

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成21年9月24日(2009.9.24)

【公表番号】特表2009-503117(P2009-503117A)

【公表日】平成21年1月29日(2009.1.29)

【年通号数】公開・登録公報2009-004

【出願番号】特願2008-525272(P2008-525272)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/4184	(2006.01)
C 0 7 D	235/18	(2006.01)
C 0 7 D	403/12	(2006.01)
C 0 7 D	403/10	(2006.01)
C 0 7 D	401/12	(2006.01)
C 0 7 D	401/10	(2006.01)
A 6 1 K	31/498	(2006.01)
A 6 1 K	31/4709	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	21/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	7/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	7/02	(2006.01)
A 6 1 P	15/06	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	19/04	(2006.01)
A 6 1 P	13/02	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)
A 6 1 P	35/04	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	41/00	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	27/06	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/04	(2006.01)
A 6 1 P	3/02	(2006.01)
A 6 1 P	21/04	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4439 (2006.01)  
 C 0 7 D 405/14 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/341 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/437 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/444 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/426 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4245 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4196 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/551 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/423 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/428 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/536 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4188 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/40 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/415 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4355 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/55 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/404 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4406 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/381 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/497 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/47 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/541 (2006.01)  
 C 0 7 D 513/04 (2006.01)  
 C 0 7 D 498/04 (2006.01)  
 C 0 7 D 471/04 (2006.01)  
 C 0 7 D 491/048 (2006.01)

## 【 F I 】

A 6 1 K 31/4184  
 C 0 7 D 235/18 C S P  
 C 0 7 D 235/18  
 C 0 7 D 403/12  
 C 0 7 D 403/10  
 C 0 7 D 401/12  
 C 0 7 D 401/10  
 A 6 1 K 31/498  
 A 6 1 K 31/4709  
 A 6 1 K 31/496  
 A 6 1 K 31/5377  
 A 6 1 P 43/00 1 0 7  
 A 6 1 P 9/00  
 A 6 1 P 21/02  
 A 6 1 P 25/08  
 A 6 1 P 19/02  
 A 6 1 P 25/28  
 A 6 1 P 3/10  
 A 6 1 P 25/16  
 A 6 1 P 25/14  
 A 6 1 P 21/00

A 6 1 P	7/00	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	7/02	
A 6 1 P	15/06	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	9/10	1 0 3
A 6 1 P	19/04	
A 6 1 P	13/02	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	35/04	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	41/00	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	27/06	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	25/04	
A 6 1 P	3/02	
A 6 1 P	21/04	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	43/00	1 0 5
A 6 1 P	11/00	
C 0 7 D	401/04	
A 6 1 K	31/4439	
C 0 7 D	405/14	
A 6 1 K	31/341	
A 6 1 K	31/437	
A 6 1 K	31/444	
A 6 1 K	31/426	
A 6 1 K	31/4245	
A 6 1 K	31/4196	
A 6 1 K	31/551	
A 6 1 K	31/423	
A 6 1 K	31/428	
A 6 1 K	31/536	
A 6 1 K	31/4188	
A 6 1 K	31/40	
A 6 1 K	31/415	
A 6 1 K	31/4355	
A 6 1 K	31/55	
A 6 1 K	31/404	
A 6 1 K	31/4406	
A 6 1 K	31/381	
A 6 1 K	31/497	
A 6 1 K	31/47	
A 6 1 K	31/541	
A 6 1 P	43/00	1 2 3

C 0 7 D 513/04      3 4 1  
 C 0 7 D 498/04      1 1 1  
 C 0 7 D 513/04      3 3 1  
 C 0 7 D 471/04      1 0 7 K  
 C 0 7 D 471/04      1 0 8 K  
 C 0 7 D 491/048

## 【手続補正書】

【提出日】平成21年8月3日(2009.8.3)

## 【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

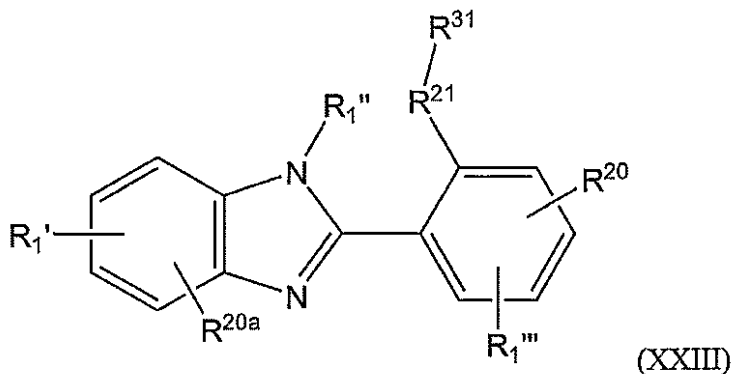
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式：

【数 1】



の化合物、またはその塩であって、該式において、

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

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

$R^{21}$  は、 $-NR_1' - C(O) -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 -$ 、 $-NR_1' - C(O) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(S) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(S) - NR_1' - CR_1'R_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1'R_1' - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(=NR_1') - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' = CR_1' -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - NR_1' - S(O)_2 -$ 、 $-NR_1' - CR_1'R_1' - C(O) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' = CR_1' - CR_1'R_1' -$ 、 $-NR_1' - C(=N-CN) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1'R_1' - O -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1'R_1' - CR_1'R_1' - O -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - CR_1'R_1' -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - CR_1'R_1' - CR_1'R_1' -$ 、または  $-NR_1' - C(O) - CR_1'R_1' -$  から選択され；そして

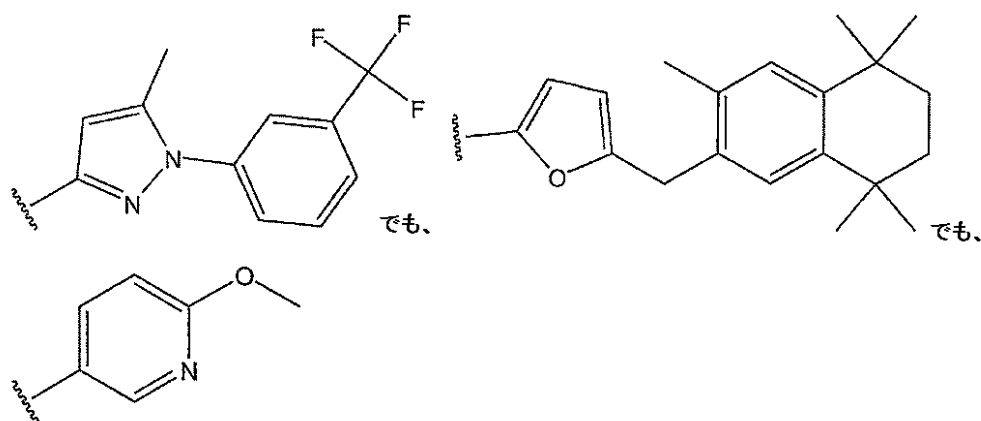
$R^{31}$  は、必要に応じて置換された単環式アリールもしくは二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式ヘテロアリールもしくは二環式ヘテロアリールから選択され、

ただし：

$R^{21}$  が  $-NH - C(O) -$  である場合、 $R^{31}$  は、3, 5 - ジニトロフェニルでも、

4 - ブトキシフェニルでも、

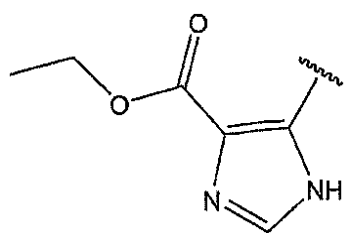
【数 2】



でもなく；

$R^{21}$  が  $-NH-C(O)-$  であり、そして  $R^{20}$ 、 $R^{20a}$ 、 $R_{1'}$ 、 $R_{1''}$  および  $R_{1'''}$  の各々が水素である場合、 $R^{31}$  は、

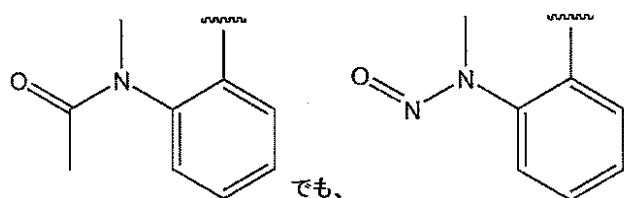
【数 3】



でも、非置換フェニルでも、2 - ニトロフェニルでも、4 - ニトロフェニルでも、2 , 4 - ジニトロフェニルでも、2 - クロロフェニルでも、4 - クロロフェニルでも、2 - ブロモフェニルでも、4 - フルオロフェニルでも、2 , 4 - ジクロロフェニルでも、2 - カルボキシフェニルでも、2 - アジドフェニルでも、2 - アミノフェニルでも、4 - アミノフェニルでも、2 - アセトアミドフェニルでも、4 - メチルフェニルでも、4 - メトキシフェニルでもなく；

