

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成20年3月13日(2008.3.13)

【公表番号】特表2007-529422(P2007-529422A)

【公表日】平成19年10月25日(2007.10.25)

【年通号数】公開・登録公報2007-041

【出願番号】特願2006-551523(P2006-551523)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/381	(2006.01)
A 6 1 K	31/4192	(2006.01)
A 6 1 K	31/423	(2006.01)
A 6 1 K	31/519	(2006.01)
A 6 1 K	31/4155	(2006.01)
A 6 1 K	31/542	(2006.01)
A 6 1 K	31/455	(2006.01)
A 6 1 K	31/404	(2006.01)
C 0 7 D	209/30	(2006.01)
A 6 1 P	31/18	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
C 0 7 D	403/06	(2006.01)
C 0 7 D	263/58	(2006.01)
C 0 7 D	495/04	(2006.01)
C 0 7 D	333/70	(2006.01)
C 0 7 D	409/12	(2006.01)
C 0 7 D	513/04	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/381			
A 6 1 K	31/4192			
A 6 1 K	31/423			
A 6 1 K	31/519			
A 6 1 K	31/4155			
A 6 1 K	31/542			
A 6 1 K	31/455			
A 6 1 K	31/404			
C 0 7 D	209/30			
A 6 1 P	31/18			
A 6 1 P	31/12			
A 6 1 P	43/00	1 1 1		
C 0 7 D	403/06			
C 0 7 D	263/58			
C 0 7 D	495/04	1 0 5 A		
C 0 7 D	333/70			
C 0 7 D	409/12			
C 0 7 D	513/04	3 2 1		

【手続補正書】

【提出日】平成20年1月24日(2008.1.24)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

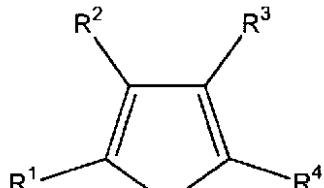
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

被験体におけるHIV媒介性障害を処置するための組成物であつて、該組成物は、式(I)：

【化1】



式(I)

を有する化合物の有効量を含み、

ここで、

R<sup>1</sup>は、H、ハロ、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アラルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>ヘテロシクリル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルキニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニルであるか；またはR<sup>2</sup>およびそれが結合する炭素とともに、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール、またはC<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロアリールを形成し；これらの各々は1～5個のR<sup>5</sup>により必要に応じて置換され得；

R<sup>2</sup>は、H、ハロ、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アラルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>ヘテロシクリル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルキニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニルであるか；またはR<sup>2</sup>およびそれが結合する炭素とともに、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール、またはC<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロアリールを形成し；これらの各々は1～5個のR<sup>6</sup>により必要に応じて置換され得；

R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>の各々は、独立して、H、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アラルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>ヘテロシクリル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルキニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニル、カルボキシ、カルボキシレート、シアノ、ニトロ、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、SO<sub>3</sub>R<sup>9</sup>、スルフェート、S(O)N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、ホスフェート、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキレンジオキシ、アシル、アミド、アミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルアミノカルボニル、アミノカルボニルアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルヒドラジノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルであり；これらの各々は独立して一つ以上のR<sup>7</sup>により置換され；

R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>の各々は、独立して、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>～C<sub>1</sub>

$C_2$  ~  $C_{12}$  アルケニル、オキソ、カルボキシ、カルボキシレート、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1$  ~  $C_6$  アルキルアミノ、 $C_1$  ~  $C_6$  ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、 $S O_3 R^9$ 、スルフェート、 $S(O)N(R^9)_2$ 、 $S(O)_2N(R^9)_2$ 、ホスフェート、 $C_1$  ~  $C_4$  アルキレンジオキシ、アシル、アミド、アミノカルボニル、 $C_1$  ~  $C_6$  アルキルアミノカルボニル、 $C_1$  ~  $C_6$  ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1$  ~  $C_{10}$  アルコキシカルボニル、 $C_1$  ~  $C_{10}$  チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1$  ~  $C_6$  アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1$  ~  $C_6$  ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルであり；

