

【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17年1月13日(2005.1.13)

【公表番号】特表2000-511902(P2000-511902A)

【公表日】平成12年9月12日(2000.9.12)

【出願番号】特願平10-500751

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 498/22

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 25/02

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 43/00

A 6 1 K 31/553

【F I】

C 0 7 D 498/22

A 6 1 K 31/00 6 0 9 F

A 6 1 K 31/00 6 2 5 F

A 6 1 K 31/00 6 2 6 N

A 6 1 K 31/00 6 2 6 E

A 6 1 K 31/00 6 2 6 F

A 6 1 K 31/00 6 2 6 B

A 6 1 K 31/00 6 4 3 C

A 6 1 K 31/55 6 0 4

【手続補正書】

【提出日】平成16年5月25日(2004.5.25)

【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】

## 手続補正書

平成16年 5月25日



特許庁長官殿

## 1. 事件の表示

平成10年特許願第500751号

## 2. 補正をする者

氏名（名称） セファロン・インコーポレイテッド

（ほか1名）

## 3. 代理人

住所

〒540-0001  
 大阪府大阪市中央区城見1丁目3番7号 IMPビル  
 青山特許事務所  
 電話 06-6949-1261 FAX 06-6949-0361

氏名

弁理士 (6214) 青山 葵



## 4. 補正対象書類名 請求の範囲

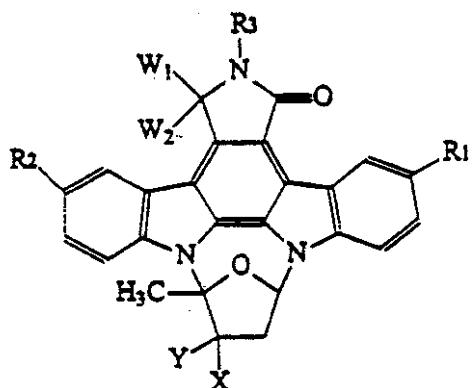
## 5. 補正対象項目名 請求の範囲

6. 補正の内容  
別紙のとおり。

(別紙)

## 請 求 の 範 囲

## 1. 一般式 (I) :

{式中、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>のうち一方は：

- a) -CO(CH<sub>2</sub>)<sub>j</sub>R<sup>4</sup> [ここにjは1～6であって、R<sup>4</sup>は
- 1) ハロゲン；
  - 2) -NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> (ここにR<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>は独立して、水素、置換低級アルキル、非置換低級アルキル、置換アリール、非置換アリール、置換ヘテロアリール、非置換ヘテロアリール、置換アラルキル、非置換アラルキル、低級アルキルアミノカルボニル、もしくは低級アルコキシカルボニルであるか；またはR<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>は窒素原子と結合して複素環基を形成する)；
  - 3) N<sub>3</sub>；
  - 4) -SR<sup>27</sup> (ここにR<sup>27</sup>は：
    - i) 水素；
    - ii) 置換低級アルキル；
    - iii) 非置換低級アルキル；
    - iv) 置換アリール；
    - v) 非置換アリール；
    - vi) 置換ヘテロアリール；
    - vii) 非置換ヘテロアリール；

- viii) 置換アルキル；
- ix) 非置換アルキル；
- x) チアゾリニル；
- xi)  $-(CH_2)_aCO_2R^{28}$  (ここに  $a$  は 1 または 2 であって、  $R^{28}$  は水素および低級アルキルよりなる群から選択される)；および
- xii)  $-(CH_2)_aCONR^5R^6$  よりなる群から選択される)；ならびに
- 5)  $OR^{29}$  (ここに  $R^{29}$  は水素、 置換低級アルキル、 非置換低級アルキル、 または  $COR^{30}$  (ここに  $R^{30}$  は水素、 低級アルキル、 置換アリール、 非置換アリール、 置換ヘテロアリール、 または非置換ヘテロアリールである)である)；
- よりなる群から選択される]
- b)  $-CH(OH)(CH_2)_bR^{4A}$  (ここに  $b$  は 1 ～ 6 であって、  $R^{4A}$  は水素または  $R^4$  の定義と同じである)；
- c)  $-(CH_2)_dCHR^{31}CO_2R^{32}$  (ここに  $d$  は 0 ～ 5 であり、  $R^{31}$  は水素、  $-CONR^5R^6$ 、 または  $-CO_2R^{33}$  (ここに  $R^{33}$  は水素または低級アルキルである)であって、  $R^{32}$  は水素または低級アルキルである)；
- d)  $-(CH_2)_dCHR^{31}CONR^5R^6$ ；
- e)  $-(CH_2)_kR^7$  [ここに  $k$  は 2 ～ 6 であって、  $R^7$  はハロゲン、  $CO_2R^8$  (ここに  $R^8$  は水素、 低級アルキル、 置換アリール、 非置換アリール、 置換ヘテロアリール、 または非置換ヘテロアリールである)、  $CONR^5R^6$ 、 置換アリール、 非置換アリール、 置換ヘテロアリール、 非置換ヘテロアリール、  $OR^9$  (ここに  $R^9$  は水素、 置換低級アルキル、 非置換低級アルキル、 アシル、 置換アリール、 または非置換アリールである)、  $SR^{27B}$  (ここに  $R^{27B}$  は  $R^{27}$  の定義と同じである)、  $NR^{10}R^{11}$  (ここに  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は  $R^5$  および  $R^6$  の定義と同じである) または  $N_3$  である]；
- f)  $-CH=CH(CH_2)_mR^{12}$  [ここに  $m$  は 0 ～ 4 であって、  $R^{12}$  は水素、 低級アルキル、  $CO_2R^{8A}$  (ここに  $R^{8A}$  は  $R^8$  の定義と同じである)、  $-CONR^5R^6$ 、 置換アリール、 非置換アリール、 置換ヘテロアリール、 非置換ヘテロアリール、

