

【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27年4月30日 (2015.4.30)

【公表番号】特表2014-508781(P2014-508781A)

【公表日】平成26年4月10日 (2014.4.10)

【年通号数】公開・登録公報2014-018

【出願番号】特願2013-557919(P2013-557919)

【国際特許分類】

C 07 J 63/00 (2006.01)

A 61 K 31/277 (2006.01)

A 61 K 31/4164 (2006.01)

C 07 J 71/00 (2006.01)

A 61 K 31/357 (2006.01)

A 61 K 31/4245 (2006.01)

A 61 K 31/5377 (2006.01)

A 61 K 31/40 (2006.01)

A 61 K 31/337 (2006.01)

A 61 K 31/445 (2006.01)

A 61 K 31/397 (2006.01)

A 61 P 25/14 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 21/02 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 17/06 (2006.01)

A 61 P 37/08 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

A 61 P 37/06 (2006.01)

A 61 P 1/18 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 P 27/06 (2006.01)

A 61 P 21/04 (2006.01)

A 61 P 25/18 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 25/08 (2006.01)

A 61 P 25/04 (2006.01)

A 61 P 25/06 (2006.01)

C 12 Q 1/26 (2006.01)

C 12 N 15/09 (2006.01)

【 F I 】

C 07 J 63/00 C S P

A 61 K 31/277

A 61 K 31/4164

C 0 7 J	71/00	
A 6 1 K	31/357	
A 6 1 K	31/4245	
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	31/40	
A 6 1 K	31/337	
A 6 1 K	31/445	
A 6 1 K	31/397	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	21/02	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	1/18	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	27/06	
A 6 1 P	21/04	
A 6 1 P	25/18	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/24	
A 6 1 P	25/08	
A 6 1 P	25/04	
A 6 1 P	25/06	
C 1 2 Q	1/26	Z N A
C 1 2 N	15/00	A

【手続補正書】

【提出日】平成27年3月6日(2015.3.6)

【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

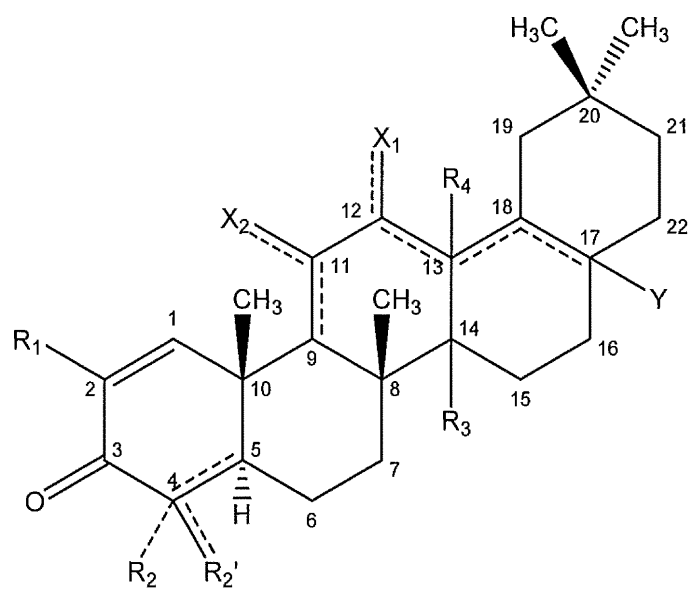
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体:



(I)

式中、

X_1 および X_2 は独立して水素、ハロ、ヒドロキシ、アミノまたはオキシであるが、但し、炭素原子12および13が二重結合によって互いに接続されている場合は X_1 はオキシではなく、さらに、炭素原子9および11が二重結合によって互いに接続されている場合は X_2 はオキシではなく；

R_1 は -H、-CN、ハロ、-CF₃ または -C(O) R_a であり、ここで R_a は -OH、アルコキシ_(C₁ ~ 4)、-N H_2 、アルキルアミノ_(C₁ ~ 4) または -NH-S(O)₂-アルキル_(C₁ ~ 4) であり；

R_2 は水素であり、あるいは、 R_2 は、それが結合している原子が二重結合の一部を形成する場合には非存在であり；

R_2' は =CH₂、またはアルキル_(C₈) であり；

R_3 および R_4 はそれぞれ独立して水素、ヒドロキシ、メチルであるか、あるいは、これらの基のいずれかが R_c 基と一緒にいる場合は以下に定義の通りであり；

Y は以下である：

-H、-OH、-SH、-CN、-F、-CF₃、-NH₂ もしくは -NCO；

アルキル_(C₈)、アルケニル_(C₈)、アルキニル_(C₈)、アリール_(C₁₂)、アラルキル_(C₁₂)、ヘテロアリール_(C₈)、ヘテロシクロアルキル_(C₁₂)、アルコキシ_(C₈)、アリールオキシ_(C₁₂)、アシルオキシ_(C₈)、アルキルアミノ_(C₈)、ジアルキルアミノ_(C₈)、アルケニルアミノ_(C₈)、アリールアミノ_(C₈)、アラルキルアミノ_(C₈)、アルキルチオ_(C₈)、アシルチオ_(C₈)、アルキルスルホニルアミノ_(C₈)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョン；

-アルカンジイル_(C₈)- R_b 、-アルケンジイル_(C₈)- R_b 、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョン、ここで R_b は

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノもしくはチオ；または

ヘテロアリール_(C₈)、アルコキシ_(C₈)、アルケニルオキシ_(C₈)、アリールオキシ_(C₈)、アラルコキシ_(C₈)、ヘテロアリールオキシ_(C₈)、アシルオキシ_(C₈)、アルキルアミノ_(C₈)、ジアルキルアミノ_(C₈)、アルケニルアミノ_(C₈)、アリールアミノ_(C₈)、アラルキルアミノ_(C₈)、ヘテロアリールアミノ_(C₈)、アルキルスルホニルアミノ_(C₈)、アミド_(C₈)、-OC(O)NH-アルキル_(C₈)、-OC(O)CH₂NHC(O)O-t-ブチル、-OCH₂-アルキルチオ_(C₈)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである；

-(CH₂)_mC(O) R_c 、ここで m は 0 ~ 6 であり、 R_c は

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノ、-NHOH、



もしくはチオ；または

アルキル_(C₈)、アルケニル_(C₈)、アルキニル_(C₈)、アリール_(C₈)、アラルキル

(C₈)、ヘテロアリール(C₈)、ヘテロシクロアルキル(C₈)、アルコキシ(C₈)、アルケニルオキシ(C₈)、アリールオキシ(C₈)、アラルコキシ(C₈)、ヘテロアリールオキシ(C₈)、アシルオキシ(C₈)、アルキルアミノ(C₈)、ジアルキルアミノ(C₈)、アリールアミノ(C₈)、アルキルスルホニルアミノ(C₈)、アミド(C₈)、-NH-アルコキシ(C₈)、-NH-ヘテロシクロアルキル(C₈)、-NHC(NOH)-アルキル(C₈)、-NH-アミド(C₈)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンであり；

R_cおよびR₃は一緒になって-O-もしくは-NR_d-となり、ここでR_dは水素もしくはアルキル(C₄)であり；または

R_cおよびR₄は一緒になって-O-もしくは-NR_d-となり、ここでR_dは水素もしくはアルキル(C₄)である；あるいは

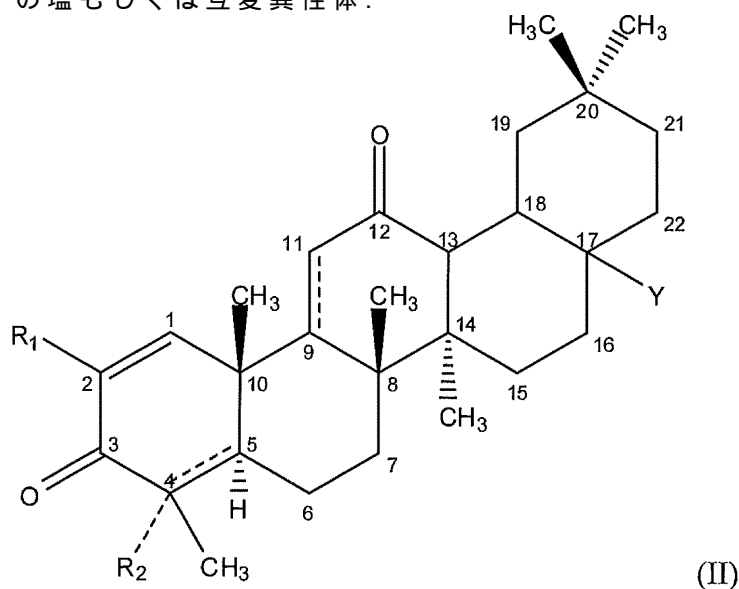
-NHC(O)R_e、ここでR_eは

水素、ヒドロキシ、アミノ；または

アルキル(C₈)、アルケニル(C₈)、アルキニル(C₈)、アリール(C₈)、アラルキル(C₈)、ヘテロアリール(C₈)、ヘテロシクロアルキル(C₈)、アルコキシ(C₈)、アリールオキシ(C₈)、アラルコキシ(C₈)、ヘテロアリールオキシ(C₈)、アシルオキシ(C₈)、アルキルアミノ(C₈)、ジアルキルアミノ(C₈)、アリールアミノ(C₈)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである。

【請求項2】

下記式によってさらに定義される請求項1記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体：



式中、

R₁は-H、-CN、ハロ、-CF₃または-C(O)R_aであり、ここでR_aは-OH、アルコキシ(C₁₋₄)、-NH₂、アルキルアミノ(C₁₋₄)または-NH-S(O)₂-アルキル(C₁₋₄)であり；

R₂は水素であり、あるいは、R₂は、それが結合している原子が二重結合の一部を形成する場合には非存在であり；

Yは以下である：

-H、-OH、-SH、-CN、-F、-CF₃、-NH₂もしくは-NCO；

アルキル(C₈)、アルケニル(C₈)、アルキニル(C₈)、アリール(C₁₂)、アラルキル(C₁₂)、ヘテロアリール(C₈)、ヘテロシクロアルキル(C₁₂)、アルコキシ(C₈)、アリールオキシ(C₁₂)、アシルオキシ(C₈)、アルキルアミノ(C₈)、ジアルキルアミノ(C₈)、アルケニルアミノ(C₈)、アリールアミノ(C₈)、アラルキルアミノ(C₈)、アルキルチオ(C₈)、アシルチオ(C₈)、アルキルスルホニルアミノ(C₈)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョン；

-アルカンジイル(C₈)-R_b、-アルケンジイル(C₈)-R_b、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョン、ここでR_bは

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノもしくはチオ；または

ヘテロアリール_(C 8)、アルコキシ_(C 8)、アルケニルオキシ_(C 8)、アリールオキシ_(C 8)、アラルコキシ_(C 8)、ヘテロアリールオキシ_(C 8)、アシルオキシ_(C 8)、アルキルアミノ_(C 8)、ジアルキルアミノ_(C 8)、アルケニルアミノ_(C 8)、アリールアミノ_(C 8)、アラルキルアミノ_(C 8)、ヘテロアリールアミノ_(C 8)、アルキルスルホニルアミノ_(C 8)、アミド_(C 8)、-OC(O)NH-アルキル_(C 8)、-OC(O)CH₂NHC(O)O-t-ブチル、-OCH₂-アルキルチオ_(C 8)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである；

-(CH₂)_mC(O)R_c、ここでmは0~6であり、R_cは

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノ、-NHOH、



もしくはチオ；または

アルキル_(C 8)、アルケニル_(C 8)、アルキニル_(C 8)、アリール_(C 8)、アラルキル_(C 8)、ヘテロアリール_(C 8)、ヘテロシクロアルキル_(C 8)、アルコキシ_(C 8)、アルケニルオキシ_(C 8)、アリールオキシ_(C 8)、アラルコキシ_(C 8)、ヘテロアリールオキシ_(C 8)、アシルオキシ_(C 8)、アルキルアミノ_(C 8)、ジアルキルアミノ_(C 8)、アリールアミノ_(C 8)、アルキルスルホニルアミノ_(C 8)、アミド_(C 8)、-NH-アルコキシ_(C 8)、-NH-ヘテロシクロアルキル_(C 8)、-NHC(NOH)-アルキル_(C 8)、-NH-アミド_(C 8)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである；あるいは

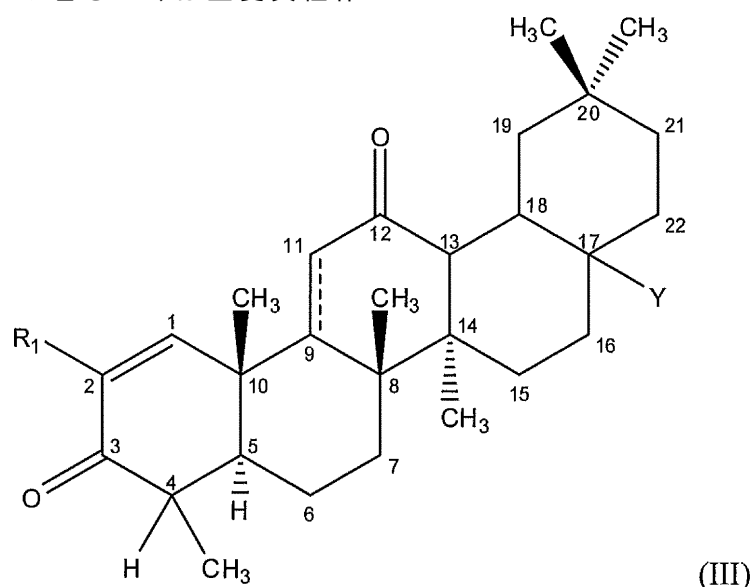
-NHC(O)R_e、ここでR_eは

水素、ヒドロキシ、アミノ；または

アルキル_(C 8)、アルケニル_(C 8)、アルキニル_(C 8)、アリール_(C 8)、アラルキル_(C 8)、ヘテロアリール_(C 8)、ヘテロシクロアルキル_(C 8)、アルコキシ_(C 8)、アリールオキシ_(C 8)、アラルコキシ_(C 8)、ヘテロアリールオキシ_(C 8)、アシルオキシ_(C 8)、アルキルアミノ_(C 8)、ジアルキルアミノ_(C 8)、アリールアミノ_(C 8)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである。

【請求項3】

下記式によってさらに定義される請求項2記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体：



(III)

式中、

R₁は-H、-CN、ハロ、-CF₃または-C(O)R_aであり、ここでR_aは-OH、アルコキシ_(C1~4)、-NH₂、アルキルアミノ_(C1~4)または-NH-S(O)₂-アルキル_(C1~4)であり；

Yは以下である：

-H、-OH、-SH、-CN、-F、-CF₃、-NH₂もしくは-NCO；

アルキル_(C 8)、アルケニル_(C 8)、アルキニル_(C 8)、アリール_(C 12)、アラルキル_(C 8)、ヘテロアリール_(C 8)、ヘテロシクロアルキル_(C 8)、アルコキシ_(C 8)、アルケニルオキシ_(C 8)、アリールオキシ_(C 8)、アラルコキシ_(C 8)、ヘテロアリールオキシ_(C 8)、アシルオキシ_(C 8)、アルキルアミノ_(C 8)、ジアルキルアミノ_(C 8)、アリールアミノ_(C 8)、アラルキルアミノ_(C 8)、ヘテロアリールアミノ_(C 8)、アルキルスルホニルアミノ_(C 8)、アミド_(C 8)、-OC(O)NH-アルキル_(C 8)、-OC(O)CH₂NHC(O)O-t-ブチル、-OCH₂-アルキルチオ_(C 8)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである；あるいは

C_{12})、ヘテロアリーール(C_8)、ヘテロシクロアルキル(C_{12})、アルコキシ(C_8)、アリーールオキシ(C_{12})、アシルオキシ(C_8)、アルキルアミノ(C_8)、ジアルキルアミノ(C_8)、アルケニルアミノ(C_8)、アリーールアミノ(C_8)、アラールキルアミノ(C_8)、アルキルチオ(C_8)、アシルチオ(C_8)、アルキルスルホニルアミノ(C_8)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョン；

-アルカンジイル(C_8)- R_b 、-アルケンジイル(C_8)- R_b 、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョン、ここで R_b は

