

【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23年7月28日(2011.7.28)

【公表番号】特表2010-527344(P2010-527344A)

【公表日】平成22年8月12日(2010.8.12)

【年通号数】公開・登録公報2010-032

【出願番号】特願2010-507977(P2010-507977)

【国際特許分類】

C 0 7 D 275/06 (2006.01)

C 0 7 D 417/10 (2006.01)

C 0 7 D 513/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/425 (2006.01)

A 6 1 K 31/422 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/14 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 275/06

C 0 7 D 417/10 C S P

C 0 7 D 513/04 3 0 1

C 0 7 D 513/04 3 4 3

A 6 1 K 31/425

A 6 1 K 31/422

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/437

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 37/06  
 A 6 1 P 17/06  
 A 6 1 P 1/14  
 A 6 1 P 9/10  
 A 6 1 P 9/04  
 A 6 1 P 1/04  
 A 6 1 P 3/10  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 31/18  
 A 6 1 P 11/06  
 A 6 1 P 11/00  
 A 6 1 P 19/02  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

## 【手続補正書】

【提出日】平成23年4月27日(2011.4.27)

## 【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

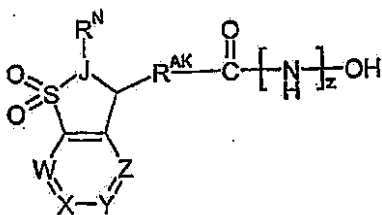
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の式：

【化1】



【式中、

Wは-CR<sup>PW</sup>=であり、Xは-CR<sup>PX</sup>=であり、Yは-CR<sup>PY</sup>=であり、Zは-CR<sup>PZ</sup>=であり、-R<sup>PW</sup>、-R<sup>PX</sup>、-R<sup>PY</sup>、及び-R<sup>PZ</sup>は、それぞれ、独立に、-H又は-R<sup>RS1</sup>であり、

各-R<sup>RS1</sup>は、独立に、-F、-Cl、-Br、-I、-R<sup>A1</sup>、-CF<sub>3</sub>、-OH、-OR<sup>A1</sup>、-OCF<sub>3</sub>、-C(=O)OH、-C(=O)OR<sup>A1</sup>、-NH<sub>2</sub>、-NHR<sup>A1</sup>、-NR<sup>A1</sup><sub>2</sub>、-NR<sup>A2</sup>R<sup>A3</sup>、-C(=O)-NH<sub>2</sub>、-C(=O)-NHR<sup>A1</sup>、-C(=O)-NR<sup>A1</sup><sub>2</sub>、-C(=O)-NR<sup>A2</sup>R<sup>A3</sup>、フェニル、又はベンジルであり、ここで、各R<sup>A1</sup>は、独立に、C<sub>1-4</sub>アルキル、フェニル、又はベンジルであり、各-NR<sup>A2</sup>R<sup>A3</sup>は、独立に、ピロリジノ、ピペリジノ(piperidino)、ピペリジノ(piperizino)又はモルホリノであり、独立に、非置換であるか、又はC<sub>1-3</sub>アルキル及び-CF<sub>3</sub>から選択される一つ若しくは複数の基で置換されており、さらに、二つの隣接する基-R<sup>RS1</sup>は、存在する場合、-OCH<sub>2</sub>O-、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-、又は-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-を形成していてもよく、

-J<は-N<であり、-R<sup>N</sup>は、独立に、-R<sup>NNN</sup>又は-L<sup>N</sup>-R<sup>NNN</sup>であり、-L<sup>N</sup>-は、独立に、飽和脂肪族C<sub>1-6</sub>アルキレンであり、場合によって一つ若しくは複数

の置換基 $-R^{G2}$ で置換されており、ここで、各 $-R^{G2}$ は、独立に、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-OR^{A1}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR^{A1}$ 、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{A1}$ 、 $-NR^{A1}_2$ 、 $-NR^{A2}R^{A3}$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NHR^{A1}$ 、 $-C(=O)-NR^{A1}_2$ 、 $-C(=O)-NR^{A2}R^{A3}$ 、フェニル、又はベンジルであり、ここで、各 $R^{A1}$ は、独立に、 $C_{1-4}$ アルキル、フェニル又はベンジルであり、各 $-NR^{A2}R^{A3}$ は、独立に、ピロリジノ、ピペリジノ(piperidino)、ピペリジノ(piperizino)又はモルホリノであり、独立に、非置換であるか、又は $C_{1-3}$ アルキル及び $-CF_3$ から選択される一つ若しくは複数の基で置換されており、

$-R^{NNN}$ は、独立に、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{3-7}$ ヘテロシクリル、 $C_{6-10}$ カルボアリアル又は $C_{5-10}$ ヘテロアリアルであり、場合によって置換されており、ここで、 $-R^{NNN}$ 上の各置換基が、存在する場合、 $-R^S$ であり、

