

【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1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2003-526613(P2003-526613A)

【公表日】平成15年9月9日(2003.9.9)

【出願番号】特願2000-593580(P2000-593580)

【国際特許分類】

**C 0 7 C 275/36 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/17 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/18 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/341 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/40 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/4035 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/4406 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/4409 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/4439 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/4453 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/495 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/496 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/5355 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/5375 (2006.01)**  
**A 6 1 P 35/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**  
**C 0 7 C 291/12 (2006.01)**  
**C 0 7 C 311/29 (2006.01)**  
**C 0 7 C 317/22 (2006.01)**  
**C 0 7 D 207/09 (2006.01)**  
**C 0 7 D 209/46 (2006.01)**  
**C 0 7 D 213/74 (2006.01)**  
**C 0 7 D 213/75 (2006.01)**  
**C 0 7 D 213/79 (2006.01)**  
**C 0 7 D 213/81 (2006.01)**  
**C 0 7 D 213/82 (2006.01)**  
**C 0 7 D 295/12 (2006.01)**  
**C 0 7 D 295/18 (2006.01)**  
**C 0 7 D 307/14 (2006.01)**  
**C 0 7 D 401/12 (2006.01)**  
**C 0 7 F 7/18 (2006.01)**  
**C 0 7 D 209/48 (2006.01)**

【 F I 】

**C 0 7 C 275/36**  
**A 6 1 K 31/17**  
**A 6 1 K 31/18**  
**A 6 1 K 31/341**  
**A 6 1 K 31/40**  
**A 6 1 K 31/4035**  
**A 6 1 K 31/4406**  
**A 6 1 K 31/4409**  
**A 6 1 K 31/4439**

A 6 1 K 31/4453  
 A 6 1 K 31/495  
 A 6 1 K 31/496  
 A 6 1 K 31/5355  
 A 6 1 K 31/5375  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1  
 C 0 7 C 291/12  
 C 0 7 C 311/29  
 C 0 7 C 317/22  
 C 0 7 D 207/09  
 C 0 7 D 209/46  
 C 0 7 D 213/74  
 C 0 7 D 213/75  
 C 0 7 D 213/79  
 C 0 7 D 213/81  
 C 0 7 D 213/82  
 C 0 7 D 295/12 A  
 C 0 7 D 295/12 Z  
 C 0 7 D 295/18 A  
 C 0 7 D 307/14  
 C 0 7 D 401/12  
 C 0 7 F 7/18 A  
 C 0 7 F 7/18 T  
 C 0 7 D 209/48 Z

## 【手続補正書】

【提出日】平成17年9月1日(2005.9.1)

## 【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式 I の化合物またはその薬学的に許容し得る塩：



式 I において、

D は -NH-C(O)-NH- であり；

A は式 -L-(M-L<sup>1</sup>)<sub>q</sub> の炭素原子 40 までの置換分であって、ここで L は D へ直接結合した 5 もしくは 6 員の環構造であり、L<sup>1</sup> は少なくとも 5 員の置換環状基を含み、M は少なくとも 1 原子を有するブリッジ基であり、q は 1～3 の整数であり、そして L および L<sup>1</sup> の環構造は窒素、酸素およびイオウよりなる群の 0～4 員を含有し；

B は置換もしくは未置換の三環までのアリールか、または窒素、酸素およびイオウよりなる群の 0～4 員を含有する D へ直結した少なくとも 6 員環構造を有する炭素原子 30 までのヘテロアリール基であり；

ここで L<sup>1</sup> は -SO<sub>2</sub>R<sub>x</sub>、-C(O)R<sub>x</sub> および -C(NR<sub>y</sub>)R<sub>z</sub> よりなる群から選ばれた少なくとも一つの置換基によって置換されており；

R<sub>y</sub> は水素か、または任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にペルハロまでハロゲン置換された炭素原子 24 までの炭素系基であり；

$R_z$  は水素か、または任意にハロゲン、ヒドロキシ、および任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にペルハロまでハロゲンで置換された炭素原子 24 までの炭素系置換基で置換された任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有する炭素原子 30 までの炭素系基であり;

$R_x$  は  $R_z$  であるか、または  $NR_a$ 、 $R_b$  であり、ここで  $R_a$  および  $R_b$  は、

a) 独立に、水素か、または任意にハロゲン、ヒドロキシ、および任意に N, S, O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンまたは  $-OSi(R_f)_3$  で置換された炭素原子 24 までの炭素系置換基で置換された任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有する炭素原子 30 までの炭素系基であり、ここで  $R_f$  は水素か、または任意にハロゲン、ヒドロキシおよび任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンで置換された炭素原子 24 までの炭素系置換基で置換された任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有する炭素原子 24 までの炭素系基であり、あるいは

b)  $R_a$  および  $R_b$  は一所で N, S および O から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 の 5 ないし 7 員複素環を形成するか、またはハロゲン、ヒドロキシもしくは任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンで置換された炭素原子 24 までの炭素系置換基で置換された N, S および O から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 の置換 5 ないし 7 員複素環を形成し、あるいは

c)  $R_a$  および  $R_b$  の一つは少なくとも 5 員の環状構造を形成するように基 L へ結合した  $-C(O)-$ ,  $C_1 - C_5$  2 価アルキレンまたは置換  $C_1 - C_5$  2 価アルキレンであって、置換  $C_1 - C_5$  2 価アルキレンの置換基はハロゲン、ヒドロキシおよび任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンで置換された炭素原子 24 までの炭素系置換基からなる群から選ばれ;

B が置換されている場合、L が置換されているかまたは  $L^1$  が追加的に置換されており、その置換基はペルハロまでのハロゲンおよび  $W_n$  ( $n$  は 1 ~ 0) よりなる群から選ばれ、

この場合めいめいの W は独立に  $-CN$ ,  $-CO_2R^7$ ,  $-C(O)NR^7R^7$ ,  $-C(O)R^7$ ,  $-NO_2$ ,  $-OR^7$ ,  $-SR^7$ ,  $-NR^7R^7$ ,  $-NR^7C(O)OR^7$ ,  $-NR^7C(O)R^7$ ,  $-Q-Ar$ , および任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして  $-CN$ ,  $-CO_2R^7$ ,  $-C(O)R^7$ ,  $-C(O)NR^7R^7$ ,  $-OR^7$ ,  $-SR^7$ ,  $-NR^7R^7$ ,  $-NO_2$ ,  $-NR^7C(O)R^7$ ,  $-NR^7C(O)OR^7$  およびペルハロまでのハロゲンよりなる群から選ばれた 1 以上の置換基で任意に置換された炭素原子 24 までの炭素系基よりなる群から独立に選ばれ、ここで各  $R^7$  は H または任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンで置換された炭素原子 24 までの炭素系基から独立に選ばれ、

ここで Q は  $-O-$ ,  $-S-$ ,  $-N(R^7)-$ ,  $-(CH_2)_m-$ ,  $-C(O)-$ ,  $-CH(OH)-$ ,  $-(CH_2)_mO-$ ,  $-(CH_2)_mS-$ ,  $-(CH_2)_mN(R^7)-$ ,  $-O(CH_2)_m-$ ,  $CHX^a-$ ,  $CX^a_2-$ ,  $-S(CH_2)_m-$ , または  $-N(R^7)(CH_2)_m-$  であり、( $m$  は 1 ~ 3 および  $X^a$  はハロゲンである); そして

