

【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4月13日(2006.4.13)

【公表番号】特表2005-524628(P2005-524628A)

【公表日】平成17年8月18日(2005.8.18)

【年通号数】公開・登録公報2005-032

【出願番号】特願2003-562142(P2003-562142)

【国際特許分類】

C 0 7 K	5/023	(2006.01)
A 6 1 K	31/70	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	31/14	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
C 0 7 K	7/02	(2006.01)
C 1 2 N	9/99	(2006.01)
A 6 1 K	38/00	(2006.01)
A 6 1 K	38/21	(2006.01)

【F I】

C 0 7 K	5/023	Z N A
A 6 1 K	31/70	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	31/14	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
C 0 7 K	7/02	
C 1 2 N	9/99	
A 6 1 K	37/02	
A 6 1 K	37/66	G

【手続補正書】

【提出日】平成18年2月23日(2006.2.23)

【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

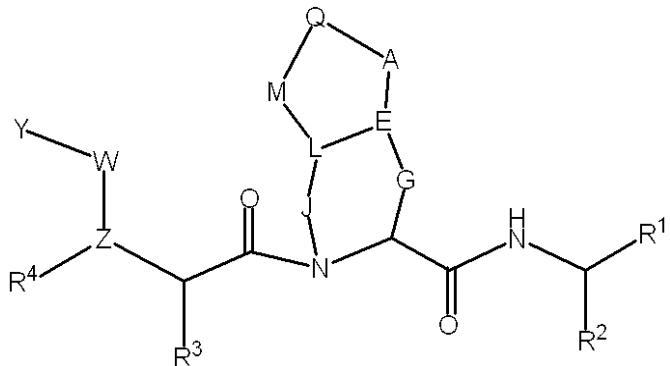
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

化合物、または該化合物の鏡像異性体、立体異性体、回転異性体、互変異性体、ラセミ体もしくはプロドラッグ、または該化合物もしくは該プロドラッグの医薬上許容される塩もしくは溶媒和物であって、該化合物は式I:

【化1】



式I

〔式中、

Yは、以下からなる群より選択され：アルキル、アルキル-アリール、ヘテロアルキル、ヘテロアリール、アリール-ヘテロアリール、アルキル-ヘテロアリール、シクロアルキル、アルキルオキシ、アルキル-アリールオキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、シクロアルキルオキシ、アルキルアミノ、アリールアミノ、アルキル-アリールアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、シクロアルキルアミノおよびヘテロシクロアルキルアミノ、ただしYは所望によりX^{1 1}またはX^{1 2}で置換されてもよく；

X^{1 1}は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキル-アルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アルキルアリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、アルキルヘテロアリールまたはヘテロアリールアルキルであり、ただしX^{1 1}はさらに所望によりX^{1 2}で置換されてもよく；

X^{1 2}は、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、チオ、アルキルチオ、アリールチオ、アミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アルキルスルホンアミド、アリールスルホンアミド、カルボキシ、カルボアルコキシ、カルボキシアミド、アルコキシカルボニルアミノ、アルコキシカルボニルオキシ、アルキルウレイド、アリールウレイド、ハロゲン、シアノまたはニトロであり、ただし上記アルキル、アルコキシおよびアリールはさらに所望によりX^{1 2}から独立して選択される部分で置換されてもよく；

R¹は、COR⁵であり；ここでR⁵は、COOR⁸、CONR⁹R^{1 0}、CF₃、C₂F₅、C₃F₇、CF₂R⁶またはR⁶であり、R⁶、R⁸、R⁹およびR^{1 0}以下からなる群より独立して選択され：H、アルキル、アリール、ヘテロアルキル、ヘテロアリール、シクロアルキル、シクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、[CH(R¹')]_pCOOR^{1 1}、[CH(R¹')]_pCONR^{1 2}R^{1 3}、[CH(R¹')]_pSO₂R^{1 1}、[CH(R¹')]_pCOR^{1 1}、[CH(R¹')]_pCH(OH)R^{1 1}、CH(R¹')CONHCH(R²')COOR^{1 1}、CH(R¹')CONHCH(R²')CONR^{1 2}R^{1 3}、CH(R¹')CONHCH(R²')R'、CH(R¹')CONHCH(R²')CONHCH(R³')COOR^{1 1}、CH(R¹')CONHCH(R²')CONHCH(R³')CONR^{1 2}R^{1 3}、CH(R¹')CONHCH(R²')CONHCH(R³')CONHCH(R⁴')COOR^{1 1}、CH(R¹')CONHCH(R²')CONHCH(R³')CONHCH(R⁴')CONHC(H(R⁴'))CONR^{1 2}R^{1 3}、CH(R¹')CONHCH(R²')CONHCH(R³')CONHCH(R⁴')CONHCH(R⁵')CONHCH(R⁴')COOR^{1 1}およびCH(R¹')CONHCH(R²')CONHCH(R³')CONHCH(R⁴')CONHCH(R⁵')CONR^{1 2}R^{1 3}、ここでR¹'、R²'、R³'、R⁴'、R⁵'、R^{1 1}、R^{1 2}、R^{1 3}、およびR'は独立して以下からなる群より選択される：H、アルキル、アリール、ヘテロアルキル、ヘテロアリール、シクロアルキル、アルキル-アリ

ール、アルキル-ヘテロアリール、アリール-アルキルおよびヘテロアラルキル；

Zは、O、N、C HまたはC Rから選択され；

Wは存在してもよくまたは存在しなくてもよく、Wが存在する場合、Wは、C = O、C = S、C (= N - C N) またはS O₂から選択され；

Qは存在してもよくまたは存在しなくてもよく、Qが存在する場合、Qは、C H、N、P、(C H₂)_p、(C H R)_p、(C R R')_p、O、N R、SまたはS O₂であり；Qが存在しない場合、Mは存在してもよくまたは存在しなくてもよく；QおよびMが存在しない場合、AはLに直接結合しており；

Aは、O、C H₂、(C H R)_p、(C H R - C H R')_p、(C R R')_p、N R、SまたはS O₂であり；

Eは、C H、N、C R、またはA、LもしくはGに向けての二重結合であり；

Gは存在してもよくまたは存在しなくてもよく、Gが存在する場合、Gは、(C H₂)_p、(C H R)_pまたは(C R R')_pであり；Gが存在しない場合、Jは存在し、Eは、Gが結合するように式I中の炭素原子に直接結合しており；

Jは存在してもよくまたは存在しなくてもよく、Jが存在する場合、Jは、(C H₂)_p、(C H R)_pまたは(C R R')_p、S O₂、N H、N RまたはOであり；Jが存在しない場合、Gは存在し、Eは、Jに結合するように式I中に示されるNに直接結合しており；

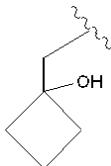
Lは存在してもよくまたは存在しなくてもよく、Lが存在する場合、Lは、C H、C R、O、SまたはN Rであり；Lが存在しない場合、Mは存在してもよくまたは存在しなくてもよく、Mが存在し、Lが存在しない場合、MはEに直接独立して結合し、JはEに直接独立して結合し；

Mは存在してもよくまたは存在しなくてもよく、Mが存在する場合、MはO、N R、S、S O₂、(C H₂)_p、(C H R)_p (C H R - C H R')_pまたは(C R R')_pであり；

pは0～6の数であり；そして

R、R'、R²、R³およびR⁴は、独立して、H；C₁-C₁₀アルキル；C₂-C₁₀アルケニル；C₃-C₈シクロアルキル；C₃-C₈ヘテロシクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アミノ、アミド、エステル、カルボン酸、カルバメート、尿素、ケトン、アルデヒド、シアノ、ニトロ、ハロゲン；(シクロアルキル)アルキルおよび(ヘテロシクロアルキル)アルキル(ここで、該シクロアルキルは3～8個の炭素原子および0～6個の酸素、窒素、硫黄またはリン原子を含み、該アルキルは1～6個の炭素原子を含む)；アリール；ヘテロアリール；アルキル-アリール；アルキル-ヘテロアリール；およびさらにR₂に関して基

【化2】



からなる群より選択され；

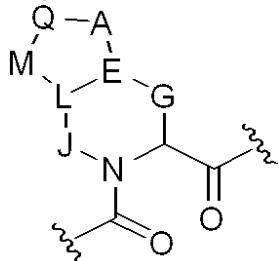
ここで、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、ヘテロアルケニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキル部分は、所望により化学的に適切に置換されてもよく、「置換」なる語は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アラルキル、シクロアルキル、複素環、ハロゲン、ヒドロキシ、チオ、アルコキシ、アリールオキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アミノ(R₂について以外)、アミド、エステル、カルボン酸、カルバメート、尿素、ケトン、アルデヒド、シアノ、ニトロ、スルホニアミド、スルホキシド、スルホン、スルホニル尿素、ヒドラジドおよびヒドロキサメートからなる群より選択される1個以上の部分での、所望による化学的に適切な置換を

いい；

さらにここで、式I中の単位N-C-G-E-L-J-Nは、5員環式環構造または6員環式環構造のいずれかを表し、ただし該単位N-C-G-E-L-J-Nが5員環式環構造を表すか、またはN、C、G、E、L、J、N、A、QおよびMを含む式I中の二環式環構造が5員環式環構造を表す場合、該5員環式環構造は環式環の一部としてカルボニル基を欠き、

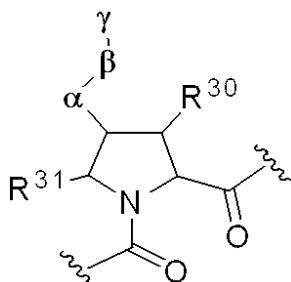
ただし式IにおいてWがC=Oであり、部分：

【化3】



が構造：

【化4】



ここで、R^{3 0}およびR^{3 1}は、独立して、H、アルキル、アルケニル、アリール、アラルキル、アラルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、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、ヘテロアリールまたはヘテロアリールアルキルであり、R^{3 0}およびR^{3 1}は、所望により、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、ケト、ヒドロキシ、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、アラルカノイルアミノ、カルボキシ、カルボキシアルキル、カルボキシアミドアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、ホルミル、アセチル、スルホニルまたはスルホンアミドから選択される1～3個のR^{3 3}置換基で置換され、R^{3 3}置換基は、所望により、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、アミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ、カルボキシ、カルボキシアルキル、カルボキシアミドアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、ホルミル、スルホニルまたはスルホンアミドで置換され得、

は、結合、-C(H)(R^{3 4})-、-O-、-S-または-N(R^{3 5})-であり、R^{3 4}は、H、アルキル、アルケニル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアラルキルであり、そして所望により1～3個のR^{3 3}置換基で置換され、R^{3 5}は、H、アルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルカノイル、-C(O)R^{3 6}、-SO₂R^{3 6}またはカルボキシアミドであり、そして所望により1～3個のR^{3 3}置換基で置換されるか、またはR^{3 5}および はそれらが結合する原子と一緒に、所望により1～3個のR^{3 3}置換基で置換された窒素含有单または二環式環系を形成し、R^{3 6}は、アルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルア

ルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアラルキルであり；

は、結合、-CH₂-、-C(O)-、-C(O)C(O)-、-S(O)-、-S(O)₂-、または-S(O)R³⁻⁴であり；

は、アルキル、アルケニル、アリール、アラルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、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、-OR³⁻⁷または-N(R³⁻⁷)₂であり、ここで任意の炭素原子は所望によりR³⁻³で置換され、R³⁻⁷は、独立して、H、アルキル、アルケニル、アリール、アラルキル、アラルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、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、ヘテロアリールまたはヘテロアラルキルであり、R³⁻⁷の任意の炭素は所望によりR³⁻³で置換される

を表す場合、

R¹⁻⁰はHであり、R⁸およびR⁹は独立して、CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})COOR¹⁻¹、CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONR¹⁻²R¹⁻³、CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})R'、CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONHC(H(R^{3'})COOR¹⁻¹、CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONHCH(R^{3'})CONR¹⁻²R¹⁻³、CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONHCH(R^{3'})CONHCH(R^{4'})COOR¹⁻¹、CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONHC(H(R^{3'})CONHCH(R^{4'})CONR¹⁻²R¹⁻³、CH(R^{1'})CONHC(H(R^{2'})CONHCH(R^{3'})CONHCH(R^{4'})CONHCH(R^{5'})COOR¹⁻¹およびCH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONHCH(R^{3'})CONHCH(R^{4'})CONHCH(R^{5'})CONR¹⁻²R¹⁻³からなる群より選択され；

ただしP2位のプロリンは修飾されており、ここでP2位はケトアミド基から2番目のアミノ酸に対応する位置である]で示される一般構造を有する化合物。

【請求項2】

R¹が-C(O)C(O)NR⁹R¹⁻⁰であり；

R⁹がHであり；

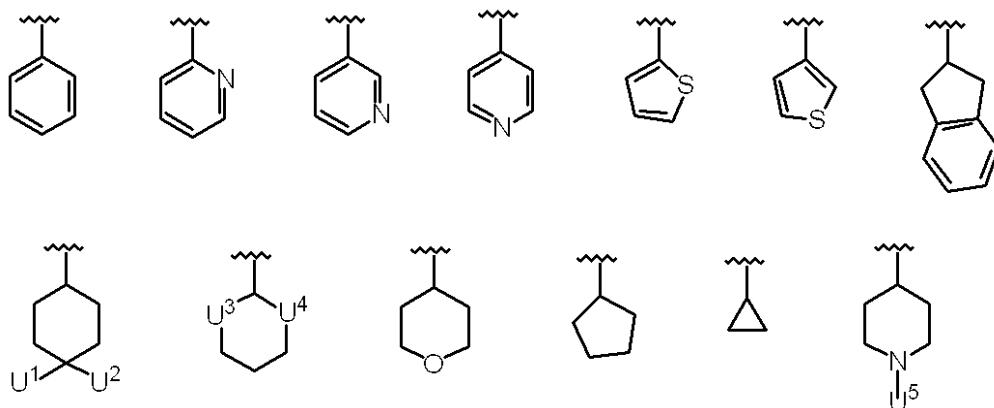
R¹⁻⁰が、H、-R¹⁻⁴、CH(R^{1'})COOR¹⁻¹、CH(R^{1'})CH(R^{1'})COOR¹⁻¹、CH(R^{1'})CONR¹⁻²R¹⁻³、CH(R^{1'})CH(R^{1'})CONR¹⁻²R¹⁻³、CH(R^{1'})CH(R^{1'})SO₂R¹⁻¹、CH(R^{1'})CH(R^{1'})SO₂NR¹⁻²R¹⁻³、CH(R^{1'})CH(R^{1'})COR¹⁻¹、CH(R^{1'})CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})COOR¹⁻¹、CH(R^{1'})CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONR¹⁻²R¹⁻³またはCH(R^{1'})CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})(R')であり、R¹⁻⁴が、H、アルキル、アリール、ヘテロアルキル、ヘテロアリール、シクロアルキル、アルキル-アリール、アルキル-ヘテロアリール、アリール-アルキル、アルケニル、アルキニルまたはヘテロアラルキルであり、R^{1'}がHまたはアルキルであり、R^{2'}が、フェニル、置換フェニル、ヘテロ原子置換フェニル、チオフェニル、シクロアルキル、ピペリジルまたはピリジルであり、

R¹⁻¹が、H、メチル、エチル、アリル、tert-ブチル、ベンジル、-メチルベンジル、-ジメチルベンジル、1-メチルシクロプロピルまたは1-メチルシクロペンチルであり；

R¹がヒドロキシメチルまたはCH₂CONR¹⁻²R¹⁻³であり；

R²が、独立して、以下からなる群より選択され：

【化5】



【式中、

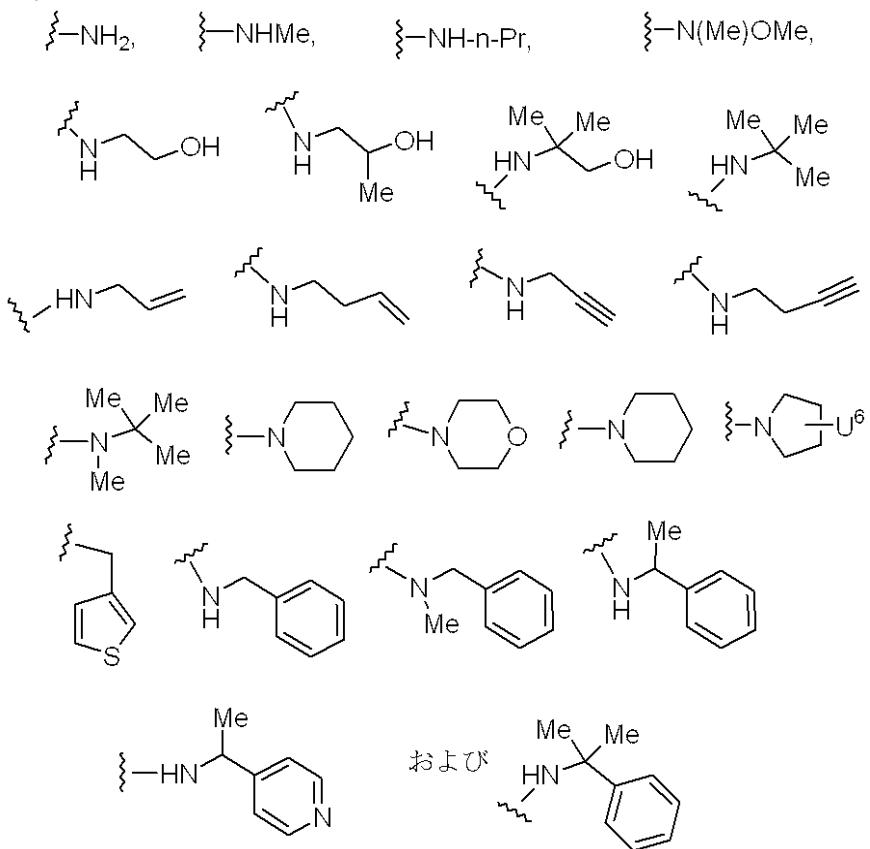
U¹ および U² は、同じでもよくまたは異なってもよく、H、F、CH₃、COOH、C₂H₅COOMe、CH₂CONH₂、CH₂CONHMe、CH₂CONMe₂、アジド、アミノ、ヒドロキシル、置換アミノ、置換ヒドロキシルから選択され；

U³ および U⁴ は、同じでもよくまたは異なってもよく、OおよびSから選択され；

U⁵ は、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアルキルスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアルキルカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アルコキカルボニル、アリールオキカルボニル、ヘテロアリールオキカルボニル、アルキルアミノカルボニル、アリールアミノカルボニル、ヘテロアリールアミノカルボニルまたはそれらの組合せからなる部分より選択される]；

NR¹₂R¹₃ が、以下からなる群より選択され：

【化6】



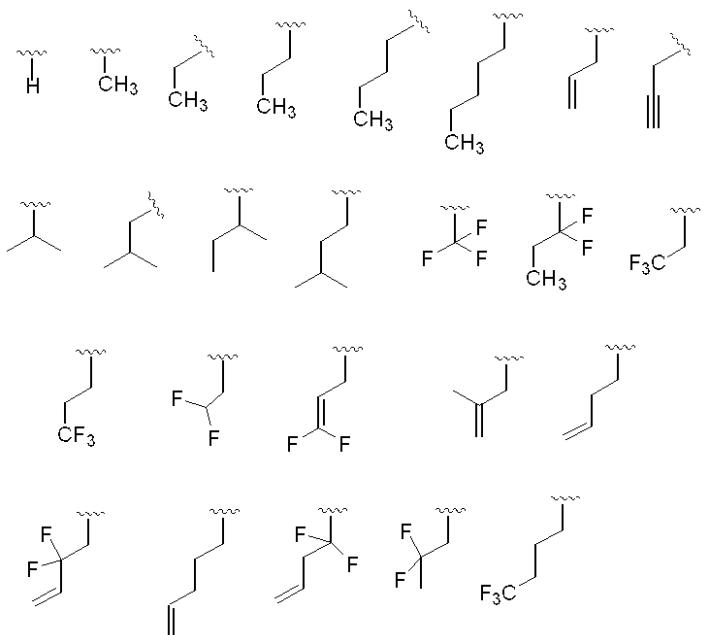
【式中、U⁶ は、H、OHまたはCH₂OHである]、そして

R^{1~4} が、H、Me、Et、n-プロピル、メトキシ、シクロプロピル、n-ブチル、1-ブタ-3-イニル、ベンジル、-メチルベンジル、フェネチル、アリル、1-ブタ-3-エニル、OMe およびシクロプロピルメチルからなる群より選択される、請求項1記載の化合物。

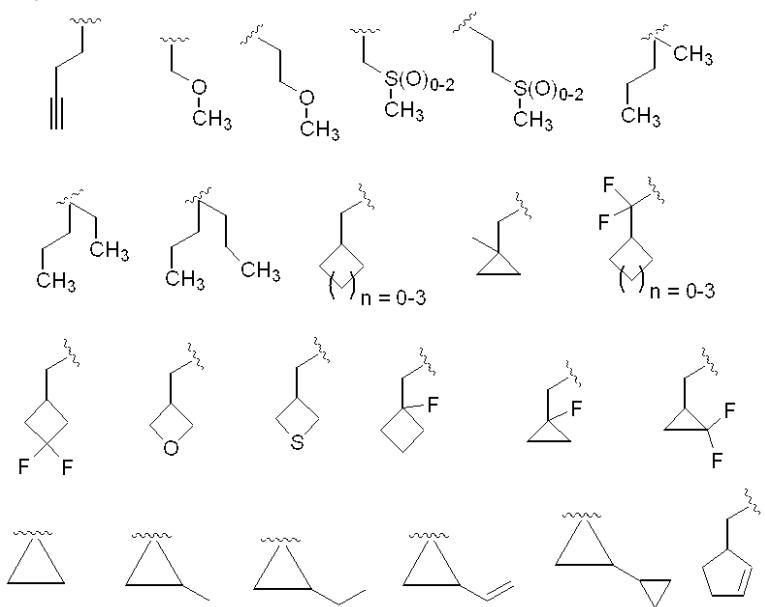
【請求項3】

R² が以下の部分からなる群より選択される、請求項2記載の化合物：

【化7】

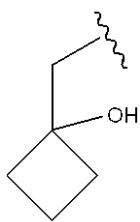


【化8】



および

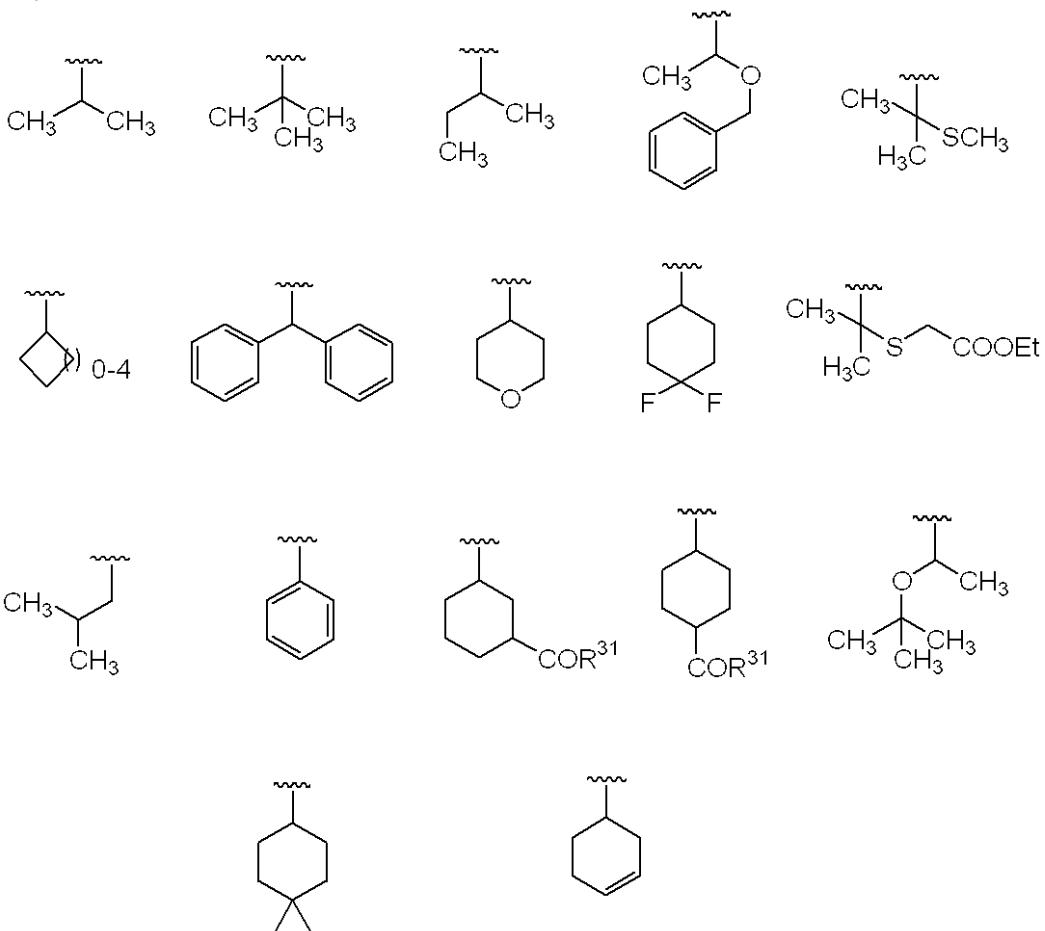
【化9】



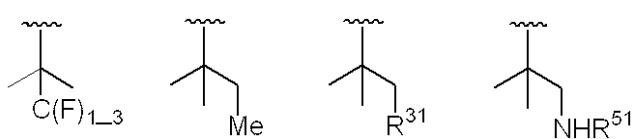
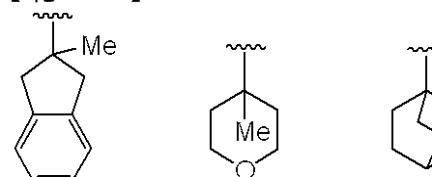
【請求項4】

