

【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27年4月23日(2015.4.23)

【公表番号】特表2014-512406(P2014-512406A)

【公表日】平成26年5月22日(2014.5.22)

【年通号数】公開・登録公報2014-027

【出願番号】特願2014-506888(P2014-506888)

【国際特許分類】

C 0 7 D 217/02 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 471/08 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/472 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/16 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 13/10 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

A 6 1 P 27/14 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/16 (2006.01)

A 6 1 P 1/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 15/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D	217/02	
C 0 7 D	401/12	C S P
A 6 1 K	31/4725	
A 6 1 K	31/454	
C 0 7 D	405/14	
C 0 7 D	471/08	
C 0 7 D	409/14	
C 0 7 D	401/14	
A 6 1 K	31/472	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	27/16	
A 6 1 P	11/02	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	15/00	
A 6 1 P	19/00	
A 6 1 P	13/08	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	25/08	
A 6 1 P	13/10	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	27/06	
A 6 1 P	27/14	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	11/08	
A 6 1 P	11/16	
A 6 1 P	1/02	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	15/10	
A 6 1 P	15/08	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	25/24	
A 6 1 P	25/22	

【手続補正書】

【提出日】平成27年2月27日(2015.2.27)

【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

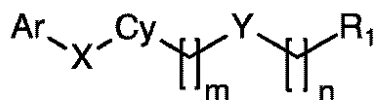
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物、又はその立体異性体、互変異性体、ラセミ体、塩、水和物、若しくは溶媒和物：

【化 1】



(式中、

X は酸素、-NH-、又は直接結合であり、

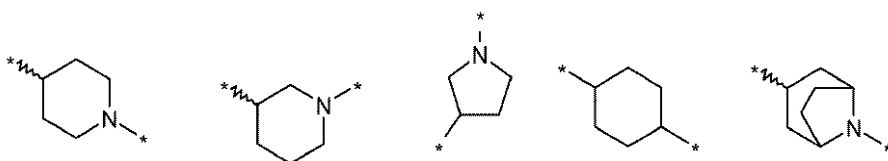
Y は -NH- 又は直接結合であり、

n は 0 ~ 4 の整数であり、

m は 0 ~ 4 の整数であり、

Cy は、縮合炭素環、重炭素環、スピロ炭素環若しくは架橋炭素環及び複素環を含む飽和(多)環からなり、又は、

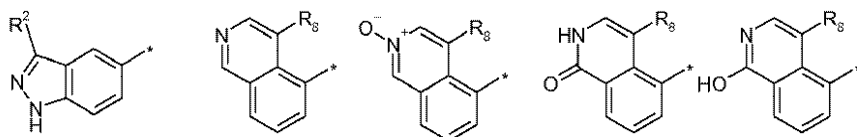
【化 2】



からなる群から選択される二価のラジカルを表し、

Ar は、

【化 3】



を含む群から選択され、

R<sup>2</sup> は水素又はメチルであり、

R<sup>8</sup> は水素、メチル、ハロゲン、又はアルキニルであり、

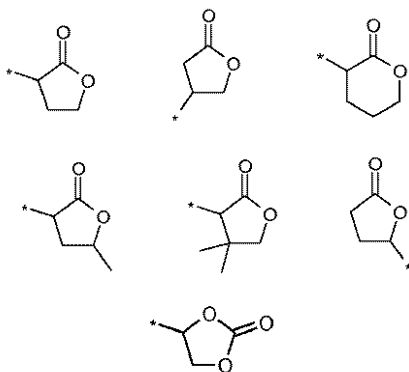
R<sup>1</sup> は、ハロ又は C<sub>1</sub> ~ 6 アルキルで任意に置換されるアリール又はヘテロアリールであり、ここで、該アリール又はヘテロアリールは、- (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub> - C(=O) - NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>、で置換され、

ここで、

p は 0 ~ 3 の整数であり、

Het<sup>1</sup> は、

【化 4】



からなる群から選択され、

R<sup>3</sup> は Het<sup>1</sup>、C<sub>1</sub> ~ 20 アルキル、アリール若しくはヘテロアリールからなる群から

選択され、ここで、該  $C_{1-20}$  アルキル、アリール若しくはヘテロアリールは、各々独立してアリール、ヘテロアリール、 $-(CH_2)_p-C(=O)-OR^{2,1}$ 、 $-Het^1$ 、 $-NH-Het^1$ 、 $-O-Het^1$ 、 $-S-Het^1$ 、 $-S-C_{2-6}$  アルキル、 $-NH-C_{2-6}$  アルキル、及び  $-O-C_{2-6}$  アルキルからなる群から選択される 1 つ、2 つ、若しくは 3 つの置換基で置換され、

