

【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21年7月9日(2009.7.9)

【公表番号】特表2008-545803(P2008-545803A)

【公表日】平成20年12月18日(2008.12.18)

【年通号数】公開・登録公報2008-050

【出願番号】特願2008-516155(P2008-516155)

【国際特許分類】

C 07 D 401/04	(2006.01)
C 07 D 491/052	(2006.01)
A 61 K 31/4741	(2006.01)
C 07 D 491/048	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)
A 61 K 31/4745	(2006.01)
A 61 K 31/4709	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 27/02	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 3/10	(2006.01)
A 61 P 17/02	(2006.01)
A 61 P 37/06	(2006.01)
A 61 P 35/02	(2006.01)
A 61 P 19/02	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 401/04	C S P
C 07 D 491/052	
A 61 K 31/4741	
C 07 D 491/048	
C 07 D 471/04	1 1 2 A
A 61 K 31/4745	
A 61 K 31/4709	
A 61 K 31/496	
A 61 K 31/5377	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 9/00	
A 61 P 35/00	
A 61 P 9/10	1 0 1
A 61 P 27/02	
A 61 P 29/00	
A 61 P 3/10	
A 61 P 9/10	
A 61 P 17/02	
A 61 P 37/06	

A 6 1 P 35/02  
A 6 1 P 43/00 105  
A 6 1 P 19/02  
A 6 1 P 25/00

## 【手続補正書】

【提出日】平成21年5月18日(2009.5.18)

## 【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

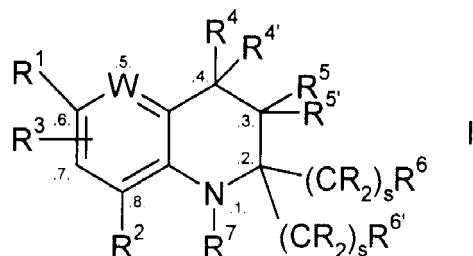
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式Iの化合物、およびあらゆる割合のその混合物を含む医薬として使用可能なその誘導体、溶媒和物、互変異性体、塩および立体異性体

## 【化1】



(式中、

Wは、C HまたはNを表し、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>は、互いに独立に、H、A、アリール、ヘテロアリール、Hal、-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-SA、-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-SCF<sub>3</sub>、-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-SCN、-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CF<sub>3</sub>、-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-OCF<sub>3</sub>、R、NR-NR<sub>2</sub>、X(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>XR、X(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>Y、(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-シクロアルキル、(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH=CH<sub>2</sub>、シクロアルキル、-SCH<sub>3</sub>、-SCN、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-OA、-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-OH、-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO<sub>2</sub>R、-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CN、-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-Hal、-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-Y、-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>R<sup>a</sup>、-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR<sub>2</sub>、(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-OA、(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-OCOA、-SCF<sub>3</sub>、(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CONR<sub>2</sub>、-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NHCOA、-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NHSO<sub>2</sub>A、SF<sub>5</sub>、Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、CO-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CH<sub>3</sub>、(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-N-ピロリドン、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NRCOO-R、NRCOOR、NCO、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>COOR、NCOOR、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OH、NR(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sub>2</sub>、C(OH)R<sub>2</sub>、NR(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OR、NCOR、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-ヘテロアリール、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>R<sup>1</sup>、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>X(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>X(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-ヘテロアリール、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CONR<sub>2</sub>、XCONR(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sub>2</sub>、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>XCOOR]CO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>XR]CO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>XR]CO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>X-アリール、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>XR]SO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NRCOOR]CO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sub>2</sub>]CO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sub>2</sub>]SO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>XR]CO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-ヘテロアリール、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>XR]CO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール、CO-アリール、SO<sub>2</sub>-アリール、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>XR]SO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-ヘテロアリール、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NRCOOR]CO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-ヘテロアリール、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sub>2</sub>]CO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-ヘテロアリール、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sub>2</sub>]CO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール

)<sub>n</sub>N R<sub>2</sub>] CO (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>N R - ヘテロアリールを表し、R<sup>1</sup>およびR<sup>3</sup>は、一緒になって、-N-C(CF<sub>3</sub>)=N-、-N-CR=N-、-N-N=N-をも表し、非隣接CY<sub>2</sub>基は、Xで置換されていてもよく、

Yは、H、A、Hal、OR、E-R<sup>1</sup>を表し、

Eは、-NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>-、-SO<sub>2</sub>NR<sup>1</sup>-、-CONR<sup>1</sup>-、-NR<sup>1</sup>CO-、-COO-、OOC-、CO、-SO<sub>2</sub>-、-X-、NR<sup>1</sup>CONR<sup>1</sup>-、-OCONR<sup>1</sup>-、-NR<sup>1</sup>COO-、-CSNR<sup>1</sup>-、-NR<sup>1</sup>CS-、-NR<sup>1</sup>CSNR<sup>1</sup>-、-SCONR<sup>1</sup>-、-NR<sup>1</sup>COS-、-OCSNR<sup>1</sup>-、NR<sup>1</sup>C SO-、SCSNR<sup>1</sup>-、NR<sup>1</sup>CCCまたは一重結合を表し、

Aは、アルキルまたはシクロアルキルを表し、1つまたは複数のH原子が、Halで置換されていてもよく、

Halは、F、Cl、BrまたはIを表し、

Rは、HまたはAを表し、ジェミナル基の場合は、Rは、一緒になって、-(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-または-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-X-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>、または-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-Z-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>も表し、

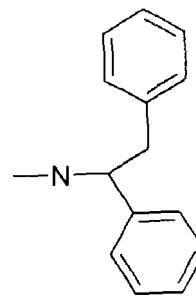
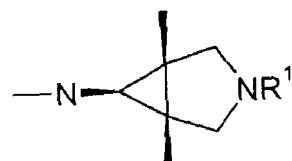
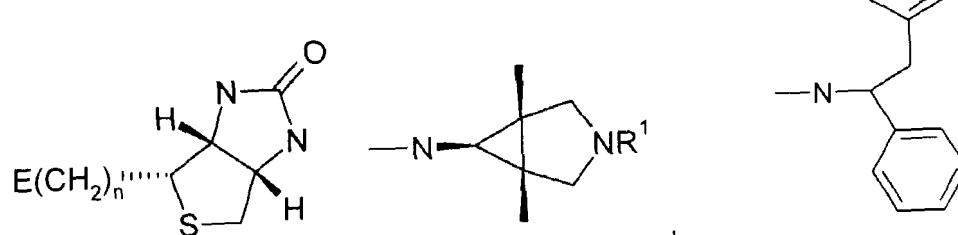
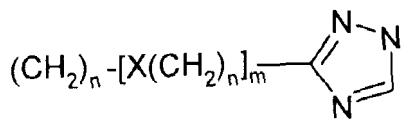
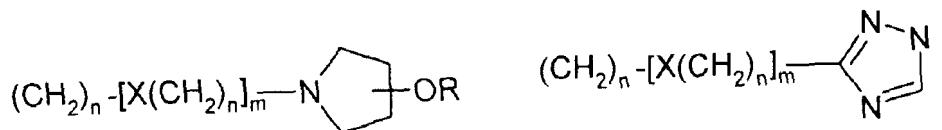
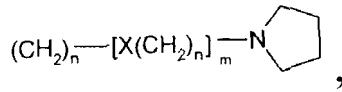
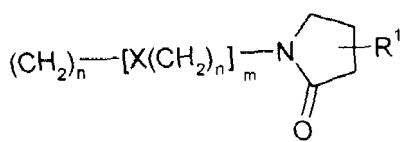
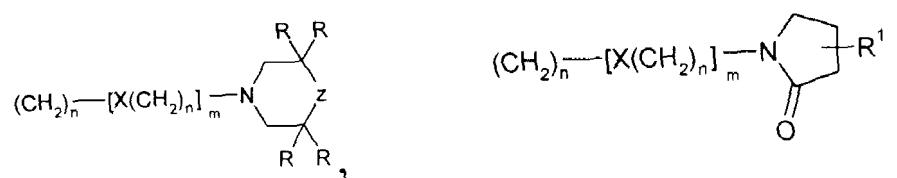
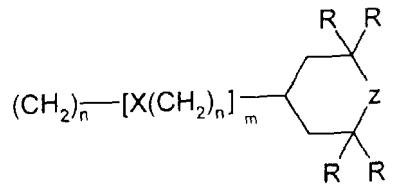
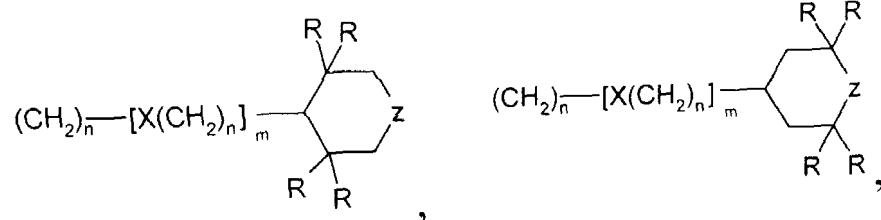
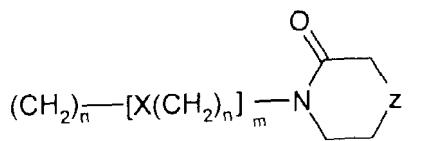
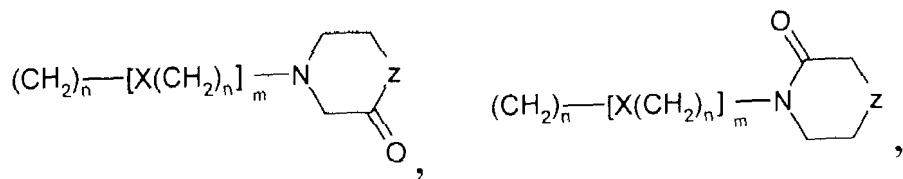
R<sup>4</sup>、R<sup>4'</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>5'</sup>は、互いに独立に、H、あるいは非置換または一もしくは多置換の-OR-、-NO<sub>2</sub>-、-Hal-、-CF<sub>3</sub>-、-OCF<sub>3</sub>-、-CN-、-NR<sub>2</sub>-または-SR-、-アリールまたは-ヘテロアリール置換N-ピロリドン、Q、(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-E-CR<sub>2</sub>R<sup>1</sup>、-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-E-CR<sub>2</sub>X R<sup>1</sup>、-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-E-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-XR<sup>1</sup>または-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-E-(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-XR<sup>a</sup>、-X-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>OR、-X-CO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、-X-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NR<sub>2</sub>、R<sup>1</sup>、S-アリール、O-アリール、CH<sub>2</sub>Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>を表し、あるいは一緒になって-X(CR<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-、-X-(CR<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-、-XCHQC Y<sub>2</sub>-、-X-CH(CH<sub>2</sub>OR)(CY<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-、-X-CH(CH<sub>2</sub>NR<sub>2</sub>)(CY<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-、-X-CH=CQ-CH<sub>2</sub>-、X-CQ=CH-CH<sub>2</sub>-、-X(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NR<sub>2</sub>、-(CR<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-、-(CR<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-、-CR=CR-CR=CR-、-XCHQ(CY<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-、-XCHQC R<sub>2</sub>-、R-N-(C=X)-N-R、-XC[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OR]<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-X-CY<sub>2</sub>CH(CH<sub>2</sub>OR)CY<sub>2</sub>-、-X-CY<sub>2</sub>CH(CH<sub>2</sub>NR<sub>2</sub>)CY<sub>2</sub>-、-X-CY<sub>2</sub>CHQ-CY<sub>2</sub>-、-XCHQC Y<sub>2</sub>-、-XCY<sub>2</sub>CHQ-、-XCHQ(CY<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-、-XCHQ(CY<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-、-XCY<sub>2</sub>CHQ(CY<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-、-XCY<sub>2</sub>CHQ(CY<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-を表し、