$-R^{AK}$ は $-R^{AK1}$ であり、

$-R^{AK1}$ は、独立に、 $-(CH_2)-$ 又は $-(CH_2)_2-$ であり、

$z$ は1であり；

各 $-R^S$ は、独立に、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-R^{D1}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2H$ 、 $-OH$ 、 $-L^1-OH$ 、 $-O-L^1-OH$ 、 $-OR^{D1}$ 、 $-L^1-OR^{D1}$ 、 $-O-L^1-OR^{D1}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、 $-OCF_2CF_2H$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{D1}$ 、 $-SCF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{D1}$ 、 $-NR^{D1}_2$ 、 $-NR^{N1}R^{N2}$ 、 $-L^1-NH_2$ 、 $-L^1-NHR^{D1}$ 、 $-L^1-NR^{D1}_2$ 、 $-L^1-NR^{N1}R^{N2}$ 、 $-O-L^1-NH_2$ 、 $-O-L^1-NHR^{D1}$ 、 $-O-L^1-NR^{D1}_2$ 、 $-O-L^1-NR^{N1}R^{N2}$ 、 $-NH-L^1-NH_2$ 、 $-NH-L^1-NHR^{D1}$ 、 $-NH-L^1-NR^{D1}_2$ 、 $-NH-L^1-NR^{N1}R^{N2}$ 、 $-NR^{D1}-L^1-NH_2$ 、 $-NR^{D1}-L^1-NHR^{D1}$ 、 $-NR^{D1}-L^1-NR^{D1}_2$ 、 $-NR^{D1}-L^1-NR^{N1}R^{N2}$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR^{D1}$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=O)NHR^{D1}$ 、 $-C(=O)NR^{D1}_2$ 、 $-C(=O)NR^{N1}R^{N2}$ 、 $-NHC(=O)R^{D1}$ 、 $-NR^{D1}C(=O)R^{D1}$ 、 $-NHC(=O)OR^{D1}$ 、 $-NR^{D1}C(=O)OR^{D1}$ 、 $-OC(=O)NH_2$ 、 $-OC(=O)NHR^{D1}$ 、 $-OC(=O)NR^{D1}_2$ 、 $-OC(=O)NR^{N1}R^{N2}$ 、 $-OC(=O)R^{D1}$ 、 $-C(=O)R^{D1}$ 、 $-NHC(=O)NH_2$ 、 $-NHC(=O)NHR^{D1}$ 、 $-NHC(=O)NR^{D1}_2$ 、 $-NHC(=O)NR^{N1}R^{N2}$ 、 $-NR^{D1}C(=O)NH_2$ 、 $-NR^{D1}C(=O)NHR^{D1}$ 、 $-NR^{D1}C(=O)NR^{D1}_2$ 、 $-NR^{D1}C(=O)NR^{N1}R^{N2}$ 、 $-NHS(=O)_2R^{D1}$ 、 $-NR^{D1}S(=O)_2R^{D1}$ 、 $-S(=O)_2NH_2$ 、 $-S(=O)_2NHR^{D1}$ 、 $-S(=O)_2NR^{D1}_2$ 、 $-S(=O)_2NR^{N1}R^{N2}$ 、 $-S(=O)R^{D1}$ 、 $-S(=O)_2R^{D1}$ 、 $-OS(=O)_2R^{D1}$ 、 $-S(=O)_2OR^{D1}$ 、 $=O$ 、 $=NR^{D1}$ 、 $=NOH$ 、又は $=NOR^{D1}$ ；であり、さらに、二つの隣接する環置換基 $-R^S$ が、存在する場合、一緒になって基 $-O-L^2-O-$ を形成していてもよく、

ここで、

各 $-L^1$ は、独立に、飽和脂肪族 $C_{1-5}$ アルキレン、脂肪族 $C_{2-5}$ アルケニレン、又は脂肪族 $C_{2-5}$ アルキニレンであり、

各 $-L^2$ は、独立に、飽和脂肪族 $C_{1-3}$ アルキレンであり、

各基 $-NR^{N1}R^{N2}$ において、 $-R^{N1}$ 及び $-R^{N2}$ は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって、厳密に一つの環ヘテロ原子又は厳密に二つの環ヘテロ原子を有する5員、6員、又は7員の非芳香族環を形成し、ここで、前記厳密に二つの環ヘテロ原子のうちの一方はNであり、前記厳密に二つの環ヘテロ原子の他方は、独立に、N、O、又はSであり、

各 $-R^{D1}$ は、独立に、

$-R^{E1}$ 、 $-R^{E2}$ 、 $-R^{E3}$ 、 $-R^{E4}$ 、 $-R^{E5}$ 、 $-R^{E6}$ 、 $-R^{E7}$ 、 $-R^{E8}$ 、

$-L^3-R^{E4}$ 、 $-L^3-R^{E5}$ 、 $-L^3-R^{E6}$ 、 $-L^3-R^{E7}$ 、又は $-L^3-R^{E8}$ であり、

ここで、

各 $-R^{E1}$ は、独立に、飽和脂肪族 $C_{1-6}$ アルキルであり、

各 $-R^{E2}$ は、独立に、脂肪族 $C_{2-6}$ アルケニルであり、

各 $-R^{E3}$ は、独立に、脂肪族 $C_{2-6}$ アルキニルであり、

各 $-R^{E4}$ は、独立に、飽和 $C_{3-6}$ シクロアルキルであり、

各 $-R^{E5}$ は、独立に、 $C_{3-6}$ シクロアルケニルであり、

各 $-R^{E6}$ は、独立に、非芳香族 $C_{3-7}$ ヘテロシクリルであり、

各 $-R^{E7}$ は、独立に、 $C_{6-14}$ カルボアリアルであり、

各 $-R^{E8}$ は、独立に、 $C_{5-14}$ ヘテロアリアルであり、

各 $-L^3$ は、独立に、飽和脂肪族 $C_{1-3}$ アルキレンであり、

また、ここで、

各 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル、非芳香族 $C_{3-7}$ ヘテロシクリル、 $C_{6-14}$ カルボアリアル、 $C_{5-14}$ ヘテ

ロアリアル、及びC<sub>1-3</sub>アルキレンは、例えば、一つ又は複数の置換基-R<sup>G4</sup>によって場合によって置換されており、ここで、各-R<sup>G4</sup>は、独立に、-F、-Cl、-Br、-I、-R<sup>F1</sup>、-CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H、-OH、-L<sup>4</sup>-OH、-O-L<sup>4</sup>-OH、-OR<sup>F1</sup>、-L<sup>4</sup>-OR<sup>F1</sup>、-O-L<sup>4</sup>-OR<sup>F1</sup>、-OCF<sub>3</sub>、-O-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H、-SH、-SR<sup>F1</sup>、-SCF<sub>3</sub>、-CN、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-NHR<sup>F1</sup>、-NR<sup>F1</sup><sub>2</sub>、-NR<sup>N3</sup>R<sup>N4</sup>、-L<sup>4</sup>-NH<sub>2</sub>、-L<sup>4</sup>-NHR<sup>F1</sup>、-L<sup>4</sup>-NR<sup>F1</sup><sub>2</sub>、又は-L<sup>4</sup>-NR<sup>N3</sup>R<sup>N4</sup>、-O-L<sup>4</sup>-NH<sub>2</sub>、-O-L<sup>4</sup>-NHR<sup>F1</sup>、-O-L<sup>4</sup>-NR<sup>F1</sup><sub>2</sub>、-O-L<sup>4</sup>-NR<sup>N3</sup>R<sup>N4</sup>、-NH-L<sup>4</sup>-NH<sub>2</sub>、-NH-L<sup>4</sup>-NHR<sup>F1</sup>、-NH-L<sup>4</sup>-NR<sup>F1</sup><sub>2</sub>、-NH-L<sup>4</sup>-NR<sup>N3</sup>R<sup>N4</sup>、-NR<sup>F1</sup>-L<sup>4</sup>-NH<sub>2</sub>、-NR<sup>F1</sup>-L<sup>4</sup>-NHR<sup>F1</sup>、-NR<sup>F1</sup>-L<sup>4</sup>-NR<sup>F1</sup><sub>2</sub>、-NR<sup>F1</sup>-L<sup>4</sup>-NR<sup>N3</sup>R<sup>N4</sup>、-C(=O)OH、-C(=O)OR<sup>F1</sup>、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-C(=O)NHR<sup>F1</sup>、-C(=O)NR<sup>F1</sup><sub>2</sub>、又は-C(=O)NR<sup>N3</sup>R<sup>N4</sup>；であり、ここで、