$Ar$  は窒素、酸素およびイオウよりなる群から選ばれたヘテロ原子 0 ~ 2 を含有し、そして任意にペルハロまでハロゲンで置換され、そして任意に  $Z_{n1}$  によって置換された 5 もしくは 6 員芳香族構造であって、ここで  $n1$  は 0 ないし 3 であり、各  $Z$  は  $-CN$ ,  $-CO_2R^7$ ,  $-C(O)R^7$ ,  $-C(O)NR^7R^7$ ,  $-NO_2$ ,  $-OR^7$ ,  $-NR^7R^7$ ,  $-NR^7C(O)OR^7$ ,  $-NR^7C(O)R^7$  および任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意に  $-CN$ ,  $-CO_2R^7$ ,  $-C(O)R^7$ ,  $-C(O)NR^7R^7$ ,  $-OR^7$ ,  $-SR^7$ ,  $-NO_2$ ,  $-NR^7R^7$ ,  $-NR^7C(O)R^7$  および  $-NR^7C(O)OR^7$  よりなる群から選ばれた 1 以上の置換基で置換された炭素原子 24 までの炭素系基よりなる群から独立に選ばれ、 $R^7$  は上記定義のとおりである。

#### 【請求項 2】

請求項 1 の化合物であって、

$R_y$  は水素、 $C_{1-10}$  アルキル、 $C_{1-10}$  アルコキシ、ヘテロ原子 0 ~ 3 を有する  $C_{3-10}$  シクロアルキル、 $C_{2-10}$  アルケニル、 $C_{1-10}$  アルケノイル、 $C_{6-12}$  アリール、N, S および O から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有する  $C_{3-12}$  ヘテロアリール、 $C_{7-24}$  アラルキル、 $C_{7-24}$  アルカリール、置換  $C_{1-10}$  アルキル、置換  $C_{1-10}$  アルコキシ、N, S および O から選ばれたヘテロ原子 0 ~ 3 を有する  $C_{3-10}$  シクロアルキル、置換  $C_{6-14}$  アリール、N, S および O から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有する置換  $C_{3-12}$  ヘテロアリール、置換  $C_{7-24}$  アラルキル、または  $C_{7-24}$  置換アルカリールであり、 $R_y$  が置換されている場合それはペルハ口までハ口ゲンで置換されており；

$R_z$  は、水素、 $C_{1-10}$  アルキル、 $C_{1-10}$  アルコキシ、N, S および O から選ばれたヘテロ原子 0 ~ 3 を有するシクロアルキル、 $C_{2-10}$  アルケニル、 $C_{1-10}$  アルケノイル、 $C_{6-12}$  アリール、N, S および O から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有する  $C_{3-12}$  ヘテロアリール、 $C_{7-24}$  アラルキル、 $C_{7-24}$  アルカリール、置換  $C_{1-10}$  アルキル、置換  $C_{1-10}$  アルコキシ、置換  $C_{6-14}$  アリール、N, S および O から選ばれたヘテロ原子 0 ~ 3 を有する置換  $C_{3-10}$  シクロアルキル、S, N および O から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有する置換  $C_{3-12}$  ヘテロアリール、置換  $C_{7-24}$  アルカリール、または置換  $C_{7-24}$  アラルキルであり、 $R_z$  が置換されている場合それはペルハ口までのハ口ゲン、ヒドロキシ、 $C_{1-10}$  アルキル、O, S および N から選ばれたヘテロ原子 0 ~ 3 を有する  $C_{3-12}$  シクロアルキル、N, S および O から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有するヘテロアリール、 $C_{1-10}$  アルコキシ、置換  $C_{6-14}$  アリール、ペルハ口アルキルまでの  $C_{1-10}$  ハ口置換アルキル、ペルハ口アリールまでの  $C_{6-12}$  ハ口置換アリール、N, S および O から選ばれたヘテロ原子 0 ~ 3 を有するペルハ口シクロアルキルまでの  $C_{3-12}$  ハ口置換シクロアルキル、O, N および S から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有するペルハ口ヘテロアリールまでの  $C_{3-12}$  ハ口置換ヘテロアリール、ペルハ口アラルキルまでのハ口置換  $C_{7-24}$  アラルキル、ペルハ口アルカリールまでのハ口置換  $C_{7-24}$  アルカリール、および  $-C(O)R_g$  によって置換されており；

$R_a$  および  $R_b$  は、

a) 独立に水素、 $C_{1-10}$  アルキル、 $C_{1-10}$  アルコキシ、 $C_{3-10}$  シクロアルキル、 $C_{2-10}$  アルケニル、 $C_{6-12}$  アリール、O, N および S から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有する  $C_{3-12}$  ヘテロアリール、N, S および O から選ばれたヘテロ原子 0 ~ 3 を有する  $C_{3-12}$  シクロアルキル、 $C_{7-24}$  アラルキル、 $C_{7-24}$  アルカリール、置換  $C_{1-10}$  アルキル、置換  $C_{1-10}$  アルコキシ、N, S および O から選ばれたヘテロ原子 0 ~ 3 を有する置換  $C_{3-10}$  シクロアルキル、置換  $C_{6-12}$  アリール、N, S および O から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有する置換  $C_{3-12}$  ヘテロアリール、置換  $C_{7-24}$  アラルキル、置換  $C_{7-24}$  アルカリールであって、 $R_a$  および  $R_b$  が置換された基である場合はそれらはペルハ口までのハ口ゲン、ヒドロキシ、 $C_{1-10}$  アルキル、O, S および N から選ばれたヘテロ原子 0 ~ 3 を有する  $C_{3-12}$  シクロアルキル、N, S および O から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有する  $C_{3-12}$  ヘテロアリール、 $C_{1-10}$  アルコキシ、 $C_{6-12}$  アリール、ペルハ口アルキルまでの  $C_{1-6}$  ハ口置換アルキル、ペルハ口アリールまでの  $C_{6-12}$  ハ口置換アリール、ペルハ口シクロアルキルまでの N, S および O から選ばれたヘテロ原子 0 ~ 3 を有する  $C_{3-12}$  ハ口置換シクロアルキル、ペルハ口ヘテロアリールまでの N, S および O から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有する  $C_{3-12}$  ハ口置換ヘテロアリール、ペルハ口アラルキルまでのハ口置換  $C_{7-24}$  アラルキル、ペルハ口アルカリールまでのハ口置換  $C_{7-24}$  アルカリール、および  $-C(O)R_g$  か、または  $-OSi(R_f)_3$  によって置換されており、

ここで  $R_f$  は水素、 $C_{1-10}$  アルキル、 $C_{1-10}$  アルコキシ、O, S および N から選ばれたヘテロ原子 0 ~ 3 を有する  $C_{3-10}$  シクロアルキル、 $C_{6-12}$  アリール、O, S および N から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有する  $C_{3-12}$  ヘテロアリール、 $C_{7-24}$  アラルキル、置換  $C_{1-10}$  アルキル、置換  $C_{1-10}$  アルコキシ、O, S および N から選ばれたヘテロ原子 0 ~ 3 を有する置換  $C_{3-12}$  ヘテロアリール、置換  $C_{6-12}$  アリール、および置換  $C_{7-24}$  アルカリールであり、 $R_f$  が置換されている基である場合はそれはペルハ口までのハ口ゲン、ヒドロキシ、 $C_{1-10}$  アルキル、O, S および N から選ばれたヘテロ原子 0 ~ 3 を有する  $C_{3-12}$  シクロアルキル、O, S および N から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有する  $C_{3-12}$  ヘテロアリール

