

【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11月16日(2006.11.16)

【公表番号】特表2006-508069(P2006-508069A)

【公表日】平成18年3月9日(2006.3.9)

【年通号数】公開・登録公報2006-010

【出願番号】特願2004-540421(P2004-540421)

【国際特許分類】

C 0 7 D 211/76 (2006.01)

A 6 1 K 31/45 (2006.01)

A 6 1 K 31/4525 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/06 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 39/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 405/06 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 211/76 C S P

A 6 1 K 31/45

A 6 1 K 31/4525

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 9/08

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 19/06

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 39/06

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 405/06

【手続補正書】

【提出日】平成18年9月29日(2006.9.29)

【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

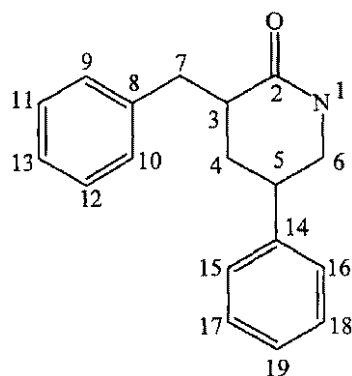
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

単一立体異性体またはその混合物としての次式の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物：

【化1】



ここで：

3、4、5、6、7、9、10、11、12、13、15、16、17、18および19位置の炭素の各々ならびに1位置の窒素は、別個に、各出現例にて、H、-Wまたは $-R^7$ (W)_nで置換されており、ここで：

Wは、 $-NH_2$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CN$ 、 $-CHO$ 、 $-OCHO$ 、 $-X$ 、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-COX$ 、 $-NHR^8$ 、 $-NR^8R^8$ 、 $-CONHR^8$ 、 $-CONR^8R^8$ 、 $-COOR^8$ 、 $-COR^8$ 、 $-OCOR^8$ 、 $-OR^8$ 、 $-BH_2$ 、 $-BHR^8$ 、 $-BR^8R^8$ 、 $-BO_2H_2$ 、 $-BO_2R^8R^8$ 、 $-PH_2$ 、 $-PHR^8$ 、 $-PR^8R^8$ 、 $-POR^8$ 、 $-PO_2R^8$ 、 $-PO_3R^8$ 、 $-SR^8$ ； $-SOR^8$ 、 $-SO_2R^8$ 、 $-SONH_2$ 、 $-SONHR^8$ 、 $-SONR^8R^8$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHR^8$ および $-SO_2NR^8R^8$ から選択される；

各 R^7 は、別個に、 $C_1 \sim C_{30}$ ヒドロカルビル、ハロカルビルまたはヒドロハロカルビル基であり、ここで、 R^7 のn個の水素原子またはハロゲン原子は、各位置で別個に選択される同数のW基で置換されているか；

または2個の隣接 $-R^7$ 基は、それらが結合する12および13位置または11および13位置の炭素と一緒に、ヘテロシクリル基を形成する；

各 R^8 は、別個に、 $C_1 \sim C_{30}$ ヒドロカルビル、ハロカルビルまたはヒドロハロカルビル基である；

nは、0、1、2、3、4および5から選択される；そして

Xは、 $-Br$ 、 $-Cl$ 、 $-F$ および $-I$ から選択される、化合物。

【請求項2】

4 および 6 位置が、全く水素のみで置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

1 9 位置が、 $-W$ で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

1 9 位置が、 $-CN$ 、 $-X$ 、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ または $-OR^8$ で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

1 7 および 1 8 位置の 1 個の炭素が、水素で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

1 7 および 1 8 位置の少なくとも 1 個の炭素が、 $-W$ で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

1 7 および 1 8 位置の少なくとも 1 個の炭素が、 $-NH_2$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CN$ 、 $-CHO$ 、 $-OCHO$ 、 $-X$ 、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-COX$ 、 $-NHR^8$ 、 $-NR^8R^8$ 、 $-CONHR^8$ 、 $-CONR^8R^8$ 、 $-COOR^8$ 、 $-COR^8$ 、 $-OCOR^8$ または $-OR^8$ で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

1 7 および 1 8 位置の少なくとも 1 個の炭素が、 $-CN$ 、 $-X$ 、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ または $-OR^8$ で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

1 7、1 8 および 1 9 位置の炭素の 1 個だけが、水素で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

