

【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23年10月20日(2011.10.20)

【公表番号】特表2010-538052(P2010-538052A)

【公表日】平成22年12月9日(2010.12.9)

【年通号数】公開・登録公報2010-049

【出願番号】特願2010-523577(P2010-523577)

【国際特許分類】

C 07C 229/52	(2006.01)
C 07C 233/81	(2006.01)
C 07C 229/66	(2006.01)
C 07C 311/21	(2006.01)
C 07C 275/54	(2006.01)
A 61P 43/00	(2006.01)
A 61P 37/08	(2006.01)
A 61P 11/06	(2006.01)
A 61P 11/00	(2006.01)
A 61P 11/02	(2006.01)
A 61P 27/02	(2006.01)
A 61P 17/00	(2006.01)
A 61P 29/00	(2006.01)
A 61P 19/02	(2006.01)
A 61P 9/00	(2006.01)
A 61P 1/04	(2006.01)
A 61P 13/00	(2006.01)
A 61P 25/00	(2006.01)
A 61P 5/00	(2006.01)
A 61P 17/04	(2006.01)
A 61P 7/10	(2006.01)
A 61P 5/24	(2006.01)
A 61P 17/02	(2006.01)
A 61P 25/04	(2006.01)
A 61P 31/04	(2006.01)
A 61P 31/10	(2006.01)
A 61P 31/12	(2006.01)
A 61P 7/06	(2006.01)
A 61P 35/00	(2006.01)
A 61K 31/216	(2006.01)
A 61K 31/196	(2006.01)
A 61K 31/606	(2006.01)
C 07D 257/04	(2006.01)
A 61K 31/41	(2006.01)

【F I】

C 07C 229/52	C S P
--------------	-------

C 07C 233/81

C 07C 229/66

C 07C 311/21

C 07C 275/54

A 61P 43/00	1 1 1
-------------	-------

A 6 1 P 37/08
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 11/02
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 13/00
 A 6 1 P 25/00 1 0 1
 A 6 1 P 5/00
 A 6 1 P 17/04
 A 6 1 P 7/10
 A 6 1 P 5/24
 A 6 1 P 17/02
 A 6 1 P 25/04
 A 6 1 P 31/04
 A 6 1 P 31/10
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 7/06
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 K 31/216
 A 6 1 K 31/196
 A 6 1 K 31/606
 C 0 7 D 257/04 E
 A 6 1 K 31/41

【手続補正書】

【提出日】平成23年9月2日(2011.9.2)

【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

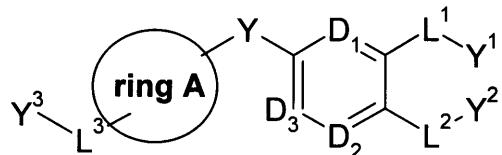
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

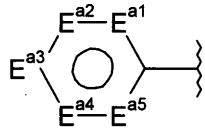
式1



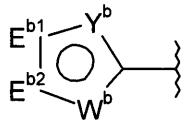
[上式中、

Yは、-C(O)-、または-C(=N-OR²⁸)-を表し；R²⁸は、水素、または、必要に応じて1ないしそれ以上のハロゲン原子によって任意に置換された、C₁₋₆アルキルを表し；

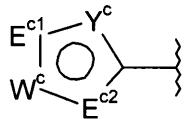
それぞれのD₁、D₂、およびD₃は、それぞれ-C(R^{1a})=、-C(R^{1b})=および-C(R^{1c})=を表す、または、それぞれD₁、D₂、およびD₃は、これに代えて独立的に、-N=を表し得；
環Aは、
環I)



(それぞれのE^{a1}、E^{a2}、E^{a3}、E^{a4}、およびE^{a5}は、それぞれ-C(H)=、-C(R^{2b})=、-C(R^{2c})=、-C(R^{2d})=、および-C(H)=を表すか、またはそれぞれのE^{a1}、E^{a2}、E^{a3}、E^{a4}、およびE^{a5}これに代えて独立的に、-N=を表し得；
R^{2b}、R^{2c}、およびR^{2d}の1つは、必須の-L³-Y³基を表し、そして、他のものは独立的に、水素、-L^{1a}-Y^{1a}、またはX¹から選択された置換基を表す；)、
環II)



(E^{b1}およびE^{b2}はそれぞれ-C(R^{3a})=および-C(R^{3b})=を表し；
Y^bは-C(R^{3c})=または-N=を表し；
W^bは-H(R^{3d})-、-O-、または-S-を表し；
R^{3a}、R^{3b}、そして存在する場合には、R^{3c}およびR^{3d}、のうちの1つが、必須の-L³-Y³基を表し、そして、残るR^{3a}、R^{3b}、および(存在する場合には)R^{3c}置換基が、水素、-L^{1a}-Y^{1a}、またはX²から選択された置換基を表し、そして残るR^{3d}置換基(存在する場合には)が、水素、またはR^{z1}から選択された置換基を表す；)、または、
環III)



(E^{c1}およびE^{c2}はそれぞれ-C(R^{4a})=および-C(R^{4b})=を表し；
Y^cは-C(R^{4c})=または-N=を表し；
W^cは-N(R^{4d})-、-O-、または-S-を表し；
R^{4a}、R^{4b}、そして存在する場合には、R^{4c}およびR^{4d}、のうちの1つが、必須の-L³-Y³基を表し、そして、残るR^{4a}、R^{4b}、および(存在する場合には)R^{4c}置換基が、水素、-L^{1a}-Y^{1a}、またはX³から選択された置換基を表し、そして残るR^{4d}置換基(存在する場合には)が、水素、またはR^{z2}から選択された置換基を表す；)を表し；
R^{z1}とR^{z2}は、独立してZ^{1a}から選択された基を表し；
R^{1a}、R^{1b}、R^{1c}は、独立して、水素、Z^{2a}から選択された基、ハロゲン、-CN、-N(R^{6b})R^{7b}、-N(R^{5d})C(O)R^{6c}、-N(R^{5e})C(O)N(R^{6d})R^{7d}、-N(R^{5f})C(O)OR^{6e}、-N₃、-NO₂、-N(R^{5g})S(O)₂N(R^{6f})R^{7f}、-OR^{5h}、-OC(O)N(R^{6g})R^{7g}、-OS(O)₂R⁵ⁱ、-N(R^{5k})S(O)₂R^{5m}、-OC(O)R⁵ⁿ、-OC(O)OR^{5p}または-OS(O)₂N(R⁶ⁱ)R⁷ⁱを表し；

X^1 、 X^2 、および X^3 は、独立して、 Z^{2a} から選択された基、または、ハロゲン、-CN、-N(R^6 ^b) R^{7b} 、-N(R^{5d})C(O) R^{6c} 、-N(R^{5e})C(O)N(R^{6d}) R^{7d} 、-N(R^{5f})C(O)OR 6e 、-N₃、-NO₂、-N(R^{5g})S(O)₂N(R^{6f}) R^{7f} 、-OR^{5h}、-OC(O)N(R^{5g}) R^{7g} 、-OS(O)₂R⁵ⁱ、-N(R^{5k})S(O)₂R^{5m}、-OC(O)R⁵ⁿ、-OC(O)OR^{5p}、または-OS(O)₂N(R^{6i}) R^{7i} を表し；

Z^{1a} および Z^{2a} は独立して、-R^{5a}、-C(O)R^{5b}、-C(O)OR^{5c}、-C(O)N(R^{6a}) R^{7a} 、-S(O)_mR^{5j}または-S(O)₂N(R^{6h}) R^{7h} を表し；

R^{5b} からR^{5h}、R^{5j}、R^{5k}、R⁵ⁿ、R^{6a}からR⁶ⁱ、R^{7a}、R^{7b}、R^{7d}、およびR^{7f}からR⁷ⁱは、独立して、HまたはR^{5a}を表す；あるいは、

R^{6a} とR^{7a}、R^{6b}とR^{7b}、R^{6d}とR^{7d}、R^{6f}とR^{7f}、R^{6g}とR^{7g}、R^{6h}とR^{7h}またはR⁶ⁱとR⁷ⁱの任意の対が、これらが付着する原子(群)と共に、3員から6員の環を形成するように、一緒に結合され、そしてその環は、必要に応じて、これらの置換基が必須で付着されている窒素原子に加えて、更なるヘテロ原子を任意に含み得、そしてまたその環は、必要に応じて、F、Cl、=O、-OR^{5h}およびR^{5a}から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得るものであり；