、 $C_{1-10}$  アルコキシ、 $C_{6-12}$  アリール、 $C_{7-24}$  アルカリール、 $C_{7-24}$  アラルキル、ペルハロアルキルまでの $C_{1-6}$  ハロ置換アルキル、ペルハロアリールまでの $C_{6-12}$  ハロ置換アリール、ペルハロシクロアルキルまでの $N$ 、 $S$ および $O$ から選ばれたヘテロ原子 $0 \sim 3$ を有する $C_{3-12}$  ハロ置換シクロアルキル、ペルハロヘテロアリールまでの $N$ 、 $S$ および $O$ から選ばれたヘテロ原子 $1 \sim 3$ を有する $C_{3-12}$  ハロ置換ヘテロアリール、ペルハロアラルキルまでのハロ置換 $C_{7-24}$  アラルキル、ペルハロアルカリールまでのハロ置換 $C_{7-24}$  アルカリールおよび $-C(O)R_g$  で置換されており；または

b)  $R_a$  および  $R_b$  は一所で $N$ 、 $S$ および $O$ から選ばれたヘテロ原子 $1 \sim 3$ を有する5ないし7員複素環構造を形成するか、またはペルハロまでのハロゲン、ヒドロキシ、 $C_{1-10}$  アルキル、 $O$ 、 $S$ および $N$ から選ばれたヘテロ原子 $0 \sim 3$ を有する $C_{3-12}$  シクロアルキル、 $N$ 、 $S$ および $O$ から選ばれたヘテロ原子 $1 \sim 3$ を有する $C_{3-12}$  ヘテロアリール、 $C_{1-10}$  アルコキシ、 $C_{6-12}$  アリール、 $C_{7-24}$  アルカリール、 $C_{7-24}$  アラルキル、ペルハロアルキルまでのハロ置換 $C_{1-6}$  アルキル、ペルハロアリールまでのハロ置換 $C_{6-12}$  アリール、ペルハロシクロアルキルまでの $N$ 、 $S$ および $O$ から選ばれたヘテロ原子 $0 \sim 3$ を有する $C_{3-12}$  シクロアルキル、ペルハロヘテロアリールまでの $N$ 、 $S$ および $O$ から選ばれたヘテロ原子 $1 \sim 3$ を有するハロ置換 $C_{3-12}$  ヘテロアリール、ペルハロアラルキルまでのハロ置換 $C_{7-24}$  アラルキル、ペルハロアルカリールまでのハロ置換 $C_{7-24}$  アルカリールおよび $-C(O)R_g$  よりなる群から選ばれた置換基を有する $N$ 、 $S$ および $O$ から選ばれたヘテロ原子 $1 \sim 3$ を有する置換5ないし7員複素環構造を形成し、または

c)  $R_a$  または  $R_b$  の一つは少なくとも5員の環状構造を形成するように基 $L$ へ結合した $C_{1-5}$  2価アルキレン基または $C_{1-5}$  2価アルキレン基であって、置換 $C_{1-5}$  2価アルキレン基の置換基はハロゲン、ヒドロキシ、 $C_{1-10}$  アルキル、 $O$ 、 $S$ および $N$ から選ばれたヘテロ原子 $0 \sim 3$ を有する $C_{3-12}$  シクロアルキル、 $N$ 、 $S$ および $O$ から選ばれたヘテロ原子 $1 \sim 3$ を有する $C_{3-12}$  ヘテロアリール、 $C_{1-10}$  アルコキシ、 $C_{6-12}$  アリール、 $C_{7-24}$  アルカリール、 $C_{7-24}$  アラルキル、ペルハロアルキルまでの $C_{1-6}$  ハロ置換アルキル、ペルハロアリールまでの $C_{6-12}$  ハロ置換アリール、ペルハロシクロアルキルまでの $N$ 、 $S$ および $O$ から選ばれたヘテロ原子 $0 \sim 3$ を有する $C_{3-12}$  ハロ置換シクロアルキル、ペルハロヘテロアリールまでの $N$ 、 $S$ および $O$ から選ばれたヘテロ原子 $1 \sim 3$ を有する $C_{3-12}$  ハロ置換ヘテロアリール、ペルハロアラルキルまでのハロ置換 $C_{7-24}$  アラルキル、ペルハロアルカリールまでのハロ置換 $C_{7-24}$  アルカリールおよび $C(O)R_g$  よりなる群から選ばれ；

$R_g$  は $C_{1-10}$  アルキル、 $-CN$ 、 $-CO_2R_d$ 、 $-OR_d$ 、 $-SR_d$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(O)R_e$ 、 $-NR_dR_e$ 、 $-NR_dC(O)OR_e$ 、 $-NR_dC(O)OR_e$  および $-NR_dC(O)R_e$  であって、 $R_d$  および  $R_e$  は独立に水素、 $C_{1-10}$  アルキル、 $C_{1-10}$  アルコキシ、 $O$ 、 $N$ および $S$ から選ばれたヘテロ原子 $0 \sim 3$ を有する $C_{3-10}$  シクロアルキル、 $C_{6-12}$  アリール、 $O$ 、 $N$ および $S$ から選ばれたヘテロ原子 $1 \sim 3$ を有する $C_{3-12}$  ヘテロアリール、 $C_{7-24}$  アラルキル、 $C_{7-24}$  アルカリール、ペルハロ置換までの $C_{1-10}$  アルキル、 $O$ 、 $N$ および $S$ から選ばれたヘテロ原子 $0 \sim 3$ を有するペルハロ置換までの $C_{3-10}$  シクロアルキル、ペルハロ置換までの $C_{6-14}$  アリール、 $O$ 、 $N$ および $S$ から選ばれたヘテロ原子 $1 \sim 3$ を有するペルハロ置換までの $C_{3-12}$  ヘテロアリール、ペルハロ置換アルカリールまでのハロ置換 $C_{7-24}$  アルカリールおよびペルハロ置換までの $C_{7-24}$  アラルキルよりなる群から選ばれ；

$W$ は独立に $-CN$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-C(O)R^7R^7$ 、 $-C(O)R^7$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR^7$ 、 $-SR^7$ 、 $-NR^7R^7$ 、 $-NR^7C(O)OR^7$ 、 $-NR^7C(O)R^7$ 、 $C_{1-10}$  アルキル、 $C_{1-10}$  アルコキシ、 $C_{2-10}$  アルケニル、 $C_{1-10}$  アルケノイル、 $O$ 、 $S$ および $N$ から選ばれたヘテロ原子 $0 \sim 3$ を有する $C_{3-10}$  シクロアルキル、 $C_{6-14}$  アリール、 $C_{7-24}$  アルカリール、 $O$ 、 $S$ および $N$ から選ばれたヘテロ原子 $1 \sim 3$ を有する $C_{3-12}$  ヘテロアリール、 $O$ 、 $N$ および $S$ から選ばれたヘテロ原子 $1 \sim 3$ を有する $C_{4-23}$  アルキルヘテロアリール、置換 $C_{1-10}$  アルキル、置換 $C_{1-10}$  アルコキシ、置換 $C_{2-10}$  アルケニル、置換 $C_{1-10}$  アルケノイル、 $O$ 、 $N$ および $S$ から選ばれたヘテロ原子 $0 \sim 3$ を有する置換 $C_{3-10}$

シクロアルキル、置換  $C_{6-12}$  アリール、O, N および S から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有する置換  $C_{3-12}$  ヘテロアリール、置換  $C_{7-24}$  アラルキル、置換  $C_{7-24}$  アルカリール、O, N および S から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有する置換  $C_{4-23}$  アルキルヘテロアリールおよび - QAr よりなる群から選ばれ;

$R^7$  は独立に H,  $C_{1-10}$  アルキル、 $C_{1-10}$  アルコキシ、 $C_{2-10}$  アルケニル、 $C_{1-10}$  アルケノイル、O, N および S から選ばれたヘテロ原子 0 ~ 3 を有する  $C_{3-10}$  シクロアルキル、 $C_{6-14}$  アリール、O, N および S から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有する  $C_{3-13}$  ヘテロアリール、 $C_{7-14}$  アルカリール、 $C_{7-24}$  アラルキル、O, N および S から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有する  $C_{4-23}$  アルキルヘテロアリール、ペルハ口置換までの  $C_{1-10}$  アルキル、O, N および S から選ばれたヘテロ原子 0 ~ 3 を有するペルハ口置換までの  $C_{3-10}$  シクロアルキル、O, N および S から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有するペルハ口置換までの  $C_{3-13}$  ヘテロアリール、ペルハ口置換までの  $C_{6-14}$  アリール、ペルハ口置換までの  $C_{7-24}$  アラルキル、ペルハ口置換までの  $C_{7-24}$  アルカリールおよびペルハ口置換までの  $C_{4-23}$  アルキルヘテロアリールよりなる群から選ばれ;

