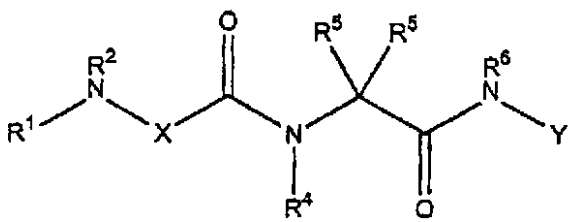
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成18年6月1日(2006.6.1)

【公表番号】特表2002-506878(P2002-506878A)
【公表日】平成14年3月5日(2002.3.5)
【出願番号】特願2000-536738(P2000-536738)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｋ　5/023　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　19/08　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　19/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　29/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　31/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　35/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　37/06　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　43/00　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 207/273　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　38/00　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｋ　5/023
Ａ６１Ｐ　19/08
Ａ６１Ｐ　19/10
Ａ６１Ｐ　29/00
Ａ６１Ｐ　31/04
Ａ６１Ｐ　35/00
Ａ６１Ｐ　37/06
Ａ６１Ｐ　43/00　１１１
Ｃ０７Ｄ 207/273
Ａ６１Ｋ　37/02

【手続補正書】
【提出日】平成18年4月4日(2006.4.4)
【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】
【特許請求の範囲】
【請求項１】　式Ｉにより表わされる化合物：
【化１】

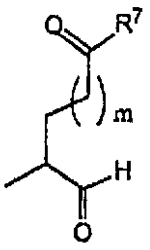


ここで、

Ｙは、以下であり：

【化２】

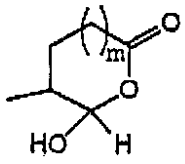
(a)



但し、Ｒ^{7}がＯＨの場合は、Ｙは以下でもあり得る：

【化３】

(b)



；

Ｘは、－Ｃ（Ｒ^{3}）$_{2}$－または－Ｎ（Ｒ^{3}）－であり；

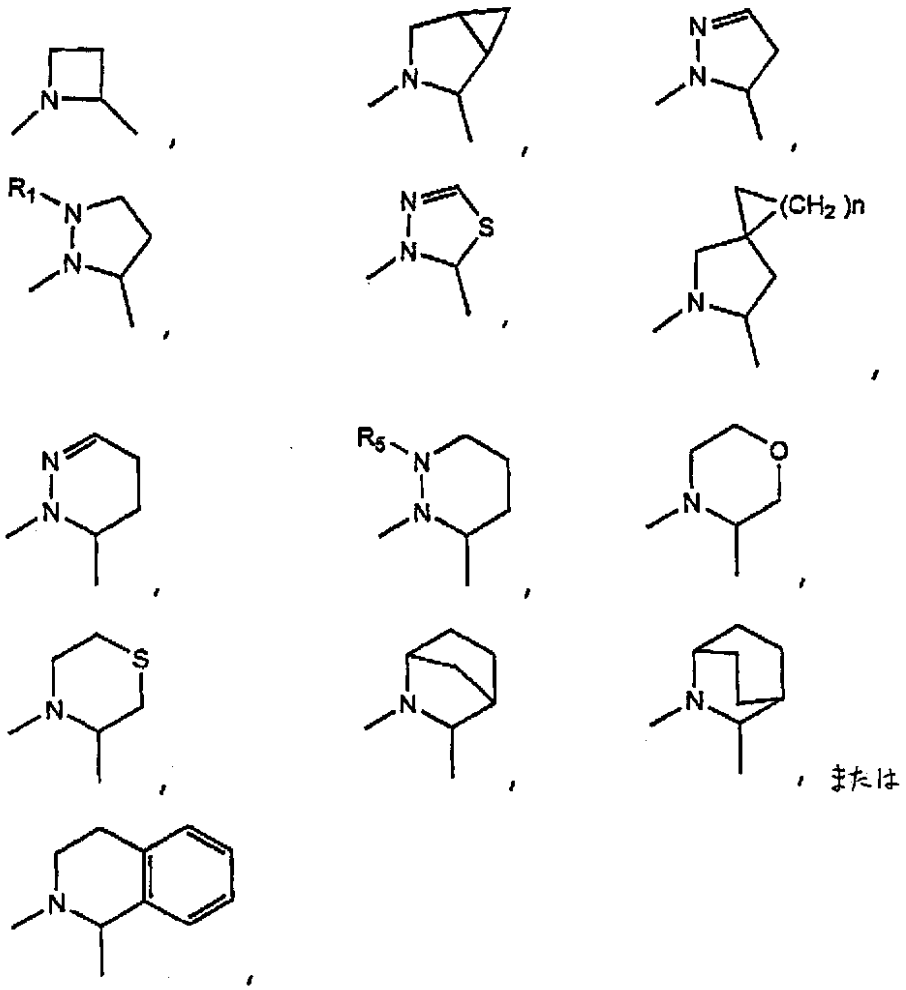
ｍは、０または１であり；

Ｒ^{1}は、Ｈ、－Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｃ（Ｏ）Ｒ^{8}、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｒ^{8}、－Ｓ（Ｏ）Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）Ｒ^{8}、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｈ）－Ｒ^{8}、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）ＣＨ＝ＣＨＲ^{8}、－Ｃ（Ｏ）ＣＨ$_{2}$ＯＲ^{8}、－Ｃ（Ｏ）ＣＨ$_{2}$Ｎ（Ｈ）Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－Ｃ（Ｏ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－Ｃ（Ｏ）ＣＨ$_{2}$Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$Ｒ^{8}、－ＣＨ$_{2}$－アルケニル－Ｒ^{8}、または－ＣＨ$_{2}$－アルキニル－Ｒ^{8}であり；

Ｒ^{2}は－Ｈであり、各Ｒ^{3}は、独立して、－Ｈ、アミノ酸側鎖、－Ｒ^{8}、アルケニル－Ｒ^{9}、またはアルキニル－Ｒ^{9}であり、あるいは各Ｒ^{3}が、これらが結合する原子と一緒になって、３～７員環または３～７員の複素環の環系を形成し、あるいはＲ^{2}と一つのＲ^{3}とが、これらが結合する原子と一緒になって、３～７員環または３～７員の複素環の環系を形成し、ここで、任意の－アルキル炭素原子または－シクロアルキル炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、－Ｒ^{10}で置換され、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、－Ｒ^{11}で置換され、該環系の任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、－Ｒ^{1}で置換され；

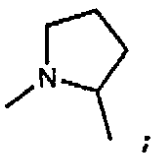
Ｒ^{4}は－Ｈであり、各Ｒ^{5}は、独立して、－Ｈ、アミノ酸側鎖、－Ｒ^{8}、－アルケニル－Ｒ^{9}、または－アルキニル－Ｒ^{9}であり、あるいはＲ^{4}と一つのＲ^{5}とが、これらが結合している原子と一緒になって、以下から選択される環系を形成し：

【化４】



ここで、任意の－アルキル炭素原子または－シクロアルキル炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{10}で置換され、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{11}で置換され、そして該環系の任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{1}で置換され、あるいは、R^{4}と一つのR^{5}とが、これらが結合した原子と一緒になって、以下の環系：

【化５】



を形成し；

R^{6}は、－Ｈであり；

R^{7}は、－ＯＨ、－ＯＲ^{8}、または－Ｎ（Ｈ）ＯＨであり；

各R^{8}は、独立して、－アルキル、－シクロアルキル、－アリール、－ヘテロアリール、－ヘテロシクリル、－アルキルシクロアルキル、－アルキルアリール、－アルキルヘテロアリール、または－アルキルヘテロシクリルであり、ここで任意の－アルキル炭素原子または－シクロアルキル炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{10}で置換さ

れ、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じてR^{11}で置換され、そして任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{1}で置換され；

各R^{9}は、独立して、－アリール、－ヘテロアリール、－シクロアルキル、または－ヘテロシクリルであり、ここで任意の－アルキル炭素原子または－シクロアルキル炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{10}で置換され、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{11}で置換され、そして任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{1}で置換され；

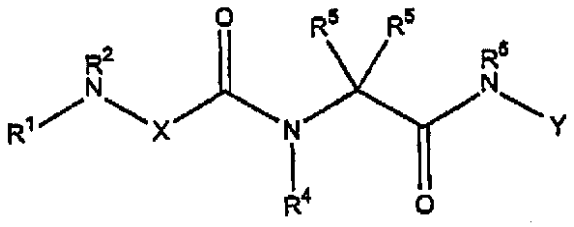
各R^{10}は、独立して、－ＯＨ、－ＳＨ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、$-NO_2$、－ＣＮ、$-NH_2$、$-CO_2H$、－Ｃ（Ｏ）NH_2、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｈ、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）NH_2、－パーフルオロアルキル、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－アリール、－Ｏ－アルキルアリール、－Ｎ（Ｈ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）アリール、－Ｎ（Ｈ）－アルキルアリール、－Ｎ（アルキル）$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（アルキル）$_2$、

－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏアルキル、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏアルキルアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）　Ｏヘテロアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏアルキルヘテロアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏシクロアルキル、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）　Ｃ（Ｏ）Ｎ（アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキルアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ　（Ｏ）Ｎ（Ｈ）ヘテロアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキルヘテロアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）シクロアルキル、－Ｓ－アルキル、－Ｓ－アリール、－Ｓ－アルキルアリール、－Ｓ（Ｏ）$_2$アルキル、－Ｓ（Ｏ）アルキル、－Ｃ（Ｏ）アルキル、$-CH_2NH_2$、$-CH_2N$（Ｈ）アルキル、もしくは$-CH_2N$（アルキル）$_2$、－アルキル、－シクロアルキル、－アリール、－ヘテロアリール、－ヘテロシクリル、－アルキルシクロアルキル、－アルキルアリール、－アルキルヘテロアリール、または－アルキルヘテロシクリルであり、ここで、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{11}で置換され、そして任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{1}で置換され；そして

各R^{11}は、独立して、－ＯＨ、－ＳＨ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、$-NO_2$、－ＣＮ、$-NH_2$、$-CO_2H$、－Ｃ（Ｏ）NH_2、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｈ、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）NH_2、－アルキル、－シクロアルキル、－パーフルオロアルキル、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－アリール、－Ｏ－アルキルアリール、－Ｎ（Ｈ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）アリール、－Ｎ（Ｈ）－アルキルアリール、－Ｎ（アルキル）$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（アルキル）$_2$、－Ｓ－アルキル、－Ｓ－アリール、－Ｓ－アルキルアリール、－Ｓ（Ｏ）$_2$アルキル、－Ｓ（Ｏ）アルキル、－Ｃ（Ｏ）アルキル、$-CH_2NH_2$、$-CH_2N$（Ｈ）アルキル、または$-CH_2N$（アルキル）$_2$である、化合物。

【請求項２】　式Ｉにより表わされる化合物：

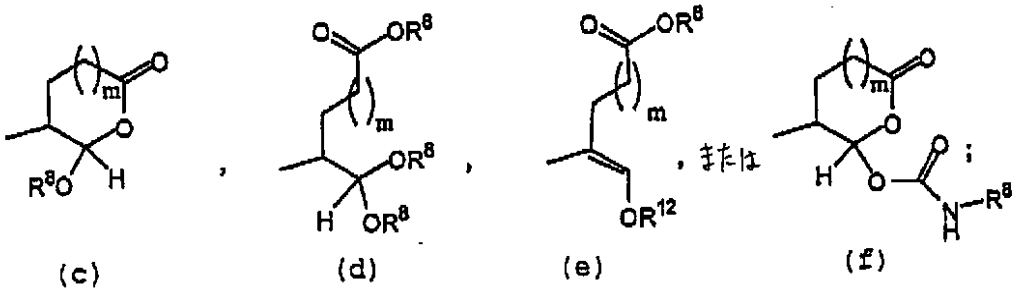
【化６】



ここで、

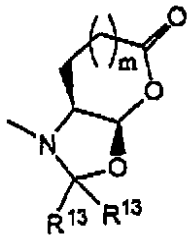
Ｙは、以下であり：

【化７】



但し、Ｒ^{6}が水素でないならば、Ｒ^{6}およびＹは、これらが結合した窒素と一緒になって、環（ｇ）を形成し：

【化８】



；

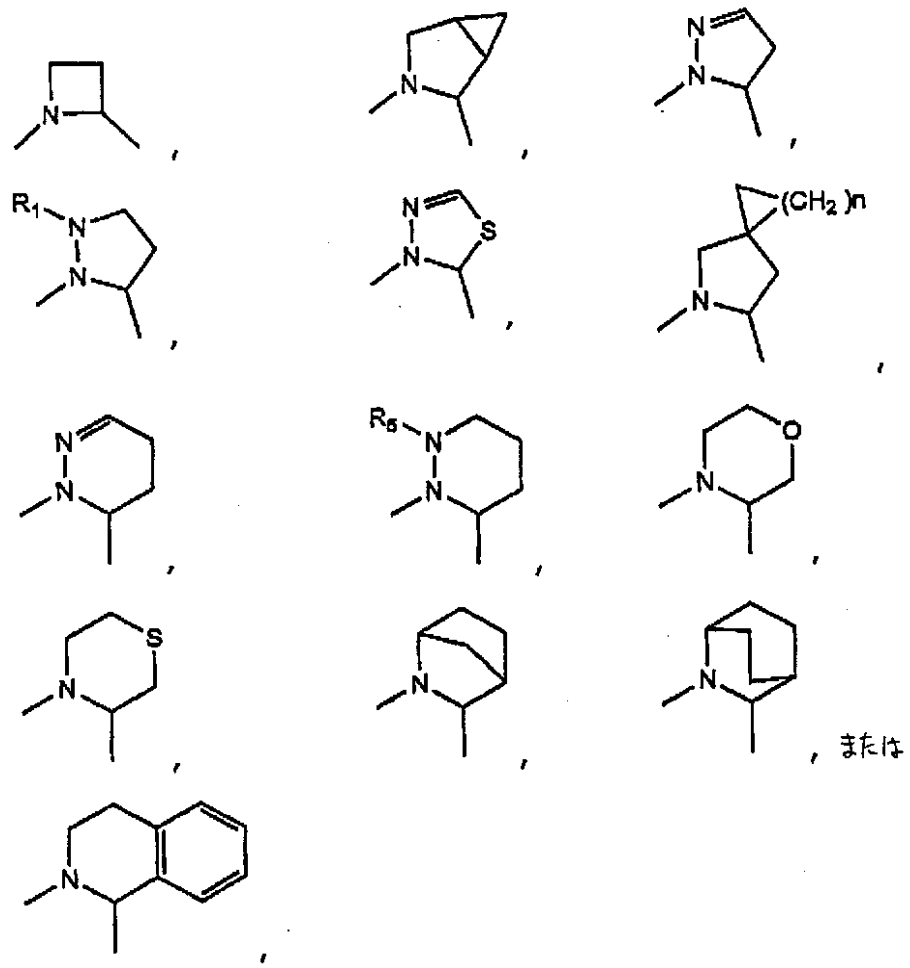
Ｘは、－Ｃ（Ｒ^{3}）$_{2}$－または－Ｎ（Ｒ^{3}）－であり；

ｍは、０または１であり；

Ｒ^{1}は、Ｈ、－Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｃ（Ｏ）Ｒ^{8}、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｒ^{8}、－Ｓ（Ｏ）Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）Ｒ^{8}、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｈ）－Ｒ^{8}、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）ＣＨ＝ＣＨＲ^{8}、－Ｃ（Ｏ）ＣＨ$_{2}$ＯＲ^{8}、－Ｃ（Ｏ）ＣＨ$_{2}$Ｎ（Ｈ）Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－Ｃ（Ｏ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－Ｃ（Ｏ）ＣＨ$_{2}$Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$Ｒ^{8}、－ＣＨ$_{2}$－アルケニル－Ｒ^{8}、または－ＣＨ$_{2}$－アルキニル－Ｒ^{8}であり；

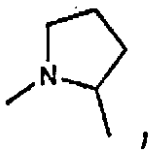
Ｒ^{2}は－Ｈであり、各Ｒ^{3}は、独立して、－Ｈ、アミノ酸側鎖、－Ｒ^{8}、アルケニル－Ｒ^{9}、またはアルキニル－Ｒ^{9}であり、あるいは各Ｒ^{3}が、これらが結合する原子と一緒になって、３～７員環または３～７員の複素環の環系を形成し、あるいはＲ^{2}と一つのＲ^{3}とが、これらが結合する原子と一緒になって、３～７員環または３～７員の複素環の環系を形成し、ここで、任意の－アルキル炭素原子または－シクロアルキル炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、－Ｒ^{10}で置換され、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、－Ｒ^{11}で置換され、該環系の任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、－Ｒ^{1}で置換され；　Ｒ^{4}は－Ｈであり、各Ｒ^{5}は、独立して、－Ｈ、アミノ酸側鎖、－Ｒ^{8}、－アルケニル－Ｒ^{9}、または－アルキニル－Ｒ^{9}であり、あるいはＲ^{4}と一つのＲ^{5}とが、これらが結合している原子と一緒になって、以下から選択される環系を形成し：