各-R<sup>F1</sup>は、独立に、飽和脂肪族C<sub>1-4</sub>アルキル、フェニル、又はベンジルであり、

各-L<sup>4</sup>-は、独立に、飽和脂肪族C<sub>1-5</sub>アルキレンであり、

各基-NR<sup>N3</sup>R<sup>N4</sup>において、-R<sup>N3</sup>及び-R<sup>N4</sup>は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって、厳密に一つの環ヘテロ原子又は厳密に二つの環ヘテロ原子を有する5員、6員、又は7員の非芳香族環を形成し、ここで、前記厳密に二つの環ヘテロ原子のうち的一方はNであり、前記厳密に二つの環ヘテロ原子の他方は、独立に、N、O、又はSである、]

の化合物、並びにその薬学的に許容される塩、水和物、及び溶媒和物から選択される化合物。

【請求項 2】

-R<sup>PW</sup>、-R<sup>PX</sup>、-R<sup>PY</sup>、及び-R<sup>PZ</sup>のそれぞれがHである、請求項1に記載の化合物。

【請求項 3】

-R<sup>N</sup>が-R<sup>NNN</sup>である、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項 4】

-R<sup>N</sup>が-L<sup>N</sup>-R<sup>NNN</sup>である、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項 5】

-L<sup>N</sup>-が、独立に、-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-、又は-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-である、請求項4に記載の化合物。

。

【請求項 6】

-R<sup>NNN</sup>が、独立に、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ピロリジニル、イミダゾリジニル、ピラゾリジニル、ペリリジニル、ペリリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、アゼピニル、ジアゼピニル、フェニル、ナフチル、フラニル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ベンゾフラニル、イソベンゾフラニル、インダゾリル、プリニル、キノリニル、イソキノリニル、ナフチリジニル、キノキサリニル、キナゾリニル、シンノリニル、インドリル、イソインドリル、カルバゾリル、カルボリニル、アクリジニル、フェノキサジニル、又はフェノチアジニルであり、場合によって置換されている、請求項1から5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

-R<sup>NNN</sup>が、独立に、フェニル、ナフチル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、又はピラゾリルであり、場合によって置換されている、請求項1から5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8】

-R<sup>NNN</sup>が、独立に、フェニルであり、場合によって置換されている、請求項1から5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

-R<sup>NNN</sup>が、独立に、フェニルであり、パラ位で場合によって置換されており、全ての他の位置で非置換である、請求項1から5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

各-R<sup>RS1</sup>が、存在する場合、独立に、-F、-Cl、-Br、-I、-Me、-Et、-CF<sub>3</sub>、-OH、-OMe、-OEt、-OCF<sub>3</sub>、又はフェニルであり、さらに、二つの隣接する基-R<sup>RS1</sup>が、存在する場合、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-を形成していてもよい、請求項1から9のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 1 1】

各-R<sup>S</sup>は、存在する場合、独立に、-F、-Cl、-Br、-I、-R<sup>D1</sup>、-CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H、-OH、-L<sup>1</sup>-OH、-O-L<sup>1</sup>-OH、-OR<sup>D1</sup>、-L<sup>1</sup>-OR<sup>D1</sup>、-O-L<sup>1</sup>-OR<sup>D1</sup>、-OCF<sub>3</sub>、-OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H、-SH、-SR<sup>D1</sup>、-SCF<sub>3</sub>、-CN、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-NHR<sup>D1</sup>、-NR<sup>D1</sup><sub>2</sub>、-NR<sup>N1</sup>R<sup>N2</sup>、-L<sup>1</sup>-NH<sub>2</sub>、-L<sup>1</sup>-NHR<sup>D1</sup>、-L<sup>1</sup>-NR<sup>D1</sup><sub>2</sub>、-L<sup>1</sup>-NR<sup>N1</sup>R<sup>N2</sup>、-O-L<sup>1</sup>-NH<sub>2</sub>、-O-L<sup>1</sup>-NHR<sup>D1</sup>、-O-L<sup>1</sup>-NR<sup>D1</sup><sub>2</sub>、-O-L<sup>1</sup>-NR<sup>N1</sup>R<sup>N2</sup>、-NH-L<sup>1</sup>-NH<sub>2</sub>、-NH-L<sup>1</sup>-NHR<sup>D1</sup>、-NH-L<sup>1</sup>-NR<sup>D1</sup><sub>2</sub>、-NH-L<sup>1</sup>-NR<sup>N1</sup>R<sup>N2</sup>、-NR<sup>D1</sup>-L<sup>1</sup>-NH<sub>2</sub>、-NR<sup>D1</sup>-L<sup>1</sup>-NHR<sup>D1</sup>、-NR<sup>D1</sup>-L<sup>1</sup>-NR<sup>D1</sup><sub>2</sub>、-NR<sup>D1</sup>-L<sup>1</sup>-NR<sup>N1</sup>R<sup>N2</sup>、-C(=O)OH、-C(=O)OR<sup>D1</sup>、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-C(=O)NHR<sup>D1</sup>、-C(=O)NR<sup>D1</sup><sub>2</sub>、-C(=O)NR<sup>N1</sup>R<sup>N2</sup>、-NHC(=O)R<sup>D1</sup>、-NR<sup>D1</sup>C(=O)R<sup>D1</sup>、-OC(=O)R<sup>D1</sup>、-C(=O)R<sup>D1</sup>、-NHS(=O)<sub>2</sub>R<sup>D1</sup>、-NR<sup>D1</sup>S(=O)<sub>2</sub>R<sup>D1</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-S(=O)<sub>2</sub>NHR<sup>D1</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>D1</sup><sub>2</sub>、又は-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>N1</sup>R<sup>N2</sup>;