R^3 が以下からなる群より選択される、請求項2記載の化合物：

【化10】

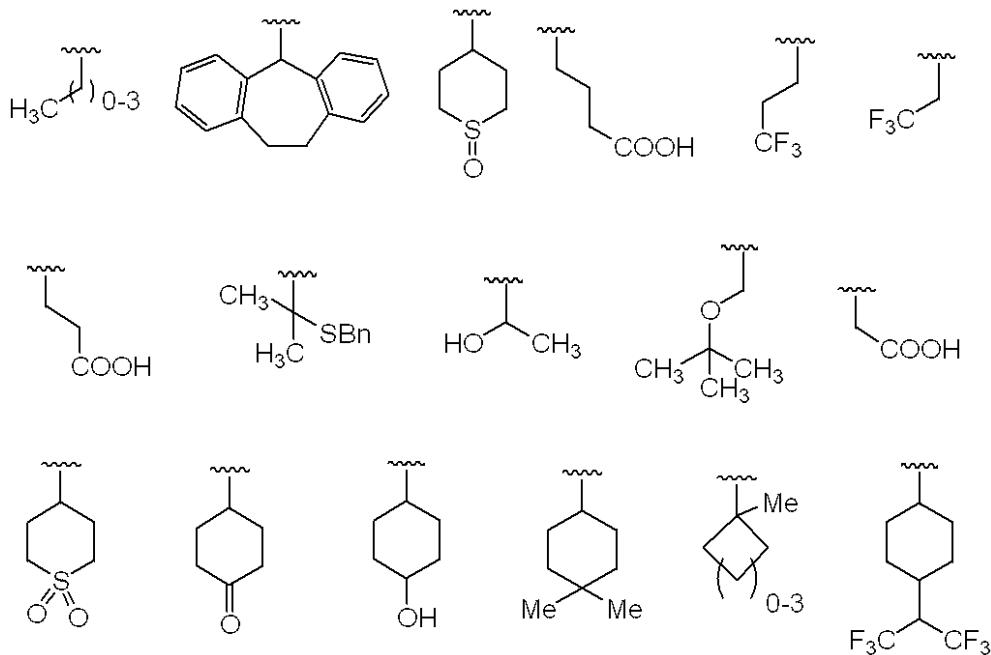


【化11】

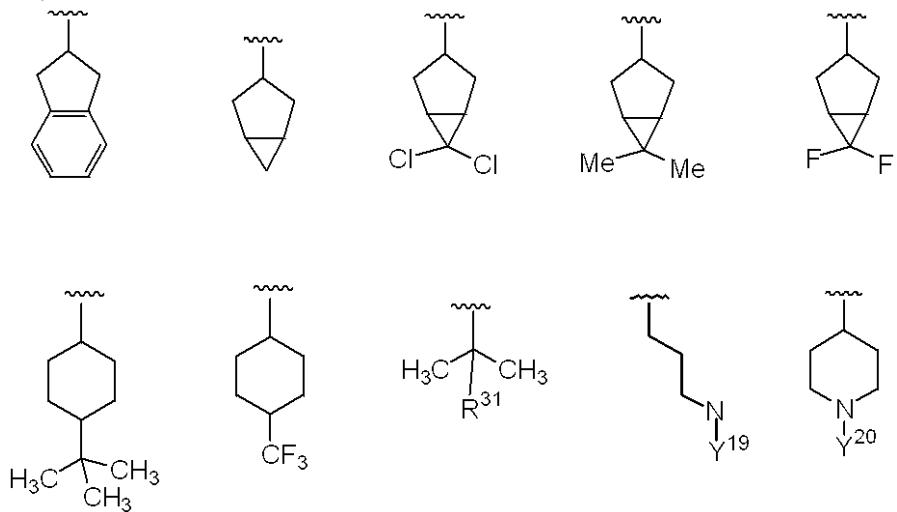


[式中、 $R^{5-1} = H$ 、 COCH_3 、 COOTBu または CONHTBu である]；

【化12】

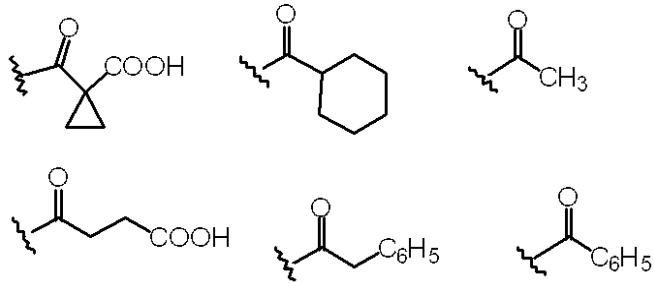


【化13】



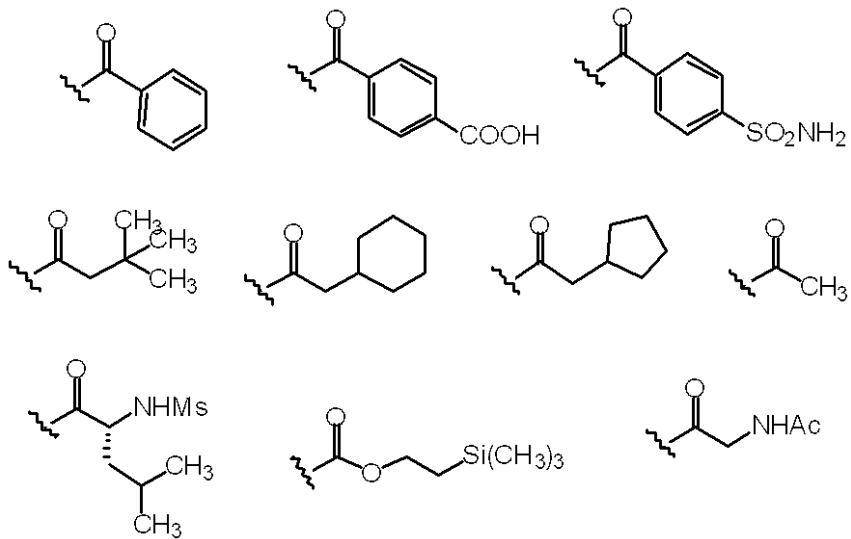
[式中、R^{3 1} = OHまたはO - アルキルであり；
Y^{1 9}は以下の部分から選択され：

【化14】



Y^{2 0}は以下の部分から選択される：

【化15】

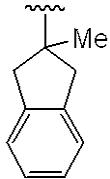


]。

【請求項5】

 R^3 が以下である、請求項4記載の化合物：

【化16】



【請求項6】

 Z が N であり、 R^4 が H である、請求項4記載の化合物。

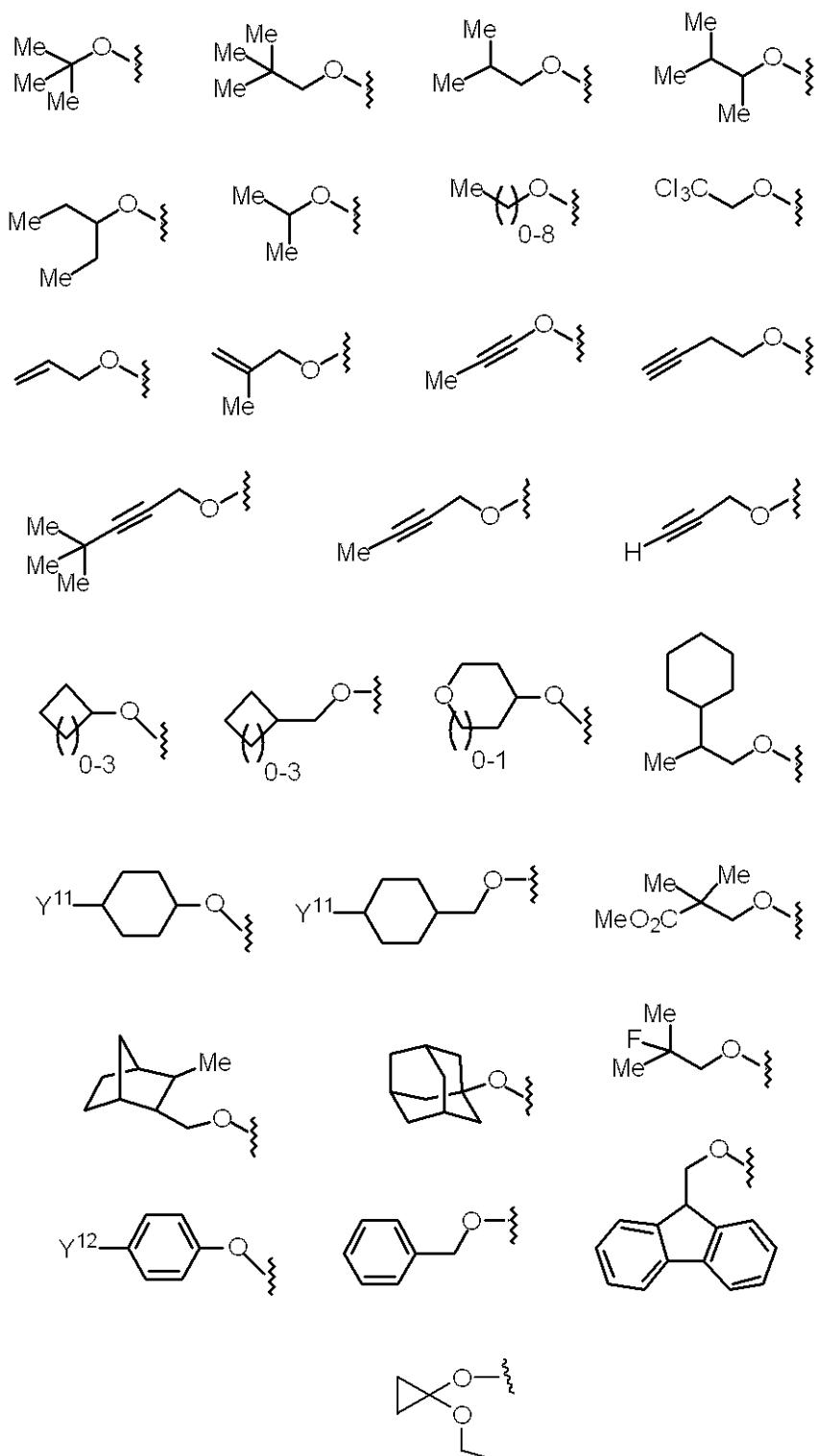
【請求項7】

 W が C = O である、請求項6記載の化合物。

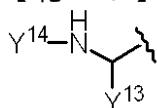
【請求項8】

 Y が以下の部分から選択される、請求項7記載の化合物：

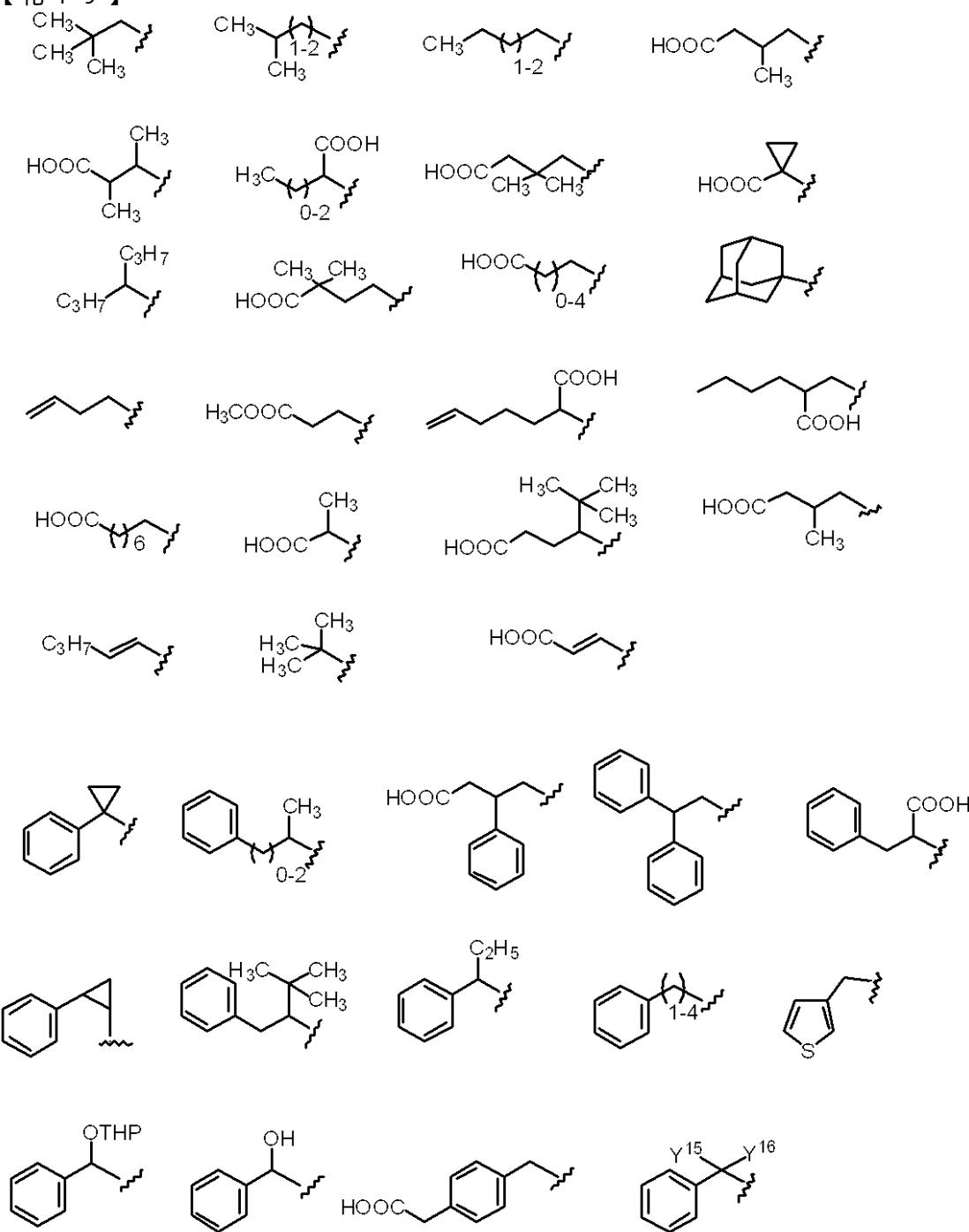
【化17】



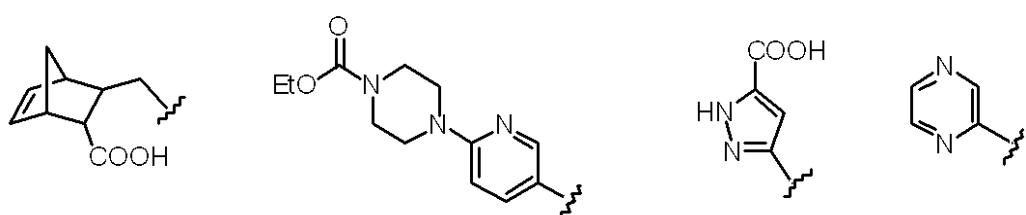
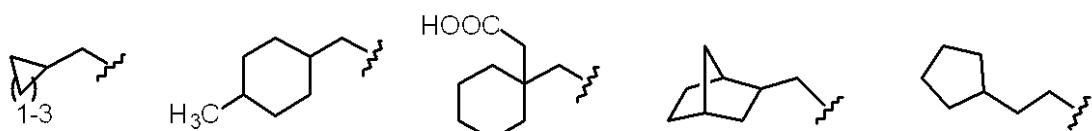
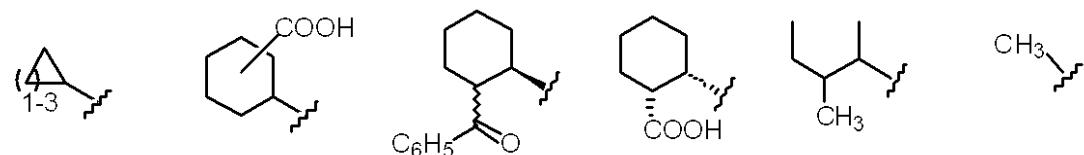
【化18】



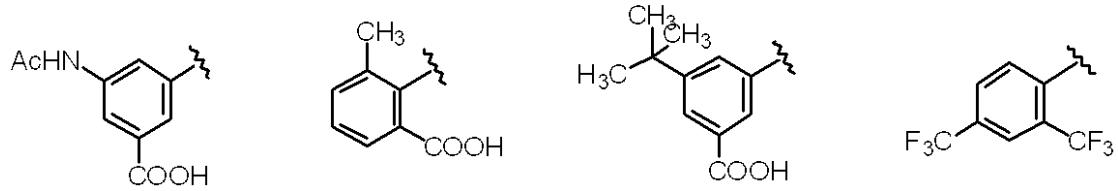
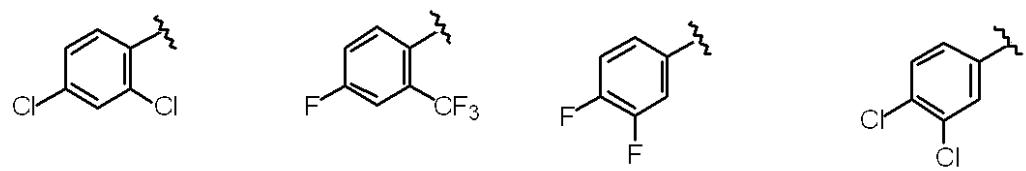
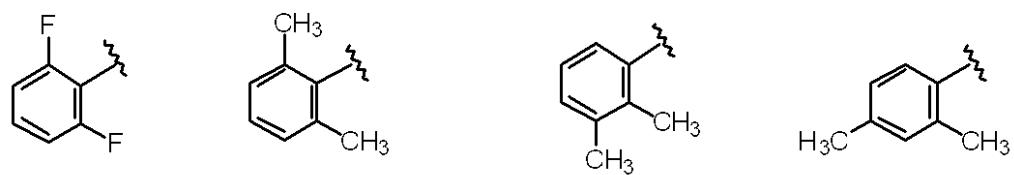
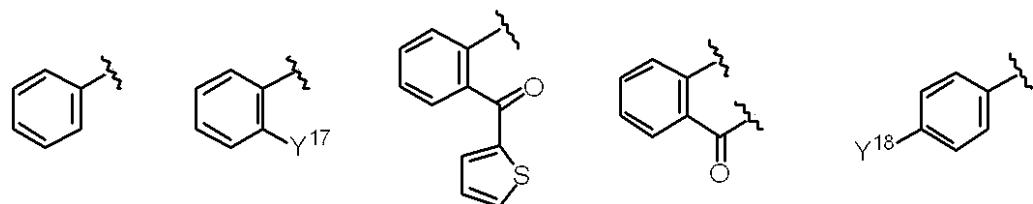
【化19】



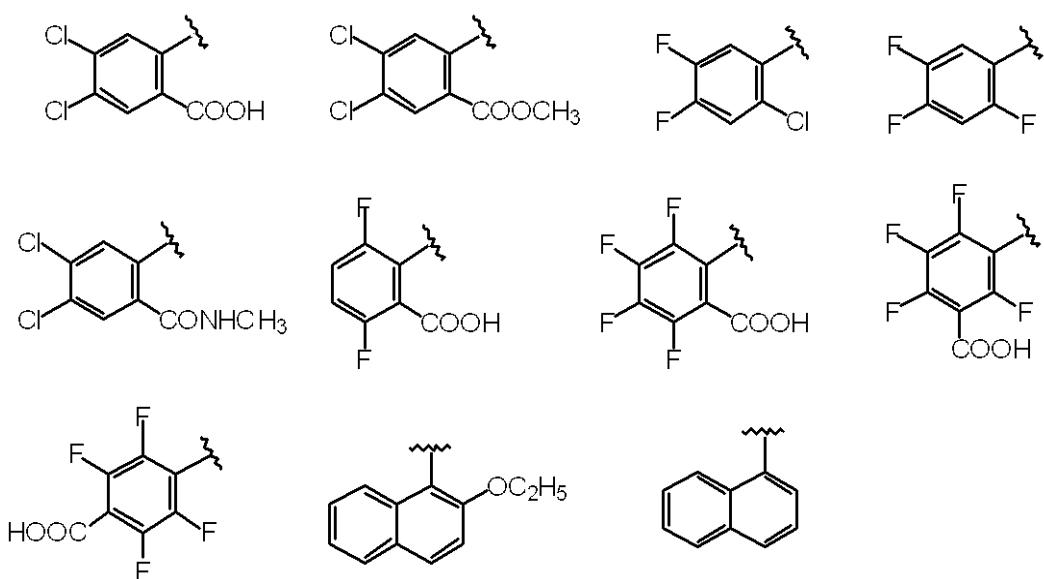
【化 2 0】



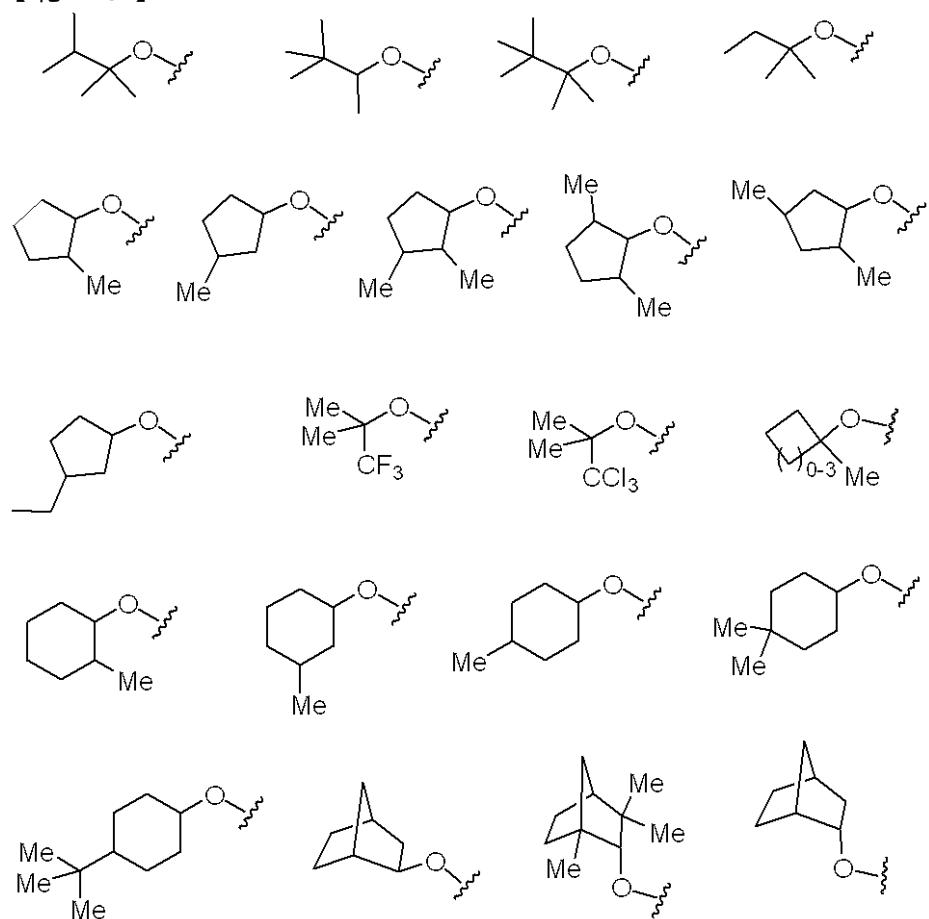
【化 2 1】



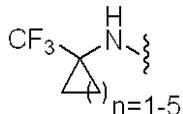
【化22】

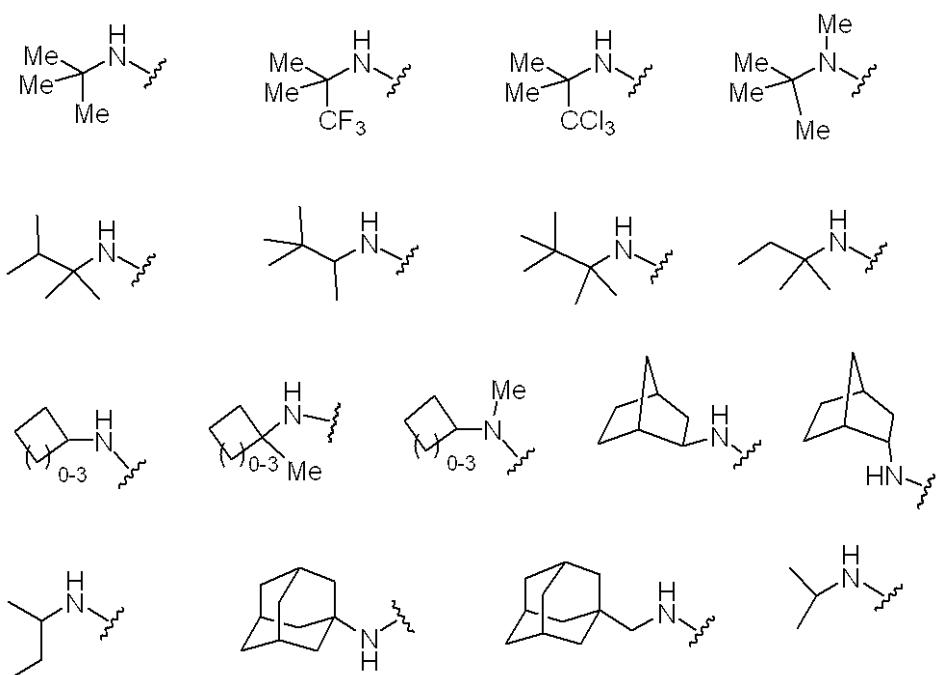


【化23】



【化24】





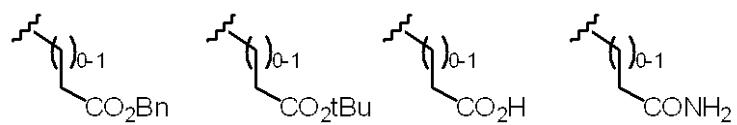
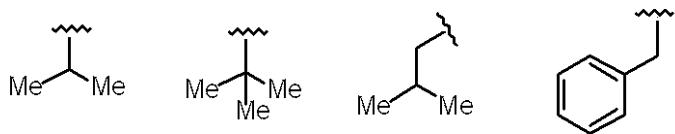
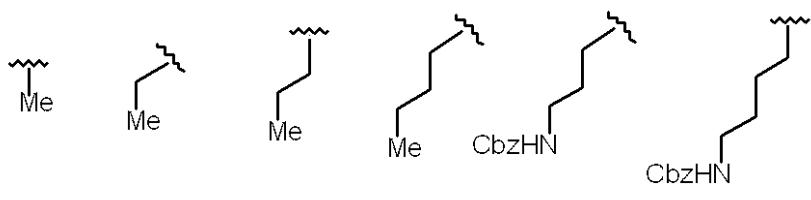
「式中、

