

【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 0 7 D	231/22	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
C 0 7 D	417/04	(2006.01)
C 0 7 D	471/04	(2006.01)
C 0 7 D	417/14	(2006.01)
C 0 7 D	403/04	(2006.01)
C 0 7 D	231/38	(2006.01)
C 0 7 D	495/14	(2006.01)
C 0 7 D	401/04	(2006.01)
C 0 7 D	403/06	(2006.01)
C 0 7 D	413/04	(2006.01)
C 0 7 D	495/04	(2006.01)
C 0 7 D	409/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/427	(2006.01)
A 6 1 K	31/437	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 K	31/415	(2006.01)
A 6 1 K	31/501	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
A 6 1 K	31/519	(2006.01)
A 6 1 K	31/4155	(2006.01)
A 6 1 K	31/422	(2006.01)
A 6 1 K	31/506	(2006.01)
A 6 1 K	31/4439	(2006.01)
A 6 1 K	31/4178	(2006.01)
A 6 1 K	31/454	(2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D	231/22	Z
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	43/00	1 0 5
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	43/00	1 2 3
C 0 7 D	417/04	C S P
C 0 7 D	471/04	1 0 4 Z
C 0 7 D	471/04	1 0 6 C
C 0 7 D	417/14	
C 0 7 D	403/04	
C 0 7 D	231/38	Z
C 0 7 D	495/14	D
C 0 7 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

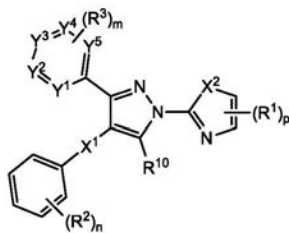
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I a) :

【化 1】



(I a)

(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)NH₂CN、-C(O)NH₂SO₂H、-C(S)R⁴、-CO₂R⁴、-C(O)NR⁵R⁶、-(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単-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単-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)、 $- (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $- O (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $- (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $- O (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $- O (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_6 \sim C_{12}$ アリール、 $- (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_6 \sim C_{12}$ アリール、 $- O (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) (N, O \text{ 及び } S \text{ から独立して選ばれる } 1 \sim 4 \text{ 個のヘテロ原子を有する単 - 及び二環式複素環})$ 、 $- (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) (N, O \text{ 及び } S \text{ から独立して選ばれる } 1 \sim 4 \text{ 個のヘテロ原子を有する単 - 及び二環式複素環})$ 、 $- C(O)R^4$ 、 $- CO_2R^4$ 、 $- C(O)NR^5R^6$ 、 $- NR^5C(O)R^4$ 、 $- (CH_2)_qNR^5(SO_2)R^4$ 、 $- (CH_2)_qNR^5C(O)R^4$ 、 $- (CH_2)_qNR^7C(O)NR^5R^6$ 、 $- (CH_2)_qNR^5R^6$ 、 $- (CH_2)_qSO_2NR^5R^6$ 、 $- (CH_2)_qSO_2R^4$ から独立して選ばれ、 $C_1 \sim C_8$ ヒドロカルビル、 $- O (C_1 \sim C_8 \text{ ヒドロカルビル})$ 、 $- (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $- O (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $- (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $- O (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $- O (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_6 \sim C_{12}$ アリール、 $- (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_6 \sim C_{12}$ アリール、 $- O (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) (N, O \text{ 及び } S \text{ から独立して選ばれる } 1 \sim 4 \text{ 個のヘテロ原子を有する単 - 及び二環式複素環})$ 、 $- (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) (N, O \text{ 及び } S \text{ から独立して選ばれる } 1 \sim 4 \text{ 個のヘテロ原子を有する単 - 及び二環式複素環})$ の各々が、置換または非置換であり；

R^3 は、ヒドロキシル、ハロ、 $- CN$ 、 $- NO_2$ 、 $- SF_5$ 、 $C_1 \sim C_8$ ヒドロカルビル、 $- O (C_1 \sim C_8 \text{ ヒドロカルビル})$ 、 $- (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $- O (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $- (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $- O (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $- O (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_6 \sim C_{12}$ アリール、 $- (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_6 \sim C_{12}$ アリール、 $- O (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) (N, O \text{ 及び } S \text{ から独立して選ばれる } 1 \sim 4 \text{ 個のヘテロ原子を有する単 - 及び二環式複素環})$ 、 $- (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) (N, O \text{ 及び } S \text{ から独立して選ばれる } 1 \sim 4 \text{ 個のヘテロ原子を有する単 - 及び二環式複素環})$ 、 $- C(O)R^4$ 、 $- CO_2R^4$ 、 $- C(O)NR^5R^6$ 、 $- NR^5C(O)R^4$ 、 $- (CH_2)_qNR^5(SO_2)R^4$ 、 $- (CH_2)_qNR^5C(O)R^4$ 、 $- (CH_2)_qNR^7C(O)NR^5R^6$ 、 $- (CH_2)_qNR^5R^6$ 、 $- (CH_2)_qSO_2NR^5R^6$ 、 $- (CH_2)_qSO_2R^4$ から独立して選ばれ、 $C_1 \sim C_8$ ヒドロカルビル、 $- O (C_1 \sim C_8 \text{ ヒドロカルビル})$ 、 $- (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $- O (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $- (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $- O (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $- O (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_6 \sim C_{12}$ アリール、 $- (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) C_6 \sim C_{12}$ アリール、 $- O (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) (N, O \text{ 及び } S \text{ から独立して選ばれる } 1 \sim 4 \text{ 個のヘテロ原子を有する単 - 及び二環式複素環})$ 、 $- (C_0 \sim C_4 \text{ ヒドロカルビル}) (N, O \text{ 及び } S \text{ から独立して選ばれる } 1 \sim 4 \text{ 個のヘテロ原子を有する単 - 及び二環式複素環})$ 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、 $- CN$ 、 $- NO_2$ 、 $- CO_2R^4$ 、 $- C(O)NR^5R^6$ 、 $-$

$\text{NR}^5(\text{SO}_2)\text{R}^4$ 、 $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^4$ 、 $-\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $-\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^4$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ ヒドロカルビル、 $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{ ヒドロカルビル})$ 、 $-(\text{C}_0 \sim \text{C}_4 \text{ ヒドロカルビル})\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル、 $-\text{O}(\text{C}_0 \sim \text{C}_4 \text{ ヒドロカルビル})\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル、 $-(\text{C}_0 \sim \text{C}_4 \text{ ヒドロカルビル})\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルケニル、 $\text{O}(\text{C}_0 \sim \text{C}_4 \text{ ヒドロカルビル})\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルケニル、 $-\text{O}(\text{C}_0 \sim \text{C}_4 \text{ ヒドロカルビル})\text{C}_6 \sim \text{C}_{12}$ アリール、 $-\text{O}(\text{C}_0 \sim \text{C}_4 \text{ ヒドロカルビル})(\text{N、O 及び S から独立して選ばれる 1} \sim 4 \text{ 個のヘテロ原子を有する単 - 及び二環式複素環})$ 、 $-(\text{C}_0 \sim \text{C}_4 \text{ ヒドロカルビル})(\text{N、O 及び S から独立して選ばれる 1} \sim 4 \text{ 個のヘテロ原子を有する単 - 及び二環式複素環})$ であり、水素、ハロ、 $-\text{CN}$ 、及び $-\text{NO}_2$ を除く R^{10} の各々が、置換または非置換であり；

各 R^{13} 及び R^{14} 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^{13} 及び R^{14} 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 $-\text{S}$ であり；

X^2 は、 $-\text{NR}^5$ 、 $-\text{O}$ 、 $-\text{SO}_2$ 、または $-\text{S}$ 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の任意の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、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ 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 $-\text{CO}_2(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ から独立して選ばれ、

R^2 が、F 及び $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ から選ばれ、ここで、 R^2 の1つが $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ であり；

R^3 が

(a) ハロゲン、ヒドロキシル、 SF_5 ；

(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(CH_2)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) $-\text{C}_0 \sim \text{C}_2$ ヒドロカルビル(フェニル)、 $-\text{C}_0 \sim \text{C}_2$ ヒドロカルビル(フェニル)、 $-\text{C}_0 \sim \text{C}_2$ ヒドロカルビル(チオフェニル)、 $-\text{C}_0 \sim \text{C}_2$ ヒドロカルビル(オキサゾリル)、 $-\text{C}_0 \sim \text{C}_2$ ヒドロカルビル(チアゾリル)、 $-\text{C}_0 \sim \text{C}_2$ ヒドロカルビル(テトラヒドロフラニル)、 $-\text{C}_0 \sim \text{C}_2$ ヒドロカルビル($\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ シクロアルキル)、 $-\text{C}_0 \sim \text{C}_2$ ヒドロカルビル($\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ シクロアルキル)、 $-\text{C}_0 \sim \text{C}_2$ ヒドロカルビル($\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ シクロアルカニル)、 $-\text{C}_0 \sim \text{C}_2$ ヒドロカルビル($\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ シクロアルケニル)、 $-\text{C}_0 \sim \text{C}_2$ ヒドロカルビル(テトラヒドロピレニル)、 $-\text{C}_0 \sim \text{C}_2$ ヒドロカルビル(イミダゾリル)、 $-\text{C}_0 \sim \text{C}_2$ ヒドロカルビル(チオフェニル)(ここで、前記 $\text{C}_0 \sim \text{C}_2$ ヒドロカルビル鎖におけるいずれのアルキレン(CH_2)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

、 $C_1 \sim C_2$ 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、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シクロアルキル、モノ-またはジ- $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ 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) R^2 の 1 つが、 $-SO_2NR^5R^6$ であり、 R^5 及び R^6 は、同じまたは異なり、各々が、H または $C_1 \sim C_8$ アルキルである；

(b) n が 1 である；

(c) 各 R^3 が、独立して、ハロ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシ、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、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) X^1 が、 $-CR^8R^9-$ 、 $-O-$ 、または $-NH-$ である；

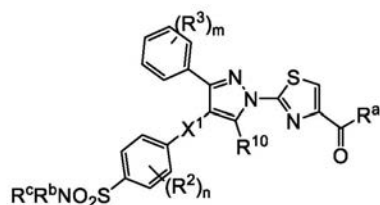
(f) X^2 が $-S-$ である；

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 (I a - 1)

【化 2】



(I a - 1)

(式中、

R^a が、 $-R^4$ 、 $-OR^4$ 、または $-NR^5R^6$ 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、同じまたは異なり、各々が、H、または置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキルであり；

R^2 が、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、 $C_1 \sim C_8$ 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、ハロアリーール、ハロアリーールオキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(O)R^4$ 、 $-CO_2R^4$ 、 $-C(O)NR^5R^6$ 、 $-NR^5C(O)R^4$ 、 $-(CH_2)_qNR^5(SO_2)R^4$ 、 $-(CH_2)_qNR^5C(O)R^4$ 、 $-(CH_2)_qNR^7C(O)NR^5R^6$ 、 $-(CH_2)_qNR^5R^6$ 、 $-(CH_2)_qSO_2NR^5R^6$ 、 $-(CH_2)_qSO_2R^4$ 、 $-(CH_2)_q$ アリーール、 $-(CH_2)_q$ ヘテロアリーール、及び $-(CH_2)_q$ 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 R^2 の各々が、置換または非置換であり；

R^3 が、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、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-(C_1 \sim C_4$ ヒドロカルビル) $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $-(C_0 \sim C_4$ アルコキシ) $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-(C_0 \sim C_4$ アルコキシ)アリーール、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、ハロアリーール、ハロアリーールオキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(O)R^4$ 、 $-CO_2R^4$ 、 $-C(O)NR^5R^6$ 、 $-NR^5C(O)R^4$ 、 $-(CH_2)_qNR^5(SO_2)R^4$ 、 $-(CH_2)_qNR^5C(O)R^4$ 、 $-(CH_2)_qNR^7C(O)$

NR^5R^6 、 $-(\text{CH}_2)_q\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $-(\text{CH}_2)_q\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $-(\text{CH}_2)_q\text{SO}_2\text{R}^4$ 、 $-(\text{C}_0\sim\text{C}_4\text{ヒドロカルビル})$ アリール、 $-(\text{C}_0\sim\text{C}_4\text{ヒドロカルビル})$ ヘテロアリール、 $-(\text{C}_0\sim\text{C}_4\text{アルコキシ})$ ヘテロアリール、 $-(\text{C}_0\sim\text{C}_4\text{アルコキシ})$ ヘテロシクロアルキル、及び $-(\text{C}_0\sim\text{C}_4\text{ヒドロカルビル})$ 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、 $\text{C}_1\sim\text{C}_8$ アルキル、または $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキルであり、 $\text{C}_1\sim\text{C}_8$ アルキル及び $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ 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、 $\text{C}_1\sim\text{C}_8$ アルキル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルキニル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ 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、 $\text{C}_1\sim\text{C}_8$ アルコキシ、ハロ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_8$ 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、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^4$ 、 $-\text{NR}^5\text{R}^6$ 、または $-\text{SO}_2\text{R}^4$ 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、 $-\text{CR}^8\text{R}^9-$ 、 $-\text{NR}^5-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}(\text{O})-$ 、または $-\text{S}(\text{O})_2-$ 、または $-\text{S}-$ であり、 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 、 $-\text{OR}^4$ 、または $-\text{NR}^5\text{R}^6$ であり；

R^2 が、ハロ、ヒドロキシル、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、アミノ、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^4$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^4$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^4$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ アルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ ハロアルキル、及び $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ 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 $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ アルキルであり；

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

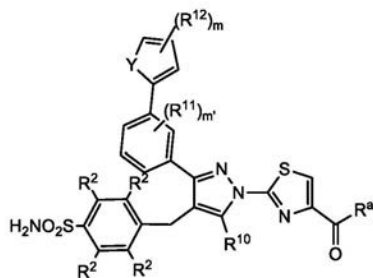
R^3 の1つが、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキニル、 $-(\text{C}_0\sim\text{C}_2\text{アルキル})\text{C}_3\sim\text{C}_6\text{シクロアルキル}$ 、 $-(\text{C}_2\sim\text{C}_4\text{アルケニル})\text{C}_3\sim\text{C}_6\text{シクロアルキル}$ 、 $-(\text{C}_2\sim\text{C}_4\text{アルキニル})\text{C}_3\sim\text{C}_6\text{シクロアルキル}$ 、 $-(\text{C}_0\sim\text{C}_2\text{アルコキシ})\text{C}_3\sim\text{C}_6\text{シクロアルキル}$ 、ジヒドロピラニル、 $-(\text{C}_0\sim\text{C}_4\text{アルコキシ})$ フェニル、 $-(\text{C}_0\sim\text{C}_4\text{アルキル})$ フェニル、 $-(\text{C}_2\sim\text{C}_4\text{アルケニル})$ フェニル、 $-(\text{C}_2\sim\text{C}_4\text{アルキニル})$ フェニル、 $-(\text{C}_0\sim\text{C}_4\text{アルコキシ})$ ヘテロアリール、 $-(\text{C}_0\sim\text{C}_4\text{アルキル})$ ヘテロアリール、 $-(\text{C}_2\sim\text{C}_4\text{アルケニル})$ ヘテロアリール、及び $-(\text{C}_2\sim\text{C}_4\text{アルキニル})$ 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、 $-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_4$ アルケニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルコキシ、 $(\text{C}_3\sim\text{C}_6\text{シクロアルキル})\text{C}_0\sim\text{C}_2$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ ハロアルキル、及び $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ 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、 $-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ ハロアルキル、及び $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ 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) :

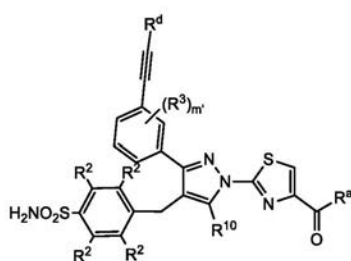
【化 3】



(I a - 2)

または

【化 4】



(I a - 3)

(式中、

Y = - CH = CH - 、 O 、 S 、 NH であり ;

R^a は、 - R⁴ 、 - OR⁴ 、または - NR⁵ 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、- CN、- NO₂、- C (O) R⁴、- CO₂ R⁴、- C (O) NR⁵ R⁶、- NR⁵ C (O) R⁴、- (CH₂)_q NR⁵ (SO₂) R⁴、- (CH₂)_q NR⁵ C (O) R⁴、- (CH₂)_q NR⁷ C (O) NR⁵ R⁶、- (CH₂)_q NR⁵ R⁶、- (CH₂)_q SO₂ NR⁵ R⁶、- (CH₂)_q SO₂ R⁴、- (CH₂)_q アリール、- (CH₂)_q ヘテロアリール、または - (CH₂)_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、- CN、NO₂、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、CO₂ R⁴、C (O) NR⁵ R⁶、NR⁵ C (O) R⁴、- (CH₂)_q NR⁵ (SO₂) R⁴、- (CH₂)_q NR⁵ C (O) R⁴、- (CH₂)_q NR⁷ C (O) NR⁵ R⁶、- (CH₂)_q NR⁵ R⁶、- (CH₂)_q SO₂ NR⁵ R⁶、及び - (CH₂)_q SO₂ R⁴ から独立して選択され、ヒドロキシル、ハロ、- CN、及び NO₂ 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、- CN、- CO₂ R⁴、- NR⁵ R⁶、または - SO₂ R⁴ であり、ハロ及び - CN 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 $-O(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 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 $-C \equiv C$ -シクロプロピル、 $-I$ 、 $-CF_3$ 、 $-NH_2$ 、または $-CN$ であり；

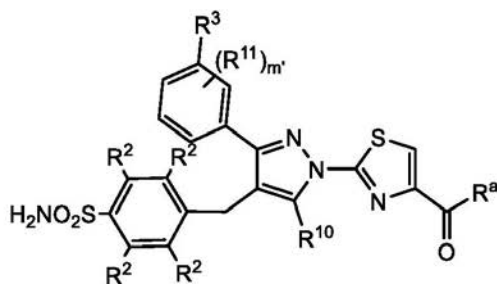
m が、0、1 または 2 であり；

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】



(I a - 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、 $-(C_2 \sim C_4$ アルキニル) $C_3 \sim C_6$ 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^{11} 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^{11} 及び R^{12} 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；

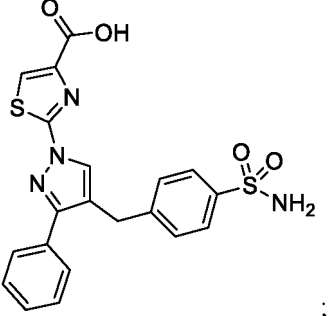
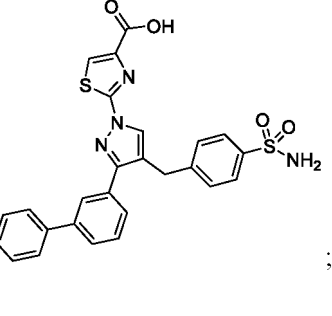
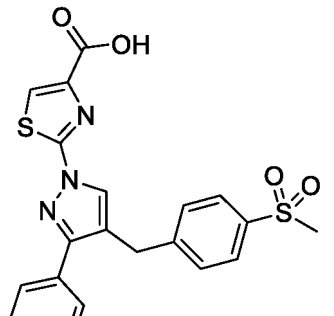
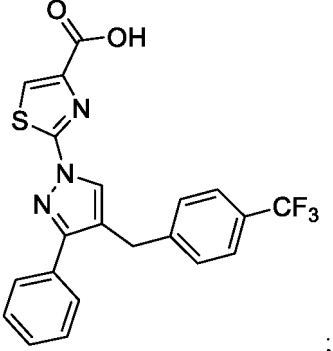
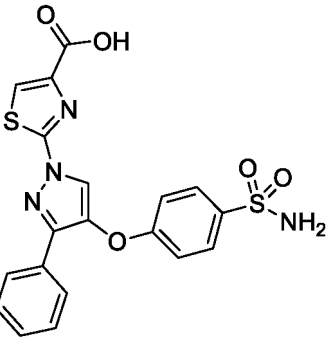
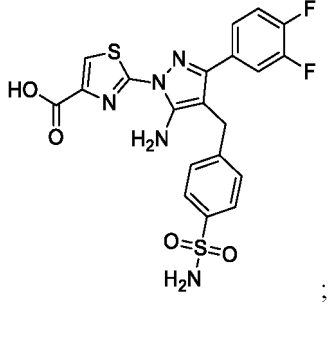
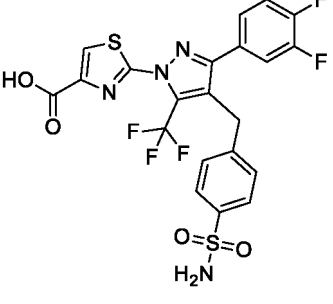
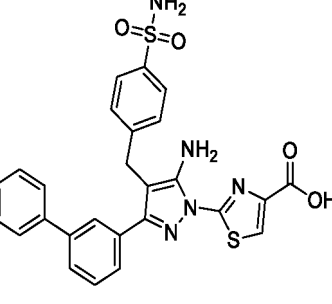
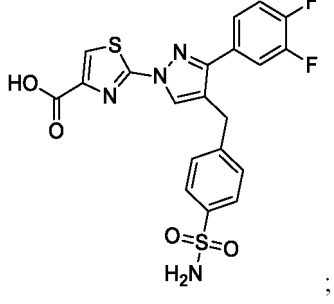
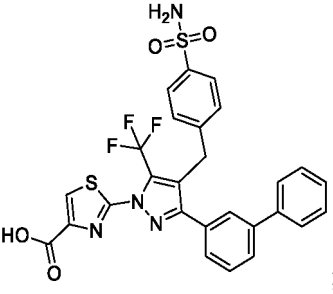
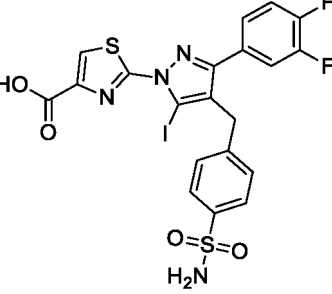
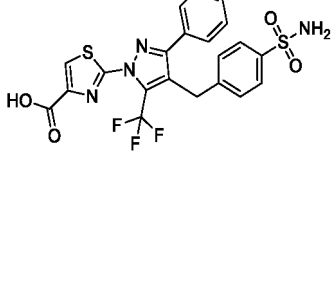
R^{10} は、水素、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアルキル、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、ハロ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、アリールアルキル、 $-CN$ 、 $-CO_2R^4$ 、 $-NR^5R^6$ 、または $-SO_2R^4$ であり、水素及びハロ

を除く R^{10} の各々が、置換または非置換であり；
m 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。