OR<sup>9A</sup>(ここにR<sup>9A</sup>はR<sup>9</sup>の定義と同じである)、またはNR<sup>10A</sup>R<sup>11A</sup>(ここにR<sup>10A</sup>およびR<sup>11A</sup>はR<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>の定義と同じである)である]；

g) -CH=C(CO<sub>2</sub>R<sup>33A</sup>)<sub>2</sub>(ここにR<sup>33A</sup>はR<sup>33</sup>の定義と同じである)；

h) -C≡C(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>R<sup>13</sup>(ここにnは0～4であって、R<sup>13</sup>はR<sup>12</sup>の定義と同じである)；ならびに

i) -CH<sub>2</sub>OR<sup>44</sup>(ここにR<sup>44</sup>は置換低級アルキルである)

よりなる群から選択され；

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>のうち他方は：

j) 水素、低級アルキル、ハロゲン、アシル、ニトロ、またはNR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>(ここにR<sup>14</sup>およびR<sup>15</sup>のうち一方は水素または低級アルキルであって、他方は水素、低級アルキル、アシル、カルバモイル、低級アルキルアミノカルボニル、置換アリールアミノカルボニル、または非置換アリールアミノカルボニルである)；

k) -CH(SR<sup>34</sup>)<sub>2</sub>(ここにR<sup>34</sup>は低級アルキルまたはアルキレンである)；

l) -CH<sub>2</sub>R<sup>35</sup>[ここにR<sup>35</sup>はOR<sup>36</sup>(ここにR<sup>36</sup>は3個の低級アルキル基が同一もしくは異なるトリ-低級アルキルシリルであるか、またはR<sup>29</sup>の定義と同じである)、またはSR<sup>37</sup>(ここにR<sup>37</sup>はR<sup>27</sup>の定義と同じである)である]；

m) -CO(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>16</sup>(ここにqは1～6であって、R<sup>16</sup>はR<sup>4</sup>の定義と同じである)；

n) -CH(OH)(CH<sub>2</sub>)<sub>e</sub>R<sup>38</sup>(ここにeは1～6であって、R<sup>38</sup>はR<sup>4A</sup>の定義と同じである)；

o) -(CH<sub>2</sub>)<sub>f</sub>CHR<sup>39</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>40</sup>(ここにfは0～5であり、R<sup>39</sup>はR<sup>31</sup>の定義と同じであって、R<sup>40</sup>はR<sup>32</sup>の定義と同じである)；

p) -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>R<sup>17</sup>(ここにrは2～6であって、R<sup>17</sup>はR<sup>7</sup>の定義と同じである)；

q) -CH=CH(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>R<sup>18</sup>(ここにtは0～4であって、R<sup>18</sup>はR<sup>12</sup>の定義と同じである)；

r) -CH=C(CO<sub>2</sub>R<sup>33B</sup>)<sub>2</sub>(ここにR<sup>33B</sup>はR<sup>33</sup>の定義と同じである)；なら

びに

s)  $-C \equiv C (CH_2)_u R^{19}$  (ここに  $u$  は 0 ~ 4 であって、  $R^{19}$  は  $R^{13}$  の定義と同じである)

よりなる群から選択され；

$R^3$  は水素、アシル、または低級アルキルであり；

X は：

a) 水素；

b) ホルミル；

c) 低級アルコキシカルボニル；

d)  $-CONR^{20}R^{21}$  [ここに  $R^{20}$  および  $R^{21}$  は独立して：

水素；または

低級アルキルである]；

e)  $-CH_2R^{22}$  (ここに  $R^{22}$  はヒドロキシである)；

f)  $-NR^{23}R^{24}$  (ここに  $R^{23}$  および  $R^{24}$  のうち一方は水素もしくは低級アルキルであって、他方は水素、低級アルキル、もしくはカルボキシル基のヒドロキシ基が除かれた  $\alpha$ -アミノ酸の残基であるか、または  $R^{23}$  および  $R^{24}$  は窒素原子と結合して複素環基を形成する)；および

g)  $-CH=N-R^{25}$  (ここに  $R^{25}$  はヒドロキシ、低級アルコキシ、アミノ、グアニジノ、またはイミダゾリルアミノである)

よりなる群から選択され；

Y はヒドロキシ、低級アルコキシ、アラルキルオキシ、またはアシルオキシであり；あるいは

X および Y は一緒になって、 $-X-Y-$ 、 $=O$ 、 $-CH_2O(C=O)O-$ 、 $-CH_2OC(=S)O-$ 、 $-CH_2NR^{26}C(=O)-$  (ここに  $R^{26}$  は水素または低級アルキルである)、 $-CH_2NHC(=S)O-$ 、 $-CH_2OS(=O)O-$ 、または $-CH_2OC(CH_3)_2O-$  を表し；ならびに

$W^1$  および  $W^2$  は水素であるか、あるいは  $W^1$  および  $W^2$  は一緒になって酸素を表す} によって定義される化合物、またはその医薬上許容される塩。

