

【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22年7月29日 (2010.7.29)

【公表番号】特表2010-500962(P2010-500962A)

【公表日】平成22年1月14日 (2010.1.14)

【年通号数】公開・登録公報2010-002

【出願番号】特願2009-515635(P2009-515635)

【国際特許分類】

C 0 7 D 303/46 (2006.01)

A 6 1 K 31/336 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/4427 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/4025 (2006.01)

A 6 1 K 31/4523 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 21/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 33/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

A 6 1 P 33/02 (2006.01)

A 6 1 P 33/04 (2006.01)

A 6 1 P 33/06 (2006.01)

A 6 1 P 33/10 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 303/46 C S P

A 6 1 K 31/336

C 0 7 D 405/12

A 6 1 K 31/4427

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/4025

A 6 1 K 31/4523

A 6 1 K 31/496
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 31/00
 A 6 1 P 37/08
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 9/10 1 0 1
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 19/08
 A 6 1 P 19/10
 A 6 1 P 21/04
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 33/00
 A 6 1 P 31/14
 A 6 1 P 33/02
 A 6 1 P 33/04
 A 6 1 P 33/06
 A 6 1 P 33/10

【手続補正書】

【提出日】平成22年6月8日(2010.6.8)

【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

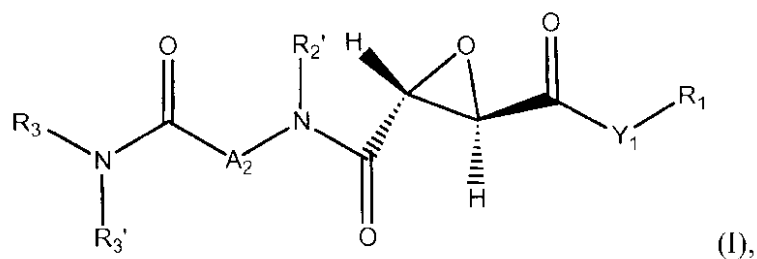
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】

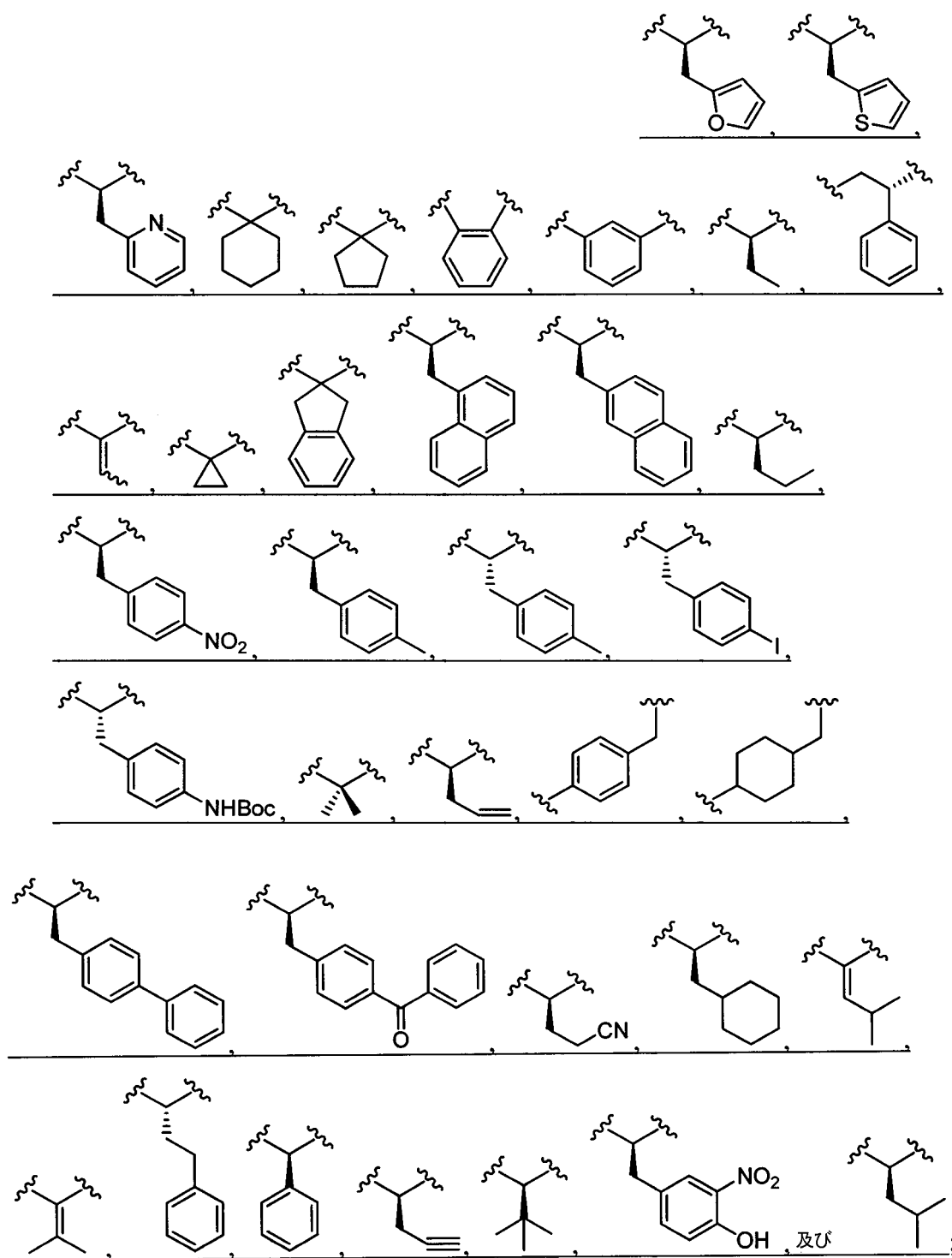


で表される化合物、その薬学的に受容される誘導体、又はそのプロドラッグ。

(式中、

Y_1 が O 又は N - R_1 ' であり、

A₂ が、
【化 2】



から選ばれ、

R₁、R₁'、R₂'、R₃、及び R₃' が独立して、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アラルキル、アラルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、カルボキシアルキル、又はカルボキシアミドアルキルであるか、かつ任意に 1 ~ 3 個の「基」により置換され、そしてアルキルの炭素原子のいずれかがヘテロ原子により置換されていてよく、そして R₃ 及び R₃' が結合している N 原子と一緒にあって、R₃ 及び R₃' が 4 員環乃至 8 員環を形成するか、

J が、アルキル、アリール、アラルキル、アルコキシ、アリーロキシ、アラルコキシ、シクロアルキル、シクロアルコキシ、ヘテロシクリル、ヘテロシクリロキシ、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ケト、ヒドロキシ、チオ、アミノ、アルキルアミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ (aroylamino)、アラルカノイルアミノ、カルボキシ、カルボネート、カルバメート、グアニジニル、ウレア、ハロ、シアノ、ニトロ、ホルミル、アシル、ホスホリル、スルホニル、又はスルホンアミドであり、かつ任意に 1 ~ 3 個の J¹ で置換されており、