ここで、前記アリール、ヘテロアリール、 $-O-C_{2-6}$  アルキル、 $-NH-C_{2-6}$  アルキル、若しくは  $-S-C_{2-6}$  アルキルは、各々独立して  $C(=O)-OR^{2,1}$ 、 $-Het^1$ 、 $-O-Het^1$ 、 $-NH-Het^1$ 、及び  $-S-Het^1$  からなる群から選択される置換基で置換され、

$R^4$  は水素若しくは  $C_{1-6}$  アルキルからなる群から選択され、又は、

$R^3$  及び  $R^4$  は、それらが結合する窒素原子とともに、 $C_{1-20}$  アルキル、アリール若しくはヘテロアリールからなる群から選択される 1 つの置換基で置換された複素環を形成し、ここで、該  $C_{1-20}$  アルキル、アリール若しくはヘテロアリールは、各々独立してアリール、ヘテロアリール、 $-C(=O)-OR^{2,1}$ 、 $-Het^1$ 、 $-O-Het^1$ 、 $-S-Het^1$ 、 $-S-C_{2-6}$  アルキル、 $-NH-C_{2-6}$  アルキル、及び  $-O-C_{2-6}$  アルキルからなる群から選択される 1 つ、2 つ、若しくは 3 つの置換基で置換され、

ここで、前記  $-O-C_{2-6}$  アルキル、 $-NH-C_{2-6}$  アルキル、若しくは  $-S-C_{2-6}$  アルキルは、各々独立して  $C(=O)-OR^{2,1}$ 、 $-Het^1$ 、 $-O-Het^1$ 、 $-NH-Het^1$ 、及び  $-S-Het^1$  からなる群から選択される置換基で置換され、

ここで上記  $R^3$  及び  $R^4$  の定義において、 $R^{2,1}$  は任意に置換された  $C_{1-20}$  アルキル、任意に置換された  $C_{1-20}$  アルケニル、任意に置換された  $C_{1-20}$  アルキニル、任意に置換された  $C_{3-15}$  シクロアルキル、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロシクリル、及び任意に置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、ここで、 $C_{1-20}$  アルキル、 $C_{1-20}$  アルケニル、 $C_{1-20}$  アルキニル、 $C_{3-15}$  シクロアルキル、ヘテロシクリルの任意に置換される置換基は、ハロ、ヒドロキシル、オキシ、カルボニル、ニトロ、アミノ、アミド、オキシム、イミノ、アジド、ヒドラジノ、シアノ、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アシル、アルキルアミノ、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロアルキル、チオール、アルキルチオ、カルボン酸、アシルアミノ、アルキルエステル、カルバメート、チオアミド、尿素、スルホンアミドのグループから選ばれる 1 又は 2 であり、さらに、アリール、ヘテロアリールの任意に置換される置換基は、ハロ、ヒドロキシル、ニトロ、アミノ、シアノ、 $C_{1-6}$  アルキル、アルキルアミノ、アルコキシ、及びハロアルキルグループから選ばれる 1 又は 2 である。

