

【公報種別】 特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】 第 3 部門第 2 区分

【発行日】 平成 18 年 8 月 31 日 (2006.8.31)

【公表番号】 特表 2006-508107 (P2006-508107A)

【公表日】 平成 18 年 3 月 9 日 (2006.3.9)

【年通号数】 公開・登録公報 2006-010

【出願番号】 特願 2004-550489 (P2004-550489)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/42 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 21/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/04 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 403/10 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 239/42 C S P Z

A 6 1 K 31/505

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 9/02

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 21/04

A 6 1 P 25/00 1 0 1

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 37/04

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 43/00 1 2 1

C O 7 D 403/10

【手続補正書】

【提出日】平成18年7月12日(2006.7.12)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

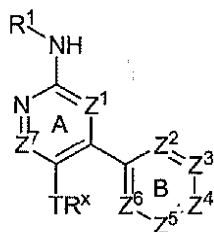
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物またはそれらの薬学的に受容可能な塩：

【化1】



ここで：

 R^1 は、 $Q-Ar^1$ であり、

ここで、 Q は、結合または $C_1 \sim 2$ アルキリデン鎖であり、ここで、 Q の一つのメチレン単位は、必要に応じて、 O 、 NR 、 $NRCO$ 、 $NRCONR$ 、 $NRCO_2$ 、 CO 、 CO_2 、 $CONR$ 、 $OCONR$ 、 SO_2 、 SO_2NR 、 $NRSO_2$ 、 $NRSO_2NR$ 、 $COCO$ 、または $COCH_2CO$ で置換されている；

Ar^1 は、5～7員の飽和、部分不飽和または完全不飽和の単環または8～12員の飽和、部分不飽和または完全不飽和の二環式環系であり、該単環は、0個～3個のヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子は、独立して、窒素、酸素または硫黄から選択され、そして該二環式環系は、0個～5個のヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子は、独立して、窒素、酸素または硫黄から選択される；ここで、 Ar^1 は、必要に応じて、 $Z-R^Z$ の q 個の独立の出現例で置換されている；ここで、 q は、0～5であり、 Z は、結合であるか、または $C_1 \sim C_6$ アルキリデン鎖であり、ここで、 Z の2個までのメチレン単位は、必要に応じて、独立して CO 、 CO_2 、 $COCO$ 、 $CONR$ 、 $OCONR$ 、 $NRNR$ 、 $NRNRCO$ 、 $NRCO$ 、 $NRCO_2$ 、 $NRCONR$ 、 SO 、 SO_2 、 $NRSO_2$ 、 SO_2NR 、 $NRSO_2NR$ 、 O 、 S または NR で置換されている；そして R^Z の各出現例は、独立して、 R' 、ハロゲン、 NO_2 、 CN 、 OR' 、 SR' 、 $N(R')$ 、 $NR'COR'$ 、 $NR'CON(R')$ 、 $NR'CO_2R'$ 、 COR' 、 CO_2R' 、 $OCOR'$ 、 $CON(R')$ 、 $OCON(R')$ 、 SOR' 、 SO_2R' 、 $SO_2N(R')$ 、 $NR'SO_2R'$ 、 $NR'SO_2N(R')$ 、 $COCOR'$ 、または $COCH_2COR'$ から選択されている；

R の各出現例は、独立して、水素または必要に応じて置換された $C_1 \sim C_6$ 脂肪族である；そして、 R' の各出現例は、独立して、水素または必要に応じて置換された $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基、3員～8員の飽和、部分不飽和または完全不飽和の単環または8～12員の飽和、部分不飽和または完全不飽和の二環式環系であり、該単環は、0個～3個のヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子は、独立して、窒素、酸素または硫黄から選択され、そして該二環式環系は、0個～5個のヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子は、独立して、窒素、酸素または硫黄から選択される；または、 R および R' 、 R の2個の出現例、もしくは R' の

2 個の出現例は、それらが結合する原子と一緒にあって、3 員～12 員の飽和、部分不飽和または完全不飽和の単環または3～12 員の飽和、部分不飽和または完全不飽和の二環式環を形成し、該単環もしくは該二環式環は、0 個～4 個のヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子は、独立して、窒素、酸素または硫黄から選択される；

Z^1 は、N または CH である；

Z^7 は、N または $C-UR^Y$ である；

T および U は、それぞれ独立して、結合または飽和もしくは不飽和の $C_1 \sim 6$ アルキリデン鎖であり、ここで、該鎖の 2 個までのメチレン単位は、必要に応じて、独立して、C、O、 CO_2 、 $COCO$ 、 $CONR$ 、 $OCOR$ 、 $NRNR$ 、 $NRNRCO$ 、 $NRCO$ 、 $NRCO_2$ 、 $NRCOR$ 、 SO 、 SO_2 、 $NRSO_2$ 、 SO_2NR 、 $NRSO_2NR$ 、O、S、または NR で置換されている；

R^X および R^Y は、それぞれ独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、または R' である；

Z^2 、 Z^5 および Z^6 は、それぞれ独立して、N または CH であるが、ただし Z^2 、 Z^5 および Z^6 のうちの 2 個以下が N である；

Z^3 は、 CR^3 である；

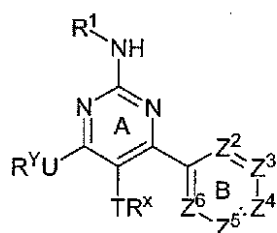
Z^4 は、 CR^4 である；

ここで、 R^3 または R^4 のうちの一方は、 R^U であり、 R^3 または R^4 のうちの他方は、 R^{V1} であり、ここで： R^U は、 $(CH_2)_t CN$ 、 $(CH_2)_t NO_2$ 、 $(CH_2)_t N(R)_2$ 、 $(CH_2)_t NRC(O)R$ 、 $(CH_2)_t CON(R)_2$ 、 $(CH_2)_t COOR$ 、 $(CH_2)_t SO_2 N(R)_2$ 、 $(CH_2)_t NRSO_2 R$ 、 $(CH_2)_t NRCOR$ 、 $(CH_2)_t NRCOR$ 、 $(CH_2)_t NRSO_2 N(R)_2$ 、 $(CH_2)_t COCOR$ 、 $(CH_2)_t Ar^2$ であり、ここで、t は 0、1、または 2 であり、 Ar^2 は、必要に応じて置換された 5～7 員の飽和、部分不飽和または完全不飽和の単環であり、該単環は、0 個～3 個のヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子は、独立して、窒素、酸素または硫黄から選択される；そして、 R^{V1} は、 OR' である、化合物。

【請求項 2】

Z^1 が、N であり、前記化合物が以下の構造 I I：

【化 2】



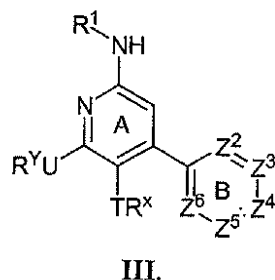
II

を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

Z^1 が、CH であり、前記化合物が以下の構造 I I I：

【化 3】



を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 が、必要に応じて置換されたフェニル、シクロヘキシル、シクロペンチル、ピリジル、ナフチル、モルホリノ、ピペラジニルまたはピペリジニル環である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

R^1 が、フェニル、シクロヘキシル、またはピリジルから選択される必要に応じて置換された基である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

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

【請求項 7】

ZR^Z の各独立の出現例が、ハロゲン、 R' 、 CN 、 NO_2 、 $-N(R)(R')$ 、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-S(O)_2N(R)(R')$ 、 $CO(C_1 \sim 4 \text{ アルキル})$ 、 $NRSO_2R$ 、 $COO(C_1 \sim 4 \text{ アルキル})$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

q が、1 または 2 であり、 ZR^Z の各独立の出現例が、 F 、 Cl 、 Br 、 $COO(C_1 \sim 4 \text{ アルキル})$ 、 $C_1 \sim 4 \text{ アルキル}$ 、 CN 、 NO_2 、 $-NH_2$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim 4 \text{ アルコキシ}$ 、 $-S(O)_2NH_2$ 、または必要に応じて置換されたベンジルオキシ基、フェニルオキシ基、もしくはフェニル基である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

TR^X および UR^Y が、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、 NO_2 、 CN 、 OR 、 SR 、もしくは $N(R)_2$ 、または必要に応じてオキシ、 OR 、 SR 、 $N(R)_2$ 、ハロゲン、 NO_2 、もしくは CN で置換された $C_1 \sim 4$ 脂肪族である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

TR^X 基および UR^Y 基が、それぞれ独立して、水素、 Me 、 OH 、 OMe または $N(R)_2$ である、請求項 1 に記載の化合物。

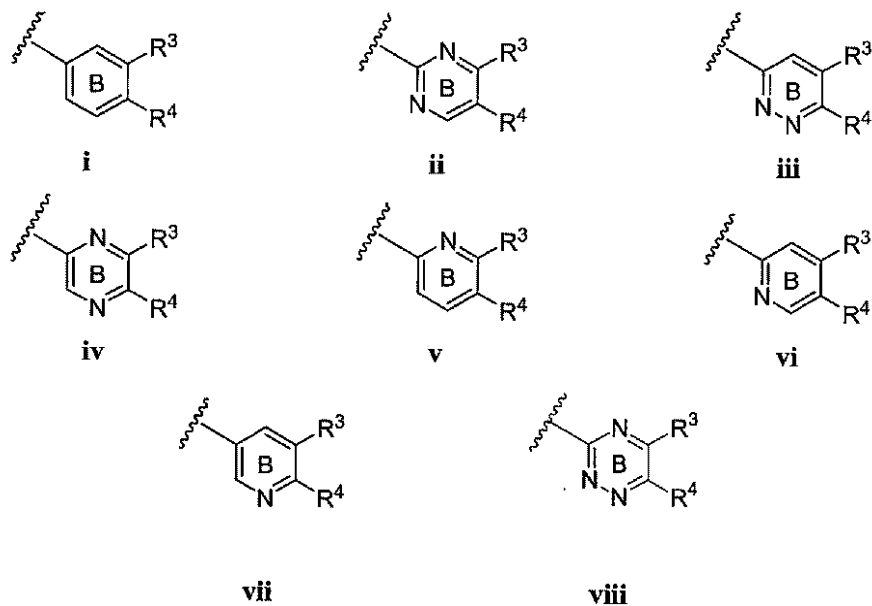
【請求項 11】

$(T)_mR^X$ および $(U)_nR^Y$ が、それぞれ、水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 12】

環 B が、以下の i ~ v i i i :

【化 4】

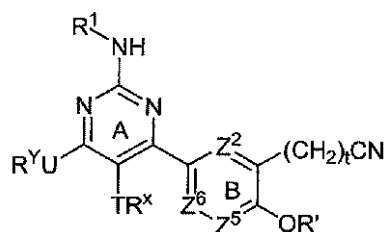


のうちの一つから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

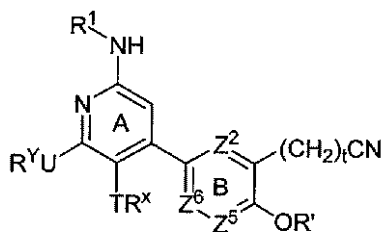
【請求項 1 3】

以下の構造：

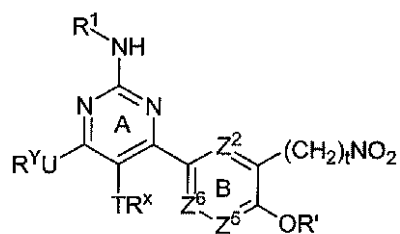
【化 5 - 1】



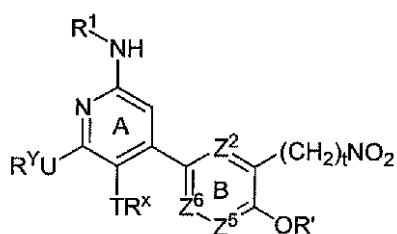
II-A



III-A

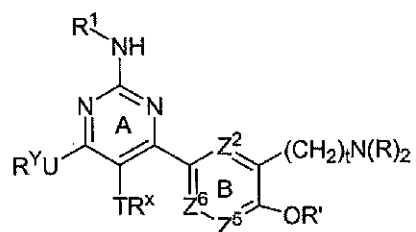
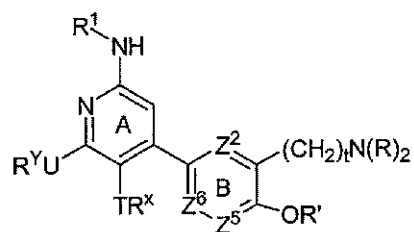
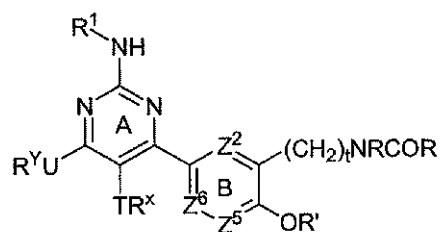
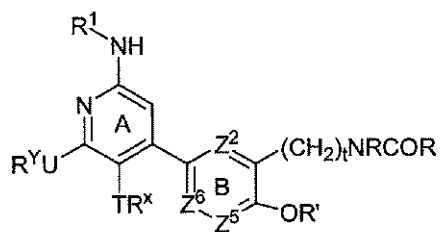
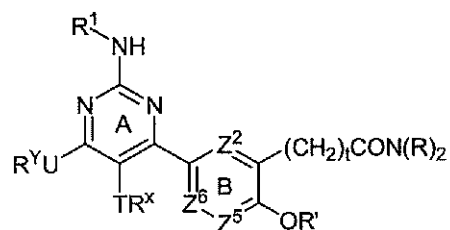
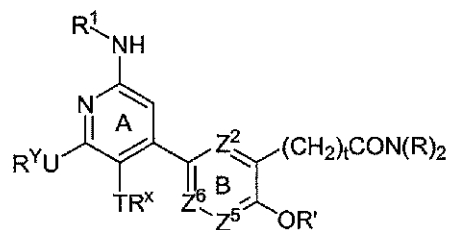
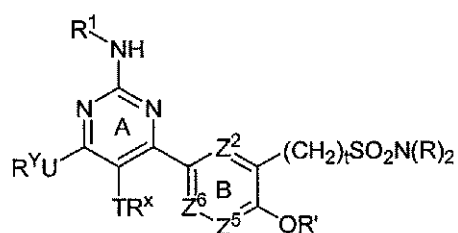
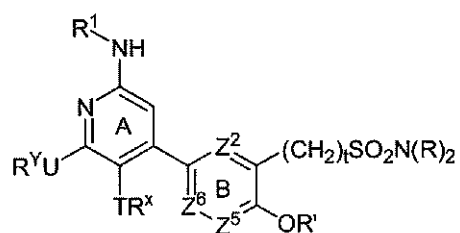
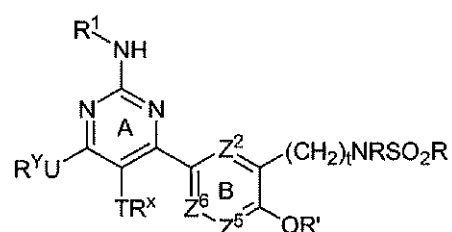
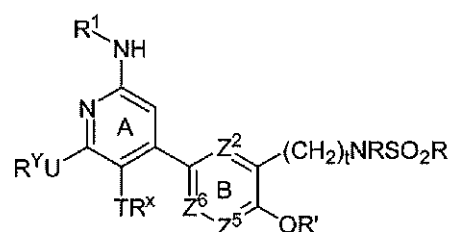