J¹ がアルキル、アリール、アラルキル、アルコキシ、アリーロキシ、ヘテロシクリル、ヘテロシクリロキシ、ケト、ヒドロキシ、チオ、アミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ (aroylamino)、カルボキシ、カルボネート、カルバメート、グアニジニル、ウレア、ハロ、シアノ、ニトロ、ホルミル、アシル、ホスホリル、スルホニル、又はスルホンアミドである。

但し、A₂ が天然に存在するアミノ酸の側鎖である場合、-Y₁-R₁ が -OH、-OCH₃、又は -OCH₂CH₃ ではない。

A₂ が -CH₂-CH(CH₃)₂ である場合、R₃ が -CH₂-CH₂-CH₂-NH-C(=NH)-NH₂ 又は -C(H)(NH₂)-CH₂-CH₂-CH₂-NH-C(=NH)-NH₂ ではなく、かつ R₃ 及び R₃' が結合している N 原子と一緒にあって、R₃ 及び R₃' がカルボキシで置換された 5 員環を形成しない。)

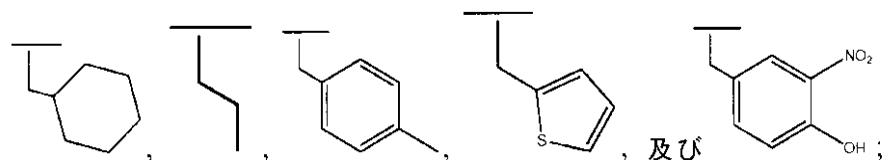
【請求項 2】

Y₁ が N-H であり、R₃' が H であり、かつ R₁ 及び R₃ が、独立しており、表 1 に記載された R₁ 及び R₃ の置換基からなる群から選ばれる、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

A₂ が

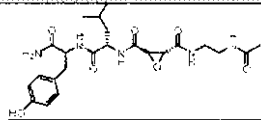
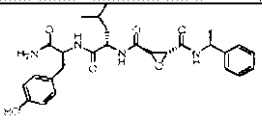
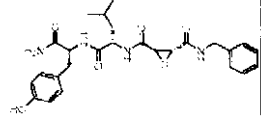
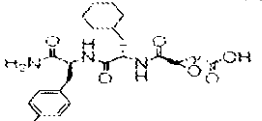
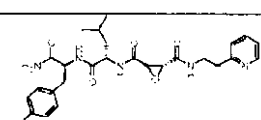
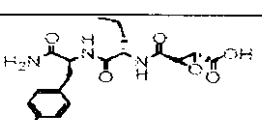
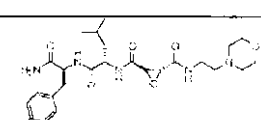
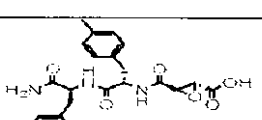
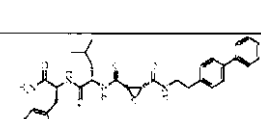
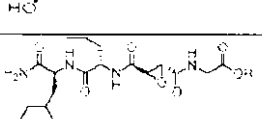
【化 3】



からなる群から選ばれる、請求項 1 記載の化合物。

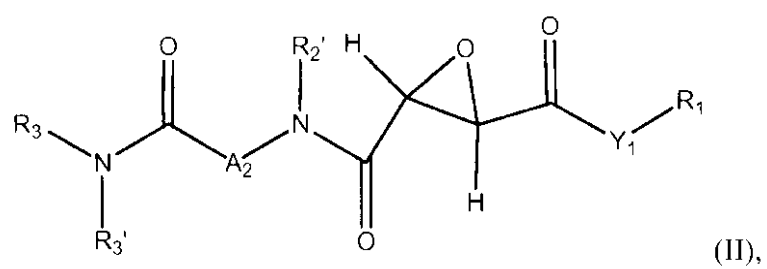
【請求項 4】

下記の表に記載された化合物からなる群から選ばれる、請求項 1 記載の化合物。

Cpd #	構造式	Cpd #	構造式
41		58	
42		74	
43		75	
44		76	
45		78	

Cpd #	構造式	Cpd #	構造式
46		80	
47		108	
48		109	
49		110	
50		113	
51		115	
52		116	
53		117	
54		118	
55		119	
56		124	
57		126	