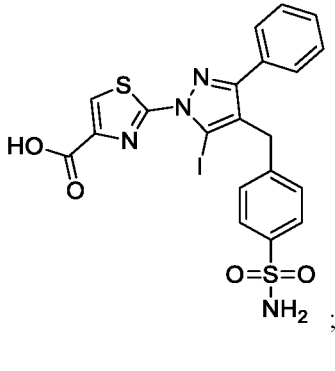
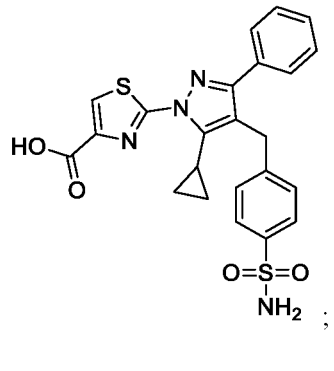
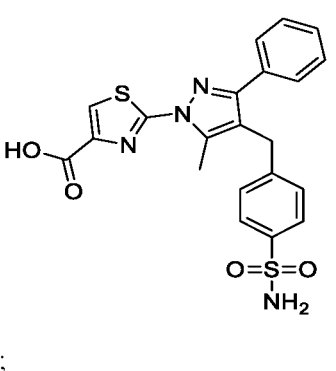
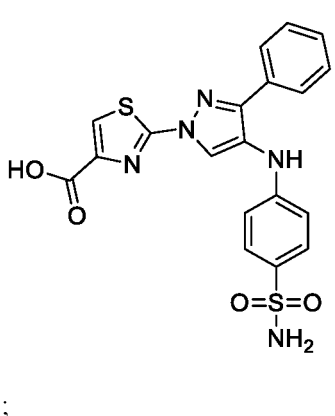
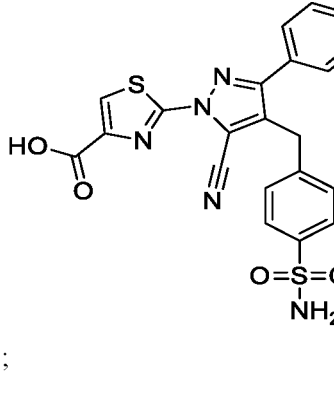
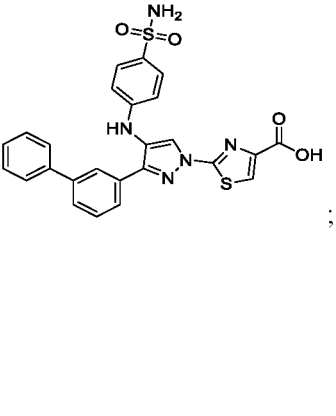
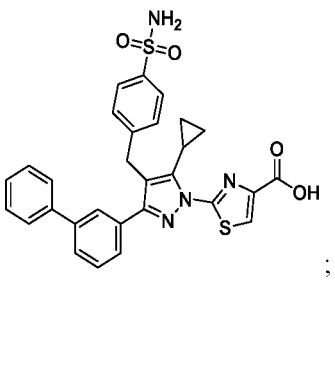
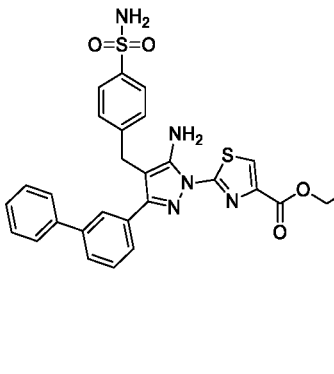
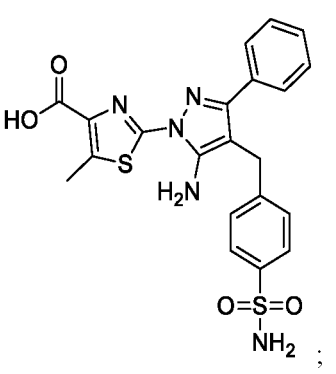
【請求項 10】

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。

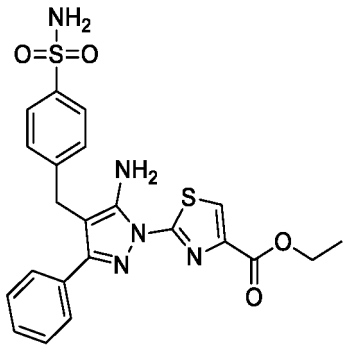
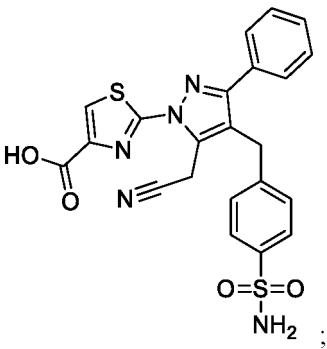
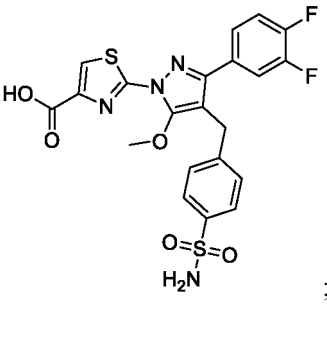
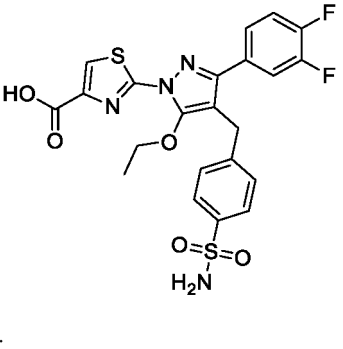
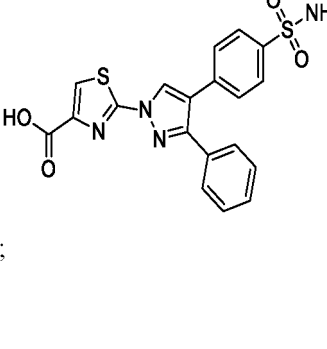
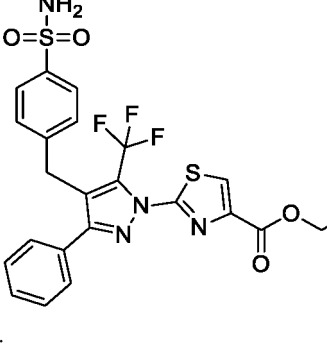
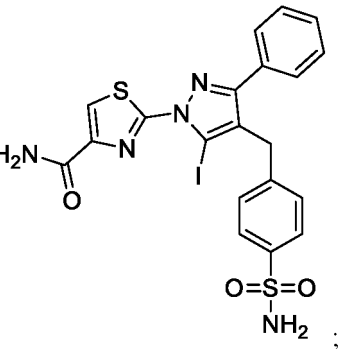
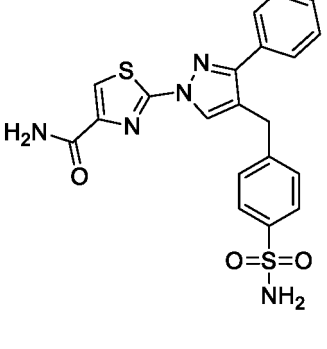
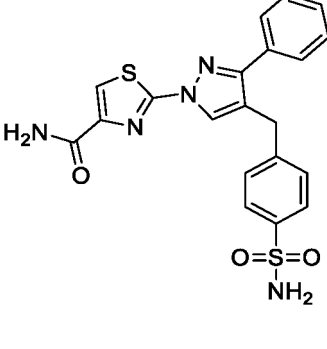
【化 6】

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

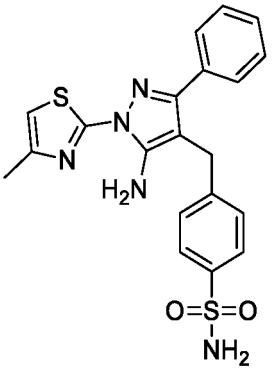
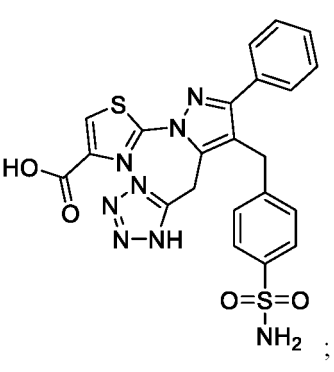
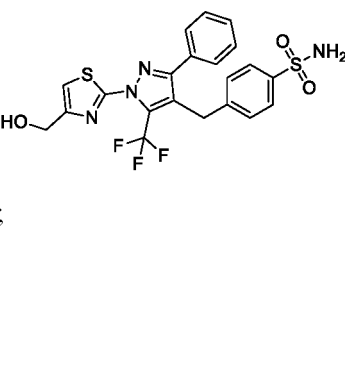
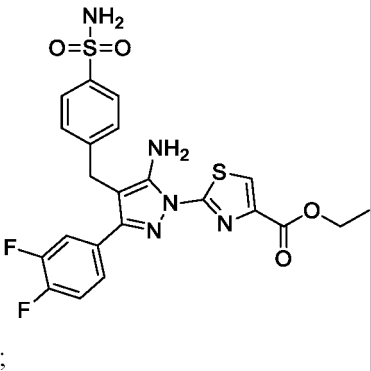
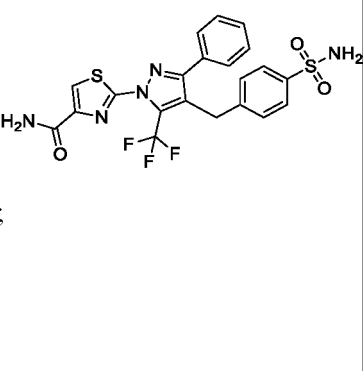
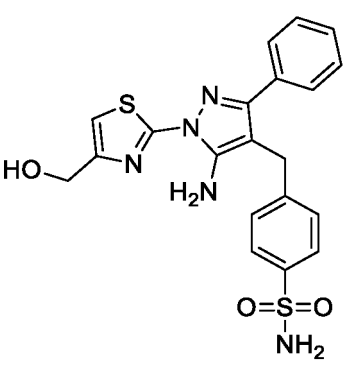
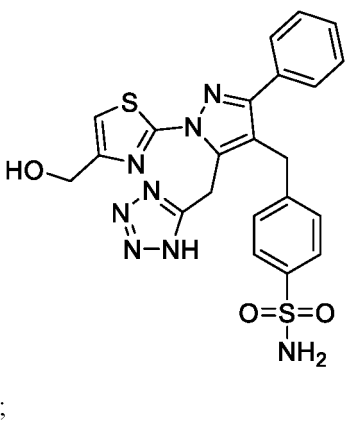
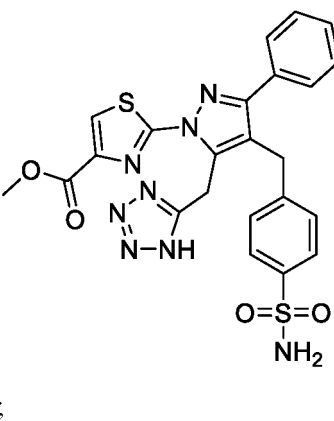
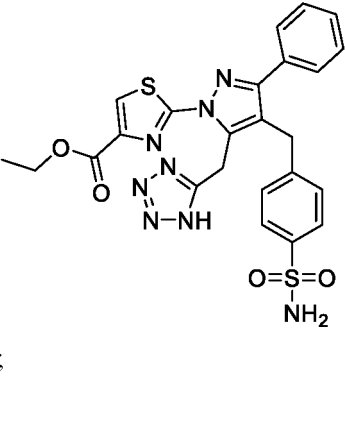
【化 7】

		
45	46	47
		
48	50	51
		
52	56	57

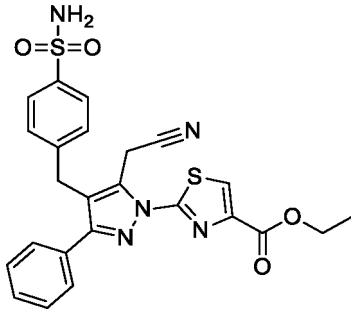
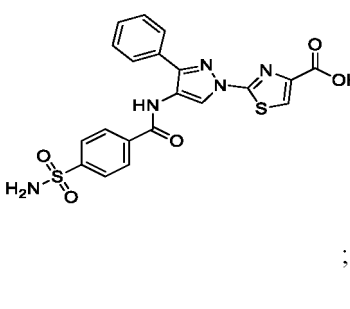
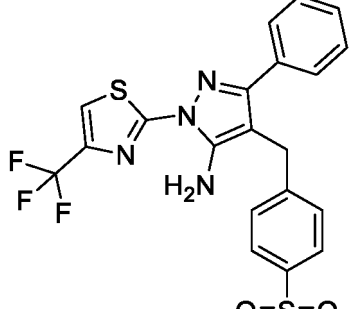
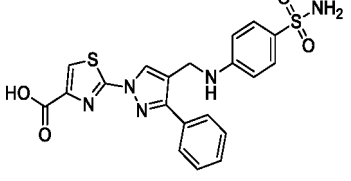
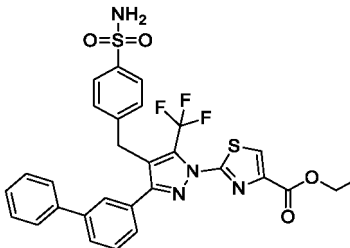
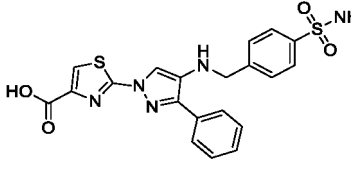
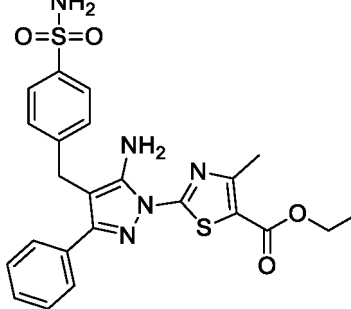
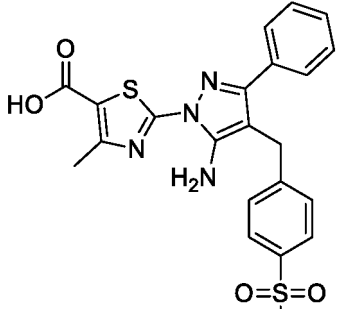
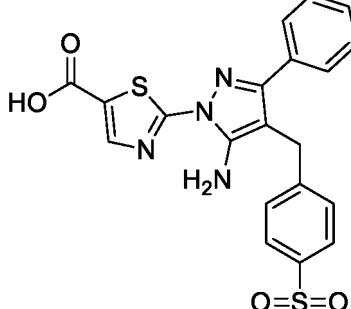
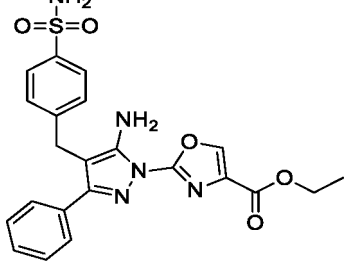
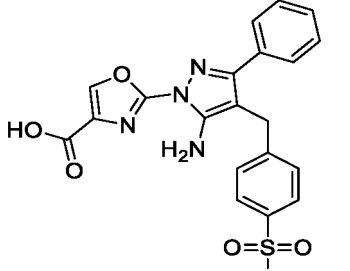
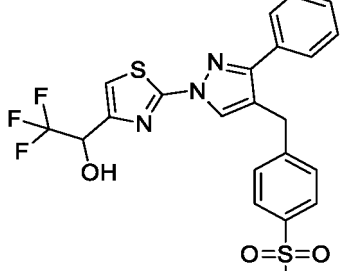
【化 8】

 <p>;</p>	 <p>;</p>	 <p>;</p>
58	59	60
 <p>;</p>	 <p>;</p>	 <p>;</p>
61	76	77
 <p>;</p>	 <p>;</p>	 <p>;</p>
78	79	80

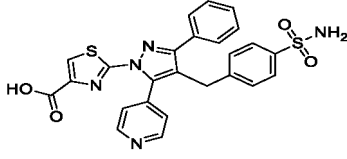
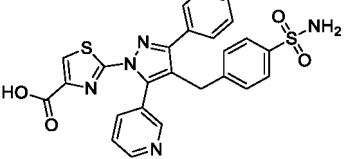
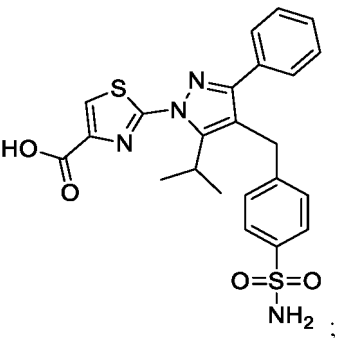
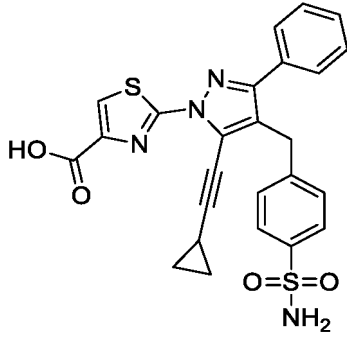
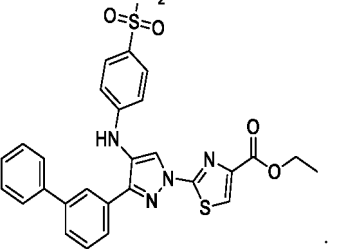
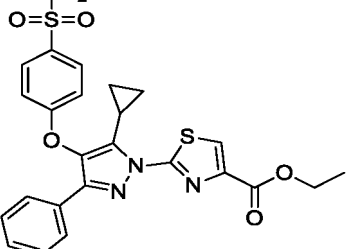
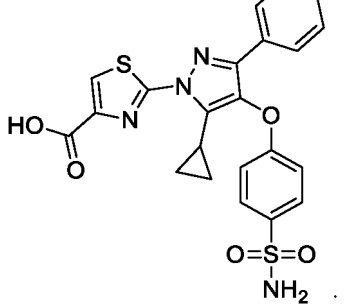
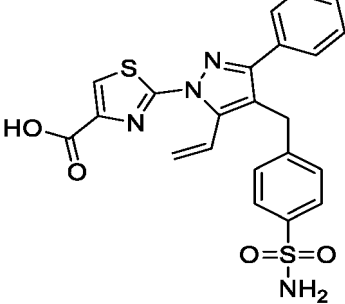
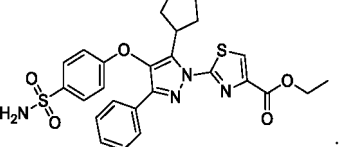
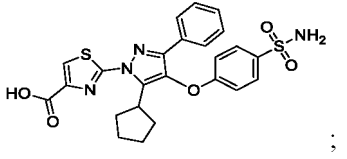
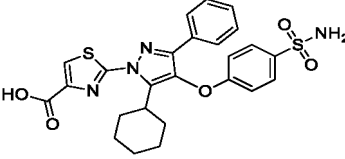
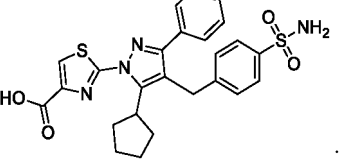
【化 9】

		
86	87	88
		
123	127	131
		
132	133	134

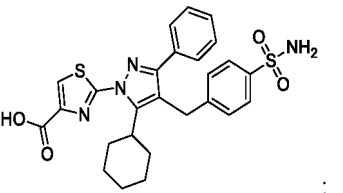
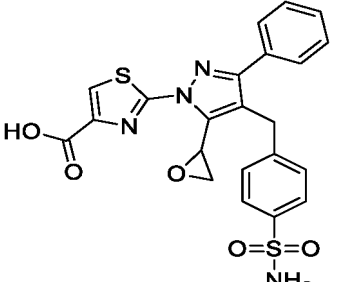
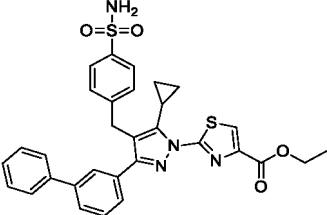
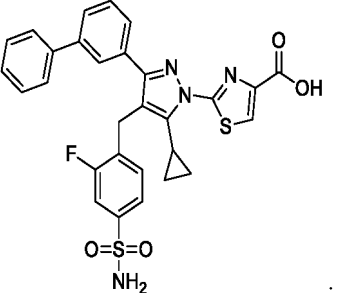
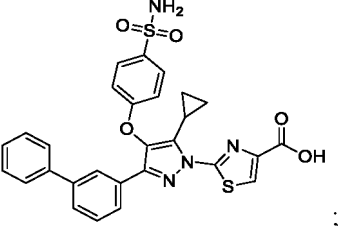
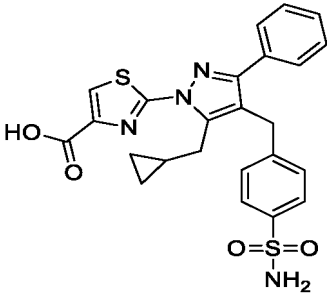
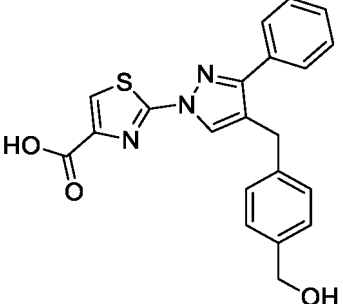
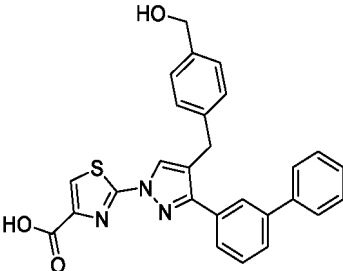
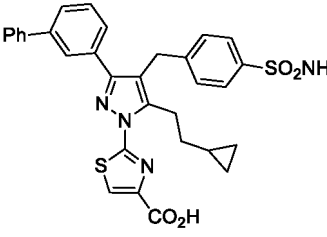
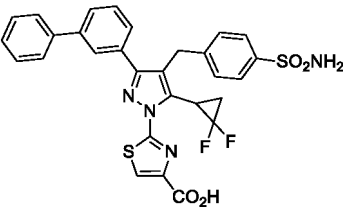
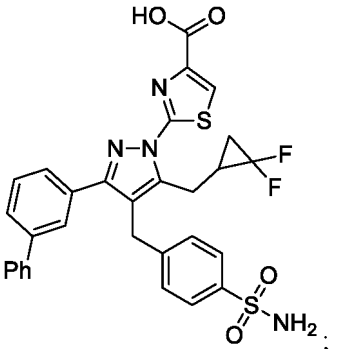
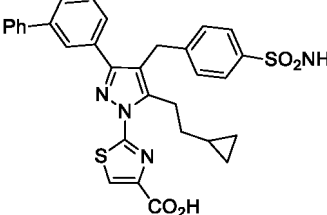
【化 1 0】