【化９】



ここで、任意の－アルキル炭素原子または－シクロアルキル炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{10}で置換され、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{11}で置換され、そして該環系の任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{1}で置換され、または、R^{4}と一つのR^{5}とが、これらが結合した原子と一緒になって、以下の環系：

【化１０】



を形成し；

R^{6}は、－Ｈであり；

各R^{8}は、独立して、－アルキル、－シクロアルキル、－アリール、－ヘテロアリール、－ヘテロシクリル、－アルキルシクロアルキル、－アルキルアリール、－アルキルヘテロアリール、または－アルキルヘテロシクリルであり、ここで任意の－アルキル炭素原子または－シクロアルキル炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{10}で置換され、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じてR^{11}で置換され、そして任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{1}で置換され；

各R^9は、独立して、－アリール、－ヘテロアリール、－シクロアルキル、または－ヘテロシクリルであり、ここで任意の－アルキル炭素原子または－シクロアルキル炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{10}で置換され、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{11}で置換され、そして任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^1で置換され；

各R^{10}は、独立して、－ＯＨ、－ＳＨ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、$-NO_2$、－ＣＮ、$-NH_2$、$-CO_2H$、－Ｃ（Ｏ）NH_2、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｈ、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）NH_2、－パーフルオロアルキル、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－アリール、－Ｏ－アルキルアリール、－Ｎ（Ｈ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）アリール、－Ｎ（Ｈ）－アルキルアリール、$-N(アルキル)_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキル、$-C(O)N(アルキル)_2$、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏアルキル、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏアルキルアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）　Ｏヘテロアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏアルキルヘテロアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏシクロアルキル、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）　Ｃ（Ｏ）$N(アルキル)_2$、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキルアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ　（Ｏ）Ｎ（Ｈ）ヘテロアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキルヘテロアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）シクロアルキル、－Ｓ－アルキル、－Ｓ－アリール、－Ｓ－アルキルアリール、$-S(O)_2$アルキル、－Ｓ（Ｏ）アルキル、－Ｃ（Ｏ）アルキル、$-CH_2NH_2$、$-CH_2N(H)$アルキル、もしくは$-CH_2N(アルキル)_2$、－アルキル、－シクロアルキル、－アリール、－ヘテロアリール、－ヘテロシクリル、－アルキルシクロアルキル、－アルキルアリール、－アルキルヘテロアリール、または－アルキルヘテロシクリルであり、ここで、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{11}で置換され、そして任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^1で置換され；そして

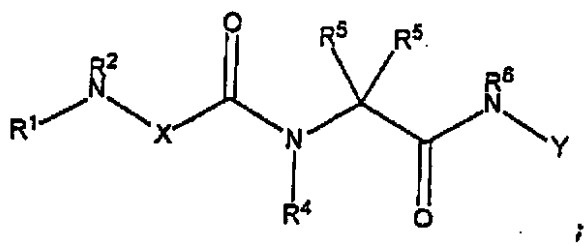
各R^{11}は、独立して、－ＯＨ、－ＳＨ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、$-NO_2$、－ＣＮ、$-NH_2$、$-CO_2H$、－Ｃ（Ｏ）NH_2、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｈ、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）NH_2、－アルキル、－シクロアルキル、－パーフルオロアルキル、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－アリール、－Ｏ－アルキルアリール、－Ｎ（Ｈ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）アリール、－Ｎ（Ｈ）－アルキルアリール、$-N(アルキル)_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキル、$-C(O)N(アルキル)_2$、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキル、$-N(H)C(O)N(アルキル)_2$、－Ｓ－アルキル、－Ｓ－アリール、－Ｓ－アルキルアリール、$-S(O)_2$アルキル、－Ｓ（Ｏ）アルキル、－Ｃ（Ｏ）アルキル、$-CH_2NH_2$、$-CH_2N(H)$アルキル、または$-CH_2N(アルキル)_2$であり；

R^{12}は、－Ｃ（Ｏ）アルキル、－Ｃ（Ｏ）シクロアルキル、<u>－Ｃ（Ｏ）アルキニル、－Ｃ（Ｏ）アルケニル</u>、－Ｃ（Ｏ）アルキルアリール、－Ｃ（Ｏ）アルキルヘテロアリール、－Ｃ（Ｏ）ヘテロシクリル、または－Ｃ（Ｏ）アルキルヘテロシクリルであり；そして

R^{13}は、－Ｈ、－アルキル、－アリール、－アルキルアリール、または－アルキルヘテロアリールである、化合物。

【請求項３】　式Ｉにより表わされる化合物：

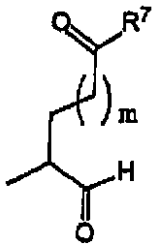
【化１１】



；

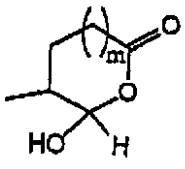
ここで、
Ｙは、以下であり：
【化１２】

(a)

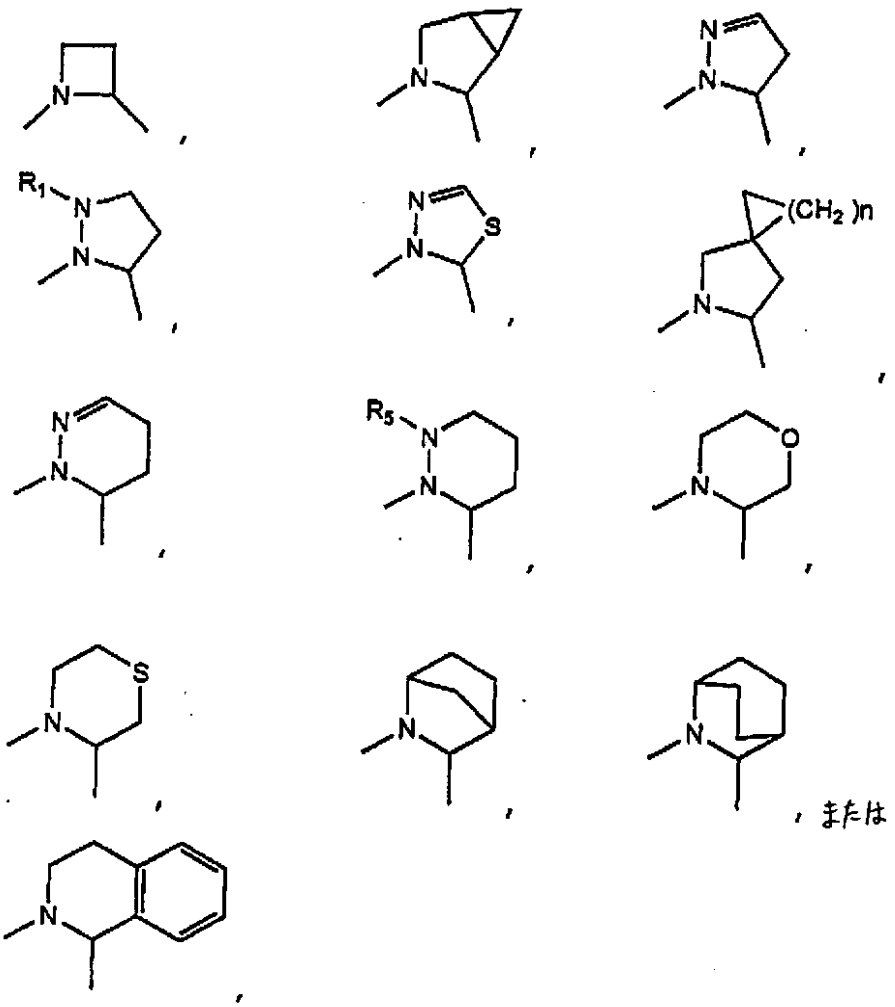


または

(b)

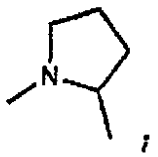


ｍは、０または１であり；
Ｘは、－Ｃ（Ｒ^{3}）$_{2}$－であり；
Ｒ^{1}は、Ｈ、－Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｃ（Ｏ）Ｒ^{8}、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｒ^{8}、－Ｓ（Ｏ）Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）Ｒ^{8}、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｈ）－Ｒ^{8}、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）ＣＨ＝ＣＨＲ^{8}、－Ｃ（Ｏ）ＣＨ$_{2}$ＯＲ^{8}、－Ｃ（Ｏ）ＣＨ$_{2}$Ｎ（Ｈ）Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－Ｃ（Ｏ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－Ｃ（Ｏ）ＣＨ$_{2}$Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$Ｒ^{8}、－ＣＨ$_{2}$－アルケニル－Ｒ^{8}、または－ＣＨ$_{2}$－アルキニル－Ｒ^{8}であり；
Ｒ^{2}は－Ｈであり、各Ｒ^{3}は、独立して、－Ｈ、アミノ酸側鎖、－Ｒ^{8}、アルケニル－Ｒ^{9}、またはアルキニル－Ｒ^{9}であり、あるいは各Ｒ^{3}が、これらが結合する原子と一緒になって、３～７員環または３～７員の複素環の環系を形成し、ここで、任意の－アルキル炭素原子または－シクロアルキル炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、－Ｒ^{10}で置換され、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、－Ｒ^{11}で置換され、該環系の任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、－Ｒ^{1}で置換され；
Ｒ^{4}は－Ｈであり、各Ｒ^{5}は、独立して、－Ｈ、アミノ酸側鎖、－Ｒ^{8}、－アルケニル－Ｒ^{9}、または－アルキニル－Ｒ^{9}であり、あるいはＲ^{4}と一つのＲ^{5}とが、これらが結合している原子と一緒になって、以下から選択される環系を形成し：
【化１３】



ここで、任意の－アルキル炭素原子または－シクロアルキル炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{10}で置換され、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{11}で置換され、そして該環系の任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{1}で置換され、または、R^{4}と一つのR^{5}とが、これらが結合した原子と一緒になって、以下の環系：

【化１４】



を形成し；

R^{6}は、－Ｈであり；

R^{7}は、－ＯＨ、－ＯR^{8}、－Ｎ（Ｈ）ＯＨ、または－Ｎ（Ｈ）Ｓ（Ｏ）$_2$$R^{8}$であり；

各R^{8}は、独立して、－アルキル、－シクロアルキル、－アリール、－ヘテロアリール、－ヘテロシクリル、－アルキルシクロアルキル、－アルキルアリール、－アルキルヘテロアリール、または－アルキルヘテロシクリルであり、ここで任意の－アルキル炭素原子

または－シクロアルキル炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{10}で置換され、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じてR^{11}で置換され、そして任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{1}で置換され；

各R^{9}は、独立して、－アリール、－ヘテロアリール、－シクロアルキル、または－ヘテロシクリルであり、ここで任意の－アルキル炭素原子または－シクロアルキル炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{10}で置換され、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{11}で置換され、そして任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{1}で置換され；

各R^{10}は、独立して、－ＯＨ、－ＳＨ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、$-NO_2$、－ＣＮ、$-NH_2$、$-CO_2H$、－Ｃ（Ｏ）NH_2、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｈ、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）NH_2、－パーフルオロアルキル、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－アリール、－Ｏ－アルキルアリール、－Ｎ（Ｈ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）アリール、－Ｎ（Ｈ）－アルキルアリール、$-N(アルキル)_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキル、$-C(O)N(アルキル)_2$、

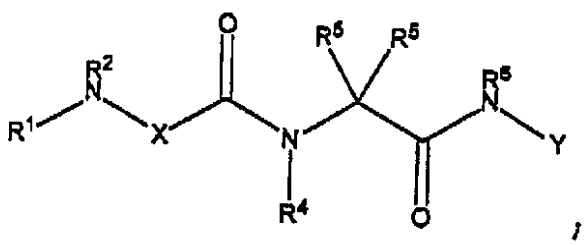
－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏアルキル、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏアルキルアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）　Ｏヘテロアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏアルキルヘテロアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏシクロアルキル、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）　Ｃ（Ｏ）$N(アルキル)_2$、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキルアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ　（Ｏ）Ｎ（Ｈ）ヘテロアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキルヘテロアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）シクロアルキル、－Ｓ－アルキル、－Ｓ－アリール、－Ｓ－アルキルアリール、－Ｓ（Ｏ）$_2$アルキル、－Ｓ（Ｏ）アルキル、－Ｃ（Ｏ）アルキル、$-CH_2NH_2$、$-CH_2N(H)$アルキル、もしくは$-CH_2N(アルキル)_2$、－アルキル、－シクロアルキル、－アリール、－ヘテロアリール、－ヘテロシクリル、－アルキルシクロアルキル、－アルキルアリール、－アルキルヘテロアリール、または－アルキルヘテロシクリルであり、ここで、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{11}で置換され、そして任意の窒素原子に結合した水素
原子が、必要に応じて、R^{1}で置換され；そして

各R^{11}は、独立して、－ＯＨ、－ＳＨ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、$-NO_2$、－ＣＮ、$-NH_2$、$-CO_2H$、－Ｃ（Ｏ）NH_2、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｈ、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）NH_2、－アルキル、－シクロアルキル、－パーフルオロアルキル、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－アリール、－Ｏ－アルキルアリール、－Ｎ（Ｈ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）アリール、－Ｎ（Ｈ）－アルキルアリール、$-N(アルキル)_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキル、$-C(O)N(アルキル)_2$、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキル、$-N(H)C(O)N(アルキル)_2$、－Ｓ－アルキル、－Ｓ－アリール、－Ｓ－アルキルアリール、－Ｓ（Ｏ）$_2$アルキル、－Ｓ（Ｏ）アルキル、－Ｃ（Ｏ）アルキル、$-CH_2NH_2$、$-CH_2N(H)$アルキル、または$-CH_2N(アルキル)_2$であり；

