

【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】令和3年2月12日(2021.2.12)

【公表番号】特表2018-503631(P2018-503631A)

【公表日】平成30年2月8日(2018.2.8)

【年通号数】公開・登録公報2018-005

【出願番号】特願2017-535439(P2017-535439)

【国際特許分類】

C 07 D 231/22	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
C 07 D 417/04	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)
C 07 D 417/14	(2006.01)
C 07 D 403/04	(2006.01)
C 07 D 231/38	(2006.01)
C 07 D 495/14	(2006.01)
C 07 D 401/04	(2006.01)
C 07 D 403/06	(2006.01)
C 07 D 413/04	(2006.01)
C 07 D 495/04	(2006.01)
C 07 D 409/04	(2006.01)
A 61 K 31/427	(2006.01)
A 61 K 31/437	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 K 31/415	(2006.01)
A 61 K 31/501	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
A 61 K 31/519	(2006.01)
A 61 K 31/4155	(2006.01)
A 61 K 31/422	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
A 61 K 31/4439	(2006.01)
A 61 K 31/4178	(2006.01)
A 61 K 31/454	(2006.01)

【F I】

C 07 D 231/22	Z
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 43/00	1 0 5
A 61 P 35/00	
A 61 P 43/00	1 2 3
C 07 D 417/04	C S P
C 07 D 471/04	1 0 4 Z
C 07 D 471/04	1 0 6 C
C 07 D 417/14	
C 07 D 403/04	
C 07 D 231/38	Z
C 07 D 495/14	D
C 07 D 231/38	A

C 0 7 D	401/04
C 0 7 D	403/06
C 0 7 D	413/04
C 0 7 D	495/04
	1 0 5 Z
C 0 7 D	409/04
A 6 1 K	31/427
A 6 1 K	31/437
A 6 1 K	31/5377
A 6 1 K	31/415
A 6 1 K	31/501
A 6 1 K	31/496
A 6 1 K	31/519
A 6 1 K	31/4155
A 6 1 K	31/422
A 6 1 K	31/506
A 6 1 K	31/4439
A 6 1 K	31/4178
A 6 1 K	31/454

【誤訳訂正書】

【提出日】令和2年12月25日(2020.12.25)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

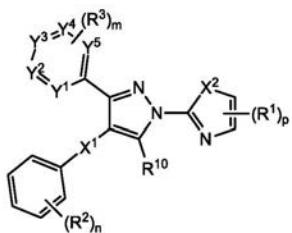
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(Ia)：

【化1】



(Ia)

(式中、

Y¹、Y²、Y³、Y⁴、及びY⁵は、各々独立して、CHまたはNであり；
 R¹は、ハロ、-C(O)R⁴、-CH₂OH、-C(O)NH₂、-C(O)NH、-C₁~C₈ヒドロカルビル)、-C(O)NHOH、-C(O)OCR⁵R⁶OC(O)OR⁴、-P(O)(OH)₂、-B(OR^{1~3})(OR^{1~4})、-SO₂(OH)、-C(O)NHS(O)₂Me、-SO₂NR⁵R⁶-(C₀~C₄ヒドロカルビル)(N、O及びSから独立して選ばれる1~4個のヘテロ原子を有する单-または二環式複素環)、及び-C(O)O-(C₀~C₄ヒドロカルビル)(N、O及びSから独立して選ばれる1~4個のヘテロ原子を有する单-または二環式複素環)から独立して選ばれ、ハロ、-P(O)(OH)₂、及び-SO₂(OH)を除くR¹の各々が、置換または非置換であり；
 R²は、ヒドロキシリル、ハロ、-CN、-NO₂、C₁~C₈ヒドロカルビル、-O(

$C_1 \sim C_8$ ヒドロカルビル)、- ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、- O ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、- ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、- O ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_6 \sim C_{12}$ アリール、- ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_6 \sim C_{12}$ アリール、- O ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) (N、O 及び S から独立して選ばれる 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する单 - 及び二環式複素環)、- ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) (N、O 及び S から独立して選ばれる 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する单 - 及び二環式複素環)、- C (O) R^4 、- CO₂ R^4 、- C (O) NR⁵ R^6 、- NR⁵ C (O) R^4 、- (CH_2)_q NR⁵ (SO₂) R^4 、- (CH_2)_q NR⁵ C (O) R^4 、- (CH_2)_q NR⁷ C (O) NR⁵ R^6 、- (CH_2)_q N R⁵ R^6 、- (CH_2)_q SO₂ NR⁵ R^6 、- (CH_2)_q SO₂ R^4 から独立して選ばれ、 $C_1 \sim C_8$ ヒドロカルビル、- O ($C_1 \sim C_8$ ヒドロカルビル)、- ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、- O ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、- ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、- O ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、- ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_6 \sim C_{12}$ アリール、- ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_6 \sim C_{12}$ アリール、- O ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) (N、O 及び S から独立して選ばれる 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する单 - 及び二環式複素環)、- ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) (N、O 及び S から独立して選ばれる 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する单 - 及び二環式複素環) の各々が、置換または非置換であり；

R^3 は、ヒドロキシリ、ハロ、- CN、- NO₂、- SF₅、 $C_1 \sim C_8$ ヒドロカルビル、- O ($C_1 \sim C_8$ ヒドロカルビル)、- ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、- O ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、- ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、- O ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、- O ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_6 \sim C_{12}$ アリール、- ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_6 \sim C_{12}$ アリール、- O ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) (N、O 及び S から独立して選ばれる 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する单 - 及び二環式複素環)、- ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) (N、O 及び S から独立して選ばれる 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する单 - 及び二環式複素環)、- C (O) R^4 、- CO₂ R^4 、- C (O) NR⁵ R^6 、- NR⁵ C (O) R^4 、- (CH_2)_q NR⁵ (SO₂) R^4 、- (CH_2)_q NR⁵ C (O) R^4 、- (CH_2)_q NR⁷ C (O) NR⁵ R^6 、- (CH_2)_q N R⁵ R^6 、- (CH_2)_q SO₂ NR⁵ R^6 、- (CH_2)_q SO₂ R^4 から独立して選ばれ、 $C_1 \sim C_8$ ヒドロカルビル、- O ($C_1 \sim C_8$ ヒドロカルビル)、- ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、- O ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、- O ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、- O ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、- ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_6 \sim C_{12}$ アリール、- ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_6 \sim C_{12}$ アリール、- O ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) (N、O 及び S から独立して選ばれる 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する单 - 及び二環式複素環)、- ($C_0 \sim C_4$ ヒドロカルビル) (N、O 及び S から独立して選ばれる 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する单 - 及び二環式複素環) の各々が、置換または非置換であり；あるいは

2 つの R^3 部位、及びこれらが結合しているフェニル基は、場合により置換されているナフチル基を形成し；

各 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、及び R^9 は、同じまたは異なっており、各々が、水素、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_6 \sim C_{12}$ アリール、 $C_1 \sim C_{12}$ ヘテロアリール、または $C_1 \sim C_{12}$ ヘテロシクロアルキルであり、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_6 \sim C_{12}$ アリール、 $C_1 \sim C_{12}$ ヘテロアリール、または $C_1 \sim C_{12}$ ヘテロシクロアルキルの各々が、置換または非置換であり；

R^{10} は、水素、ハロ、- CN、- NO₂、- CO₂ R^4 、- C (O) NR⁵ R^6 、-

$\text{NR}^5(\text{SO}_2)\text{R}^4$ 、 $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^4$ 、 $-\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $-\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^4$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ ヒドロカルビル、 $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ ヒドロカルビル)、 $-(\text{C}_0 \sim \text{C}_4$ ヒドロカルビル) $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル、 $-\text{O}(\text{C}_0 \sim \text{C}_4$ ヒドロカルビル) $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル、 $-(\text{C}_0 \sim \text{C}_4$ ヒドロカルビル) $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルケニル、 $\text{O}(\text{C}_0 \sim \text{C}_4$ ヒドロカルビル) $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルケニル、 $-\text{O}(\text{C}_0 \sim \text{C}_4$ ヒドロカルビル) $\text{C}_6 \sim \text{C}_{12}$ アリール、 $-\text{O}(\text{C}_0 \sim \text{C}_4$ ヒドロカルビル) (N、O及びSから独立して選ばれる1~4個のヘテロ原子を有する単-及び二環式複素環)、 $-(\text{C}_0 \sim \text{C}_4$ ヒドロカルビル) (N、O及びSから独立して選ばれる1~4個のヘテロ原子を有する単-及び二環式複素環)であり、水素、ハロ、-CN、及び-NO₂を除くR^{1~0}の各々が、置換または非置換であり；

各R^{1~3}及びR^{1~4}は、同じまたは異なっており、各々が、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_6 \sim \text{C}_{12}$ アリールであり、R^{1~3}及びR^{1~4}が、場合により互いに結合して環を形成しており；

X^1 は、結合、 $-\text{CR}^8\text{R}^9$ -、 $-\text{NR}^5$ -、 $-\text{CR}^8\text{NR}^5$ -、 $-\text{NR}^5\text{CR}^8$ -、 $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})$ -、 $-\text{O}$ -、 $-\text{CO}$ -、 $-\text{SO}$ -、 $-\text{SO}_2$ -、または-S-であり；
 X^2 は、 $-\text{NR}^5$ -、 $-\text{O}$ -、 $-\text{SO}_2$ -、または-S-であり；

m、n及びqは、同じまたは異なっており、各々が、0、1、2、3、4、または5であり；

pは、1または2であり、

ここで、置換とは、指定された原子または基上に任意の1つまたは複数の水素が、ハロゲン、シアノ基、ヒドロキシル基、ニトロ基、1~8個の炭素原子を有するアルキル基、3~8個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~8個の炭素原子を有する(シクロアルキル)アルキル基、1つ以上の不飽和結合及び2~8個の炭素原子を有するアルケニル基、1つ以上の不飽和結合及び2~8個の炭素原子を有するアルキニル基、1つ以上の酸素連結部及び1~8個の炭素原子を有するアルコキシ基、アリールオキシ基、ならびに1つ以上のチオエーテル連結部及び1~8個の炭素原子を有するアルキルチオ基から選択されるもので置き換えられることを意味する。

の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項2】

R^1 が、ヒドロキシル、ハロ、-CO₂H、-SO₂NH₂、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ、場合によりハロで置換されている $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルコキシ、及び-CO₂($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル)から独立して選ばれ、

R^2 が、F及び-SO₂NH₂から選ばれ、ここで、 R^2 の1つが-SO₂NH₂であり；
 R^3 が

(a) ハロゲン、ヒドロキシル、SF₅；
 (b) $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヒドロカルビル(ここで、前記ヒドロカルビル鎖におけるいずれのアルキレン(CH₂)基も、NH、O、またはSによって場合により置き換えられていてよい)；
 (c) -C₀~C₂ ヒドロカルビル(フェニル)、-C₀~C₂ ヒドロカルビル(フェニル)、-C₀~C₂ ヒドロカルビル(チオフェニル)、-C₀~C₂ ヒドロカルビル(オキサゾリル)、-C₀~C₂ ヒドロカルビル(チアゾリル)、-C₀~C₂ ヒドロカルビル(テトラヒドロフラニル)、-C₀~C₂ ヒドロカルビル(C₃~C₆ シクロアルキル)、-C₀~C₂ ヒドロカルビル(C₃~C₆ シクロアルカニル)、-C₀~C₂ ヒドロカルビル(C₃~C₆ シクロアルケニル)、-C₀~C₂ ヒドロカルビル(テトラヒドロピレニル)、-C₀~C₂ ヒドロカルビル(イミダゾリル)、-C₀~C₂ ヒドロカルビル(チオフェニル)(ここで、前記C₀~C₂ ヒドロカルビル鎖におけるいずれのアルキレン(CH₂)基も、NH、O、またはSによって場合により置き換えられていてよい)から独立して選ばれ、

(b) の各々が、非置換であるか、またはハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、アミノ

、C₁～C₂ハロアルキル、及びC₁～C₂ハロアルコキシから独立して選ばれる1つ以上の置換基で置換されており；

(c)の各々が、非置換であるか、またはハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、アミノ、C₁～C₄アルキル、C₁～C₆シクロアルキル、モノ-またはジ-C₁～C₄アルキルアミノ、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₂ハロアルキル、及びC₁～C₂ハロアルコキシから独立して選ばれる1つ以上の置換基で置換されている、請求項1に記載の化合物または塩。

【請求項3】

(a) R²の1つが、-SO₂NR⁵R⁶であり、R⁵及びR⁶は、同じまたは異なっており、各々が、HまたはC₁～C₈アルキルである；

(b) nが1である；

(c) 各R³が、独立して、ハロ、C₁～C₈ハロアルキル、C₁～C₈ハロアルコキシ、置換もしくは非置換のC₁～C₈アルキル、C₂～C₈アルケニル、C₂～C₈アルキニル、または置換もしくは非置換のフェニルである；

(d) mが1または2である；

(e) X¹が、-CR⁸R⁹-、-O-、または-NH-である；

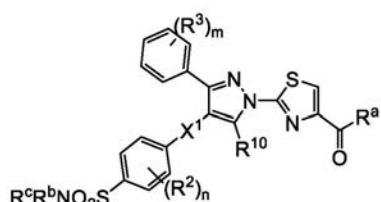
(f) X²が-S-である；

の(a)から(f)のうちの1つ以上を満たす、請求項1または2に記載の化合物または塩。

【請求項4】

式(Ia-1)

【化2】



(Ia-1)

(式中、

R^aが、-R⁴、-OR⁴、または-NR⁵R⁶であり、これらの各々が、置換または非置換であり；

R^b及びR^cは、同じまたは異なっており、各々が、H、または置換もしくは非置換のC₁～C₈アルキルであり；

R²が、ヒドロキシル、C₁～C₈アルキル、C₂～C₈アルケニル、C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₈アルコキシ、C₃～C₆シクロアルキルオキシ、アリールオキシ、ハロ、C₁～C₈ハロアルコキシ、C₁～C₈ハロアルキル、ハロアリール、ハロアリールオキシ、-CN、-NO₂、-C(O)R⁴、-CO₂R⁴、-C(O)NR⁵R⁶、-NR⁵C(O)R⁴、-(CH₂)_qNR⁵(SO₂)R⁴、-(CH₂)_qNR⁵C(O)R⁴、-(CH₂)_qNR⁷C(O)NR⁵R⁶、-(CH₂)_qNR⁵R⁶、-(CH₂)_qSO₂NR⁵R⁶、-(CH₂)_qSO₂R⁴、-(CH₂)_qアリール、-(CH₂)_qヘテロアリール、及び-(CH₂)_qヘテロシクロアルキルから独立して選ばれ、ヒドロキシル及びハロを除くR²の各々が、置換または非置換であり；

R³が、ヒドロキシル、C₁～C₈アルキル、C₂～C₈アルケニル、C₂～C₈アルキニル、C₃～C₆シクロアルキル、-(C₁～C₄ヒドロカルビル)C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₈アルコキシ、-(C₀～C₄アルコキシ)C₃～C₆シクロアルキル、-(C₀～C₄アルコキシ)アリール、ハロ、C₁～C₈ハロアルコキシ、C₁～C₈ハロアルキル、ハロアリール、ハロアリールオキシ、-CN、-NO₂、-C(O)R⁴、-CO₂R⁴、-C(O)NR⁵R⁶、-NR⁵C(O)R⁴、-(CH₂)_qNR⁵(SO₂)R⁴、-(CH₂)_qNR⁷C(O)R⁴、

$\text{N R}^5 \text{R}^6$ 、 $-\text{(C H}_2\text{)}_q \text{N R}^5 \text{R}^6$ 、 $-\text{(C H}_2\text{)}_q \text{S O}_2 \text{N R}^5 \text{R}^6$ 、 $-\text{(C H}_2\text{)}_q \text{S O}_2 \text{R}^4$ 、 $-\text{(C}_0\text{~C}_4\text{ヒドロカルビル)}$ アリール、 $-\text{(C}_0\text{~C}_4\text{ヒドロカルビル})$ ヘテロアリール、 $-\text{(C}_0\text{~C}_4\text{アルコキシ})$ ヘテロアリール、 $-\text{(C}_0\text{~C}_4\text{アルコキシ})$ ヘテロシクロアルキル、及び $-\text{(C}_0\text{~C}_4\text{ヒドロカルビル})$ ヘテロシクロアルキルから独立して選ばれ、ヒドロキシル及びハロを除く R^3 の各々が、置換または非置換であり；あるいは

2つの R^3 部位、及びこれらが結合しているフェニル基が、場合により置換されているナフチル基を形成しており；

各 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、及び R^9 は、同じまたは異なっており、各々が、水素、 $\text{C}_1\text{~C}_8$ アルキル、または $\text{C}_3\text{~C}_6$ シクロアルキルであり、 $\text{C}_1\text{~C}_8$ アルキル及び $\text{C}_3\text{~C}_6$ シクロアルキルの各々が、置換または非置換であり；

R^{10} は、水素、 $\text{C}_1\text{~C}_8$ アルキル、 $\text{C}_2\text{~C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_2\text{~C}_8$ アルキニル、 $\text{C}_3\text{~C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_3\text{~C}_6$ シクロアルキルアルキル、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、 $\text{C}_1\text{~C}_8$ アルコキシ、ハロ、 $\text{C}_1\text{~C}_8$ ハロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、 $-\text{C N}$ 、 $-\text{C O}_2 \text{R}^4$ 、 $-\text{N R}^5 \text{R}^6$ 、または $-\text{S O}_2 \text{R}^4$ であり、水素、ヒドロキシル及びハロを除く R^{10} の各々が、置換または非置換であり；

X^1 は、結合、 $-\text{C R}^8 \text{R}^9$ 、 $-\text{N R}^5$ 、 $-\text{O}$ 、 $-\text{S(O)}$ 、または $-\text{S(O)}$ 、または $-\text{S}$ 、 R^8 及び R^9 の各々が、置換または非置換であり； N が、0~4の整数であり；

m 及び q は、同じまたは異なっており、各々が、0、または1~5の整数である)の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩である、請求項1に記載の化合物または塩。

【請求項5】

R^a が R^4 、 $-\text{O R}^4$ 、または $-\text{N R}^5 \text{R}^6$ であり；

R^2 が、ハロ、ヒドロキシル、 $-\text{C N}$ 、 $-\text{N O}_2$ 、アミノ、 $-\text{C(O)R}^4$ 、 $-\text{C O}_2 \text{R}^4$ 、 $-\text{C(O)N R}^5 \text{R}^6$ 、 $-\text{N R}^5 \text{C(O)R}^4$ 、 $\text{C}_1\text{~C}_2$ アルキル、 $\text{C}_1\text{~C}_2$ アルコキシ、 $\text{C}_1\text{~C}_2$ ハロアルキル、及び $\text{C}_1\text{~C}_2$ ハロアルコキシから独立して選ばれる1つ以上の置換基であり；

各 R^4 、 R^5 、及び R^6 は、同じまたは異なっており、各々が、水素または $\text{C}_1\text{~C}_2$ アルキルであり；

R^{10} が、水素、ヒドロキシル、ハロ、 $-\text{C N}$ 、 $\text{C}_1\text{~C}_4$ アルキル、ヒドロキシル $\text{C}_1\text{~C}_4$ アルキル、 $\text{C}_1\text{~C}_4$ アルコキシ、 $\text{C}_2\text{~C}_4$ アルケニル、($\text{C}_3\text{~C}_6$ シクロアルキル) $\text{C}_0\text{~C}_2$ アルキル、 $\text{C}_1\text{~C}_2$ ハロアルキル、 $\text{C}_1\text{~C}_2$ ハロアルコキシ、 $-\text{C O}_2 \text{R}^4$ 、 $-\text{N R}^5 \text{R}^6$ 、または $-\text{S O}_2 \text{R}^4$ であり、

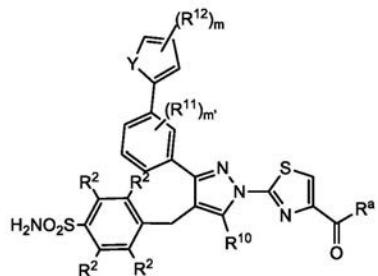
R^3 の1つが、 $\text{C}_2\text{~C}_6$ アルキニル、 $-\text{(C}_0\text{~C}_2\text{アルキル})\text{C}_3\text{~C}_6$ シクロアルキル、 $-\text{(C}_2\text{~C}_4\text{アルケニル})\text{C}_3\text{~C}_6$ シクロアルキル、 $-\text{(C}_2\text{~C}_4\text{アルキニル})\text{C}_3\text{~C}_6$ シクロアルキル、 $-\text{(C}_0\text{~C}_2\text{アルコキシ})\text{C}_3\text{~C}_6$ シクロアルキル、ジヒドロピラニル、 $-\text{(C}_0\text{~C}_4\text{アルコキシ})$ フェニル、 $-\text{(C}_0\text{~C}_4\text{アルキル})$ フェニル、 $-\text{(C}_2\text{~C}_4\text{アルケニル})$ フェニル、 $-\text{(C}_2\text{~C}_4\text{アルキニル})$ フェニル、 $-\text{(C}_0\text{~C}_4\text{アルコキシ})$ ヘテロアリール、 $-\text{(C}_0\text{~C}_4\text{アルキル})$ ヘテロアリール、 $-\text{(C}_2\text{~C}_4\text{アルケニル})$ ヘテロアリール、及び $-\text{(C}_2\text{~C}_4\text{アルキニル})$ ヘテロアリールから選択され、ここで、ヘテロアリールが、チエニル、フラニル、チアゾリル、ピラゾリル、イミダゾリルから選ばれ；1つ以上の置換基の各々が、ヒドロキシル、ハロ、 $-\text{C N}$ 、 $\text{C}_1\text{~C}_4$ アルキル、 $\text{C}_2\text{~C}_4$ アルケニル、 $\text{C}_1\text{~C}_4$ アルキニル、 $\text{C}_1\text{~C}_4$ アルコキシ、($\text{C}_3\text{~C}_6$ シクロアルキル) $\text{C}_0\text{~C}_2$ アルキル、 $\text{C}_1\text{~C}_2$ ハロアルキル、及び $\text{C}_1\text{~C}_2$ ハロアルコキシから選択され；

0または1つ以上の R^3 が、ヒドロキシル、ハロ、 $-\text{C N}$ 、 $\text{C}_1\text{~C}_4$ アルキル、 $\text{C}_1\text{~C}_4$ アルコキシ、 $\text{C}_1\text{~C}_2$ ハロアルキル、及び $\text{C}_1\text{~C}_2$ ハロアルコキシから選択される、請求項4に記載の化合物または塩。

【請求項 6】

式 (I a - 2) :

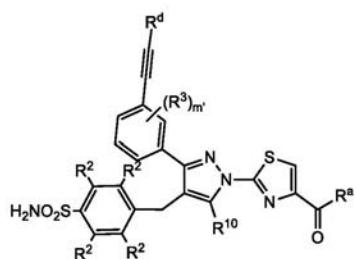
【化 3】



(I a - 2)

または

【化 4】



(I a - 3)

