

【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25年4月18日 (2013.4.18)

【公表番号】特表2012-519703(P2012-519703A)

【公表日】平成24年8月30日 (2012.8.30)

【年通号数】公開・登録公報2012-034

【出願番号】特願2011-553135(P2011-553135)

【国際特許分類】

C 0 7 K 5/06 (2006.01)

C 0 7 D 295/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/5375 (2006.01)

C 0 7 D 207/16 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

C 0 7 D 473/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/522 (2006.01)

C 0 7 D 241/08 (2006.01)

C 0 7 D 233/74 (2006.01)

C 0 7 D 233/56 (2006.01)

A 6 1 K 31/4164 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 K 5/06

C 0 7 D 295/12 C S P Z

A 6 1 K 31/5375

C 0 7 D 207/16

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 37/02

C 0 7 D 473/08

A 6 1 K 31/522

C 0 7 D 241/08

C 0 7 D 233/74

C 0 7 D 233/56

A 6 1 K 31/4164

A 6 1 P 43/00 1 2 3

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/00  
A 6 1 P 21/02  
A 6 1 P 25/08  
A 6 1 P 25/10  
A 6 1 P 25/12  
A 6 1 P 25/14  
A 6 1 P 9/10  
A 6 1 P 3/10  
A 6 1 P 25/02  
A 6 1 P 17/14

【手続補正書】

【提出日】平成25年3月4日(2013.3.4)

【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】

(2R,3R)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミド、(2R,3S)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミド及び(2S,3R)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミドから成る群から選択される化合物又はこれらの医薬的に許容された塩、溶媒和物、エステル若しくはプロドラッグから成る、p75発現に係る障害を治療するための医薬組成物。

【請求項 2】

(2S,3S)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミド、(2R,3R)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミド、(2R,3S)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミド及び(2S,3R)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミドから成る群から選択される2以上の化合物の混合物、又はこれらの化合物の医薬的に許容された塩、溶媒和物、エステル若しくはプロドラッグ(但し、該混合物が、(2S,3S)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミド及び(2R,3R)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミドのみから成る混合物、又はこれらの医薬的に許容された塩、溶媒和物、エステル若しくはプロドラッグである場合、(2S,3S)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミド又はこの医薬的に許容された塩、溶媒和物、エステル若しくはプロドラッグの量は、該混合物の総量に対して約5重量%未満ではない。)から成る、p75発現に係る障害を治療するための医薬組成物。

【請求項 3】

(2R,3R)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミド、(2R,3S)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミド及び(2S,3R)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミドから成る群から選択される化合物又はこれらの医薬的に許容された塩、溶媒和物、エステル若しくはプロドラッグ。

【請求項 4】

(2S,3S)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミド、(2R,3R)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミド、(2R,3S)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミド及び(2S,3R)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミドから成る群から選択される2以上の化合物の混合物、又はこれらの化合物の医薬的に許容された塩、溶媒和物、エステル若しくはプロドラッグ(但し、該混合物が、(2S,3S)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミド及び(2R,3

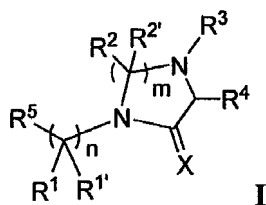
R)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミドのみから成る混合物、又はこれらの医薬的に許容された塩、溶媒和物、エステル若しくはプロドラッグである場合、(2S,3S)-2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ペンタンアミド又はこの医薬的に許容された塩、溶媒和物、エステル若しくはプロドラッグの量は、該混合物の総量に対して約5重量%未満ではない。 )。

【請求項5】

医薬的に許容された希釈剤又は担体、及び化学式I、IA、IB、II、IIA、IIB、III、IV又はIVAで表される化合物又はこれらの医薬的に許容された塩、エステル、プロドラッグ若しくは溶媒和物から成る医薬組成物であって、