式 I I :
【化 4】



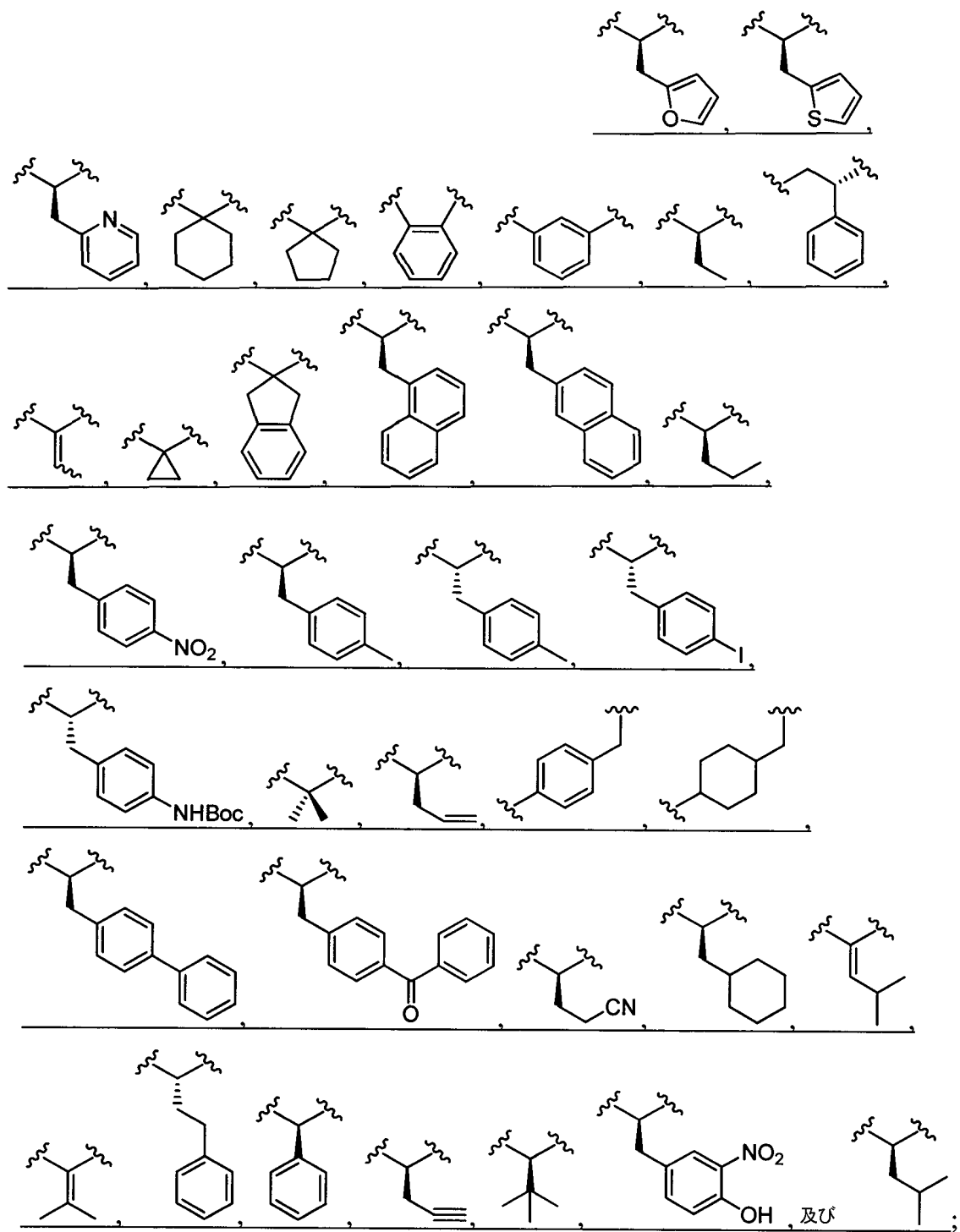
で表される化合物、その薬学的に受容される誘導体、又はそのプロドラッグ。

(式中、

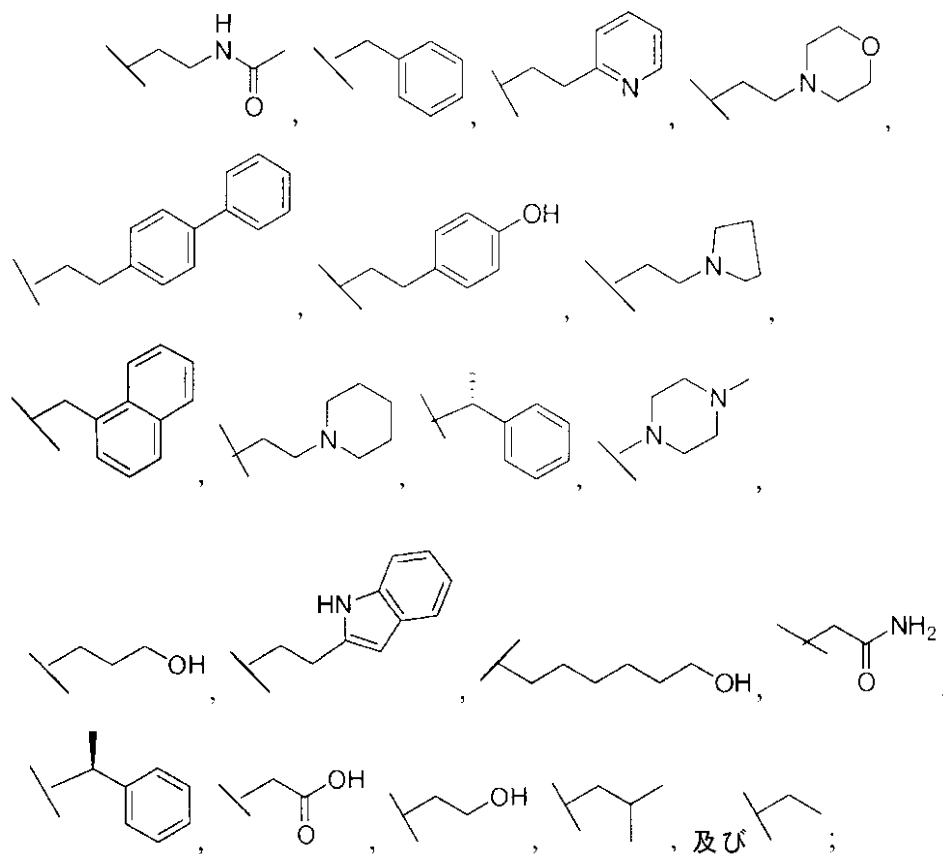
Y_1 が O 又は N - H であり、

A_2 が、

から選ばれ、
R₁が



【化 6】



からなる群から選ばれ、

R₂'、R₃、及びR₃'が、独立しており、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アラルキル、アラルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、カルボキシアルキル、又はカルボキシアミドアルキルであるか、かつ任意に1～3個の「基」により置換され、かつアルキルの炭素原子のいずれかがヘテロ原子により置換されていてもよく、

「J」が、アルキル、アリール、アラルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アラルコキシ、シクロアルキル、シクロアルコキシ、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルオキシ、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ケト、ヒドロキシ、チオ、アミノ、アルキルアミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ (a r o y l a m i n o) 、アラルカノイルアミノ、カルボキシ、カルボネート、カルバメート、グアニジニル、ウレア、ハロ、シアノ、ニトロ、ホルミル、アシル、ホスホリル、スルホニル、又はスルホンアミドであり、かつ任意に 1 ~ 3 個の「J」¹ で置換されており、

J¹ が、アルキル、アリール、アラルキル、アルコキシ、アリーロキシ、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルオキシ、ケト、ヒドロキシ、チオ、アミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ (aroylamino)、カルボキシ、カルボネート、カルバメート、グアニジニル、ウレア、ハロ、シアノ、ニトロ、ホルミル、アシル、ホスホリル、スルホニル、又はスルホンアミドである。

但し、 Y_1 が 0 である場合、 R_1 が

【化 7】



ではない。)