2. a)  $R^1$ および $R^2$ のうち一方が、 $-(CH_2)_k R^7$ 、  
 $-CH=CH(CH_2)_m R^{12}$ 、 $-C\equiv C(CH_2)_n R^{13}$ 、 $-CO(CH_2)_j SR^{27}$ 、  
 および $-CH_2 OR^{44}$ （ここに $R^{44}$ はメトキシメチル、エトキシメチル、またはメ  
 トキシエチルである）よりなる群から選択され；  
 $R^1$ および $R^2$ のうち他方が、 $-(CH_2)_r R^{17}$ 、 $-CH=CH(CH_2)_t R^{18}$ 、  
 $-C\equiv C(CH_2)_u R^{19}$ 、 $NR^{14}R^{15}$ 、水素、ハロゲン、ニトロ、 $-CH_2 O-$ （置  
 換低級アルキルまたは非置換低級アルキル）、 $-CO(CH_2)_q SR^{27}$ 、 $-CH_2$   
 $R^{35}$ （ここに $R^{35}$ は $OR^{36}$ である）、および $-CH_2 SR^{37}$ （ここに $R^{37}$ は低級ア  
 ルキル、ピリジルおよびベンゾイミダゾールよりなる群から選択される）よりな  
 る群から選択され；
- b)  $k$ および $r$ が、各々、2、3または4であり；
- c)  $j$ および $q$ が、各々、1または2であり；
- d)  $R^7$ および $R^{17}$ が：
- 1) フェニル、ピリジル、イミダゾリル、チアゾリル、またはテトラゾリル  
 よりなる群から選択されるか；あるいは
  - 2)
- i)  $-CO_2 R^8$ および $CO_2 R^{8A}$ （ここに $R^8$ および $R^{8A}$ は独立して、水素、  
 メチル、エチル、またはフェニルである）；
- ii)  $-OR^9$ および $-OR^{9A}$ （ここに $R^9$ および $R^{9A}$ は独立して、水素、メチ  
 ル、エチル、フェニル、またはアシルである）；
- iii)  $-SR^{27B}$ （ここに $R^{27B}$ は非置換低級アルキル、2-チアゾリン、お  
 よびピリジルよりなる群から選択される）；および
- iv)  $-NR^{10}R^{11}$ および $-NR^{14}R^{15}$ （ここに $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{14}$ 、および  
 $R^{15}$ は独立して、水素、メチル、エチル、フェニル、カルバモイル、および低級  
 アルキルアミノカルボニルよりなる群から選択される）  
 よりなる群から対として選択され；
- e)  $R^{27}$ が、置換低級アルキル、非置換低級アルキル、置換フェニル、非置換  
 フェニル、ピリジル、ピリミジニル、チアゾール、およびテトラゾールよりなる

群から選択され；

- f)  $R^{3,6}$ が、メトキシメチル、エトキシメチル、およびメトキシエチルよりなる群から選択され；
- g)  $m$ 、 $n$ 、 $t$ および $u$ が、各々、0または1であって；
- h)  $R^{1,2}$ 、 $R^{1,3}$ 、 $R^{1,8}$ 、および $R^{1,9}$ が、独立して、水素、メチル、エチル、フェニル、ピリジル、イミダゾール、チアゾール、テトラゾール、 $-CO_2R^8$ 、 $-OR^9$ 、および $NR^{1,0}R^{1,1}$  ( $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{1,0}$ および $R^{1,1}$ は、各々、水素、メチル、エチル、またはフェニルである) よりなる群から選択される請求項1記載の化合物。

3.  $R^3$ が水素またはアセチルであり、 $X$ がヒドロキシメチルまたは低級アルコキシカルボニルであり、 $Y$ がヒドロキシまたはアセチルオキシであって、 $W^1$ および $W^2$ が水素である請求項2記載の化合物。

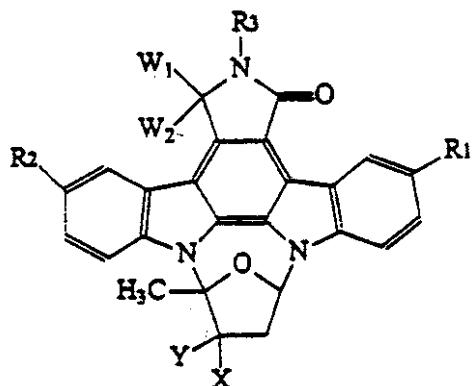
4.  $X$ がメトキシカルボニルであり、 $Y$ がヒドロキシであって、 $R^3$ が水素である請求項3記載の化合物。

5.  $R^1$ および $R^2$ のうち一方が、メトキシカルボニルビニル、エトキシカルボニルビニル、スチリル、2-ピリジルビニル、4-ピリジルビニル、2-ピリジルエチル、4-ピリジルエチル、フェニルエチル、メトキシプロピニル、ヒドロキシプロピニル、 $-COCH_2SEt$ 、 $-C\equiv CCH_2NMeBn$ 、 $-CH=CHEt$ 、 $-(CH_2)_2SMe$ 、 $-(CH_2)_2S-2-\text{チアゾリン}$ 、 $-(CH_2)_3SMe$ 、 $-CH=CHEt$ 、 $-CH=CH-2-\text{イミダゾール}$ 、 $(CH_2)_2OC(=O)H$ 、メトキシメトキシメチル、エトキシメトキシメチル、メトキシエトキシメチル、および2-ヒドロキシエチルよりなる群から選択され；

$R^1$ および $R^2$ のうち他方が、水素、ハロゲン、メトキシカルボニルビニル、エトキシカルボニルビニル、スチリル、2-ピリジルビニル、4-ピリジルビニル、2-ピリジルエチル、4-ピリジルエチル、フェニルエチル、ニトロ、アミノ、 $N$ -エチル尿素、メトキシプロピニル、ヒドロキシプロピニル、 $-COCH_2SEt$ 、 $-C\equiv CCH_2NMeBn$ 、 $-CH=CHEt$ 、 $-(CH_2)_2SMe$ 、 $-(CH_2)_2S-2-\text{チアゾリン}$ 、 $-(CH_2)_3SMe$ 、 $-CH_2OMe$ 、 $-CH_2OEt$ 、

-CH<sub>2</sub>SEt、ピリジルチオメチル、-CH<sub>2</sub>S-2-ベンゾイミダゾール、-CH=CHEt、-CH=CH-2-イミダゾール、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>OOC(=O)H、メトキシメトキシメチル、エトキシメトキシメチル、メトキシエトキシメチル、および2-ヒドロキシエチルよりなる群から選択される請求項3記載の化合物。

### 6. 一般式 (I):



{式中、 $R^1$ および $R^2$ のうち一方は：

- a)  $-\text{CO}(\text{CH}_2)_j\text{R}^4$  [ここに  $j$  は 1 ~ 6 であって、 $\text{R}^4$  は