#### 【請求項 2】

X が酸素又は NH、又は NH である、請求項 1 に記載の化合物。

#### 【請求項 3】

X が酸素、 $-NH-$ 、若しくは直接結合、又は酸素若しくは  $-NH-$ 、又は  $-NH-$  であり、

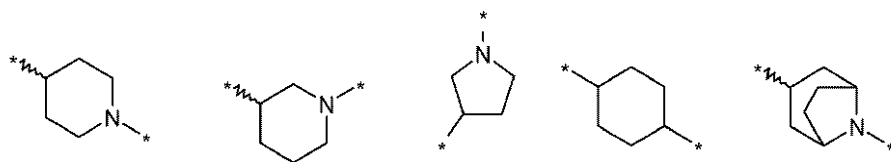
Y が  $-NH-$  若しくは直接結合であり、

n が 0 ~ 4 の整数であり、

m が 0 ~ 4 の整数であり、

Cy が、

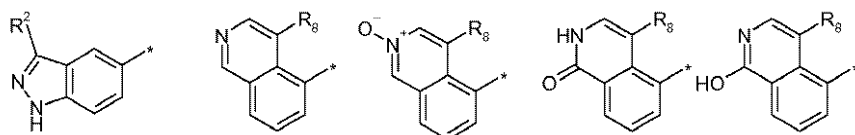
#### 【化 6】



からなる群から選択され、

Ar が、

## 【化 7】



を含む群から選択され、

$R^2$  が水素若しくはメチル、又は水素であり、

$R^8$  が水素、メチル、ハロゲン、若しくはアルキニル、又は水素若しくはメチル、又は水素であり、

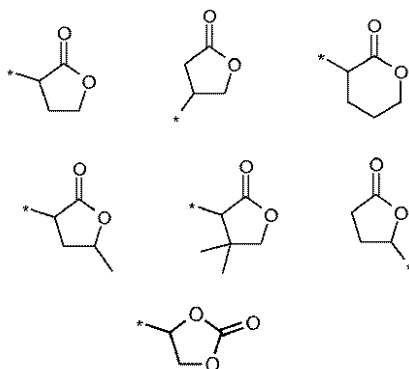
$R^1$  が、ハロ又は  $C_{1-6}$  アルキルで任意に置換されたアリール又はヘテロアリールであり、ここで、該アリール又はヘテロアリールは、 $-(CH_2)_p-C(=O)-NR^3R^4$ 、で置換され、

ここで、

$p$  は 0 ~ 3 の整数であり、

Het<sup>1</sup> は、

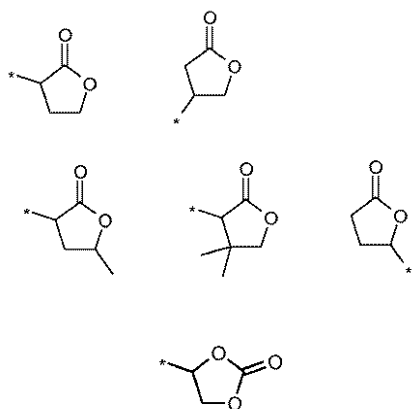
## 【化 8】



からなる群から選択され、

又は Het<sup>1</sup> は、

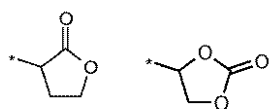
## 【化 9】



からなる群から選択され、

又は Het<sup>1</sup> は、

## 【化 10】



からなる群から選択され、

$R^3$  は Het<sup>1</sup>、 $C_{1-20}$  アルキル、アリール若しくはヘテロアリールからなる群から

選択され、ここで、該  $C_{1-20}$  アルキル、アリール若しくはヘテロアリールは、各々独立してアリール、ヘテロアリール、 $-(CH_2)_p-C(=O)-OR^{21}$ 、 $-Het^1$ 、 $-NH-Het^1$ 、 $-O-Het^1$ 、 $-S-Het^1$ 、 $-S-C_{2-6}$  アルキル、 $-NH-C_{2-6}$  アルキル、及び  $-O-C_{2-6}$  アルキルからなる群から選択される1つ、2つ、若しくは3つの置換基で置換され、

ここで、前記アリール、ヘテロアリール、 $-O-C_{2-6}$  アルキル、 $-NH-C_{2-6}$  アルキル、若しくは  $-S-C_{2-6}$  アルキルは、各々独立して  $C(=O)-OR^{21}$ 、 $-Het^1$ 、 $-O-Het^1$ 、 $-NH-Het^1$ 、及び  $-S-Het^1$  からなる群から選択される置換基で置換され、

又は  $R^3$  は  $Het^1$ 、 $C_{1-20}$  アルキル、アリール若しくはヘテロアリールからなる群から選択され、ここで、該  $C_{1-20}$  アルキル、アリール若しくはヘテロアリールは、各々独立して  $-(CH_2)_p-C(=O)-OR^{21}$ 、 $-Het^1$ 、 $-NH-Het^1$ 、 $-O-Het^1$ 、及び  $-S-Het^1$  からなる群から選択される1つ、2つ、若しくは3つの置換基で置換され、