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノもしくはチオ；または

ヘテロアリーール(C_8)、アルコキシ(C_8)、アルケニルオキシ(C_8)、アリーールオキシ(C_8)、アラールコキシ(C_8)、ヘテロアリーールオキシ(C_8)、アシルオキシ(C_8)、アルキルアミノ(C_8)、ジアルキルアミノ(C_8)、アルケニルアミノ(C_8)、アリーールアミノ(C_8)、アラールキルアミノ(C_8)、ヘテロアリーールアミノ(C_8)、アルキルスルホニルアミノ(C_8)、アミド(C_8)、-OC(O)NH-アルキル(C_8)、-OC(O)CH₂NHC(O)O-t-ブチル、-OCH₂-アルキルチオ(C_8)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである；

-(CH₂)_mC(O) R_c 、ここでmは0~6であり、 R_c は

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノ、-NHOH、



もしくはチオ；または

アルキル(C_8)、アルケニル(C_8)、アルキニル(C_8)、アリーール(C_8)、アラールキル(C_8)、ヘテロアリーール(C_8)、ヘテロシクロアルキル(C_8)、アルコキシ(C_8)、アルケニルオキシ(C_8)、アリーールオキシ(C_8)、アラールコキシ(C_8)、ヘテロアリーールオキシ(C_8)、アシルオキシ(C_8)、アルキルアミノ(C_8)、ジアルキルアミノ(C_8)、アリーールアミノ(C_8)、アルキルスルホニルアミノ(C_8)、アミド(C_8)、-NH-アルコキシ(C_8)、-NH-ヘテロシクロアルキル(C_8)、-NHC(NOH)-アルキル(C_8)、-NH-アミド(C_8)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである；あるいは

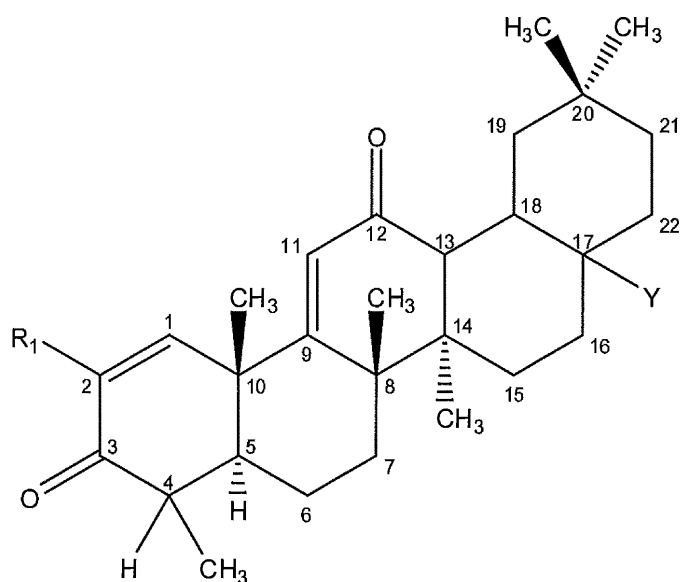
-NHC(O) R_e 、ここで R_e は

水素、ヒドロキシ、アミノ；または

アルキル(C_8)、アルケニル(C_8)、アルキニル(C_8)、アリーール(C_8)、アラールキル(C_8)、ヘテロアリーール(C_8)、ヘテロシクロアルキル(C_8)、アルコキシ(C_8)、アリーールオキシ(C_8)、アラールコキシ(C_8)、ヘテロアリーールオキシ(C_8)、アシルオキシ(C_8)、アルキルアミノ(C_8)、ジアルキルアミノ(C_8)、アリーールアミノ(C_8)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである。

【請求項4】

下記式によってさらに定義される請求項3記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体：



式中、

R_1 は $-H$ 、 $-CN$ 、ハロ、 $-CF_3$ または $-C(O)R_a$ であり、ここで R_a は $-OH$ 、アルコキシ (C_{1-4})、 $-NH_2$ 、アルキルアミノ (C_{1-4}) または $-NH-S(O)_2$ -アルキル (C_{1-4}) であり；

Y は以下である：

$-H$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $-F$ 、 $-CF_3$ 、 $-NH_2$ もしくは $-NCO$ ；

アルキル (C_{1-8})、アルケニル (C_{2-8})、アルキニル (C_{2-8})、アリール (C_{6-12})、アラルキル (C_{7-12})、ヘテロアリール (C_{5-8})、ヘテロシクロアルキル (C_{3-12})、アルコキシ (C_{1-8})、アリールオキシ (C_{6-12})、アシルオキシ (C_{1-8})、アルキルアミノ (C_{1-8})、ジアルキルアミノ (C_{2-8})、アルケニルアミノ (C_{2-8})、アリールアミノ (C_{6-8})、アラルキルアミノ (C_{7-8})、アミド (C_{2-8})、アルキルチオ (C_{1-8})、アシルチオ (C_{1-8})、アルキルスルホニルアミノ (C_{1-8})、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョン；

$-$ アルカンジイル (C_{1-8})- R_b 、 $-$ アルケンジイル (C_{2-8})- R_b 、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョン、ここで R_b は

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノもしくはチオ；または

ヘテロアリール (C_{5-8})、アルコキシ (C_{1-8})、アルケニルオキシ (C_{2-8})、アリールオキシ (C_{6-8})、アラルコキシ (C_{7-8})、ヘテロアリールオキシ (C_{5-8})、アシルオキシ (C_{1-8})、アルキルアミノ (C_{1-8})、ジアルキルアミノ (C_{2-8})、アルケニルアミノ (C_{2-8})、アリールアミノ (C_{6-8})、アラルキルアミノ (C_{7-8})、ヘテロアリールアミノ (C_{5-8})、アルキルスルホニルアミノ (C_{1-8})、アミド (C_{2-8})、 $-OC(O)NH$ -アルキル (C_{1-8})、 $-OC(O)CH_2NHC(O)O$ - t -ブチル、 $-OCH_2$ -アルキルチオ (C_{1-8})、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである；

$-(CH_2)_mC(O)R_c$ 、ここで m は 0 ~ 6 であり、 R_c は

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノ、 $-NHOH$ 、



もしくはチオ；または

アルキル (C_{1-8})、アルケニル (C_{2-8})、アルキニル (C_{2-8})、アリール (C_{6-8})、アラルキル (C_{7-8})、ヘテロアリール (C_{5-8})、ヘテロシクロアルキル (C_{3-8})、アルコキシ (C_{1-8})、アルケニルオキシ (C_{2-8})、アリールオキシ (C_{6-8})、アラルコキシ (C_{7-8})、ヘテロアリールオキシ (C_{5-8})、アシルオキシ (C_{1-8})、アルキルアミノ (C_{1-8})、ジアルキルアミノ (C_{2-8})、アリールアミノ (C_{6-8})、アルキルスルホニルアミノ (C_{1-8})、アミド (C_{2-8})、 $-NH$ -アルコキシ (C_{1-8})、 $-NH$ -ヘテロシクロアルキル (C_{3-8})、 $-NHC(NOH)$ -アルキル (C_{1-8})、 $-NH$ -アミド (C_{2-8})、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである；あるいは

$-NHC(O)R_e$ 、ここで R_e は

水素、ヒドロキシ、アミノ；または

アルキル (C_{1-8})、アルケニル (C_{2-8})、アルキニル (C_{2-8})、アリール (C_{6-8})、アラルキル

(C₈)、ヘテロアリーール(C₈)、ヘテロシクロアルキル(C₈)、アルコキシ(C₈)、アリーールオキシ(C₈)、アラルコキシ(C₈)、ヘテロアリーールオキシ(C₈)、アシルオキシ(C₈)、アルキルアミノ(C₈)、ジアルキルアミノ(C₈)、アリーールアミノ(C₈)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである。

【請求項 5】

R₁が-CNである、請求項1～4のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 6】

Yが-(CH₂)_mC(O)R_cであり、ここでmが0～6であり、R_cが水素、ヒドロキシ、アミノ、-NH OH、



、アルキル(C₈)、アルケニル(C₈)、アルキニル(C₈)、アリーール(C₈)、アラルキル(C₈)、ヘテロアリーール(C₈)、ヘテロシクロアルキル(C₈)、アルコキシ(C₈)、アルケニルオキシ(C₈)、アリーールオキシ(C₈)、アラルコキシ(C₈)、アシルオキシ(C₈)、アルキルアミノ(C₈)、ジアルキルアミノ(C₈)、アリーールアミノ(C₈)、アルキルスルホニルアミノ(C₈)、アミド(C₈)、-NH-アルコキシ(C₈)、-NH-ヘテロシクロアルキル(C₈)、-NHC(NOH)-アルキル(C₈)、-NH-アミド(C₈)、または水素、ヒドロキシ、アミノおよび-NHOH以外のこれらの基のいずれかの置換バージョンである、請求項1～5のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 7】

Yが-アルカンジイル(C₈)-R_bである、請求項1～5のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 8】

Yが-CH₂-R_bである、請求項7記載の化合物。

【請求項 9】

R_bがヒドロキシ、アシルオキシ(C₈)、置換アシルオキシ(C₈)、アルコキシ(C₈)、置換アルコキシ(C₈)、ヘテロアリーール(C₈)、-OC(O)NH-アルキル(C₈)、-OC(O)CH₂NHC(O)O-t-ブチル、および-OCH₂-アルキルチオ(C₈)からなる群より選択される、請求項7または8に記載の化合物。

【請求項 10】

Yがアルキルスルホニルアミノ(C₈)、置換アルキルスルホニルアミノ(C₈)、およびヘテロアリーール(C₈)からなる群より選択される、請求項1～5のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 11】

Yが-NHC(O)R_eであり、ここでR_eが水素、ヒドロキシ、アミノ、アルキル(C₈)、アリーール(C₈)、アルコキシ(C₈)、アシルオキシ(C₈)、アルキルアミノ(C₈)、ジアルキルアミノ(C₈)、または水素、ヒドロキシおよびアミノ以外のこれらの基のいずれかの置換バージョンである、請求項1～5のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 12】

R_eがアルキル(C₈)または置換アルキル(C₈)である、請求項11記載の化合物。

【請求項 13】

R_eがメチル、エチル、シクロプロピル、シクロブチル、n-ヘキシル、1,1-ジフルオロエチルまたは2,2,2-トリフルオロエチルである、請求項12記載の化合物。

【請求項 14】

Yが-(CH₂)_mC(O)R_cであり、ここでmが0であり、R_cおよびR₃が一緒になって-O-となる、請求項1または5に記載の化合物。

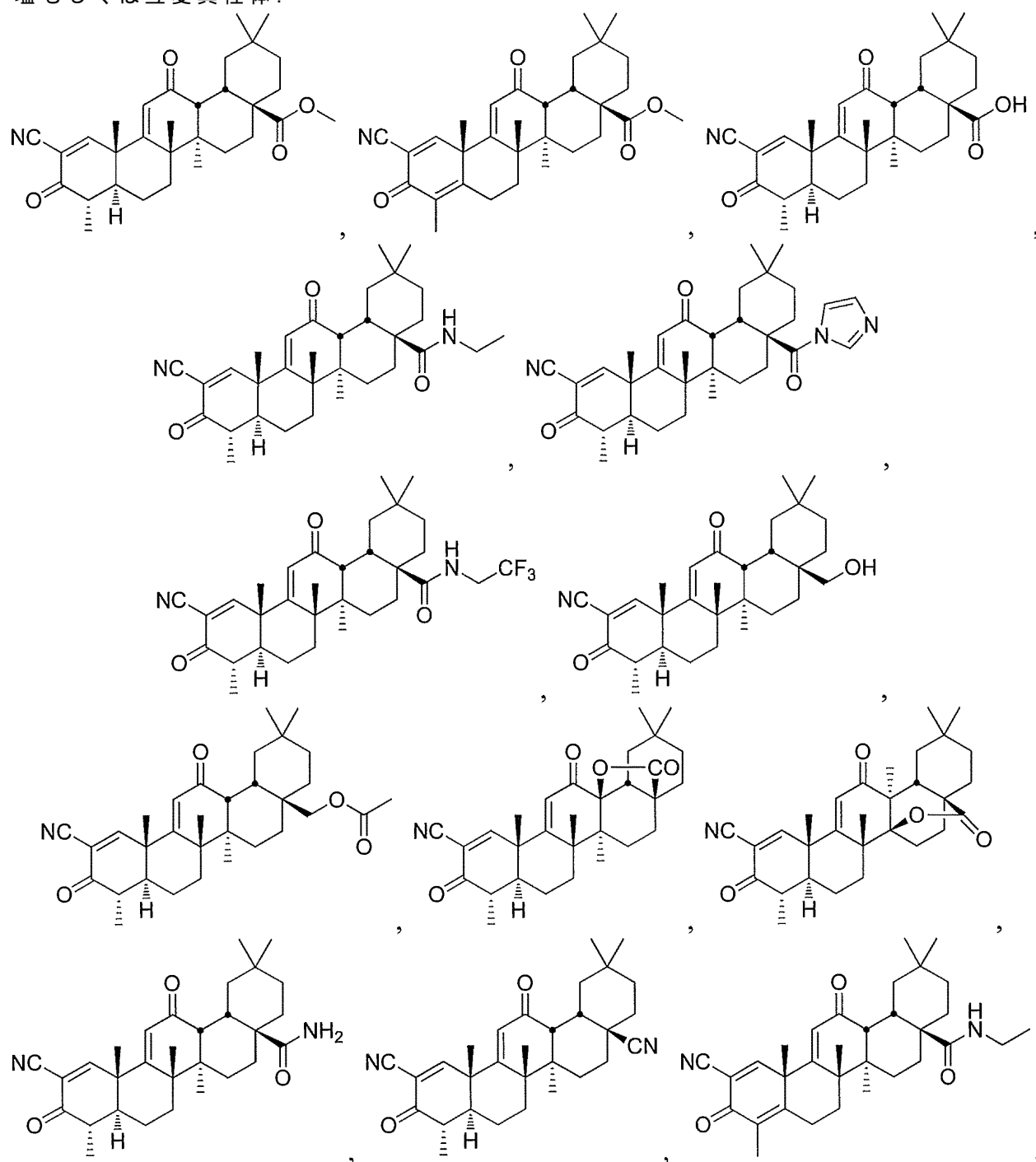
【請求項 15】

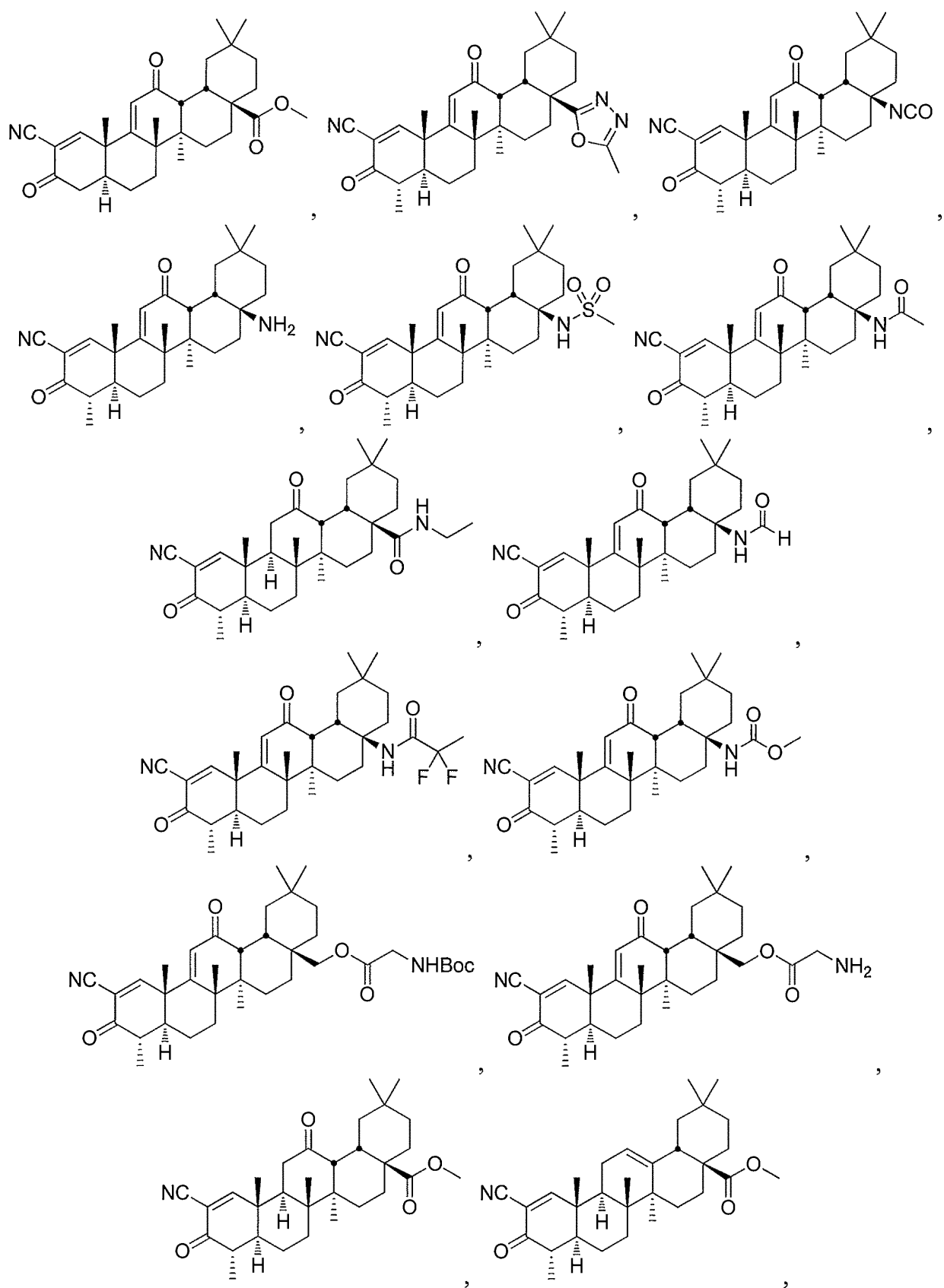
Yが-(CH₂)_mC(O)R_cであり、ここでmが0であり、R_cおよびR₄が一緒になって-O-となる、請求項1または5に記載の化合物。

