

【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

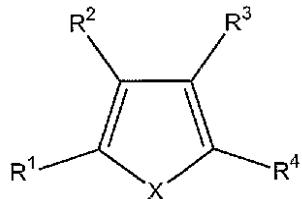
【補正の内容】

【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、

$R^1$  は、H、ハロ、 $C_1 \sim C_{10}$  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、 $C_3 \sim C_8$  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か；または $R^2$  およびそれが結合している炭素と一緒にになって、 $C_5 \sim C_{10}$  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し；その各々は必要に応じて1～5個の $R^5$  で置換され得；

$R^2$  は、H、ハロ、 $C_1 \sim C_{10}$  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、 $C_3 \sim C_8$  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か；または $R^2$  およびそれが結合している炭素と一緒にになって、 $C_5 \sim C_{10}$  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し；その各々は必要に応じて1～5個の $R^6$  で置換され得；

$R^3$  および $R^4$  の各々は独立して、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、 $S O_3 R^9$ 、サルフェート、 $S(O)N(R^9)_2$ 、 $S(O)_2N(R^9)_2$ 、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、アミノカルボニルアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$  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；その各々は独立して1個以上の $R^7$  で置換され；

$R^5$  および $R^6$  の各々は独立して、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、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、 $S O_3 R^9$ 、サルフェート、 $S(O)N(R^9)_2$ 、 $S(O)_2N(R^9)_2$ 、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

ルヒドラジノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>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<sup>7</sup>は独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、アミノカルボニル、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アラルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>ヘテロシクリル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルキニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロシクリルアルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>シクロアルキルアルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロシクロアルケニルアルキルまたはC<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>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<sup>10</sup>で置換されており；

Xは、NR<sup>8</sup>、OまたはSであり；

R<sup>8</sup>は、H、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アリールアルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロアリールアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>ヘテロシクリル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルキニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロシクリルアルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>シクロアルキルアルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロシクロアルケニルアルキルまたはC<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>シクロアルケニルアルキルであり；

R<sup>9</sup>は、HまたはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであり；そして、

各R<sup>10</sup>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<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は、それらが結合している炭素と一緒にになって、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリールまたはC<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>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<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は、それらが結合している炭素と一緒にになって、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>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<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は、それらが結合している炭素と一緒にになって、必要に応じて1個または2個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルで置換されたC<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>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<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は、一緒にになって、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルで置換されたC<sub>5</sub>～C<sub>7</sub>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<sup>1</sup>がC<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アラルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>ヘテロシクリル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニルまたはC<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>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<sup>1</sup>がC<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリールである、請求項6に記載の組成物。

#### 【請求項8】

R<sup>2</sup>がH、ハロ、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>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<sup>3</sup>がカルボキシ、シアノ、アミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキルチオイルカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルヒドラジノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>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】

$R^3$  がアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  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、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 9 に記載の組成物。

## 【請求項 11】

$R^3$  がアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  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ある、請求項 10 に記載の組成物。

## 【請求項 12】

$R^3$  がH、チオアルコキシまたはチオアリールオキシである、請求項 1 に記載の組成物。

## 【請求項 13】

$R^4$  がニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノまたはアミドである、請求項 1 に記載の組成物。

## 【請求項 14】

$R^4$  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】

$R^4$  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】

$R^3$  がアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  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あり；そして、

$R^4$  がアミノ、 $C_1 \sim C_6$  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  $NR^8$  である、請求項 1 に記載の組成物。

## 【請求項 21】

$R^8$  がH、 $C_1 \sim C_6$  アルキルまたは $C_7 \sim C_{10}$  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つて、ここで、

$R^1$  は、 $C_6 \sim C_{10}$  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か；または $R^2$  およびそれが結合している炭素と一緒にになる場合は $C_5 \sim C_{10}$  シクロアルケニルを形成し；

$R^2$  は、H、ハロ、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルであるか；または $R^1$  およびそれが結合している炭素と一緒にになる場合、 $C_5 \sim C_{10}$  シクロアルケニルを形成し；