該化学式Iで表される化合物が下記構造：

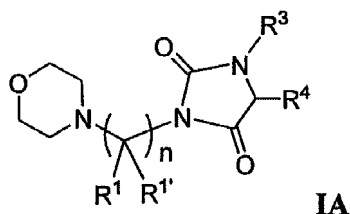
【化1】



(式中、 $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、又は $R^2$ 及び $R^{2'}$ は共に=O、=S又は=CH<sub>2</sub>を形成してもよく、 $R^5$ は、ヘテロシクロアルキル基を表し、Xは、CH<sub>2</sub>、NH、O又はSを表し、nは0、1、2、3、4、又は5を表し、mは1又は2を表す。)で表され、

該化学式IAで表される化合物が下記構造：

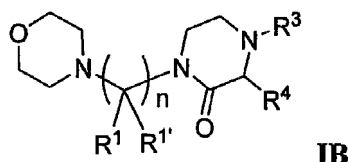
【化2】



(式中、 $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、nは、0、1、2、3、4又は5を表す。)で表され、

該化学式IBで表される化合物が下記構造：

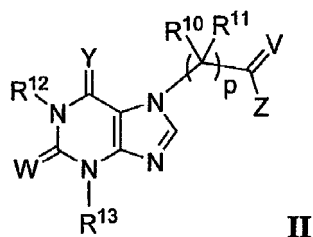
【化3】



(式中、 $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表す。)で表され、

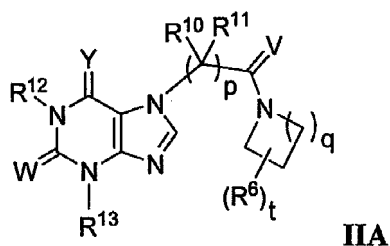
該化学式IIで表される化合物が下記構造：

## 【化 4】



(式中、p は、0, 1, 2, 3, 4, 5 又は 6 を表し、Y、V 及び W は、それぞれ独立して、 $=CH_2$ 、 $=NH$ 、 $=O$  又は  $=S$  を表し、 $R^{10}$  及び  $R^{11}$  は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、 $R^{12}$  及び  $R^{13}$  は、それぞれ独立して、水素原子、 $-NR^aR^b$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)NHR^a$ 、 $-NHC(=O)R^a$ 、 $-NHS(=O)_2R^a$  又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、 $R^a$  及び  $R^b$  は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、Z はヘテロシクロアルキル基又はヘテロアリール基を表し、各ヘテロシクロアルキル基又はヘテロアリール基はヘテロ原子を介して結合し、任意に置換基を有していてもよい。) で表され、該化学式 IIA で表される化合物が下記構造：

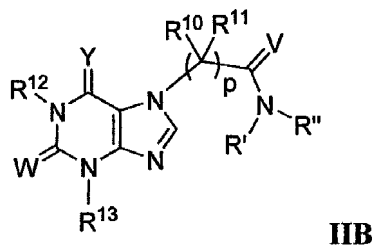
## 【化 5】



(式中、p は、0, 1, 2, 3, 4, 5 又は 6 を表し、q は、1, 2, 3 又は 4 を表し、t は、0, 1, 2, 又は 3 を表し、Y、V 及び W は、それぞれ独立して、O 又は S を表し、 $R^6$  は、それぞれ独立して、 $-NR^aR^b$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)NHR^a$ 、 $-NHC(=O)R^a$ 、 $-NHS(=O)_2R^a$  又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、 $R^{10}$  及び  $R^{11}$  は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、 $R^{12}$  及び  $R^{13}$  は、それぞれ独立して、水素原子、 $-NR^aR^b$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)NHR^a$ 、 $-NHC(=O)R^a$ 、 $-NHS(=O)_2R^a$  又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表す。) で表され、

