

【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21年9月17日(2009.9.17)

【公表番号】特表2009-503114(P2009-503114A)

【公表日】平成21年1月29日(2009.1.29)

【年通号数】公開・登録公報2009-004

【出願番号】特願2008-525242(P2008-525242)

【国際特許分類】

C 0 7 D 277/66	(2006.01)
C 0 7 D 513/04	(2006.01)
A 6 1 K 31/437	(2006.01)
C 0 7 D 417/06	(2006.01)
A 6 1 K 31/5377	(2006.01)
A 6 1 K 31/496	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)
A 6 1 P 9/00	(2006.01)
A 6 1 P 19/02	(2006.01)
A 6 1 P 25/28	(2006.01)
A 6 1 P 25/08	(2006.01)
A 6 1 P 3/10	(2006.01)
A 6 1 P 25/16	(2006.01)
A 6 1 P 25/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/14	(2006.01)
A 6 1 P 7/02	(2006.01)
A 6 1 P 9/10	(2006.01)
A 6 1 P 15/06	(2006.01)
A 6 1 P 35/00	(2006.01)
A 6 1 P 9/02	(2006.01)
A 6 1 P 35/04	(2006.01)
A 6 1 P 7/06	(2006.01)
A 6 1 P 13/12	(2006.01)
A 6 1 P 27/02	(2006.01)
A 6 1 P 27/06	(2006.01)
A 6 1 P 19/00	(2006.01)
A 6 1 P 19/04	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 277/66	C S P
C 0 7 D 513/04	3 4 3
A 6 1 K 31/437	
C 0 7 D 417/06	
A 6 1 K 31/5377	
A 6 1 K 31/496	
A 6 1 P 43/00	1 0 5
A 6 1 P 9/00	
A 6 1 P 19/02	
A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 25/08	
A 6 1 P 3/10	
A 6 1 P 25/16	

A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 25/14
A 6 1 P 7/02
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 15/06
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 9/10 1 0 1
A 6 1 P 9/02
A 6 1 P 35/04
A 6 1 P 7/06
A 6 1 P 13/12
A 6 1 P 27/02
A 6 1 P 27/06
A 6 1 P 19/00
A 6 1 P 19/04

【手続補正書】

【提出日】平成21年8月3日(2009.8.3)

【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

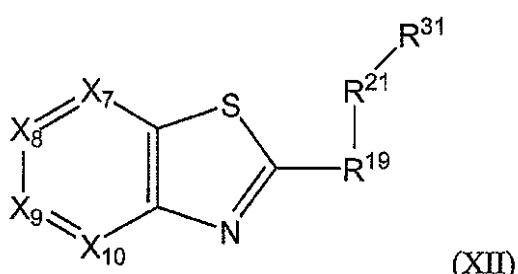
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式:

【数1】



の化合物、またはその塩であって、該式において、

X_7 、 X_8 、 X_9 および X_{10} の各々は、N、 $CR^{2\ 0}$ 、または CR_1' から独立して選択され：

各 $R^{2\ 0}$ は、Hまたは可溶化基から独立して選択され；

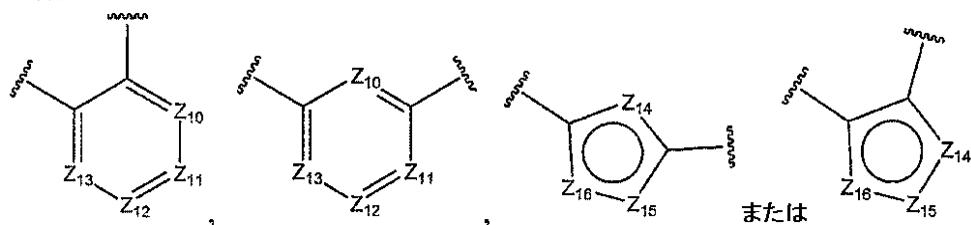
各 CR_1' は、H、または必要に応じて置換された C_1 ～ C_3 の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから独立して選択され；

X_7 、 X_8 、 X_9 および X_{10} のうちの1つはNであり、そして他のものは $CR^{2\ 0}$ または CR_1' から選択され；そして

0～1個の $R^{2\ 0}$ は可溶化基であり；

$R^{1\ 9}$ は：

【数2】



または

から選択され：

各 Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} および Z_{13} は、N、CR^{2 0}、またはCR_{1'}から独立して選択され；そして

各 Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} は、N、NR_{1'}、S、O、CR^{2 0}、またはCR_{1'}から独立して選択され：

Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} または Z_{13} のうちの 0 ~ 2 個は、N であり；

Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} のうちの少なくとも 1 個は、N、NR_{1'}、S または O であり；

Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} のうちの 0 ~ 1 個は、S または O であり；

Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} のうちの 0 ~ 2 個は、N または NR_{1'} であり；

0 ~ 1 個の R^{2 0} は可溶化基であり；

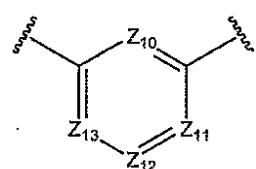
0 ~ 1 個の R_{1'} は、必要に応じて置換された C₁ ~ C₃ の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルであり；そして