  - 1) ハロゲン；
  - 2)  $-\text{NR}^5\text{R}^6$  (ここに  $\text{R}^5$  および  $\text{R}^6$  は独立して、水素、置換低級アルキル、非置換低級アルキル、置換アリール、非置換アリール、置換ヘテロアリール、非置換ヘテロアリール、置換アラルキル、非置換アラルキル、低級アルキルアミノカルボニル、もしくは低級アルコキシカルボニルであるか；または  $\text{R}^5$  および  $\text{R}^6$  は窒素原子と結合して複素環基を形成する)；
  - 3)  $\text{N}_3$ ；
  - 4)  $-\text{SR}^{27}$  (ここに  $\text{R}^{27}$  は：
    - i) 水素；
    - ii) 置換低級アルキル；
    - iii) 非置換低級アルキル；
    - iv) 置換アリール；
    - v) 非置換アリール；
    - vi) 置換ヘテロアリール；

- vii) 非置換ヘテロアリール；
- viii) 置換アラルキル；
- ix) 非置換アラルキル；
- x) チアゾリニル；
- xi)  $-(CH_2)_a CO_2 R^{28}$  (ここに  $a$  は 1 または 2 であって、  $R^{28}$  は水素および低級アルキルよりなる群から選択される)；および
- xii)  $-(CH_2)_a CON R^5 R^6$  よりなる群から選択される)；ならびに
- 5)  $OR^{29}$  (ここに  $R^{29}$  は水素、 置換低級アルキル、 非置換低級アルキル、 または  $COR^{30}$  (ここに  $R^{30}$  は水素、 低級アルキル、 置換アリール、 非置換アリール、 置換ヘテロアリール、 または非置換ヘテロアリールである) である)； よりなる群から選択される]
- b)  $-CH(OH)(CH_2)_b R^{4A}$  (ここに  $b$  は 1 ～ 6 であって、  $R^{4A}$  は水素または  $R^4$  の定義と同じである)；
- c)  $-(CH_2)_d CHR^{31} CO_2 R^{32}$  (ここに  $d$  は 0 ～ 5 であり、  $R^{31}$  は水素、  $-CON R^5 R^6$ 、 または  $-CO_2 R^{33}$  (ここに  $R^{33}$  は水素または低級アルキルである) であって、  $R^{32}$  は水素または低級アルキルである)；
- d)  $-(CH_2)_d CHR^{31} CON R^5 R^6$ ；
- e)  $-(CH_2)_k R^7$  [ここに  $k$  は 2 ～ 6 であって、  $R^7$  はハロゲン、  $CO_2 R^8$  (ここに  $R^8$  は水素、 低級アルキル、 置換アリール、 非置換アリール、 置換ヘテロアリール、 または非置換ヘテロアリールである)、  $CON R^5 R^6$ 、 置換アリール、 非置換アリール、 置換ヘテロアリール、 非置換ヘテロアリール、  $OR^9$  (ここに  $R^9$  は水素、 置換低級アルキル、 非置換低級アルキル、 アシル、 置換アリール、 または非置換アリールである)、  $SR^{27B}$  (ここに  $R^{27B}$  は  $R^{27}$  の定義と同じである)、  $NR^{10} R^{11}$  (ここに  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は  $R^5$  および  $R^6$  の定義と同じである) または  $N_3$  である]；
- f)  $-CH=CH(CH_2)_m R^{12}$  [ここに  $m$  は 0 ～ 4 であって、  $R^{12}$  は水素、 低級アルキル、  $CO_2 R^{8A}$  (ここに  $R^{8A}$  は  $R^8$  の定義と同じである)、  $-CON R^5 R^6$ 、

置換アリール、非置換アリール、置換ヘテロアリール、非置換ヘテロアリール、  
 $OR^{9A}$ (ここに $R^{9A}$ は $R^9$ の定義と同じである)、または $NR^{10A}R^{11A}$ (ここに  
 $R^{10A}$ および $R^{11A}$ は $R^5$ および $R^6$ の定義と同じである)である] ;

g)  $-CH=C(CO_2R^{33A})_2$ (ここに $R^{33A}$ は $R^{33}$ の定義と同じである) ;

h)  $-C\equiv C(CH_2)_nR^{13}$ (ここにnは0～4であって、 $R^{13}$ は $R^{12}$ の定義と  
 同じである) ; ならびに

i)  $-CH_2OR^{44}$ (ここに $R^{44}$ は置換低級アルキルである)

よりなる群から選択され ;

$R^1$ および $R^2$ のうち他方は :

j) 水素、低級アルキル、ハロゲン、アシル、ニトロ、または $NR^{14}R^{15}$   
 (ここに $R^{14}$ および $R^{15}$ のうち一方は水素または低級アルキルであって、他方は  
 水素、低級アルキル、アシル、カルバモイル、低級アルキルアミノカルボニル、  
 置換アリールアミノカルボニル、または非置換アリールアミノカルボニルであ  
 る) ;

k)  $-CH(SR^{34})_2$ (ここに $R^{34}$ は低級アルキルまたはアルキレンである) ;

l)  $-CH_2R^{35}$ [ここに $R^{35}$ は $OR^{36}$ (ここに $R^{36}$ は3個の低級アルキル基が  
 同一もしくは異なるトリ-低級アルキルシリルであるか、または $R^{29}$ の定義と同  
 じである)、または $SR^{37}$ (ここに $R^{37}$ は $R^{27}$ の定義と同じである)である] ;

m)  $-CO(CH_2)_qR^{16}$ (ここにqは1～6であって、 $R^{16}$ は $R^4$ の定義と同じ  
 である) ;

n)  $-CH(OH)(CH_2)_eR^{38}$ (ここにeは1～6であって、 $R^{38}$ は $R^{4A}$ の定  
 義と同じである) ;

o)  $-(CH_2)_fCHR^{39}CO_2R^{40}$ (ここにfは0～5であり、 $R^{39}$ は $R^{31}$ の定  
 義と同じであって、 $R^{40}$ は $R^{32}$ の定義と同じである) ;

p)  $-(CH_2)_rR^{17}$ (ここにrは2～6であって、 $R^{17}$ は $R^7$ と同一である) ;

q)  $-CH=CH(CH_2)_tR^{18}$ (ここにtは0～4であって、 $R^{18}$ は $R^{12}$ の定義  
 同じである) ;

r)  $-CH=C(CO_2R^{33B})_2$ (ここに $R^{33B}$ は $R^{33}$ の定義と同じである) ; なら

びに

s)  $-C\equiv C(CH_2)_u R^{19}$  (ここにuは0~4であって、 $R^{19}$ は $R^{13}$ の定義と同じである)

