェニルまたはR⁶ - ナフチルであり；

R¹ は、水素、C₁ - C₆ アルキルまたはC₂ - C₆ アルケニルであり；

R² は、R⁷、R⁸、R⁹ - フェニル；R⁷、R⁸、R⁹ - 置換6員ヘテロアリール；R⁷、R⁸、R⁹ - 置換6員ヘテロアリールN - オキシド；R¹⁰、R¹¹ - 置換5員ヘテロアリール；ナフチル；フルオレニル；ジフェニルメチル

【化 10】



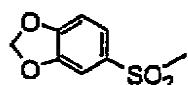
であり；

R^3 は、 R^6 - フェニル、 R^6 - ヘテロアリールまたは R^6 - ナフチルであり； R^4 は、水素、 C_1 - C_6 アルキル、フルオロ - C_1 - C_6 アルキル、シクロプロピルメチル、- CH_2CH_2OH 、- $CH_2CH_2-O-(C_1-C_6)$ アルキル、- $CH_2C(O)-O-(C_1-C_6)$ アルキル、- $CH_2C(O)NH_2$ 、- $CH_2C(O)-NH(C_1-C_6)$ アルキルまたは- $CH_2C(O)-N((C_1-C_6)アルキル)_2$ であり；

R^5 および R^{1-1} は、水素および (C_1-C_6) アルキルからなる群から独立して選択され；

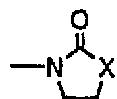
R^6 は、水素、ハロゲン、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 - アルコキシ、- CF_3 、 CF_3O - 、 $CH_3C(O)$ - 、- CN 、 CH_3SO_2 - 、- CF_3SO_2 - 、 R^{1-4} - フェニル、 R^{1-4} - ベンジル、 $CH_3C(=NOCH_3)$ - 、 $CH_3C(=NOCH_2CH_3)$ - 、

【化11】



、- NH_2 、- $NHCOCF_3$ 、- $NHC(=O)NH(C_1-C_6)$ アルキル）、- $NHCO(C_1-C_6)$ アルキル）、- $NHSO_2(C_1-C_6)$ アルキル）、5員ヘテロアリール、および

【化12】



からなる群から独立して選択される1~3個の置換基であり、ここで、Xは、- O - 、- NH - または- $N(CH_3)$ - であり；

R^7 および R^8 は、 (C_1-C_6) アルキル、ハロゲン、- $NR^{2-0}R^{2-1}$ 、- OH 、- CF_3 、- OCH_3 、- O - アシル、および- OCF_3 からなる群から独立して選択され；

R^9 は、 R^7 、水素、フェニル、- NO_2 、- CN 、- CH_2F 、- CHF_2 、- CH O 、- $CH=NO$ R^{2-0} 、ピリジル、ピリジルN - オキシド、ピリミジニル、ピラジニル、- $N(R^{2-0})CONR^{2-1}R^{2-2}$ 、- $NHC(=O)NH(C_1-C_6)$ アルキル）、- $NHC(=O)(C_1-C_6)$ アルキル）、- $NHC(=O)NH((C_3-C_1)_0)$ - シクロアルキル（ C_1-C_6 ）アルキル）、- $NHC(=O)(C_1-C_6)$ アルキル）、- $NHC(=O)CF_3$ 、- $NHSO_2N((C_1-C_6)_2$ ）、- $NHC(=O)SO_2(C_1-C_6)$ アルキル）、- $NHSO_2(C_1-C_6)$ アルキル）、- $N(SO_2CF_3)_2$ 、- $NHC(=O)SO_2(C_1-C_6)$ アルキル）、- SO_2R^{2-3} 、- $SO_2NH(C_1-C_6)$ アルキル）、- $OSO_2(C_1-C_6)$ アルキル）、- OSO_2CF_3 、ヒドロキシ（ C_1-C_6 ）アルキル）、- $CONR^{2-0}R^{2-1}$ 、- $CON(CH_2CH_2-O-CH_3)_2$ 、- $OCONH(C_1-C_6)$ アルキル）、- CO_2R^{2-0} 、- $Si(CH_3)_3$ または- $B(OCC(CH_3)_2)_2$ であり； R^{1-0} は、 (C_1-C_6) アルキル、- NH_2 または R^{1-2} - フェニルであり； R^{1-2} は、水素、 (C_1-C_6) アルキル、- CF_3 、- CO_2R^{2-0} 、- CN 、 (C_1-C_6) アルコキシおよびハロゲンならなる群から独立して選択される、1~3個の置換基であり；

