

【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3月23日(2006.3.23)

【公表番号】特表2005-535594(P2005-535594A)

【公表日】平成17年11月24日(2005.11.24)

【年通号数】公開・登録公報2005-046

【出願番号】特願2004-506748(P2004-506748)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/41 (2006.01)

A 6 1 K 31/416 (2006.01)

A 6 1 K 31/4184 (2006.01)

A 6 1 K 31/4196 (2006.01)

A 6 1 K 31/423 (2006.01)

A 6 1 K 31/4245 (2006.01)

A 6 1 K 31/428 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/06 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 231/54 (2006.01)

C 0 7 D 231/56 (2006.01)

C 0 7 D 239/42 (2006.01)

C 0 7 D 261/20 (2006.01)

C 0 7 D 275/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/41

A 6 1 K 31/416

A 6 1 K 31/4184

A 6 1 K 31/4196

A 6 1 K 31/423

A 6 1 K 31/4245

A 6 1 K 31/428
A 6 1 K 31/454
A 6 1 K 31/505
A 6 1 K 31/506
A 6 1 K 31/5377
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 13/12
A 6 1 P 17/00
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 19/04
A 6 1 P 31/04
A 6 1 P 31/06
A 6 1 P 31/18
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 37/02
A 6 1 P 43/00 1 1 1
C 0 7 D 231/54
C 0 7 D 231/56 B
C 0 7 D 239/42 Z
C 0 7 D 261/20
C 0 7 D 275/04
C 0 7 D 401/12
C 0 7 D 403/04
C 0 7 D 405/14
C 0 7 D 413/04

【手続補正書】

【提出日】平成18年2月6日(2006.2.6)

【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】

疾患に関連した消耗を治療するための組成物であって、有効成分としてJNK阻害剤を含む組成物。

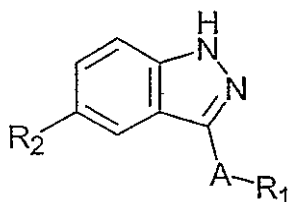
【請求項2】

疾患に関連した消耗を予防するための組成物であって、有効成分としてJNK阻害剤を含む組成物。

【請求項3】

疾患に関連した消耗を治療または予防するための組成物であって、有効成分として下記式

【化 1】



(式中、

Aは、直接結合、 $-(CH_2)_a-$ 、 $-(CH_2)_bCH=CH(CH_2)_c-$ 、または $-(CH_2)_bC \equiv C(CH_2)_c-$ であり；

R_1 は、アリール、ヘテロアリール、またはフェニルに縮合したヘテロ環であって、各々は R_3 から独立に選択される1~4個の置換基で置換されていてもよく；

R_2 は、 $-R_3$ 、 $-R_4$ 、 $-(CH_2)_bC(=O)R_5$ 、 $-(CH_2)_bC(=O)OR_5$ 、 $-(CH_2)_bC(=O)NR_5R_6$ 、 $-(CH_2)_bC(=O)NR_5(CH_2)_cC(=O)R_6$ 、 $-(CH_2)_bNR_5C(=O)R_6$ 、 $-(CH_2)_bNR_5C(=O)NR_6R_7$ 、 $-(CH_2)_bNR_5R_6$ 、 $-(CH_2)_bOR_5$ 、 $-(CH_2)_bSO_2R_5$ 、または $-(CH_2)_bSO_2NR_5R_6$ であり；

aは、1、2、3、4、5、または6であり；

bおよびcは同じかまたは異なり、各々出現するたびに独立に0、1、2、3、または4から選択され；

dは、各々出現するたびに0、1、または2であり；

R_3 は、各々出現するたびに、独立に、ハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、ヘテロシクロアルキル、 $-C(=O)OR_8$ 、 $-OC(=O)R_8$ 、 $-C(=O)NR_8R_9$ 、 $-C(=O)NR_8OR_9$ 、 $-SO_2NR_8R_9$ 、 $-NR_8SO_2R_9$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-NR_8C(=O)R_9$ 、 $-NR_8C(=O)(CH_2)_bOR_9$ 、 $-NR_8C(=O)(CH_2)_bR_9$ 、 $-O(CH_2)_bNR_8R_9$ 、またはフェニルに縮合したヘテロ環であり；