よりなる群から選択され；

$R^3$ は水素、アシル、または低級アルキルであり；

Xは：

a) 水素；

b) ホルミル；

c) 低級アルコキシカルボニル；

d)  $-CONR^{20}R^{21}$  [ここに $R^{20}$ および $R^{21}$ は独立して：

水素；

低級アルキル；

$-CH_2R^{22}$  (ここに $R^{22}$ はヒドロキシである)；または

$-NR^{23}R^{24}$  (ここに $R^{23}$ および $R^{24}$ のうち一方は水素または低級アルキルであって、他方は水素、低級アルキル、またはカルボキシル基のヒドロキシ基が除かれた $\alpha$ -アミノ酸の残基であるか、あるいは $R^{23}$ および $R^{24}$ は窒素原子と結合して複素環基を形成する)である]；および

e)  $-CH=N-R^{25}$  (ここに $R^{25}$ はヒドロキシ、低級アルコキシ、アミノ、グアニジノ、またはイミダゾリルアミノである)

よりなる群から選択され；

Yはヒドロキシ、低級アルコキシ、アラルキルオキシ、またはアシルオキシであり；あるいは

XおよびYは一緒になって、 $-X-Y-$ 、 $=O$ 、 $-CH_2O(C=O)O-$ 、 $-CH_2OC(=S)O-$ 、 $-CH_2NR^{26}C(=O)-$  (ここに $R^{26}$ は水素または低級アルキル)、 $-CH_2NHC(=S)O-$ 、 $-CH_2OS(=O)O-$ 、または $-CH_2OC(CH_3)_2O-$ を表し；ならびに

$W^1$ および $W^2$ は水素であるか、あるいは $W^1$ および $W^2$ は一緒になって酸素を表す} によって定義される化合物、またはその医薬上許容される塩を有効成分とする

る、栄養因子応答性細胞の機能増強剤。

7. 少なくとも1種の請求項2記載の化合物を有効成分とする、栄養因子応答性細胞の機能増強剤。

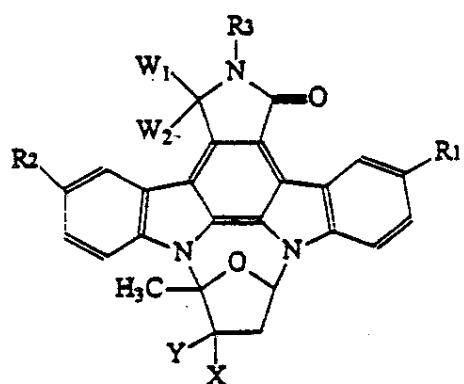
8. 少なくとも1種の請求項5記載の化合物を有効成分とする、栄養因子応答性細胞の機能増強剤。

9. 栄養因子応答性細胞が哺乳動物中に存在する栄養因子応答性細胞である請求項6記載の栄養因子応答性細胞の機能増強剤。

10. 栄養因子応答性細胞がニューロンである請求項6記載の栄養因子応答性細胞の機能増強剤。

11. ニューロンがコリン作動性ニューロンおよび知覚ニューロンよりなる群から選択される請求項10記載の栄養因子応答性細胞の機能増強剤。

12. 一般式(I)：



{式中、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>のうち一方は：

- a) -CO(CH<sub>2</sub>)<sub>j</sub>R<sup>4</sup>[ここにjは1~6であって、R<sup>4</sup>は  
 1) ハロゲン；  
 2) -NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>(ここにR<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>は独立して、水素、置換低級アルキル、非置換低級アルキル、置換アリール、非置換アリール、置換ヘテロアリール、非置換ヘテロアリール、置換アラルキル、非置換アラルキル、低級アルキルアミノカルボニル、もしくは低級アルコキシカルボニルであるか；またはR<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>は窒素原子と結合して複素環基を形成する)；  
 3) N<sub>3</sub>；

4)  $-SR^{27}$  (ここに  $R^{27}$  は：

- i) 水素；
- ii) 置換低級アルキル；
- iii) 非置換低級アルキル；
- iv) 置換アリール；
- v) 非置換アリール；
- vi) 置換ヘテロアリール；
- vii) 非置換ヘテロアリール；
- viii) 置換アルキル；
- ix) 非置換アルキル；
- x) チアゾリニル；
- xi)  $-(CH_2)_aCO_2R^{28}$  (ここに  $a$  は 1 または 2 であって、  $R^{28}$  は水素および低級アルキルよりなる群から選択される)；および
- xii)  $-(CH_2)_aCONR^5R^6$

よりなる群から選択される)；ならびに

5)  $OR^{29}$  (ここに  $R^{29}$  は水素、 置換低級アルキル、 非置換低級アルキル、 または  $COR^{30}$  (ここに  $R^{30}$  は水素、 低級アルキル、 置換アリール、 非置換アリール、 置換ヘテロアリール、 または非置換ヘテロアリールである) である)；  
よりなる群から選択される]

b)  $-CH(OH)(CH_2)_bR^{4A}$  (ここに  $b$  は 1 ～ 6 であって、  $R^{4A}$  は水素または  $R^4$  の定義と同じである)；

c)  $-(CH_2)_dCHR^{31}CO_2R^{32}$  (ここに  $d$  は 0 ～ 5 であり、  $R^{31}$  は水素、  $-CONR^5R^6$ 、 または  $-CO_2R^{33}$  (ここに  $R^{33}$  は水素または低級アルキルである) であって、  $R^{32}$  は水素または低級アルキルである)；

d)  $-(CH_2)_dCHR^{31}CONR^5R^6$ ；

e)  $-(CH_2)_kR^7$  [ここに  $k$  は 2 ～ 6 であって、  $R^7$  はハロゲン、  $CO_2R^8$  (ここに  $R^8$  は水素、 低級アルキル、 置換アリール、 非置換アリール、 置換ヘテロアリール、 または非置換ヘテロアリールである)、  $CONR^5R^6$ 、 置換アリール、