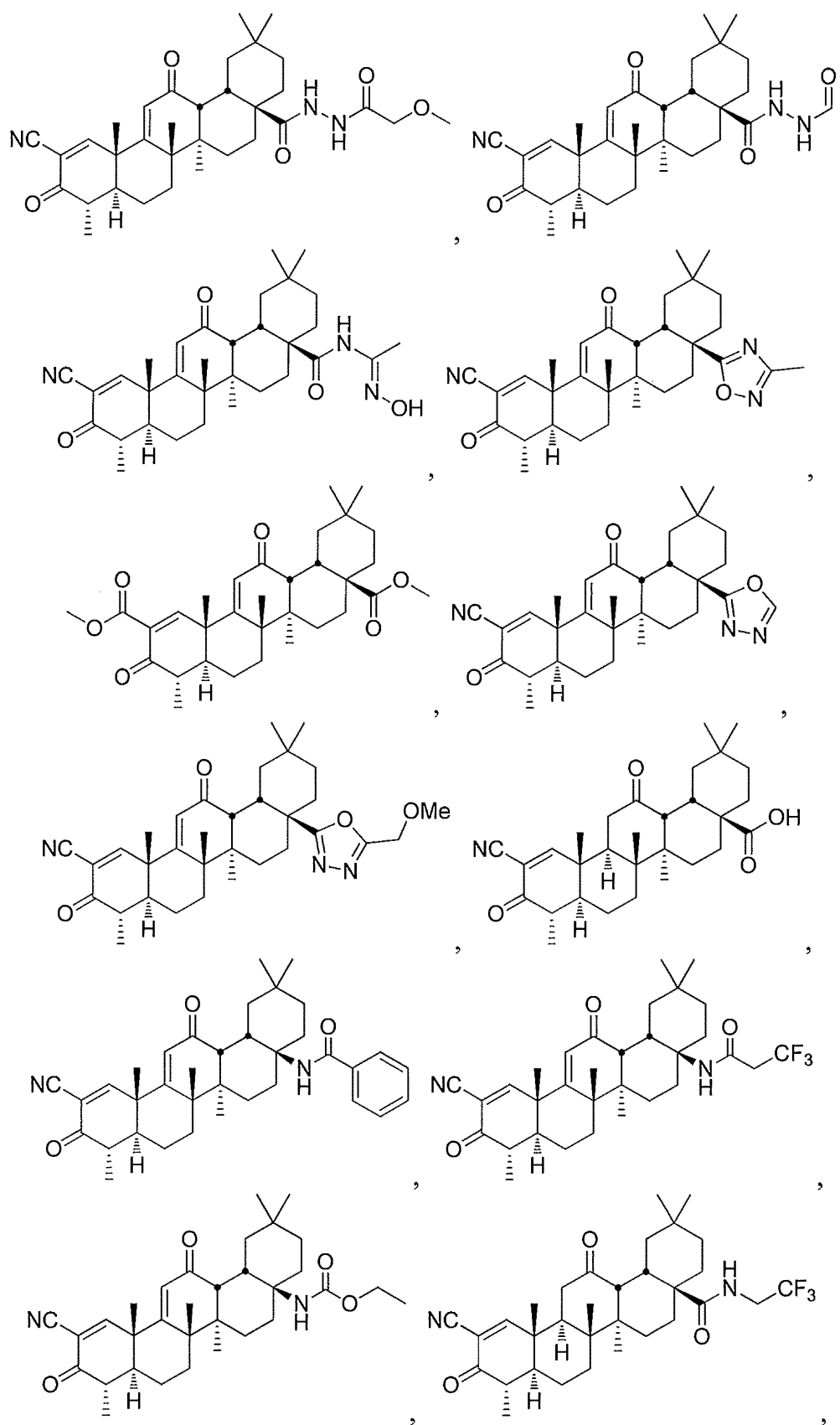
【請求項 16】

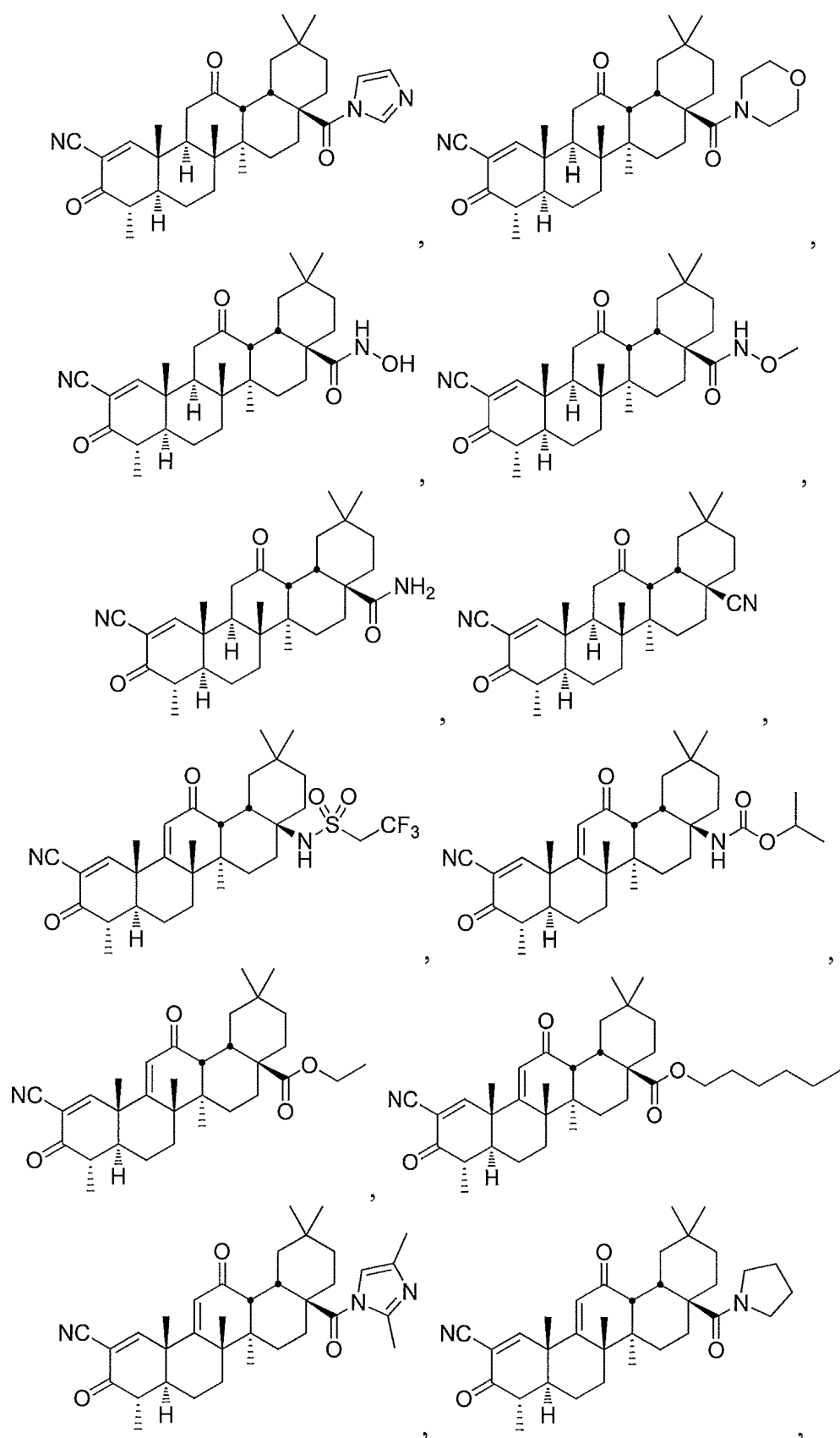
下記式としてさらに定義される請求項1記載の化合物、または薬学的に許容されるその

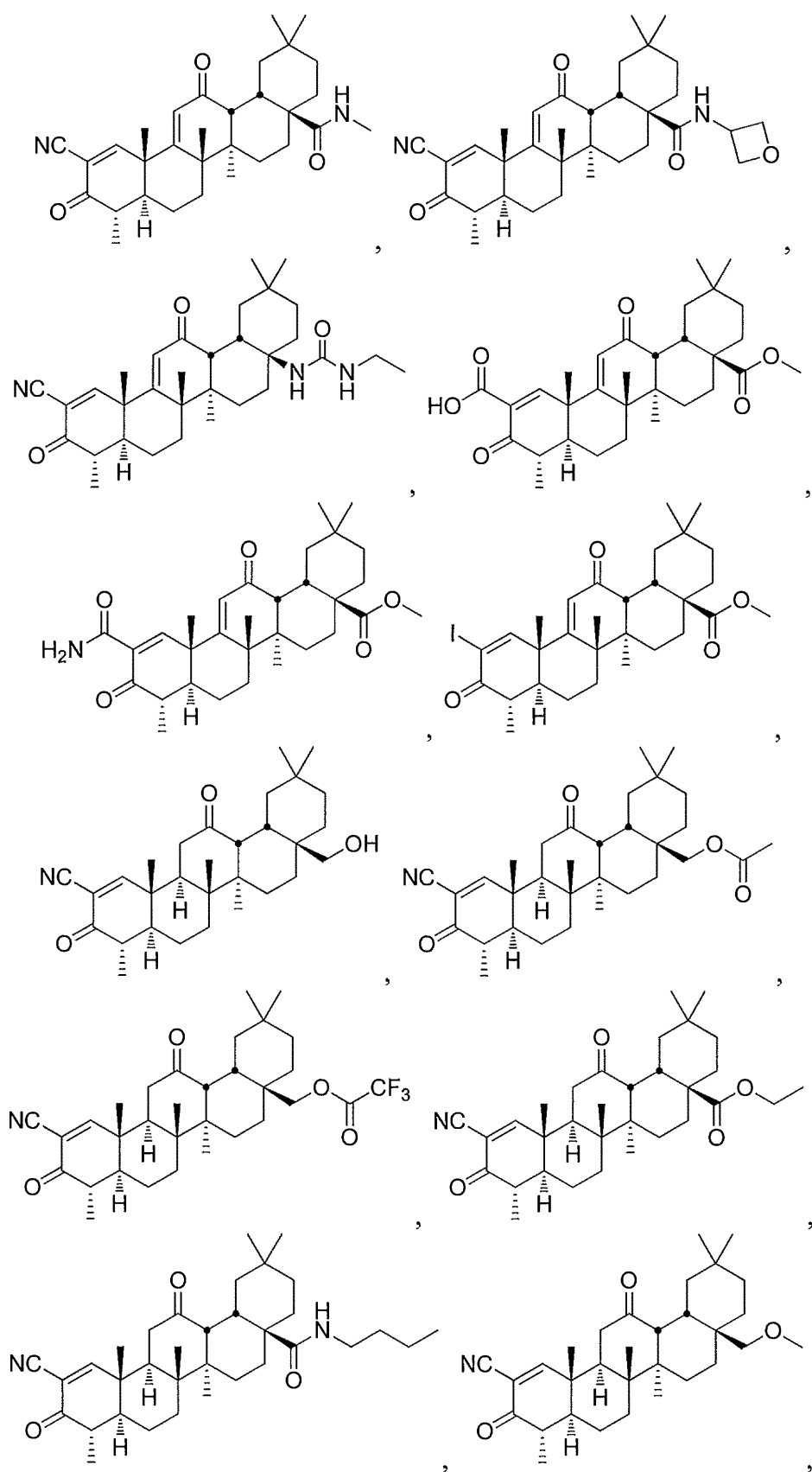
塩もしくは互変異性体：

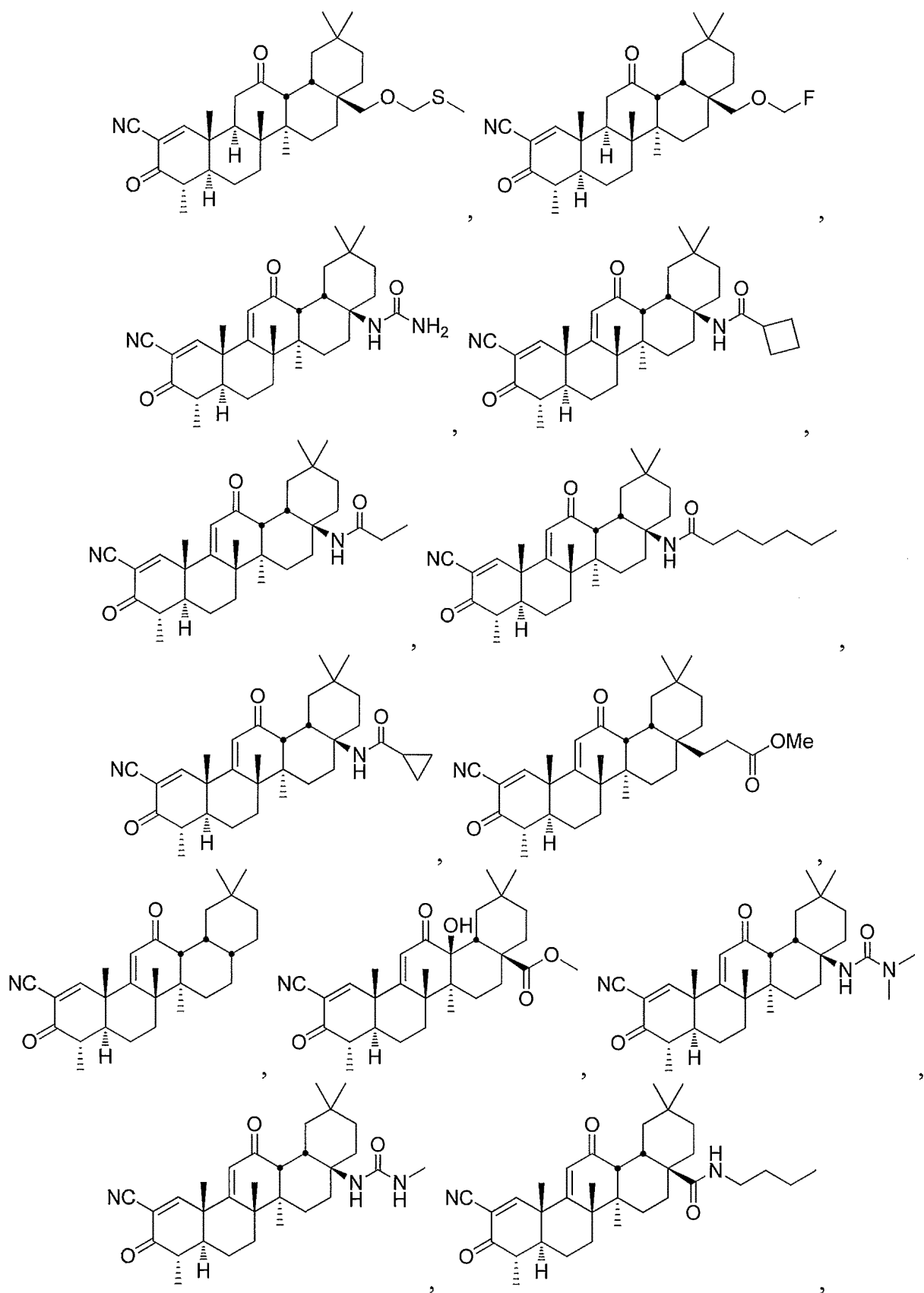


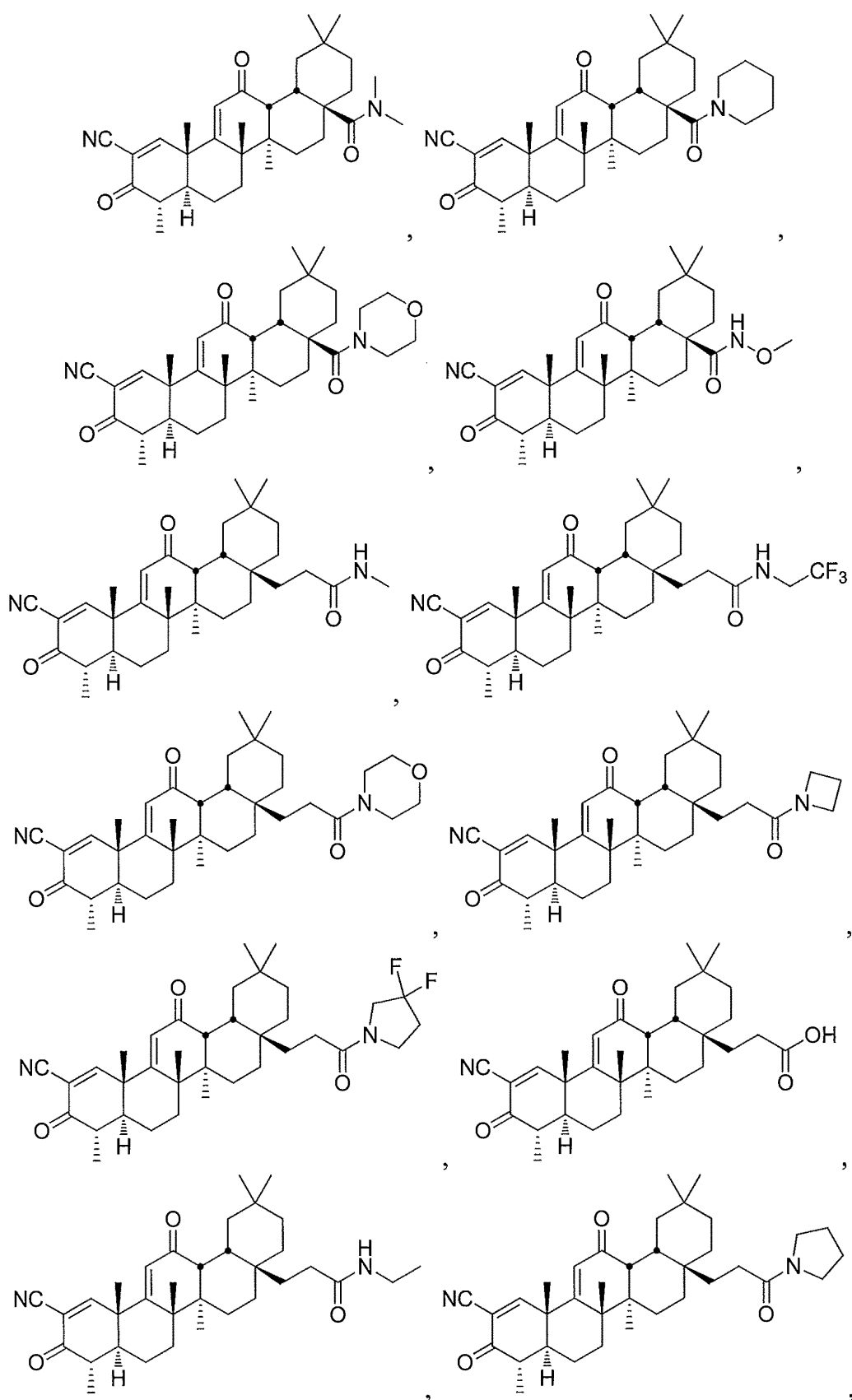


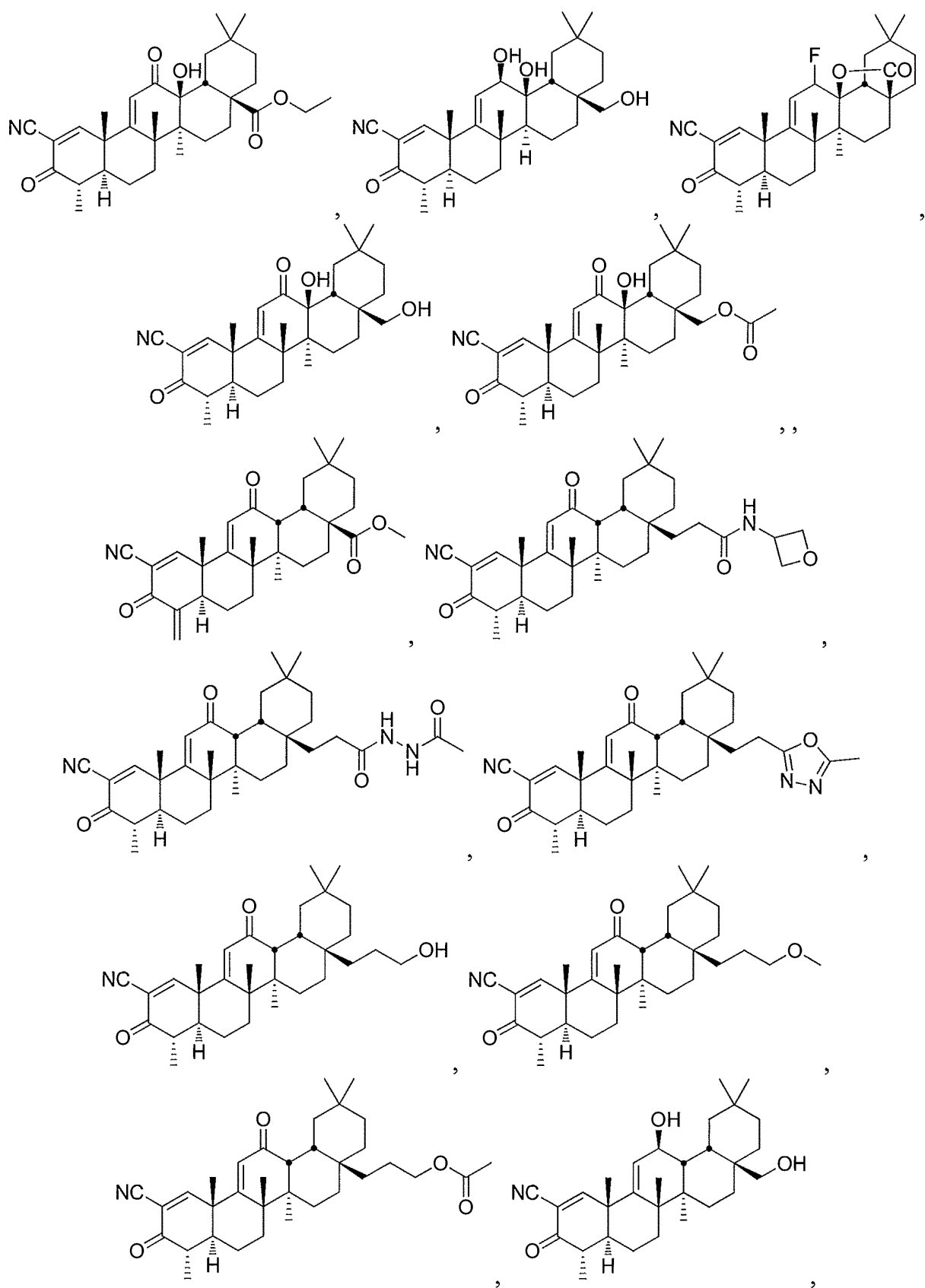


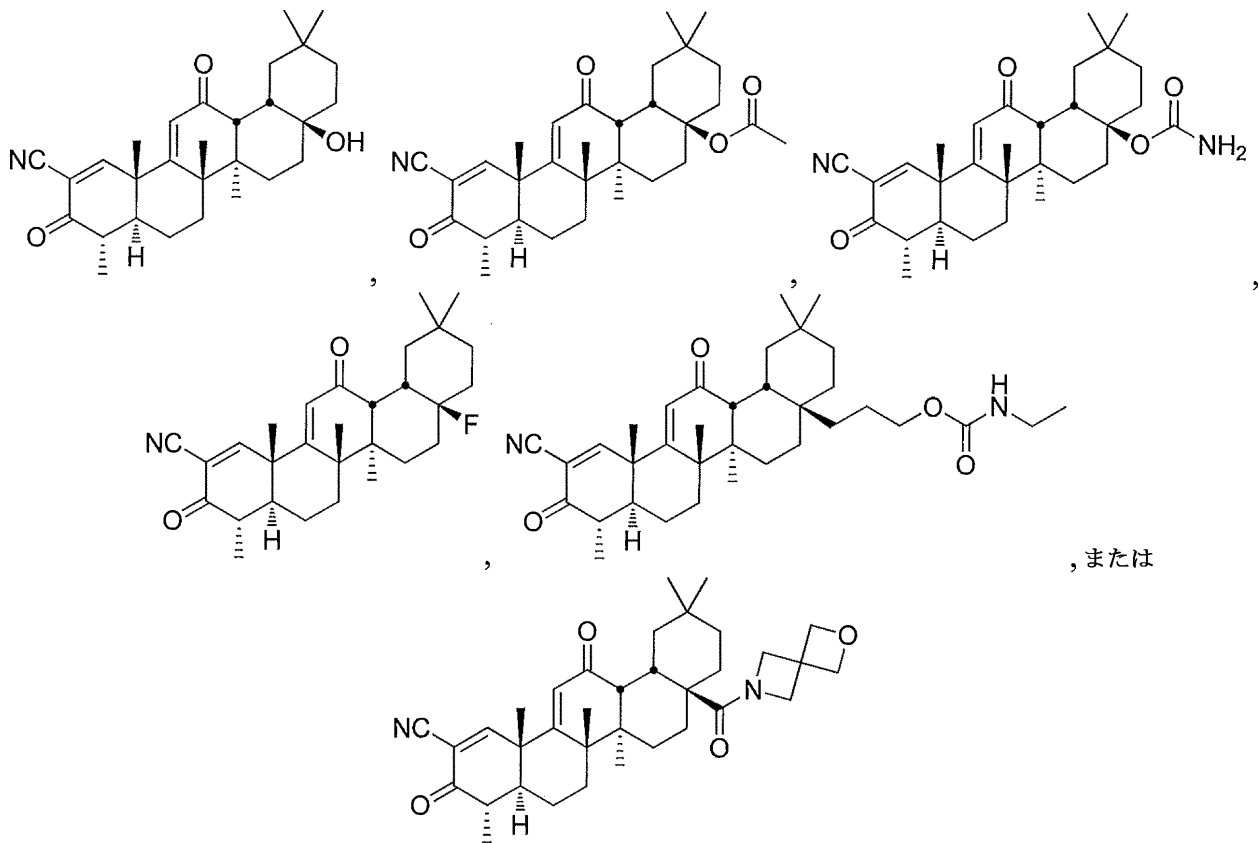












。

【請求項 17】

a) 請求項1～16のいずれか一項記載の化合物；および

b) 賦形剤

を含む、薬学的組成物。

【請求項 18】

請求項1～16のいずれか一項記載の化合物を含む、治療において使用するための薬学的組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0025

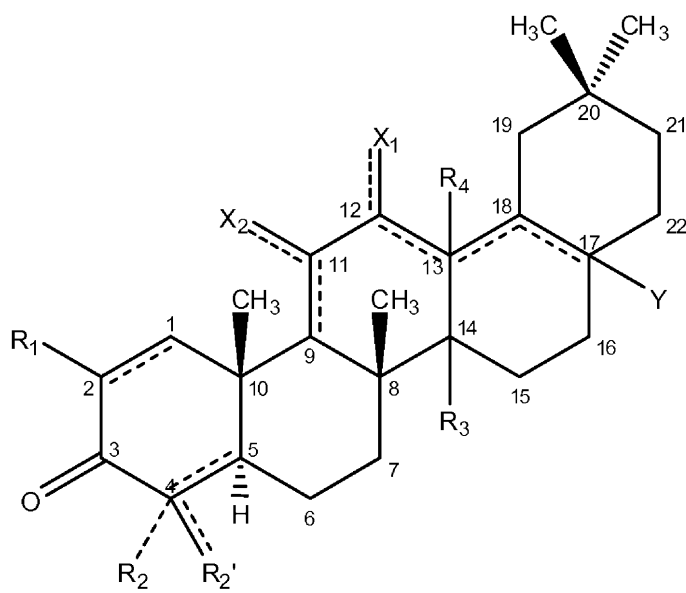
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0025】

[本発明1001]

下記式の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体：



式中、

X_1 および X_2 は独立して水素、ハロ、ヒドロキシ、アミノまたはオキシであるが、但し、炭素原子12および13が二重結合によって互いに接続されている場合は X_1 はオキシではなく、さらに、炭素原子9および11が二重結合によって互いに接続されている場合は X_2 はオキシではなく；

R_1 は-H、-CN、ハロ、-CF₃または-C(O) R_a であり、ここで R_a は-OH、アルコキシ_(C₁~4)、-NH₂、アルキルアミノ_(C₁~4)または-NH-S(O)₂-アルキル_(C₁~4)であり；

R_2 は水素であり、あるいは、 R_2 は、それが結合している原子が二重結合の一部を形成する場合には非存在であり；

