

【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20年2月7日 (2008.2.7)

【公表番号】特表2007-515429(P2007-515429A)

【公表日】平成19年6月14日 (2007.6.14)

【年通号数】公開・登録公報2007-022

【出願番号】特願2006-545607(P2006-545607)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/381 (2006.01)

C 0 7 D 333/38 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

C 0 7 D 333/68 (2006.01)

C 0 7 D 333/78 (2006.01)

C 0 7 D 333/80 (2006.01)

C 1 2 N 15/09 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/381

C 0 7 D 333/38

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 9/12

C 0 7 D 333/68

C 0 7 D 333/78

C 0 7 D 333/80

C 1 2 N 15/00 Z N A A

【手続補正書】

【提出日】平成19年12月11日 (2007.12.11)

【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】

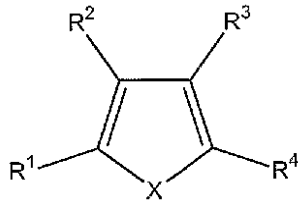
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

被験体における障害を治療または予防するための組成物であって、該組成物は、式 (I)

:

【化 1】



式 (I)

を有する化合物の有効量を含有し、
ここで、

R¹ は、H、ハロ、C₁ ~ C₁₀ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₆ ~ C₁₀ アリール、C₅ ~ C₁₀ ヘテロアリール、C₇ ~ C₁₂ アラルキル、C₇ ~ C₁₂ ヘテロアラルキル、C₃ ~ C₈ ヘテロシクリル、C₂ ~ C₁₂ アルケニル、C₂ ~ C₁₂ アルキニル、C₅ ~ C₁₀ シクロアルケニル、C₅ ~ C₁₀ ヘテロシクロアルケニルであるか；または R² およびそれが結合している炭素と一緒にあって、C₅ ~ C₁₀ シクロアルケニル、C₅ ~ C₁₀ ヘテロシクロアルケニル、C₆ ~ C₁₀ アリールまたは C₆ ~ C₁₀ ヘテロアリールを形成し；その各々は必要に応じて 1 ~ 5 個の R⁵ で置換され得；

R² は、H、ハロ、C₁ ~ C₁₀ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₆ ~ C₁₀ アリール、C₅ ~ C₁₀ ヘテロアリール、C₇ ~ C₁₂ アラルキル、C₇ ~ C₁₂ ヘテロアラルキル、C₃ ~ C₈ ヘテロシクリル、C₂ ~ C₁₂ アルケニル、C₂ ~ C₁₂ アルキニル、C₅ ~ C₁₀ シクロアルケニル、C₅ ~ C₁₀ ヘテロシクロアルケニルであるか；または R² およびそれが結合している炭素と一緒にあって、C₅ ~ C₁₀ シクロアルケニル、C₅ ~ C₁₀ ヘテロシクロアルケニル、C₆ ~ C₁₀ アリールまたは C₆ ~ C₁₀ ヘテロアリールを形成し；その各々は必要に応じて 1 ~ 5 個の R⁶ で置換され得；

R³ および R⁴ の各々は独立して、H、ハロ、ヒドロキシ、C₁ ~ C₁₀ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₁ ~ C₁₀ アルコキシ、C₁ ~ C₆ ハロアルコキシ、C₆ ~ C₁₀ アリール、C₅ ~ C₁₀ ヘテロアリール、C₇ ~ C₁₂ アラルキル、C₇ ~ C₁₂ ヘテロアラルキル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₃ ~ C₈ ヘテロシクリル、C₂ ~ C₁₂ アルケニル、C₂ ~ C₁₂ アルキニル、C₅ ~ C₁₀ シクロアルケニル、C₅ ~ C₁₀ ヘテロシクロアルケニル、カルボキシ、カルボキシレート、シアノ、ニトロ、アミノ、C₁ ~ C₆ アルキルアミノ、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、SO₃R⁹、サルフェート、S(O)N(R⁹)₂、S(O)₂N(R⁹)₂、ホスフェート、C₁ ~ C₄ アルキレンジオキシ、アシル、アミド、アミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノカルボニル、アミノカルボニルアルキル、C₁ ~ C₁₀ アルコキシカルボニル、C₁ ~ C₁₀ チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルヒドラジノカルボニル、C₁ ~ C₆ ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルであり；その各々は独立して 1 個以上の R⁷ で置換され；