非置換アリール、置換ヘテロアリール、非置換ヘテロアリール、OR<sup>9</sup>(ここにR<sup>9</sup>は水素、置換低級アルキル、非置換低級アルキル、アシル、置換アリール、または非置換アリールである)、SR<sup>27B</sup>(ここにR<sup>27B</sup>はR<sup>27</sup>の定義と同じである)、NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>(ここにR<sup>10</sup>およびR<sup>11</sup>はR<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>の定義と同じである)またはN<sub>3</sub>である] ;

f) -CH=CH(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>R<sup>12</sup>[ここにmは0～4であって、R<sup>12</sup>は水素、低級アルキル、CO<sub>2</sub>R<sup>8A</sup>(ここにR<sup>8A</sup>はR<sup>8</sup>の定義と同じである)、-CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、置換アリール、非置換アリール、置換ヘテロアリール、非置換ヘテロアリール、OR<sup>9A</sup>(ここにR<sup>9A</sup>はR<sup>9</sup>の定義と同じである)、またはNR<sup>10A</sup>R<sup>11A</sup>(ここにR<sup>10A</sup>およびR<sup>11A</sup>はR<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>の定義と同じである)である] ;

g) -CH=C(CO<sub>2</sub>R<sup>33A</sup>)<sub>2</sub>(ここにR<sup>33A</sup>はR<sup>33</sup>の定義と同じである) ;

h) -C≡C(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>R<sup>13</sup>(ここにnは0～4であって、R<sup>13</sup>はR<sup>12</sup>の定義と同じである) ; ならびに

i) -CH<sub>2</sub>OR<sup>44</sup>(ここにR<sup>44</sup>は置換低級アルキルである)

よりなる群から選択され ;

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>のうち他方は :

j) 水素、低級アルキル、ハロゲン、アシル、ニトロ、またはNR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>(ここにR<sup>14</sup>およびR<sup>15</sup>のうち一方は水素または低級アルキルであって、他方は水素、低級アルキル、アシル、カルバモイル、低級アルキルアミノカルボニル、置換アリールアミノカルボニル、または非置換アリールアミノカルボニルである) ;

k) -CH(SR<sup>34</sup>)<sub>2</sub>(ここにR<sup>34</sup>は低級アルキルまたはアルキレンである) ;

l) -CH<sub>2</sub>R<sup>35</sup>[ここにR<sup>35</sup>はOR<sup>36</sup>(ここにR<sup>36</sup>は3個の低級アルキル基が同一もしくは異なるトリ-低級アルキルシリルであるか、またはR<sup>29</sup>の定義と同じである)、またはSR<sup>37</sup>(ここにR<sup>37</sup>はR<sup>27</sup>の定義と同じである)である] ;

m) -CO(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>16</sup>(ここにqは1～6であって、R<sup>16</sup>はR<sup>4</sup>の定義と同じである) ;

n) -CH(OH)(CH<sub>2</sub>)<sub>e</sub>R<sup>38</sup>(ここにeは1～6であって、R<sup>38</sup>はR<sup>4A</sup>の定

義と同じである) ;

o)  $-(CH_2)_fCHR^{39}CO_2R^{40}$  (ここに  $f$  は 0 ~ 5 であり、  $R^{39}$  は  $R^{31}$  の定義と同じであって、  $R^{40}$  は  $R^{32}$  の定義と同じである) ;

p)  $-(CH_2)_rR^{17}$  (ここに  $r$  は 2 ~ 6 であって、  $R^{17}$  は  $R^7$  の定義と同じである) ;

q)  $-CH=CH(CH_2)_tR^{18}$  (ここに  $t$  は 0 ~ 4 であって、  $R^{18}$  は  $R^{12}$  の定義と同じである) ;

r)  $-CH=C(CO_2R^{33B})_2$  (ここに  $R^{33B}$  は  $R^{33}$  の定義と同じである) ; ならびに

s)  $-C\equiv C(CH_2)_uR^{19}$  (ここに  $u$  は 0 ~ 4 であって、  $R^{19}$  は  $R^{13}$  の定義と同じである)

よりなる群から選択され ;

$R^3$  は水素、 アシル、 または低級アルキルであり ;

X は :

a) 水素 ;

b) ホルミル ;

c) 低級アルコキシカルボニル ;

d)  $-CONR^{20}R^{21}$  [ここに  $R^{20}$  および  $R^{21}$  は独立して :

水素 ;

低級アルキル ;

$-CH_2R^{22}$  (ここに  $R^{22}$  はヒドロキシである) ; または

$-NR^{23}R^{24}$  (ここに  $R^{23}$  および  $R^{24}$  のうち一方は水素または低級アルキルであって、 他方は水素、 低級アルキル、 またはカルボキシル基のヒドロキシ基が除かれた  $\alpha$ -アミノ酸の残基であるか、 あるいは  $R^{23}$  および  $R^{24}$  は窒素原子と結合して複素環基を形成する) である] ; および

e)  $-CH=N-R^{25}$  (ここに  $R^{25}$  はヒドロキシ、 低級アルコキシ、 アミノ、 グアニジノ、 またはイミダゾリルアミノである)

よりなる群から選択され ;