但し、一方のR^{3}が－Ｈの場合は、他方のR^{3}は－Ｈではない、化合物。

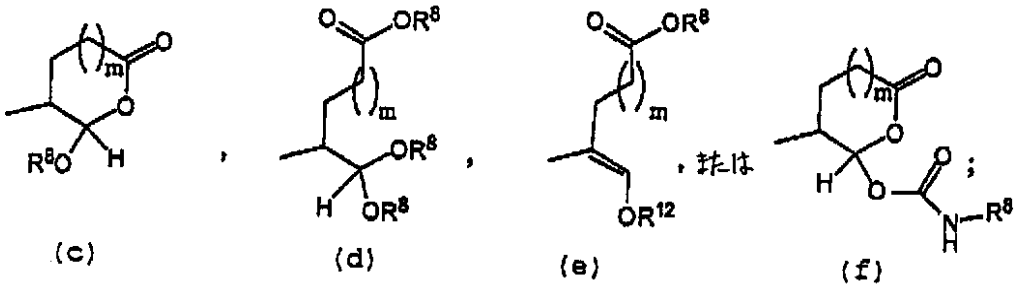
【請求項４】　式Ｉにより表わされる化合物：

【化１５】

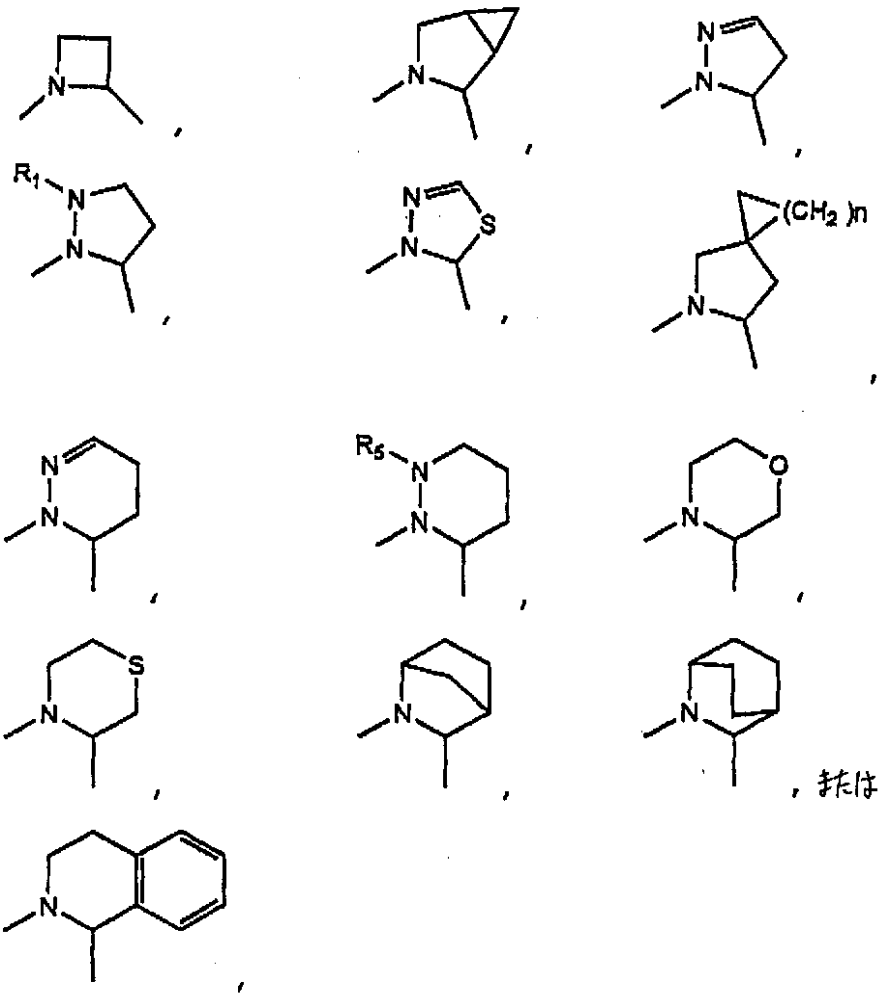


I

ここで、
Ｙは、以下であり：
【化１６】

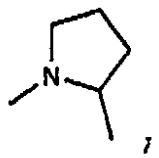


ｍは、０または１であり；
Ｘは、－Ｃ（Ｒ^{3}）$_{2}$－であり；
Ｒ^{1}は、Ｈ、－Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｃ（Ｏ）Ｒ^{8}、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｒ^{8}、－Ｓ（Ｏ）Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）Ｒ^{8}、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｈ）－Ｒ^{8}、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）ＣＨ＝ＣＨＲ^{8}、－Ｃ（Ｏ）ＣＨ$_{2}$ＯＲ^{8}、－Ｃ（Ｏ）ＣＨ$_{2}$Ｎ（Ｈ）Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－Ｃ（Ｏ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－Ｃ（Ｏ）ＣＨ$_{2}$Ｎ（Ｒ^{8}）$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$Ｒ^{8}、－ＣＨ$_{2}$－アルケニル－Ｒ^{8}、または－ＣＨ$_{2}$－アルキニル－Ｒ^{8}であり；
Ｒ^{2}は－Ｈであり、各Ｒ^{3}は、独立して、－Ｈ、アミノ酸側鎖、－Ｒ^{8}、アルケニル－Ｒ^{9}、またはアルキニル－Ｒ^{9}であり、あるいは各Ｒ^{3}が、これらが結合する原子と一緒になって、３～７員環または３～７員の複素環の環系を形成し、ここで、任意の－アルキル炭素原子または－シクロアルキル炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、－Ｒ^{10}で置換され、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、－Ｒ^{11}で置換され、該環系の任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、－Ｒ^{1}で置換され；
Ｒ^{4}は－Ｈであり、各Ｒ^{5}は、独立して、－Ｈ、アミノ酸側鎖、－Ｒ^{8}、－アルケニル－Ｒ^{9}、または－アルキニル－Ｒ^{9}であり、またはＲ^{4}と一つのＲ^{5}とが、これらが結合している原子と一緒になって、以下から選択される環系を形成し：
【化１７】



ここで、任意の－アルキル炭素原子または－シクロアルキル炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{10}で置換され、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{11}で置換され、そして該環系の任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{1}で置換され、または、R^{4}と一つのR^{5}とが、これらが結合した原子と一緒になって、以下の環系：

【化１８】



を形成し；

R^{6}は、－Hであり；

各R^{8}は、独立して、－アルキル、－シクロアルキル、－アリール、－ヘテロアリール、－ヘテロシクリル、－アルキルシクロアルキル、－アルキルアリール、－アルキルヘテロアリール、または－アルキルヘテロシクリルであり、ここで任意の－アルキル炭素原子または－シクロアルキル炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{10}で置換され、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、

必要に応じてR^{11}で置換され、そして任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{1}で置換され；

各R^{9}は、独立して、－アリール、－ヘテロアリール、－シクロアルキル、または－ヘテロシクリルであり、ここで任意の－アルキル炭素原子または－シクロアルキル炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{10}で置換され、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{11}で置換され、そして任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{1}で置換され；

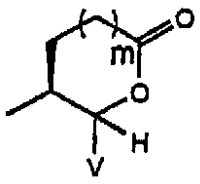
各R^{10}は、独立して、－ＯＨ、－ＳＨ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－NO_2、－ＣＮ、－NH_2、－CO_2H、－Ｃ（Ｏ）NH_2、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｈ、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）NH_2、－パーフルオロアルキル、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－アリール、－Ｏ－アルキルアリール、－Ｎ（Ｈ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）アリール、－Ｎ（Ｈ）－アルキルアリール、－Ｎ（アルキル）$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏアルキル、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏアルキルアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）　Ｏヘテロアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏアルキルヘテロアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｏシクロアルキル、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）　Ｃ（Ｏ）Ｎ（アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキルアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ　（Ｏ）Ｎ（Ｈ）ヘテロアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキルヘテロアリール、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）シクロアルキル、－Ｓ－アルキル、－Ｓ－アリール、－Ｓ－アルキルアリール、－Ｓ（Ｏ）$_2$アルキル、－Ｓ（Ｏ）アルキル、－Ｃ（Ｏ）アルキル、－CH_2NH_2、－CH_2Ｎ（Ｈ）アルキル、もしくは－CH_2Ｎ（アルキル）$_2$、－アルキル、－シクロアルキル、－アリール、－ヘテロアリール、－ヘテロシクリル、－アルキルシクロアルキル、－アルキルアリール、－アルキルヘテロアリール、または－アルキルヘテロシクリルであり、ここで、任意の－アリール炭素原子または－ヘテロアリール炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{11}で置換され、そして任意の窒素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{1}で置換され；そして

各R^{11}は、独立して、－ＯＨ、－ＳＨ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－NO_2、－ＣＮ、－NH_2、－CO_2H、－Ｃ（Ｏ）NH_2、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｈ、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）NH_2、－アルキル、－シクロアルキル、－パーフルオロアルキル、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－アリール、－Ｏ－アルキルアリール、－Ｎ（Ｈ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）アリール、－Ｎ（Ｈ）アルキルアリール、－Ｎ（アルキル）$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）アルキル、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（アルキル）$_2$、－Ｓ－アルキル、－Ｓ－アリール、－Ｓ－アルキルアリール、－Ｓ（Ｏ）$_2$アルキル、－Ｓ（Ｏ）アルキル、－Ｃ（Ｏ）アルキル、－CH_2NH_2、－CH_2Ｎ（Ｈ）アルキル、または－CH_2Ｎ（アルキル）$_2$であり；そして

R^{12}は、－Ｃ（Ｏ）アルキル、－Ｃ（Ｏ）シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）アルキニル、－Ｃ（Ｏ）アルケニル、－Ｃ（Ｏ）アルキルアリール、－Ｃ（Ｏ）アルキルヘテロアリール、－Ｃ（Ｏ）ヘテロシクリル、または－Ｃ（Ｏ）アルキルヘテロシクリルである、化合物。

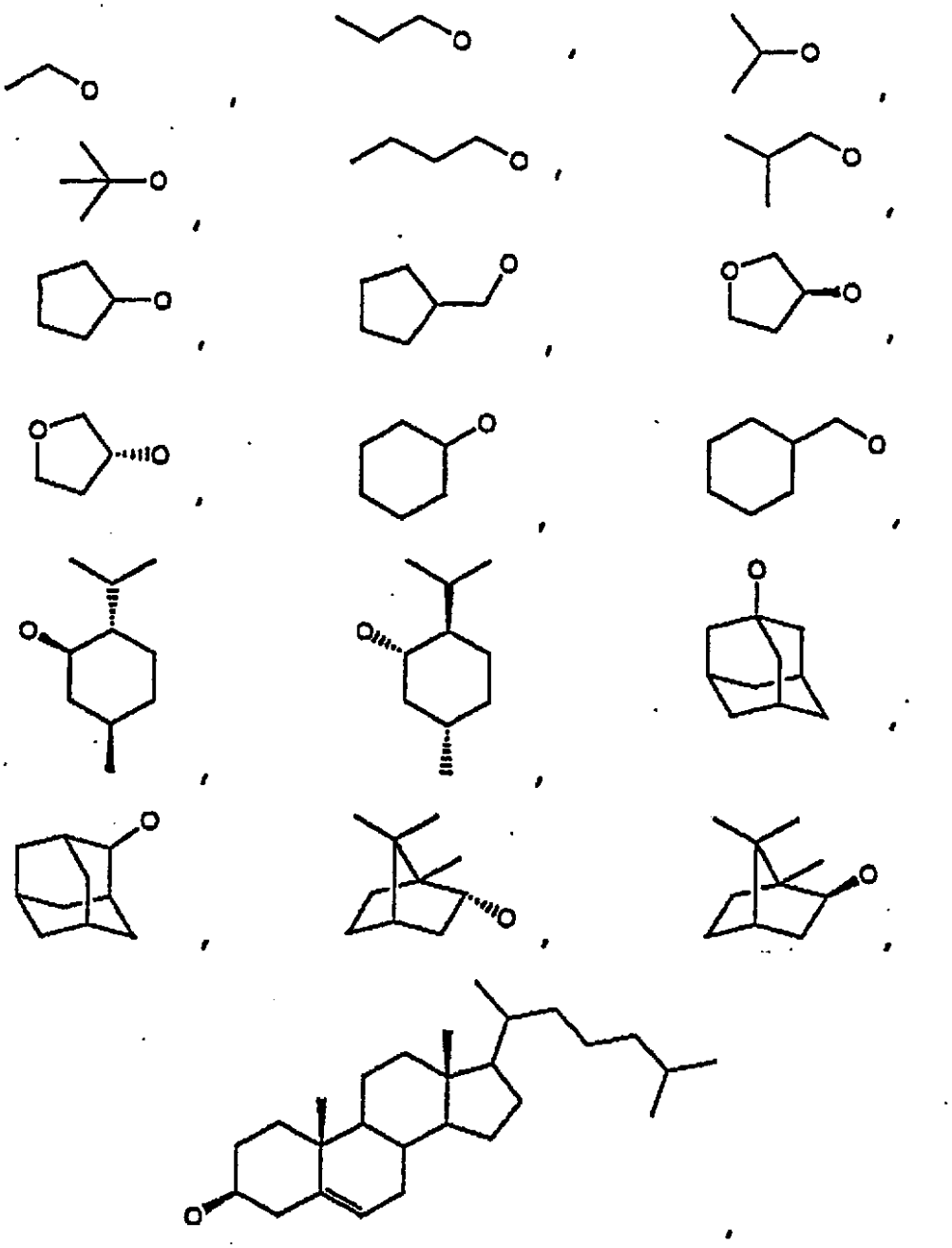
【請求項５】　請求項２または４に記載の化合物であって、ここで、Ｙは以下であり：

【化１９】

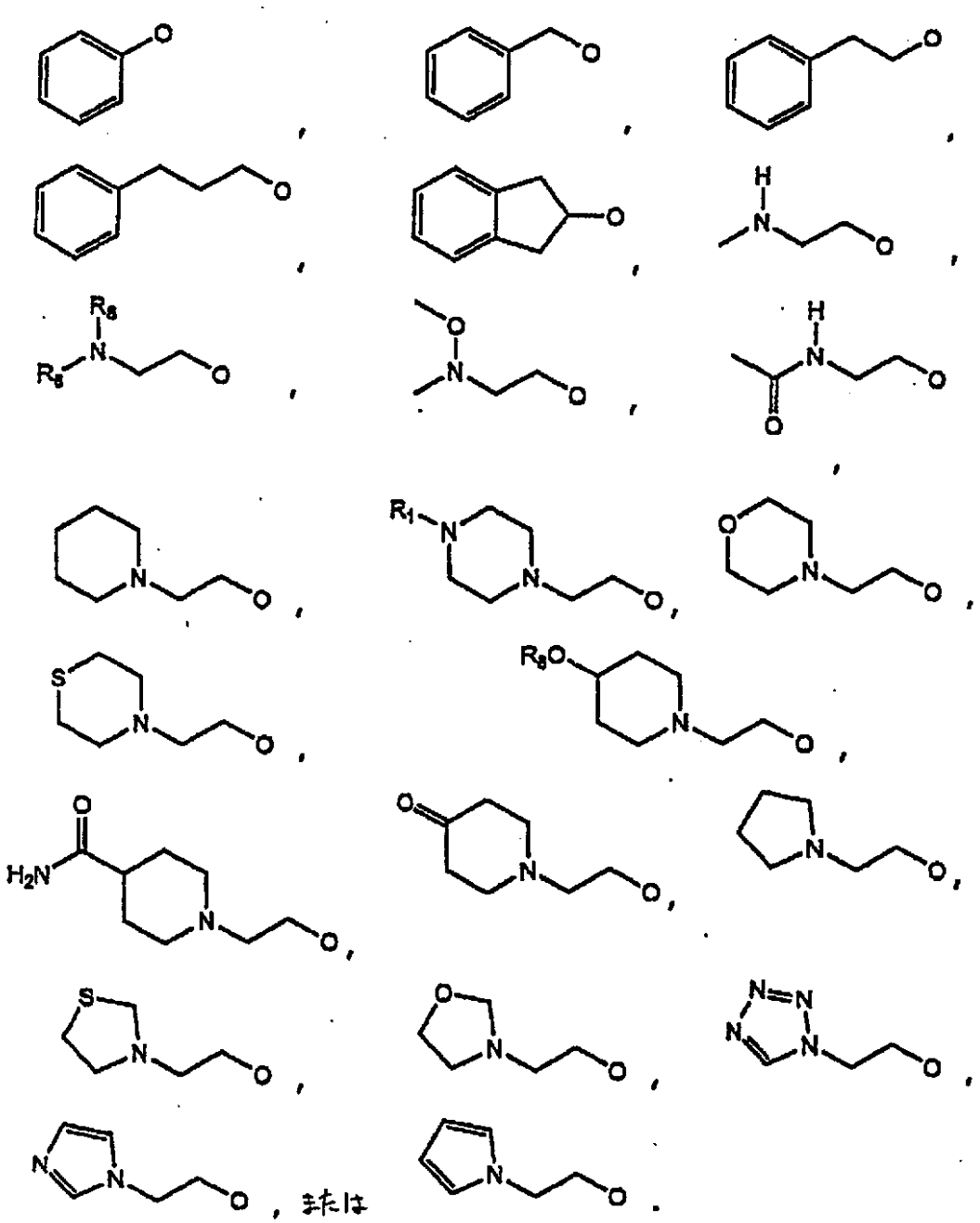


そしてＶは、ＣＨ$_3$Ｏ、

【化２０－１】



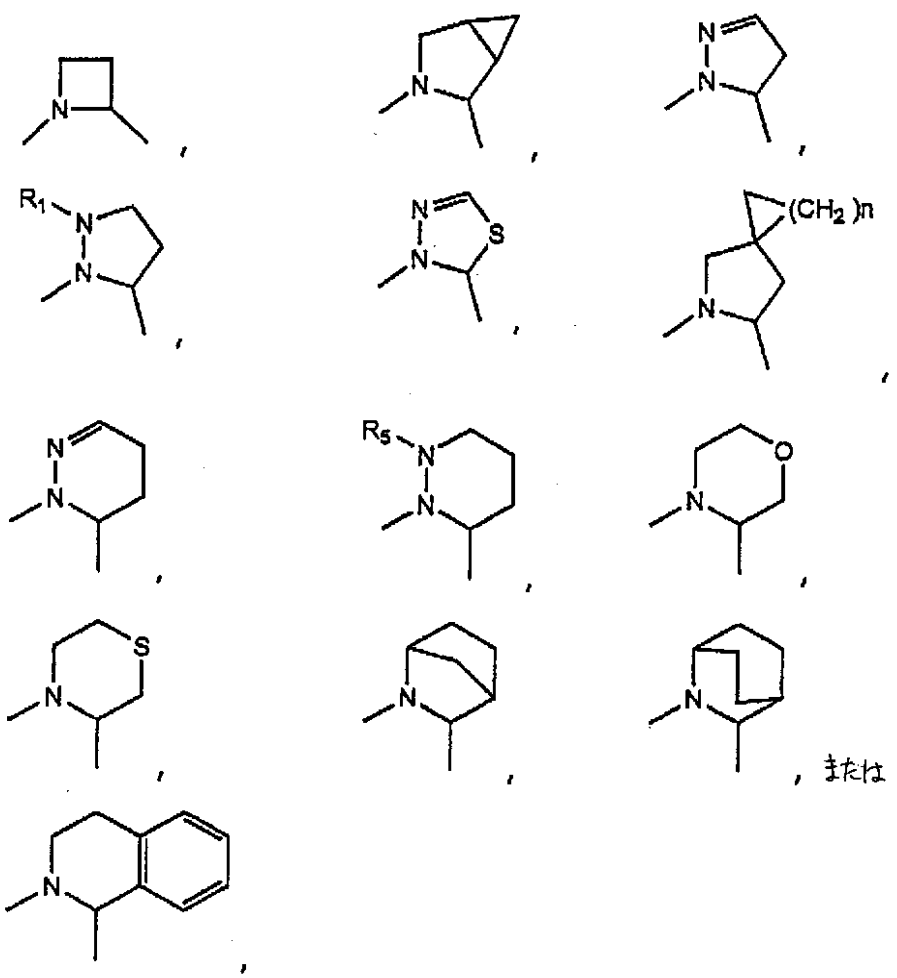
【化２０－２】



である、化合物。

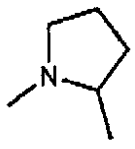
【請求項６】　請求項１～５のいずれか１項に記載の化合物であって、ここで、R^4と一つのR^5とが、これらが結合している原子と一緒になって、以下から選択される環系：