$R^3$  は、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、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り；

$R^4$  は、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ミドであり；そして、

X は S である、

組成物。

【請求項 2 3】

請求項 1 に記載の組成物であって、ここで、

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、それらが結合している炭素と一緒にになって、C<sub>5</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルケニルを形成し；

R<sup>3</sup> は、アミノカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルアミノカルボニルまたはC<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ジアルキルアミノカルボニルであり；

R<sup>4</sup> は、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルアミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> 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 2 4】

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

【請求項 2 5】

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 2 6】

前記化合物が、約 1 μM 未満の Sirt1 に対する K<sub>i</sub> を有する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 2 7】

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 2 8】

前記腫瘍性障害が癌である、請求項 2 7 に記載の組成物。

【請求項 2 9】

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 3 0】

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 2 9 に記載の組成物。

【請求項 3 1】

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 3 2】

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 3 1 に記載の組成物。

【請求項 3 3】

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 3 4】

前記被験体が I 型糖尿病を有する、請求項 3 3 に記載の組成物。

【請求項 3 5】

前記被験体が II 型糖尿病を有する、請求項 3 3 に記載の組成物。

【請求項 3 6】

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 3 7】

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 3 6 に記載の組成物。

【請求項 3 8】

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 3 6 に記載の組成物。

【請求項 3 9】

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 4 0】

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 3 9 に記載の組成物。

## 【請求項 4 1】

前記被験体が肥満である、請求項 3 9 に記載の組成物。

## 【請求項 4 2】

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 3 9 に記載の組成物。

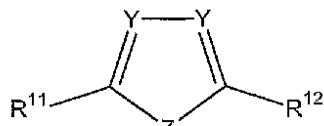
## 【請求項 4 3】

前記被験体が高血圧を有する、請求項 3 9 に記載の組成物。

## 【請求項 4 4】

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つて、該組成物は、式(II)：

## 【化 2】



式(II)

を有する化合物の有効量を含有し、

ここで、

$R^{1-1}$  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、 $C_2 \sim C_1$  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、 $SO_3(R^{1-3})$ 、サルフェート、 $S(O)N(R^{1-3})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{1-3})_2$ 、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、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  $R^{1-4}$  で置換されており；

$R^{1-2}$  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、 $C_2 \sim C_1$  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<sup>1~5</sup>で置換されており；

R<sup>1~3</sup>は、H、C<sub>1~C<sub>10</sub></sub>アルキル、C<sub>6~C<sub>10</sub></sub>アリール、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロアリール、C<sub>7~C<sub>12</sub></sub>アラルキル、C<sub>7~C<sub>12</sub></sub>ヘテロアラルキル、C<sub>2~C<sub>12</sub></sub>アルケニル、C<sub>2~C<sub>12</sub></sub>アルキニルまたはC<sub>5~C<sub>10</sub></sub>シクロアルケニルであり；

R<sup>1~4</sup>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<sub>1~C<sub>6</sub></sub>アルキルアミノ、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>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<sub>3</sub>H、サルフェート、S(O)NH<sub>2</sub>、S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、ホスフェート、アシル、アミジル、アミノカルボニル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>ジアルキルアミノカルボニル、C<sub>1~C<sub>10</sub></sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1~C<sub>10</sub></sub>チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>アルキルヒドラジノカルボニル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>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<sup>1~5</sup>は、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1~C<sub>10</sub></sub>アルキル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>ハロアルキル、C<sub>1~C<sub>10</sub></sub>アルコキシ、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>ハロアルコキシ、C<sub>6~C<sub>10</sub></sub>アリールオキシ、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロアリールオキシ、C<sub>6~C<sub>10</sub></sub>アリール、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロアリール、C<sub>7~C<sub>12</sub></sub>アラルキル、C<sub>7~C<sub>12</sub></sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3~C<sub>8</sub></sub>ヘテロシクリル、C<sub>2~C<sub>12</sub></sub>アルケニル、C<sub>2~C<sub>12</sub></sub>アルキニル、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>シクロアルケニル、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6~C<sub>10</sub></sub>アリールアルコキシまたはC<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロアリールアルコキシであり；