R_4 は、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、またはヘテロシクロアルキルであり、各々は R_3 から独立に選択される1~4個の置換基で置換されていてもよく、あるいは、 R_4 はハロゲンまたはヒドロキシであり；

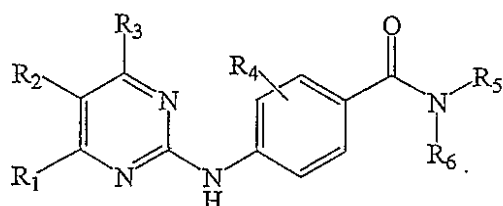
R_5 、 R_6 、および R_7 は同じかまたは異なり、各々出現するたびに独立に、水素、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、またはヘテロシクロアルキルであり、 R_5 、 R_6 、および R_7 の各々は、 R_3 から独立に選択される1~4個の置換基で置換されていてもよく； R_8 および R_9 は同じかまたは異なり、各々出現するたびに独立に、水素、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、またはヘテロシクロアルキルであるか、あるいは R_8 と R_9 はそれらが結合している1個または複数の原子と一緒になってヘテロ環を形成しており、 R^8 、 R^9 、および一緒になってヘテロ環を形成している R^8 と R^9 はそれぞれ、 R_3 から独立に選択される1~4個の置換基で置換されていてもよい)

で表される化合物または医薬的に許容されるその塩を含む組成物。

【請求項 4】

疾患に関連した消耗を治療または予防するための組成物であって、有効成分として下記式

【化 2】



(式中、

R_1 は、 R_7 から独立に選択される1~4個の置換基で置換されていてもよいアリールまたは

ヘテロアリールであり；

R_2 は水素であり；

R_3 は水素または低級アルキルであり；

R_4 は、1～4個の任意選択の置換基を示し、各々の置換基は同じかまたは異なり、独立に、ハロゲン、ヒドロキシ、低級アルキル、および低級アルコキシから選択され；

R_5 および R_6 は同じかまたは異なり、独立に、 $-R_8$ 、 $-(CH_2)_aC(=O)R_9$ 、 $-(CH_2)_aC(=O)OR_9$ 、 $-(CH_2)_aC(=O)NR_9R_{10}$ 、 $-(CH_2)_aC(=O)NR_9(CH_2)_bC(=O)R_{10}$ 、 $-(CH_2)_aNR_9C(=O)R_{10}$ 、 $(CH_2)_aNR_{11}C(=O)NR_9R_{10}$ 、 $-(CH_2)_aNR_9R_{10}$ 、 $-(CH_2)_aOR_9$ 、 $-(CH_2)_aSO_cR_9$ 、または $-(CH_2)_aSO_2NR_9R_{10}$ であるか；

あるいは、 R_5 と R_6 はそれらが結合している窒素原子と一緒にあってヘテロ環または置換ヘテロ環を形成しており；

R_7 は、各々出現するたびに独立に、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、ヘテロシクロアルキル、 $-C(=O)OR_8$ 、 $-OC(=O)R_8$ 、 $-C(=O)NR_8R_9$ 、 $-C(=O)NR_8OR_9$ 、 $-SO_cR_8$ 、 $-SO_cNR_8R_9$ 、 $-NR_8SO_cR_9$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-NR_8C(=O)R_9$ 、 $-NR_8C(=O)(CH_2)_bOR_9$ 、 $-NR_8C(=O)(CH_2)_bR_9$ 、 $-O(CH_2)_bNR_8R_9$ 、またはフェニルに縮合したヘテロ環であり；

R_8 、 R_9 、 R_{10} 、および R_{11} は同じかまたは異なり、各々出現するたびに独立に、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、またはヘテロシクロアルキルであるか；