R⁵ および R⁶ の各々は独立して、ハロ、ヒドロキシ、C₁ ~ C₁₀ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₁ ~ C₁₀ アルコキシ、C₁ ~ C₆ ハロアルコキシ、C₂ ~ C₁₂ アルケニル、C₂ ~ C₁₂ アルキニル、オキソ、カルボキシ、カルボキシレート、シアノ、ニトロ、アミノ、C₁ ~ C₆ アルキルアミノ、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、SO₃R⁹、サルフェート、S(O)N(R⁹)₂、S(O)₂N(R⁹)₂、ホスフェート、C₁ ~ C₄ アルキレンジオキシ、アシル、アミド、アミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₁₀ アルコキシカルボニル、C₁ ~ C₁₀ チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキ

ルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルであり；

各 R^7 は独立して、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、アミノカルボニル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロシクリルアルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロシクロアルケニルアルキルまたは $C_7 \sim C_{12}$ シクロアルケニルアルキルであり；その各々は必要に応じて 1 ～ 4 個の R^{10} で置換されており；

X は、 NR^8 、O または S であり；

R^8 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アリールアルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアリールアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロシクリルアルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロシクロアルケニルアルキルまたは $C_7 \sim C_{12}$ シクロアルケニルアルキルであり；

R^9 は、H または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；そして、

各 R^{10} は独立して、ハロ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ニトロ、アミノ、シアノ、アミドまたはアミノカルボニルである、

組成物。

【請求項 2】

R^1 および R^2 は、それらが結合している炭素と一緒にあって、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリールまたは $C_6 \sim C_{10}$ ヘテロアリールを形成する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

R^1 および R^2 は、それらが結合している炭素と一緒にあって、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニルを形成する、請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

R^1 および R^2 は、それらが結合している炭素と一緒にあって、必要に応じて 1 個または 2 個の $C_1 \sim C_6$ アルキルで置換された $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニルを形成する、請求項 3 に記載の組成物。

【請求項 5】

R^1 および R^2 は、一緒にあって、 $C_1 \sim C_6$ アルキルで置換された $C_5 \sim C_7$ シクロアルケニル環を形成する、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 6】

R^1 が $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニルまたは $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

R^1 が $C_6 \sim C_{10}$ アリールである、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 8】

R^2 が H、ハロ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 9】

R^3 がカルボキシ、シアノ、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルチオイルカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルヒドラジノカルボニルまたはヒドロキシアミノカルボニルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 10】

R³ がアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルヒドラジノカルボニル、C₁ ~ C₆ ジアルキルヒドラジノカルボニルまたはヒドロキシアミノカルボニルである、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 11】

R³ がアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノカルボニルまたは C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノカルボニルである、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】

R³ が H、チオアルコキシまたはチオアリーロキシである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 13】

R⁴ がニトロ、アミノ、C₁ ~ C₆ アルキルアミノ、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノまたはアミドである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 14】

R⁴ がアミノまたはアミドである、請求項 13 に記載の組成物。

【請求項 15】

R⁴ がアミノカルボニルアルキルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 16】

前記アミノカルボニルアルキルのアミノがアリール、アリールアルキル、アルキルなどで置換されている、請求項 15 に記載の組成物。

【請求項 17】

各置換基が独立してハロ、ヒドロキシまたはアルコキシでさらに置換され得る、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 18】

R³ がアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノカルボニルまたは C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノカルボニルであり；そして、
R⁴ がアミノ、C₁ ~ C₆ アルキルアミノ、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノまたはアミドである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 19】

X が S である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 20】

X が NR⁸ である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 21】

R⁸ が H、C₁ ~ C₆ アルキルまたは C₇ ~ C₁₀ アリールアルキルである、請求項 20 に記載の組成物。

【請求項 22】

請求項 1 に記載の組成物であって、ここで、

R¹ は、C₆ ~ C₁₀ アリール、C₅ ~ C₁₀ ヘテロアリール、C₇ ~ C₁₂ アラルキル、C₇ ~ C₁₂ ヘテロアラルキル、C₃ ~ C₈ ヘテロシクリル、C₅ ~ C₁₀ シクロアルケニルまたは C₅ ~ C₁₀ ヘテロシクロアルケニルであるか；または R² およびそれが結合している炭素と一緒になる場合は C₅ ~ C₁₀ シクロアルケニルを形成し；

