

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成18年6月29日(2006.6.29)

【公表番号】特表2005-530763(P2005-530763A)

【公表日】平成17年10月13日(2005.10.13)

【年通号数】公開・登録公報2005-040

【出願番号】特願2004-502949(P2004-502949)

【国際特許分類】

C 0 7 D 235/20 (2006.01)

A 6 1 K 31/4184 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 P 1/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/12 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

A 6 1 P 13/10 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)

A 6 1 P 21/02 (2006.01)

A 6 1 P 21/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/16 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 235/20 C S P

A 6 1 K 31/4184

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 P 1/02

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/12
A 6 1 P 1/18
A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 3/12
A 6 1 P 9/08
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 9/12
A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 11/02
A 6 1 P 11/06
A 6 1 P 13/02
A 6 1 P 13/10
A 6 1 P 13/12
A 6 1 P 15/00
A 6 1 P 15/06
A 6 1 P 17/14
A 6 1 P 21/02
A 6 1 P 21/04
A 6 1 P 25/06
A 6 1 P 25/08
A 6 1 P 25/16
A 6 1 P 25/18
A 6 1 P 25/22
A 6 1 P 25/24
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 27/02
A 6 1 P 27/16
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 37/06
C 0 7 D 401/14

【手続補正書】

【提出日】平成18年5月12日(2006.5.12)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

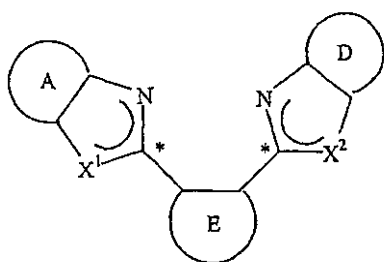
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

以下の式：

【化 1】



[式中、

A 及び E が、置換又は非置換フェニル、及び置換又は非置換ピリジル環系から独立して選ばれ；

ここで、当該置換フェニル環系 A は、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換アリール、置換又は非置換ヘテロアリール、 NH_2 、アルキルアミン、アリールアミン、カルボキシル、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、アルキルアミド、アリールアミド、スルホンアミド、チオウレア、アルコキシ、カルバメート、エステル、ヒドロキシ、イミド、及びそれらの組合せから選ばれるメンバーで置換され、

D が、非置換フェニル、及び置換又は非置換ピリジル環系から選ばれ；

ここで、当該置換フェニル環系 D は、置換アルキル、置換又は非置換アリール、置換又は非置換ヘテロアリール、 NH_2 、アルキルアミン、アリールアミン、カルボキシル、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、アルキルアミド、アリールアミド、スルホンアミド、チオウレア、アルコキシ、カルバメート、エステル、ヒドロキシ、イミド、及びそれらの組合せから選ばれるメンバーで置換され、

曲線が、 C^* と N との間の二重結合、 C^* と X^1 との間の二重結合、及び C^* と X^2 との間の二重結合から選ばれ；

X^1 及び X^2 が、 $\text{N}(\text{R}^1)$ 、 $\text{NHC}(\text{R}^2)$ 、 SCR^3 、 $\text{OC}(\text{R}^4)$ 、及び $\text{C}(\text{R}^5)$ から独立して選ばれ、そして

ここで、

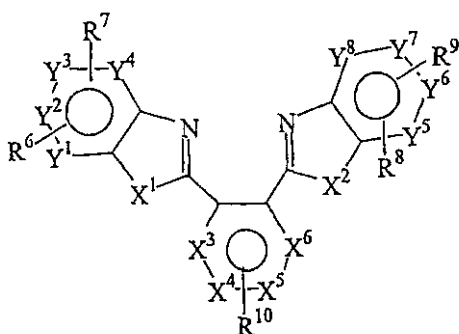
R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、及び R^5 、H、置換又は非置換アルキル、及び置換又は非置換ヘテロアリールからなる群から独立して選ばれるメンバーである]

で表される化合物。

【請求項 2】

以下の式：

【化 2】



[式中、

X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 、 Y^6 、 Y^7 、及び Y^8 が、 $C(R^{11})$ 及びNから独立して選ばれるメンバーであり、但し、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及び Y^4 の内の2以下がNであり、そして Y^5 、 Y^6 、 Y^7 、及び Y^8 の内の2以下がNであり；