(式中、

Y = - C H = C H - 、 O 、 S 、 N H であり；

R'a は、 - R⁴ 、 - O R⁴ 、 または - N R⁵ R⁶ であり、 R⁴ 、 R⁵ 、 及び R⁶ の各々が、 置換または非置換であり；

各 R² が、 同じまたは異なっており、 水素、 ヒドロキシル、 C₁ ~ C₈ アルキル、 C₂ ~ C₈ アルケニル、 C₃ ~ C₆ シクロアルキル、 C₃ ~ C₆ シクロアルキルアルキル、 C₁ ~ C₈ アルコキシ、 C₃ ~ C₆ シクロアルキルオキシ、 アリールオキシ、 ハロ、 C₁ ~ C₈ ハロアルコキシ、 C₁ ~ C₈ ハロアルキル、 ハロアリール、 ハロアリールオキシ、 - C N 、 - N O₂ 、 - C(O)R⁴ 、 - C O₂ R⁴ 、 - C(O)N R⁵ R⁶ 、 - N R⁵ C(O)R⁴ 、 - (C H₂)_q N R⁵ (S O₂)R⁴ 、 - (C H₂)_q N R⁵ C(O)R⁴ 、 - (C H₂)_q N R⁷ C(O)N R⁵ R⁶ 、 - (C H₂)_q N R⁵ R⁶ 、 - (C H₂)_q S O₂ N R⁵ R⁶ 、 - (C H₂)_q S O₂ R⁴ 、 - (C H₂)_q アリール、 - (C H₂)_q ヘテロアリール、 または - (C H₂)_q ヘテロシクロアルキルであり、 水素、 ヒドロキシル及びハロを除く R² の各々が、 置換または非置換であり；

各 R¹¹ 及び R¹² が、 ヒドロキシル、 ハロ、 - C N 、 N O₂ 、 C₁ ~ C₈ アルキル、 C₂ ~ C₈ アルケニル C₁ ~ C₈ アルコキシ、 C₁ ~ C₂ ハロアルコキシ、 C₁ ~ C₂ ハロアルキル、 C(O)R⁴ 、 C O₂ R⁴ 、 C(O)N R⁵ R⁶ 、 N R⁵ C(O)R⁴ 、 - (C H₂)_q N R⁵ (S O₂)R⁴ 、 - (C H₂)_q N R⁵ C(O)R⁴ 、 - (C H₂)_q N R⁷ C(O)N R⁵ R⁶ 、 - (C H₂)_q N R⁵ R⁶ 、 - (C H₂)_q S O₂ N R⁵ R⁶ 、 及び - (C H₂)_q S O₂ R⁴ から独立して選択され、 ヒドロキシル、 ハロ、 - C N 、 及び N O₂ 以外の R¹¹ 及び R¹² の各々が、 置換または非置換であり；

R^d は、 水素、 C₁ ~ C₈ アルキル、 C₂ ~ C₈ アルケニル、 C₂ ~ C₈ アルキニル、 C₃ ~ C₆ シクロアルキル、 C₃ ~ C₆ シクロアルキルアルキル、 ヒドロキシル、 ヒドロキシアルキル、 C₁ ~ C₈ アルコキシ、 ハロ、 C₁ ~ C₈ ハロアルキル、 アリール、 アリールアルキル、 ヘテロアリール、 ヘテロアリールアルキル、 - C N 、 - C O₂ R⁴ 、 - N R⁵ R⁶ 、 または - S O₂ R⁴ であり、 ハロ及び - C N を除く R^d の各々が、 置換または非置換であり；

各 R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 は、同じまたは異なっており、各々が、水素、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、または $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、 $C_1 \sim C_8$ アルキル及び $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルの各々が、置換または非置換であり；

R^{10} は、水素、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアルキル、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、ハロ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、アリールアルキル、- CN 、- CO_2R^4 、- NR^5R^6 、または- SO_2R^4 であり、水素及びハロを除く R^{10} の各々が、置換または非置換であり；

m 及び q は、同じまたは異なっており、各々が、0、または1、2、3、4 もしくは5 であり；

m' が、0 または 1 ~ 4 の整数である)

の化合物である、請求項4に記載の化合物または塩。

【請求項7】

R^a が、水素、ヒドロキシル、アミノ、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、及びモノ- またはジ- $C_1 \sim C_2$ アルキルアミノ- であり；

各 R^2 が、同じまたは異なっており、水素、ハロ、ヒドロキシル、- CN 、- NO_2 、アミノ、- $C(O)R^4$ 、- CO_2R^4 、- $C(O)NR^5R^6$ 、- $NR^5C(O)R^4$ 、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、及び $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシから独立して選択され；

各 R^3 が、ヒドロキシル、ハロ、- CN 、 NO_2 、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、及び $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルから独立して選ばれ；

各 R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 は、同じまたは異なっており、各々が、水素または $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

m' が、0 または 1 ~ 4 の整数であり；

R^{10} が、水素、ヒドロキシル、ハロ、- CN 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、ヒドロキシル $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、($C_3 \sim C_6$ シクロアルキル) $C_0 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、- CO_2R^4 、- NR^5R^6 、または- SO_2R^4 であり、

R^d がメチルで置換されているチエニルである、請求項6に記載の化合物または塩。

【請求項8】

R^a が、ヒドロキシルまたは置換もしくは非置換の- $O(C_1 \sim C_8$ アルキル) であり；

R^2 が、水素、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、またはハロであり；

R^{11} 及び R^{12} が、各々、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_4$ アルキル、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、またはハロから独立して選択され；

R^{10} が、水素、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、置換もしくは非置換のシクロプロピル、置換もしくは非置換の- CH_2 - シクロプロピル、置換もしくは非置換の- $CH=CH_2$ 、置換もしくは非置換の- CC - シクロプロピル、- I 、- CF_3 、- NH_2 、または- CN であり；

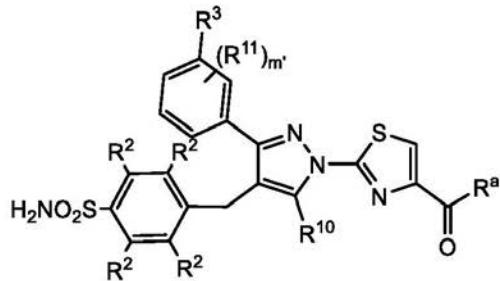
m が、0、1 または 2 であり；

m' が、0 である、請求項6に記載の化合物または塩。

【請求項9】

式 (I a - 4) :

【化5】



(Ia-4)

(式中、

R^a は、 $-R^4$ 、 $-OR^4$ 、または $-NR^5R^6$ であり、 R^4 、 R^5 、及び R^6 の各々が、置換または非置換であり；

各 R^2 が、同じまたは異なっており、水素、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルオキシ、アリールオキシ、ハロ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、ハロアリール、ハロアリールオキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(O)R^4$ 、 $-CO_2R^4$ 、 $-C(O)NR^5R^6$ 、 $-NR^5C(O)R^4$ 、 $-(CH_2)_qNR^5(SO_2)R^4$ 、 $-(CH_2)_qNR^5C(O)R^4$ 、 $-(CH_2)_qNR^7C(O)NR^5R^6$ 、 $-(CH_2)_qNR^5R^6$ 、 $-(CH_2)_qSO_2NR^5R^6$ 、 $-(CH_2)_qSO_2R^4$ 、 $-(CH_2)_q$ アリール、 $-(CH_2)_q$ ヘテロアリール、または $-(CH_2)_q$ ヘテロシクロアルキルであり、水素、ヒドロキシル及びハロを除く R^2 の各々が、置換または非置換であり；

R^3 が、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-(C_0 \sim C_2$ アルキル) $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-(C_2 \sim C_4$ アルケニル) $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-(C_0 \sim C_2$ アルコキシ) $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、ジヒドロピラニル、 $-(C_0 \sim C_4$ アルコキシ)フェニル、 $-(C_0 \sim C_4$ アルキル)フェニル、 $-(C_2 \sim C_4$ アルケニル)フェニル、 $-(C_2 \sim C_4$ アルキニル)フェニル、 $-(C_0 \sim C_4$ アルコキシ)ヘテロアリール、 $-(C_0 \sim C_4$ アルキル)ヘテロアリール、 $-(C_2 \sim C_4$ アルケニル)ヘテロアリール、及び $-(C_2 \sim C_4$ アルキニル)ヘテロアリールから選択され、ここで、ヘテロアリールは、N、O及びSから独立して選ばれる1、2、3、または4個のヘテロ原子を有する5または6員のヘテロアリールであり、ここで、各 R^3 は、非置換であるか、ヒドロキシル、ハロ、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $(C_3 \sim C_6$ シクロアルキル) $C_0 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、及び $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシから選択される1つ以上の置換基で置換されており；

各 $R^{1,1}$ が、ヒドロキシル、ハロ、 $-CN$ 、 NO_2 、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $-C(O)R^4$ 、 $-CO_2R^4$ 、 $-C(O)NR^5R^6$ 、 $-NR^5C(O)R^4$ 、 $-(CH_2)_qNR^5(SO_2)R^4$ 、 $-(CH_2)_qNR^5C(O)R^4$ 、 $-(CH_2)_qNR^7C(O)NR^5R^6$ 、 $-(CH_2)_qNR^5R^6$ 、 $-(CH_2)_qSO_2NR^5R^6$ 、及び $-(CH_2)_qSO_2R^4$ から独立して選択され、ヒドロキシル、ハロ、 $-CN$ 、 NO_2 以外の $R^{1,1}$ 及び $R^{1,2}$ の各々が、置換または非置換であり；

各 R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 は、同じまたは異なっており、各々が、水素、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、または $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、 $C_1 \sim C_8$ アルキル及び $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルの各々が、置換または非置換であり；

$R^{1,0}$ は、水素、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアルキル、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、ハロ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、アリールアルキル、 $-CN$ 、 $-CO_2R^4$ 、 $-NR^5R^6$ 、または $-SO_2R^4$ であり、水素及びハロ

を除く $R^{1 \sim 0}$ の各々が、置換または非置換であり；
 m が、0 または 1、2、3、4、もしくは 5 であり；
 m' が、0 または 1 ~ 4 の整数である)
の化合物である、請求項 4 に記載の化合物または塩。

【請求項 10】

下記に示す化合物である、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

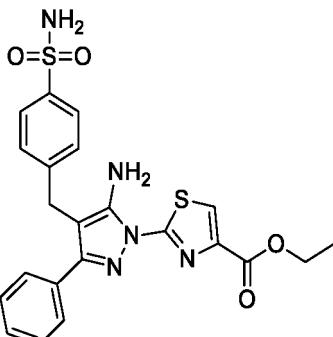
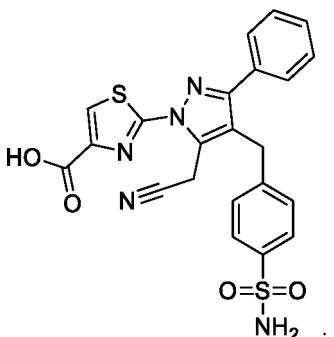
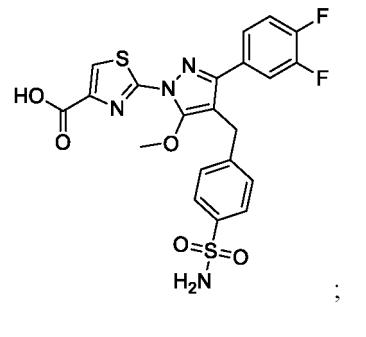
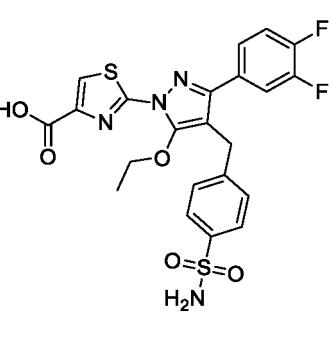
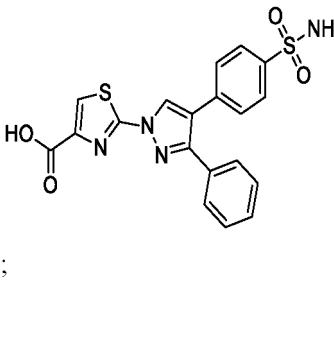
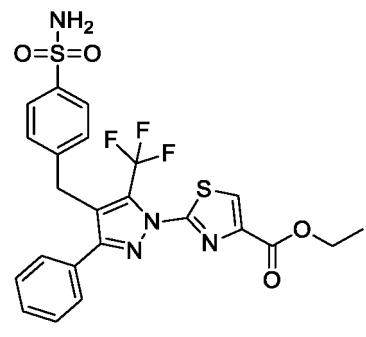
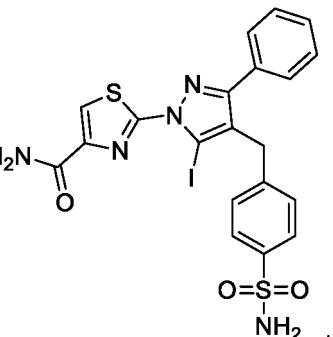
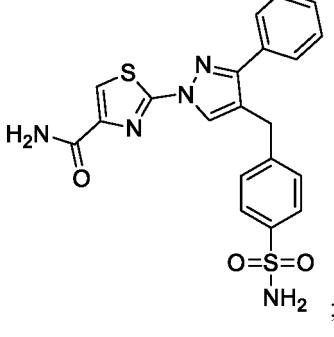
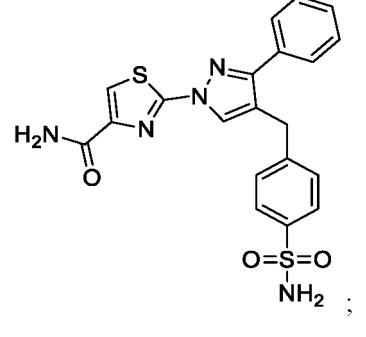
【化6】

19	20	27
28	33	38
39	40	41
42	43	44

【化7】

45	46	47
48	49	50
51	52	53

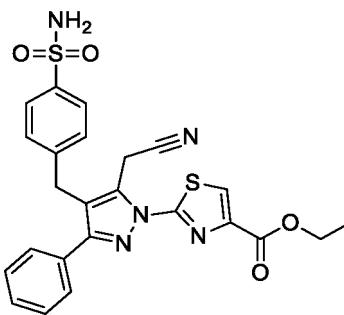
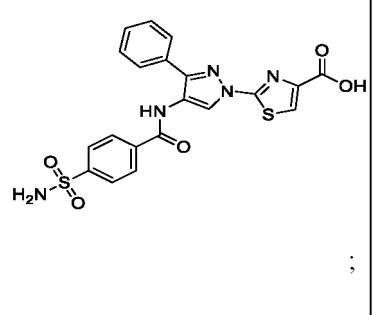
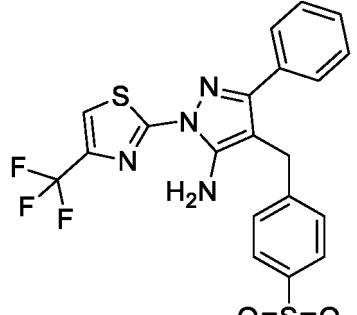
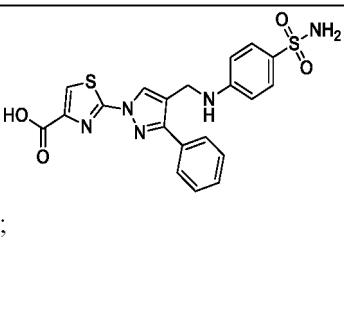
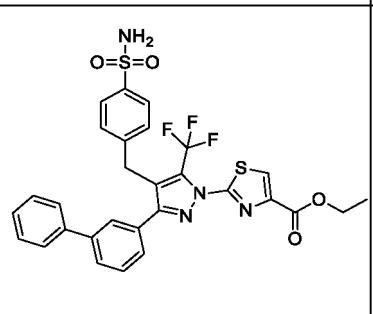
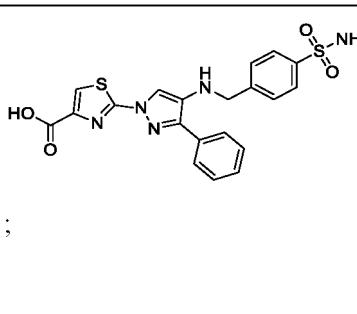
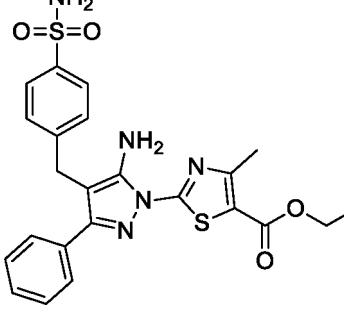
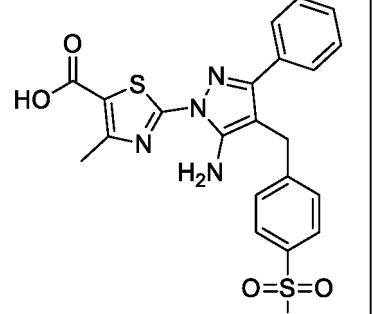
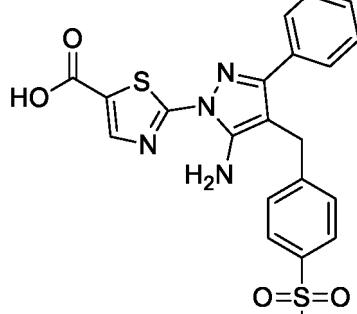
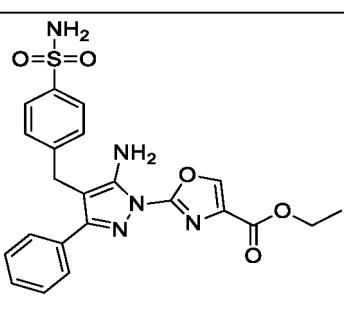
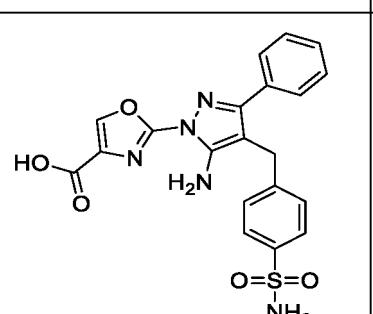
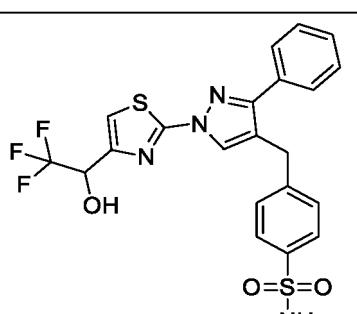
【化 8】

		
58	59	60
		
61	76	77
		
78	79	80

【化9】

86	87	88
123	127	131
132	133	134

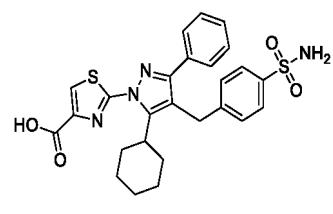
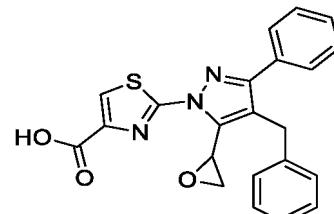
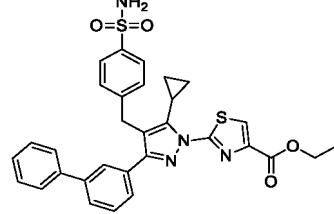
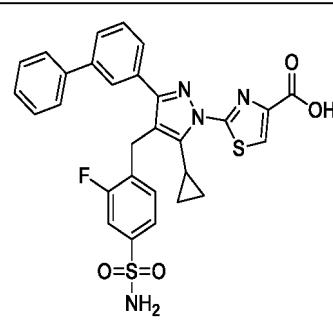
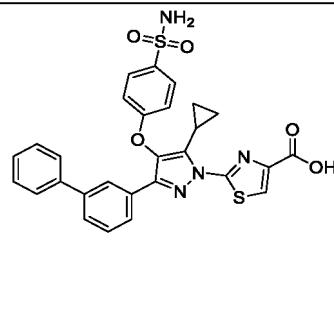
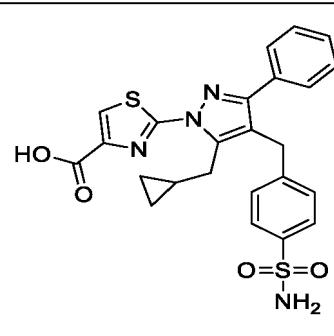
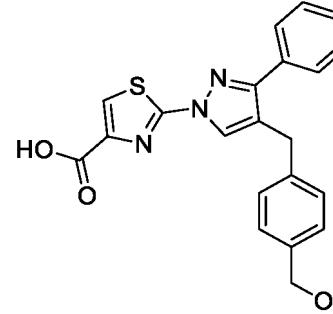
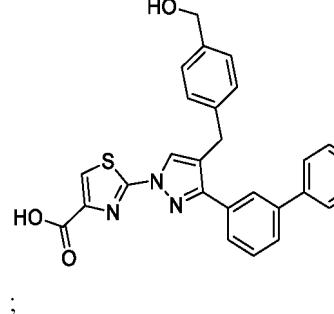
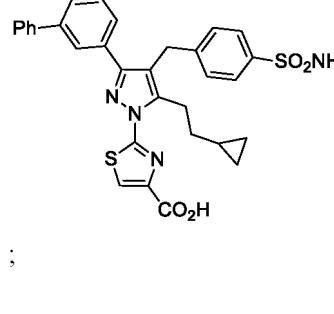
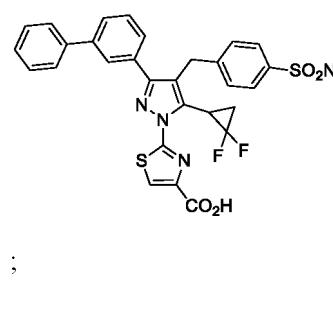
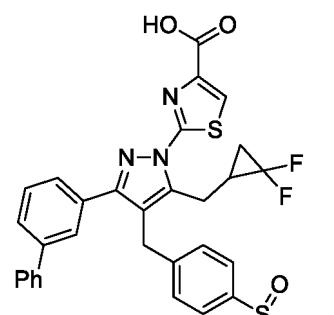
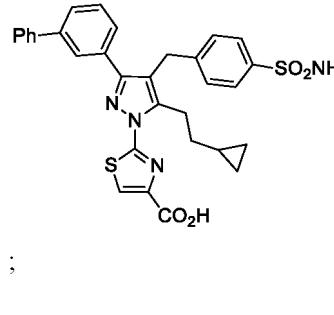
【化 1 0】