γ^{1-1} は、H、-C(O)OH、-C(O)OEt、-OMe、-Ph、-OPh、-NHMe、-NHAc、-NHPH、-CH(Me)₂、1-トリアゾリル、1-イミダゾリルおよびNHCH₂COOHからなる群より選択され；

Y^{1-2} は、 H 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OMe}$ 、 $-\text{OMe}$ 、 F 、 Cl および Br からなる群より選択され；

Y¹ 3 は、以下の部分からなる群より選択され：

【化 2 5】



Y^{1-4} は、 $\text{MeS(O}_2\text{)}$ - 、 - Ac 、 - Boc 、 - iBoc 、 - Cbz または - $\text{Al}\text{l}\text{o}\text{c}$ であり；

Y¹⁻⁵ および Y¹⁻⁶ は、同じでもよくまたは異なってもよく、独立して、アルキル、アリール、ヘテロアルキル、およびヘテロアリールから選択され；

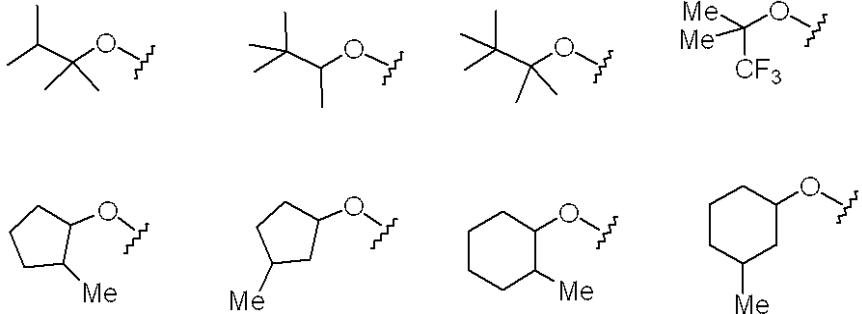
Y^{17} は、 $-\text{C}\text{F}_3$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$ 、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{OC}_6\text{H}_5$ 、 $-\text{C}_6\text{H}_5$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{C}_6\text{H}_5$ 、 $-\text{NH}_2$ 、または $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ であり；そして

$\gamma^1 \sim \gamma^8$ は、 $\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 F 、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{C}(\text{H}_2)\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{S}(\text{O}_2)\text{NH}_2$ 、または $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ である】。

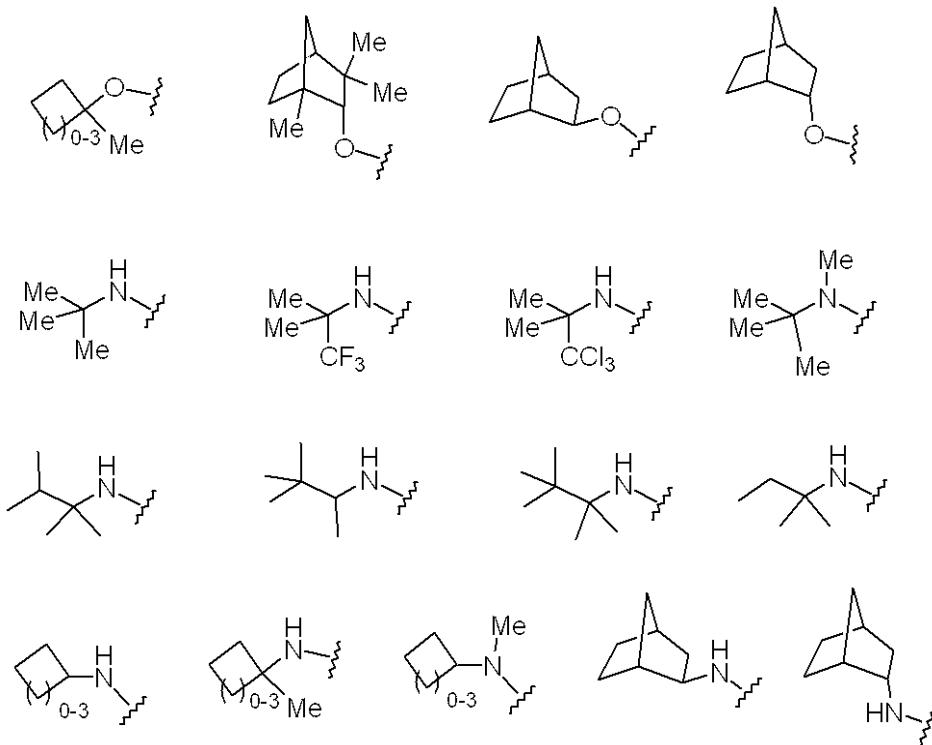
【請求項 9】

γ が以下からなる群より選択される、請求項 8記載の化合物：

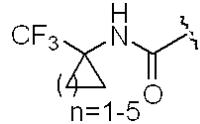
【化 2 6】



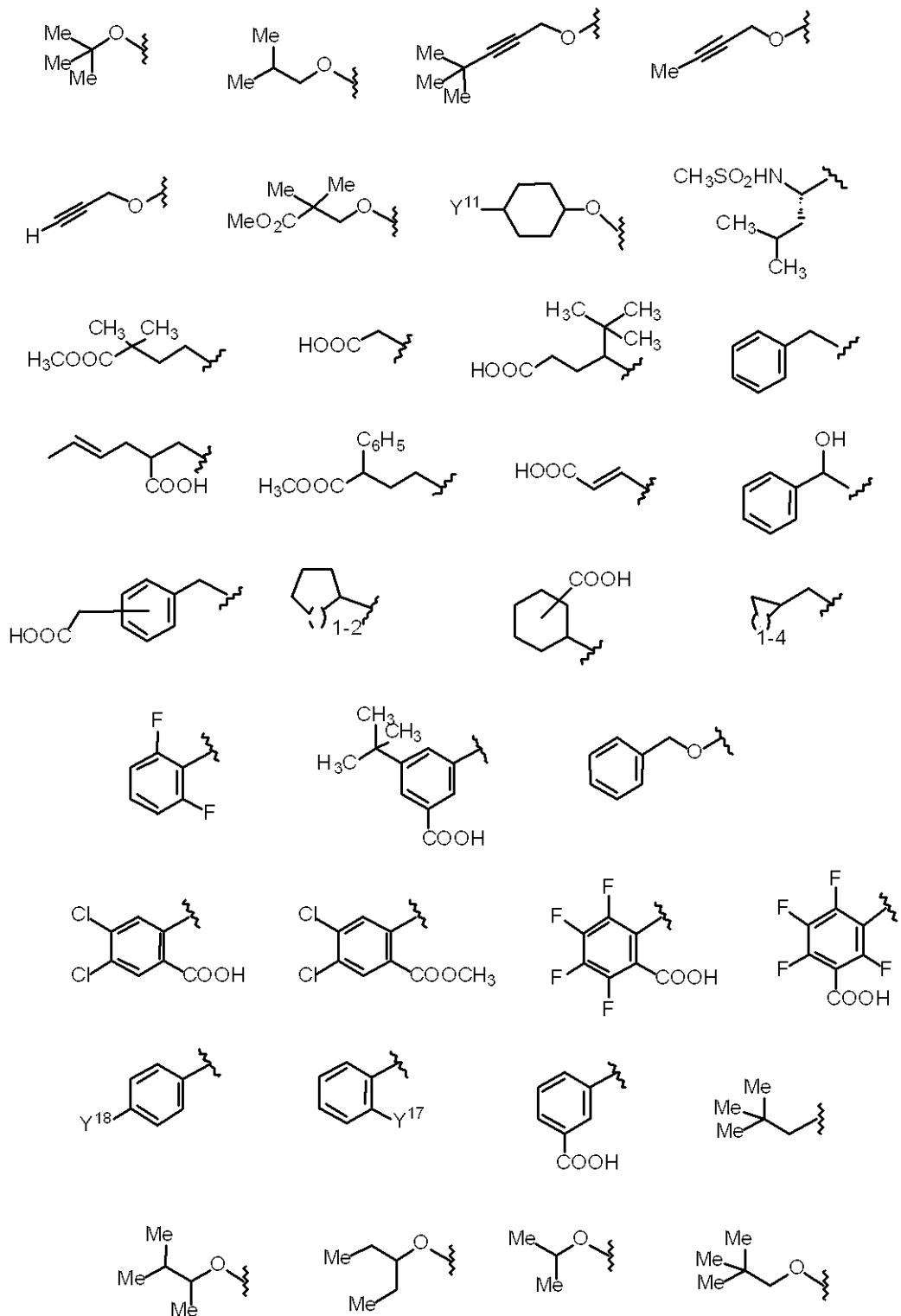
【化 2 7】



【化 2 8】



【化29】

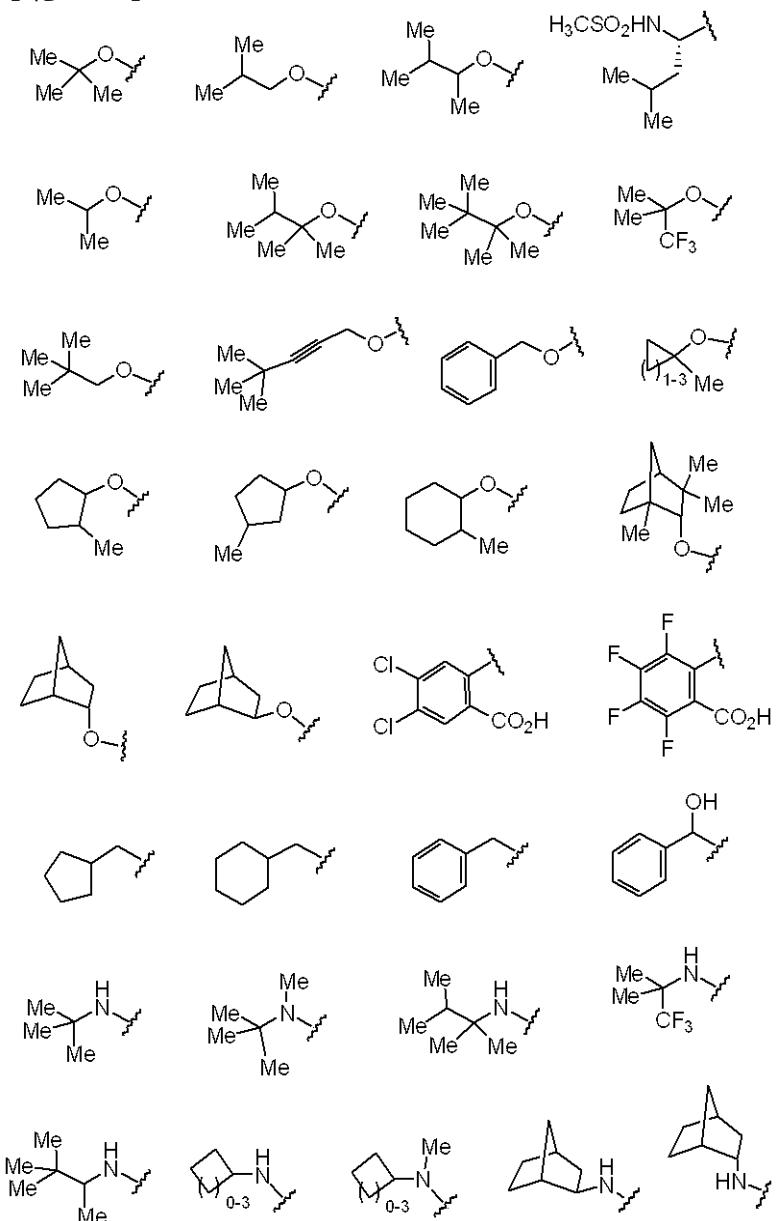


[式中、
 $Y^{1-7} = CF_3, NO_2, CONH_2, OH, NH_2$ または $COOH$ であり；
 $Y^{1-8} = F, COOH$ である]。