 <p>;</p>	 <p>;</p>	 <p>;</p>
135	136	137
 <p>;</p>	 <p>;</p>	 <p>;</p>
139	141	142
 <p>;</p>	 <p>;</p>	 <p>;</p>
146	147	148
 <p>;</p>	 <p>;</p>	 <p>;</p>
151	153	154

【化 1 1】

 <p>;</p>	 <p>;</p>	 <p>;</p>
156	157	159
 <p>;</p>	 <p>;</p>	 <p>;</p>
160	162	164
 <p>;</p>	 <p>;</p>	 <p>;</p>
166	167	169
 <p>;</p>	 <p>;</p>	 <p>;</p>
171	173	175

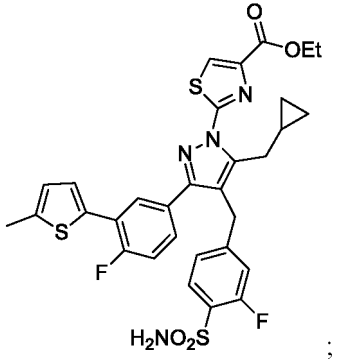
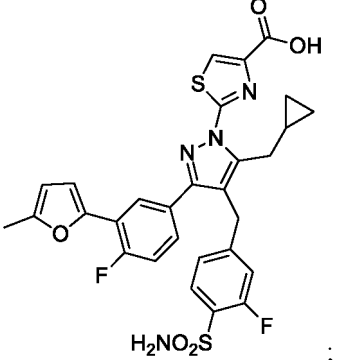
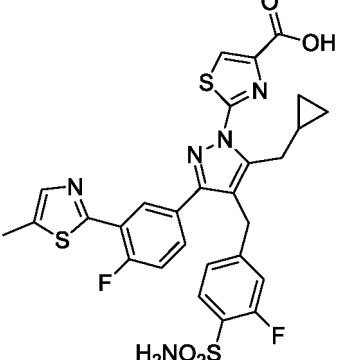
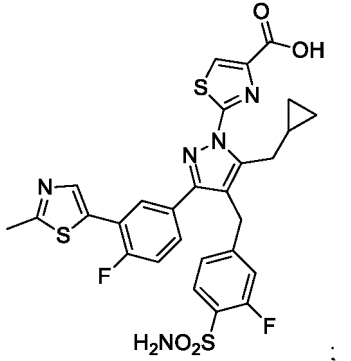
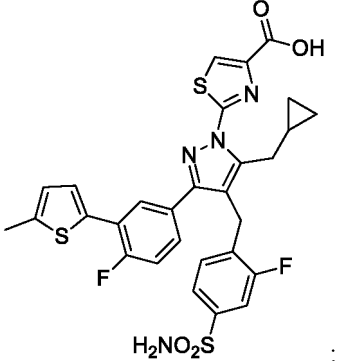
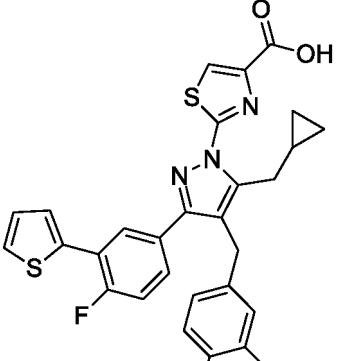
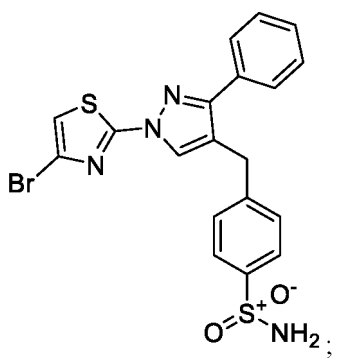
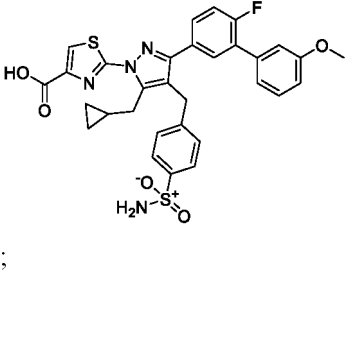
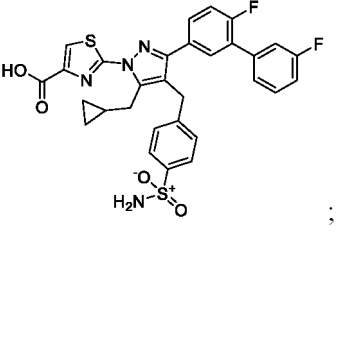
【化 1 2】

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

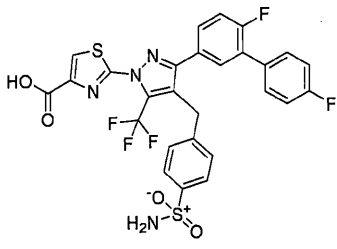
【化 1 3】

 ;	 ;	 ;
212	214	215
 ;	 ;	 ;
217	219	221
 ;	 ;	 ;
223	225	227

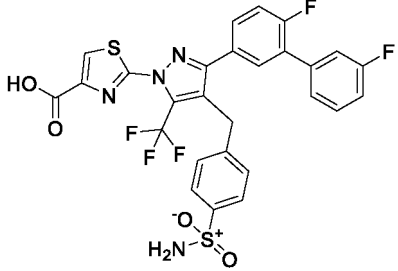
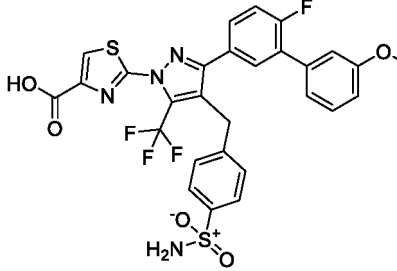
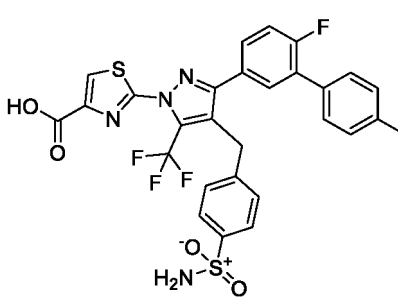
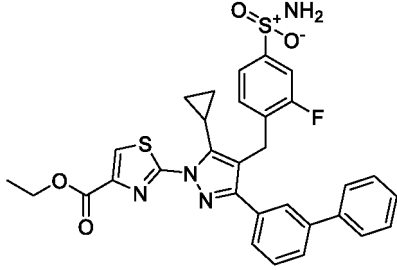
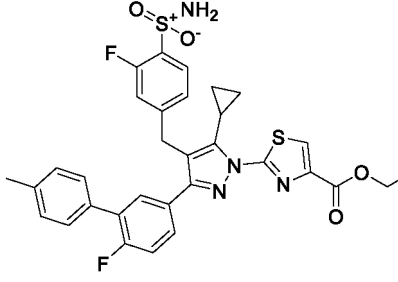
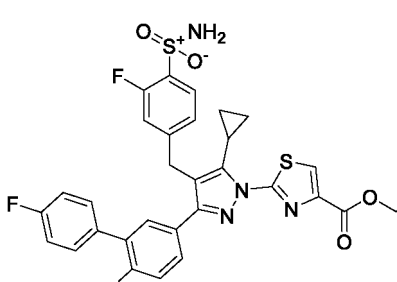
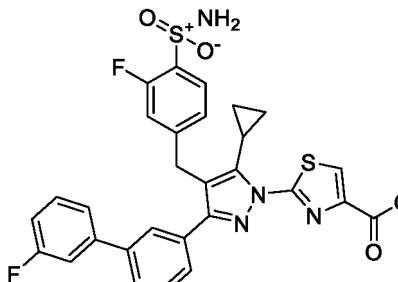
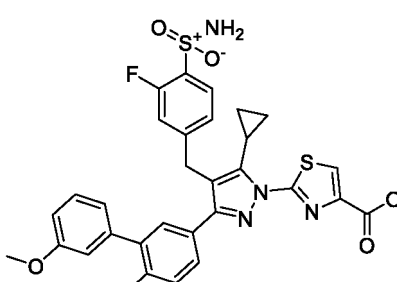
【化 1 4】

		
229	230	231
		
232	233	234
		
235	237	239

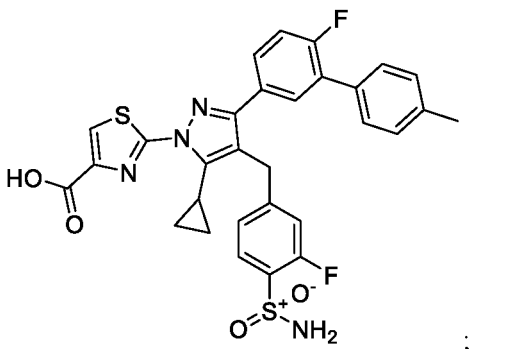
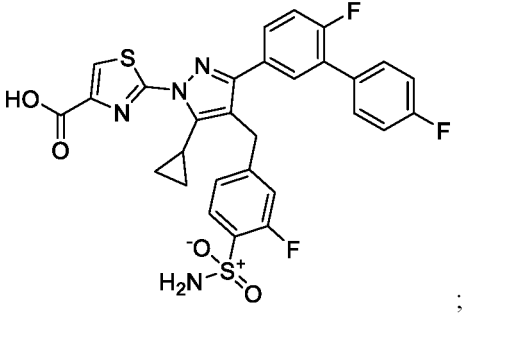
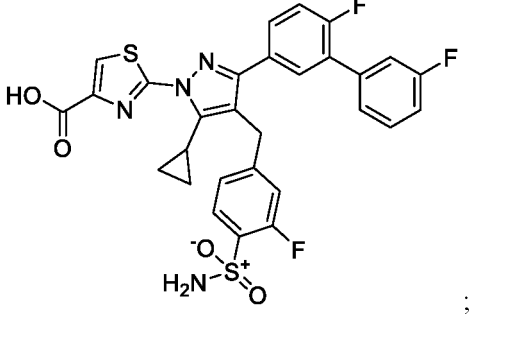
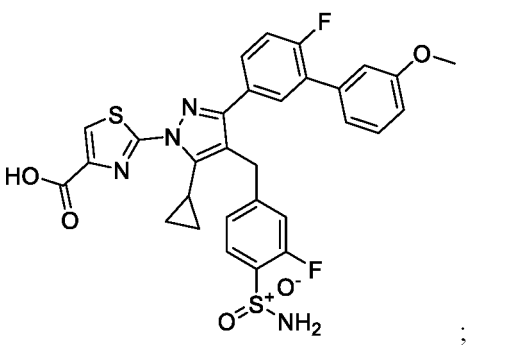
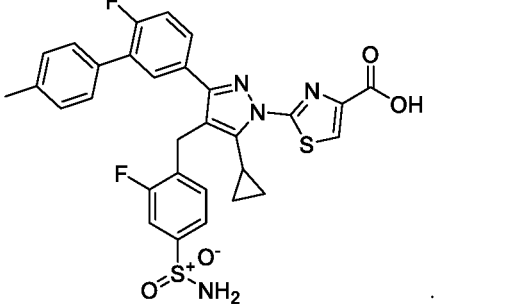
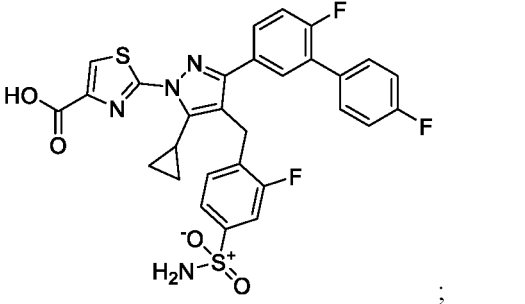
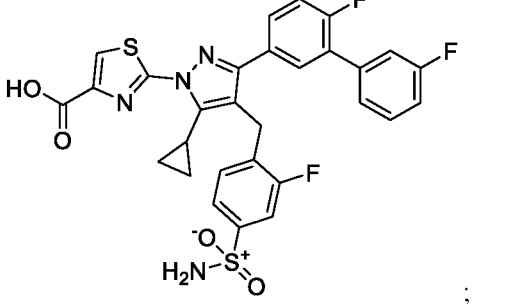
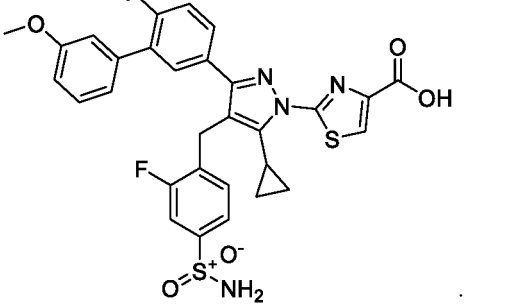
【化 1 5】

 <p data-bbox="220 533 231 562">;</p>		
240		

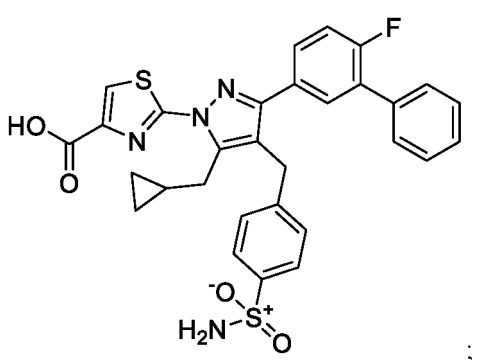
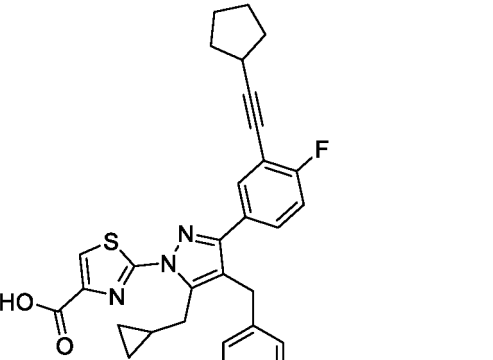
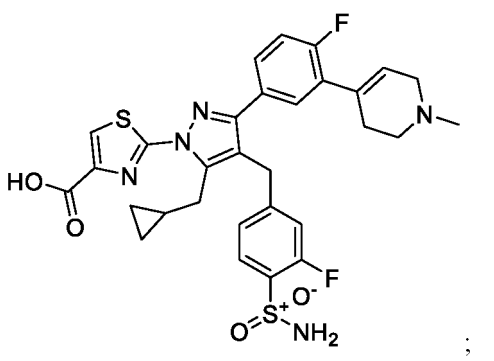
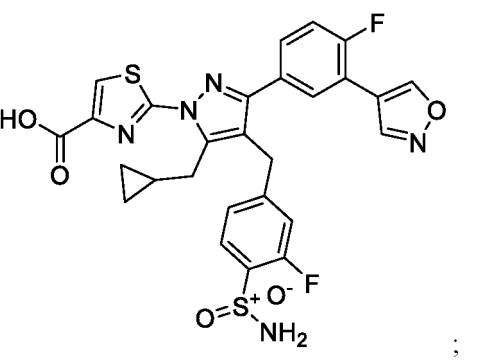
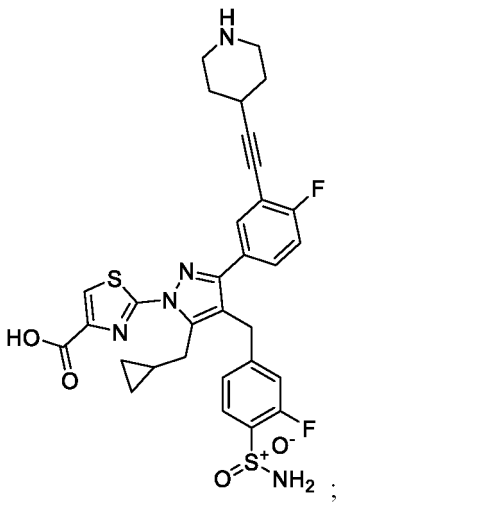
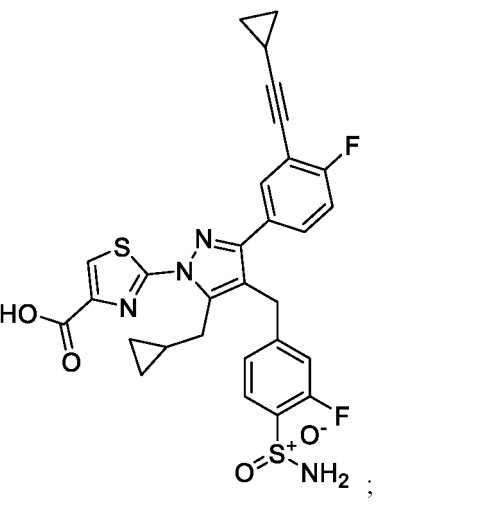
【化 1 6】

	
241	242
	
243	244
	
245	246
	
247	248

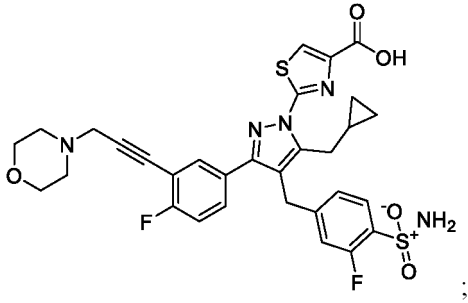
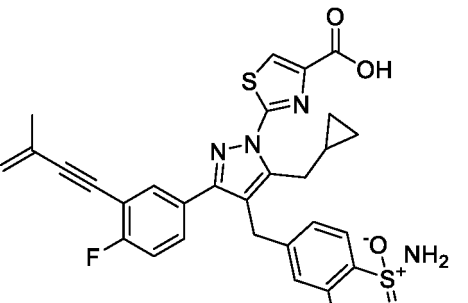
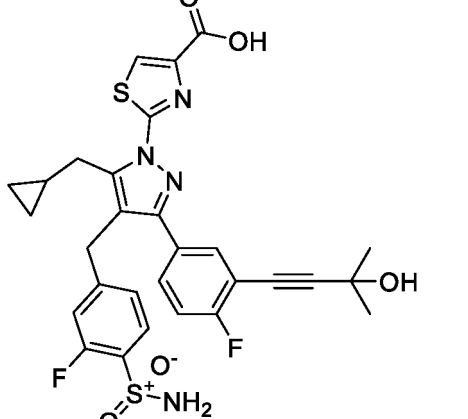
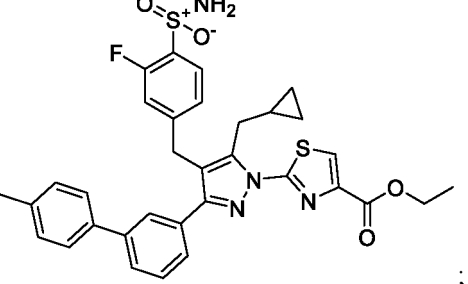
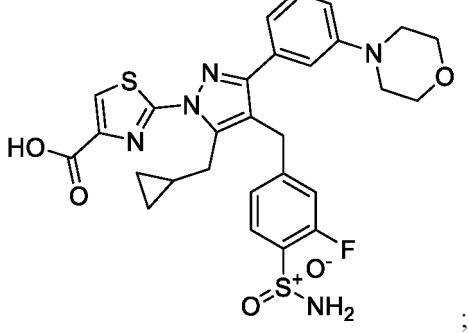
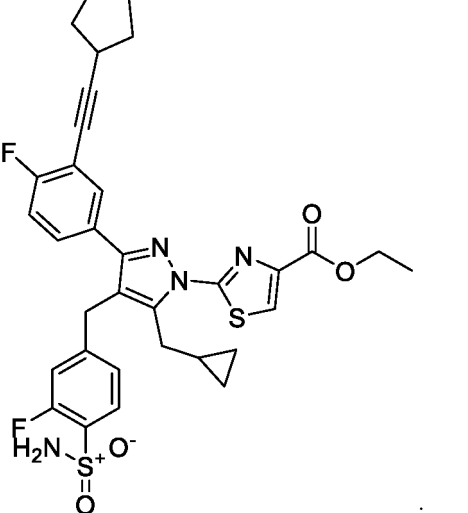
【化 17】

	
249	250
	
251	252
	
253	254
	
255	256

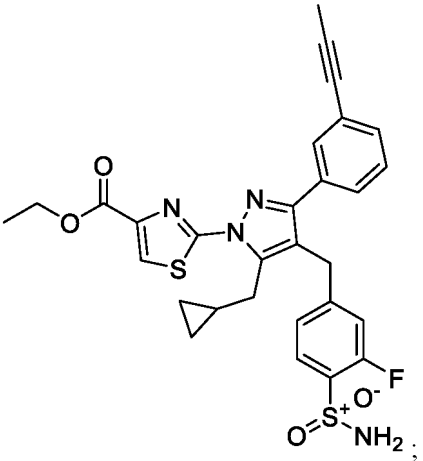
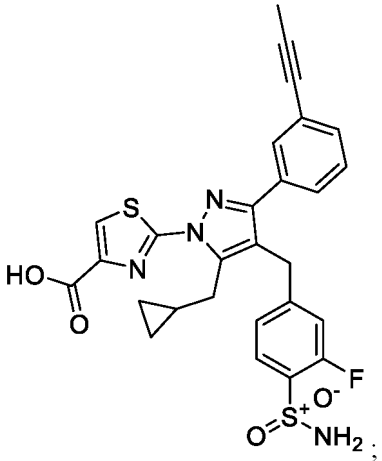
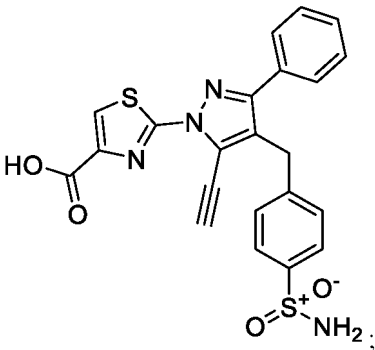
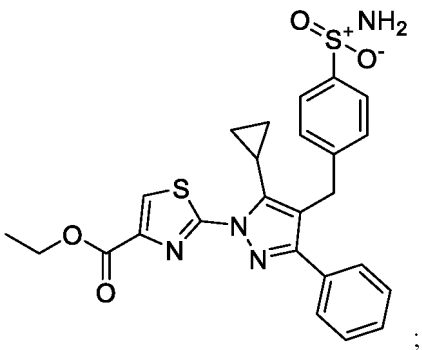
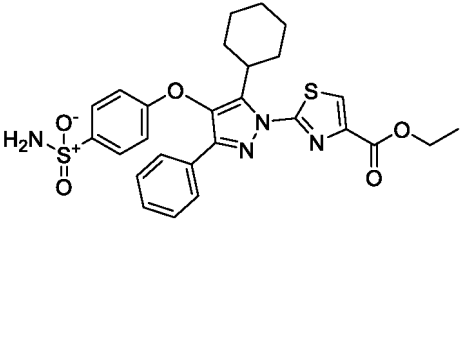
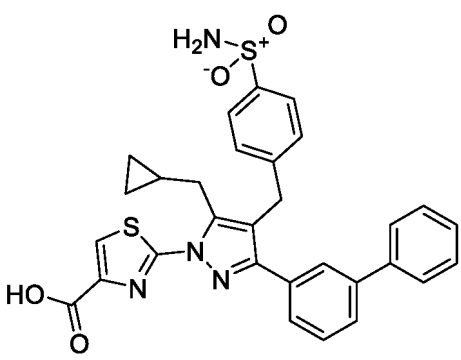
【化 1 8】