Zは、NR<sup>1~6</sup>、OまたはSであり；

各Yは、独立してNまたはCR<sup>1~8</sup>であり；

R<sup>1~6</sup>は、H、C<sub>1~C<sub>10</sub></sub>アルキル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>ハロアルキル、C<sub>6~C<sub>10</sub></sub>アリール、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロアリール、C<sub>7~C<sub>12</sub></sub>アラルキル、C<sub>7~C<sub>12</sub></sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3~C<sub>8</sub></sub>シクロアルキル、C<sub>3~C<sub>8</sub></sub>ヘテロシクリル、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>シクロアルケニル、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>2~C<sub>12</sub></sub>アルケニル、C<sub>2~C<sub>12</sub></sub>アルキニルであるか；またはR<sup>1~1</sup>またはR<sup>1~2</sup>の1つおよびR<sup>1~6</sup>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を形成し；ここで各々は必要に応じてR<sup>1~7</sup>で置換されており；

R<sup>1~7</sup>は、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>アルキル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>ハロアルキル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>アルコキシ、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>ハロアルコキシ、C<sub>2~C<sub>8</sub></sub>アルケニル、C<sub>2~C<sub>8</sub></sub>アルキニル、オキソ、メルカプト、チオアルコキシ、SO<sub>3</sub>H、サルフェート、S(O)NH<sub>2</sub>、S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、ホスフェート、アシル、アミド、アミノカルボニル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>ジアルキルアミノカルボニル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>アルキルヒドラジノカルボニル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>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<sup>1~8</sup>は、H、ハロまたはC<sub>1~C<sub>6</sub></sub>アルキルである、

組成物。

【請求項4~5】

ZがNR<sup>1~6</sup>である、請求項4~4に記載の組成物。

【請求項4~6】

ZがNR<sup>1~6</sup>であり、そしてR<sup>1~6</sup>がC<sub>1~C<sub>10</sub></sub>アルキル、シクロアルケニル、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6~C<sub>10</sub></sub>アリール、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロアリール、C<sub>7~C<sub>12</sub></sub>アラルキルまたはC<sub>7~C<sub>12</sub></sub>ヘテロアラルキルである、請求項4~5に記載の組成物。

【請求項4~7】

R<sup>1~6</sup>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<sub>1~C<sub>10</sub></sub>アルキル、C<sub>6~C<sub>10</sub></sub>アリール、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロアリール、C<sub>7~C<sub>12</sub></sub>アラルキルまたはC<sub>7~C<sub>12</sub></sub>ヘテロアラルキルである、請求項4~6に記載の組成物。

【請求項4~8】

$R^{1-1}$  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、 $S O_3$  ( $R^{1-3}$ )、サルフェート、 $S(O)N(R^{1-3})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{1-3})_2$  である、請求項 4 4 に記載の組成物。

【請求項 4 9】

$R^{1-1}$  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 4 8 に記載の組成物。

【請求項 5 0】

$R^{1-1}$  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 4 9 に記載の組成物。

【請求項 5 1】

$R^{1-1}$  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 5 0 に記載の組成物。

【請求項 5 2】

$R^{1-1}$  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 5 1 に記載の組成物。

【請求項 5 3】

$R^{1-2}$  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 4 4 に記載の組成物。

【請求項 5 4】

$R^{1-2}$  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 5 3 に記載の組成物。

【請求項 5 5】

$R^{1-2}$  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 5 4 に記載の組成物。

【請求項 5 6】

$R^{1-2}$  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 5 5 に記載の組成物。

【請求項 5 7】

各 Y が N である、請求項 4 4 に記載の組成物。

【請求項 5 8】

請求項 4 4 に記載の組成物であって、ここで、

$R^{1-1}$  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；

$R^{1-2}$  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、 $N R^{1-6}$  であり；