【化２１】



を形成し、ここで、任意の－アルキル炭素原子または－シクロアルキル炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じて、R^{10}で置換され、または、R^4と一つのR^5とが、これらが結合している原子と一緒になって、以下の環系：

【化２２】



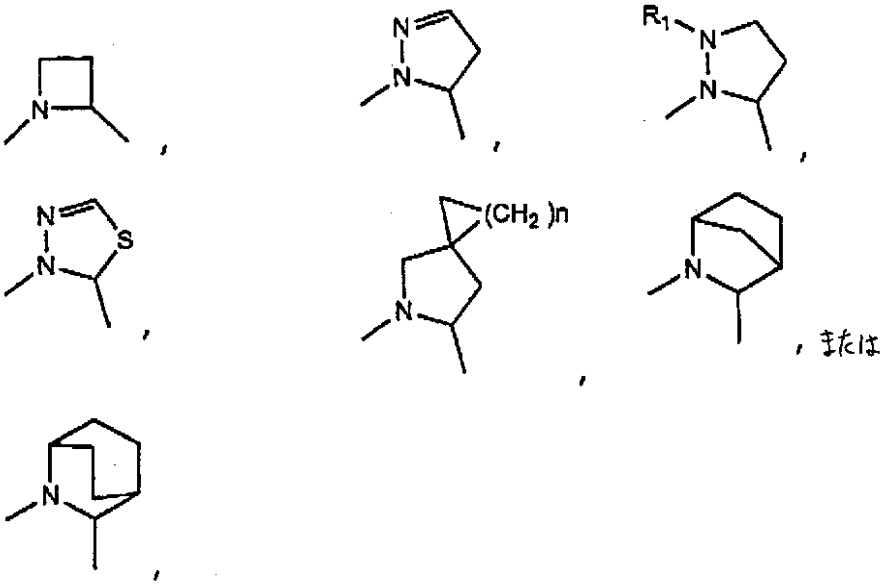
を形成する、化合物。

【請求項７】　請求項６に記載の化合物であって、ここで、一方のR^3は－Ｈであり、そして他方のR^3は、メチル、イソプロピル、ｔｅｒｔ－ブチル、$-CH_2SR^8$、$-CH_2SO_2R^8$、$-CH_2CH_2SR^8$、または$-CH_2CH_2SO_2R^8$である、化合物。

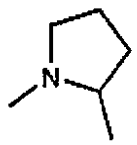
【請求項８】　請求項７に記載の化合物であって、ここで、一方のR^3が－Ｈであり、そして他方のR^3がメチルである、化合物。

【請求項９】　請求項８に記載の化合物であって、ここでR^1が$-C(O)R^8$、または$-C(O)C(O)R^8$である、化合物。

【請求項１０】　請求項６に記載の化合物であって、ここで、Ｒ^{4}と一方のＲ^{5}とが、それらが結合している原子と一緒になって、以下から選択される環系：
【化２３】



を形成し、そして他方のＲ^{5}がＨであり、ここで、任意のｎ－アルキル炭素原子またはｎ－シクロアルキル炭素原子に結合した水素原子が、必要に応じてＲ^{10}で置換される、化合物。
【請求項１１】　請求項１０に記載の化合物であって、ここで一方のＲ^{3}がｎ－Ｈであり、そして他方のＲ^{3}が、メチル、イソプロピル、ｔｅｒｔ－ブチル、－ＣＨ$_{2}$ＳＲ^{8}、－ＣＨ$_{2}$ＳＯ$_{2}$Ｒ^{8}、－ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{2}$ＳＲ^{8}、または－ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{2}$ＳＯ$_{2}$Ｒ^{8}である、化合物。
【請求項１２】　請求項１１に記載の化合物であって、ここで、一方のＲ^{3}がｎ－Ｈであり、そして他方のＲ^{3}がメチルである、化合物。
【請求項１３】　請求項１２に記載の化合物であって、ここで、Ｒ^{1}がｎ－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{8}、またはｎ－Ｃ（Ｏ）Ｃ（Ｏ）Ｒ^{8}である、化合物。
【請求項１４】　請求項６に記載の化合物であって、ここで、一方のＲ^{4}と一方のＲ^{5}とが、これらが結合している原子と一緒になって、以下の環系：
【化２４】

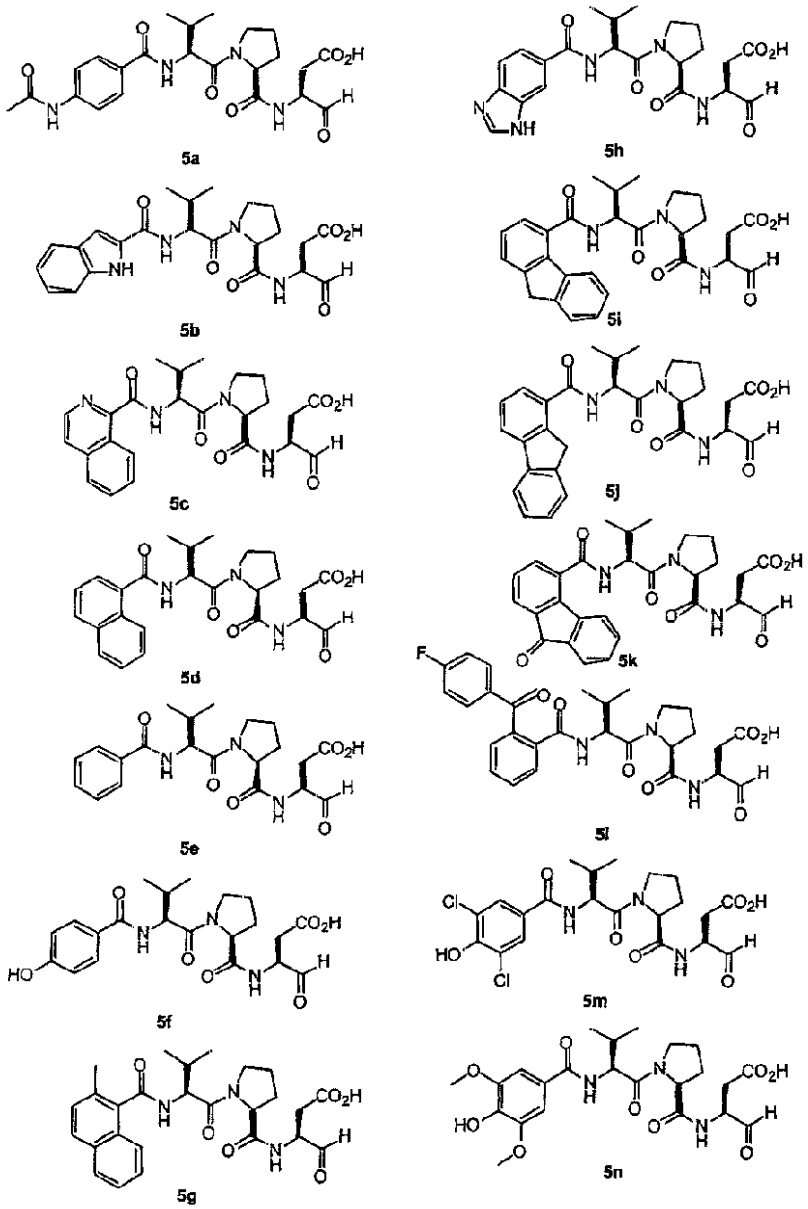


を形成し、そして他方のＲ^{5}がＨである、化合物。
【請求項１５】　請求項１４に記載の化合物であって、ここで、一方のＲ^{3}がｎ－Ｈであり、そして他方のＲ^{3}が、メチル、イソプロピル、ｔｅｒｔ－ブチル、－ＣＨ$_{2}$ＳＲ^{8}、－ＣＨ$_{2}$ＳＯ$_{2}$Ｒ^{8}、－ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{2}$ＳＲ^{8}、または－ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{2}$ＳＯ$_{2}$Ｒ^{8}である、化合物。
【請求項１６】　請求項１５に記載の化合物であって、ここで、一方のＲ^{3}がｎ－Ｈであり、そして他方のＲ^{3}がメチルである、化合物。
【請求項１７】　請求項１６に記載の化合物であって、ここで、Ｒ^{1}がｎ－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{8}

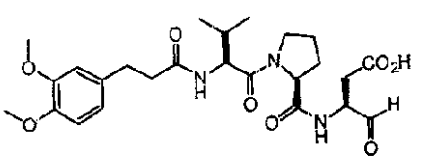
、または－Ｃ（Ｏ）Ｃ（Ｏ）Ｒ^{8}である、化合物。

【請求項１８】　請求項１または３に記載の化合物であって、以下：５ａ－５ｂｄ、７ａ－７ａｔ、２０ａ－２０ｔ、２３ａ－２３ｉ、２４ａ－２４ｅ、２６ｄ、２６ｅ、２９ａ－２９ｓ、３２ａ－ｅ、３４、４２、４６、５２、５７、６１、６５、６９、７３、１２１、および１２２ａ－ｖ、