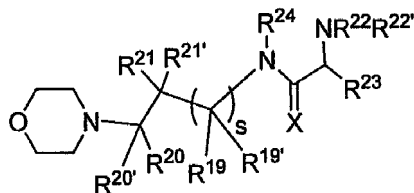
該化学式 IIB で表される化合物が下記構造：

## 【化 6】



(式中、p は、0, 1, 2, 3, 4, 5 又は 6 を表し、Y、V 及び W は、それぞれ独立して、O 又は S を表し、 $R^{10}$  及び  $R^{11}$  は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、 $R^{12}$  及び  $R^{13}$  は、それぞれ独立して、水素原子、 $-NR^aR^b$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)NHR^a$ 、 $-NHC(=O)R^a$ 、 $-NHS(=O)_2R^a$  又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、 $R'$  及び  $R''$  は、これらに結合した窒素原子と共に任意に置換基を有していてもよい複素環アリール基を形成する。) で表され、該化学式 III で表される化合物が下記構造：

## 【化 7】

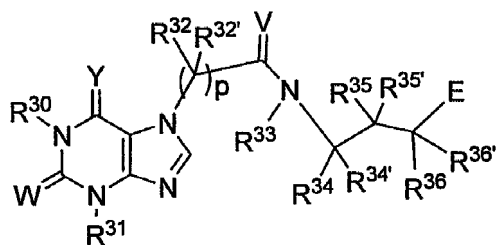


III

(式中、Xは、CH<sub>2</sub>、NH、O又はSを表し、sは、0、1、2、3又は4を表し、R<sup>19</sup>、R<sup>19'</sup>、R<sup>20</sup>、R<sup>20'</sup>、R<sup>21</sup>、R<sup>21'</sup>、R<sup>22</sup>、R<sup>22'</sup>及びR<sup>24</sup>は、それぞれ独立して、不存在、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、又はR<sup>20</sup>及びR<sup>20'</sup>は共に=O、=S又は=CH<sub>2</sub>を形成してもよく、又はR<sup>20</sup>及びR<sup>21</sup>はこれらに結合する原子と共に任意に置換基を有していてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、又はR<sup>20</sup>及びR<sup>21</sup>はこれらに結合する原子と共に任意に置換基を有していてもよいアリール基を形成してもよく、又はR<sup>19</sup>及びR<sup>20</sup>は、これらに結合する原子と共に任意に置換基を有していてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、又はR<sup>19</sup>及びR<sup>20</sup>は、これらに結合する原子と共に任意に置換基を有していてもよいアリール基を形成してもよく、R<sup>23</sup>は、水素原子、任意に置換基を有していてもよいアルキル基、任意に置換基を有していてもよいシクロアルキル基、又は任意に置換基を有していてもよいアリール基を表す。)で表され、

該化学式IVで表される化合物が下記構造：

## 【化 8】

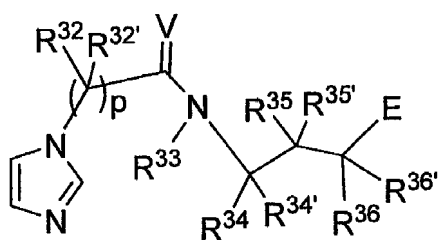


IV

(式中、pは、1、2、3、4、5又は6を表し、Y、V及びWは、それぞれ独立して、CH<sub>2</sub>、NH、O又はSを表し、R<sup>30</sup>、R<sup>31</sup>、R<sup>32</sup>、R<sup>32'</sup>、R<sup>33</sup>、R<sup>34</sup>、R<sup>34'</sup>、R<sup>35</sup>、R<sup>35'</sup>、R<sup>36</sup>、及びR<sup>36'</sup>は、それぞれ独立して、不存在、水素原子、又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、又はR<sup>34</sup>及びR<sup>36</sup>は、これらに結合する原子と共に、任意に置換基を有していてもよい炭化水素環を形成してもよく、Eは、-CHR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>、-NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>、-OR<sup>c</sup>又はSR<sup>c</sup>を表し、R<sup>c</sup>及びR<sup>d</sup>は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、又はR<sup>c</sup>及びR<sup>d</sup>はこれらに結合する窒素原子と共に任意に置換基を有していてもよい複素環基を形成し、又はR<sup>c</sup>及びR<sup>d</sup>はこれらに結合する炭素原子と共に任意に置換基を有していてもよい炭素環基を形成する。)で表され、