R_2' は水素、=CH₂、アルキル_(C₁~8)または置換アルキル_(C₁~8)であり；

R_3 および R_4 はそれぞれ独立して水素、ヒドロキシ、メチルであるか、あるいは、これらの基のいずれかが R_c 基と一緒にになる場合は以下に定義の通りであり；

Yは以下である：

-H、-OH、-SH、-CN、-F、-CF₃、-NH₂もしくは-NCO；

アルキル_(C₁~8)、アルケニル_(C₂~8)、アルキニル_(C₂~8)、アリール_(C₆~12)、アラルキル_(C₆~12)、ヘテロアリール_(C₆~8)、ヘテロシクロアルキル_(C₃~12)、アルコキシ_(C₁~8)、アリールオキシ_(C₆~12)、アシルオキシ_(C₁~8)、アルキルアミノ_(C₁~8)、ジアルキルアミノ_(C₁~8)、アルケニルアミノ_(C₂~8)、アリールアミノ_(C₆~8)、アラルキルアミノ_(C₆~8)、アルキルチオ_(C₁~8)、アシルチオ_(C₁~8)、アルキルスルホニルアミノ_(C₁~8)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョン；

-アルカンジイル_(C₁~8)- R_b 、-アルケンジイル_(C₂~8)- R_b 、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョン、ここで R_b は

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノもしくはチオ；または

ヘテロアリール_(C₆~8)、アルコキシ_(C₁~8)、アルケニルオキシ_(C₂~8)、アリールオキシ_(C₆~12)、アラルコキシ_(C₆~12)、ヘテロアリールオキシ_(C₆~8)、アシルオキシ_(C₁~8)、アルキルアミノ_(C₁~8)、ジアルキルアミノ_(C₁~8)、アルケニルアミノ_(C₂~8)、アリールアミノ_(C₆~8)、アラルキルアミノ_(C₆~8)、ヘテロアリールアミノ_(C₆~8)、アルキルスルホニルアミノ_(C₁~8)、アミド_(C₁~8)、-OC(O)NH-アルキル_(C₁~8)、-OC(O)CH₂NHC(O)O-t-ブチル、-OCH₂-アルキルチオ_(C₁~8)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである；