又は  $R^3$  は  $Het^1$ 、 $C_{1-20}$  アルキル若しくはアリールからなる群から選択され、ここで、該  $C_{1-20}$  アルキル若しくはアリールは、各々独立して  $-(CH_2)_p-C(=O)-OR^{21}$ 、 $-Het^1$ 、及び  $-S-Het^1$  からなる群から選択される1つ、2つ、若しくは3つ、又は1つの置換基で置換され、

$R^4$  は水素若しくは  $C_{1-6}$  アルキル、又は水素からなる群から選択され、又は、 $R^3$  及び  $R^4$  は、それらが結合する窒素原子とともに、 $C_{1-20}$  アルキル、アリール若しくはヘテロアリールからなる群から選択される1つの置換基で置換された複素環を形成し、ここで、該  $C_{1-20}$  アルキル、アリール若しくはヘテロアリールは、各々独立してアリール、ヘテロアリール、 $-C(=O)-OR^{21}$ 、 $-Het^1$ 、 $-O-Het^1$ 、 $-S-Het^1$ 、 $-S-C_{2-6}$  アルキル、 $-NH-C_{2-6}$  アルキル、及び  $-O-C_{2-6}$  アルキルからなる群から選択される1つ、2つ、若しくは3つの置換基で置換され、ここで、前記  $-O-C_{2-6}$  アルキル、 $-NH-C_{2-6}$  アルキル、若しくは  $-S-C_{2-6}$  アルキルは、各々独立して  $C(=O)-OR^{21}$ 、 $-Het^1$ 、 $-O-Het^1$ 、 $-NH-Het^1$ 、及び  $-S-Het^1$  からなる群から選択される置換基で置換され、

ここで上記  $R^3$  及び  $R^4$  の定義において、 $R^{21}$  は任意に置換された  $C_{1-20}$  アルキル、任意に置換された  $C_{1-20}$  アルケニル、任意に置換された  $C_{1-20}$  アルキニル、任意に置換された  $C_{3-15}$  シクロアルキル、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロシクリル、及び任意に置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、又は  $R^{21}$  は任意に置換された  $C_{1-20}$  アルキル及び任意に置換されたアリール、若しくはアリール及び任意に置換された  $C_{1-20}$  アルキルから選択され、ここで、 $1-20$  アルキル、 $C_{1-20}$  アルケニル、 $C_{1-20}$  アルキニル、 $C_{3-15}$  シクロアルキル、ヘテロシクリルの任意に置換される置換基は、ハロ、ヒドロキシル、オキソ、カルボニル、ニトロ、アミノ、アミド、オキシム、イミノ、アジド、ヒドラジノ、シアノ、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アシル、アルキルアミノ、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロアルキル、チオール、アルキルチオ、カルボン酸、アシルアミノ、アルキルエステル、カルバメート、チオアミド、尿素、スルホンアミドのグループから選ばれる1又は2であり、さらに、アリール、ヘテロアリールの任意に置換される置換基は、ハロ、ヒドロキシル、ニトロ、アミノ、シアノ、 $C_{1-6}$  アルキル、アルキルアミノ、アルコキシ、及びハロアルキルグループから選ばれる1又は2である、

請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項4】

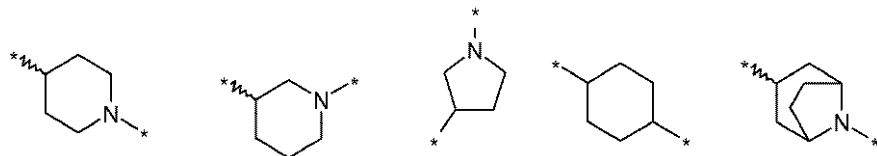
$R^1$  が、 $-(CH_2)_p-C(=O)-NR^3R^4$  で置換された、アリール若しくはヘテロアリール、又はアリール、若しくはインドリル以外の任意のヘテロアリール、又はフェニル、ピロリル若しくはチオフェニルである、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項5】

$R^1$  が、 $-(CH_2)_p-C(=O)-NR^3R^4$  で置換された、アリール若しくはヘテロアリール、又はフェニル、ピロリル若しくはチオフェニルである、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

