

【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

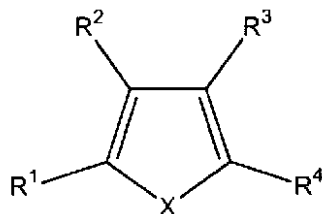
【補正の内容】

【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って、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、

R¹ は、H、ハロ、C₁ ~ C₁₀ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₆ ~ C₁₀ アリール、C₅ ~ C₁₀ ヘテロアリール、C₇ ~ C₁₂ アラルキル、C₇ ~ C₁₂ ヘテロアラルキル、C₃₀₀ ~ C₈ ヘテロシクリル、C₂ ~ C₁₂ アルケニル、C₂ ~ C₁₂ アルキニル、C₅ ~ C₁₀ シクロアルケニル、C₅ ~ C₁₀ ヘテロシクロアルケニルであるか；または R² およびそれが結合する炭素とともに、C₅ ~ C₁₀ シクロアルケニル、C₅ ~ C₁₀ ヘテロシクロアルケニル、C₆ ~ C₁₀ アリール、または C₆ ~ C₁₀ ヘテロアリールを形成し；これらの各々は 1 ~ 5 個の R⁵ により必要に応じて置換され得；

R² は、H、ハロ、C₁ ~ C₁₀ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₆ ~ C₁₀ アリール、C₅ ~ C₁₀ ヘテロアリール、C₇ ~ C₁₂ アラルキル、C₇ ~ C₁₂ ヘテロアラルキル、C₃ ~ C₈ ヘテロシクリル、C₂ ~ C₁₂ アルケニル、C₂ ~ C₁₂ アルキニル、C₅ ~ C₁₀ シクロアルケニル、C₅ ~ C₁₀ ヘテロシクロアルケニルであるか；または R² およびそれが結合する炭素とともに、C₅ ~ C₁₀ シクロアルケニル、C₅ ~ C₁₀ ヘテロシクロアルケニル、C₆ ~ C₁₀ アリール、または C₆ ~ C₁₀ ヘテロアリールを形成し；これらの各々は 1 ~ 5 個の R⁶ により必要に応じて置換され得；

R³ および R⁴ の各々は、独立して、H、ハロ、ヒドロキシ、C₁ ~ C₁₀ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₁ ~ C₁₀ アルコキシ、C₁ ~ C₆ ハロアルコキシ、C₆ ~ C₁₀ アリール、C₅ ~ C₁₀ ヘテロアリール、C₇ ~ C₁₂ アラルキル、C₇ ~ C₁₂ ヘテロアラルキル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₃ ~ C₈ ヘテロシクリル、C₂ ~ C₁₂ アルケニル、C₂ ~ C₁₂ アルキニル、C₅ ~ C₁₀ シクロアルケニル、C₅ ~ C₁₀ 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、C₁ ~ C₆ アルキルアミノ、C₁ ~ C₆ 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、SO₃R⁹、スルフェート、S(O)N(R⁹)₂、S(O)₂N(R⁹)₂、ホスフェート、C₁ ~ C₄ アルキレンジオキシ、アシル、アミド、アミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ 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、C₁ ~ C₁₀ アルコキシカルボニル、C₁ ~ C₁₀ チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルヒドラジノカルボニル、C₁ ~ C₆ 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 R⁷ により置換され；

R⁵ および R⁶ の各々は、独立して、ハロ、ヒドロキシ、C₁ ~ C₁₀ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₁ ~ C₁₀ アルコキシ、C₁ ~ C₆ ハロアルコキシ、C₂ ~ C₁

$_2$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ 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_3R^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、 $C_1 \sim C_4$ アルケンジオキシ、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、 $C_1 \sim C_{10}$ 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であり；

各 R^7 は独立して $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、アミノカルボニル、 $C_6 \sim C_{10}$ 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、 $C_7 \sim C_{12}$ 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、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロシクリルアルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロシクロアルケニルアルキル、または $C_7 \sim C_{12}$ 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、 NR^8 、O、または S であり；

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

R^9 は、H または $C_1 \sim C_6$ 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、 $C_5 \sim C_{10}$ 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 $C_6 \sim C_{10}$ 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、 $C_5 \sim C_{10}$ 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、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニルを形成し、該 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニルは、1 または 2 個の $C_1 \sim C_6$ 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、 $C_1 \sim C_6$ アルキルにより置換された $C_5 \sim C_7$ 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、 $C_6 \sim C_{10}$ 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、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