R^{2 1} は、-NR_{1'}-C(O)-、-NR_{1'}-S(O)₂-、-NR_{1'}-C(O)-NR_{1'}-、-NR_{1'}-C(S)-NR_{1'}-、-NR_{1'}-C(S)-NR_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-NR_{1'}-、-NR_{1'}-C(=NR_{1'})-NR_{1'}-、-C(O)-NR_{1'}-、-C(O)-NR_{1'}-S(O)₂-、-NR_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-、-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}=C_{1'}-、-NR_{1'}-S(O)₂-NR_{1'}-、-NR_{1'}-C(O)-NR_{1'}-S(O)₂-、-NR_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-C(O)-NR_{1'}-、-C_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-C(O)-NR_{1'}-、-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}=CR_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-、-NR_{1'}-C(=N-CN)-NR_{1'}-、-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}=CR_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-、-O-、-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}R_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-O-、-NR_{1'}-S(O)₂-CR_{1'}R_{1'}-、-NR_{1'}-S(O)₂-CR_{1'}R_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-、-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}R_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-、-NR_{1'}-C(O)-O- または -NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}R_{1'}- から選択され；そして

R^{3 1} は、必要に応じて置換された単環式アリールもしくは二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式ヘテロアリールもしくは二環式ヘテロアリールから選択され、ただし：

X₇ が N であり、R^{1 9} が

【数3】



であり、そして Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} および Z_{13} の各々が CR^{2 0}、または CR_{1'} から独立して選択される場合：

a) X₈、X₉ または X₁₀ のうちの少なくとも 1 個は、C-(C₁ ~ C₃ 直鎖アルキル)、C-(C₁ ~ C₃ 分枝鎖アルキル) または C-(可溶化基) であるか；あるいは

b) $Z_{1\ 0}$ 、 $Z_{1\ 1}$ 、 $Z_{1\ 2}$ および $Z_{1\ 3}$ のうちの少なくとも 1 個は、 $C\ R^{2\ 0}$ であり、ここで $R^{2\ 0}$ は、可溶化基である、化合物。

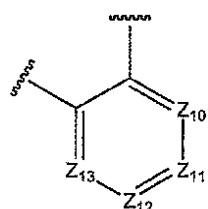
【請求項 2】

$R^{1\ 9}$ が、必要に応じて置換されたフェニル、必要に応じて置換されたピリジル、必要に応じて置換されたチエニルまたは必要に応じて置換されたフリルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

$R^{1\ 9}$ が

【数 4】



であり、ここで $Z_{1\ 0}$ 、 $Z_{1\ 1}$ 、 $Z_{1\ 2}$ および $Z_{1\ 3}$ の各々は、 $C\ R^{2\ 0}$ または $C\ R_1$ から独立して選択され；そして

$R^{2\ 1}$ が、 $-NH-C(O)-$ 、 $-NH-C(O)-CH(CH_3)-O-$ 、 $-NH-C(O)-CH_2-O-$ 、または $-NH-S(O)_2-CH_2-CH_2-$ から選択され；そして

$R^{3\ 1}$ が、必要に応じて置換されたアリール、またはフェニル置換されたフリル以外の必要に応じて置換されたヘテロアリールから選択される。

請求項 1 に記載の化合物。

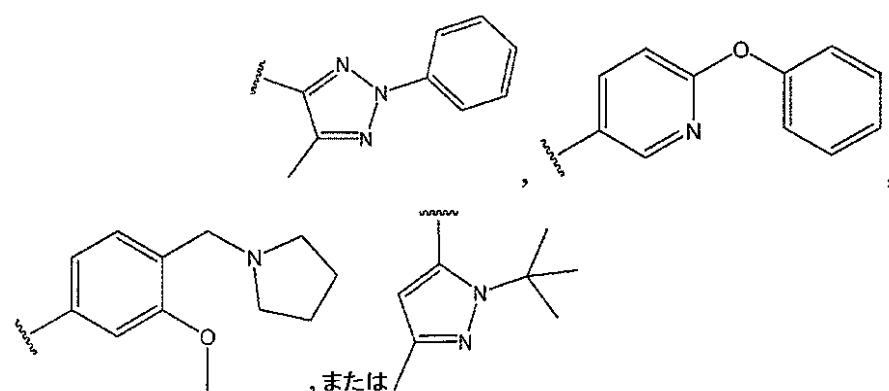
【請求項 4】

$R^{3\ 1}$ が、1 個～3 個の置換基で必要に応じて置換されており、該置換基は、 $-OCH_3$ 、 $-CH_3$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、フェニル、フェノキシ、3,4-ジオキシメチレン、フルオロ、または別の可溶化基から独立して選択される、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

$R^{3\ 1}$ が、非置換キノリニル、2,4-ジメトキシフェニル、3,4-ジメトキシフェニル、3,5-ジメトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル、2,3,4-トリメトキシフェニル、2-ジメチルアミノフェニル、3-ジメチルアミノフェニル、4-ジメチルアミノフェニル、3,5-ジメチルフェニル、3,5-ジフルオロフェニル、3-トリフルオロメトキシフェニル、非置換キノキサリニル、非置換ベンゾピリミジニル、

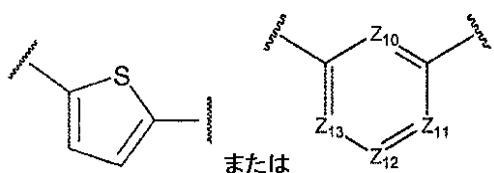
【数 5】



から選択される、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 6】

$R^{1 \sim 9}$ が、
【数6】



から選択され；

Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} および Z_{13} の各々が、 $CR^{2 \sim 0}$ 、または CR_1' から独立して選択され；