該化学式IVAで表される化合物が下記構造：

## 【化 9】



IVA

(式中、pは1、2、3、4、5又は6を表し、Vは、CH<sub>2</sub>、NH、O又はSを表し、R<sup>32</sup>、R<sup>32'</sup>、R<sup>33</sup>、R<sup>34</sup>、R<sup>34'</sup>、R<sup>35</sup>、R<sup>35'</sup>、R<sup>36</sup>及びR<sup>36'</sup>は、それぞ

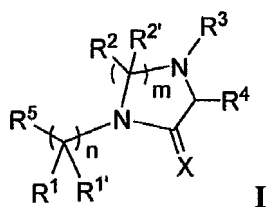
れ独立して、不存在、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、又は  $R^3$ 、 $R^4$  及び  $R^3$ 、 $R^6$  は、これらに結合する原子と共に任意に置換基を有していてもよい炭素環基を形成してもよく、E は、 $-\text{CHR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{OR}^c$  及び  $-\text{SR}^c$  を表し、 $R^c$  及び  $R^d$  は、それぞれ独立して水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、又は  $R^c$  及び  $R^d$  は、これらに結合する窒素原子と共に任意に置換基を有していてもよい複素環基を形成し、又は  $R^c$  及び  $R^d$  は、これらに結合する炭素原子と共に任意に置換基を有していてもよい炭素環基を形成する。) で表される医薬組成物。

【請求項 6】

化学式 I、IA、IB、II、IIA、IIB、III、IV 又は IVA で表される化合物又はこれらの医薬的に許容された塩、エステル、プロドラッグ若しくは溶媒和物から成る、p75 発現に関係する障害を治療するための医薬組成物であって、

該化学式 I で表される化合物が下記構造：

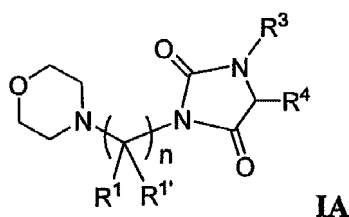
【化 1】



(式中、 $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、又は  $R^2$  及び  $R^{2'}$  は共に  $=\text{O}$ 、 $=\text{S}$  又は  $=\text{CH}_2$  を形成してもよく、 $R^5$  は、ヘテロシクロアルキル基を表し、X は、 $\text{CH}_2$ 、 $\text{NH}$ 、 $\text{O}$  又は  $\text{S}$  を表し、n は 0, 1, 2, 3, 4, 又は 5 を表し、m は 1 又は 2 を表す。) で表され、

該化学式 IA で表される化合物が下記構造：

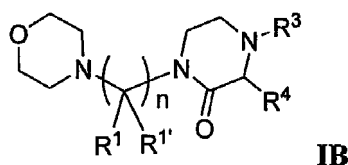
【化 2】



(式中、 $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、n は、0, 1, 2, 3, 4 又は 5 を表す。) で表され、