R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、及び R^{11} が、H、 NH_2 、アルキル・アミン、アリール・アミン、カルボキシル、 $C(O)NH_2$ 、アルキル・アミド、アリール・アミド、スルホンアミド、チオウレア、エステル、アルコキシ、カルバメート、ヒドロキシ、置換アルキル、置換又は非置換アリール、置換又は非置換ヘテロアリール、ケトン及びそれらの組合せから独立して選ばれるメンバーであり、そして R^6 と R^7 が、場合により結合して4～8員を有する環を形成し、並びに R^8 と R^9 が、場合により結合して4～8員を有する環を形成し；そして

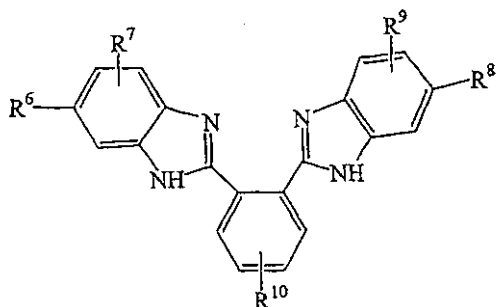
R^{10} が、H、OH、 NH_2 、ハロゲン、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換アリール、置換又は非置換ヘテロアリール、置換又は非置換ヘテロシクロアルキル、及び置換又は非置換アリールアルキル基からなる群から選ばれるメンバーである]

で表される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

以下の式：

【化3】



[式中、

R^6 、 R^7 、 R^8 、及び R^9 が、H、置換アルキル、置換又は非置換アリール、置換又は非置換ヘテロアリール、 $C(O)R^{12}$ 、及び $NR^{13}R^{14}$ からなる群から独立して選ばれるメンバーであり、但し、 R^6 と R^7 の内の1以下がHであり、かつ、 R^6 と R^7 の内の1が NH_2 である場合、 R^8 と R^9 のいずれも NH_2 ではない、

ここで、

R^{12} が、H、置換又は非置換アルキル、 OR^{18} 、及び $NR^{19}R^{20}$ からなる群から選ばれるメンバーであり、

ここで、

R^{18} 、 R^{19} 、及び R^{20} が、H及び置換又は非置換アルキルからなる群から独立して選ばれるメンバーであり、そして R^{19} と R^{20} がそれらが結合する窒素と一緒にあって、場合により結合して、4～8員を有する環を形成し、

R^{13} と R^{14} が、それらが結合する窒素と一緒にあって、場合により結合して環になり、そしてH、置換又は非置換アルキル、 $C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $C(S)NR^{15}R^{16}$ 、 $S(O)_2R^{17}$ 、 $C(O)OR^{17}$ 、及び $C(O)R^{17}$ からなる群から独立して選ばれるメンバーであり、

ここで、

R^{15} 及び R^{16} が、H、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換ヘテロアルキル、置換又は非置換アリール、及び置換又は非置換ヘテロアリールからなる群から独立して選ばれるメンバーであり、そしてそれらが結合する窒素と一緒にあって、場合により結合して4～8員を有する環になり；

R^{17} が、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換ヘテロアルキル、置換又は非置換アリール、及び置換又は非置換ヘテロアリールからなる群から選ばれる メンバー であり；そして

R^{10} が、H、OH、 NH_2 、ハロゲン、及び置換又は非置換アルキル基からなる群から選ばれる メンバー である]

で表される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^6 、 R^7 、 R^8 、及び R^9 が、以下の基：

H、 NH_2 、置換アルキル、置換又は非置換アリール、置換又は非置換ヘテロアリール、 $NHC(O)-(C_1-C_{10})$ アルキル； $NHS(O)_2-(C_1-C_{10})$ アルキル、 $NHC(S)NH-(C_1-C_{10})$ アルキル、 $NHC(O)O-(C_1-C_{10})$ アルキル、 $NHC(O)NH-(C_1-C_{10})$ アルキルから独立して選ばれる メンバー であり、但し、 R^6 と R^8 の両方が H ではない、請求項 3 に記載の化合物。