【請求項 10】

Y が以下からなる群より選択される、請求項 9 記載の化合物：

【化 30】



【請求項 11】

L および M が存在せず、J が E に直接結合している、請求項 10 記載の化合物。

【請求項 12】

L、J および M が存在せず、E が N に直接結合している、請求項 10 記載の化合物。

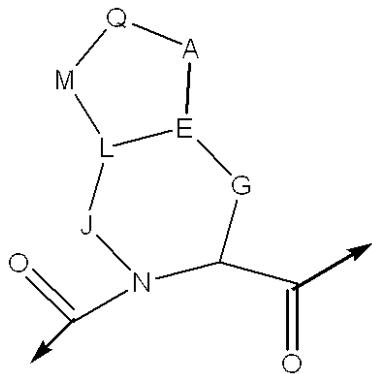
【請求項 13】

G および M が存在しない、請求項 10 記載の化合物。

【請求項 14】

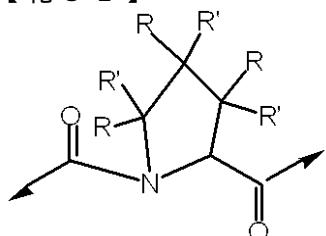
部分：

【化31】



が、

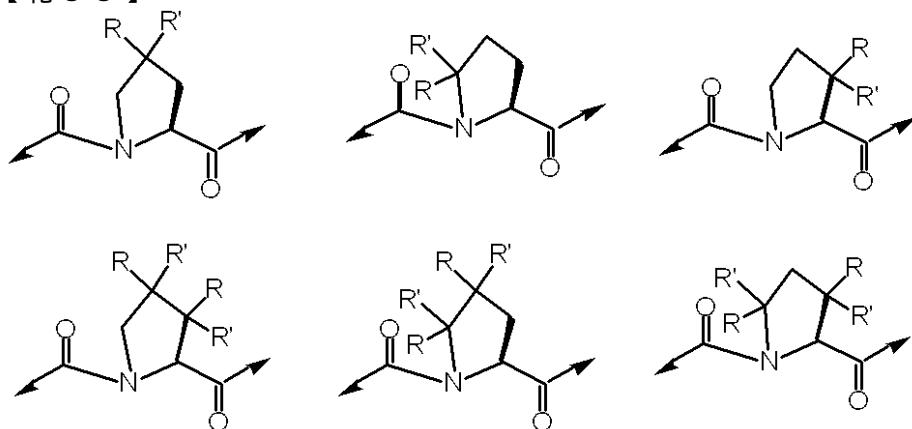
【化32】

aである、請求項10記載の化合物。

【請求項15】

構造aが以下の構造から選択される、請求項14記載の化合物：

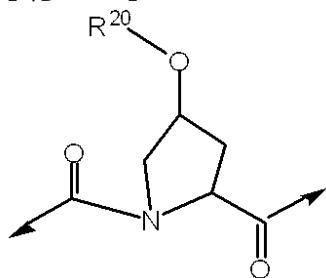
【化33】



【請求項16】

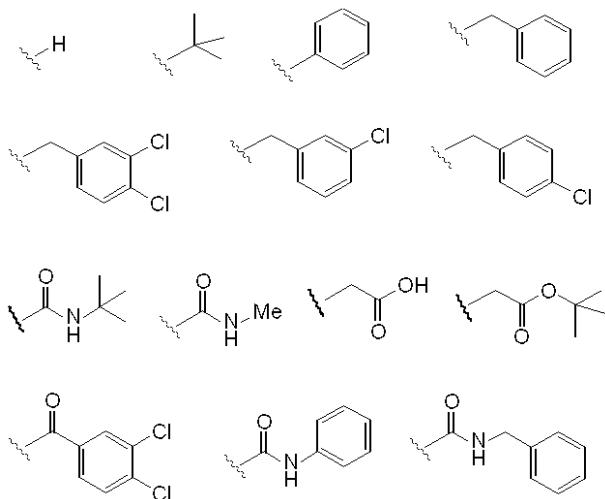
構造aが以下である、請求項14記載の化合物：

【化34】



[式中、 $R^{2\ 0}$ は以下の構造から選択される：

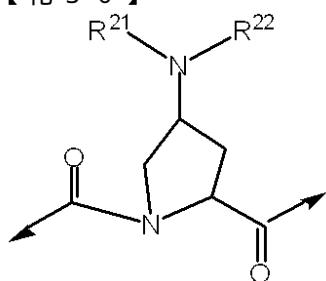
【化 3 5】



【請求項 1 7】

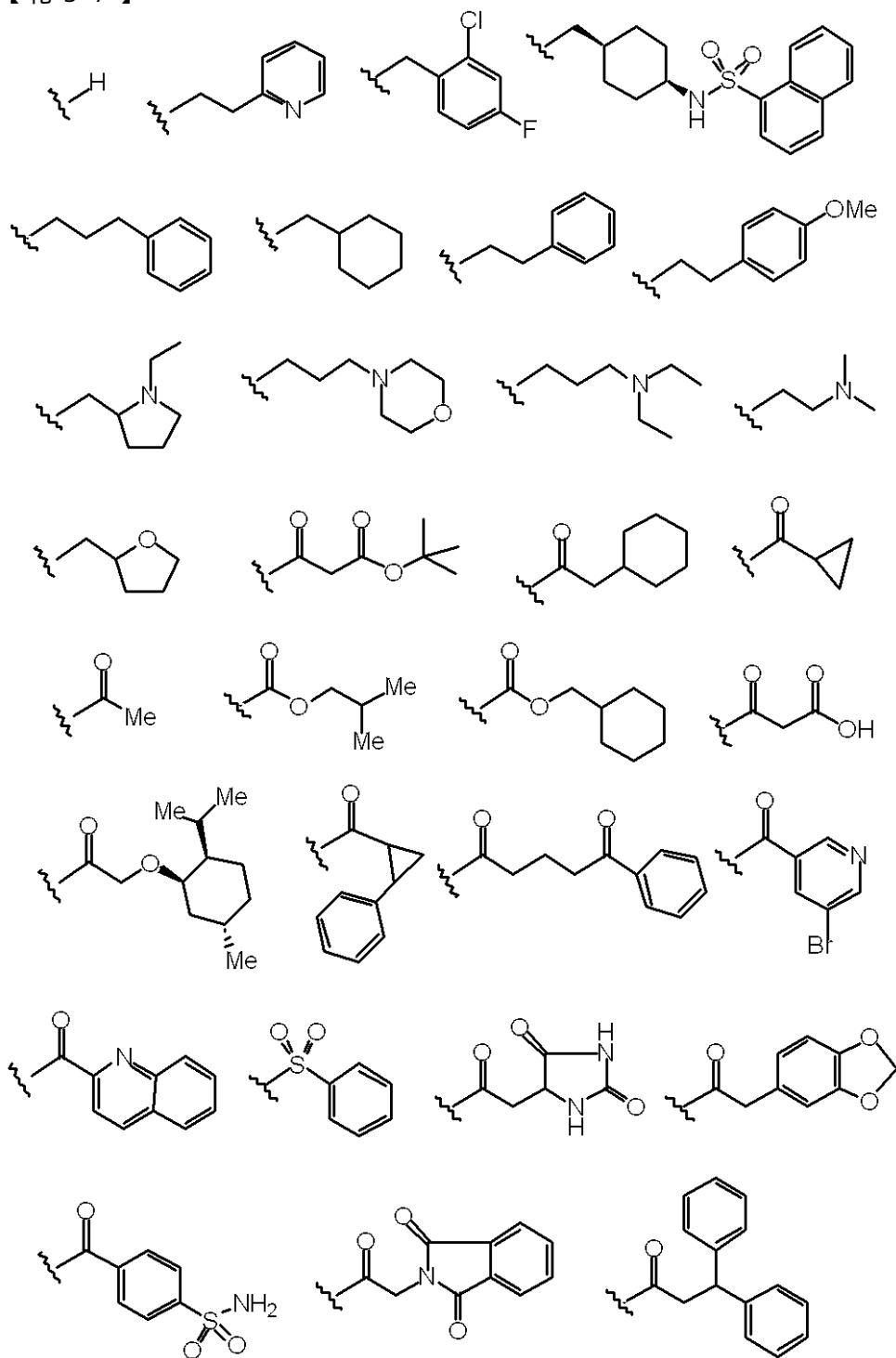
構造 a が以下である、請求項 1 4 記載の化合物：

【化 3 6】



[式中、 $R^{2\ 1}$ および $R^{2\ 2}$ は、同じでもよくまたは異なってもよく、独立して、以下の構造からなる群より選択される：

【化37】

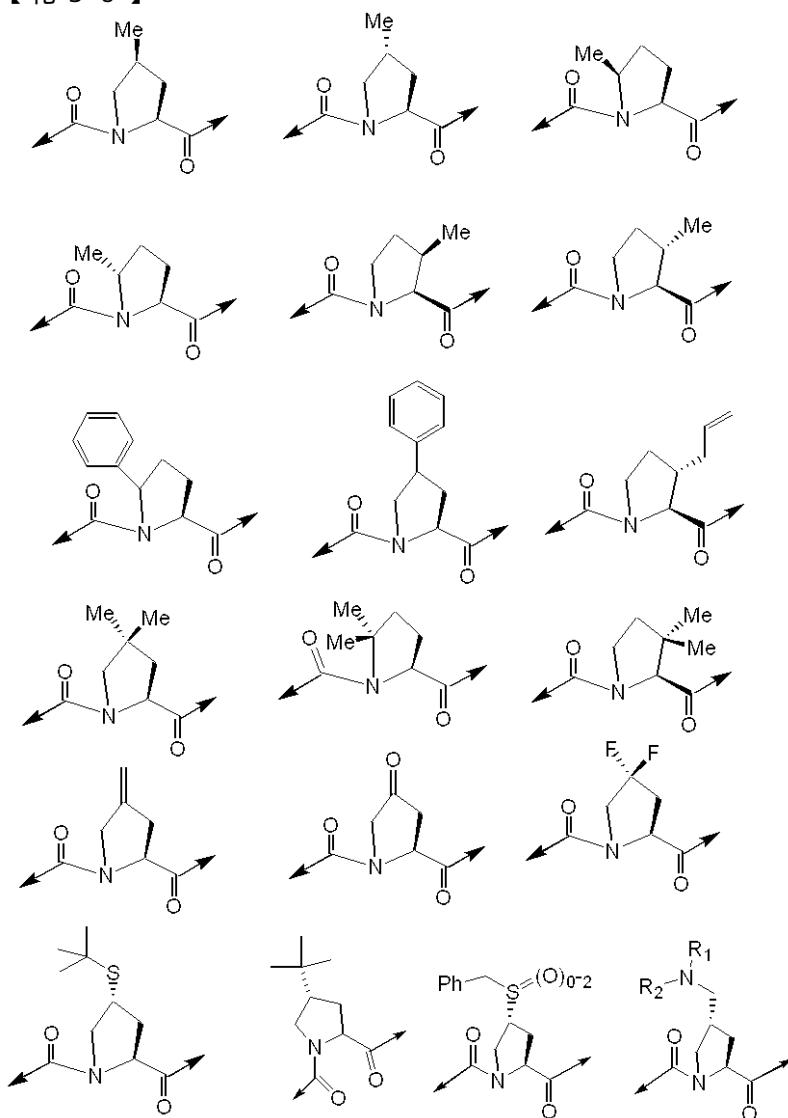


]。

【請求項18】

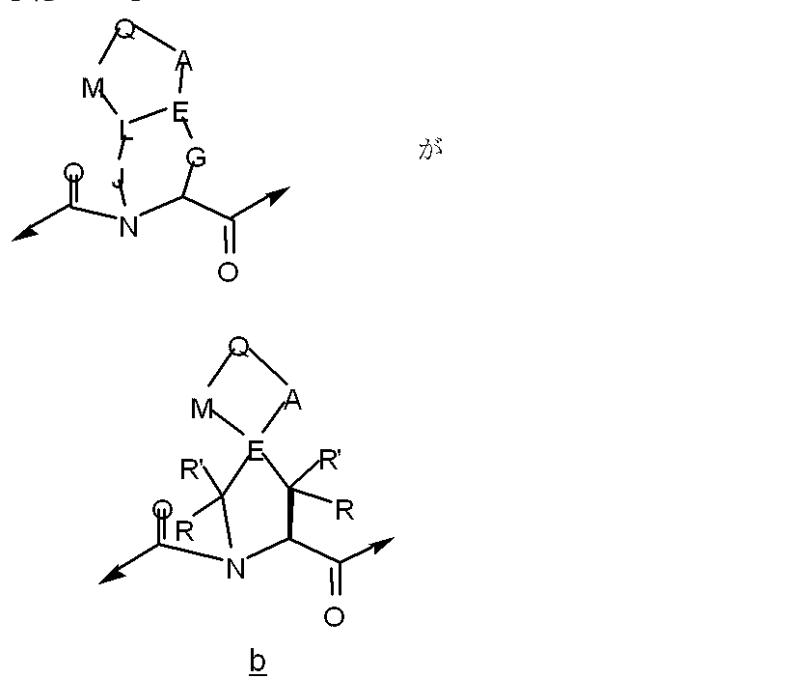
構造 a が以下の構造からなる群より選択される、請求項14記載の化合物：

【化38】



【請求項19】

【化39】



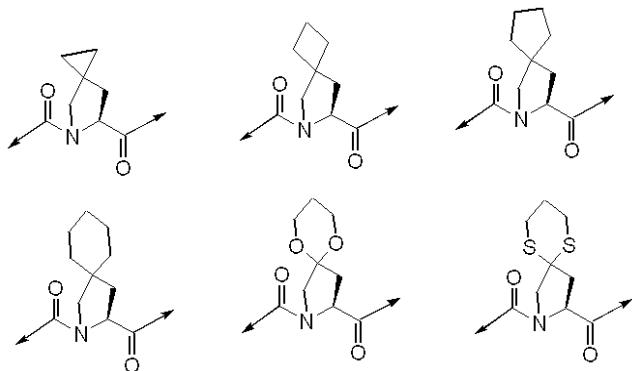
[式中、Qは存在してもよくまたは存在しなくてもよく、Qが存在しない場合、MはAに直接結合している]

である、請求項10記載の化合物。

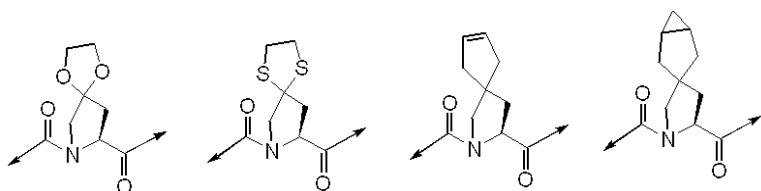
【請求項20】

構造bが、以下の構造から選択される、請求項19記載の化合物：

【化40】

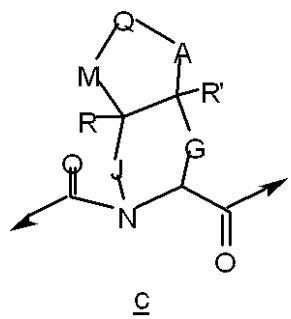
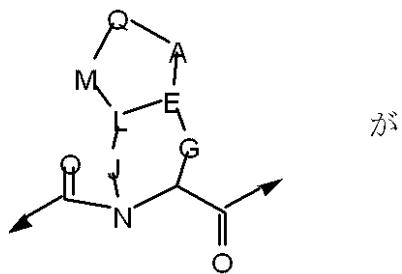


【化41】



【請求項21】

【化42】



C'

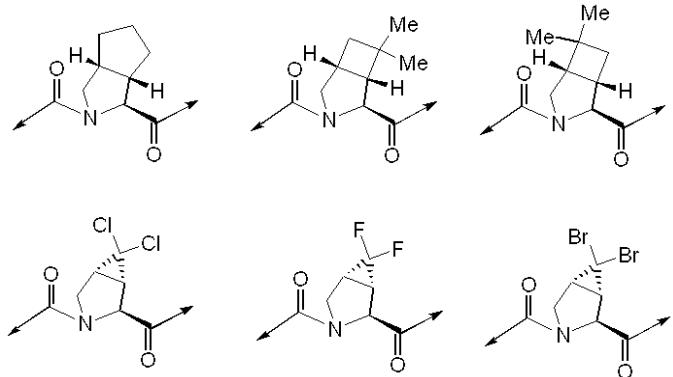
[式中、GおよびJは同じでもよくまたは異なってもよく、独立して、(CH₂)_p、(CHR)_p、(CHR-CHR')_pおよび(CRR')_pからなる群より選択され；AおよびMは同じでもよくまたは異なってもよく、独立して、O、S、S(O₂)、N(R)、(CH₂)_p、(CHR)_p、(CHR-CHR')_pおよび(CRR')_pからなる群より選択され；そして

Q は、 C H₂ 、 C H (R) 、 C (R R') 、 N (H) 、 N (R) 、 O 、 S 、 S (O₂) 、 N (R) 、 (C H₂)_p 、 (C H R)_p または (C R R')_p である]
である、 請求項 10 記載の化合物。

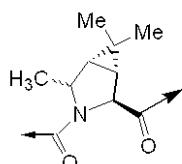
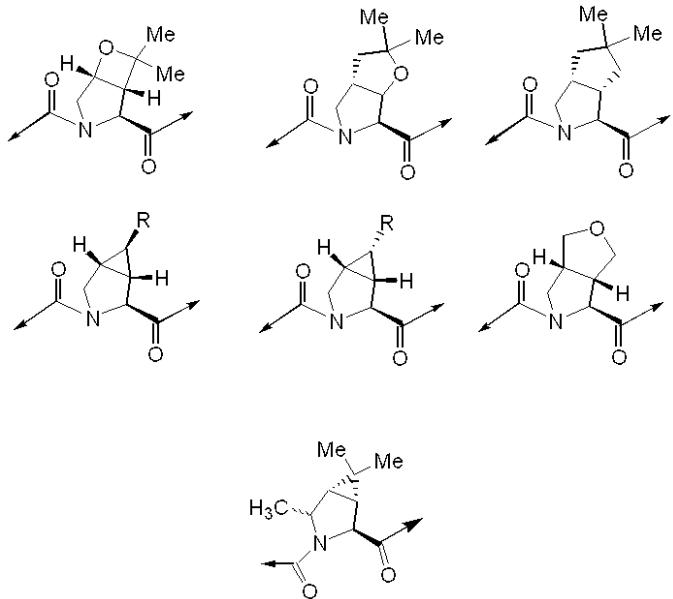
【請求項 22】

構造 c が以下の構造から選択される、請求項 21 記載の化合物：

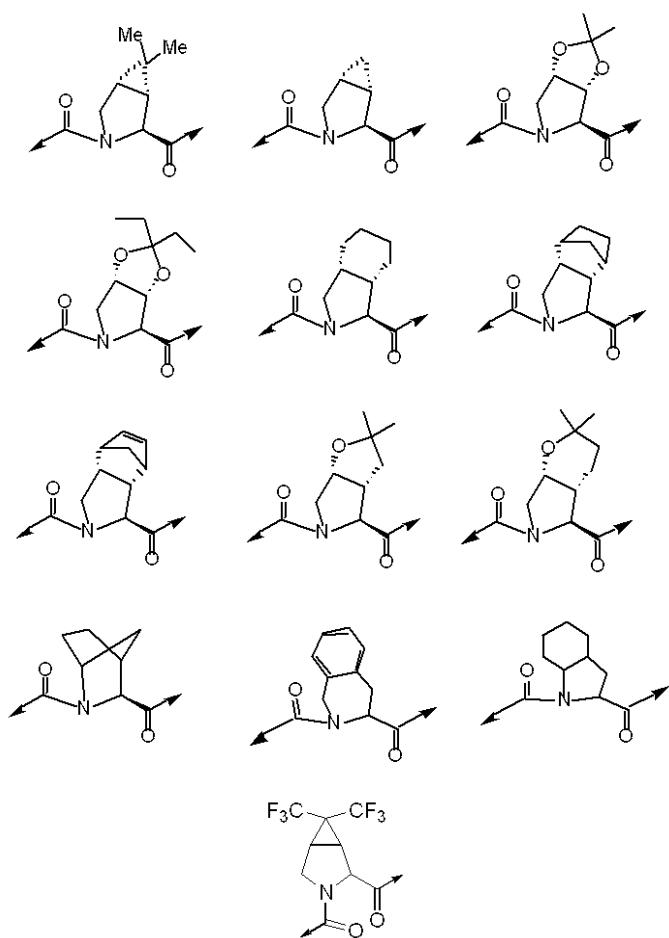
【化 4 3】



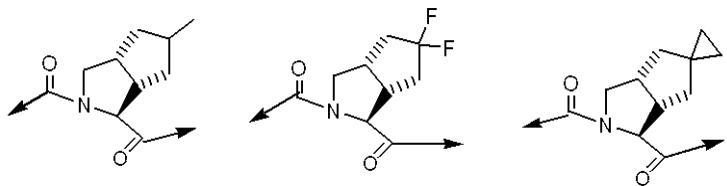
【化 4 4】



【化45】

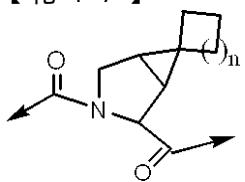


【化46】



および

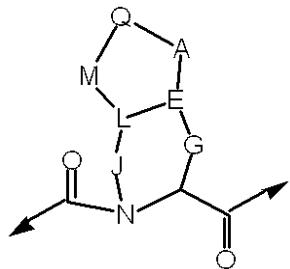
【化47】



[式中、n = 0 - 4である]。

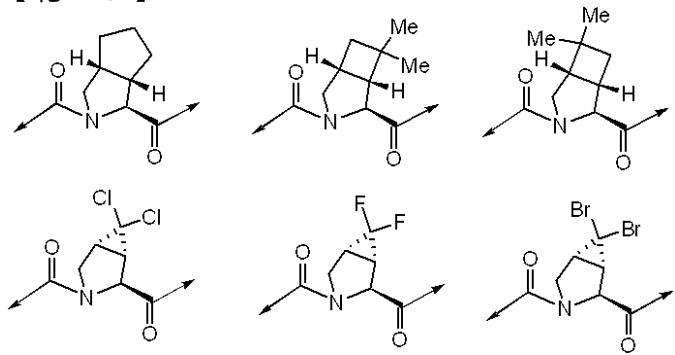
【請求項23】

【化48】

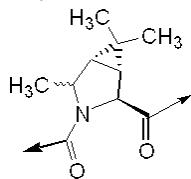


が以下の構造から選択される、請求項10記載の化合物：

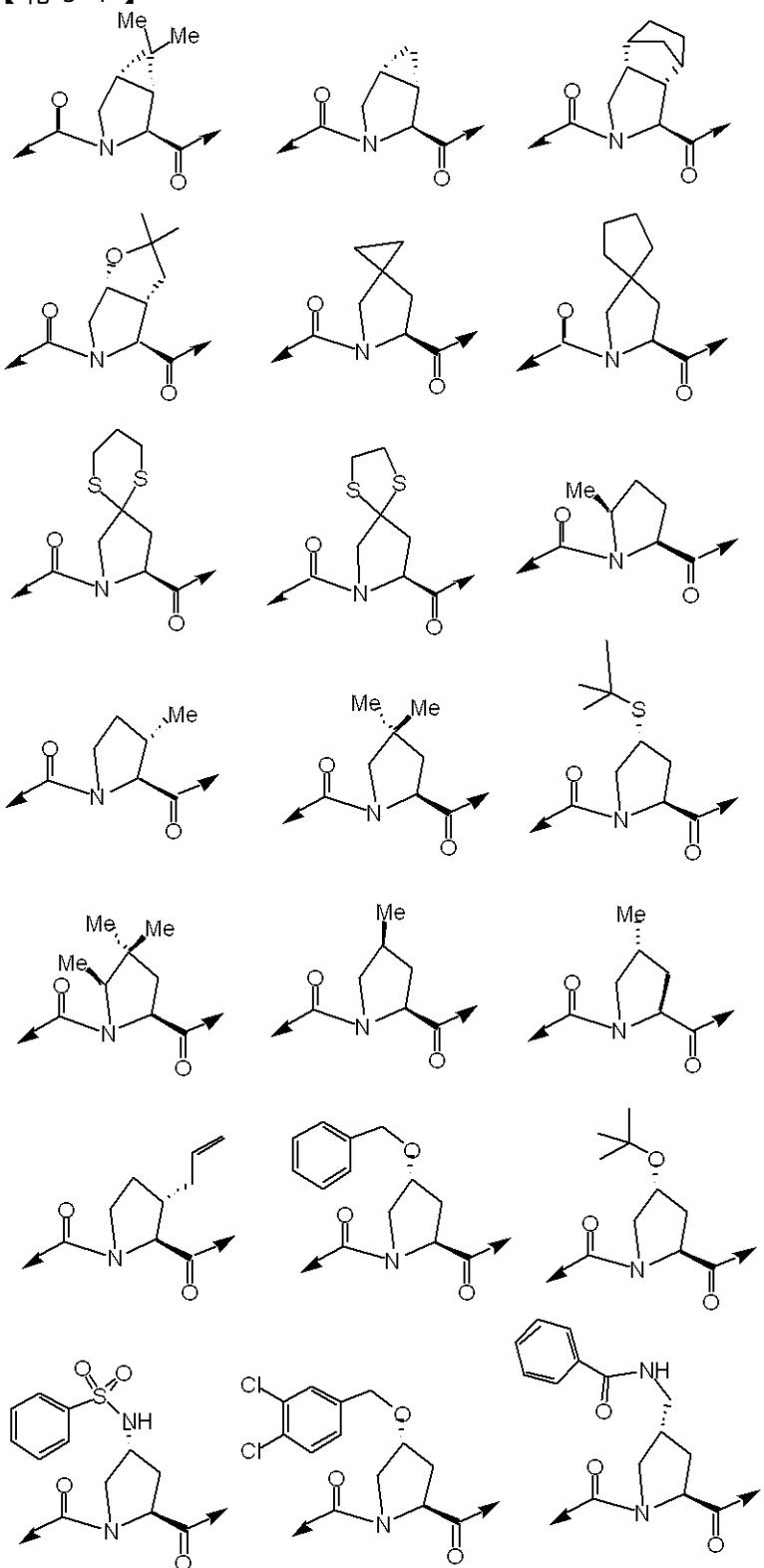
【化49】



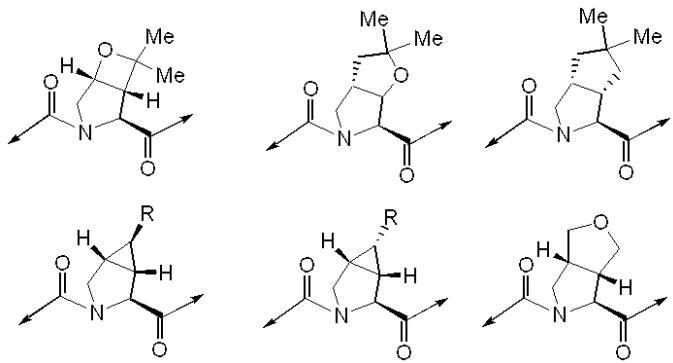
【化50】



【化 5 1】

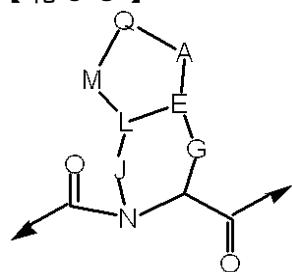


【化 5 2】



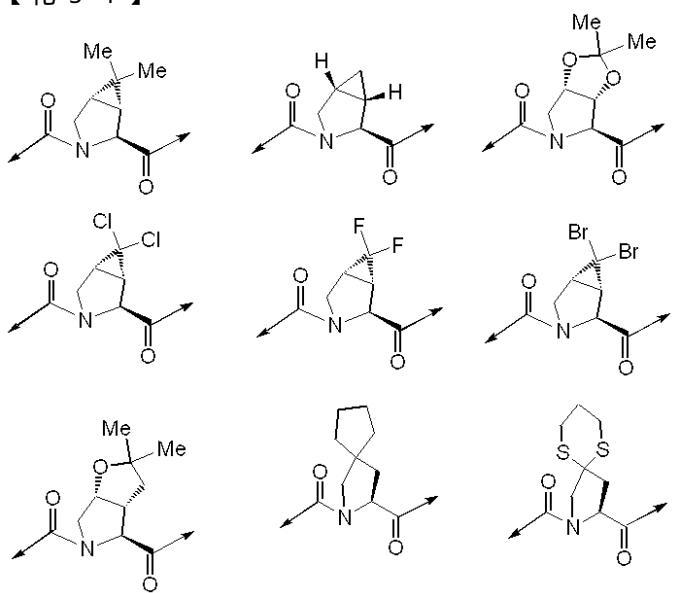
【請求項 2 4】

【化 5 3】

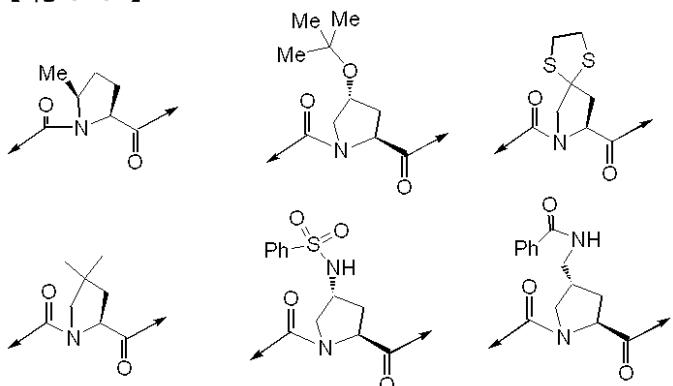


が、以下の構造から選択される、請求項 2 3記載の化合物：

【化 5 4】

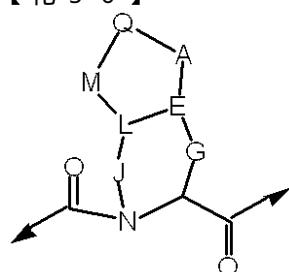


【化55】



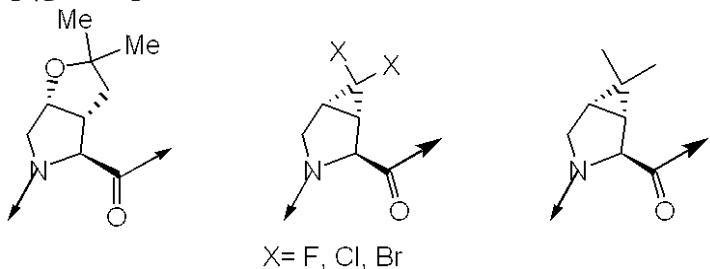
【請求項25】

【化56】



が、以下の構造から選択される、請求項23記載の化合物：

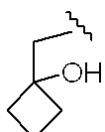
【化57】



【請求項26】

R^2 が以下の部分である、請求項1記載の化合物：

【化58】



【請求項27】

有効成分として少なくとも1つの請求項1記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項28】

HCV関連障害の処置における使用のための、請求項27記載の医薬組成物。

【請求項29】

さらに医薬上許容される担体を含む、請求項27記載の医薬組成物。

【請求項30】

さらに少なくとも1つの抗ウイルス剤を含有する、請求項29記載の医薬組成物。

【請求項31】

さらにインターフェロンを含有する、請求項30記載の医薬組成物。

【請求項 3 2】

抗ウイルス剤がリバビリンであり、インターフェロンが - インターフェロンまたはPEG化インターフェロンである、請求項 3 1記載の医薬組成物。

【請求項 3 3】

HCV関連障害の処置用医薬組成物の製造における請求項1記載の化合物の使用であって、該医薬組成物は少なくとも1つの請求項1記載の化合物の治療有効量を含み、処置を必要とする患者に投与される、使用。