R⁵ⁱ、R^{5m}、およびR^{5p}は独立してR^{5a}を表し；

R^{5a}は、ここにおいて用いられる各場合において、必要に応じてハロゲン、-CN、-N₃、=O、-OR^{8a}、-N(R^{8b})R^{8c}、-S(O)_nR^{8d}、-S(O)₂N(R^{8e})R^{8f}、および-OS(O)₂N(R^{8g})R^{8h}により任意に置換され得る、C₁₋₆アルキルを表し；

nは0、1または2を表し；

R^{8a}、R^{8b}、R^{8d}、R^{8e}、およびR^{8g}は、独立して、H、または、必要に応じてハロゲン、=O、-OR^{11a}、-N(R^{12a})R^{12b}および-S(O)₂-M¹から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る、C₁₋₆アルキルを表し；

R^{8c}、R^{8f}、およびR^{8h}は、独立して、H、-S(O)₂CH₃、-S(O)₂CF₃、または、必要に応じてF、Cl、=O、-OR^{13a}、-N(R^{14a})R^{14b}および-S(O)₂-M²から選択された、1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る、C₁₋₆アルキルを表し；あるいは、

R^{8b}とR^{8c}、R^{8e}とR^{8f}、またはR^{8g}とR^{8h}は、これらが付着する原子(群)と共に、3員から6員の環を形成するように、一緒に結合され、そしてその環は、必要に応じて、これらの置換基が必須で付着されている窒素原子に加えて、更なるヘテロ原子を任意に含み得、そしてまたその環は、必要に応じて、F、Cl、=O、およびC₁₋₃アルキル(必要に応じて=Oおよびフッ素から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る)によって任意に置換され得るものであり；

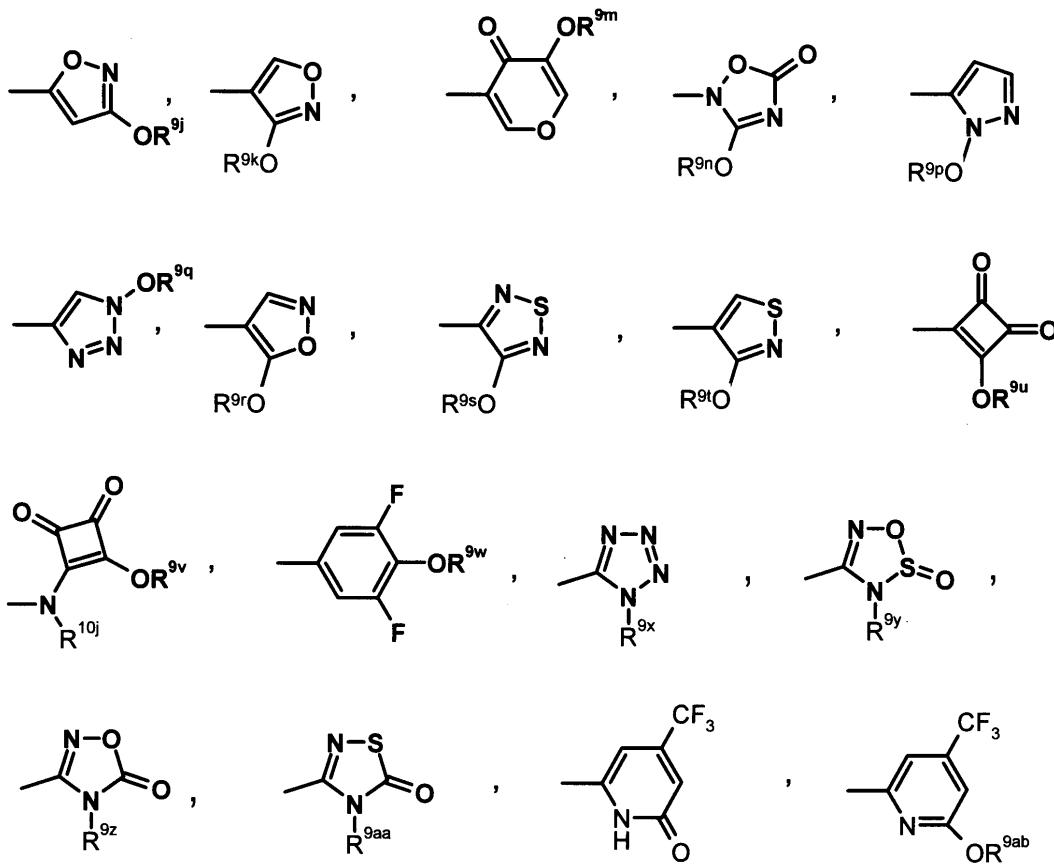
M¹およびM²は、独立して、-N(R^{15a})R^{15b}または、必要に応じて1ないしそれ以上のフッ素原子によって任意に置換され得るC₁₋₃アルキルを表し；

R^{11a}とR^{13a}は、独立して、Hまたは、1ないしそれ以上のフッ素原子によって任意に置換され得るC₁₋₃アルキルを表し；

R^{12a}、R^{12b}、R^{14a}、R^{14b}、R^{15a}、およびR^{15b}は、独立してH、-CH₃または-CH₂CH₃を表し；

Y¹およびY^{1a}は、ここにおいて用いられる各場合において、独立して、-N(H)SO₂R^{9a}、-C(H)(CF₃)OH、-C(O)CF₃、-C(OH)₂CF₃、-C(O)OR^{9b}、-S(O)₃R^{9c}、-P(O)(OR^{9d})₂、-P(O)(OR^{9e})N(R^{10f})R^{9f}、-P(O)(N(R^{10g})R^{9g})₂、-B(OR^{9h})₂、-C(CF₃)₂OH、-S(O)₂N(R^{10i})R⁹ⁱ、または以下のいずれか1つの基：

を表し；



R^{9a} から R^{9z} 、 R^{9aa} 、 R^{9ab} 、 R^{10f} 、 R^{10g} 、 R^{10i} および R^{10j} は、独立して、 C_{1-8} アルキルまたはヘテロシクロアルキル基（これらのいずれも、必要に応じて、 G^1 および/または Z^1 から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。）を表し；または R^{9a} から R^{9z} 、 R^{9aa} 、 R^{9ab} 、 R^{10f} 、 R^{10g} 、 R^{10i} および R^{10j} は、独立して、水素を表し；あるいは、

R^{9a} から R^{9z} 、 R^{9aa} 、 R^{10f} 、 R^{10g} 、 R^{10i} および R^{10j} は、独立して、 C_{1-8} アルキルまたはヘテロシクロアルキル基（これらのいずれも、必要に応じて、 G^1 および/または Z^1 から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。）を表し；または R^{9a} から R^{9z} 、 R^{9aa} 、 R^{10f} 、 R^{10g} 、 R^{10i} および R^{10j} は、独立して、水素を表し；あるいは、 R^{9f} と R^{10f} 、 R^{9g} と R^{10g} 、および、 R^{9i} と R^{10i} の任意の対が、これらが付着する原子（群）と共に、3員から6員の環を形成するように、一緒に結合され、そしてその環は、必要に応じて、これらの置換基が必須で付着されている窒素原子に加えて、更なるヘテロ原子を任意に含み得、そしてまたその環は、必要に応じて、F、Cl、=O、-OR^{5h}およびR^{5a}から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得るものであり；

Y^2 および Y^3 の一方は、アリール基またはヘテロアリール基（これらのいずれも、必要に応じて、Aから選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。）を表し、他方は：

- (a) アリール基またはヘテロアリール基（これらのいずれも、必要に応じて、Aから選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。）または、
- (b) 必要に応じて、 G^1 および/または Z^1 から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る、 C_{1-12} アルキル

但し、ここで

- (a) Y^2 が C_{1-12} アルキルを表す場合には、これは、1ないしそれ以上の G^1 置換基によって任意に置換され得る C_{1-6} アルキルであり；そして
- (b) Y^3 が C_{1-12} アルキルを表す場合には、これは、1ないしそれ以上の G^1 置換基によって任意に置換され得る環状 C_{3-6} アルキル基である；