Xは、O、SまたはNR<sup>1</sup>を表し、

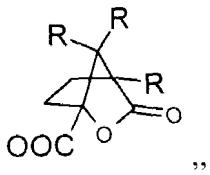
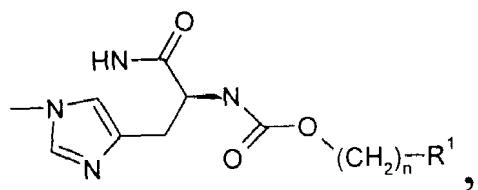
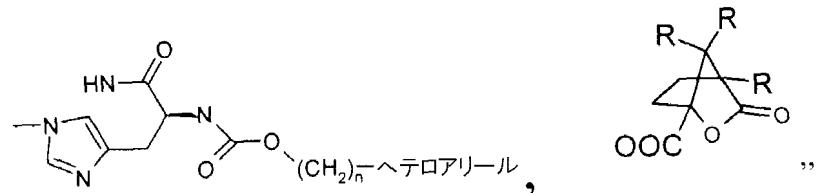
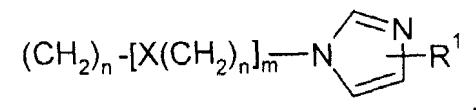
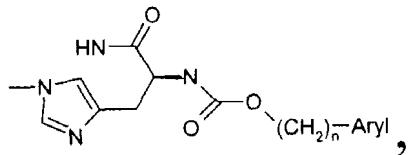
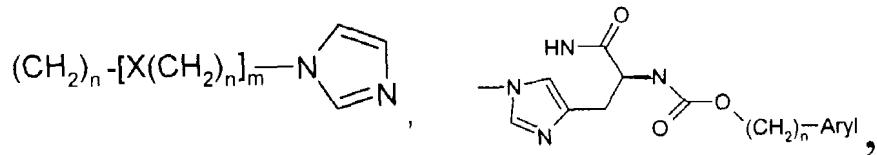
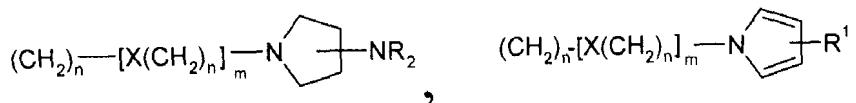
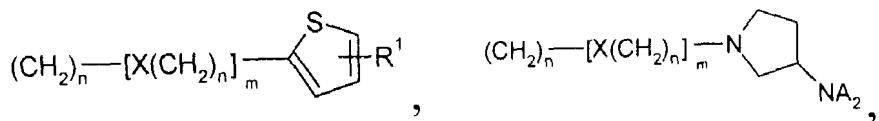
Qは、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-E-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>R<sup>1</sup>、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-E-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>R<sup>a</sup>、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>Hal、CHO、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>SR<sup>1</sup>、COR<sup>a</sup>、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>R<sup>a</sup>、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OCONR<sup>a</sup>、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>NCOR<sup>1</sup>、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OR<sup>1</sup>、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OCON(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OCONOR<sup>1</sup>、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>NHC CON(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>NHC COO R<sup>1</sup>、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>CN、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>COOR<sup>1</sup>を表し、

R<sup>a</sup>は、

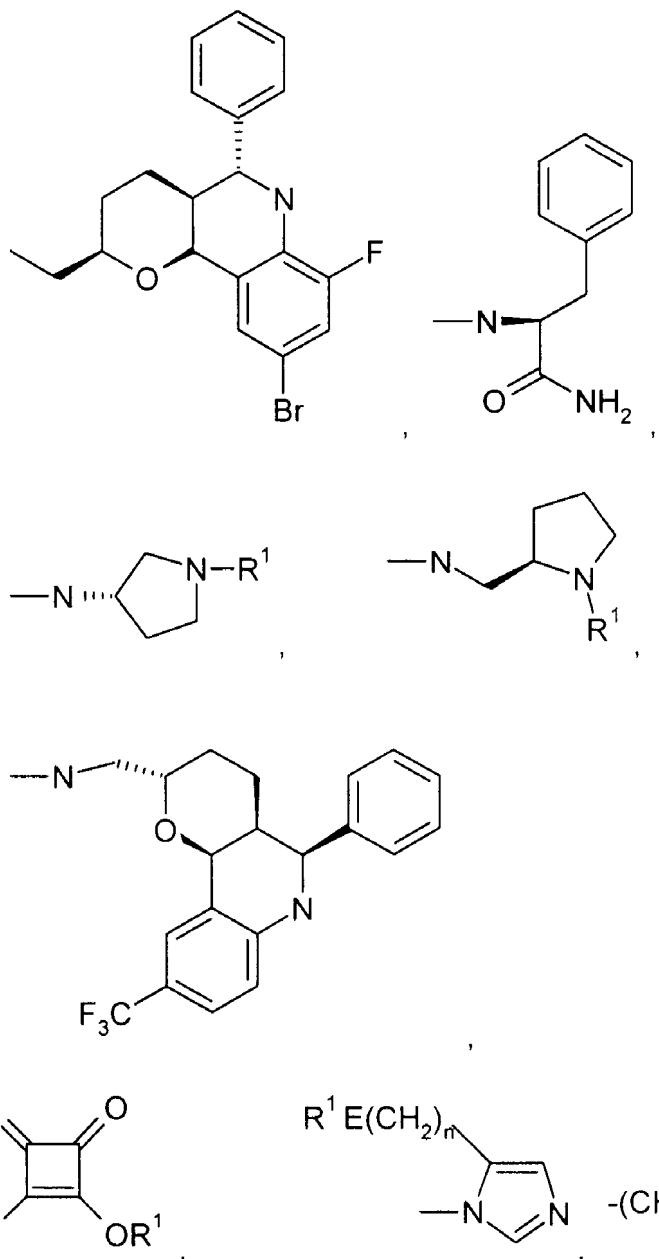
【化 2 - 1】



【化2-2】



【化2-3】



、OR、NHR、NR<sub>2</sub>、NR(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール、NR(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OR、COOR  
 、N-ピロリドン基、OCOR、NR(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sub>2</sub>、(CY<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール、(CY<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-ヘテロアリール、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sub>2</sub>]CO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NHCOOR]CO-アリール、R<sup>1</sup>、N[CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OR]<sub>2</sub>、NR(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NCOOR、X(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>X(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>XR、NR(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>X(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OH、NR(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OH、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>COOR、O(CO)NR(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OR、O(CO)(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sub>2</sub>、NR(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sub>2</sub>、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sub>2</sub>]CO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>XR]CO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>XR]CO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-ヘテロアリール、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sub>2</sub>]CO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-ヘテロアリール、N[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sub>2</sub>]CO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>R<sup>1</sup>、N(R)(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>N(R)COOR、XCOO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sub>2</sub>、OSO<sub>2</sub>A、OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、OSO<sub>2</sub>Ar、OCOONR<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sub>2</sub>、CONR<sup>1</sup>、COR<sup>1</sup>を表し、

Zは、CH<sub>2</sub>、X、CHCONH<sub>2</sub>、CH(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sup>1</sup>COOR<sup>1</sup>、CHNR<sup>1</sup>COO<sup>1</sup>、NCHO、CHCON(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>、CH(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>COOR<sup>1</sup>、NCOOR<sup>1</sup>、CH(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OH、N(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OH、CHNH<sub>2</sub>、CH(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sup>1</sup><sub>2</sub>、CH(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>