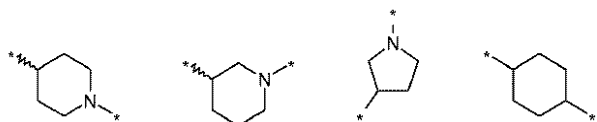
【請求項 6】

Cy が、  
【化 1 2】



からなる群、又は、

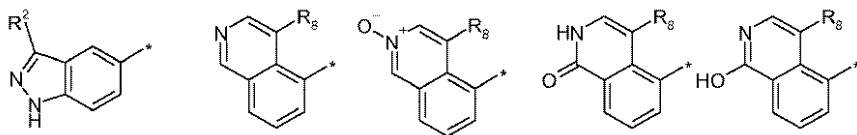
【化 1 3】



からなる群から選択される二価のラジカルを表し、

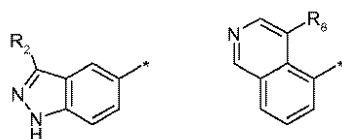
Ar が、

【化 1 4】



からなる群、又は、

【化 1 5】



からなる群から選択される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

以下の制限の 1 つ又は複数が適用される、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物：

X が酸素、-NH- 若しくは直接結合、又は酸素若しくは -NH-、又は -NH- である；

Y が -NH- 若しくは直接結合、又は -NH- である；

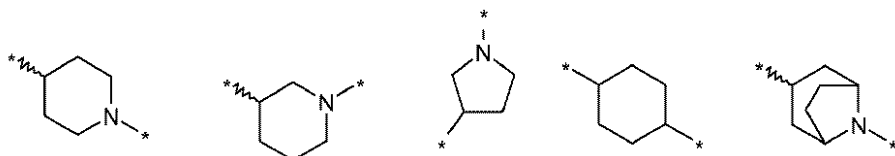
n が 0 ~ 4 の整数、又は 0 若しくは 1 である；

m が 0 ~ 4 の整数、又は 0 若しくは 1 である；

Cy が縮合炭素環、重炭素環、スピロ炭素環又は架橋炭素環及び複素環を含む飽和（多）環からなる二価のラジカルを表す；

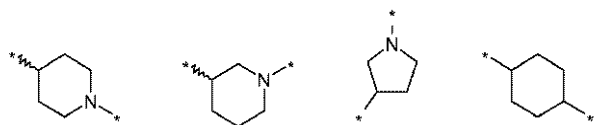
Cy が、

【化 1 6】



からなる群、又は、

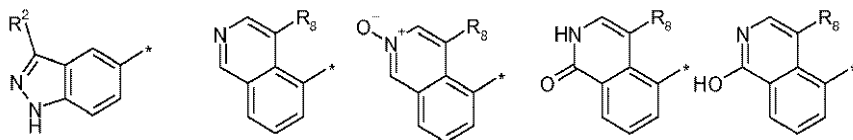
## 【化 17】



からなる群から選択される；

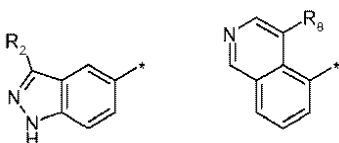
A r が、

## 【化 18】



を含む群、又は、

## 【化 19】



からなる群から選択される；

R<sup>2</sup> が水素若しくはメチル、又は水素である；

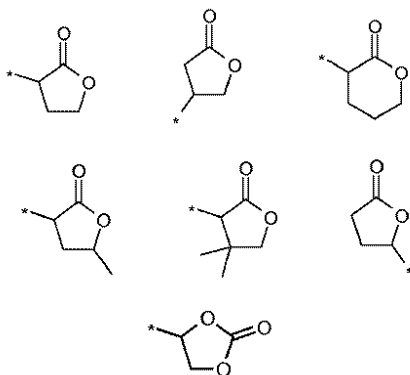
R<sup>8</sup> が水素、メチル、ハロゲン、若しくはアルキニル、又は水素若しくはメチル、又は水素である；

R<sup>1</sup> が、ハロ又は C<sub>1</sub> - 6 アルキルで任意に置換されたアリール又はヘテロアリールであり、ここで、該アリール又はヘテロアリールは、 $-(CH_2)_p-C(=O)-NR^3$  R<sup>4</sup> で置換されている、あるいは、R<sup>1</sup> が、 $-(CH_2)_p-C(=O)-NR^3 R^4$  で置換された、アリール若しくはヘテロアリール、又はアリール、ピロリル若しくはチオフェニル、又はフェニル、ピロリル若しくはチオフェニルである；