各  $R^7$  は独立して  $C_1$  ~  $C_{10}$  アルキル、 $C_1$  ~  $C_6$  ハロアルキル、アミノカルボニル、 $C_6$  ~  $C_{10}$  アリール、 $C_5$  ~  $C_{10}$  ヘテロアリール、 $C_7$  ~  $C_{12}$  アラルキル、 $C_7$  ~  $C_{12}$  ヘテロアラルキル、 $C_3$  ~  $C_8$  シクロアルキル、 $C_3$  ~  $C_8$  ヘテロシクリル、 $C_2$  ~  $C_{12}$  アルケニル、 $C_2$  ~  $C_{12}$  アルキニル、 $C_5$  ~  $C_{10}$  シクロアルケニル、 $C_5$  ~  $C_{10}$  ヘテロシクロアルケニル、 $C_7$  ~  $C_{12}$  ヘテロシクリルアルキル、 $C_7$  ~  $C_{12}$  シクロアルキルアルキル、 $C_7$  ~  $C_{12}$  ヘテロシクロアルケニルアルキル、または  $C_7$  ~  $C_{12}$  シクロアルケニルアルキルであり；これらの各々は 1 ~ 4 個の  $R^{10}$  により必要に応じて置換され；

$X$  は、 $N R^8$ 、 $O$ 、または  $S$  であり；

$R^8$  は、 $H$ 、 $C_1$  ~  $C_6$  アルキル、 $C_6$  ~  $C_{10}$  アリール、 $C_5$  ~  $C_{10}$  ヘテロアリール、 $C_7$  ~  $C_{12}$  アリールアルキル、 $C_7$  ~  $C_{12}$  ヘテロアリールアルキル、 $C_3$  ~  $C_8$  シクロアルキル、 $C_3$  ~  $C_8$  ヘテロシクリル、 $C_2$  ~  $C_{12}$  アルケニル、 $C_2$  ~  $C_{12}$  アルキニル、 $C_5$  ~  $C_{10}$  シクロアルケニル、 $C_5$  ~  $C_{10}$  ヘテロシクロアルケニル、 $C_7$  ~  $C_{12}$  ヘテロシクリルアルキル、 $C_7$  ~  $C_{12}$  シクロアルキルアルキル、 $C_7$  ~  $C_{12}$  ヘテロシクロアルケニルアルキル、または  $C_7$  ~  $C_{12}$  シクロアルケニルアルキルであり；

$R^9$  は、 $H$  または  $C_1$  ~  $C_6$  アルキルであり；そして

各  $R^{10}$  は、独立してハロ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ニトロ、アミノ、シアノ、アミド、またはアミノカルボニルである、組成物。

#### 【請求項 2】

$R^1$  および  $R^2$  が、ともに、それらが結合する炭素とともに、 $C_5$  ~  $C_{10}$  シクロアルケニル、 $C_5$  ~  $C_{10}$  ヘテロシクロアルケニル、 $C_6$  ~  $C_{10}$  アリール、または  $C_6$  ~  $C_{10}$  ヘテロアリールを形成する、請求項 1 に記載の組成物。

#### 【請求項 3】

$R^1$  および  $R^2$  が、ともに、それらが結合する炭素とともに、 $C_5$  ~  $C_{10}$  シクロアルケニルを形成する、請求項 2 に記載の組成物。

#### 【請求項 4】

$R^1$  および  $R^2$  が、ともに、それらが結合する炭素とともに、 $C_5$  ~  $C_{10}$  シクロアルケニルを形成し、該  $C_5$  ~  $C_{10}$  シクロアルケニルは、1 または 2 個の  $C_1$  ~  $C_6$  アルキルにより必要に応じて置換される、請求項 3 に記載の組成物。

#### 【請求項 5】

$R^1$  および  $R^2$  が、ともに、 $C_1$  ~  $C_6$  アルキルにより置換された  $C_5$  ~  $C_7$  シクロアルケニル環を形成する、請求項 4 に記載の組成物。

#### 【請求項 6】

$R^1$  が、 $C_6$  ~  $C_{10}$  アリール、 $C_5$  ~  $C_{10}$  ヘテロアリール、 $C_7$  ~  $C_{12}$  アラルキル、 $C_7$  ~  $C_{12}$  ヘテロアラルキル、 $C_3$  ~  $C_8$  ヘテロシクリル、 $C_5$  ~  $C_{10}$  シクロアルケニル、または  $C_5$  ~  $C_{10}$  ヘテロシクロアルケニルである、請求項 1 に記載の組成物。