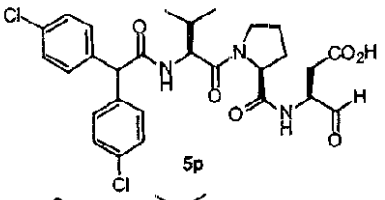
【化２５－１】



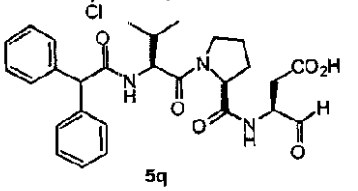
【化２５－２】



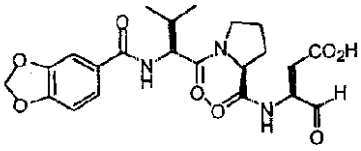
5o



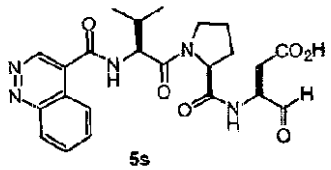
5p



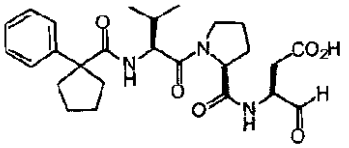
5q



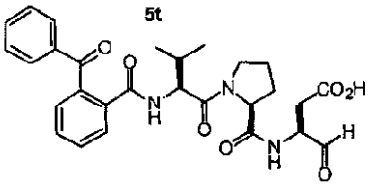
5r



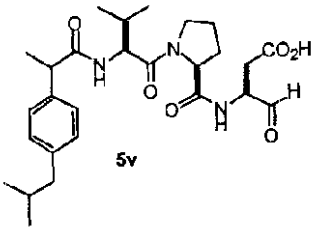
5s



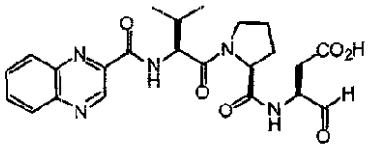
5t



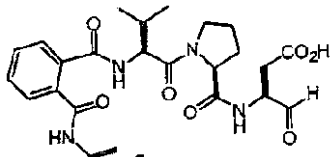
5u



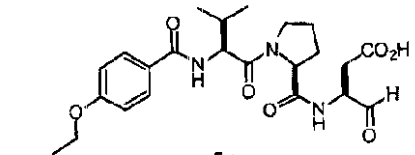
5v



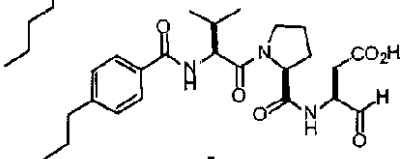
5w



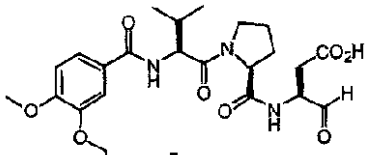
5x



5y

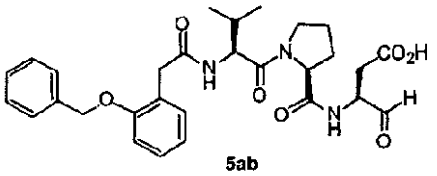


5z

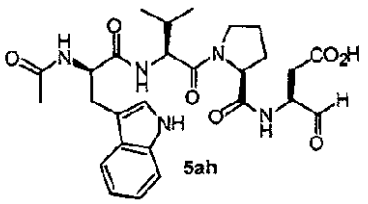


5aa

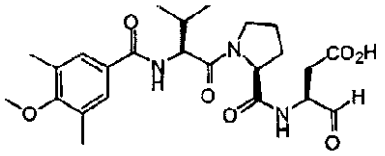
【化２５－３】



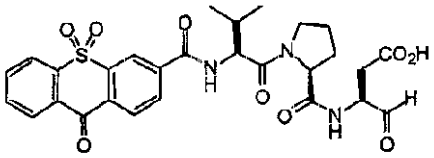
5ab



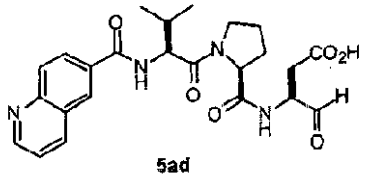
5ah



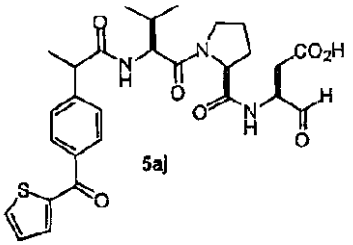
5ac



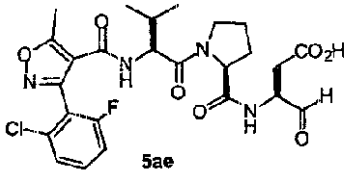
5ai



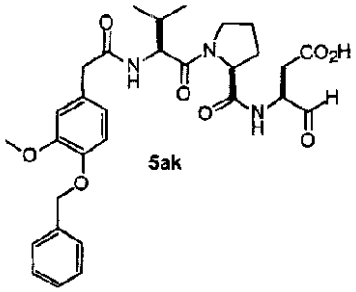
5ad



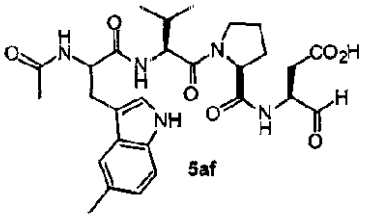
5aj



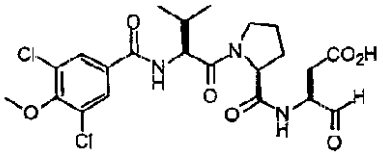
5ae



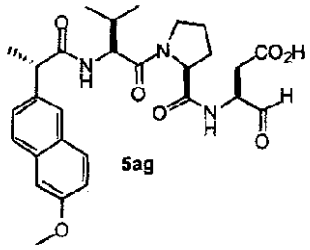
5ak



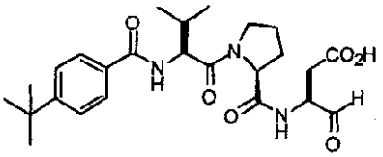
5af



5al

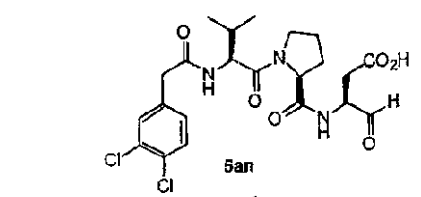


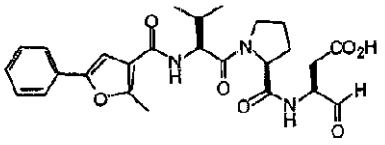
5ag

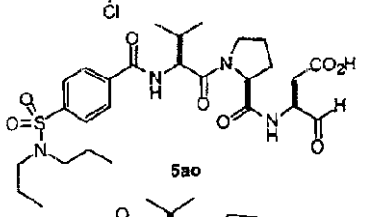


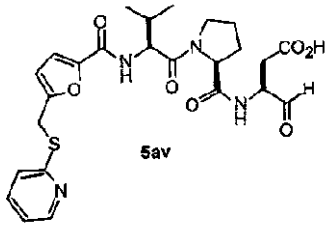
5am

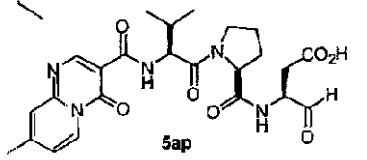
【化２５－４】

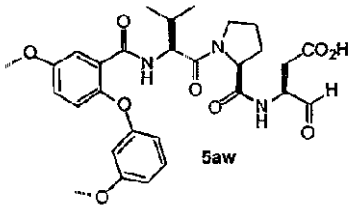

5an

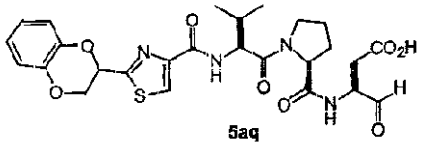

5au

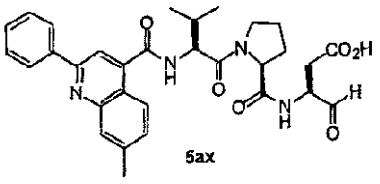

5ao

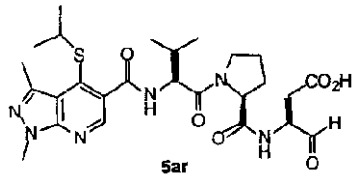

5av

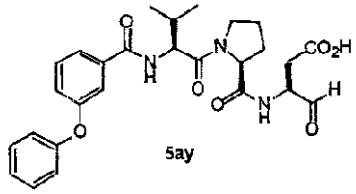

5ap

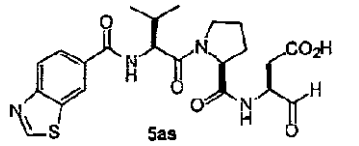

5aw

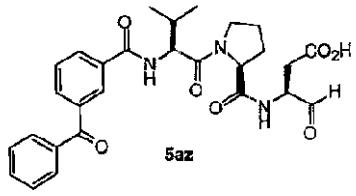

5aq

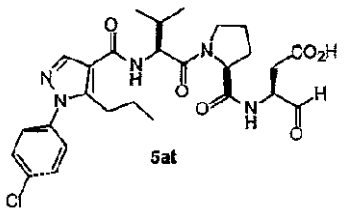

5ax


5ar

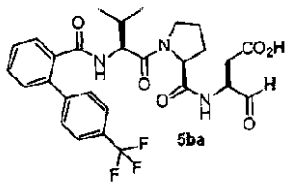

5ay

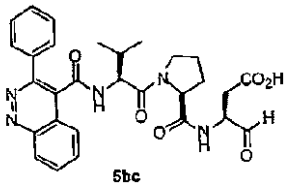

5as

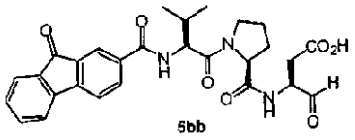

5az

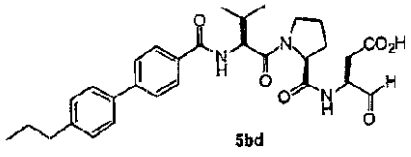

5at

【化２５－５】

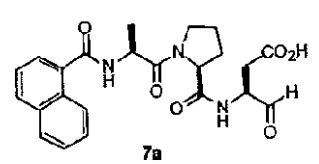

5ba

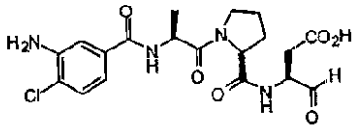

5bc

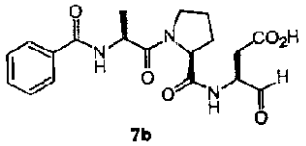

5bb

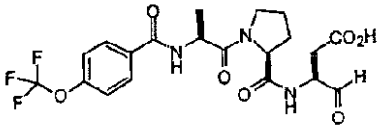

5bd

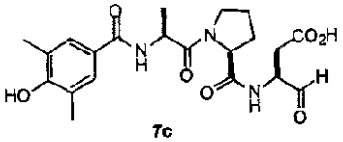
【化２５－６】

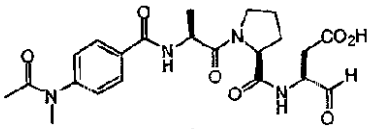

7a

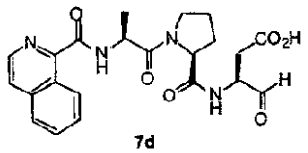

7h

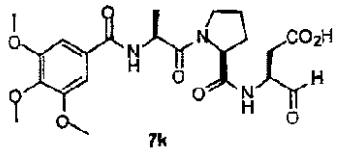

7b

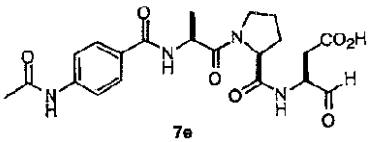

7i

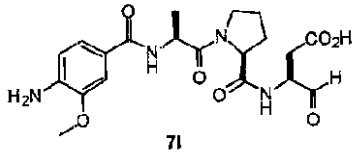

7c

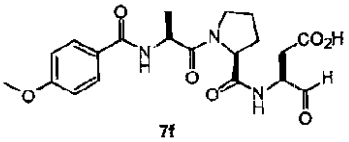

7j

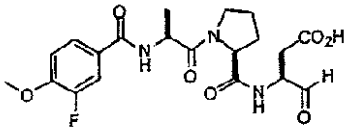

7d

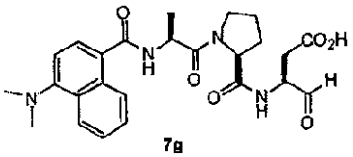

7k

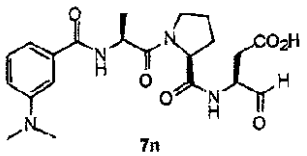

7e


7l

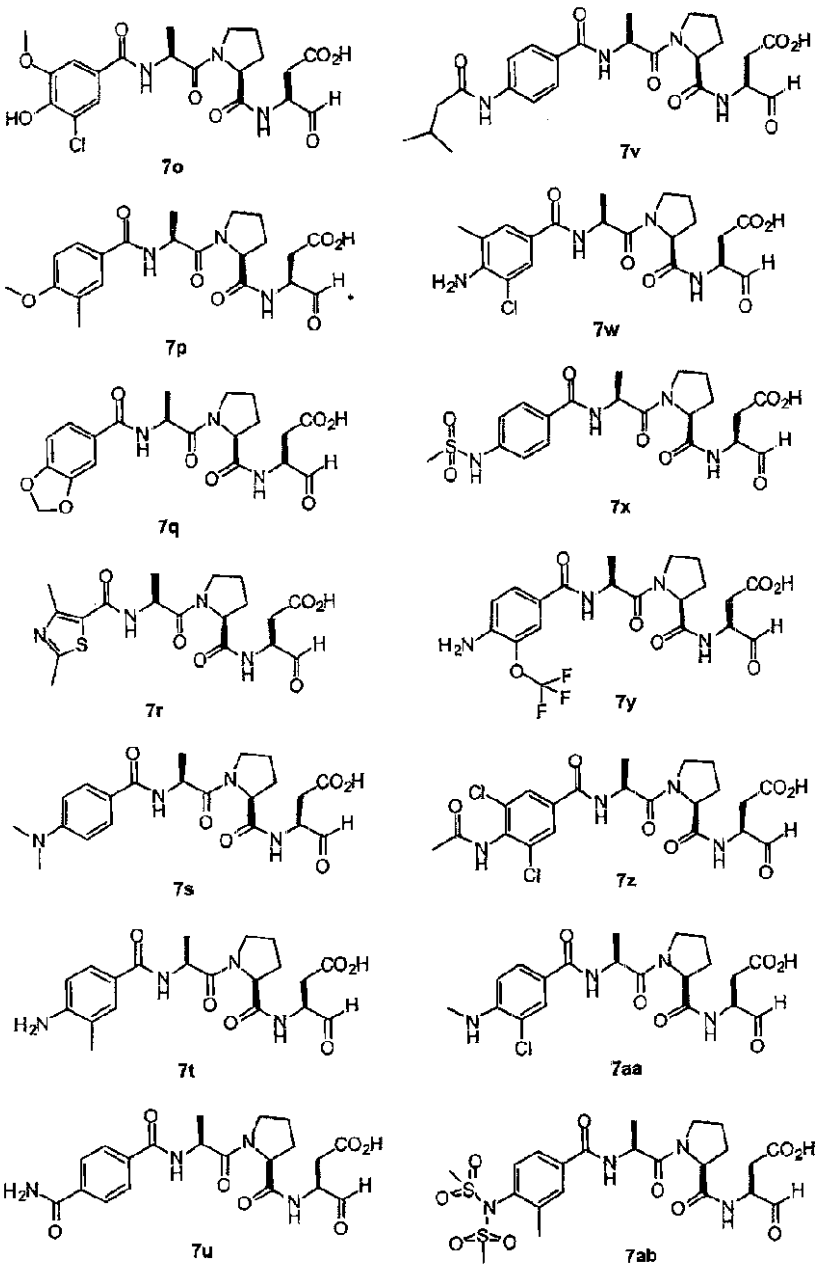

7f


7m

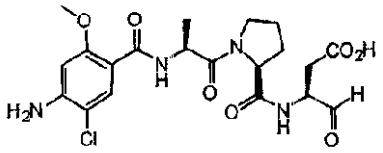

7g

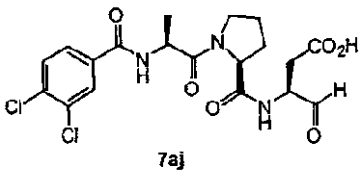

7n

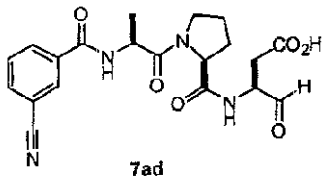
【化２５－７】

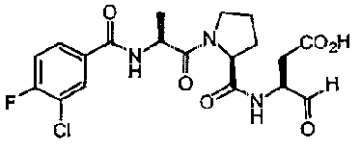


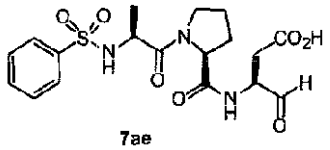
【化２５－８】

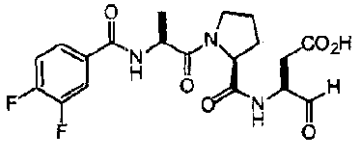

7ac

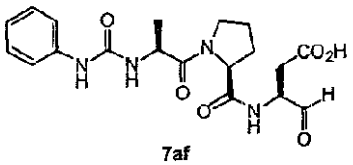

7aj

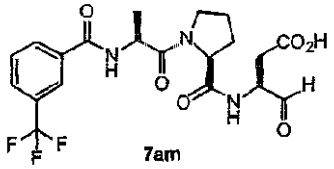

7ad

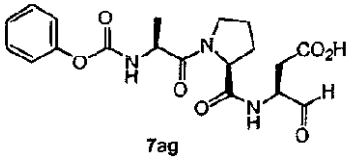

7ak

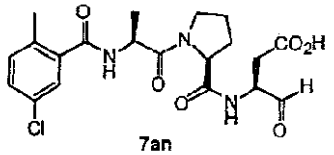

7ae

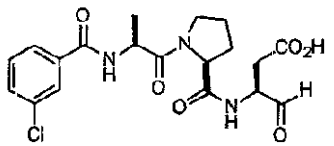

7al

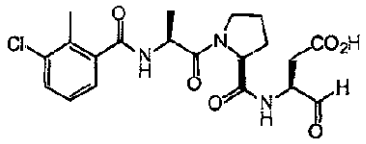

7af

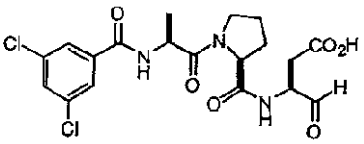

7am

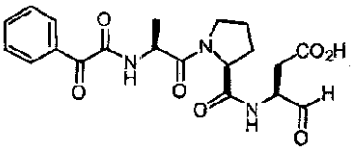

7ag


7an

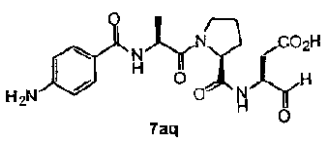

7ah

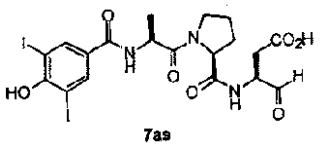

7ao

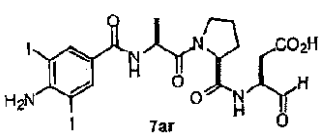

7ai

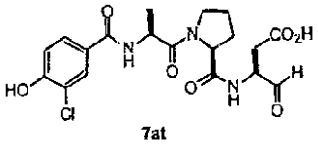

7ap

【化２５－９】

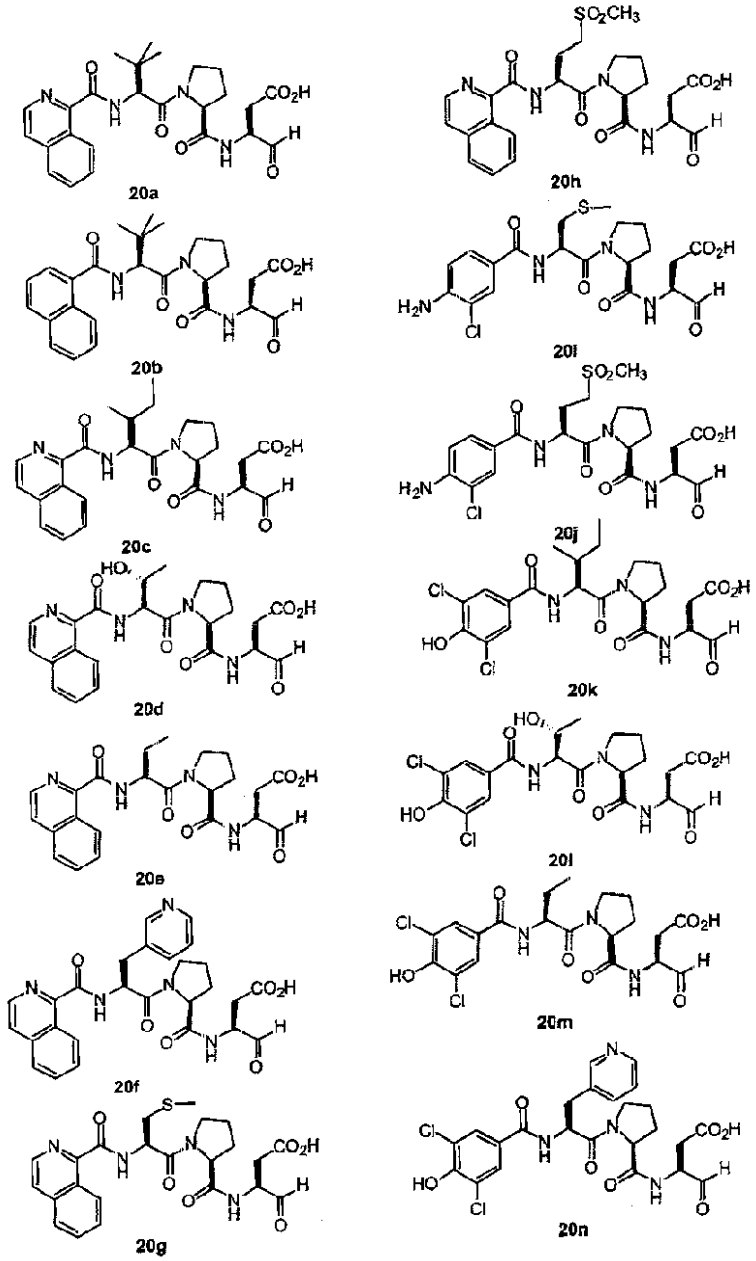

7aq


7as

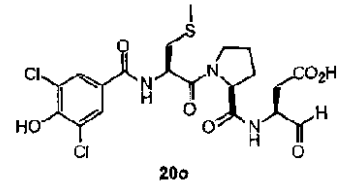

7ar

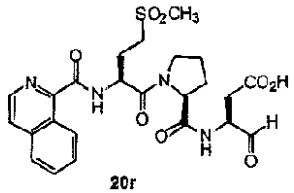

7at

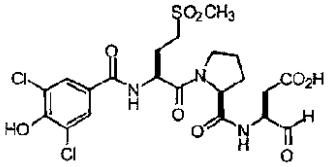
【化２５－１０】

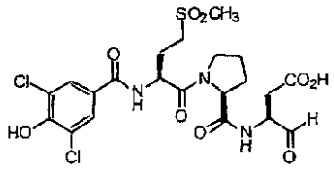


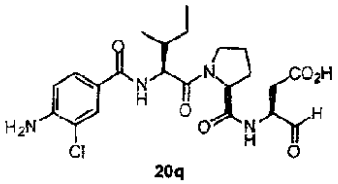