7 位置の炭素が、全く水素のみで置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

3 位置の炭素が、水素、 R^8 または X で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 12】

9 および 10 位置の炭素が、水素で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 13】

1 1、1 2 および 1 3 位置の炭素が、別個に、水素および $-W$ で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 14】

1 1 および 1 2 位置の炭素の 1 個だけが、水素で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 15】

1 1 および 1 2 位置から選択される炭素が、 $-CN$ 、 $-X$ 、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ または $-OR^8$ で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 16】

1 1、1 2 および 1 3 位置の少なくとも 1 個の炭素が、 $-R^7(W)_n$ で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 17】

1 1、1 2 および 1 3 位置の少なくとも 1 個の炭素が、 $C_1 \sim C_6$ ヒドロカルビル、 $C_1 \sim C_6$ ハロカルビルまたは $C_1 \sim C_6$ ヒドロハロカルビルで置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 18】

1 1、1 2 および 1 3 位置の炭素の正確に 2 個が、水素で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 19】

W が、 $-OCHO$ 、 $-OH$ 、 $-OCOR^8$ および $-OR^8$ から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 20】

Wが、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{X}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NHR}^8$ 、 $-\text{NR}^8\text{R}^8$ 、 $-\text{OR}^8$ および $-\text{SR}^8$ から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 21】

Wが、 $-\text{OR}^8$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 22】

R^7 が、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ ヒドロカルビル基であり、ここで、 R^7 の n 個の水素原子またはハロゲン原子が、各位置で別個に選択される同数の W 基で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 23】

R^7 が、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アラルキル、アルキルアリール、アルケニル置換アリール、アリール置換アルケニル、アルキニル置換アリール、アリール置換アルキニル、ビアリール、シクロアルキル、シクロアルケニル、ビスシクロアルキル、ビスシクロアルケニル、アルキルシクロアルキル、アルケニルシクロアルキル、アルキニルシクロアルキル、アリール置換シクロアルキル、シクロアルキル置換アリール、アリール置換シクロアルケニル、シクロアルケニル置換アリール、アリール縮合シクロアルキルおよびポリシクロアルキルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 24】

R^8 が、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ ヒドロカルビル基である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 25】

R^8 が、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ シクロヒドロカルビル基である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 26】

R^8 が、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アラルキル、アルキルアリール、アルケニル置換アリール、アリール置換アルケニル、アルキニル置換アリール、アリール置換アルキニル、ビアリール、シクロアルキル、シクロアルケニル、ビスシクロアルキル、ビスシクロアルケニル、アルキルシクロアルキル、アルケニルシクロアルキル、アルキニルシクロアルキル、アリール置換シクロアルキル、シクロアルキル置換アリール、アリール置換シクロアルケニル、シクロアルケニル置換アリール、アリール縮合シクロアルキルおよびポリシクロアルキルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 27】

n が、0 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 28】

1 位置が、水素で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 29】

炭素 3 で S 立体配置を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 30】

炭素 3 で R 立体配置を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 31】

炭素 5 で S 立体配置を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 32】

炭素 5 で R 立体配置を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 33】

3、4、6、7、9 および 10 位置が、水素で置換されており、11 および 12 位置の 1 個が、水素で置換されており、そして 17 および 18 位置の 1 個が、水素で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 34】

11、12 および 13 位置の少なくとも 1 個の炭素が、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヒドロカルビル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロカルビルまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヒドロハロカルビルで置換されており、ここで、11、12 および 13 位置の炭素の正確に 2 個が、水素で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 35】

19 位置が、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{X}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{SH}$ または $-\text{OR}^8$ で置換されており、17および18位置の1個の炭素が、水素で置換されており、そして17および18位置の少なくとも1個の炭素が、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{X}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{SH}$ または $-\text{OR}^8$ で置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項 36】

3、4、6、7、9および10位置が、水素で置換されており、11、12および13位置の正確に2個の炭素が、水素で置換されており、11、12および13位置の少なくとも1個の炭素が、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヒドロカルビル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロカルビルまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヒドロハロカルビルで置換されており、17および18位置の1個が、水素で置換されており、19位置が、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{X}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{SH}$ または $-\text{OR}^8$ で置換されており、そして17および18位置の少なくとも1個の炭素が、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{X}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{SH}$ または $-\text{OR}^8$ で置換されており、そして17および18位置の1個の炭素が、水素で置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項 37】