#### 【請求項 7】

$R^1$  が  $C_6$  ~  $C_{10}$  アリールである、請求項 6 に記載の組成物。

#### 【請求項 8】

$R^2$  が  $H$ 、ハロ、 $C_1$  ~  $C_{10}$  アルキル、または  $C_1$  ~  $C_6$  ハロアルキルである、請求項

1に記載の組成物。

【請求項 9】

$R^3$ が、カルボキシ、シアノ、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルチオイルカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルヒドラジノカルボニル、またはヒドロキシアミノカルボニルである、請求項1に記載の組成物。

【請求項 10】

$R^3$ が、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルヒドラジノカルボニル、またはヒドロキシアミノカルボニルである、請求項9に記載の組成物。

【請求項 11】

$R^3$ が、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、または $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニルである、請求項10に記載の組成物。

【請求項 12】

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

【請求項 13】

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

【請求項 14】

$R^4$ が、アミノまたはアミドである、請求項13に記載の組成物。

【請求項 15】

$R^4$ がアミノカルボニルアルキルである、請求項1に記載の組成物。

【請求項 16】

前記アミノカルボニルアルキルのアミノが、アリール、アリールアルキル、アルキルなどにより置換される、請求項15に記載の組成物。

【請求項 17】

各置換基が独立して、ハロ、ヒドロキシまたはアルコキシによりさらに置換され得る、請求項16に記載の組成物。

【請求項 18】

$R^3$ が、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、または $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニルであり；そして $R^4$ が、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノまたはアミドである、請求項1に記載の組成物。

【請求項 19】

XがSである、請求項1に記載の組成物。

【請求項 20】

XがNR<sup>8</sup>である、請求項1に記載の組成物。

【請求項 21】

$R^8$ が、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_7 \sim C_{10}$ アリールアルキルである、請求項20に記載の組成物。

【請求項 22】

請求項1に記載の組成物であって、

$R^1$ が、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニルまたは $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニルであるか；または $R^2$ およびそれが結合する炭素とともに、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニルを形成し；

$R^2$ が、H、ハロ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであるか；または $R^1$ およびそれが結合する炭素とともに、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニルを形成し；

$R^3$  が、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルヒドラジノカルボニル、またはヒドロキシアミノカルボニルであり；

$R^4$  が、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノまたはアミドであり；そして

$X$  が  $S$  である、組成物。

【請求項 2 3】

請求項 1 に記載の組成物であって、

$R^1$  および  $R^2$  が、それらが結合する炭素とともに、 $C_5 \sim C_{10}$  シクロアルケニルを形成し；

$R^3$  が、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノカルボニル、または  $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノカルボニルであり；

$R^4$  が、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノまたはアミドであり；そして

$X$  が  $S$  である、組成物。

【請求項 2 4】

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

【請求項 2 5】

前記化合物が、S i r T 1 に対して少なくとも 5 倍の選択性を有する、請求項 1 に記載の組成物。

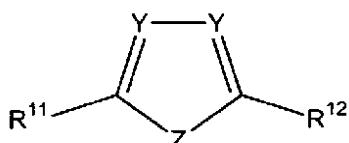
【請求項 2 6】

前記化合物が、S i r T 1 に対して約 1  $\mu M$  未満の  $K_i$  を有する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 2 7】

被験体における H I V 媒介性障害を処置するための組成物であって、該組成物は、式(II)：

【化 2】



式 (II)

を有する化合物の有効量を含む、

ここで、

$R^{11}$  は、H、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシ、 $C_6 \sim C_{10}$  アリール、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$  アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$  ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$  シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロシクロアルケニル、カルボキシ、カルボキシレート、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、 $S O_3 (R^{13})$ 、スルフェート、 $S(O)N(R^{13})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{13})_2$ 、ホスフェート、 $C_1 \sim C_4$  アルキレンジオキシ、アシリル、アミド、アミノカルボニル、アミノカルボニルアルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$  アルコキカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$  チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニル

ニルであり；各々がR<sup>1~4</sup>により必要に応じて置換され；

R<sup>1~2</sup>は、H、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1~C<sub>10</sub></sub>アルキル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>ハロアルキル、C<sub>1~C<sub>10</sub></sub>アルコキシ、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>ハロアルコキシ、C<sub>6~C<sub>10</sub></sub>アリール、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロアリール、C<sub>7~C<sub>12</sub></sub>アラルキル、C<sub>7~C<sub>12</sub></sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3~C<sub>8</sub></sub>シクロアルキル、C<sub>3~C<sub>8</sub></sub>ヘテロシクリル、C<sub>2~C<sub>12</sub></sub>アルケニル、C<sub>2~C<sub>1</sub></sub>アルキニル、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>シクロアルケニル、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6~C<sub>10</sub></sub>アリールオキシ、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロアリールオキシ、カルボキシ、カルボキシレート、シアノ、ニトロ、アミノ、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>アルキルアミノ、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、SO<sub>3</sub>(R<sup>3</sup>)、スルフェート、S(O)N(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>、S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>、ホスフェート、C<sub>1~C<sub>4</sub></sub>アルキレンジオキシ、アシル、アミド、アミノカルボニル、アミノカルボニルアルキル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>ジアルキルアミノカルボニル、C<sub>1~C<sub>10</sub></sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1~C<sub>10</sub></sub>チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>アルキルヒドラジノカルボニル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>ジアルキルヒドラジノカルボニル、あるいはヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルであり；各々がR<sup>1~5</sup>と必要に応じて置換され；

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

R<sup>1~4</sup>は、ヒドロキシ、カルボキシ、カルボキシレート、シアノ、ニトロ、アミノ、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>アルキルアミノ、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>ジアルキルアミノ、オキソ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、SO<sub>3</sub>H、スルフェート、S(O)NH<sub>2</sub>、S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、ホスフェート、アシル、アミジル、アミノカルボニル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>ジアルキルアミノカルボニル、C<sub>1~C<sub>10</sub></sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1~C<sub>10</sub></sub>チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>アルキルヒドラジノカルボニル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルであり；

R<sup>1~5</sup>は、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1~C<sub>10</sub></sub>アルキル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>ハロアルキル、C<sub>1~C<sub>10</sub></sub>アルコキシ、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>ハロアルコキシ、C<sub>6~C<sub>10</sub></sub>アリールオキシ、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロアリールオキシ、C<sub>6~C<sub>10</sub></sub>アリール、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロアリール、C<sub>7~C<sub>12</sub></sub>アラルキル、C<sub>7~C<sub>12</sub></sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3~C<sub>8</sub></sub>ヘテロシクリル、C<sub>2~C<sub>12</sub></sub>アルケニル、C<sub>2~C<sub>12</sub></sub>アルキニル、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>シクロアルケニル、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6~C<sub>10</sub></sub>アリールアルコキシまたはC<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロアリールアルコキシであり；

ZはNR<sup>1~6</sup>、OまたはSであり；

各Yは独立してNまたはCR<sup>1~8</sup>であり；

R<sup>1~6</sup>は、H、C<sub>1~C<sub>10</sub></sub>アルキル、C<sub>1~C<sub>6</sub></sub>ハロアルキル、C<sub>6~C<sub>10</sub></sub>アリール、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロアリール、C<sub>7~C<sub>12</sub></sub>アラルキル、C<sub>7~C<sub>12</sub></sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3~C<sub>8</sub></sub>シクロアルキル、C<sub>3~C<sub>8</sub></sub>ヘテロシクリル、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>シクロアルケニル、C<sub>5~C<sub>10</sub></sub>ヘテロシクロアルケニル、C<sub>2~C<sub>12</sub></sub>アルケニル、C<sub>2~C<sub>12</sub></sub>アルキニルであるか；またはR<sup>1~1</sup>またはR<sup>1~2</sup>の一方およびR<sup>1~6</sup>は4~6個の炭素、1~3個の窒素、0~2個の酸素および0~2個の硫黄を含む環状部分を形成し；各々がR<sup>1~7</sup>により必要に応じて置換され；

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

キシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルであり；そして

$R^{1-8}$  は H、ハロまたは  $C_1 \sim C_6$  アルキルである、組成物。

【請求項 28】

$Z$  が  $NR^{1-6}$  である、請求項 27 に記載の組成物。

【請求項 29】

$Z$  が  $NR^{1-6}$  であり、 $R^{1-6}$  が  $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$  アリール、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$  アラルキルまたは  $C_7 \sim C_{12}$  ヘテロアラルキルである、請求項 28 に記載の組成物。