$R^{2 \sim 1}$ が、 $-NH-C(O)-$ 、 $NH-C(O)-CH_2-CH(CH_3)-O$ 、 $-NH-C(O)-NH-$ 、 $-NH-C(S)-NH-$ 、 $-NH-C(S)-NH-CH_2-$ 、または $-NH-S(O)_2-$ から選択され；

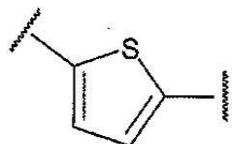
$R^{3 \sim 1}$ が、必要に応じて置換されたフェニル、必要に応じて置換されたナフチル、または必要に応じて置換されたヘテロアリールから選択され；

X_8 が N であり、 $R^{2 \sim 1}$ が $-NH-C(S)-NH-$ であり、そして $R^{1 \sim 9}$ がフェニルである場合、 $R^{3 \sim 1}$ は、2-メトキシ-5-ニトロフェニルでも、2-S-メチルフェニルでも、2-アセチルフェニルでもなく；

X_8 が N であり、 $R^{2 \sim 1}$ が $-NH-S(O)_2-$ であり、そして $R^{1 \sim 9}$ がフェニルである場合、 $R^{3 \sim 1}$ は、チアジアゾール置換されたチエニルでも 4-メチルスルホニルフェニルでもなく；

X_8 が N であり、 $R^{2 \sim 1}$ が $-NH-CO-$ であり、そして $R^{1 \sim 9}$ がフェニルである場合、 $R^{3 \sim 1}$ は、2,4-ジフルオロフェニルでも、ピリジル置換されたチエニルでも、3,4-ジクロロフェニルでも、4-t-ブチルフェニルでも、3-ベンジルオキシフェニルでもなく；

X_9 が N であり、 $R^{2 \sim 1}$ が $-NH-C(O)-$ であり、そして $R^{1 \sim 9}$ が
【数7】



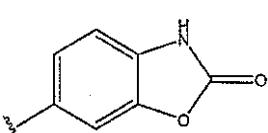
である場合、 $R^{3 \sim 1}$ は、2,3,4-トリメトキシフェニルでも 3,5-ジメトキシフェニルでもなく；そして

X_9 が N であり、 $R^{2 \sim 1}$ が $-NH-C(O)-$ であり、そして $R^{1 \sim 9}$ がフェニルである場合、 $R^{3 \sim 1}$ は、3,5-ジメトキシフェニルではない、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

$R^{3 \sim 1}$ が、フェニル、ナフチル、ピラゾリル、フリル、チエニル、ピリジル、イソオキサゾリル、ベンゾピラゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、キノリニル、ベンゾイソオキサゾリル、または

【数8】



から選択され、そして $R^{3 \sim 1}$ が必要に応じて置換されている、請求項6に記載の化合物。

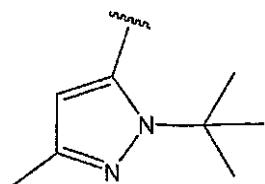
【請求項8】

R^{31} が、3個までの置換基で必要に応じて置換されており、該置換基は、 $-OCH_3$ 、 $-CH_3$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-O-$ フェニル、または別の可溶化基から独立して選択される、請求項7に記載の化合物。

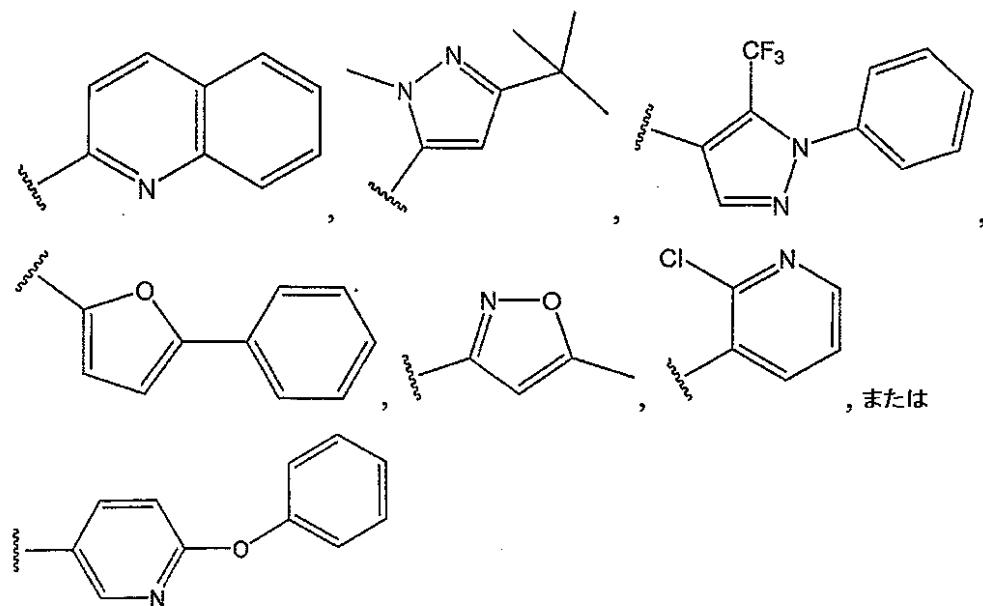
【請求項9】

R^{31} が、非置換フェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2,3-ジメトキシフェニル、2,4-ジメトキシフェニル、2,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル、3,4-ジメトキシフェニル、3,5-ジメトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル、2,3,4-トリメトキシフェニル、2-メトキシ-4-メチルフェニル、2-フェノキシフェニル、3-ジメチルアミノフェニル、4-ジメチルアミノフェニル、非置換2-フラニル、非置換2-チエニル、