II-B

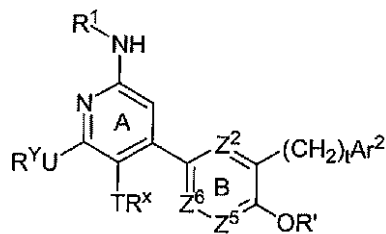
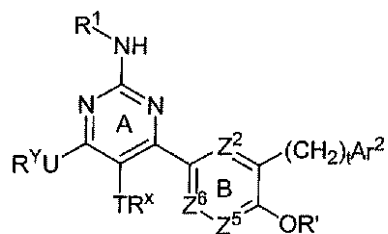
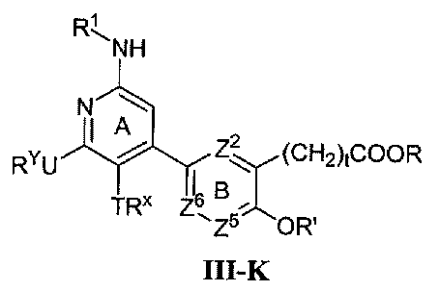
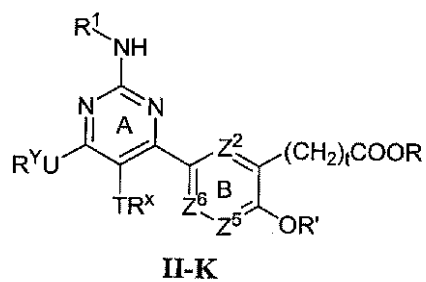
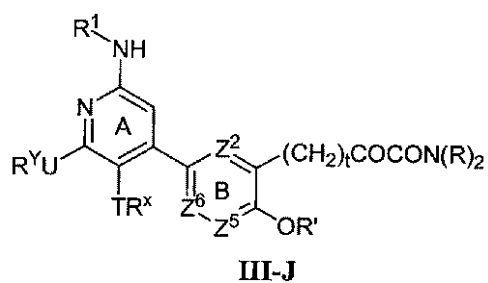
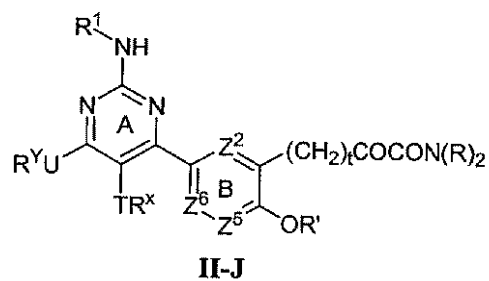
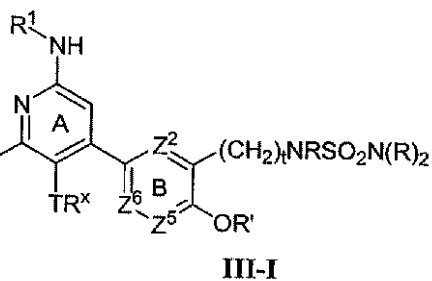
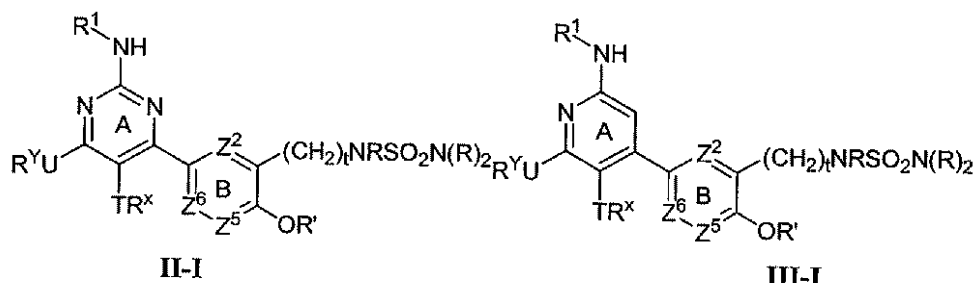
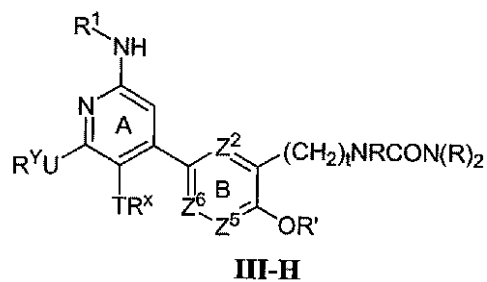
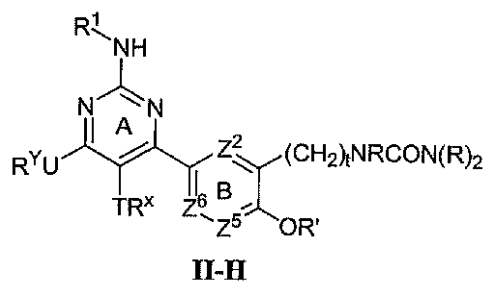


III-B

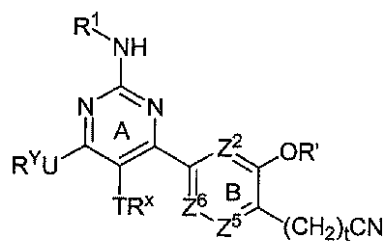
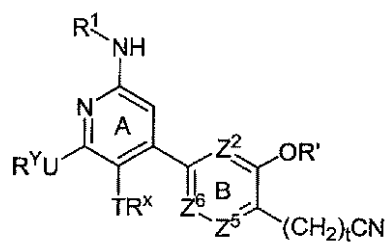
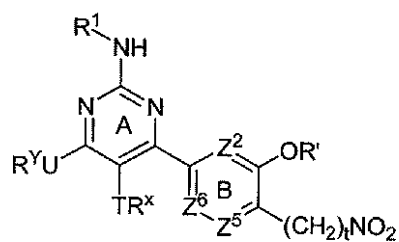
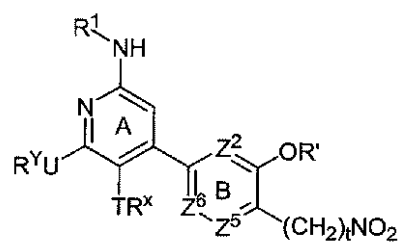
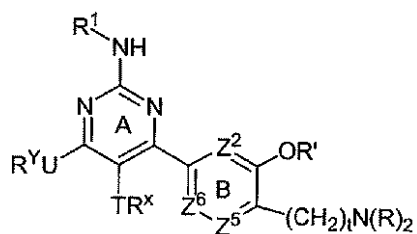
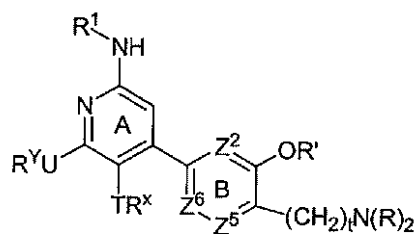
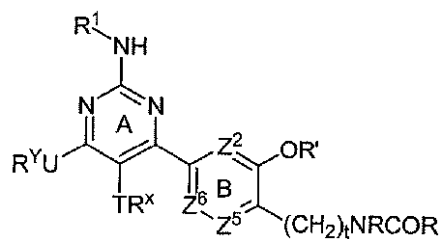
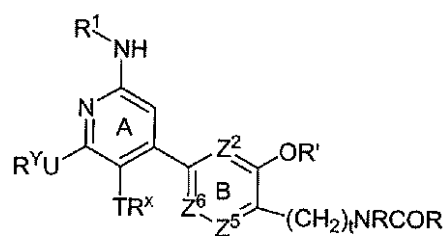
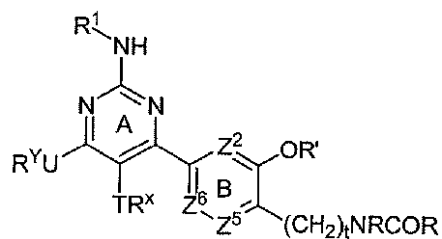
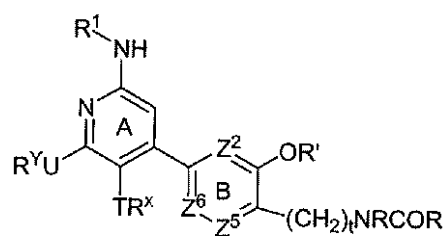
【化 5 - 2】

**II-C****III-C****II-D****III-D****II-E****III-E****II-F****III-F****II-G****III-G**

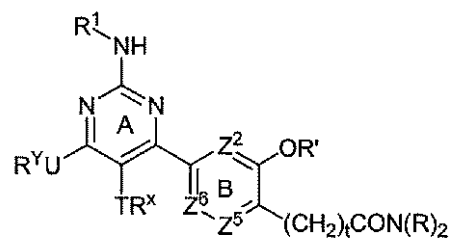
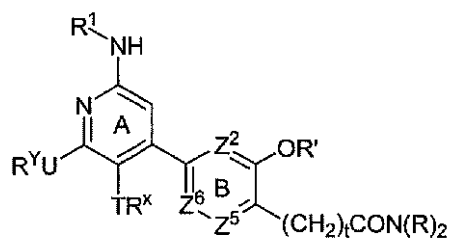
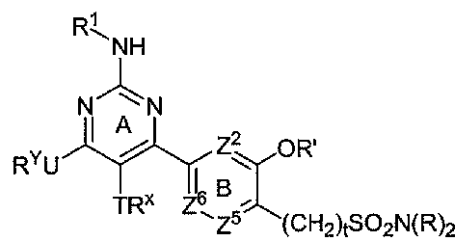
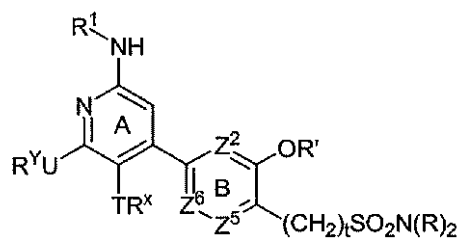
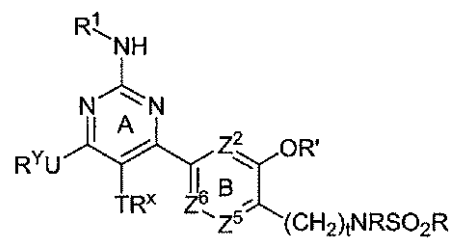
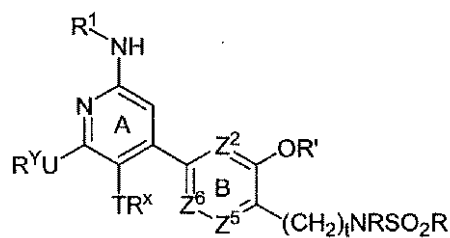
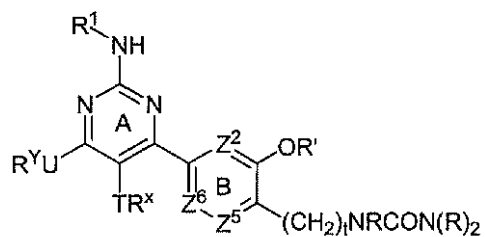
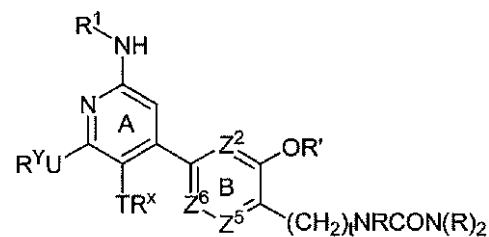
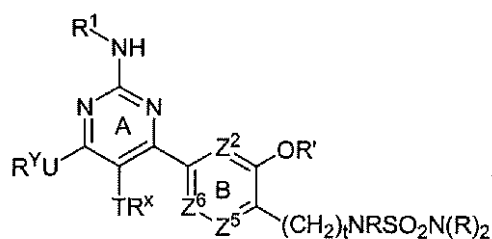
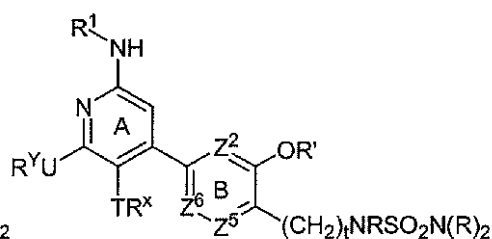
【化 5 - 3】



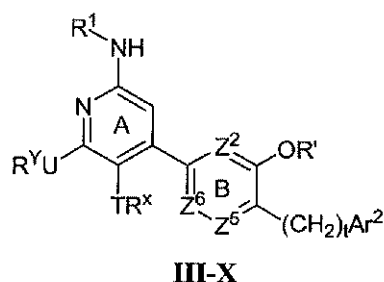
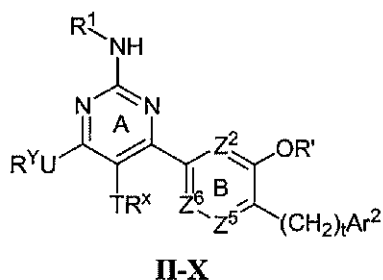
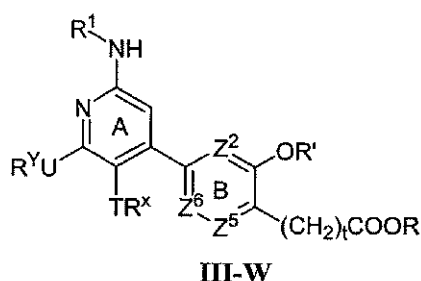
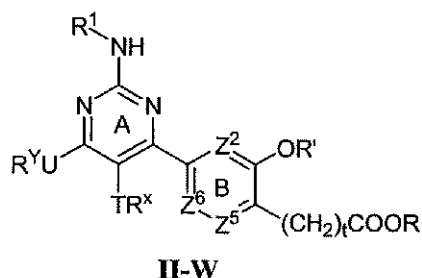
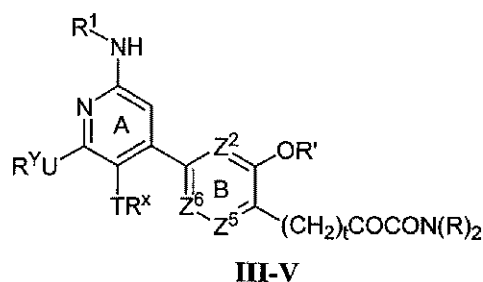
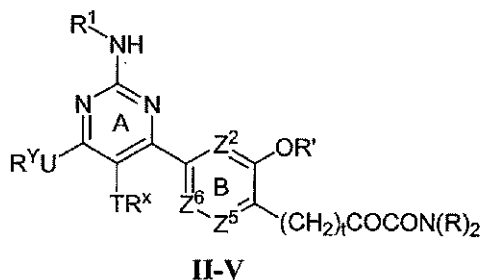
【化 5 - 4】