各 Z は独立に - CN, - CO<sub>2</sub>  $R^7$ , - C(O)  $R^7$ , - C(O) NR<sup>7</sup>  $R^7$ , - NO<sub>2</sub>, - OR<sup>7</sup>, - SR<sup>7</sup>, - NR<sup>7</sup>  $R^7$ , NR<sup>7</sup> C(O) OR<sup>7</sup>, - NR<sup>7</sup> C(O)  $R^7$ ,  $C_{1-10}$  アルキル、 $C_{1-10}$  アルコキシ、 $C_{2-10}$  アルケニル、 $C_{1-10}$  アルケノイル、O, N および S から選ばれたヘテロ原子 0 ~ 3 を有する  $C_{3-10}$  シクロアルキル、 $C_{6-14}$  アリール、O, N および S から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有する  $C_{3-13}$  ヘテロアリール、 $C_{7-24}$  アルカリール、 $C_{7-24}$  アラルキル、O, N および S から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有する  $C_{4-23}$  アルキルヘテロアリール、置換  $C_{1-10}$  アルキル、置換  $C_{1-10}$  アルコキシ、置換  $C_{2-10}$  アルケニル、置換  $C_{1-10}$  アルケノイル、O, N および S から選ばれたヘテロ原子 0 ~ 3 を有する  $C_{3-10}$  シクロアルキル、置換  $C_{6-12}$  アリール、置換  $C_{7-24}$  アルカリール、置換  $C_{7-24}$  アラルキル、O, N および S から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 を有する置換  $C_{4-23}$  アルキルヘテロアリールよりなる群から選ばれ、もし Z が置換された基である場合は一以上の置換基は - CN, - CO<sub>2</sub>  $R^7$ , - COR<sup>7</sup>, - C(O) NR<sup>7</sup>  $R^7$ , - OR<sup>7</sup>, - SR<sup>7</sup>, - NO<sub>2</sub>, - NR<sup>7</sup>  $R^7$ , - NR<sup>7</sup> C(O) OR<sup>7</sup> および - NR<sup>7</sup> C(O) OR<sup>7</sup> よりなる群から選ばれ、前記化合物。

【請求項 3】

M は - O -, - S -, - N( $R^7$ ) -, - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> -, - C(O) -, - CH(OH) -, - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> O -, - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> S -, - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> N( $R^7$ ) -, - O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> -, - CHX<sup>a</sup> -, - CX<sup>a</sup><sub>2</sub> -, - S(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - および - N( $R^7$ )(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - からなる群から選ばれた一以上のブリッジ基であり、m は 1 ~ 3, X<sup>a</sup> はハロゲン、 $R^7$  前記定義のとおりである請求項 1 の化合物。

【請求項 4】

D へ直結した環状構造 B および L はオルト位置が - OH によって置換されていない請求項 1 の化合物。

【請求項 5】

D へ直結した環状構造 B および L はオルト位置がイオン化し得る水素および 10 以下の pK<sub>a</sub> を有する基によって置換されていない請求項 1 の化合物。

【請求項 6】

式 I の B は、置換または未置換の 6 員アリール基または 6 員ヘテロアリール基であり、前記ヘテロアリール基は窒素、酸素およびイオンからなる群から選ばれた 1 ~ 4 員を有し、ヘテロアリール基の残余は炭素である請求項 1 の化合物。

【請求項 7】

式 I の B は、未置換フェニル基、未置換ピリジル基、未置換ピリミジニル基、ハロゲンおよび W<sub>n</sub> (W および n は請求項 1 の定義に同じ) よりなる群から選ばれた置換基で置換されたフェニル基、ハロゲンおよび W<sub>n</sub> (W および n は請求項 1 の定義に同じ) よりなる群から選ばれた置換基で置換されたピリミジニル基、またはハロゲンおよび W<sub>n</sub> (W および n は請求項 1 の定義に同じ) よりなる群から選ばれた置換により置換されたピリジル基

である請求項 1 の化合物。

【請求項 8】

式 I の B は、置換フェニル基、置換ピリミジニル基または置換ピリジル基であって、これらは -CN, ハロゲン、 $C_{1-10}$  アルキル、 $C_{1-10}$  アルコキシ、-OH, ペルハロまで置換された  $C_{1-10}$  アルキル、ペルハロまで置換された  $C_{1-10}$  アルコキシ、およびペルハロまでハロゲンで置換されたフェニル基よりなる一以上の置換基によって 1 ~ 3 回置換されている請求項 1 の化合物。

【請求項 9】

D へ直結した 6 員環構造 L は、置換もしくは未置換の 6 員環アリールまたは置換もしくは未置換の 6 員環ヘテロアリールであって、前記ヘテロアリールは窒素、酸素およびイオウから選ばれたヘテロ原子 1 ~ 4 員と残余の炭素原子を有し、置換はハロゲンおよび  $W_n$  (W および n は請求項 1 の定義に同じ) からなる群から選ばれた一以上の置換基である請求項 1 の化合物。

【請求項 10】

D へ直結した 6 員環構造 L は、置換フェニル、未置換フェニル、置換ピリミジニル、未置換ピリミジニル、置換ピリジルまたは未置換ピリジルである請求項 8 の化合物。

【請求項 11】

前記置換環状基  $L^1$  は 5 または 6 員環のアリール基またはヘテロアリール基を含み、前記ヘテロアリール基は窒素、酸素およびイオウからなるヘテロ原子の群から選ばれた 1 ないし 4 員を含んでいる請求項 1 の化合物。

【請求項 12】

前記置換環状基  $L^1$  はフェニル、ピリジニルまたはピリミジニルである請求項 1 の化合物。

【請求項 13】

前記置換環状基  $L^1$  はフェニル、ピリジニルまたはピリミジニルである請求項 3 の化合物。

【請求項 14】

前記置換環状基  $L^1$  はフェニル、ピリジニルまたはピリミジニルである請求項 6 の化合物。

【請求項 15】

前記置換環状基  $L^1$  はフェニル、ピリジニルまたはピリミジニルである請求項 8 の化合物。

【請求項 16】

前記置換環状基  $L^1$  はフェニル、ピリジニルまたはピリミジニルである請求項 9 の化合物。

【請求項 17】

前記置換環状基  $L^1$  はフェニル、ピリジニルまたはピリミジニルである請求項 10 の化合物。

【請求項 18】

M は、-O-, -S-, -N( $R^7$ )-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-, -C(O)-, -CH(OH)-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>O-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>S-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N( $R^7$ )-, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-, -CHX<sup>a</sup>-, -CX<sup>a</sup><sub>2</sub>-, -S(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>- および -N( $R^7$ )(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>- からなる群から選ばれた一以上のブリッジ基であり、ここで m は 1 ~ 3, X<sup>a</sup> はハロゲン、 $R^7$  は水素または任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含むしそして任意にペルハロまでハロゲンで置換された炭素原子 24 までの炭素系基である請求項 14 の化合物。

【請求項 19】

M は、-O-, -S-, -N( $R^7$ )-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-, -C(O)-, -CH(OH)-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>O-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>S-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N( $R^7$ )-, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-, -CHX<sup>a</sup>-, -CX<sup>a</sup><sub>2</sub>-, -S(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>- および -N( $R^7$

) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - からなる群から選ばれた一以上のブリッジ基であり、ここで m は 1 ~ 3, X<sup>a</sup> はハロゲン、R<sup>7</sup> は水素または任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含むしそして任意にペルハロまでハロゲンで置換された炭素原子 24 までの炭素系基である請求項 15 の化合物。