1、3、4、6、7、9、10、11および18位置が、水素で置換されており、17および19位置が、 OR^8 で置換されており、ここで、 R^8 が、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ ヒドロカルビル基であり、そして12位置が、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヒドロカルビル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロカルビルまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヒドロハロカルビルで置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項 38】

1、3、4、5、6、7、9、10、11、13、15、16および18位置が、水素で置換されており、12位置が、 C_1 ヒドロカルビルで置換されており、17位置が、 $-\text{O}$ シクロペンチルで置換されており、そして19位置が、 $-\text{O}$ メチルで置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項 39】

3位置および5位置の両方が、Sの原子空間配置を有する、請求項38に記載の化合物。

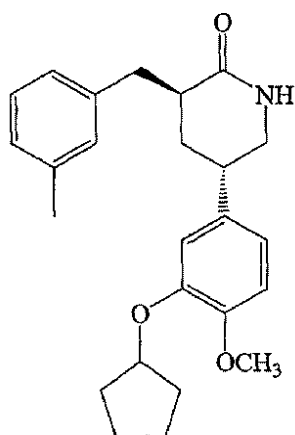
【請求項 40】

請求項1に記載の化合物の薬学的に受容可能な塩または溶媒和物。

【請求項 41】

単一立体異性体またはその混合物としての次式の請求項1に記載の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物：

【化 2】

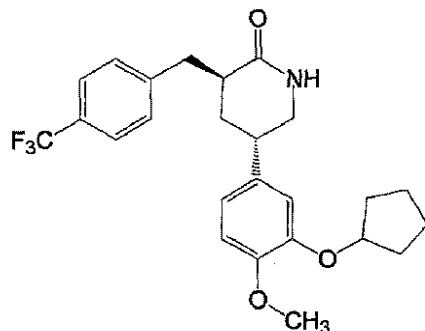


。

【請求項 42】

単一立体異性体またはその混合物としての次式の請求項1に記載の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物：

【化 3】

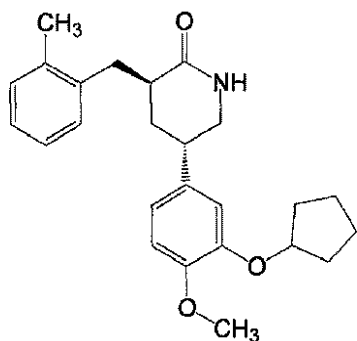


。

【請求項 4 3】

単一立体異性体またはその混合物としての次式の請求項 1 に記載の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物：

【化 4】

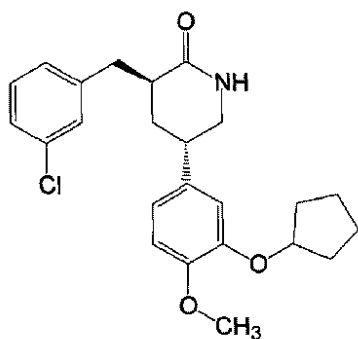


。

【請求項 4 4】

単一立体異性体またはその混合物としての次式の請求項 1 に記載の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物：

【化 5】

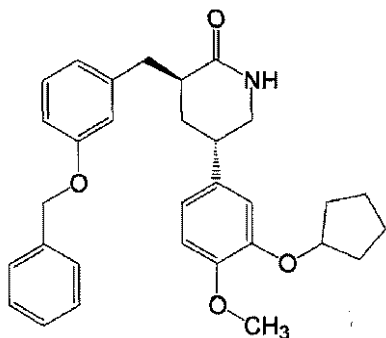


。

【請求項 4 5】

単一立体異性体またはその混合物としての次式の請求項 1 に記載の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物：

【化 6】

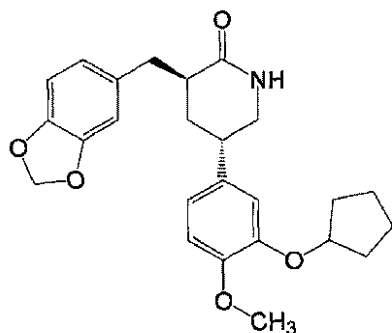


。

【請求項 4 6】

単一立体異性体またはその混合物としての次式の請求項 1 に記載の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物：