$\text{N R}^1_2$ 、 $\text{C(OH)R}^1$ 、 $\text{CHNCOR}^1$ 、 $\text{NCOR}^1$ 、 $\text{N(CH}_2\text{)}_n$ -アリール、 $\text{N(CH}_2\text{)}_n$ -ヘテロアリール、 $\text{CHR}^1$ 、 $\text{NR}^1$ 、 $\text{CH(CH}_2\text{)}_n$ -アリール、 $\text{CH(CH}_2\text{)}_n$ -ヘテロアリール、 $\text{CH(CH}_2\text{)}_n\text{R}^1$ 、 $\text{N(CH}_2\text{)}_n\text{COOR}^1$ 、 $\text{CH(CH}_2\text{)}_n\text{X(CH}_2\text{)}_n$ -アリール、 $\text{CH(CH}_2\text{)}_n\text{X(CH}_2\text{)}_n$ -ヘテロアリール、 $\text{N(CH}_2\text{)}_n\text{CON(R}^1\text{)}_2$ 、 $\text{NSO}_2\text{R}^1$ 、 $\text{CHSO}_2\text{N(R}^1\text{)}_2$ 、 $\text{XCONR(CH}_2\text{)}_n\text{N(R}^1\text{)}_2$ 、 $\text{NCO(CH}_2\text{)}_n$ -アリール、 $\text{NCO(CH}_2\text{)}_n\text{X}$ -アリール、 $\text{NSO}_2(\text{CH}_2)_n$ -アリール、 $\text{NCO(CH}_2\text{)}_n$ -アリール、 $\text{NCO(CH}_2\text{)}_n\text{NR}^1$ -アリール、 $\text{NCO(CH}_2\text{)}_n$ -ヘテロアリール、 $\text{NCO(CH}_2\text{)}_n\text{X}$ -ヘテロアリール、 $\text{NSO}_2\text{R}$ 、 $\text{NSO}_2(\text{CH}_2)_n$ -ヘテロアリール、 $\text{NCO(CH}_2\text{)}_n\text{NR}^1$ -ヘテロアリール、 $\text{N(CH}_2\text{)}_n\text{NR}_2\text{C}$  $\text{H}$ 、 $\text{CHO(CH}_2\text{)}_n\text{N(R}^1\text{)}_2$ 、 $\text{CHX(CH}_2\text{)}_n\text{N(R}^1\text{)}_2$ 、 $\text{NCO(CH}_2\text{)}_n\text{NR}^1$ 、 $\text{CHR}^a$ 、 $\text{NR}^a$ 、 $\text{C(OH)CY}_3$ 、 $\text{C(OH)}$ -アリール、 $\text{C(NR}_2\text{)}$ -アリールを表し、

$\text{R}^6$ は、それぞれ非置換、または(Hal、 $\text{NO}_2$ 、CN、A、OR、OCOR、COR、 $\text{NR}_2$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{OCF}_3$ 、 $\text{OCH(CF}_3\text{)}_2$ で置換されていてよい)アリールまたはヘテロアリール、Hal、 $\text{NO}_2$ 、CN、OR、A、-( $\text{CY}_2\text{)}_n$ -OR、-OCOR、-( $\text{CY}_2\text{)}_n\text{CO}_2\text{R}$ 、-( $\text{CY}_2\text{)}_n\text{CN}$ 、-NCOR、-CORまたは-( $\text{CY}_2\text{)}_n\text{NR}_2$ で一もしくは多置換されているアリールまたはヘテロアリールを表し、

$\text{R}^6'$ は、Hまたは $\text{R}^6$ を表し、

$\text{R}^7$ は、(C=O)-R、(C=O)-NR<sub>2</sub>、(C=O)-OR、HまたはAを表し、

mは、0、1または2を表し、

nは、0、1、2、3、4、5、6または7を表し、

pは、0、1、2、3、4または5、好ましくは1または2を表し、

Sは、0、1、2、3または4、特に0を表す)。

#### 【請求項2】

$\text{R}^1$ が、A、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{OCF}_3$ 、SA、SCN、 $\text{CH}_2\text{CN}$ 、-OCOA、Hal、SCF<sub>3</sub>、t-ブチル、-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、イソプロピル、エチルまたはメチルを表す、請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項3】

$\text{R}^2$ が、Hを表す、請求項1または2に記載の化合物。

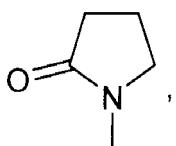
#### 【請求項4】

$\text{R}^3$ が、Hを表す、請求項1から3の一項または複数項に記載の化合物。

#### 【請求項5】

$\text{R}^5$ がHを表す場合に、 $\text{R}^4$ は、以下の基の1つを好ましくは表す、請求項1から4の一項または複数項に記載の化合物

#### 【化3】



-X-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-NR<sub>2</sub>または

(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-E(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>R<sup>a</sup>または(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-E-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>R<sup>1</sup>  
(X、R、R<sup>a</sup>、<sub>p</sub>およびEは、請求項1に示された意味を有する)。

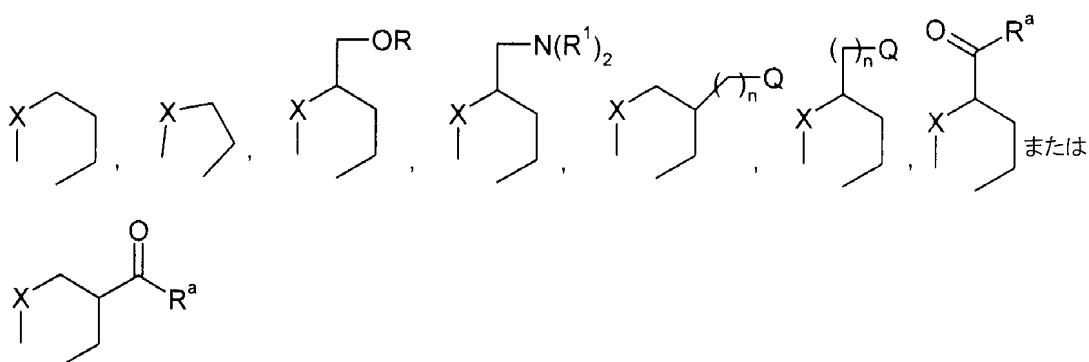
#### 【請求項6】

$\text{R}^5$ が、Hを表す、請求項1から5の一項または複数項に記載の化合物。

#### 【請求項7】

$\text{R}^5$ が、 $\text{R}^4$ と一緒にになって、以下の意味の1つを採用する、請求項1から6の一項または複数項に記載の化合物

## 【化4】



(式中、n、X、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>は、以上に示された意味を有する)。

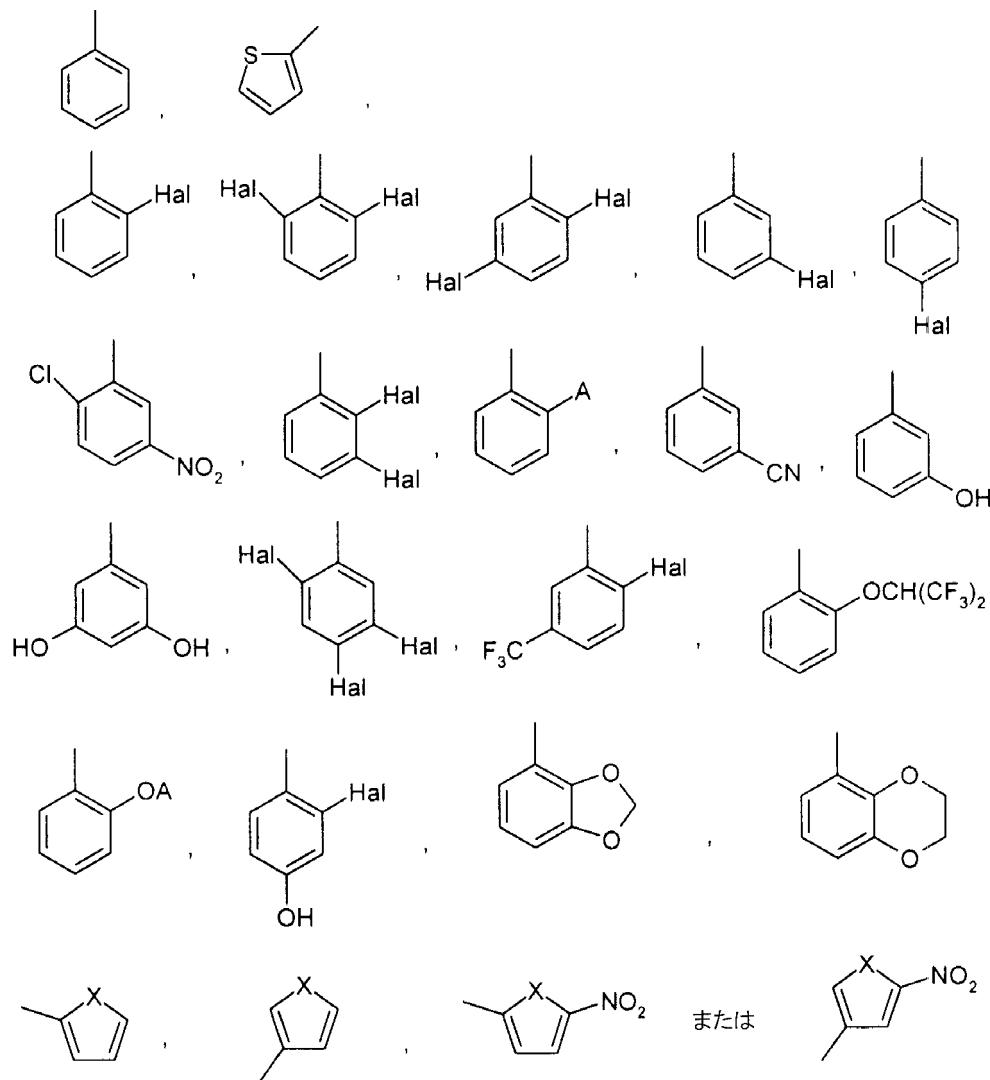
## 【請求項8】

R<sup>6</sup>が、それぞれ非置換、あるいはHal、CN、NO<sub>2</sub>、OH、CF<sub>3</sub>、OCH(CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、OCOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>またはAで一もしくは多置換されているフェニル、2-、3-もしくは4-ピリジル、ピリミジル、フリルまたはチエニルを表す、請求項1から7の一項または複数項に記載の化合物。