		
135	136	137
		
139	141	142
		
146	147	148
		
151	153	154

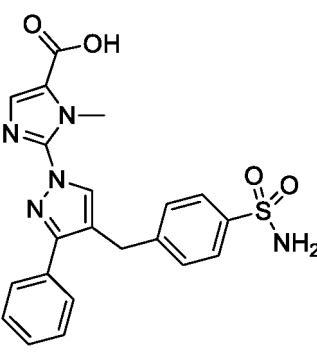
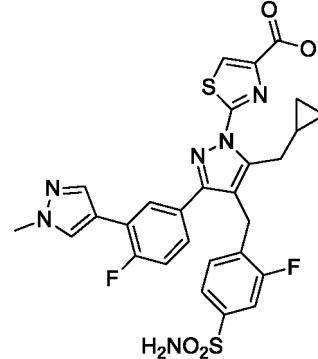
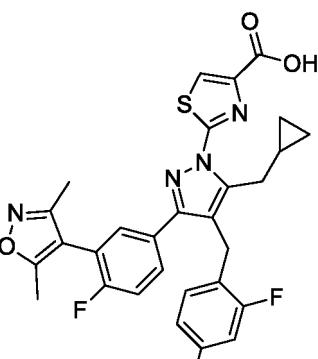
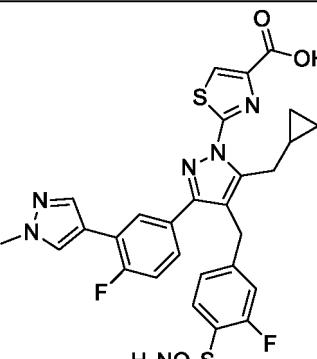
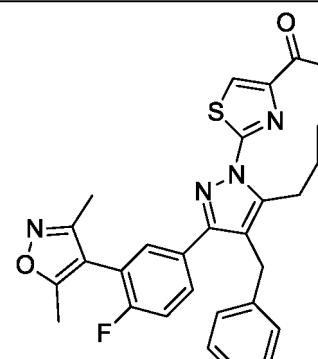
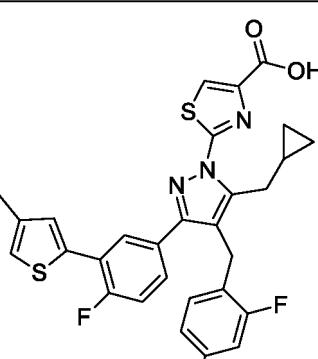
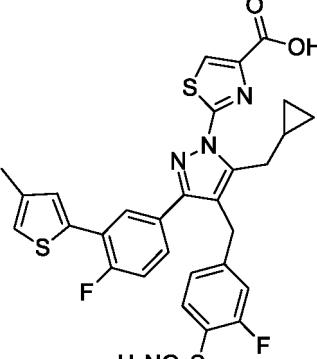
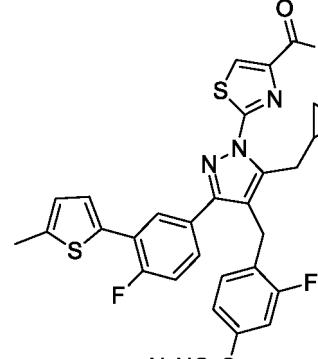
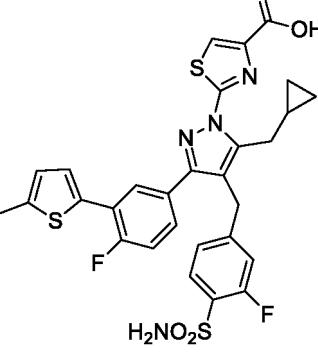
【化 11】

156	157	159
160	162	164
166	167	169
171	173	175

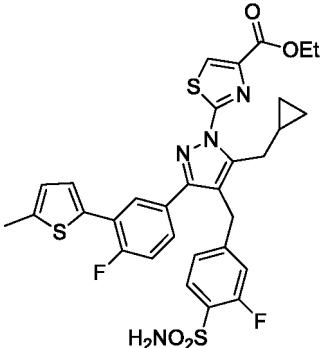
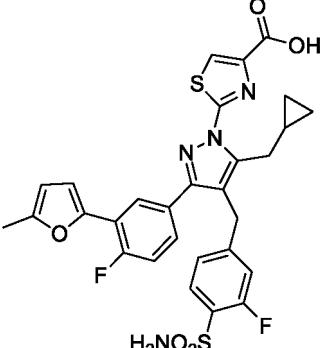
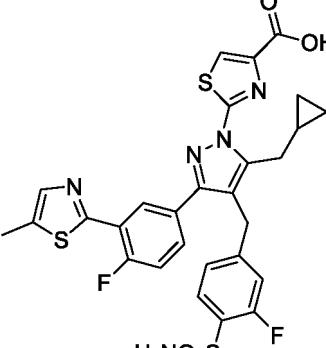
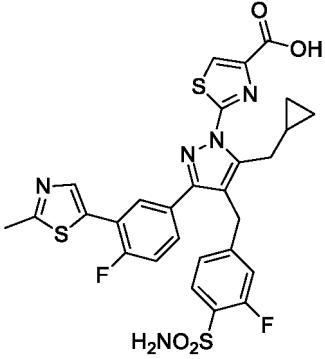
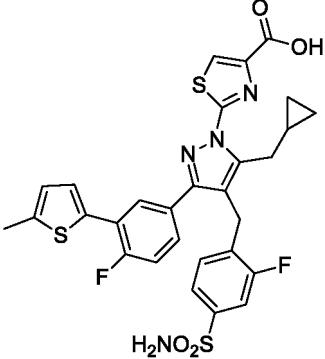
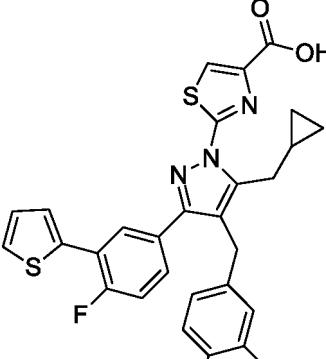
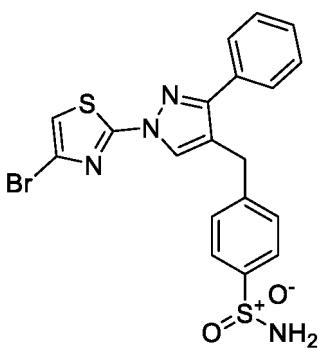
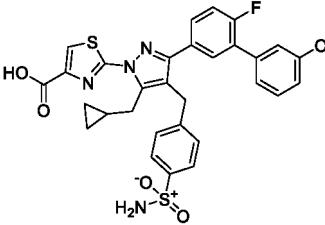
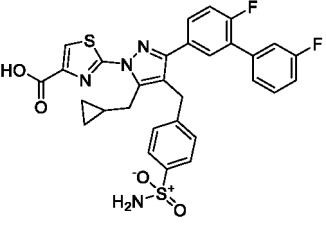
【化12】

		
177	178	181
		
183	187	189
		
199	200	203
		
205	207	209

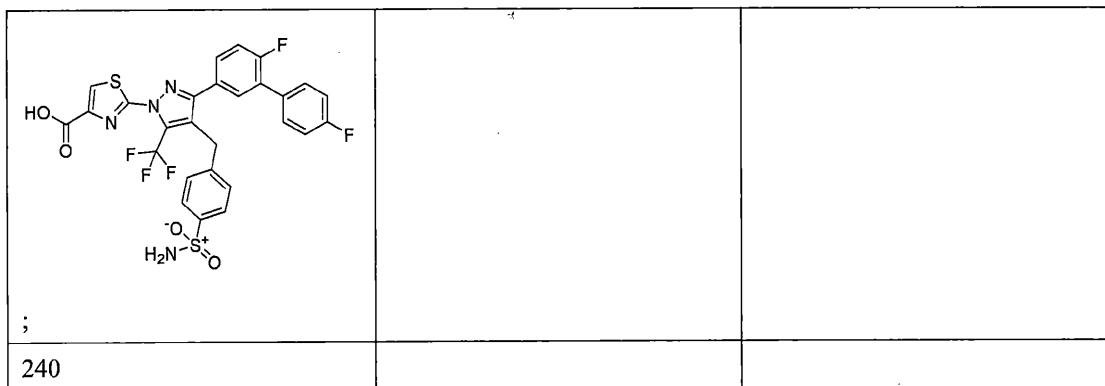
【化 1 3】

		
212	214	215
		
217	219	221
		
223	225	227

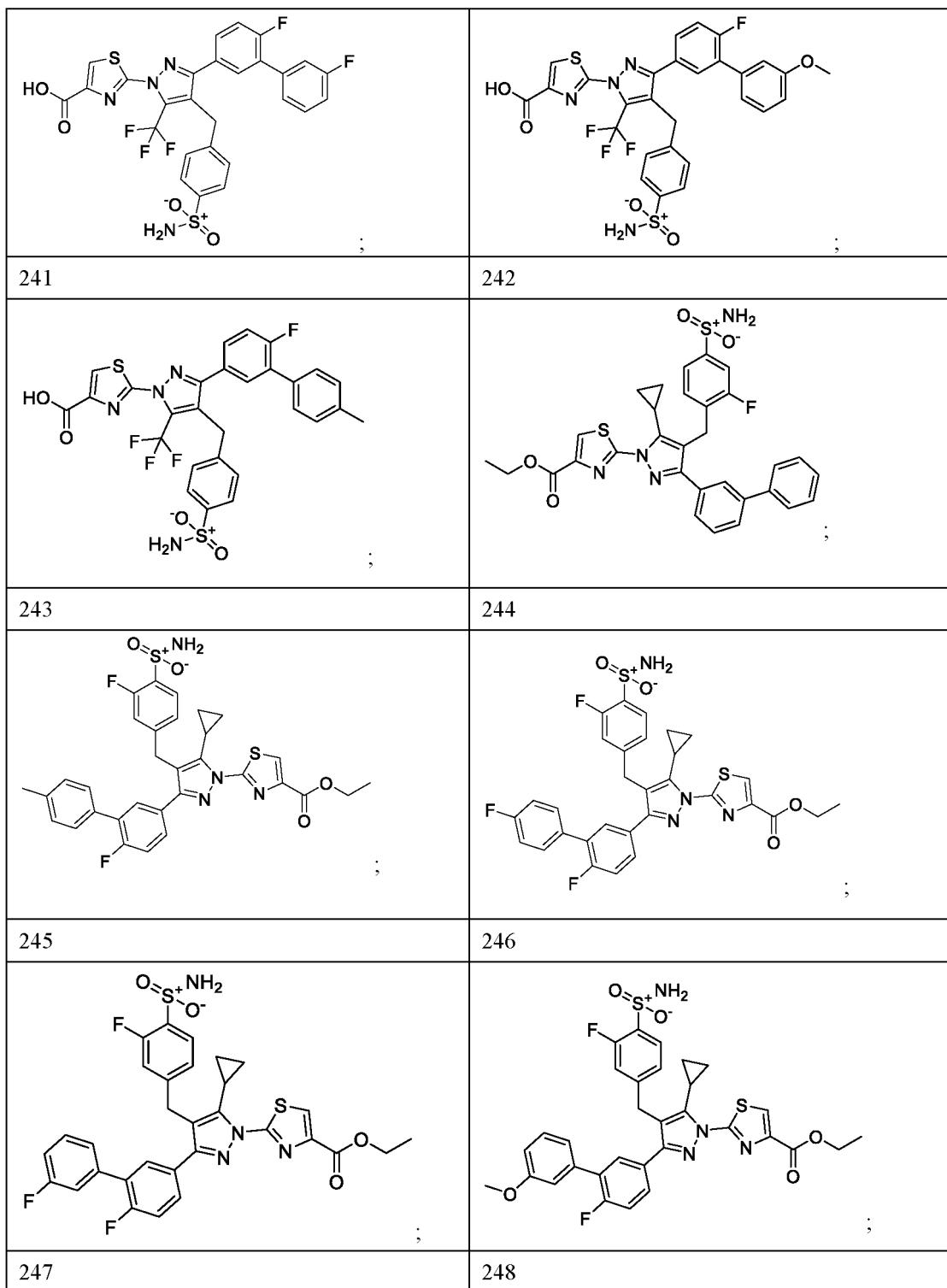
【化14】

		
229	230	231
		
232	233	234
		
235	237	239

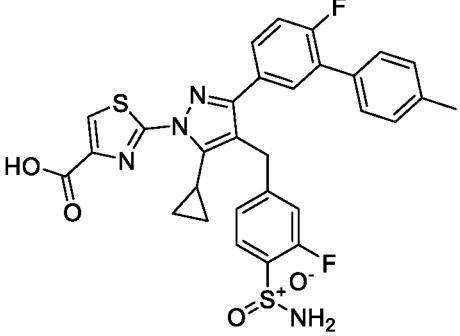
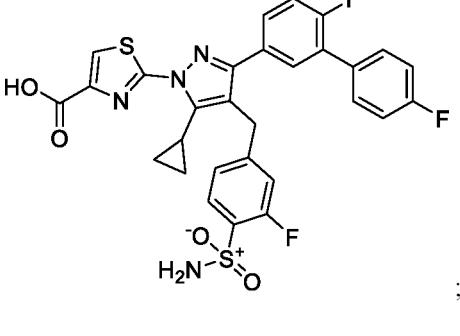
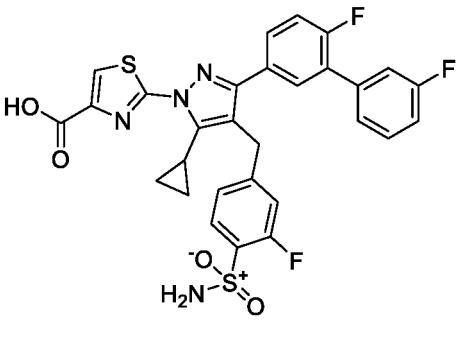
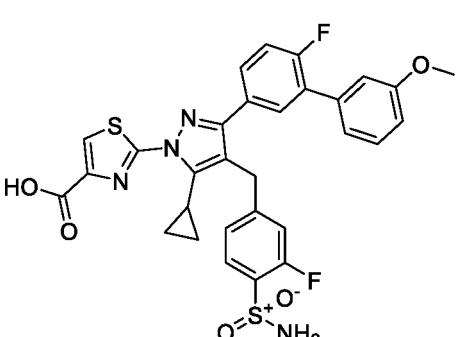
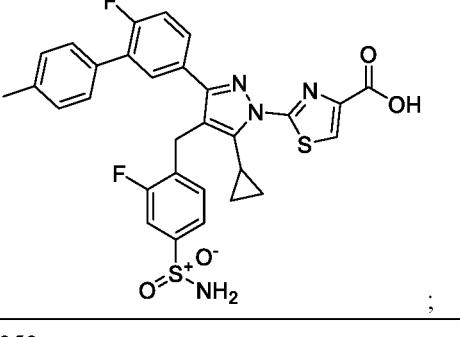
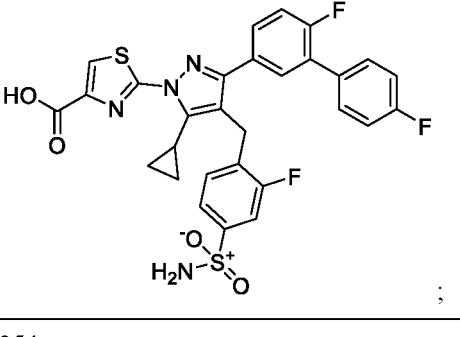
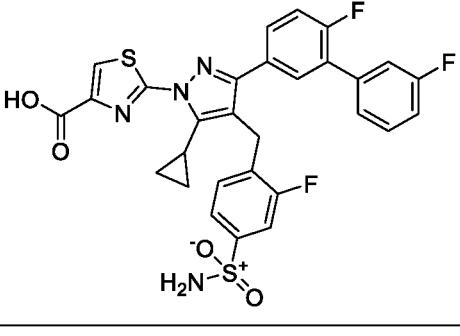
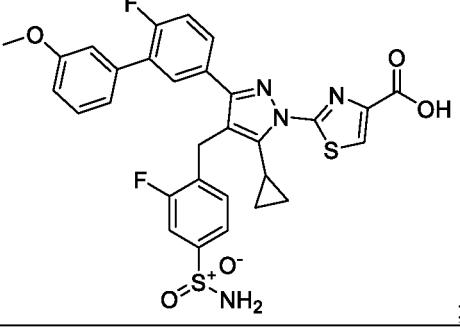
【化 1 5】



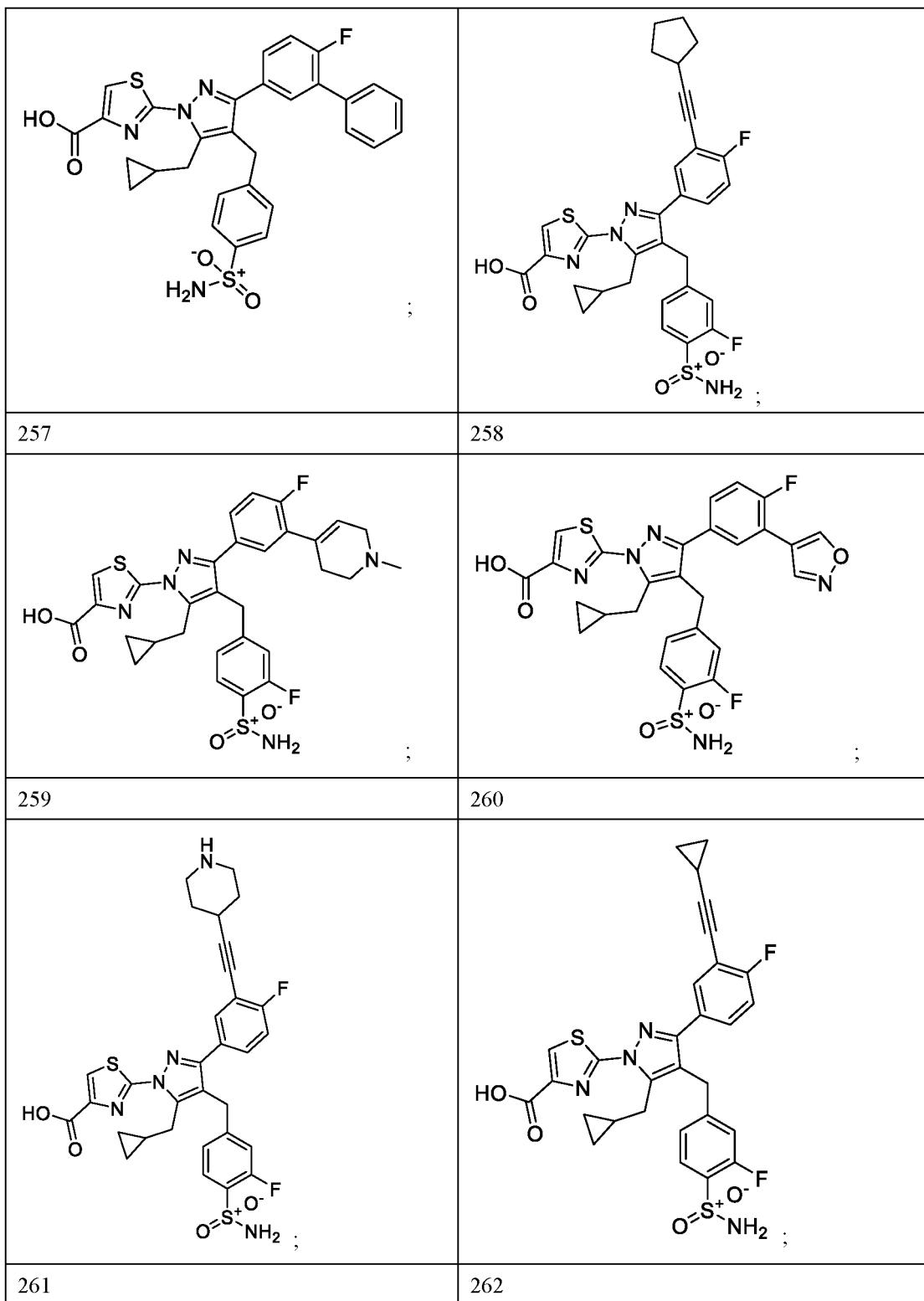
【化 1 6】



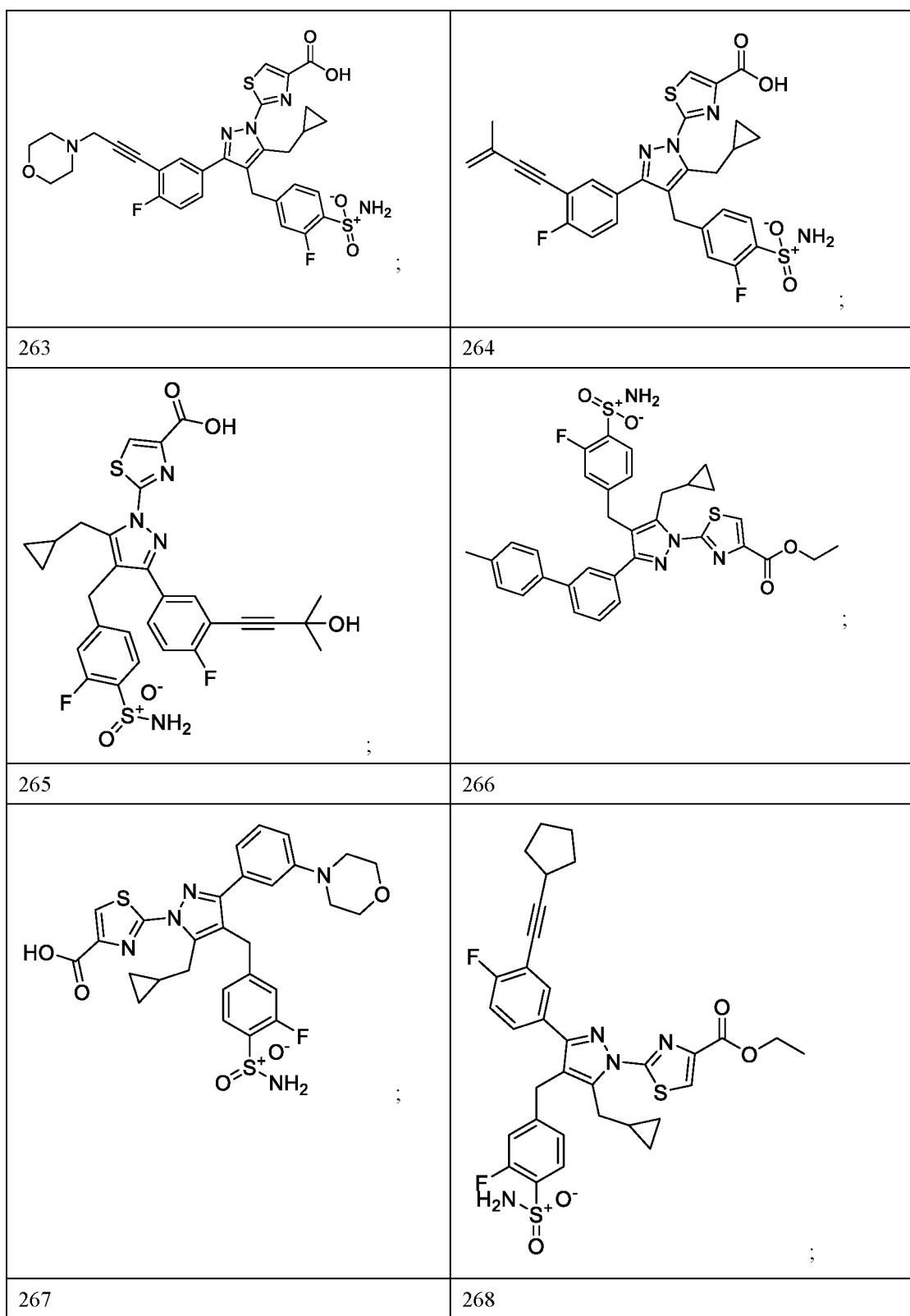
【化 17】

 <p>;</p>	 <p>;</p>
<p>249</p>  <p>;</p>	<p>250</p>  <p>;</p>
<p>251</p>  <p>;</p>	<p>252</p>  <p>;</p>
<p>253</p>  <p>;</p>	<p>254</p>  <p>;</p>
<p>255</p>	<p>256</p>