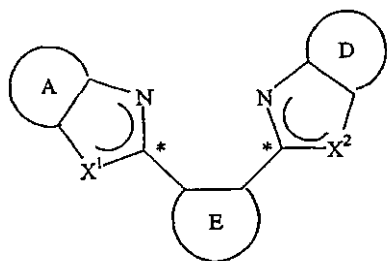
【請求項 5】

前記化合物が、図 1 に記載の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

細胞において電位依存性カリウム・チャネルを通過するイオン流を低減する方法であって、当該方法が、当該細胞を、カリウム・チャネル調節する量の以下の式：

【化 4】



[式中、

A、D、及び E が、置換又は非置換アリール、及び置換又は非置換ヘテロアリール環系から独立して選ばれ；

曲線が、 C^* と N との間の二重結合、 C^* と X^1 との間の二重結合、及び C^* と X^2 との間の二重結合から選ばれ；

X^1 及び X^2 が、 NR^1 、S、O、 $NHC(R^2)$ 、 $SC(R^3)$ 、 $OC(R^4)$ 、及び $C(R^5)$ を独立して表し；そして

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、及び R^5 が、H 及び置換又は非置換アルキル、置換又は非置換アリールアルキル、及び置換又は非置換ヘテロアリールからなる群から独立して選ばれる メンバー である]

で表される化合物と接触させることを含む、前記方法。

【請求項 7】

前記環系 A、D、及び E が、置換又は非置換フェニル、及び置換又は非置換ピリジル環系から独立して選ばれる、請求項 6 に記載の方法。

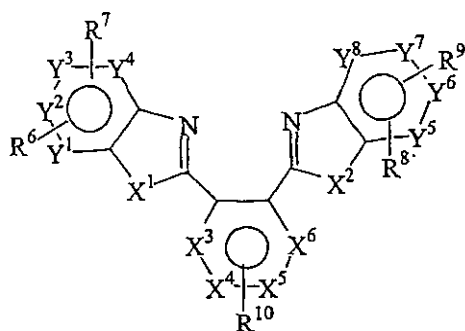
【請求項 8】

前記置換フェニル環系 A 及び D が、 NH_2 、アルキル・アミン、アリール・アミン、カルボキシル、エステル、 $C(O)NH_2$ 、アルキル・アミド、アリール・アミド、スルホンアミド、チオウレア、ハロゲン、アルコキシ、カルバメート、エーテル、ヒドロキシ、イミド、及びそれらの組み合わせから選ばれる メンバー で置換される、請求項 7 に記載の方法。

【請求項 9】

前記化合物が以下の式：

【化 5】



[式中、

X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 、 Y^6 、 Y^7 、及び Y^8 が、 $C(R^{11})$ 及びNから独立して選ばれるメンバーであり、但し、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及び Y^4 の内の2以下がNであり、そして Y^5 、 Y^6 、 Y^7 、及び Y^8 の内の2以下がNであり；

R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、及び R^{11} が、H、 NH_2 、アルキル・アミン、アリール・アミン、カルボキシル、 $C(O)NH_2$ 、アルキル・アミド、アリール・アミド、スルホンアミド、チオウレア、エステル、ハロゲン、アルコキシ、カルバメート、エーテル、ヒドロキシ置換又は非置換アルキル、置換又は非置換アリール、置換又は非置換ヘテロアリール、ケトン及びそれらの組合せから独立して選ばれるメンバーであり、そして R^6 と R^7 は、場合により結合して4～8員を有する環を形成し、並びに R^8 と R^9 は、場合により結合して4～8員を有する環を形成し；そして