R^{1-3} 、 R^{1-4} 、 R^{1-5} および R^{1-6} は、水素および (C_1-C_6) アルキルからなる群から独立して選択され；

R^{1-7} および R^{1-8} は、水素および C_1-C_6 アルキルからなる群から独立して選択されるか、または R^{1-7} および R^{1-8} は、一緒になって C_2-C_5 アルキレン基となり、そ

して該 R^{1-7} および R^{1-8} に結合する炭素は、3~6個の炭素原子のスピロ環を形成し；
 R^{1-9} は、 R^6 -フェニル、 R^6 -ヘテロアリール、 R^6 -ナフチル、 C_3-C_{10} シクロアルキル、 (C_3-C_{10}) シクロアルキル(C_1-C_6)アルキルまたは (C_1-C_6) アルコキシ(C_1-C_6)アルキルであり；

R^{2-0} 、 R^{2-1} および R^{2-2} は、H および C_1-C_6 アルキルからなる群から独立して選択され；そして

R^{2-3} は、 C_1-C_6 アルキルまたはフェニルである、
 使用。

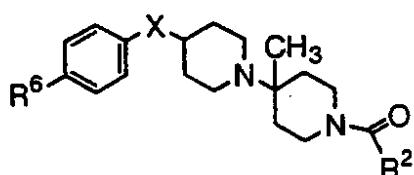
【請求項8】ヒト免疫不全ウイルスの処置のための請求項7に記載の使用であって、該使用は、ヒト免疫不全ウイルスの処置において有用な1つ以上の抗ウイルス剤または他の薬剤をさらに含む、使用。

【請求項9】1つのパッケージにおいて別個の容器内にヒト免疫不全ウイルスを処置するために組み合わせた使用のための薬学的組成物を含むキットであって、該キットは、1つの容器において、薬学的に受容可能なキャリア内に請求項7に記載の有効量の C_3-C_5 アンタゴニストを含む薬学的組成物を含み、そして別個の容器に、薬学的に受容可能なキャリア内にヒト免疫不全ウイルスの処置の際に有用な有効量の抗ウイルス剤または他の薬剤を含む1つ以上の薬学的組成物を含む、キット。

【請求項10】薬学的組成物であって、該薬学的組成物が、請求項1に記載の化合物を含み、ここで、該組成物が、クリームの形態である、薬学的組成物。

【請求項11】請求項10に記載の薬学的組成物であって、前記化合物が、以下の式：

【化13】



によって表される化合物からなる群から選択され、ここでX、 R^6 および R^2 は、以下の表：

【化14】

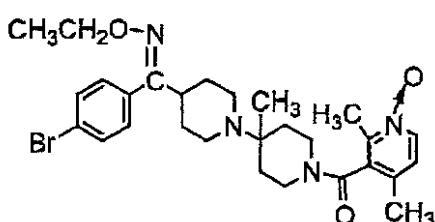
R^6	X	R^2
Br	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_3\text{N}^+-\text{O}^-$

において定義される通りである、薬学的組成物。

【請求項12】

薬学的組成物であって、以下の構造式

【化15】



によって表される化合物を、ヌクレオシド逆転写酵素インヒビター、非ヌクレオシド逆転写酵素インヒビター、およびプロテアーゼインヒビターからなる群より選択される一種以上の抗ウイルス剤またはヒト免疫不全ウイルスの処置において有用な他の薬剤、ならびに薬学的に受容可能なキャリアとともに含む、組成物。