-(CH₂)_mC(O) R_c 、ここでmは0~6であり、 R_c は

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノ、-NHOH、



もしくはチオ；または

アルキル_(C₈)、アルケニル_(C₈)、アルキニル_(C₈)、アリール_(C₈)、アラルキル_(C₈)、ヘテロアリール_(C₈)、ヘテロシクロアルキル_(C₈)、アルコキシ_(C₈)、アルケニルオキシ_(C₈)、アリールオキシ_(C₈)、アラルコキシ_(C₈)、ヘテロアリールオキシ_(C₈)、アシルオキシ_(C₈)、アルキルアミノ_(C₈)、ジアルキルアミノ_(C₈)、アリールアミノ_(C₈)、アルキルスルホニルアミノ_(C₈)、アミド_(C₈)、-NH-アルコキシ_(C₈)、-NH-ヘテロシクロアルキル_(C₈)、-NHC(OH)-アルキル_(C₈)、-NH-アミド_(C₈)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンであり；

R_cおよびR₃は一緒になって-O-もしくは-NR_d-となり、ここでR_dは水素もしくはアルキル_(C₄)であり；または

R_cおよびR₄は一緒になって-O-もしくは-NR_d-となり、ここでR_dは水素もしくはアルキル_(C₄)である；あるいは

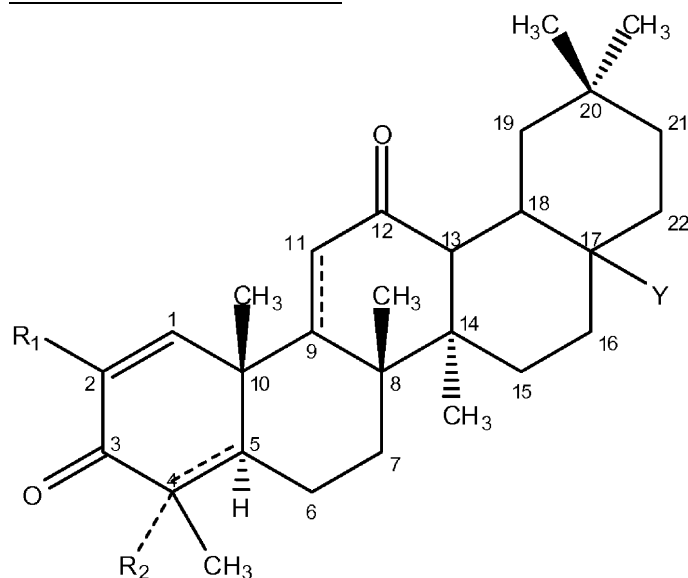
-NHC(O)R_e、ここでR_eは

水素、ヒドロキシ、アミノ；または

アルキル_(C₈)、アルケニル_(C₈)、アルキニル_(C₈)、アリール_(C₈)、アラルキル_(C₈)、ヘテロアリール_(C₈)、ヘテロシクロアルキル_(C₈)、アルコキシ_(C₈)、アリールオキシ_(C₈)、アラルコキシ_(C₈)、ヘテロアリールオキシ_(C₈)、アシルオキシ_(C₈)、アルキルアミノ_(C₈)、ジアルキルアミノ_(C₈)、アリールアミノ_(C₈)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである。

[本発明1002]

下記式によってさらに定義される本発明1001の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体：



(II)

式中、

R₁は-H、-CN、ハロ、-CF₃または-C(O)R_aであり、ここでR_aは-OH、アルコキシ_(C₁₋₄)、-NH₂、アルキルアミノ_(C₁₋₄)または-NH-S(O)₂-アルキル_(C₁₋₄)であり；

R₂は水素であり、あるいは、R₂は、それが結合している原子が二重結合の一部を形成する場合には非存在であり；

Yは以下である：

-H、-OH、-SH、-CN、-F、-CF₃、-NH₂もしくは-NCO；

アルキル_(C₈)、アルケニル_(C₈)、アルキニル_(C₈)、アリール_(C₁₂)、アラルキル_(C₁₂)、ヘテロアリール_(C₈)、ヘテロシクロアルキル_(C₁₂)、アルコキシ_(C₈)、アリールオキシ_(C₁₂)、アシルオキシ_(C₈)、アルキルアミノ_(C₈)、ジアルキルアミノ_(C₈)、アルケニルアミノ_(C₈)、アリールアミノ_(C₈)、アラルキルアミノ_(C₈)、アルキルチオ_(C₈)、アシルチオ_(C₈)、アルキルスルホニルアミノ_(C₈)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョン；

-アルカンジイル_(C₈)-R_b、-アルケンジイル_(C₈)-R_b、もしくはこれらの基のいずれか

の置換バージョン、ここで R_b は

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノもしくはチオ；または

ヘテロアリール_(C 8)、アルコキシ_(C 8)、アルケニルオキシ_(C 8)、アリールオキシ_(C 8)、アラルコキシ_(C 8)、ヘテロアリールオキシ_(C 8)、アシルオキシ_(C 8)、アルキルアミノ_(C 8)、ジアルキルアミノ_(C 8)、アルケニルアミノ_(C 8)、アリールアミノ_(C 8)、アラルキルアミノ_(C 8)、ヘテロアリールアミノ_(C 8)、アルキルスルホニルアミノ_(C 8)、アミド_(C 8)、 $-OC(O)NH-$ アルキル_(C 8)、 $-OC(O)CH_2NHC(O)O-$ t-ブチル、 $-OCH_2-$ アルキルチオ_(C 8)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである；

$-(CH_2)_mC(O)R_c$ 、ここで m は0~6であり、 R_c は

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノ、 $-NHOH$ 、



もしくはチオ；または

アルキル_(C 8)、アルケニル_(C 8)、アルキニル_(C 8)、アリール_(C 8)、アラルキル_(C 8)、ヘテロアリール_(C 8)、ヘテロシクロアルキル_(C 8)、アルコキシ_(C 8)、アルケニルオキシ_(C 8)、アリールオキシ_(C 8)、アラルコキシ_(C 8)、ヘテロアリールオキシ_(C 8)、アシルオキシ_(C 8)、アルキルアミノ_(C 8)、ジアルキルアミノ_(C 8)、アリールアミノ_(C 8)、アルキルスルホニルアミノ_(C 8)、アミド_(C 8)、 $-NH-$ アルコキシ_(C 8)、 $-NH-$ ヘテロシクロアルキル_(C 8)、 $-NHC(NOH)-$ アルキル_(C 8)、 $-NH-$ アミド_(C 8)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである；あるいは

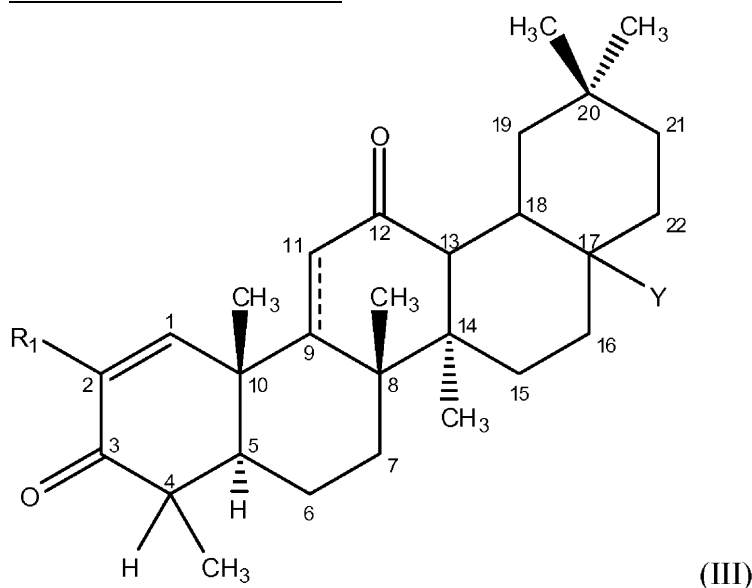
$-NHC(O)R_e$ 、ここで R_e は

水素、ヒドロキシ、アミノ；または

アルキル_(C 8)、アルケニル_(C 8)、アルキニル_(C 8)、アリール_(C 8)、アラルキル_(C 8)、ヘテロアリール_(C 8)、ヘテロシクロアルキル_(C 8)、アルコキシ_(C 8)、アリールオキシ_(C 8)、アラルコキシ_(C 8)、ヘテロアリールオキシ_(C 8)、アシルオキシ_(C 8)、アルキルアミノ_(C 8)、ジアルキルアミノ_(C 8)、アリールアミノ_(C 8)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである。

[本発明1003]

下記式によってさらに定義される本発明1002の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体：



式中、

R_1 は $-H$ 、 $-CN$ 、ハロ、 $-CF_3$ または $-C(O)R_a$ であり、ここで R_a は $-OH$ 、アルコキシ_(C1~4)、 $-NH_2$ 、アルキルアミノ_(C1~4)または $-NH-S(O)_2-$ アルキル_(C1~4)であり；

Y は以下である：

$-H$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $-F$ 、 $-CF_3$ 、 $-NH_2$ もしくは $-NCO$ ；

アルキル_(C₈)、アルケニル_(C₈)、アルキニル_(C₈)、アリール_(C₁₂)、アラルキル_(C₁₂)、ヘテロアリール_(C₈)、ヘテロシクロアルキル_(C₁₂)、アルコキシ_(C₈)、アリーロキシ_(C₁₂)、アシルオキシ_(C₈)、アルキルアミノ_(C₈)、ジアルキルアミノ_(C₈)、アルケニルアミノ_(C₈)、アリールアミノ_(C₈)、アラルキルアミノ_(C₈)、アルキルチオ_(C₈)、アシルチオ_(C₈)、アルキルスルホニルアミノ_(C₈)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョン；

-アルカンジイル_(C₈)-R_b、-アルケンジイル_(C₈)-R_b、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョン、ここでR_bは

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノもしくはチオ；または

ヘテロアリール_(C₈)、アルコキシ_(C₈)、アルケニルオキシ_(C₈)、アリーロキシ_(C₈)、アラルコキシ_(C₈)、ヘテロアリーロキシ_(C₈)、アシルオキシ_(C₈)、アルキルアミノ_(C₈)、ジアルキルアミノ_(C₈)、アルケニルアミノ_(C₈)、アリールアミノ_(C₈)、アラルキルアミノ_(C₈)、ヘテロアリールアミノ_(C₈)、アルキルスルホニルアミノ_(C₈)、アミド_(C₈)、-OC(O)NH-アルキル_(C₈)、-OC(O)CH₂NHC(O)O-t-ブチル、-OCH₂-アルキルチオ_(C₈)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである；

-(CH₂)_mC(O)R_c、ここでmは0~6であり、R_cは

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノ、-NHOH、



もしくはチオ；または

アルキル_(C₈)、アルケニル_(C₈)、アルキニル_(C₈)、アリール_(C₈)、アラルキル_(C₈)、ヘテロアリール_(C₈)、ヘテロシクロアルキル_(C₈)、アルコキシ_(C₈)、アルケニルオキシ_(C₈)、アリーロキシ_(C₈)、アラルコキシ_(C₈)、ヘテロアリーロキシ_(C₈)、アシルオキシ_(C₈)、アルキルアミノ_(C₈)、ジアルキルアミノ_(C₈)、アリールアミノ_(C₈)、アルキルスルホニルアミノ_(C₈)、アミド_(C₈)、-NH-アルコキシ_(C₈)、-NH-ヘテロシクロアルキル_(C₈)、-NHC(NOH)-アルキル_(C₈)、-NH-アミド_(C₈)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである；あるいは

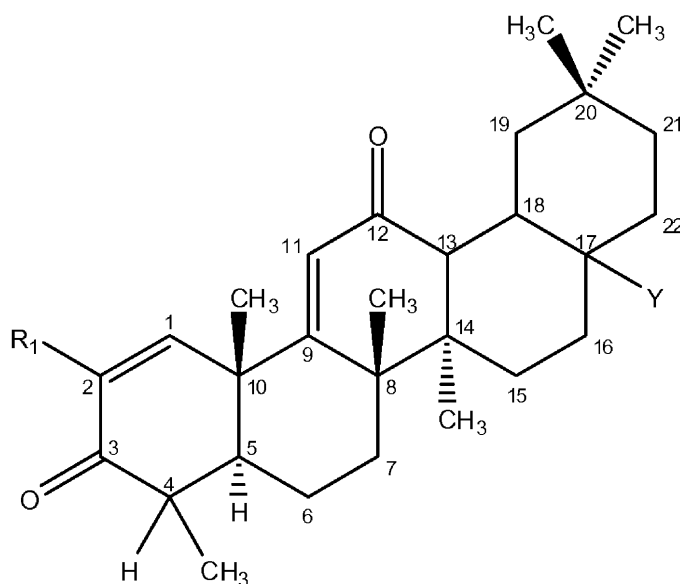
-NHC(O)R_e、ここでR_eは

水素、ヒドロキシ、アミノ；または

アルキル_(C₈)、アルケニル_(C₈)、アルキニル_(C₈)、アリール_(C₈)、アラルキル_(C₈)、ヘテロアリール_(C₈)、ヘテロシクロアルキル_(C₈)、アルコキシ_(C₈)、アリーロキシ_(C₈)、アラルコキシ_(C₈)、ヘテロアリーロキシ_(C₈)、アシルオキシ_(C₈)、アルキルアミノ_(C₈)、ジアルキルアミノ_(C₈)、アリールアミノ_(C₈)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである。

[本発明1004]

下記式によってさらに定義される本発明1003の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体：



(IV)

式中、

R_1 は -H、-CN、ハロ、-CF₃ または -C(O)R_a であり、ここで R_a は -OH、アルコキシ (C₁ ~ 4)、-NH₂、アルキルアミノ (C₁ ~ 4) または -NH-S(O)₂-アルキル (C₁ ~ 4) であり；

Y は以下である：

-H、-OH、-SH、-CN、-F、-CF₃、-NH₂ もしくは -NCO；

アルキル (C₈)、アルケニル (C₈)、アルキニル (C₈)、アリール (C₁₂)、アラルキル (C₁₂)、ヘテロアリール (C₈)、ヘテロシクロアルキル (C₁₂)、アルコキシ (C₈)、アリールオキシ (C₁₂)、アシルオキシ (C₈)、アルキルアミノ (C₈)、ジアルキルアミノ (C₈)、アルケニルアミノ (C₈)、アリールアミノ (C₈)、アラルキルアミノ (C₈)、アミド (C₈)、アルキルチオ (C₈)、アシルチオ (C₈)、アルキルスルホニルアミノ (C₈)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョン；

-アルカンジイル (C₈)-R_b、-アルケンジイル (C₈)-R_b、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョン、ここで R_b は

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノもしくはチオ；または

ヘテロアリール (C₈)、アルコキシ (C₈)、アルケニルオキシ (C₈)、アリールオキシ (C₈)、アラルコキシ (C₈)、ヘテロアリールオキシ (C₈)、アシルオキシ (C₈)、アルキルアミノ (C₈)、ジアルキルアミノ (C₈)、アルケニルアミノ (C₈)、アリールアミノ (C₈)、アラルキルアミノ (C₈)、ヘテロアリールアミノ (C₈)、アルキルスルホニルアミノ (C₈)、アミド (C₈)、-OC(O)NH-アルキル (C₈)、-OC(O)CH₂NHC(O)O-t-ブチル、-OCH₂-アルキルチオ (C₈)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである；

-(CH₂)_mC(O)R_c、ここで m は 0 ~ 6 であり、R_c は

水素、ヒドロキシ、ハロ、アミノ、-NHOH、



もしくはチオ；または

アルキル (C₈)、アルケニル (C₈)、アルキニル (C₈)、アリール (C₈)、アラルキル (C₈)、ヘテロアリール (C₈)、ヘテロシクロアルキル (C₈)、アルコキシ (C₈)、アルケニルオキシ (C₈)、アリールオキシ (C₈)、アラルコキシ (C₈)、ヘテロアリールオキシ (C₈)、アシルオキシ (C₈)、アルキルアミノ (C₈)、ジアルキルアミノ (C₈)、アリールアミノ (C₈)、アルキルスルホニルアミノ (C₈)、アミド (C₈)、-NH-アルコキシ (C₈)、-NH-ヘテロシクロアルキル (C₈)、-NHC(NOH)-アルキル (C₈)、-NH-アミド (C₈)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである；あるいは