p が 0 ~ 3 の整数、又は 0 若しくは 1 である；

H e t<sup>1</sup> が、

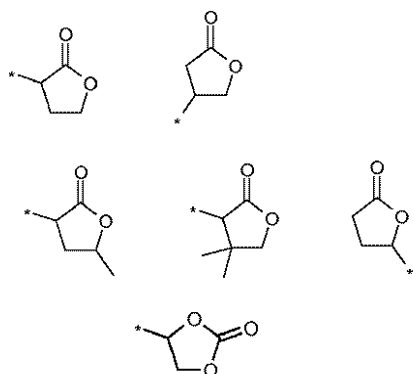
## 【化 20】



からなる群から選択され、

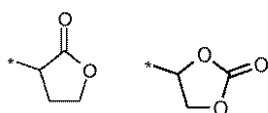
又は H e t<sup>1</sup> が、

## 【化 2 1】



からなる群から選択され、  
又は  $\text{Het}^1$  が、

## 【化 2 2】



からなる群から選択される；

$\text{R}^3$  が  $\text{Het}^1$ 、 $\text{C}_{1 \sim 20}$  アルキル、アリール若しくはヘテロアリールからなる群から選択され、ここで、該  $\text{C}_{1 \sim 20}$  アルキル、アリール又はヘテロアリールは、各々独立してアリール、ヘテロアリール、 $-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^{21}$ 、 $-\text{Het}^1$ 、 $-\text{NH}-\text{Het}^1$ 、 $-\text{O}-\text{Het}^1$ 、 $-\text{S}-\text{Het}^1$ 、 $-\text{S}-\text{C}_{2 \sim 6}$  アルキル、 $-\text{NH}-\text{C}_{2 \sim 6}$  アルキル、及び  $-\text{O}-\text{C}_{2 \sim 6}$  アルキルからなる群から選択される 1 つ、2 つ、若しくは 3 つの置換基で置換され、

ここで、前記アリール、ヘテロアリール、 $-\text{O}-\text{C}_{2 \sim 6}$  アルキル、 $-\text{NH}-\text{C}_{2 \sim 6}$  アルキル、若しくは  $-\text{S}-\text{C}_{2 \sim 6}$  アルキルは、各々独立して  $\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^{21}$ 、 $-\text{Het}^1$ 、 $-\text{O}-\text{Het}^1$ 、 $-\text{NH}-\text{Het}^1$ 、及び  $-\text{S}-\text{Het}^1$  からなる群から選択される置換基で置換され、

又は  $\text{R}^3$  が  $\text{Het}^1$ 、 $\text{C}_{1 \sim 20}$  アルキル、アリール若しくはヘテロアリールからなる群から選択され、ここで、該  $\text{C}_{1 \sim 20}$  アルキル、アリール若しくはヘテロアリールは、各々独立して  $-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^{21}$ 、 $-\text{Het}^1$ 、 $-\text{NH}-\text{Het}^1$ 、 $-\text{O}-\text{Het}^1$ 、及び  $-\text{S}-\text{Het}^1$  からなる群から選択される 1 つ、2 つ、若しくは 3 つの置換基で置換され、

又は  $\text{R}^3$  が  $\text{Het}^1$ 、 $\text{C}_{1 \sim 20}$  アルキル、若しくはアリールからなる群から選択され、ここで、該  $\text{C}_{1 \sim 20}$  アルキル若しくはアリールは、各々独立して  $-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^{21}$ 、 $-\text{Het}^1$ 、及び  $-\text{S}-\text{Het}^1$  からなる群から選択される 1 つ、2 つ、若しくは 3 つ、又は 1 つの置換基で置換され、

又は  $\text{R}^3$  が  $\text{Het}^1$ 、 $\text{C}_{1 \sim 20}$  アルキル、若しくはフェニルからなる群から選択され、ここで、該  $\text{C}_{1 \sim 20}$  アルキル若しくはフェニルは、各々独立して  $-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^{21}$ 、 $-\text{Het}^1$ 、及び  $-\text{S}-\text{Het}^1$  からなる群から選択される 1 つ、2 つ、若しくは 3 つ、又は 1 つの置換基で置換される；