【数9】



【数10】

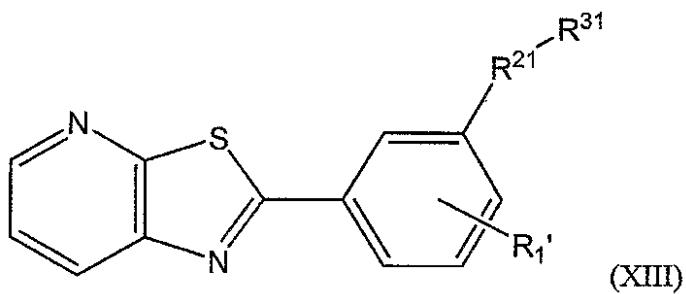


から選択される、請求項7に記載の化合物。

【請求項10】

式：

【数11】



の化合物、またはその塩であって、該式において、

R_1' は、Hまたは必要に応じて置換された $C_1 \sim C_3$ の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから選択され；

$R^{2\ 1}$ は、 $-NR_1'-C(O)-$ 、 $-NR_1'-S(O)_2-$ 、 $-NR_1'-C(O)-$
 $-NR_1'-$ 、 $-NR_1'-C(S)-NR_1'-$ 、 $-NR_1'-C(S)-NR_1'-$
 $-CR_1'R_1'-$ 、 $-NR_1'-C(O)-CR_1'R_1'-NR_1'-$ 、 $-NR_1'-$
 $-C(=NR_1')-NR_1'-$ 、 $-C(O)-NR_1'-$ 、 $-C(O)-NR_1'-S$
 $(O)_2-$ 、 $-NR_1'-$ 、 $-CR_1'R_1'-$ 、 $-NR_1'-C(O)-CR_1'-$
 $R_1'-$ 、 $-NR_1'-S(O)_2-NR_1'-$ 、 $-NR_1'-C(O)-NR_1'-S$
 $(O)_2-$ 、 $-NR_1'-CR_1'R_1'-C(O)-NR_1'-$ 、 $-CR_1'R_1'-$
 $C(O)-NR_1'-$ 、 $-NR_1'-C(O)-CR_1'=CR_1'-CR_1'R_1'-$
 $-NR_1'-C(=N-CN)-NR_1'-$ 、 $-NR_1'-C(O)-CR_1'R_1'-$
 $-O-$ 、 $-NR_1'-C(O)-CR_1'R_1'-CR_1'R_1'-O-$ 、 $-NR_1'-$
 $S(O)_2-CR_1'R_1'-$ 、 $-NR_1'-S(O)_2-CR_1'R_1'-CR_1'R_1'-$
 $-NR_1'-C(O)-CR_1'R_1'-CR_1'R_1'-$ 、 $-NR_1'-C(S)-NR_1'-CR_1'R_1'-CR_1'R_1'-$
 $-NR_1'-C(O)-CR_1'R_1'-CR_1'R_1'-$ 、 $-NR_1'-C(O)-O-$ または
 $-NR_1'-C(O)-CR_1'R_1'-$ から選択され；そして

$R^{3\ 1}$ は、必要に応じて置換された単環式アリールもしくは二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式ヘテロアリールもしくは二環式ヘテロアリールから選択され、

ただし：

$R^{2\ 1}$ が $-NH-C(O)-$ である場合、 $R^{3\ 1}$ は、非置換フリルでも、5-ブロモフリルでも、非置換フェニルでも、ハロもしくはメチルで一置換されたフェニルでも、3-メトキシフェニルでも、4-メトキシフェニルでも、4-ブトキシフェニルでも、4-t-ブチルフェニルでも、3-トリフルオロメチルフェニルでも、2-ベンゾイルフェニル、2-エトキシフェニルでも、4-エトキシフェニルでも、2,3-ジメトキシフェニルでも、2,4-ジメトキシフェニルでも、3,4-ジメトキシフェニルでも、3,5-ジメトキシフェニルでも、3,4,5-トリメトキシフェニルでも、2,4-ジフルオロフェニルでも、2,6-ジフルオロフェニルでも、3,4-ジオキシメチレンフェニルでも、3,4-ジメチルフェニルでも、2-クロロ-5-ブロモフェニルでも、2-メトキシ-5-クロロフェニルでも、非置換キノリニルでも、メチルとフェニルとで同時に置換されたチアゾリルでも、エトキシ置換されたピリジニルでもなく；

$R^{2\ 1}$ が $-NH-C(O)-CH(CH_2-CH_3)-$ である場合、 $R^{3\ 1}$ は非置換フェニルではなく；

$R^{2\ 1}$ が $-NH-C(O)-CH_2-$ である場合、 $R^{3\ 1}$ は、非置換フェニルでも、3-メチルフェニルでも、4-クロロフェニルでも、4-エトキシフェニルでも、4-フルオロフェニルでも4-メトキシフェニルでもなく；

$R^{2\ 1}$ が $-NH-C(O)-CH_2-O-$ である場合、 $R^{3\ 1}$ は、非置換フェニルでも4-クロロフェニルでもなく；そして

$R^{2\ 1}$ が $-NH-S(O)_2-$ である場合、 $R^{3\ 1}$ は、3,4-ジオキシメチレンフェニルでも、2,4,5-トリメチルフェニルでも、2,4,6-トリメチルフェニルでも、2,4-ジメチルフェニルでも、3,4-ジメチルフェニルでも、2,5-ジフルオロフェニルでも、2,5-ジメトキシフェニルでも、3,4-ジメトキシフェニルでも、フルオロフェニルでも、4-クロロフェニルでも、4-ブロモフェニルでも、4-エチルフェニルでも、4-メチルフェニルでも、3-メチル-4-メトキシフェニルでも、非置換フェニルでも、非置換ピリジニルでも、非置換チエニルでも、クロロ置換されたチエニルでも、メチル置換されたベンゾチアゾリルでもない、化合物。