【請求項 30】

$R^{1-6}$  が、1つ以上のハロ、アルキルまたはアルコキシにより置換された  $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_6 \sim C_{10}$  アリール、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$  アラルキルまたは  $C_7 \sim C_{12}$  ヘテロアラルキルである、請求項 29 に記載の組成物。

【請求項 31】

$R^{1-1}$  が、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、 $SO_3(R^{1-3})$ 、スルフェート、 $S(O)N(R^{1-3})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{1-3})_2$  である、請求項 27 に記載の組成物。

【請求項 32】

$R^{1-1}$  が、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシである、請求項 31 に記載の組成物。

【請求項 33】

$R^{1-1}$  が、1つ以上のアシル、アミドアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$  アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$  チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルにより置換されたチオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシである、請求項 32 に記載の組成物。

【請求項 34】

$R^{1-1}$  が、1つ以上のアミド、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノカルボニルまたは  $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノカルボニルにより置換されたチオアルコキシである、請求項 33 に記載の組成物。

【請求項 35】

$R^{1-1}$  が、アミノカルボニルにより置換されたチオアルコキシである、請求項 34 に記載の組成物。

【請求項 36】

$R^{1-2}$  が、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_6 \sim C_{10}$  アリール、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$  アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$  ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$  ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$  シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロシクロアルケニルである、請求項 27 に記載の組成物。

【請求項 37】

$R^{1-2}$  が、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_6 \sim C_{10}$  アリール、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$  アラルキルまたは  $C_7 \sim C_{12}$  ヘテロアラルキルである、請求項 36 に記載の組成物。

【請求項 38】

$R^{1-2}$  が、1つ以上のハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$  アルコキシ、 $C_6 \sim C_{10}$  アリールオキシまたは  $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロアリールオキシにより置換された  $C_1 \sim C_{10}$  アルキルである、請求項 37 に記載の組成物。

【請求項 39】

$R^{1-2}$  が、アリールオキシにより置換された  $C_1 \sim C_{10}$  アルキルである、請求項 38 に

記載の組成物。

【請求項 4 0】

各 Y が N である、請求項 2 7 に記載の組成物。

【請求項 4 1】

請求項 2 7 に記載の組成物であつて、

R<sup>1 1</sup> が、1つ以上のアシル、アミドアミノカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ジアルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>10</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>10</sub> チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルヒドラジノカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルにより置換されたチオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシであり；

R<sup>1 2</sup> が、1つ以上のハロ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>10</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>10</sub> アルコキシ、C<sub>6</sub> ~ C<sub>10</sub> アリールオキシまたはC<sub>5</sub> ~ C<sub>10</sub> ヘテロアリールオキシより置換されたC<sub>1</sub> ~ C<sub>10</sub> アルキルであり；

Z が N R<sup>1 6</sup> であり；

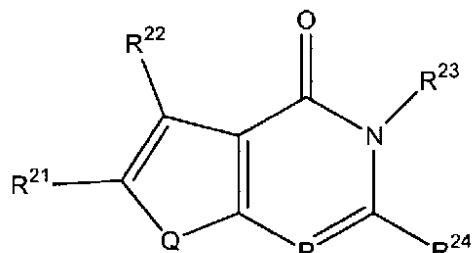
各 Y が N であり；そして

R<sup>1 6</sup> が、1つ以上のハロ、アルキルまたはアルコキシにより置換されたC<sub>1</sub> ~ C<sub>10</sub> アルキル、C<sub>6</sub> ~ C<sub>10</sub> アリール、C<sub>5</sub> ~ C<sub>10</sub> ヘテロアリール、C<sub>7</sub> ~ C<sub>12</sub> アラルキルまたはC<sub>7</sub> ~ C<sub>12</sub> ヘテロアラルキルである、組成物。

【請求項 4 2】

被験体における H I V 媒介性障害を処置するための組成物であつて、該組成物は、式(ⅠⅠ)：

【化 3】



式 (III)