であり、さらに、二つの隣接する環置換基-R<sup>S</sup>は、存在する場合、一緒になって基-O-L<sup>2</sup>-O-を形成していてもよい、請求項1から10のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 1 2】

各-R<sup>S</sup>は、存在する場合、独立に、-OR<sup>D1</sup>である、請求項1から10のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 1 3】

各基-NR<sup>N1</sup>R<sup>N2</sup>が、存在する場合、独立に、ピロリジノ、ペペリジノ(piperidino)、ペペリジノ(piperizino)又はモルホリノであり、独立に、非置換であるか、又はC<sub>1-3</sub>アルキル及び-CF<sub>3</sub>から選択される一つ若しくは複数の基で置換され;

各-R<sup>E1</sup>が、存在する場合、独立に、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、又はt-ブチルであり、場合によって置換され;

各-R<sup>E2</sup>が、存在する場合、独立に、-CH<sub>2</sub>-CH=CH<sub>2</sub>であり、場合によって置換され;

各-R<sup>E3</sup>が、存在する場合、独立に、-CH<sub>2</sub>-C(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>、-CH(CH<sub>3</sub>)-C(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>、-CH(CH<sub>3</sub>)-C(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>、又は-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-C(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>3</sub>であり、場合によって置換され;

各-R<sup>E4</sup>が、存在する場合、独立に、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、又はシクロヘキシルであり、場合によって置換され;

各-R<sup>E6</sup>が、存在する場合、独立に、ピロリジニル、ペペリジニル、ペペラジニル、モルホリニル、テトラヒドロフラニル、又はテトラヒドロピラニルであり、場合によって置換され;

各-R<sup>E7</sup>が、存在する場合、独立に、フェニル又はナフチルであり、場合によって置換されており;

各-R<sup>E8</sup>が、存在する場合、独立してフラニル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、キノリニル、又はイソキノリニルであり、場合によって置換されており;

各-L<sup>2</sup>-が、存在する場合、独立に、-CH<sub>2</sub>-又は-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-であり;

各-R<sup>G4</sup>が、存在する場合、独立に、-F、-Cl、-Br、-I、-R<sup>F1</sup>、-OH、-OR<sup>F1</sup>、-NH<sub>2</sub>、-NHR<sup>F1</sup>、-NR<sup>F1</sup><sub>2</sub>、及び-NR<sup>N3</sup>R<sup>N4</sup>から選択され;

各基-NR<sup>N3</sup>R<sup>N4</sup>が、存在する場合、独立に、ピロリジノ、ペペリジノ(piperidino)、ペペリジノ(piperizino)又はモルホリノであり、独立に、非置換であるか、又は例えばC<sub>1-3</sub>アルキル及び-CF<sub>3</sub>から選択される一つ若しくは複数の基で置換されている、請求項1から12のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 1 4】

基Jに隣接する環炭素原子が、(R)配置である、請求項1から13のいずれか一項に記載の化合物。

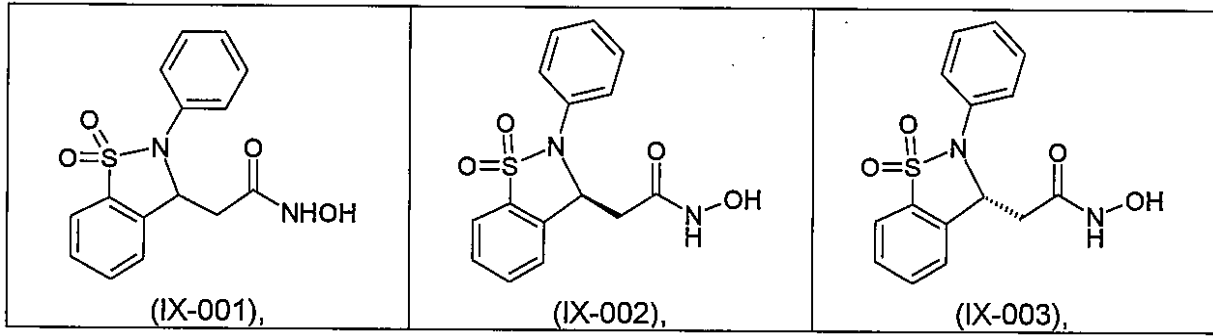
## 【請求項 1 5】

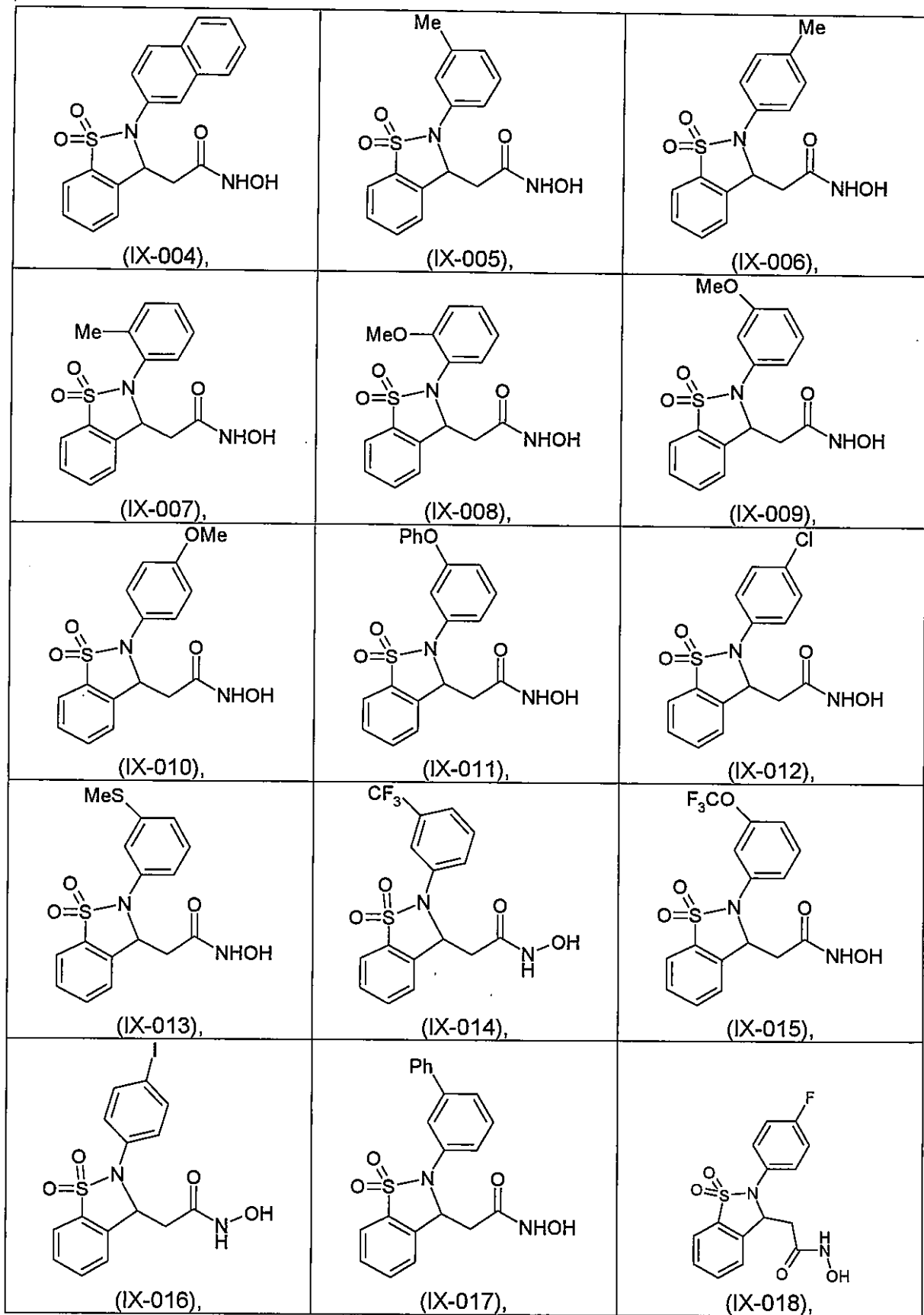
基Jに隣接する環炭素原子が、(S)配置である、請求項1から13のいずれか一項に記載の化合物。