$R^{21}$  が  $-NH-C(O)-$  であり、 $R_{1''}$  がメチルであり；そして  $R^{20}$ 、 $R^{20a}$ 、 $R_{1'}$  および  $R_{1'''}$  の各々が水素である場合、 $R^{31}$  は、2 - メチルアミノフェニルでも、

【数 4】



でもなく；

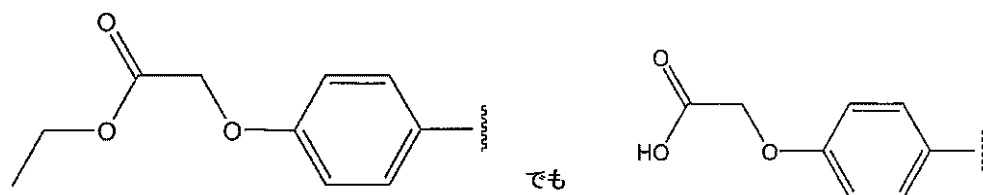
$R^{21}$  が  $-NH-C(O)-CH_2-$  または  $NH-C(S)-NH-$  であり、そして  $R^{20}$ 、 $R^{20a}$ 、 $R_{1'}$ 、 $R_{1''}$  および  $R_{1'''}$  の各々が水素である場合、 $R^{31}$  は非置換フェニルではなく；

$R^{21}$  が  $-NH-S(O)_2-$  であり、 $R_{1''}$  が水素またはメチルであり、そして  $R^{20}$ 、 $R^{20a}$ 、 $R_{1'}$  および  $R_{1'''}$  の各々が水素である場合、 $R^{31}$  は 4 - メチル

フェニルではなく；そして

$R^{21}$  が  $-NH-S(O)_2-$  であり、 $R^{20a}$  が水素または  $-CH_2-N(CH_2CH_3)_2$  であり、そして  $R^{20}$ 、 $R_1'$ 、 $R_1''$  および  $R_1'''$  の各々が水素である場合、 $R^{31}$  は

【数 5】



でもない、  
化合物。

【請求項 2】

$R^{21}$  が、 $-NH-C(O)-$ 、または  $-NH-C(O)-NR_1'$  から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

$R^{31}$  が、必要に応じて置換されたフェニル、キノキサリニルまたはキノリニルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

$R^{31}$  が、3 個までの置換基で必要に応じて置換されており、該置換基が  $-OCH_3$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、または可溶化基から独立して選択される、請求項 3 に記載の化合物。

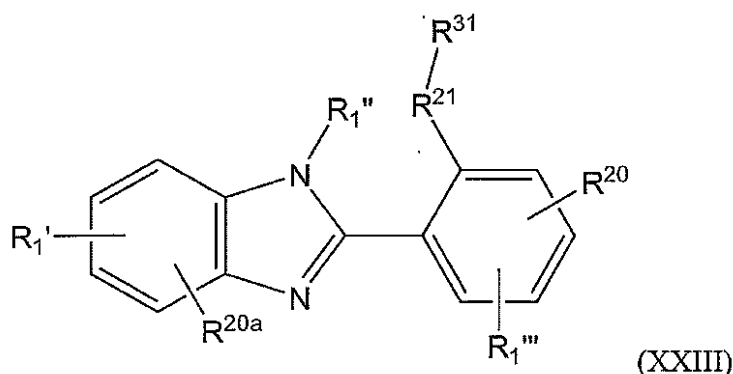
【請求項 5】

$R^{31}$  が、4 - ジメチルアミノフェニル、3, 4 - ジメトキシフェニル、3, 5 - ジメトキシフェニル、3, 4, 5 - トリメトキシフェニル、3 - メトキシ - 4 - ((ピペラジン - 1 - イル)メチル)フェニル、3 - メトキシ - 4 - ((モルホリノ)メチル)フェニル、3 - メトキシ - 4 - ((ピロリジン - 1 - イル)メチル)フェニル、非置換フェニル、非置換キノキサリニル、または非置換キノリニルから選択される、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

式：

【数 6】



の化合物、またはその塩であって、該式において、

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

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

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

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

R<sup>31</sup> は、必要に応じて置換された単環式アリールもしくは二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式ヘテロアリールもしくは二環式ヘテロアリールから選択され、

i i i) 少なくとも1個の R<sup>20</sup> は、可溶化基であるか、または少なくとも1個の R<sub>1</sub>' は、必要に応じて置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルもしくはその両方であるか；あるいは

i v) R<sup>20a</sup> は CH<sub>2</sub> - N(CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> 以外の可溶化基である、化合物。

【請求項 7】

R<sup>21</sup> が、 - NH - C(O) - 、または - NH - C(O) - NR<sub>1</sub>' - から選択される、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

R<sup>31</sup> が、必要に応じて置換されたフェニル、キノキサリニルまたはキノリニルから選択される、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 9】

R<sup>31</sup> が、3 個までの置換基で必要に応じて置換されており、該置換基は、 - OCH<sub>3</sub>、 - N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、または可溶化基から独立して選択される、請求項 8 に記載の化合物。

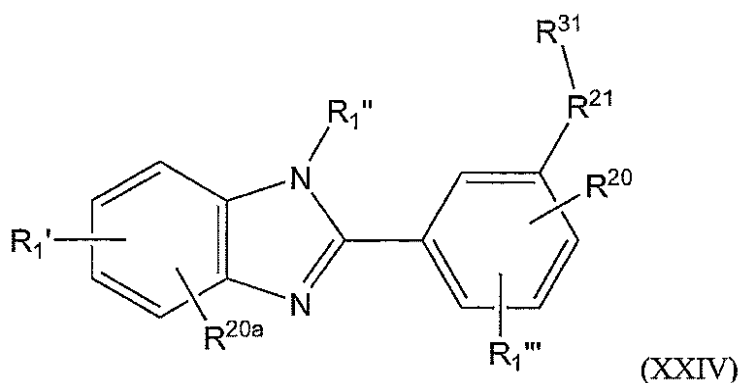
【請求項 10】

R<sup>31</sup> が、4 - ジメチルアミノフェニル、3, 4 - ジメトキシフェニル、3, 5 - ジメトキシフェニル、3, 4, 5 - トリメトキシフェニル、3 - メトキシ - 4 - ((ピペラジン - 1 - イル)メチル)フェニル、3 - メトキシ - 4 - ((モルホリノ)メチル)フェニル、3 - メトキシ - 4 - ((ピロリジン - 1 - イル)メチル)フェニル、非置換フェニル、非置換キノキサリニル、または非置換キノリニルから選択される、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

式：

【数 7】



の化合物、またはその塩であって、該式において、

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

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

$R^{21}$  は、 $-NR^{23}-C(O)-$ 、 $-NR_1'-S(O)_2-$ 、 $-NR_1'-C(O)-NR_1'-$ 、 $-NR_1'-C(S)-NR_1'-$ 、 $-NR_1'-C(S)-NR_1'-CR_1'R_1'-$ 、 $-NR_1'-C(O)-CR_1'R_1'-NR_1'-$ 、 $-NR_1'-C(=NR_1')-NR_1'-$ 、 $-NR_1'-C(O)-CR_1'=CR_1'-$ 、 $-NR_1'-S(O)_2-NR_1'-$ 、 $-NR_1'-C(O)-NR_1'-S(O)_2-$ 、 $-NR_1'-CR_1'R_1'-C(O)-NR_1'-$ 、 $-NR_1'-C(O)-CR_1'=CR_1'-CR_1'R_1'-$ 、 $-NR_1'-C(=N-CN)-NR_1'-$ 、 $-NR_1'-C(O)-CR_1'R_1'-O-$ 、 $-NR_1'-C(O)-CR_1'R_1'-CR_1'R_1'-O-$ 、 $-NR_1'-S(O)_2-CR_1'R_1'-$ 、 $-NR_1'-S(O)_2-CR_1'R_1'-CR_1'R_1'-$ 、または  $-NR_1'-C(O)-CR_1'R_1'-$  から選択され；そして

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

ただし：

$R^{21}$  が  $-NH-C(O)-CH_2-$  である場合、 $R^{31}$  は、2-メチルフェニルでも3,4-ジメトキシフェニルでもなく；

$R^{21}$  が  $-NH-C(O)-CH=CH-$  である場合、 $R^{31}$  は2-クロロフェニルではなく；

$R^{21}$  が  $-NH-C(O)-NH-$  である場合、 $R^{31}$  は非置換ベンゾイミダゾリルではなく；

$R^{21}$  が  $-NH-S(O)_2-$  であり、そして  $R^{20}$ 、 $R^{20a}$ 、 $R_1'$ 、 $R_1''$  および  $R_1'''$  の各々が水素である場合、 $R^{31}$  は、非置換フェニルでも、4-クロロフェニルでも、4-メチルフェニルでも、4-アセトアミドフェニルでもなく；