を表し；

Aは、

I) アリール基またはヘテロアリール基（これらのいずれも、必要に応じて、Bから選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。）；

II) C_{1-8} アルキルまたはヘテロシクロアルキル基（これらのいずれも、必要に応じて、G¹および/またはZ¹から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。）；または

III) G¹基；

を表し；

G¹は、ハロゲン、シアノ、-N₃、-NO₂、-ONO₂または-A¹-R^{16a}を表し；

ここで、A¹は単結合、または-C(O)A²-、-S-、-S(O)₂A³-、-N(R^{17a})A⁴-または、-OA⁵-から選択されたスペーサー基を表し、ここで：

A²は単結合、-O-、-N(R^{17b})-、または-C(O)-を表し；

A³は単結合、-O-、または-N(R^{17c})-を表し；

A⁴およびA⁵は、独立して、単結合、-C(O)-、-C(O)N(R^{17d})-、-C(O)O-、-S(O)₂-、または-S(O)₂N(R^{17e})-を表し；

Z¹は、=O、=S、=NOR^{16b}、=NS(O)₂N(R^{17f})R^{16c}、=NCNまたは=C(H)NO₂を表し；

Bは、

I) アリール基またはヘテロアリール基（これらのいずれも、必要に応じて、G²から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。）；

II) C_{1-8} アルキルまたはヘテロシクロアルキル基（これらのいずれも、必要に応じて、G²および/またはZ²から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。）；または

III) G²基；

を表し；

G²は、ハロゲン、シアノ、-N₃、-NO₂、-ONO₂または-A⁶-R^{18a}を表し；

ここで、A⁶は単結合、または-C(O)A⁷-、-S-、-S(O)₂A⁸-、-N(R^{19a})A⁹-または、-OA¹⁰-から選択されたスペーサー基を表し、ここで：

A⁷は単結合、-O-、-N(R^{19b})-、または-C(O)-を表し；

A⁸は単結合、-O-、または-N(R^{19c})-を表し；

A⁹およびA¹⁰は、独立して、単結合、-C(O)-、-C(O)N(R^{19d})-、-C(O)O-、-S(O)₂-または-S(O)₂N(R^{19e})-を表し；

Z²は、=O、=S、=NOR^{18b}、=NS(O)₂N(R^{19f})R^{18c}、=NCNまたは=C(H)NO₂を表し；

R^{16a}、R^{16b}、R^{16c}、R^{17a}、R^{17b}、R^{17c}、R^{17d}、R^{17e}、R^{17f}、R^{18a}、R^{18b}、R^{18c}、R^{19a}、R^{19b}、R^{19c}、R^{19d}、R^{19e}およびR^{19f}は、独立して、

i) 水素；

ii) アリール基またはヘテロアリール基（これらのいずれも、必要に応じて、G³から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。）；

iii) C_{1-8} アルキルまたはヘテロシクロアルキル基（これらのいずれも、必要に応じて、G³および/またはZ³から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。）；

から選択されたものであり：、あるいは、

R^{16a}からR^{16c}とR^{17a}からR^{17f}、並びに/または、R^{18a}からR^{18c}とR^{19a}からR^{19f}、の任意の対が、これらと共に、あるいはその他の関連する原子群と共に、3員から8員の環をさらに形成するように、一緒に結合され、そしてその環は、必要に応じて、1~3個のヘテロ原子および/または1~3個の二重結合を任意に含み得、またその環は、必要に応じて、G³および/またはZ³から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得るものであり；

G³は、ハロゲン、シアノ、-N₃、-NO₂、-ONO₂または-A¹¹-R^{20a}を表し；

ここで、A¹¹は単結合、または-C(O)A¹²-、-S-、-S(O)₂A¹³-、-N(R^{21a})A¹⁴-または、-OA¹⁵

- から選択されたスペーサー基を表し、ここで：

A^{12} は単結合、-O-、-N(R^{21b})-、または-C(O)-を表し；

A^{13} は単結合、-O-、または-N(R^{21c})-を表し；

A^{14} および A^{15} は、独立して、単結合、-C(O)-、-C(O)N(R^{21d})-、-C(O)O-、-S(O)₂-または-S(O)₂N(R^{21e})-を表し；

Z^3 は、=O、=S、=NOR^{20b}、=NS(O)₂N(R^{21f})R^{21c}、=NCNまたは=C(H)NO₂を表し；

R^{20a} 、 R^{20b} 、 R^{20c} 、 R^{21a} 、 R^{21b} 、 R^{21c} 、 R^{21d} 、 R^{21e} および R^{21f} は、独立して、

i) 水素；

ii) C_{1-8} アルキルまたはヘテロアルキル基(これらのいずれも、必要に応じて、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、-N(R^{22a})R^{23a}、-OR^{22b}、および=Oから選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。)；および

iii) アリール基またはヘテロアリール基(これらのいずれも、必要に応じて、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル(必要に応じて、=O、フッ素および塩素から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。)、-N(R^{22c})R^{23b}、および-OR^{22d}から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。)；

から選択されたものであり；あるいは、

R^{20a} から R^{20c} と R^{21a} から R^{21f} の任意の対が、これらと共に、あるいはその他の関連する原子群と共に、3員から8員の環をさらに形成するように、一緒に結合され、そしてその環は、必要に応じて、1～3個のヘテロ原子および/または1もしくは2個の二重結合を任意に含み得、またその環は、必要に応じて、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、-N(R^{22e})R^{23c}、-OR^{22f}および=Oから選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得るものであり；

L^1 および L^{1a} は、独立して、単結合、または-(CH₂)_p-Q-(CH₂)_q-を表し；

Qは-C(R^{y1})(R^{y2})-、-C(O)-または-O-を表し；

R^{y1} および R^{y2} は、独立してH、Fまたは X^4 を表し、あるいは、

R^{y1} および R^{y2} は、3員から6員の環を形成するように、一緒に結合され、そしてその環は、必要に応じて、ヘテロ原子を任意に含み得、そしてまたその環は、必要に応じて、F、C1、=O、および X^5 から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得るものであり；

L^2 および L^3 は、独立して、単結合、または-(CH₂)_p-C(R^{y3})(R^{y4})-(CH₂)_q- A^{16} -、-C(O) A^{17} -、-S-、-SC(R^{y3})(R^{y4})-、-S(O)₂ A^{18} -、-N(R^W) A^{19} -または、-OA²⁰-から選択されたスペーサー基を表し、ここで：

A^{16} は単結合、-O-、-N(R^W)-、-C(O)-または-S(O)_m-を表し；

A^{17} および A^{18} は、独立して、単結合、-C(R^{y3})(R^{y4})-、-O-、または-N(R^W)-を表し；

A^{19} および A^{20} は、独立して、単結合、-C(R^{y3})(R^{y4})-、-C(O)-、-C(O)C(R^{y3})(R^{y4})-、-C(O)N(R^W)-、-C(O)O-、-S(O)₂-または-S(O)₂N(R^W)-を表し；

pおよびqは、独立して、0、1または2を表し；

mは0、1または2を表し；

R^{y3} および R^{y4} は、独立して、H、Fまたは X^6 を表し；あるいは、

R^{y3} および R^{y4} は、3員から6員の環を形成するように、一緒に結合され、そしてその環は、必要に応じて、ヘテロ原子を任意に含み得、そしてまたその環は、必要に応じて、F、C1、=O、および X^7 から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得るものであり；

R^W は、Hまたは X^8 を表し；

X^4 ～ X^8 は、独立して、 C_{1-6} アルキル(必要に応じて、ハロゲン、-CN、-N(R^{24a})R^{25a}、-OR^{24b}、=O、アリール、およびヘテロアリール(後の2つの基は、必要に応じて、ハロゲン、-CN、 C_{1-4} アルキル(必要に応じて、フッ素、塩素および=Oから選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。)、-N(R^{24c})R^{25b}および-OR^{24d}から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。)、アリール、またはヘテロアリール(後の2つの基は、必要に応じて、ハロゲン、-CN、 C_{1-4} アルキル(必要に応じて