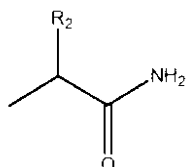
【請求項 6】

R_3 が H であり、及び R_3 が、表 1 に記載された R_3 の置換基からなる群から選ばれる、請求項 5 記載の化合物。

【請求項 7】

R_3 が、

【化 8】



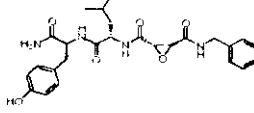
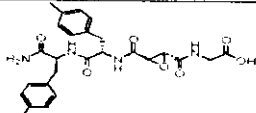
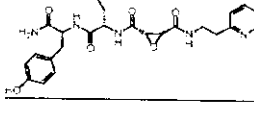
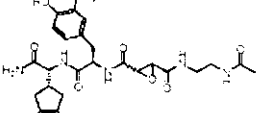
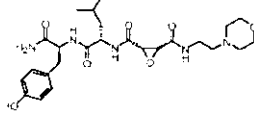
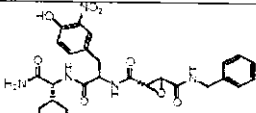
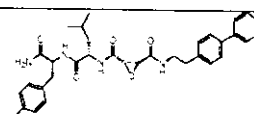
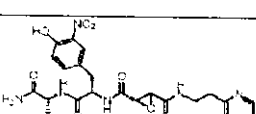
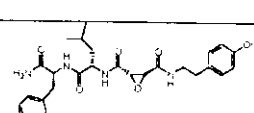
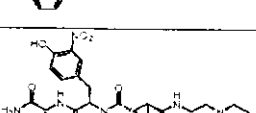
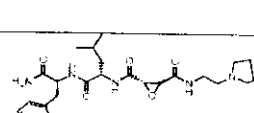
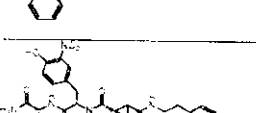
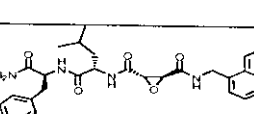
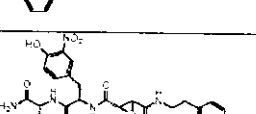
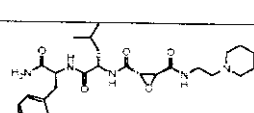
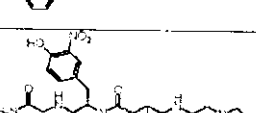
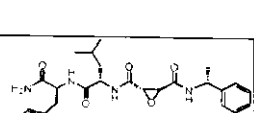
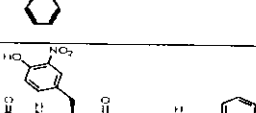
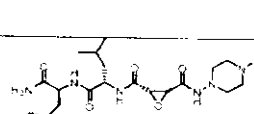
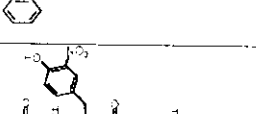
であり、 R_2 が、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アラルキル、アラルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、カルボキシアルキル又はカルボキシアミドアルキルであり、ここにおいて、 R_2 が、1 - 3 個の J 基で任意に置換されていてもよく、かつアルキルのあらゆる炭素原子がヘテロ原子により置換されていてもよい、請求項 5 記載の化合物。

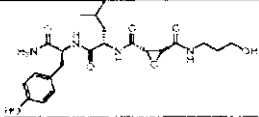
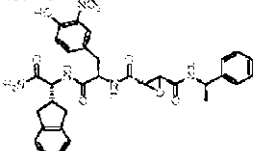
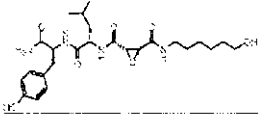
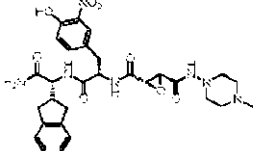
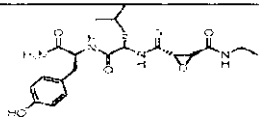
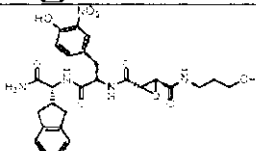
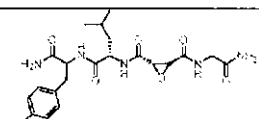
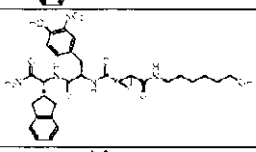
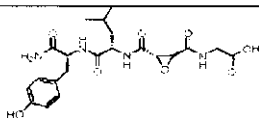
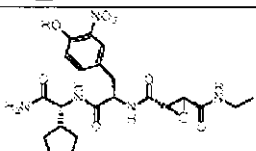
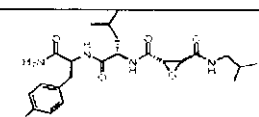
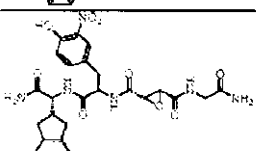
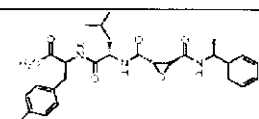
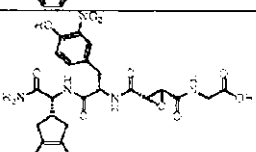
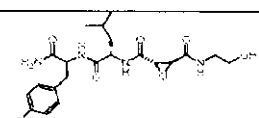
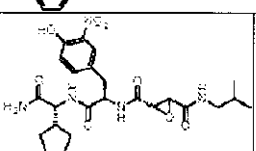
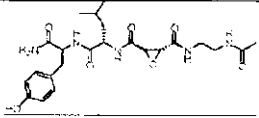
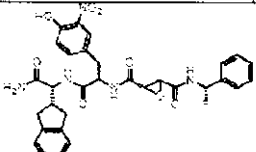
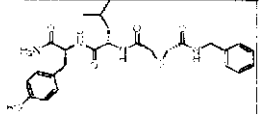
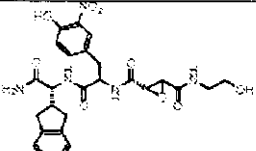
【請求項 8】

下記の表に記載された化合物から選ばれる、請求項 5 記載の化合物。

Cpd #	構造式	Cpd #	構造式
1		56	
2		57	
3		58	
4		61	
5		62	
6		63	

Cpd #	構造式	Cpd #	構造式
7		64	
8		65	
9		66	
10		67	
11		68	
12		69	
13		70	
14		71	
15		72	
16		73	
17		78	
20		79	

Cpd #	構造式	Cpd #	構造式
21		80	
22		81	
23		82	
24		83	
25		84	
26		85	
27		86	
28		87	
29		88	
30		89	

Cpd #	構造式	Cpd #	構造式
31		90	
32		91	
33		92	
34		93	
35		94	
36		95	
37		96	
38		97	
41		98	
42		99	

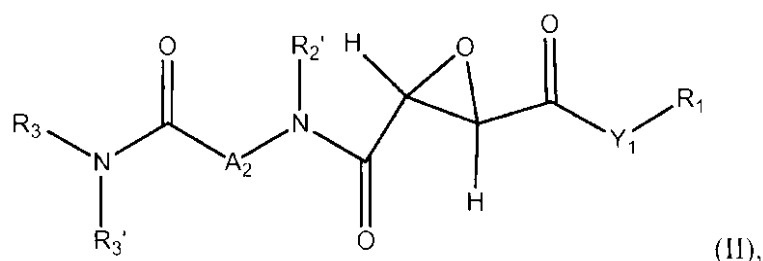
Cpd #	構造式	Cpd #	構造式
43		100	
44		104	
45		106	
46		109	
47		110	
48		111	
49		112	
50		113	
51		116	
52		117	
53		118	
54		120	

Cpd #	構造式	Cpd #	構造式
55		121	

【請求項 9】

式 I I :