【請求項 20】

M は、- O - , - S - , - N (R<sup>7</sup>) - , - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - , - C (O) - , - CH (OH) - , - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> O - , - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> S - , - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> N (R<sup>7</sup>) - , - O (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - , - CHX<sup>a</sup> - , - CX<sup>a</sup><sub>2</sub> - , - S (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - および - N (R<sup>7</sup>) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - からなる群から選ばれた一以上のブリッジ基であり、ここで m は 1 ~ 3, X<sup>a</sup> はハロゲン、R<sup>7</sup> は水素または任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含むしそして任意にペルハロまでハロゲンで置換された炭素原子 24 までの炭素系基である請求項 16 の化合物。

【請求項 21】

M は、- O - , - S - , - N (R<sup>7</sup>) - , - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - , - C (O) - , - CH (OH) - , - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> O - , - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> S - , - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> N (R<sup>7</sup>) - , - O (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - , - CHX<sup>a</sup> - , - CX<sup>a</sup><sub>2</sub> - , - S (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - および - N (R<sup>7</sup>) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - からなる群から選ばれた一以上のブリッジ基であり、ここで m は 1 ~ 3, X<sup>a</sup> はハロゲン、R<sup>7</sup> は水素または任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含むしそして任意にペルハロまでハロゲンで置換された炭素原子 24 までの炭素系基である請求項 17 の化合物。

【請求項 22】

L<sup>1</sup> は、C<sub>1-10</sub> アルキル、ペルハロ置換までの C<sub>1-10</sub> アルキル、- CN, - OH, ハロゲン、C<sub>1-10</sub> アルコキシおよびペルハロ置換までの C<sub>1-10</sub> アルコキシよりなる群から選ばれた一以上の置換基によって付加的に 1 ないし 3 回置換されている請求項 1 の化合物。

【請求項 23】

L<sup>1</sup> は、C<sub>1-10</sub> アルキル、ペルハロ置換までの C<sub>1-10</sub> アルキル、- CN, - OH, ハロゲン、C<sub>1-10</sub> アルコキシおよびペルハロ置換までの C<sub>1-10</sub> アルコキシよりなる群から選ばれた一以上の置換基によって付加的に 1 ないし 3 回置換されている請求項 13 の化合物。

【請求項 24】

L<sup>1</sup> は、C<sub>1-10</sub> アルキル、ペルハロ置換までの C<sub>1-10</sub> アルキル、- CN, - OH, ハロゲン、C<sub>1-10</sub> アルコキシおよびペルハロ置換までの C<sub>1-10</sub> アルコキシよりなる群から選ばれた一以上の置換基によって付加的に 1 ないし 3 回置換されている請求項 18 の化合物。

【請求項 25】

L<sup>1</sup> は、C<sub>1-10</sub> アルキル、ペルハロ置換までの C<sub>1-10</sub> アルキル、- CN, - OH, ハロゲン、C<sub>1-10</sub> アルコキシおよびペルハロ置換までの C<sub>1-10</sub> アルコキシよりなる群から選ばれた一以上の置換基によって付加的に 1 ないし 3 回置換されている請求項 19 の化合物。

【請求項 26】

L<sup>1</sup> は、C<sub>1-10</sub> アルキル、ペルハロ置換までの C<sub>1-10</sub> アルキル、- CN, - OH, ハロゲン、C<sub>1-10</sub> アルコキシおよびペルハロ置換までの C<sub>1-10</sub> アルコキシよりなる群から選ばれた一以上の置換基によって付加的に 1 ないし 3 回置換されている請求項 20 の化合物。

【請求項 27】

L<sup>1</sup> は、C<sub>1-10</sub> アルキル、ペルハロ置換までの C<sub>1-10</sub> アルキル、- CN, - OH, ハロゲン、C<sub>1-10</sub> アルコキシおよびペルハロ置換までの C<sub>1-10</sub> アルコキシよりなる群から選ばれた一以上の置換基によって付加的に 1 ないし 3 回置換されている請求項 21 の化合物。

【請求項 28】

L<sup>1</sup> は - C (O) R<sub>x</sub> によって置換されている請求項 1 の化合物。

【請求項 29】

L<sup>1</sup> は - SO<sub>2</sub> R<sub>x</sub> によって置換されている請求項 1 の化合物。

【請求項 30】

L<sup>1</sup> は - C (O) R<sub>x</sub> のみによって置換されている請求項 1 の化合物。



## 【請求項 3 1】

$L^1$  は  $-SO_2 R_x$  のみによって置換されている請求項 1 の化合物。

## 【請求項 3 2】

$L^1$  は  $-C(O)R_x$  または  $-SO_2 R_x$  によって置換され、ここで  $R_x$  は  $NR_a R_b$  である請求項 1 の化合物。

## 【請求項 3 3】

$L^1$  は  $-C(O)R_x$  または  $-SO_2 R_x$  によって置換され、ここに  $R_x$  は  $NR_a R_b$  であり、 $R_a$  とよび  $R_b$  は、

a) 独立に水素か、任意にハロゲン、ヒドロキシおよび任意に  $N$ ,  $S$  および  $O$  から選ばれたヘテロ原子を含有しそしてハロゲンまたは  $-OSi(R_f)_3$  で置換された炭素原子 2 4 までの炭素系置換基で置換された任意に  $N$ ,  $S$  および  $O$  から選ばれたヘテロ原子を含有する炭素原子 3 0 までの炭素系基であり、ここで  $R_f$  は水素か、または任意にハロゲン、ヒドロキシおよび任意に  $N$ ,  $S$  および  $O$  から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンで置換された炭素原子 2 4 までの炭素系置換基で置換された  $N$ ,  $S$  および  $O$  から選ばれたヘテロ原子を含有する炭素数 2 4 までの炭素系基であり；または

b)  $R_a$  および  $R_b$  は一所で  $N$ ,  $S$  および  $O$  から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 の 5 ~ 7 員複素環構造か、またはハロゲン、ヒドロキシもしくは任意に  $N$ ,  $S$  および  $O$  から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンで置換された炭素原子 2 4 までの炭素系置換基で置換された  $N$ ,  $S$  および  $O$  から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 の 5 ~ 7 員複素環構造であり、または

c)  $R_a$  または  $R_b$  の一つは少なくとも 5 員の環構造を形成するように、基  $L$  へ結合した  $-C(O)-C_{1-5}$  二価アルキレン基または置換  $C_{1-5}$  二価アルキレン基であり、ここで置換  $C_{1-5}$  二価アルキレン基の置換基はハロゲン、ヒドロキシ、および任意に  $N$ ,  $S$  および  $O$  から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンによって置換された炭素原子 2 3 までの炭素系置換基よりなる群から選ばれた請求項 1 3 の化合物。

## 【請求項 3 4】

$L^1$  は  $-C(O)R_x$  または  $-SO_2 R_x$  によって置換され、ここに  $R_x$  は  $NR_a R_b$  であり、 $R_a$  および  $R_b$  は独立に水素か、または任意にハロゲン、ヒドロキシおよび任意に  $N$ ,  $S$  および  $O$  から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンによって置換された炭素原子 2 4 までの炭素系基置換基によって置換された任意に  $N$ ,  $S$  および  $O$  から選ばれたヘテロ原子を含有する炭素原子 3 0 までの炭素系基である請求項 1 8 の化合物。

## 【請求項 3 5】

$L^1$  は  $-C(O)R_x$  または  $-SO_2 R_x$  によって置換され、ここに  $R_x$  は  $NR_a R_b$  であり、 $R_a$  および  $R_b$  は独立に水素か、または任意にハロゲン、ヒドロキシおよび任意に  $N$ ,  $S$  および  $O$  から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンによって置換された炭素原子 2 4 までの炭素系基置換基によって置換された任意に  $N$ ,  $S$  および  $O$  から選ばれたヘテロ原子を含有する炭素原子 3 0 までの炭素系基である請求項 1 9 の化合物。