【化２５－１１】

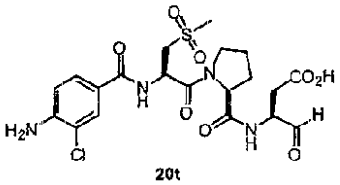

20o


20r

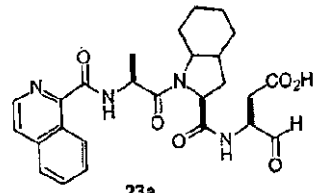

20p

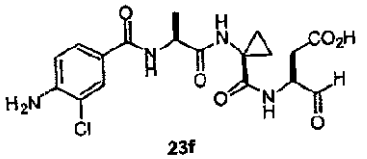

20s

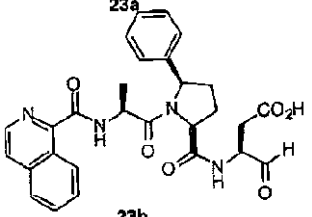

20q

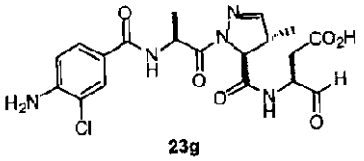

20t

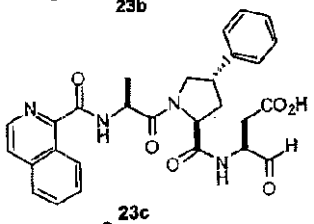
【化２５－１２】

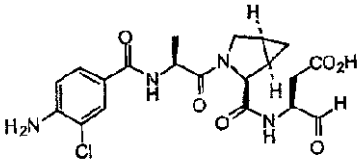

23a

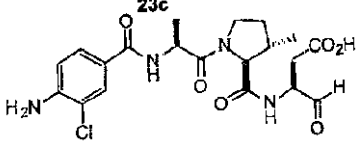

23f

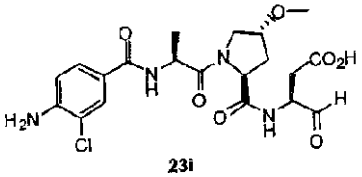

23b

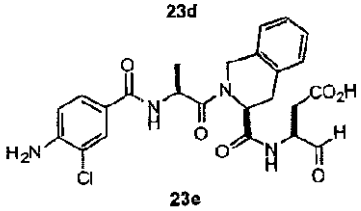

23g


23c

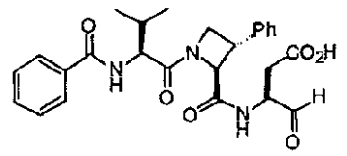

23h


23d

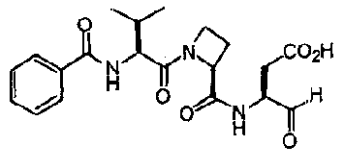

23i


23e

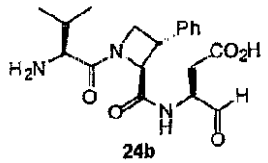
【化２５－１３】



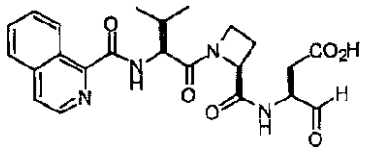
24a



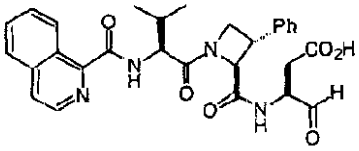
24d



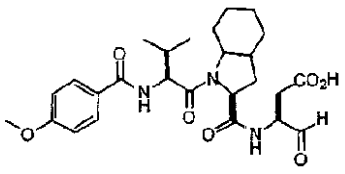
24b



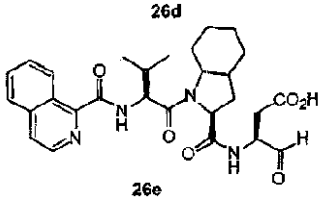
24e



24c

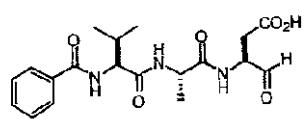


26d

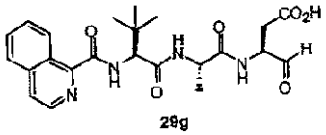


26e

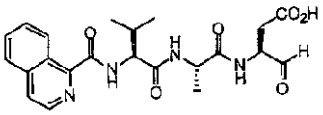
【化２５－１４】



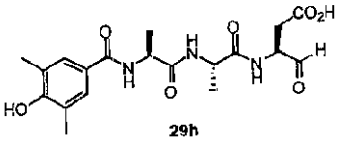
29a



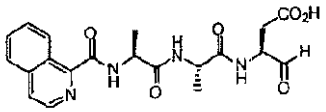
29g



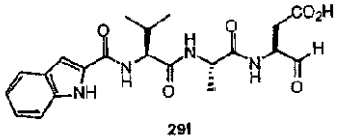
29b



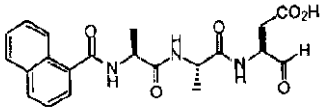
29h



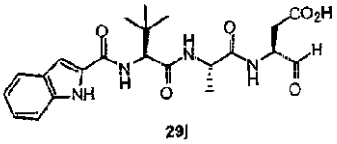
29c



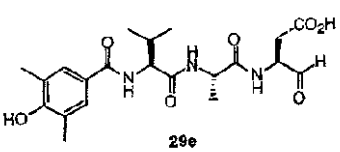
29i



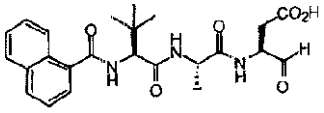
29d



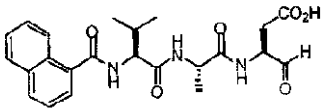
29j



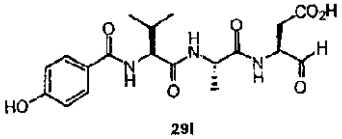
29e



29k

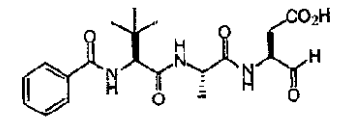


29f

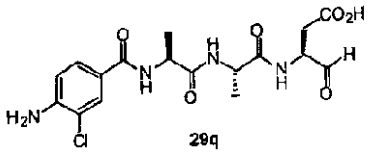


29l

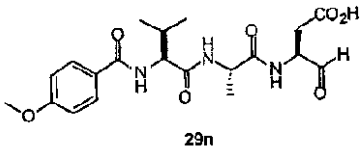
【化２５－１５】



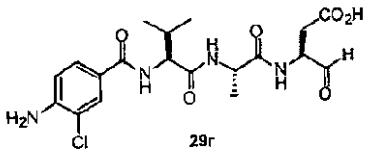
29m



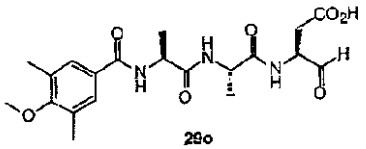
29q



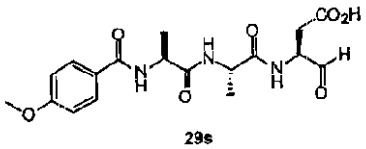
29n



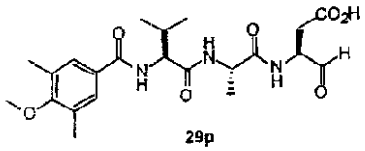
29r



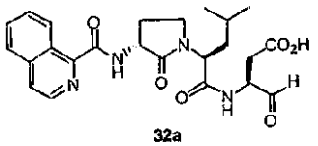
29o



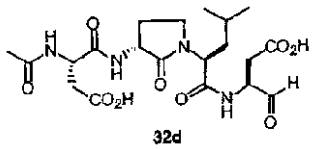
29s



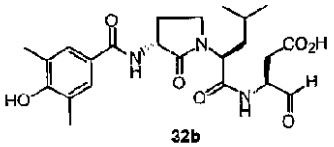
29p



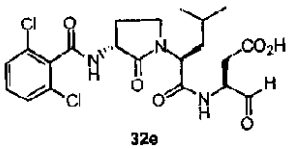
32a



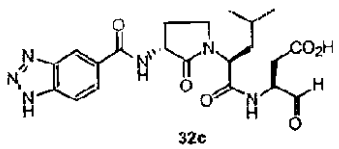
32d



32b

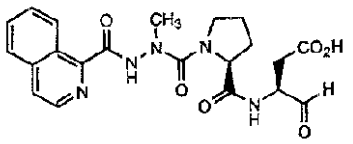


32e

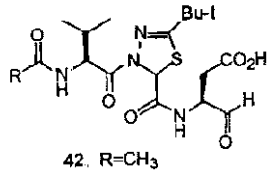


32c

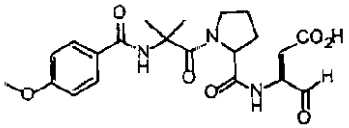
【化２５－１６】



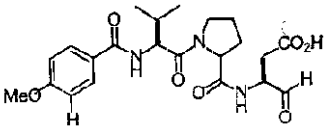
34



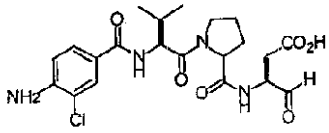
42, R=CH_3
46, R=4-MeOPh-



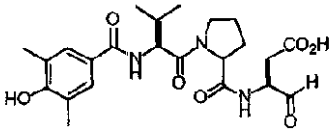
52



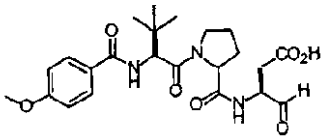
57



61

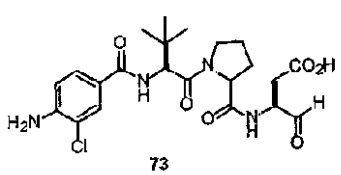


65

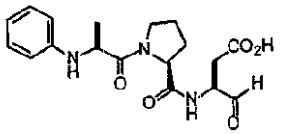


69

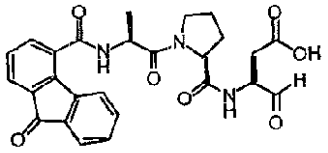
【化２５－１７】



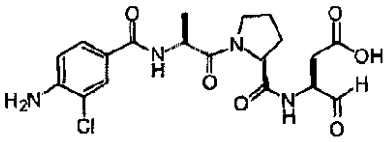
73



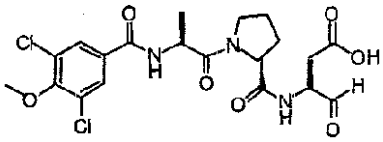
121



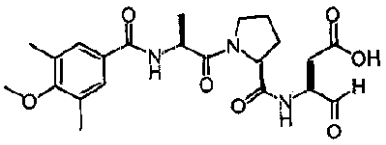
122a



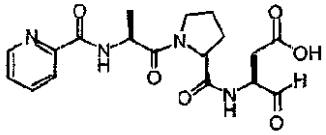
122b



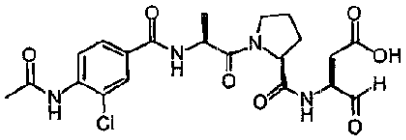
122c



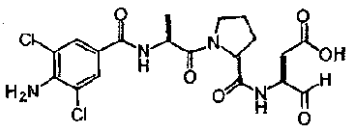
122d



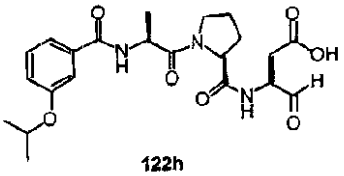
122e



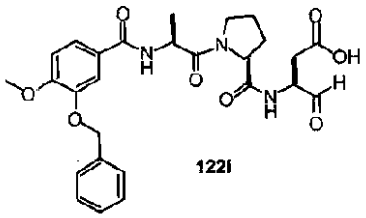
122f



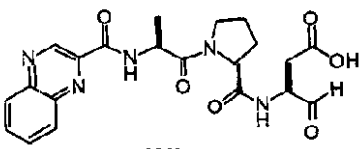
122g



122h

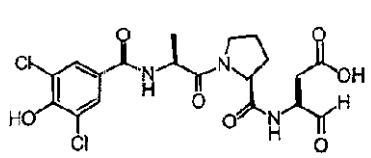


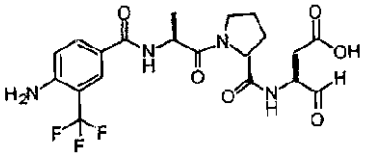
122i

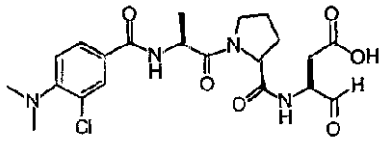


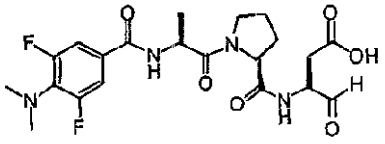
122j

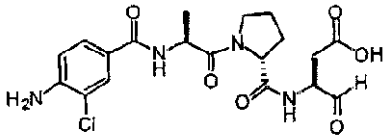
【化２５－１８】

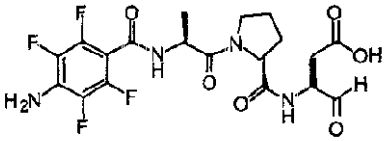

122k

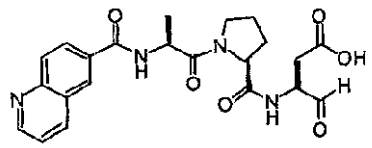

122l

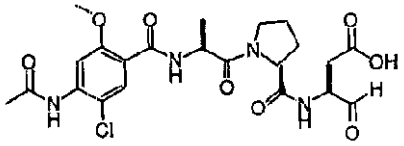

122m

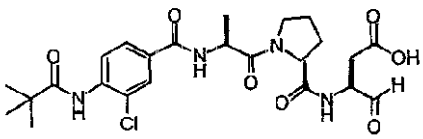

122n

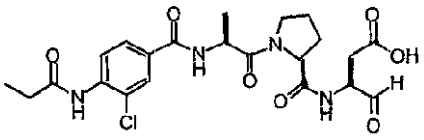

122o


122p

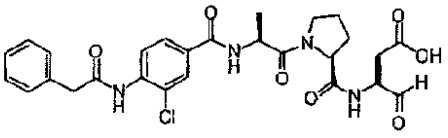

122q


122r

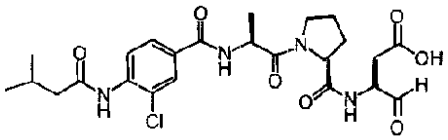

122s


122t

【化２５－１９】


122u

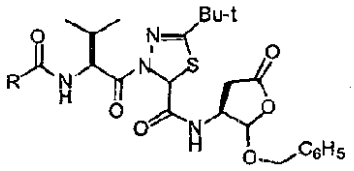
および


122v

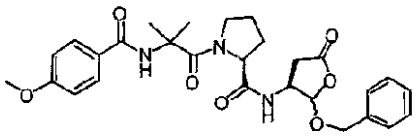
からなる群から選択される、化合物。

【請求項１９】　請求項４に記載の化合物であって、以下：
４１、４５、５１、５６、６０、６４、６８、７２、７６－９３、９８ａ－ｚ、９８ａａ－ａｚ、９８ｂａおよび９８ｂｂ、１０１、１０２ａ、１０２ｂ、１０８ａ－１０８ｄ、１１０、１１１、ならびに１１６ａ－１１６ｈ、