【化 7】

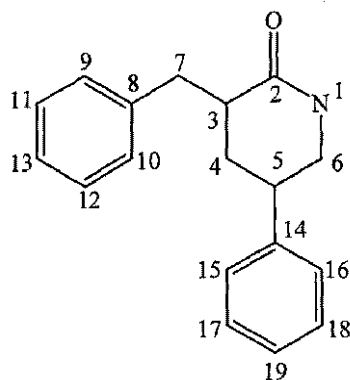


。

【請求項 4 7】

単一立体異性体またはその混合物としての次式の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物と、薬学的に受容可能な担体、希釈剤または賦形剤とを含有する、薬学的組成物：

【化 8】



ここで：

3、4、5、6、7、9、10、11、12、13、15、16、17、18 および 19 位置の炭素の各々ならびに 1 位置の窒素は、別個に、各出現例にて、H、-W または -R⁷ (W)_n で置換されており、ここで：

W は、-NH₂、-CONH₂、-COOH、-CN、-CHO、-OCHO、-X、-OH、-NO₂、-SH、-COX、-NHR⁸、-NR⁸R⁸、-CONHR⁸、-CONR⁸R⁸、-COOR⁸、-COR⁸、-OCOR⁸、-OR⁸、-BH₂、-B

HR^8 、 $-\text{BR}^8 \text{R}^8$ 、 $-\text{BO}_2 \text{H}_2$ 、 $-\text{BO}_2 \text{R}^8 \text{R}^8$ 、 $-\text{PH}_2$ 、 $-\text{PHR}^8$ 、 $-\text{PR}^8 \text{R}^8$ 、 $-\text{POR}^8$ 、 $-\text{PO}_2 \text{R}^8$ 、 $-\text{PO}_3 \text{R}^8$ 、 $-\text{SR}^8$ ； $-\text{SOR}^8$ 、 $-\text{SO}_2 \text{R}^8$ 、 $-\text{SONH}_2$ 、 $-\text{SONHR}^8$ 、 $-\text{SONR}^8 \text{R}^8$ 、 $-\text{SO}_2 \text{NH}_2$ 、 $-\text{SO}_2 \text{NHR}^8$ および $-\text{SO}_2 \text{NR}^8 \text{R}^8$ から選択される；

各 R^7 は、別個に、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{30}$ ヒドロカルビル、ハロカルビルまたはヒドロハロカルビル基であり、ここで、 R^7 の n 個の水素原子またはハロゲン原子は、各位置で別個に選択される同数の W 基で置換されているか；

または 2 個の隣接 $-\text{R}^7$ 基は、それらが結合する 1 2 および 1 3 位置または 1 1 および 1 3 位置の炭素と一緒にあって、ヘテロシクリル基を形成する；

各 R^8 は、別個に、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{30}$ ヒドロカルビル、ハロカルビルまたはヒドロハロカルビル基である；

n は、0、1、2、3、4 および 5 から選択される；そして

X は、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{F}$ および $-\text{I}$ から選択される、組成物。

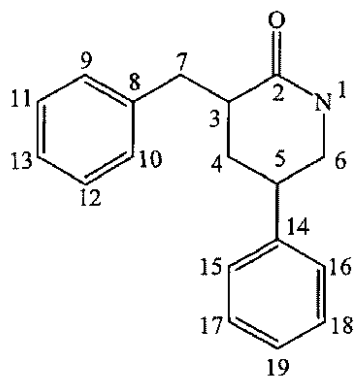
【請求項 48】

前記化合物が、1、3、4、5、6、7、9、10、11、13、15、16 および 18 位置が、水素で置換されており、12 位置が、 C_1 ヒドロカルビルで置換されており、17 位置が、 $-\text{O}-$ シクロペンチルで置換されており、そして 19 位置が、 $-\text{O}-$ メチルで置換されている化合物である、請求項 47 に記載の組成物。

【請求項 49】

患者における炎症状態または炎症性疾患を治療または予防する ための組成物 であって、単一立体異性体または混合物 としての次式の化合物あるいは それらの薬学的に受容可能な塩 または 溶媒和物の治療有効量を含有 する；