Yはヒドロキシ、低級アルコキシ、アラルキルオキシ、またはアシルオキシであり；あるいは

XおよびYは一緒になって、-X-Y-、=O、-CH<sub>2</sub>O(C=O)O-、-CH<sub>2</sub>O C(=S)O-、-CH<sub>2</sub>NR<sup>26</sup>C(=O)-（ここにR<sup>26</sup>は水素または低級アルキル）、-CH<sub>2</sub>NHC(=S)O-、-CH<sub>2</sub>OS(=O)O-、または-CH<sub>2</sub>O C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>O-を表し；ならびに

W<sup>1</sup>およびW<sup>2</sup>は水素であるか、あるいはW<sup>1</sup>およびW<sup>2</sup>は一緒になって酸素を表す}によって定義される化合物、またはその医薬上許容される塩を有効成分とする、栄養因子応答性細胞の生存性増強剤。

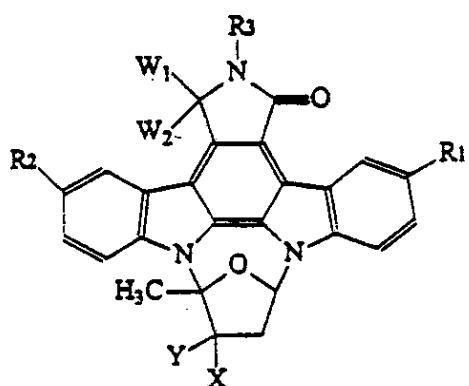
13. 請求項2記載の化合物を有効成分とする、栄養因子応答性細胞の生存性増強剤。

14. 請求項5記載の化合物を有効成分とする、栄養因子応答性細胞の生存性増強剤。

15. 栄養因子応答性細胞がニューロンである請求項12記載の栄養因子応答性細胞の生存性増強剤。

16. ニューロンがコリン作動性ニューロンである請求項15記載の栄養因子応答性細胞の生存性増強剤。

17. 一般式(I)：



{式中、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>のうち一方は：

- a) -CO(CH<sub>2</sub>)<sub>j</sub>R<sup>4</sup>[ここにjは1～6であって、R<sup>4</sup>は  
1) ハロゲン；

2)  $-NR^5R^6$  (ここに  $R^5$  および  $R^6$  は独立して、水素、置換低級アルキル、非置換低級アルキル、置換アリール、非置換アリール、置換ヘテロアリール、非置換ヘテロアリール、置換アラルキル、非置換アラルキル、低級アルキルアミノカルボニル、もしくは低級アルコキシカルボニルであるか；または  $R^5$  および  $R^6$  は窒素原子と結合して複素環基を形成する)；

3)  $N_3$ ；

4)  $-SR^{27}$  (ここに  $R^{27}$  は：

- i) 水素；
- ii) 置換低級アルキル；
- iii) 非置換低級アルキル；
- iv) 置換アリール；
- v) 非置換アリール；
- vi) 置換ヘテロアリール；
- vii) 非置換ヘテロアリール；
- viii) 置換アラルキル；
- ix) 非置換アラルキル；
- x) チアゾリニル；

xii)  $-(CH_2)_aCO_2R^{28}$  (ここに  $a$  は 1 または 2 であって、 $R^{28}$  は水素および低級アルキルよりなる群から選択される)；および

xiii)  $-(CH_2)_aCONR^5R^6$

よりなる群から選択される)；ならびに

5)  $OR^{29}$  (ここに  $R^{29}$  は水素、置換低級アルキル、非置換低級アルキル、または  $COR^{30}$  (ここに  $R^{30}$  は水素、低級アルキル、置換アリール、非置換アリール、置換ヘテロアリール、または非置換ヘテロアリールである)である)；  
よりなる群から選択される]

b)  $-CH(OH)(CH_2)_bR^{4A}$  (ここに  $b$  は 1 ～ 6 であって、 $R^{4A}$  は水素または  $R^4$  の定義と同じである)；

c)  $-(CH_2)_dCHR^{31}CO_2R^{32}$  (ここに  $d$  は 0 ～ 5 であり、 $R^{31}$  は水素、

-CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、または-CO<sub>2</sub>R<sup>33</sup>(ここにR<sup>33</sup>は水素または低級アルキルである)であって、R<sup>32</sup>は水素または低級アルキルである)；

- d) -(CH<sub>2</sub>)<sub>d</sub>CHR<sup>31</sup>CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>；
- e) -(CH<sub>2</sub>)<sub>k</sub>R<sup>7</sup>[ここにkは2～6であって、R<sup>7</sup>はハロゲン、CO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>(ここにR<sup>8</sup>は水素、低級アルキル、置換アリール、非置換アリール、置換ヘテロアリール、または非置換ヘテロアリールである)、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、置換アリール、非置換アリール、置換ヘテロアリール、非置換ヘテロアリール、OR<sup>9</sup>(ここにR<sup>9</sup>は水素、置換低級アルキル、非置換低級アルキル、アシル、置換アリール、または非置換アリールである)、SR<sup>27B</sup>(ここにR<sup>27B</sup>はR<sup>27</sup>の定義と同じである)、NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>(ここにR<sup>10</sup>およびR<sup>11</sup>はR<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>の定義と同じである)またはN<sub>3</sub>である]；
- f) -CH=CH(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>R<sup>12</sup>[ここにmは0～4であって、R<sup>12</sup>は水素、低級アルキル、CO<sub>2</sub>R<sup>8A</sup>(ここにR<sup>8A</sup>はR<sup>8</sup>の定義と同じである)、-CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、置換アリール、非置換アリール、置換ヘテロアリール、非置換ヘテロアリール、OR<sup>9A</sup>(ここにR<sup>9A</sup>はR<sup>9</sup>の定義と同じである)、またはNR<sup>10A</sup>R<sup>11A</sup>(ここにR<sup>10A</sup>およびR<sup>11A</sup>はR<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>と同一である)である]；
- g) -CH=C(CO<sub>2</sub>R<sup>33A</sup>)<sub>2</sub>(ここにR<sup>33A</sup>はR<sup>33</sup>の定義と同じである)；
- h) -C≡C(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>R<sup>13</sup>(ここにnは0～4であって、R<sup>13</sup>はR<sup>12</sup>の定義と同じである)；ならびに
- i) -CH<sub>2</sub>OR<sup>44</sup>(ここにR<sup>44</sup>は置換低級アルキルである)よりなる群から選択され；
- R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>のうち他方は：
- j) 水素、低級アルキル、ハロゲン、アシル、ニトロ、またはNR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>(ここにR<sup>14</sup>およびR<sup>15</sup>のうち一方は水素または低級アルキルであって、他方は水素、低級アルキル、アシル、カルバモイル、低級アルキルアミノカルボニル、置換アリールアミノカルボニル、または非置換アリールアミノカルボニルである)；
- k) -CH(SR<sup>34</sup>)<sub>2</sub>(ここにR<sup>34</sup>は低級アルキルまたはアルキレンである)；