該化学式 IB で表される化合物が下記構造：

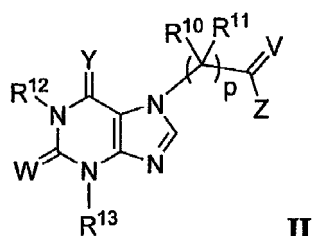
【化 3】



(式中、 $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表す。) で表され、

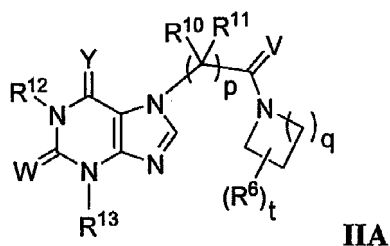
該化学式 II で表される化合物が下記構造：

## 【化 4】



(式中、p は、0, 1, 2, 3, 4, 5 又は 6 を表し、Y、V 及び W は、それぞれ独立して、 $=CH_2$ 、 $=NH$ 、 $=O$  又は  $=S$  を表し、 $R^{10}$  及び  $R^{11}$  は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、 $R^{12}$  及び  $R^{13}$  は、それぞれ独立して、水素原子、 $-NR^aR^b$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)NHR^a$ 、 $-NHC(=O)R^a$ 、 $-NHS(=O)_2R^a$  又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、 $R^a$  及び  $R^b$  は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、Z はヘテロシクロアルキル基又はヘテロアリール基を表し、各ヘテロシクロアルキル基又はヘテロアリール基はヘテロ原子を介して結合し、任意に置換基を有していてもよい。) で表され、該化学式 IIA で表される化合物が下記構造：

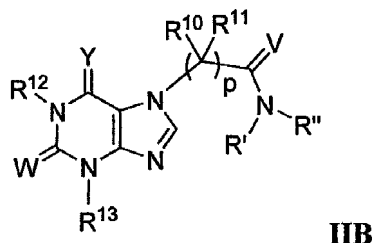
## 【化 5】



(式中、p は、0, 1, 2, 3, 4, 5 又は 6 を表し、q は、1, 2, 3 又は 4 を表し、t は、0, 1, 2, 又は 3 を表し、Y、V 及び W は、それぞれ独立して、O 又は S を表し、 $R^6$  は、それぞれ独立して、 $-NR^aR^b$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)NHR^a$ 、 $-NHC(=O)R^a$ 、 $-NHS(=O)_2R^a$  又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、 $R^{10}$  及び  $R^{11}$  は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、 $R^{12}$  及び  $R^{13}$  は、それぞれ独立して、水素原子、 $-NR^aR^b$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)NHR^a$ 、 $-NHC(=O)R^a$ 、 $-NHS(=O)_2R^a$  又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表す。) で表され、

該化学式 IIB で表される化合物が下記構造：

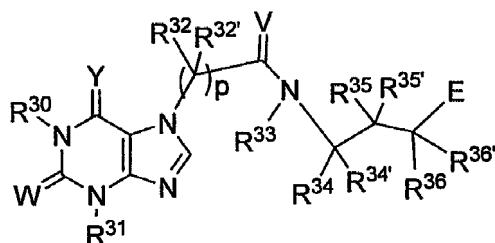
## 【化 6】



(式中、p は、0, 1, 2, 3, 4, 5 又は 6 を表し、Y、V 及び W は、それぞれ独立して、O 又は S を表し、 $R^{10}$  及び  $R^{11}$  は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、 $R^{12}$  及び  $R^{13}$  は、それぞれ独立して、水素原子、 $-NR^aR^b$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)NHR^a$ 、 $-NHC(=O)R^a$ 、 $-NHS(=O)_2R^a$  又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、 $R'$  及び  $R''$  は、これらに結合した窒素原子と共に任意に置換基を有していてもよい複素環アリール基を形成する。) で表され、該化学式 III で表される化合物が下記構造：