【化 9】



ここで：

3、4、5、6、7、9、10、11、12、13、15、16、17、18 および 19 位置の炭素の各々 ならびに 1 位置の窒素 は、別個に、各出現例にて、H、 $-\text{W}$ または $-\text{R}^7 (\text{W})_n$ で置換されており、ここで：

W は、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CONH}_2$ 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{OCHO}$ 、 $-\text{X}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{COX}$ 、 $-\text{NHR}^8$ 、 $-\text{NR}^8 \text{R}^8$ 、 $-\text{CONHR}^8$ 、 $-\text{CONR}^8 \text{R}^8$ 、 $-\text{COOR}^8$ 、 $-\text{COR}^8$ 、 $-\text{OCOR}^8$ 、 $-\text{OR}^8$ 、 $-\text{BH}_2$ 、 $-\text{BHR}^8$ 、 $-\text{BR}^8 \text{R}^8$ 、 $-\text{BO}_2 \text{H}_2$ 、 $-\text{BO}_2 \text{R}^8 \text{R}^8$ 、 $-\text{PH}_2$ 、 $-\text{PHR}^8$ 、 $-\text{PR}^8 \text{R}^8$ 、 $-\text{POR}^8$ 、 $-\text{PO}_2 \text{R}^8$ 、 $-\text{PO}_3 \text{R}^8$ 、 $-\text{SR}^8$ ； $-\text{SOR}^8$ 、 $-\text{SO}_2 \text{R}^8$ 、 $-\text{SONH}_2$ 、 $-\text{SONHR}^8$ 、 $-\text{SONR}^8 \text{R}^8$ 、 $-\text{SO}_2 \text{NH}_2$ 、 $-\text{SO}_2 \text{NHR}^8$ および $-\text{SO}_2 \text{NR}^8 \text{R}^8$ から選択される；

各 R^7 は、別個に、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{30}$ ヒドロカルビル、ハロカルビルまたはヒドロハロカルビル基であり、ここで、 R^7 の n 個の水素原子またはハロゲン原子は、各位置で別個に選択される同数の W 基で置換されているか；

または 2 個の隣接 $-\text{R}^7$ 基は、それらが結合する 1 2 および 1 3 位置または 1 1 および

1 3 位置の炭素と一緒にあって、ヘテロシクリル基を形成する；

各 R^8 は、別個に、 $C_1 \sim C_{30}$ ヒドロカルビル、ハロカルビルまたはヒドロハロカルビル基である；

n は、0、1、2、3、4 および 5 から選択される；そして

X は、 $-Br$ 、 $-Cl$ 、 $-F$ および $-I$ から選択され、

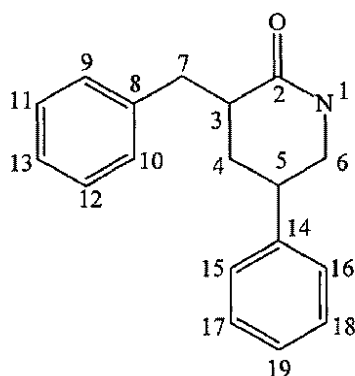
ここで、該量は、該患者の炎症状態または炎症性疾患を治療または予防するのに有効である、

組成物。

【請求項 50】

患者内の細胞内環状アデノシン 5' -モノリン酸レベルを調節するための組成物であって、単一立体異性体またはその混合物としての次式の化合物あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物の治療有効量を含有する：

【化 10】



ここで：

3、4、5、6、7、9、10、11、12、13、15、16、17、18 および 19 位置の炭素の各々ならびに 1 位置の窒素は、別個に、各出現例にて、 H 、 $-W$ または $-R^7 (W)_n$ で置換されており、ここで：

W は、 $-NH_2$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CN$ 、 $-CHO$ 、 $-OCHO$ 、 $-X$ 、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-COX$ 、 $-NHR^8$ 、 $-NR^8 R^8$ 、 $-CONHR^8$ 、 $-CONR^8 R^8$ 、 $-COOR^8$ 、 $-COR^8$ 、 $-OCOR^8$ 、 $-OR^8$ 、 $-BH_2$ 、 $-BHR^8$ 、 $-BR^8 R^8$ 、 $-BO_2 H_2$ 、 $-BO_2 R^8 R^8$ 、 $-PH_2$ 、 $-PHR^8$ 、 $-PR^8 R^8$ 、 $-POR^8$ 、 $-PO_2 R^8$ 、 $-PO_3 R^8$ 、 $-SR^8$ ； $-SOR^8$ 、 $-SO_2 R^8$ 、 $-SONH_2$ 、 $-SONHR^8$ 、 $-SONR^8 R^8$ 、 $-SO_2 NH_2$ 、 $-SO_2 NHR^8$ および $-SO_2 NR^8 R^8$ から選択される；