## 【請求項 3 6】

$L^1$  は  $-C(O)R_x$  または  $-SO_2 R_x$  によって置換され、ここに  $R_x$  は  $NR_a R_b$  であり、 $R_a$  および  $R_b$  は独立に水素か、または任意にハロゲン、ヒドロキシおよび任意に  $N$ ,  $S$  および  $O$  から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンによって置換された炭素原子 2 4 までの炭素系基置換基によって置換された任意に  $N$ ,  $S$  および  $O$  から選ばれたヘテロ原子を含有する炭素原子 3 0 までの炭素系基である請求項 2 0 の化合物。

## 【請求項 3 7】

$L^1$  は  $-C(O)R_x$  または  $-SO_2 R_x$  によって置換され、ここに  $R_x$  は  $NR_a R_b$  であり、 $R_a$  および  $R_b$  は独立に水素か、または任意にハロゲン、ヒドロキシおよび任意に  $N$ ,  $S$  および  $O$  から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンによって置換された炭素原子 2 4 までの炭素系基置換基によって置換された任意に  $N$ ,  $S$  および  $O$  から選ばれたヘテロ原子を含有する炭素原子 3 0 までの炭素系基である請求項 2 1 の化合物。

## 【請求項 3 8】

下記式 I の化合物またはその薬学的に許容し得る塩：



式 I において、

D は  $-NH-C(O)-NH-$  であり；

A は式  $-L-(M-L^1)_q$  の炭素原子 40 までの置換分であって、ここで L は D へ直接結合した 6 員アリール基または 6 員ヘテロアリール基であり、 $L^1$  は少なくとも 5 員の置換環状基を含み、M は少なくとも 1 原子を有するブリッジ基であり、q は 1 ~ 3 の整数である。そして L および  $L^1$  の各環状構造は窒素、酸素およびイオウよりなる群の 0 ~ 4 員を含有し；

B は置換もしくは未置換の三環までのアリール、または窒素、酸素およびイオウよりなる群の 0 ~ 4 員を含有する D へ直結した少なくとも 6 員環状構造を有する炭素原子 30 までのヘテロアリール基であり；

ここで  $L^1$  は  $-SO_2R_x$ 、 $-C(O)R_x$  および  $-C(NR_y)R_z$  よりなる群から選ばれた少なくとも一つの置換基によって置換されており；

$R_y$  は水素か、または任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にペルハロまでハロゲン置換された炭素原子 24 までの炭素系基であり；

$R_z$  は水素か、または任意にハロゲン、ヒドロキシ、および任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にペルハロまでハロゲンで置換された炭素原子 24 までの炭素系置換基で置換された任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有する炭素原子 30 までの炭素系基であり；

$R_x$  は  $R_z$  であるか、または  $NR_aR_b$  であり、ここで  $R_a$  および  $R_b$  は、

a) 独立に、水素か、または任意にハロゲン、ヒドロキシ、および任意に N, S, O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンまたは  $-OSi(R_f)_3$  で置換された炭素原子 24 までの炭素系置換基で置換された任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有する炭素原子 30 までの炭素系基であり、ここで  $R_f$  は水素か、または任意にハロゲン、ヒドロキシおよび任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンで置換された炭素原子 24 までの炭素系置換基で置換された任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有する炭素原子 24 までの炭素系基であり、あるいは

b)  $R_a$  および  $R_b$  は一所で N, S および O から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 の 5 ないし 7 員複素環を形成するか、またはハロゲン、ヒドロキシもしくは任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンで置換された炭素原子 24 までの炭素系置換基で置換された N, S および O から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 の置換 5 ないし 7 員複素環を形成し、あるいは

c)  $R_a$  および  $R_b$  の一つは少なくとも 5 員の環状構造を形成するように基 L へ結合した  $-C(O)-$ 、 $C_1-C_5$  2 価アルキレンまたは置換  $C_1-C_5$  2 価アルキレンであって、置換  $C_1-C_5$  2 価アルキレンの置換基はハロゲン、ヒドロキシおよび任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンで置換された炭素原子 24 までの炭素系置換基からなる群から選ばれ；

B が置換されている場合、L が置換されているかまたは  $L^1$  が追加的に置換されており、その置換基はペルハロまでのハロゲンおよび  $W_n$  (n は 1 ~ 3) よりなる群から選ばれ、

この場合めいめいの W は独立に  $-CN$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-C(O)NR^7R^7$ 、 $-C(O)R^7$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR^7$ 、 $-SR^7$ 、 $-NR^7R^7$ 、 $-NR^7C(O)OR^7$ 、 $-NR^7C(O)R^7$ 、 $-Q-Ar$ 、および任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして  $-CN$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-C(O)R^7$ 、 $-C(O)NR^7R^7$ 、 $-OR^7$ 、 $-SR^7$ 、 $-NR^7R^7$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR^7C(O)R^7$ 、 $-NR^7C(O)OR^7$  およびペルハロまでのハロゲンよりなる群から選ばれた 1 以上の置換基で任意に置換された炭素原子 24 までの炭素系基よりなる群から独立に選ばれ、ここで各  $R^7$  は H または任意に N, S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンで置換され

た炭素原子 2 4 までの炭素系基から独立に選ばれ、

ここで Q は - O - , - S - , - N ( R<sup>7</sup> ) - , - ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> - , - C ( O ) - , - C H ( O H ) - , - ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> O - , - ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> S - , - ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> N ( R<sup>7</sup> ) - , - O ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> - , C H X<sup>a</sup> - , C X<sup>a</sup><sub>2</sub> - , - S ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> - , または - N ( R<sup>7</sup> ) ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> - であり、( m は 1 ~ 3 および X<sup>a</sup> はハロゲンである ) ; そして

A r は窒素、酸素およびイオウよりなる群から選ばれたヘテロ原子 0 ~ 2 を含有し、そして任意にペルハロまでハロゲンで置換され、そして任意に Z<sub>n1</sub> によって置換された 5 もしくは 6 員芳香族構造であって、ここで n 1 は 0 ないし 3 であり、各 Z は - C N , - C O<sub>2</sub> R<sup>7</sup> , - C ( O ) R<sup>7</sup> , - C ( O ) N R<sup>7</sup> R<sup>7</sup> , - N O<sub>2</sub> , - O R<sup>7</sup> , - N R<sup>7</sup> R<sup>7</sup> , - N R<sup>7</sup> C ( O ) O R<sup>7</sup> , - N R<sup>7</sup> C ( O ) R<sup>7</sup> および任意に N , S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意に - C N , - C O<sub>2</sub> R<sup>7</sup> , - C ( O ) R<sup>7</sup> , - C ( O ) N R<sup>7</sup> R<sup>7</sup> , - O R<sup>7</sup> , - S R<sup>7</sup> , - N O<sub>2</sub> , - N R<sup>7</sup> R<sup>7</sup> , - N R<sup>7</sup> C ( O ) R<sup>7</sup> および - N R<sup>7</sup> C ( O ) O R<sup>7</sup> よりなる群から選ばれた 1 以上の置換基で置換された炭素原子 2 4 までの炭素系基よりなる群から独立に選ばれ、R<sup>7</sup> は上記定義のとおりであり、

ここで M は - O - , - S - , - N ( R<sup>7</sup> ) - , - ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> - , - C ( O ) - , - C H ( O H ) - , - ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> O - , - ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> S - , - ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> N ( R<sup>7</sup> ) - , - O ( C H<sub>2</sub> ) - , - C H X<sup>a</sup> - , - C X<sup>a</sup> - , - S ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> - および - N ( R<sup>7</sup> ) ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> - よりなる群から選ばれた 1 以上のブリッジ基であり、ここで m = 1 ~ 3 , X<sup>a</sup> はハロゲンである。