R² は、H、ハロ、C₁ ~ C₁₀ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキルであるか；または R¹ およびそれが結合している炭素と一緒になる場合、C₅ ~ C₁₀ シクロアルケニルを形成し；

R³ は、アミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルヒドラジノカルボニル、C₁ ~ C₆ ジアルキルヒドラジノカルボニルまたはヒドロキシアミノカルボニルであり；

R⁴ は、アミノ、C₁ ~ C₆ アルキルアミノ、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノまたはアミドであり；そして、

XはSである、
組成物。

【請求項23】

請求項1に記載の組成物であって、ここで、

R¹およびR²は、それらが結合している炭素と一緒に、C₅～C₁₀シクロアルケニルを形成し；

R³は、アミノカルボニル、C₁～C₆アルキルアミノカルボニルまたはC₁～C₆ジアルキルアミノカルボニルであり；

R⁴は、アミノ、C₁～C₆アルキルアミノ、C₁～C₆ジアルキルアミノまたはアミドであり；そして、

Xは、Sである、
組成物。

【請求項24】

前記化合物が、非Sirt1サーチインと比較してSirt1を優先的に阻害する、請求項1に記載の組成物。

【請求項25】

前記化合物が、Sirt1に対して少なくとも5倍の優先度を有する、請求項1に記載の組成物。

【請求項26】

前記化合物が、約1μM未満のSirt1に対するK_iを有する、請求項1に記載の組成物。

【請求項27】

前記障害が腫瘍性障害である、請求項1に記載の組成物。

【請求項28】

前記腫瘍性障害が癌である、請求項27に記載の組成物。

【請求項29】

前記障害が神経変性障害である、請求項1に記載の組成物。

【請求項30】

前記神経変性障害がアルツハイマー病またはパーキンソン病である、請求項29に記載の組成物。

【請求項31】

前記障害が脂肪細胞関連障害である、請求項1に記載の組成物。

【請求項32】

前記化合物の投与が被験体における脂肪生成を増強する、請求項31に記載の組成物。

【請求項33】

前記障害が糖尿病である、請求項1に記載の組成物。

【請求項34】

前記被験体がI型糖尿病を有する、請求項33に記載の組成物。

【請求項35】

前記被験体がII型糖尿病を有する、請求項33に記載の組成物。

【請求項36】

前記被験体が糖尿病の危険性を有すると同定される、請求項1に記載の組成物。

【請求項37】

前記被験体が損なわれた耐糖能を有することにより糖尿病の危険性を有すると同定される、請求項36に記載の組成物。

【請求項38】

前記被験体が空腹時の高血糖症を有することにより糖尿病の危険性を有すると同定される、請求項36に記載の組成物。

【請求項39】

前記障害がメタボリックシンドロームである、請求項1に記載の組成物。

【請求項 40】

前記被験体がアテローム生成異脂肪血症を有する、請求項 39 に記載の組成物。

【請求項 41】

前記被験体が肥満である、請求項 39 に記載の組成物。

【請求項 42】

前記被験体がインスリン抵抗性または損なわれた耐糖能を有する、請求項 39 に記載の組成物。

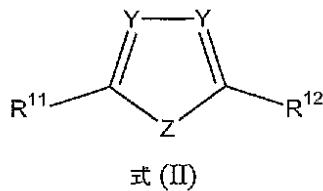
【請求項 43】

前記被験体が高血圧を有する、請求項 39 に記載の組成物。

【請求項 44】

被験体における障害を治療または予防するための組成物であって、該組成物は、式 (II) :

【化 2】



を有する化合物の有効量を含有し、
ここで、

R^{11} は、H、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、カルボキシ、カルボキシレート、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、 $SO_3(R^{13})$ 、サルフェート、 $S(O)N(R^{13})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{13})_2$ 、ホスフェート、 $C_1 \sim C_4$ アルキレンジオキシ、アシル、アミド、アミノカルボニル、アミノカルボニルアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルであり；ここで各々は必要に応じて R^{14} で置換されており；

R^{12} は、H、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリールオキシ、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリールオキシ、カルボキシ、カルボキシレート、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、 $SO_3(R^3)$ 、サルフェート、 $S(O)N(R^3)_2$ 、 $S(O)_2N(R^3)_2$ 、ホスフェート、 $C_1 \sim C_4$ アルキレンジオキシ、アシル、アミド、アミノカルボニル、アミノカルボニルアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルヒドラジノカルボニルまたはヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシ

アミノカルボニルであり；ここで各々は必要に応じて R^{15} で置換されており；

R^{13} は、H、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニルまたは $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニルであり；

R^{14} は、ヒドロキシ、カルボキシ、カルボキシレート、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、オキソ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、 SO_3H 、サルフェート、 $S(O)NH_2$ 、 $S(O)_2NH_2$ 、ホスフェート、アシル、アミジル、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルであり；

R^{15} は、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_6 \sim C_{10}$ アリールオキシ、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリールオキシ、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリールアルコキシまたは $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリールアルコキシであり；

Z は、 NR^{16} 、O または S であり；

各 Y は、独立して N または CR^{18} であり；

R^{16} は、H、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニルであるか；または R^{11} または R^{12} の 1 つおよび R^{16} は、4 ～ 6 個の炭素、1 ～ 3 個の窒素、0 ～ 2 個の酸素および 0 ～ 2 個の硫黄を含有する環状の部分形成し；ここで各々は必要に応じて R^{17} で置換されており；

R^{17} は、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、オキソ、メルカプト、チオアルコキシ、 SO_3H 、サルフェート、 $S(O)NH_2$ 、 $S(O)_2NH_2$ 、ホスフェート、アシル、アミド、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルであり；そして、

R^{18} は、H、ハロまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである、

組成物。

【請求項 45】

Z が NR^{16} である、請求項 44 に記載の 組成物。

【請求項 46】

Z が NR^{16} であり、そして R^{16} が $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキルまたは $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキルである、請求項 45 に記載の 組成物。

【請求項 47】

R^{16} が 1 個以上のハロ、アルキルまたはアルコキシで置換された $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキルまたは $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキルである、請求項 46 に記載の 組成物。

【請求項 48】

R^{11} がメルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、 $SO_3(R^{13})$ 、サルフェート、 $S(O)N(R^{13})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{13})_2$ である、請求項 44 に記載の組成物。

【請求項 49】

R^{11} がチオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシである、請求項 48 に記載の組成物。

【請求項 50】

R^{11} が、1 個以上のアシル、アミド、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルで置換されたチオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシである、請求項 49 に記載の組成物。

【請求項 51】

R^{11} が、1 個以上のアミド、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニルまたは $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニルで置換されたチオアルコキシである、請求項 50 に記載の組成物。

【請求項 52】

R^{11} がアミノカルボニルで置換されたチオアルコキシである、請求項 51 に記載の組成物。

【請求項 53】

R^{12} が $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニルである、請求項 44 に記載の組成物。

【請求項 54】

R^{12} が $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキルまたは $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキルである、請求項 53 に記載の組成物。

【請求項 55】

R^{12} が、1 個以上のハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_6 \sim C_{10}$ アリールオキシまたは $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリールオキシで置換された $C_1 \sim C_{10}$ アルキルである、請求項 54 に記載の組成物。

【請求項 56】

R^{12} が、アリールオキシで置換された $C_1 \sim C_{10}$ アルキルである、請求項 55 に記載の組成物。

【請求項 57】

各 Y が N である、請求項 44 に記載の組成物。

【請求項 58】

請求項 44 に記載の組成物であって、ここで、

R^{11} は、1 個以上のアシル、アミド、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルで置換されたチオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシであり；

R^{12} は、1 個以上のハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_6 \sim C_{10}$ アリールオキシまたは $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリールオキシで置換された $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；

Z は、 NR^{16} であり；

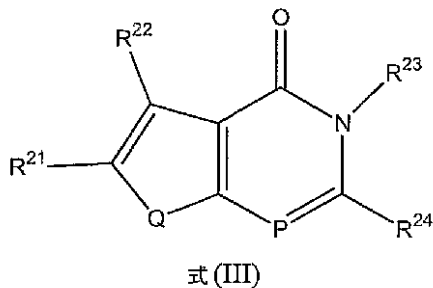
各 Y は、N であり；そして、

R^{16} は、1 個以上のハロ、アルキルまたはアルコキシで置換された $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキルまたは $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキルである、
組成物。

【請求項 59】

被験体における障害を治療または予防するための組成物であって、該組成物は、式 (III)：

【化 3】



を有する化合物の有効量を含有し、
ここで、

R^{21} は、ハロ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキルであるか；または R^{22} およびそれが結合している炭素と一緒に、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリールまたは $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリールを形成し；その各々は必要に応じて 1 ～ 5 個の R^{25} で置換され得；