各 R^7 は、別個に、 $C_1 \sim C_{30}$ ヒドロカルビル、ハロカルビルまたはヒドロハロカルビル基であり、ここで、 R^7 の n 個の水素原子またはハロゲン原子は、各位置で別個に選択される同数の W 基で置換されているか；

または 2 個の隣接 $-R^7$ 基は、それらが結合する 12 および 13 位置または 11 および 13 位置の炭素と一緒にあって、ヘテロシクリル基を形成する；

各 R^8 は、別個に、 $C_1 \sim C_{30}$ ヒドロカルビル、ハロカルビルまたはヒドロハロカルビル基である；

n は、0、1、2、3、4 および 5 から選択される；そして

X は、 $-Br$ 、 $-Cl$ 、 $-F$ および $-I$ から選択され、

ここで、該量は、該患者の細胞内環状アデノシン 5' -モノリン酸レベルを調節するのに有効である、

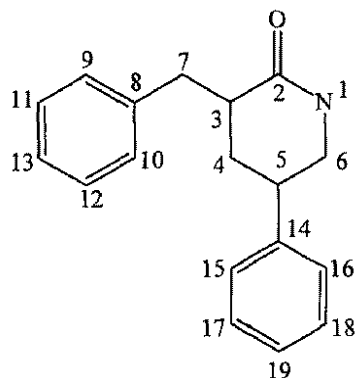
組成物。

【請求項 51】

患者の疾患または状態を治療または予防するための組成物であって、ここで、該疾患または状態は、二次細胞メッセンジャーに関連する酵素を阻害することにより調節される病理

状態に関連しており、単一立体異性体またはその混合物としての次式の化合物あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物の治療有効量を含有する：

【化 1 1】



ここで：

3、4、5、6、7、9、10、11、12、13、15、16、17、18および19位置の炭素の各々ならびに1位置の窒素は、別個に、各出現例にて、H、 $-W$ または $-R^7(W)_n$ で置換されており、ここで：

W は、 $-NH_2$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CN$ 、 $-CHO$ 、 $-OCHO$ 、 $-X$ 、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-COX$ 、 $-NHR^8$ 、 $-NR^8R^8$ 、 $-CONHR^8$ 、 $-CONR^8R^8$ 、 $-COOR^8$ 、 $-COR^8$ 、 $-OCOR^8$ 、 $-OR^8$ 、 $-BH_2$ 、 $-BHR^8$ 、 $-BR^8R^8$ 、 $-BO_2H_2$ 、 $-BO_2R^8R^8$ 、 $-PH_2$ 、 $-PHR^8$ 、 $-PR^8R^8$ 、 $-POR^8$ 、 $-PO_2R^8$ 、 $-PO_3R^8$ 、 $-SR^8$ ； $-SOR^8$ 、 $-SO_2R^8$ 、 $-SONH_2$ 、 $-SONHR^8$ 、 $-SONR^8R^8$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHR^8$ および $-SO_2NR^8R^8$ から選択される；

各 R^7 は、別個に、 $C_1 \sim C_{30}$ ヒドロカルビル、ハロカルビルまたはヒドロハロカルビル基であり、ここで、 R^7 の n 個の水素原子またはハロゲン原子は、各位置で別個に選択される同数の W 基で置換されているか；