、フッ素、塩素および=0から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。)、-N(R^{26a})R^{26b}および-OR^{26c}から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。)を表し;

R^{22a}、R^{22b}、R^{22c}、R^{22d}、R^{22e}、R^{22f}、R^{23a}、R^{23b}、R^{23c}、R^{24a}、R^{24b}、R^{24c}、R^{24d}、R^{25a}、R^{25b}、R^{26a}、R^{26b}およびR^{26c}は、独立して、ハロゲンおよびC₁₋₄アルキル(後者の基は、必要に応じて、フッ素、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃および/または=0から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。)から選択されてなるものである。]

の化合物、またはその薬学的に許容される塩またはそれらのプロドラッグであって、D₁、D₂、およびD₃が全て、-C(H)=を表し;環Aが環(I)を表し;E^{a1}、E^{a2}、E^{a3}、E^{a4}およびE^{a5}が、それぞれ、-C(H)=、-C(R^{2b})=、-C(R^{2c})=、-C(R^{2d})=および-C(H)=を表し;R^{2d}がHを表し;L¹およびL¹²が共に単結合を表し;Y¹およびY^{1a}が共に-C(O)OR^{9b}を表し;R^{9b}がHを表す場合に:

(A) R^{2c}は-L³-Y³を表し;R^{2b}が-L^{1a}-Y^{1a}を表し;L²およびL³が共に-N(R^W)A¹⁹-を表し;R^WがHを表し;A¹⁹が-C(O)-を表すと、Y²およびY³がいずれも1-ナフチルを表すことにはならず;

(B) L²およびL³が共に-C(O)A¹⁷-を表し、A¹⁷が-N(R^W)-を表し;R^WがHを表す場合であって:

(i) R^{2b}が-L³-Y³を表し;R^{2c}が-L^{1a}-Y^{1a}を表すと:

(I) Y²およびY³はともに、4-ピリジル、2-ピリジル、4-メチルフェニルまたは4-メトキシフェニルを表すことにはならず;

(II) Y²およびY³はともに、メタ位においてG¹置換基(ここでG¹は、塩素を表す)によって置換されたフェニル、そしてパラ位においてG¹(ここでG¹は、-A¹-R^{16a}を表し;A¹は単結合を表し、そしてR^{16a}は、第3位において=0であるZ³基で置換され、第4位で2つのG³基(ここでG³基は-A¹¹-R^{20a}を表し、A¹¹は単結合を表し;そしてR^{20a}は-CH₃を表す。)で置換されたメチルで置換されたフェニルを表すことにはならず;

(ii) R^{2c}が-L³-Y³を表し;R^{2b}が-L^{1a}-Y^{1a}を表すと:

(I) Y²およびY³はともに、4-プロモフェニル、フェニル、4-メチルフェニルまたは4-メトキシフェニル、3-ニトロ-4-アミノフェニルまたは3-ニトロ-4-ヒドロキシフェニルを表すことにはならない、あるいは、;Y²およびY³のいずれか一方は、他方が未置換フェニルを表す場合には、4-プロモフェニルを表すことにはならず;

(II) Y²およびY³がともに、Aによって置換されたフェニルを表す場合、

(1) AはG¹を表し;G¹は-A¹-R^{16a}を表し;R^{16a}はG³によって置換されたフェニルを表し;G³は-A¹¹-R^{20a}を表し;-A¹¹は-N(R^{21a})A¹⁴を表し;A¹⁴は-C(O)-を表し;R^{21a}はHを表し;そしてR^{20a}は=0と-OR^{22b}基との双方で同じ炭素原子において末端置換されたアルキル基を表すものであって、ここにおいて、

(a) AとG³がともにパラ位にあり、そして、R^{20a}が、-CH=C(CH₃)₂であるC₄アルキル基、または-C(H)=C(H)-CH₃であるC₃アルキル基(これらの双方はCH₃基群のいずれか1つにおいて末端置換されている。)であり、更に、A¹が-OA⁵-を表す場合には、A⁵は単結合を表すものではなく;

(b) AとG³がともにパラ位にあり、そして、R^{20a}が、-CH=C(CH₃)₂(このCH₃基で末端置換されている)を表し、更に、A¹が-S(O)₂A³を表す場合には、A³は単結合を表すものではなく;

(c) AとG³がともにメタ位にあり、そして、R^{20a}が、-C(H)=C(H)-CH₃(このCH₃基で末端置換されている)を表し、更に、A¹が-S(O)₂A³を表す場合には、A³は単結合を表すものではなく;

(2) Aが、G¹基によって置換されたメチルを表し;G¹が-A¹-R^{16a}を表し;A¹が単結合を表し;R^{16a}がパラ位においてG³によって置換されたフェニルを表し;G³が-A¹¹-R^{20a}を表し;-A¹¹が-N(R^{21a})A¹⁴を表し;A¹⁴が-C(O)-を表し;R^{21a}がHを表し;そしてR^{20a}が、-CH₂-C(=CH₂)-CH₃であるC₄アルキル基、または-C(H)=C(H)-CH₃であるC₃アルキル基である場合

、これら最後の2つのアルキル基は、いずれもそれぞれ-CH₃部分において、=Oと-OR^{22b}基(ここでR^{22b}は水素である。)との双方で末端置換されたものとはならない;との条件を満たす、化合物またはその薬学的に許容される塩またはそれらのプロドラッグ。

【請求項2】

Y²およびY³の一方が、アリールまたはヘテロアリール(これらのいずれも、Aから選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。)を表し、他方は、

(a) アリールまたはヘテロアリール(これらのいずれも、Aから選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。)または、

(b) 1ないしそれ以上のG¹置換基によって任意に置換され得る、環状C₃₋₆アルキル基である、

請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

Y²およびY³が、独立して、アリールまたはヘテロアリール(これらのいずれも、Aから選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換され得る。)を表すものである請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

L³(および/またはL²)が-OA²⁰-、-S-、-SC(R^{Y3})(R^{Y4})-、-(CH₂)_p-C(R^{Y3})(R^{Y4})-(CH₂)_q-A¹⁶-、-S(O)₂A¹⁸-または-N(R^W)A¹⁹-で表されるものである請求項1~3のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項5】

D₁、D₂、およびD₃が、独立して、-C(H)=を表すものである、請求項1~4のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項6】

環Aが環(I)を表すものである、請求項1~5のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項7】

E^{a1}およびE^{a5}が、独立して、-C(H)=を表し、また、E^{a2}、E^{a3}およびE^{a4}が、それぞれ、-C(R^{2b})=、-C(R^{2c})=および-C(R^{2d})=を表すものである、請求項1~6のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項8】

R^{2b}が、水素または-L^{1a}-Y^{1a}を表すものである、請求項1~7のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項9】

R^{2c}が、必須の-L³-Y³を表すものである、請求項1~8のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項10】

R^{2d}が、Hを表すものである、請求項1~9のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項11】

L¹およびL^{1a}が、独立して、単結合を表すものである、請求項1~10のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項12】

Y¹およびY^{1a}が、独立して、-C(O)OR^{9b}を表すものである、上記した請求項1~11のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項13】

R^{9b}が、C₁₋₆アルキルまたはHを表すものである、請求項1~12のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項14】

L²およびL³が、独立して、-N(R^W)A¹⁹-を表すものである、請求項1~13のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項15】

A¹⁹が、単結合、-S(O)₂-、-C(O)-または-C(O)N(R^W)-を表すものである、請求項1~14

のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項16】

R^w が、 C_{1-3} アルキルまたはHを表すものである、請求項1～15のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項17】

Y^2 および Y^3 が、独立して、任意に置換された、フェニル、ナフチル、ピロリル、フラニル、チエニル、イミダゾーリル、オキサゾーリル、イソキサゾーリル、チアゾーリル、ピラゾーリル、ピリジル、インダゾーリル、インドリル、インドニリル、イソインドリニル、キノリニル、1,2,3,4-テトラヒドロキノリニル、イソキノリニル、1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリニル、キノリジニル、ベンゾキサゾーリル、ベンゾフラニル、イソベンゾフラニル、クロマニル、ベンゾチエニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、インダゾーリル、ベンゾイミダゾーリル、キナゾリニル、キノキサリニル、1,3-ベンゾジオキソリル、テトラゾーリル、ベンゾチアゾーリル、および/または、ベンゾジオキサニルを表すものである、請求項1～16のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項18】