【化 9】



で表される化合物、その薬学的に受容される誘導体、又はそのプロドラッグ。

(式中、

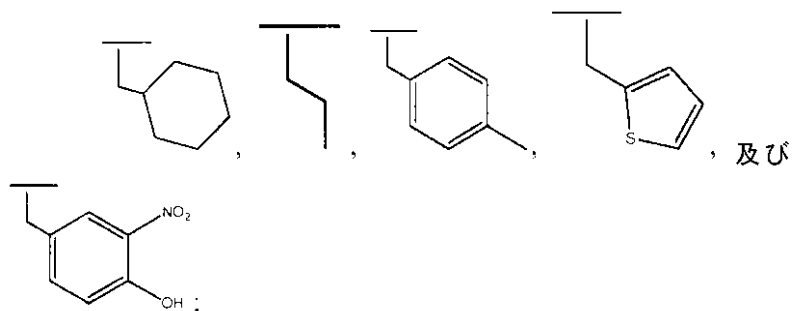
Y_1 が O 又は N - R_1 ' であり、

A_2 が、1 ~ 3 個の「」により任意に置換された、- C (R_2) (R_2 ") - 、アリーレン、シクロアルキレン、ヘテロアリーレン、又はヘテロシクロアルキレンであり、

R_2 " が H であり、

R_2 が、

【化 10】



からなる群から選ばれ、

R_1 、 R_1 '、 R_2 '、 R_3 、及び R_3 ' が独立しており、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アラルキル、アラルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、カルボキシアルキル、又はカルボキシアミドアルキルであるか、かつ任意に 1 ~ 3 個の「」基により置換され、かつアルキルの炭素原子のいずれかがヘテロ原子により置換されていてもよく、かつ R_3 、及び R_3 ' が結合している窒素原子とともに、 R_3 、及び R_3 ' が 4 員環乃至 8 員環を形成し、

「」が、アルキル、アリール、アラルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アラルコキシ、シクロアルキル、シクロアルコキシ、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルオキシ、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ケト、ヒドロキシ、チオ、アミノ、アルキルアミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ (a r o y l a m i n o)、ア

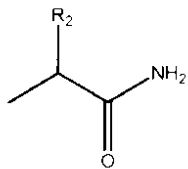
ラルカノイルアミノ、カルボキシ、カルボネート、カルバメート、グアニジニル、ウレア、ハロ、シアノ、ニトロ、ホルミル、アシル、ホスホリル、スルホニル、又はスルホンアミドであり、かつ任意に 1 ~ 3 個の J¹ 基で置換されており、

J¹ が、アルキル、アリール、アラルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルオキシ、ケト、ヒドロキシ、チオ、アミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ (aroylamino)、カルボキシ、カルボネート、カルバメート、グアニジニル、ウレア、ハロ、シアノ、ニトロ、ホルミル、アシル、ホスホリル、スルホニル、又はスルホンアミドである。)

【請求項 10】

R₃ が、

【化 11】

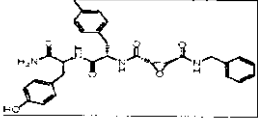
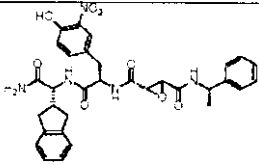
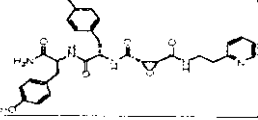
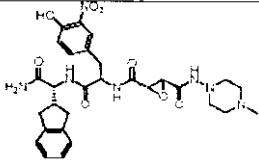
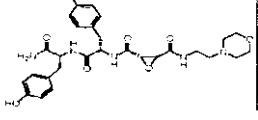
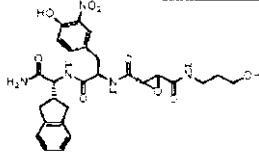
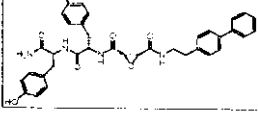
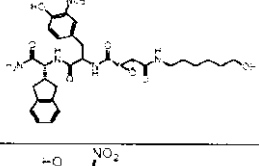
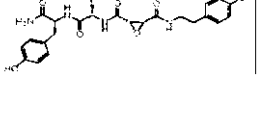
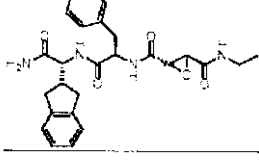
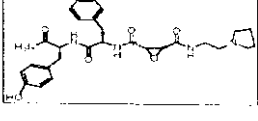
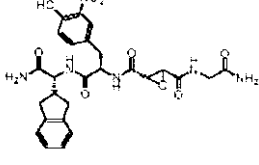
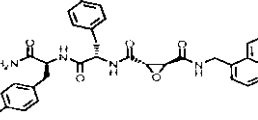
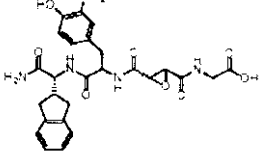
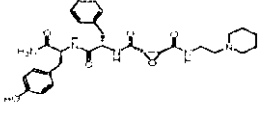
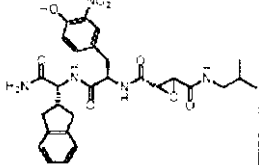
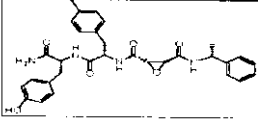
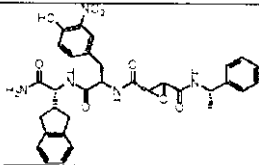


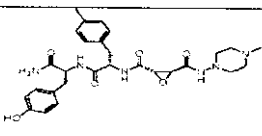
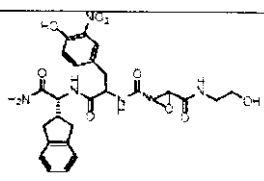
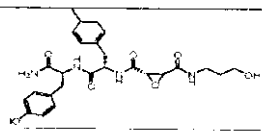
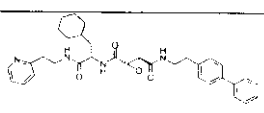
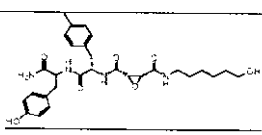
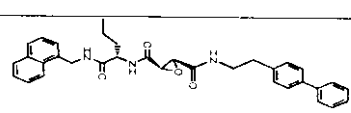
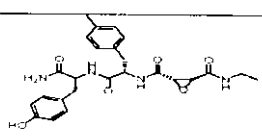
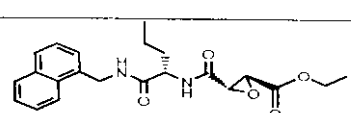
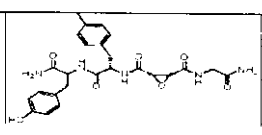
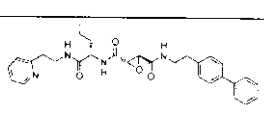
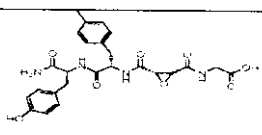
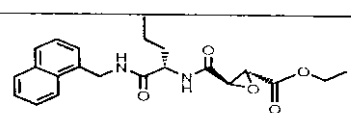
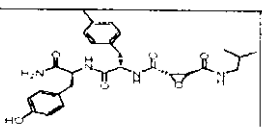
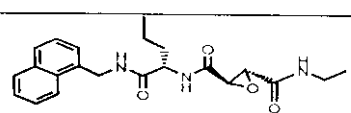
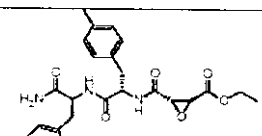
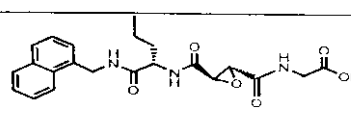
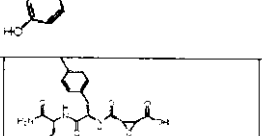
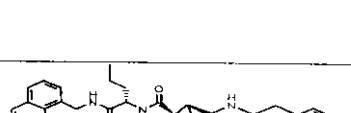
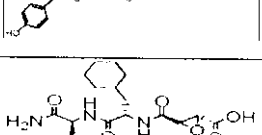
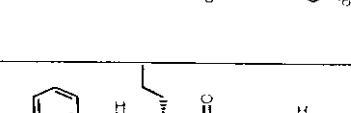
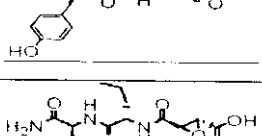
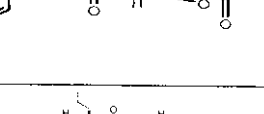
であり、R₂ が請求項 9 と同様に定義されている、請求項 9 記載の化合物。