【請求項 3 4】

投与が経口または皮下である、請求項 3 3記載の使用。

【請求項 3 5】

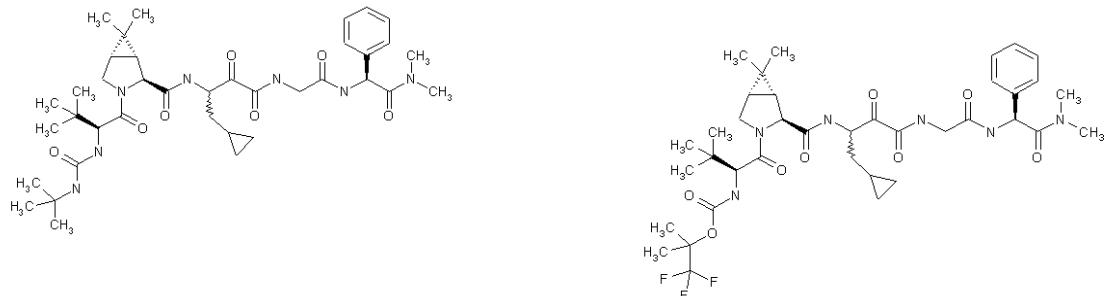
HCV関連障害を処置するための医薬の製造における請求項1記載の化合物の使用。

【請求項 3 6】

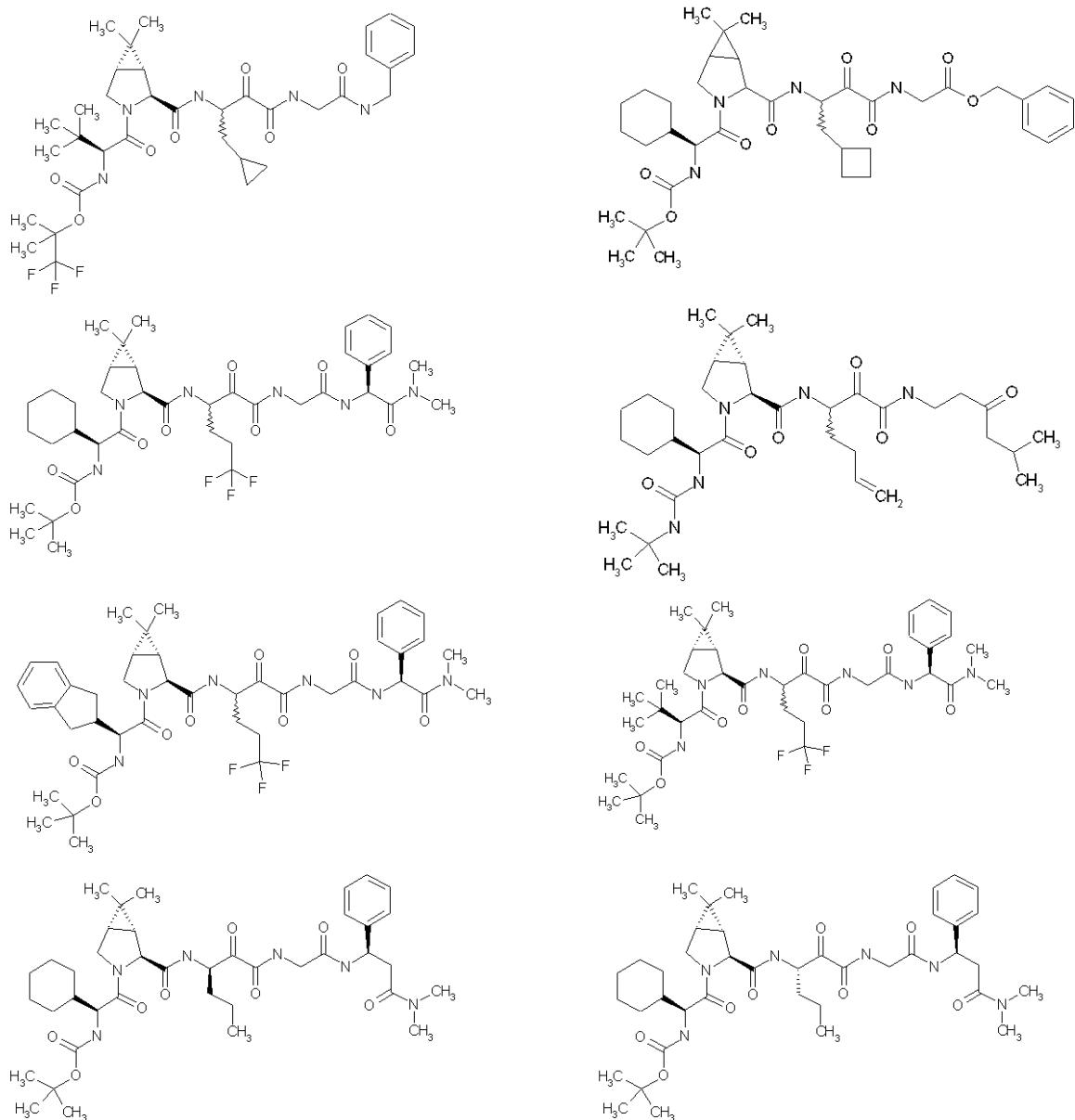
HCV関連障害を処置するための医薬組成物の製造方法であって、少なくとも1つの請求項1記載の化合物および医薬上許容される担体を緊密に接触させる工程を包含する方法。

【請求項 3 7】

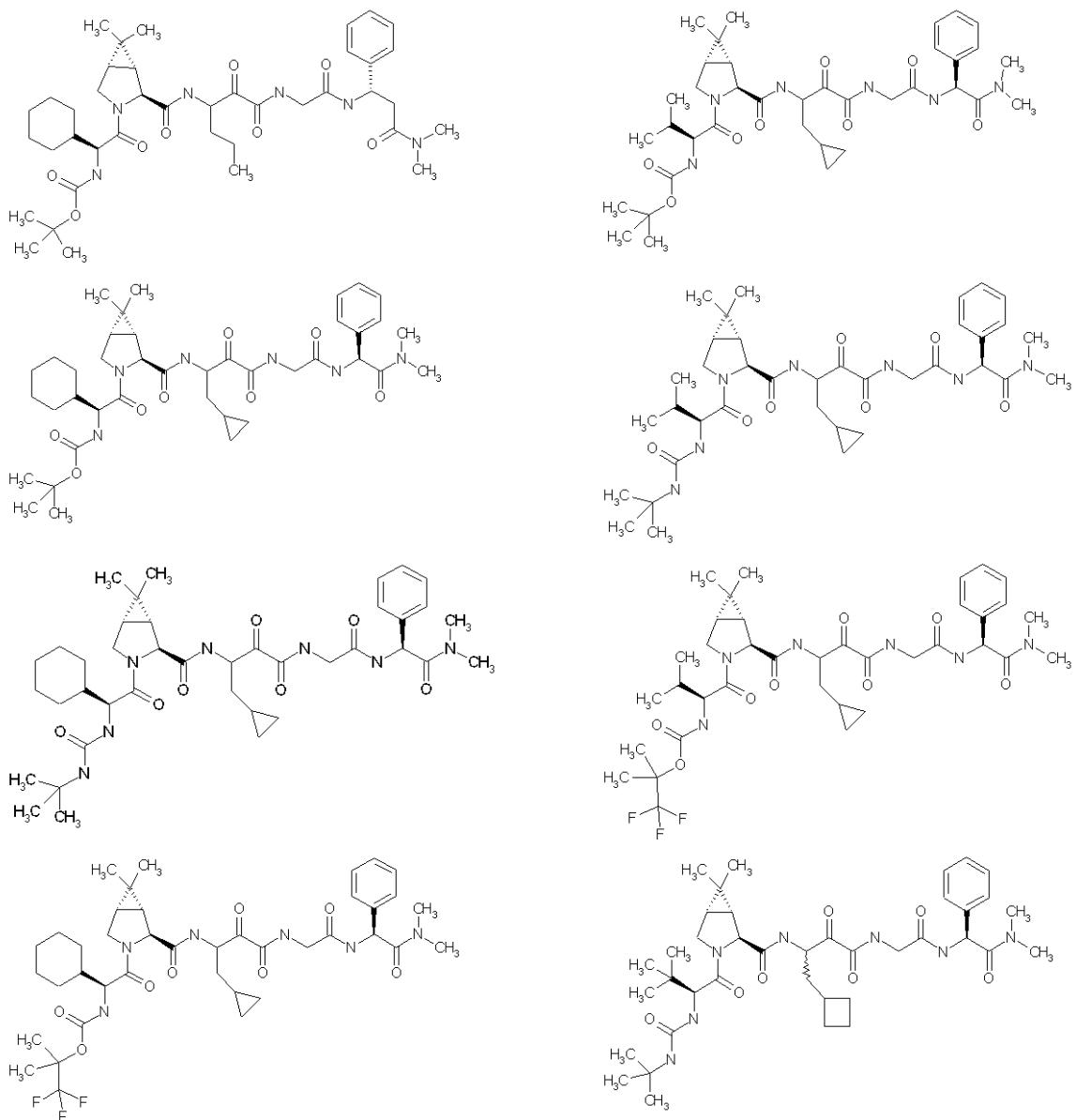
HCVプロテアーゼ阻害活性を示す化合物、または該化合物の鏡像異性体、立体異性体、回転異性体、互変異性体、ラセミ体およびプロドラッグ、または該化合物もしくは該プロドラッグの医薬上許容される塩もしくは溶媒和物であって、下記に例挙した構造で表される化合物から選択される化合物：