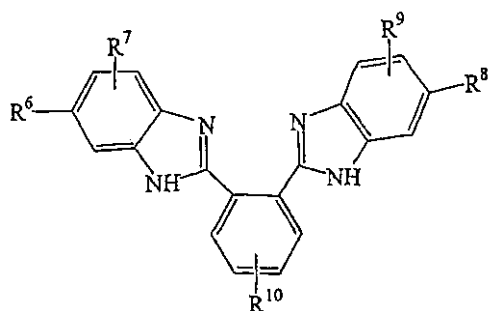
R^{10} が、H、OH、 NH_2 、ハロゲン、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換アリール、置換又は非置換ヘテロアリール、置換又は非置換ヘテロシクロアルキル、及び置換又は非置換アリールアルキル基からなる群から選ばれるメンバーである]

で表される、請求項6に記載の方法。

【請求項 10】

前記化合物が以下の式：

【化 6】



[式中、

R^6 、 R^7 、 R^8 、及び R^9 が、H、ハロゲン、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換アリール、置換又は非置換ヘテロアリール、 $C(O)R^{12}$ 、及び $NR^{13}R^{14}$ からなる群から独立して選ばれるメンバーであり、但し、 R^6 と R^7 の内の1以下がHであり、かつ R^6 と R^7 のうちの1が NH_2 である場合、 R^8 と R^9 のいずれも NH_2 ではない、

ここで、

R^{12} が、H、置換又は非置換アルキル、 OR^{18} 、及び $NR^{19}R^{20}$ からなる群から選ばれるメンバーであり、

ここで、

R^{18} 、 R^{19} 、及び R^{20} が、H 及び置換又は非置換アルキルからなる群から独立して選ばれるメンバーであり、そして R^{19} と R^{20} がそれらが結合する窒素と一緒にあって、場合により結合して環を形成し、

R^{13} と R^{14} が、それらが結合する窒素と一緒にあって、場合により結合して環になり、そして H、置換又は非置換アルキル、 $C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $C(S)NR^{15}R^{16}$ 、 $S(O)_2R^{17}$ 、 $C(O)OR^{17}$ 、及び $C(O)R^{17}$ からなる群から独立して選ばれるメンバーであり、

ここで、

R^{15} 及び R^{16} が、H、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換ヘテロアルキル、置換又は非置換アリール及び置換又は非置換ヘテロアリールからなる群から独立して選ばれるメンバーであり、そしてそれらが結合する窒素と一緒にあって、場合により結合して 4 ~ 8 員を有する環になり；

R^{17} が、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換ヘテロアルキル、置換又は非置換アリール及び置換又は非置換ヘテロアリールからなる群から選ばれるメンバーであり；そして

R^{10} が、H、OH、 NH_2 、ハロゲン、及び置換又は非置換アルキル基からなる群から選ばれるメンバーである]

で表される、請求項 9 に記載の方法。

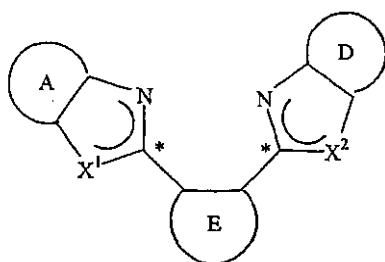
【請求項 11】

前記化合物が図 1 に記載の構造を有する、請求項 6 に記載の方法。

【請求項 12】

SK ファミリーの電位依存性カリウム・チャネルの調節を介して疾患又は病気を治療する方法であって、当該方法が、そうした治療を必要とする対象へ、治療有効量の以下の式：

【化 7】



[式中、

A、D、及び E が、置換又は非置換アリール、及び置換又は非置換ヘテロアリール環系から独立して選ばれ；

曲線が、 C^* と N との間の二重結合、 C^* と X^1 との間の二重結合、及び C^* と X^2 との間の二重結合から選ばれ；

X^1 及び X^2 が、 $N(R^1)$ 、S、O、 $NHC(R^2)$ 、 $SC(R^3)$ 、及び $OC(R^4)$ 、及び C(R^5) を独立して表し；そして

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、及び R^5 が、H、及び置換又は非置換アルキル、置換又は非置換アリールアルキル、及び置換又は非置換ヘテロアリールからなる群から独立して選ばれるメンバーである]