【請求項 1 3】

請求項 1 2 に記載の組成物であって、前記ヌクレオシド逆転写酵素インヒビターが、ジドブジン、ジダノシン、ザルシタビン、スタブジン、ラミブジン、アバカビル、アデホビルジビボキシル、ロブカビル、B C H - 1 0 6 5 2、エミトリシタビン、- L - F D 4、D A P D、(-) - - D - 2, 6 - ジアミノ - プリンジオキソラン、およびロデノシンからなる群より選択され；前記非ヌクレオシド逆転写酵素インヒビターが、ネビラピン、デラビラジン、エファビレンツ、P N U - 1 4 2 7 2 1、A G - 1 5 4 9、5 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - チオ - 4 - イソプロピル - 1 - (4 - ピリジル) メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イルメチルカーボネート、(1 - (エトキシ - メチル) - 5 - (1 - メチルエチル) - 6 - (フェニルメチル) - (2 , 4 (1 H , 3 H) - ピリミジンジオン)、ならびに(+) - カラノリド A および B からなる群より選択され；前記プロテアーゼインヒビターが、サキナビル、リトナビル、ネルフナビル、アンプレナビル、ラジナビル、D M P - 4 5 0、A B T - 3 7 8、および A G - 1 5 4 9 からなる群より選択され；前記ヒト免疫不全ウイルスの処置において有用な他の薬剤は、ヒドロキシウレア、リバビリン、I L - 2、I L - 1 2、およびペントラフシドからなる群より選択される、組成物。

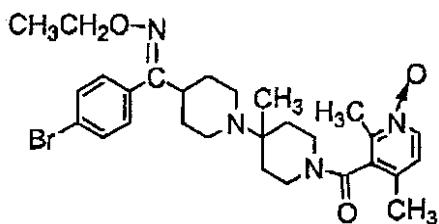
【請求項 1 4】

前記抗ウイルス剤が、リトナビルである、請求項 1 3 に記載の組成物。

【請求項 1 5】

別個の容器に、ヒト免疫不全ウイルスを処置するために併用して使用するための単一パッケージで薬学的組成物を含むキットであって、該キットは、一方の容器に、薬学的に受容可能なキャリア中に有効量の以下の式

【化 1 6】



の化合物を含有する薬学的組成物を含み、そして別の容器に、薬学的に受容可能なキャリア中に有効量のヌクレオシド逆転写酵素インヒビター、非ヌクレオシド逆転写酵素インヒビター、およびプロテアーゼインヒビターからなる群より選択される抗ウイルス剤またはヒト免疫不全ウイルスの処置において有用な他の薬剤を含有する 1 種またはそれ以上の薬学的組成物を含む、キット。

【請求項 1 6】

請求項 1 5 に記載のキットであって、前記ヌクレオシド逆転写酵素インヒビターが、ジドブジン、ジダノシン、ザルシタビン、スタブジン、ラミブジン、アバカビル、アデホビルジビボキシル、ロブカビル、B C H - 1 0 6 5 2、エミトリシタビン、- L - F D 4、D A P D、(-) - - D - 2, 6 - ジアミノ - プリンジオキソラン、およびロデノシンからなる群より選択され；前記非ヌクレオシド逆転写酵素インヒビターが、ネビラピン、デラビラジン、エファビレンツ、P N U - 1 4 2 7 2 1、A G - 1 5 4 9、5 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - チオ - 4 - イソプロピル - 1 - (4 - ピリジル) メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イルメチルカーボネート、(1 - (エトキシ - メチル) - 5 - (1 - メチルエチル) - 6 - (フェニルメチル) - (2 , 4 (1 H , 3 H) - ピリミジンジオン)、ならびに(+) - カラノリド A および B からなる群より選択され；前記プロテアーゼインヒビターが、サキナビル、リトナビル、ネルフナビル、アンプレナビル、ラジナビル

ル、D M P - 4 5 0、A B T - 3 7 8、およびA G - 1 5 4 9からなる群より選択され；前記ヒト免疫不全ウイルスの処置において有用な他の薬剤は、ヒドロキシウレア、リバビリン、I L - 2、I L - 1 2およびペントラフシドからなる群より選択される、キット。