【化 5 9】

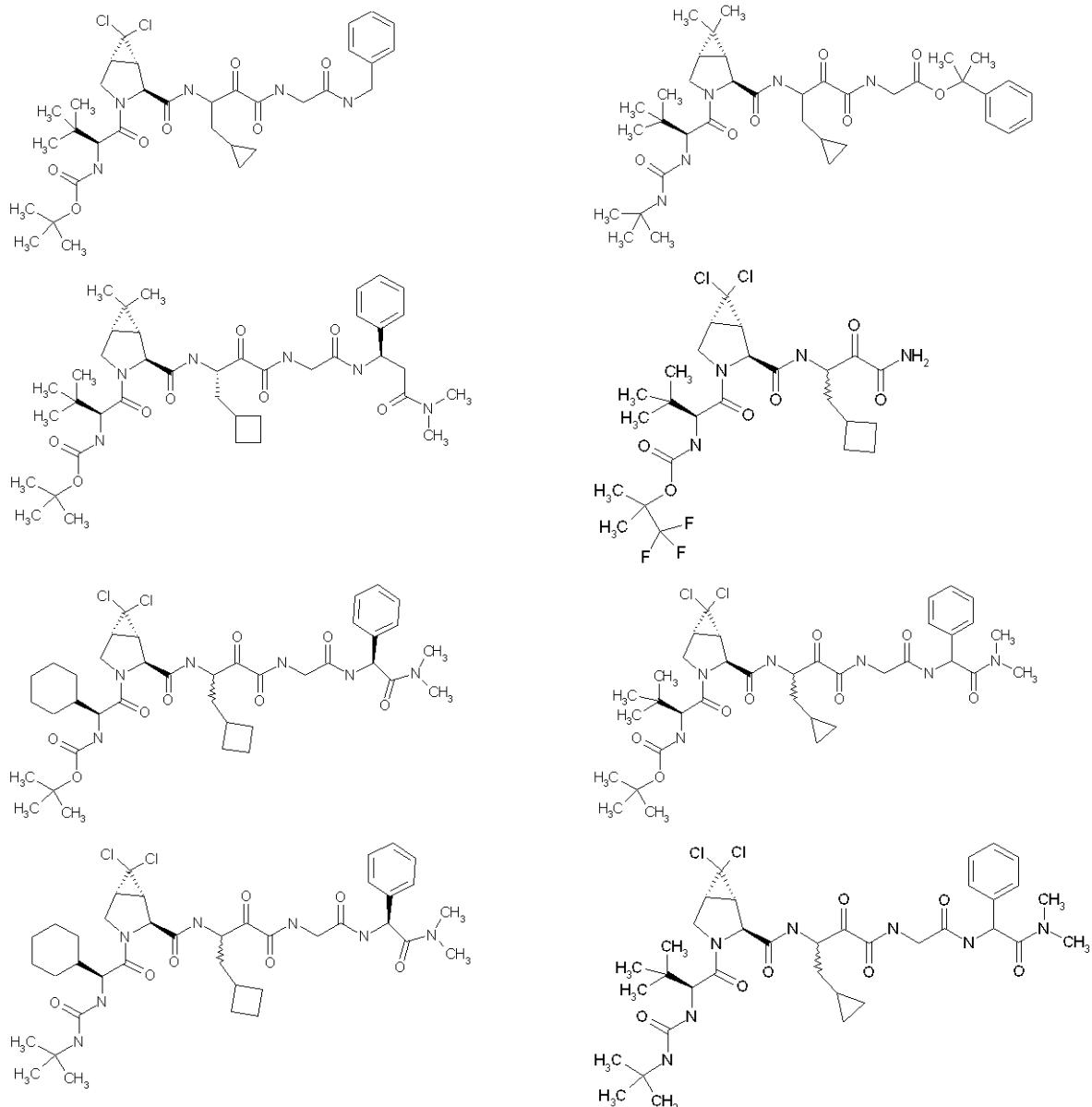
【化 6 0】



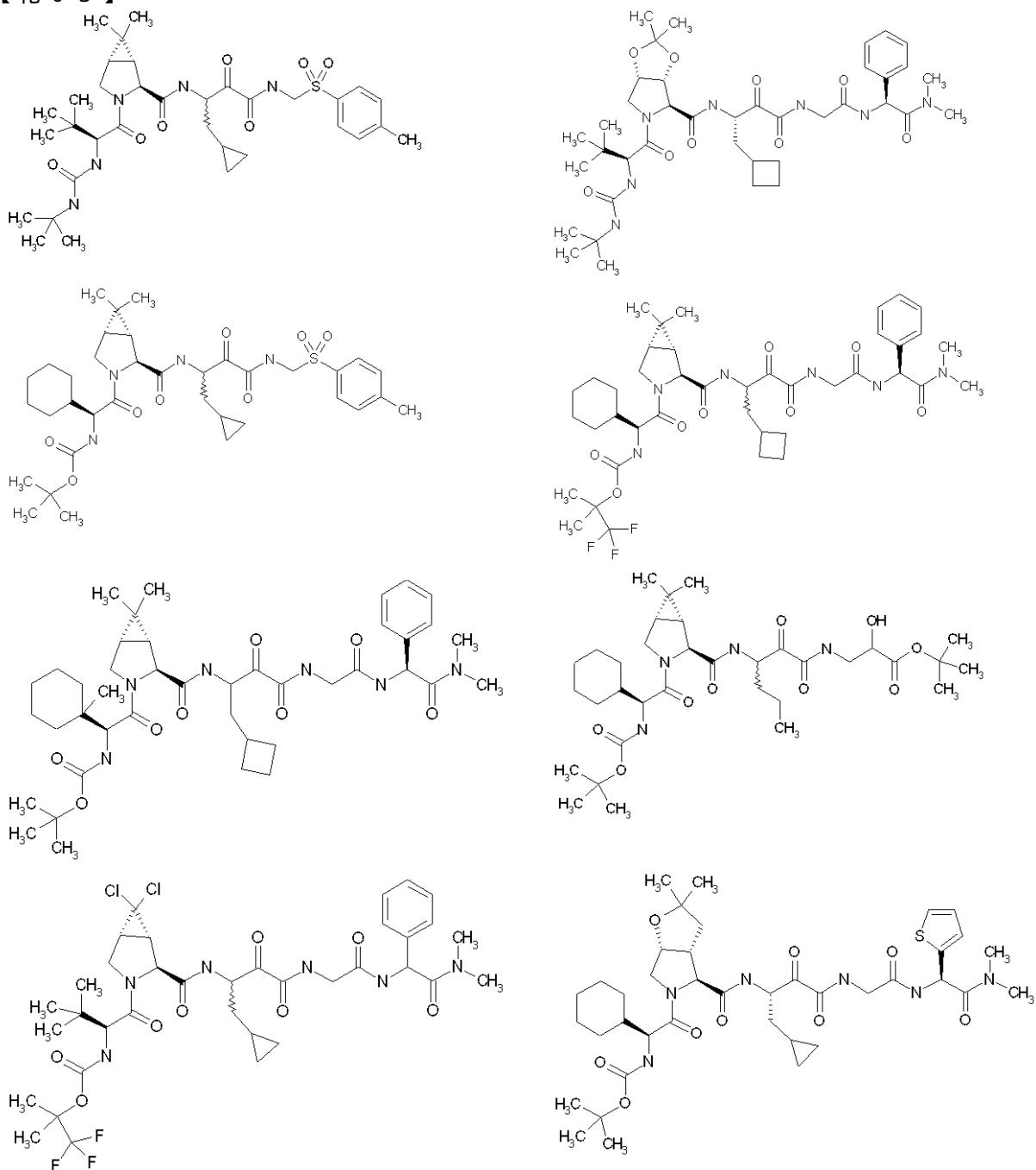
【化 6 1】



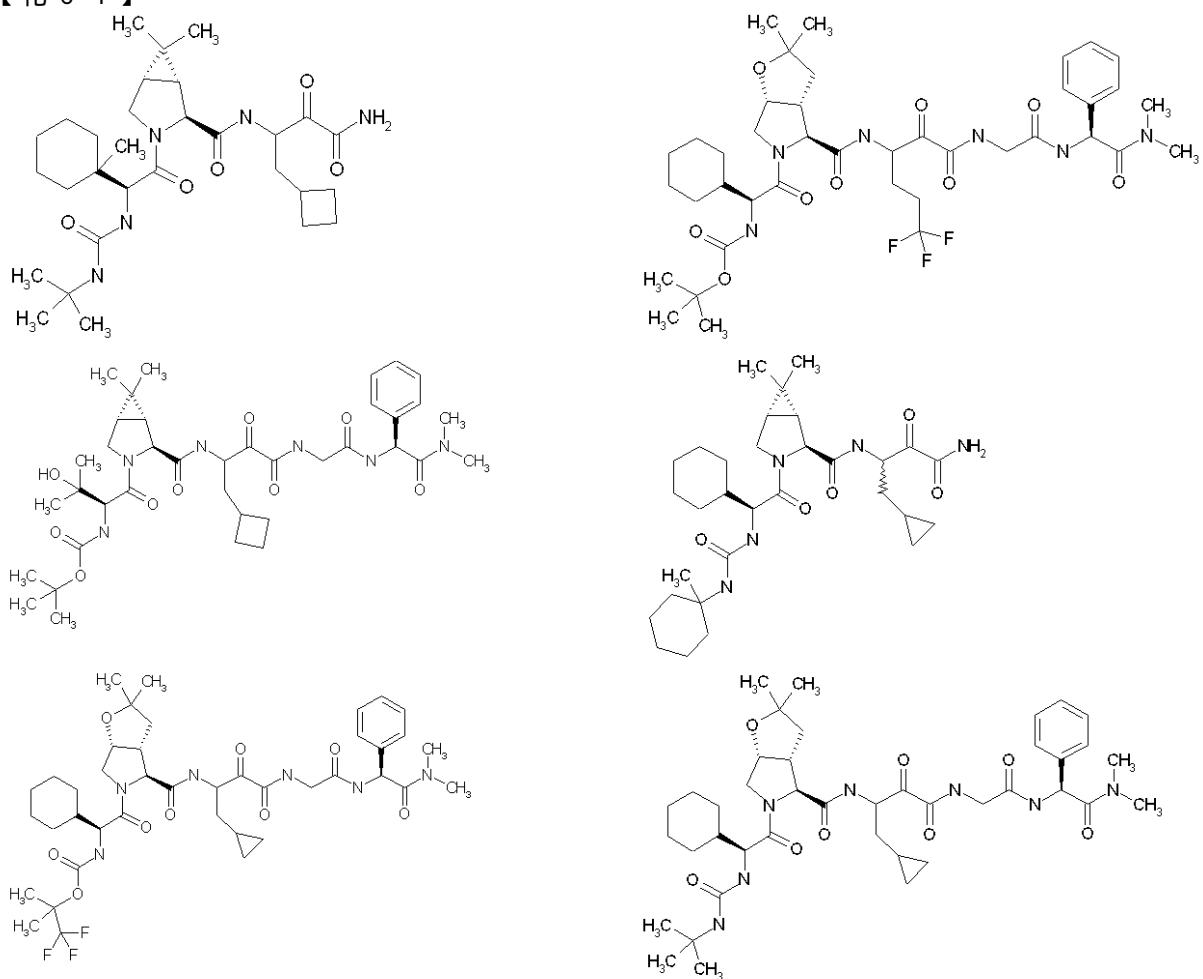
【化 6 2】



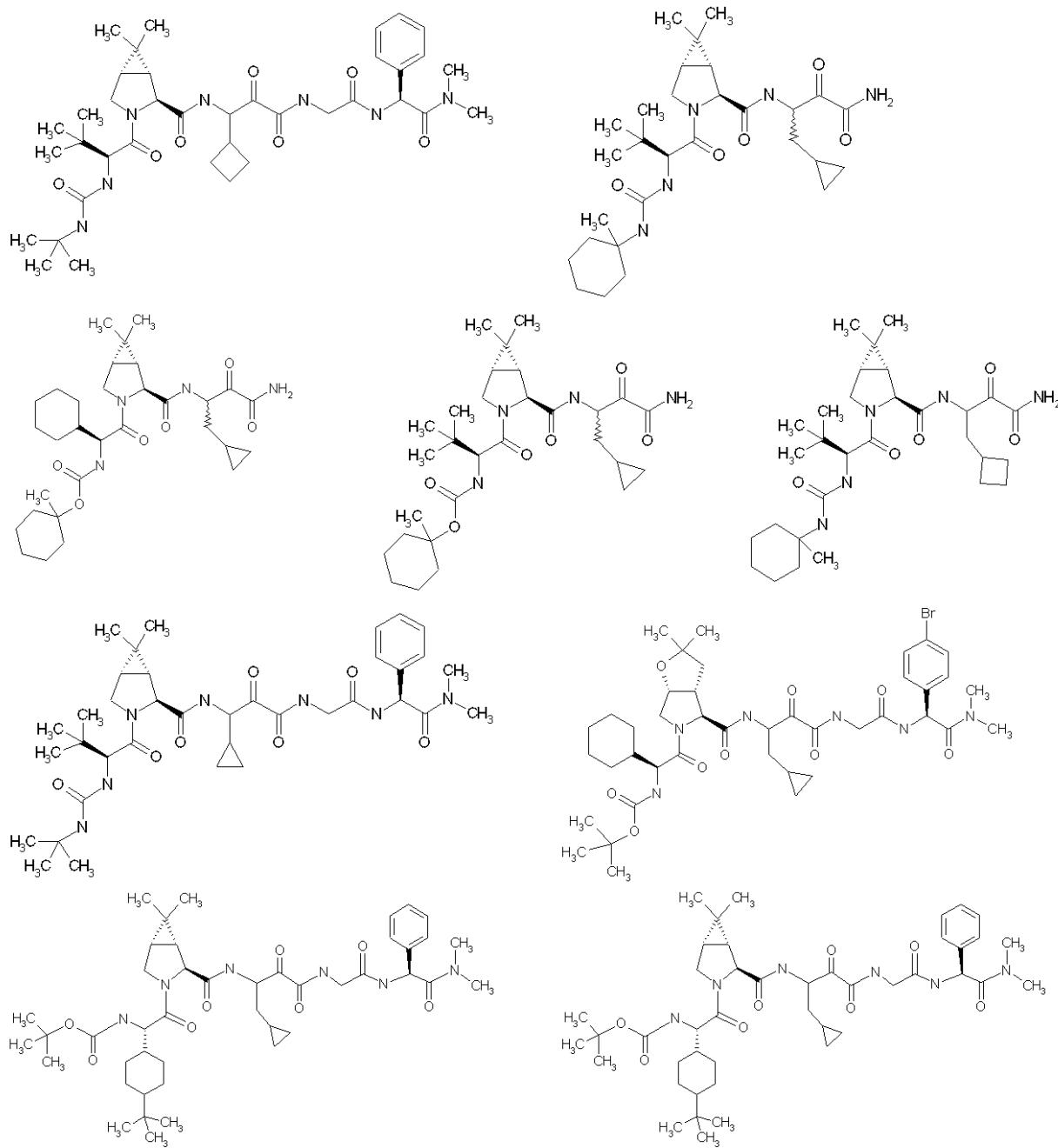
【化 6 3】



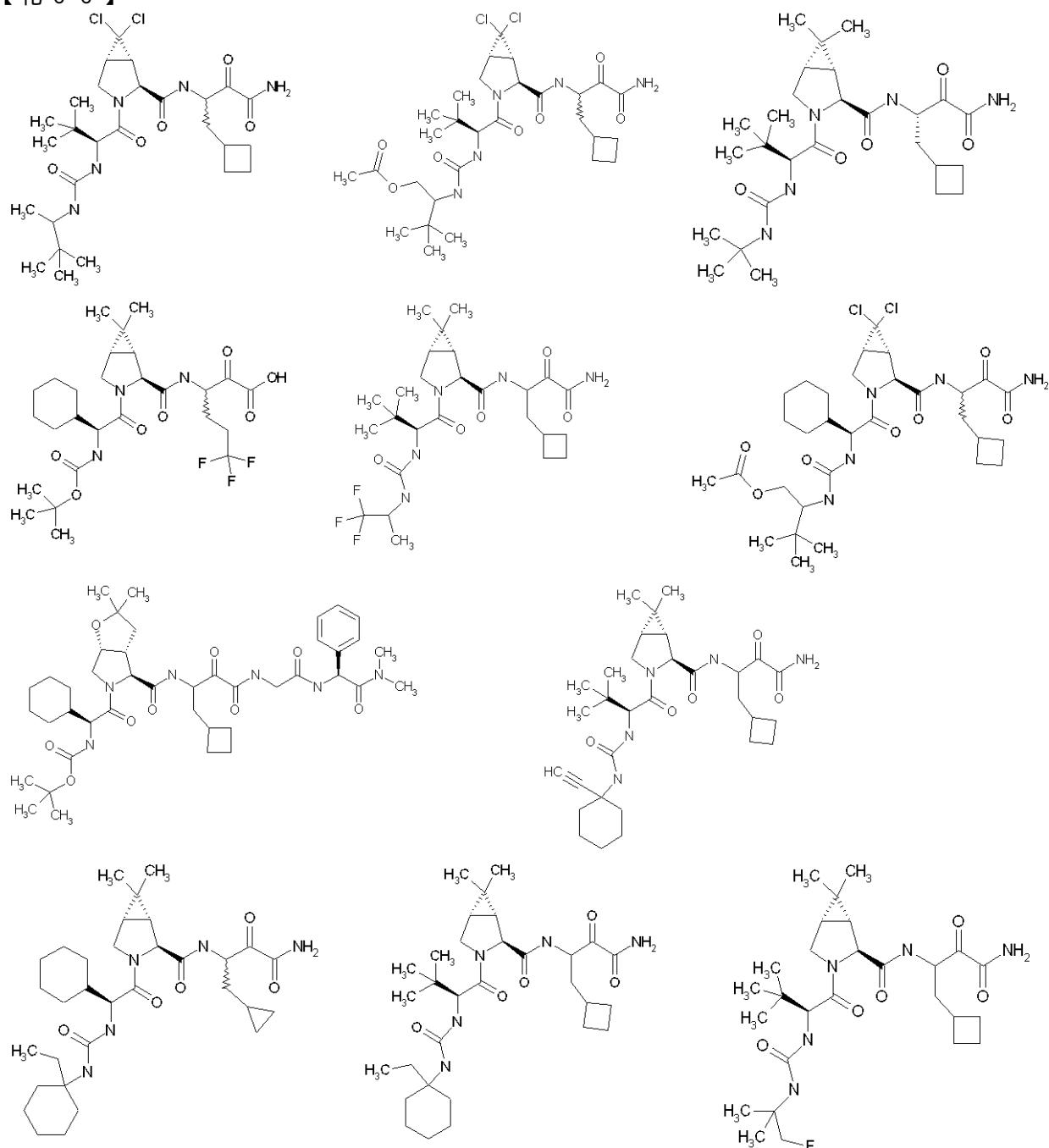
【化 6 4】



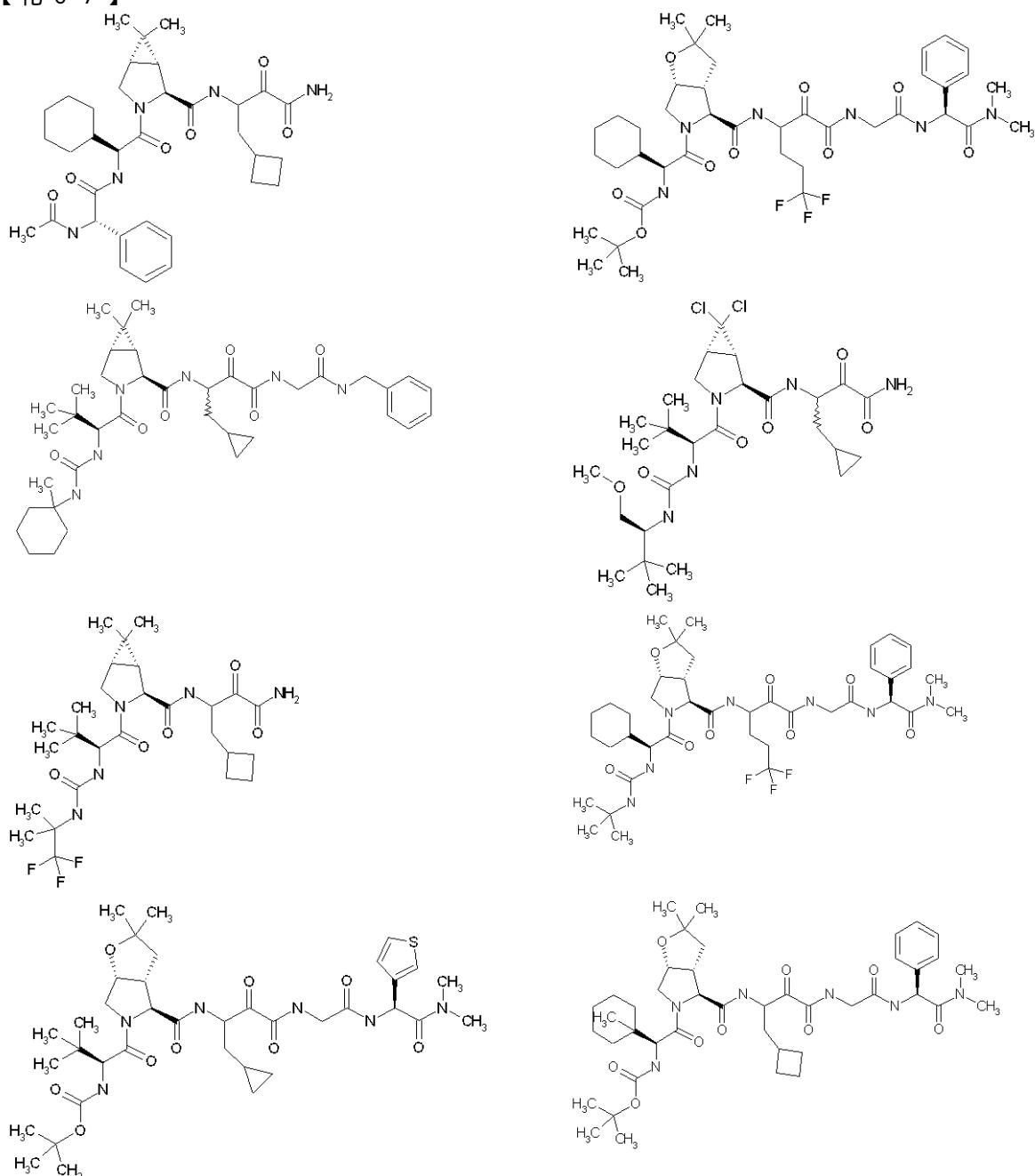
【化 6 5】



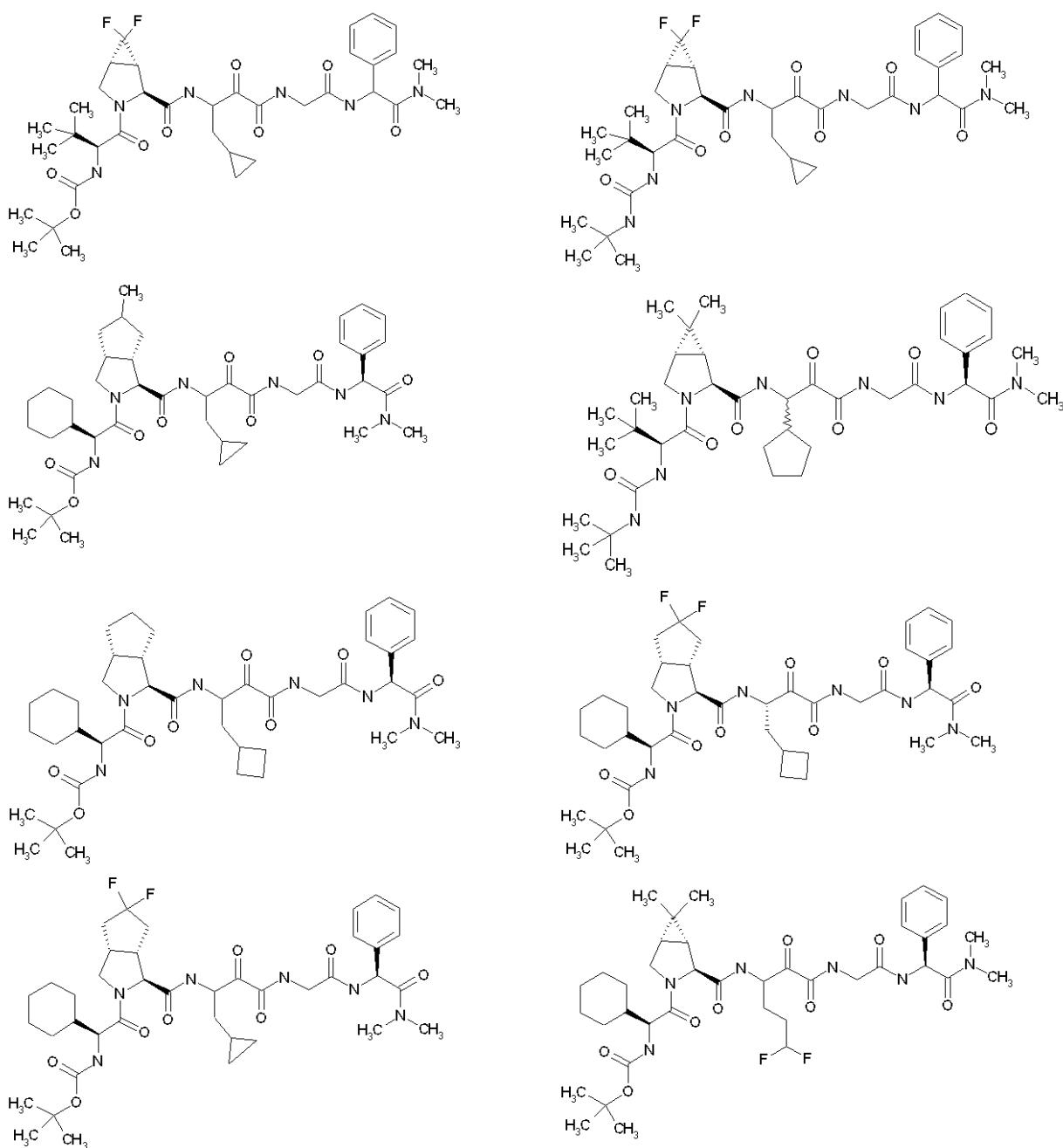
【化 6 6】



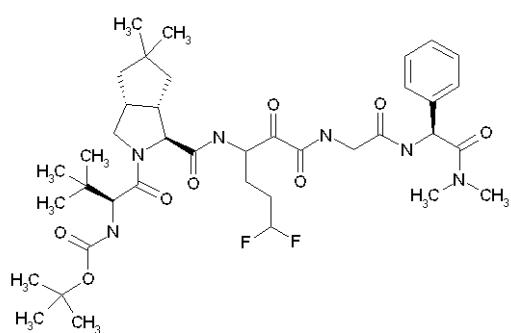
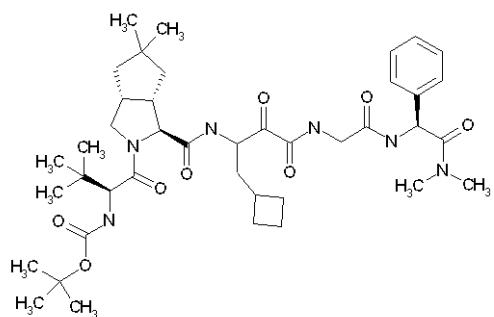
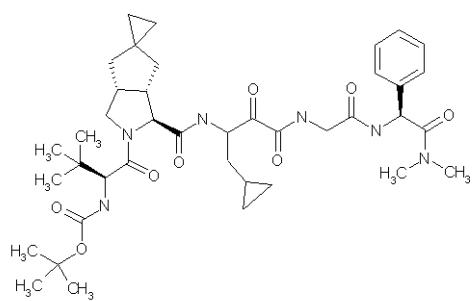
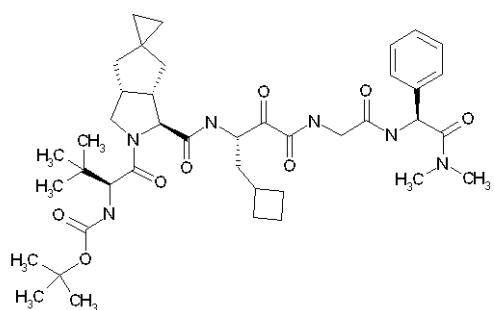
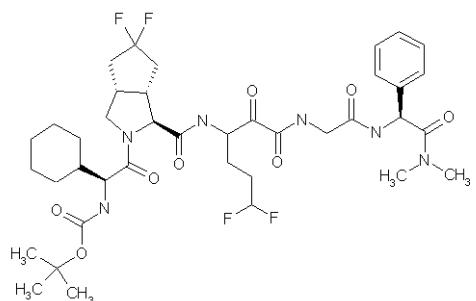
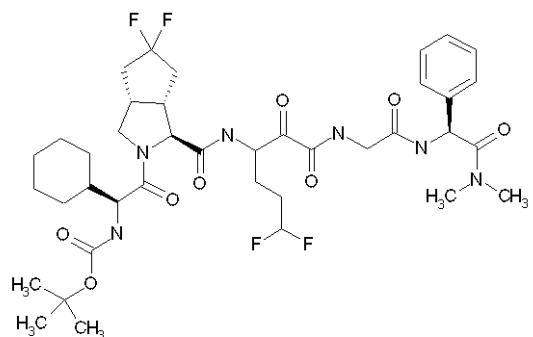
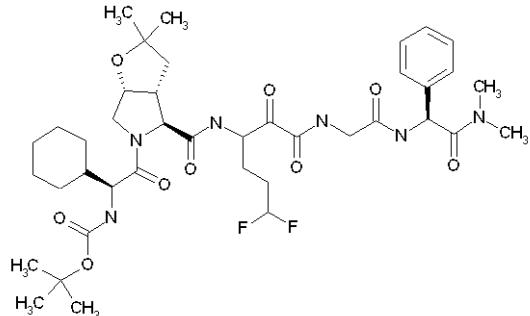
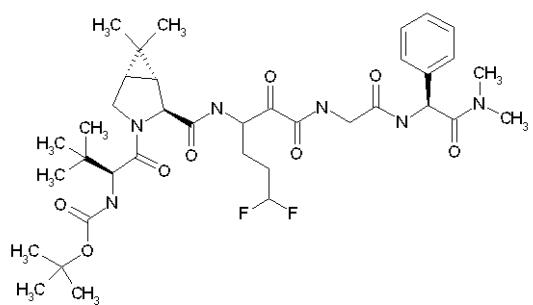
【化 6 7】



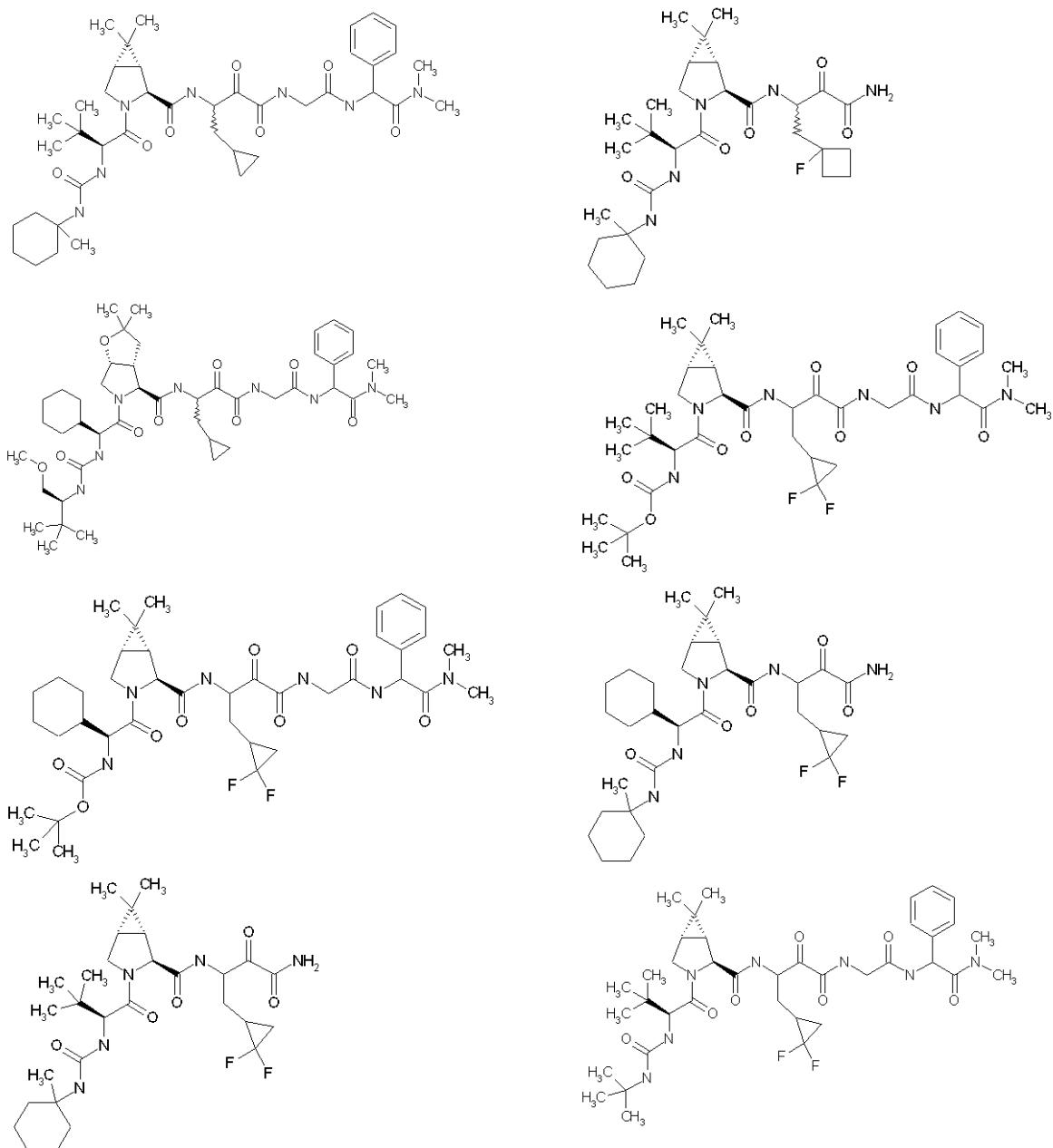
【化 6 8】



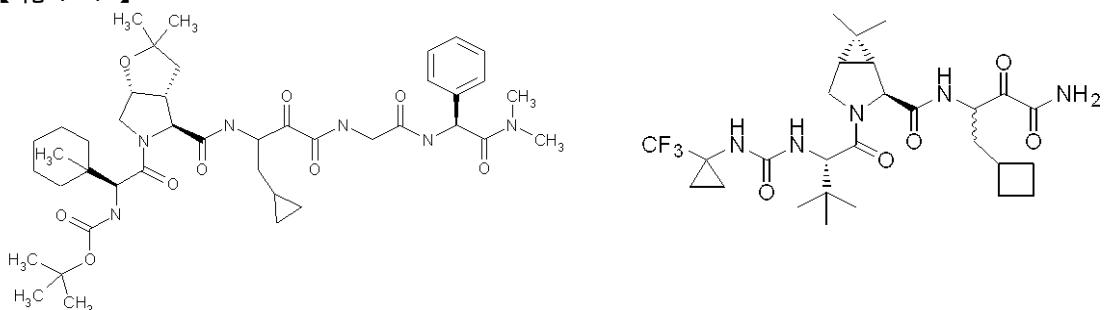
【化 6 9】



【化70】



【化71】



および

【請求項38】

HCV関連障害処置用医薬組成物であって、1種以上の請求項37記載の化合物の治療有効量および医薬上許容される担体を含有する組成物。

【請求項39】

さらに抗ウイルス剤を含む、請求項38記載の医薬組成物。

【請求項40】

さらにインターフェロンまたはPEG-インターフェロン結合体を含む、請求項39記載の医薬組成物。

【請求項41】

抗ウイルス剤がリバビリンであり、インターフェロンが-インターフェロンである、請求項40記載の医薬組成物。

【請求項42】

C型肝炎ウイルス関連障害の処置用医薬組成物の製造における請求項37記載の化合物の使用であって、該医薬組成物が1種以上の請求項37記載の化合物の有効量を含む、使用。

【請求項43】

HCVプロテアーゼを、1種以上の請求項37記載の化合物と接触させる工程を包含する、C型肝炎ウイルス(HCV)プロテアーゼ活性の調節方法。

【請求項44】

1つ以上のC型肝炎の症状の処置、予防または改善用医薬組成物の製造における請求項37記載の化合物の使用であって、該医薬組成物が1種以上の請求項37記載の化合物の有効量を含む、使用。

【請求項45】

HCVプロテアーゼがNS3/NS4aプロテアーゼである、請求項43記載の方法。

【請求項46】

化合物がHCV NS3/NS4aプロテアーゼを阻害する、請求項44記載の使用。

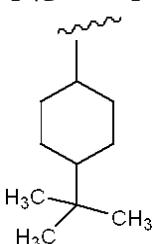
【請求項47】

C型肝炎ウイルス(HCV)ポリペプチドのプロセシングの調節方法であって、ポリペプチドがプロセシングされる条件下でHCVポリペプチドを含む組成物を1種以上の請求項37記載の化合物と接触させる工程を包含する方法。

【請求項48】

R³が以下である、請求項4記載の化合物：

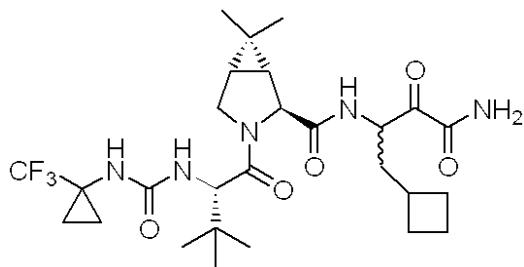
【化72】



【請求項49】

HCVプロテアーゼ阻害活性を示す化合物、または該化合物の鏡像異性体、立体異性体、回転異性体、互変異性体、ラセミ体もしくはプロドラッグ、または該化合物もしくは該プロドラッグの医薬上許容される塩もしくは溶媒和物であって、該化合物は以下に示す構造で表される化合物である化合物：

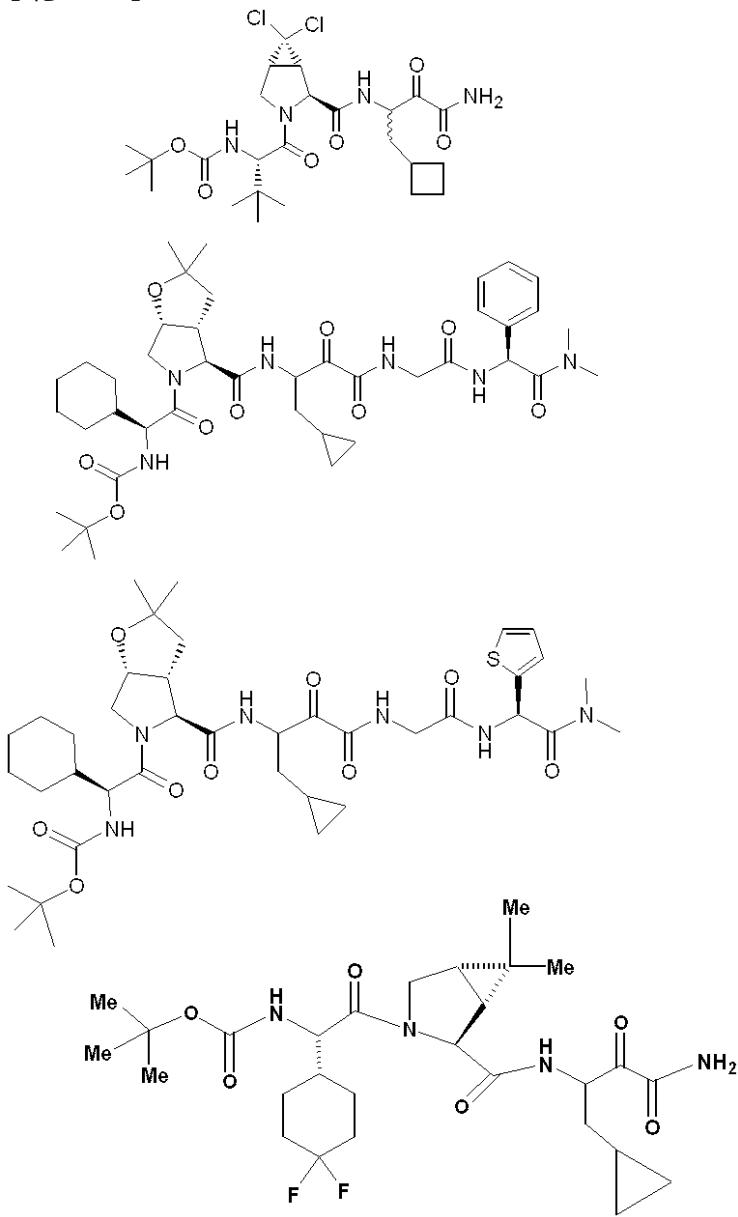
【化73】



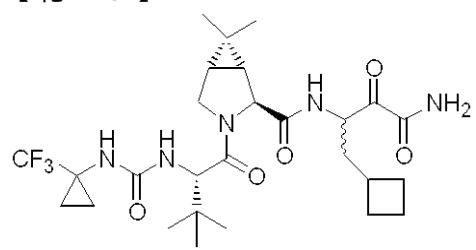
【請求項 50】

有効成分として以下から選択される化合物、または該化合物の鏡像異性体、立体異性体、回転異性体、互変異性体、ラセミ体もしくはプロドラッグ、または該化合物もしくは該プロドラッグの医薬上許容される塩もしくは溶媒和物を含む医薬組成物：