各Yは、Nであり；そして、

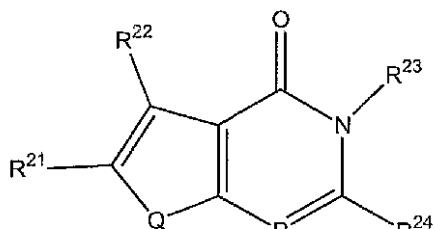
R<sup>1~6</sup>は、1個以上のハロ、アルキルまたはアルコキシで置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>6</sub>~C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>7</sub>~C<sub>12</sub>アラルキルまたはC<sub>7</sub>~C<sub>12</sub>ヘテロアラルキルである。

組成物。

【請求項 5 9】

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 I I)：

【化3】



式(III)

を有する化合物の有効量を含有し、

ここで、

R<sup>2~1</sup>は、ハロ、C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ヘテロシクリル、C<sub>2</sub>~C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>12</sub>アルキル、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6</sub>~C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>7</sub>~C<sub>12</sub>アラルキル、C<sub>7</sub>~C<sub>12</sub>ヘテロアラルキルであるか；またはR<sup>2~2</sup>およびそれが結合している炭素と一緒にになって、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6</sub>~C<sub>10</sub>アリールまたはC<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>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<sub>2~5</sub>で置換され得；

R<sup>2~2</sup>は、ハロ、C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ヘテロシクリル、C<sub>2</sub>~C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>12</sub>アルキル、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6</sub>~C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>7</sub>~C<sub>12</sub>アラルキル、C<sub>7</sub>~C<sub>12</sub>ヘテロアラルキルであるか；またはR<sup>2~1</sup>およびそれが結合している炭素と一緒にになって、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6</sub>~C<sub>10</sub>アリールまたはC<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>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<sub>2~6</sub>で置換され；

R<sup>2~3</sup>は、H、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>6</sub>~C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>7</sub>~C<sub>12</sub>アラルキル、C<sub>7</sub>~C<sub>12</sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ヘテロシクリル、C<sub>2</sub>~C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>12</sub>アルキル、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>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<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルアミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ジアルキルアミノ、アシリル、C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>チオアルコキシカルボニルであり；

R<sup>2~4</sup>は、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>6</sub>~C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>7</sub>~C<sub>12</sub>アラルキル、C<sub>7</sub>~C<sub>12</sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ヘテロシクリル、C<sub>2</sub>~C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>12</sub>アルキル、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6</sub>~C<sub>10</sub>アリールオキシ、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>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<sup>2</sup>～R<sup>7</sup>で置換されており；

各R<sup>2</sup>～R<sup>5</sup>およびR<sup>2</sup>～R<sup>6</sup>は、H、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アラルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>ヘテロシクリル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルキニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>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<sub>3</sub>H、サルフェート、S(O)N(R<sup>2</sup>～R<sup>8</sup>)<sub>2</sub>、S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>2</sup>～R<sup>8</sup>)<sub>2</sub>、ホスフェート、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルヒドラジノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>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<sup>2</sup>～R<sup>7</sup>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<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>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<sub>3</sub>H、サルフェート、S(O)N(R<sup>2</sup>～R<sup>8</sup>)<sub>2</sub>、S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>2</sup>～R<sup>8</sup>)<sub>2</sub>、ホスフェート、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルヒドラジノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>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<sup>2</sup>～R<sup>8</sup>は、H、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アラルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロアラルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルキニルまたはC<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニルであり；

Qは、S、OまたはNR<sup>2</sup>～R<sup>9</sup>であり；

R<sup>2</sup>～R<sup>9</sup>は、H、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アラルキルまたはC<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロアラルキルであり；

Pは、NまたはCR<sup>3</sup>～R<sup>10</sup>であり；そして、

R<sup>3</sup>～R<sup>10</sup>は、HまたはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルである、