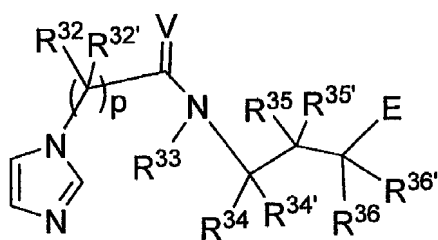
(式中、Xは、CH<sub>2</sub>、NH、O又はSを表し、sは、0, 1, 2, 3又は4を表し、R<sup>1 9</sup>, R<sup>1 9</sup>, R<sup>2 0</sup>, R<sup>2 0</sup>, R<sup>2 1</sup>, R<sup>2 1</sup>, R<sup>2 2</sup>, R<sup>2 2</sup>及びR<sup>2 4</sup>は、それぞれ独立して、不存在、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、又はR<sup>2 0</sup>及びR<sup>2 0</sup>は共に=O、=S又は=CH<sub>2</sub>を形成してもよく、又はR<sup>2 0</sup>及びR<sup>2 1</sup>はこれらに結合する原子と共に任意に置換基を有していてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、又はR<sup>2 0</sup>及びR<sup>2 1</sup>はこれらに結合する原子と共に任意に置換基を有していてもよいアリール基を形成してもよく、又はR<sup>1 9</sup>及びR<sup>2 0</sup>は、これらに結合する原子と共に任意に置換基を有していてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、又はR<sup>1 9</sup>及びR<sup>2 0</sup>は、これらに結合する原子と共に任意に置換基を有していてもよいアリール基を形成してもよく、R<sup>2 3</sup>は、水素原子、任意に置換基を有していてもよいアルキル基、任意に置換基を有していてもよいシクロアルキル基、又は任意に置換基を有していてもよいアリール基を表す。)で表され、

【化 8】



(式中、pは、1, 2, 3, 4, 5又は6を表し、Y, V及びWは、それぞれ独立して、 $\text{CH}_2$ ,  $\text{NH}$ ,  $\text{O}$ 又は $\text{S}$ を表し、 $\text{R}^{30}$ ,  $\text{R}^{31}$ ,  $\text{R}^{32}$ ,  $\text{R}^{33}$ ,  $\text{R}^{34}$ ,  $\text{R}^{35}$ ,  $\text{R}^{36}$ , 及び $\text{R}^{36}$ は、それぞれ独立して、不存在、水素原子、又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、又は $\text{R}^{34}$ 及び $\text{R}^{36}$ は、これらに結合する原子と共に、任意に置換基を有していてもよい炭化水素環を形成してもよく、Eは、 $-\text{CHR}^{\text{c}}$ 、 $-\text{NR}^{\text{c}}$ 、 $-\text{OR}^{\text{c}}$ 又は $\text{SR}^{\text{c}}$ を表し、 $\text{R}^{\text{c}}$ 及び $\text{R}^{\text{d}}$ は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、又は $\text{R}^{\text{c}}$ 及び $\text{R}^{\text{d}}$ はこれらに結合する窒素原子と共に任意に置換基を有していてもよい複素環基を形成し、又は $\text{R}^{\text{c}}$ 及び $\text{R}^{\text{d}}$ はこれらに結合する炭素原子と共に任意に置換基を有していてもよい炭素環基を形成する。)で表され、

【化 9】



(式中、pは1, 2, 3, 4, 5又は6を表し、Vは、CH<sub>2</sub>、NH、O又はSを表し、R<sup>3 2</sup>, R<sup>3 2'</sup>, R<sup>3 3</sup>, R<sup>3 4</sup>, R<sup>3 4'</sup>, R<sup>3 5</sup>, R<sup>3 5'</sup>, R<sup>3 6</sup>及びR<sup>3 6'</sup>は、それぞ

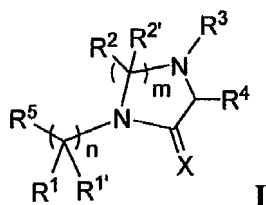


れ独立して、不存在、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、又は  $R^3$  及び  $R^3$  は、これらに結合する原子と共に任意に置換基を有していてもよい炭素環基を形成してもよく、E は、 $-\text{CHR}^cR^d$ 、 $-\text{NR}^cR^d$ 、 $-\text{OR}^c$  及び  $-\text{SR}^c$  を表し、 $R^c$  及び  $R^d$  は、それぞれ独立して水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、又は  $R^c$  及び  $R^d$  は、これらに結合する窒素原子と共に任意に置換基を有していてもよい複素環基を形成し、又は  $R^c$  及び  $R^d$  は、これらに結合する炭素原子と共に任意に置換基を有していてもよい炭素環基を形成する。) で表される 医薬組成物。

【請求項 7】

化学式 I :