- 1)  $-\text{CH}_2\text{R}^{35}$  [ここに  $\text{R}^{35}$  は  $\text{OR}^{36}$  (ここに  $\text{R}^{36}$  は 3 個の低級アルキル基が同一もしくは異なるトリー低級アルキルシリルであるか、または  $\text{R}^{29}$  の定義と同じである)、または  $\text{SR}^{37}$  (ここに  $\text{R}^{37}$  は  $\text{R}^{27}$  の定義と同じである) である] ;
- m)  $-\text{CO}(\text{CH}_2)_q\text{R}^{16}$  (ここに  $q$  は 1 ~ 6 であって、 $\text{R}^{16}$  は  $\text{R}^4$  の定義と同じである) ;
- n)  $-\text{CH}(\text{OH})(\text{CH}_2)_e\text{R}^{38}$  (ここに  $e$  は 1 ~ 6 であって、 $\text{R}^{38}$  は  $\text{R}^{4A}$  の定義と同じである) ;
- o)  $-(\text{CH}_2)_f\text{CHR}^{39}\text{CO}_2\text{R}^{40}$  (ここに  $f$  は 0 ~ 5 であり、 $\text{R}^{39}$  は  $\text{R}^{31}$  の定義と同じであって、 $\text{R}^{40}$  は  $\text{R}^{32}$  の定義と同じである) ;
- p)  $-(\text{CH}_2)_r\text{R}^{17}$  (ここに  $r$  は 2 ~ 6 であって、 $\text{R}^{17}$  は  $\text{R}^7$  の定義と同じである) ;
- q)  $-\text{CH}=\text{CH}(\text{CH}_2)_t\text{R}^{18}$  (ここに  $t$  は 0 ~ 4 であって、 $\text{R}^{18}$  は  $\text{R}^{12}$  の定義と同じである) ;
- r)  $-\text{CH}=\text{C}(\text{CO}_2\text{R}^{33B})_2$  (ここに  $\text{R}^{33B}$  は  $\text{R}^{33}$  の定義と同じである) ; ならびに
- s)  $-\text{C}\equiv\text{C}(\text{CH}_2)_u\text{R}^{19}$  (ここに  $u$  は 0 ~ 4 であって、 $\text{R}^{19}$  は  $\text{R}^{13}$  の定義と同じである)
- よりなる群から選択され ;
- $\text{R}^3$  は水素、アシル、または低級アルキルであり ;
- X は :
- a) 水素 ;
- b) ホルミル ;
- c) 低級アルコキシカルボニル ;
- d)  $-\text{CONR}^{20}\text{R}^{21}$  [ここに  $\text{R}^{20}$  および  $\text{R}^{21}$  は独立して :
- 水素 ;
- 低級アルキル ;
- $-\text{CH}_2\text{R}^{22}$  (ここに  $\text{R}^{22}$  はヒドロキシである) ; または
- $-\text{NR}^{23}\text{R}^{24}$  (ここに  $\text{R}^{23}$  および  $\text{R}^{24}$  のうち一方は水素または低級アルキ

ルであって、他方は水素、低級アルキル、またはカルボキシル基のヒドロキシ基が除かれた $\alpha$ -アミノ酸の残基であるか、あるいはR<sup>23</sup>およびR<sup>24</sup>は窒素原子と結合して複素環基を形成する)である] ; および

e)  $-\text{CH}=\text{N}-\text{R}^{25}$  (ここにR<sup>25</sup>はヒドロキシ、低級アルコキシ、アミノ、グアニジノ、またはイミダゾリルアミノである)  
よりなる群から選択され ;

Yはヒドロキシ、低級アルコキシ、アラルキルオキシ、またはアシルオキシであり ; あるいは

XおよびYは一緒になって、 $-\text{X}-\text{Y}-$ 、=O、 $-\text{CH}_2\text{O}(\text{C}=\text{O})\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{O}\text{C}(=\text{S})\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}\text{R}^{26}\text{C}(=\text{O})-$  (ここにR<sup>26</sup>は水素または低級アルキル)、 $-\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{S})\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{O}\text{S}(=\text{O})\text{O}-$ 、または $-\text{CH}_2\text{O}\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{O}-$ を表し ; ならびに

W<sup>1</sup>およびW<sup>2</sup>は水素であるか、あるいはW<sup>1</sup>およびW<sup>2</sup>は一緒になって酸素を表す} によって定義される化合物、またはその医薬上許容される塩有効成分とする、死滅する危険性にある細胞の生存性増強剤。

18. 請求項2記載の化合物を有効成分とする、死滅する危険性にある細胞の生存性増強剤。

19. 請求項5記載の化合物を有効成分とする、死滅する危険性にある細胞の生存性増強剤。

20. 細胞が、老化、外傷、および疾病よりなる群から選択されるプロセスに起因して死滅する危険性にある細胞である請求項17記載の死滅する危険性にある細胞の生存性増強剤。

21. 細胞がニューロンである請求項20記載の死滅する危険性にある細胞の生存性増強剤。

22. 請求項16記載の化合物を有効成分とする、ハンチントン舞踏病の治療剤。