Y^2 および Y^3 が、独立して、任意に置換された、ナフチル、2-ベンゾキサゾーリル、2-ベンゾイミダゾーリル、2-ベンゾチアゾーリル、チエニル、オキサゾーリル、チアゾーリル、ピリジル、またはフェニルを表すものである、請求項17に記載の化合物。

【請求項19】

Y^2 および Y^3 が、独立して、必要に応じてAより選択された1ないしそれ以上の任意の置換基によって置換された、フェニルを表すものである、請求項18に記載の化合物。

【請求項20】

前記任意の置換基が、

ハロゲン；シアノ； $-NO_2$ ；必要に応じて1ないしそれ以上のハロゲン基で任意に置換された C_{1-6} アルキル；必要に応じて C_{1-3} アルキルおよび=0から選択された1ないしそれ以上の置換基で任意に置換されたヘテロシクロアルキル； $-OR^{26}$ ； $-C(O)R^{26}$ ； $-C(O)OR^{26}$ ；および $-N(R^{26})R^{27}$

(ここで、 R^{26} および R^{27} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル(必要に応じて1ないしそれ以上のハロゲンにより任意に置換され得る。)、または、アリール(必要に応じて1ないしそれ以上のハロゲンまたは C_{1-3} アルキル基(当該アルキル基は、必要に応じて1ないしそれ以上のハロゲン原子により任意に置換され得る。)を表すものである。)

から、選択されたものである、請求項17～19のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項21】

Aが、 G^1 、または、必要に応じて G^1 から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換された C_{1-6} アルキルを表すものである、請求項1～20のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項22】

G^1 が、ハロゲン、 NO_2 または $-A^1-R^{16a}$ 表すものである、請求項1～21のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項23】

A^1 が、-0-を表すものである、請求項1～22のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項24】

R^{16a} が、水素または、必要に応じて G^3 から選択された1ないしそれ以上の置換基によって任意に置換された C_{1-6} アルキルを表すものである、請求項1～23のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項25】

G^3 がハロゲンを表すものである、請求項1～24のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項26】

請求項1に定義された条件(B)を除いて、請求項1～25のいずれか1つにおいて定義されたものである、式1の化合物、またはその薬学的に許容される塩を含んでなる薬剤。

【請求項 27】

請求項1に定義された条件(B)を除いて、請求項1～25のいずれか1つにおいて定義されたものである、式1の化合物、またはその薬学的に許容される塩を、薬学的に許容されるアジュバント、希釈剤または担体との混合物の形態で含んでなる薬剤組成物。

【請求項 28】

請求項1に定義された条件群を除いて、請求項1～25のいずれか1つにおいて定義されたものである、式1の化合物、またはその薬学的に許容される塩を含む、ロイコトリエンC₄の合成の阻害が望まれるおよび／または必要とされる疾患の治療に使用するための薬剤。

【請求項 29】

請求項1に定義された条件群を除いて、請求項1～25のいずれか1つにおいて定義されたものである、式1の化合物、またはその薬学的に許容される塩の、ロイコトリエンC₄の合成の阻害が望まれるおよび／または必要とされる疾患の治療のための薬剤の製造のための、使用。

【請求項 30】

疾患が、呼吸性疾患、炎症および／または、炎症性成分を持っているものである、請求項28に記載の薬剤。

【請求項 31】

疾患が、呼吸性疾患、炎症および／または、炎症性成分を持っているものである、請求項29に記載の使用。

【請求項 32】

疾患が、アレルギー性疾患、喘息、小児喘鳴、慢性閉塞性肺疾患、気管支肺異形成症、囊胞性纖維症、間質性肺疾患、耳鼻咽喉の疾患、目の疾患、皮膚疾患、リウマチ性疾患、脈管炎、心血管疾患、胃腸疾患、泌尿器疾患、中枢神経系の疾患、内分泌疾患、蕁麻疹、過敏性、血管性浮腫、クワシオルコルにおける浮腫、月経困難症、熱傷誘発性の酸化損傷、多発性外傷、疼痛、毒性油症候群、内毒素ショック、敗血症、細菌感染症、真菌感染症、ウイルス感染症、鎌状赤血球貧血症、過好酸球性症候群、または悪性腫瘍である、請求項30に記載の薬剤。

【請求項 33】

疾患が、アレルギー性疾患、喘息、小児喘鳴、慢性閉塞性肺疾患、気管支肺異形成症、囊胞性纖維症、間質性肺疾患、耳鼻咽喉の疾患、目の疾患、皮膚疾患、リウマチ性疾患、脈管炎、心血管疾患、胃腸疾患、泌尿器疾患、中枢神経系の疾患、内分泌疾患、蕁麻疹、過敏性、血管性浮腫、クワシオルコルにおける浮腫、月経困難症、熱傷誘発性の酸化損傷、多発性外傷、疼痛、毒性油症候群、内毒素ショック、敗血症、細菌感染症、真菌感染症、ウイルス感染症、鎌状赤血球貧血症、過好酸球性症候群、または悪性腫瘍である、請求項31に記載の使用。

【請求項 34】

疾患が、アレルギー性疾患、喘息、鼻炎、結膜炎、COPD、囊胞性纖維症、皮膚疾患、蕁麻疹、好酸球性胃腸疾患、炎症性腸疾患、リウマチ様関節炎、骨関節炎または疼痛である請求項32に記載の薬剤。

【請求項 35】

疾患が、アレルギー性疾患、喘息、鼻炎、結膜炎、COPD、囊胞性纖維症、皮膚疾患、蕁麻疹、好酸球性胃腸疾患、炎症性腸疾患、リウマチ様関節炎、骨関節炎または疼痛である請求項33に記載の使用。

【請求項 36】

ロイコトリエンC₄の合成の阻害が望まれるおよび／または必要とされる疾患の治療方法であって、請求項1に定義された条件群を除いて、請求項1～25のいずれか1つにおいて定義されたものである、式1の化合物、またはその薬学的に許容される塩を、このような症状を病む、あるいはこのような症状に感受性のヒトを除く患者に対し、治療学的に有効な量で投与することでなる、疾患の治療方法。

【請求項 3 7】

- (A) 請求項 1 に定義された条件群を除いて、請求項 1 ~ 2 5 のいずれか 1 つにおいて定義されたものである、式 I の化合物、またはその薬学的に許容される塩；および
 (B) 呼吸性疾患および / または炎症の治療に有用な他の治療薬
 を含んでなり、成分 (A) と (B) のそれぞれが、薬学的に許容されるアジュバント、希釈剤または担体との混合物の形態で組成物とされていることを特徴とする、組合せ製品。

【請求項 3 8】

請求項 1 に定義された条件群を除いて、請求項 1 ~ 2 5 のいずれか 1 つにおいて定義されたものである、式 I の化合物、またはその薬学的に許容される塩；呼吸性疾患および / または炎症の治療に有用な他の治療薬；ならびに、薬学的に許容されるアジュバント、希釈剤または担体を含む 1 つの薬学的組成物からなることを特徴とする請求項 3 7 に記載の組合せ製品。

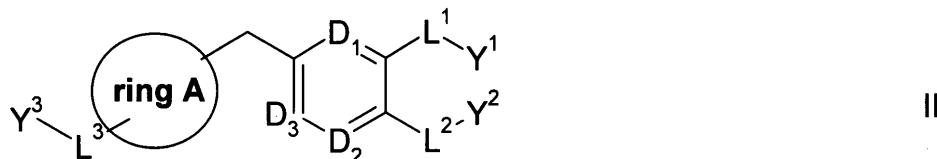
【請求項 3 9】

- (a) 請求項 1 に定義された条件群を除いて、請求項 1 ~ 2 5 のいずれか 1 つにおいて定義されたものである、式 I の化合物、またはその薬学的に許容される塩；および、薬学的に許容されるアジュバント、希釈剤または担体を含む 1 つの薬学的組成物からなる部分；ならびに、
 (b) 呼吸器疾患および / または炎症の治療に有用な他の治療薬；および、薬学的に許容されるアジュバント、希釈剤または担体を含む 1 つの薬学的組成物からなる部分
 を含み、部分 (a) と部分 (b) が、それぞれ、他方と併用して投与するために適した形態において与えられているものである、当該部分のキットからなることを特徴とする請求項 3 7 に記載の組合せ製品。