$\text{R}^4$  が水素若しくは  $\text{OC}_{1 \sim 6}$  アルキル、又は水素からなる群から選択される；

$\text{R}^3$  及び  $\text{R}^4$  が、それらが結合する窒素原子とともに、 $\text{C}_{1 \sim 20}$  アルキル、アリール又はヘテロアリールからなる群から選択される 1 つの置換基で置換された複素環を形成し、ここで、該  $\text{C}_{1 \sim 20}$  アルキル、アリール又はヘテロアリールは、各々独立してアリール、ヘテロアリール、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^{21}$ 、 $-\text{Het}^1$ 、 $-\text{O}-\text{Het}^1$ 、 $-\text{S}-\text{Het}^1$ 、 $-\text{S}-\text{C}_{2 \sim 6}$  アルキル、 $-\text{NH}-\text{C}_{2 \sim 6}$  アルキル、及び  $-\text{O}-\text{C}_{2 \sim 6}$  アルキルからなる群から選択される 1 つ、2 つ、又は 3 つの置換基で置換され、

ここで上記  $R^3$  及び  $R^4$  の定義において、 $R^{2,1}$  が任意に置換された  $C_{1-20}$  アルキル、任意に置換された  $C_{1-20}$  アルケニル、任意に置換された  $C_{1-20}$  アルキニル、任意に置換された  $C_{3-15}$  シクロアルキル、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロシクリル、及び任意に置換されたヘテロアリール、又は任意に置換された  $C_{1-20}$  アルキル及び任意に置換されたアリール、又はアリール及び任意に置換された  $C_{1-20}$  アルキルからなる群から選択される；

$R^{2,1}$  が  $C_{1-20}$  アルキル又はアリールから選択され、ここで、該  $C_{1-20}$  アルキル若しくはアリールは、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、 $C_{1-6}$  アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、及びアルコキシから選択される1つ又は複数の基で任意に置換され、又はシクロアルキル、アリール、ヒドロキシ、アルコキシ、及びヘテロシクリルから選択される1つの基で任意に置換される；

$R^{2,1}$  がアリール及び  $C_{1-20}$  アルキルから選択され、ここで、該  $C_{1-20}$  アルキルはハロ、ヒドロキシ、シアノ、 $C_{1-6}$  アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、若しくはアルコキシ、又はシクロアルキル、フェニル、ヒドロキシ、アルコキシ、及びヘテロシクリルで任意に置換される；

ここで、前記  $-O-C_{2-6}$  アルキル、 $-NH-C_{2-6}$  アルキル、又は  $-S-C_{2-6}$  アルキルは、各々独立して  $C(=O)-OR^{2,1}$ 、 $-Het^1$ 、 $-O-Het^1$ 、 $-NH-Het^1$ 、及び  $-S-Het^1$  からなる群から選択される置換基で置換される；

$R^3$  及び  $R^4$  が、それらが結合する窒素原子とともに複素環を形成することはない；

$R^1$  がインドリルから選択されることはない；

$R^1$  がフェニルである場合、該フェニルはメタ位で置換され、又は該フェニルはメタ位で、 $-(CH_2)_p-C(=O)-NR^3R^4$  で置換される。

#### 【請求項 8】

ヒト又は動物用の医薬用である、請求項 1～7 のいずれか一項に記載の化合物。

#### 【請求項 9】

ヒト又は動物用の医薬用である、請求項 1～7 のいずれか一項に記載の化合物を含む組成物。

#### 【請求項 10】

平滑筋細胞機能、炎症、線維化、過剰な細胞増殖、過剰な血管形成、過敏性、バリア機能障害、神経変性 (neurodegeneration)、及びリモデリングに関わる疾患等の R O C K が関与する少なくとも1つの疾患又は障害の予防及び / 又は治療用である、請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物。

#### 【請求項 11】

眼疾患、気道疾患、耳鼻咽喉疾患、腸疾患、皮膚疾患、心血管及び他の血管の疾患、炎症性疾患、神経障害、増殖性疾患、腎疾患、性機能障害、骨疾患、良性前立腺過形成、移植片拒絶反応、痙攣、慢性閉塞性膀胱疾患、及びアレルギーからなる群から選択される少なくとも1つの疾患又は障害の予防及び / 又は治療用である、請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物。

#### 【請求項 12】

網膜症、視神経症、緑内障、炎症性眼疾患、並びに黄斑変性症及び網膜色素変性症等の網膜変性疾患からなる群から選択される眼疾患、又は緑内障の予防及び / 又は治療用である、請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物。