または2個の隣接 $-R^7$ 基は、それらが結合する12および13位置または11および13位置の炭素と一緒に、ヘテロシクリル基を形成する；

各 R^8 は、別個に、 $C_1 \sim C_{30}$ ヒドロカルビル、ハロカルビルまたはヒドロハロカルビル基である；

n は、0、1、2、3、4および5から選択される；そして

X は、 $-Br$ 、 $-Cl$ 、 $-F$ および $-I$ から選択され、

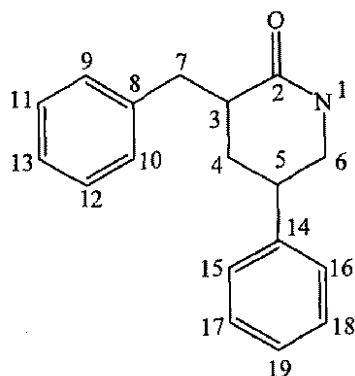
ここで、該量は、二次細胞メッセンジャーに関連する酵素を阻害することにより調節される病理状態に関連する疾患または状態を治療または予防するのに有効である、

組成物。

【請求項 5 2】

患者における移植拒絶を治療または予防するための組成物であって、単一立体異性体またはその混合物としての次式の化合物あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物の治療有効量を含有する：

【化 1 2】



ここで：

3、4、5、6、7、9、10、11、12、13、15、16、17、18および19位置の炭素の各々ならびに1位置の窒素は、別個に、各出現例にて、H、-Wまたは $-R^7$ (W)_nで置換されており、ここで：

Wは、 $-NH_2$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CN$ 、 $-CHO$ 、 $-OCHO$ 、 $-X$ 、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-COX$ 、 $-NHR^8$ 、 $-NR^8R^8$ 、 $-CONHR^8$ 、 $-CONR^8R^8$ 、 $-COOR^8$ 、 $-COR^8$ 、 $-OCOR^8$ 、 $-OR^8$ 、 $-BH_2$ 、 $-BHR^8$ 、 $-BR^8R^8$ 、 $-BO_2H_2$ 、 $-BO_2R^8R^8$ 、 $-PH_2$ 、 $-PHR^8$ 、 $-PR^8R^8$ 、 $-POR^8$ 、 $-PO_2R^8$ 、 $-PO_3R^8$ 、 $-SR^8$ ； $-SOR^8$ 、 $-SO_2R^8$ 、 $-SONH_2$ 、 $-SONHR^8$ 、 $-SONR^8R^8$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHR^8$ および $-SO_2NR^8R^8$ から選択される；

各 R^7 は、別個に、 $C_1 \sim C_{30}$ ヒドロカルビル、ハロカルビルまたはヒドロハロカルビル基であり、ここで、 R^7 のn個の水素原子またはハロゲン原子は、各位置で別個に選択される同数のW基で置換されているか；

または2個の隣接 $-R^7$ 基は、それらが結合する12および13位置または11および13位置の炭素と一緒に、ヘテロシクリル基を形成する；

各 R^8 は、別個に、 $C_1 \sim C_{30}$ ヒドロカルビル、ハロカルビルまたはヒドロハロカルビル基である；

nは、0、1、2、3、4および5から選択される；そして

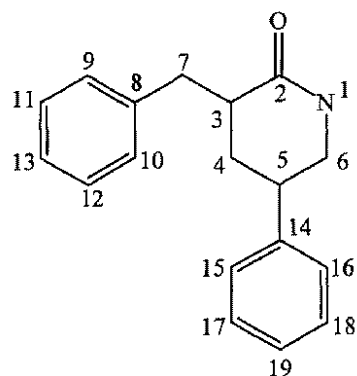
Xは、 $-Br$ 、 $-Cl$ 、 $-F$ および $-I$ から選択され、

ここで、該量は、該患者における移植拒絶を治療または予防するのに有効である、組成物。

【請求項 5 3】

患者における制御不能な細胞増殖を治療または予防するための組成物であって、単一立体異性体またはその混合物としての次式の化合物あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物の治療有効量を含有する：

【化 1 3】



ここで：

3、4、5、6、7、9、10、11、12、13、15、16、17、18および19位置の炭素の各々ならびに1位置の窒素は、別個に、各出現例にて、H、-Wまたは R^7 (W)_nで置換されており、ここで：