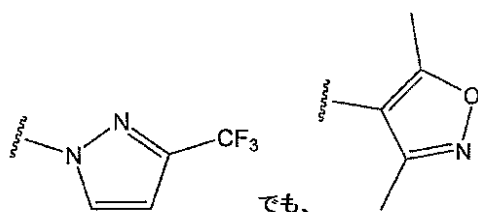
$R^{21}$  が  $-NH-S(O)_2-$  であり、 $R_1'$  および  $R_1''$  の各々がメチルまたは水素であり、そして  $R^{20}$ 、 $R^{20a}$  および  $R_1'''$  の各々が水素である場合、 $R^{31}$  は4-ニトロフェニルではなく；

$R^{21}$  が  $-NH-C(O)-CH_2-O-$  であり、 $R_1'''$  がメチルまたは水素であり、そして  $R^{20}$ 、 $R^{20a}$ 、 $R_1'$  および  $R_1''$  の各々が水素である場合、 $R^{31}$  は、2,3-ジメチルフェニルでも、2,5-ジメチルフェニルでも、2,6-ジメチルフェニルでも、3,4-ジメチルフェニルでも、3,5-ジメチルフェニルでも、2,4-ジクロロメチルでも、2,4-ジメチル-6-プロモフェニルでも、2-クロロフェニルでも、4-クロロフェニルでも、2-(1-メチルプロピル)フェニルでも、5-メチル-2-(1-メチルエチル)フェニルでも、2-メチルフェニルでも、4-メチルフェニルでも、2,4-ジクロロ-6-メチルフェニルでも、ニトロフェニルでも、2,4-ジメチル-6-ニトロフェニルでも、2-メトキシフェニルでも、4-メトキシフェニルでも、4-アセチル-2-メトキシフェニルでも、4-クロロ-3,5-ジメチルフェニルでも、3-エチルフェニルでも、4-プロモフェニルでも、4-シクロヘキシルフェニルでも、4-(1-メチルプロピル)フェニルでも、4-(1-メチルエチル)フェニルでも、4-(1,1-ジメチルエチル)フェニルでも、非置換フェニルでもなく；

$R^{21}$  が  $-NH-C(O)-CH_2-$  であり、 $R_1'''$  がメチルまたは水素であり、そして  $R^{20}$ 、 $R^{20a}$ 、 $R_1'$  および  $R_1''$  の各々が水素である場合、 $R^{31}$  は、非置換ナフチルでも、4-クロロフェニルでも、4-ニトロフェニルでも、4-メトキシフェニルでも、非置換フェニルでも、非置換チエニルでも、



## 【数 8】



でもなく；

$R^{21}$  が  $-NH-C(O)-CH_2-$  であり、 $R_{1'}$  がメチルであり、そして  $R^{20}$ 、 $R^{20a}$ 、 $R_{1''}$  および  $R_{1'''}$  の各々が水素である場合、 $R^{31}$  は非置換フェニルではなく；

$R^{21}$  が  $-NH-C(O)-CH=CH-$  であり、 $R_{1''}$  がメチルまたは水素であり、そして  $R^{20}$ 、 $R^{20a}$ 、 $R_{1'}$  および  $R_{1''}$  の各々が水素である場合、 $R^{31}$  は、非置換フリルでも、ニトロフェニル置換フリルでも、2,4-ジクロロフェニルでも、3,5-ジクロロ-2-メトキシフェニルでも、3-ニトロフェニルでも、4-ニトロフェニルでも、4-メトキシフェニルでも、非置換フェニルでも、ニトロ置換チエニルでもなく；

$R^{21}$  が  $-NH-C(O)-CH(CH_2CH_3)-$  であり、そして  $R^{20}$ 、 $R^{20a}$ 、 $R_{1'}$ 、 $R_{1''}$  および  $R_{1'''}$  の各々が水素である場合、 $R^{31}$  は非置換フェニルではなく；

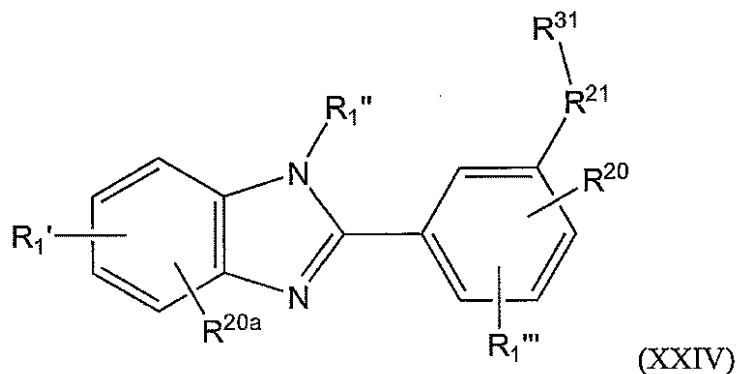
$R^{21}$  が  $-NH-C(O)-CH(CH_3)-O-$  であり、 $R_{1''}$  がメチルまたは水素であり、そして  $R^{20}$ 、 $R^{20a}$ 、 $R_{1'}$  および  $R_{1''}$  の各々が水素である場合、 $R^{31}$  は2,4-ジクロロフェニルではない、

化合物。

## 【請求項 12】

式：

## 【数 9】



の化合物、またはその塩であって、該式において、

各  $R^{20}$  および  $R^{20a}$  は、Hまたは可溶化基から独立して選択され、そして  $R^{20}$  および  $R^{20a}$  のうちの少なくとも1個は、可溶化基であり；

各  $R_{1'}$ 、 $R_{1''}$  および  $R_{1'''}$  は、Hまたは必要に応じて置換された  $C_1 \sim C_3$  の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから独立して選択され；

$R^{21}$  は、 $-NR^{23}-C(O)-$ 、 $-NR_{1'}-S(O)_2-$ 、 $-NR_{1'}-C(O)-NR_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(S)-NR_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(S)-NR_{1'}-$ 、 $-CR_{1'}R_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}R_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(=NR_{1'})-NR_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}=CR_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-S(O)_2-NR_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(O)-NR_{1'}-S(O)_2-$ 、 $-NR_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-C(O)-NR_{1'}-$ 、 $-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}=$

$\text{CR}_1' - \text{CR}_1' \text{R}_1' -$ 、 $-\text{NR}_1' - \text{C}(=\text{N} - \text{CN}) - \text{NR}_1' -$ 、 $-\text{NR}_1' -$   
 $-\text{C}(\text{O}) - \text{CR}_1' \text{R}_1' - \text{O} -$ 、 $-\text{NR}_1' - \text{C}(\text{O}) - \text{CR}_1' \text{R}_1' - \text{CR}_1' \text{R}_1' -$   
 $\text{O} -$ 、 $-\text{NR}_1' - \text{S}(\text{O})_2 - \text{CR}_1' \text{R}_1' -$ 、 $-\text{NR}_1' - \text{S}(\text{O})_2 -$   
 $\text{CR}_1' \text{R}_1' - \text{CR}_1' \text{R}_1' -$ 、または  $-\text{NR}_1' - \text{C}(\text{O}) - \text{CR}_1' \text{R}_1' -$  で  
 あり、ここで  $\text{R}^{2,3}$  は、必要に応じて置換された  $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$  の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから選択され；そして

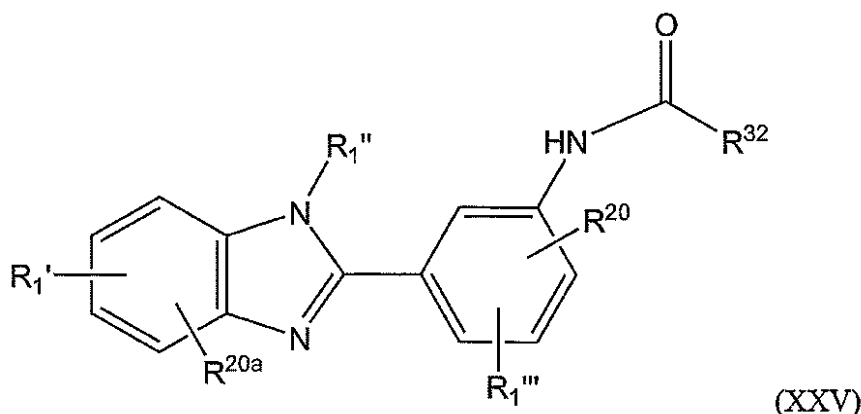
$\text{R}^{3,1}$  は、必要に応じて置換された単環式アリールもしくは二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式ヘテロアリールもしくは二環式ヘテロアリールから選択される、

化合物。

【請求項 13】

式：

【数 10】



の化合物、またはその塩であって、該式において、

$\text{R}^{2,0}$  および  $\text{R}^{2,0a}$  は、Hまたは可溶化基から独立して選択され、ここで  $\text{R}^{2,0}$  および  $\text{R}^{2,0a}$  のうちの少なくとも1個は、可溶化基であり；