を有する化合物の有効量を含み、

ここで、

R<sup>2 1</sup> は、ハロ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>10</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> ヘテロシクリル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>12</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキニル、C<sub>5</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルケニル、C<sub>5</sub> ~ C<sub>10</sub> ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6</sub> ~ C<sub>10</sub> アリール、C<sub>5</sub> ~ C<sub>10</sub> ヘテロアリール、C<sub>7</sub> ~ C<sub>12</sub> アラルキル、C<sub>7</sub> ~ C<sub>12</sub> ヘテロアラルキルであるか；または R<sup>2 2</sup> およびそれが結合する炭素とともに、C<sub>5</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルケニル、C<sub>5</sub> ~ C<sub>10</sub> ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6</sub> ~ C<sub>10</sub> アリールまたはC<sub>5</sub> ~ C<sub>10</sub> ヘテロアリールを形成し；これらの各々は、1 ~ 5 個の R<sup>2 5</sup> と必要に応じて置換され得；

R<sup>2 2</sup> は、ハロ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>10</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> ヘテロシクリル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>12</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキニル、C<sub>5</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルケニル、C<sub>5</sub> ~ C<sub>10</sub> ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6</sub> ~ C<sub>10</sub> アリール、C<sub>5</sub> ~ C<sub>10</sub> ヘテロアリール、C<sub>7</sub> ~ C<sub>12</sub> アラルキル、C<sub>7</sub> ~ C<sub>12</sub> ヘテロアラルキルであるか；または R<sup>2 1</sup> およびそれが結合する炭素とともに、C<sub>5</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルケニル、C<sub>5</sub> ~ C<sub>10</sub> ヘテロシクロアルケニル、C<sub>6</sub> ~ C<sub>10</sub> アリールまたはC<sub>5</sub> ~ C<sub>10</sub> ヘテロアリールを形成し；これらの各々は 1 ~ 5 個の R<sup>2 6</sup> により必要に応じて置換され；

$R^{2\sim 3}$  は、H、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_6 \sim C_{10}$  アリール、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$  アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$  ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$  シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロシクロアルケニル、カルボキシ、カルボキシレート、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノ、アシリル、 $C_1 \sim C_{10}$  アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$  チオアルコキシカルボニルであり；

$R^{2\sim 4}$  は、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシ、 $C_6 \sim C_{10}$  アリール、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$  アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$  ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$  シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$  アリールオキシ、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロアリールオキシ、カルボキシ、カルボキシレート、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、アシリルまたはアミジルであり；これらの各々は $R^{2\sim 7}$  により必要に応じて置換され；

各 $R^{2\sim 5}$  および $R^{2\sim 6}$  は、H、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシ、 $C_6 \sim C_{10}$  アリール、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$  アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$  ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$  ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$  シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロシクロアルケニル、カルボキシ、カルボキシレート、オキソ、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、 $SO_3H$ 、スルフェート、 $S(O)N(R^{2\sim 8})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{2\sim 8})_2$ 、ホスフェート、 $C_1 \sim C_4$  アルキレンジオキシ、アシリル、アミジル、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$  アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$  チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルであり；

$R^{2\sim 7}$  は、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、カルボキシレート、オキソ、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、 $SO_3H$ 、スルフェート、 $S(O)N(R^{2\sim 8})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{2\sim 8})_2$ 、ホスフェート、 $C_1 \sim C_4$  アルキレンジオキシ、アシリル、アミジル、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$  アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$  チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルであり；

$R^{2\sim 8}$  は、H、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_6 \sim C_{10}$  アリール、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$  アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$  ヘテロアラルキル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルキニルまたは $C_5 \sim C_{10}$  シクロアルケニルであり；

Q は、S、O または NR<sup>2~9</sup> であり；

$R^{2\sim 9}$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_7 \sim C_{12}$  アラルキルまたは $C_7 \sim C_{12}$  ヘテロアラルキルであり；

P は N または CR<sup>3~0</sup> であり；そして

$R^{3\sim 0}$  は H または  $C_1 \sim C_6$  アルキルである、組成物。

#### 【請求項 4 3】

$R^{2\sim 1}$  および $R^{2\sim 2}$  が、それらが結合する炭素とともに、 $C_5 \sim C_{10}$  シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$  アリールまたは $C_5 \sim C_{10}$  ヘテ

ロアリールを形成する、請求項42に記載の組成物。

【請求項44】

$R^{2-1}$ および $R^{2-2}$ が、それらが結合する炭素とともに、 $C_5 \sim C_{10}$ のシクロアルケニルを形成する、請求項43に記載の組成物。