### 組成物。

#### 【請求項60】

R<sup>2</sup>～R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>～R<sup>2</sup>は、それらが結合している炭素と一緒にになって、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリールまたはC<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>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<sup>2</sup>～R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>～R<sup>2</sup>は、それらが結合している炭素と一緒にになって、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>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<sup>2</sup>～R<sup>3</sup>が、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アラルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>ヘテロシクリル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルキニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>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になって、 $C_5 \sim C_{10}$  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、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<sup>2 1</sup>およびR<sup>2 2</sup>は、それらが結合している炭素と一緒にになって、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニルまたはC<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニルを形成し；

R<sup>2 3</sup>は、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アラルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>ヘテロシクリル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルキニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノまたはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルアミノであり；

R<sup>2 4</sup>は、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>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<sup>2 7</sup>は、カルボキシ、カルボキシレート、SO<sub>3</sub>H、サルフェート、S(O)N(R<sup>2 8</sup>)<sub>2</sub>、S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>2 8</sup>)<sub>2</sub>、ホスフェート、アミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルアミノカルボニルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシカルボニルであり；

QはSであり；そして、

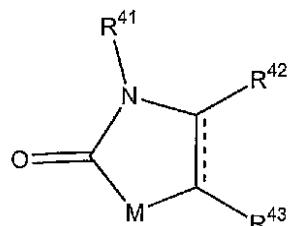
PはNである、

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(IV)：

**【化4】**



式(IV)

を有する化合物の有効量を含有し、  
ここで、

R<sup>4 1</sup>は、H、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アラルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>ヘテロシクリル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルキニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルアミノ、アシリル、アミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシカルボニルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>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<sup>4 4</sup>で置換され；

R<sup>4 2</sup>およびR<sup>4 3</sup>は、それらが結合している炭素と一緒にになって、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルキル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクリル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリールまたはC<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>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<sup>4～5</sup>で置換され；

R<sup>4～4</sup>は、H、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アラルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>ヘテロシクリル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>1</sub>アルキニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリールオキシ、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>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<sub>3</sub>H、サルフェート、S(O)N(R<sup>4～6</sup>)<sub>2</sub>、S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>4～6</sup>)<sub>2</sub>、ホスフェート、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキレンジオキシ、アシル、アミド、アミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルヒドラジノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>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<sup>4～5</sup>は、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>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<sub>3</sub>H、サルフェート、S(O)N(R<sup>4～6</sup>)<sub>2</sub>、S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>4～6</sup>)<sub>2</sub>、ホスフェート、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキレンジオキシ、アシル、アミド、アミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルヒドラジノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルヒドラジ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<sup>4～6</sup>は、H、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アラルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロアラルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルキニルまたはC<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニルであり；そして、

Mは、NR<sup>4～7</sup>、SまたはOであり；

R<sup>4～7</sup>は、H、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルキニル、カルボキシ、カルボキシレート、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルアミノ、アシル、アミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルアミノカルボニルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシカルボニルである、

組成物。

#### 【請求項73】

R<sup>4～2</sup>およびR<sup>4～3</sup>は、それらが結合している炭素と一緒にになって、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリールまたはC<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロアリールを形成する、請求項72に記載の組成物。

#### 【請求項74】

R<sup>4～2</sup>およびR<sup>4～3</sup>は、それらが結合している炭素と一緒にになって、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<sup>4～2</sup>およびR<sup>4～3</sup>は、それらが結合している炭素と一緒にになって、フェニルを形成し；そしてハロまたはC<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>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<sup>4～1</sup>はC<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキルであり；そしてR<sup>4～4</sup>はH、ハロ、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>ヘテロシクリル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルキニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニル、

$C_5 \sim C_{10}$  ヘテロシクロアルケニル、アシル、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、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、カルボキシまたは $C_1 \sim C_{10}$  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  $C_1 \sim C_{10}$  アルキルであり；そして  $R^{4-4}$  は、アシル、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、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、カルボキシまたは $C_1 \sim C_{10}$  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になって、 $C_6 \sim C_{10}$  アリールまたは $C_6 \sim C_{10}$  ヘテロアリールを形成し；そして、

M は O である、

組成物。