$\text{R}_1'$ 、 $\text{R}_1''$  および  $\text{R}_1'''$  は、Hまたは必要に応じて置換された  $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$  の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから独立して選択され；そして

$\text{R}^{3,2}$  は必要に応じて置換されたフェニルである、  
 化合物。

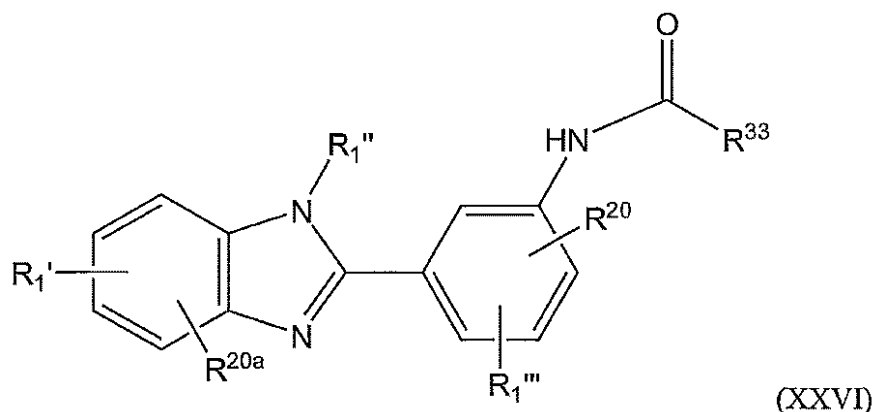
【請求項 14】

$\text{R}^{3,2}$  が、3,4-ジメトキシフェニル、2,6-ジメトキシフェニル、または2,4-ジメトキシフェニルから選択され；そして  $\text{R}^{3,2}$  が可溶化基で必要に応じてさらに置換されている、請求項 13に記載の化合物。

【請求項 15】

式：

## 【数 1 1】



の化合物、またはその塩であって、該式において、

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

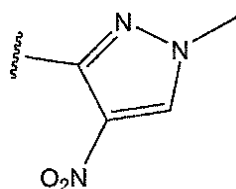
各  $R_1'$ 、 $R_1''$  および  $R_1'''$  は、Hまたは必要に応じて置換された  $C_1 \sim C_3$  の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから独立して選択され；そして

$R^{33}$  は、必要に応じて置換されたヘテロアリールまたは必要に応じて置換された二環式アリールから選択され、

ただし：

$R_1'$  および  $R_1'''$  の各々が水素またはメチルであり、そして  $R_1''$ 、 $R^{20}$  および  $R^{20a}$  の各々が水素である場合、 $R^{33}$  は、5, 6, 7, 8 - テトラヒドロナフチルでも、非置換ベンゾフラニルでも、非置換ベンゾチアゾリルでも、クロロ置換ベンゾチエニルでも、ニトロ置換ベンゾチエニルでも、非置換フリルでも、フェニル置換フリルでも、プロモ置換フリルでも、ニトロ置換フリルでも、ジメチル置換イソオキサゾリルでも、非置換ナフチルでも、5 - プロモナフチルでも、4 - メチルナフチルでも、1 - メトキシナフチルでも、3 - メトキシナフチルでも、アゾ置換ナフチルでも、非置換ピラジニルでも、5 - メチル置換ピリジニルでも、非置換ピリジニルでも、チエニル置換キノリニルでも、フェニル置換キノリニルでも、クロロ置換チエニルでも、プロモ置換チエニルでも、ニトロ置換チエニルでも、非置換チエニルでも、

## 【数 1 2】

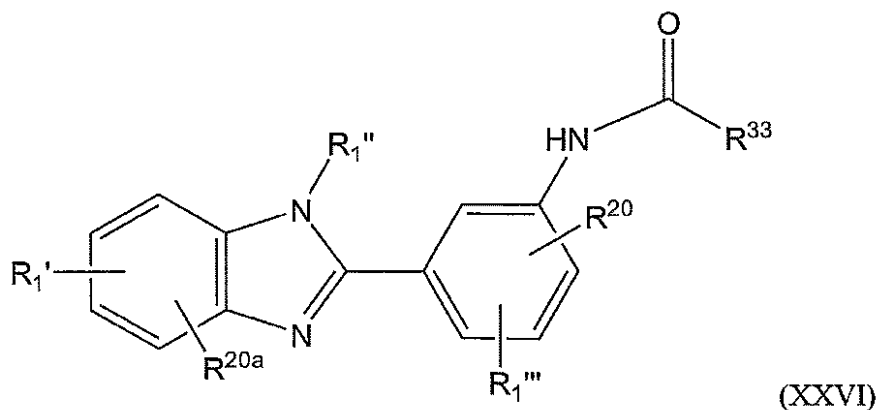


でもない、  
化合物。

## 【請求項 1 6】

式：

【数 1 3】



の化合物、またはその塩であって、該式において、

各  $R^{20}$  および  $R^{20a}$  は、Hまたは可溶化基から独立して選択され、ここで  $R^{20}$  または  $R^{20a}$  のうちの少なくとも1個は、可溶化基であり；

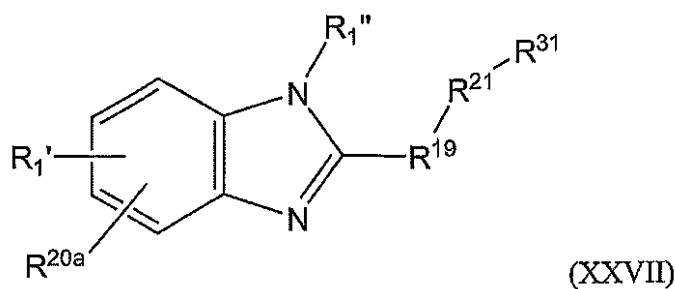
各  $R_1'$ 、 $R_1''$  および  $R_1'''$  は、Hまたは必要に応じて置換された  $C_1 \sim C_3$  の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから独立して選択され；そして

$R^{33}$  は、必要に応じて置換されたヘテロアリールまたは必要に応じて置換された二環式アリールから選択される、化合物。

【請求項 1 7】

式：

【数 1 4】



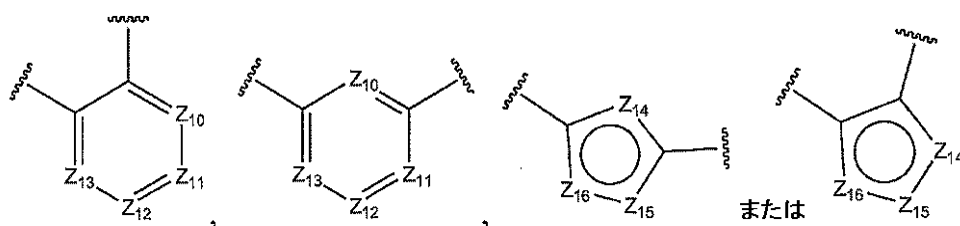
の化合物、またはその塩であって、該式において、

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

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

$R^{19}$  は：

【数 1 5】



から選択され：

各  $Z_{10}$ 、 $Z_{11}$ 、 $Z_{12}$  および  $Z_{13}$  は、N、 $CR^{20}$ 、または  $CR_1'$  から独立して選択され；そして

各  $Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  は、N、 $NR_1'$ 、S、O、 $CR^{20}$ 、または  $CR_1'$

から独立して選択され：

$Z_{10}$ 、 $Z_{11}$ 、 $Z_{12}$  または  $Z_{13}$  のうちの 1 個～2 個は、N であり；

$Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  のうちの少なくとも 1 個は、N、 $NR_1'$ 、S または O であり；

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

$Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  のうちの 0～2 個は、N または  $NR_1'$  であり；

0～1 個の  $R^{20}$  は可溶化基であり；

0～1 個の  $R_1'$  は、必要に応じて置換された  $C_1 \sim C_3$  の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルであり；そして

$R^{21}$  は、 $-NR_1' - C(O) -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 -$ 、 $-NR_1' - C(O) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(S) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(S) - NR_1' - CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(=NR_1') - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' = CR_1' -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - NR_1' - S(O)_2 -$ 、 $-NR_1' - CR_1' R_1' - C(O) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' = CR_1' - CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - C(=N - CN) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' - O -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' - CR_1' R_1' - O -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - CR_1' R_1' - CR_1' R_1' -$ 、または  $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' -$  から選択され；そして

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

ただし：

$R^{21}$  が  $-NH - C(O) -$  である場合、 $R^{19}$  はピラゾリルではなく；

$R^{21}$  が  $-NH - C(O) - CH_2 -$  であり、そして  $R^{19}$  がピラゾリルである場合、 $R^{31}$  は非置換インドリルでも非置換フェニルでもなく；

$R^{21}$  が  $-NH - C(O) - NH -$  であり、そして  $R^{19}$  がピラゾリルである場合、 $R^{31}$  は、非置換イソオキサゾリルでも、非置換ナフチルでも、非置換フェニルでも、2,6-ジフルオロフェニルでも；2,5-ジメチルフェニルでも；3,4-ジクロロフェニルでも；4-クロロフェニルでもなく；