## 【請求項9】

R<sup>6</sup>が、以下の基の1つを表す、請求項1から8の一項または複数項に記載の化合物。

## 【化5】



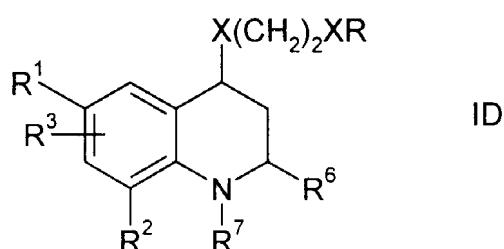
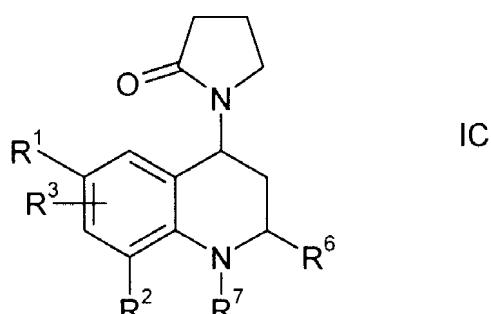
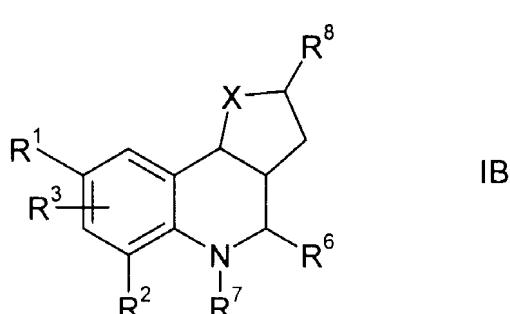
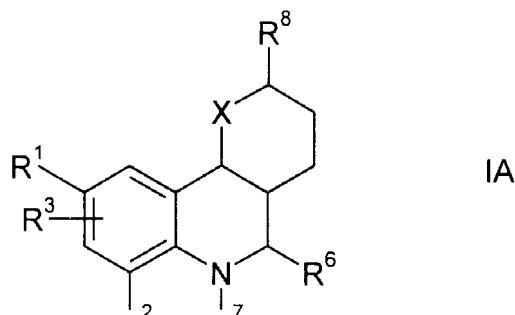
## 【請求項 10】

$R^7$ が、Hを表す、請求項1から9の一項または複数項に記載の化合物。

## 【請求項 11】

下位式IAからIDの化合物

## 【化6】



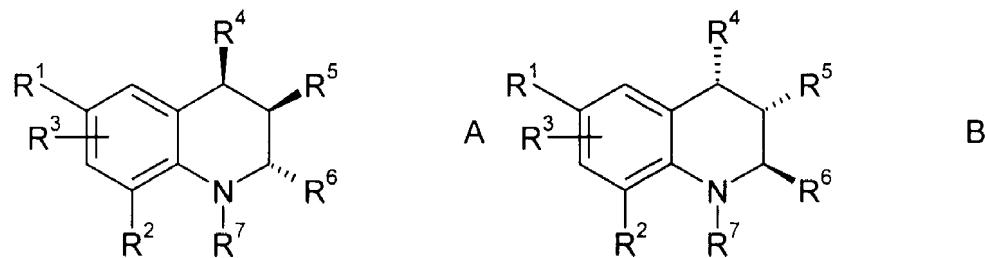
(式中、 $R$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^7$ および $X$ は、請求項1に示された意味を有し、

$R^8$ は、H、 $CH_2OR$ または $CH_2NR_2$ 、 $CH_2R^a$ 、 $COR^a$ 、 $(CH_2)_p-E-R^1$ 、 $(CH_2)_n-E-(CH_2)_p-R^a$ を表す)。

## 【請求項 12】

下位式AおよびBの化合物

【化7】

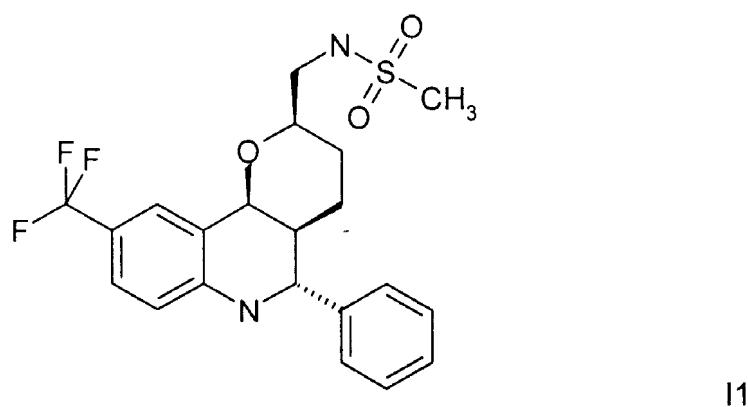


(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>は、請求項1に示された意味を有する、およびそのラセミ体、または鏡像異性体の他の混合物)。