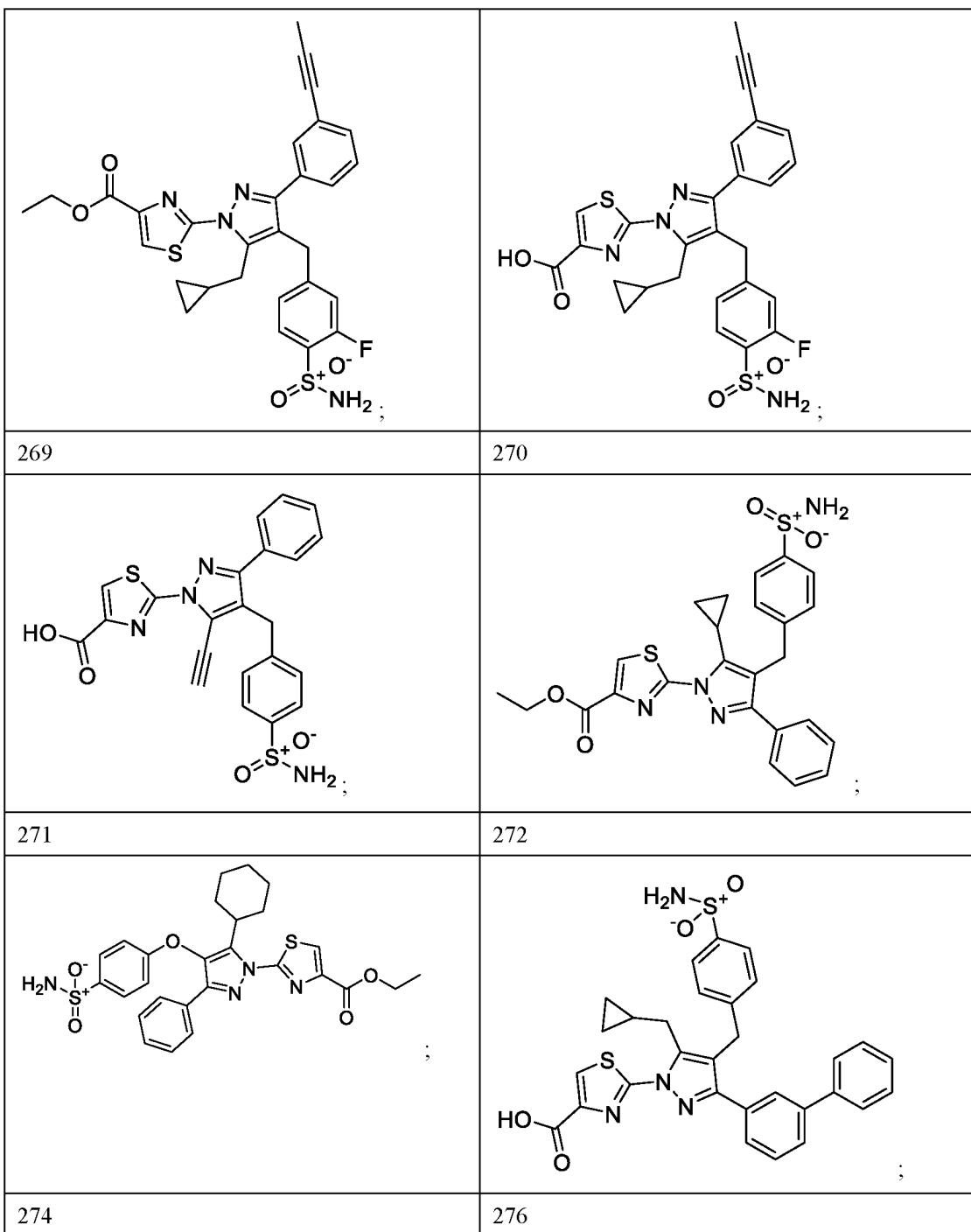
【化 1 8】



【化19】



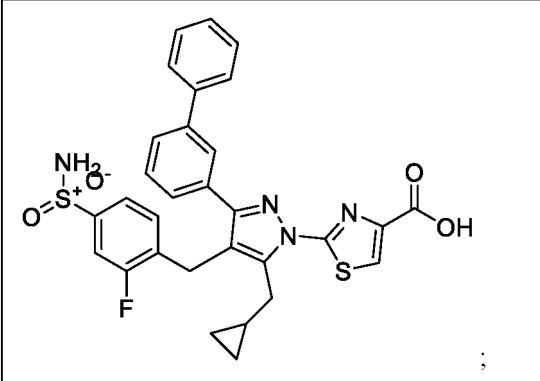
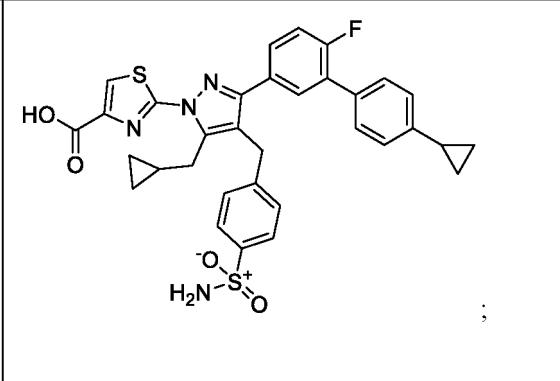
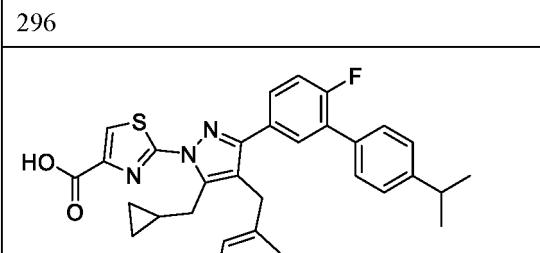
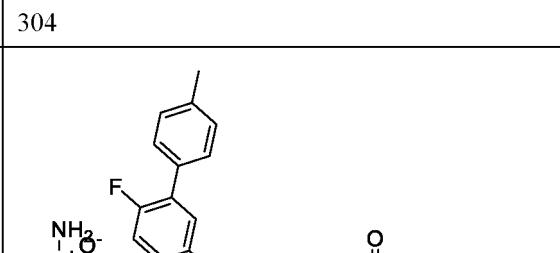
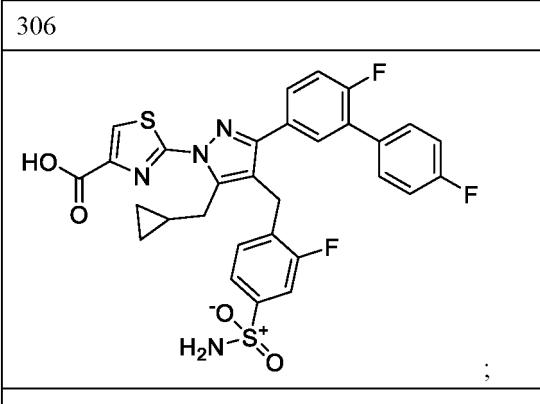
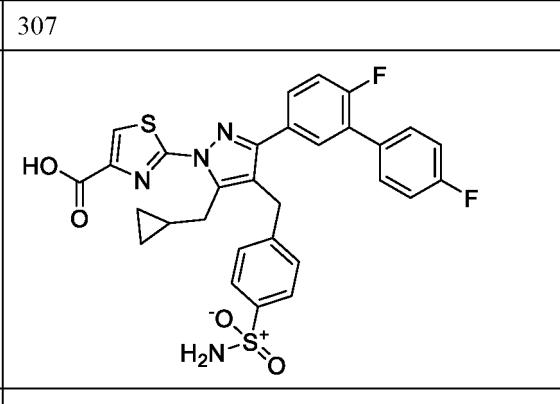
【化 2 0】



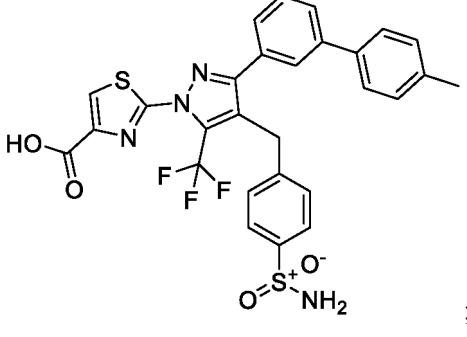
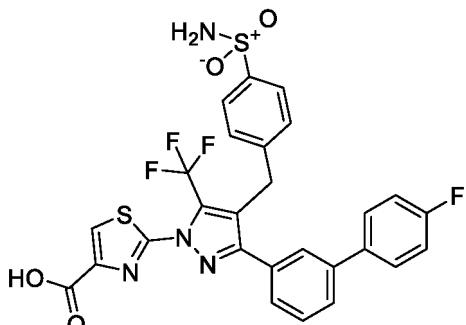
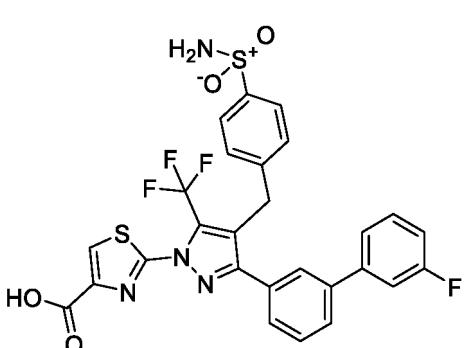
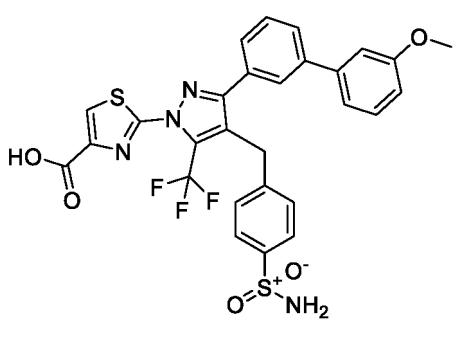
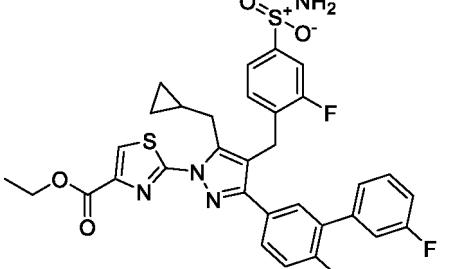
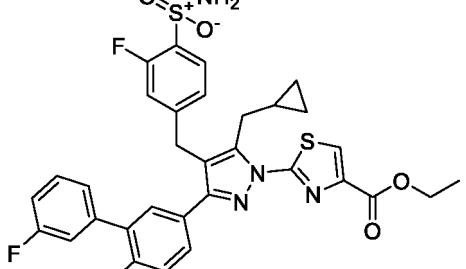
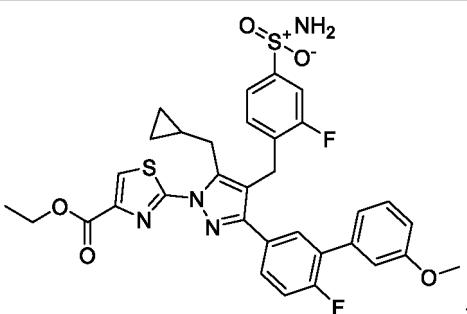
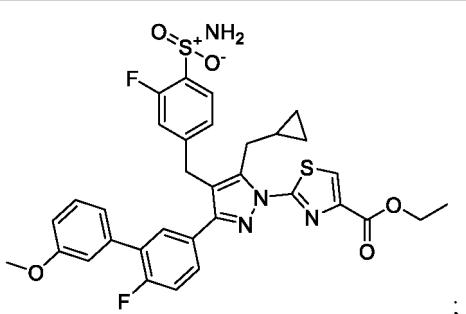
【化 2 1】

278	279
281	282
284	288

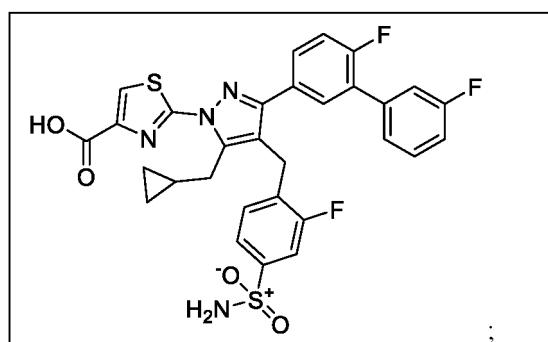
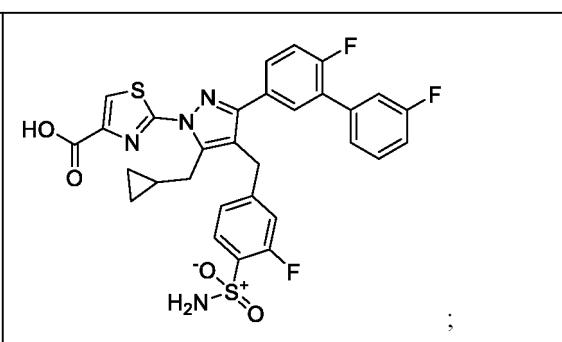
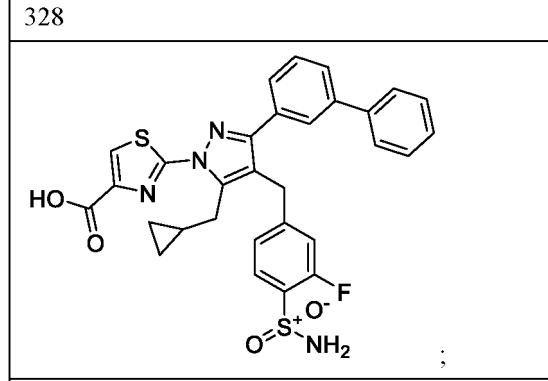
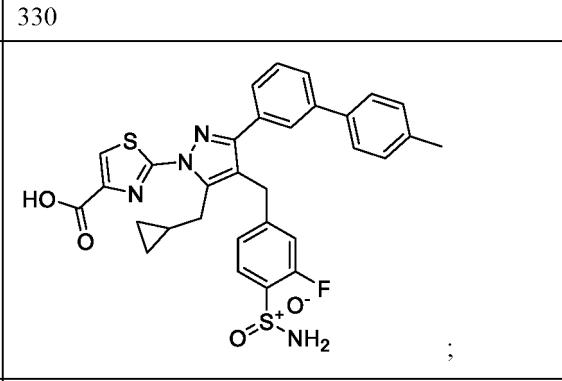
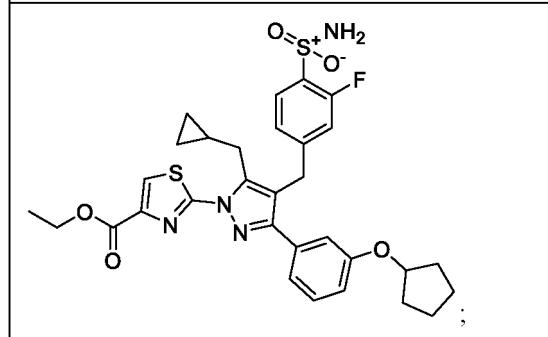
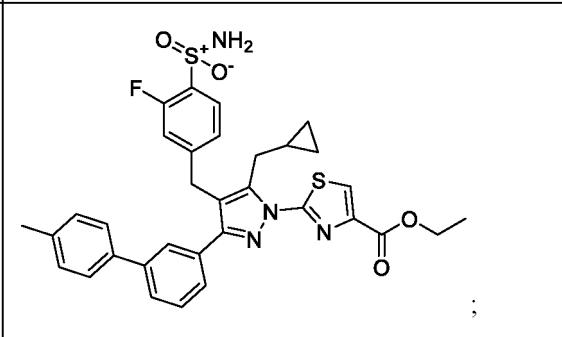
【化 2 2】

	
290	294
	
296	304
	
306	307
309	310

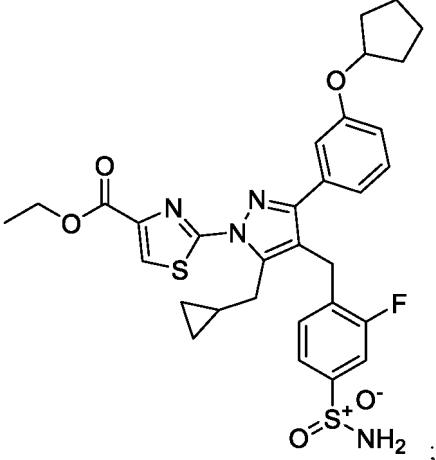
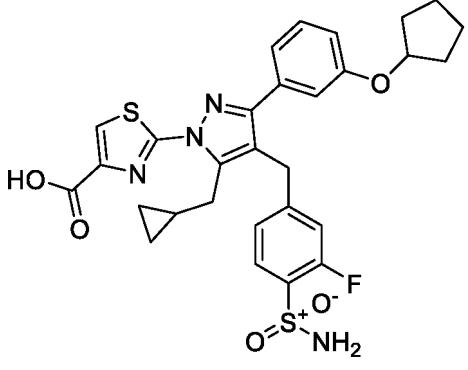
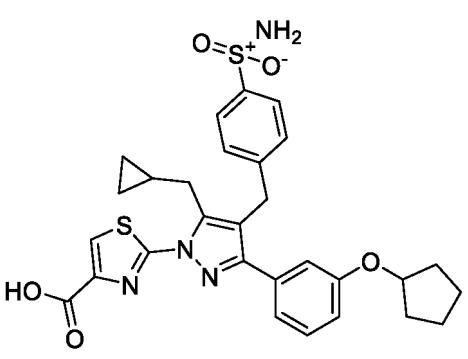
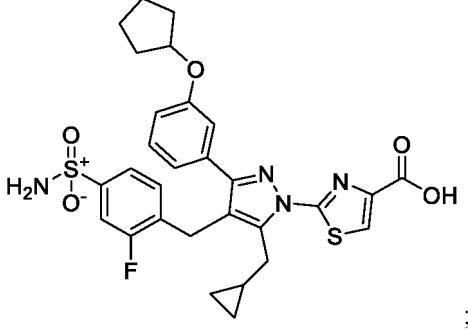
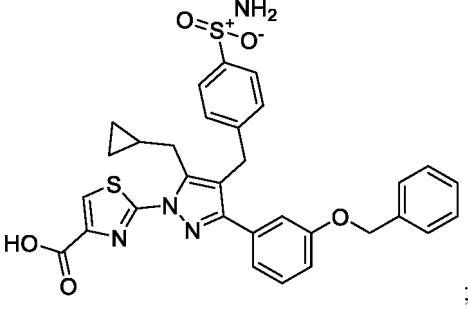
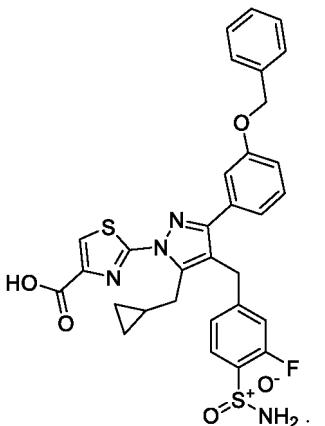
【化 2 3】

 <p>;</p>	
<p>311</p>  <p>;</p>	<p>312</p> 
<p>313</p> 	<p>314</p> 
<p>316</p>  <p>;</p>	<p>318</p>  <p>;</p>
<p>320</p>	<p>322</p>

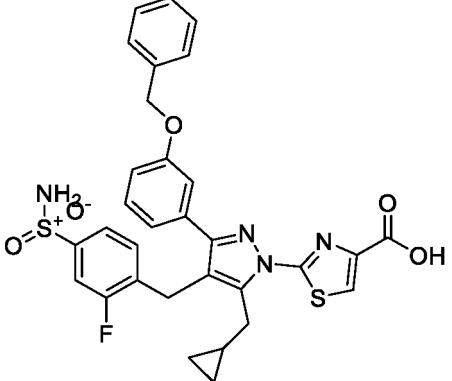
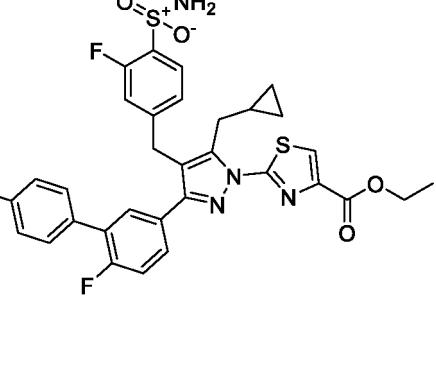
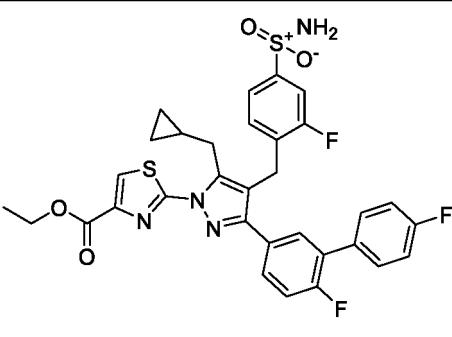
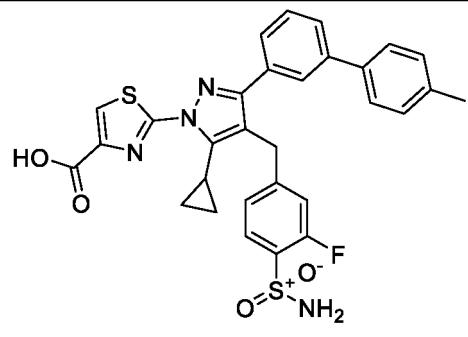
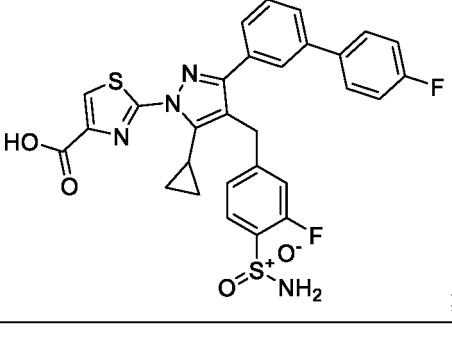
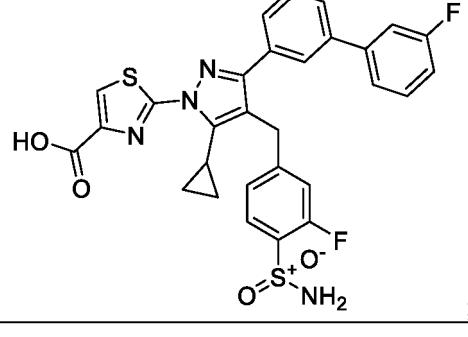
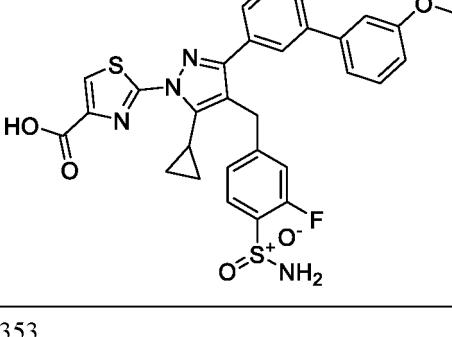
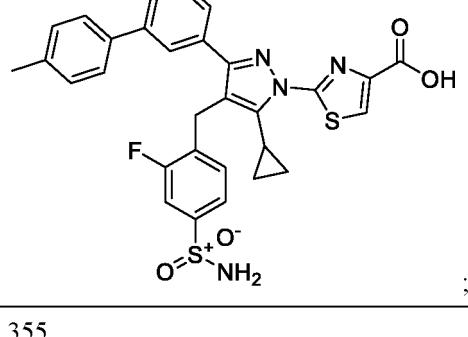
【化 2 4】