II-L**III-L****II-M****III-M****II-N****III-N****II-O****III-O****II-P****III-P**

【化 5 - 5】

**II-Q****III-Q****II-R****III-R****II-S****III-S****II-T****III-T****II-U****III-U**

【化 5 - 6】



のうちの一つを有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

請求項 1 3 に記載の化合物であって、ここで化合物変数が、以下の群のうちの一つ以上、またはすべてから選択される：

i) R^1 は、フェニル、シクロヘキシル、シクロペンチル、ピリジル、モルホリノ、ピペラジニルまたはピペリジニルから選択される必要に応じて置換された基から選択される；

i i) R^1 は、フェニル、シクロヘキシル、またはピリジルから選択される必要に応じて置換された基である；

i i i) R^1 は、必要に応じて置換されたフェニルである；

i v) Ar^1 は、5 個までの $Z R^Z$ の出現例で置換されており、 $Z R^Z$ 基は、ハロゲン、 R' 、 CN 、 NO_2 、 $-N(R)(R')$ 、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-S(O)_2N(R)(R')$ 、 $CO(C_1 \sim 4 \text{ アルキル})$ 、 $NRSO_2R'$ 、 $COO(C_1 \sim 4 \text{ アルキル})$ から選択される；

v) q は、1 であり、 $Z R^Z$ は、 F 、 Cl 、 Br 、 $COO(C_1 \sim 4 \text{ アルキル})$ 、 $C_1 \sim 4 \text{ アルキル}$ 、 CN 、 NO_2 、 $-NH_2$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim 4 \text{ アルコキシ}$ 、 $-S(O)_2NH_2$ 、または必要に応じて置換されたベンジルオキシ基、フェニルオキシ基、もしくはフェニル基である；

v i) q は、1 であり、 $Z R^Z$ は、メタ位またはパラ位にあり、そして $Z R^Z$ は、 F 、 Cl 、 Br 、ベンジルオキシ、フェニル、フェニルオキシ、 $COO(C_1 \sim 4 \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim 4 \text{ アルコキシ}$ 、または $-S(O)_2NH_2$ である；

v i i) TR^X および UR^Y は、水素、ハロゲン、 NO_2 、 CN 、 OR 、 SR もしくは

$N(R)_2$ 、または必要に応じてオキソ、OR、SR、 $N(R)_2$ 、ハロゲン、 NO_2 もしくはCNで置換された $C_1 \sim 4$ 脂肪族から選択される；

v i i i) TR^X 基および UR^Y 基は、水素、Me、OH、OMeまたは $N(R)_2$ から選択される；

i x) TR^X および UR^Y は、それぞれ、水素である；

x) Z^2 および Z^6 は、それぞれ、CHである；

x i) t は、0である；

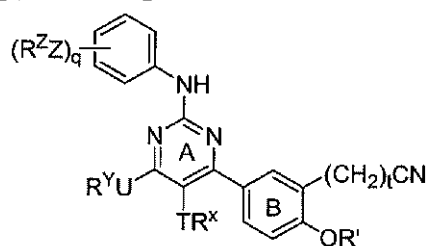
x i i) t は、1である；ならびに

x i i i) Ar^2 は、必要に応じて置換されたテトラゾール基、トリアゾール基、オキサゾール基、チアゾール基、チアジアゾール基、オキサジアゾール基またはピリジル基である、化合物。

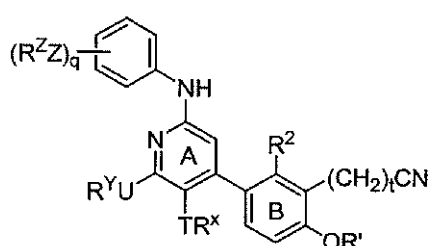
【請求項15】

以下の構造：

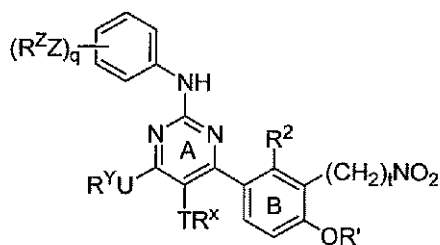
【化6-1】



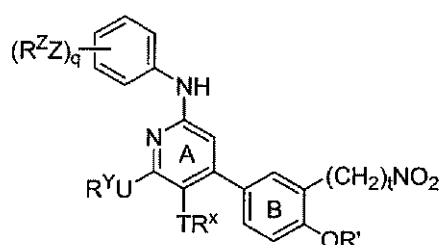
II-A-(i)



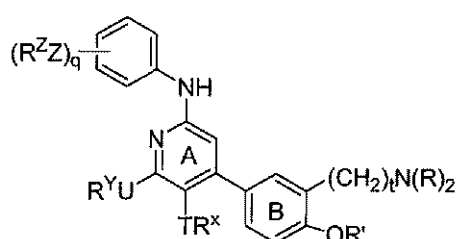
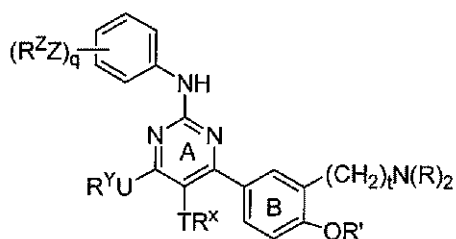
III-A-(i)



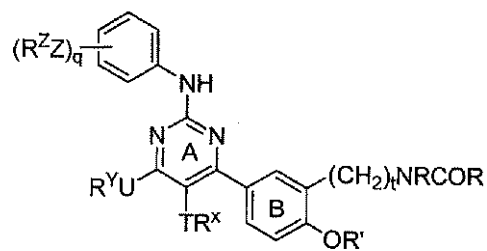
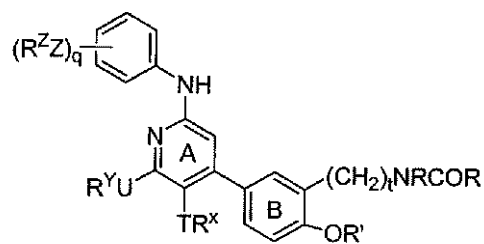
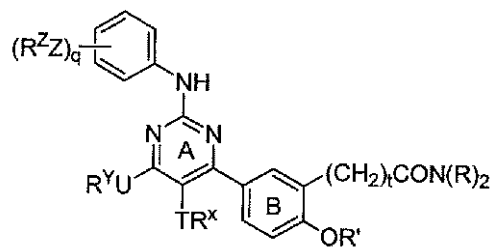
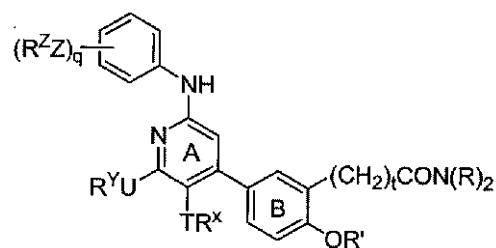
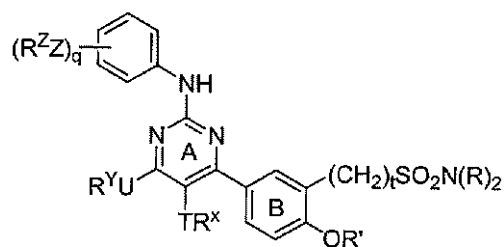
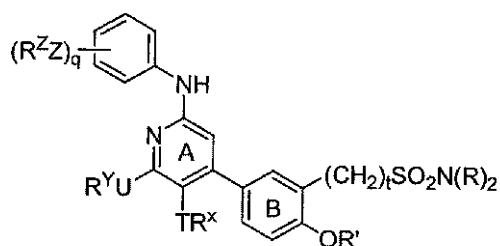
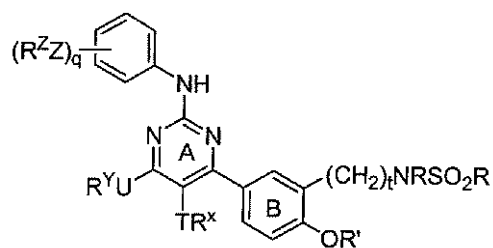
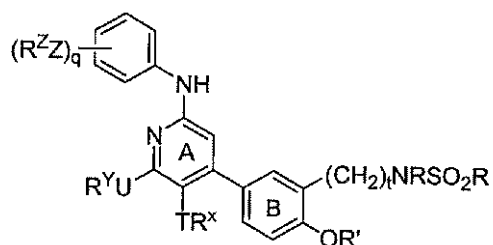
II-B-(i)



III-B-(i)

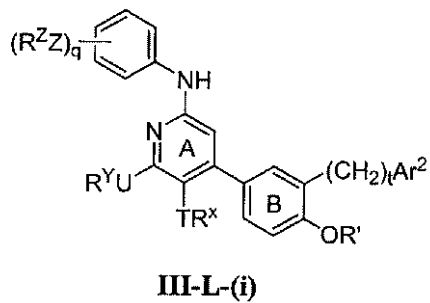
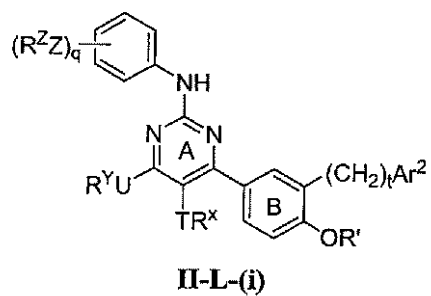
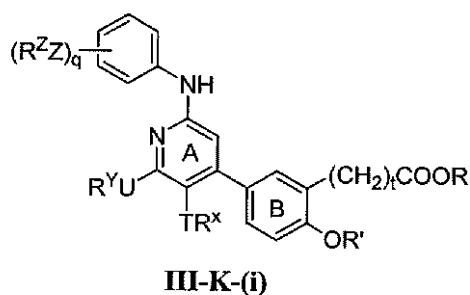
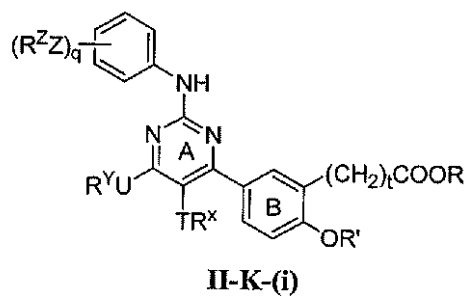
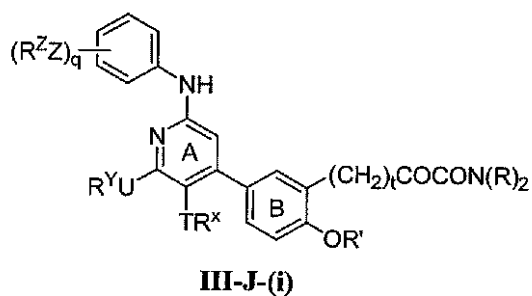
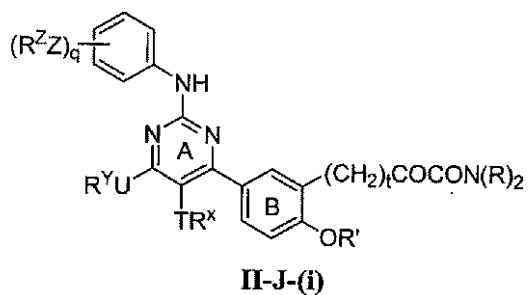
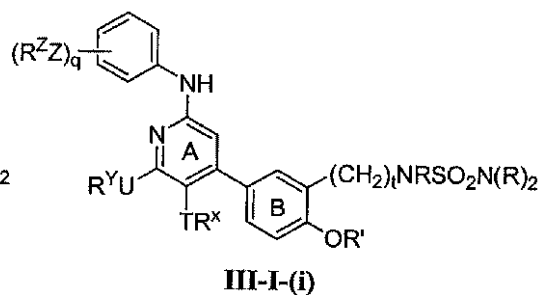
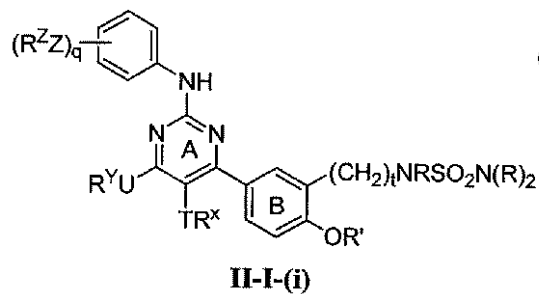
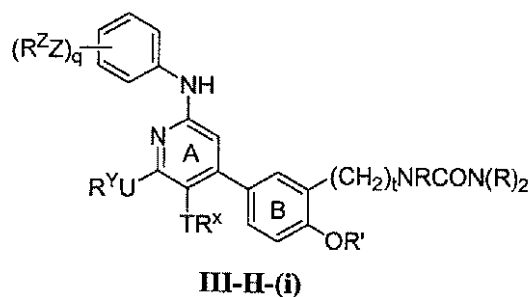