$R^{20a}$  が可溶化基であり、 $R^{19}$  が 1-メチルピロリルであり、そして  $R^{21}$  が  $-NH - C(O) -$  である場合、 $R^{31}$  は非置換フェニルでも；非置換フリルでも；非置換ピロリルでも；非置換ピラゾリルでも；非置換イソキノリニルでも；非置換ベンゾチエニルでも；クロロ置換ベンゾチエニルでも；2-フルオロ-4-クロロフェニルでも、可溶化基単独で置換されたフェニルでもなく；

$R^{20a}$  が可溶化基であり、 $R^{19}$  がチエニルであり、そして  $R^{21}$  が  $-NH - C(O) -$  である場合、 $R^{31}$  は非置換フェニルではなく；

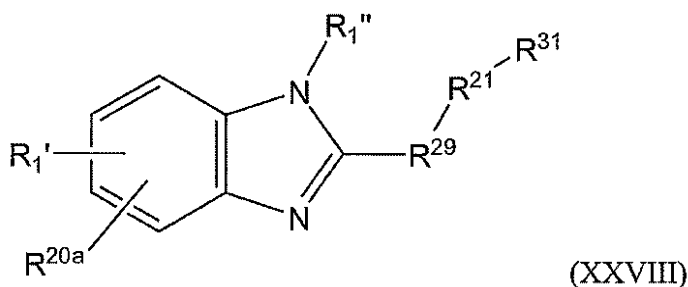
$R^{20a}$  が可溶化基であり、 $R^{19}$  がメチルイミダゾリルであり、そして  $R^{21}$  が  $-NH - C(O) -$  である場合、 $R^{31}$  は、1-メチル-4-(1,1-ジメチルエチルオキシカルボニルアミノ)ピロール-2-イルでも、可溶化基単独で置換されたフェニルでもなく；そして

$R^{21}$  が  $-NH - C(O) -$  であり、そして  $R^{19}$  がチアゾリルまたはピリミジニルである場合、 $R^{31}$  は非置換フェニルではない、化合物。

【請求項 18】

式：

## 【数 1 6】



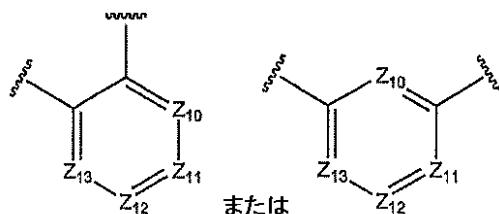
の化合物、またはその塩であって、該式において、

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

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

$R^{29}$  は：

## 【数 1 7】



から選択され：

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

0～1個の  $R^{20}$  は可溶化基であり；

0～1個の  $R_1''$  は、必要に応じて置換された  $C_1 \sim C_3$  の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルであり；そして

$R^{21}$  は、 $-NR_1' - C(O) -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 -$ 、 $-NR_1' - C(O) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(S) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(S) - NR_1' - CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(=NR_1') - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' = CR_1' -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - NR_1' - S(O)_2 -$ 、 $-NR_1' - CR_1' R_1' - C(O) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' = CR_1' - CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - C(=N - CN) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' - O -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' - CR_1' R_1' - O -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - CR_1' R_1' - CR_1' R_1' -$ 、または  $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' -$  から選択され；そして

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

## 【請求項 1 9】

$R^{31}$  が必要に応じて置換されたフェニルである、請求項 1 8 に記載の化合物。

## 【請求項 2 0】

$R^{31}$  が、3 - メトキシフェニル、3, 4 - ジメトキシフェニル、3, 4, 5 - トリメトキシフェニル、または 4 - ジメチルアミノフェニルから選択される、請求項 1 9 に記載

の化合物。

【請求項 2 1】

$R^{21}$  が、 $-NH-C(O)-$  から選択されるか、または  $R_1'$  および  $R^{21}$  が、これらがそれぞれ結合している記載されるベンゾイミダゾール環およびフェニル環と一緒に、6 - 員の複素環式環を形成する、請求項 1 8 に記載の化合物。

【請求項 2 2】

$R^{31}$  が必要に応じて置換されたフェニルである、請求項 2 1 に記載の化合物。

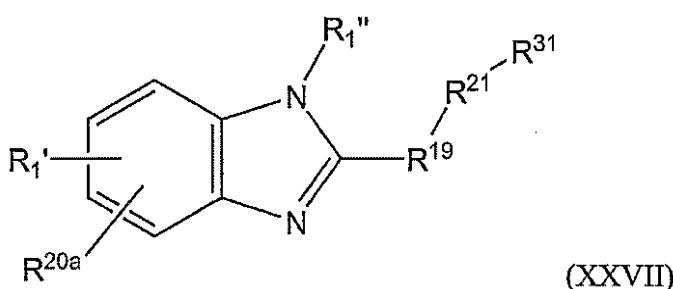
【請求項 2 3】

$R^{31}$  が、3 - メトキシフェニル、3, 4 - ジメトキシフェニル、3, 4, 5 - トリメトキシフェニル、または 4 - ジメチルアミノフェニルから選択される、請求項 2 2 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

式：

【数 1 8】



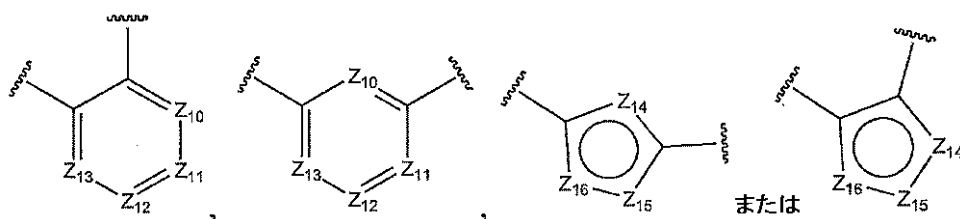
の化合物、またはその塩を含有する組成物であって、該式において、

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

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

$R^{19}$  は：

【数 1 9】



から選択され：

各  $Z_{10}$ 、 $Z_{11}$ 、 $Z_{12}$  および  $Z_{13}$  は、N、 $CR^{20}$ 、または  $CR_1'$  から独立して選択され；そして

各  $Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  は、N、 $NR_1'$ 、S、O、 $CR^{20}$ 、または  $CR_1'$  から独立して選択され；

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

$Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  のうちの少なくとも 1 個は、N、 $NR_1'$ 、S または O であり；

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

$Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  のうちの 0 ~ 2 個は、N または  $NR_1'$  であり；

0 ~ 1 個の  $R^{20}$  は可溶化基であり；

0 ~ 1 個の  $R_1'$  は、必要に応じて置換された  $C_1 \sim C_3$  の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルであり；そして

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

$-NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(S) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(S) - NR_1' -$   
 $-CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' - NR_1' -$ 、 $-NR_1' -$   
 $-C(=NR_1') - NR_1' -$ 、 $-C(O) - NR_1' -$ 、 $-C(O) - NR_1' - S$   
 $(O)_2 -$ 、 $-NR_1' -$ 、 $-CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' = C$   
 $R_1' -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - NR_1' - S$   
 $(O)_2 -$ 、 $-NR_1' - CR_1' R_1' - C(O) - NR_1' -$ 、 $-CR_1' R_1' -$   
 $C(O) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' = CR_1' - CR_1' R_1' -$   
 $-NR_1' - C(=N-CN) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' -$   
 $-O -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' - CR_1' R_1' - O -$ 、 $-NR_1' -$   
 $S(O)_2 - CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - CR_1' R_1' - CR_1' R_1' -$   
 $R_1' -$ 、または  $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' -$  から選択され；そして

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

ただし：

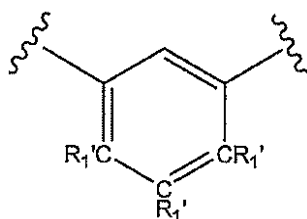
$R^{21}$  が  $-NH - C(O) -$  である場合、 $R^{19}$  はピラゾリルではなく；

$R^{21}$  が  $-NH -$  であり、そして  $R^{19}$  がチアゾリルである場合、 $R^{31}$  は、必要に応じて置換されたフェニルでも、必要に応じて置換されたピリジルでもなく；

$R^{21}$  が  $-NH - C(O) - CH_2 -$  であり、そして  $R^{19}$  がピラゾリルである場合、 $R^{31}$  は非置換インドリルでも非置換フェニルでもなく；