【請求項 4 0】

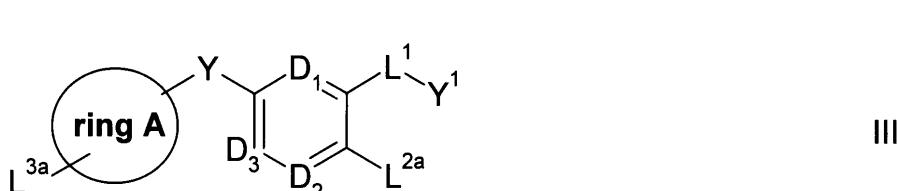
以下の方法を含んでなることを特徴とする、請求項 1 に定義された式 I の化合物の調製方法：

- (i) Y が -C(O)- を表す式 I の化合物群に関して、
 式 II



(上式中、環 A、D₁、D₂、D₃、L¹、Y¹、L²、Y²、L³ および Y³ は、請求項 1 において先に定義したとおりのものである。) の化合物の酸化；

- (ii) L²、および / または、L³ が -N(R^W)A¹⁹- を表し、ここで R^W が H を表す式 I の化合物群に関して、
 式 III



(上式中、L^{2a} は -NH₂ または -N(R^W)A¹⁹-Y² を表し、L^{3a} は -NH₂ または -N(R^W)A¹⁹-Y³ を表す。ただし、少なくとも L^{2a} と L^{3a} の一方が、-NH₂ を表すものである。Y、環 A、D₁、D₂、D₃、L¹、および Y¹ は、請求項 1 において先に定義したとおりのものである。) の化合物またはその保護された誘導体と、以下の化合物との反応：

- (A) A¹⁹ が -C(O)N(R^W)- を表し、ここで、R^W が H を表す場合：
 (a) 式 IV の化合物：



IV

または

(b) CO(または、COの適当な源である試薬)、もしくは、式Vの化合物：



V

の存在下におけるホスゲンまたはトリホスゲンなどの試薬

(ここで、どちらの場合も、 Y^a は、請求項1において先に定義したとおりの Y^2 または Y^3 (適切であるか/必要であるかによる)を表すものである。)

(B) A^{19} が $-S(O)_2N(R^w)$ -を表す場合：

(a) $CISO_3H$ 、 PCl_5 、そして、その後、上記において定義されるような式Vの化合物；

(b) SO_2Cl_2 、次いで、上記において定義されるような式Vの化合物；

(c) 式VAの化合物



VA

(上式中、 Y^a は、上記において定義したとおりのものである。)；

(d) $CISO_2N=C=O$ 、次いで、上記において定義されるような式Vの化合物；

(C) A^{19} が単結合を表す場合：

式VIの化合物



VI

(上式中、 L^a は、適当な脱離基を表し、 Y^a は、先に定義したとおりのものである。)；

(D) A^{19} が、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(R^{y3})(R^{y4})-$ 、 $-C(O)-C(R^{y3})(R^{y4})-$ 、または $-C(O)O-$ を表す場合：

式VIIの化合物：

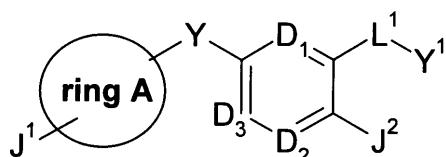


VII

(上式中、 A^{19a} は、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(R^{y3})(R^{y4})-$ 、 $-C(O)-C(R^{y3})(R^{y4})-$ または $-C(O)O-$ を表し、 Y^a および L^a は、先に定義したとおりのものである。)；

(iii) L^2 および L^3 の一方が $-N(R^w)C(O)N(R^w)$ -を表し、他方が $-NH_2$ (またはその保護された誘導体)または $-N(R^w)C(O)N(R^w)$ -を表し、 R^w はHを表す(すべての場合)、化学式Iの化合物群について、

式VIII



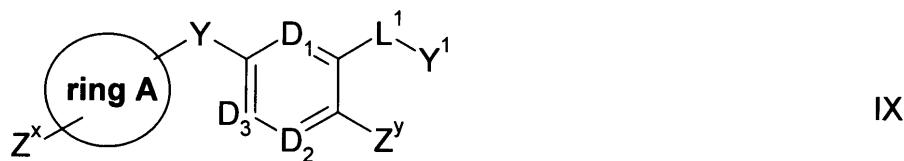
VIII

(上式中、 J_1 または J_2 の一方は、 $-N=C=O$ を表し、他方が $-NH_2$ (または、その保護された誘導体)または $-N=C=O$ を表し(適宜なもの)、そして、 Y 、環A、 D_1 、 D_2 、 D_3 、 L^1 および Y^1 は、請求項1において先に定義したとおりのものである。)の化合物の、

上記において定義したような式Vの化合物との、反応；

(iv) L^2 および L^3 が独立して、単結合、 $-S-$ 、 $-SC(R^{y3})(R^{y4})-$ 、 $-N(R^w)A^{19}-$ または $-OA^{20}-$ を表すものである、式Iの化合物群について、

式IX



(上式中、 Z^X および Z^Y の少なくとも 1 つが、適当な脱離基を表し、他方はまた、独立して、適当な脱離基を表す、または、 Z^Y は、 $-L^2-Y^2$ を表し得、そして Z^X は、 $-L^3-Y^3$ を表し得るものであり、そして、Y、環A、 D_1 、 D_2 、 D_3 、 L^1 、 Y^1 、 L^2 、 Y^2 、 L^3 および Y^3 は、請求項 1において先に定義したとおりのものである。) の化合物の、式X



(上式中、 L^x は単結合、 $-S-$ 、 $-SC(R^y)^3(R^y)^4-$ 、 $-N(R^W)A^{19}$ -または $-OA^{20}$ -を表し、 Y^a は、先に定義したとおりのものである。)の1つの(または2つの異なる)化合物(群)(適切であるか/必要であるかによる)との、反応:

(v) 水素を表すものではないR^w基が存在する場合(あるいは、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷、R¹⁸、R¹⁹、R²⁰、R²¹、R²²、R²³、R²⁴、R²⁵またはR²⁶基が存在する場合に、これが窒素または酸素のようなヘテロ原子に結合し、そしてこれが水素を表すものではない場合)の式Iの化合物群は、水素を表すものであるこのような基が存在する式Iの相応する化合物を、

式XIの化合物



(上式中、 R^WY は、請求項1において定義したような、但し、これが水素を表すものではない R^W （適宜のもの）を表し（あるいは R^W は $R^5 \sim R^{19}$ 基の1つを表し、ここにおいてこれらの基は水素を表すものではない。）、そして L^b は、適当な脱離基を表す。）と、反応させることによって調製可能：

(vi) 飽和アルキル基群のみを含む式 T の化合物群に関して

不飽和結合を含む、式 I の相應する化合物の還元：

(vii) Y^1 および / または、存在している場合に、 Y^{1a} が、 $-C(O)OR^{9b}$ 、 $-S(O)_3R^{9c}$ 、 $-P(O)(OR^{9d})_2$ 、または $-B(OR^{9h})_2$ を表し、ここにおいて、 R^{9b} 、 R^{9c} 、 R^{9d} および R^{9h} が水素を表すものである。式1の化合物群に関して

R^{9b} 、 R^{9c} 、 R^{9d} または R^{9h} （適宜のもの）がHを表すものではない、式Iの相応する化合物の
加水分解：または

Yが $-P(O)(OR^9d)_2$ または $S(O)_3R^9c$ を表し、ここにおいて R^9c および R^9d がHを表すものである
式1の化合物群について

Yが、 $-P(O)(OR^{9e})N(R^{10f})R^{9f}$ 、 $-P(O)(N(R^{10g})R^{9g})_2$ または $-S(O)_2N(R^{10i})R^{9i}$ （適宜のもの）を表す。式1の相應する化合物の加水分解：