【化 6 - 2】

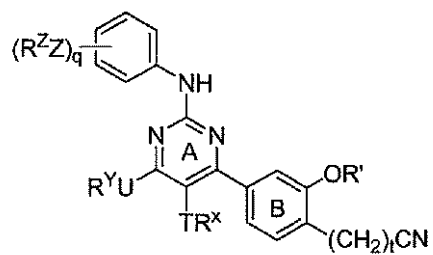
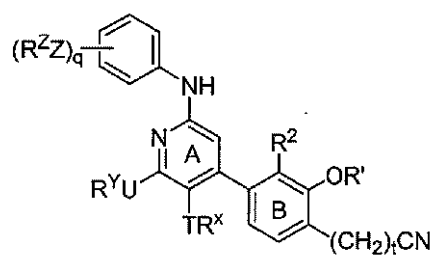
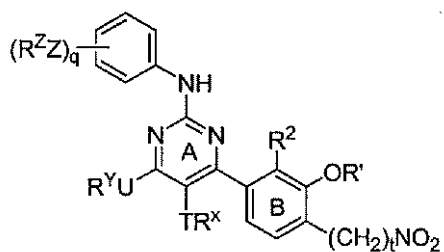
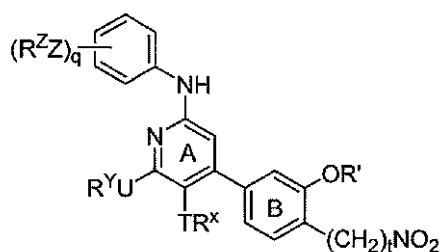
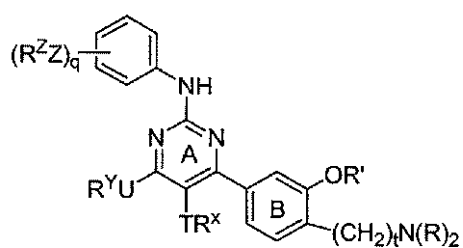
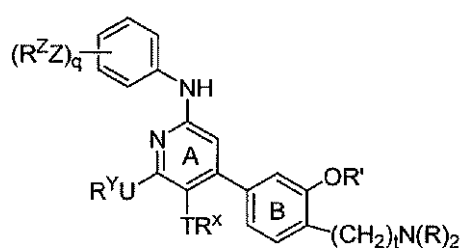
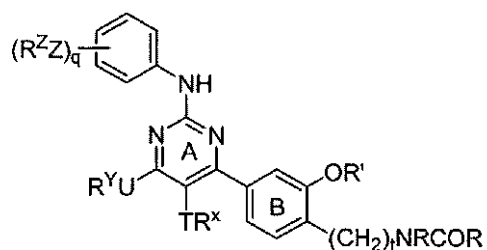
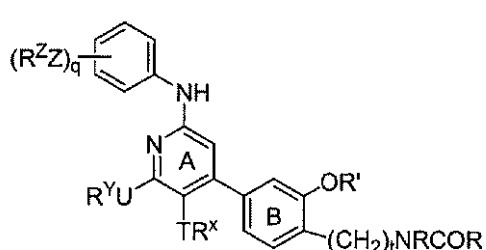
II-C-(i)**II-D-(i)****III-C-(i)****III-D-(i)****II-E-(i)****III-E-(i)****II-F-(i)****III-F-(i)****II-G-(i)****III-G-(i)**

$$\begin{array}{c}
 (R^Z Z)_q - \text{C}_6\text{H}_4 - \text{NH} \\
 | \\
 \text{N} \quad \text{N} \\
 \diagup \quad \diagdown \\
 \text{A} \\
 | \quad | \\
 R^Y U \quad \text{TR}^X \\
 | \\
 \text{C} \quad \text{C} \\
 \diagup \quad \diagdown \\
 \text{B} \\
 | \quad | \\
 (\text{CH}_2)_t \text{NRCON}(\text{R})_2 \quad \text{OR}'
 \end{array}$$

II-H-(i)



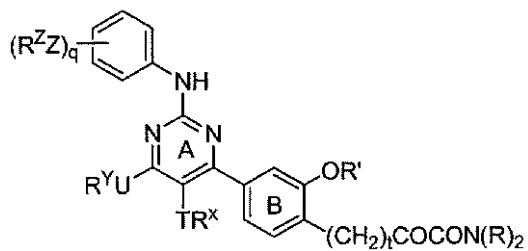
【化 6 - 4】

**II-M-(i)****III-M-(i)****II-N-(i)****III-N-(i)****II-O-(i)****III-O-(i)****II-P-(i)****III-P-(i)**

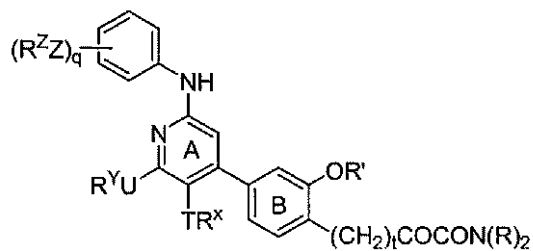
c1ccc(Nc2nc(R^YU)c(TR^X)c(c2-c3ccc(OR')cc3CC(=O)N(R)^R)c4ccccc4)cc1*c1ccc(Nc2nc(R^YU)c(TR^X)c(c2-c3ccc(OR')cc3C(=O)N(R)^2)cc1*c1ccc(Nc2nc(R^YU)c(TR^X)c(c2-c3ccc(OR')cc3C(C)(C)S(=O)(=O)N(R)R)nc2-c4ccc(NC5=CC=C(C=C5)C6=CC=CC=C6C7=CC=CC=C7C8=CC=CC=C8C9=CC=CC=C9C10=CC=CC=C10C11=CC=CC=C11C12=CC=CC=C12C13=CC=CC=C13C14=CC=CC=C14C15=CC=CC=C15C16=CC=CC=C16C17=CC=CC=C17C18=CC=CC=C18C19=CC=CC=C19C20=CC=CC=C20C21=CC=CC=C21C22=CC=CC=C22C23=CC=CC=C23C24=CC=CC=C24C25=CC=CC=C25C26=CC=CC=C26C27=CC=CC=C27C28=CC=CC=C28C29=CC=CC=C29C30=CC=CC=C30C31=CC=CC=C31C32=CC=CC=C32C33=CC=CC=C33C34=CC=CC=C34C35=CC=CC=C35C36=CC=CC=C36C37=CC=CC=C37C38=CC=CC=C38C39=CC=CC=C39C40=CC=CC=C40C41=CC=CC=C41C42=CC=CC=C42C43=CC=CC=C43C44=CC=CC=C44C45=CC=CC=C45C46=CC=CC=C46C47=CC=CC=C47C48=CC=CC=C48C49=CC=CC=C49C50=CC=CC=C50C51=CC=CC=C51C52=CC=CC=C52C53=CC=CC=C53C54=CC=CC=C54C55=CC=CC=C55C56=CC=CC=C56C57=CC=CC=C57C58=CC=CC=C58C59=CC=CC=C59C60=CC=CC=C60C61=CC=CC=C61C62=CC=CC=C62C63=CC=CC=C63C64=CC=CC=C64C65=CC=CC=C65C66=CC=CC=C66C67=CC=CC=C67C68=CC=CC=C68C69=CC=CC=C69C70=CC=CC=C70C71=CC=CC=C71C72=CC=CC=C72C73=CC=CC=C73C74=CC=CC=C74C75=CC=CC=C75C76=CC=CC=C76C77=CC=CC=C77C78=CC=CC=C78C79=CC=CC=C79C80=CC=CC=C80C81=CC=CC=C81C82=CC=CC=C82C83=CC=CC=C83C84=CC=CC=C84C85=CC=CC=C85C86=CC=CC=C86C87=CC=CC=C87C88=CC=CC=C88C89=CC=CC=C89C90=CC=CC=C90C91=CC=CC=C91C92=CC=CC=C92C93=CC=CC=C93C94=CC=CC=C94C95=CC=CC=C95C96=CC=CC=C96C97=CC=CC=C97C98=CC=CC=C98C99=CC=CC=C99C100=CC=CC=C100C101=CC=CC=C101C102=CC=CC=C102C103=CC=CC=C103C104=CC=CC=C104C105=CC=CC=C105C106=CC=CC=C106C107=CC=CC=C107C108=CC=CC=C108C109=CC=CC=C109C110=CC=CC=C110C111=CC=CC=C111C112=CC=CC=C112C113=CC=CC=C113C114=CC=CC=C114C115=CC=CC=C115C116=CC=CC=C116C117=CC=CC=C117C118=CC=CC=C118C119=CC=CC=C119C120=CC=CC=C120C121=CC=CC=C121C122=CC=CC=C122C123=CC=CC=C123C124=CC=CC=C124C125=CC=CC=C125C126=CC=CC=C126C127=CC=CC=C127C128=CC=CC=C128C129=CC=CC=C129C130=CC=CC=C130C131=CC=CC=C131C132=CC=CC=C132C133=CC=CC=C133C134=CC=CC=C134C135=CC=CC=C135C136=CC=CC=C136C137=CC=CC=C137C138=CC=CC=C138C139=CC=CC=C139C140=CC=CC=C140C141=CC=CC=C141C142=CC=CC=C142C143=CC=CC=C143C144=CC=CC=C144C145=CC=CC=C145C146=CC=CC=C146C147=CC=CC=C147C148=CC=CC=C148C149=CC=CC=C149C150=CC=CC=C150C151=CC=CC=C151C152=CC=CC=C152C153=CC=CC=C153C154=CC=CC=C154C155=CC=CC=C155C156=CC=CC=C156C157=CC=CC=C157C158=CC=CC=C158C159=CC=CC=C159C160=CC=CC=C160C161=CC=CC=C161C162=CC=CC=C162C163=CC=CC=C163C164=CC=CC=C164C165=CC=CC=C165C166=CC=CC=C166C167=CC=CC=C167C168=CC=CC=C168C169=CC=CC=C169C170=CC=CC=C170C171=CC=CC=C171C172=CC=CC=C172C173=CC=CC=C173C174=CC=CC=C174C175=CC=CC=C175C176=CC=CC=C176C177=CC=CC=C177C178=CC=CC=C178C179=CC=CC=C179C180=CC=CC=C180C181=CC=CC=C181C182=CC=CC=C182C183=CC=CC=C183C184=CC=CC=C184C185=CC=CC=C185C186=CC=CC=C186C187=CC=CC=C187C188=CC=CC=C188C189=CC=CC=C189C190=CC=CC=C190C191=CC=CC=C191C192=CC=CC=C192C193=CC=CC=C193C194=CC=CC=C194C195=CC=CC=C195C196=CC=CC=C196C197=CC=CC=C197C198=CC=CC=C198C199=CC=CC=C199C200=CC=CC=C200C201=CC=CC=C201C202=CC=CC=C202C203=CC=CC=C203C204=CC=CC=C204C205=CC=CC=C205C206=CC=CC=C206C207=CC=CC=C207C208=CC=CC=C208C209=CC=CC=C209C210=CC=CC=C210C211=CC=CC=C211C212=CC=CC=C212C213=CC=CC=C213C214=CC=CC=C214C215=CC=CC=C215C216=CC=CC=C216C217=CC=CC=C217C218=CC=CC=C218C219=CC=CC=C219C220=CC=CC=C220C221=CC=CC=C221C222=CC=CC=C222C223=CC=CC=C223C224=CC=CC=C224C225=CC=CC=C225C226=CC=CC=C226C227=CC=CC=C227C228=CC=CC=C228C229=CC=CC=C229C230=CC=CC=C230C231=CC=CC=C231C232=CC=CC=C232C233=CC=CC=C233C234=CC=CC=C234C235=CC=CC=C235C236=CC=CC=C236C237=CC=CC=C237C238=CC=CC=C238C239=CC=CC=C239C240=CC=CC=C240C241=CC=CC=C241C242=CC=CC=C242C243=CC=CC=C243C244=CC=CC=C244C245=CC=CC=C245C246=CC=CC=C246C247=CC=CC=C247C248=CC=CC=C248C249=CC=CC=C249C250=CC=CC=C250C251=CC=CC=C251C252=CC=CC=C252C253=CC=CC=C253C254=CC=CC=C254C255=CC=CC=C255C256=CC=CC=C256C257=CC=CC=C257C258=CC=CC=C258C259=CC=CC=C259C260=CC=CC=C260C261=CC=CC=C261C262=CC=CC=C262C263=CC=CC=C263C264=CC=CC=C264C265=CC=CC=C265C266=CC=CC=C266C267=CC=CC=C267C268=CC=CC=C268C269=CC=CC=C269C270=CC=CC=C270C271=CC=CC=C271C272=CC=CC=C272C273=CC=CC=C273C274=CC=CC=C274C275=CC=CC=C275C276=CC=CC=C276C277=CC=CC=C277C278=CC=CC=C278C279=CC=CC=C279C280=CC=CC=C280C281=CC=CC=C281C282=CC=CC=C282C283=CC=CC=C283C284=CC=CC=C284C285=CC=CC=C285C286=CC=CC=C286C287=CC=CC=C287C288=CC=CC=C288C289=CC=CC=C289C290=CC=CC=C290C291=CC=CC=C291C292=CC=CC=C292C293=CC=CC=C293C294=CC=CC=C294C295=CC=CC=C295C296=CC=CC=C296C297=CC=CC=C297C298=CC=CC=C298C299=CC=CC=C299C300=CC=CC=C300C301=CC=CC=C301C302=CC=CC=C302C303=CC=CC=C303C304=CC=CC=C304C305=CC=CC=C305C306=CC=CC=C306C307=CC=CC=C307C308=CC=CC=C308C309=CC=CC=C309C310=CC=CC=C310C311=CC=CC=C311C312=CC=CC=C312C313=CC=CC=C313C314=CC=CC=C314C315=CC=CC=C315C316=CC=CC=C316C317=CC=CC=C317C318=CC=CC=C318C319=CC=CC=C319C320=CC=CC=C320C321=CC=CC=C321C322=CC=CC=C322C323=CC=CC=C323C324=CC=CC=C324C325=CC=CC=C325C326=CC=CC=C326C327=CC=CC=C327C328=CC=CC=C328C329=CC=CC=C329C330=CC=CC=C330C331=CC=CC=C331C332=CC=CC=C332C333=CC=CC=C333C334=CC=CC=C334C335=CC=CC=C335C336=CC=CC=C336C337=CC=CC=C337C338=CC=CC=C338C339=CC=CC=C339C340=CC=CC=C340C341=CC=CC=C341C342=CC=CC=C342C343=CC=CC=C343C344=CC=CC=C344C345=CC=CC=C345C346=CC=CC=C346C347=CC=CC=C347C348=CC=CC=C348C349=CC=CC=C349C350=CC=CC=C350C351=CC=CC=C351C352=CC=CC=C352C353=CC=CC=C353C354=CC=CC=C354C355=CC=CC=C355C356=CC=CC=C356C357=CC=CC=C357C358=CC*c1ccc(Nc2nc(R^YU)c(TR^X)c(c2-c3ccc(OR')cc3CCS(=O)(=O)N(R)^2)cc1*c1ccc(Nc2nc(R^YU)c(TR^X)c(c2-c3ccc(OR')cc3CNC(=O)R)nc2*)cc1*c1ccc(Nc2nc(RYU)c(trX)c(c2-c3ccc(OR')cc3CNC(=O)R)cc1RZZ*c1ccc(Nc2nc(R^YU)c(TR^X)c(c2-c3ccc(OR')cc3CNC(=O)R^2)nc2)cc1R^Z*c1ccc(Nc2nc(R^YU)c(TR^X)c(c2-c3ccc(OR')cc3CNRCON(R)^2)cc1*c1ccc(Nc2nc(*)c(*)c(c2-c3ccc(OR')cc3C4N(R)RS(=O)(=O)N(R)R)nc2*)cc1*c1ccc(Nc2nc(R^YU)c(TR^X)c(c2-c3ccc(OR')cc3CCN(R)S(=O)(=O)N(R)R)cc1