-NHC(O)R_e、ここで R_e は

水素、ヒドロキシ、アミノ；または

アルキル_(C₁ - 8)、アルケニル_(C₂ - 8)、アルキニル_(C₂ - 8)、アリール_(C₆ - 8)、アラルキル_(C₁ - 8)、ヘテロアリール_(C₁ - 8)、ヘテロシクロアルキル_(C₁ - 8)、アルコキシ_(C₁ - 8)、アリーロキシ_(C₁ - 8)、アラルコキシ_(C₁ - 8)、ヘテロアリーロキシ_(C₁ - 8)、アシルオキシ_(C₁ - 8)、アルキルアミノ_(C₁ - 8)、ジアルキルアミノ_(C₁ - 8)、アリールアミノ_(C₁ - 8)、もしくはこれらの基のいずれかの置換バージョンである。

[本発明1005]

炭素原子1および2の間の結合が二重結合である、本発明1001の化合物。

[本発明1006]

炭素原子1および2の間の結合が単結合である、本発明1001の化合物。

[本発明1007]

炭素原子4および5の間の結合が単結合である、本発明1001～1002および1005～1006のいずれかの化合物。

[本発明1008]

炭素原子4および5の間の結合が二重結合である、本発明1001～1002および1005～1006のいずれかの化合物。

[本発明1009]

炭素原子9および11の間の結合が二重結合である、本発明1001～1003および1005～1008のいずれかの化合物。

[本発明1010]

炭素原子9および11の間の結合が単結合である、本発明1001～1003および1005～1008のいずれかの化合物。

[本発明1011]

X₁がオキソである、本発明1001および1005～1010のいずれかの化合物。

[本発明1012]

X₁が水素である、本発明1001および1005～1010のいずれかの化合物。

[本発明1013]

X₁がヒドロキシである、本発明1001および1005～1010のいずれかの化合物。

[本発明1014]

X₂がオキソである、本発明1001、1005～1010および1012のいずれかの化合物。

[本発明1015]

X₂が水素である、本発明1001および1005～1013のいずれかの化合物。

[本発明1016]

R₁が-CNである、本発明1001～1015のいずれかの化合物。

[本発明1017]

R₁が-C(O)R_aであり、ここでR_aが-OH、アルコキシ_(C₁ - 4)、-NH₂、アルキルアミノ_(C₁ - 4)または-NH-S(O)₂-アルキル_(C₁ - 4)である、本発明1001～1015のいずれかの化合物。

[本発明1018]

R_aが-OHである、本発明1017の化合物。

[本発明1019]

R_aがアルコキシ_(C₁ - 4)である、本発明1017の化合物。

[本発明1020]

R_aがメトキシである、本発明1019の化合物。

[本発明1021]

R_aが-NH₂である、本発明1019の化合物。

[本発明1022]

R₁が-Hである、本発明1001～1015のいずれかの化合物。

[本発明1023]

R₁がハロである、本発明1001～1015のいずれかの化合物。

[本発明1024]

R₁がヨードである、本発明1023の化合物。

[本発明1025]

R_2 が水素である、本発明1001～1002、1005～1007および1009～1024のいずれかの化合物。

[本発明1026]

R_2 が非存在である、本発明1001～1002、1005～1024のいずれかの化合物。

[本発明1027]

R_2' がアルキル $_{(C-8)}$ である、本発明1001および1005～1026のいずれかの化合物。

[本発明1028]

R_2' がメチルである、本発明1027の化合物。

[本発明1029]

R_2' が水素である、本発明1001および1005～1026のいずれかの化合物。

[本発明1030]

R_2' が $=CH_2$ である、本発明1001、1005～1016および1026のいずれかの化合物。

[本発明1031]

R_3 がメチルである、本発明1001および1005～1030のいずれかの化合物。

[本発明1032]

R_4 が水素である、本発明1001および1005～1031のいずれかの化合物。

[本発明1033]

R_4 がメチルである、本発明1001および1005～1031のいずれかの化合物。

[本発明1034]

R_4 がヒドロキシである、本発明1001および1005～1031のいずれかの化合物。

[本発明1035]

Yが $-(CH_2)_mC(O)R_c$ であり、ここでmが0～6であり、 R_c が水素、ヒドロキシ、アミノ、-NH

OH、



、アルキル $_{(C-8)}$ 、アルケニル $_{(C-8)}$ 、アルキニル $_{(C-8)}$ 、アリール $_{(C-8)}$ 、アラルキル $_{(C-8)}$ 、ヘテロアリール $_{(C-8)}$ 、ヘテロシクロアルキル $_{(C-8)}$ 、アルコキシ $_{(C-8)}$ 、アルケニルオキシ $_{(C-8)}$ 、アリールオキシ $_{(C-8)}$ 、アラルコキシ $_{(C-8)}$ 、アシルオキシ $_{(C-8)}$ 、アルキルアミノ $_{(C-8)}$ 、ジアルキルアミノ $_{(C-8)}$ 、アリールアミノ $_{(C-8)}$ 、アルキルスルホニルアミノ $_{(C-8)}$ 、アミド $_{(C-8)}$ 、-NH-アルコキシ $_{(C-8)}$ 、-NH-ヘテロシクロアルキル $_{(C-8)}$ 、-NHC(NOH)-アルキル $_{(C-8)}$ 、-NH-アミド $_{(C-8)}$ 、または水素、ヒドロキシ、アミノおよび-NHOH以外のこれらの基のいずれかの置換バージョンである、本発明1001～1034のいずれかの化合物。

[本発明1036]

R_c がアルコキシ $_{(C-8)}$ である、本発明1035の化合物。

[本発明1037]

R_c がメトキシ、エトキシまたはイソプロポキシである、本発明1036の化合物。

[本発明1038]

R_c がヒドロキシである、本発明1035の化合物。

[本発明1039]

R_c がアミノである、本発明1035の化合物。

[本発明1040]

R_c がアルキルアミノ $_{(C-8)}$ または置換アルキルアミノ $_{(C-8)}$ である、本発明1035の化合物。

[本発明1041]

R_c がメチルアミノ、エチルアミノ、n-ブチルアミノまたは2,2,2-トリフルオロエチルアミノである、本発明1040の化合物。

[本発明1042]

R_c がヘテロアリール $_{(C-8)}$ である、本発明1035の化合物。

[本発明1043]

R_c がイミダゾリルまたはジメチルイミダゾリルである、本発明1042の化合物。

[本発明1044]

R_c が-NHOHまたは-NHOCH₃である、本発明1035の化合物。

[本発明1045]

R_c がヘテロシクロアルキル_(C₈)または置換ヘテロシクロアルキル_(C₈)である、本発明1035の化合物。

[本発明1046]

R_c がN-ピロリジニル、N-モルホリニル、N-ピペリジニルまたはN-アゼチジニルである、本発明1045の化合物。

[本発明1047]

R_c が-NH-ヘテロシクロアルキル_(C₈)である、本発明1035の化合物。

[本発明1048]

R_c が-NH-アミド_(C₈)またはその置換バージョンである、本発明1035の化合物。

[本発明1049]

R_c が-NHNHC(O)H、-NHNHC(O)CH₃または-NHNHC(O)CH₂OCH₃である、本発明1048の化合物。

[本発明1050]

R_c が-NHC(NOH)CH₃である、本発明1035の化合物。

[本発明1051]

mが0である、本発明1001～1050のいずれかの化合物。

[本発明1052]

mが2である、本発明1001～1050のいずれかの化合物。

[本発明1053]

Yが-アルカンジイル_(C₈)-R_bである、本発明1001～1034のいずれかの化合物。

[本発明1054]

Yが-CH₂-R_bである、本発明1053の化合物。

[本発明1055]

R_bがヒドロキシである、本発明1053または1054のいずれかの化合物。

[本発明1056]

R_bがアシルオキシ_(C₈)または置換アシルオキシ_(C₈)である、本発明1053または1054のいずれかの化合物。

[本発明1057]

R_bがアセチルオキシ、トリフルオロアセチルオキシまたは-OC(O)CH₂NH₂である、本発明1056の化合物。

[本発明1058]

R_bがアルコキシ_(C₈)または置換アルコキシ_(C₈)である、本発明1053または1054のいずれかの化合物。

[本発明1059]

R_bがメトキシまたはフルオロメトキシである、本発明1058の化合物。

[本発明1060]

R_bがヘテロアリール_(C₈)である、本発明1053または1054のいずれかの化合物。

[本発明1061]

R_bが-OC(O)NH-アルキル_(C₈)、-OC(O)CH₂NHC(O)O-t-ブチルまたは-OCH₂-アルキルチオ_(C₈)である、本発明1053または1054のいずれかの化合物。

[本発明1062]

Yが-CNである、本発明1001～1034のいずれかの化合物。

[本発明1063]

Yがイソシアネートである、本発明1001～1034のいずれかの化合物。

[本発明1064]

Yがフルオロである、本発明1001～1034のいずれかの化合物。

[本発明1065]

Yがアルキルスルホニルアミノ_(C₈)または置換アルキルスルホニルアミノ_(C₈)である、本発明1001～1034のいずれかの化合物。

[本発明1066]

Yが-NHS(O)₂CH₃または-NHS(O)₂CH₂CF₃である、本発明1065の化合物。

[本発明1067]

Yがヘテロアリール_(C₈)である、本発明1001～1034のいずれかの化合物。

[本発明1068]

Yがオキサジアゾリル、メチルオキサジアゾリルまたはメトキシメチルオキサジアゾリルである、本発明1067の化合物。

[本発明1069]

Yが-NHC(O)R_eであり、ここでR_eが水素、ヒドロキシ、アミノ、アルキル_(C₈)、アリール_(C₈)、アルコキシ_(C₈)、アシルオキシ_(C₈)、アルキルアミノ_(C₈)、ジアルキルアミノ_(C₈)、または水素、ヒドロキシおよびアミノ以外のこれらの基のいずれかの置換バージョンである、本発明1001～1034のいずれかの化合物。

[本発明1070]

R_eが水素である、本発明1069の化合物。

[本発明1071]

R_eがアミノである、本発明1069の化合物。

[本発明1072]

R_eがアルキル_(C₈)または置換アルキル_(C₈)である、本発明1069の化合物。

[本発明1073]

R_eがメチル、エチル、シクロプロピル、シクロブチル、n-ヘキシル、1,1-ジフルオロエチルまたは2,2,2-トリフルオロエチルである、本発明1072の化合物。

[本発明1074]

R_eがアリール_(C₈)である、本発明1069の化合物。

[本発明1075]

R_eがフェニルである、本発明1074の化合物。

[本発明1076]

R_eがアルコキシ_(C₈)である、本発明1069の化合物。

[本発明1077]

R_eがメトキシ、エトキシまたはイソプロポキシである、本発明1076の化合物。

[本発明1078]

R_eがアルキルアミノ_(C₈)またはジアルキルアミノ_(C₈)である、本発明1069の化合物。

[本発明1079]

R_eがメチルアミノ、エチルアミノまたはジメチルアミノである、本発明1078の化合物。

[本発明1080]

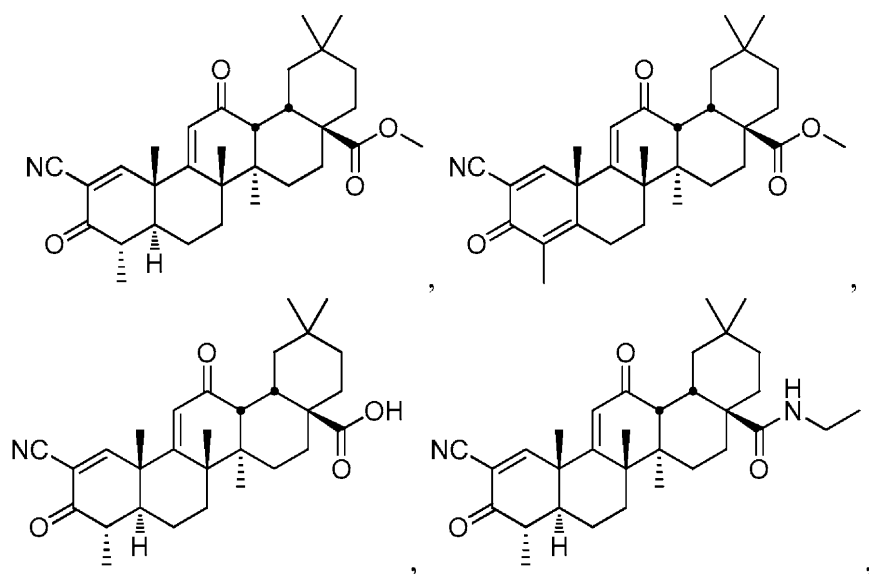
Yが-(CH₂)_mC(O)R_cであり、ここでmが0であり、R_cおよびR₃が一緒になって-O-となる、本発明1001および1005～1034のいずれかの化合物。

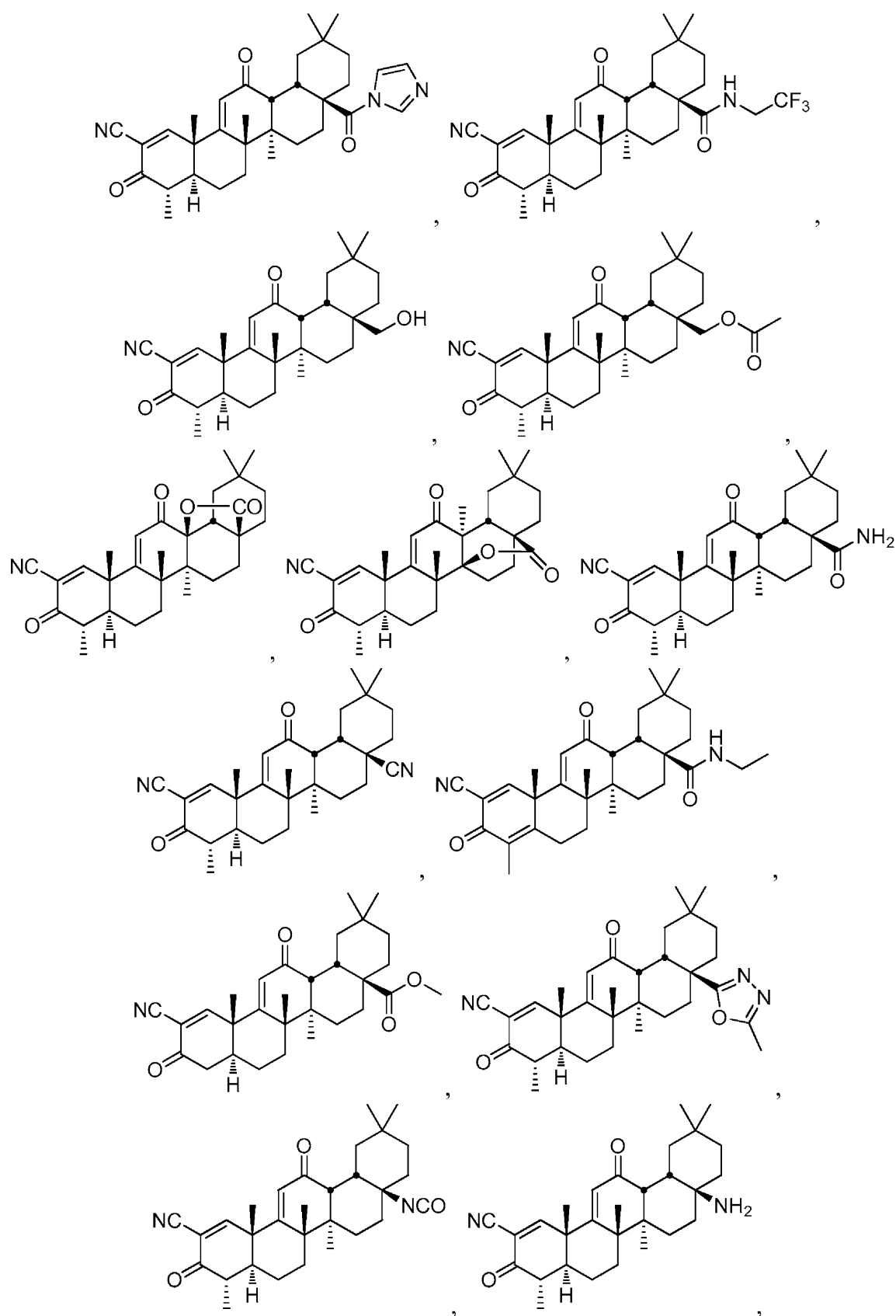
[本発明1081]