あるいは、 R_8 と R_9 は、それらが結合している1個または複数の原子と一緒にあってヘテロ環を形成しており；

a および b は同じかまたは異なり、各々出現するたびに独立に、0、1、2、3、または4から選択され；

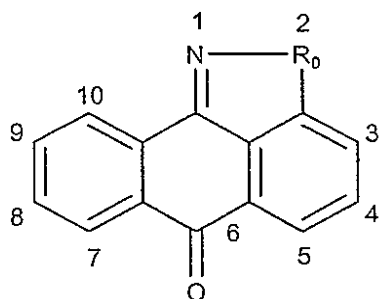
c は、各々出現するたびに、0、1、または2である）

で表される化合物または医薬的に許容されるその塩を含む組成物。

【請求項5】

疾患に関連した消耗を治療または予防するための組成物であって、有効成分として下記式

【化3】



(式中、

R_0 は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 NH 、または $-CH_2-$ である)

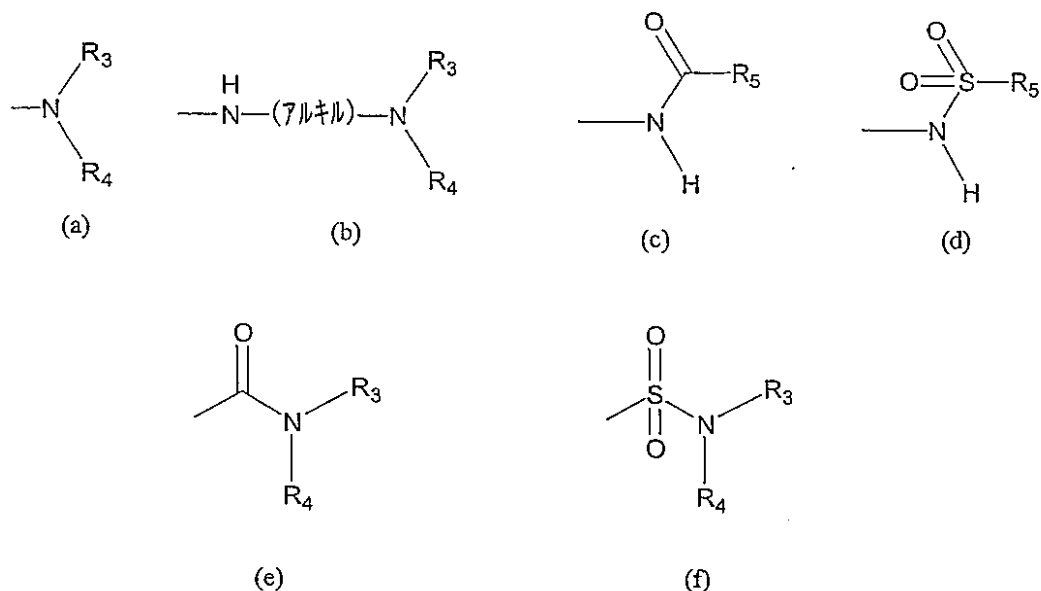
で表される化合物または医薬的に許容されるその塩を含み；

前記化合物が、(i)非置換であるか、(ii)一置換であり、第一置換基を有するか、または(iii)二置換であり、第一置換基および第二置換基を有し；

第一または第二置換基は、存在する場合、3、4、5、7、8、9、または10位にあり、第一および第二置換基は、存在する場合、独立に、アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン、ニトロ、トリフルオロメチル、スルホニル、カルボキシル、アルコキシカルボニル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアルキルオキシ、アリールアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、シクロアルキルオキシ、アルコキシアルキル、アルコキシアルコキシ、アミノアルコキシ、モノ-アルキルアミノアルコキシ、ジ-アルキルアミノアルコキシ

、または式 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、もしくは (f)

【化 4】



により示される基であり；

R₃とR₄は一緒になって、アルキリデンまたはヘテロ原子含有環式アルキリデンを示すか、あるいは、R₃およびR₄は、独立に、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキルアルキル、アリールオキシアルキル、アルコキシアルキル、アミノアルキル、モノ-アルキルアミノアルキル、またはジ-アルキルアミノアルキルであり；