$R^{21}$  が  $-NH - C(O) - CH_2 -$  であり、そして  $R^{19}$  が

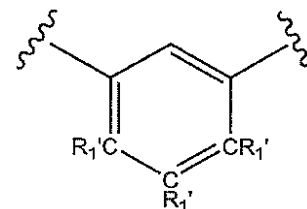
【数 20】



である場合、 $R^{31}$  は、2 - メチルフェニルでも 3 , 4 - ジメトキシフェニルでもなく；

$R^{21}$  が  $-NH - C(O) - CH = CH -$  であり、そして  $R^{19}$  が

【数 21】



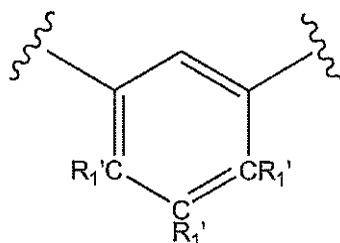
である場合、 $R^{31}$  は 2 - クロロフェニルではなく；

$R^{21}$  が  $-NH - C(O) - NH -$  であり、そして  $R^{19}$  がピラゾリルである場合、 $R^{31}$  は、非置換イソオキサゾリルでも、非置換ナフチルでも、非置換フェニルでも、2 , 6 - ジフルオロフェニルでも、2 , 5 - ジメチルフェニルでも、3 , 4 - ジクロロフェニルでも、4 - クロロフェニルでもなく；

$R^{21}$  が  $-NH - C(O) - NH -$  であり、そして  $R^{19}$  が



## 【数 2 2】



である場合、 $R^{3\ 1}$  は非置換ベンゾイミダゾリルではなく；

$R^{2\ 1}$  が  $-NH-$  であり、そして  $R^{1\ 9}$  がピラゾリルである場合、 $R^{3\ 1}$  は非置換ピリジルではなく；

$R^{2\ 0\ a}$  が可溶化基であり、 $R^{1\ 9}$  が 1 - メチルピロリルであり、そして  $R^{2\ 1}$  が  $-NH-C(O)-$  である場合、 $R^{3\ 1}$  は、非置換フェニルでも、非置換フリルでも、非置換ピロリルでも、非置換ピラゾリルでも、非置換イソキノリニルでも、非置換ベンゾチエニルでも、クロロ置換ベンゾチエニルでも、2 - フルオロ - 4 - クロロフェニルでも、可溶化基単独で置換されたフェニルでもなく；

$R^{2\ 0\ a}$  が可溶化基であり、 $R^{1\ 9}$  がチエニルであり、そして  $R^{2\ 1}$  が  $-NH-C(O)-$  である場合、 $R^{3\ 1}$  は非置換フェニルではなく；

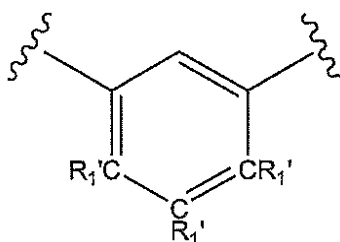
$R^{2\ 0\ a}$  が可溶化基であり、 $R^{1\ 9}$  がメチルイミダゾリルであり、そして  $R^{2\ 1}$  が  $-NH-C(O)-$  である場合、 $R^{3\ 1}$  は、1 - メチル - 4 - (1, 1 - ジメチルエチルオキシカルボニルアミノ) ピロール - 2 - イルでも可溶化基単独で置換されたフェニルでもなく；

$R^{2\ 1}$  が  $-NH-$  であり、そして  $R^{1\ 9}$  がピリジル、オキサジアゾリルまたはチアジアゾリルである場合、 $R^{3\ 1}$  は、非置換フェニルでも、3 - メトキシフェニルでも、4 - メトキシフェニルでもなく；

$R^{2\ 1}$  が  $-NH-C(O)-$  であり、そして  $R^{1\ 9}$  がチアゾリルまたはピリミジニルである場合、 $R^{3\ 1}$  は非置換フェニルではなく；

$R^{2\ 1}$  が  $-NH-C(O)-$  であり、そして  $R^{1\ 9}$  が

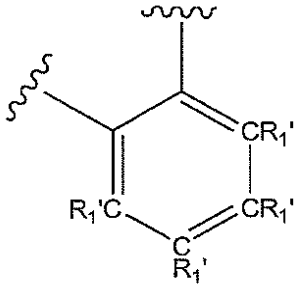
## 【数 2 3】



である場合、 $R^{3\ 1}$  は、非置換ピリジルでも、非置換チエニルでも、非置換フェニルでも、2 - メチルフェニルでも、4 - フルオロフェニルでも、4 - メトキシフェニルでも、4 - メチルフェニルでも、3, 4 - ジオキシエチレンフェニルでも、3 - アセチルアミノ - 4 - メチルフェニルでも、3 - [(6 - アミノ - 1 - オキソヘキシル) アミノ] - 4 - メチルフェニルでも、3 - アミノ - 4 - メチルフェニルでも、2, 6 - ジメトキシフェニルでも、3, 5 - ジメトキシフェニルでも、3 - ハロ - 4 - メトキシフェニルでも、3 - ニトロ - 4 - メチルフェニルでも、4 - プロボキシフェニルでも、3, 4, 5 - トリメトキシフェニルでも、非置換フリルでもなく；

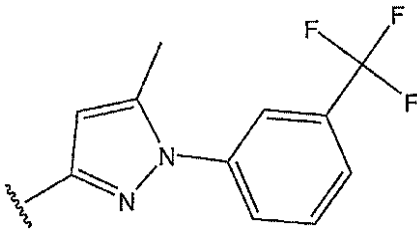
$R^{2\ 1}$  が  $-NH-C(O)-$  であり、そして  $R^{1\ 9}$  が

【数 2 4】



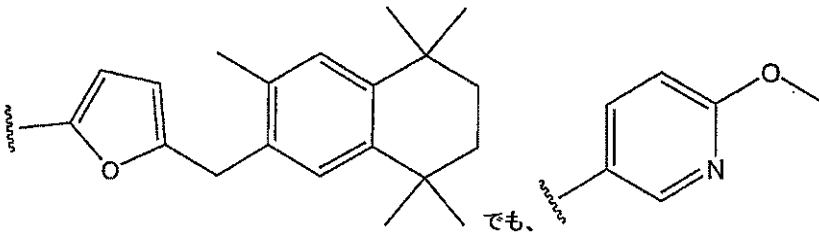
である場合、 $R^{31}$  は、3, 5 - ジニトロフェニルでも、4 - ブトキシフェニルでも、

【数 2 5】



でも、

【数 2 6】



でもなく、

該組成物が発熱性物質を含まない、  
組成物。

【請求項 2 5】

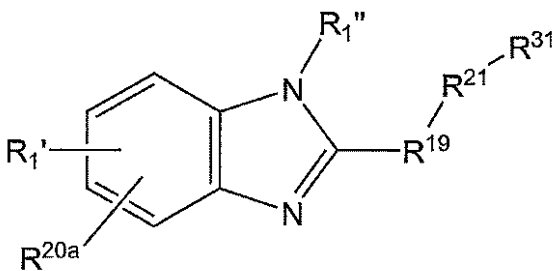
請求項 1 ~ 2 3 のいずれか 1 項に記載の化合物を含有する組成物であって、該組成物は、  
発熱性物質を含まない、組成物。

【請求項 2 6】

薬学的組成物であって：

a . 式：

【数 2 7】



(XXVII)

の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩もしくはプロドラッグであって、該式におい

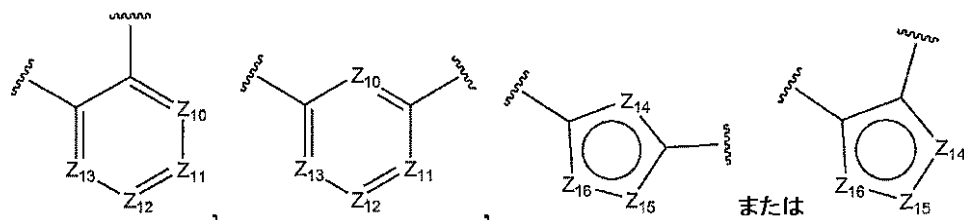
て：

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

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

$R^{19}$  は：

【数 28】



から選択され：

各  $Z_{10}$ 、 $Z_{11}$ 、 $Z_{12}$  および  $Z_{13}$  は、N、 $CR^{20}$ 、または  $CR_1'$  から独立して選択され；そして

各  $Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  は、N、 $NR_1'$ 、S、O、 $CR^{20}$ 、または  $CR_1'$  から独立して選択され：

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

$Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  のうちの少なくとも1個は、N、 $NR_1'$ 、SまたはOであり；

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

$Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  のうちの0～2個は、Nまたは  $NR_1'$  であり；

0～1個の  $R^{20}$  は可溶化基であり；

0～1個の  $R_1'$  は、必要に応じて置換された  $C_1 \sim C_3$  の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルであり；そして