	
257	258
	
259	260
	
261	262

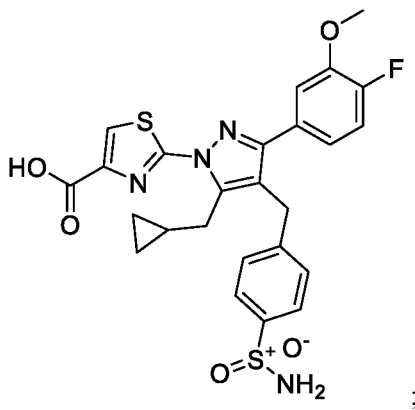
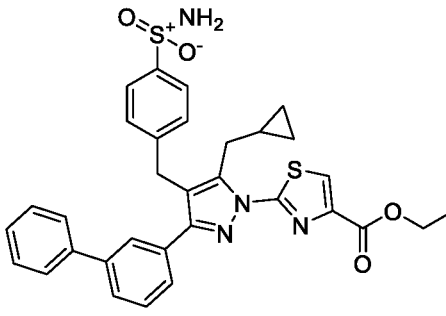
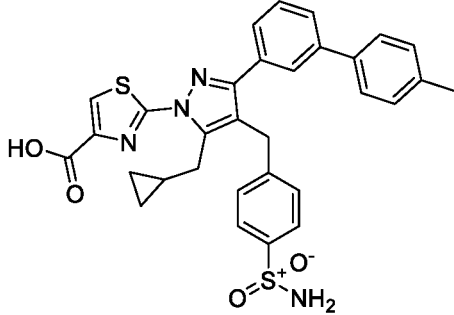
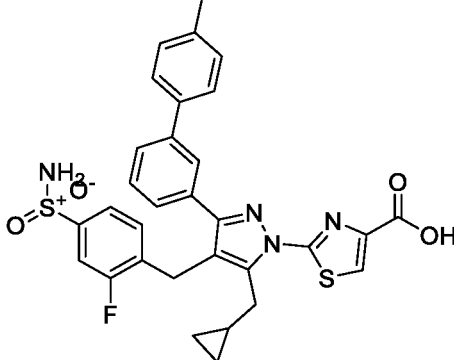
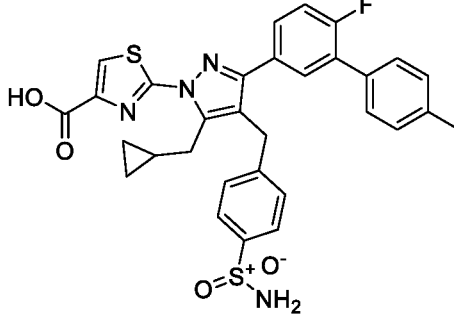
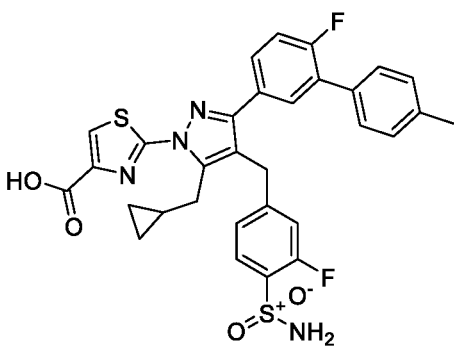
【化 19】

	
263	264
	
265	266
	
267	268

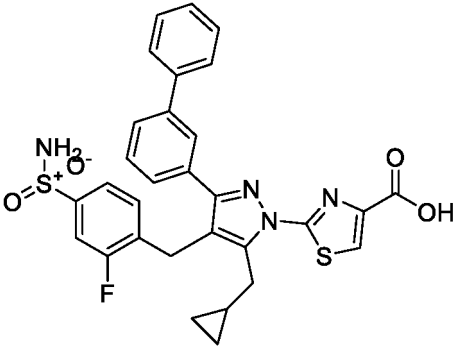
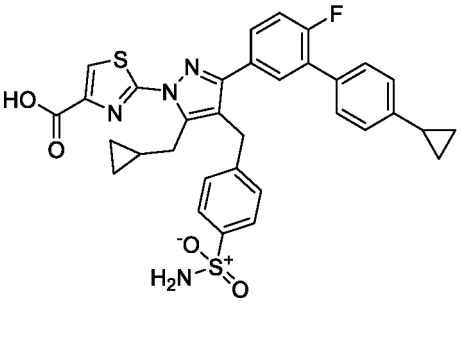
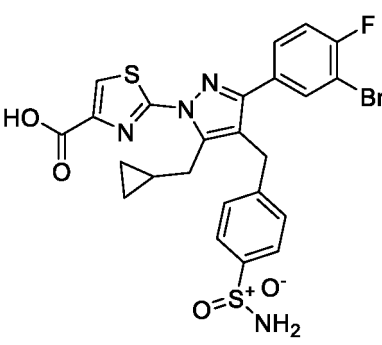
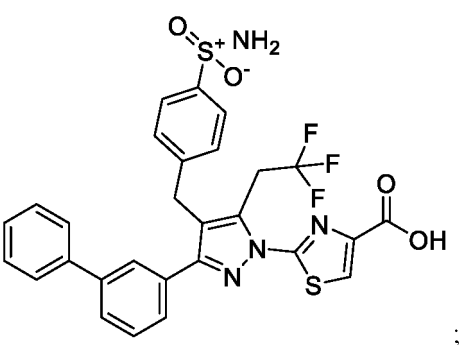
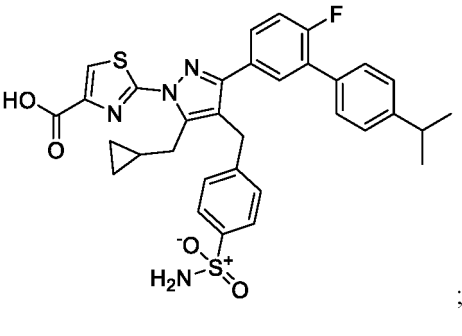
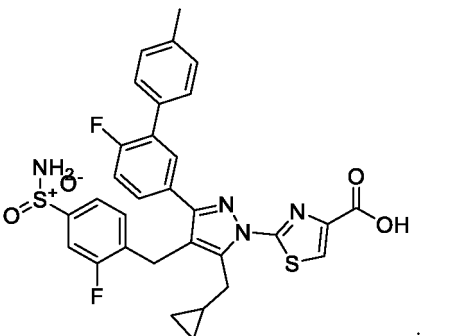
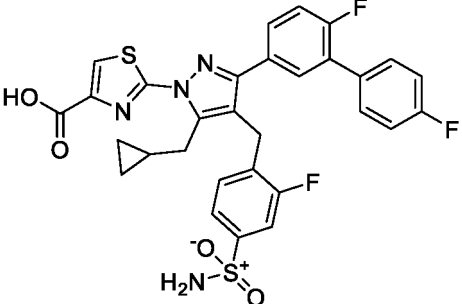
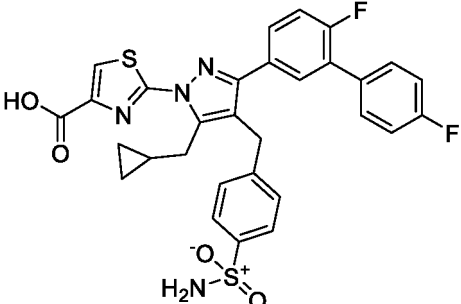
【化 20】

	
269	270
	
271	272
	
274	276

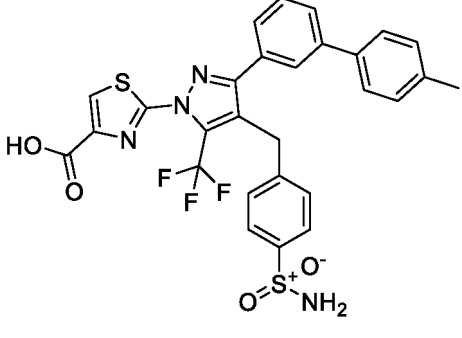
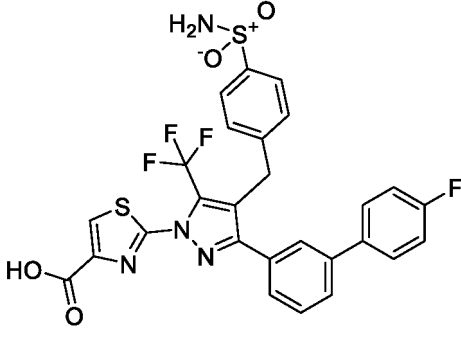
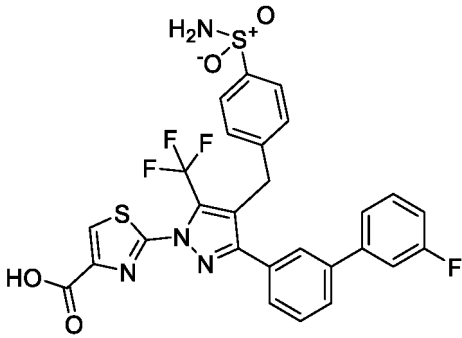
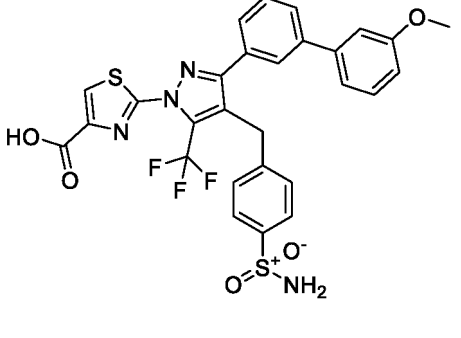
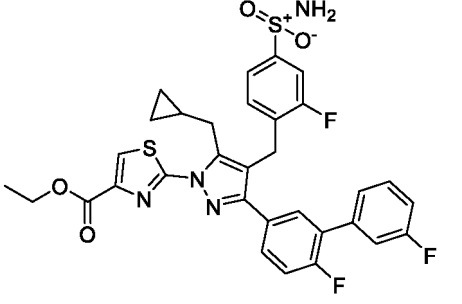
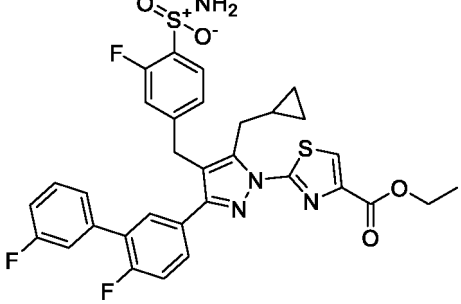
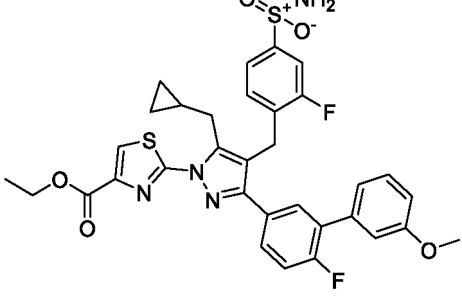
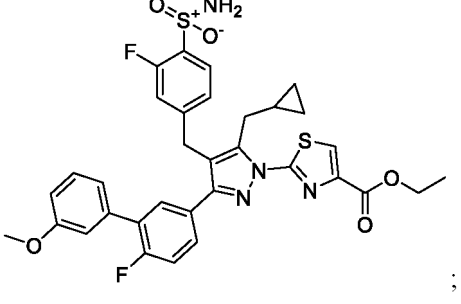
【化 2 1】

	
278	279
	
281	282
	
284	288

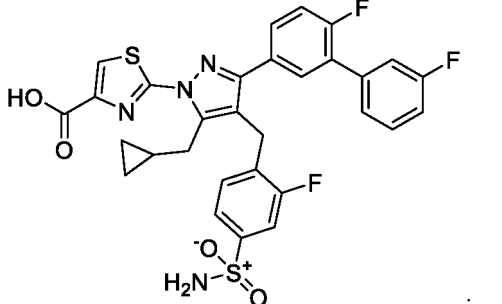
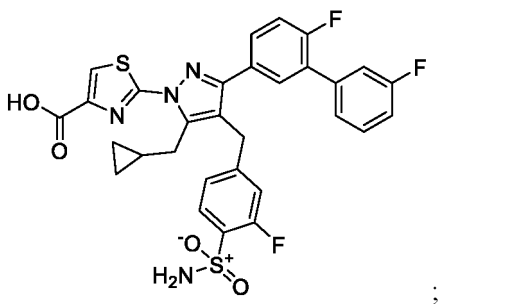
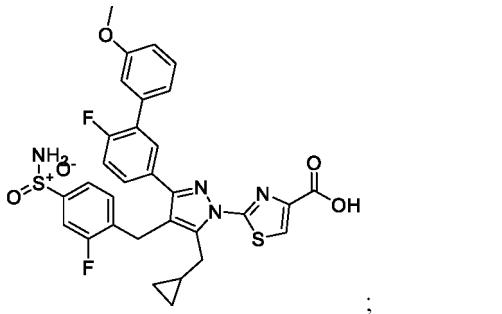
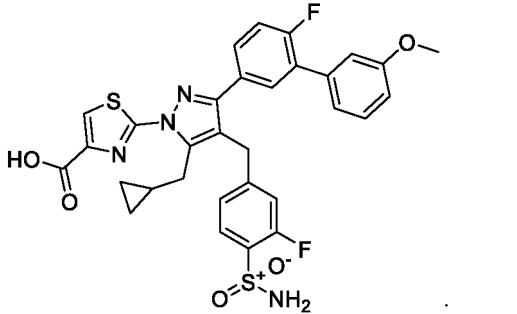
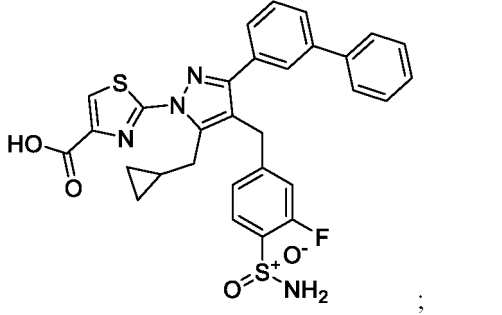
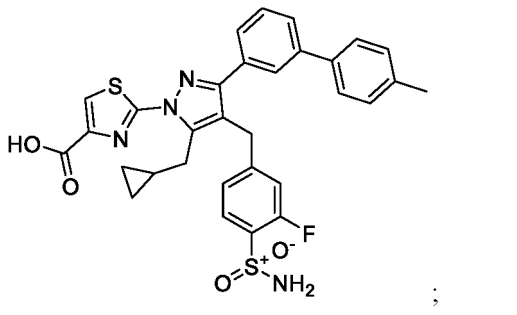
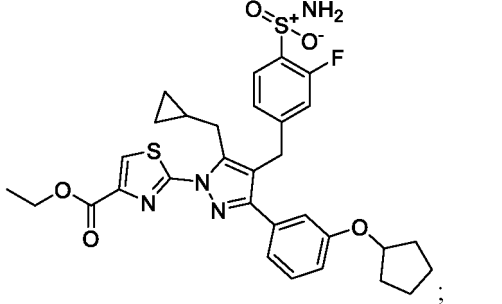
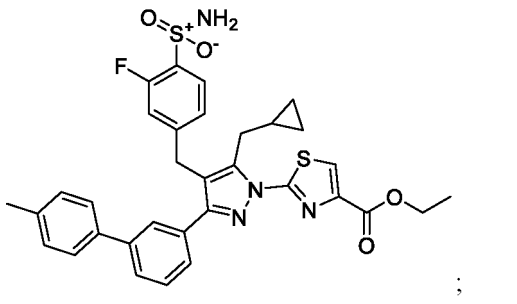
【化 2 2】

	
290	294
	
296	304
	
306	307
	
309	310

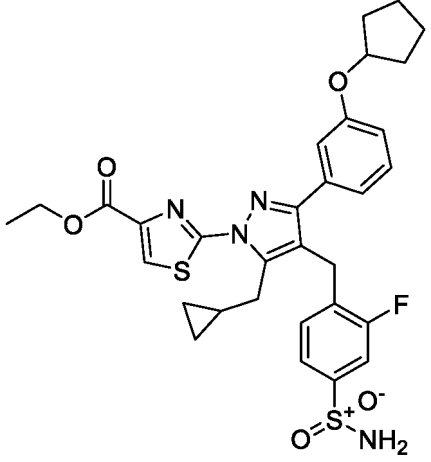
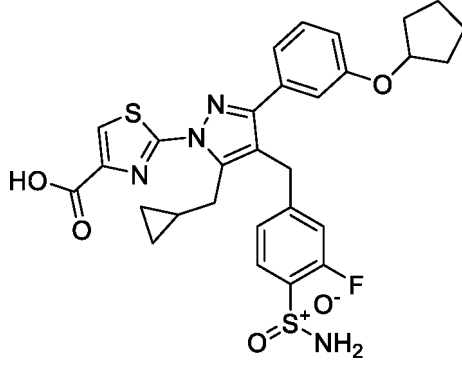
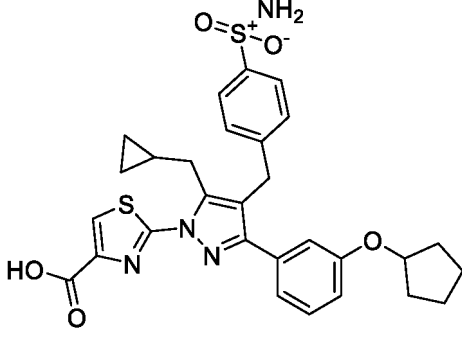
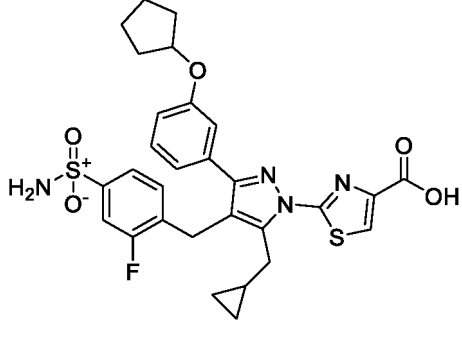
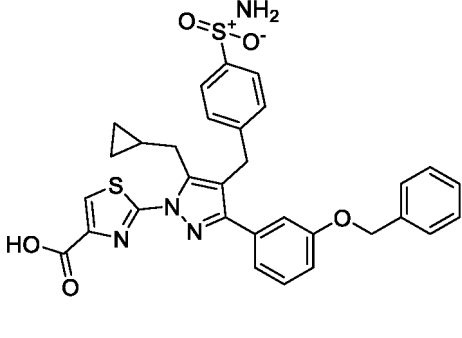
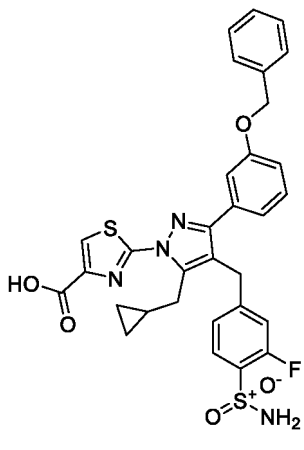
【化 2 3】

	
311	312
	
313	314
	
316	318
	
320	322

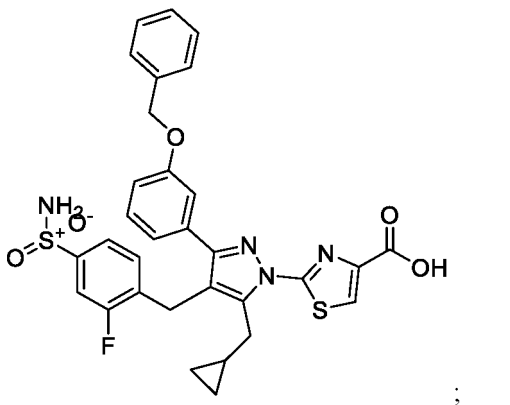
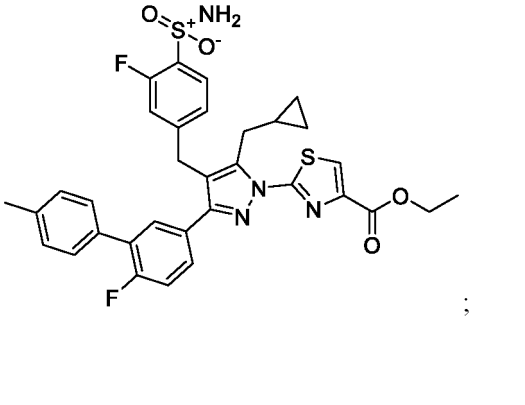
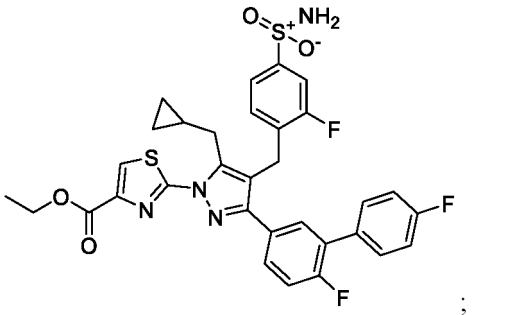
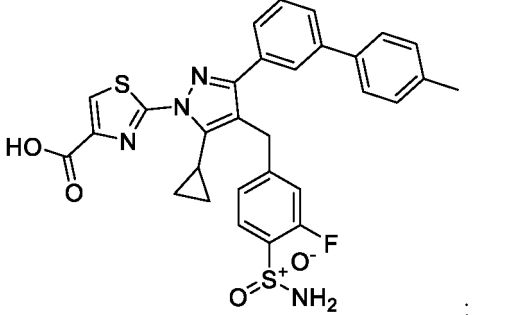
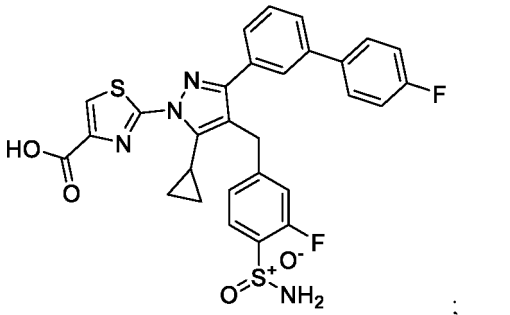
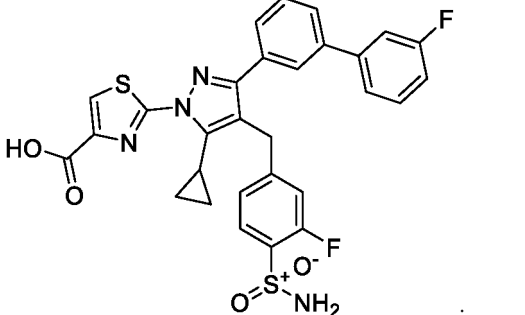
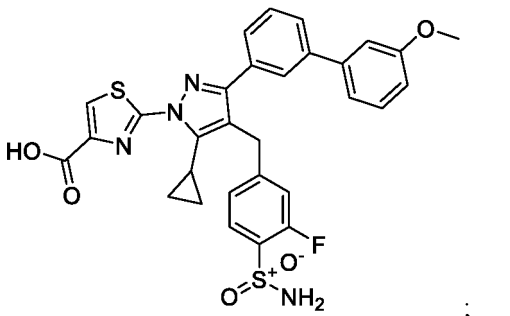
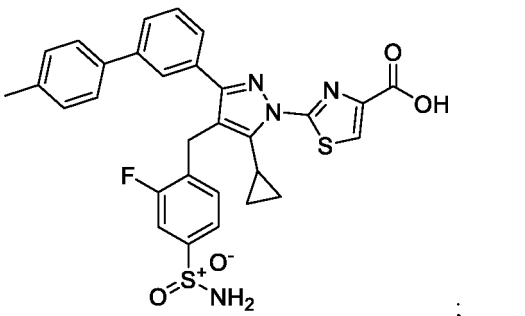
【化 2 4】