【請求項45】

$R^{2-3}$ が、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノまたはアシルである、請求項42に記載の組成物。

【請求項46】

$R^{2-3}$ が、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_5 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニルまたは $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニルである、請求項45に記載の組成物。

【請求項47】

$R^{2-4}$ が、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリールオキシ、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリールオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、メルカブト、チオアルコキシ、チオアリールオキシまたはチオヘテロアリールオキシである、請求項42に記載の組成物。

【請求項48】

$R^{2-4}$ が、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、チオアルコキシ、チオアリールオキシまたはチオヘテロアリールオキシである、請求項47に記載の組成物。

【請求項49】

$R^{2-4}$ が、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルまたはチオアルコキシであり；そして $R^{2-7}$ が、カルボキシ、カルボキシレート、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、 $SO_3H$ 、スルフェート、 $S(O)N(R^{2-8})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{2-8})_2$ 、ホスフェート、アシル、アミジル、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{10}$ チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルである、請求項48に記載の組成物。

【請求項50】

$R^{2-4}$ が、カルボキシ、カルボキシレート、アミジルまたはアミノカルボニルにより置換された $C_1 \sim C_{10}$ アルキルまたはチオアルコキシである、請求項49に記載の組成物。

【請求項51】

XがSである、請求項42に記載の組成物。

【請求項52】

YがNである、請求項42に記載の組成物。

【請求項53】

請求項42に記載の組成物であって、

$R^{2-1}$ および $R^{2-2}$ が、それらが結合する炭素とともに、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリールまたは $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリールを形成し；

$R^{2-3}$ が、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール、 $C_5 \sim C_{10}$

ヘテロアリール、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アラルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>ヘテロシクリル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>アルキニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニル、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルアミノまたはアシルであり；

R<sup>2～4</sup>が、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、チオアルコキシ、チオアリールオキシまたはチオヘテロアリールオキシであり；

R<sup>2～7</sup>が、カルボキシ、カルボキシレート、シアノ、ニトロ、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルアミノ、SO<sub>3</sub>H、スルフェート、S(O)N(R<sup>2～8</sup>)<sub>2</sub>、S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>2～8</sup>)<sub>2</sub>、ホスフェート、アシル、アミジル、アミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルヒドラジノカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルであり；

QがSであり；そして

PがNである、組成物。

#### 【請求項54】

請求項42に記載の組成物であって、

R<sup>2～1</sup>およびR<sup>2～2</sup>が、それらが結合する炭素とともに、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルケニルまたはC<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルケニルを形成し；

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

R<sup>2～4</sup>が、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、チオアルコキシ、チオアリールオキシまたはチオヘテロアリールオキシであり；

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

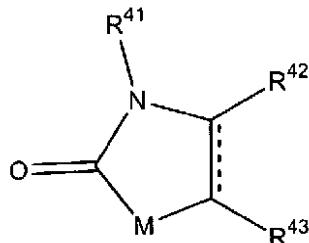
QがSであり；そして

PがNである、組成物。

#### 【請求項55】

被験体においてHIV媒介性障害を処置するための組成物であって、該組成物は、式(IV)：

#### 【化4】



式(IV)

を有する化合物の有効量を含み、

ここで、

R<sup>4～1</sup>は、H、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール、C<sub>5</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロアリール、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アラルキル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>ヘテロアラルキル、C<sub>3</sub>～

$C_8$  シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{1,2}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_1$  アルキニル、 $C_5 \sim C_{1,0}$  シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{1,0}$  ヘテロシクロアルケニル、カルボキシ、カルボキシレート、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノ、アシル、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{1,0}$  アルコキシカルボニルまたは $C_1 \sim C_1$  チオアルコキシカルボニルであり；これらの各々が1個以上の $R^{4,4}$  により必要に応じて置換され；

$R^{4,2}$  および $R^{4,3}$  は、それらが結合する炭素とともに、 $C_5 \sim C_{1,0}$  シクロアルキル、 $C_5 \sim C_{1,0}$  ヘテロシクリル、 $C_5 \sim C_{1,0}$  シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{1,0}$  ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{1,0}$  アリールまたは $C_6 \sim C_{1,0}$  ヘテロアリールであり、これらの各々が1～4個の $R^{4,5}$  により必要に応じて置換され；または