で表される化合物を投与することを含む、前記方法。

【請求項 13】

前記環系 A、D、及び E が、置換又は非置換フェニル及び置換又は非置換ピリジル環系から独立して選ばれる、請求項 12 に記載の方法。

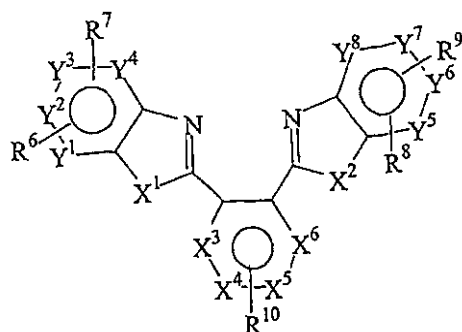
【請求項 14】

前記置換フェニル環系 A 及び D が、 NH_2 、アルキル・アミン、アリール・アミン、カルボキシル、エステル、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、アルキル・アミド、アリール・アミド、スルホンアミド、チオウレア、ハロゲン、アルコキシ、カルバメート、エーテル、ヒドロキシ、イミド、及びそれらの組み合わせから選ばれるメンバーで置換される、請求項 13 に記載の方法。

【請求項 15】

前記化合物が、以下の：

【化 8】



[式中、

X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 、 Y^6 、 Y^7 、及び Y^8 が、 $\text{C}(\text{R}^{11})$ 及びNから独立して選ばれるメンバーであり、但し、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及び Y^4 の内の2以下がNであり、そして Y^5 、 Y^6 、 Y^7 、及び Y^8 の内の2以下がNであり；

R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、及び R^{11} が、H、 NH_2 、アルキル・アミン、アリール・アミン、カルボキシル、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、アルキル・アミド、アリール・アミド、スルホンアミド、チオウレア、エステル、ハロゲン、アルコキシ、カルバメート、エーテル、ヒドロキシ置換又は非置換アルキル、置換又は非置換アリール、置換又は非置換ヘテロアリール、ケトン及びそれらの組合せから独立して選ばれるメンバーであり、そして R^6 と R^7 が、場合により結合して4～8員を有する環を形成し、並びに R^8 と R^9 が、場合により結合して4～8員を有する環を形成し；そして

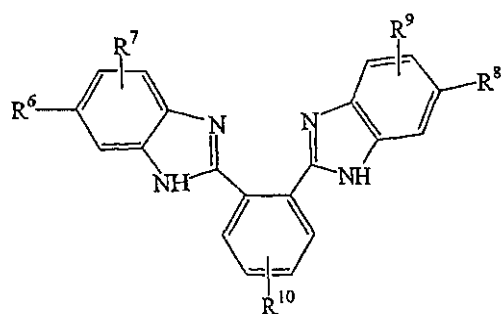
R^{10} が、H、OH、 NH_2 、ハロゲン、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換アリール、置換又は非置換ヘテロアリール、置換又は非置換ヘテロシクロアルキル、及び置換又は非置換アリールアルキル基からなる群から選ばれるメンバーである]

で表される式を有する、請求項 12 に記載の方法。

【請求項 16】

前記化合物が、以下の：

【化 9】



【式中、

R^6 、 R^7 、 R^8 、及び R^9 が、H、ハロゲン、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換アリール、置換又は非置換ヘテロアリール、 $C(O)R^{12}$ 、及び $NR^{13}R^{14}$ からなる群から独立して選ばれるメンバーであり、但し、 R^6 と R^7 の内の1以下がHであり、そして R^6 と R^7 の内の1が NH_2 である場合、 R^8 と R^9 のいずれも NH_2 ではなく、

ここで、

R^{12} が、H、置換又は非置換アルキル、 OR^{18} 、及び $NR^{19}R^{20}$ からなる群から選ばれるメンバーであり、

ここで、

R^{18} 、 R^{19} 、及び R^{20} が、H及び置換又は非置換アルキルからなる群から独立して選ばれるメンバーであり、そして R^{19} と R^{20} がそれらが結合する窒素と一緒になっている場合により結合して環を形成し、