	
324	326
	
328	330
	
331	332
	
333	334

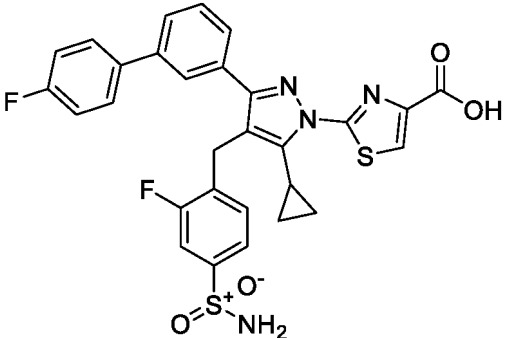
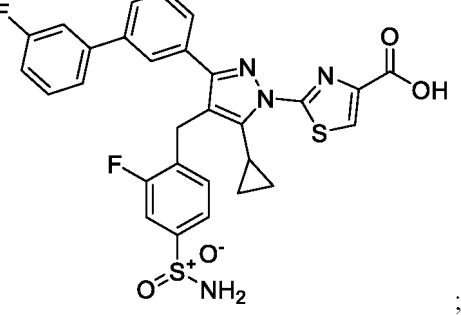
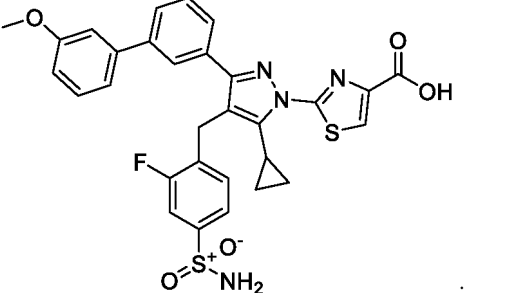
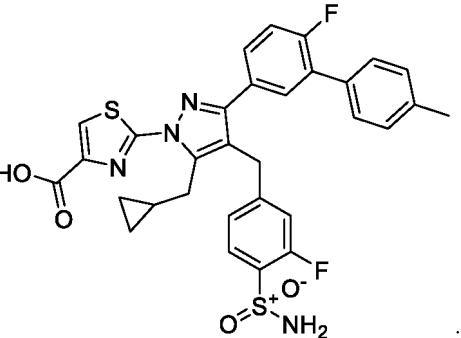
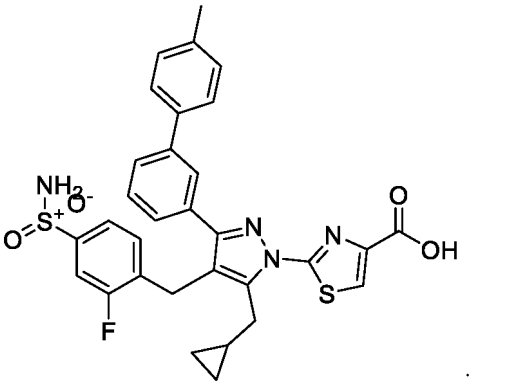
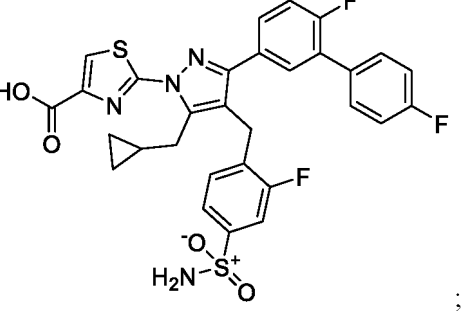
【化 2 5】

	
335	336
	
337	338
	
339	340

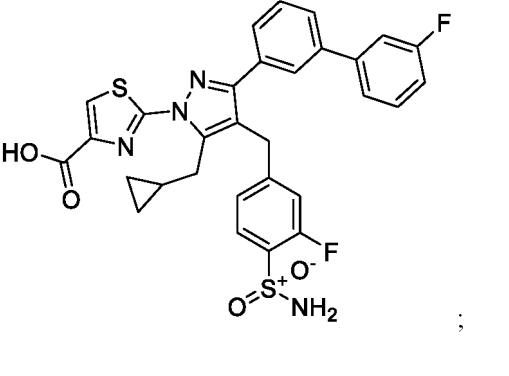
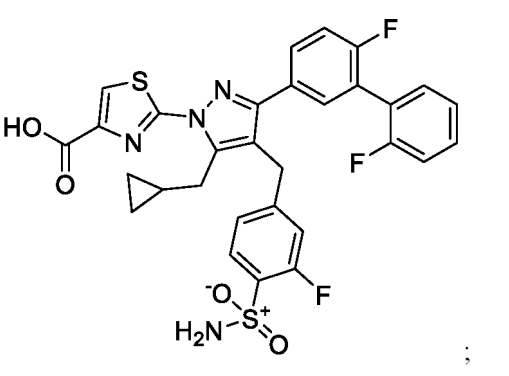
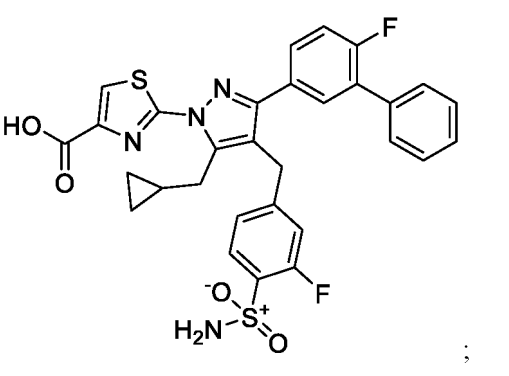
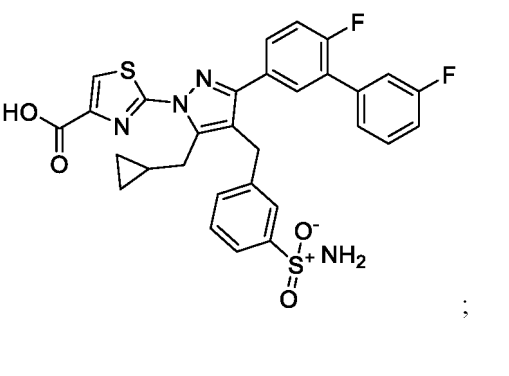
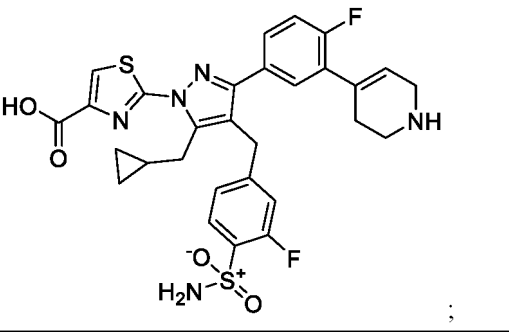
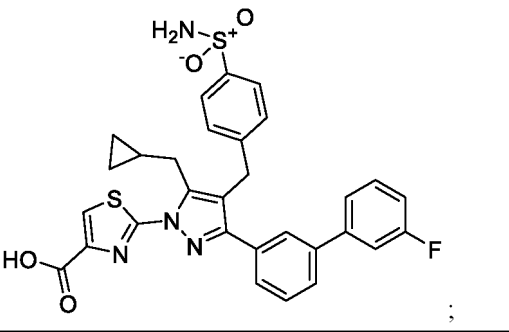
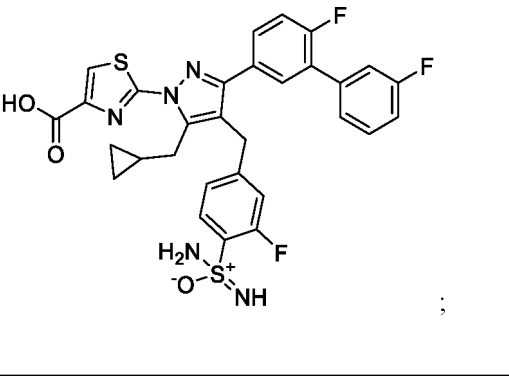
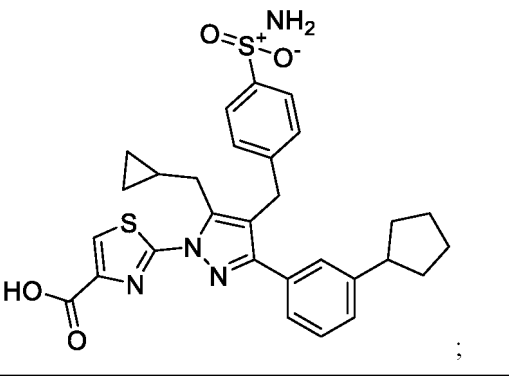
【化 2 6】

	
341	343
	
345	347
	
349	351
	
353	355

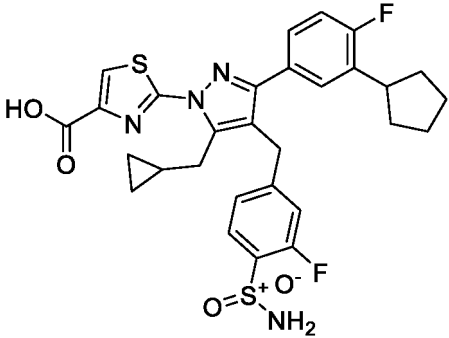
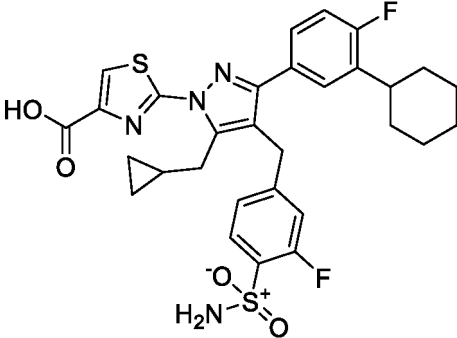
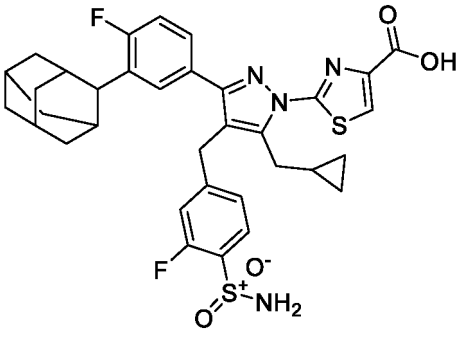
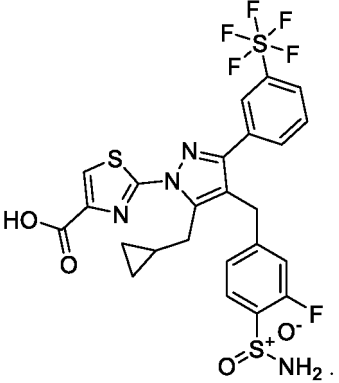
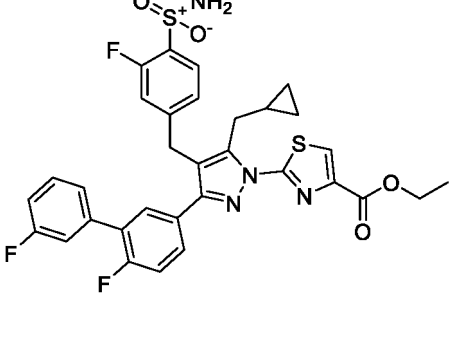
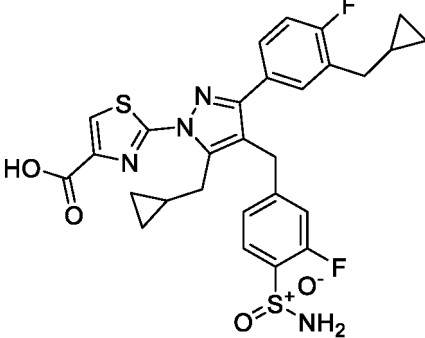
【化 2 7】

	
357	359
	
361	362
	
363	364

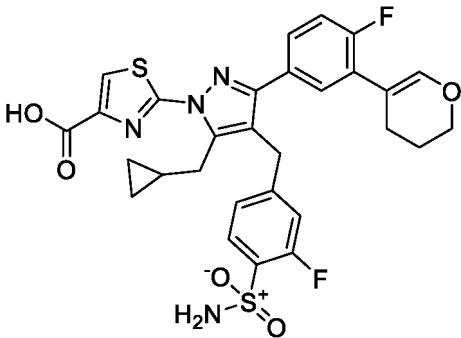
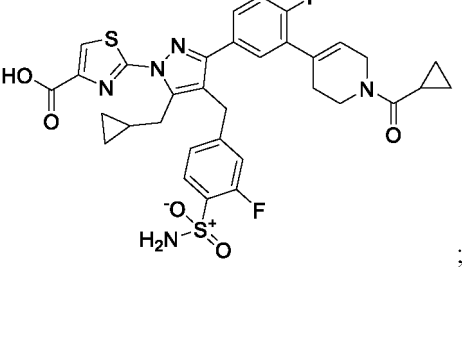
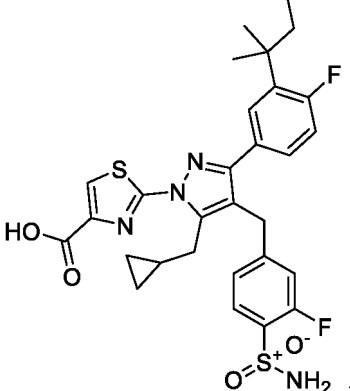
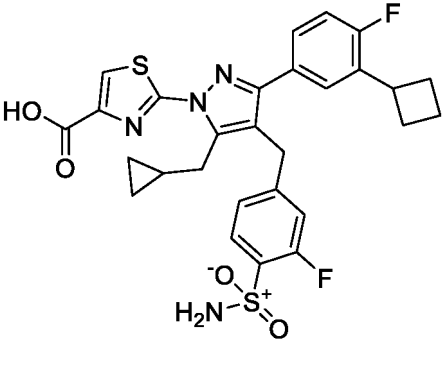
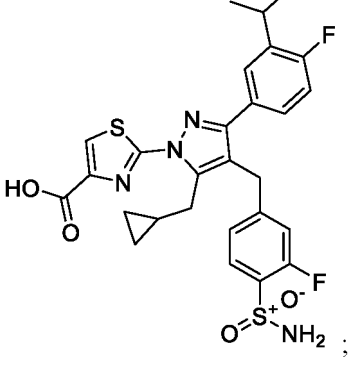
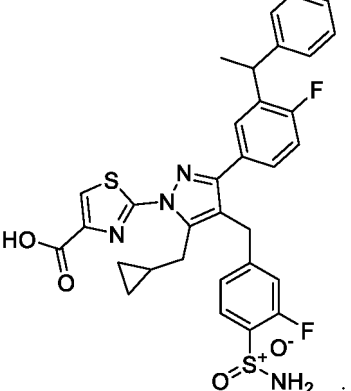
【化 2 8】

	
365	366
	
367	368
	
369	370
	
371	372

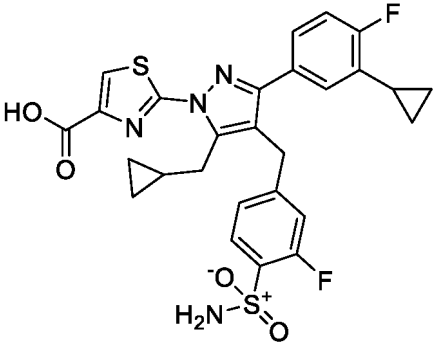
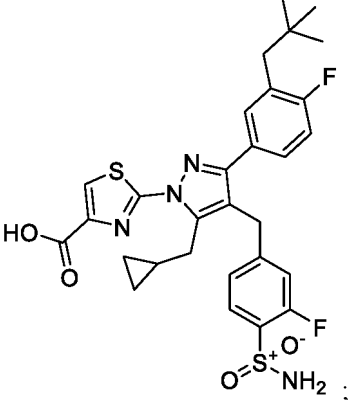
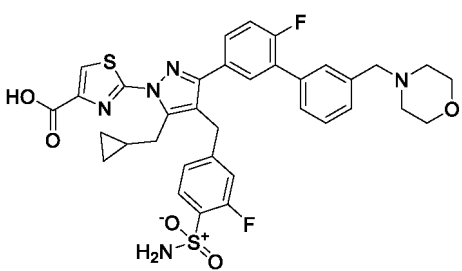
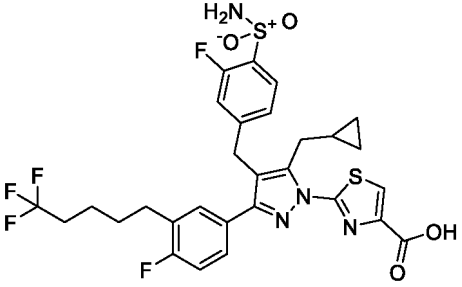
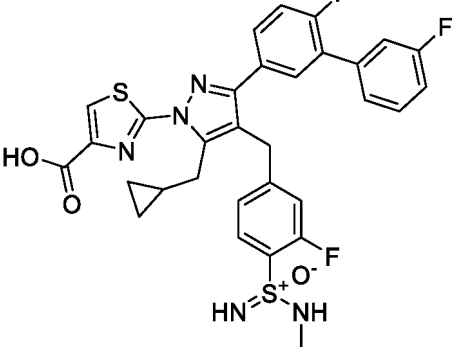
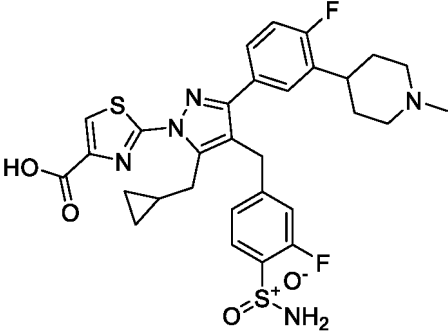
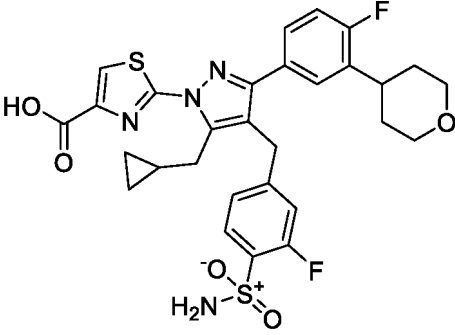
【化 2 9】

	
373	374
	
375	376
	
377	378

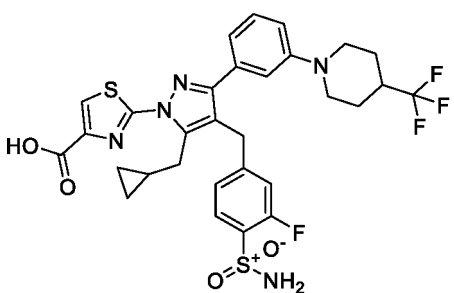
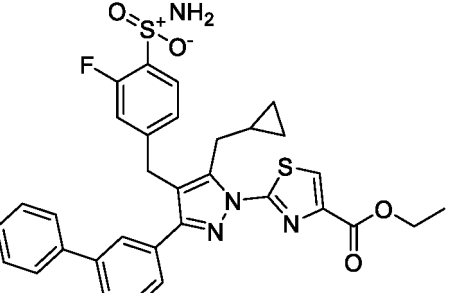
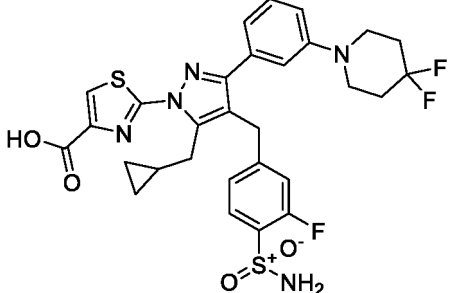
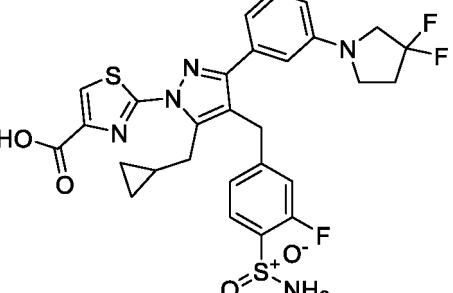
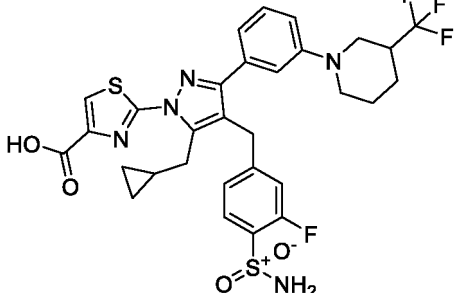
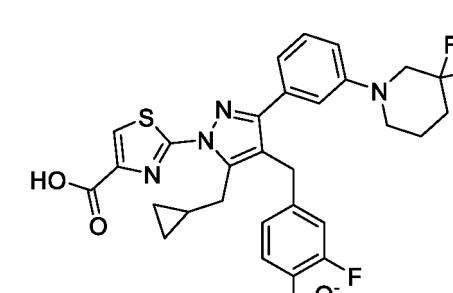
【化 3 0】