【化 1】

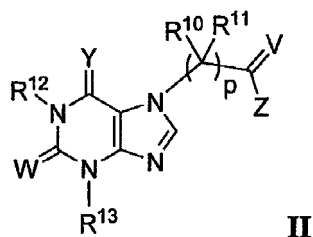


(式中、 $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、又は  $R^2$  及び  $R^{2'}$  は共に  $=O$ 、 $=S$  又は  $=CH_2$  を形成してもよく、 $R^5$  は、ヘテロシクロアルキル基を表し、X は、 $CH_2$ 、 $NH$ 、 $O$ 、又は  $S$  を表し、n は 0, 1, 2, 3, 4, 又は 5 を表し、m は 1 又は 2 を表す。) で表される化合物又は医薬的に許容可能なこれらの塩、エステル、プロドラッグ若しくは溶媒和物。

【請求項 8】

化学式 II :

【化 4】

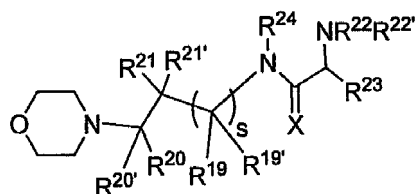


(式中、p は、0, 1, 2, 3, 4, 5 又は 6 を表し、Y、V 及び W は、それぞれ独立して、 $=CH_2$ 、 $=NH$ 、 $=O$  又は  $=S$  を表し、 $R^{10}$  及び  $R^{11}$  は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、 $R^{12}$  及び  $R^{13}$  は、それぞれ独立して、水素原子、 $-\text{NR}^aR^b$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=O)\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=O)\text{NHR}^a$ 、 $-\text{NHC}(=O)\text{R}^a$ 、 $-\text{NHS}(=O)_2\text{R}^a$  又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、 $R^a$  及び  $R^b$  は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、Z は任意に置換基を有していてもよいヘテロシクロアルキル基又は任意に置換基を有していてもよいヘテロアリール基を表す。) で表される化合物、又はこれらの医薬的に許容された塩、エステル、プロドラッグ若しくは溶媒和物。

【請求項 9】

化学式 III :

【化 7】

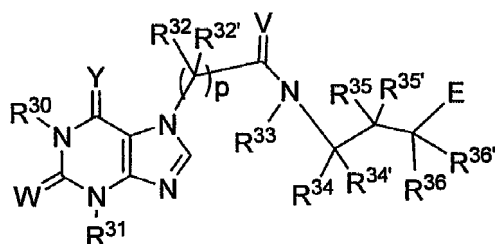


(式中、Xは、CH<sub>2</sub>、NH、O又はSを表し、sは、0、1、2、3又は4を表し、R<sup>1 9</sup>、R<sup>1 9</sup>、R<sup>2 0</sup>、R<sup>2 0</sup>、R<sup>2 1</sup>、R<sup>2 1</sup>、R<sup>2 2</sup>、R<sup>2 2</sup>及びR<sup>2 4</sup>は、それぞれ独立して、不存在、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、又はR<sup>2 0</sup>及びR<sup>2 0</sup>は共に=O、=S又は=CH<sub>2</sub>を形成してもよく、又はR<sup>2 0</sup>及びR<sup>2 1</sup>はこれらに結合する原子と共に任意に置換基を有していてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、又はR<sup>2 0</sup>及びR<sup>2 1</sup>はこれらに結合する原子と共に任意に置換基を有していてもよいアリール基を形成してもよく、又はR<sup>1 9</sup>及びR<sup>2 0</sup>は、これらに結合する原子と共に任意に置換基を有していてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、又はR<sup>1 9</sup>及びR<sup>2 0</sup>は、これらに結合する原子と共に任意に置換基を有していてもよいアリール基を形成してもよく、R<sup>2 3</sup>は、水素原子、任意に置換基を有していてもよいアルキル基、任意に置換基を有していてもよいシクロアルキル基、又は任意に置換基を有していてもよいアリール基を表し、R<sup>2 2</sup>及びR<sup>2 3</sup>は、これらに結合する原子と共に任意に置換基を有していてもよいヘテロシクロアルキル基を形成し、化学式IIIで表される化合物は、2-アミノ-3-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-ブタンアミドではない。)で表される化合物、又はこの医薬的に許容された塩、エステル、プロドラッグ若しくは溶媒和物。