	
324	326
	
328	330
	
331	332
333	334

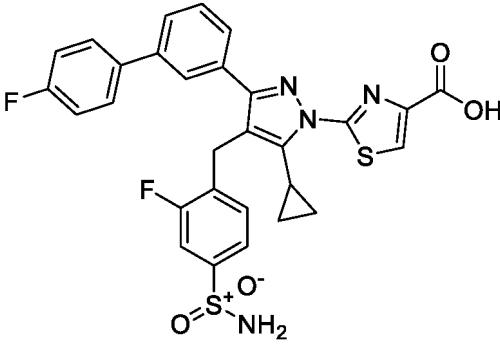
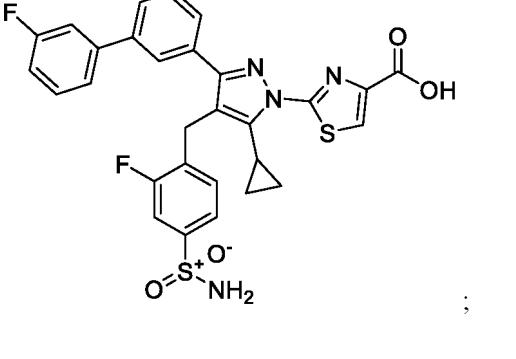
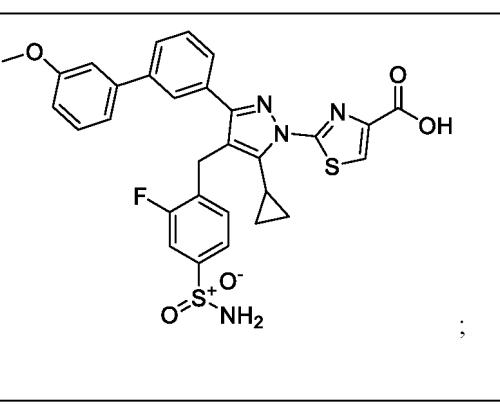
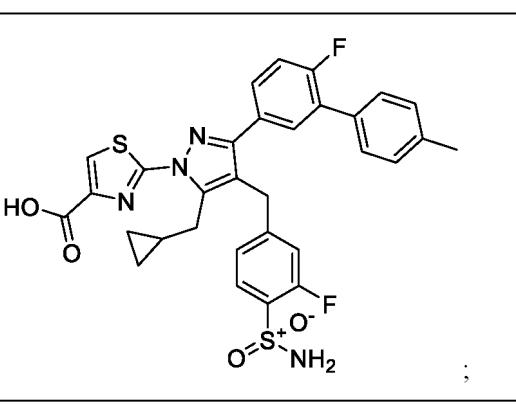
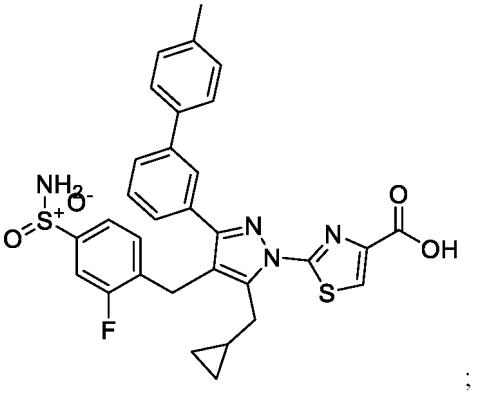
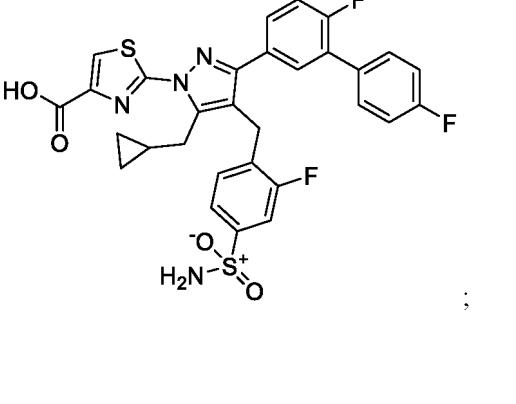
【化 2 5】

	
335	336
	
337	338
	
339	340

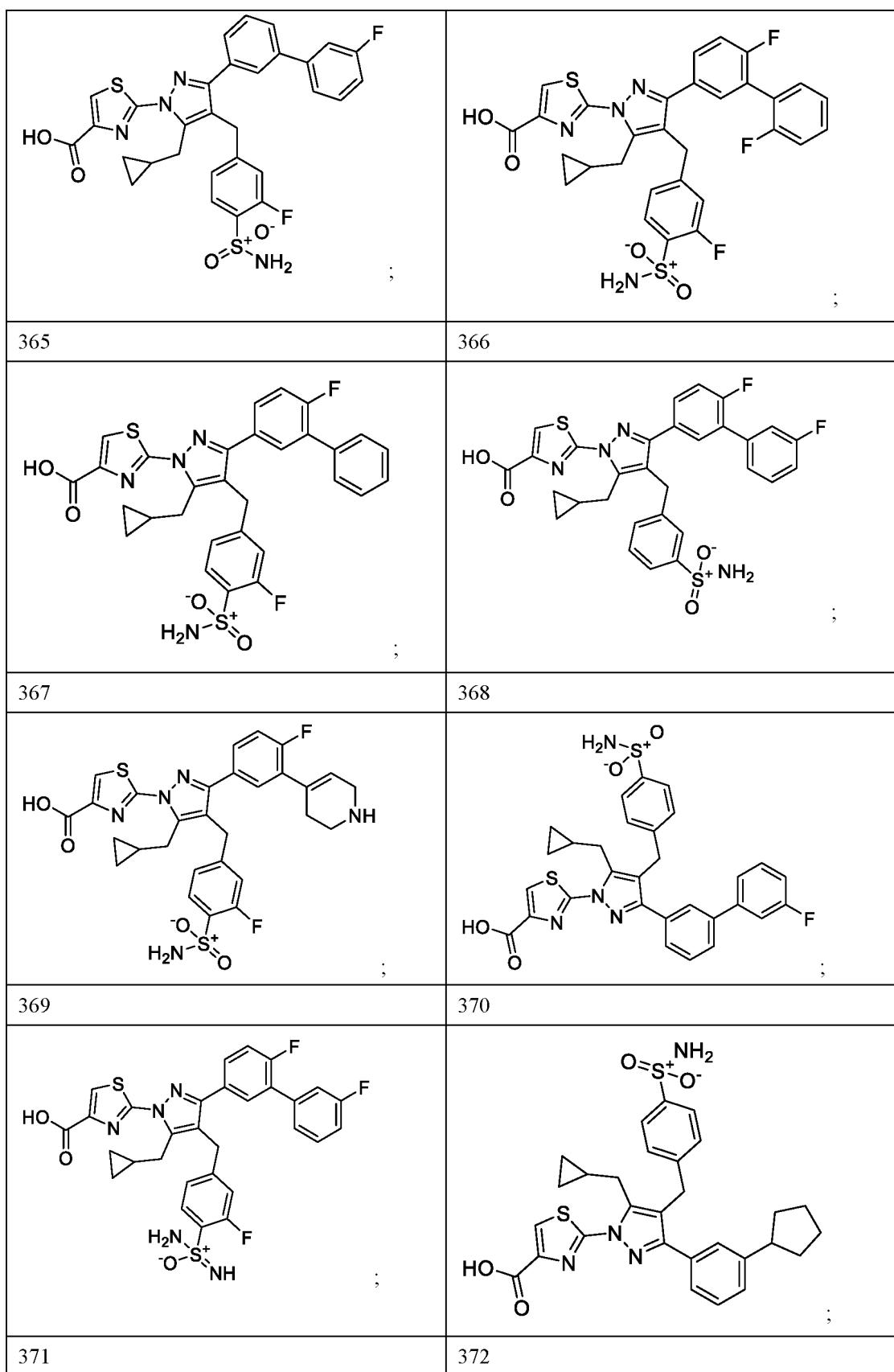
【化 2 6】

 <p>;</p>	 <p>;</p>
<p>341</p>  <p>;</p>	<p>343</p>  <p>;</p>
<p>345</p>  <p>;</p>	<p>347</p>  <p>;</p>
<p>349</p>  <p>;</p>	<p>351</p>  <p>;</p>

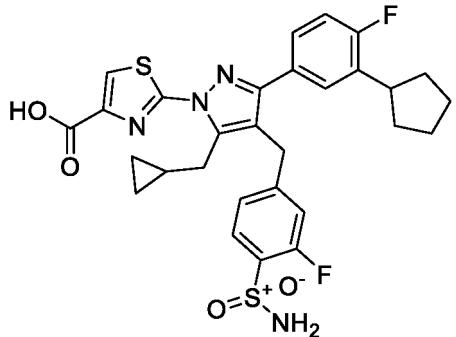
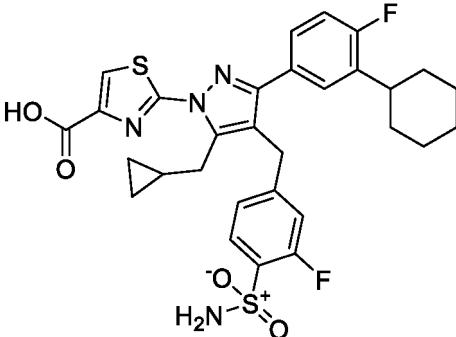
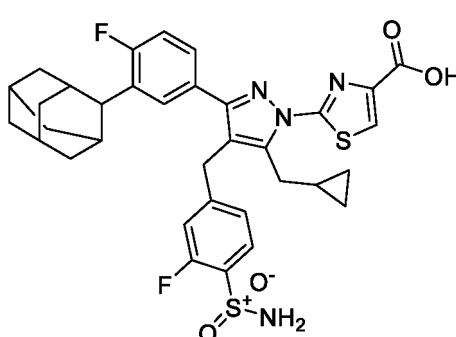
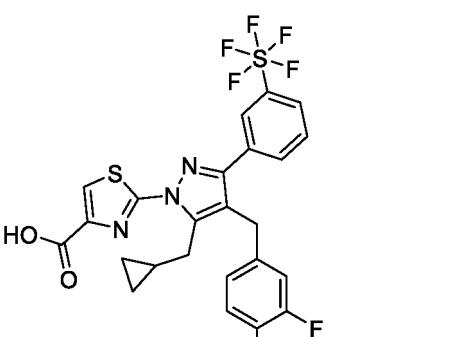
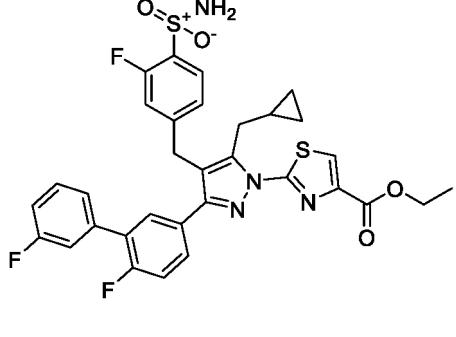
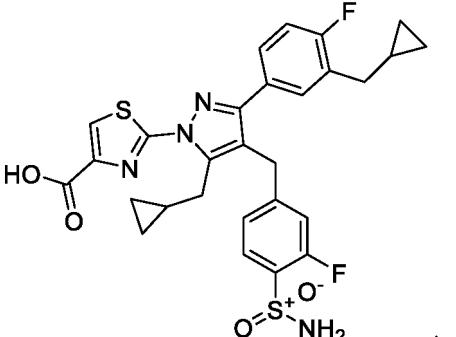
【化 2 7】

	
357	359
	
361	362
	
363	364

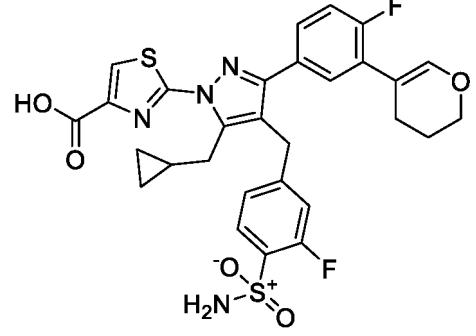
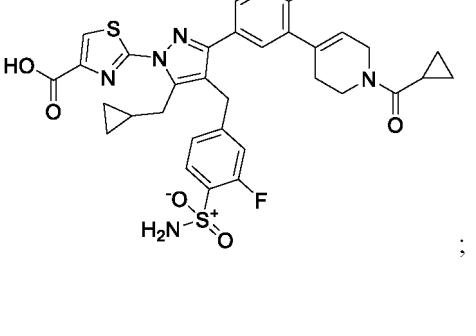
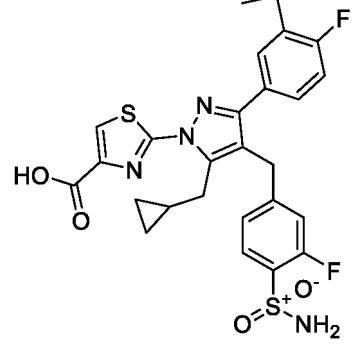
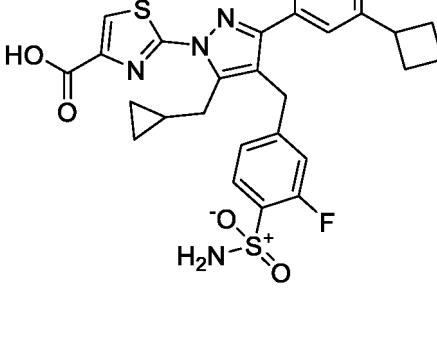
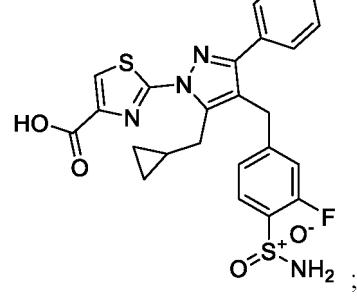
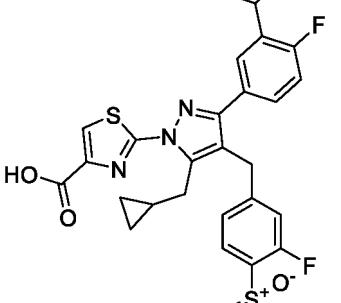
【化 2 8】



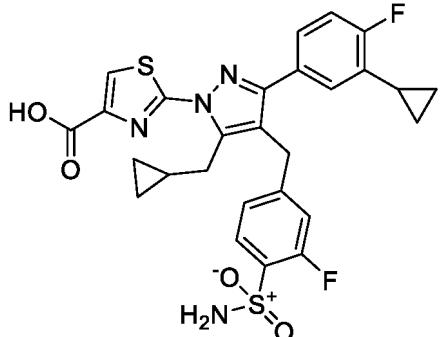
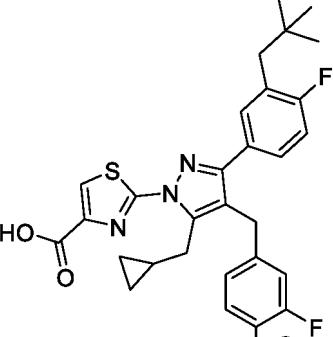
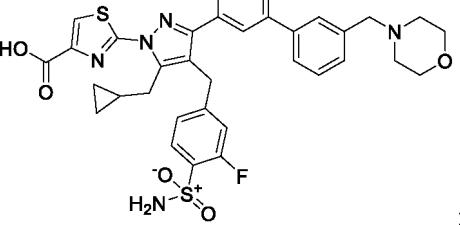
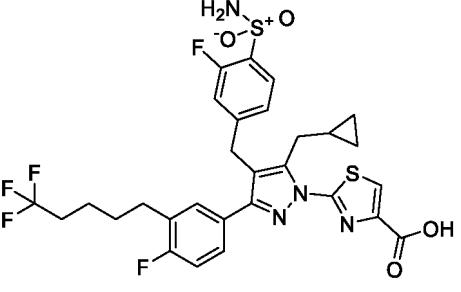
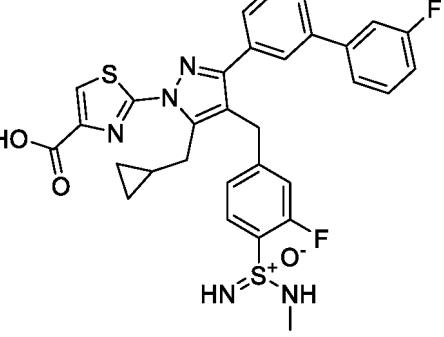
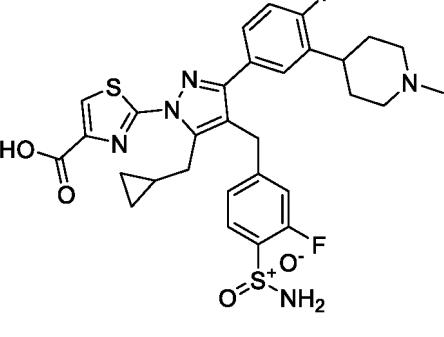
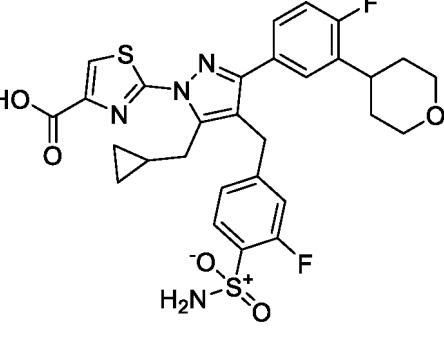
【化 2 9】

 <p>;</p>	 <p>;</p>
<p>373</p>  <p>;</p>	<p>374</p>  <p>;</p>
<p>375</p>  <p>;</p>	<p>376</p>  <p>;</p>
<p>377</p> <p>;</p>	<p>378</p> <p>;</p>

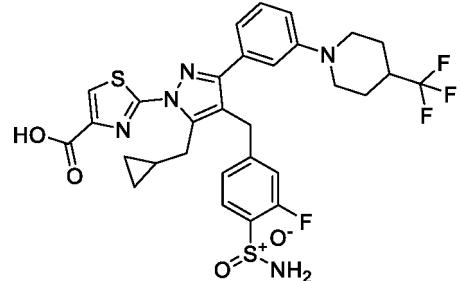
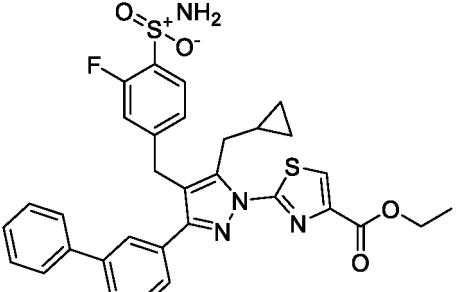
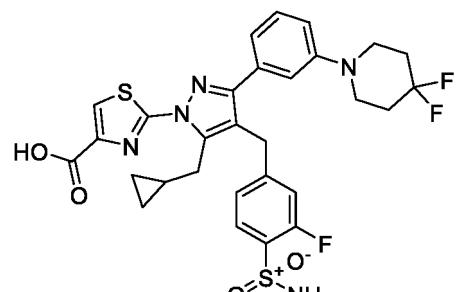
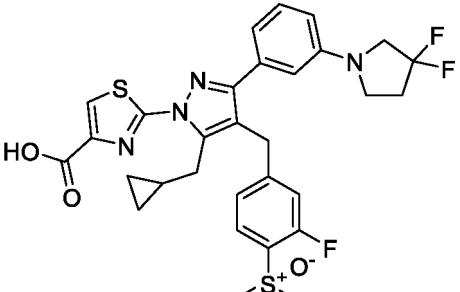
【化 3 0】

	
379	380
	
381	382
	
383	384

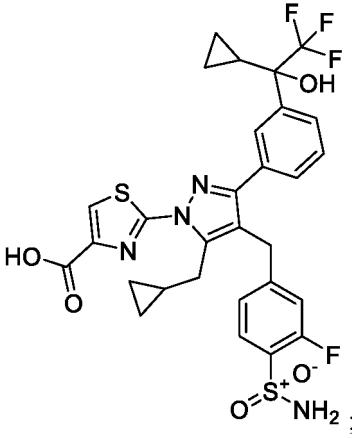
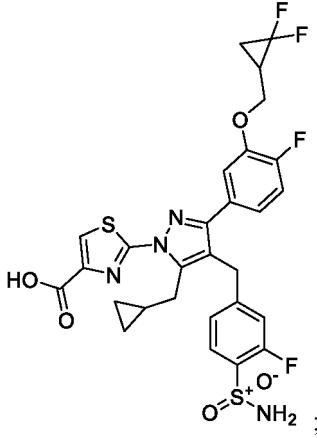
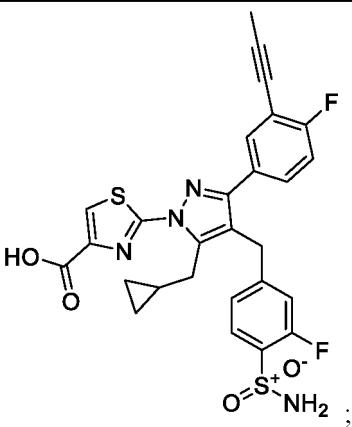
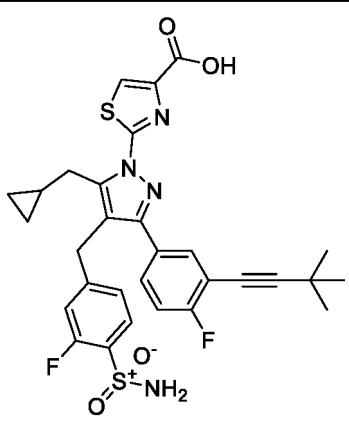
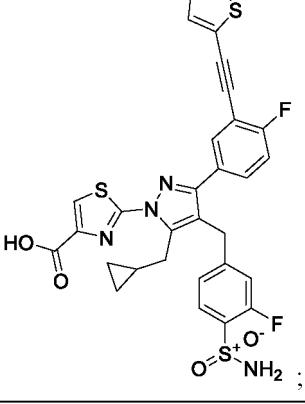
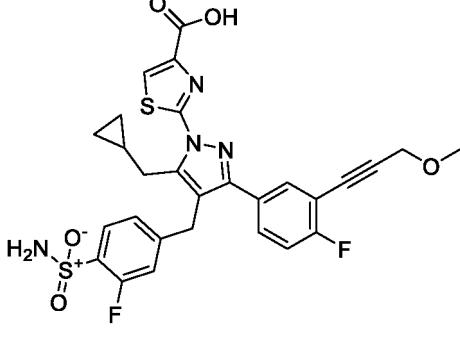
【化 3 1】

 <p>;</p>	 <p>;</p>
<p>385</p>  <p>;</p>	<p>386</p>  <p>;</p>
<p>387</p>  <p>;</p>	<p>388</p>  <p>;</p>
<p>389</p>  <p>;</p>	<p>390</p>  <p>;</p>
<p>391</p>	