【請求項 11】

R_1' が、H または必要に応じて置換された $C_1 \sim C_3$ の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから選択され；

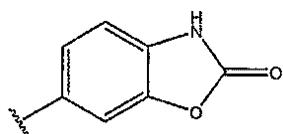
$R^{2\sim 1}$ が、 $-NR_1' - C(O) -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 -$ 、 $-NR_1' - C(O) - NR_1' -$
 $-CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - C(S) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(S) - NR_1' -$
 $-CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' - NR_1' -$ 、 $-NR_1' -$
 $-C(=NR_1') - NR_1' -$ 、 $-C(O) - NR_1' -$ 、 $-C(O) - NR_1' - S$
 $(O)_2 -$ 、 $-NR_1' -$ 、 $-CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' =$
 $R_1' -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - NR_1' - S$
 $(O)_2 -$ 、 $-NR_1' - CR_1' R_1' - C(O) - NR_1' -$ 、 $-CR_1' R_1' -$
 $C(O) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' = CR_1' - CR_1' R_1' -$
 $-NR_1' - C(=N - CN) - NR_1' -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' -$
 $-O -$ 、 $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' - CR_1' R_1' - O -$ 、 $-NR_1' -$
 $S(O)_2 - CR_1' R_1' -$ 、 $-NR_1' - S(O)_2 - CR_1' R_1' - CR_1' R_1' -$ 、
 または $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' -$ から選択され；そして

$R^{3\sim 1}$ が、単環式アリールもしくは二環式アリール、または単環式ヘテロアリールもしくは二環式ヘテロアリールから選択され、そして可溶化基の置換基を含む、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

$R^{3\sim 1}$ が、フェニル、ナフチル、ピラゾリル、フリル、チエニル、ピリジル、イソオキサゾリル、ベンゾピラゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、キノリニル、ベンゾイソオキサゾリル、または

【数 12】



から選択され、そして $R^{3\sim 1}$ が必要に応じて置換されている、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 13】

$R^{2\sim 1}$ が、 $-NH - C(O) -$ 、 $NH - C(O) - CH_2 - CH(CH_3) - O -$ 、 $-NH - C(O) - NH -$ 、 $-NH - C(S) - NH -$ 、 $-NH - C(S) - NH - CH_2 -$ 、または $-NH - S(O)_2 -$ から選択され；そして

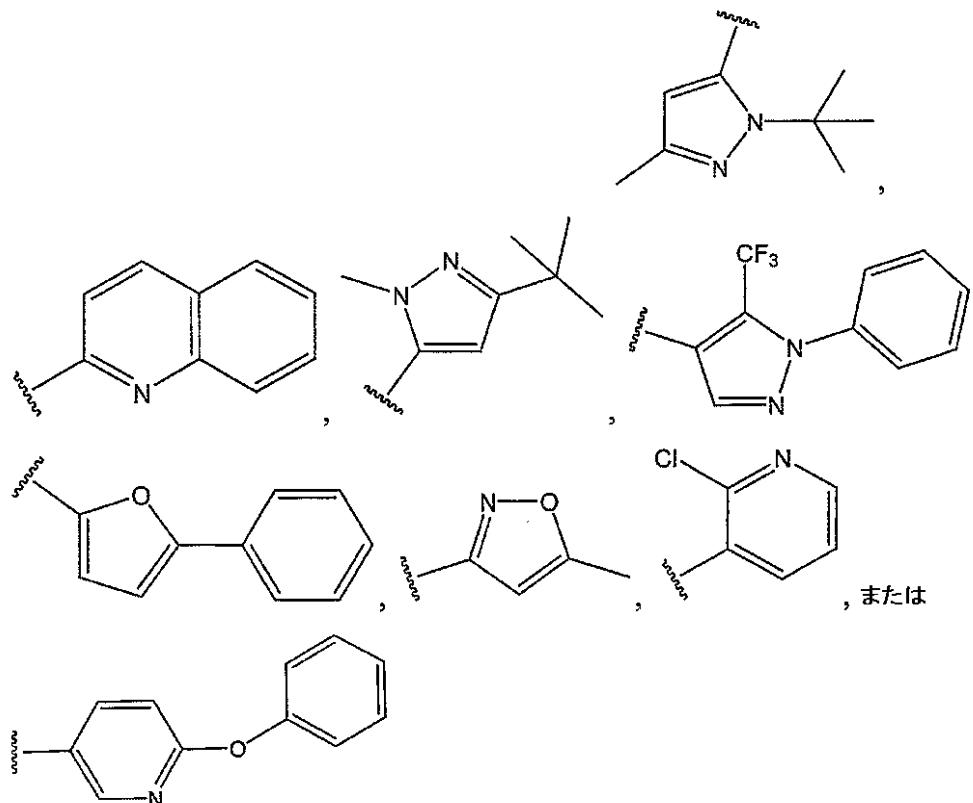
$R^{3\sim 1}$ が、必要に応じて置換されたフェニル、必要に応じて置換されたナフチル、または必要に応じて置換されたヘテロアリールから選択される、