Wは、 $-NH_2$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CN$ 、 $-CHO$ 、 $-OCHO$ 、 $-X$ 、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-COX$ 、 $-NHR^8$ 、 $-NR^8R^8$ 、 $-CONHR^8$ 、 $-CONR^8R^8$ 、 $-COOR^8$ 、 $-COR^8$ 、 $-OCOR^8$ 、 $-OR^8$ 、 $-BH_2$ 、 $-BHR^8$ 、 $-BR^8R^8$ 、 $-BO_2H_2$ 、 $-BO_2R^8R^8$ 、 $-PH_2$ 、 $-PHR^8$ 、 $-PR^8R^8$ 、 $-POR^8$ 、 $-PO_2R^8$ 、 $-PO_3R^8$ 、 $-SR^8$ ； $-SOR^8$ 、 $-SO_2R^8$ 、 $-SONH_2$ 、 $-SONHR^8$ 、 $-SONR^8R^8$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHR^8$ および $-SO_2NR^8R^8$ から選択される；

各 R^7 は、別個に、 $C_1 \sim C_{30}$ ヒドロカルビル、ハロカルビルまたはヒドロハロカルビル基であり、ここで、 R^7 のn個の水素原子またはハロゲン原子は、各位置で別個に選択される同数のW基で置換されているか；

または2個の隣接 $-R^7$ 基は、それらが結合する12および13位置または11および13位置の炭素と一緒にあって、ヘテロシクリル基を形成する；

各 R^8 は、別個に、 $C_1 \sim C_{30}$ ヒドロカルビル、ハロカルビルまたはヒドロハロカルビル基である；

nは、0、1、2、3、4および5から選択される；そして

Xは、 $-Br$ 、 $-Cl$ 、 $-F$ および $-I$ から選択され、

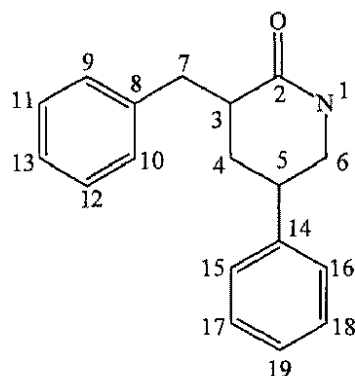
ここで、該量は、該患者における制御不能な細胞増殖を治療または予防するのに有効である、

組成物。

【請求項 5 4】

患者における中枢神経系 (CNS) に関連する状態を治療または予防するための組成物であって、単一立体異性体またはその混合物としての次式の化合物あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物の治療有効量を含有する：

【化 1 4】



ここで：

3、4、5、6、7、9、10、11、12、13、15、16、17、18および19位置の炭素の各々ならびに1位置の窒素は、別個に、各出現例にて、H、-Wまたは $-R^7(W)_n$ で置換されており、ここで：

Wは、 $-NH_2$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CN$ 、 $-CHO$ 、 $-OCHO$ 、 $-X$ 、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-COX$ 、 $-NHR^8$ 、 $-NR^8R^8$ 、 $-CONHR^8$ 、 $-CONR^8R^8$ 、 $-COOR^8$ 、 $-COR^8$ 、 $-OCOR^8$ 、 $-OR^8$ 、 $-BH_2$ 、 $-BHR^8$ 、 $-BR^8R^8$ 、 $-BO_2H_2$ 、 $-BO_2R^8R^8$ 、 $-PH_2$ 、 $-PHR^8$ 、 $-PR^8R^8$ 、 $-POR^8$ 、 $-PO_2R^8$ 、 $-PO_3R^8$ 、 $-SR^8$ ； $-SOR^8$ 、 $-SO_2R^8$ 、 $-SONH_2$ 、 $-SONHR^8$ 、 $-SONR^8R^8$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHR^8$ および $-SO_2NR^8R^8$ から選択される；

各 R^7 は、別個に、 $C_1 \sim C_{30}$ ヒドロカルビル、ハロカルビルまたはヒドロハロカルビル基であり、ここで、 R^7 のn個の水素原子またはハロゲン原子は、各位置で別個に選択される同数のW基で置換されているか；

または2個の隣接 $-R^7$ 基は、それらが結合する12および13位置または11および13位置の炭素と一緒にあって、ヘテロシクリル基を形成する；

各 R^8 は、別個に、 $C_1 \sim C_{30}$ ヒドロカルビル、ハロカルビルまたはヒドロハロカルビル基である；

nは、0、1、2、3、4および5から選択される；そして

Xは、 $-Br$ 、 $-Cl$ 、 $-F$ および $-I$ から選択され、

ここで、該量は、該患者の中枢神経系(CNS)に関連する状態を治療または予防するのに有効である、

組成物。