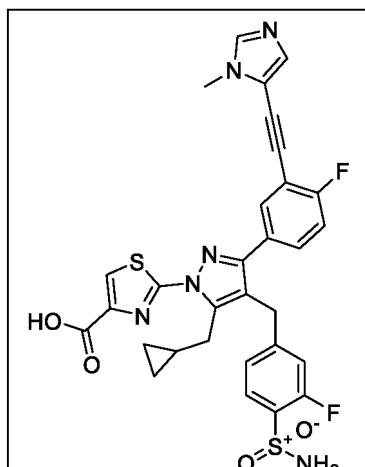
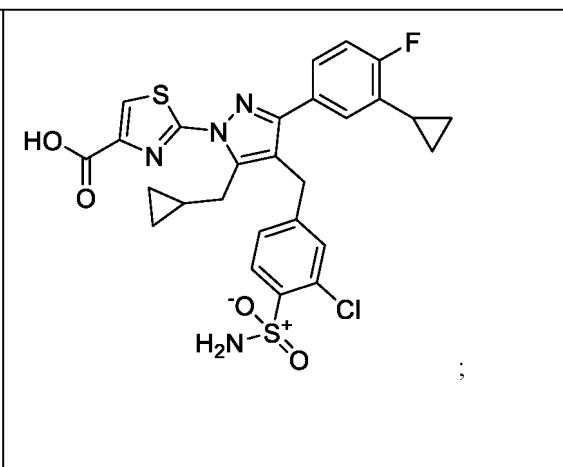
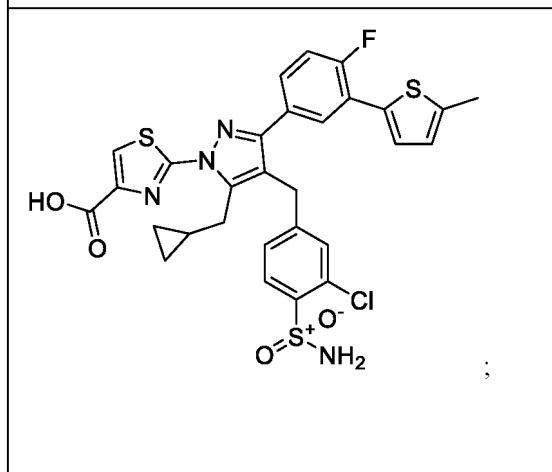
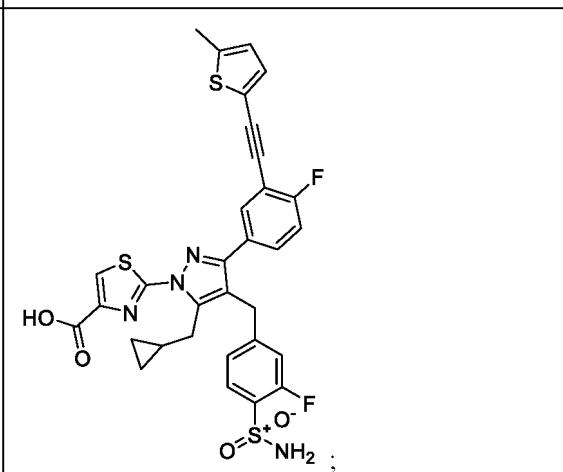
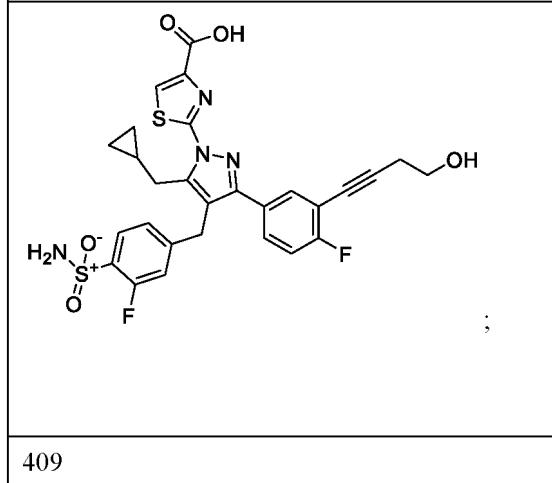
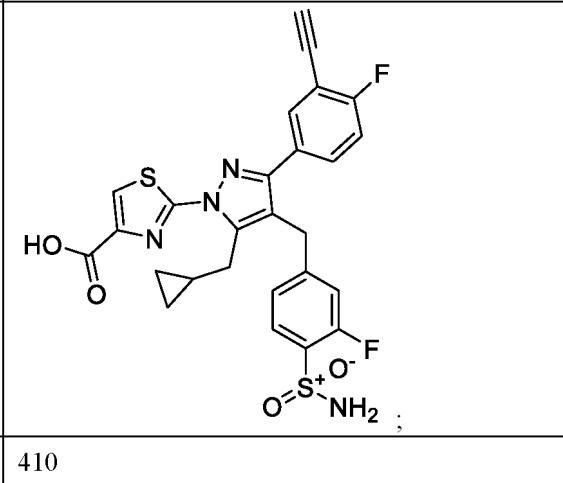
【化 3 2】

	
392	393
	
394	395
396	397

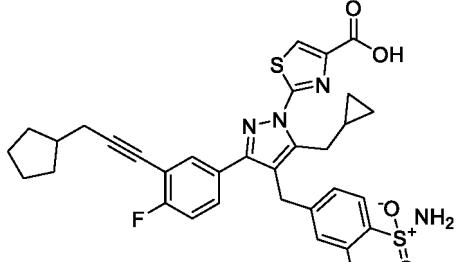
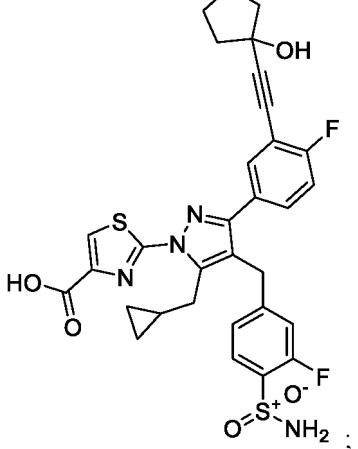
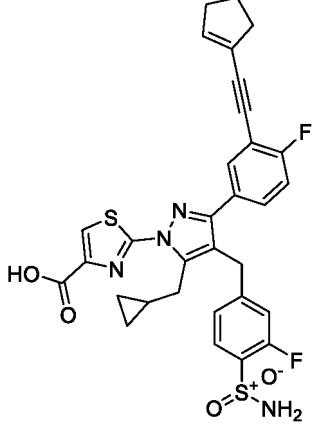
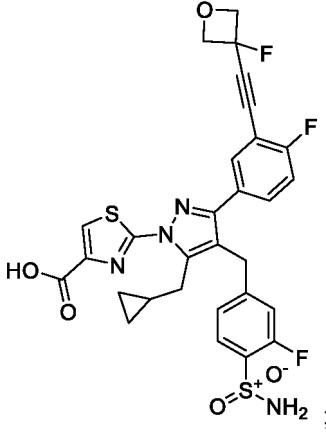
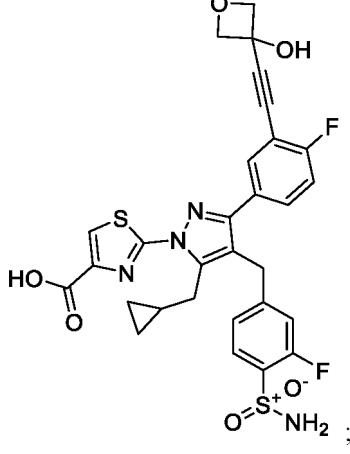
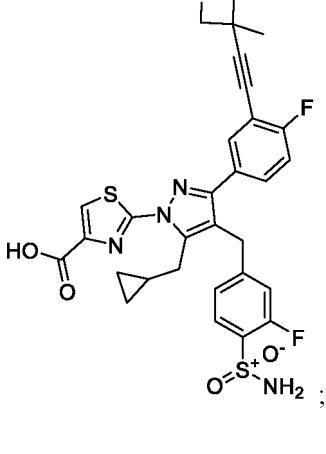
【化 3 3】

	
398	400
	
401	402
	
403	404

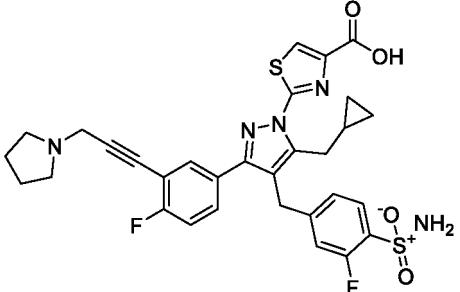
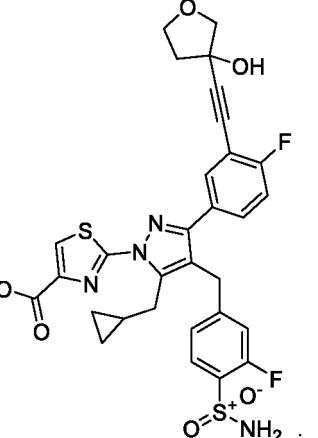
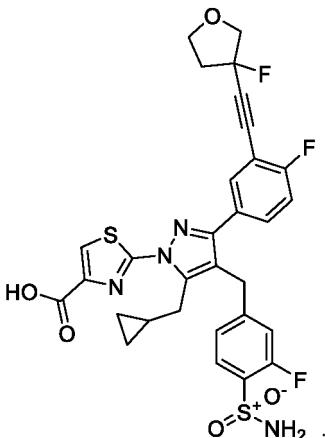
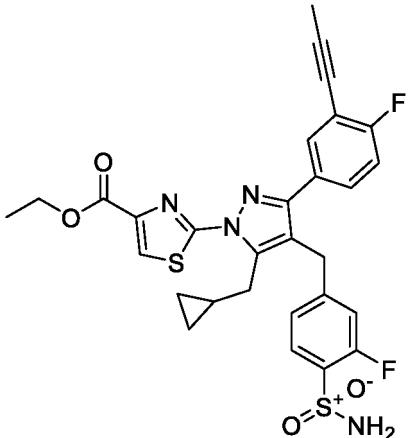
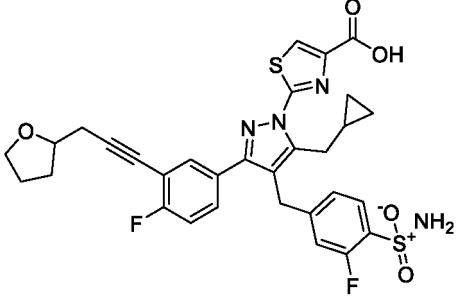
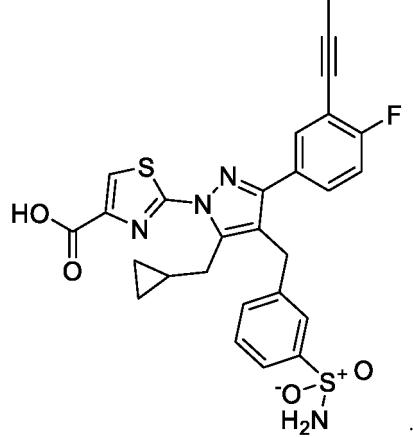
【化 3 4】

	
405	406
	
407	408
	
409	410

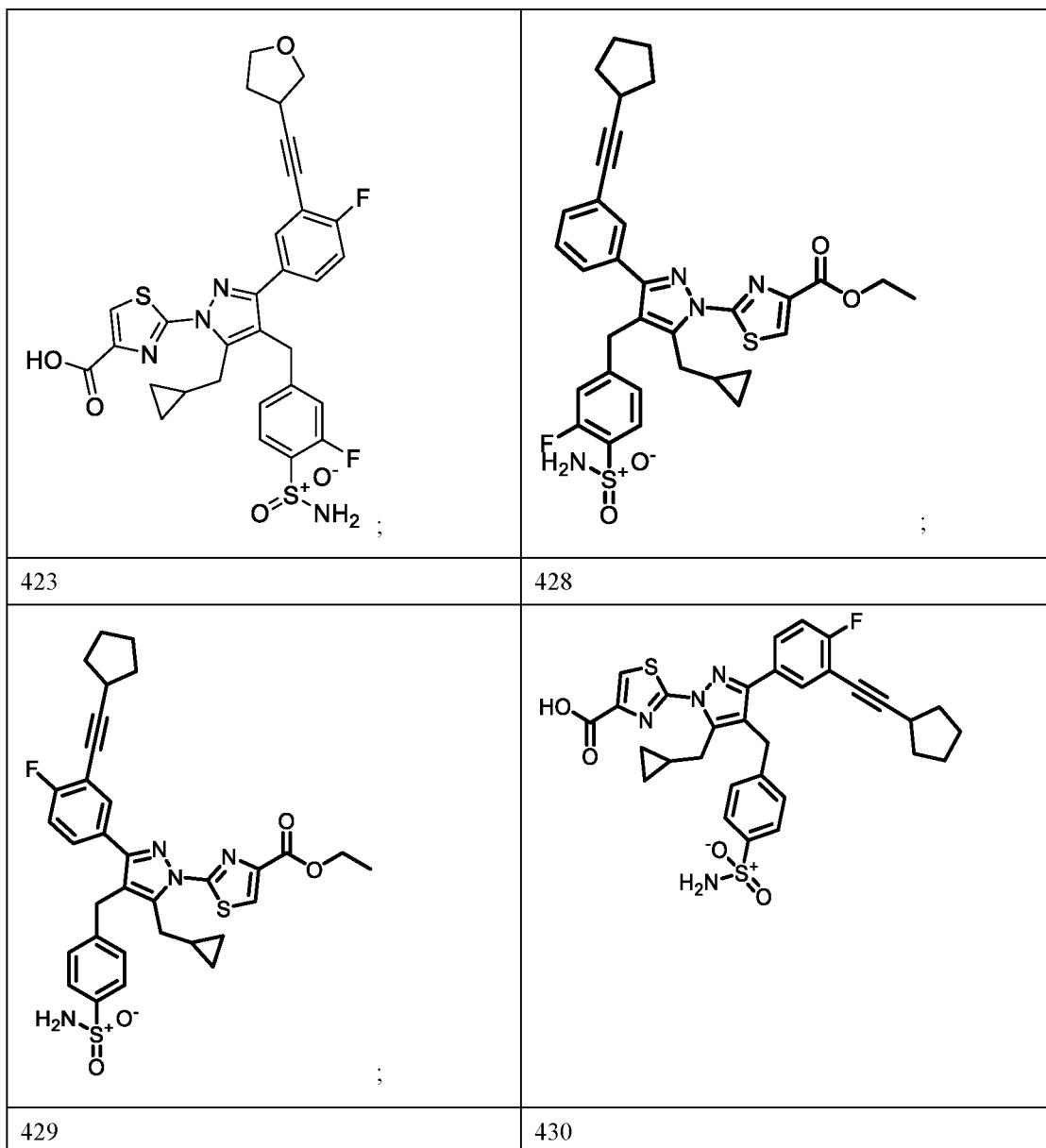
【化 3 5】

 <p>;</p>	 <p>;</p>
<p>411</p>  <p>;</p>	<p>412</p>  <p>;</p>
<p>413</p>  <p>;</p>	<p>414</p>  <p>;</p>
<p>415</p>	<p>416</p>

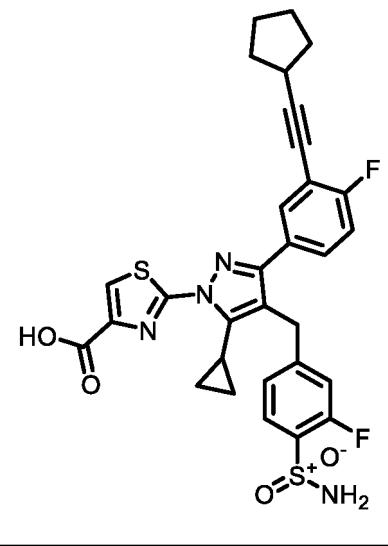
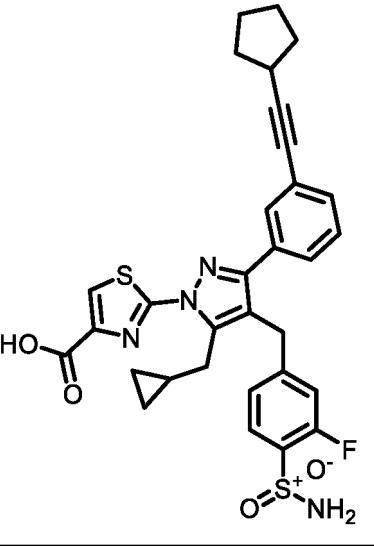
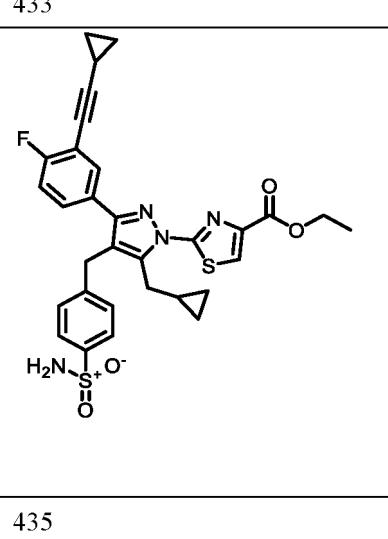
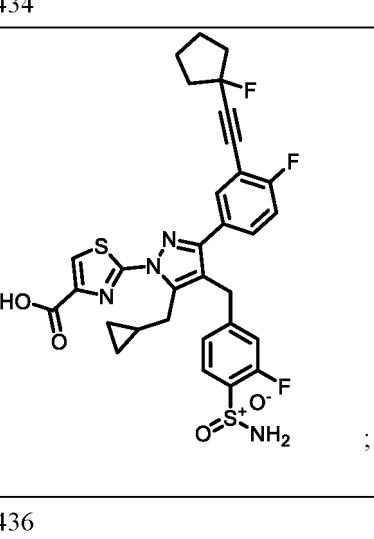
【化 3 6】

 <p>;</p>	 <p>;</p>
<p>417</p>  <p>;</p>	<p>418</p>  <p>;</p>
<p>419</p>  <p>;</p>	<p>420</p>  <p>;</p>
<p>421</p>	<p>422</p>

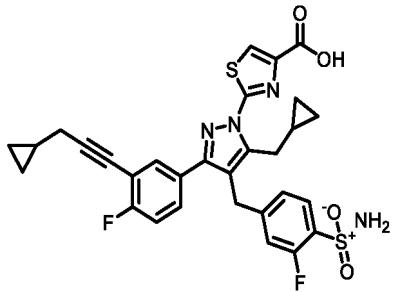
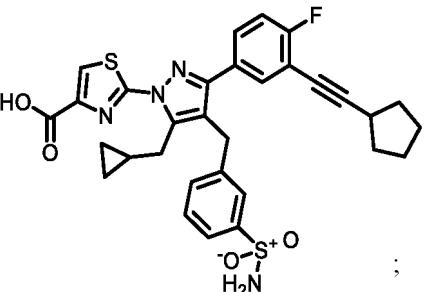
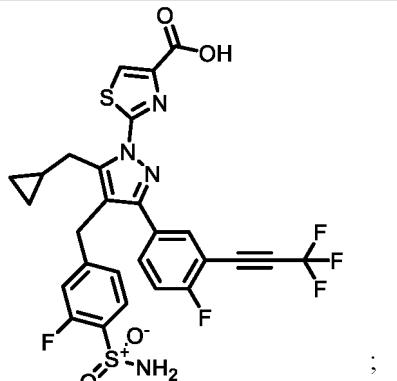
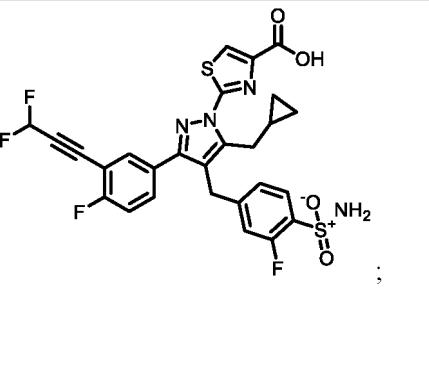
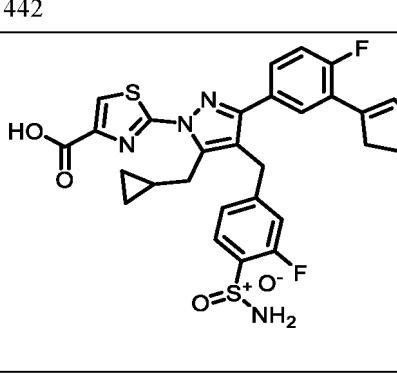
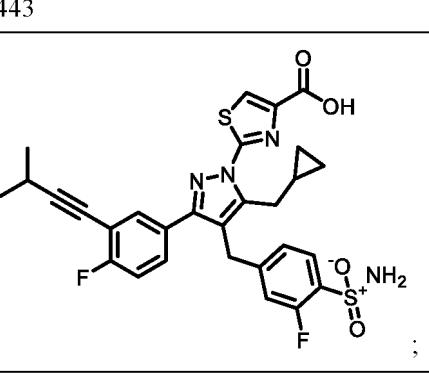
【化 3 7】



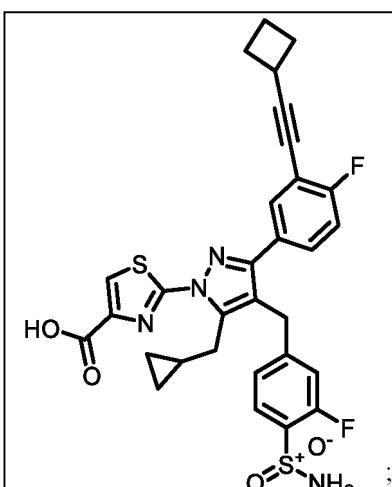
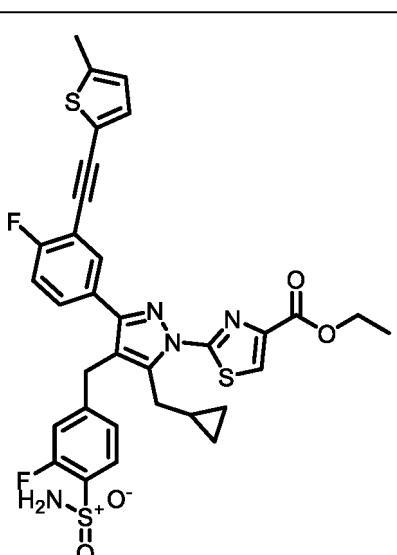
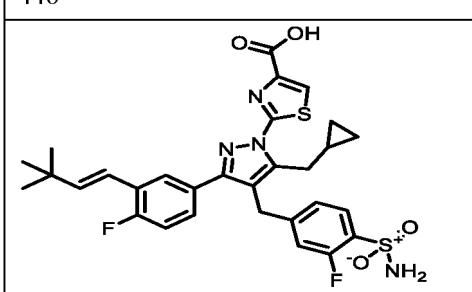
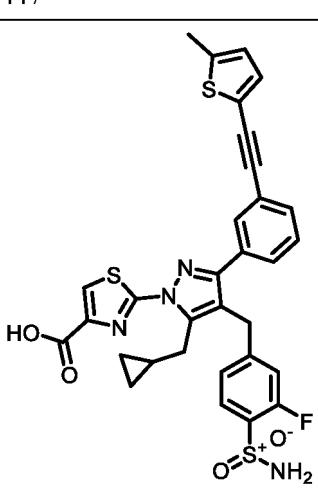
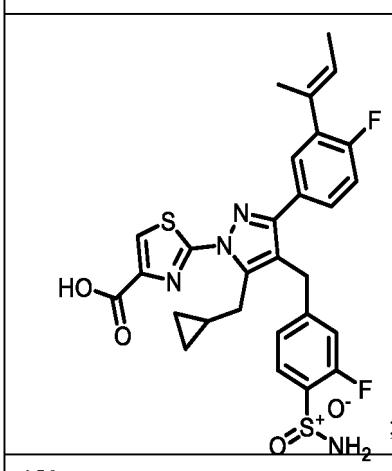
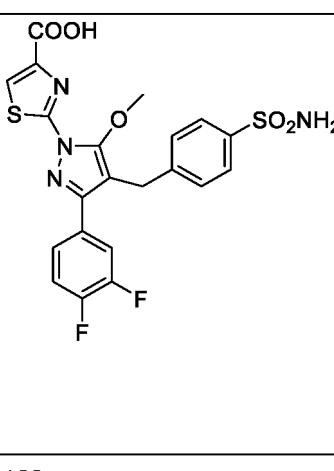
【化 3 8】

	
431	432
;	;
	