【 請求項 1 7 】

前記抗ウイルス剤が、リトナビルである、請求項 16 に記載のキット。

【請求項 18】

請求項 6 に記載の使用であって、前記抗ウイルス剤が、ジドブジン、ジダノシン、ザルシタビン、スタブジン、ラミブジン、アバカビル、アデホビルジピボキシル、ロブカビル、B C H - 1 0 6 5 2、エミトリシタビン、 - L - F D 4、D A P D、(-) - - D - 2, 6 - ジアミノ - プリンジオキソラン、およびロデノシンからなる群より選択されるヌクレオシド逆転写酵素インヒビター；ネビラピン、デラビラジン、エファビレンツ、P N U - 1 4 2 7 2 1、A G - 1 5 4 9、5 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - チオ - 4 - イソプロピル - 1 - (4 - ピリジル) メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イルメチルカーボネート、(1 - (エトキシ - メチル) - 5 - (1 - メチルエチル) - 6 - (フェニルメチル) - (2 , 4 (1 H , 3 H) - ピリミジンジオン)、ならびに(+) - カラノリド A および B からなる群より選択される非ヌクレオシド逆転写酵素インヒビター；サキナビル、リトナビル、ネルフナビル、アンプレナビル、ラジナビル、D M P - 4 5 0, A B T - 3 7 8、および A G - 1 5 4 9 からなる群より選択されるプロテアーゼインヒビター；ならびにヒドロキシウレア、リバビリン、I L - 2、I L - 1 2 および ペンタフシドからなる群より選択されるヒト免疫不全ウイルスの処置において有用な他の薬剤からなる群より選択される、使用。

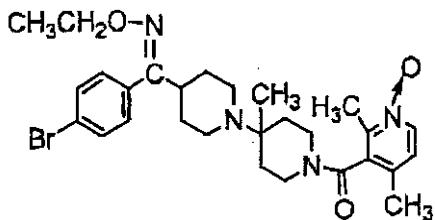
【請求項 19】

前記抗ウイルス剤が、リトナビルである、請求項18に記載の使用。

【請求項 20】

請求項 1 8 に記載の使用であつて、前記請求項 1 に記載の化合物が、以下の構造

【化 1 7】



を有する、使用。

【請求項 21】

前記抗ウイルス剤が、リトナビルである、請求項 20 に記載の使用。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】 0 0 4 1

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

[0 0 4 1]

代表的な適切なNRTIとして、以下が挙げられる：Glaxo Wellcome Inc.、Research Triangle, NC 27709からRETROVIRの登録商標のもとで入手可能なジドブシン(AZT)；Bristol-Myers Squibb Co., Princeton, NJ 08543からVIDEXの登録商標のもとで入手可能なジダノシン(ddI)；Roche Pharmaceutical, Nutley, NJ 07110からHIVIDの登録商標のもとで入手可能なザルシタビン(ddC)；Bristol-Myers Squibb Co., Princeton, NJ 08543からZERITの登録商標のもとで入手可能なスタブシン(d4T)；G1

axoWellcome Inc.、Research Triangle, NC 27709からEPIVIRの登録商標のもとで入手可能なラミブジン(3TC)；第WO96/30025号に開示されており、そしてGalaxoWellcome Inc.、Research Triangle, NC 27709からZIAGENの登録商標のもとで入手可能なアバカビル(1592U89)；Gilead Sciences, Foster City, CA 94404からPREVONの登録商標のもとで入手可能なアベホビルジピボキシリ[ビス(POM)-PMEA]；第EP-0358154号および第EP-0736533号に開示されており、そしてBristol-Myers Squibb Co., Princeton, NJ 08543による開発のもとのヌクレオシド逆転写酵素インヒビターである、ロブカビル(BMS-180194)；Biochempharma, Laval, Quebec H7V, 4A7, Canadaによる開発のもとの逆転写酵素インヒビター(BCH-10618およびBCH-10619のラセミ混合物の形態で)である、BCH-10652；Emory Univ.の米国特許第5,814,639号もとでEmory Universityによって権利を得られ、そしてTriangle Pharmaceuticals, Durham, NC 27707による開発の下の、エミトリシタシン[(-)-FTC]；Yale UniversityによってVion Pharmaceuticals, New Haven CT 06511によって権利を与えられた、-L-FD4(-L-D4Cとも呼ばれ、そして-L-2',3'-ジデオキシ-5'-フルオロ-シチデンと命名された)；第EP0656778号に開示され、そしてEmory UniversityおよびUniversity of GeorgiaからTriangle Pharmaceuticals, Durham, NC 27707に権利を与えられた、DAPD、プリンヌクレオシド、(-)-D-2,6,-ジアミノ-プリンジオキソラン；ならびにNIHによって発見され、そしてU.S.Bioscience Inc., West Conshohocken, PA 19428による開発のものでの、酸安定性のプリンに基づく逆転写酵素インヒビターである、ロデノシン(FddA)、9-(2,3-ジデオキシ-2-フルオロ-b-D-スレオ-ペントフラノシリ)アデニン。