$R^{21}$  は、 $-NR_1' - C(O) -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 -$ 、 $-NR_1' - C(O) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(S) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(S) - NR_1' - CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(=NR_1') - NR_1' -$ 、 $-C(O) - NR_1' -$ 、 $-C(O) - NR_1' - S(O)_2 -$ 、 $-NR_1' -$ 、 $-CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' = CR_1' -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - NR_1' - S(O)_2 -$ 、 $-NR_1' - CR_1' R_1' - C(O) - NR_1' -$ 、 $-CR_1' R_1' - C(O) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' = CR_1' - CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - C(=N - CN) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' - O -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' - CR_1' R_1' - O -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - CR_1' R_1' - CR_1' R_1' -$ 、または  $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' -$  から選択され；そして

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

ただし：

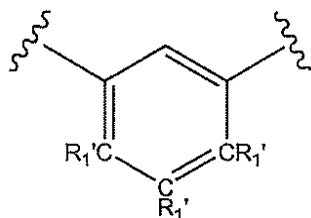
$R^{21}$  が  $-NH - C(O) -$  である場合、 $R^{19}$  はピラゾリルではなく；

$R^{21}$  が  $-NH -$  であり、そして  $R^{19}$  がチアゾリルである場合、 $R^{31}$  は、必要に応じて置換されたフェニルでも必要に応じて置換されたピリジルでもなく；

$R^{21}$  が  $-NH - C(O) - CH_2 -$  であり、そして  $R^{19}$  がピラゾリルである場合、 $R^{31}$  は非置換インドリルでも非置換フェニルでもなく；

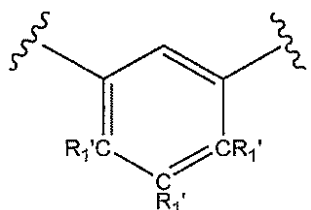
$R^{21}$  が  $-NH - C(O) - CH_2 -$  であり、そして  $R^{19}$  が

## 【数 29】



である場合、 $R^{31}$ は、2-メチルフェニルでも3,4-ジメトキシフェニルでもなく；  
 $R^{21}$ が $-\text{NH}-\text{C}(\text{O})-\text{CH}=\text{CH}-$ であり、そして $R^{19}$ が

## 【数 30】

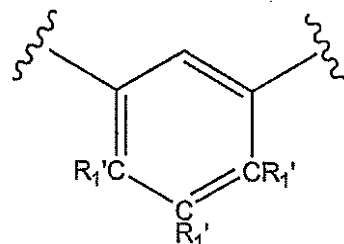


である場合、 $R^{31}$ は2-クロロフェニルではなく；

$R^{21}$ が $-\text{NH}-\text{C}(\text{O})-\text{NH}-$ であり、そして $R^{19}$ がピラゾリルである場合、 $R^{31}$ は、非置換イソキサゾリルでも、非置換ナフチルでも、非置換フェニルでも、2,6-ジフルオロフェニルでも、2,5-ジメチルフェニルでも、3,4-ジクロロフェニルでも、4-クロロフェニルでもなく；

$R^{21}$ が $-\text{NH}-\text{C}(\text{O})-\text{NH}-$ であり、そして $R^{19}$ が

## 【数 31】



である場合、 $R^{31}$ は非置換ベンゾイミダゾリルではなく；

$R^{21}$ が $-\text{NH}-$ であり、そして $R^{19}$ がピラゾリルである場合、 $R^{31}$ は非置換ピリジルではなく；

$R^{20a}$ が可溶化基であり、 $R^{19}$ が1-メチルピロリルであり、そして $R^{21}$ が $-\text{NH}-\text{C}(\text{O})-$ である場合、 $R^{31}$ は、非置換フェニルでも、非置換フリルでも、非置換ピロリルでも、非置換ピラゾリルでも、非置換イソキノリニルでも、非置換ベンゾチエニルでも、クロロ置換ベンゾチエニルでも、2-フルオロ-4-クロロフェニルでも、可溶化基単独で置換されたフェニルでもなく；

$R^{20a}$ が可溶化基であり、 $R^{19}$ がチエニルであり、そして $R^{21}$ が $-\text{NH}-\text{C}(\text{O})-$ である場合、 $R^{31}$ は非置換フェニルではなく；

$R^{20a}$ が可溶化基であり、 $R^{19}$ がメチルイミダゾリルであり、そして $R^{21}$ が $-\text{NH}-\text{C}(\text{O})-$ である場合、 $R^{31}$ は、1-メチル-4-(1,1-ジメチルエチルオキシカルボニルアミノ)ピロール-2-イルでも可溶化基単独で置換されたフェニルでもなく；

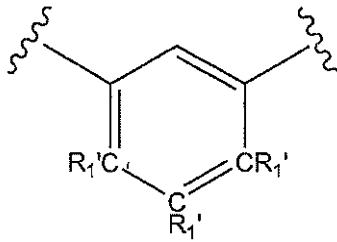
$R^{21}$ が $-\text{NH}-$ であり、そして $R^{19}$ がピリジル、オキサジアゾリルまたはチアジアゾリルである場合、 $R^{31}$ は、非置換フェニルでも、3-メトキシフェニルでも、4-メ

トキシフェニルでもなく；

$R^{21}$  が  $-NH-C(O)-$  であり、そして  $R^{19}$  がチアゾリルまたはピリミジニルである場合、 $R^{31}$  は非置換フェニルではなく；

$R^{21}$  が  $-NH-C(O)-$  であり、そして  $R^{19}$  が

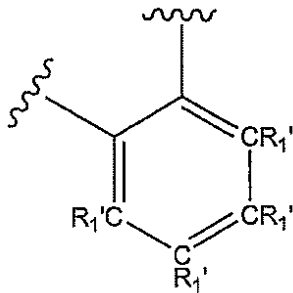
【数 3 2】



である場合、 $R^{31}$  は、非置換ピリジルでも、非置換チエニルでも、非置換フェニルでも、2-メチルフェニルでも、4-フルオロフェニルでも、4-メトキシフェニルでも、4-メチルフェニルでも、3,4-ジオキシエチレンフェニルでも、3-アセチルアミノ-4-メチルフェニルでも、3-[(6-アミノ-1-オキソヘキシル)アミノ]-4-メチルフェニルでも、3-アミノ-4-メチルフェニルでも、2,6-ジメトキシフェニルでも、3,5-ジメトキシフェニルでも、3-ハロ-4-メトキシフェニルでも、3-ニトロ-4-メチルフェニルでも、4-プロボキシフェニルでも、3,4,5-トリメトキシフェニルでも、非置換フリルでもなく；

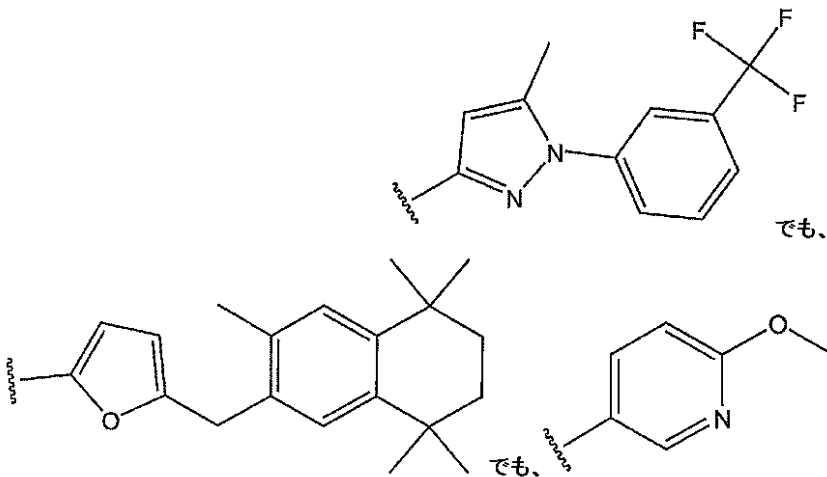
$R^{21}$  が  $-NH-C(O)-$  であり、そして  $R^{19}$  が

【数 3 3】



である場合、 $R^{31}$  は、3,5-ジニトロフェニルでも、4-ブトキシフェニルでも、

【数 3 4】

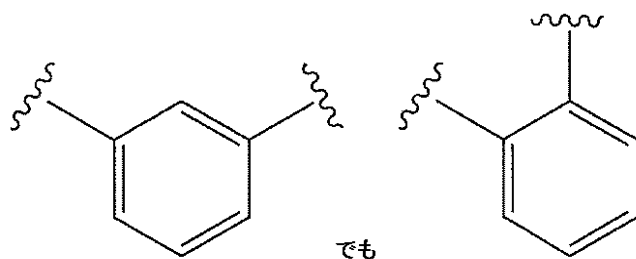


でもない、  
化合物；ならびに

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

【請求項 27】

$R^{21}$  が  $-NH-C(O)-$  である場合、 $R^{19}$  は  
【数 35】



でもない、請求項 26 に記載の組成物。

【請求項 28】

$R^{21}$  が  $-NH-C(O)-$  である場合、 $R^{19}$  は、必要に応じて置換されたピラゾリルでも、チアゾリルでも、チエニルでも、ピロリルでも、ピリミジニルでもなく；