	
379	380
	
381	382
	
383	384

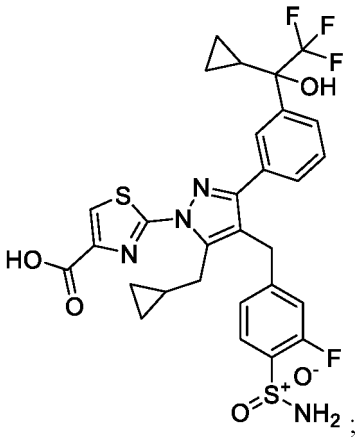
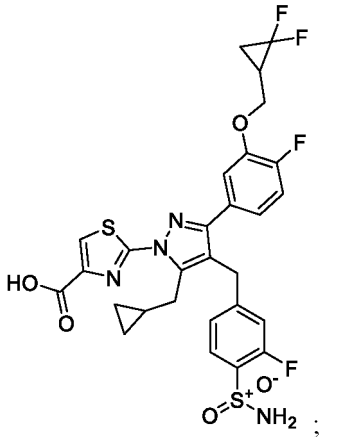
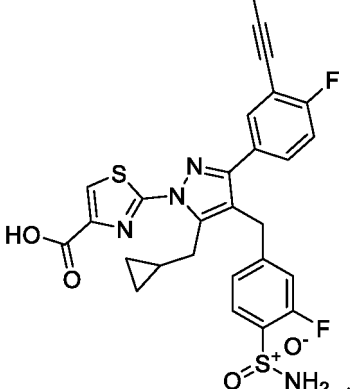
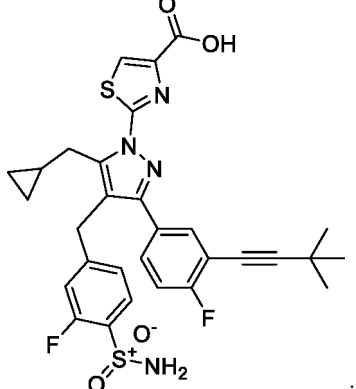
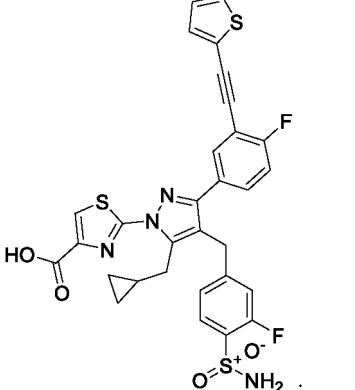
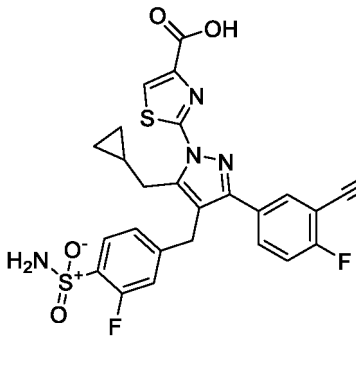
【化 3 1】

	
385	386
	
387	388
	
389	390
	
391	

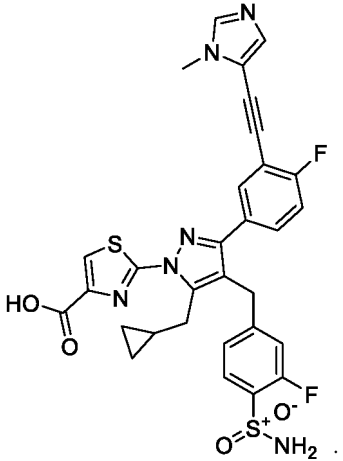
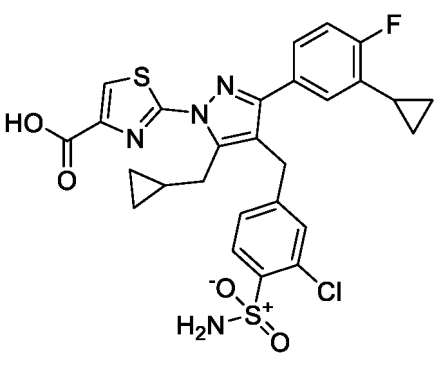
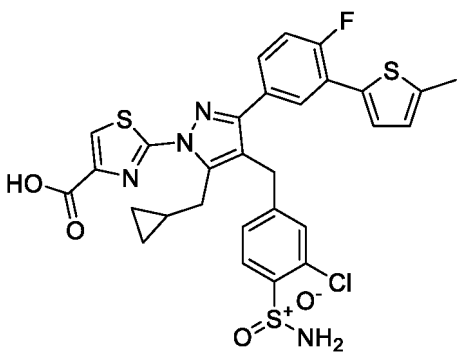
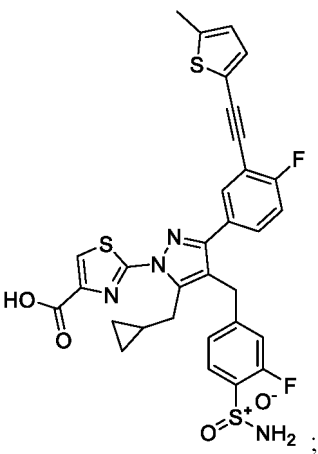
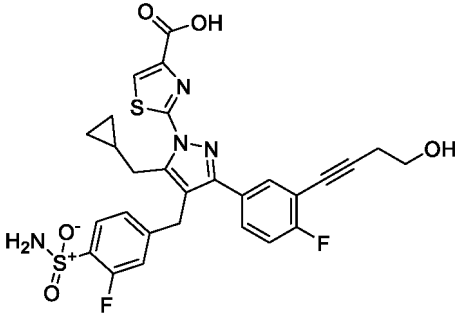
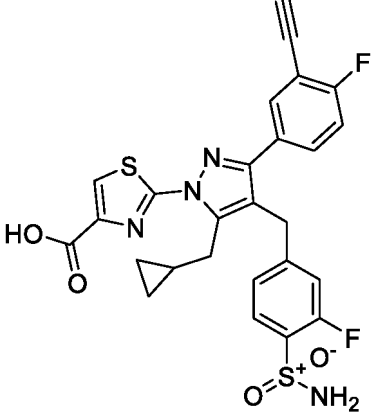
【化 3 2】

	
392	393
	
394	395
	
396	397

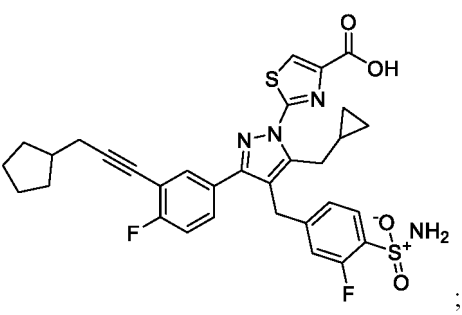
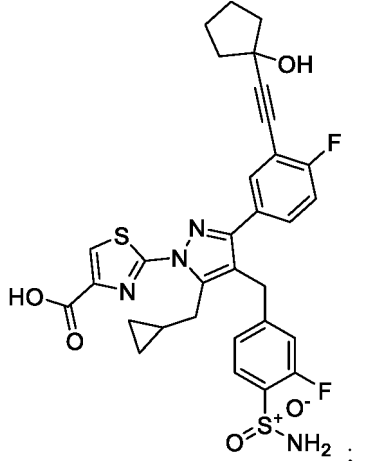
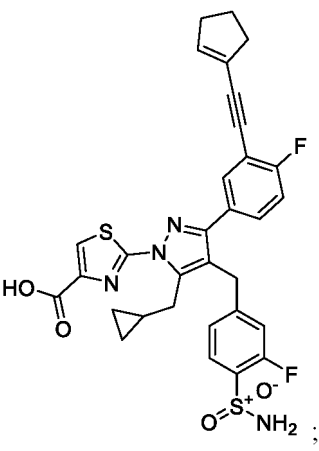
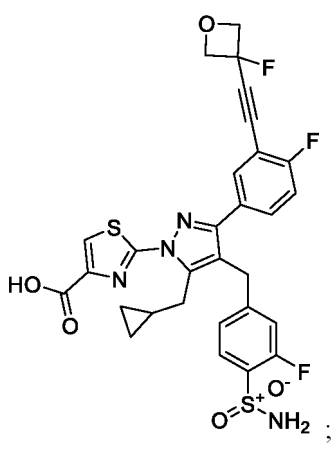
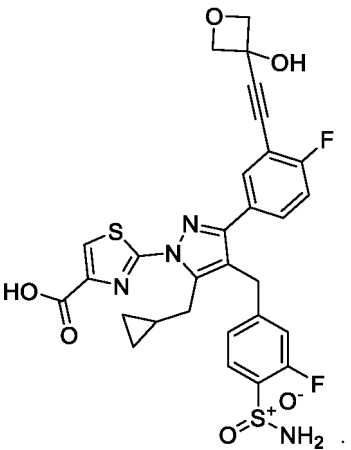
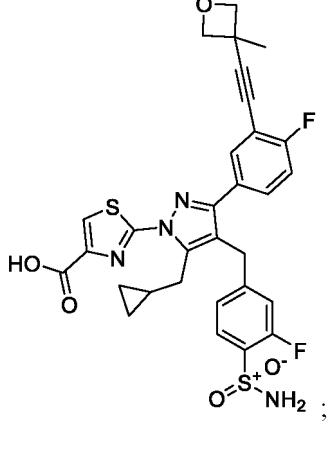
【化 3 3】

	
398	400
	
401	402
	
403	404

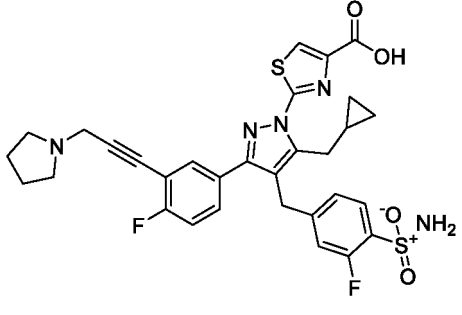
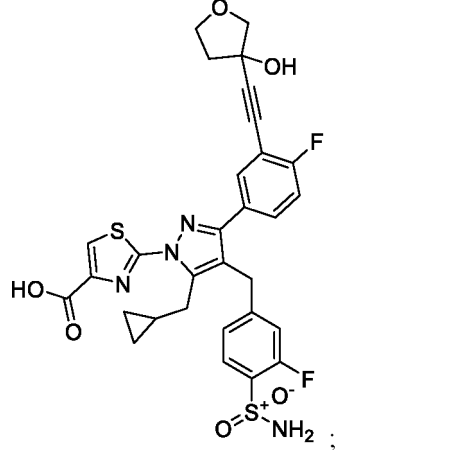
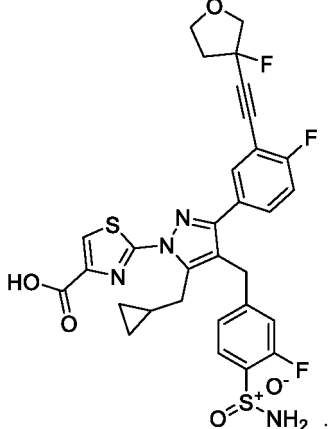
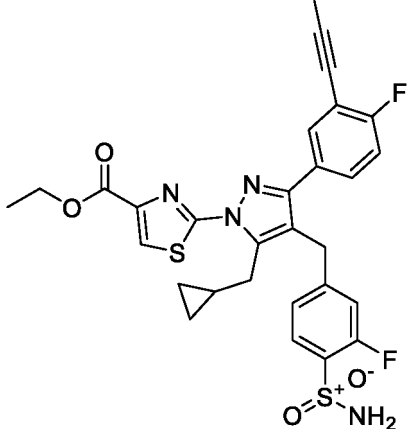
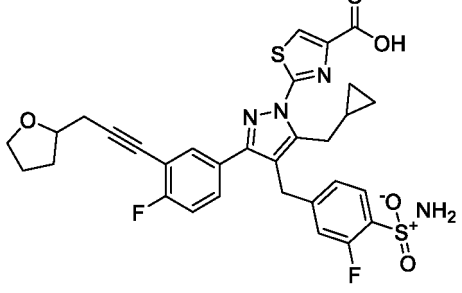
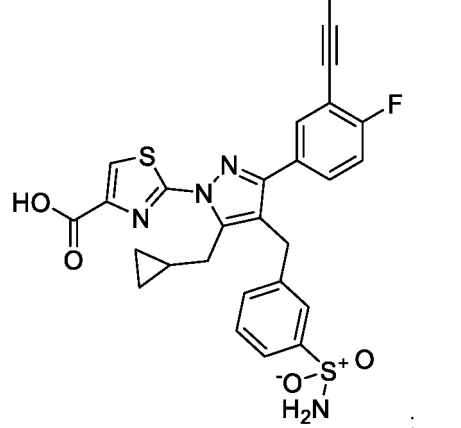
【化 3 4】

	
405	406
	
407	408
	
409	410

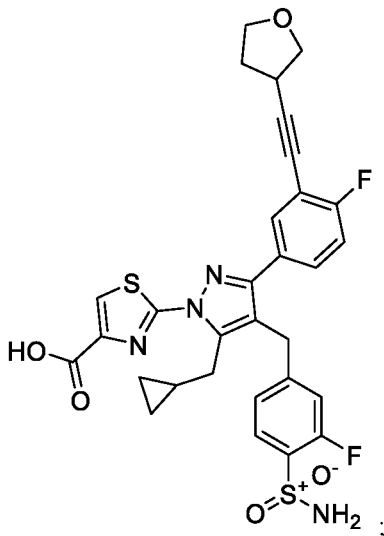
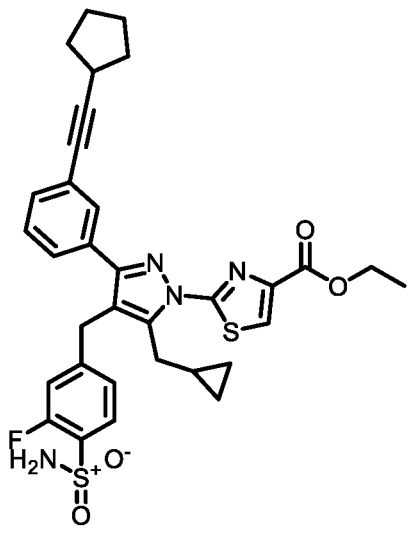
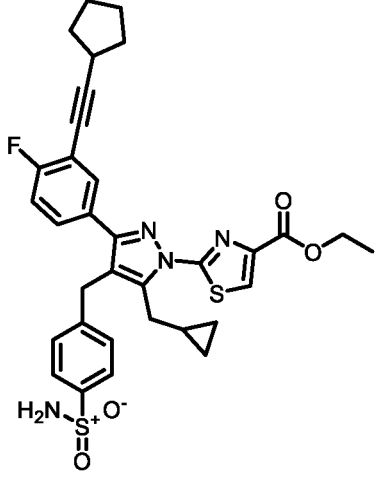
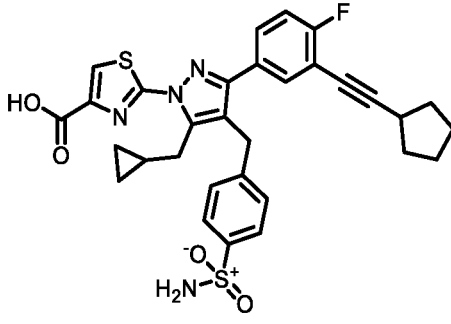
【化 3 5】

	
411	412
	
413	414
	
415	416

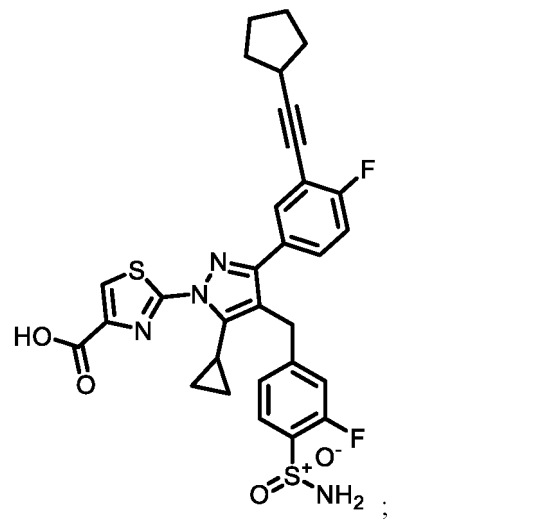
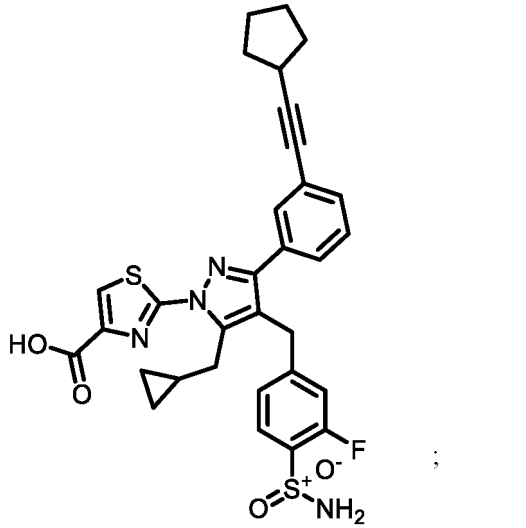
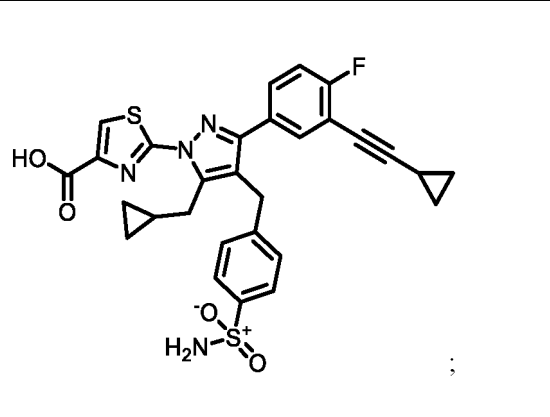
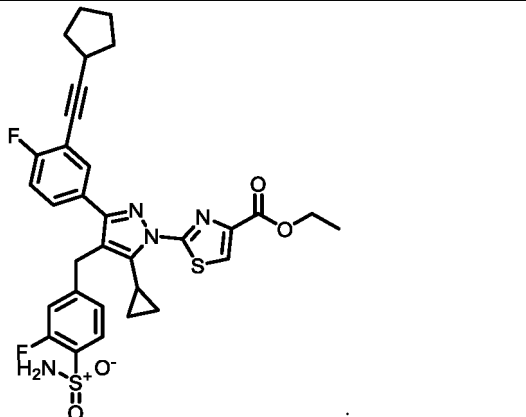
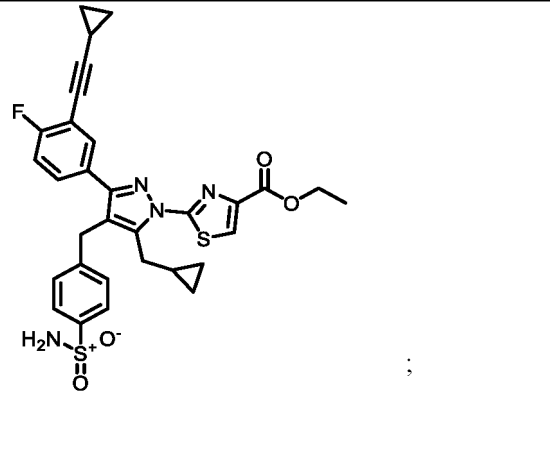
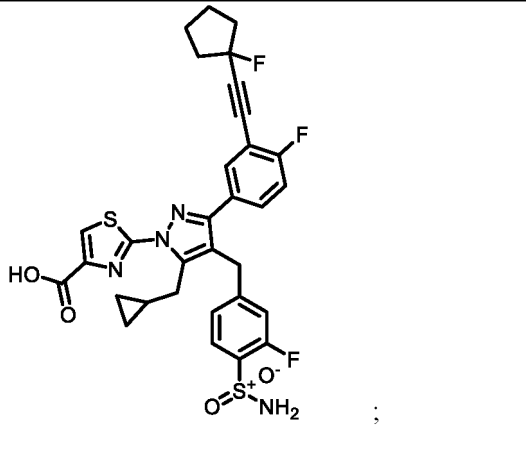
【化 3 6】

	
417	418
	
419	420
	
421	422

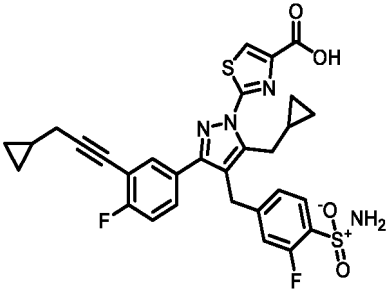
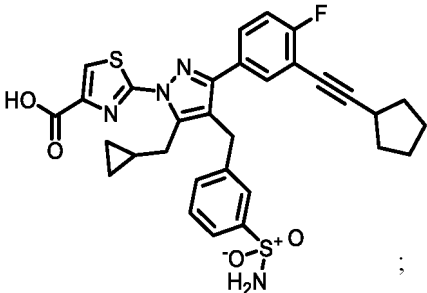
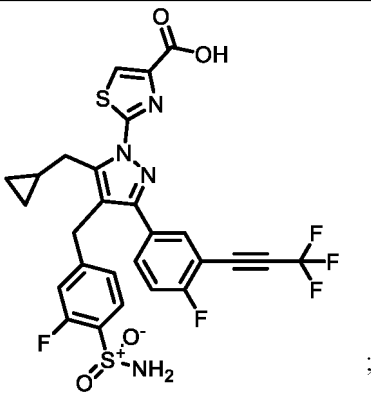
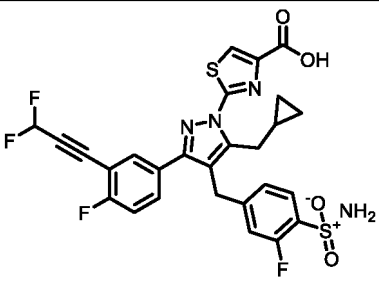
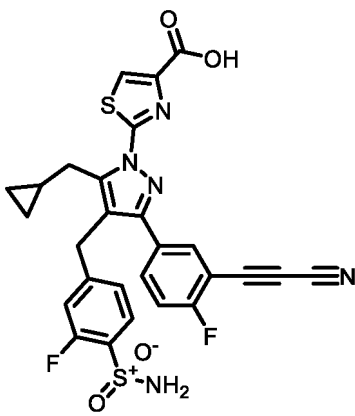
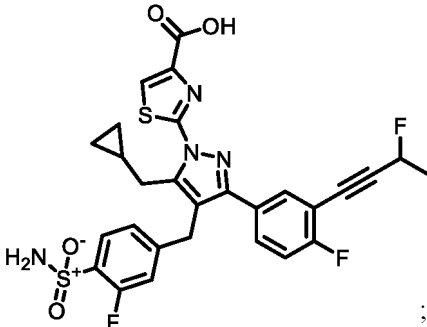
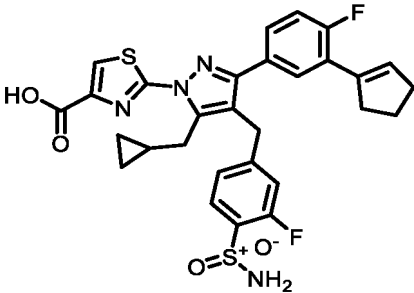
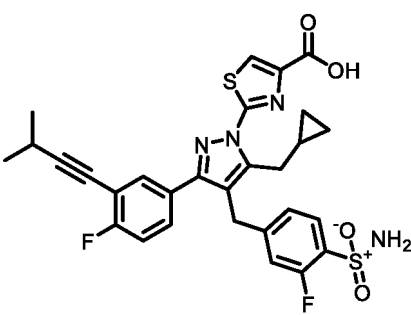
【化 3 7】