$R^{4,4}$  は、H、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{1,0}$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{1,0}$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシ、 $C_6 \sim C_{1,0}$  アリール、 $C_5 \sim C_{1,0}$  ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{1,2}$  アラルキル、 $C_7 \sim C_{1,2}$  ヘテロアラルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{1,2}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_1$  アルキニル、 $C_5 \sim C_{1,0}$  シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{1,0}$  ヘテロシクロアルケニル、 $C_6 \sim C_{1,0}$  アリールオキシ、 $C_5 \sim C_{1,0}$  ヘテロアリールオキシ、カルボキシ、カルボキシレート、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、 $SO_3H$ 、スルフェート、 $S(O)N(R^{4,6})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{4,6})_2$ 、ホスフェート、 $C_1 \sim C_4$  アルキレンジオキシ、アシル、アミド、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_1$  アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{1,0}$  チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルヒドラジノカルボニル、あるいはヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルであり；

$R^{4,5}$  は、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{1,0}$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{1,0}$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_{1,2}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_1$  アルキニル、オキソ、カルボキシ、カルボキシレート、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノ、メルカプト、チオアルコキシ、チオアリールオキシ、チオヘテロアリールオキシ、 $SO_3H$ 、スルフェート、 $S(O)N(R^{4,6})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{4,6})_2$ 、ホスフェート、 $C_1 \sim C_4$  アルキレンジオキシ、アシル、アミド、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_{1,0}$  アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{1,0}$  チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルヒドラジノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルヒドラジノカルボニル、ヒドロキシアミノカルボニルまたはアルコキシアミノカルボニルであり；

$R^{4,6}$  は、H、 $C_1 \sim C_{1,0}$  アルキル、 $C_6 \sim C_{1,0}$  アリール、 $C_5 \sim C_{1,0}$  ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{1,2}$  アラルキル、 $C_7 \sim C_{1,2}$  ヘテロアラルキル、 $C_2 \sim C_{1,2}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{1,2}$  アルキニルまたは $C_5 \sim C_{1,0}$  シクロアルケニルであり；そして

Mは $NR^{4,7}$ 、SまたはOであり；

$R^{4,7}$  は、H、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_{1,0}$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{1,0}$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_{1,2}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{1,2}$  アルキニル、カルボキシ、カルボキシレート、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノ、アシル、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_1 \sim C_{1,0}$  アルコキシカルボニルである、組成物。

#### 【請求項56】

$R^{4,2}$  および $R^{4,3}$  が、それらが結合する炭素とともに、 $C_6 \sim C_{1,0}$  アリールまたは $C_6 \sim C_{1,0}$  ヘテロアリールを形成する、請求項55に記載の組成物。

#### 【請求項57】

$R^{4-2}$  および  $R^{4-3}$  が、それらが結合する炭素とともに、フェニルを形成する、請求項 5 6 に記載の組成物。

【請求項 5 8】

$R^{4-2}$  および  $R^{4-3}$  が、それらが結合する炭素とともに、フェニルを形成し、かつハロまたは  $C_1 \sim C_{10}$  アルキルにより置換される、請求項 5 7 に記載の組成物。

【請求項 5 9】

$R^{4-1}$  が、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキルであり；そして  $R^{4-4}$  が、H、ハロ、 $C_6 \sim C_{10}$  アリール、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロアリール、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  ヘテロシクリル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルキニル、 $C_5 \sim C_{10}$  シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$  ヘテロシクロアルケニル、アシル、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノ、アミド、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノカルボニル、カルボキシまたは  $C_1 \sim C_{10}$  アルコキシカルボニルである、請求項 5 5 に記載の組成物。

【請求項 6 0】

M が O である、請求項 5 5 に記載の組成物。

【請求項 6 1】

請求項 5 5 に記載の組成物であって、

$R^{4-1}$  が、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキルであり；そして  $R^{4-4}$  が、アシル、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノ、アミド、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  ジアルキルアミノカルボニル、カルボキシまたは  $C_1 \sim C_{10}$  アルコキシカルボニルであり；

$R^{4-2}$  および  $R^{4-3}$  は、それらが結合する炭素とともに、 $C_6 \sim C_{10}$  アリールまたは  $C_6 \sim C_{10}$  ヘテロアリールを形成し；そして

M は O である、組成物。