R₅は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アルコキシカルボニルアルキル、アミノ、モノ-アルキルアミノ、ジ-アルキルアミノ、アリールアミノ、アリールアルキルアミノ、シクロアルキルアミノ、シクロアルキルアルキルアミノ、アミノアルキル、モノ-アルキルアミノアルキル、またはジ-アルキルアミノアルキルである、組成物。

【請求項 6】

Aが直接結合である、請求項3に記載の組成物。

【請求項 7】

Aが $-(\text{CH}_2)_a-$ である、請求項3に記載の組成物。

【請求項 8】

Aが $-(\text{CH}_2)_b\text{CH=CH}(\text{CH}_2)_c-$ である、請求項3に記載の組成物。

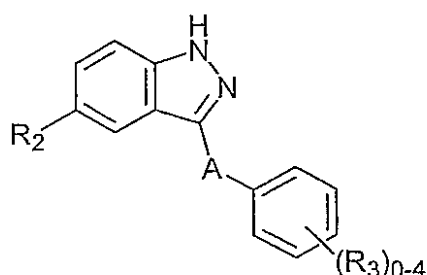
【請求項 9】

Aが $-(\text{CH}_2)_b\text{C}(\text{R}_1)\text{C}(\text{CH}_2)_c-$ である、請求項3に記載の組成物。

【請求項 10】

化合物が下記式

【化 5】



(式中、

Aは、直接結合、 $-(CH_2)_a-$ 、 $-(CH_2)_bCH=CH(CH_2)_c-$ 、または $-(CH_2)_bC \quad C(CH_2)_c-$ であり；

R_1 は、アリール、ヘテロアリール、またはフェニルに縮合したヘテロ環であって、各々は R_3 から独立に選択される1~4個の置換基で置換されていてもよく；

R_2 は、 $-R_3$ 、 $-R_4$ 、 $-(CH_2)_bC(=O)R_5$ 、 $-(CH_2)_bC(=O)OR_5$ 、 $-(CH_2)_bC(=O)NR_5R_6$ 、 $-(CH_2)_bC(=O)NR_5(CH_2)_cC(=O)R_6$ 、 $-(CH_2)_bNR_5C(=O)R_6$ 、 $-(CH_2)_bNR_5C(=O)NR_6R_7$ 、 $-(CH_2)_bNR_5R_6$ 、 $-(CH_2)_bOR_5$ 、 $-(CH_2)_bSO_dR_5$ 、または $-(CH_2)_bSO_2NR_5R_6$ であり；

aは、1、2、3、4、5、または6であり；

bおよびcは同じかまたは異なり、各々出現するたびに独立に0、1、2、3、または4から選択され；

dは、各々出現するたびに0、1、または2であり；

R_3 は、各々出現するたびに、独立に、ハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、ヘテロシクロアルキル、 $-C(=O)OR_8$ 、 $-OC(=O)R_8$ 、 $-C(=O)NR_8R_9$ 、 $-C(=O)NR_8OR_9$ 、 $-SO_2NR_8R_9$ 、 $-NR_8SO_2R_9$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-NR_8C(=O)R_9$ 、 $-NR_8C(=O)(CH_2)_bOR_9$ 、 $-NR_8C(=O)(CH_2)_bR_9$ 、 $-O(CH_2)_bNR_8R_9$ 、またはフェニルに縮合したヘテロ環であり；

R_4 は、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、またはヘテロシクロアルキルであり、各々は R_3 から独立に選択される1~4個の置換基で置換されていてもよく、あるいは、 R_4 はハロゲンまたはヒドロキシであり；

R_5 、 R_6 、および R_7 は同じかまたは異なり、各々出現するたびに独立に、水素、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、またはヘテロシクロアルキルであり、 R_5 、 R_6 、および R_7 の各々は、 R_3 から独立に選択される1~4個の置換基で置換されていてもよく；