【化 6 - 6】

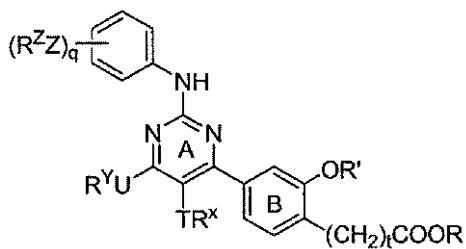
II-U-(i)



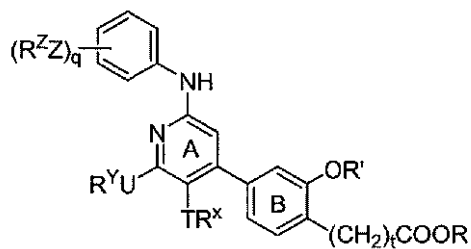
III-U-(i)



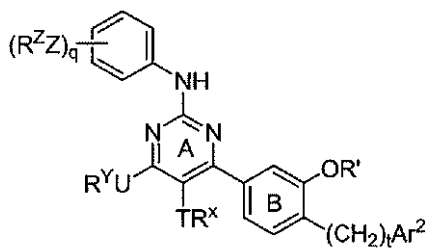
II-V-(i)



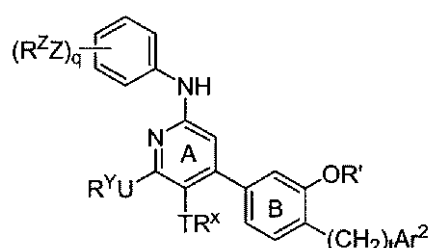
III-V-(i)



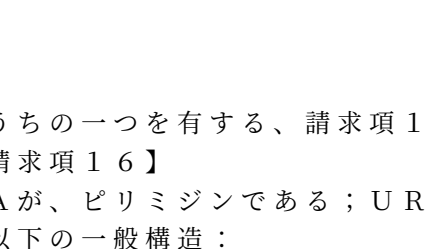
II-W-(i)



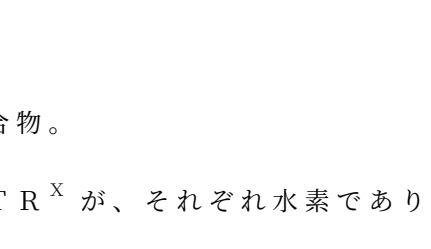
III-W-(i)



II-X-(i)



III-X-(i)

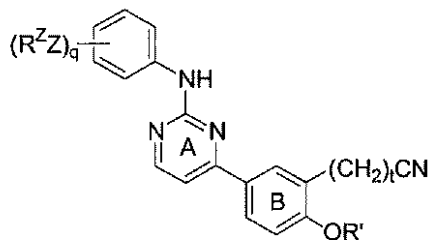


のうちの一つを有する、請求項 1 に記載の化合物。

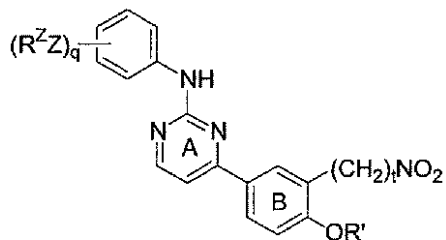
【請求項 16】

環 A が、ピリミジンである； $U R^Y$ 、および $T R^X$ が、それぞれ水素であり、前記化合物が以下の一般構造：

【化 7 - 1】

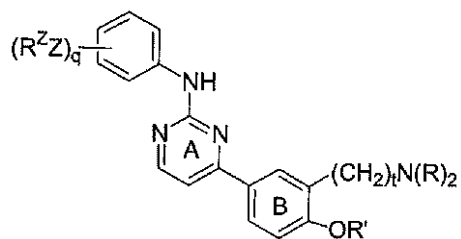
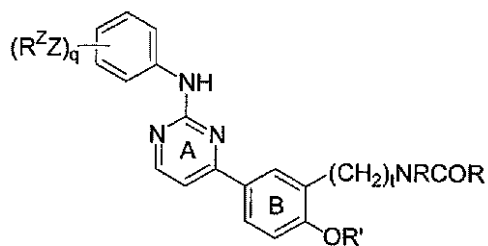
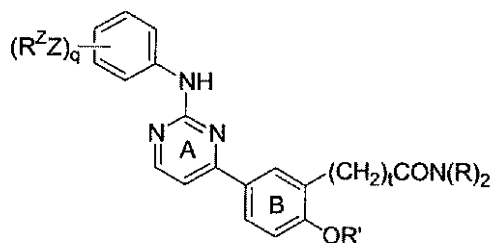
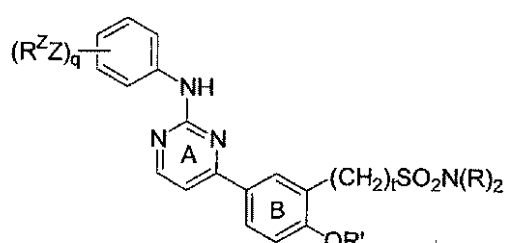
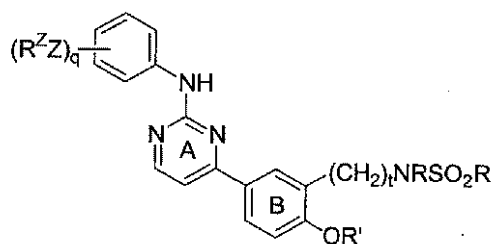
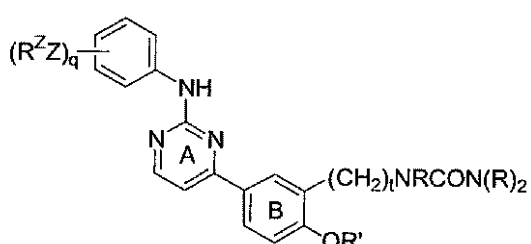
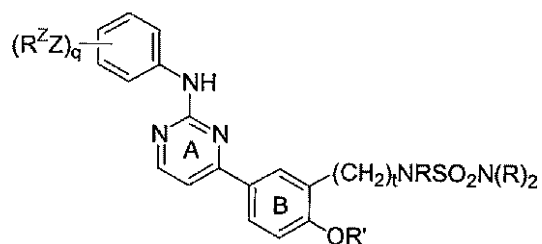
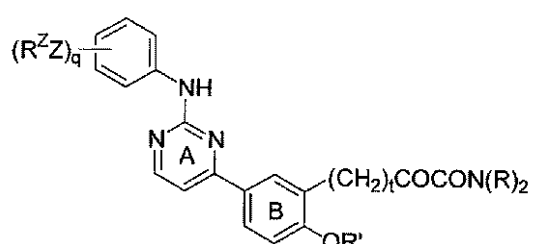
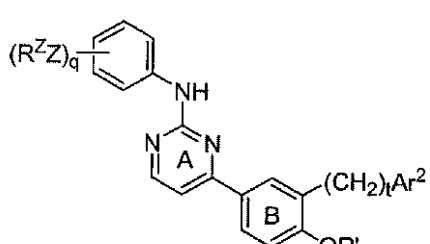
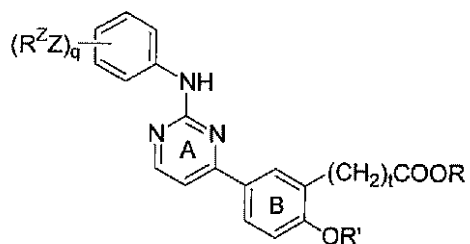


II-A-(i)-a

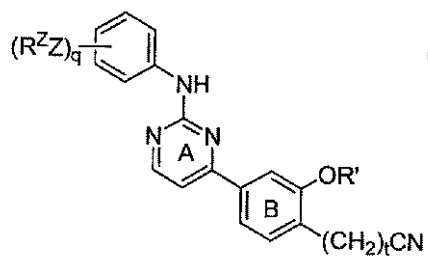
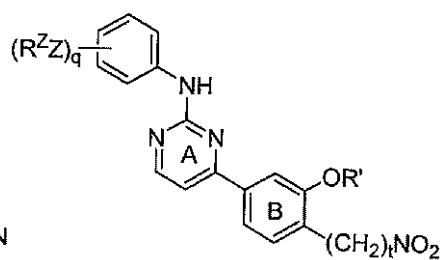
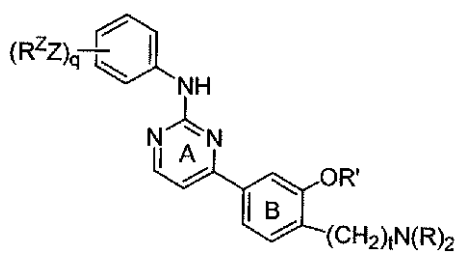
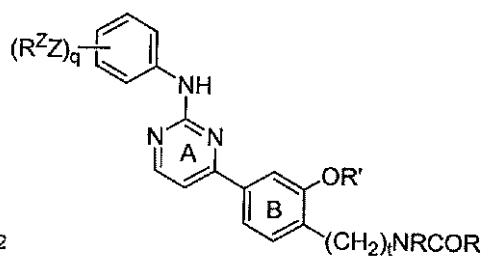
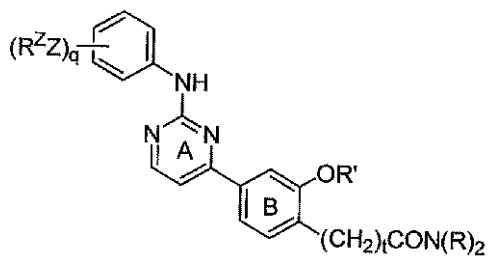
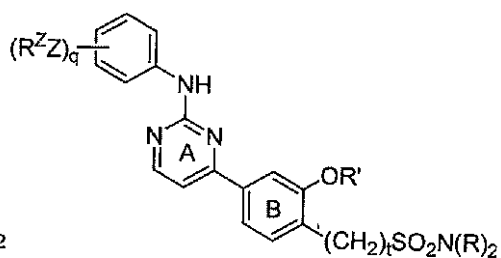
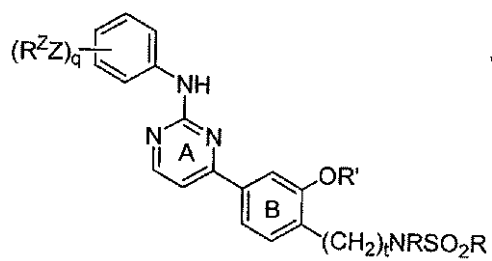
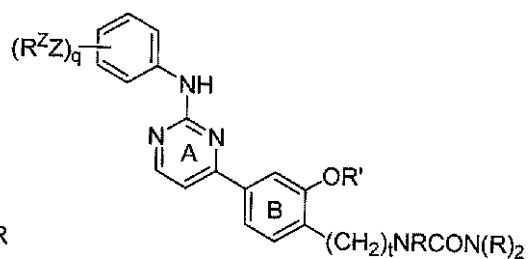


II-B-(i)-a

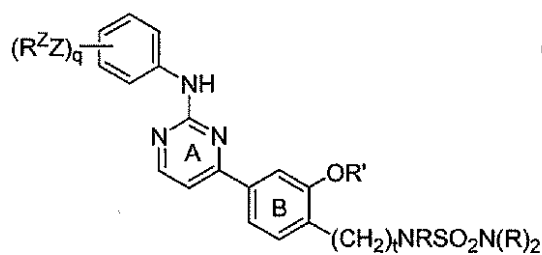
【化 7 - 2】

**II-C(i)-a****II-D(i)-a****II-E(i)-a****II-F(i)-a****II-G(i)-a****II-H(i)-a****II-I(i)-a****II-J(i)-a**

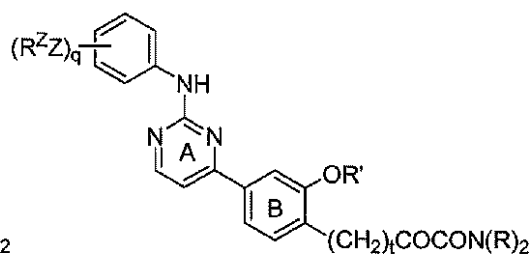
【化 7 - 3】

II-K(i)-a**II-L(i)-a****II-M(i)-a****II-N(i)-a****II-O(i)-a****II-P(i)-a****II-Q(i)-a****II-R(i)-a****II-S(i)-a****II-T(i)-a**

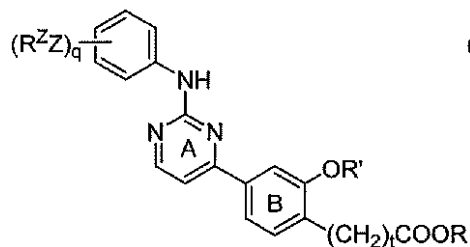
【化 7 - 4】



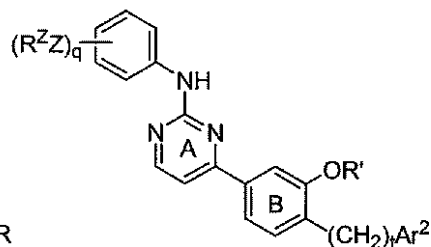
II-U-(i)-a



II-V-(i)-a



II-W-(i)-a



II-X-(i)-a.