R^{22} は、ハロ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキルであるか；または R^{21} およびそれが結合している炭素と一緒に、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリールまたは $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリールを形成し；その各々は必要に応じて 1 ～ 5 個の R^{26} で置換され；

R^{23} は、H、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、カルボキシ、カルボキシレート、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、アシル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ チオアルコキシカルボニルであり；

R^{24} は、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリールオキシ、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリールオキシ、カルボキシ、カルボキシ

レート、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、アシルまたはアミジルであり；その各々は必要に応じて R^{27} で置換されており；

各 R^{25} および R^{26} は、H、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、カルボキシ、カルボキシレート、オキソ、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、 SO_3H 、サルフェート、 $S(O)N(R^{28})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{28})_2$ 、ホスフェート、 $C_1 \sim C_4$ アルキレンジオキシ、アシル、アミジル、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルであり；

R^{27} は、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、カルボキシレート、オキソ、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、 SO_3H 、サルフェート、 $S(O)N(R^{28})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{28})_2$ 、ホスフェート、 $C_1 \sim C_4$ アルキレンジオキシ、アシル、アミジル、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルであり；

R^{28} は、H、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニルまたは $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニルであり；

Q は、S、O または NR^{29} であり；

R^{29} は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキルまたは $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキルであり；

P は、N または CR^{30} であり；そして、

R^{30} は、H または $C_1 \sim C_6$ アルキルである、

組成物。

【請求項 60】

R^{21} および R^{22} は、それらが結合している炭素と一緒にあって、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリールまたは $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリールを形成する、請求項 59 に記載の 組成物。

【請求項 61】

R^{21} および R^{22} は、それらが結合している炭素と一緒にあって、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニルを形成する、請求項 60 に記載の 組成物。

【請求項 62】

R^{23} が、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノまたはアシルである、請求項 59 に記載の 組成物。

【請求項 63】

$R^{2\ 3}$ が $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_5 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニルまたは $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニルである、請求項 6 2 に記載の組成物。

【請求項 6 4】

$R^{2\ 4}$ がハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリールオキシ、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリールオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシまたはチオヘテロアリールオキシである、請求項 5 9 に記載の組成物。

【請求項 6 5】

$R^{2\ 4}$ が $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、チオアルコキシ、チオアリールオキシまたはチオヘテロアリールオキシである、請求項 6 4 に記載の組成物。

【請求項 6 6】

$R^{2\ 4}$ が $C_1 \sim C_{10}$ アルキルまたはチオアルコキシであり；そして $R^{2\ 7}$ がカルボキシ、カルボキシレート、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、 SO_3H 、サルフェート、 $S(O)N(R^{2\ 8})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{2\ 8})_2$ 、ホスフェート、アシル、アミジル、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルである、請求項 6 5 に記載の組成物。

【請求項 6 7】

$R^{2\ 4}$ がカルボキシ、カルボキシレート、アミジルまたはアミノカルボニルで置換された $C_1 \sim C_{10}$ アルキルまたはチオアルコキシである、請求項 6 6 に記載の組成物。

【請求項 6 8】

X が S である、請求項 5 9 に記載の組成物。

【請求項 6 9】

Y が N である、請求項 5 9 に記載の組成物。

【請求項 7 0】

請求項 5 9 に記載の組成物であって、ここで、

$R^{2\ 1}$ および $R^{2\ 2}$ は、それらが結合している炭素と一緒にあって、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリールまたは $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリールを形成し；

$R^{2\ 3}$ は、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノまたはアシルであり；

$R^{2\ 4}$ は、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、チオアルコキシ、チオアリールオキシまたはチオヘテロアリールオキシであり；

$R^{2\ 7}$ は、カルボキシ、カルボキシレート、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、 SO_3H 、サルフェート、 $S(O)N(R^{2\ 8})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{2\ 8})_2$ 、ホスフェート、アシル、アミジル、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルヒドラジノカルボニル、

ノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルであり；
QはSであり；そして、
PはNである、

組成物。

【請求項 7 1】

請求項 5 9 に記載の組成物であって、ここで、

$R^{2\ 1}$ および $R^{2\ 2}$ は、それらが結合している炭素と一緒にあって、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニルまたは $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニルを形成し；