請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 14】

$R^{3\sim 1}$ が、非置換フェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2,3-ジメトキシフェニル、2,4-ジメトキシフェニル、2,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル、3,4-ジメトキシフェニル、3,5-ジメトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル、2,3,4-トリメトキシフェニル、2-メトキシ-4-メチルフェニル、2-フェノキシフェニル、3-ジメチルアミノフェニル、4-ジメチルアミノフェニル、非置換2-フラニル、非置換2-チエニル、

【数13】

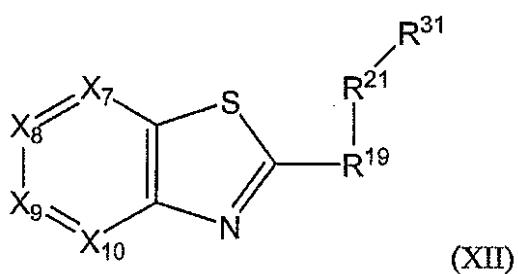


から選択される、請求項13に記載の化合物。

【請求項15】

式：

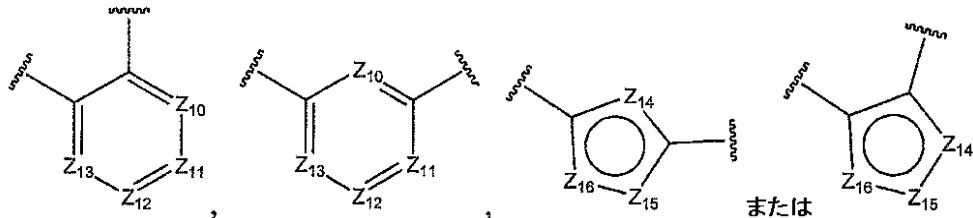
【数14】



の化合物、またはその塩を含有する組成物であって、該式において、

X₇、X₈、X₉およびX₁₀の各々は、N、CR²⁰、またはCR_{1'}から独立して選択され：各R²⁰は、Hまたは可溶化基から独立して選択され；各R_{1'}は、Hまたは必要に応じて置換されたC₁～C₃の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから独立して選択され；X₇、X₈、X₉およびX₁₀のうちの1つはNであり、そして他のものはCR²⁰またはCR_{1'}から選択され；そして0～1個のR²⁰は可溶化基であり；R¹⁹は：

【数15】



または

から選択され：

各 Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} および Z_{13} は、N、CR^{2 0}、またはCR_{1'}から独立して選択され；そして

各 Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} は、N、NR_{1'}、S、O、CR^{2 0}、またはCR_{1'}から独立して選択され：

Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} または Z_{13} のうちの 0 ~ 2 個は、N であり；

Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} のうちの少なくとも 1 個は、N、NR_{1'}、O または S であり；

Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} のうちの 0 ~ 1 個は、S または O であり；

Z_{14} 、 Z_{15} および Z_{16} のうちの 0 ~ 2 個は、N または NR_{1'} であり；

0 ~ 1 個の R^{2 0} は可溶化基であり；

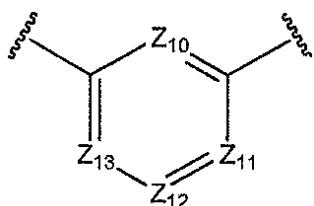
0 ~ 1 個の R_{1'} は、必要に応じて置換された C₁ ~ C₃ の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルであり；そして

R^{2 1} は、-NR_{1'}-C(O)-、-NR_{1'}-S(O)₂-、-NR_{1'}-C(O)-NR_{1'}-、-NR_{1'}-C(S)-NR_{1'}-、-NR_{1'}-C(S)-NR_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-NR_{1'}-、-NR_{1'}-C(=NR_{1'})-NR_{1'}-、-C(O)-NR_{1'}-、-C(O)-NR_{1'}-S(O)₂-、-NR_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-、-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}=CR_{1'}-、-NR_{1'}-S(O)₂-NR_{1'}-、-NR_{1'}-C(O)-NR_{1'}-S(O)₂-、-NR_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-C(O)-NR_{1'}-、-CR_{1'}R_{1'}-C(O)-NR_{1'}-、-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}=CR_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-、-NR_{1'}-C(=N-CN)-NR_{1'}-、-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}=CR_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-、-O-、-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}R_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-O-、-NR_{1'}-S(O)₂-CR_{1'}R_{1'}-、-NR_{1'}-S(O)₂-CR_{1'}R_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-、-NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}R_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-、-NR_{1'}-C(S)-NR_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-CR_{1'}R_{1'}-、-NR_{1'}-C(O)-O- または -NR_{1'}-C(O)-CR_{1'}R_{1'}- から選択され；そして

R^{3 1} は、必要に応じて置換された単環式アリールもしくは二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式ヘテロアリールもしくは二環式ヘテロアリールから選択され

、ただし、R^{1 9} が

【数16】



であり、 Z_{10} 、 Z_{11} 、 Z_{12} および Z_{13} が各々 CH であり、そして R^{2 1} が -NH-C(O)- である場合、R^{3 1} は、必要に応じて置換されたフェニルではなく、該組成物は、発熱性物質を含まない、組成物。

【請求項 1 6】

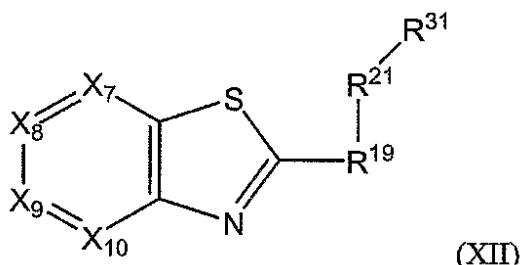
請求項 1 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物を含有する組成物であって、該組成物が発熱性物質を含まない、組成物。