を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 17】

請求項 16 に記載の化合物であって、ここで：

a. q は 0、1、または 2 であり、 ZR^Z は、ハロゲン、 R' 、 CN 、 NO_2 、 $-N(R)(R')$ 、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-S(O)_2N(R)(R')$ 、 $CO(C_1 \sim 4 \text{ アルキル})$ 、 $-NRSO_2R'$ 、 $COO(C_1 \sim 4 \text{ アルキル})$ である；

b. t は、0 である；

c. R は、必要に応じて置換された $C_1 \sim 6$ アルキルまたは水素である；そして

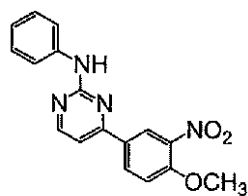
d. R' は、必要に応じて置換された $C_1 \sim 6$ アルキルまたは水素である、

化合物。

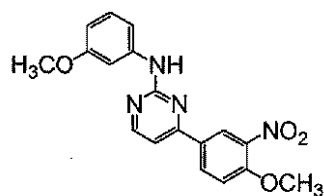
【請求項 18】

請求項 1 に記載の化合物であって、該化合物が、以下の構造：

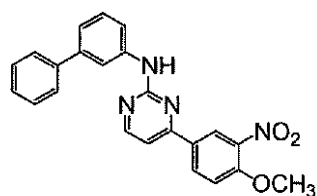
【化 8 - 1】



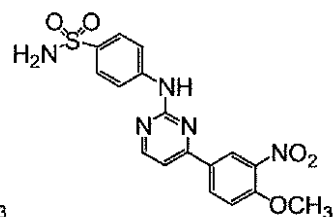
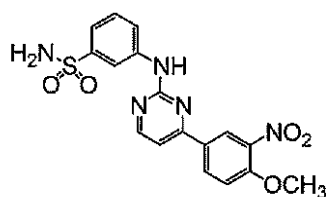
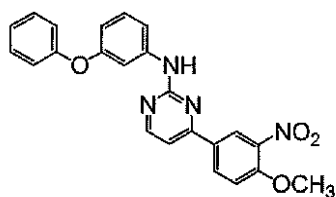
II-1