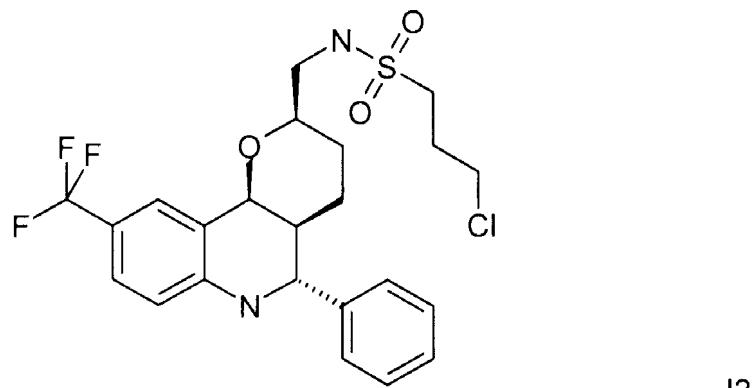
【請求項13】

下位式I-1からI-5の化合物。

【化8-1】

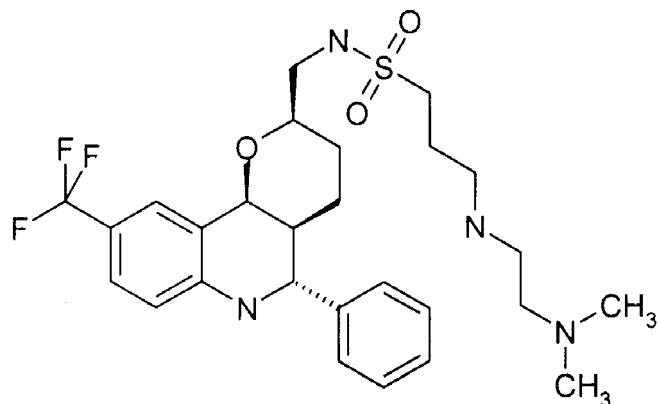


I1

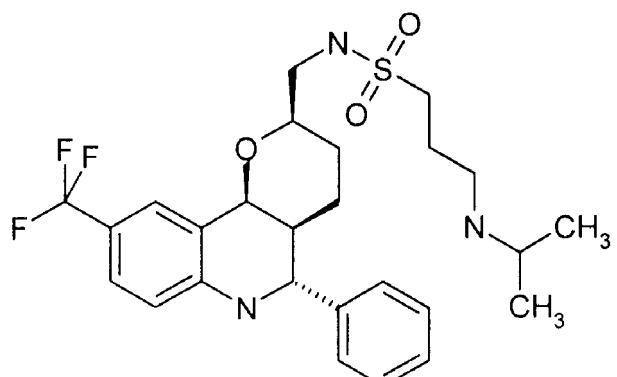


I2

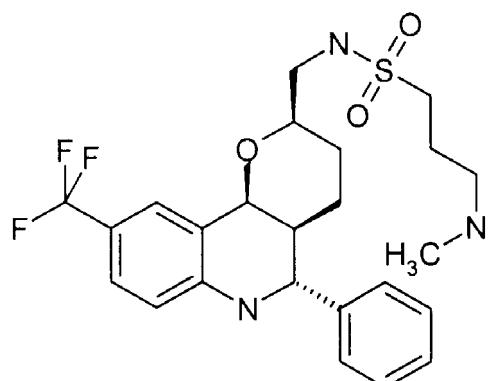
【化 8 - 2】



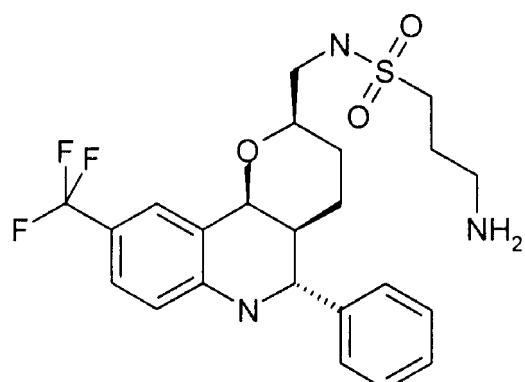
I3



I4

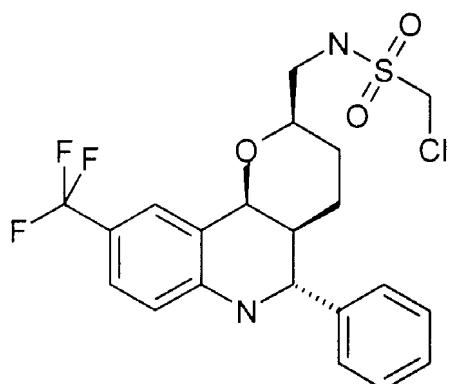


I5

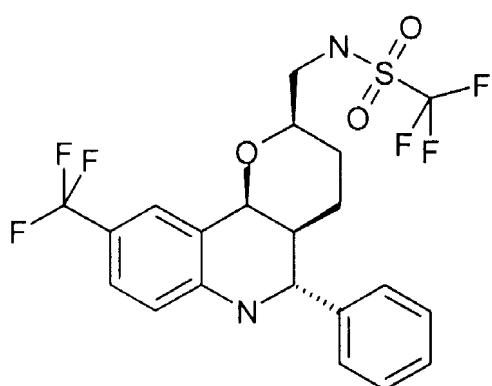


I6

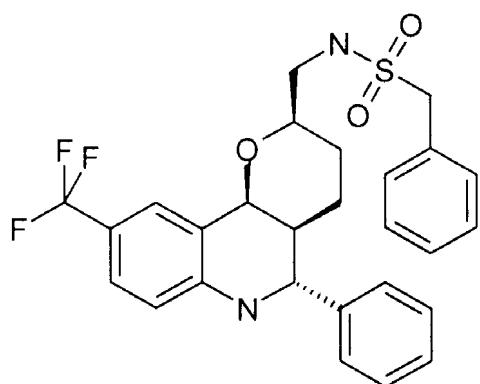
【化 8 - 3】



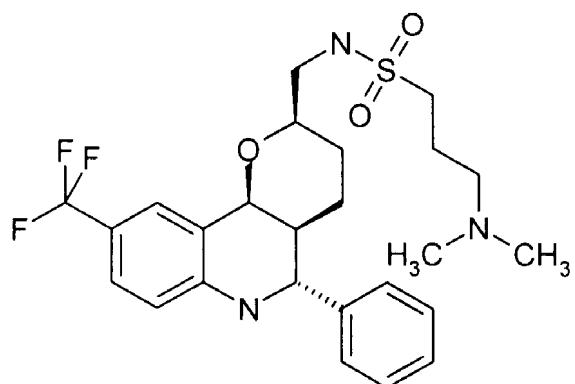
I7



I8

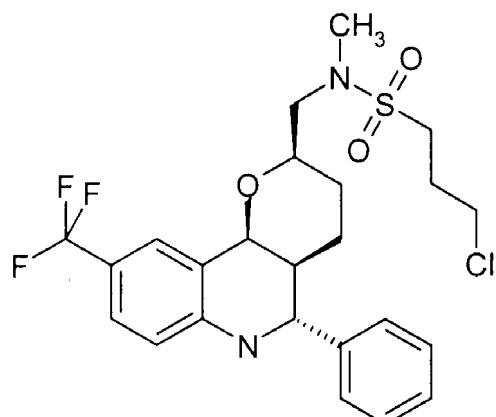


I9

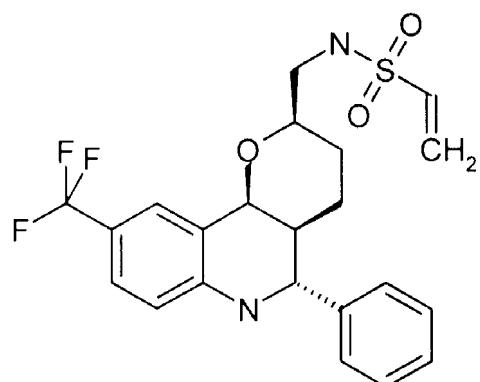


I10

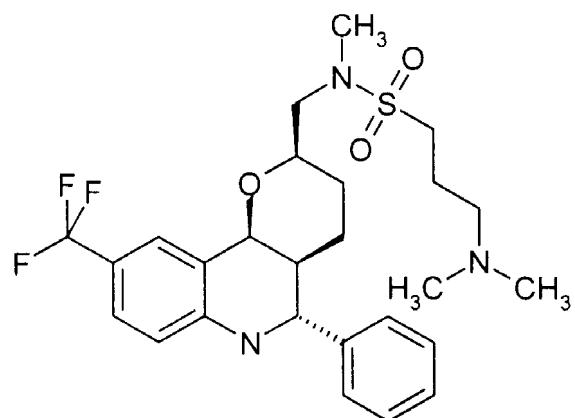
【化 8 - 4】



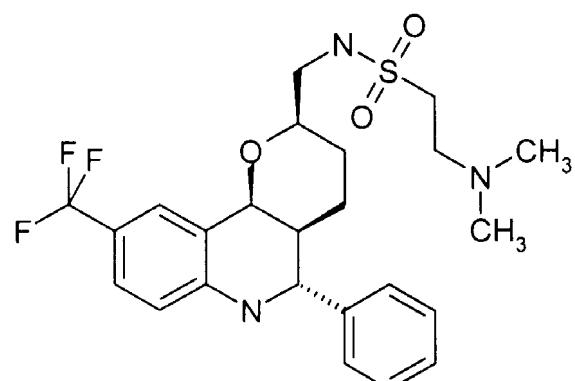
I11



I12

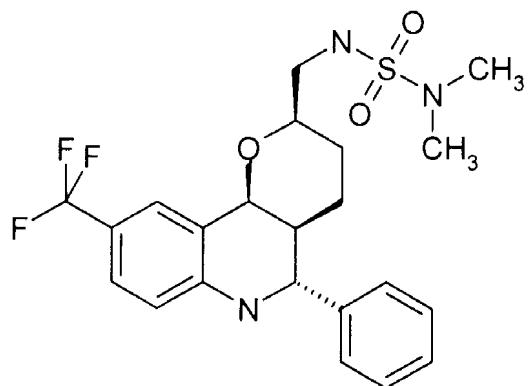


I13

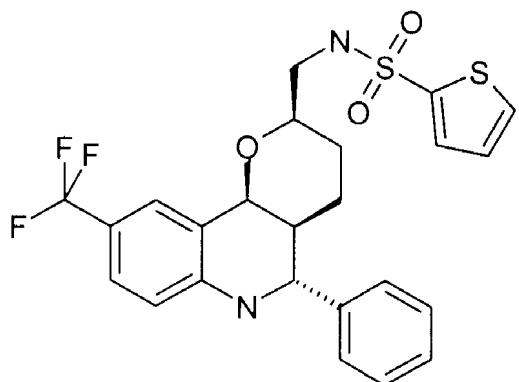


I14

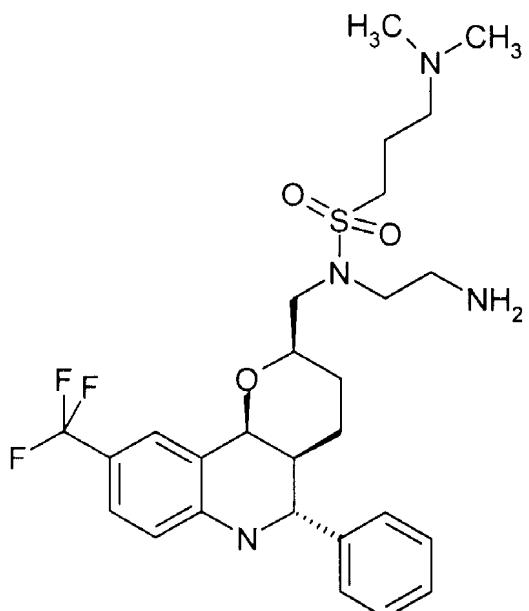
【化 8 - 5】



I15

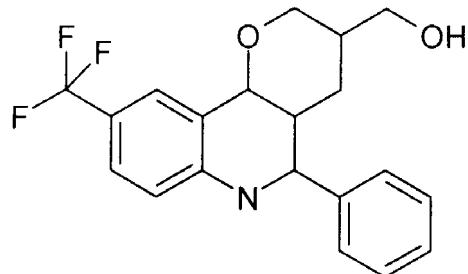


I16

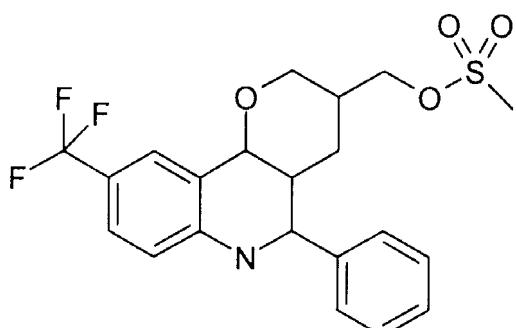


I17

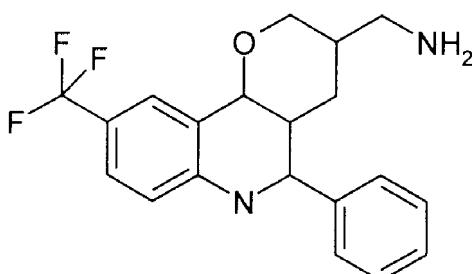
【化 8 - 6】



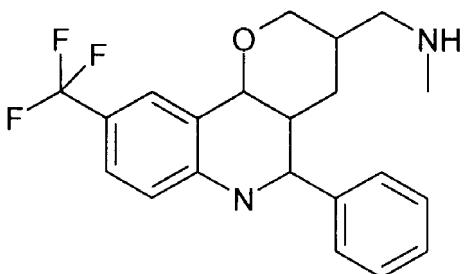
I18



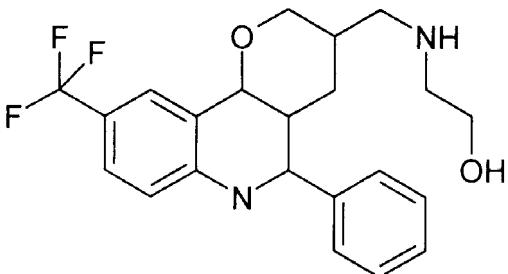