【請求項 1 7】

薬学的組成物であって：

a . 式 :

【数 1 7】



の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩もしくはプロドラッグであって、該式において：

X_7 、 X_8 、 X_9 および X_{10} の各々は、N、CR^{2 0}、またはCR₁'から独立して選択され：

各R^{2 0}は、Hまたは可溶化基から独立して選択され；

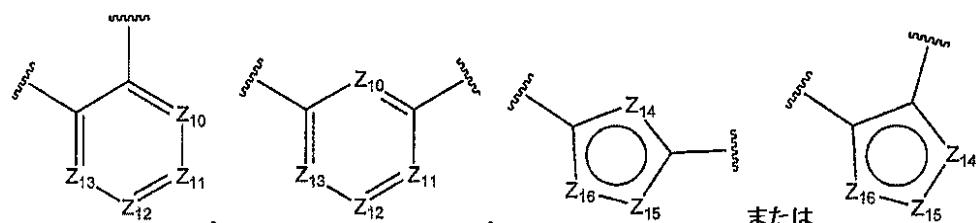
各CR₁'は、Hまたは必要に応じて置換されたC₁~C₃の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから独立して選択され；

X_7 、 X_8 、 X_9 および X_{10} のうちの 1 つは N であり、そして他のものは CR^{2 0} または CR₁' から選択され；そして

0 ~ 1 個の R^{2 0} は可溶化基であり；

R^{1 9} は：

【数 1 8】



から選択され：

各Z₁₀、Z₁₁、Z₁₂ および Z₁₃ は、N、CR^{2 0}、またはCR₁'から独立して選択され；そして

各Z₁₄、Z₁₅ および Z₁₆ は、N、NR₁'、S、O、CR^{2 0}、またはCR₁'から独立して選択され；

Z₁₀、Z₁₁、Z₁₂ または Z₁₃ のうちの 0 ~ 2 個は、N であり；

Z₁₄、Z₁₅ および Z₁₆ のうちの少なくとも 1 個は、N、NR₁'、O または S であり；

Z₁₄、Z₁₅ および Z₁₆ のうちの 0 ~ 1 個は、S または O であり；

Z₁₄、Z₁₅ および Z₁₆ のうちの 0 ~ 2 個は、N または NR₁' であり；

0 ~ 1 個の R^{2 0} は可溶化基であり；

0 ~ 1 個の R₁' は、必要に応じて置換されたC₁~C₃の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルであり；そして

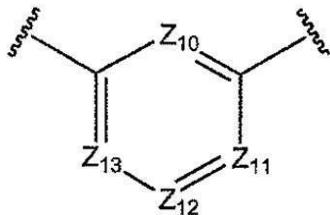
R^{2 1} は、-NR₁' -C(O)-、-NR₁' -S(O)₂-、-NR₁' -C(O)

) - N R₁ ' - - N R₁ ' - C (S) - N R₁ ' - - N R₁ ' - C (S) - N R₁ ' -
 - C R₁ ' R₁ ' - - N R₁ ' - C (O) - C R₁ ' R₁ ' - N R₁ ' - - N R₁ ' -
 - C (= N R₁ ') - N R₁ ' - - C (O) - N R₁ ' - - C (O) - N R₁ ' - S
 (O)₂ - - N R₁ ' - - C R₁ ' R₁ ' - - N R₁ ' - C (O) - C R₁ ' = C
 R₁ ' - - N R₁ ' - S (O)₂ - N R₁ ' - - N R₁ ' - C (O) - N R₁ ' - S
 (O)₂ - - N R₁ ' - C R₁ ' R₁ ' - C (O) - N R₁ ' - - C R₁ ' R₁ ' -
 C (O) - N R₁ ' - - N R₁ ' - C (O) - C R₁ ' = C R₁ ' - C R₁ ' R₁ ' -
 - N R₁ ' - C (= N - C N) - N R₁ ' - - N R₁ ' - C (O) - C R₁ ' R₁ ' -
 - O - - N R₁ ' - C (O) - C R₁ ' R₁ ' - C R₁ ' R₁ ' - O - - N R₁ ' -
 S (O)₂ - C R₁ ' R₁ ' - - N R₁ ' - S (O)₂ - C R₁ ' R₁ ' - C R₁ ' R₁ ' -
 - N R₁ ' - C (O) - C R₁ ' R₁ ' - C R₁ ' R₁ ' - - N R₁ ' - C (S) - N R₁ ' - C R₁ ' R₁ ' - C R₁ ' R₁ ' - - N R₁ ' - C (O) - O - または - N R₁ ' - C (O) - C R₁ ' R₁ ' - から選択され；そして

R³ ' は、必要に応じて置換された単環式アリールもしくは二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式ヘテロアリールもしくは二環式ヘテロアリールから選択され

、ただし、R¹ ' が

【数19】



であり、Z₁0、Z₁1、Z₁2 および Z₁3 が各々 C H であり、そして R² ' が - N H C (O) - である場合、R³ ' は、必要に応じて置換されたフェニルではない、化合物；ならびに

b . 薬学的に受容可能なキャリアまたは希釈剤、を含有する、薬学的組成物。

【請求項18】

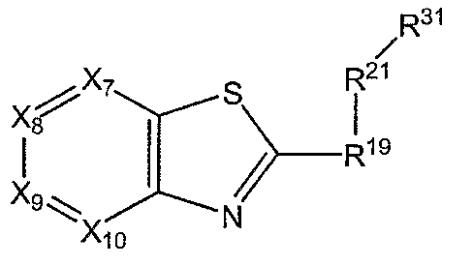
薬学的に受容可能なキャリアまたは希釈剤と、請求項1～14のいずれか1項に記載の化合物とを含有する、薬学的組成物。