【請求項 11】

下記の表に記載された化合物から群から選ばれる、請求項 9 記載の化合物。

Cpd #	構造式	Cpd #	構造式
1		89	

Cpd #	構造式	Cpd #	構造式
2		90	
3		91	
4		92	
5		93	
6		94	
7		95	
8		96	
9		97	
10		98	

Cpd #	構造式	Cpd #	構造式
11		99	
12		100	
13		104	
14		105	
15		106	
16		108	
17		109	
18		110	
19		111	
74		112	
75		113	

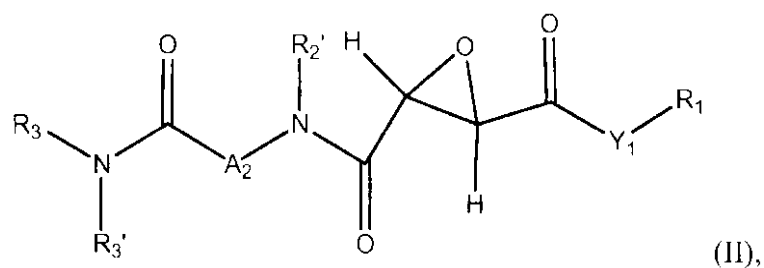
Cpd #	構造式	Cpd #	構造式
76		114	
77		115	
78		116	
79		117	
80		118	
81		119	
82		120	
83		121	
84		122	
85		123	

Cpd #	構造式	Cpd #	構造式
86		124	
87		125	
88		126	

【請求項 1 2】

式 I I :

【化 1 2】



で表される化合物、その薬学的に受容される誘導体、又はそのプロドラッグ。

(式中、

Y_1 が O 又は N - R_1 ' であり、

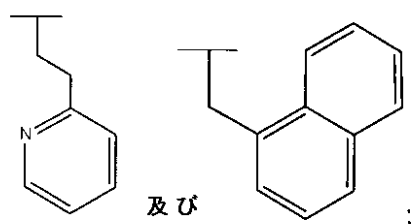
A_2 が、1 ~ 3 個の J により任意に置換された、- C (R_2) (R_2 ") -、アリーレン、シクロアルキレン、ヘテロアリーレン、又はヘテロシクロアルキレンであり、

R_2 及び R_2 " が、独立しており、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリアル、アラルキル、アラルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルケニル、ヘテロアリアル、ヘテロアラルキル、カルボキシアルキル又はカルボキシアミドアルキルであり、 R_2 及び R_2 " が結合している C 原子と一緒に、 R_2 及び R_2 " が 4 員環乃至 8 員環を形成するか、又は R_2 及び R_2 " が結合している C 原子と一緒に、 R_2 及び R_2 " がアルケンを形成するか、

R_2 及び R_2 " が、独立して任意に 1 ~ 3 個の J 基により置換され、かつアルキルの炭素原子のいずれかがヘテロ原子により置換されていてもよく、

R_3 が、

【化 1 3】



からなる群から選ばれ、

R_3' が H であり、

R_1 、 R_1' 、及び R_2' が、独立しており、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アラルキル、アラルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、カルボキシアルキル、又はカルボキシアミドアルキルであるか、かつ任意に 1 ~ 3 個の J 基により置換され、かつアルキルの炭素原子のいずれかがヘテロ原子により置換されていてもよく、

J が、アルキル、アリール、アラルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アラルコキシ、シクロアルキル、シクロアルコキシ、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルオキシ、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ケト、ヒドロキシ、チオ、アミノ、アルキルアミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ (aroylamino)、アラルカノイルアミノ、カルボキシ、カルボネート、カルバメート、グアニジニル、ウレア、ハロ、シアノ、ニトロ、ホルミル、アシル、ホスホリル、スルホニル、又はスルホンアミドであり、かつ任意に 1 ~ 3 個の J^1 基で置換されており、

J^1 が、アルキル、アリール、アラルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルオキシ、ケト、ヒドロキシ、チオ、アミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ (aroylamino)、カルボキシ、カルボネート、カルバメート、グアニジニル、ウレア、ハロ、シアノ、ニトロ、ホルミル、アシル、ホスホリル、スルホニル、又はスルホンアミドである。))