(viii) Y^1 および / または、存在している場合に、 Y^{1a} が、 $-C(O)OR^{9b}$ 、 $-S(O)_3R^{9c}$ 、 $-P(O)(OR^{9d})_2$ 、 $-P(O)(OR^{9e})N(R^{10f})R^{9f}$ 、または $-B(OR^{9h})_2$ を表し、ここにおいて $R^{9b} \sim R^{9e}$ および R^{9h} が H を表さない。式 I の化合物群に関する。

ズルの適当なアリコール



(上式中、 $R^{9z a}$ は、 $R^{9b} \sim R^{9e}$ または R^{9h} (適宜のもの) を表すが、但し、 H ではない。) の存在下における

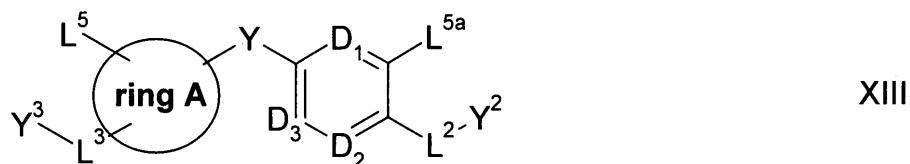
(A) $R^{9b} \sim R^{9e}$ および R^{9h} が H を表す、式 I の相応する化合物のエステル化(または、同様のもの): または

(B) P_9^{9b} ～ P_9^{9e} および P_9^{9f} がHを表さない(そして調製されるべき式)の化合物における相

応する R^9b ~ R^9e および R^9h の等価を表すものではない)、式Iの相応する化合物のエステル交換;

(ix) Y^1 および / または、存在している場合に、 Y^{1a} が、 $-C(O)OR^{9b}$ 、 $-S(O)_3R^{9c}$ 、 $-P(O)(OR^{9d})_2$ 、 $-P(O)(OR^{9e})N(R^{10f})R^{9f}$ 、 $-P(O)(N(R^{10g})R^{9g})_2$ 、 $-B(OR^{9h})_2$ または、 $-S(O)_2N(R^{10i})R^{9i}$ を表し、ここにおいて $R^{9b} \sim R^{9i}$ 、 R^{10f} 、 R^{10g} および R^{10i} が H 以外であり、そして、 L^1 および / または、存在している場合に、 L^{1a} が、請求項 1 において定義されたとおりのもの（ただし、 $-(CH_2)_p-Q-(CH_2)_q-$ （式中、p は 0 を表し、Q は $-O-$ を表す。）を表すものではない。）を表すものである、式 I の化合物群に関して、

式XIIIの化合物



(上式中、 L^5 および L^{5a} の少なくとも 1 つが、適當なアルカリ金属基、-Mg-ハロゲン化物、亜鉛系基、または適當な脱離基、またはこれらの保護された誘導体を表し、他方が、- L^{1a} - Y^1 または $-L^{1a}-Y^{1a}$ (適宜のもの)を表し、また、 Y 、環A、 D_1 、 D_2 、 D_3 、 L^2 、 Y^2 、 L^3 および Y^3 は、請求項 1 において先に定義したとおりのものである。) の、

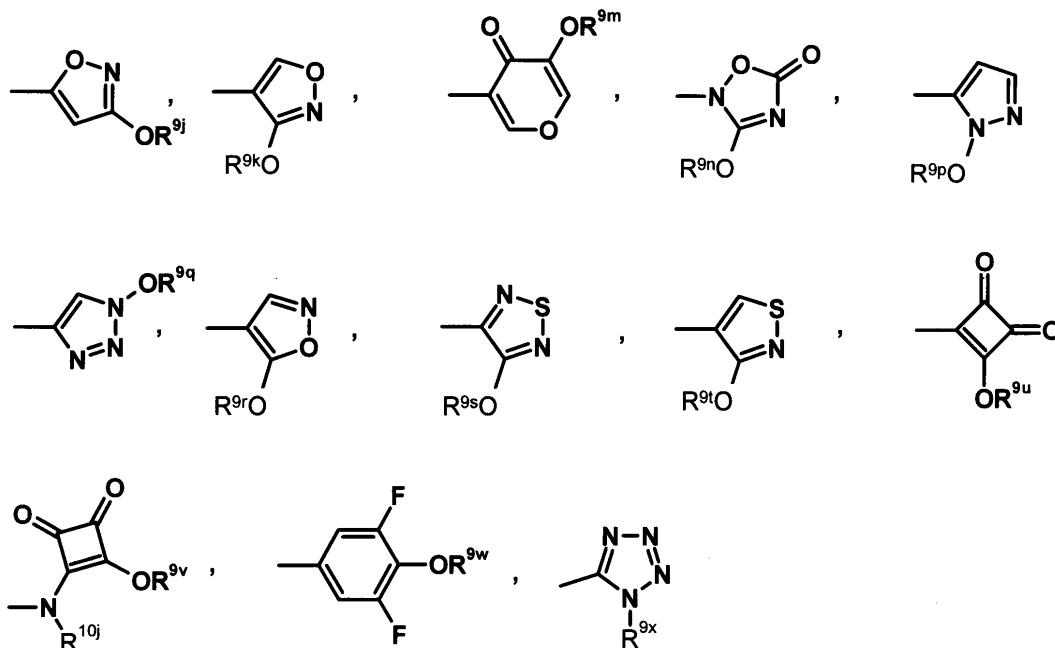
式XIVの化合物



(上式中、 L^{xy} は、 L^1 または L^{1a} (適宜のもの)を表し、 Y^b は、 $-C(O)OR^{9b}$ 、 $-S(O)_3R^{9c}$ 、 $-P(O)(OR^{9d})_2$ 、 $-P(O)(OR^{9e})N(R^{10f})R^{9f}$ 、 $-P(O)(N(R^{10g})R^{9g})_2$ 、 $-B(OR^{9h})_2$ または $-S(O)_2N(R^{10i})R^{9i}$ を表し、ここにおいて、 $R^{9b} \sim R^{9i}$ 、 R^{10f} 、 R^{10g} および R^{10i} はH以外のものであり、そして、 L^6 は、適当な脱離基を表すものである。)

との反応：

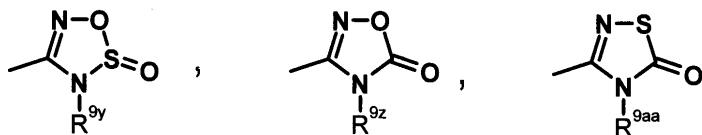
(x) L^1 および / または、存在している場合、 L^{1a} が、単結合を表し、 Y^1 および / または、存在している場合、 Y^{1a} が、 $-B(OR^{9h})_2$ (ここにおいて、 R^{9h} は H を表す。) ; $-S(O)_3R^{9c}$; または以下の基のいずれか :



(上式中、 R^9j 、 R^9k 、 R^9m 、 R^9n 、 R^9p 、 R^9r 、 R^9s 、 R^9t 、 R^9u 、 R^9v 、 R^{10j} および R^9x は水素を表し、 R^9w は請求項 1 において定義したとおりのものである。)

のいずれかを表すものである、式Iの化合物群は、国際特許出願WO2006/077366に記載されている手順に従って、調製可能であり；

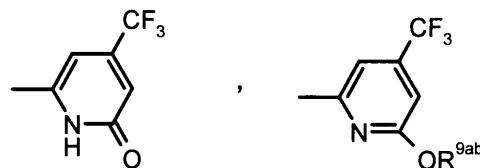
(xi) L^1 および/または、存在している場合、 L^{1a} が、単結合を表し、 Y^1 および/または、存在している場合、 Y^{1a} が、以下の基のいずれか：



(上式中、 R^{9y} 、 R^{9z} および R^{9aa} はHを表す。)を表すものである、式Iの化合物群は、式Iの化合物に相応するが、 Y^1 および/または、存在している場合、 Y^{1a} が、-CNである化合物の、

ヒドロキシルアミンとの反応（したがって、相応するヒドロキシアミジノ化合物を形成する）、およびその後の、それぞれ、 $SOCl_2$ 、 $R^j-OC(O)Cl$ （式中、 R^j は C_{1-6} アルキル基を表す。）または、チオカルボニルジイミダゾールとの反応；