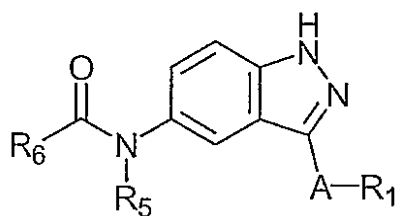
R_8 および R_9 は同じかまたは異なり、各々出現するたびに独立に、水素、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、またはヘテロシクロアルキルであるか、あるいは R_8 と R_9 はそれらが結合している1個または複数の原子と一緒になってヘテロ環を形成しており、 R^8 、 R^9 、および一緒になってヘテロ環を形成している R^8 と R^9 はそれぞれ、 R_3 から独立に選択される1~4個の置換基で置換されていてもよい)

で表される化合物、または医薬的に許容されるその塩である、請求項3に記載の組成物。

【請求項11】

化合物が、下記式

【化6】



(式中、

Aは、直接結合、 $-(CH_2)_a-$ 、 $-(CH_2)_bCH=CH(CH_2)_c-$ 、または $-(CH_2)_bC \quad C(CH_2)_c-$ であり；

R_1 は、アリール、ヘテロアリール、またはフェニルに縮合したヘテロ環であって、各々は R_3 から独立に選択される1~4個の置換基で置換されていてもよく；

R_2 は、 $-R_3$ 、 $-R_4$ 、 $-(CH_2)_bC(=O)R_5$ 、 $-(CH_2)_bC(=O)OR_5$ 、 $-(CH_2)_bC(=O)NR_5R_6$ 、 $-(CH_2)_bC(=O)NR_5(CH_2)_cC(=O)R_6$ 、 $-(CH_2)_bNR_5C(=O)R_6$ 、 $-(CH_2)_bNR_5C(=O)NR_6R_7$ 、 $-(CH_2)_bNR_5R_6$ 、 $-(CH_2)_bOR_5$ 、 $-(CH_2)_bSO_dR_5$ 、または $-(CH_2)_bSO_2NR_5R_6$ であり；

aは、1、2、3、4、5、または6であり；

bおよびcは同じかまたは異なり、各々出現するたびに独立に0、1、2、3、または4から選択され；

dは、各々出現するたびに0、1、または2であり；

R_3 は、各々出現するたびに、独立に、ハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、ヘテロシクロアルキル、 $-C(=O)OR_8$ 、 $-OC(=O)R_8$ 、 $-C(=O)NR_8R_9$ 、 $-C(=O)NR_8OR_9$ 、 $-SO_2NR_8R_9$ 、 $-NR_8SO_2R_9$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-NR_8C(=O)R_9$ 、 $-NR_8C(=O)(CH_2)_bOR_9$ 、 $-NR_8C(=O)(CH_2)_bR_9$ 、 $-O(CH_2)_bNR_8R_9$ 、またはフェニルに縮合したヘテロ環であり；

R_4 は、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、またはヘテロシクロアルキルであり、各々は R_3 から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていてもよく、あるいは、 R_4 はハロゲンまたはヒドロキシであり；

R_5 、 R_6 、および R_7 は同じかまたは異なり、各々出現するたびに独立に、水素、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、またはヘテロシクロアルキルであり、 R_5 、 R_6 、および R_7 の各々は、 R_3 から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていてもよく；

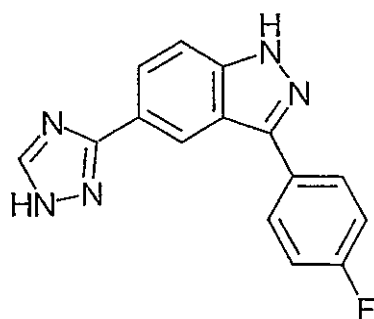
R_8 および R_9 は同じかまたは異なり、各々出現するたびに独立に、水素、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、またはヘテロシクロアルキルであるか、あるいは R_8 と R_9 はそれらが結合している1個または複数の原子と一緒になってヘテロ環を形成しており、 R^8 、 R^9 、および一緒になってヘテロ環を形成している R^8 と R^9 はそれぞれ、 R_3 から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていてもよい)