#### 【請求項 39】

下記式 I の化合物またはその薬学的に許容し得る塩：



式 I において、

D は - N H - C ( O ) - N H - であり；

A は式 - L - ( M - L<sup>1</sup> )<sub>q</sub> の炭素数 4 0 までの置換分であって、ここで L は D へ直接結合した置換もしくは未置換のフェニル基またはペリトニアル基であり、L<sup>1</sup> は置換フェニル、プリトニル、またはピリミジニルを含み、M は少なくとも 1 原子を有するブリッジ基であり、q は 1 ~ 3 の整数であり；

B は D へ直結した置換もしくは未置換のフェニルまたはピリジニル基であり；

ここで L<sup>1</sup> は - S O<sub>2</sub> R<sub>x</sub> , - C ( O ) R<sub>x</sub> および - C ( N R<sub>y</sub> ) R<sub>z</sub> よりなる群から選ばれた少なくとも一つの置換基によって置換されており；

R<sub>y</sub> は水素か、または任意に N , S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にペルハロまでハロゲン置換された炭素原子 2 4 までの炭素系基であり；

R<sub>z</sub> は水素か、または任意にハロゲン、ヒドロキシ、および任意に N , S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にペルハロまでハロゲンで置換された炭素原子 2 4 までの炭素系置換基で置換された任意に N , S および O から選ばれた炭素原子 3 0 までの炭素系基であり；

R<sub>x</sub> は R<sub>z</sub> であるか、または N R<sub>a</sub> R<sub>b</sub> であり、ここで R<sub>a</sub> および R<sub>b</sub> は、

a ) 独立に、水素か、または任意にハロゲン、ヒドロキシ、および任意に N , S , O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンまたは - O S i ( R<sub>f</sub> )<sub>3</sub> で置換された炭素原子 2 4 までの炭素系置換基で置換された任意に N , S および O から選ばれたヘテロ原子を含有する炭素原子 3 0 までの炭素系基であり、ここで R<sub>f</sub> は水素か、または任意にハロゲン、ヒドロキシおよび任意に N , S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンで置換された炭素原子 2 4 までの炭素系置換基で置換された任意に N , S および O から選ばれたヘテロ原子を含有する炭素原子 2 4 までの炭素系基であり、あるいは

b ) R<sub>a</sub> および R<sub>b</sub> は一所で N , S および O から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 の 5 ないし 7 員複素環を形成するか、またはハロゲン、ヒドロキシもしくは任意に N , S および O から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンで置換された炭素原子 2 4 までの炭素系置換基で置換された N , S および O から選ばれたヘテロ原子 1 ~ 3 の置換 5 ないし 7

員複素環を形成し、あるいは

c)  $R_a$  および  $R_b$  の一つは少なくとも5員の環状構造を形成するように基Lへ結合した  $-C(O)-$ 、 $C_1 - C_5$  2価アルキレンまたは置換  $C_1 - C_5$  2価アルキレンであって、置換  $C_1 - C_5$  2価アルキレンの置換基はハロゲン、ヒドロキシおよび任意にN、SおよびOから選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンで置換された炭素原子24までの炭素系置換基からなる群から選ばれ；

Bが置換されている場合、Lが置換されているかまたは  $L^1$  が追加的に置換されており、その置換基はペルハロまでのハロゲンおよび  $W_n$  ( $n$  は  $1 \sim 0$ ) よりなる群から選ばれ、

この場合めいめいのWは独立に  $-CN$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-C(O)NR^7R^7$ 、 $-C(O)R^7$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR^7$ 、 $-SR^7$ 、 $-NR^7R^7$ 、 $-NR^7C(O)OR^7$ 、 $-NR^7C(O)R^7$ 、 $-Q-Ar$ 、および任意にN、SおよびOから選ばれたヘテロ原子を含有しそして  $-CN$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-C(O)R^7$ 、 $-C(O)NR^7R^7$ 、 $-OR^7$ 、 $-SR^7$ 、 $-NR^7R^7$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR^7C(O)R^7$ 、 $-NR^7C(O)OR^7$  およびペルハロまでのハロゲンよりなる群から選ばれた1以上の置換基で任意に置換された炭素原子24までの炭素系基よりなる群から独立に選ばれ、ここで各  $R^7$  はHまたは任意にN、SおよびOから選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンで置換された炭素原子24までの炭素系基から独立に選ばれ、

ここでQは  $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-N(R^7)-$ 、 $-(CH_2)_m-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CH(OH)-$ 、 $-(CH_2)_mO-$ 、 $-(CH_2)_mS-$ 、 $-(CH_2)_mN(R^7)-$ 、 $-O(CH_2)_m-$ 、 $CHX^a-$ 、 $-CX^a_2-$ 、 $-S(CH_2)_m-$ 、または  $-N(R^7)(CH_2)_m-$  であり、( $m$  は  $1 \sim 3$  および  $X^a$  はハロゲンである)；そして

Arは窒素、酸素およびイオウよりなる群から選ばれたヘテロ原子0~2を含有し、そして任意にペルハロまでハロゲンで置換され、そして任意に  $Z_{n1}$  によって置換された5もしくは6員芳香族構造であって、ここで  $n1$  は0ないし3であり、各Zは  $-CN$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-C(O)R^7$ 、 $-C(O)NR^7R^7$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR^7$ 、 $-NR^7R^7$ 、 $-NR^7C(O)OR^7$ 、 $-NR^7C(O)R^7$  および任意にN、SおよびOから選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意に  $-CN$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-C(O)R^7$ 、 $-C(O)NR^7R^7$ 、 $-OR^7$ 、 $-SR^7$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR^7R^7$ 、 $-NR^7C(O)R^7$  および  $-NR^7C(O)OR^7$  よりなる群から選ばれた1以上の置換基で置換された炭素原子24までの炭素系基よりなる群から独立に選ばれ、 $R^7$  は上記定義のとおりであり；

ここでMは  $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-N(R^7)-$ 、 $-(CH_2)_m-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CH(OH)-$ 、 $-(CH_2)_mO-$ 、 $-(CH_2)_mS-$ 、 $-(CH_2)_mN(R^7)-$ 、 $-O(CH_2)_m-$ 、 $-CHX^a-$ 、 $-CX^a_2-$ 、 $-S(CH_2)_m-$  および  $-N(R^7)(CH_2)_m-$  よりなる群から選ばれた1以上のブリッジ基であり、ここで  $m = 1 \sim 3$ 、 $X^a$  はハロゲンである。

#### 【請求項40】

Dへ直結する環構造BおよびLはそのオルト位置が  $-OH$  によって置換されていない請求項38の化合物。

#### 【請求項41】

Dへ直結する環構造BおよびLはそのオルト位置がイオン化可能な水素および10以下の  $pK_a$  を有する基によって置換されていない請求項38の化合物。

#### 【請求項42】

Dへ直結する環構造BおよびLはそのオルト位置が  $-OH$  によって置換されていない請求項39の化合物。

#### 【請求項43】

Dへ直結する環構造BおよびLはそのオルト位置がイオン化可能な水素および10以下の  $pK_a$  を有する基によって置換されていない請求項39の化合物。

#### 【請求項44】

BおよびLのための置換基および  $L^1$  のための追加的置換基は、 $C_{1-10}$  アルキル、ペル

八口までの置換  $C_{1-10}$  アルキル、 $CN$ 、 $OH$ 、ハロゲン、 $C_{1-10}$  アルコキシおよびペルハ口までの置換  $C_{1-10}$  アルコキシよりなる群から選ばれる請求項 38 の化合物。

【請求項 45】

B および L のための置換基および  $L^1$  のための追加的置換基は、 $C_{1-10}$  アルキル、ペルハ口までの置換  $C_{1-10}$  アルキル、 $CN$ 、 $OH$ 、ハロゲン、 $C_{1-10}$  アルコキシおよびペルハ口までの置換  $C_{1-10}$  アルコキシよりなる群から選ばれる請求項 39 の化合物。