【請求項19】

インスリン抵抗性、メタボリック症候群、糖尿病、またはその合併症を処置または予防するため、あるいは被験体におけるインスリン感受性を増加させるための組成物であって

、該組成物は、式：

【数29】



の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩もしくはプロドラッグを含み、該式において：

X₇、X₈、X₉ および X₁₀ の各々は、N、C R² ' 0、または C R₁ ' から独立して

選択され：

各 R^2 は、H または可溶化基から独立して選択され；

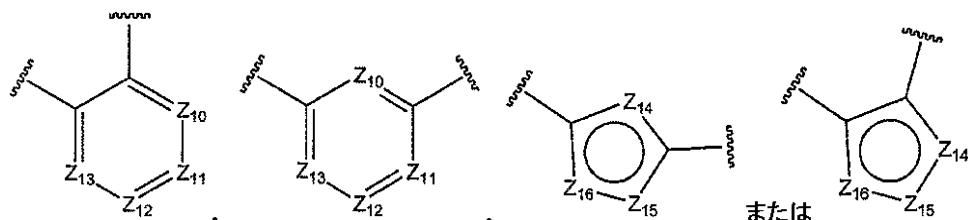
各 R_1 は、H または必要に応じて置換された $C_1 \sim C_3$ の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルから独立して選択され：

X_7 、 X_8 、 X_9 および X_{10} のうちの1つはNであり、そして他のものはCR²⁰またはCR₁から選択され；そして

0 ~ 1 個の R^{2-0} は可溶化基であり；

R 1 9 は・

【数30】



から選択され：

各 $Z_{1,0}$ 、 $Z_{1,1}$ 、 $Z_{1,2}$ および $Z_{1,3}$ は、 N 、 $CR^{2,0}$ 、または CR_1 ’から独立して選択され；そして

各 Z_{1-4} 、 Z_{1-5} および Z_{1-6} は、N、NR₁’、S、O、CR²⁻⁰、または CR₁’から独立して選択され：

$Z_{1,0}$ 、 $Z_{1,1}$ 、 $Z_{1,2}$ または $Z_{1,3}$ のうちの 0 ~ 2 個は、N であり；

$Z_{1,4}$ 、 $Z_{1,5}$ および $Z_{1,6}$ のうちの少なくとも1個は、N、NR₁’、OまたはSであり；

$Z_{1,4}$, $Z_{1,5}$ および $Z_{1,6}$ のうちの 0 ~ 1 個は、S または 0 であり；

$Z_{-1,1}$ 、 $Z_{-1,5}$ および $Z_{-1,6}$ のうちの 0 ~ 2 個は、 N または N_R であり、

0 ~ 1 個の R^{2-0} は可溶化基であり：

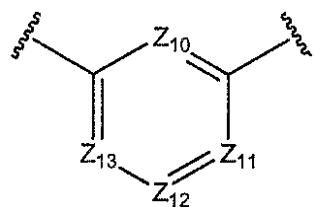
0 ~ 1 個の R₁，は、必要に応じて置換された C₁ ~ C₃ の直鎖アルキルもしくは分枝鎖アルキルであり；そして

R^2 は、
 $-NR_1' - C(O) - NR_1' - S(O)_2 - NR_1' - C(O)$
 $- NR_1' - NR_1' - C(S) - NR_1' - NR_1' - C(S) - NR_1'$
 $- CR_1' R_1' - NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' - NR_1' - NR_1'$
 $- C(=NR_1') - NR_1' - C(O) - NR_1' - C(O) - NR_1' - S(O)_2$
 $- NR_1' - C(R_1' R_1' - NR_1' - C(O) - CR_1' = CR_1' - CR_1' R_1'$
 $R_1' - NR_1' - S(O)_2 - NR_1' - NR_1' - C(O) - NR_1' - S(O)_2$
 $- NR_1' - C(R_1' R_1' - C(O) - CR_1' = CR_1' - CR_1' R_1'$
 $- NR_1' - C(=N-CN) - NR_1' - NR_1' - C(O) - CR_1' R_1'$
 $- O - NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' - CR_1' R_1' - O - NR_1'$
 $S(O)_2 - CR_1' R_1' - NR_1' - S(O)_2 - CR_1' R_1' - CR_1' R_1'$
 $_1' - NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' - CR_1' R_1' - NR_1' - C(S)$
 $- NR_1' - CR_1' R_1' - CR_1' R_1' - NR_1' - C(O) - O$
 または $-NR_1' - C(O) - CR_1' R_1' -$ から選択され；そして

R^{3-1} は、必要に応じて置換された単環式アリールもしくは二環式アリール、または必要に応じて置換された単環式ヘテロアリールもしくは二環式ヘテロアリールから選択され

ただし R¹ 9 が

【数 3 1】



であり、 $Z_{1\ 0}$ 、 $Z_{1\ 1}$ 、 $Z_{1\ 2}$ および $Z_{1\ 3}$ が各々 C H であり、そして $R^{2\ 1}$ が - N H C (O) - である場合、 $R^{3\ 1}$ は、必要に応じて置換されたフェニルではない、組成物。