で表される化合物または医薬的に許容されるその塩である、請求項3に記載の組成物。

【請求項12】

化合物が下記式

【化7】

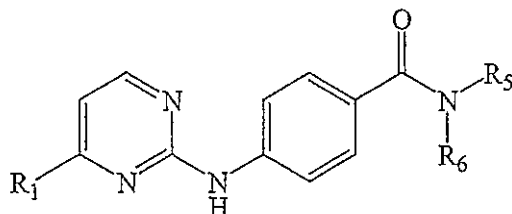


で表される化合物または医薬的に許容されるその塩である、請求項3に記載の組成物。

【請求項13】

化合物が下記式

【化8】



(式中、

R_1 は、 R_7 から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていてもよいアリールまたはヘテロアリールであり；

R_2 は水素であり；

R_3 は水素または低級アルキルであり；

R_4 は、1～4個の任意選択の置換基を示し、各々の置換基は同じかまたは異なり、独立に、ハロゲン、ヒドロキシ、低級アルキル、および低級アルコキシから選択され；

R_5 および R_6 は同じかまたは異なり、独立に、 $-R_8$ 、 $-(CH_2)_aC(=O)R_9$ 、 $-(CH_2)_aC(=O)OR_9$ 、

$-(CH_2)_a C(=O)NR_9R_{10}$ 、 $-(CH_2)_a C(=O)NR_9(CH_2)_b C(=O)R_{10}$ 、 $-(CH_2)_a NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $(CH_2)_a NR_{11}C(=O)NR_9R_{10}$ 、 $-(CH_2)_a NR_9R_{10}$ 、 $-(CH_2)_a OR_9$ 、 $-(CH_2)_a SO_c R_9$ 、または $-(CH_2)_a SO_2 NR_9R_{10}$ であるか；

あるいは、 R_5 と R_6 はそれらが結合している窒素原子と一緒になってヘテロ環または置換ヘテロ環を形成しており；

R_7 は、各々出現するたびに独立に、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、ヘテロシクロアルキル、 $-C(=O)OR_8$ 、 $-OC(=O)R_8$ 、 $-C(=O)NR_8R_9$ 、 $-C(=O)NR_8OR_9$ 、 $-SO_cR_8$ 、 $-SO_cNR_8R_9$ 、 $-NR_8SO_cR_9$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-NR_8C(=O)R_9$ 、 $-NR_8C(=O)(CH_2)_bOR_9$ 、 $-NR_8C(=O)(CH_2)_bR_9$ 、 $-O(CH_2)_bNR_8R_9$ 、またはフェニルに縮合したヘテロ環であり；

R_8 、 R_9 、 R_{10} 、および R_{11} は同じかまたは異なり、各々出現するたびに独立に、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、またはヘテロシクロアルキルであるか；

あるいは、 R_8 と R_9 は、それらが結合している1個または複数の原子と一緒になってヘテロ環を形成しており；

aおよびbは同じかまたは異なり、各々出現するたびに独立に、0、1、2、3、または4から選択され；

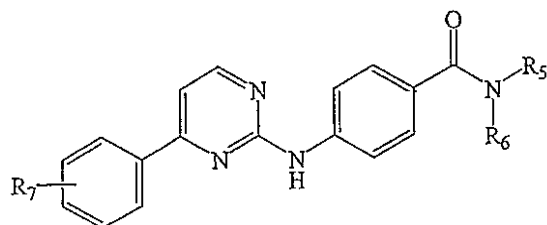
cは、各々出現するたびに、0、1、または2である)

で表される化合物または医薬的に許容されるその塩である、請求項4に記載の組成物。

【請求項14】

化合物が、下記式

【化9】



(式中、

R_1 は、 R_7 から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていてもよいアリールまたはヘテロアリールであり；

R_2 は水素であり；

R_3 は水素または低級アルキルであり；

R_4 は、1～4個の任意選択の置換基を示し、各々の置換基は同じかまたは異なり、独立に、ハロゲン、ヒドロキシ、低級アルキル、および低級アルコキシから選択され；

R_5 および R_6 は同じかまたは異なり、独立に、 $-R_8$ 、 $-(CH_2)_a C(=O)R_9$ 、 $-(CH_2)_a C(=O)OR_9$ 、 $-(CH_2)_a C(=O)NR_9R_{10}$ 、 $-(CH_2)_a C(=O)NR_9(CH_2)_b C(=O)R_{10}$ 、 $-(CH_2)_a NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $(CH_2)_a NR_{11}C(=O)NR_9R_{10}$ 、 $-(CH_2)_a NR_9R_{10}$ 、 $-(CH_2)_a OR_9$ 、 $-(CH_2)_a SO_c R_9$ 、または $-(CH_2)_a SO_2 NR_9R_{10}$ であるか；

あるいは、 R_5 と R_6 はそれらが結合している窒素原子と一緒になってヘテロ環または置換ヘテロ環を形成しており；

R_7 は、各々出現するたびに独立に、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、ヘテロシクロアルキル、 $-C(=O)OR_8$ 、 $-OC(=O)R_8$ 、 $-C(=O)NR_8R_9$ 、 $-C(=O)NR_8OR_9$ 、 $-SO_cR_8$ 、 $-SO_cNR_8R_9$ 、 $-NR_8SO_cR_9$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-NR_8C(=O)R_9$ 、 $-NR_8C(=O)(CH_2)_bOR_9$ 、 $-NR_8C(=O)(CH_2)_bR_9$ 、 $-O(CH_2)_bNR_8R_9$ 、またはフェニルに縮合したヘテロ環であり；

R_8 、 R_9 、 R_{10} 、および R_{11} は同じかまたは異なり、各々出現するたびに独立に、水素、ア

ルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、またはヘテロシクロアルキルであるか；

あるいは、 R_8 と R_9 は、それらが結合している1個または複数の原子と一緒になってヘテロ環を形成しており；

aおよびbは同じかまたは異なり、各々出現するたびに独立に、0、1、2、3、または4から選択され；

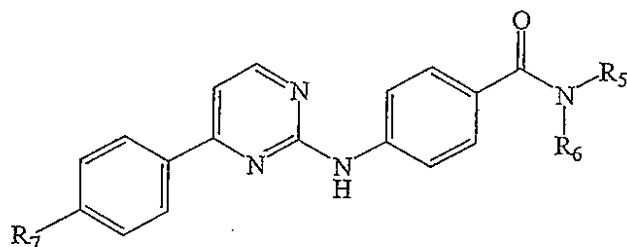
cは、各々出現するたびに、0、1、または2である）

で表される化合物または医薬的に許容されるその塩である、請求項4に記載の組成物。

【請求項15】

化合物が、下記式

【化10】



(式中、

R_1 は、 R_7 から独立に選択される1～4個の置換基で置換されていてもよいアリールまたはヘテロアリールであり；

R_2 は水素であり；

R_3 は水素または低級アルキルであり；

R_4 は、1～4個の任意選択の置換基を示し、各々の置換基は同じかまたは異なり、独立に、ハロゲン、ヒドロキシ、低級アルキル、および低級アルコキシから選択され；

R_5 および R_6 は同じかまたは異なり、独立に、 $-R_8$ 、 $-(CH_2)_a C(=O)R_9$ 、 $-(CH_2)_a C(=O)OR_9$ 、 $-(CH_2)_a C(=O)NR_9 R_{10}$ 、 $-(CH_2)_a C(=O)NR_9 (CH_2)_b C(=O)R_{10}$ 、 $-(CH_2)_a NR_9 C(=O)R_{10}$ 、 $(CH_2)_a NR_{11} C(=O)NR_9 R_{10}$ 、 $-(CH_2)_a NR_9 R_{10}$ 、 $-(CH_2)_a OR_9$ 、 $-(CH_2)_a SO_c R_9$ 、または $-(CH_2)_a SO_2 NR_9 R_{10}$ であるか；