433	434
;	;
435	436

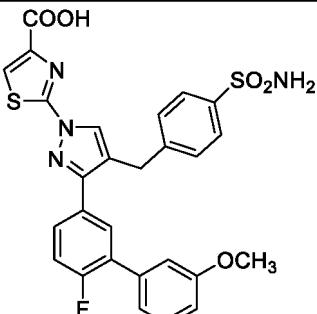
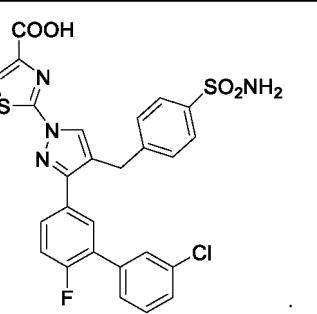
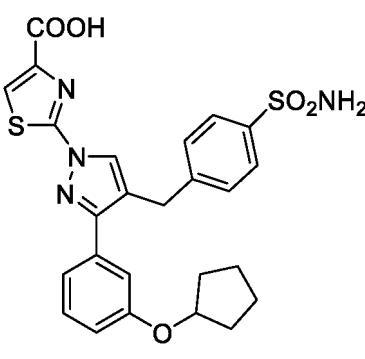
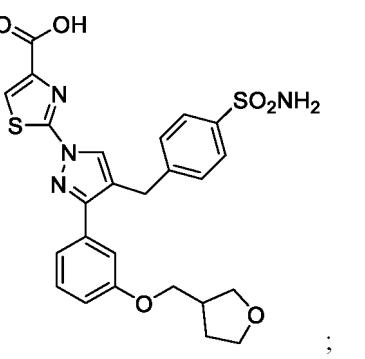
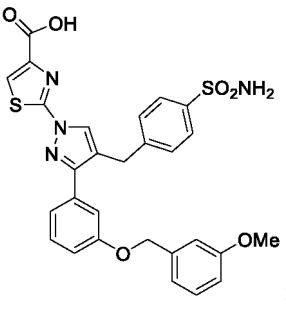
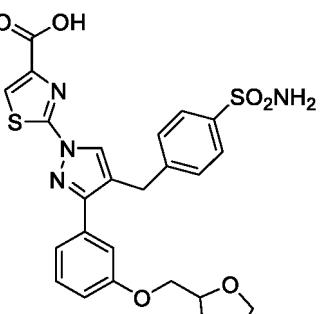
【化 3 9】

	
437	438
	
439	440
442	443
	
444	445

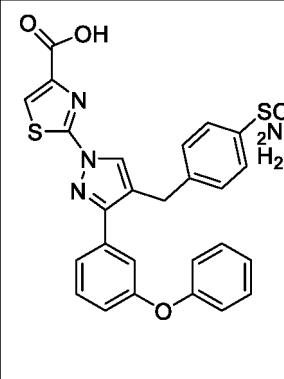
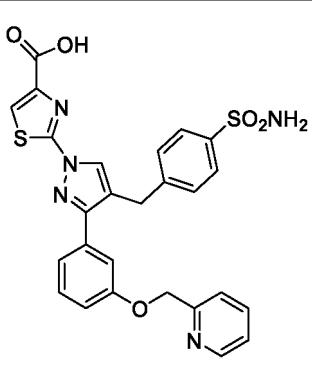
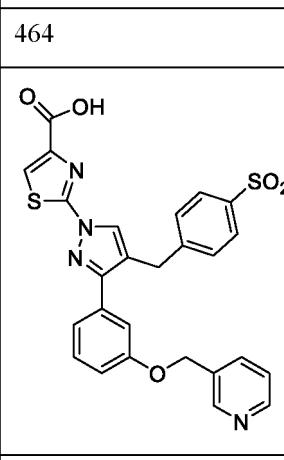
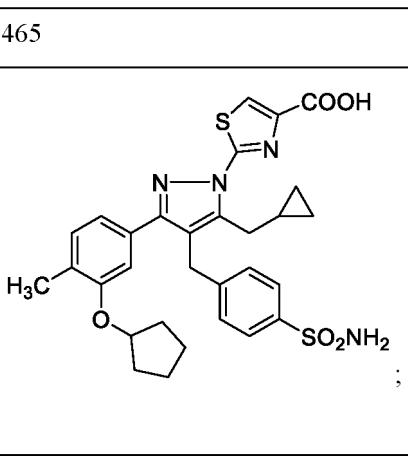
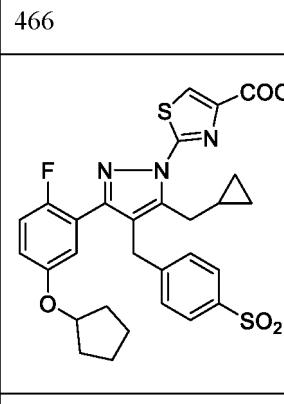
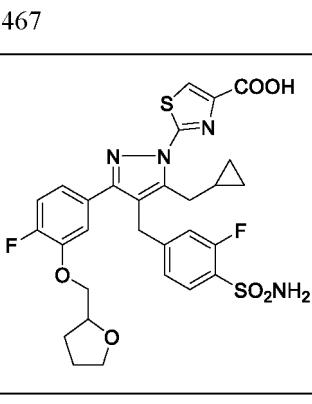
【化 4 0】

	
446	447
	
448	449
	
450	455

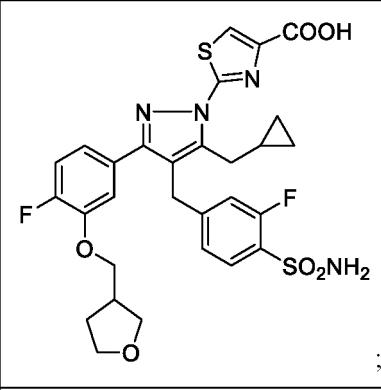
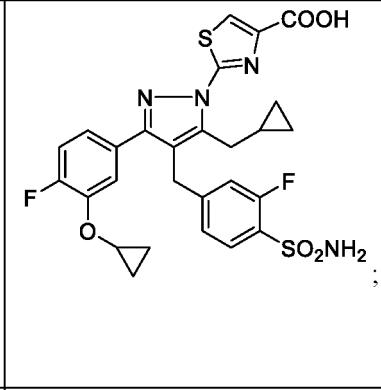
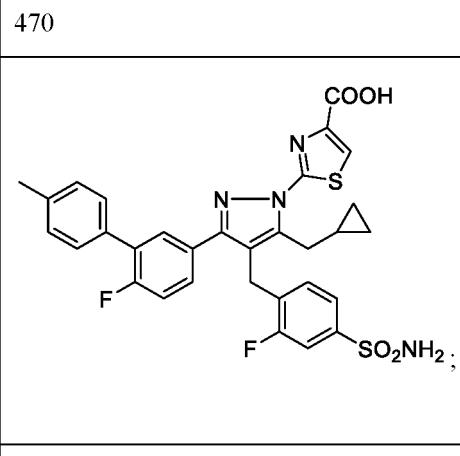
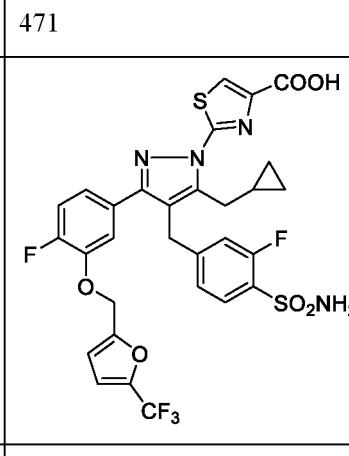
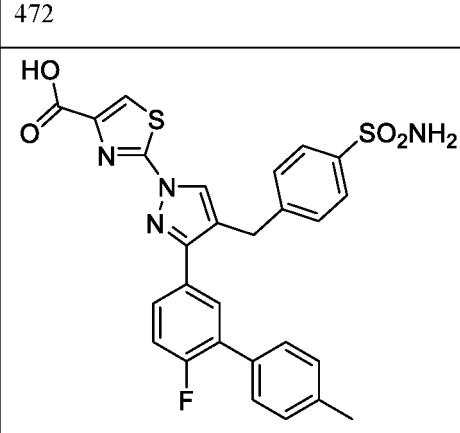
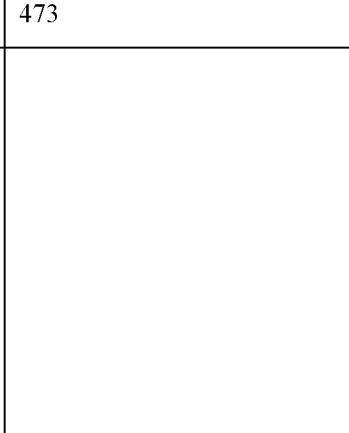
【化41】

 <p>;</p>	 <p>;</p>
<p>456</p>	<p>457</p>
<p>;</p>	<p>;</p>
<p>458</p>	<p>459</p>
 <p>;</p>	 <p>;</p>
<p>460</p>	<p>461</p>
 <p>;</p>	 <p>;</p>
<p>462</p>	<p>463</p>

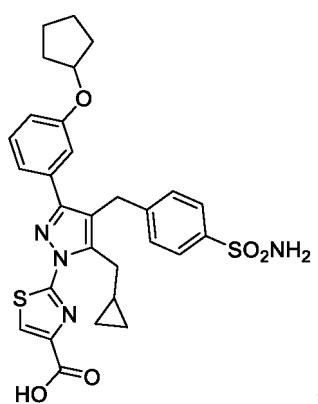
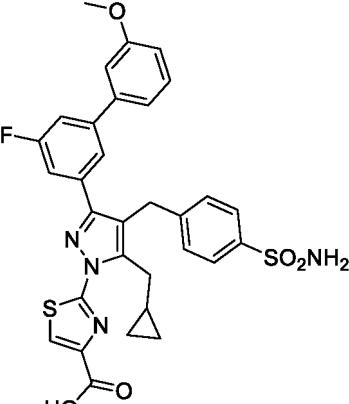
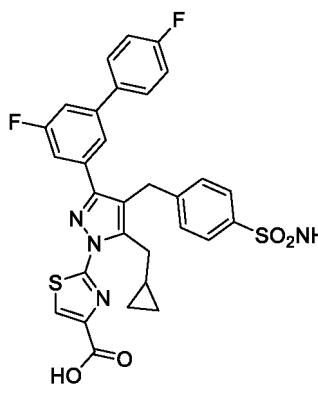
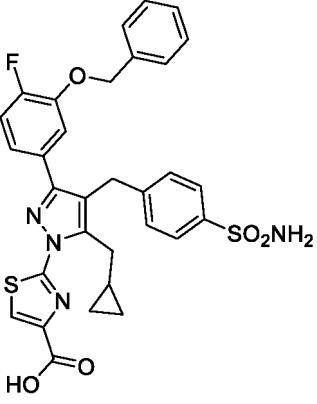
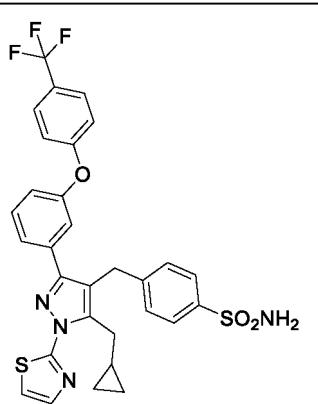
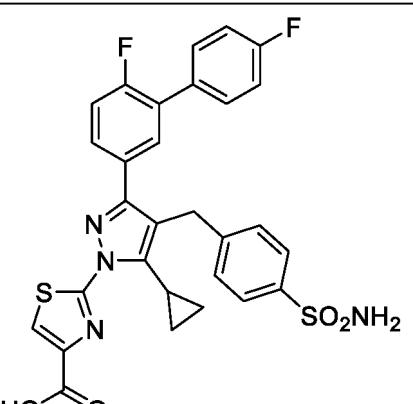
【化 4 2】

 <p>;</p>	 <p>;</p>
<p>464</p>  <p>;</p>	<p>465</p>  <p>;</p>
<p>466</p>  <p>;</p>	<p>467</p>  <p>;</p>
<p>468</p>	<p>469</p>

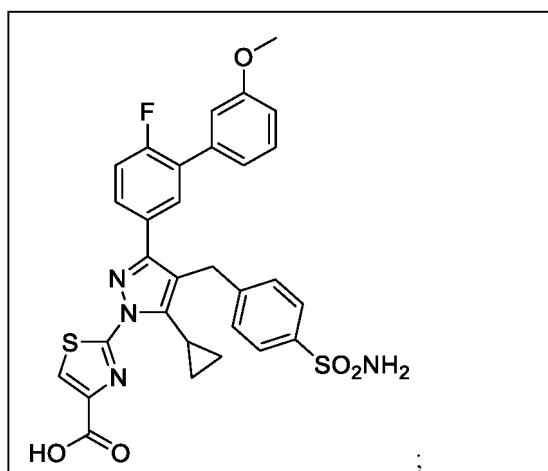
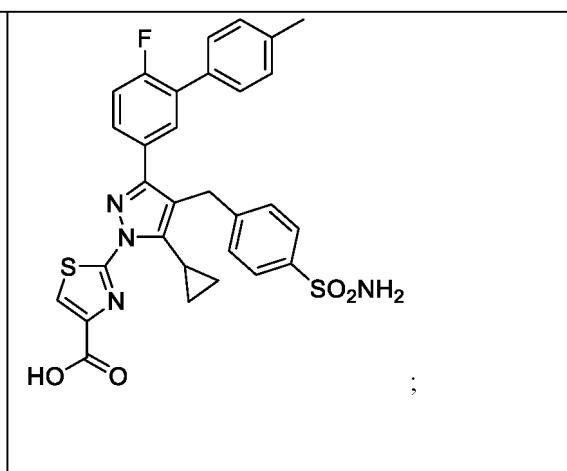
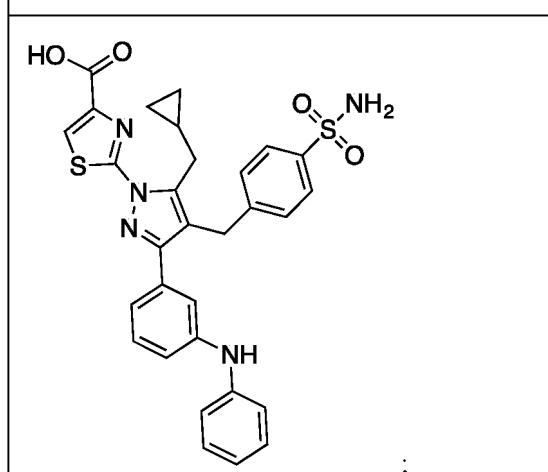
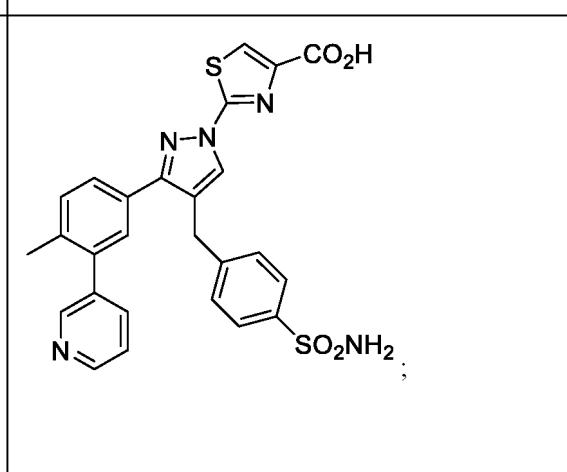
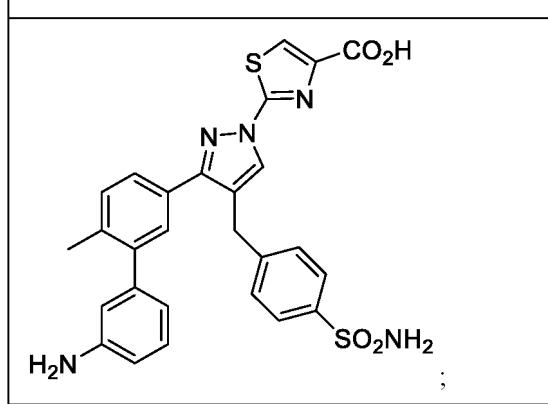
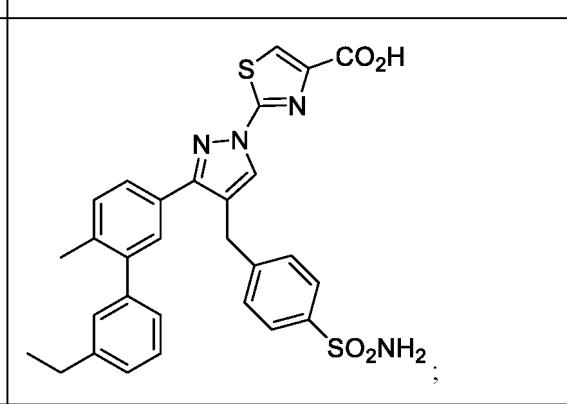
【化43】

 <p>;</p>	 <p>;</p>
<p>470</p>  <p>;</p>	<p>471</p>  <p>;</p>
<p>472</p>  <p>;</p>	<p>473</p>  <p>;</p>
<p>476</p>  <p>;</p>	

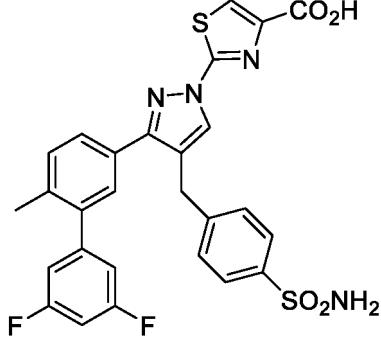
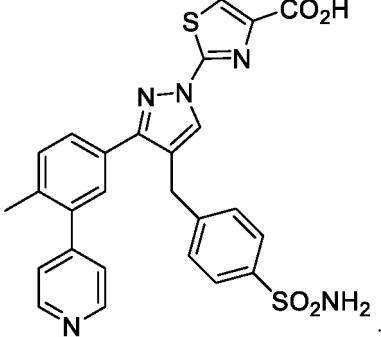
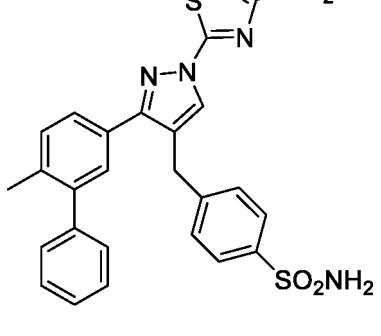
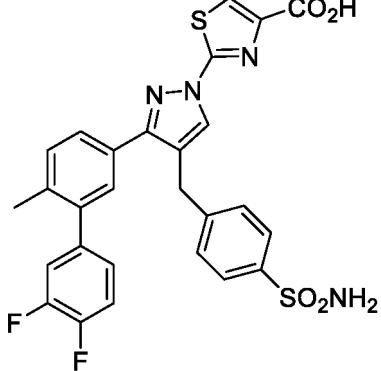
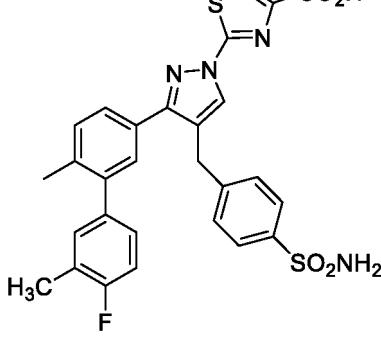
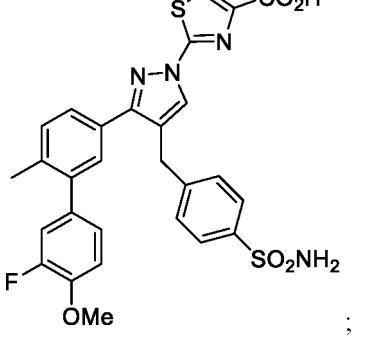
【化 4 4】

 <p>;</p>	 <p>;</p>
<p>477</p>	<p>478</p>
 <p>;</p>	 <p>;</p>
<p>479</p>	<p>480</p>
 <p>;</p>	 <p>;</p>
<p>481</p>	<p>482</p>

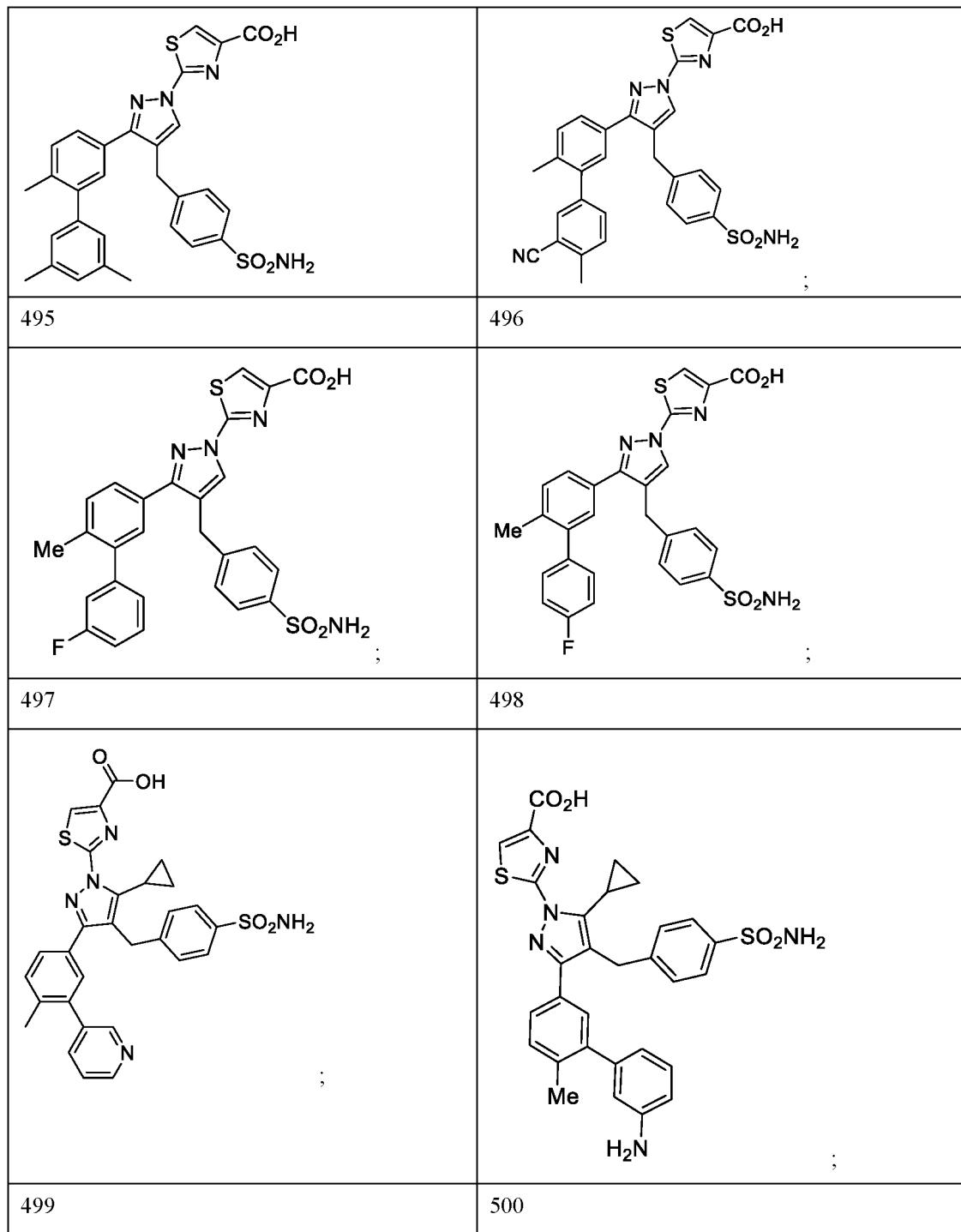
【化45】

 <p>;</p>	 <p>;</p>
483	484
 <p>;</p>	 <p>;</p>
485	486
 <p>;</p>	 <p>;</p>
487	488