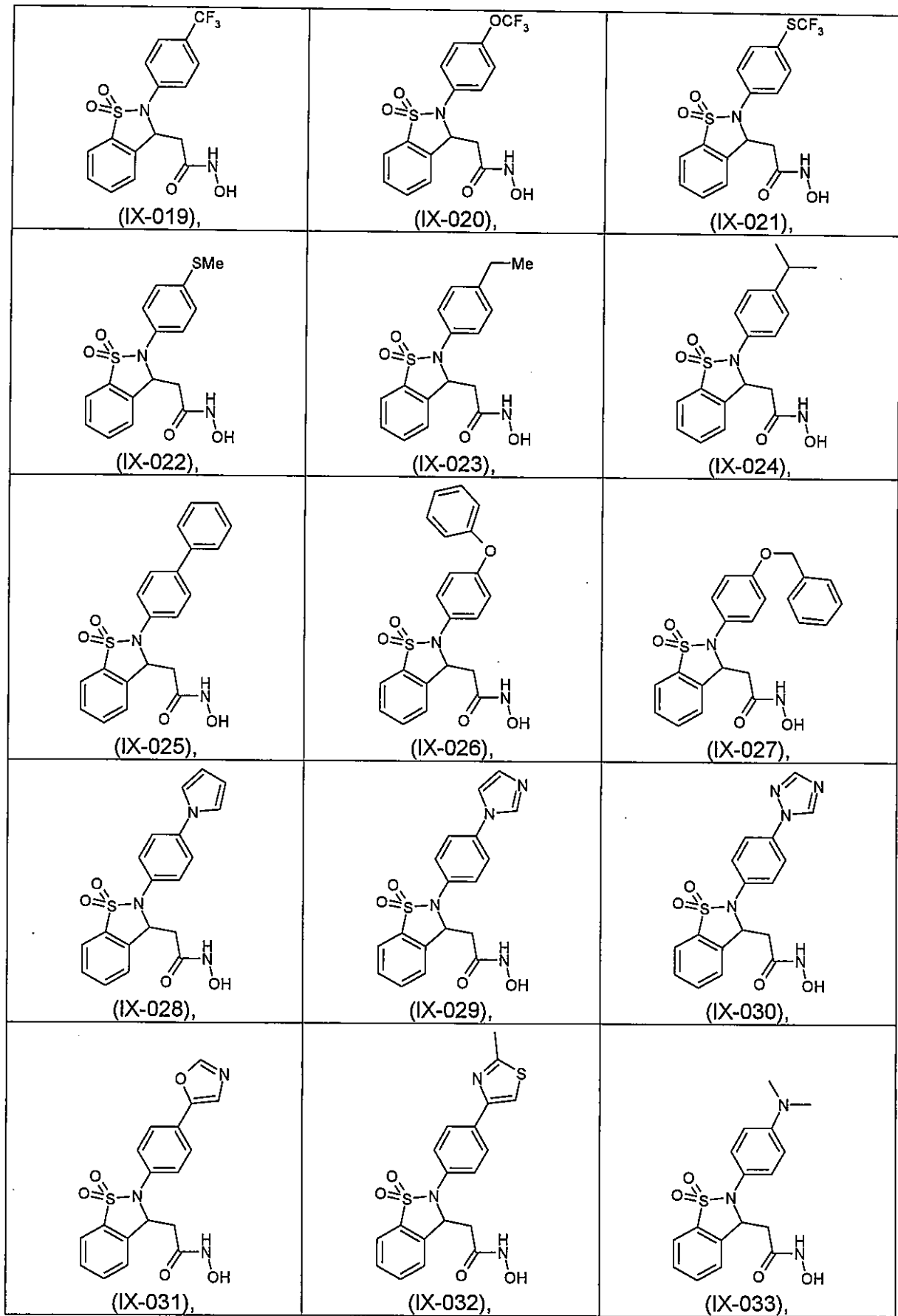
## 【請求項 1 6】

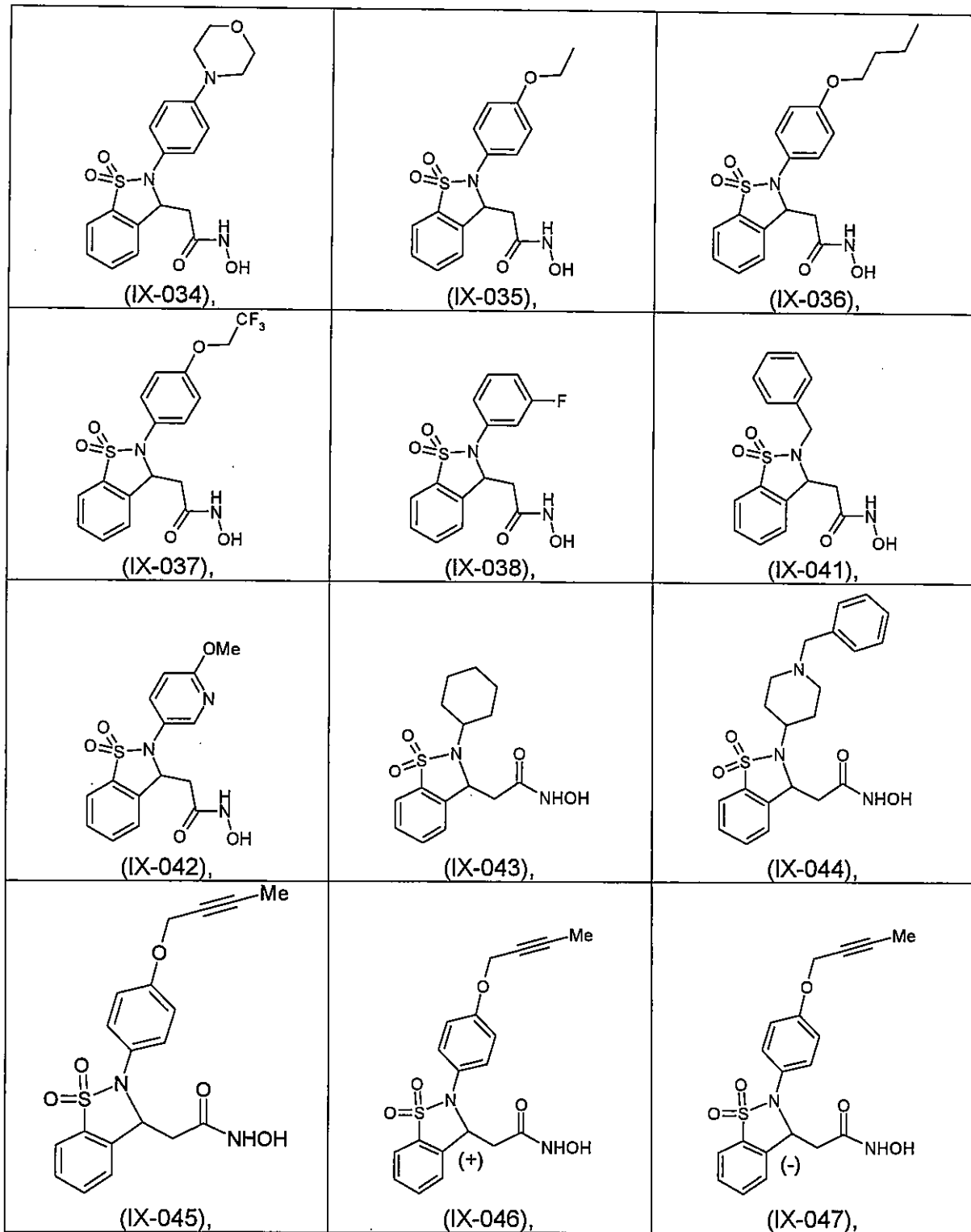
以下の化合物

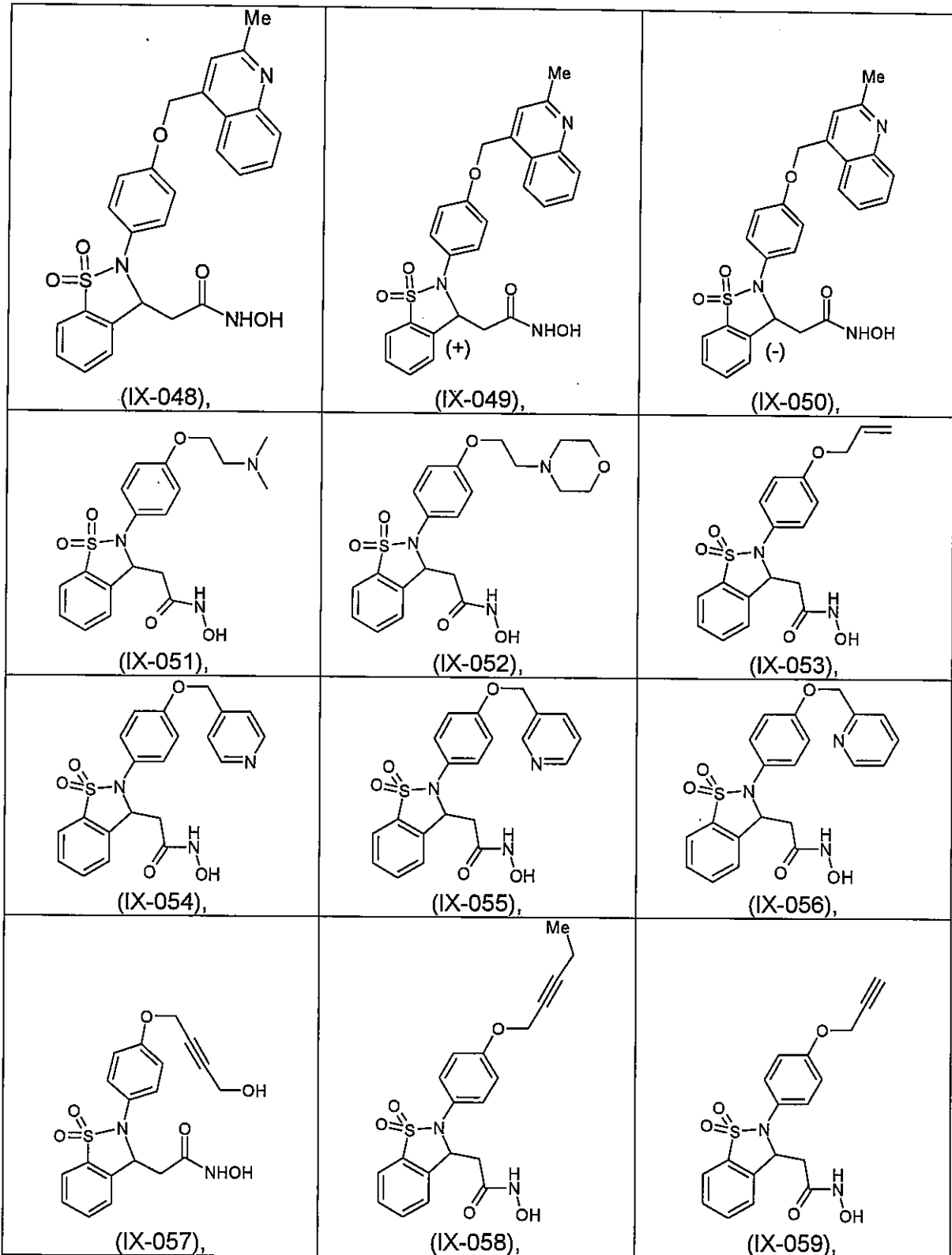
【化2】

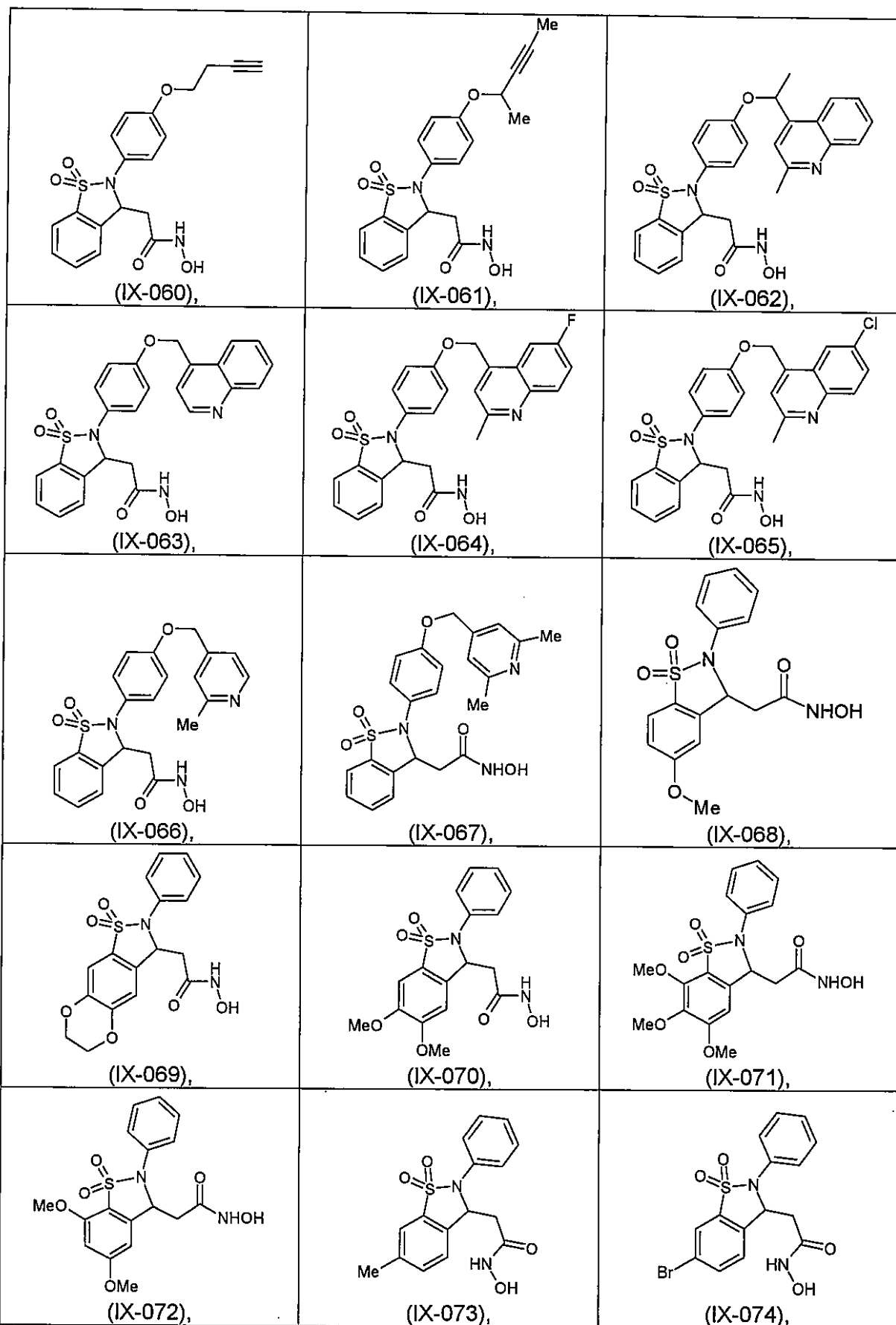


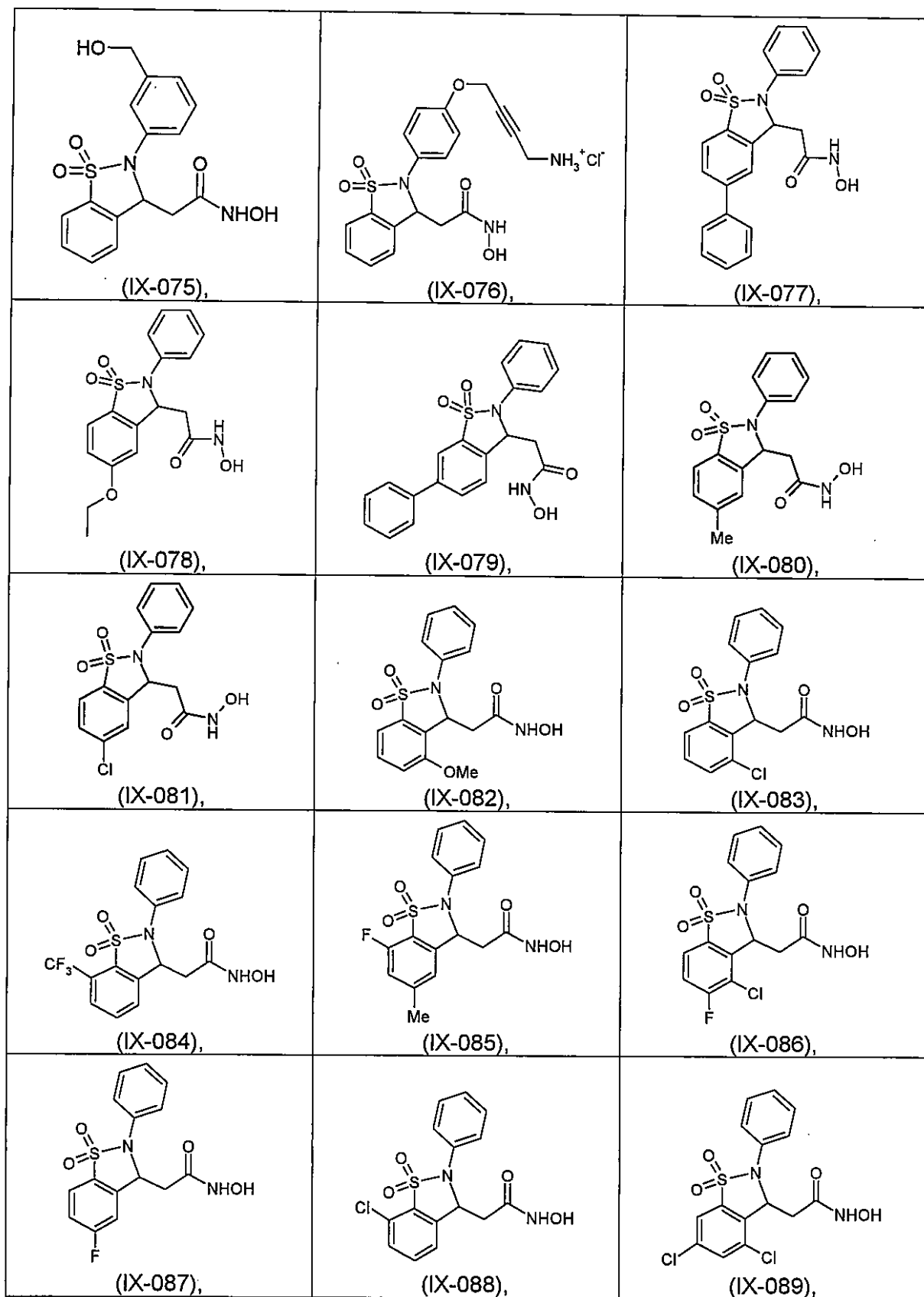


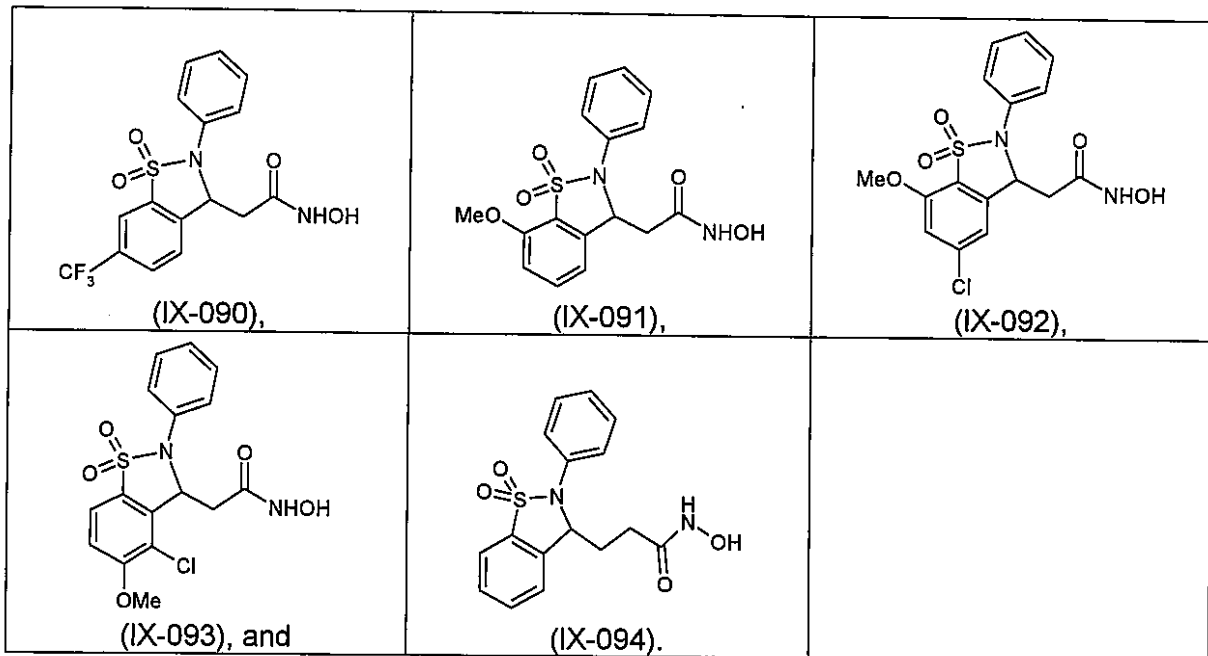