I19



I20

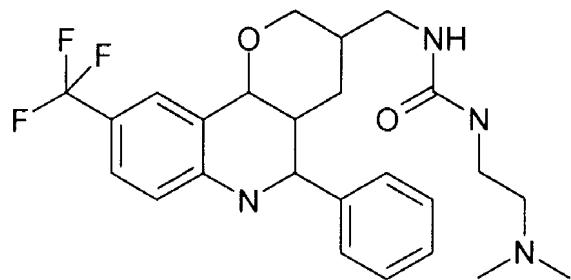


I21

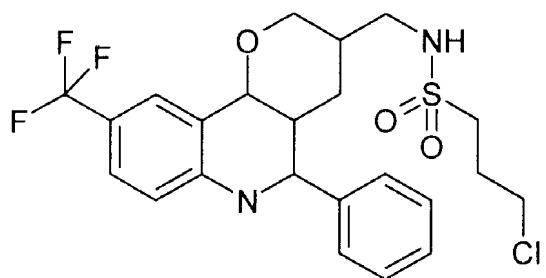


I22

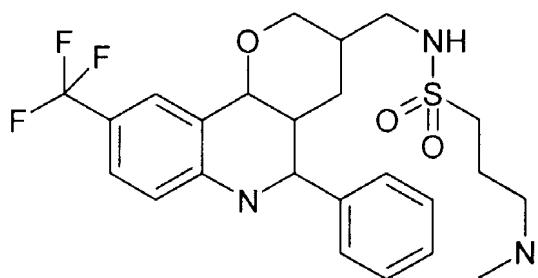
【化 8 - 7】



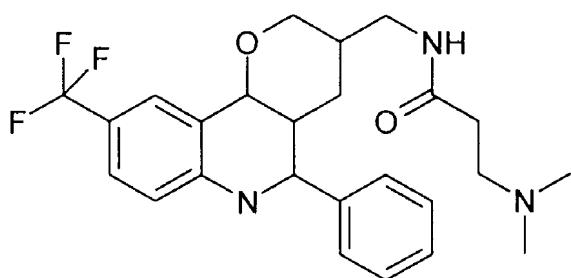
I23



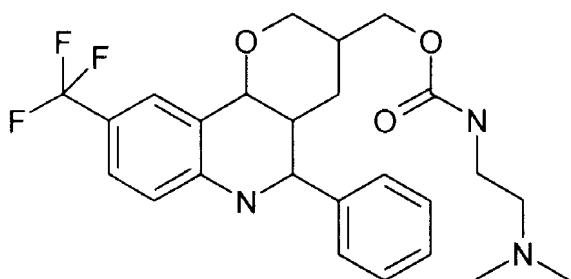
I24



I25

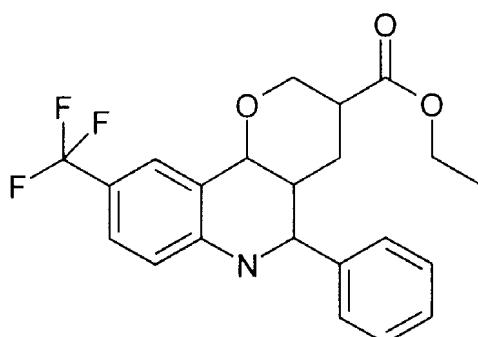


I26

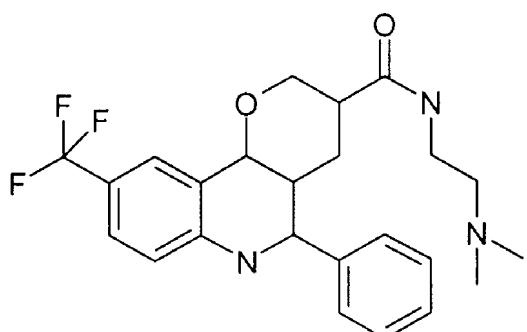


I27

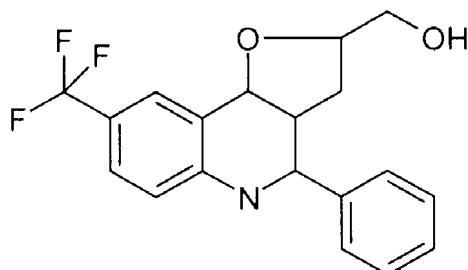
【化 8 - 8】



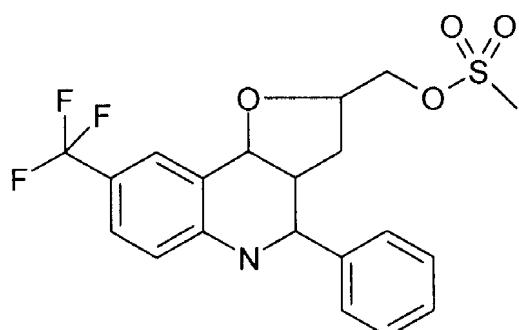
I28



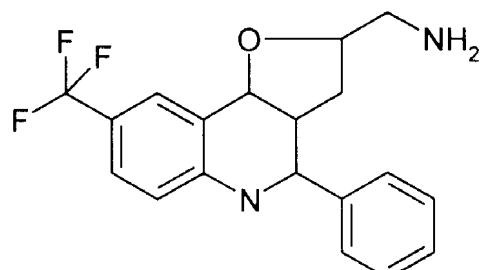
I29



I30

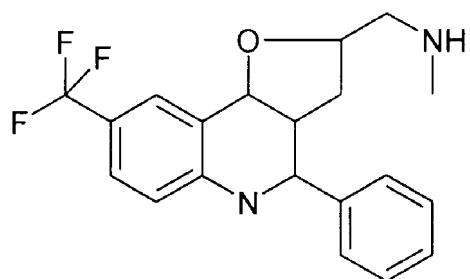


I31

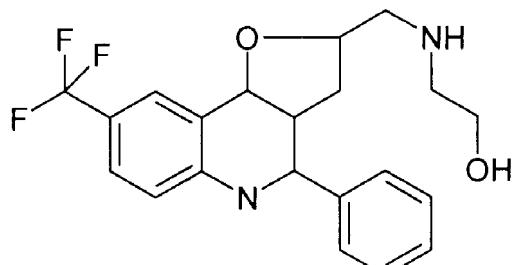


I32

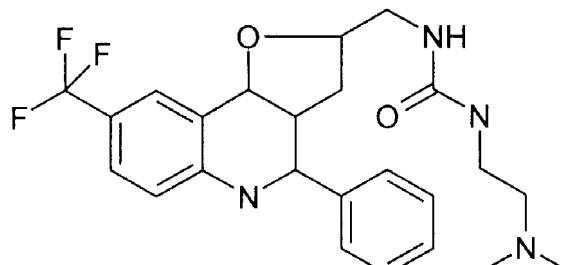
【化 8 - 9】



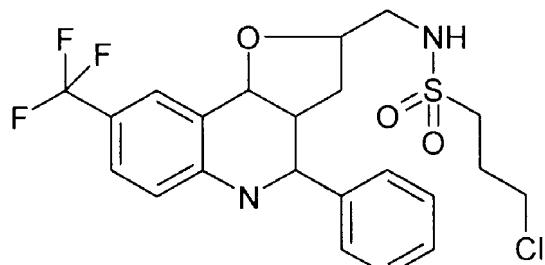
I33



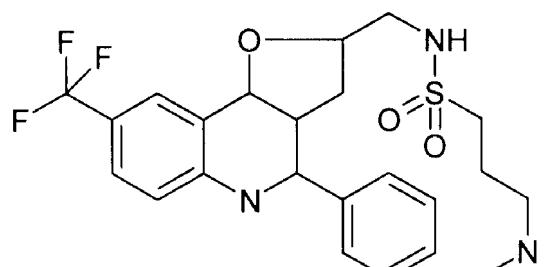
I34



I35

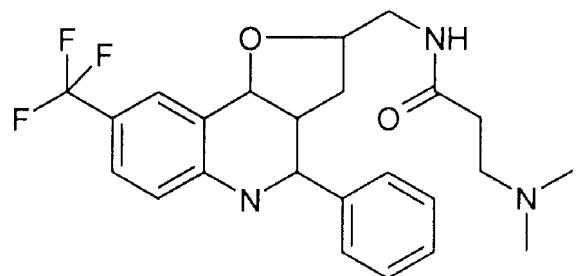


I36

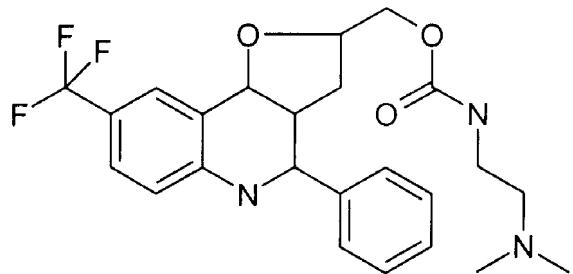


I37

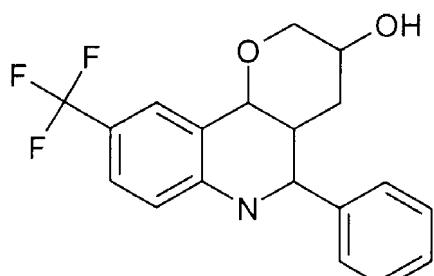
【化 8 - 1 0】



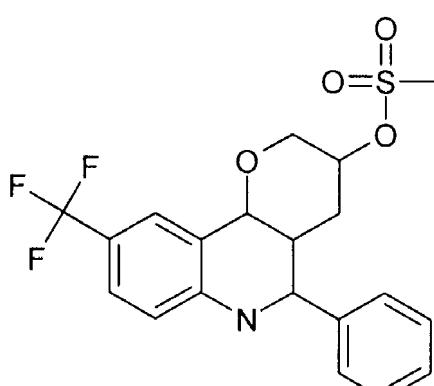
I38



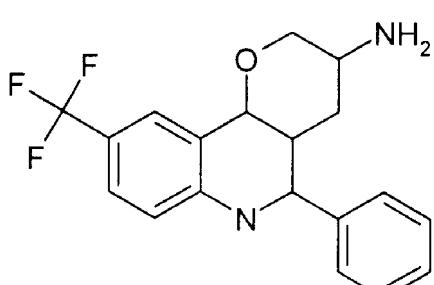
I39



I40

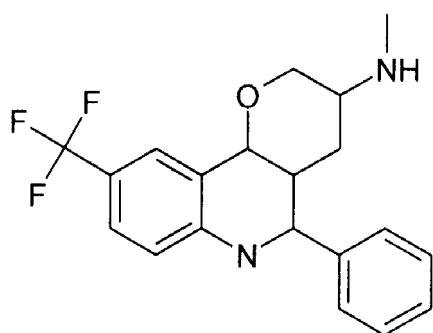