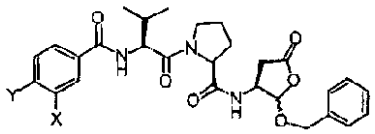
【化２５－２０】



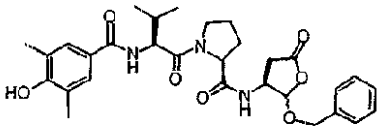
41, R=CH_3
45, R=4-MeOPh-



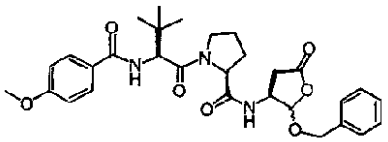
51



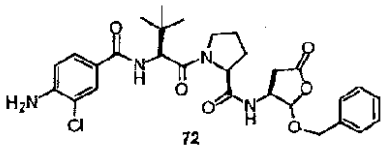
56, X=H, Y=MeO
60, X=Cl, Y=NH_2



64

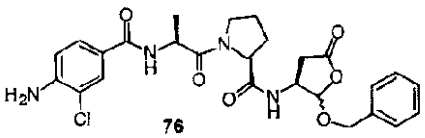


68

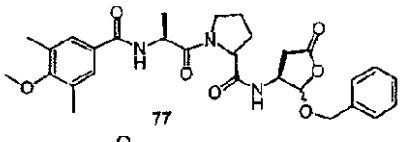


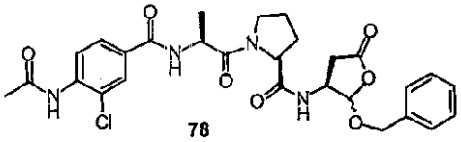
72

【化２５－２１】

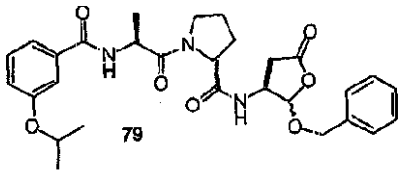


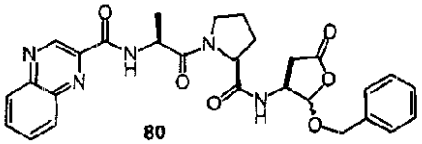
76

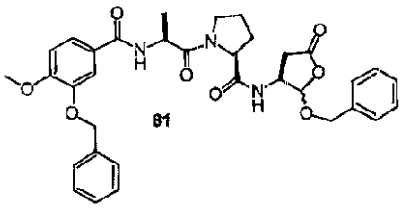

77

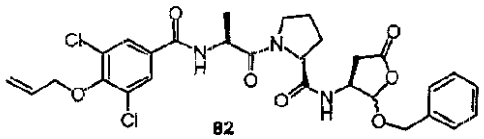


78

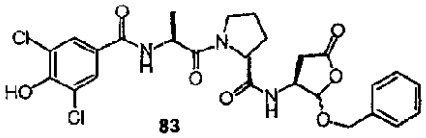

79


80

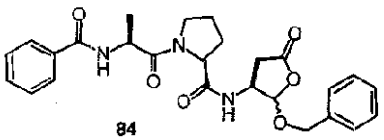

81

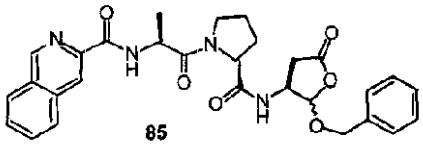


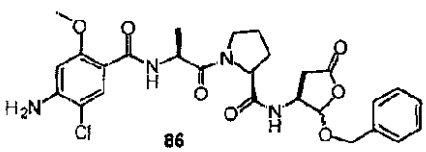
82



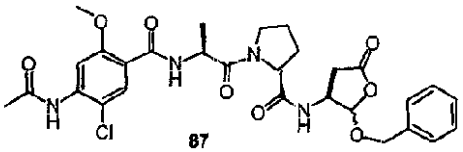
83


84


85

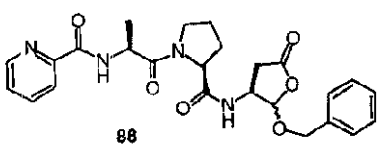


86

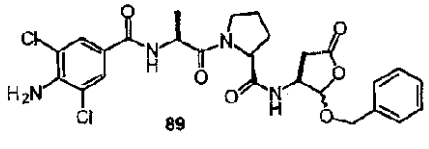


87

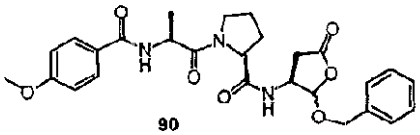
【化２５－２２】



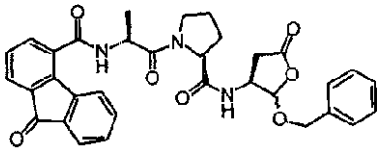
88



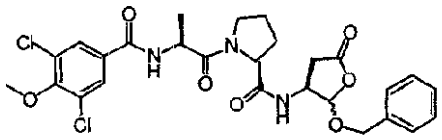
89



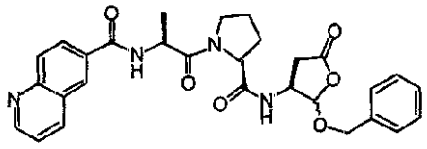
90



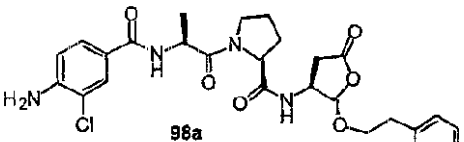
91



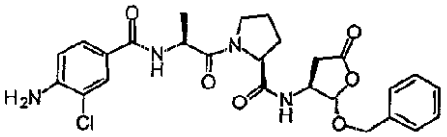
92



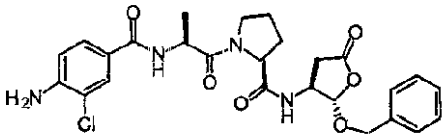
93



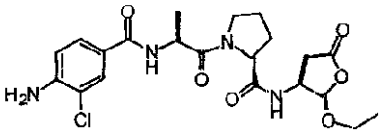
98a



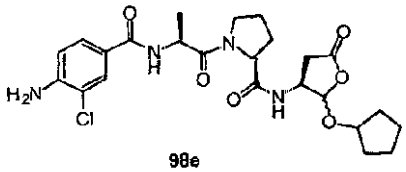
98b



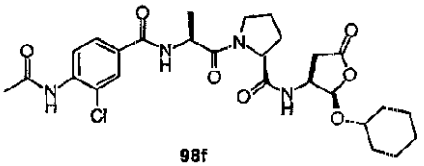
98c



98d

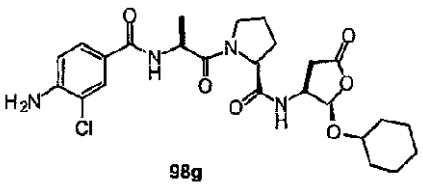


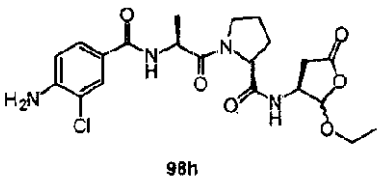
98e

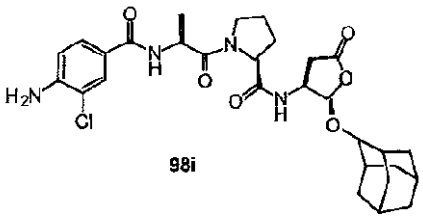


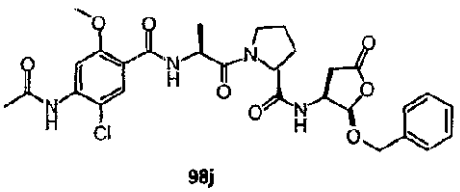
98f

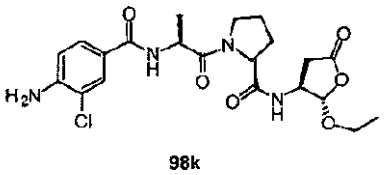
【化２５－２３】

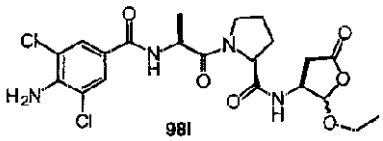

98g

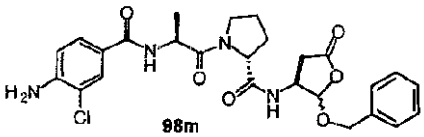

98h

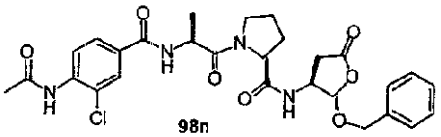

98i

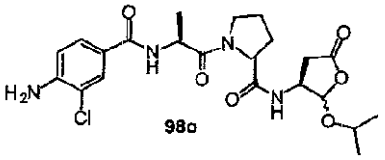

98j

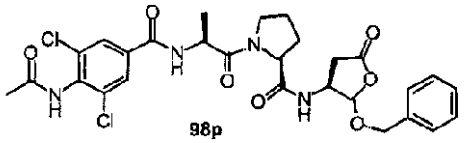

98k

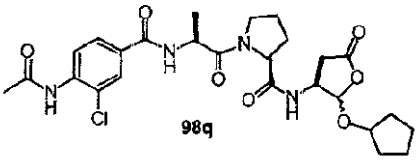

98l

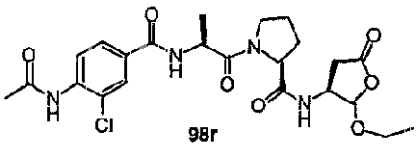

98m


98n

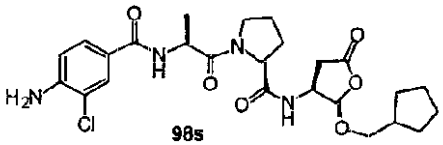

98o

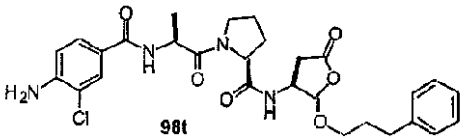

98p

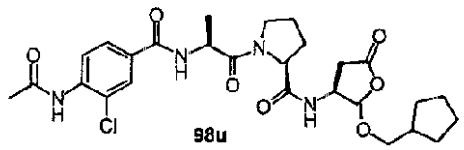

98q

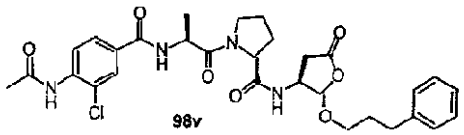

98r

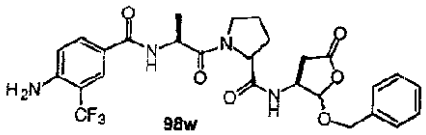
【化２５－２４】

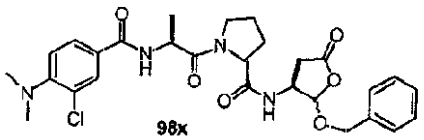

98s

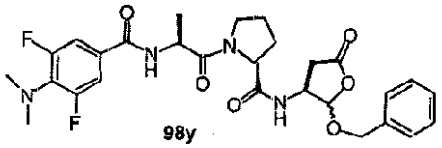

98t

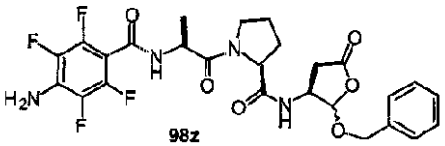

98u

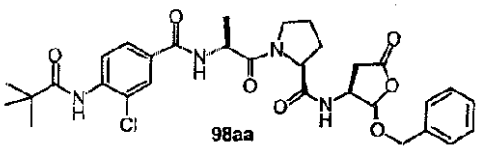

98v

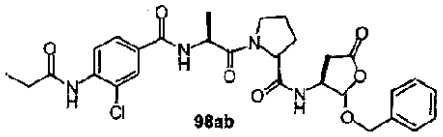

98w


98x

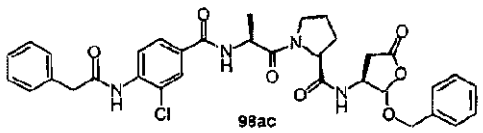

98y

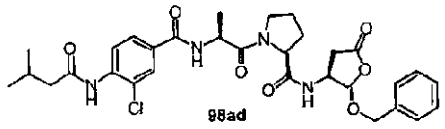

98z

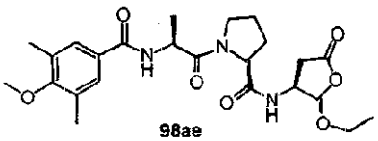

98aa

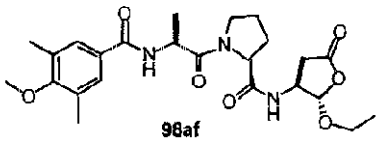

98ab

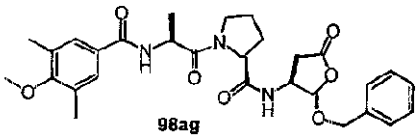
【化２５－２５】

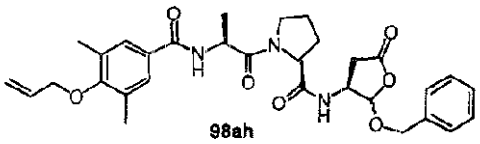

98ac

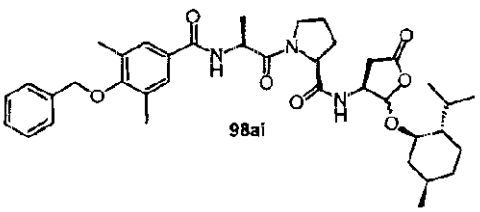

98ad

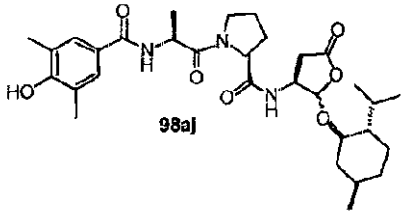

98ae


98af

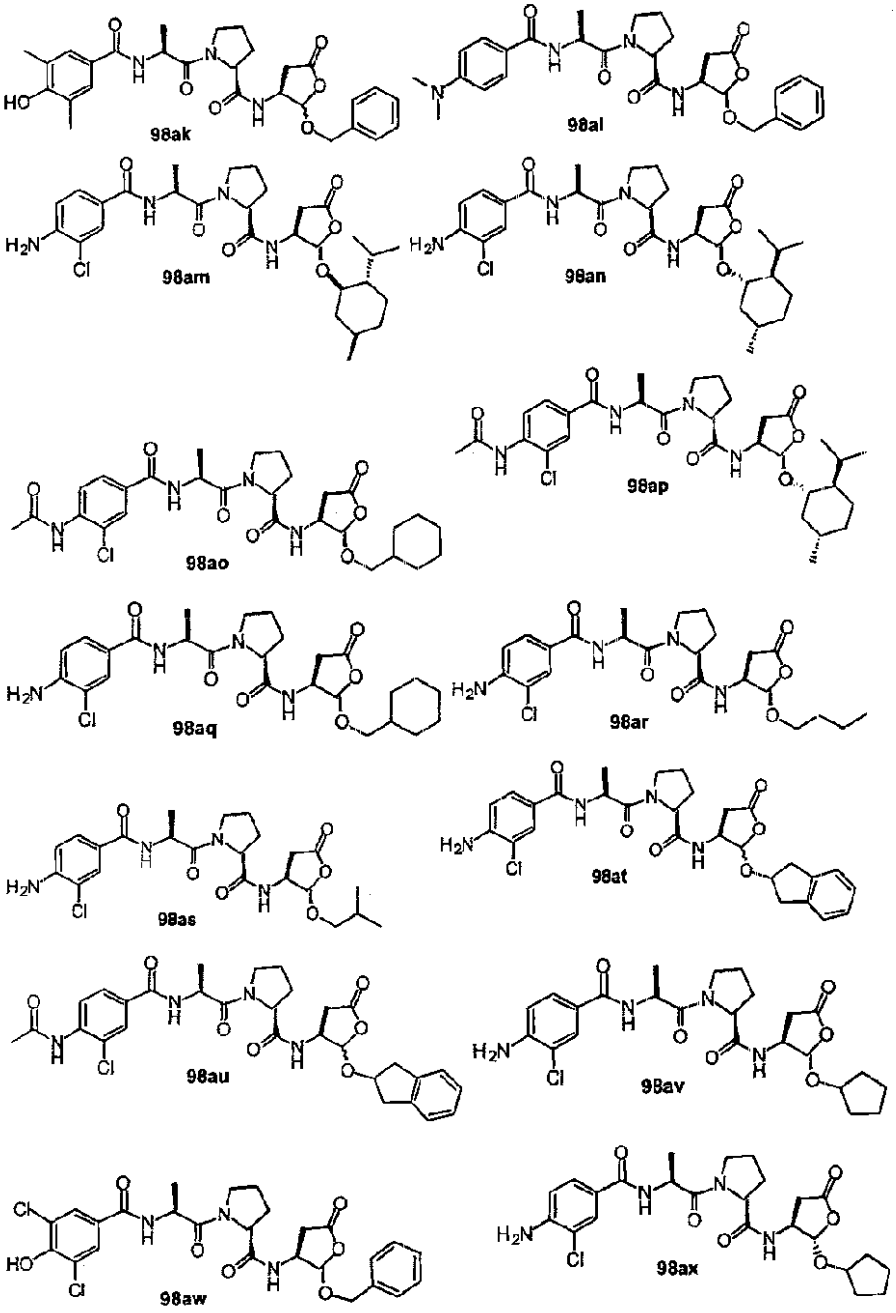

98ag


98ah

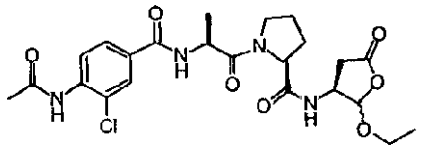

98ai


98aj

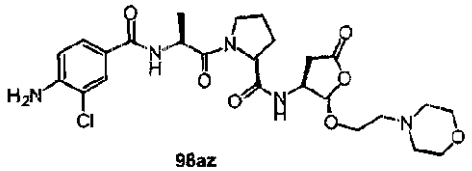
【化２５－２６】


98ak
98al
98am
98an
98ao
98ap
98aq
98ar
98as
98at
98au
98av
98aw
98ax

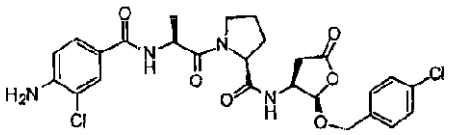
【化２５－２７】



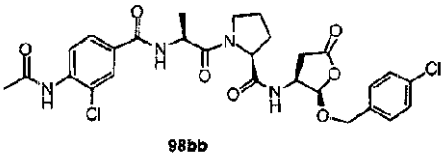
98ay



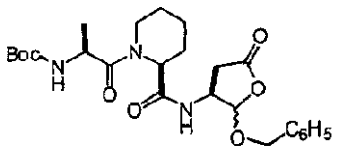
98az



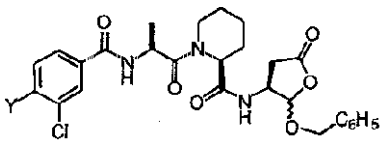
98ba



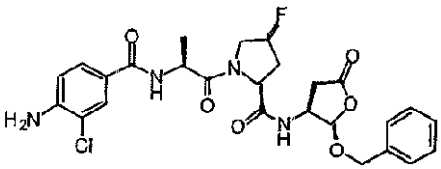
98bb



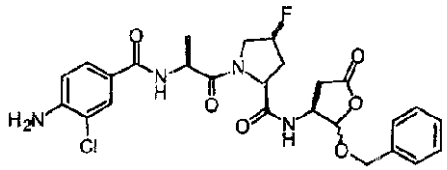
101



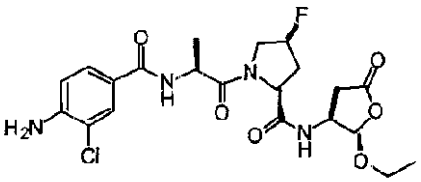
102a, Y=AcNH