【請求項 46】

$L^1$  は  $C(O)R_x$  または  $SO_2R_x$  によって置換されている請求項 38 の化合物。

【請求項 47】

$L^1$  は  $C(O)R_x$  または  $SO_2R_x$  によって置換されている請求項 39 の化合物。

【請求項 48】

$R_x$  は  $NR_aR_b$  であり、そして  $R_a$  および  $R_b$  は独立に水素か、またはハロゲン、ヒドロキシ、および任意に  $N$ 、 $S$  および  $O$  から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンで置換された炭素原子 24 までの炭素系置換基によって置換された任意に  $N$ 、 $S$  および  $O$  から選ばれた炭素原子 30 までの炭素系基である請求項 46 の化合物。

【請求項 49】

$R_x$  は  $NR_aR_b$  であり、そして  $R_a$  および  $R_b$  は独立に水素か、またはハロゲン、ヒドロキシ、および任意に  $N$ 、 $S$  および  $O$  から選ばれたヘテロ原子を含有しそして任意にハロゲンで置換された炭素原子 24 までの炭素系置換基によって置換された任意に  $N$ 、 $S$  および  $O$  から選ばれた炭素原子 30 までの炭素系基である請求項 47 の化合物。

【請求項 50】

a) 塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸、メタンスルホン酸、トリフルオロスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸(トシル酸)、1-ナフタレンスルホン酸、2-ナフタレンスルホン酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、リンゴ酸、酒石酸、クエン酸、乳酸、シュウ酸、コハク酸、フマル酸、マレイン酸、安息香酸、サリチル酸、フェニル酢酸、およびマンデル酸からなる群から選ばれた無機酸および有機酸の塩基塩、および

b) アルカリカチオン、アルカリ土類カチオン、アンモニウムカチオン、脂肪族置換アンモニウムカチオンおよび芳香族置換アンモニウムカチオンよりなる群から選ばれた無機および有機塩基の酸塩、よりなる群から選ばれた式 I の化合物の薬学的に許容し得る塩である請求項 1 の化合物。

【請求項 51】

a) 塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸、メタンスルホン酸、トリフルオロスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸(トシル酸)、1-ナフタレンスルホン酸、2-ナフタレンスルホン酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、リンゴ酸、酒石酸、クエン酸、乳酸、シュウ酸、コハク酸、フマル酸、マレイン酸、安息香酸、サリチル酸、フェニル酢酸、およびマンデル酸からなる群から選ばれた無機酸および有機酸の塩基塩、および

b) アルカリカチオン、アルカリ土類カチオン、アンモニウムカチオン、脂肪族置換アンモニウムカチオンおよび芳香族置換アンモニウムカチオンよりなる群から選ばれた無機および有機塩基の酸塩、よりなる群から選ばれた式 I の化合物の薬学的に許容し得る塩である請求項 2 の化合物。

【請求項 52】

a) 塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸、メタンスルホン酸、トリフルオロスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸(トシル酸)、1-ナフタレンスルホン酸、2-ナフタレンスルホン酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、リンゴ酸、酒石酸、クエン酸、乳酸、シュウ酸、コハク酸、フマル酸、マレイン酸、安息香酸、サリチル酸、フェニル酢酸、およびマンデル酸からなる群から選ばれた無機酸および有機酸の塩基塩、および

b) アルカリカチオン、アルカリ土類カチオン、アンモニウムカチオン、脂肪族置換アンモニウムカチオンおよび芳香族置換アンモニウムカチオンよりなる群から選ばれた無機および有機塩基の酸塩、よりなる群から選ばれた式 I の化合物の薬学的に許容し得る塩である請求項 33 の化合物。

## 【請求項 53】

a) 塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸、メタンスルホン酸、トリフルオロスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p - トルエンスルホン酸 (トシル酸)、1 - ナフタレンスルホン酸、2 - ナフタレンスルホン酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、リンゴ酸、酒石酸、クエン酸、乳酸、シュウ酸、コハク酸、フマル酸、マレイン酸、安息香酸、サリチル酸、フェニル酢酸、およびマンデル酸からなる群から選ばれた無機酸および有機酸の塩基塩、および

b) アルカリカチオン、アルカリ土類カチオン、アンモニウムカチオン、脂肪族置換アンモニウムカチオンおよび芳香族置換アンモニウムカチオンよりなる群から選ばれた無機および有機塩基の酸塩、よりなる群から選ばれた式 I の化合物の薬学的に許容し得る塩である請求項 38 の化合物。

## 【請求項 54】

a) 塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸、メタンスルホン酸、トリフルオロスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p - トルエンスルホン酸 (トシル酸)、1 - ナフタレンスルホン酸、2 - ナフタレンスルホン酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、リンゴ酸、酒石酸、クエン酸、乳酸、シュウ酸、コハク酸、フマル酸、マレイン酸、安息香酸、サリチル酸、フェニル酢酸、およびマンデル酸からなる群から選ばれた無機酸および有機酸の塩基塩、および

b) アルカリカチオン、アルカリ土類カチオン、アンモニウムカチオン、脂肪族置換アンモニウムカチオンおよび芳香族置換アンモニウムカチオンよりなる群から選ばれた無機および有機塩基の酸塩、よりなる群から選ばれた式 I の化合物の薬学的に許容し得る塩である請求項 39 の化合物。

## 【請求項 55】

請求項 1 の化合物または式 I の化合物の薬学的に許容し得る塩と、そして生理学的に許容し得る担体を含む薬剤組成物。

## 【請求項 56】

式 I に一致する請求項 2 の化合物またはその薬学的に許容し得る塩と、そして生理学的に許容し得る担体を含む薬剤組成物。

## 【請求項 57】

式 I に一致する請求項 33 の化合物またはその薬学的に許容し得る塩と、そして生理学的に許容し得る担体を含む薬剤組成物。

## 【請求項 58】

式 I に一致する請求項 38 の化合物またはその薬学的に許容し得る塩と、そして生理学的に許容し得る担体を含む薬剤組成物。

## 【請求項 59】

式 I に一致する請求項 39 の化合物またはその薬学的に許容し得る塩と、そして生理学的に許容し得る担体を含む薬剤組成物。

## 【請求項 60】

表 1 の 3 - t - ブチルフェニル尿素、

表 2 の 5 - t - ブチル - 2 - メトキシフェニル尿素、

表 3 の 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - メトキシフェニル尿素、

表 4 の 3 - (トリフルオロメチル) - 4 - クロロフェニル尿素、

表 5 の 3 - (トリフルオロメチル) - 4 - プロモフェニル尿素、

表 6 の 5 - (トリフルオロメチル) - 4 - クロロ - 2 - メトキシフェニル尿素、および

表 7 の尿素 101 ないし 103 よりなる群から選ばれた化合物。

## 【請求項 61】

3 - t - ブチルフェニル尿素類：

N - (3 - t - ブチルフェニル) - N' - (4 - (3 - (N - メチルカルバモイル)フェノキシ)フェニル尿素、および

N - (3 - t - ブチルフェニル) - N' - (4 - (4 - アセチルフェノキシ)フェニル尿素；

5 - t - ブチル - 2 - メトキシフェニル尿素類：

N - ( 2 - メトキシ - 4 - クロロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ) - N ' - ( 2 - クロロ - 4 - ( 2 - ( N - メチルカルバモイル ) - 4 - ピリジルオキシ ) フェニル )

尿素、および

N - ( 2 - メトキシ - 4 - クロロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ) - N ' - ( 3 - クロロ - 4 - ( 2 - ( N - メチルカルバモイル ) - 4 - ピリジルオキシ ) フェニル )

尿素、

からなる群から選ばれた化合物。