【請求項 1 3】

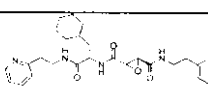
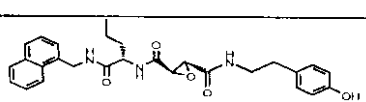
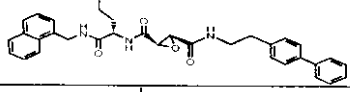
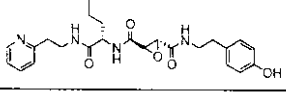
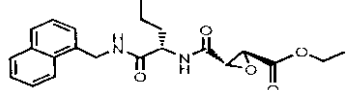
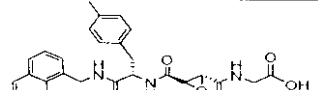
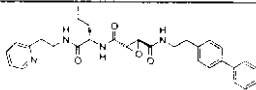
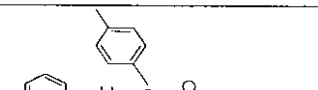
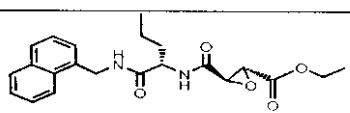
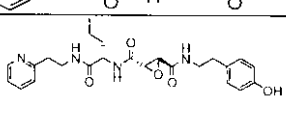
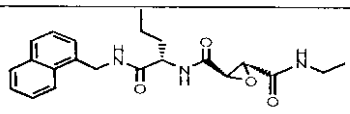
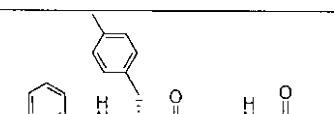
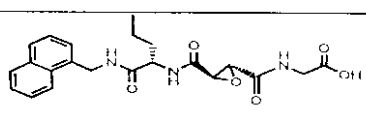
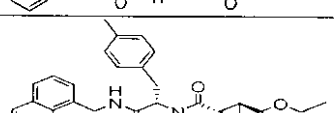
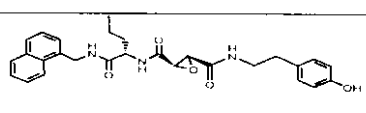
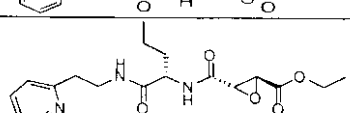
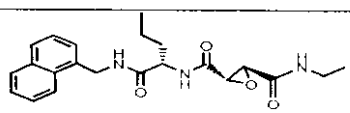
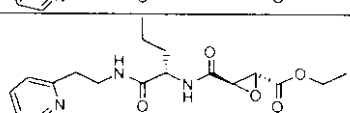
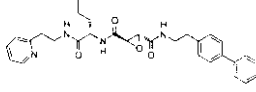
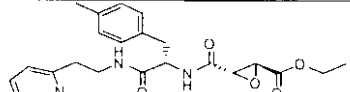
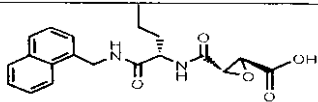
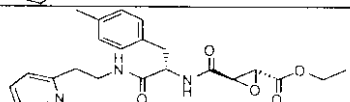
A_2 が $-C(R_2)(R_2'')$ - であり、かつ R_2 が天然に存在するアミノ酸の側鎖であり、かつ R_2'' が H である、請求項 1 2 記載の化合物。

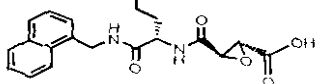
【請求項 1 4】

A_2 が表 2 に記載された A_2 基からなる群から選ばれ、 Y_1 が N - H であり、かつ R_1 が、表 1 に記載された R_1 の置換基からなる群から選ばれる、請求項 1 2 記載の化合物。

【請求項 1 5】

下記の表に記載された化合物から群から選ばれる、請求項 1 2 記載の化合物。

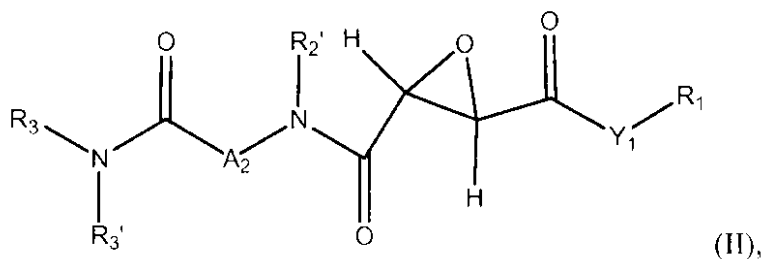
Cpd #	構造式	Cpd #	構造式
100		116	
104		117	
105		118	
106		119	
108		120	
109		121	
110		122	
111		123	
112		124	
113		125	
114		126	

Cpd #	構造式	Cpd #	構造式
115			

【請求項 16】

式 I I :

【化 1 4】



で表される化合物、その薬学的に受容される誘導体、又はそのプロドラッグ。

(式中、

Y_1 が O 又は N - R_1 ' であり、

A_2 が、1 ~ 3 個の J により任意に置換された、- C (R_2) (R_2 ") -、アリーレン、シクロアルキレン、ヘテロアリーレン、又はヘテロシクロアルキレンであり、

R_2 及び R_2 " が、独立しており、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アラルキル、アラルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、カルボキシアルキル又はカルボキシアミドアルキルであり、 R_2 及び R_2 " が結合している C 原子と一緒にあって、 R_2 及び R_2 " が 4 員環乃至 8 員環を形成するか、又は R_2 及び R_2 " が結合している C 原子と一緒にあって、 R_2 及び R_2 " がアルケンを形成するか、

R_2 及び R_2 " が、独立しており、任意に 1 ~ 3 個の J 基により置換され、かつアルキルの炭素原子のいずれかがヘテロ原子により置換されていてもよく、

R_1 、 R_1 '、 R_3 、及び R_3 ' が独立しており、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アラルキル、アラルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、カルボキシアルキル、又はカルボキシアミドアルキルであるか、かつ任意に 1 ~ 3 個の J 基により置換され、かつアルキルの炭素原子のいずれかがヘテロ原子により置換されていてもよく、かつ R_3 及び R_3 ' が結合している N 原子と一緒にあって、 R_2 及び R_2 " が 4 員環乃至 8 員環を形成するか、

R_2 ' が、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アラルキル、アラルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、カルボキシアルキル又はカルボキシアミドアルキルであり、かつ R_2 ' が、任意に 1 ~ 3 個の J 基により置換され、かつアルキルの炭素原子のいずれかがヘテロ原子により置換されていてもよく、

J が、アルキル、アリール、アラルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アラルコキシ、シクロアルキル、シクロアルコキシ、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルオキシ、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ケト、ヒドロキシ、チオ、アミノ、アルキルアミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ (aroylamino)、アラルカノイルアミノ、カルボキシ、カルボネート、カルバメート、グアニジニル、ウレア、ハロ、シアノ、ニトロ、ホルミル、アシル、ホスホリル、スルホニル、又はスルホンアミドであり、かつ任意に 1 ~ 3 個の J¹ 基で置換されており、

J¹ が、アルキル、アリール、アラルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルオキシ、ケト、ヒドロキシ、チオ、アミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ (aroylamino)、カルボキシ、カルボネート、カルバメート、グアニジニル、ウレア、ハロ、シアノ、ニトロ、ホルミル、アシル、ホスホリル、スルホニル、又はスルホンアミドである。)

【請求項 17】

Y_1 が N - H であり、かつ R_1 が、表 1 に記載された R_1 の置換基からなる群から選ば

れる、請求項 1、9、12 又は 16 記載の化合物。

【請求項 18】

R_3' が H であり、かつ R_3 が、表 1 に記載された R_3 の置換基からなる群から選ばれる、請求項 1、5、9 又は 16 記載の化合物。

【請求項 19】

Y_1 が N-H であり、 R_3' が H であり、かつ R_1 及び R_3 が、独立しており、表 1 に記載された R_1 及び R_3 の置換基からなる群から選ばれる、請求項 1、9 又は 16 記載の化合物。