102b, Y=NH_2



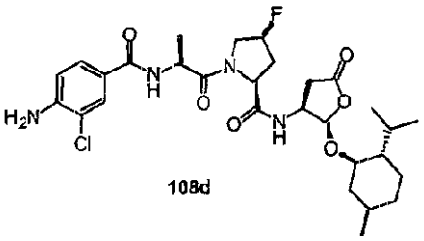
108a



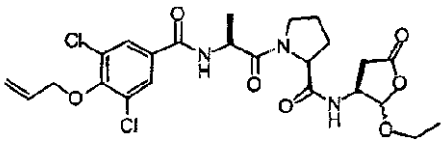
108b



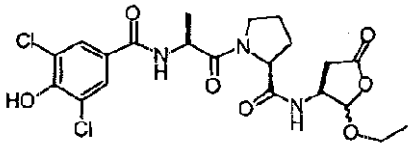
108c



108d

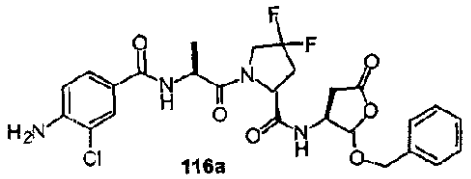


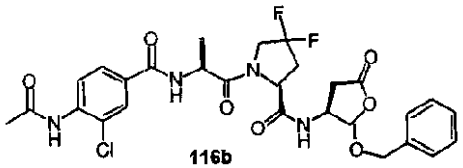
110

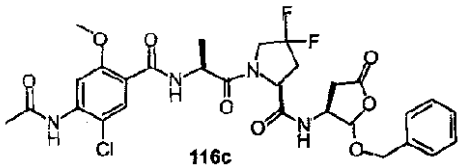


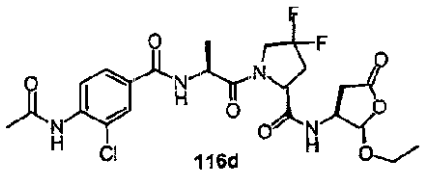
111

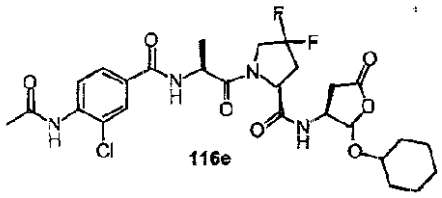
【化２５－２８】

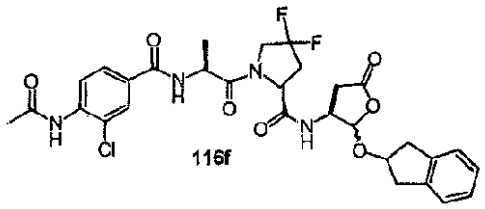

116a

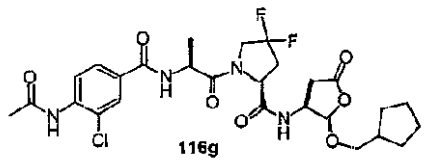

116b

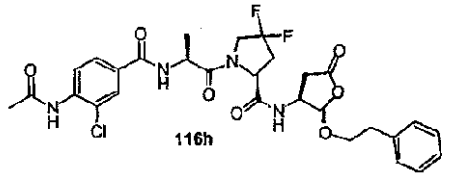

116c


116d


116e


116f

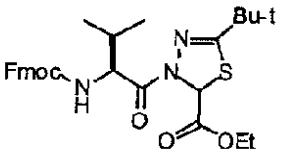

116g および


116h

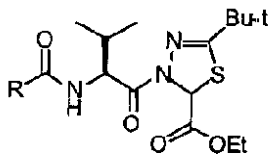
からなる群から選択される、化合物。

【請求項２０】　以下：３７、３８、３９、４３、４４、５０、５８、５９、７１、７５、９６ａ－９６ｃ、９７ａ－９７ｃ、１０７、１０９、１１５ａ－１１５ｃ、１２０ａ、および１２０ｂ、

【化２５－２９】

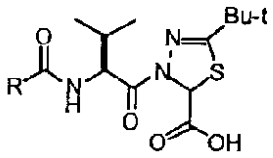


37



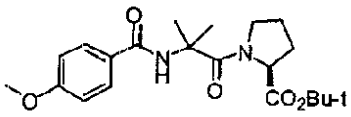
38, R=CH_3

43, R=4-MeOPh-



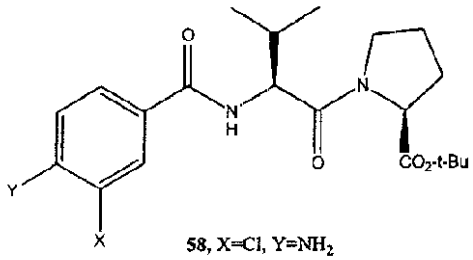
39, R=CH_3

44, R=4-MeOPh-

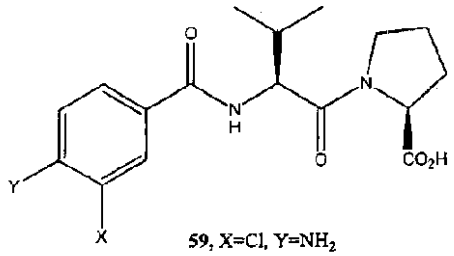


50

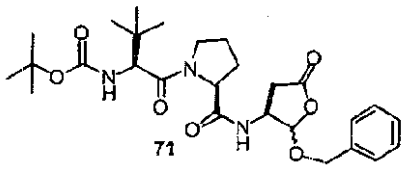
【化２５－３０】



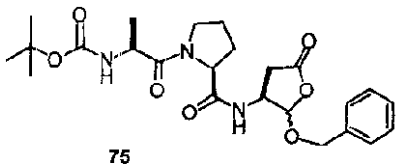
58, X=Cl, Y=NH_2



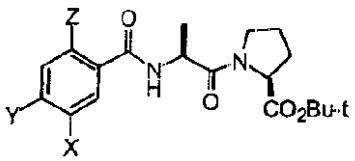
59, X=Cl, Y=NH_2



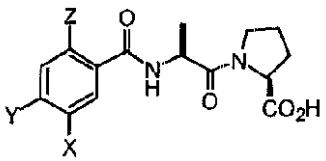
71



75

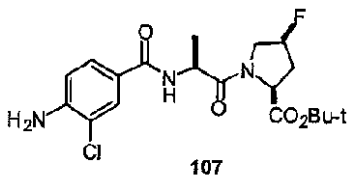


96a, X=Cl, Y=NH_2, Z=H
96b, X=Cl, Y=AcNH, Z=H
96c, X=Cl, Y=AcNH, Z=CH_3O

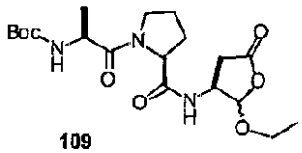


97a, X=Cl, Y=NH_2, Z=H
97b, X=Cl, Y=AcNH, Z=H
97c, X=Cl, Y=AcNH, Z=CH_3O

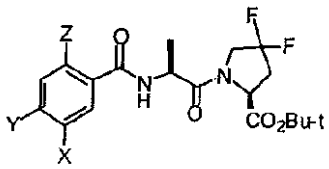
【化２５－３１】



107



109

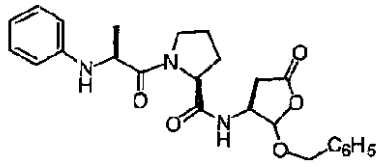


115a, X=Cl, Y=NH_2, Z=H

115b, X=Cl, Y=AcNH, Z=H

115c, X=Cl, Y=AcNH, Z=CH_3O

および



120a= *anti*
120b= *syn*

からなる群から選択される、化合物。

【請求項２１】　ａ）請求項１～１９のいずれか１項に記載の化合物、およびｂ）薬学的に受容可能なキャリア、アジュバントまたはビヒクルを含有する、薬学的組成物。

【請求項２２】　患者における、ＩＬ－１媒介性疾患、アポトーシス媒介性疾患、炎症性疾患、自己免疫性疾患、破壊性骨障害、増殖性障害、感染性疾患、変　性疾患、壊死性疾患、過剰な食用アルコール摂取疾患、ウイルス媒介性疾患、炎症性腹膜炎、変形性関節症、膵炎、喘息、成人型呼吸窮迫症候群、糸球体腎炎、　慢性関節リウマチ、全身性エリテマトーデス、硬皮症、慢性甲状腺炎、グレーヴス病、自己免疫性胃炎、インスリン依存型糖尿病（Ｉ型）、自己免疫性溶血性貧　血、自己免疫性好中球減少症、血小板減少症、慢性活動性肝炎、重症筋無力症、炎症性腸疾患、クローン病、乾癬、アトピー性皮膚炎、移植片対宿主病、骨粗鬆　症、白血病および関連障害、脊椎形成異常症候群、多発性骨髄腫関連骨障害、急性骨髄性白血病、慢性骨髄性白血病、転移性メラノーマ、カポジ肉腫、多発性骨　髄腫、敗血症、敗血症性ショッ　ク、細菌性赤痢、アルツハイマー病、パーキンソン病、脳性虚血、心筋虚血、脊髄筋萎縮症、多発性硬化症、ＡＩＤＳ関連脳炎、ＨＩＶ関連脳炎、老化、脱毛　症、発作による神経学的損傷、潰瘍性大腸炎、外傷性脳傷害、器官移植の拒絶、Ｂ型肝炎、Ｃ型肝炎、Ｇ型肝炎、黄熱病、デング熱および日本脳炎から選択され　る疾患を処置または予防するための医薬の製造における、請求項１～１９のいずれか１項に記載の化合物または請求項２１に記載の薬学的組成物の使用。

【請求項２３】　請求項２６に記載の使用であって、ここで、前記疾患が、慢性関節リウマチ、炎症性腸疾患、クローン病、潰瘍性大腸炎、炎症性腹膜炎、敗　血症性ショック、膵炎、外傷性脳傷害、器官移植の拒絶、変形性関節症、喘息、乾癬、アルツハイマー病、アトピー性皮膚炎、白血病および関連の障害、脊椎形　成異常症候群、または多発性骨髄腫である、使用。

【請求項２４】　患者におけるＩＣＥ－媒介機能を阻害するための医薬の製造における、請求項１～１９のいずれか１項に記載の化合物または請求項２１に記載の薬学的組成物の使用。

【請求項２５】　患者におけるＩＧＩＦまたはＩＦＮ－γの産生を低減するための医薬の製造における、請求項１～１９のいずれか１項に記載の化合物または請求項２１に記載の薬学的組成物の使用。

【手続補正２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００７５
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００７５】
R^{12}は、－Ｃ（Ｏ）アルキル、－Ｃ（Ｏ）シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）アルキニル、－Ｃ（Ｏ）アルケニル、－Ｃ（Ｏ）アルキルアリール、－Ｃ（Ｏ）アルキルヘテロアリール、－Ｃ（Ｏ）ヘテロシクリル、または－Ｃ（Ｏ）アルキルヘテロシクリルであり；
R^{13}は、－Ｈ、－アルキル、－アリール、－アルキルアリールまたは－アルキルヘテロアリールであり；そして
他の置換基は上記で定義した通りである。
【手続補正３】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００８６
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００８６】
R^{12}は、－Ｃ（Ｏ）アルキル、－Ｃ（Ｏ）シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）アルキニル、－Ｃ（Ｏ）アルケニル、－Ｃ（Ｏ）アルキルアリール、－Ｃ（Ｏ）アルキルヘテロアリール、－Ｃ（Ｏ）ヘテロシクリル、または、－Ｃ（Ｏ）アルキルヘテロシクリルであり；そして
他の置換基は、両方のR^{3}基が－Ｈであっても良いことを除いて、上記の通りである。