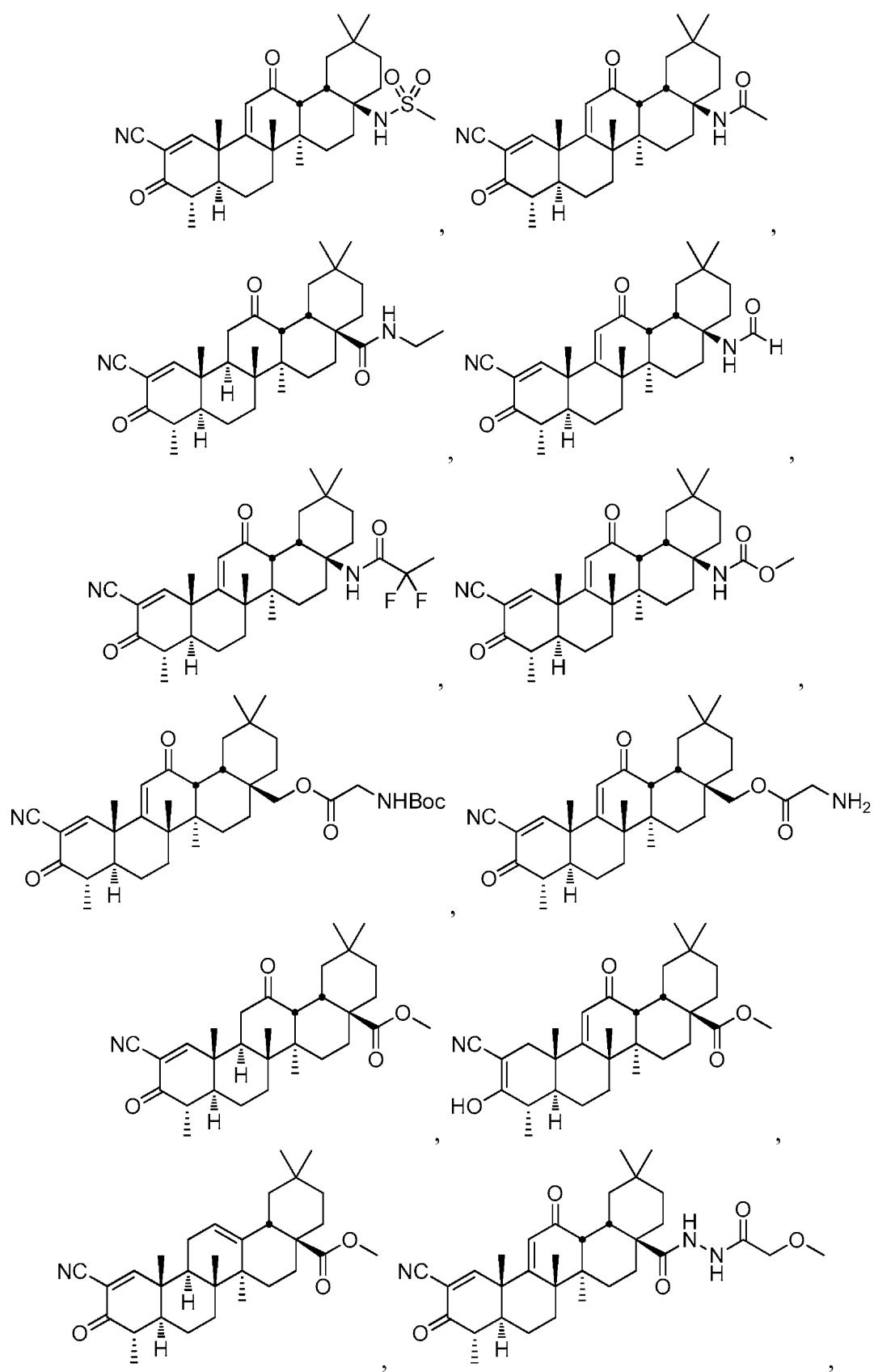
Yが-(CH₂)_mC(O)R_cであり、ここでmが0であり、R_cおよびR₄が一緒になって-O-となる、本発明1001および1005～1034のいずれかの化合物。

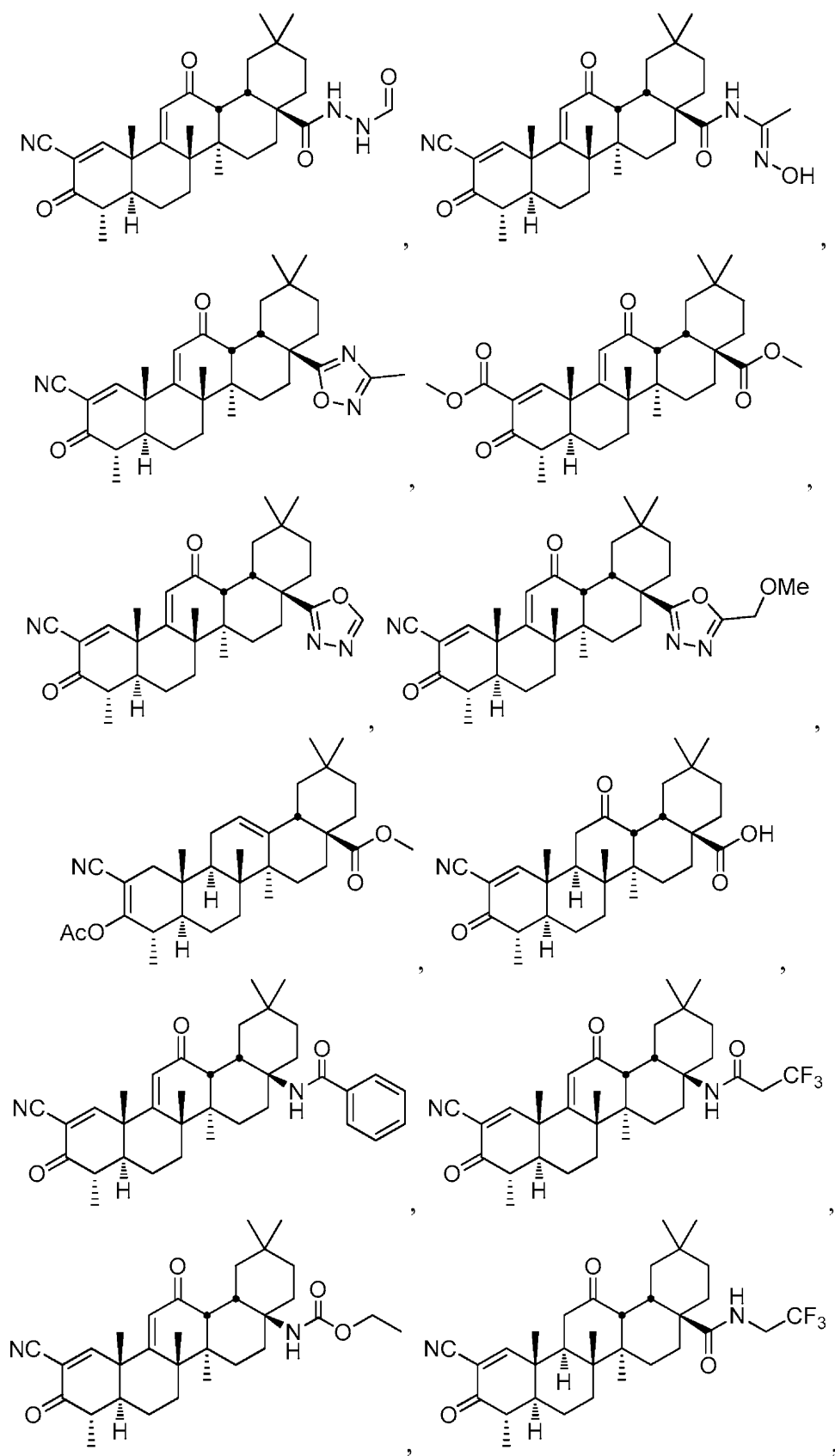
[本発明1082]

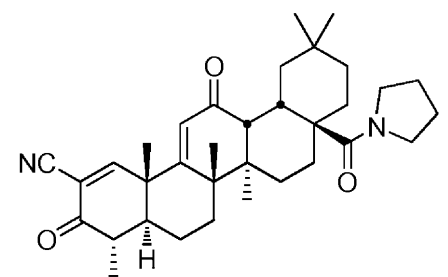
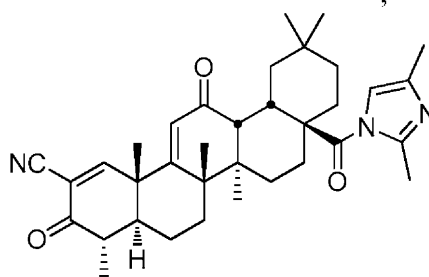
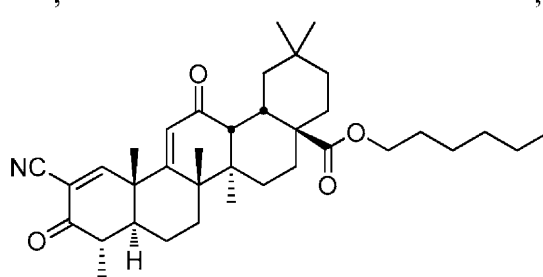
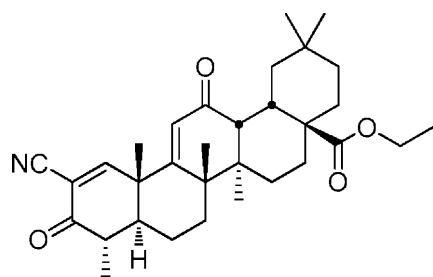
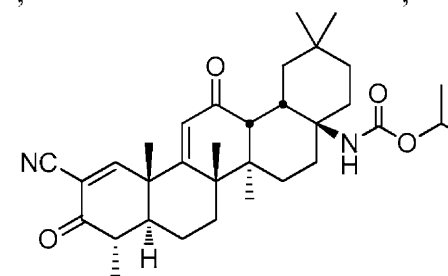
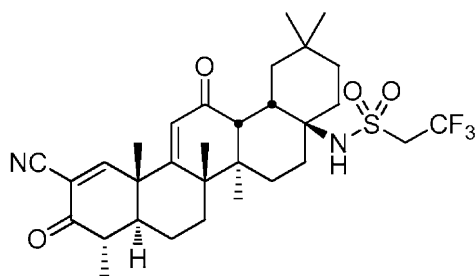
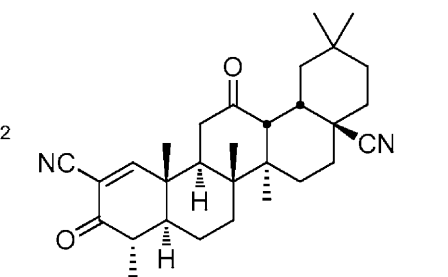
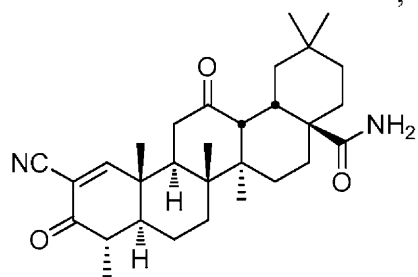
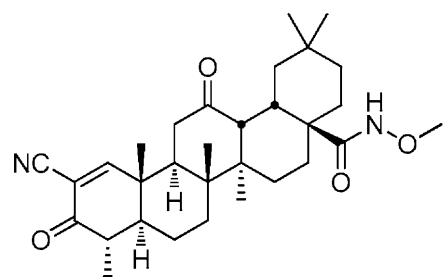
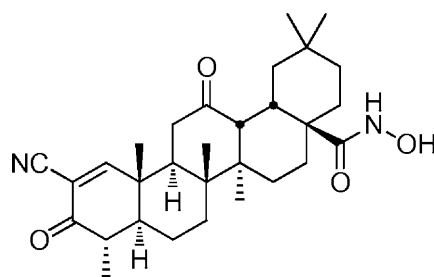
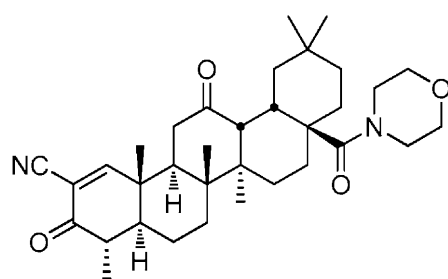
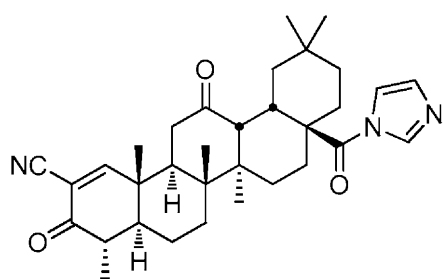
下記式としてさらに定義される本発明1001の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体：