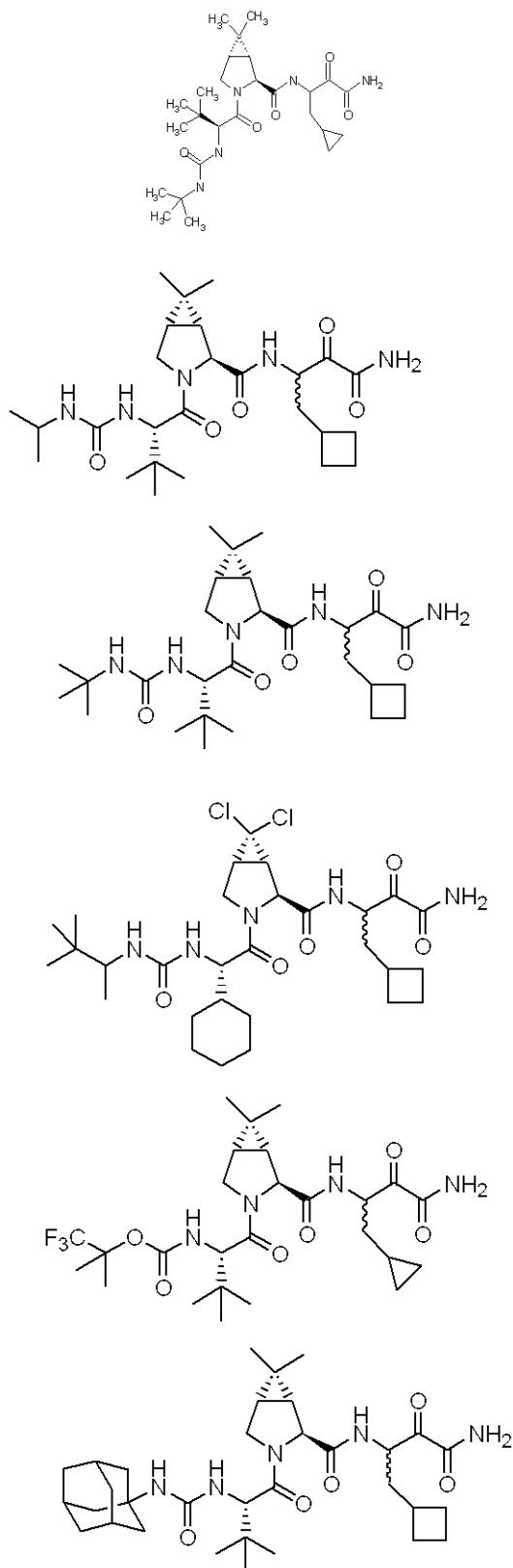
【化74】



【化75】



【化76】



【請求項51】

さらに抗ウイルス剤を含有する、請求項50記載の医薬組成物。

【請求項52】

さらにインターフェロンまたはPEG-インターフェロン結合体を含有する、請求項51記載の医薬組成物。

【請求項53】

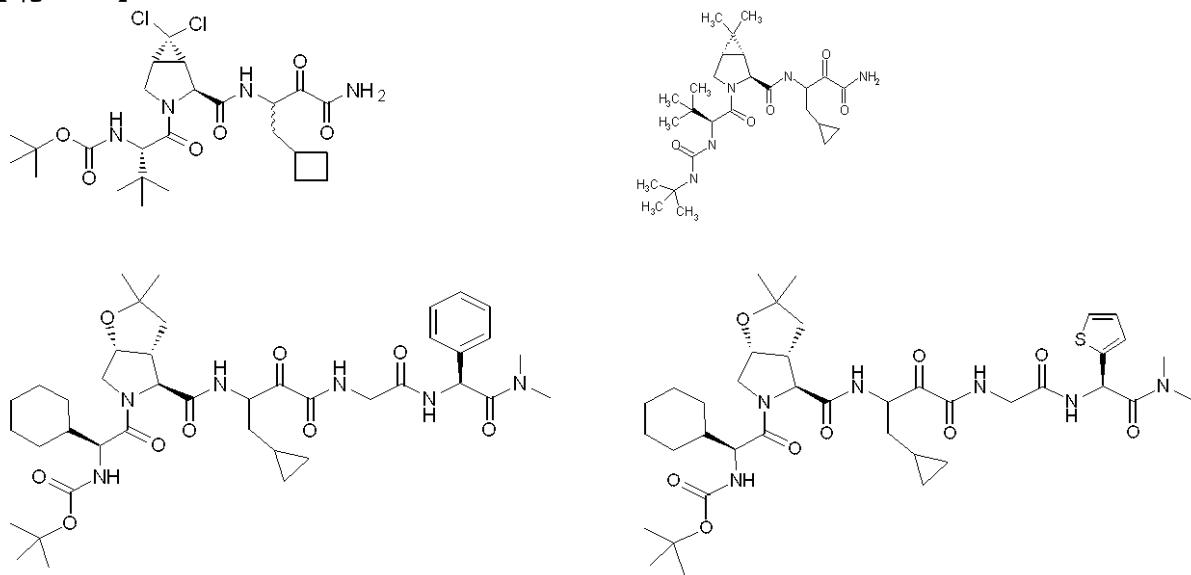
抗ウイルス剤がリバビリンであり、インターフェロンが-インターフェロンである、

請求項 5 2 記載の医薬組成物。

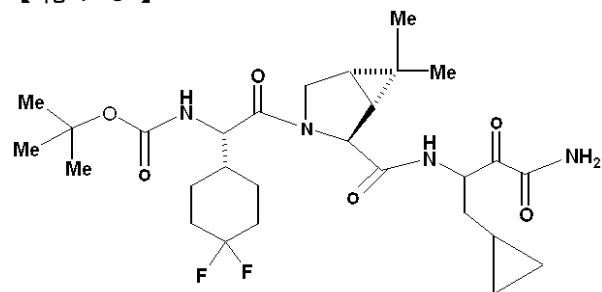
【請求項 5 4】

HCV関連障害の処置用医薬組成物の製造における、以下から選択される化合物、または該化合物の鏡像異性体、立体異性体、回転異性体、互変異性体、ラセミ体もしくはプロドラッグ、または該化合物もしくは該プロドラッグの医薬上許容される塩もしくは溶媒和物の使用であつて、該医薬組成物は治療有効量の該化合物を含み、処置を必要とする患者に投与される、使用：