【請求項10】

化学式IV:

【化8】



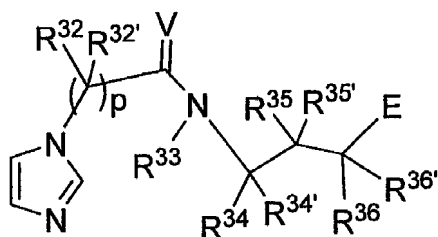
IV

(式中、pは、1、2、3、4、5又は6を表し、Y、V及びWは、それぞれ独立して、CH<sub>2</sub>、NH、O又はSを表し、R<sup>3 0</sup>、R<sup>3 1</sup>、R<sup>3 2</sup>、R<sup>3 2</sup>、R<sup>3 3</sup>、R<sup>3 4</sup>、R<sup>3 4</sup>、R<sup>3 5</sup>、R<sup>3 5</sup>、R<sup>3 6</sup>、及びR<sup>3 6</sup>は、それぞれ独立して、不存在、水素原子、又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、又はR<sup>3 4</sup>及びR<sup>3 6</sup>は、これらに結合する原子と共に、任意に置換基を有していてもよい炭化水素環を形成してもよく、Eは、-CHR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>、-NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>、-OR<sup>c</sup>又はSR<sup>c</sup>を表し、R<sup>c</sup>及びR<sup>d</sup>は、それぞれ独立して、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、又はR<sup>c</sup>及びR<sup>d</sup>はこれらに結合する窒素原子と共に任意に置換基を有していてもよい複素環基を形成し、又はR<sup>c</sup>及びR<sup>d</sup>はこれらに結合する炭素原子と共に任意に置換基を有していてもよい炭素環基を形成する。但し、化学式IVで表される化合物は、N-(3-(ジエチルアミノ)プロピル)-2-(4,6-ジメチル-5,7-ジオキソ-4,5,6,7-テトラヒドロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-1-yl)アセトアミドではない。)で表される化合物又は医薬的に許容されたこれらの塩、エステル、プロドラッグ若しくは溶媒和物。

【請求項11】

化学式IVA:

【化9】



IVA

(式中、pは1、2、3、4、5又は6を表し、Vは、CH<sub>2</sub>、NH、O又はSを表し、R<sup>3 2</sup>

,  $R^{3\ 2'}$ ,  $R^{3\ 3}$ ,  $R^{3\ 4}$ ,  $R^{3\ 4'}$ ,  $R^{3\ 5}$ ,  $R^{3\ 5'}$ ,  $R^{3\ 6}$  及び  $R^{3\ 6'}$  は、それぞれ独立して、不存在、水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、又は  $R^{3\ 4}$  及び  $R^{3\ 6}$  は、これらに結合する原子と共に任意に置換基を有していてもよい炭素環基を形成してもよく、E は、 $-\text{CHR}^{\text{c}}\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{NR}^{\text{c}}\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{OR}^{\text{c}}$  及び  $-\text{SR}^{\text{c}}$  を表し、 $R^{\text{c}}$  及び  $R^{\text{d}}$  は、それぞれ独立して水素原子又は任意に置換基を有していてもよいアルキル基を表し、又は  $R^{\text{c}}$  及び  $R^{\text{d}}$  は、これらに結合する窒素原子と共に任意に置換基を有していてもよい複素環基を形成し、又は  $R^{\text{c}}$  及び  $R^{\text{d}}$  は、これらに結合する炭素原子と共に任意に置換基を有していてもよい炭素環基を形成する。) で表される化合物又はこれらの化合物の医薬的に許容された塩、エステル、プロドラッグ若しくは溶媒和物。