	
423	428
	
429	430

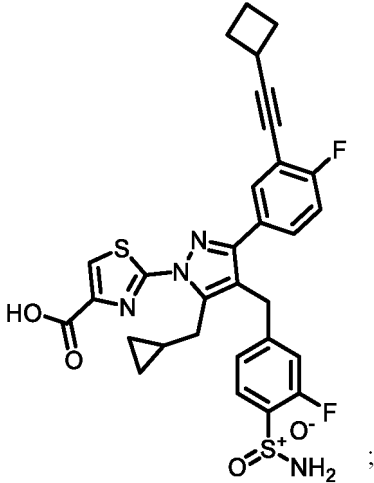
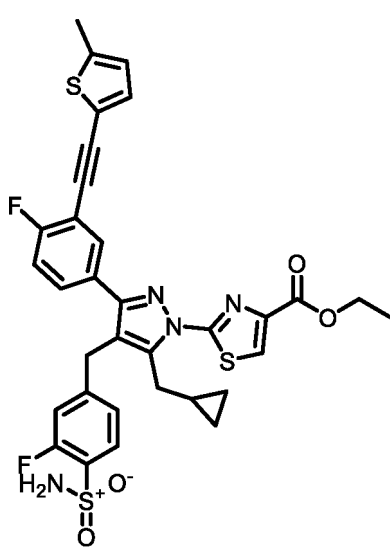
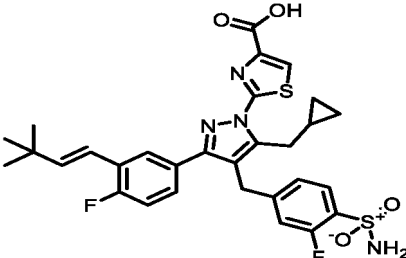
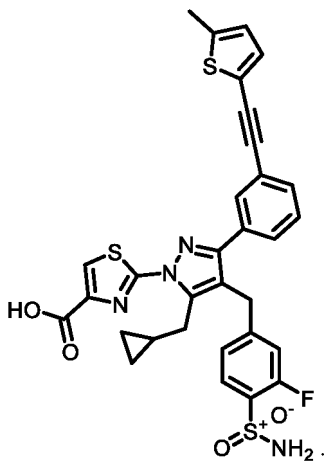
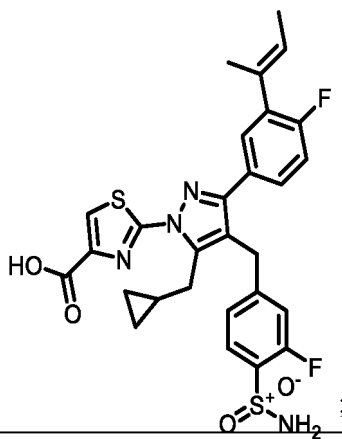
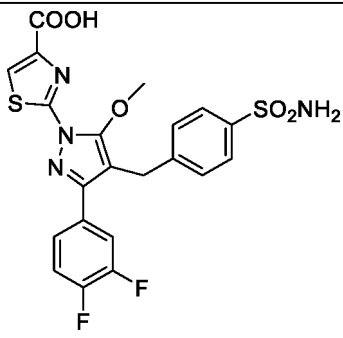
【化 3 8】

	
431	432
	
433	434
	
435	436

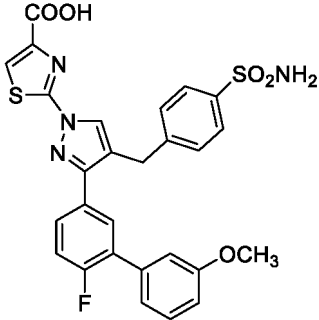
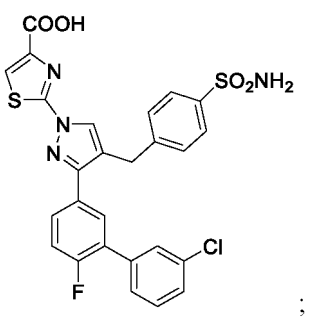
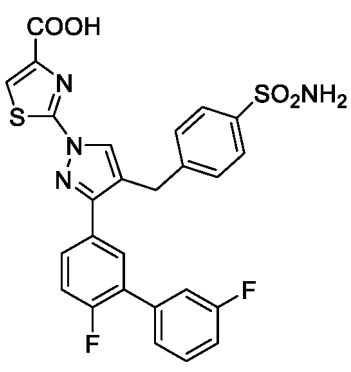
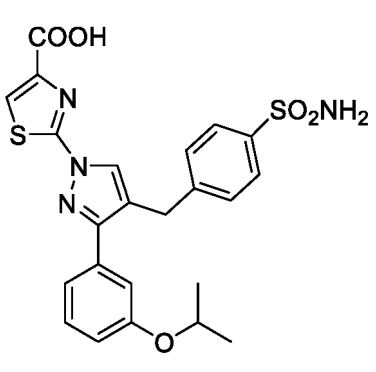
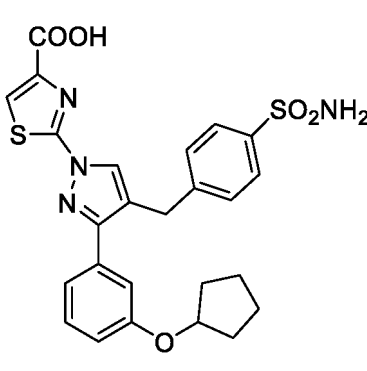
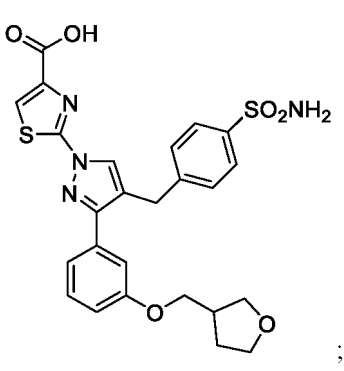
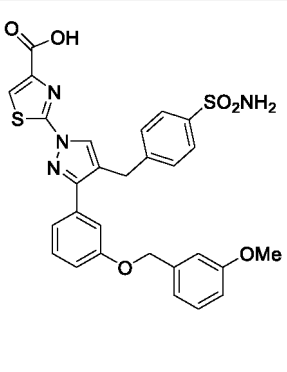
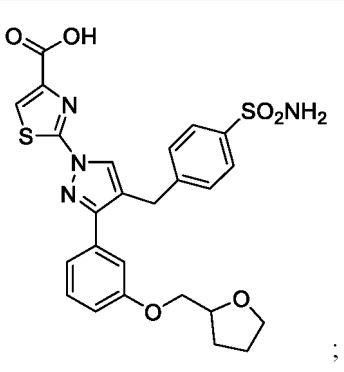
【化 3 9】

	
437	438
	
439	440
	
442	443
	
444	445

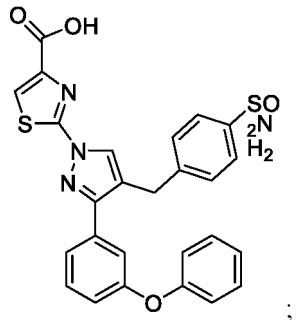
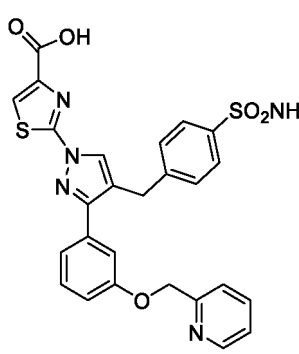
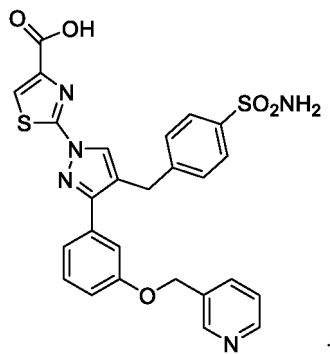
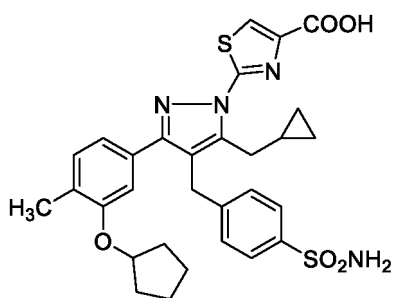
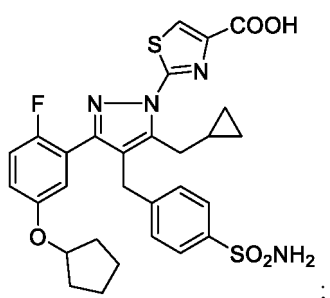
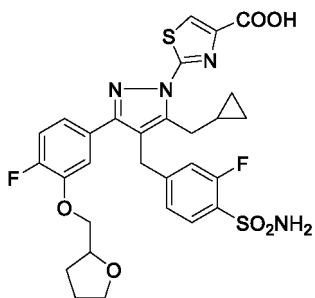
【化 4 0】

	
446	447
	
448	449
	
450	455

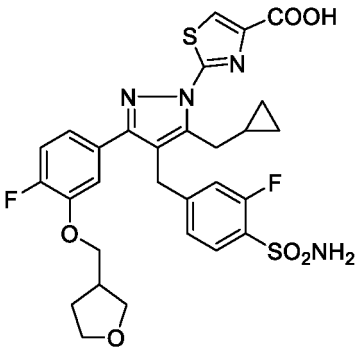
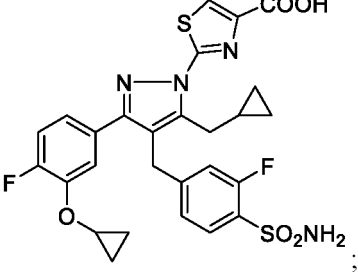
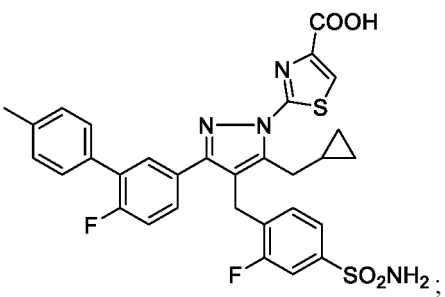
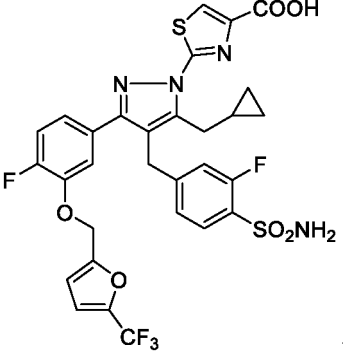
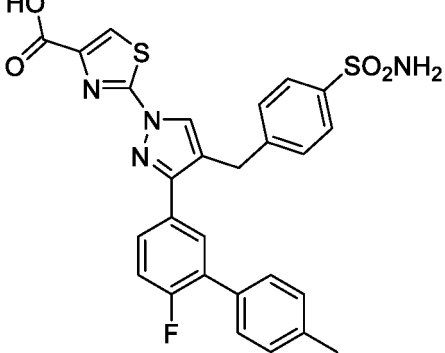
【化 4 1】

 ;	 ;
456	457
 ;	 ;
458	459
 ;	 ;
460	461
 ;	 ;
462	463

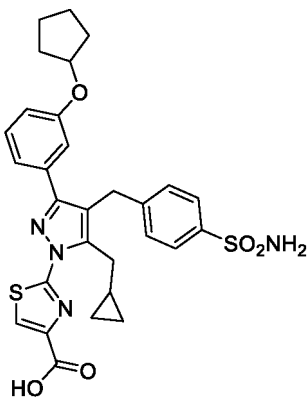
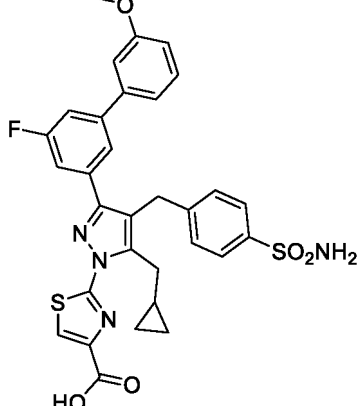
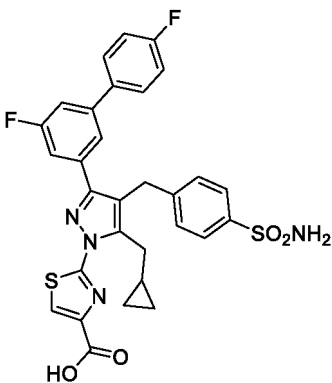
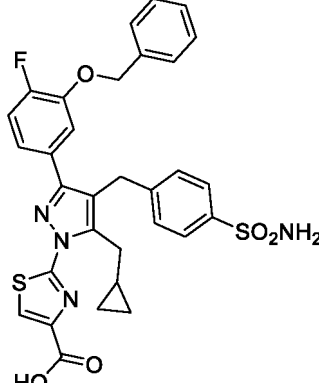
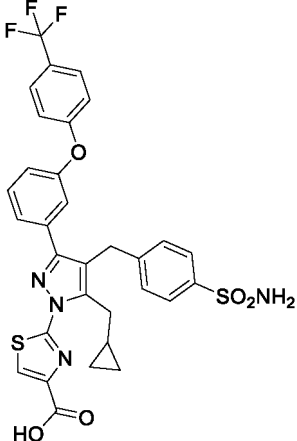
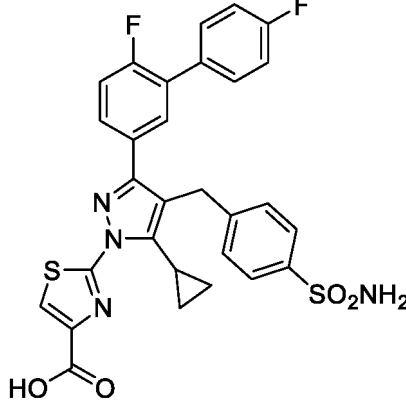
【化 4 2】

	
464	465
	
466	467
	
468	469

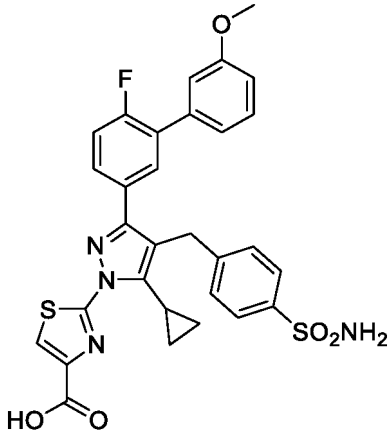
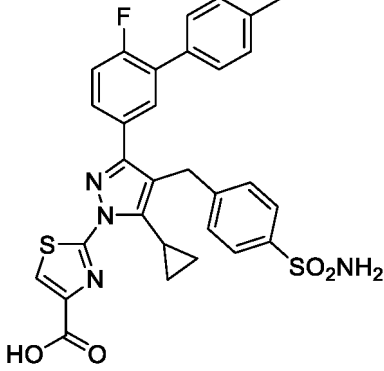
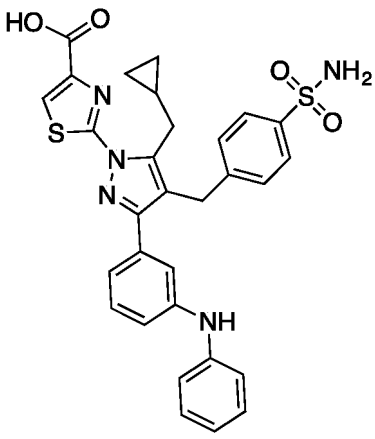
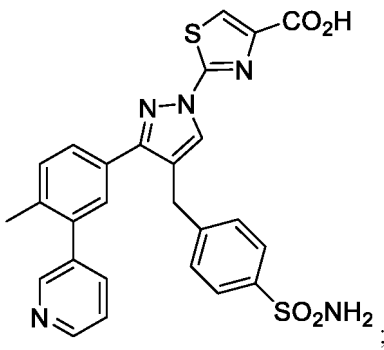
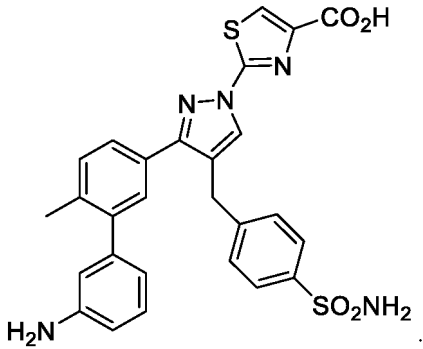
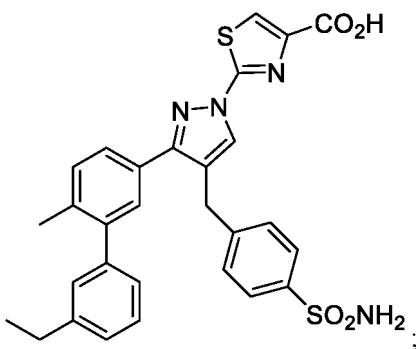
【化 4 3】

	
470	471
	
472	473
	
476	

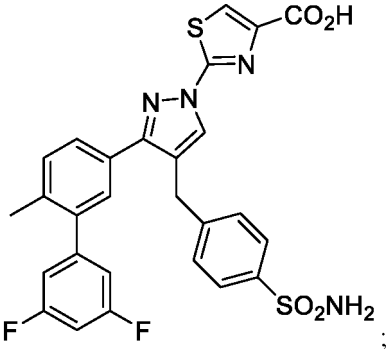
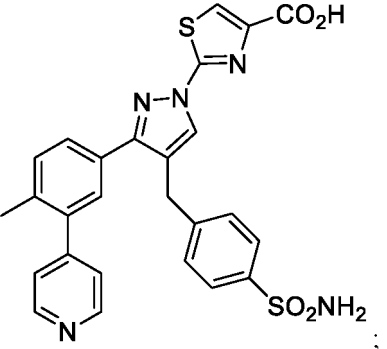
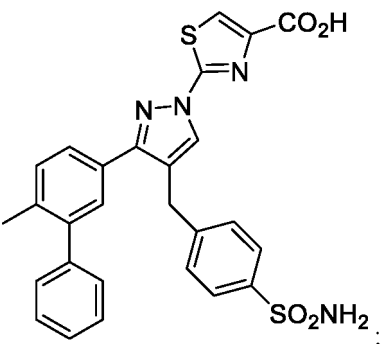
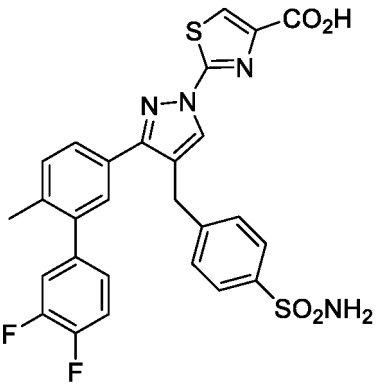
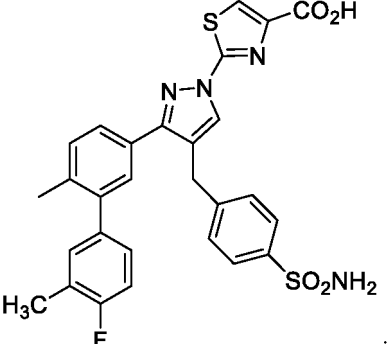
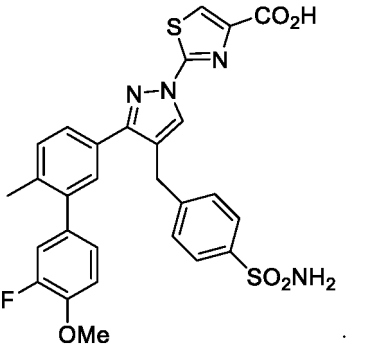
【化 4 4】

	
477	478
	
479	480
	
481	482

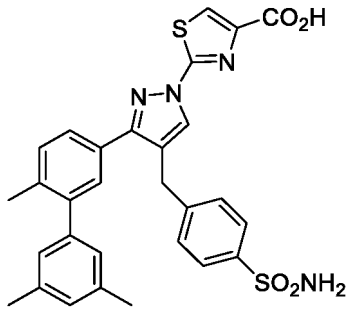
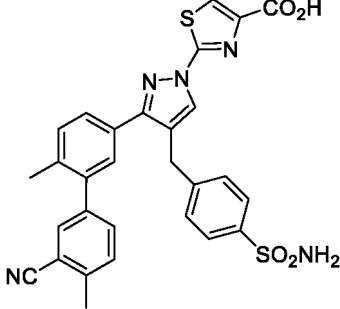
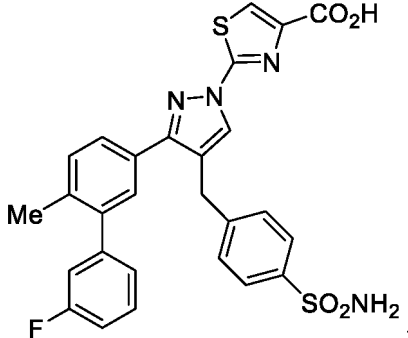
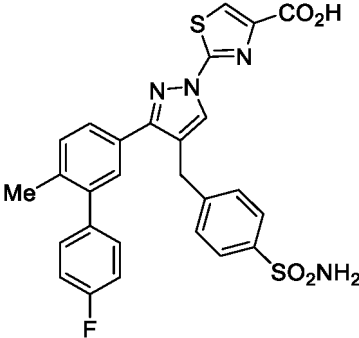
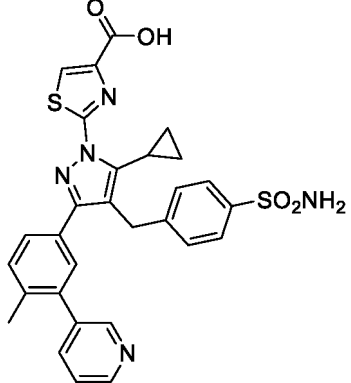
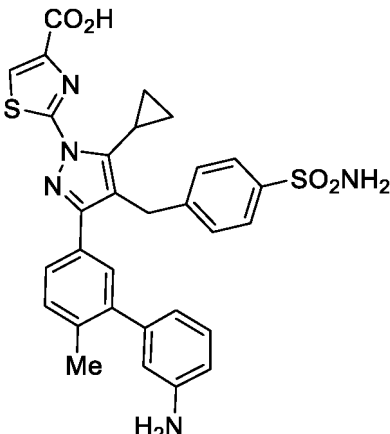
【化 4 5】