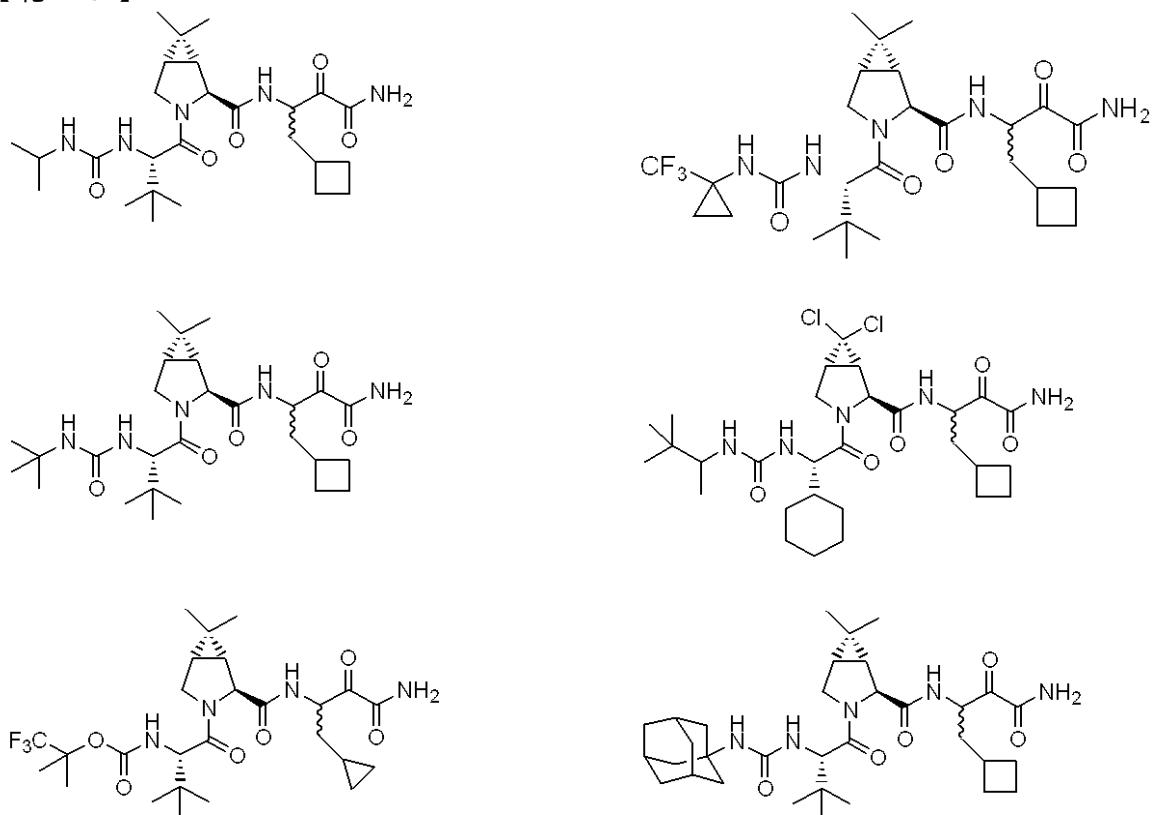
【化 7 7】



【化 7 8】



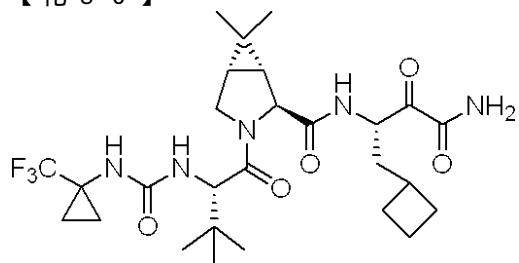
【化79】



【請求項55】

下記式を有する請求項49記載の化合物：

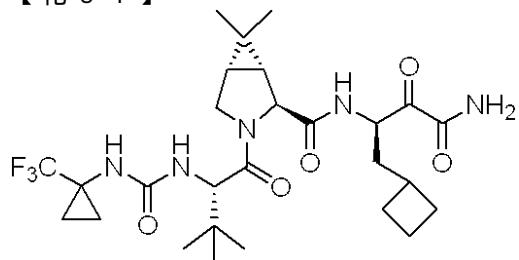
【化80】



【請求項56】

下記式を有する請求項49記載の化合物：

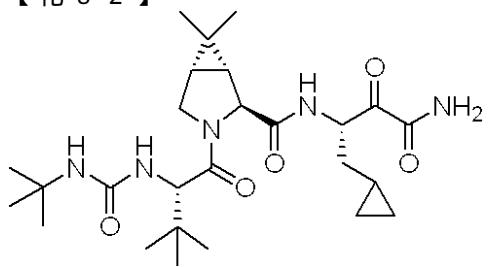
【化81】



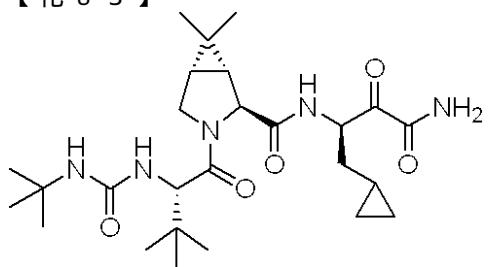
【請求項57】

化合物が以下から選択される請求項50記載の医薬組成物：

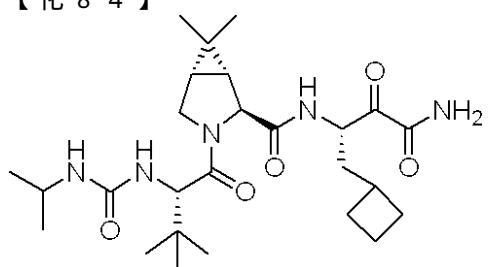
【化 8 2】



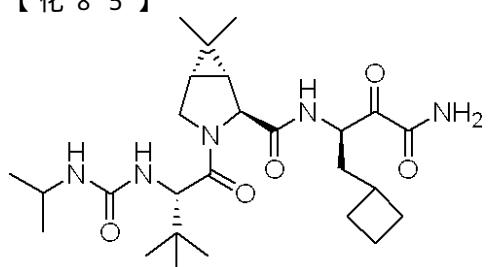
【化 8 3】



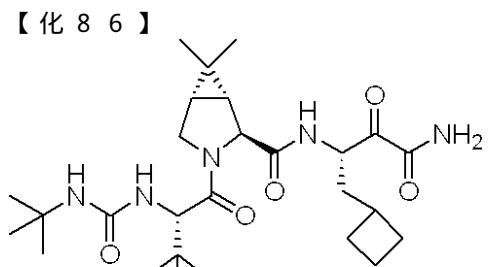
【化 8 4】



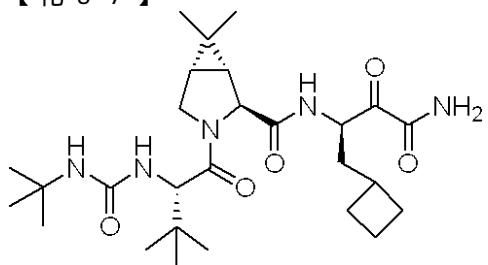
【化 8 5】



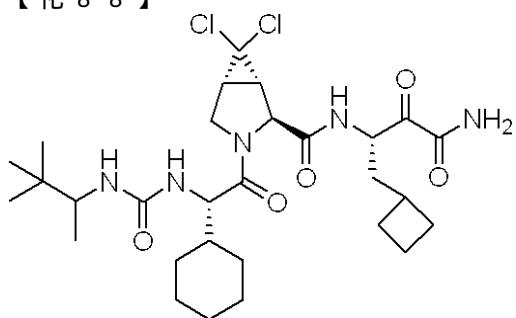
【化 8 6】



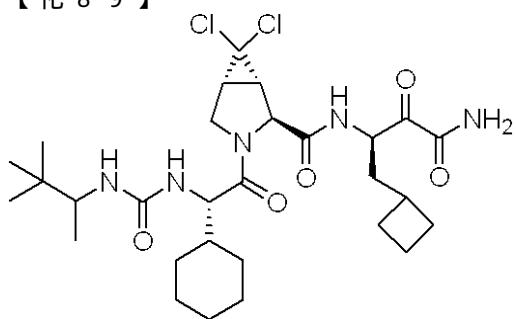
【化 8 7】



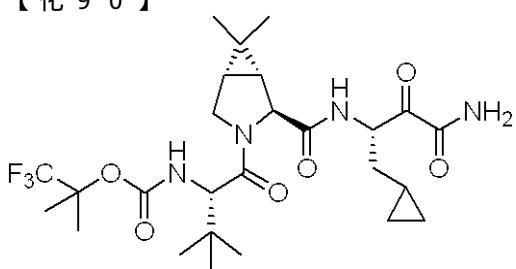
【化 8 8】



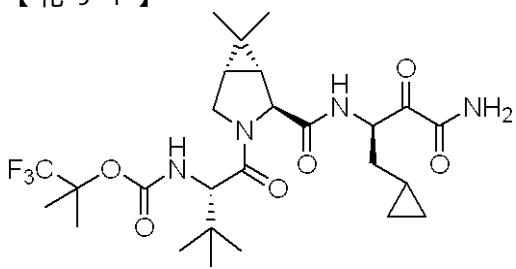
【化 8 9】



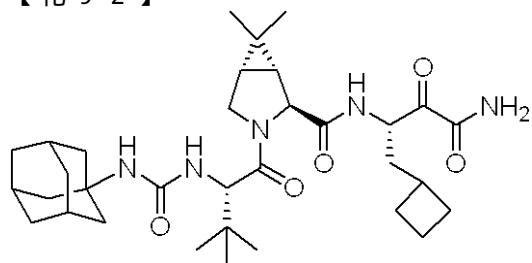
【化 9 0】



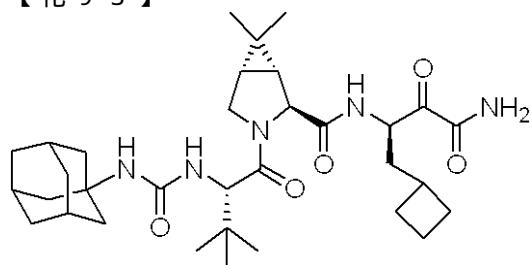
【化 9 1】



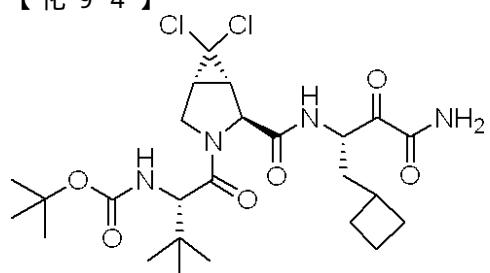
【化 9 2】



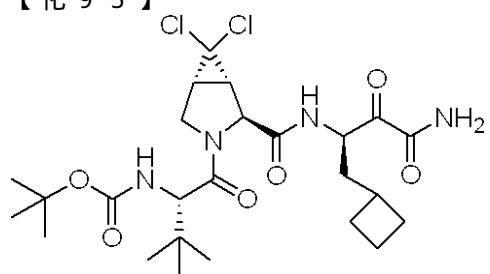
【化 9 3】



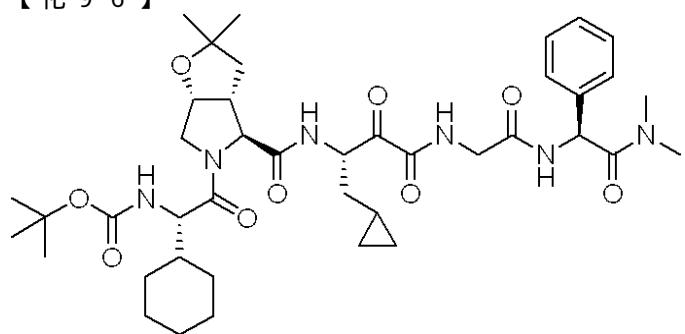
【化 9 4】



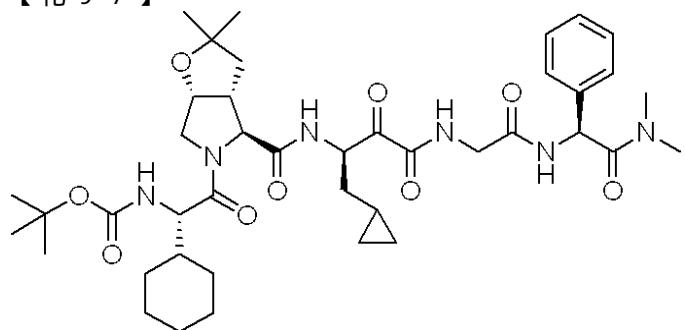
【化 9 5】



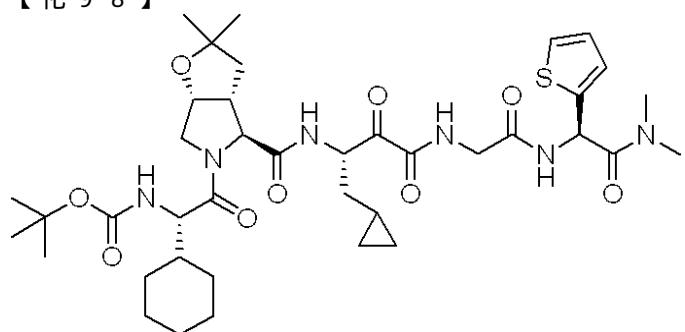
【化 9 6】



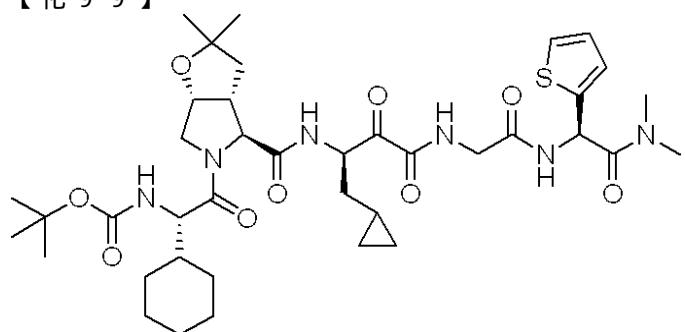
【化 9 7】



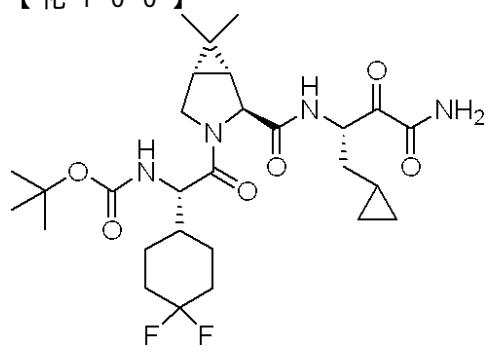
【化 9 8】



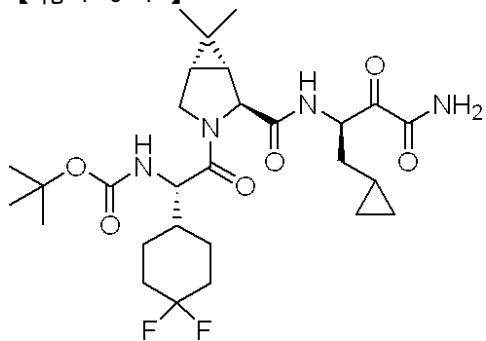
【化 9 9】



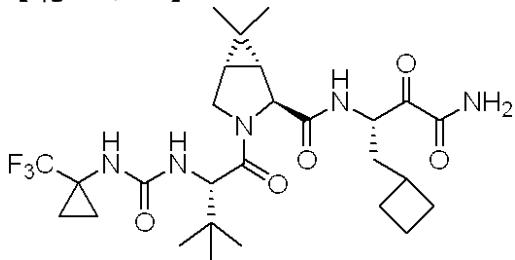
【化 1 0 0】



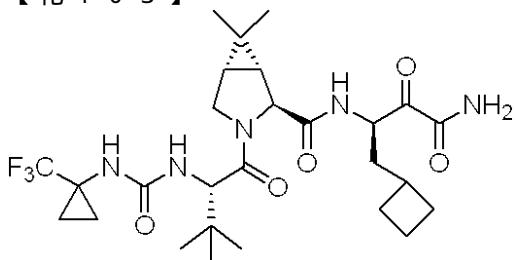
【化101】



【化102】



【化103】



【請求項58】

さらに抗ウイルス剤を含む、請求項57記載の医薬組成物。

【請求項59】

さらにインターフェロンまたはPEG化インターフェロン結合体を含む、請求項58記載の医薬組成物。

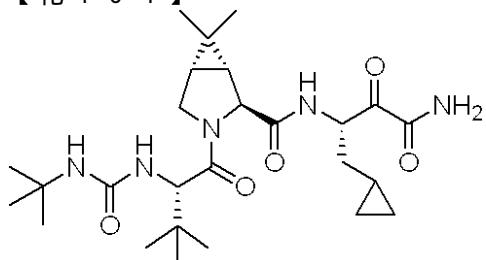
【請求項60】

抗ウイルス剤がリバビリンであり、インターフェロンが-インターフェロンである、請求項59記載の医薬組成物。

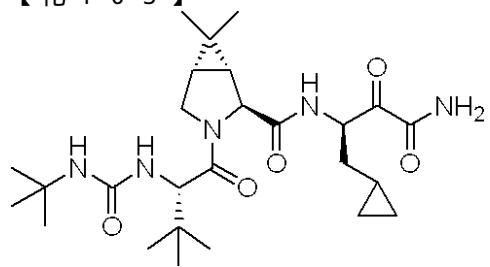
【請求項61】

化合物が以下から選択される請求項54記載の使用：

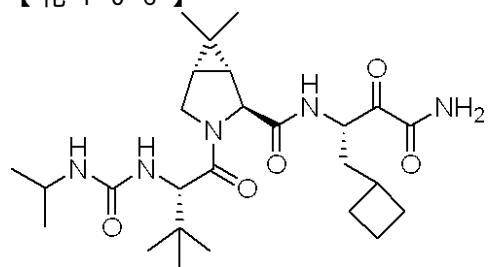
【化104】



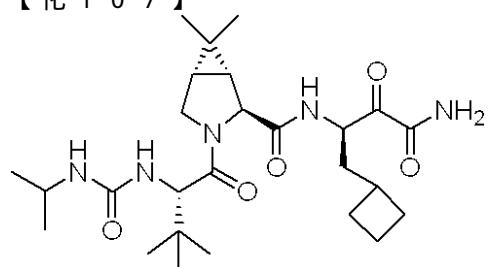
【化 1 0 5】



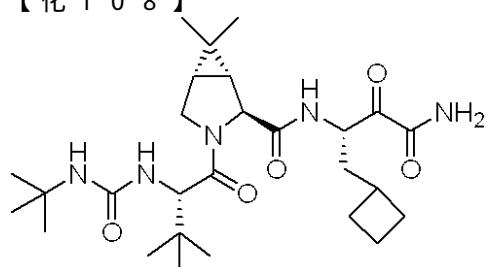
【化 1 0 6】



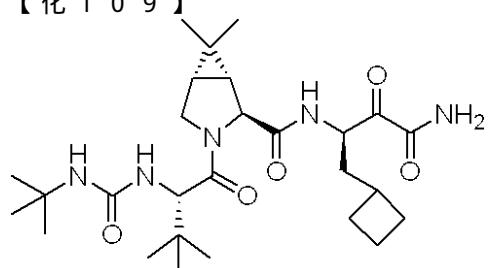
【化 1 0 7】



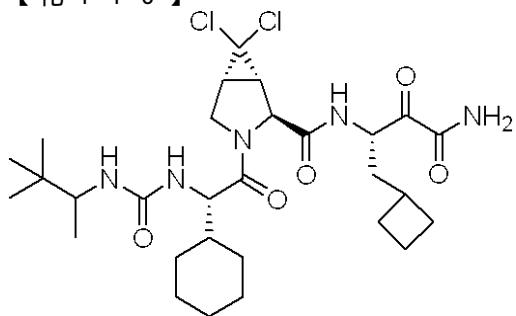
【化 1 0 8】



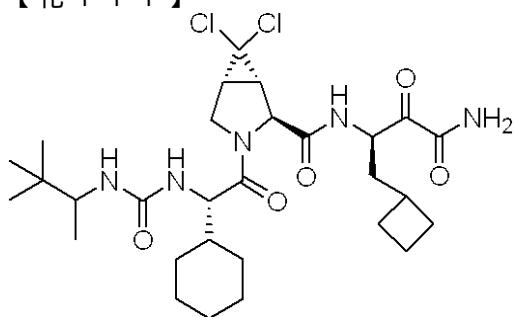
【化 1 0 9】



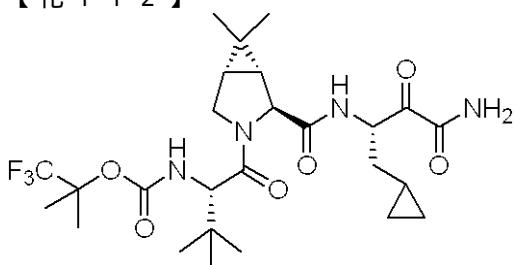
【化 1 1 0】



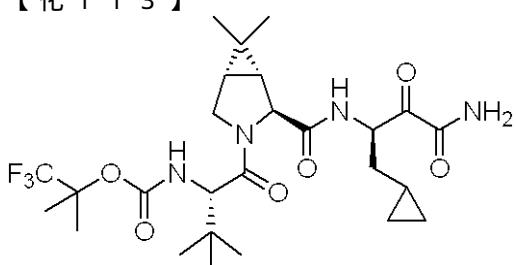
【化 1 1 1】



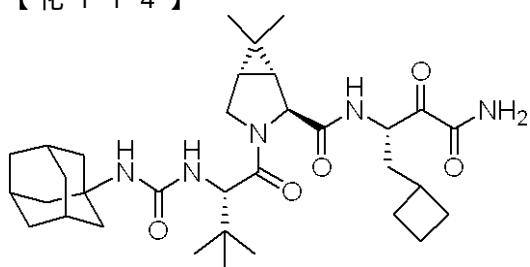
【化 1 1 2】



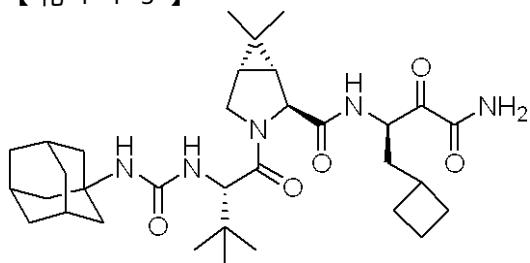
【化 1 1 3】



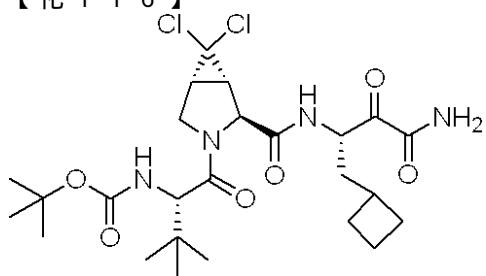
【化 1 1 4】



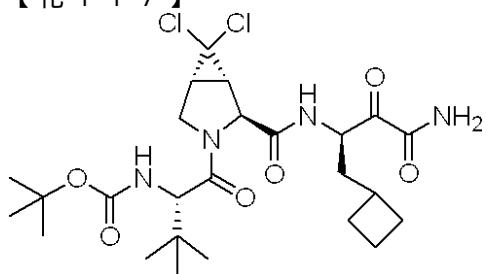
【化 1 1 5】



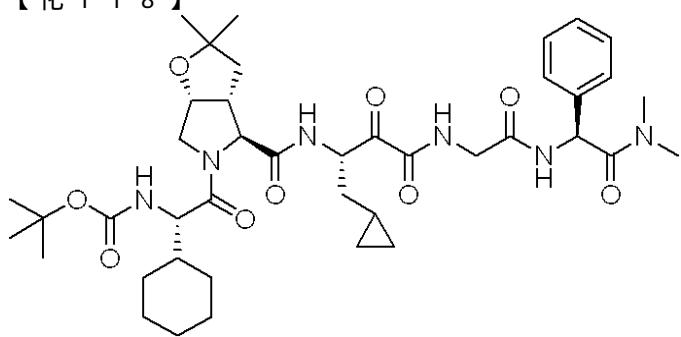
【化 1 1 6】



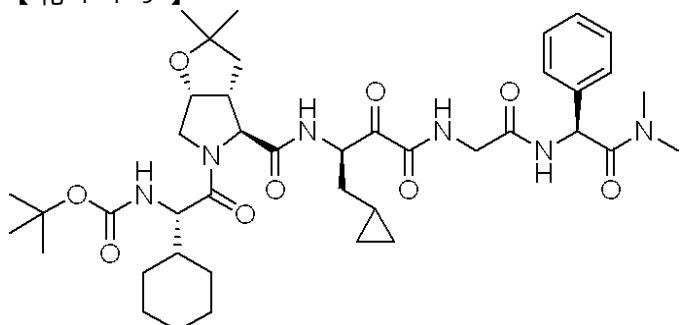
【化 1 1 7】



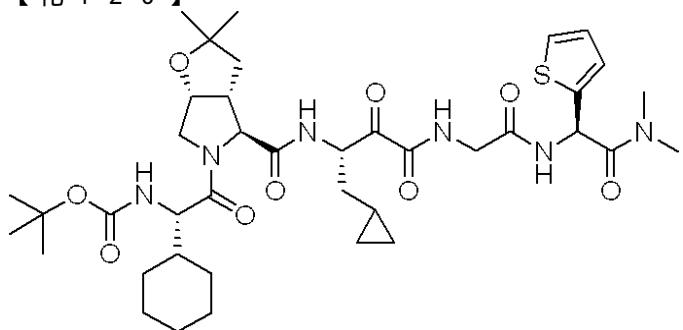
【化 1 1 8】



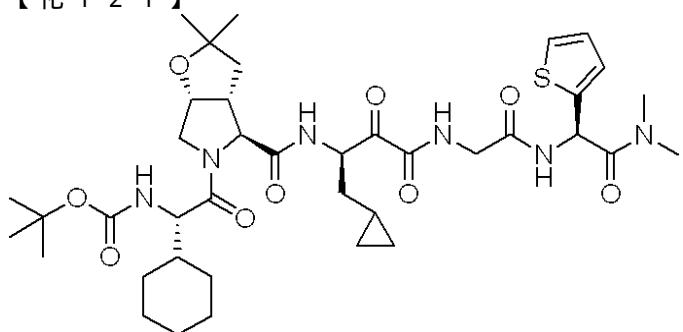
【化 1 1 9】



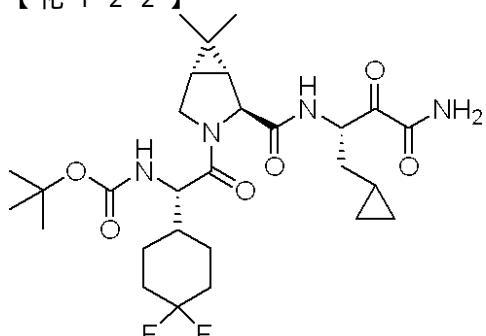
【化 1 2 0】



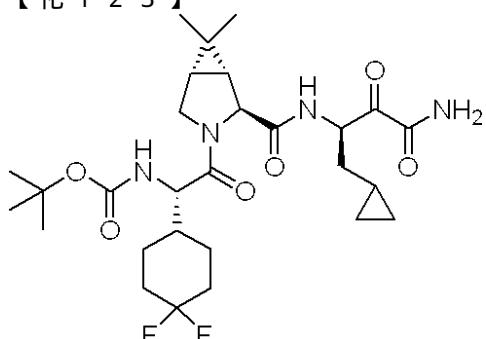
【化 1 2 1】



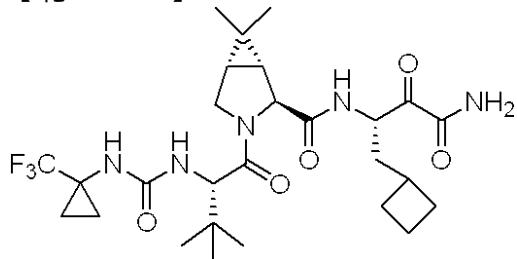
【化 1 2 2】



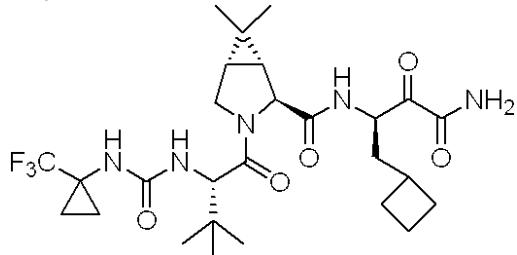
【化 1 2 3】



【化124】



【化125】



【請求項62】

請求項1記載の化合物から選択される化合物であって、該化合物の鏡像異性体、立体異性体、回転異性体、互変異性体、ラセミ体およびプロドラッグ、ならびに該化合物または該プロドラッグの医薬上許容される塩または溶媒和物を包含する化合物を有効成分として含有し、さらにインターフェロンを含有する医薬組成物。

【請求項63】

インターフェロンが -インターフェロンまたはPEG化インターフェロンである、請求項62記載の医薬組成物。

【請求項64】

経口または皮下投与に適切である、請求項63記載の医薬組成物。

【請求項65】

請求項37記載の化合物から選択される化合物であって、該化合物の鏡像異性体、立体異性体、回転異性体、互変異性体、ラセミ体およびプロドラッグ、ならびに該化合物または該プロドラッグの医薬上許容される塩または溶媒和物を包含する化合物を有効成分として含有し、さらにインターフェロンを含有する医薬組成物。

【請求項66】

インターフェロンが -インターフェロンまたはPEG化インターフェロンである、請求項65記載の医薬組成物。

【請求項67】

経口または皮下投与に適切である、請求項66記載の医薬組成物。

【請求項68】

さらにインターフェロンを含む、請求項50記載の医薬組成物。

【請求項69】

インターフェロンが -インターフェロンまたはPEG化インターフェロンである、請求項68記載の医薬組成物。

【請求項70】

経口または皮下投与に適切である、請求項69記載の医薬組成物。

【請求項71】

さらに抗ウイルス剤を含有する、請求項62記載の医薬組成物。

【請求項72】

請求項55または56記載の化合物から選択される化合物であって、該化合物のプロドラッグ、および該化合物または該プロドラッグの医薬上許容される塩または溶媒和物を包含する化合物を有効成分として含有し、さらにインターフェロンを含有する医薬組成物。

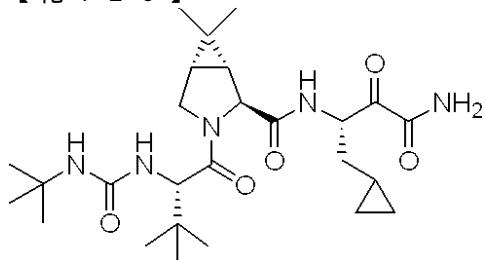
【請求項 7 3】

さらにインターフェロンを含む、請求項 5 7 記載の医薬組成物。

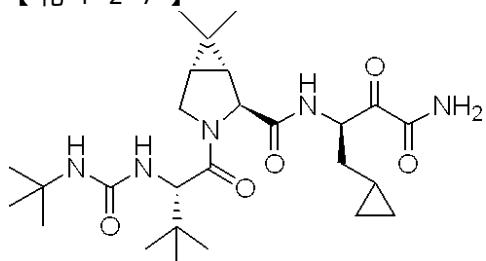
【請求項 7 4】

下記から選択される化合物であって、該化合物のプロドラッグ、および該化合物または該プロドラッグの医薬上許容される塩または溶媒和物を包含する化合物を有効成分として含有し、さらにインターフェロンを含有するする医薬組成物：

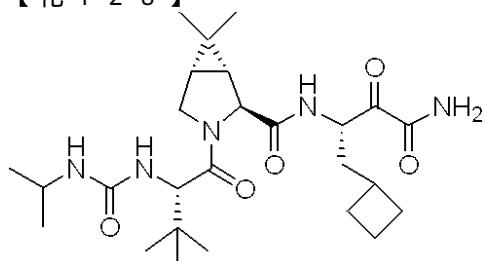
【化 1 2 6】



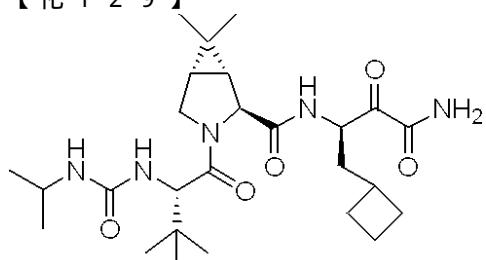
【化 1 2 7】



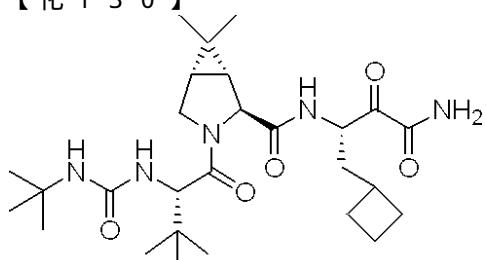
【化 1 2 8】



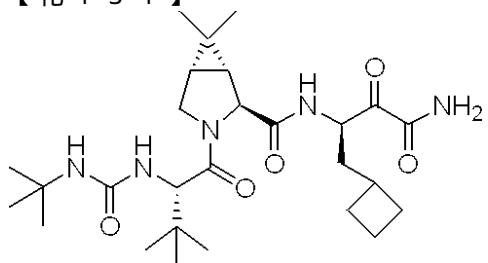
【化 1 2 9】



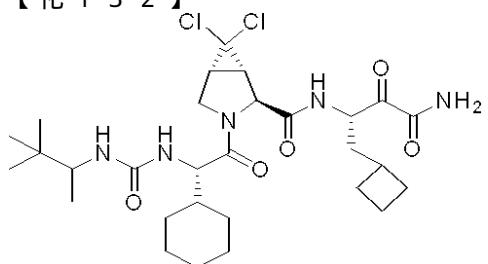
【化 1 3 0】



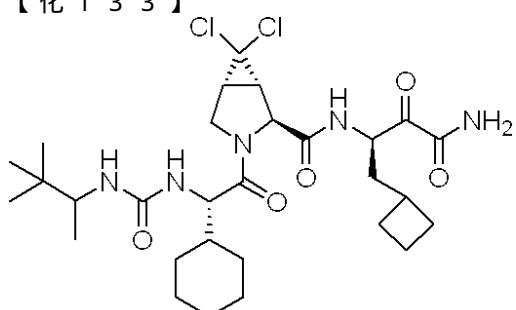
【化 1 3 1】



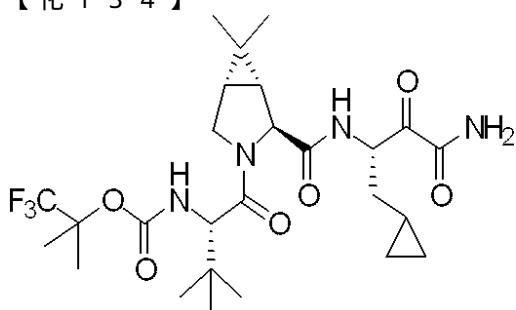
【化 1 3 2】



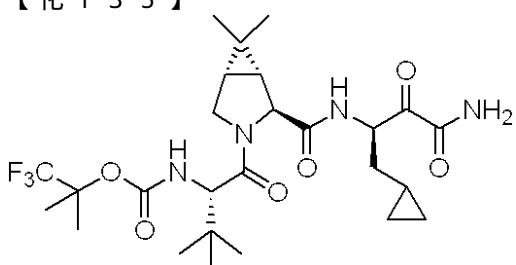
【化 1 3 3】



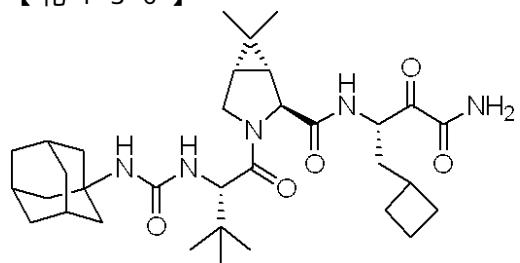
【化 1 3 4】



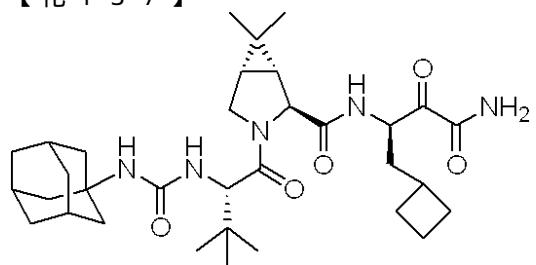
【化 1 3 5】



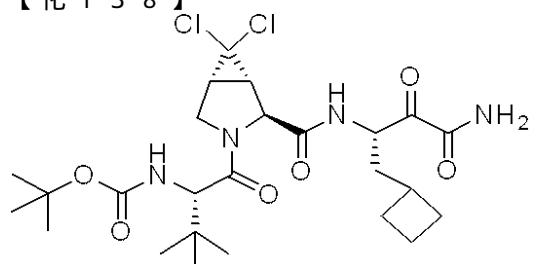
【化 1 3 6】



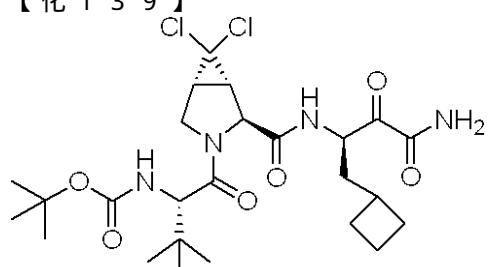
【化 1 3 7】



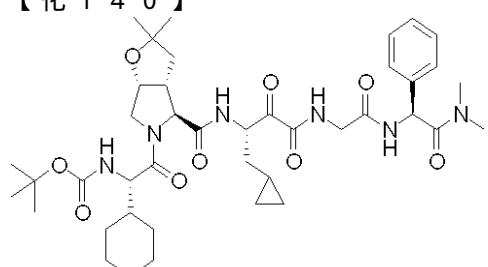
【化 1 3 8】



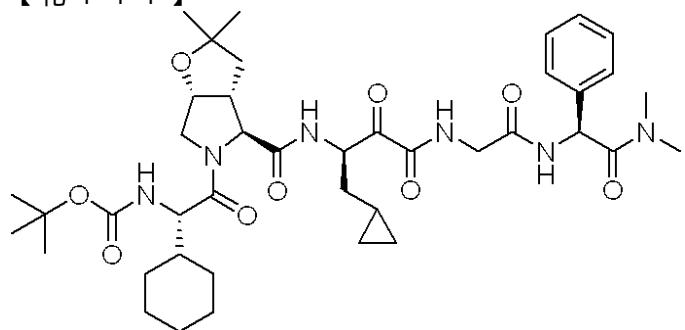
【化 1 3 9】



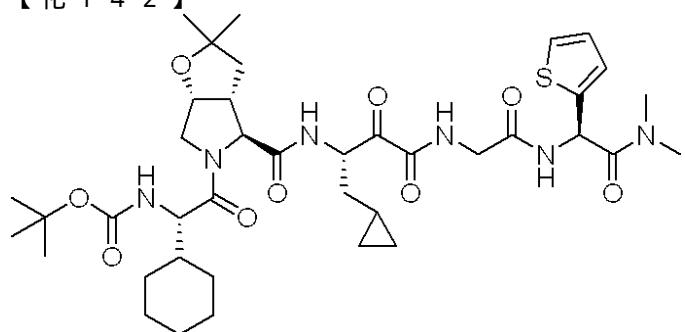
【化 1 4 0】



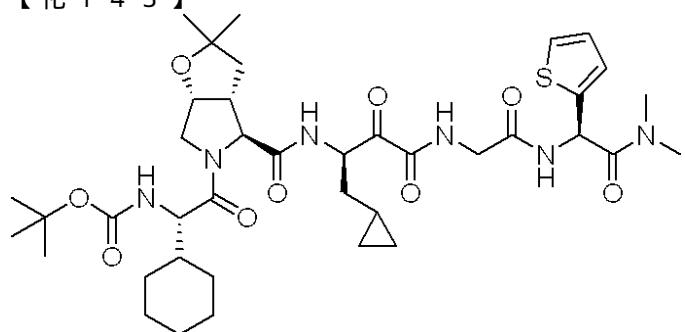
【化 141】



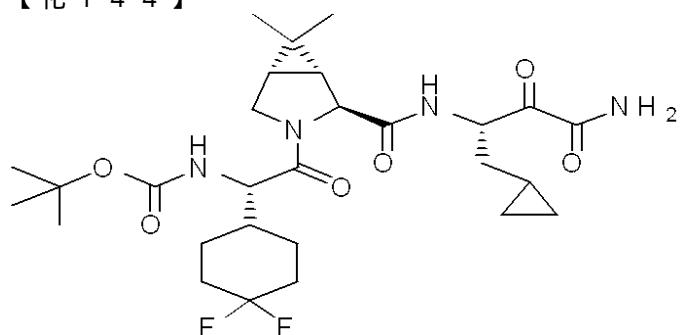
【化 142】



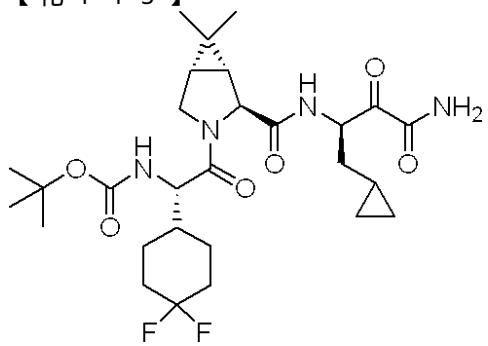
【化 143】



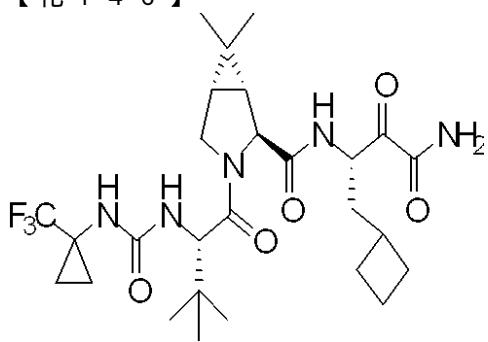
【化 144】



【化 1 4 5】



【化 1 4 6】



【化 1 4 7】