I41

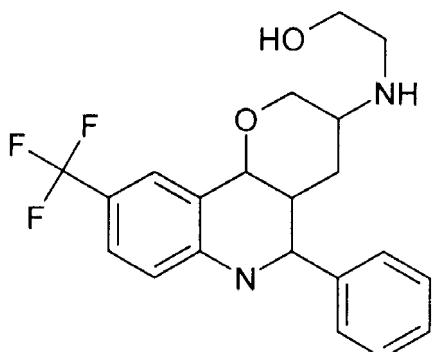


I42

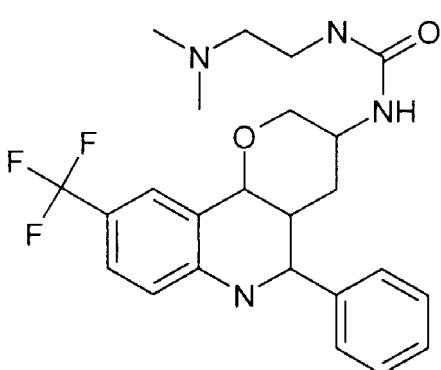
【化 8 - 1 1】



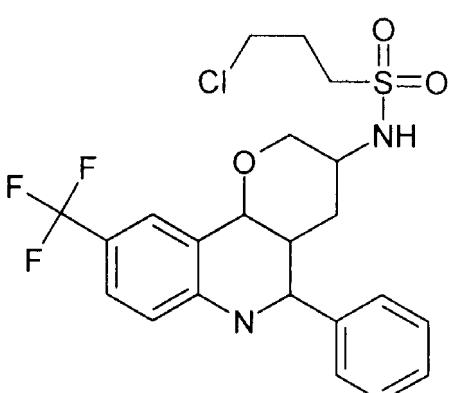
I43



I44

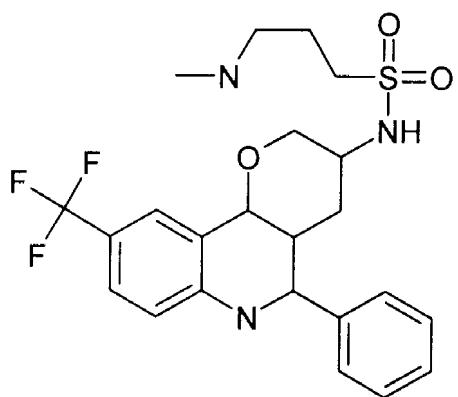


I45

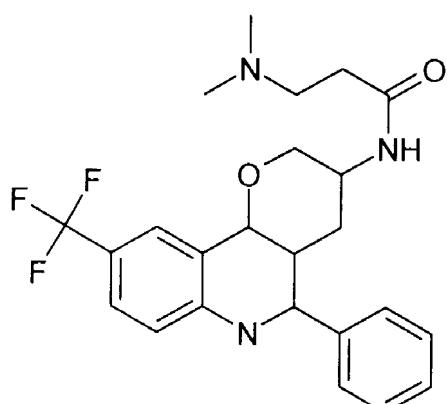


I46

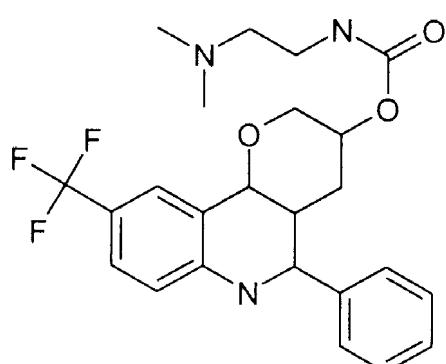
【化 8 - 1 2】



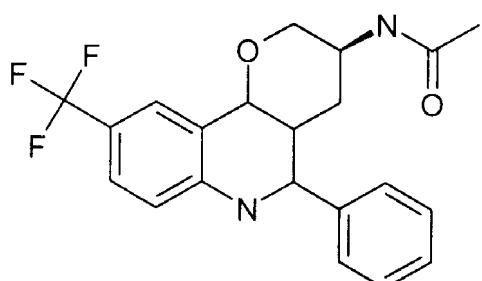
I47



I48

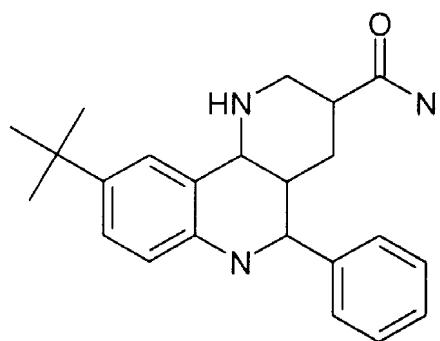


I49

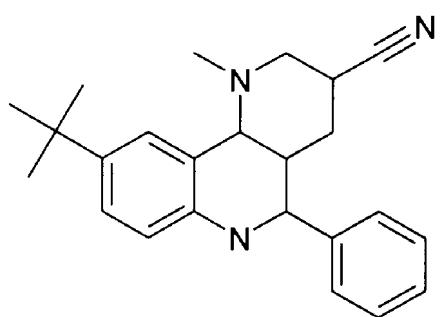


I50

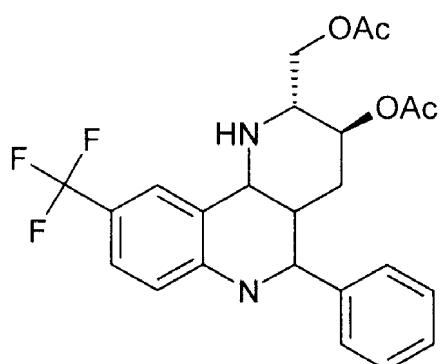
【化 8 - 1 3】



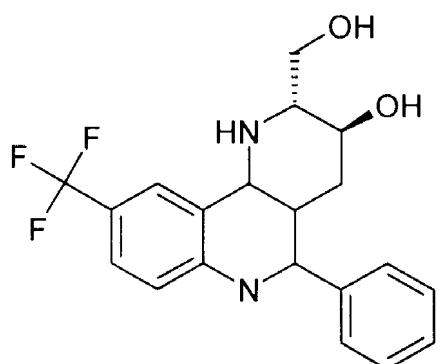
I51



I52

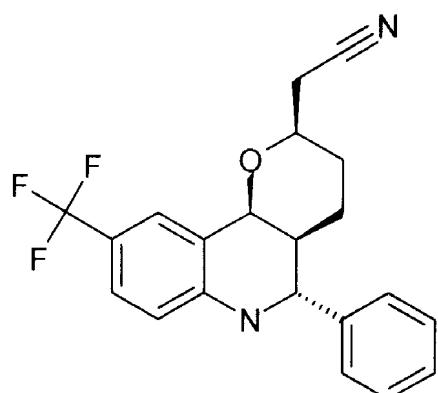


I53

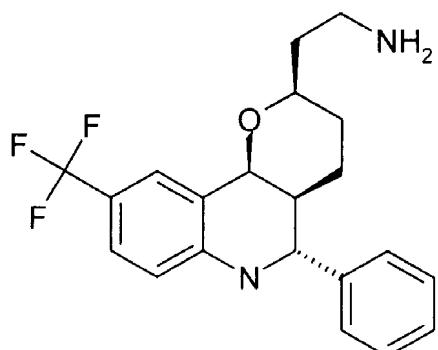


I54

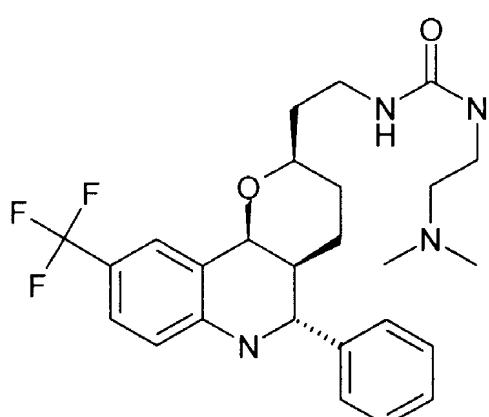
【化 8 - 1 4】



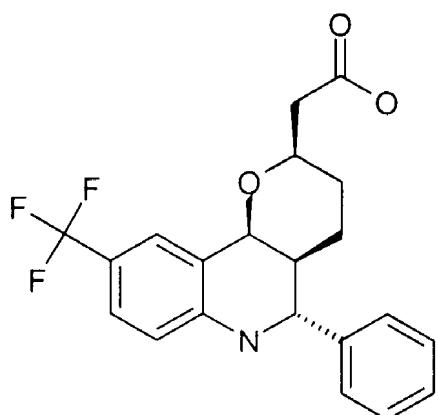
I55



I56

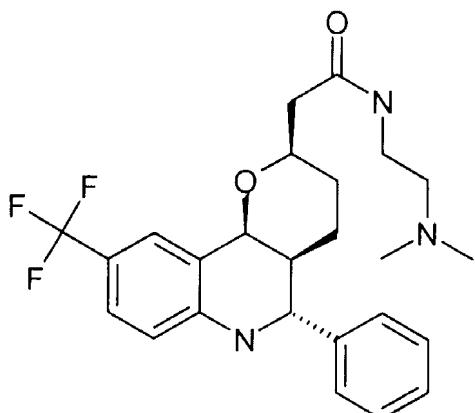


I57



I58

【化 8 - 1 5】

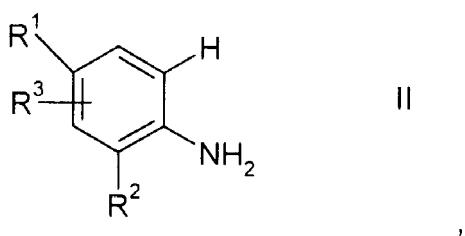


I59

【請求項 1 4】

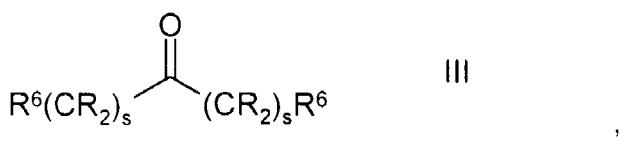
請求項 1 から 1 3 に記載の式 I の化合物、および医薬として使用可能なその誘導体、塩、溶媒和物、互変異性体および立体異性体を調製するための方法であって、式 I I :