R^{13} と R^{14} が、それらが結合する窒素と一緒になっている場合により結合して環になり、そしてH、置換又は非置換アルキル、 $C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $C(S)NR^{15}R^{16}$ 、 $S(O)_2R^{17}$ 、 $C(O)OR^{17}$ 、及び $C(O)R^{17}$ からなる群から独立して選ばれるメンバーであり、

ここで、

R^{15} 及び R^{16} が、H、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換ヘテロアルキル、置換又は非置換アリール、及び置換又は非置換ヘテロアリールからなる群から独立して選ばれるメンバーであり、そしてそれらが結合する窒素と一緒になっている場合により結合して4～8員を有する環になり；

R^{17} が、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換ヘテロアルキル、置換又は非置換アリール、及び置換又は非置換ヘテロアリールからなる群から選ばれるメンバーであり；そして

R^{10} が、H、OH、 NH_2 、ハロゲン、及び置換又は非置換アルキル基からなる群から選ばれるメンバーである]

で表される式を有する、請求項15に記載の方法。

【請求項17】

R^5 、 R^6 、 R^7 、及び R^8 が、以下の群：

H、 NH_2 、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換アリール、置換又は非置換ヘテロアリール、 $NHC(O)-(C_1-C_{10})$ アルキル；ハロゲン； $NHS(O)_2-(C_1-C_{10})$ アルキル、 $NHC(S)NH-(C_1-C_{10})$ アルキル、 $NHC(O)O-(C_1-C_{10})$ アルキル、 $NHC(O)NH-(C_1-C_{10})$ アルキルから独立して選ばれるメンバーであり、但し、 R^5 及び R^7 の両方ともはHではない、請求項16に記載の方法。

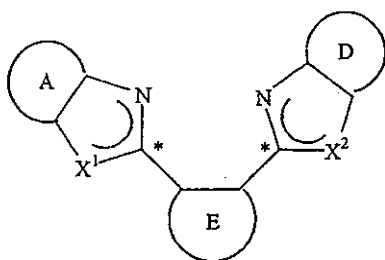
【請求項18】

前記化合物が、図1に記載の構造を有する、請求項12に記載の方法。

【請求項19】

医薬として許容される賦形剤及び以下の式：

【化 1 0】



[式中、

A、D、及びEが、置換又は非置換アリール、及び置換又は非置換ヘテロアリール環系から独立して選ばれ；

曲線が、 C^* とNとの間の二重結合、 C^* と X^1 との間の二重結合、及び C^* と X^2 との間の二重結合から選ばれ；

X^1 及び X^2 が、 $N(R^1)$ 、S、O、 $NHC(R^2)$ 、 $SC(R^3)$ 、 $OC(R^4)$ 、及び $C(R^5)$ を独立して表し；そして

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、及び R^5 が、H及び置換又は非置換アルキル、置換又は非置換アリールアルキル、及び置換又は非置換ヘテロアリールからなる群から独立して選ばれるメンバーである]

で表される化合物を含む組成物。

【請求項 2 0】

前記環系 A、D、及びEが、置換又は非置換フェニル及び置換又は非置換ピリジル環系から独立して選ばれる、請求項 1 9 に記載の組成物。

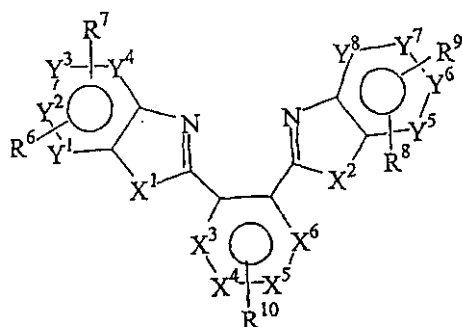
【請求項 2 1】

前記置換フェニル環系 A 及び D が、 NH_2 、アルキル・アミン、アリール・アミン、カルボキシル、エステル、 $C(O)NH_2$ 、アルキル・アミド、アリール・アミド、スルホンアミド、チオウレア、アルコキシ、カルバメート、エーテル、ヒドロキシ、イミド、及びそれらの組み合わせから選ばれるメンバーで置換される、請求項 2 0 に記載の組成物。

【請求項 2 2】

前記化合物が、以下の：

【化 1 1】



[式中、

X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 、 Y^6 、 Y^7 、及び Y^8 が、 $C(R^{11})$ 及