$R^{21}$  が  $-NH-C(O)-CH_2-$  または  $-NH-C(O)-NH-$  である場合、 $R^{19}$  はピラゾリルではなく；そして

$R^{21}$  が  $-NH-$  である場合、 $R^{19}$  は、必要に応じて置換されたピリジリルでも、チアゾリルでも、ピラゾリルでも、チアジアゾリルでも、オキサジアゾリルでもない、  
請求項 24 に記載の組成物。

【請求項 29】

$R^{21}$  が、 $-NH-C(O)-$ 、 $-NH-C(O)-NR_{1'}$  から選択される、請求項 26 または 27 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 30】

$R^{31}$  が、必要に応じて置換されたフェニル、キノキサリニルまたはキノリニルから選択される、請求項 26 または 27 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 31】

$R^{31}$  が、3 個までの置換基で必要に応じて置換されており、該置換基は、 $-OCH_3$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、または可溶化基から独立して選択される、請求項 30 に記載の化合物。

【請求項 32】

$R^{31}$  が、4 - ジメチルアミノフェニル、3, 4 - ジメトキシフェニル、3, 5 - ジメトキシフェニル、3, 4, 5 - トリメトキシフェニル、3 - メトキシ - 4 - ((ピペラジン - 1 - イル)メチル)フェニル、3 - メトキシ - 4 - ((モルホリノ)メチル)フェニル、3 - メトキシ - 4 - ((ピロリジン - 1 - イル)メチル)フェニル、非置換フェニル、非置換キノキサリニル、または非置換キノリニルから選択される、請求項 30 に記載の化合物。

【請求項 33】

$R^{32}$  が、3, 4 - ジメトキシフェニル、2, 6 - ジメトキシフェニル、または 2, 4 - ジメトキシフェニルから選択され；そして  $R^{32}$  が、可溶化基で必要に応じて置換されている、請求項 26 または 27 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 34】

$R^{21}$  が、 $-NH-C(O)-$  から選択されるか、または  $R_{1''}$  および  $R^{21}$  が、これらがそれぞれ結合している記載されるベンゾイミダゾール環およびフェニル環と一緒にあって、6 - 員の複素環式環を形成する、請求項 26 または 27 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 35】

$R^{31}$  が必要に応じて置換されたフェニルである、請求項 34 に記載の化合物。

【請求項 36】

$R^{31}$  が、3 - メトキシフェニル、3, 4 - ジメトキシフェニル、3, 4, 5 - トリメトキシフェニル、または 4 - ジメチルアミノフェニルから選択される、請求項 35 に記載の化合物。

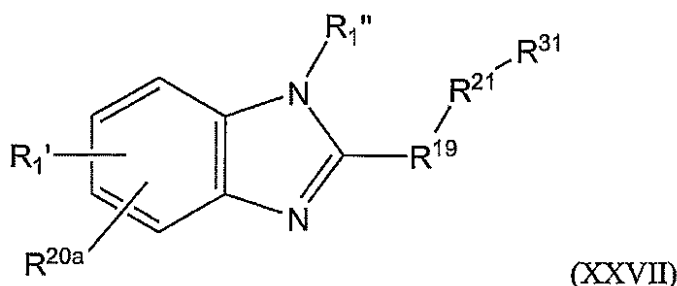
【請求項 37】

薬学的に受容可能なキャリアまたは希釈剤および請求項 1 ~ 23 のいずれか 1 項に記載の化合物を含有する、薬学的組成物。

【請求項 38】

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

【数 51】



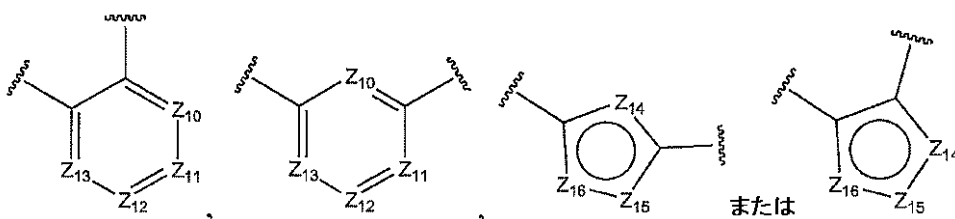
の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩もしくはプロドラッグを含有し、該式において：

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

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

$R^{19}$  は：

【数 52】



から選択され：

各  $Z_{10}$ 、 $Z_{11}$ 、 $Z_{12}$  および  $Z_{13}$  は、N、 $CR^{20}$ 、または  $CR_1'$  から独立して選択され；そして

各  $Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  は、N、 $NR_1'$ 、S、O、 $CR^{20}$ 、または  $CR_1'$  から独立して選択され：

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

$Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  のうちの少なくとも 1 個は、N、 $NR_1'$ 、S または O であり；

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

$Z_{14}$ 、 $Z_{15}$  および  $Z_{16}$  のうちの 0 ~ 2 個は、N または  $NR_1'$  であり；

0 ~ 1 個の  $R^{20}$  は可溶化基であり；

0 ~ 1 個の  $R_1'$  は、必要に応じて置換された  $C_1 \sim C_3$  の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルであり；そして

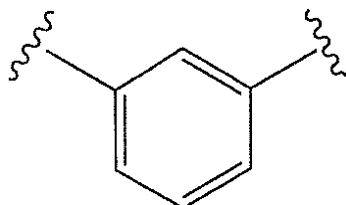
$R^{21}$  は、 $-NR_1' - C(O) -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 -$ 、 $-NR_1' - C(O)$

$-NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(S) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(S) - NR_1' -$   
 $-CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' - NR_1' -$ 、 $-NR_1' -$   
 $-C(=NR_1') - NR_1' -$ 、 $-C(O) - NR_1' -$ 、 $-C(O) - NR_1' - S$   
 $(O)_2 -$ 、 $-NR_1' -$ 、 $-CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' = C$   
 $R_1' -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - NR_1' - S$   
 $(O)_2 -$ 、 $-NR_1' - CR_1' R_1' - C(O) - NR_1' -$ 、 $-CR_1' R_1' -$   
 $C(O) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' = CR_1' - CR_1' R_1' -$   
 $-NR_1' - C(=N-CN) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' -$   
 $-O -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' - CR_1' R_1' - O -$ 、 $-NR_1' -$   
 $S(O)_2 - CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - CR_1' R_1' - CR_1' R_1'$   
 $'_1 -$ 、または  $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' -$  から選択され；そして

$R^{3'}$  は、必要に応じて置換された単環式アリールもしくは二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式ヘテロアリールもしくは二環式ヘテロアリールから選択され、

ただし、 $R^{2'}$  が  $-NH-C(O)-$  であり、そして  $R^{1'9}$  が

【数 53】



である場合、 $R^{3'}$  は、非置換ピリジルでも、2,6-ジメトキシフェニルでも、3,4,5-トリメトキシフェニルでも、非置換フリルでもない、組成物。

【請求項 39】

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

$Het-L-Q-Ar'$  (IVa)

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もしくはプロドラッグを含有し、式 (IVa) において：

$Het$  は、必要に応じて置換された複素環式アリール基であり；

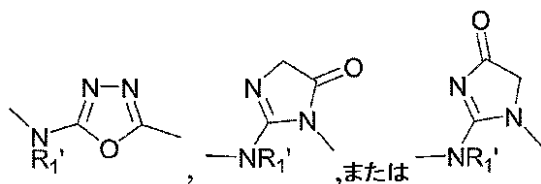
$L$  は、必要に応じて置換された炭素環式アリーレン基または複素環式アリーレン基であり；

$Ar'$  は、必要に応じて置換された炭素環式アリール基または複素環式アリール基であり；そして

$Q$  は、 $-NR_1' - C(O) -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 -$ 、 $-NR_1' - C(O) -$   
 $NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(S) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1'$   
 $_1 - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(=NR_1') - NR_1' -$ 、 $-C(O) - NR_1' -$   
 $-C(O) - NR_1' - S(O)_2 -$ 、 $-NR_1' -$ 、 $-CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1'$   
 $' - C(O) - CR_1' = CR_1' -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - NR_1' -$ 、 $-NR_1'$   
 $' - C(O) - NR_1' - S(O)_2 -$ 、 $-NR_1' - CR_1' R_1' - C(O) - NR_1'$   
 $_1 -$ 、 $-CR_1' R_1' - C(O) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' =$   
 $C(CR_1') -$ 、 $-NR_1' - C(=N-CN) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O)$   
 $- CR_1' R_1' -$ 、



【数 9 8】



から選択され；そして

各  $\text{R}_1'$  は、H または必要に応じて置換された  $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$  の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから独立して選択され；

H e t が多環式ヘテロアリールであり、L が必要に応じて置換されたフェニレンであり、Q と H e t とがメタ配向で L に結合しており、そして A r ' が必要に応じて置換されたフェニルである場合；Q は  $-\text{NH}-\text{C}(\text{O})-$  ではない、

組成物。