【化 9】



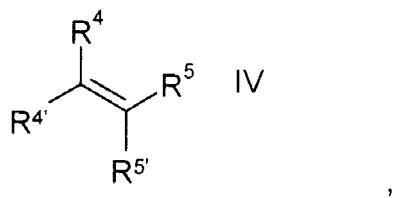
(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、請求項 1 に示された意味を有する)  
の化合物を式 I I I :

【化 1 0】



(式中、R<sup>6</sup>およびsは、請求項 1 に示された意味を有する)  
の化合物、および式 I V :

【化 1 1】



(式中、R<sup>4</sup>、R<sup>4'</sup>、R<sup>5</sup>およびR<sup>5'</sup>は、請求項 1 に示された意味を有する)  
の化合物、その二重結合異性体(E異性体)またはその混合物と反応させ、  
要望に応じて、Hを表す基R<sup>7</sup>を、H以外の意味を有する基R<sup>7</sup>に変換し、  
かつ/または、要望に応じて、式 I の塩基または酸をその塩の1つに変換することを特

徴とする方法。

**【請求項 15】**

前記反応は、プロトン酸またはルイス酸の存在下で実施されることを特徴とする、請求項14に記載の方法。

**【請求項 16】**

前記反応は、トリフルオロ酢酸、ヘキサフルオロイソプロパノール、塩化ビスマス(II)、イッテルビウム(III)トリフラート、スカンジウム(III)トリフラートまたは硝酸セリウム(IV)アンモニウムの存在下で実施されることを特徴とする、請求項14または15に記載の方法。

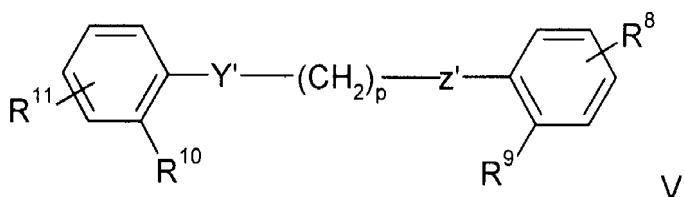
**【請求項 17】**

請求項1から13に記載の式Iの少なくとも1つの化合物、および/またはそのあらゆる割合の混合物を含む医薬として使用可能なその誘導体、塩、溶媒和物、互変異性体および立体異性体、ならびに場合によって賦形剤および/または補助剤を含む医薬品。

**【請求項 18】**

式Iの1つまたは複数の化合物およびある量の式Vの1つまたは複数の化合物、その類似体および/またはその代謝物質を含む混合物

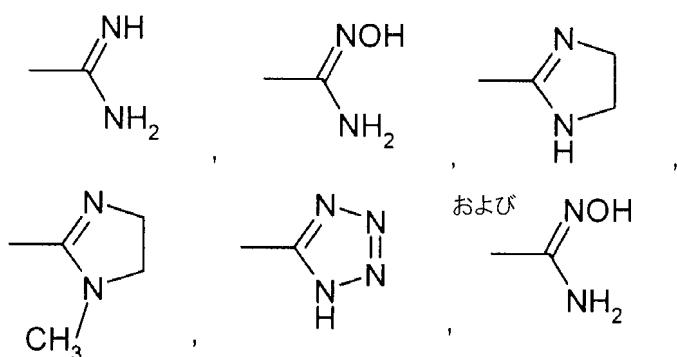
**【化12】**



(式中、

Y'およびZ'は、それぞれ互いに独立に、OまたはNを表し、R<sup>9</sup>およびR<sup>10</sup>は、それぞれ互いに独立に、H、OH、ハロゲン、OC1-10-アルキル、OCF<sub>3</sub>、NO<sub>2</sub>またはNH<sub>2</sub>を表し、nは、2以上6以下の整数を表し、R<sup>8</sup>およびR<sup>11</sup>は、それぞれ互いに独立に、メタ位またはパラ位にあり、

**【化13】**



の群から選択される)。

**【請求項 19】**

使用される式Vの化合物は、ペンタミジンまたはその塩である、請求項18に記載の使用。

**【請求項 20】**

有糸分裂運動タンパク質Eg5の阻害、制御および/または調節に影響されうる疾患の治療のための医薬品を調製するための請求項1から13に記載の化合物、およびあらゆる割合のその混合物を含む医薬として使用可能なその誘導体、塩、溶媒和物、互変異性体および立体異性体、あるいは請求項18に記載の混合物の使用。

**【請求項 21】**

癌疾患の治療および予防のための医薬品を調製するための請求項1から13に記載の化合物、または請求項18に記載の混合物の使用。

**【請求項22】**

前記癌疾患には、扁平上皮、膀胱、胃、腎臓、頭および首、食道、頸、甲状腺、腸、肝臓、脳、前立腺、尿生殖路、リンパ系、胃、喉頭および／または肺の腫瘍の群からの腫瘍を伴う、請求項21に記載の使用。

**【請求項23】**

前記腫瘍が、単球性白血病、肺腺癌、小細胞肺癌、膵臓癌、グリア芽腫および乳癌および結腸癌の群から生じる請求項22に記載の使用。

**【請求項24】**

治療される癌疾患が、血液または免疫系の腫瘍である、請求項21に記載の使用。

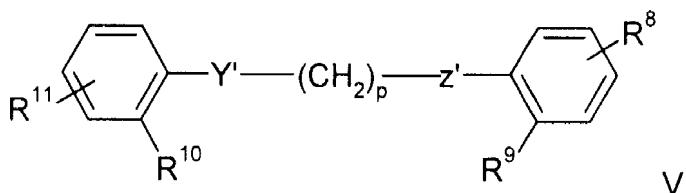
**【請求項25】**

前記腫瘍が、急性単球性白血病、慢性単球性白血病、急性リンパ性白血病および／または慢性リンパ性白血病の群から生じる、請求項24に記載の使用。

**【請求項26】**

腫瘍の治療のための医薬品を調製するための請求項1から13に記載の式Iの化合物、および／または生理的に許容可能なその塩および溶媒和物を、治療有効量の式V：

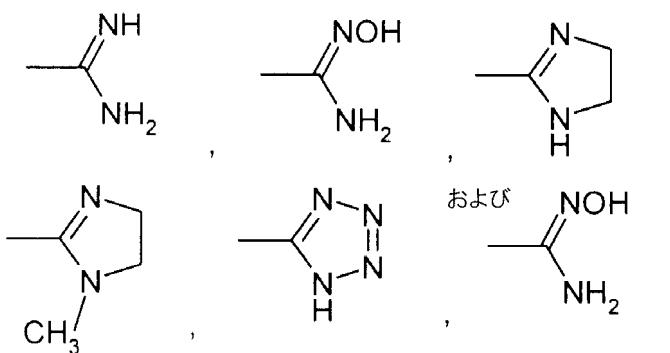
**【化14】**



(式中、

Y'およびz'は、それぞれ互いに独立に、OまたはNを表し、R<sup>9</sup>およびR<sup>10</sup>は、それぞれ互いに独立に、H、OH、ハロゲン、OC1-10-アルキル、OCF<sub>3</sub>、NO<sub>2</sub>またはNH<sub>2</sub>を表し、nは、2以上6以下の整数を表し、R<sup>8</sup>およびR<sup>11</sup>は、それぞれ互いに独立に、メタ位またはパラ位にあり、

**【化15】**



の群から選択される)

の1つまたは複数の化合物、その類似体および／またはその代謝物質と組み合わせた使用において、

式Iの化合物、および式Vの化合物、その類似体および／またはその代謝物質は、腫瘍または他の過剰増殖細胞の成長を阻害するのに十分な量で同時にまたは互いに14日以内に投与される使用。

**【請求項27】**

使用される式Vの化合物が、ペンタミジンまたはその塩である、請求項26に記載の使用。

**【請求項28】**

腫瘍の治療のための医薬品を調製するための請求項1から13に記載の式Iの化合物、および/または生理的に許容可能なその塩および溶媒和物の使用において、治療有効量の式Iの化合物は、放射線療法、および1)エストロゲン受容体モジュレーター、2)アンドロゲン受容体モジュレーター、3)レチノイド受容体モジュレーター、4)細胞毒性薬、5)抗増殖剤、6)プレニル・タンパク質転移酵素阻害剤、7)HMG-CoA還元酵素阻害剤、8)HIVプロテアーゼ阻害剤、9)逆転写酵素阻害剤および10)さらなる血管新生阻害剤の群からの化合物と組み合わせて投与される使用。

**【請求項29】**

式I118の化合物、およびあらゆる割合のその混合物を含む医薬として使用可能なその誘導体、溶媒和物、互変異性体、塩および立体異性体。

**【化16】**