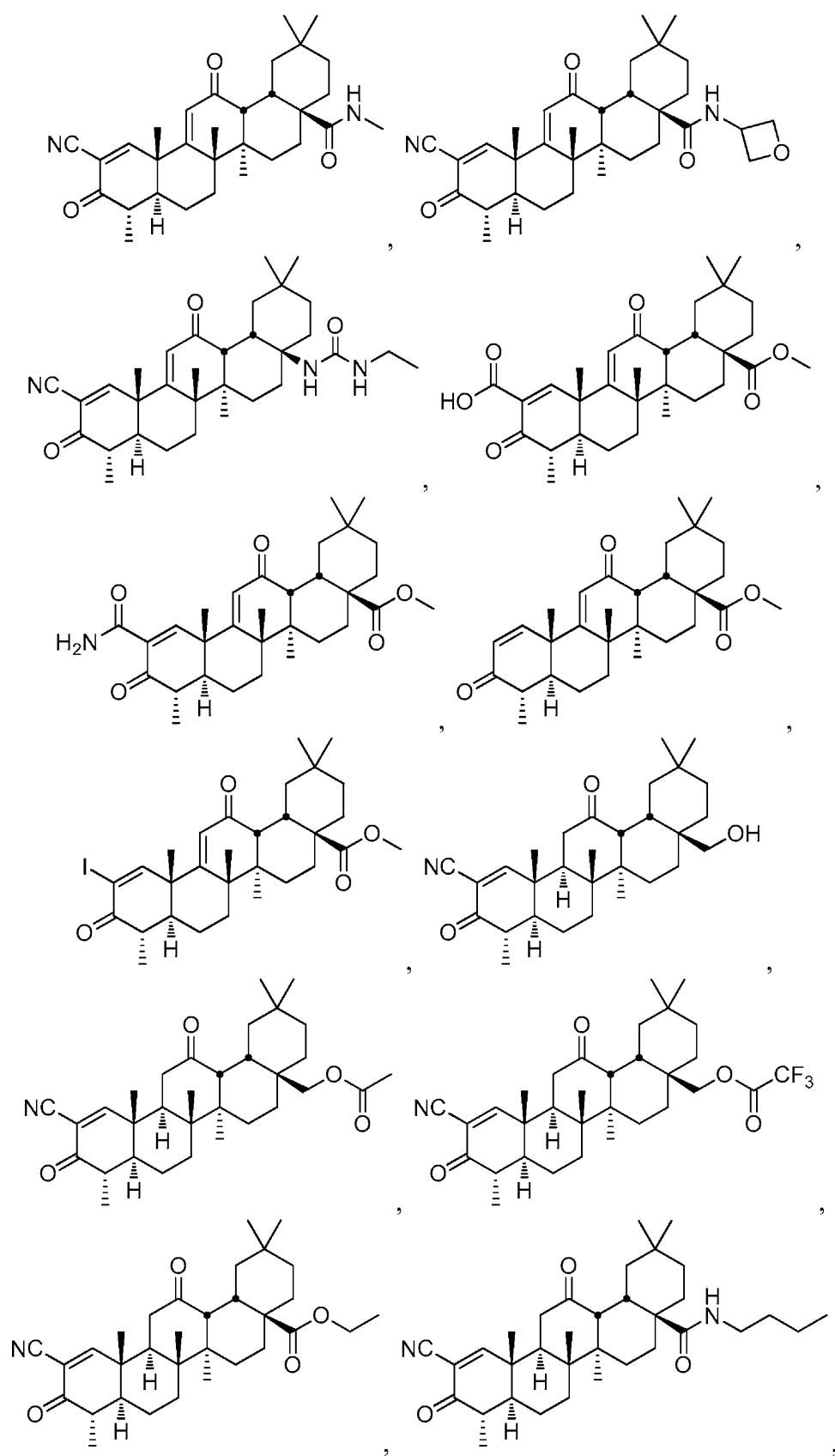


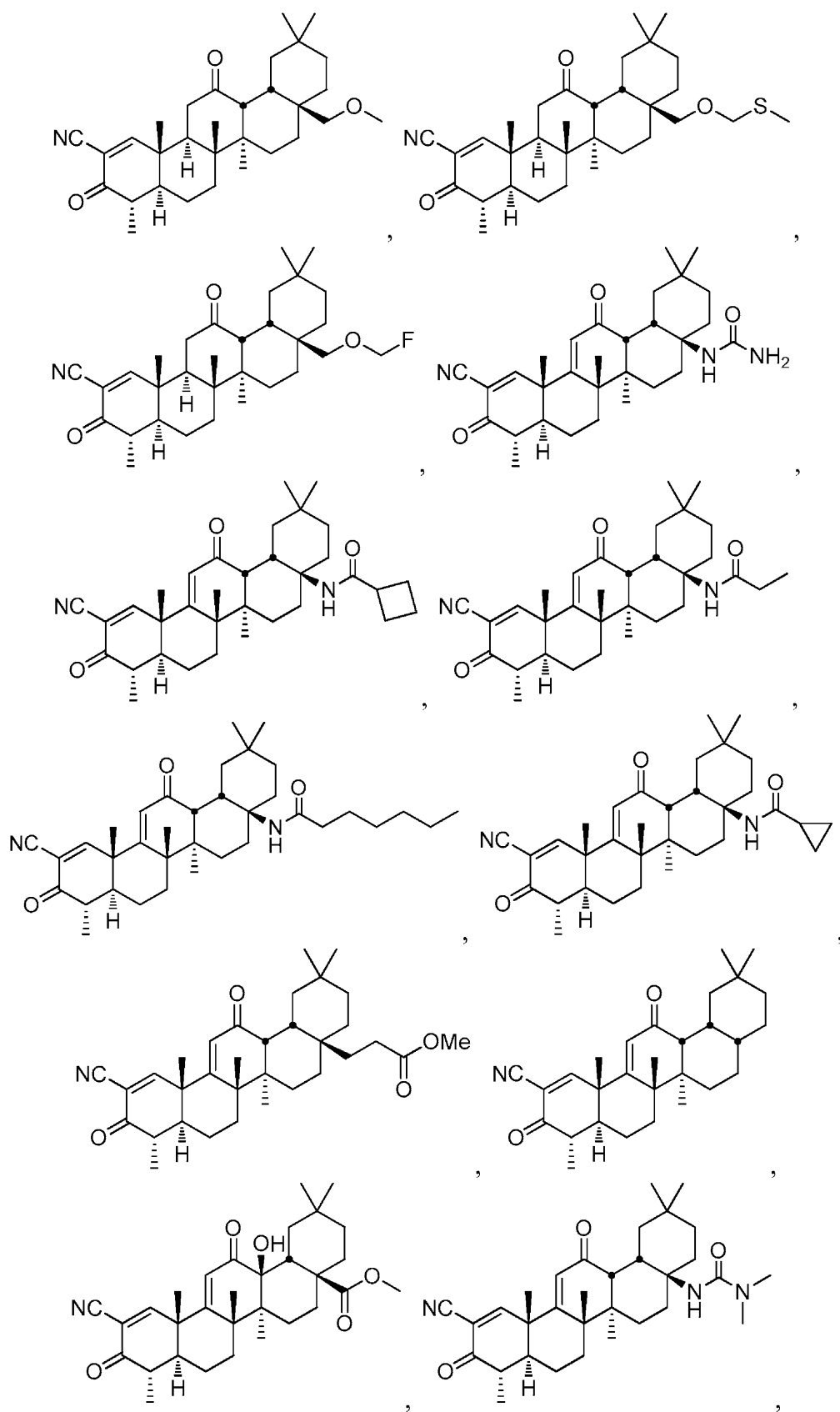


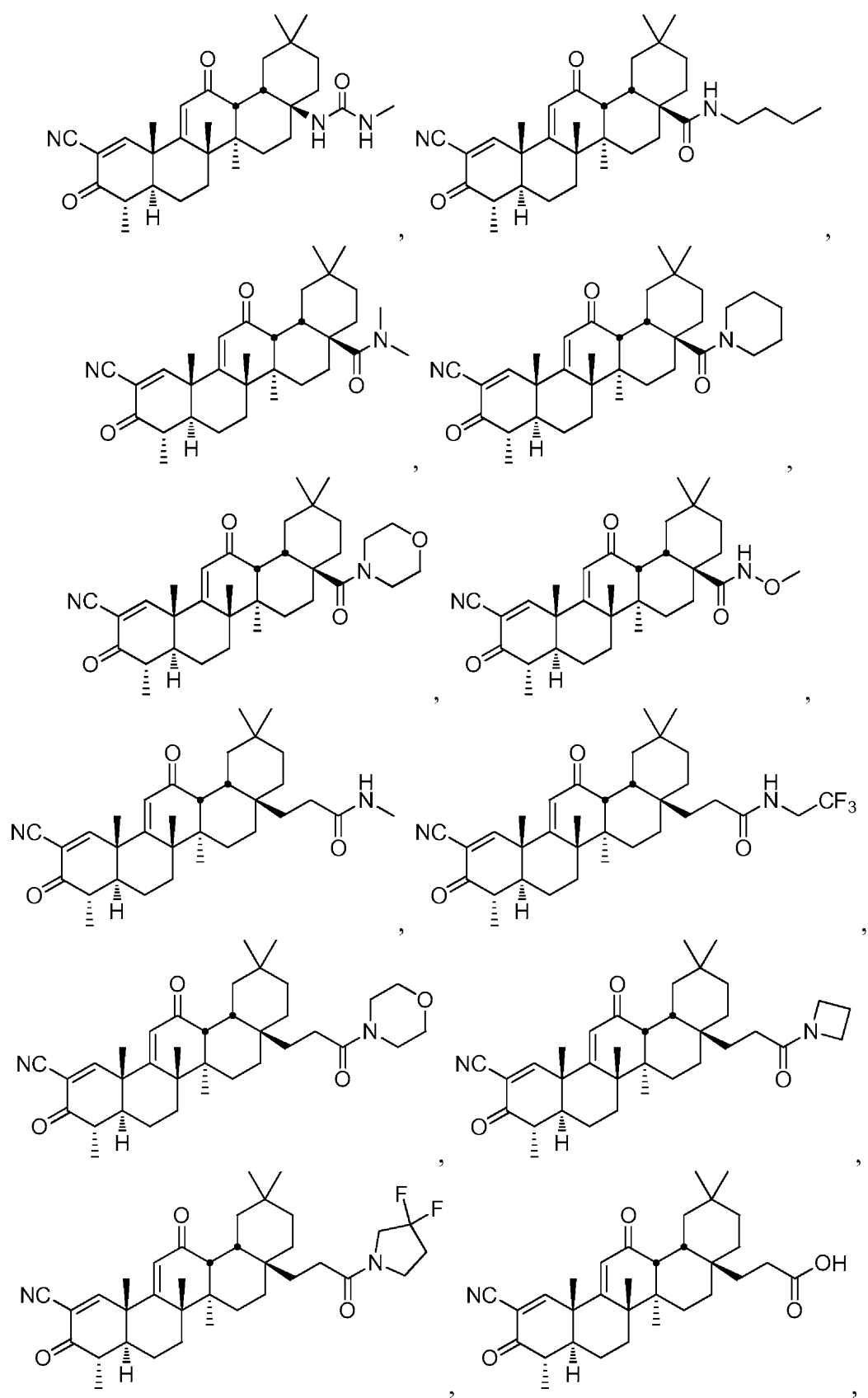


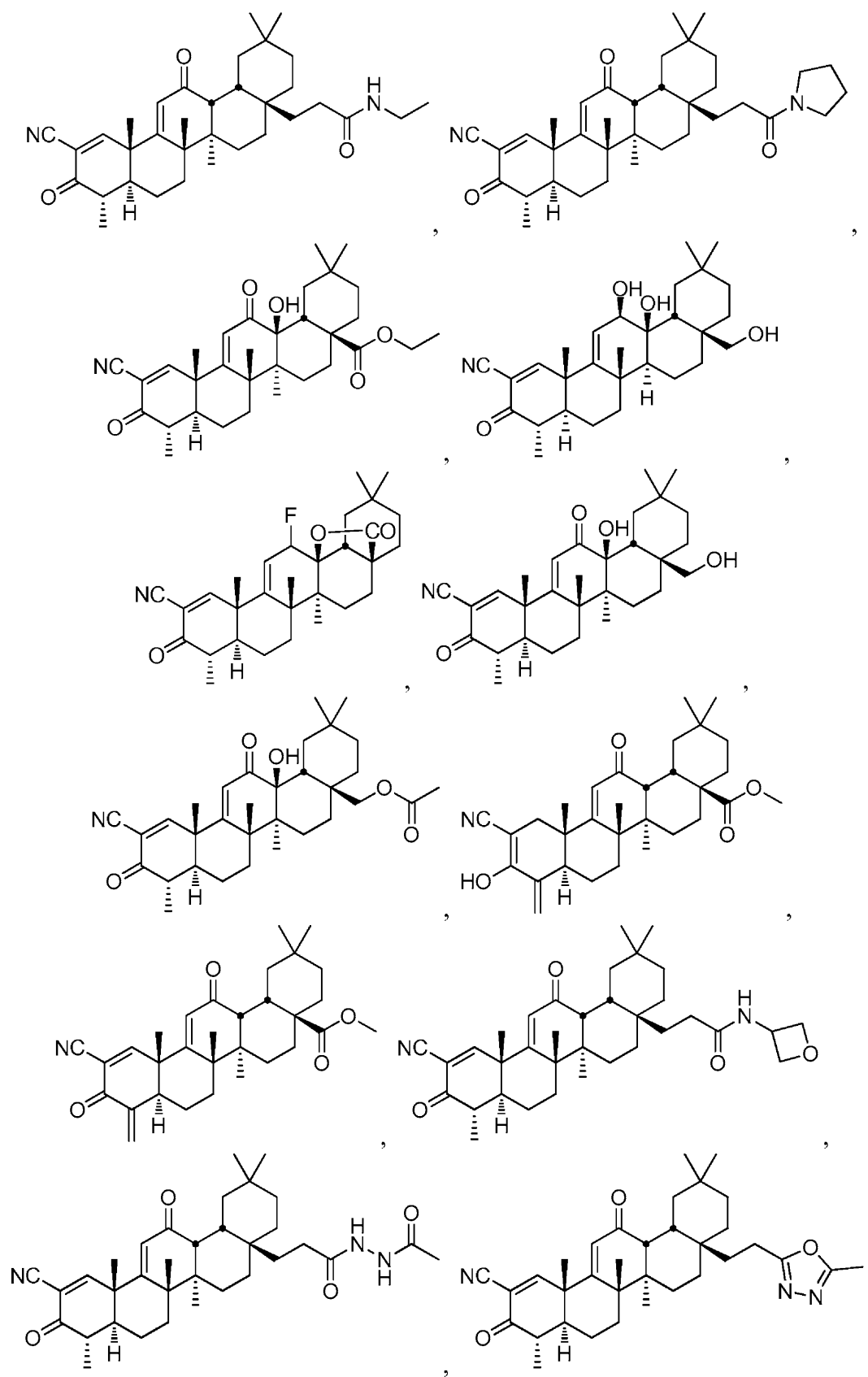


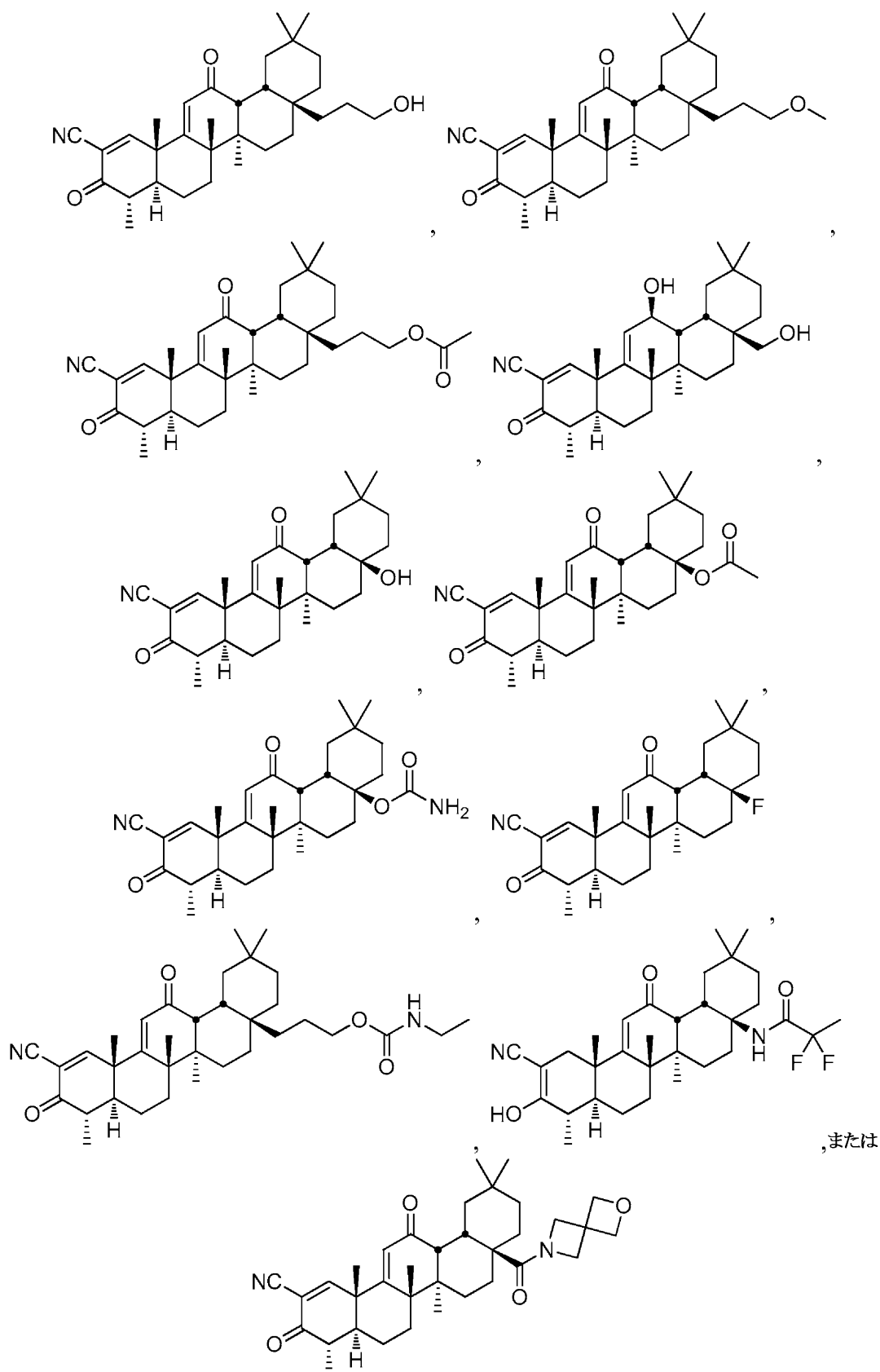












[本発明1083]

a) 本発明1001 ~ 1082のいずれかの化合物; および

b) 賦形剤

を含む、薬学的組成物。

[本発明1084]

それを必要とする患者において疾患または障害を処置および/または予防する方法であ

って、該疾患または障害を処置および/または予防するために十分な量で本発明1001～1082のいずれかの化合物を該患者に投与する段階を含む、方法。

本開示の他の目的、特徴および利点は、以下の詳細な説明から明らかになるであろう。しかし、本発明の真意および範囲内の各種の変更および修正がこの詳細な説明から当業者に明らかになることから、本発明の具体的な態様を示す詳細な説明および具体例が例示のみを目的として示されると理解すべきである。単に特定の化合物が1つの特定の一般式に帰することをもって、それが別の一般式にも属することができないことを意味するわけではないことに留意されたい。