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

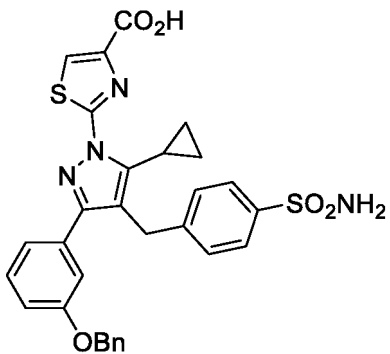
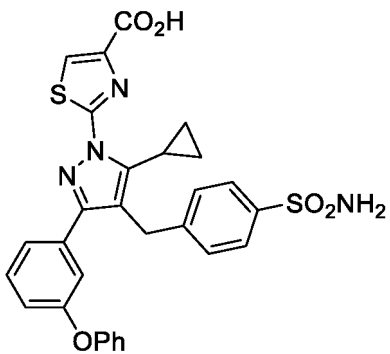
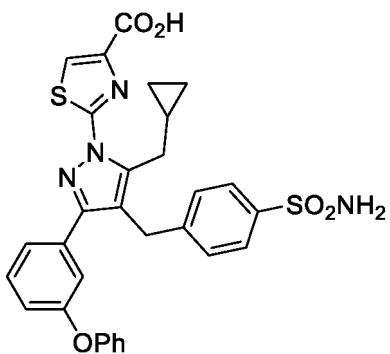
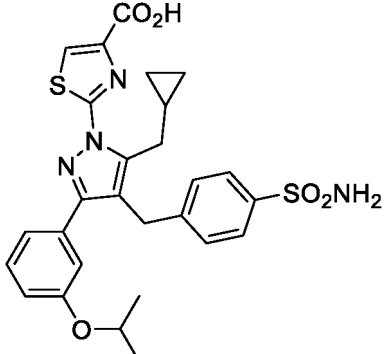
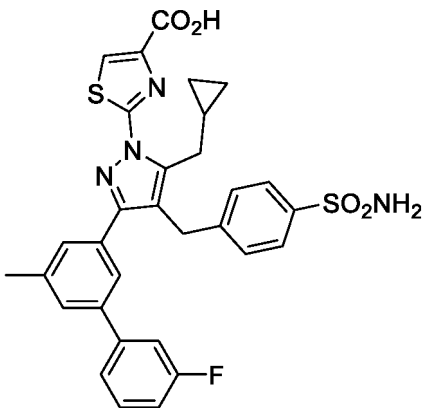
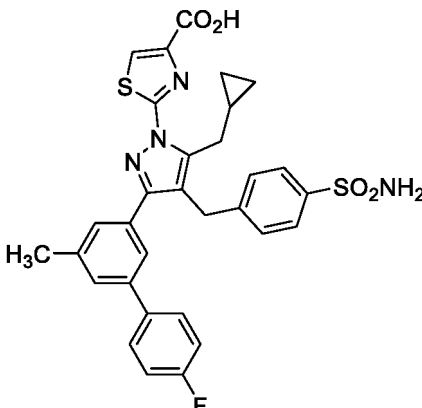
【化 4 6】

	
489	490
	
491	492
	
493	494

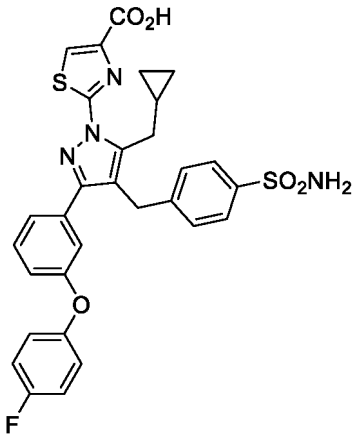
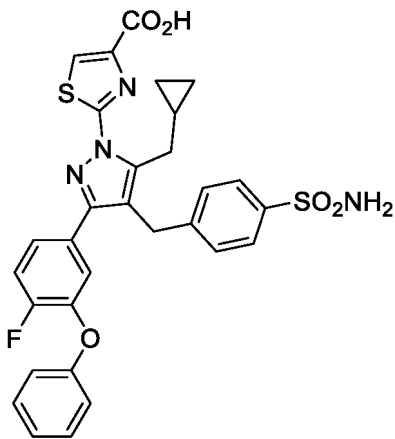
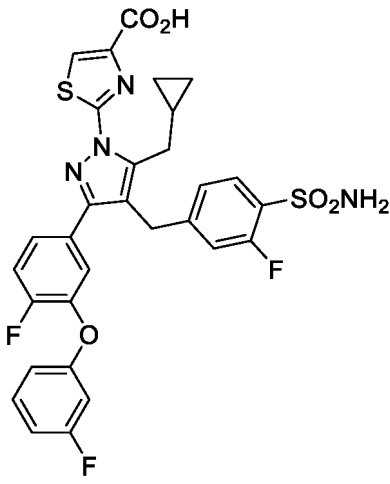
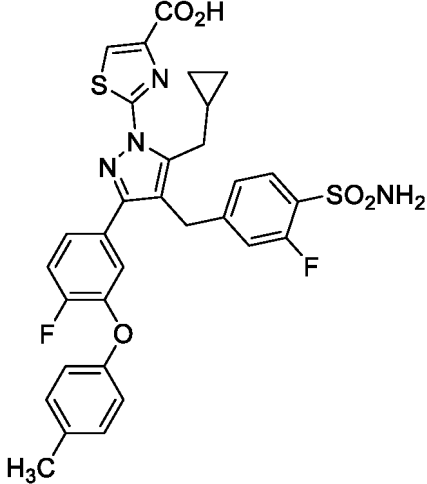
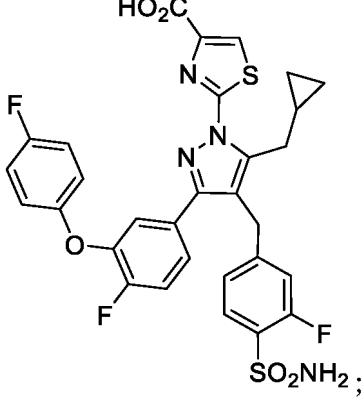
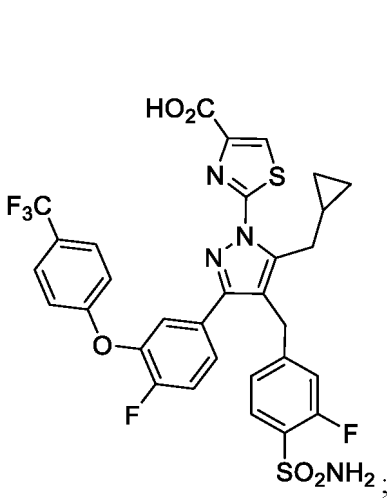
【化 4 7】

	
495	496
	
497	498
	
499	500

【化 4 8】

 	
501	502
 	
503	504
 	
505	506

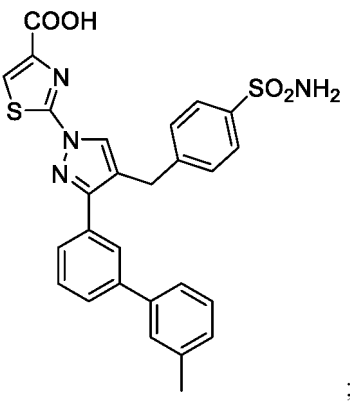
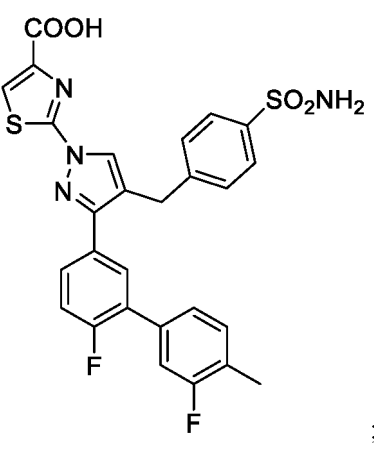
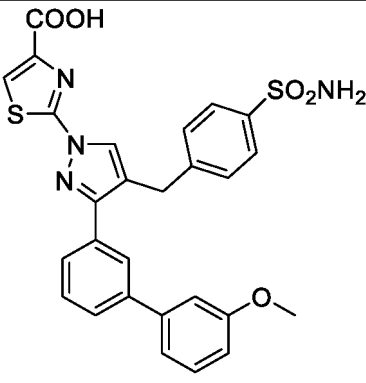
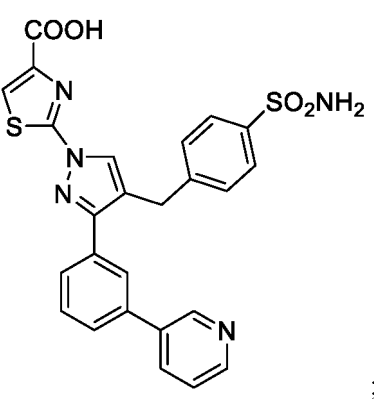
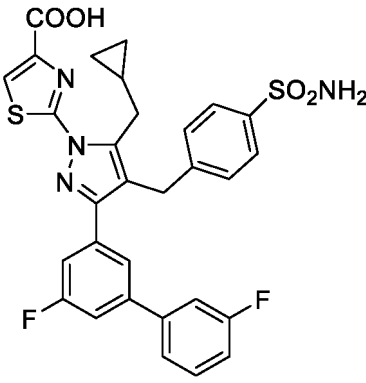
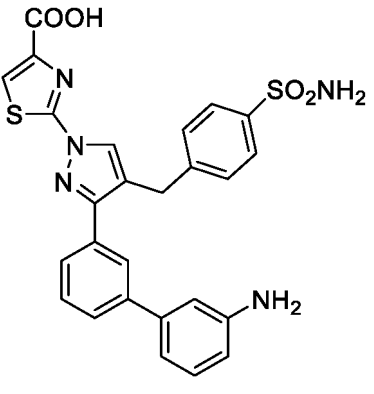
【化 4 9】

	
507	508
	
509	510
	
511	512

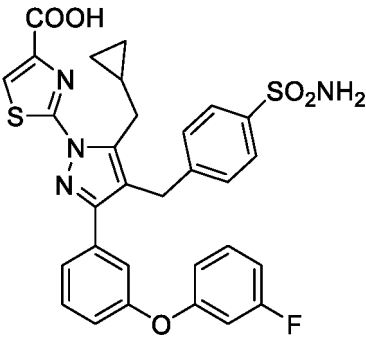
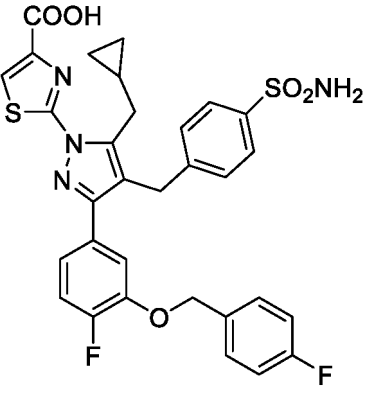
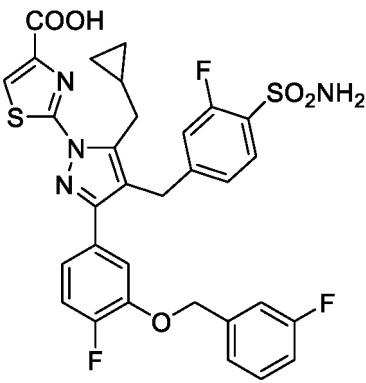
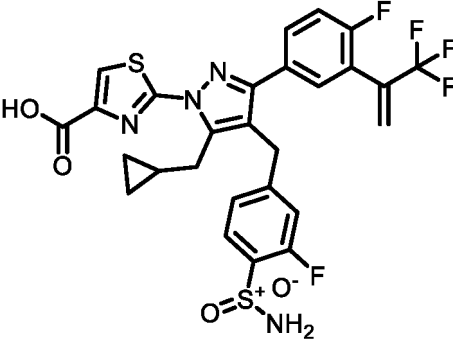
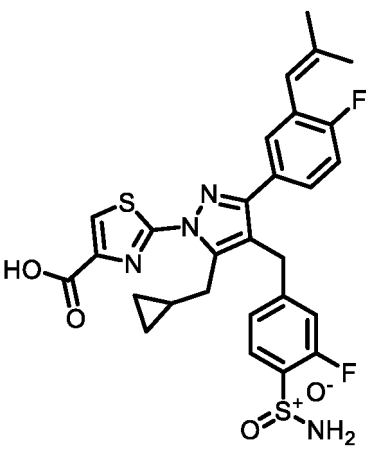
【化 5 0】

 ;	 ;
513	514
 ;	 ;
515	516
 ;	 ;
517	518

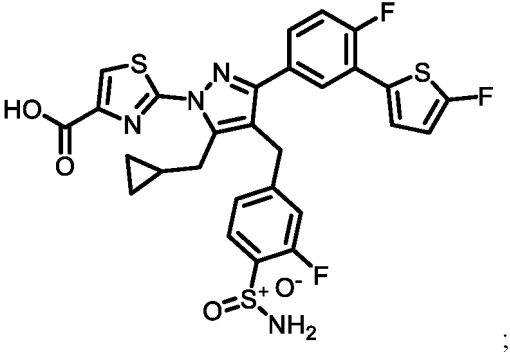
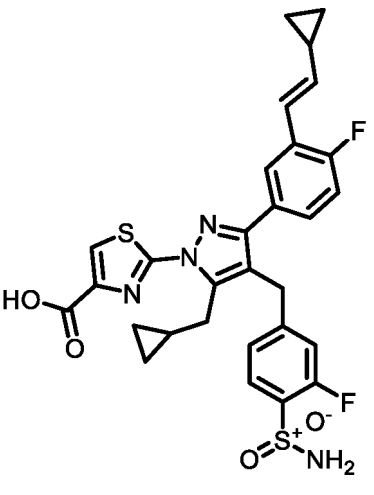
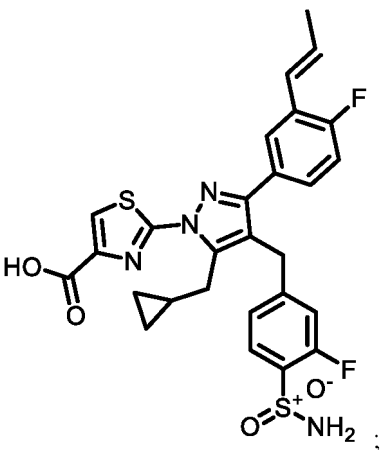
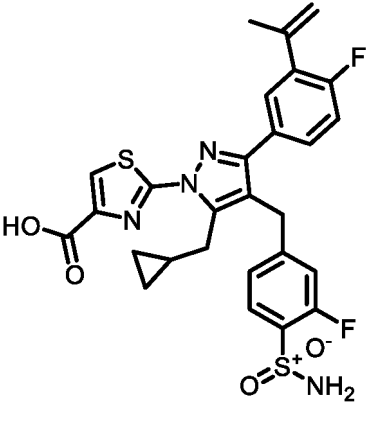
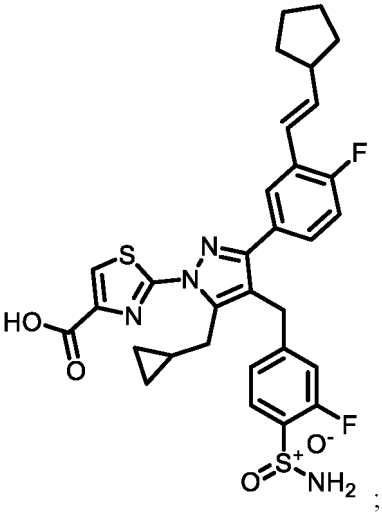
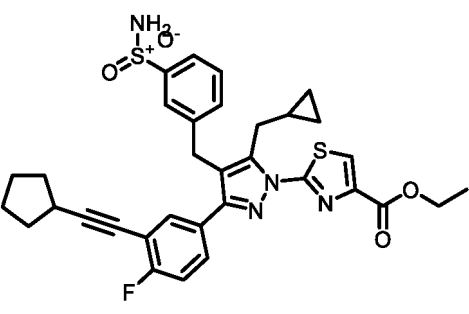
【化 5 1】

	
519	520
	
521	522
	
523	524

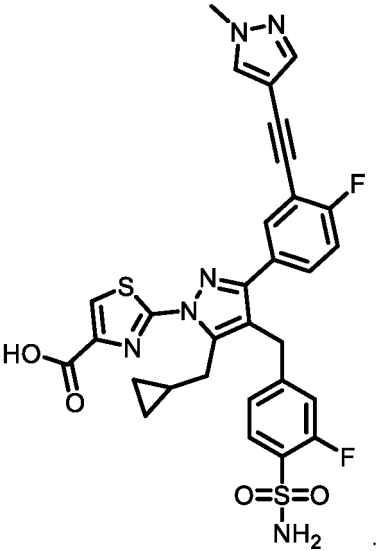
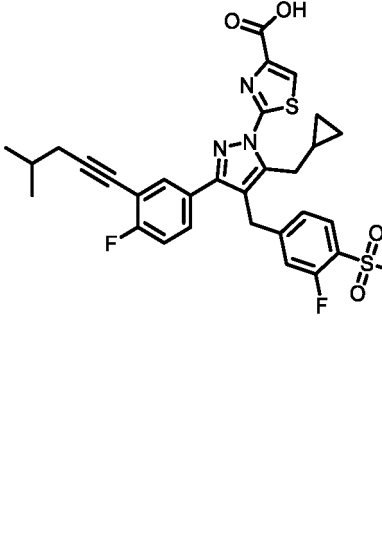
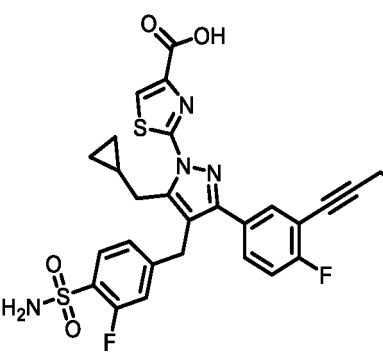
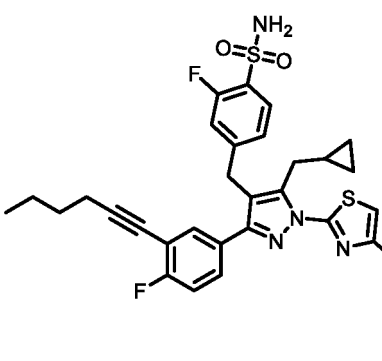
【化 5 2】

	
526	527
	
528	529
	
530	

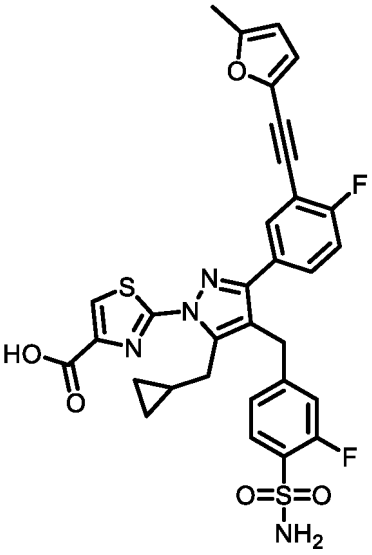
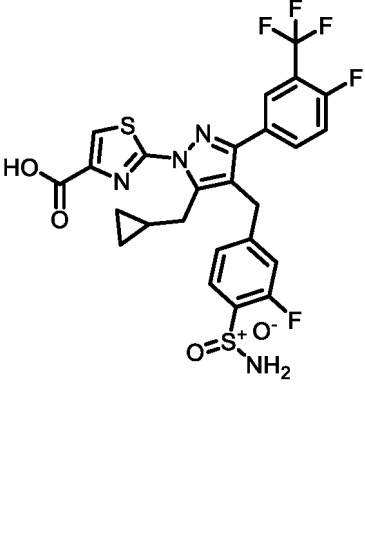
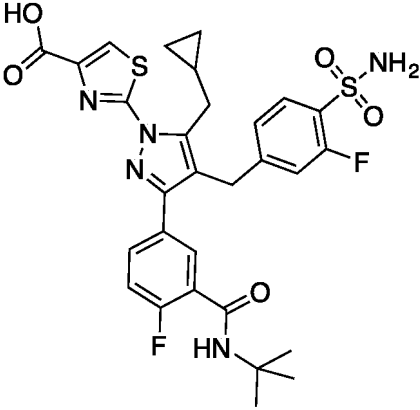
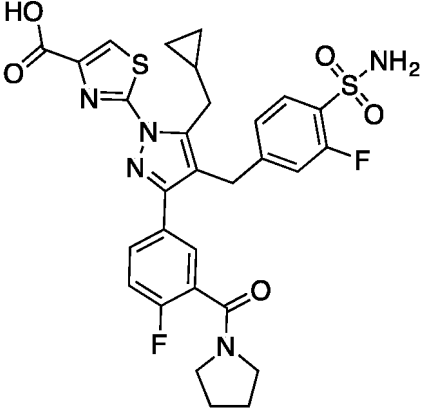
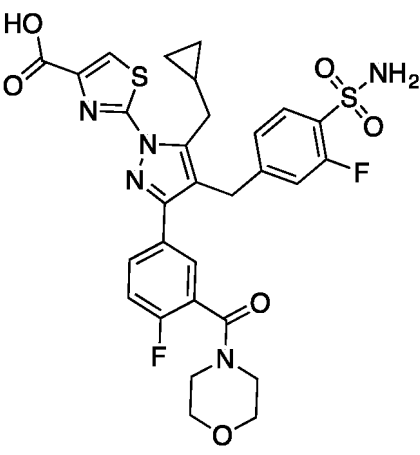
【化 5 3】

	
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 ~ 1 0 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いてもよい。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。