II-2

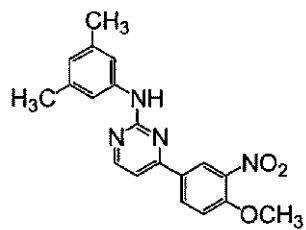


II-3

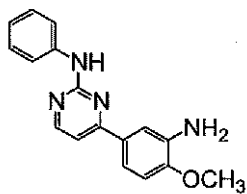


【化 8 - 2】

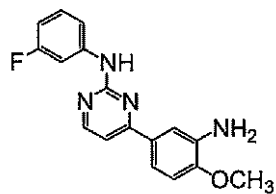
II-4



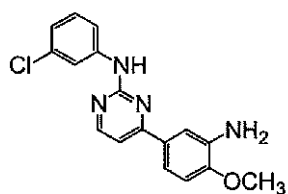
II-5



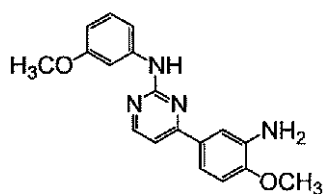
II-6



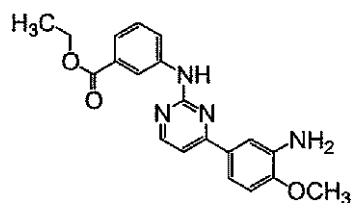
II-7



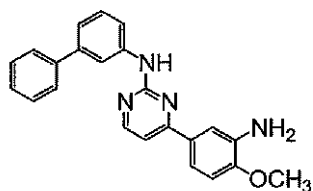
II-8



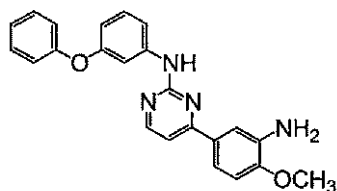
II-9



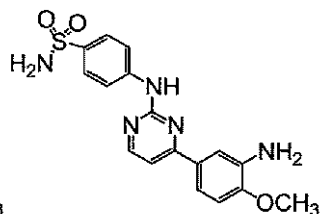
II-10



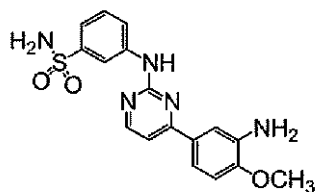
II-11



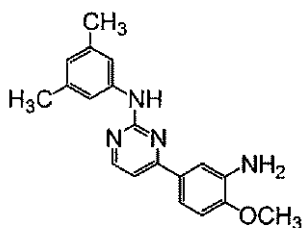
II-12



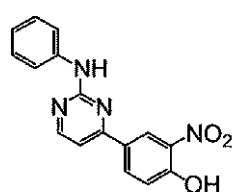
II-13



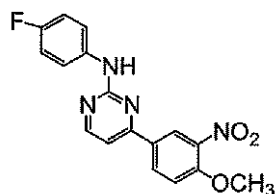
II-14



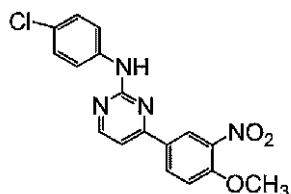
II-15



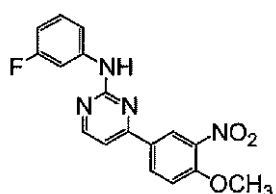
II-16



II-17

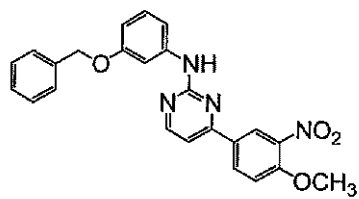


II-18

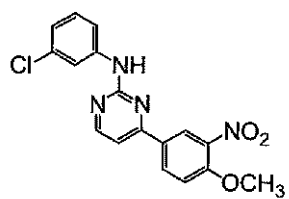


【化 8 - 3】

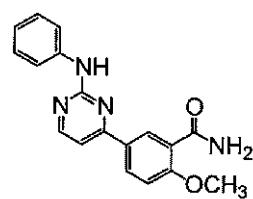
II-19



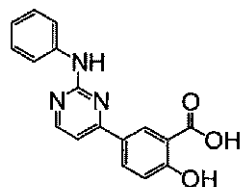
II-20



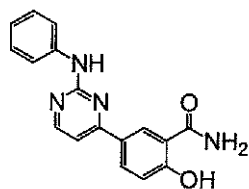
II-21



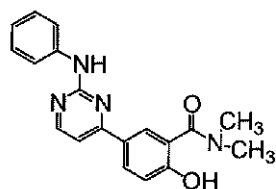
II-22



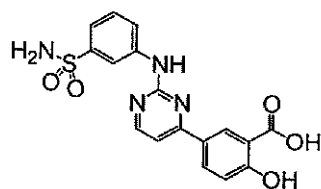
II-23



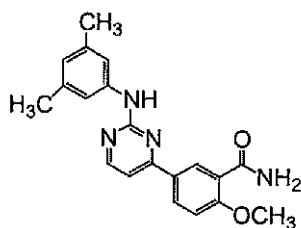
II-24



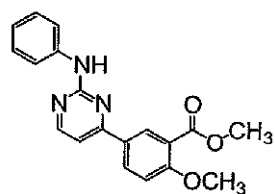
II-25



II-26



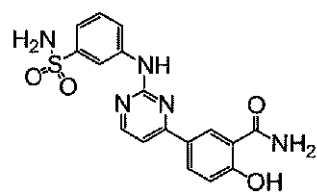
II-27



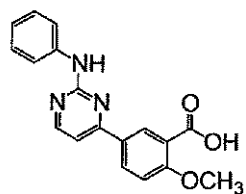
II-28

II-29

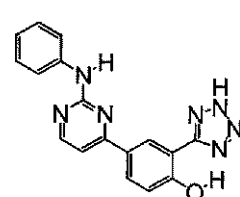
II-30



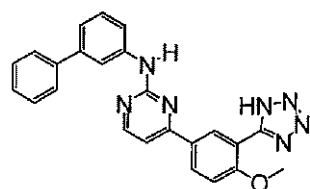
II-31



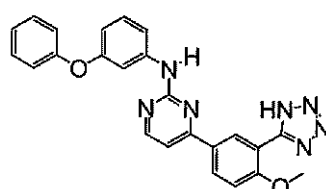
II-32



II-33

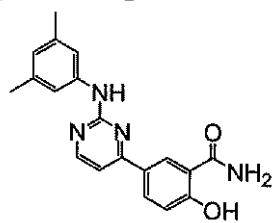


II-34

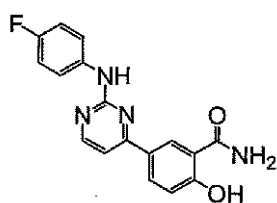


II-35

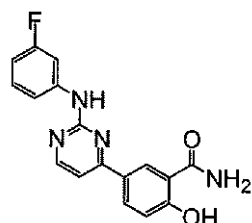
【化 8 - 4】



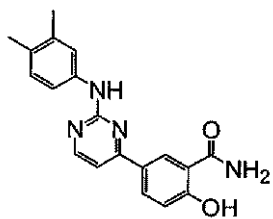
II-36



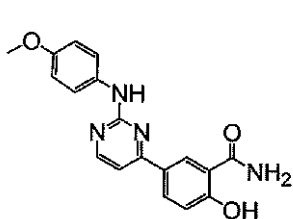
II-37



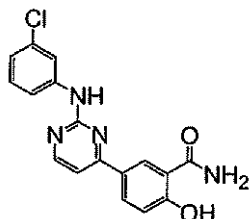
II-38



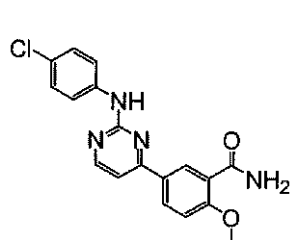
II-39



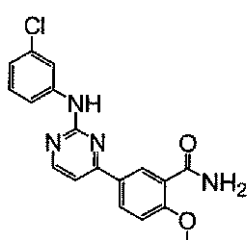
II-40



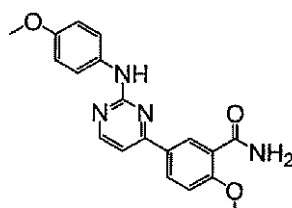
II-41



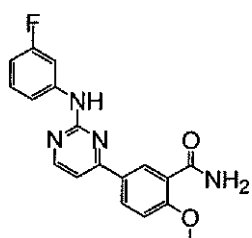
II-42



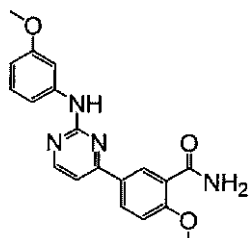
II-43



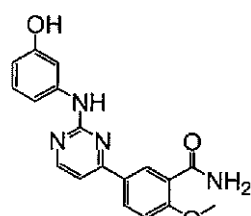
II-44



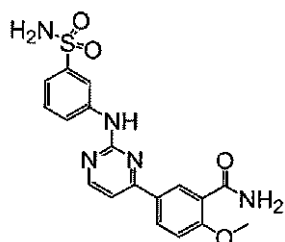
II-45



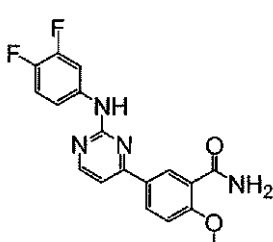
II-46



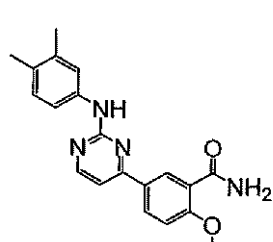
II-47



II-48

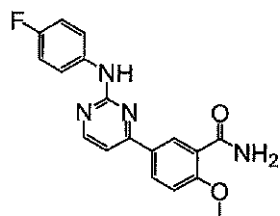


II-49

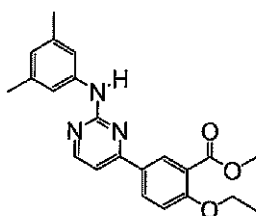


II-50

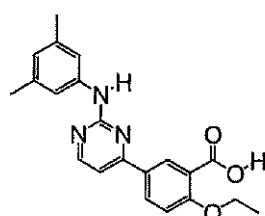
【化 8 - 5】



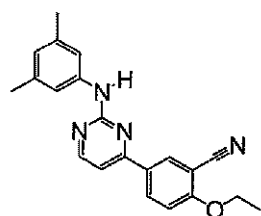
II-51



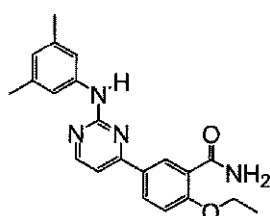
II-52



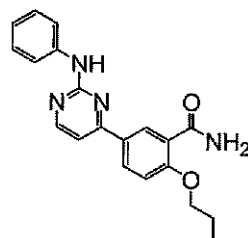
II-53



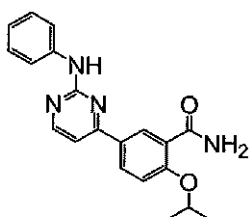
II-54



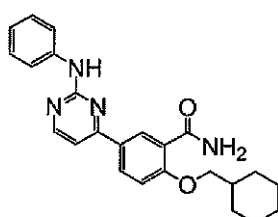
II-55



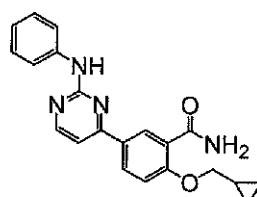
II-56



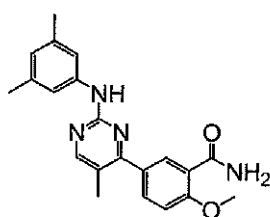
II-57



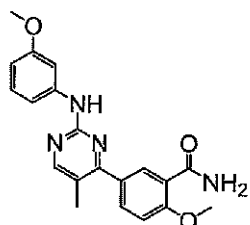
II-58



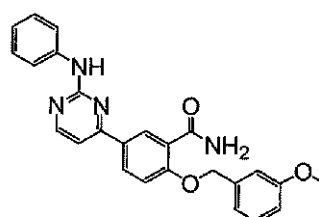
II-59



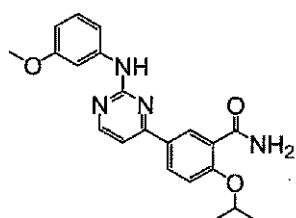
II-60



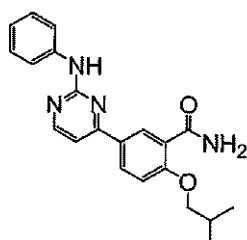
II-61



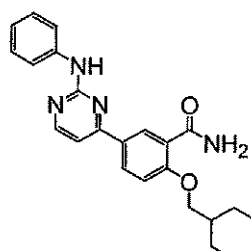
II-62



II-63

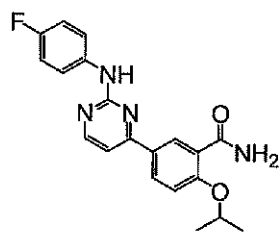


II-64

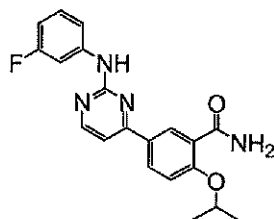


II-65

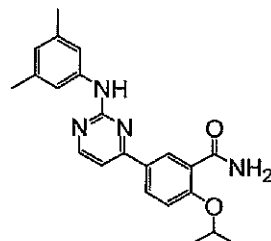
【化 8 - 6】



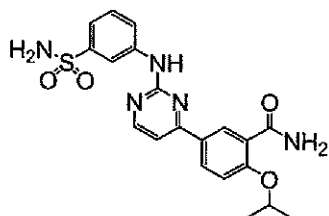
II-66



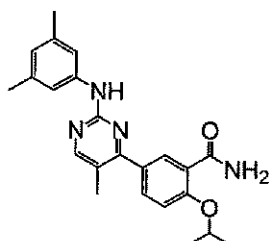
II-67



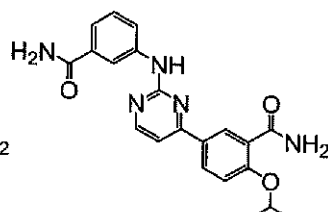
II-68



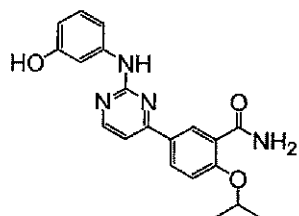
II-69



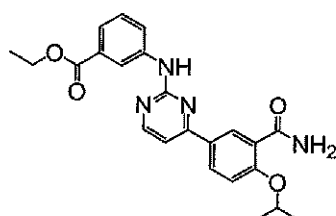
II-70



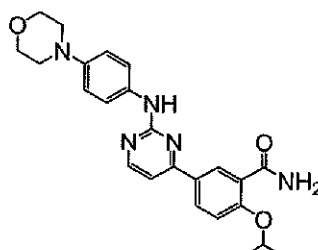
II-71



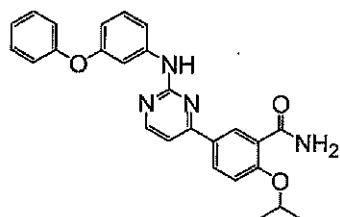
II-72



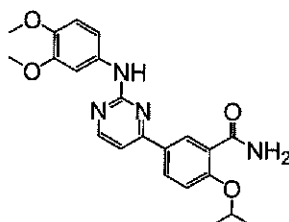
II-73



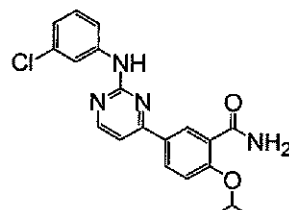
II-74



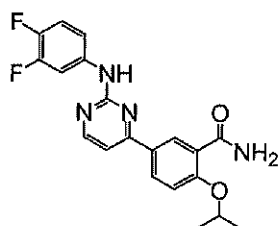
II-75



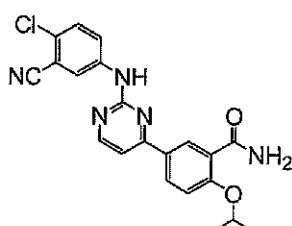
II-76



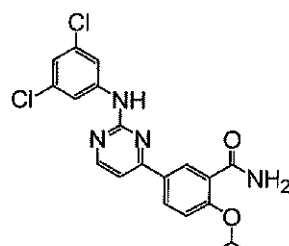
II-77



II-78

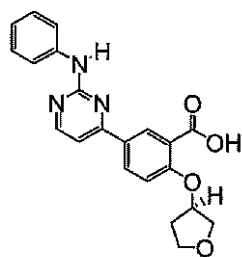


II-79

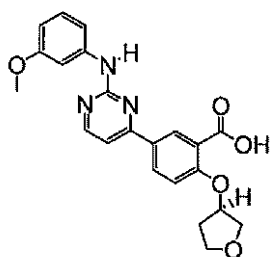


II-80

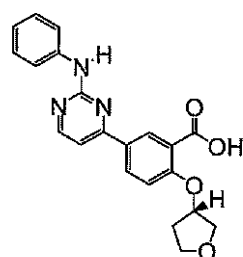
【化 8 - 7】



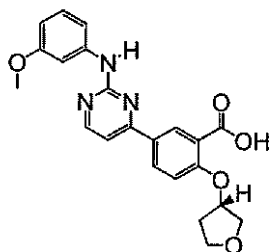
II-81



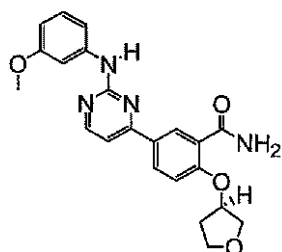
II-82



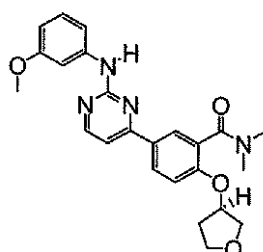
II-83



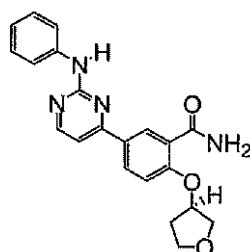
II-84



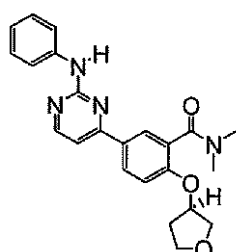
II-85



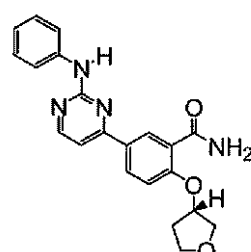
II-86



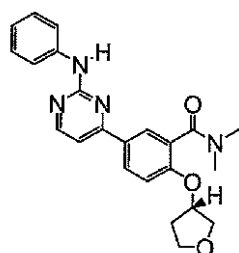
II-87



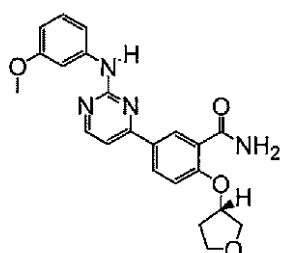
II-88



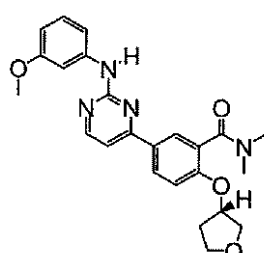
II-89



II-90

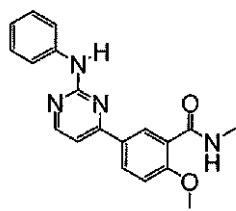


II-91

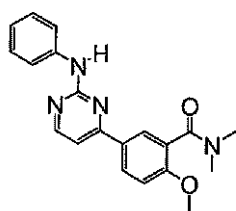


II-92

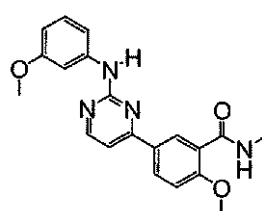
【化 8 - 8】



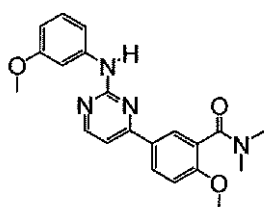
II-93



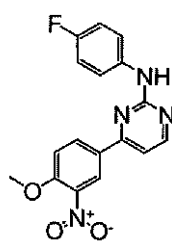
II-94



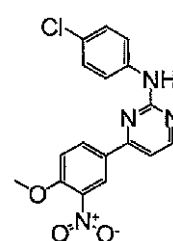
II-95



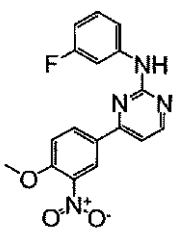
II-96



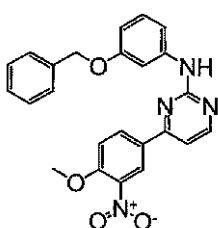
II-97



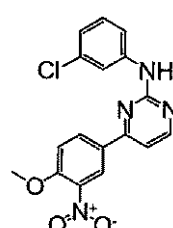
II-98



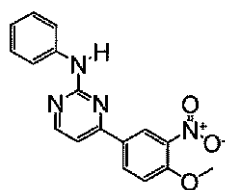
II-99



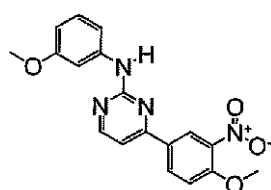
II-100



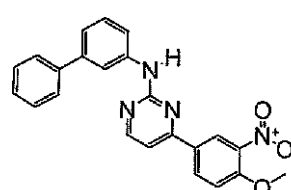
II-101



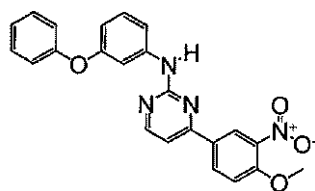
II-102



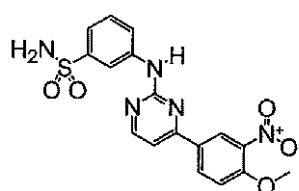
II-103



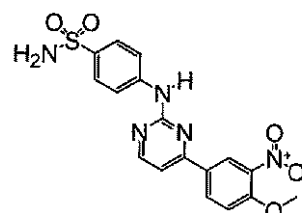
II-104



II-105

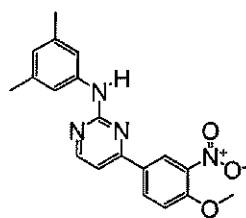


II-106

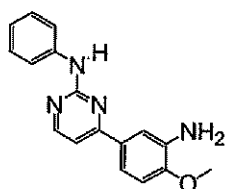


II-107

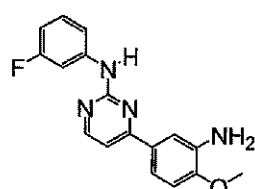
【化 8 - 9】