あるいは、 R_5 と R_6 はそれらが結合している窒素原子と一緒になってヘテロ環を形成しており；

R_7 は、各々出現するたびに独立に、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、ヘテロシクロアルキル、 $-C(=O)OR_8$ 、 $-OC(=O)R_8$ 、 $-C(=O)NR_8 R_9$ 、 $-C(=O)NR_8 OR_9$ 、 $-SO_c R_8$ 、 $-SO_c NR_8 R_9$ 、 $-NR_8 SO_c R_9$ 、 $-NR_8 R_9$ 、 $-NR_8 C(=O)R_9$ 、 $-NR_8 C(=O)(CH_2)_b OR_9$ 、 $-NR_8 C(=O)(CH_2)_b R_9$ 、 $-O(CH_2)_b NR_8 R_9$ 、またはフェニルに縮合したヘテロ環であり；

R_8 、 R_9 、 R_{10} 、および R_{11} は同じかまたは異なり、各々出現するたびに独立に、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、またはヘテロシクロアルキルであるか；

あるいは、 R_8 と R_9 は、それらが結合している1個または複数の原子と一緒になってヘテロ環を形成しており；

aおよびbは同じかまたは異なり、各々出現するたびに独立に、0、1、2、3、または4から選択され；

cは、各々出現するたびに、0、1、または2である）

で表される化合物または医薬的に許容されるその塩である、請求項4に記載の組成物。

【請求項16】

R_0 が-O-である、請求項5に記載の組成物。

【請求項17】

R_0 が -S- である、請求項5に記載の組成物。

【請求項 18】

R_0 が -S(0)- である、請求項5に記載の組成物。

【請求項 19】

R_0 が -S(0)₂- である、請求項5に記載の組成物。

【請求項 20】

R_0 が NH である、請求項5に記載の組成物。

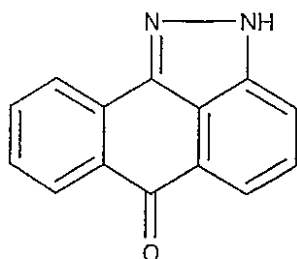
【請求項 21】

R_0 が CH₂- である、請求項5に記載の組成物。

【請求項 22】

化合物が下記式

【化 11】



で表される化合物または医薬的に許容されるその塩である、請求項5に記載の組成物。

【請求項 23】

予防剤または治療剤をさらに含む、請求項1に記載の組成物。

【請求項 24】

予防剤または治療剤をさらに含む、請求項2に記載の組成物。

【請求項 25】

予防剤または治療剤をさらに含む、請求項3に記載の組成物。

【請求項 26】

予防剤または治療剤をさらに含む、請求項5に記載の組成物。

【請求項 27】

予防剤または治療剤をさらに含む、請求項5に記載の組成物。

【請求項 28】

疾患が、HIV、エイズ、末期腎疾患、腎不全、癌、結核、慢性心不全、慢性肺疾患、関節リウマチ、強皮症、混合結合組織疾患、骨関節炎、または細菌性心内膜炎である、請求項1に記載の組成物。

【請求項 29】

疾患が、HIV、エイズ、末期腎疾患、腎不全、癌、結核、慢性心不全、慢性肺疾患、関節リウマチ、強皮症、混合結合組織疾患、骨関節炎、または細菌性心内膜炎である、請求項2に記載の組成物。

【請求項 30】

疾患が、HIV、エイズ、末期腎疾患、腎不全、癌、結核、慢性心不全、慢性肺疾患、関節リウマチ、強皮症、混合結合組織疾患、骨関節炎、または細菌性心内膜炎である、請求項3に記載の組成物。

【請求項 31】

疾患が、HIV、エイズ、末期腎疾患、腎不全、癌、結核、慢性心不全、慢性肺疾患、関節リウマチ、強皮症、混合結合組織疾患、骨関節炎、または細菌性心内膜炎である、請求項4に記載の組成物。

【請求項 32】

疾患が、HIV、エイズ、末期腎疾患、腎不全、癌、結核、慢性心不全、慢性肺疾患、関節リウマチ、強皮症、混合結合組織疾患、骨関節炎、または細菌性心内膜炎である、請求

項5に記載の組成物。