【請求項 20】

A_2 が $-C(R_2)(R_2'')$ - である、請求項 12 又は 16 記載の化合物。

【請求項 21】

A_2 が $-C(R_2)(R_2'')$ - であり、かつ R_2 及び R_2'' が H である、請求項 16 記載の化合物。

【請求項 22】

A_2 がアリーレン、シクロアルキレン、ヘテロアリーレン、又はヘテロシクロアルキレンである、請求項 12 又は 16 記載の化合物。

【請求項 23】

A_2 が、表 2 に記載された A_2 基からなる群から選ばれる、請求項 12 又は 16 記載の化合物。

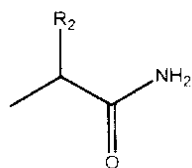
【請求項 24】

A_2 が、表 2 に記載された A_2 基からなる群から選ばれ、 Y_1 が N-H であり、 R_3' が H であり、並びに R_1 及び R_3 が独立しており、表 1 に記載されている R_1 及び R_3 の置換基からなる群から選ばれる、請求項 16 記載の化合物。

【請求項 25】

R_3 が、

【化 15】

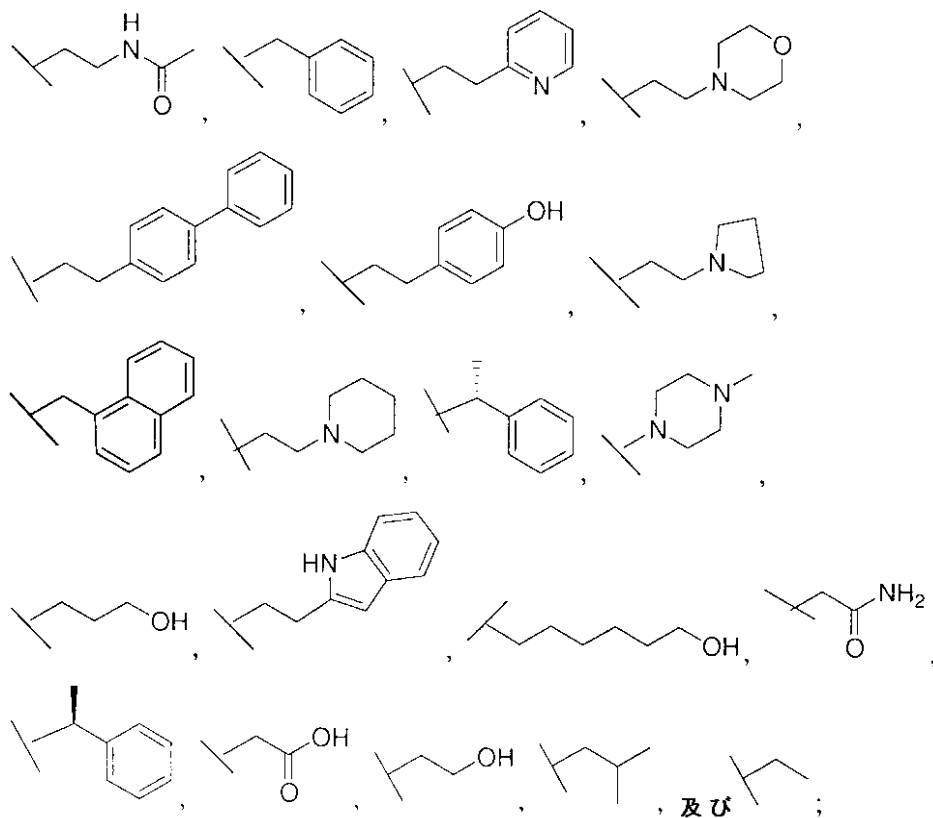


であり、 R_2 が H、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アラルキル、アラルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、カルボキシアルキル又はカルボキシアミドアルキルであり、ここにおいて、 R_2 が、1 - 3 個の J 基で任意に置換されていてもよく、かつアルキルのあらゆる炭素原子がヘテロ原子により置換されていてもよい、請求項 1 又は 16 記載の化合物。

【請求項 26】

下記の置換基からなる群から選ばれる、請求項 1 又は 16 記載の化合物。

【化 1 6】

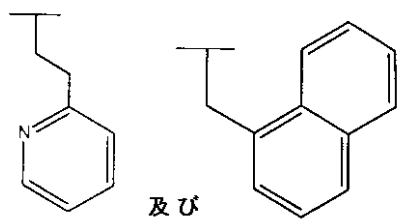


【請求項 2 7】

R_3 が H であり、かつ

R_3 が、

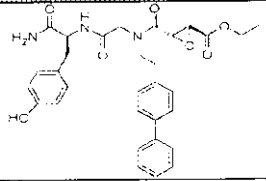
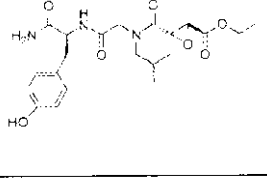
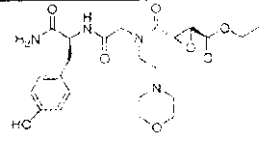
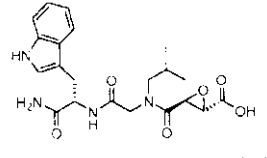
【化 1 7】



からなる置換基の群から選ばれる、請求項 1 又は 1 6 記載の化合物。

【請求項 2 8】

下記の表に記載された化合物からなる群から選ばれる、請求項 1 6 記載の化合物。

Cpd #	構造式	Cpd #	構造式
101		103	
102		107	

【請求項 29】

前記 (S, S) - エポキサイド ジアステレオマーに対する前記 (R, R) - エポキサイド ジアステレオマー比が少なくとも 2 である、請求項 5、9、12 又は 16 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 30】

前記 (R, R) - エポキサイド ジアステレオマーに対する前記 (S, S) - エポキサイド ジアステレオマー比が少なくとも 2 である、請求項 5、9、12 又は 16 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 31】

請求項 1 乃至請求項 30 のいずれかに記載の化合物及び薬学的に受容されうるキャリアーを含む薬学的組成物

【請求項 32】

請求項 31 記載の薬学的組成物及び哺乳動物宿主において前記組成物を使用するための使用説明書が同梱された、包装された薬学的組成物。

【請求項 33】

哺乳動物宿主におけるパパイン科 (papain - family) システインプロテアーゼを阻害するために使用される、請求項 31 の薬学組成物。

【請求項 34】

前記パパイン科 (papain - family) システインプロテアーゼがカテプシンである、請求項 33 記載の薬学組成物。

【請求項 35】

哺乳動物宿主におけるパパイン科 (papain - family) システインプロテアーゼと関連する疾患を処置又は予防するために使用される請求項 31 の薬学的組成物。

【請求項 36】

前記疾患がカテプシンと関連している、請求項 35 記載の薬学的組成物。

【請求項 37】

哺乳動物宿主における免疫システムを抑圧するために使用される、請求項 31 の薬学的組成物。

【請求項 38】

哺乳動物宿主における免疫関連疾患、炎症疾患、組織リモデリング疾患 (tissue remodeling disease)、癌、又は感染症を処置又は予防するために使用される、請求項 31 の薬学的組成物。