#### 【請求項 13】

肺線維症、肺気腫、慢性気管支炎、喘息、線維症、肺炎、嚢胞性線維症、慢性閉塞性肺疾患 (COPD)、気管支炎、鼻炎、及び呼吸窮迫症候群からなる群から選択される気道疾患、又は喘息又は COPD の予防及び / 又は治療用である、請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物。

#### 【請求項 14】

副鼻腔問題、聴覚問題、歯痛、扁桃炎、潰瘍、及び鼻炎からなる群から選択される耳鼻咽喉疾患の予防及び / 又は治療用である、請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物又

は請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 15】

過角化症、錯角化症、顆粒層肥厚、表皮肥厚症、異常角化症、海綿状態、及び潰瘍形成からなる群から選択される皮膚疾患の予防及び／又は治療用である、請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 16】

炎症性腸疾患（IBD）、大腸炎、胃腸炎、腸閉塞、回腸炎、虫垂炎、及びクローン病からなる群から選択される腸疾患の予防及び／又は治療用である、請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 17】

勃起不全、性腺機能低下症、膀胱疾患、高血圧、肺高血圧、若しくは骨盤手術後の障害からなる群から選択される性機能障害の予防及び／又は治療用である、及び／又は高血圧、鬱病、若しくは不安神経症の治療に使用される薬物等の或る特定の薬物を用いた治療に関連する性機能障害の治療用である、請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 18】

眼疾患、気道疾患、耳鼻咽喉疾患、腸疾患、皮膚疾患、心血管及び他の血管の疾患、炎症性疾患、神経障害及び CNS 障害、増殖性疾患、腎疾患、性機能障害、骨疾患、良性前立腺過形成、移植片拒絶反応、痙攣、慢性閉塞性膀胱疾患、及びアレルギーを含む群から選択される少なくとも 1 つの疾患又は障害の予防及び／又は治療剤であって、それを必要とする被験体に治療的有効量の請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物を投与する、請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物を含む予防及び／又は治療剤。

【請求項 19】

網膜症、視神経症、緑内障、炎症性眼疾患、並びに黄斑変性症及び網膜色素変性症等の網膜変性疾患からなる群から選択される眼疾患、又は緑内障の予防及び／又は治療剤であって、それを必要とする被験体に治療的有効量の請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物、又は請求項 9 に記載の組成物を投与する、請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物を含む予防及び／又は治療剤。

【請求項 20】

肺線維症、肺気腫、慢性気管支炎、喘息、線維症、肺炎、嚢胞性線維症、慢性閉塞性肺疾患（COPD）、気管支炎、鼻炎、及び呼吸窮迫症候群からなる群から選択される気道疾患、又は喘息又は COPD の予防及び／又は治療剤であって、それを必要とする被験体に治療的有効量の請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物、又は請求項 9 に記載の組成物を投与する、請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物を含む予防及び／又は治療剤。

【請求項 21】

副鼻腔問題、聴覚問題、歯痛、扁桃炎、潰瘍、及び鼻炎からなる群から選択される耳鼻咽喉疾患の予防及び／又は治療剤であって、それを必要とする被験体に治療的有効量の請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物を投与する、請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物を含む予防及び／又は治療剤。

【請求項 22】

過角化症、錯角化症、顆粒層肥厚、表皮肥厚症、異常角化症、海綿状態、及び潰瘍形成からなる群から選択される皮膚疾患の予防及び／又は治療剤であって、それを必要とする被験体に治療的有効量の請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物を投与する、請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物を含む予防及び／又は治療剤。

【請求項 23】

炎症性腸疾患（IBD）、大腸炎、胃腸炎、腸閉塞、回腸炎、虫垂炎、及びクローン病

からなる群から選択される腸疾患の予防及び／又は治療剤であって、それを必要とする被験体に治療的有効量の請求項 1 ～ 8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物を投与する、請求項 1 ～ 8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物を含む予防及び／又は治療剤。

【請求項 24】

勃起不全、性腺機能低下症、膀胱疾患、高血圧、糖尿病、若しくは骨盤手術後の障害からなる群から選択される性機能障害の予防及び／又は治療剤、及び／又は高血圧、鬱病、若しくは不安神経症の治療に使用される薬物等の或る特定の薬物を用いた治療に関連する性機能障害の治療剤であって、それを必要とする被験体に治療的有効量の請求項 1 ～ 8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物を投与する、請求項 1 ～ 8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 9 に記載の組成物を含む予防及び／又は治療剤。