並びにその薬学的に許容される塩、水和物、及び溶媒和物から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項17】

請求項1から16のいずれか一項に記載の化合物、及び薬学的に許容される担体、希釈剤、又は賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項18】

医薬組成物を調製する方法であって、請求項1から16のいずれか一項に記載の化合物、及び薬学的に許容される担体、希釈剤、又は賦形剤を混合することを含む方法。

【請求項19】

治療による人体又は動物体の処置方法における使用のための、請求項1から16のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項20】

関節リウマチ；炎症；乾癬；敗血症性ショック；移植片拒絶；悪液質；食欲不振；鬱血性心不全；虚血再灌流後の傷害；中枢神経系の炎症性疾患；炎症性腸疾患；インスリン耐性；HIV感染；癌；慢性閉塞性肺疾患(COPD)；喘息；骨関節炎；潰瘍性大腸炎；クローン病；多発性硬化症；変性性軟骨損失；炎症；関節リウマチ；又は乾癬の処置における使用のための、請求項1から16のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項21】

請求項1から16のいずれか一項に記載の化合物の、関節リウマチ；炎症；乾癬；敗血症性ショック；移植片拒絶；悪液質；食欲不振；鬱血性心不全；虚血再灌流後の傷害；中枢神経系の炎症性疾患；炎症性腸疾患；インスリン耐性；HIV感染；癌；慢性閉塞性肺疾患(COPD)；喘息；骨関節炎；潰瘍性大腸炎；クローン病；多発性硬化症；変性性軟骨損失；炎症；関節リウマチ；又は乾癬の処置のための薬剤の製造における使用。