(xi i) L^1 および/または、存在している場合、 L^{1a} が、単結合を表し、 Y^1 および/または、存在している場合、 Y^{1a} が、以下の基のいずれか：

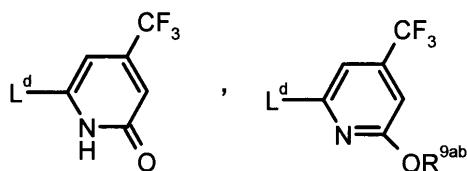


(上式中、 R^{9ab} は、請求項1において定義したとおりのものである。)を表すものである、式Iの化合物群は、

式XIIIの化合物

（式中、 L^5 および L^{5a} の少なくとも1つが、適当なアルカリ金属基、-Mg-ハロゲン化物、亜鉛系基、または適当な脱離基を表し、他方が、- L^1-Y^1 または- $L^{1a}-Y^{1a}$ （適宜のもの）を表し、また、環A、 D_1 、 D_{2a} 、 D_{2b} 、 D_3 、 L^3 および Y^3 は、請求項1において先に定義したとおりのものである。）の、

式XIVaまたは式XIVbの化合物



XIVa

XIVb

(上式中、 R^{9ab} は、請求項1において定義したとおりのものであり、 L^d は（適宜に）適当なアルカリ金属基、-Mg-ハロゲン化物、亜鉛系基、または適当な脱離基を表す。)との反応；

(xi i i) L^1 および/または、存在している場合、 L^{1a} が、単結合を表し、 Y^1 および/または、存在している場合、 Y^{1a} が、- $C(O)OR^{9b}$ を表し、ここにおいて R^{9b} がHである、式Iの化合物群に関して、

上記に定義したとおりであるが、 L^5 および/または L^{5a} （適宜のもの）が、

(I) アルカリ金属；または

(II) -Mg-ハロゲン化物

のいずれかである、式XIIIの化合物の

二酸化炭素との反応、およびその後の、酸性化；

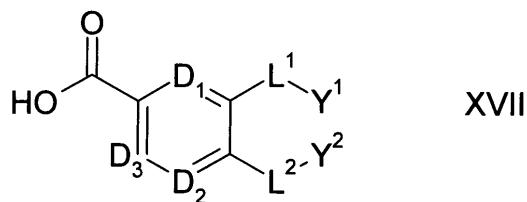
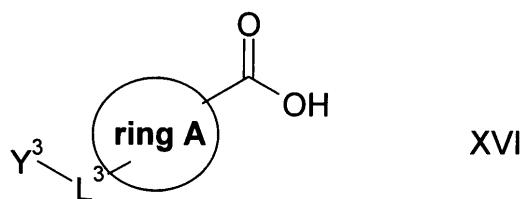
(xiv) L^1 および / または、存在している場合、 L^{1a} が、単結合を表し、 Y^1 および / または、存在している場合、 Y^{1a} が、 $-C(O)OR^{9b}$ を表すものである、式Iの化合物群に関して、上記に定義したとおりであるが、 L^5 および / または L^{5a} (適宜のもの) が、適當な脱離基である、式XIIIの化合物の、

CO(または、COの適當な源である試薬)との、
式XVの化合物

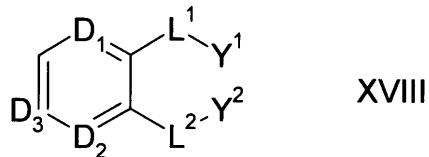


(上式中、 R^{9b} は、請求項1において定義したとおりのものである。) および適當な触媒系の存在下における、反応；

(xv) Y が $-C(O)-$ を表すものである式Iの化合物群に関して、
式XVIまたはXVIIの化合物のどちらか

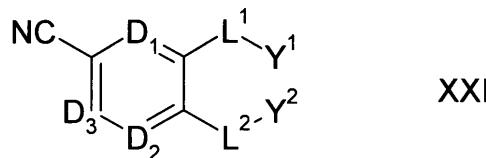
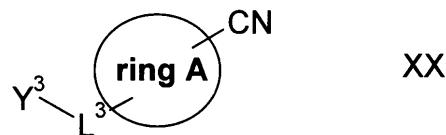


の、それぞれ式XVIIIまたはXIXの化合物

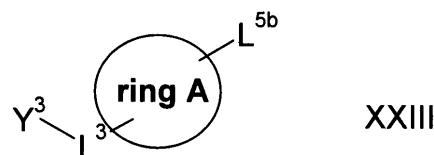
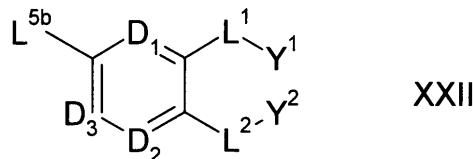


(上式中 (全ての場合において)、環A、 D_1 、 D_2 、 D_3 、 L^1 、 Y^1 、 L^2 、 Y^2 、 L^3 および Y^3 は、請求項1において定義したとおりのものである。) との、反応；

(xvi) Y が $-C(O)-$ を表す式Iの化合物群に関して、
式XXまたはXXIの化合物どちらか



の、それぞれ式XXIIまたはXXIIIの化合物



(上式中、 L^{5b} は、上記で定義されたとおりであるが、 $-L^1-Y^1$ を表すものではない、 L^5 を表すものであり、そして(全ての場合において)環A、 D_1 、 D_2 、 D_3 、 L^1 、 Y^1 、 L^2 、 Y^2 、 L^3 および Y^3 は、請求項1において定義したとおりのものである。)との、反応；

(xvii) Y が $-C(O)-$ を表す式Iの化合物群に関して、

上記に定義されたとおりの、式XVIまたはXVIIの化合物の活性化された誘導体の、それぞれ式XXIIまたはXXIIIの化合物(上記に定義したとおりのものである。)との、反応；

(xviii) Y が $-C(=N-OR^{28})-$ を表すものである式Iの化合物群に関して、

相応する式Iの化合物の、

式XXIIIAの化合物

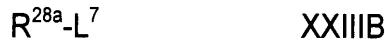


(上式中、 R^{28} は、請求項1において定義したとおりのものである)との、反応；

(xix) Y が $-C(=N-OR^{28})-$ を表し、そして R^{28} が、必要に応じて1ないしそれ以上のハロゲン原子によって任意に置換された C_{1-6} アルキルを表すものである、式Iの化合物群に関して、

R^{28} が水素を表すものである、相応する式Iの化合物の、

式XXIIIBの化合物



(上式中、 R^{28a} は R^{28} を表すものであるが、これは水素を表すものではなく、また、 L^7 は、適当な脱離基を表すものである。)との、反応；

(xx) $-L^1-Y^1$ および/または、存在している場合、 $-L^{1a}-Y^{1a}$ が $-S(O)_3H$ を表すものである、式Iの化合物群、

式Iに相応するが、 $-L^1-Y^1$ および/または $-L^{1a}-Y^{1a}$ (適宜なもの)が水素を表すものである化合物の、スルホニル化；

(xxi) $-L^1-Y^1$ および/または、存在している場合、 $-L^{1a}-Y^{1a}$ が $-S(O)_3H$ を表すものである

、式Iの化合物群、

式Iに相応するが、-L¹-Y¹および/または-L^{1a}-Y^{1a}（適宜なもの）が-SHを表すものである化合物の、酸化。

【請求項41】

請求項27において定義される薬剤組成物の調製方法であって、当該方法が、請求項1に定義された条件（B）を除いて、請求項1～25のいずれか1つにおいて定義されたものである、式Iの化合物、またはその薬学的に許容される塩を、薬学的に許容されるアジュバント、希釈剤または担体と、組み合わせることを特徴とする調製方法。

【請求項42】

請求項37～39のいずれか1つにおいて定義される組合せ製品の調製方法であって、当該方法が、請求項1に定義された条件群を除いて、請求項1～25のいずれか1つにおいて定義されたものである、式Iの化合物、またはその薬学的に許容される塩を、呼吸性疾患および/または炎症の治療に有用な他の治療薬と、少なくとも1つの薬学的に許容されるアジュバント、希釈剤または担体と、組み合わせることを特徴とする調製方法。