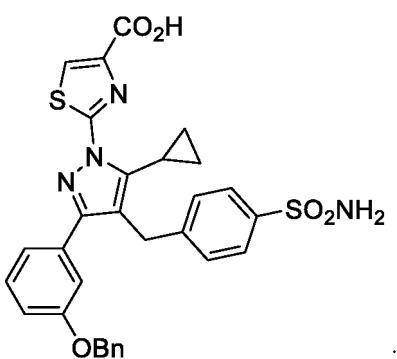
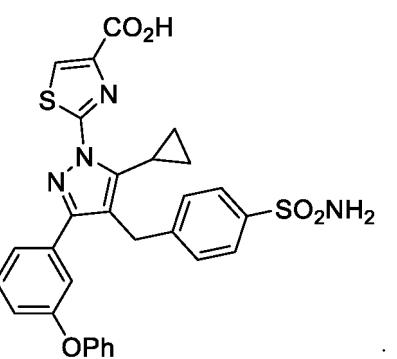
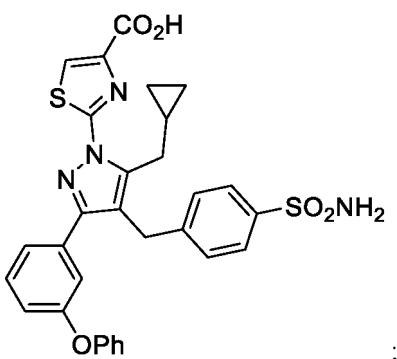
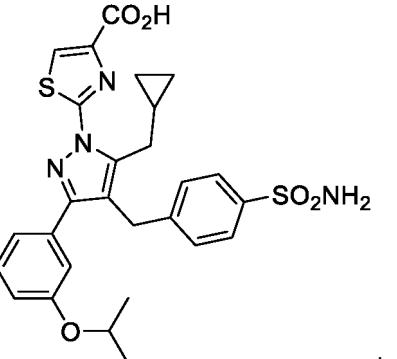
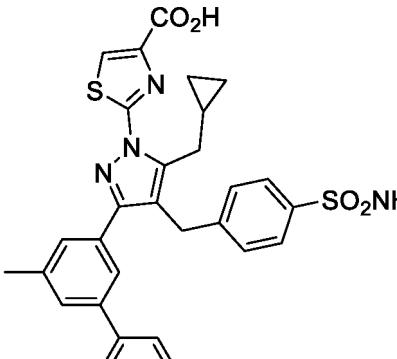
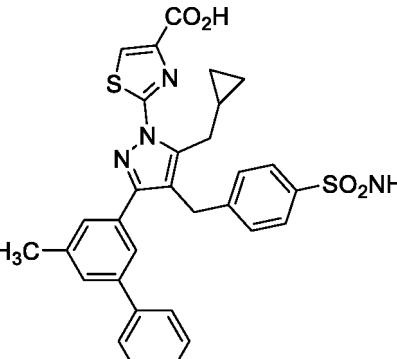
【化46】

	
489	490
	
491	492
	
493	494

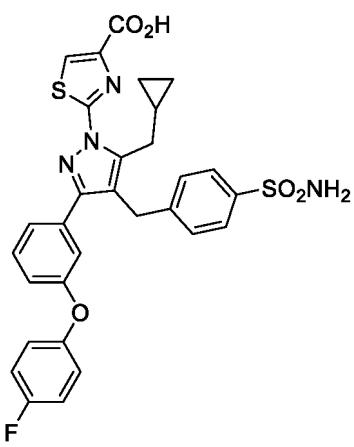
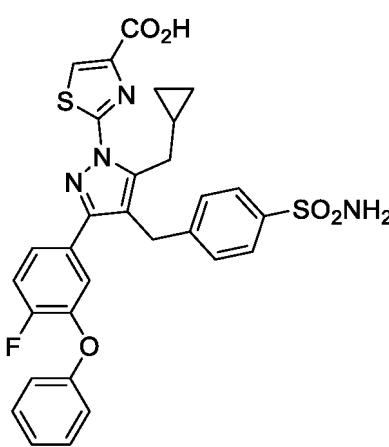
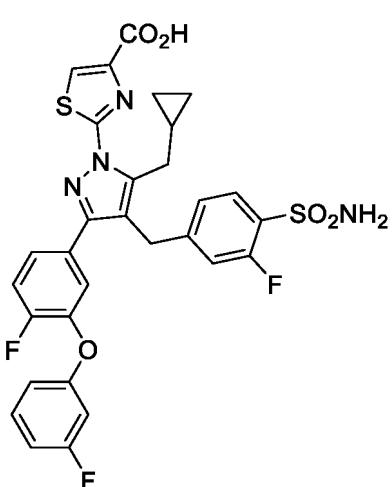
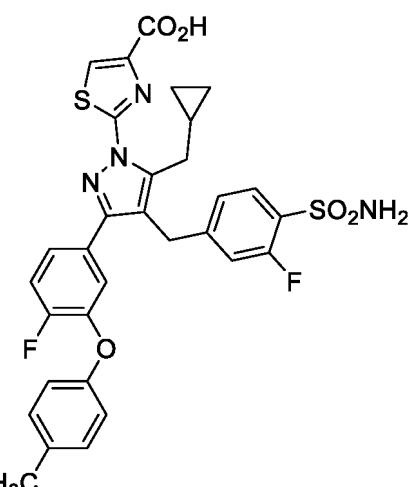
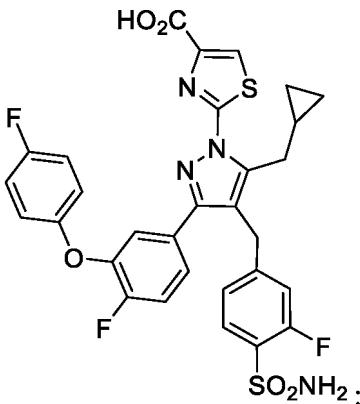
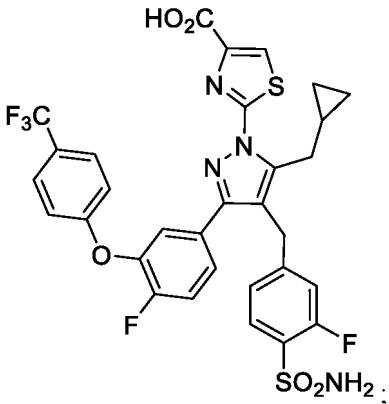
【化 4 7】



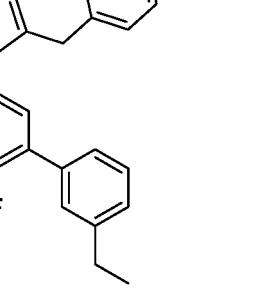
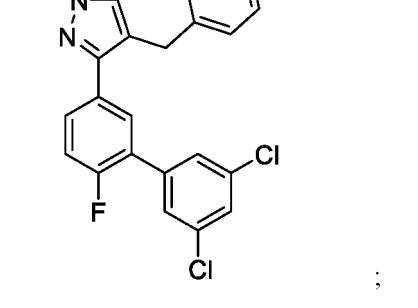
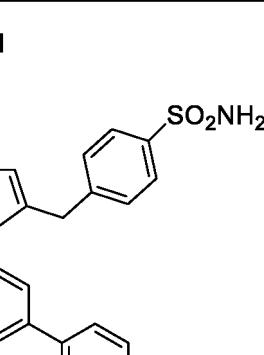
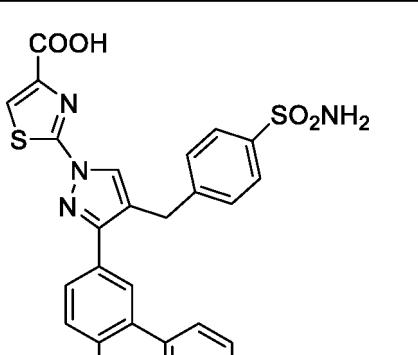
【化48】

	
501	502
	
503	504
	
505	506

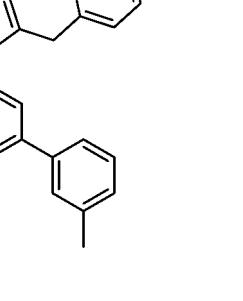
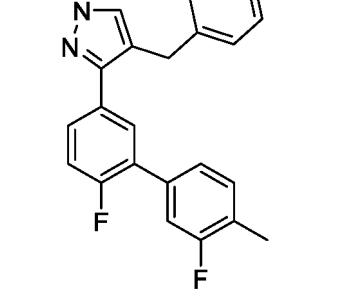
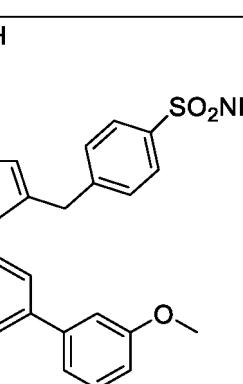
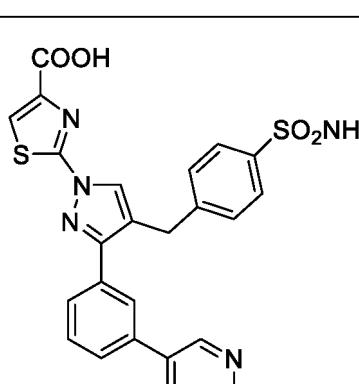
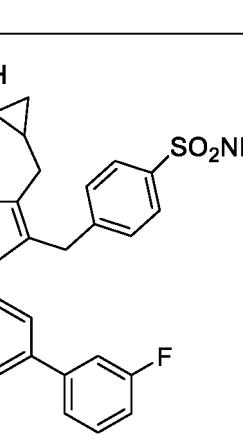
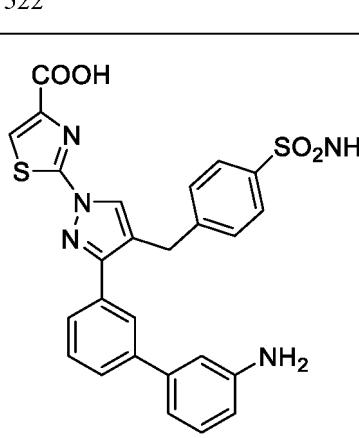
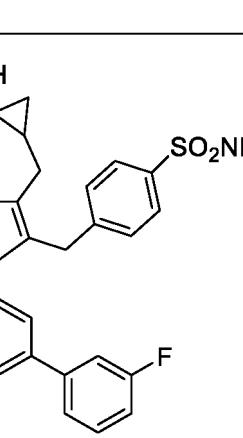
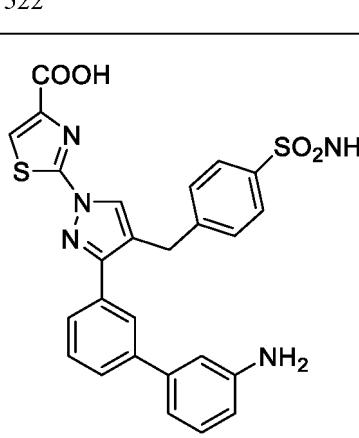
【化 4 9】

 <p>;</p>	
<p>507</p>	<p>508</p>
 <p>;</p>	 <p>;</p>
<p>509</p>	<p>510</p>
 <p>;</p>	 <p>;</p>
<p>511</p>	<p>512</p>

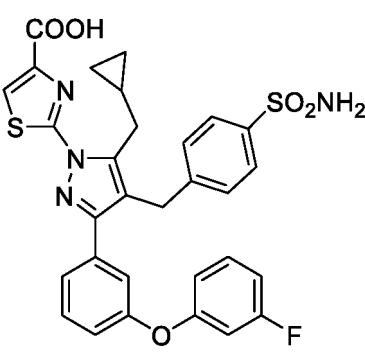
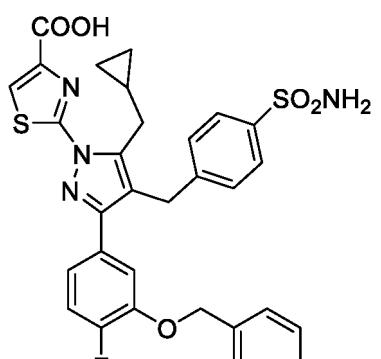
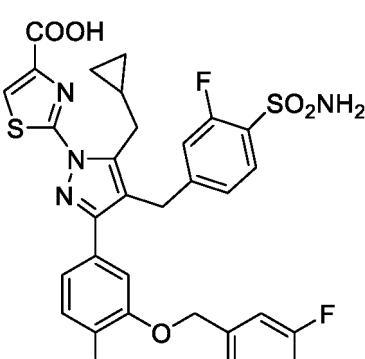
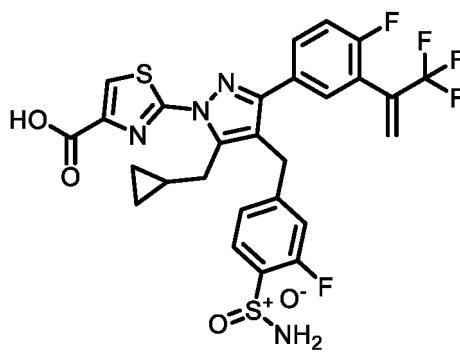
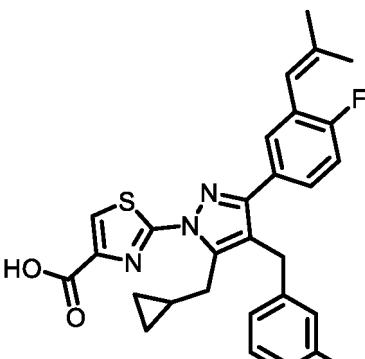
【化 5 0 】

	
513	514
	
515	516
517	518

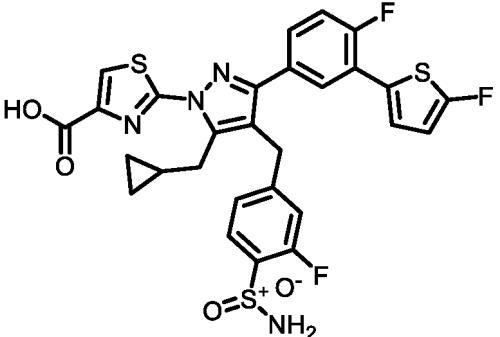
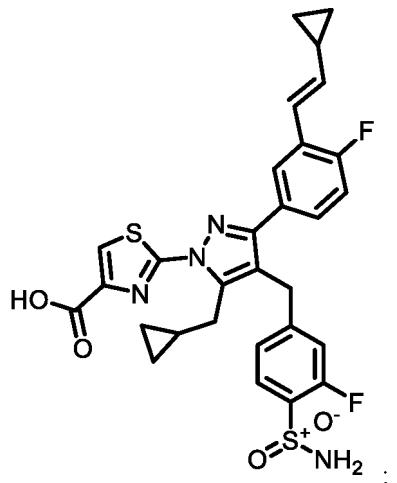
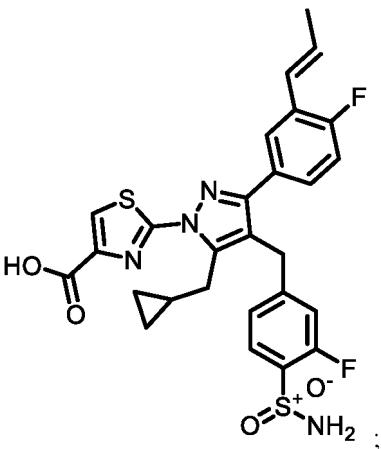
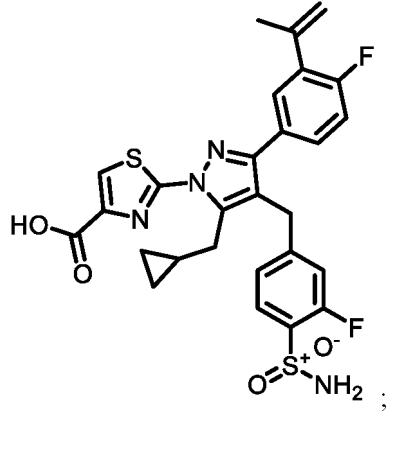
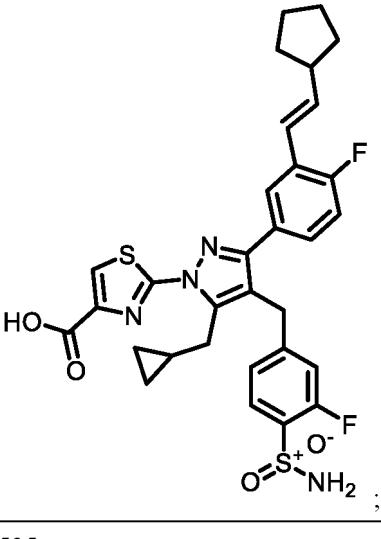
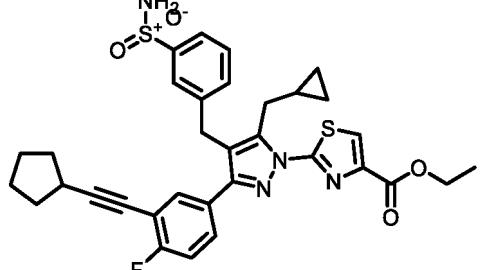
【化 5 1】

 <p>;</p>	 <p>;</p>
<p>519</p>  <p>;</p>	<p>520</p>  <p>;</p>
<p>521</p>  <p>;</p>	<p>522</p>  <p>;</p>
 <p>;</p>	 <p>;</p>
<p>523</p>	<p>524</p>

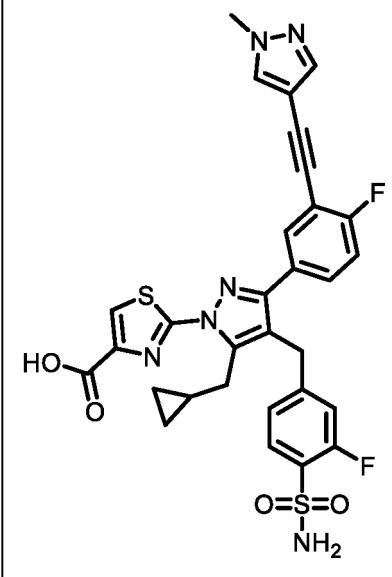
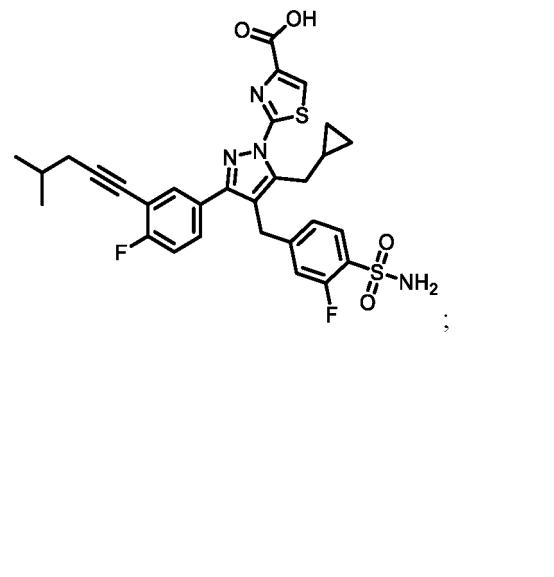
【化 5 2】

	
526	527
	
528	529
	
530	

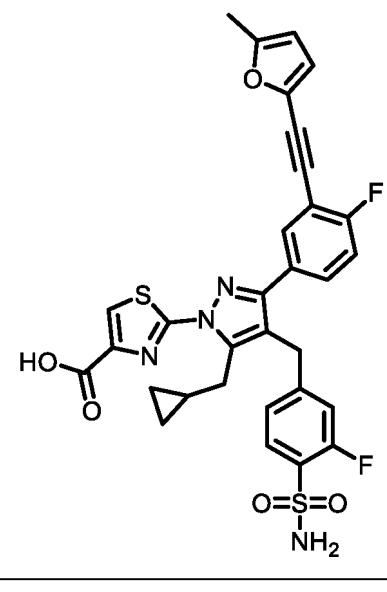
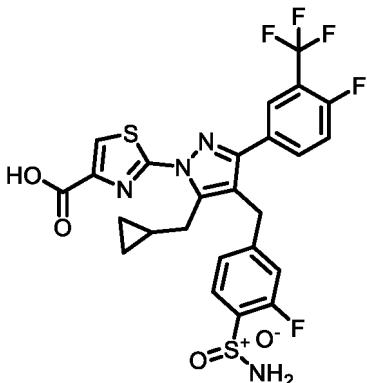
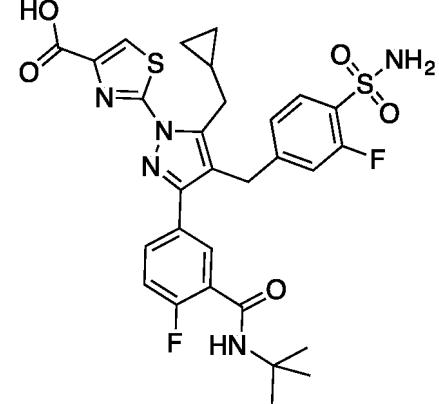
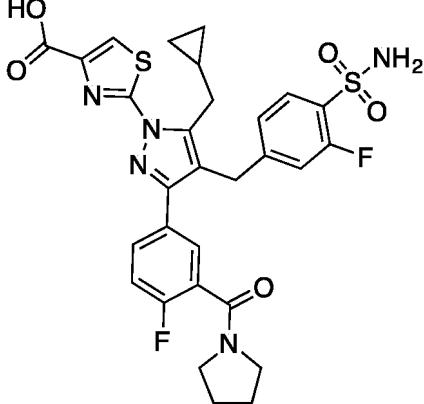
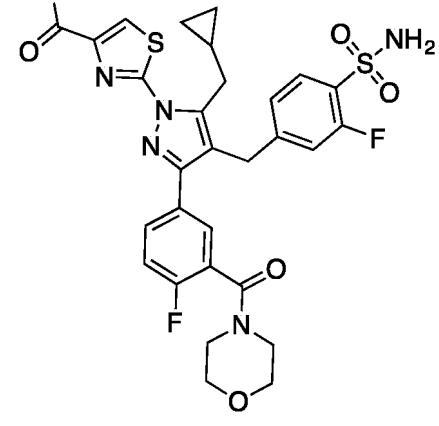
【化 5 3】

	
531	532
	
533	534
	
535	536

【化 5 4】

	
537	538
	
539	540

【化 5 5】

	
541	542
	
543	545
	
546	

【請求項 1 1】

請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の少なくとも 1 つの化合物またはその薬学的に許容可能な塩と、薬学的に許容可能な担体とを含む医薬組成物。

【請求項 1 2】

抗がん剤に耐性のあるがん細胞を有する患者を処置する方法に用いられる、請求項1～10のいずれかに記載の化合物、または請求項11に記載の組成物であって、

前記方法において、前記化合物または前記組成物と、前記抗がん剤とが、前記患者に投与され、前記化合物が、前記抗がん剤にがん細胞を再感作させる、化合物または組成物。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0066

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0066】

上記実施形態のいずれかにおいて、用語「ヒドロカルビル」は、構造に示されている置換の数に鑑みて特定の数の炭素原子及び適切な価数を有する脂肪族基を意味する。ヒドロカルビル基は、少なくとも炭素及び水素を含有し、単一、二重、及び三重の炭素-炭素結合を含有することができる。ある特定の実施形態において、ヒドロカルビル基は、N、O、S、Si、P、またはこれらの組み合わせから選択される1個以上（例えば、1～8個）のヘテロ原子を場合により含有する。ヒドロカルビル基は、非置換であってよく、またはヒドロカルビル基によって許容される価数まで1つ以上の置換基によって置換されてもよい。例えば、ヒドロカルビル基は、ヒドロキシル、シアノ、アミノ、ハロゲン、オキソ、シクロアルキル、N、O、及びSから選択される1～3個のヘテロ原子を含有する5～7員のヘテロシクロアルキル、N、O、及びSから選択される1～5個のヘテロ原子を有して選択される5または6員のヘテロアリール、及びフェニルで置換されていてもよい。