$R^{2\ 3}$ は、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノまたは $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノであり；

$R^{2\ 4}$ は、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、チオアルコキシ、チオアリールオキシまたはチオヘテロアリールオキシであり；

$R^{2\ 7}$ は、カルボキシ、カルボキシレート、 SO_3H 、サルフェート、 $S(O)N(R^{2\ 8})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{2\ 8})_2$ 、ホスフェート、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニルであり；

QはSであり；そして、

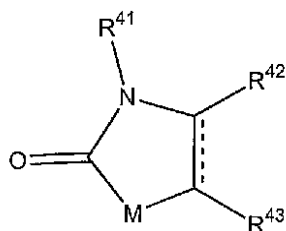
PはNである、

組成物。

【請求項 7 2】

被験体における障害を治療または予防するための組成物であって、該組成物は、式 (I V)：

【化 4】



式 (IV)

を有する化合物の有効量を含有し、

ここで、

$R^{4\ 1}$ は、H、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、カルボキシ、カルボキシレート、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、アシル、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニルまたは $C_1 \sim C_{10}$ チオアルコキシカルボニルであり；その各々は必要に応じて1個以上の $R^{4\ 4}$ で置換され；

$R^{4\ 2}$ および $R^{4\ 3}$ は、それらが結合している炭素と一緒にあって、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクリル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリールまたは $C_6 \sim C_{10}$ ヘテロアリールを

形成し；その各々は必要に応じて1～4個の R^{45} で置換され；

R^{44} は、H、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_6 \sim C_{10}$ アリーール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリーール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリーールオキシ、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリーールオキシ、カルボキシ、カルボキシレート、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリーールオキシ、チオヘテロアリーールオキシ、 SO_3H 、サルフェート、 $S(O)N(R^{46})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{46})_2$ 、ホスフェート、 $C_1 \sim C_4$ アルキレンジオキシ、アシル、アミド、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルヒドラジノカルボニルまたはヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルであり；

R^{45} は、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、オキソ、カルボキシ、カルボキシレート、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリーールオキシ、チオヘテロアリーールオキシ、 SO_3H 、サルフェート、 $S(O)N(R^{46})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{46})_2$ 、ホスフェート、 $C_1 \sim C_4$ アルキレンジオキシ、アシル、アミド、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルであり；

R^{46} は、H、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリーール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリーール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニルまたは $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニルであり；そして、

Mは、 NR^{47} 、SまたはOであり；

R^{47} は、H、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、カルボキシ、カルボキシレート、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、アシル、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニルである、

組成物。

【請求項73】

R^{42} および R^{43} は、それらが結合している炭素と一緒にあって、 $C_6 \sim C_{10}$ アリーールまたは $C_6 \sim C_{10}$ ヘテロアリーールを形成する、請求項72に記載の組成物。

【請求項74】

R^{42} および R^{43} は、それらが結合している炭素と一緒にあって、フェニルを形成する、請求項73に記載の組成物。

【請求項75】

R^{42} および R^{43} は、それらが結合している炭素と一緒にあって、フェニルを形成し；そしてハロまたは $C_1 \sim C_{10}$ アルキルで置換されている、請求項74に記載の組成物。

【請求項76】

R^{41} は $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；そして R^{44} はH、ハロ、 $C_6 \sim C_{10}$ アリーール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリーール、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、

C₅ ~ C₁₀ ヘテロシクロアルケニル、アシル、アミノ、C₁ ~ C₆ アルキルアミノ、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノ、アミド、アミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノカルボニル、カルボキシまたはC₁ ~ C₁₀ アルコキシカルボニルである、請求項 7 2 に記載の組成物。

【請求項 7 7】

M が O である、請求項 7 2 に記載の組成物。

【請求項 7 8】

請求項 7 2 に記載の組成物であって、ここで、

R^{4 1} は C₁ ~ C₁₀ アルキルであり；そして R^{4 4} は、アシル、アミノ、C₁ ~ C₆ アルキルアミノ、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノ、アミド、アミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノカルボニル、カルボキシまたはC₁ ~ C₁₀ アルコキシカルボニルであり；

R^{4 2} および R^{4 3} は、それらが結合している炭素と共に一緒になって、C₆ ~ C₁₀ アリールまたはC₆ ~ C₁₀ ヘテロアリールを形成し；そして、

M は O である、

組成物。