びNから独立して選ばれるメンバーであり、但し、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及び Y^4 の内の2以下がNであり、そして Y^5 、 Y^6 、 Y^7 、及び Y^8 の内の2以下がNであり；

R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、及び R^{11} が、H、 NH_2 、アルキル・アミン、アリール・アミン、カルボキシル、 $C(O)NH_2$ 、アルキル・アミド、アリール・アミド、スルホンアミド、チオウレア、エステル、アルコキシ、カルバメート、エーテル、ヒドロキシ置換又は非置換アルキル、置換又は非置換アリール、置換又は非置換ヘテロアリール、ケトン及びそれらの組合せから独立して選ばれるメンバーであり、そして R^6 と R^7 が、場合により結合して4～8員を有する環を形成し、並びに R^8 と R^9 が、場合により結合して4～8員を有する環を形成し；そして

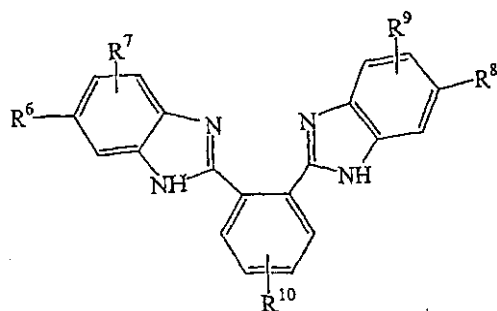
R^{10} が、H、OH、 NH_2 、ハロゲン、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換アリール、置換又は非置換ヘテロアリール、置換又は非置換ヘテロシクロアルキル、及び置換又は非置換アリールアルキル基からなる群から選ばれるメンバーである]

で表される式を有する、請求項19に記載の組成物。

【請求項23】

前記化合物が、以下の：

【化12】



[式中、

R^6 、 R^7 、 R^8 、及び R^9 が、H、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換アリール、置換又は非置換ヘテロアリール、 $C(O)R^{12}$ 、及び $NR^{13}R^{14}$ からなる群から独立して選ばれるメンバーであり、但し、 R^6 と R^7 の内の1以下がHであり、そして R^6 と R^7 のうちの1が NH_2 である場合、 R^8 と R^9 のいずれも NH_2 ではない、

ここで、

R^{12} が、H、置換又は非置換アルキル、 OR^{18} 、及び $NR^{19}R^{20}$ からなる群から選ばれるメンバーであり、

ここで、

R^{18} 、 R^{19} 、及び R^{20} が、H及び置換又は非置換アルキルからなる群から独立して選ばれるメンバーであり、そして R^{19} と R^{20} がそれらが結合する窒素と一緒にあって場合により結合して環を形成し、

R^{13} と R^{14} が、それらが結合する窒素と一緒にあって、場合により結合して環になり、そしてH、置換又は非置換アルキル、 $C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $C(S)NR^{15}R^{16}$ 、 $S(O)_2R^{17}$ 、 $C(O)OR^{17}$ 、及び $C(O)R^{17}$ からなる群から独立して選ばれるメンバーであり、

ここで、

R^{15} 及び R^{16} が、H、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換ヘテロアルキル、置換又は非置換アリール、及び置換又は非置換ヘテロアリールからなる群から独立して選ばれるメンバーであり、そしてそれらが結合する窒素と一緒にあって、場合により結合して4～8員を有する環になり；

R^{17} が、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換ヘテロアルキル、置換又

は非置換アリール、及び置換又は非置換ヘテロアリールからなる群から選ばれるメンバーであり、そして

R^{10} は、H、OH、 NH_2 、ハロゲン、及び置換又は非置換アルキル基からなる群から選ばれるメンバーである]