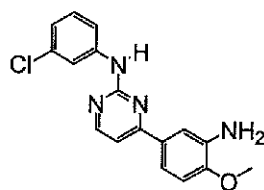
II-108



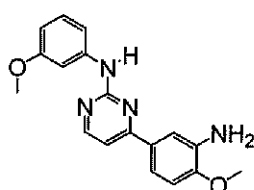
II-109



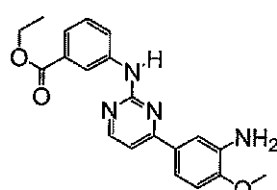
II-110



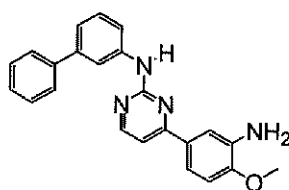
II-111



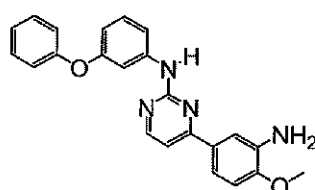
II-112



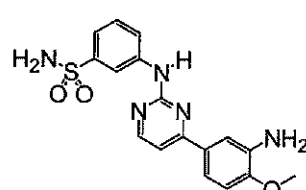
II-113



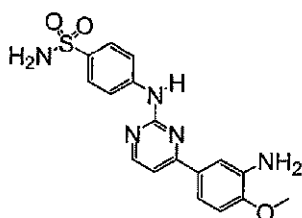
II-114



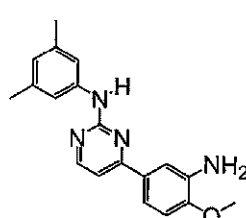
II-115



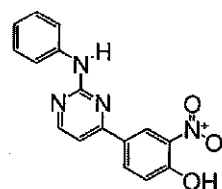
II-116



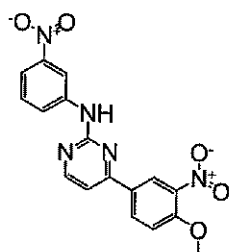
II-117



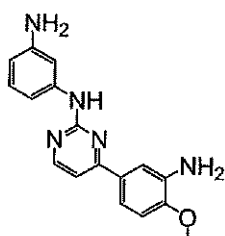
II-118



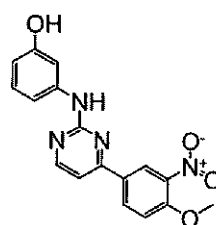
II-119



II-120

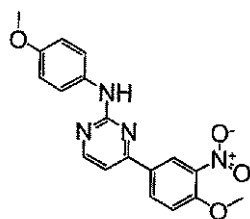


II-121

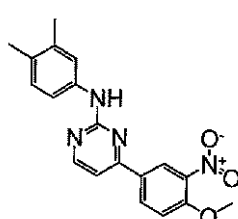


II-122

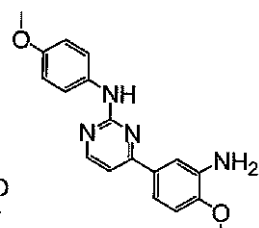
【化 8 - 1 0】



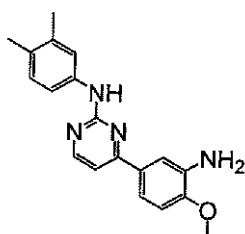
II-123



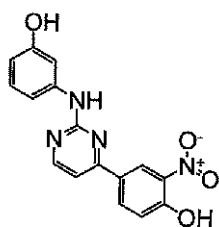
II-124



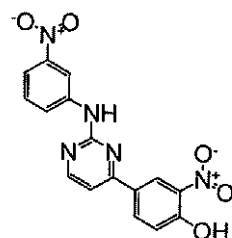
II-125



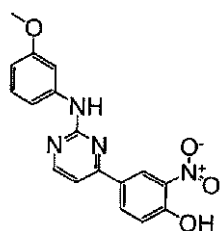
II-126



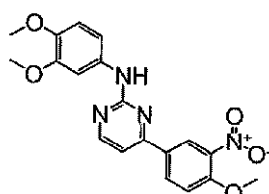
II-127



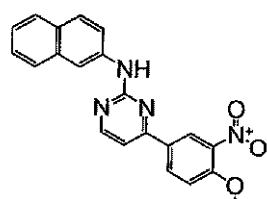
II-128



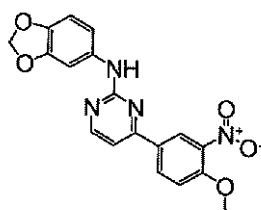
II-129



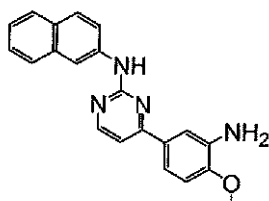
II-130



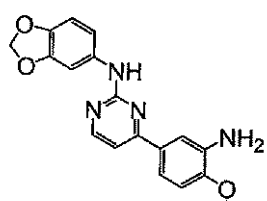
II-131



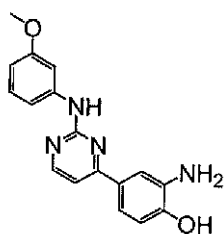
II-132



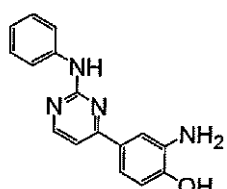
II-133



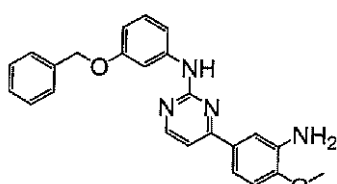
II-134



II-135

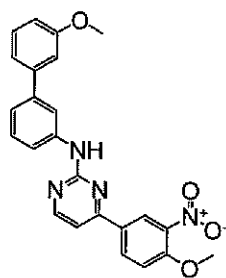


II-136

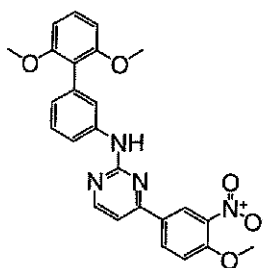


II-137

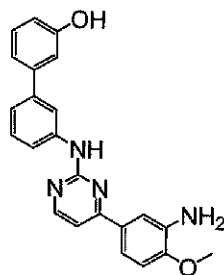
【化 8 - 1 1】



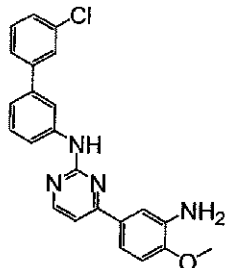
II-138



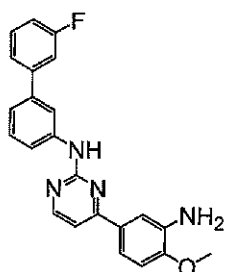
II-139



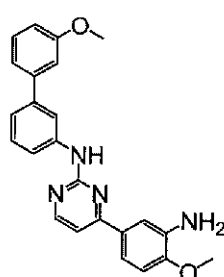
II-140



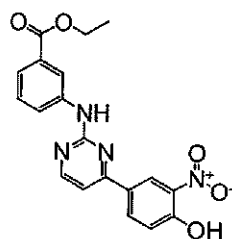
II-141



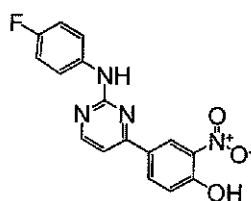
II-142



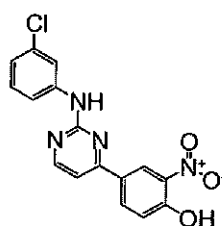
II-143



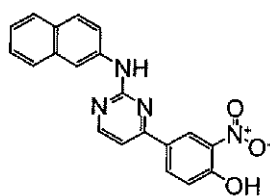
II-144



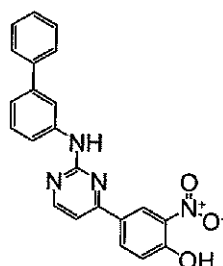
II-145



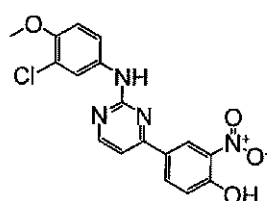
II-146



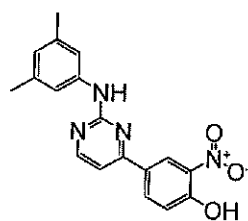
II-147



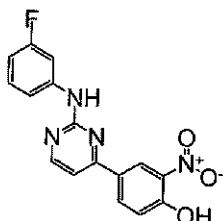
II-148



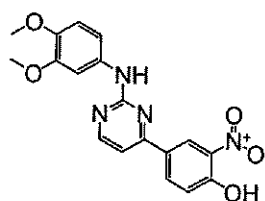
II-149



II-150

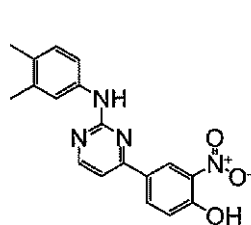


II-151

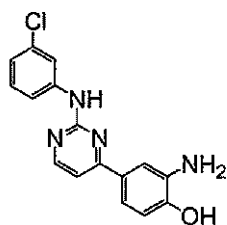


II-152

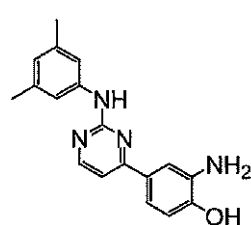
【化 8 - 1 2】



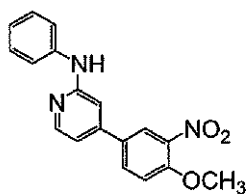
II-153



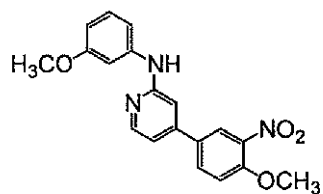
II-154



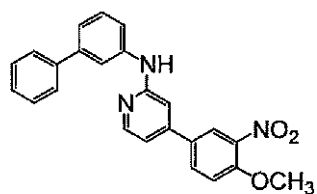
II-155



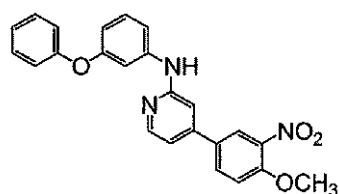
III-1



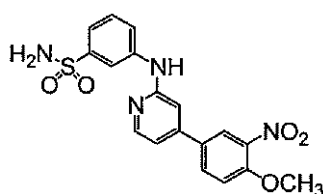
III-2



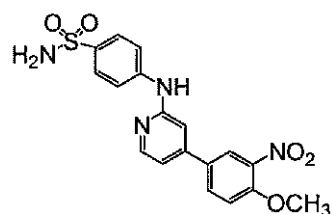
III-3



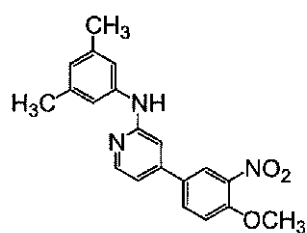
III-4



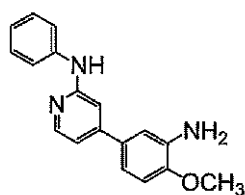
III-5



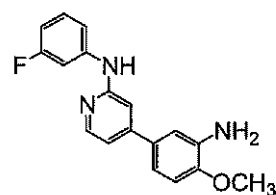
III-6



III-7

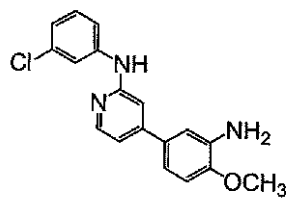


III-8

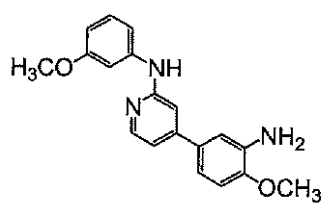


III-9

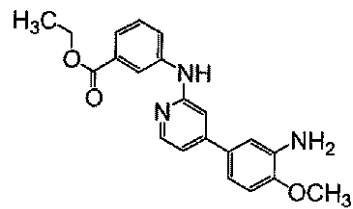
【化 8 - 1 3】



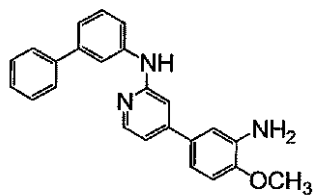
III-10



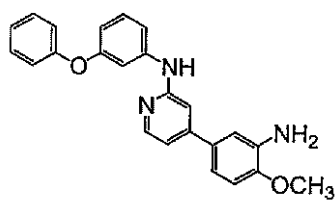
III-11



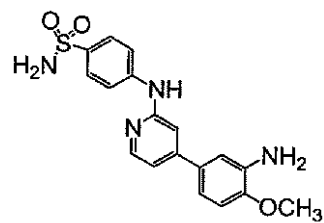
III-12



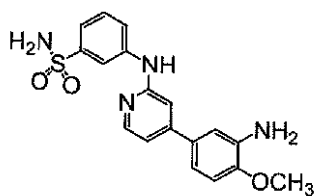
III-13



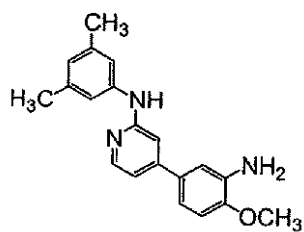
III-14



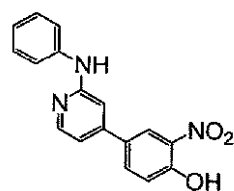
III-15



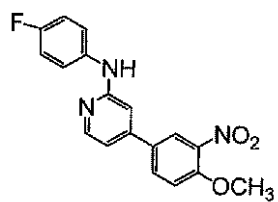
III-16



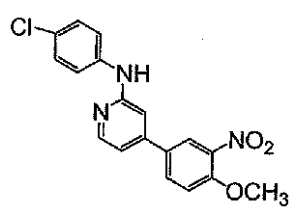
III-17



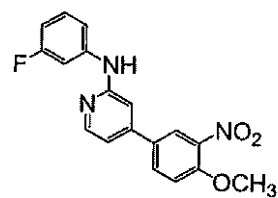
III-18



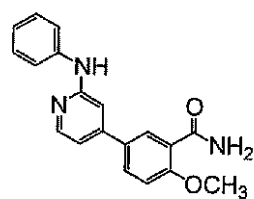
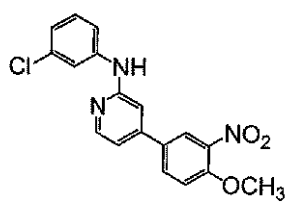
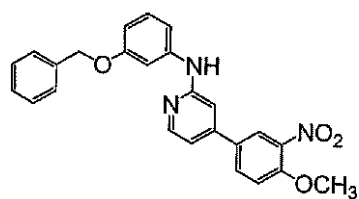
III-19



III-20

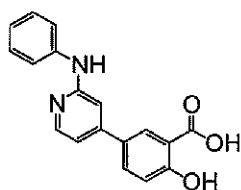


III-21



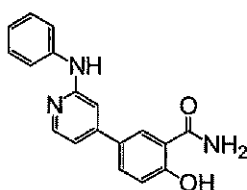
【化 8 - 1 4】

III-22



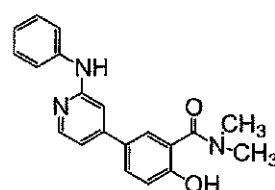
III-25

III-23

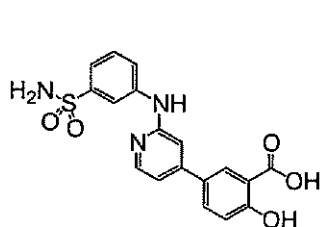


III-26

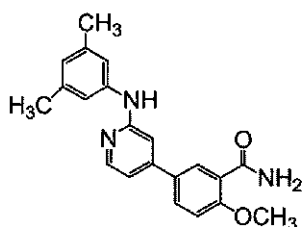
III-24



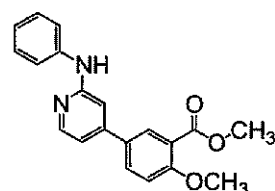
III-27



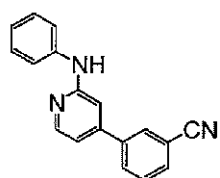
III-28



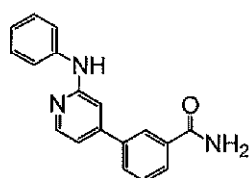
III-29



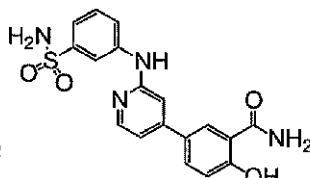
III-30



III-31

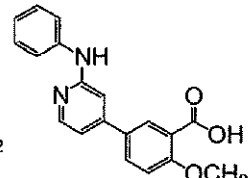


III-32



III-33

または



III-34

のうちの 1 個から選択される、化合物。

【請求項 19】

請求項 1 に記載の化合物と、薬学的に受容可能な担体、アジュバントまたはビヒクルとを含有する、薬学的組成物。

【請求項 20】

さらに、追加治療薬を含有し、該追加治療薬が、化学療法薬または抗増殖薬、アルツハイマー病治療薬、パーキンソン病治療薬、多発性硬化症 (MS) 治療薬、喘息治療薬、統合失調症治療薬、抗炎症薬、免疫調節薬または免疫抑制薬、神経栄養因子、循環器病治療薬、破壊的骨障害治療薬、肝疾患治療薬、血液疾患治療薬、または免疫不全障害治療薬から選択される、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 21】

(a) 生物学的試料における JAK-3 キナーゼ活性、JNK-3 キナーゼ活性、CDK-2 キナーゼ活性、SYK キナーゼ活性、GSK-3 キナーゼ活性を阻害する方法であって、請求項 1 に記載の化合物または請求項 19 に記載の組成物を該生物学的試料と接触させる工程を包含する、方法。

【請求項 22】

免疫応答、自己免疫疾患、神経変性障害、固形悪性腫瘍または血液悪性腫瘍から選択される疾患または障害を処置するかその重症度を軽くするための組成物であって、請求項 1 に記載の化合物または請求項 24 に記載の組成物を含み、ここで該組成物が、それを必要と

する患者への投与に適切である、組成物。

【請求項 2 3】

前記疾患または障害が、アレルギー性または I 型過感受性反応、喘息、移植片拒絶、移植片対宿主病、慢性関節リウマチ、筋萎縮性側索硬化症、多発性硬化症、家族性筋萎縮性側索硬化症（FALS）、白血病またはリンパ腫から選択される、請求項 2 2 に記載の組成物。

【請求項 2 4】

追加治療薬を含む、該追加治療薬が、化学療法薬または抗増殖薬、アルツハイマー病治療薬、パーキンソン病治療薬、多発性硬化症（MS）治療薬、喘息治療薬、統合失調症治療薬、抗炎症薬、免疫調節薬または免疫抑制薬、神経栄養因子、循環器病治療薬、破壊的骨障害治療薬、肝疾患治療薬、血液疾患治療薬、または免疫不全障害治療薬から選択され、ここで、

該追加治療薬が、治療する疾患に適切であり、そして

該追加治療薬が、単一剤形として、前記組成物と共に投与されるか、または複数剤形の一部として、該組成物とは別々に投与されるのに適切である、請求項 2 2 に記載の組成物。

【請求項 2 5】

患者における JAK-3 キナーゼ活性、JNK-3 キナーゼ活性、CDK-2 キナーゼ活性、SYK キナーゼ活性、GSK-3 キナーゼ活性を阻害するための組成物であって、請求項 1 に記載の化合物または請求項 1 9 に記載の組成物を含む、組成物。