で表される式を有する、請求項 22 に記載の組成物。

【請求項 24】

R^5 、 R^6 、 R^7 、及び R^8 が、以下の群：

H、 NH_2 、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換アリール、置換又は非置換ヘテロアリール、 $NHC(O)-(C_1-C_{10})$ アルキル； $NHS(O)_2-(C_1-C_{10})$ アルキル、 $NHC(S)NH-(C_1-C_{10})$ アルキル、 $NHC(O)O-(C_1-C_{10})$ アルキル、 $NHC(O)NH-(C_1-C_{10})$ アルキルから独立して選ばれるメンバーであり、但し、 R^5 と R^7 の両方ともはHではない、請求項 23 に記載の組成物。

【請求項 25】

前記化合物が、図 1 に記載の構造を有する、請求項 19 に記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0060

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0060】

別の例示の態様において、本発明は、置換フェニル環系 A 及び D が、 NH_2 、アルキルアミン、アリールアミン、カルボキシル、エステル、 $C(O)NH_2$ 、アルキルアミド、アリールアミド、スルホンアミド、チオウレア、ハロゲン、アルコキシ、カルバメート、エーテル、ヒドロキシ、イミド及びその組み合わせから選ばれるメンバーで置換される化合物を提供する。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0066

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0066】

式IIにおいて、記号 X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 、 Y^6 、 Y^7 、及び Y^8 は、 $C(R^{11})$ 及び N から独立して選ばれるメンバーを表す。但し、

Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及び Y^4 のうちの 2 以下は N であり、 Y^5 、 Y^6 、 Y^7 、及び Y^8 のうちの 2 以下は N である。 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、及び R^{11} は、H、 NH_2 、アルキル・アミン、アリール・アミン、カルボキシル、 $C(O)NH_2$ 、アルキル・アミド、アリール・アミド、スルホンアミド、チオウレア、エステル、ハロゲン、アルコキシ、カルバメート、エーテル、ヒドロキシ、置換又は非置換アルキル、ケトン及びその組み合わせから独立して選ばれるメンバーを表す。 R^6 及び R^7 は、場合により結合して環を形成し、そして R^8 及び R^9 は、場合により結合して環を形成する。記号 R^{10} は、H、OH、 NH_2 、ハロゲン、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換アリール、置換又は非置換ヘテロアリール、置換又は非置換ヘテロシクロアルキル、及び置換又は非置換アリールアルキル基を表す。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0069

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0069】

式IIIにおいて、記号 R^6 、 R^7 、 R^8 、及び R^9 は、独立してハロゲン、置換又は非置換アルキル、 $C(O)R^{12}$ 又は $NR^{13}R^{14}$ を表す。但し、 R^6 及び R^7 のうちの 1 以下は、H で

あり、 R^6 及び R^7 のうちの1が NH_2 であるなら、 R^8 と R^9 のいずれも NH_2 ではない。記号 R^{12} は、H、置換又は非置換アルキル、 OR^{18} 、又は $NR^{19}R^{20}$ を表す。 R^{18} 、 R^{19} 、及び R^{20} は、独立してH又は置換若しくは非置換アルキルを表す。 R^{19} 及び R^{20} は、それらが結合するNと一緒にあって、場合により結合して環を形成する。記号 R^{13} 及び R^{14} は、それらが結合する窒素と一緒にあって、場合により一緒に結合して環になり、並びに独立してH、置換又は非置換アルキル、 $C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $C(S)NR^{15}R^{16}$ 、 $S(O)_2R^{17}$ 、 $C(O)R^{17}$ 、又は $C(O)R^{17}$ を表す。 R^{15} 及び R^{16} は、H、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換ヘテロアルキル、置換又は非置換アリール、及び置換又は非置換ヘテロアリールからなる群から独立して選ばれるメンバーであり、そしてそれらが結合する窒素と一緒にあって、場合により結合されて環になる。 R^{17} は、置換又は非置換アルキル、置換又は非置換ヘテロアルキル、置換又は非置換アリール、或いは置換又は非置換ヘテロアリールを表す。記号 R^{10} は、H、OH、 NH_2 、ハロゲン、又は置換若しくは非置換アルキル基を表す。

【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0076

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0076】

スキーム1において、記号M及び X^1 は、独立してCH又はNを表す。 R^1 及び R^2 は、実質的に上記のとおりである。YHは、OH、SH、及び NH_2 から選ばれるメンバーである。