R^1 が $C_6 \sim C_{10}$ 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、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、または $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルである、請求項

1 に記載の組成物。

【請求項 9】

R³ が、カルボキシ、シアノ、アミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₁₀ アルコキシカルボニル、C₁ ~ C₁₀ アルキルチオイカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルヒドラジノカルボニル、C₁ ~ C₆ 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】

R³ が、アミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルヒドラジノカルボニル、C₁ ~ C₆ 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】

R³ が、アミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノカルボニル、または C₁ ~ C₆ 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】

R³ が、H、チオアルコキシまたはチオアリーロキシである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 13】

R⁴ が、ニトロ、アミノ、C₁ ~ C₆ アルキルアミノ、C₁ ~ C₆ 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】

R⁴ 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】

R⁴ 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】

R³ が、アミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノカルボニル、または C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノカルボニルであり；そして R⁴ が、アミノ、C₁ ~ C₆ アルキルアミノ、C₁ ~ C₆ 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 NR⁸ である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 21】

R⁸ が、H、C₁ ~ C₆ アルキルまたは C₇ ~ C₁₀ 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、

R¹ が、C₆ ~ C₁₀ アリール、C₅ ~ C₁₀ ヘテロアリール、C₇ ~ C₁₂ アラルキル、C₇ ~ C₁₂ ヘテロアラルキル、C₃ ~ C₈ ヘテロシクリル、C₅ ~ C₁₀ シクロアルケニルまたは C₅ ~ C₁₀ ヘテロシクロアルケニルであるか；または R² およびそれが結合する炭素とともに、C₅ ~ C₁₀ シクロアルケニルを形成し；

R² が、H、ハロ、C₁ ~ C₁₀ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキルであるか；または R¹ およびそれが結合する炭素とともに、C₅ ~ C₁₀ 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 23】

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 24】

前記化合物が、非 S i r T 1 サーチインと比較して 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 25】

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。

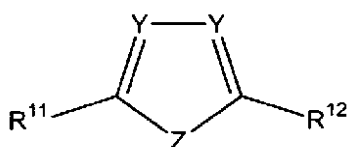
【請求項 26】

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 27】

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 (I)：

【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、 $SO_3(R^{13})$ 、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

ニルであり；各々が R^{14} により必要に応じて置換され；

R^{12} 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、 $C_6 \sim C_{10}$ 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、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、 $SO_3(R^3)$ 、スルフェート、 $S(O)N(R^3)_2$ 、 $S(O)_2N(R^3)_2$ 、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、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、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^{15} と必要に応じて置換され；

R^{13} 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；

R^{14} 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、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ 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_3H 、スルフェート、 $S(O)NH_2$ 、 $S(O)_2NH_2$ 、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り；

R^{15} 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、 $C_6 \sim C_{10}$ アリールオキシ、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリールオキシ、 $C_6 \sim C_{10}$ 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、 $C_6 \sim C_{10}$ アリールアルコキシまたは $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリールアルコキシであり；

Z は NR^{16} 、O または S であり；

各 Y は独立して N または CR^{18} であり；

R^{16} は、H、 $C_1 \sim C_{10}$ 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、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニルであるか；または R^{11} または R^{12} の一方および R^{16} 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^{17} により必要に応じて置換され；

R^{17} は、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、オキソ、メルカプト、チオアルコキシ、 SO_3H 、スルフェート、 $S(O)NH_2$ 、 $S(O)_2NH_2$ 、ホスフェート、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、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ 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；そして

R^{18} 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^{16} である、請求項 27 に記載の 組成物。

【請求項 29】

Z が NR^{16} であり、 R^{16} 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^{16} 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^{11} 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、 $SO_3(R^{13})$ 、スルフェート、 $S(O)N(R^{13})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{13})_2$ である、請求項 27 に記載の 組成物。

【請求項 32】

R^{11} 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^{11} 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^{11} 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^{11} 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^{12} 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^{12} 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^{12} 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^{12} 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 40】

各 Y が N である、請求項 27 に記載の組成物。

【請求項 41】

請求項 27 に記載の組成物であって、

R^{11} 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り；

R^{12} 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より置換された $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；

Z が NR^{16} であり；

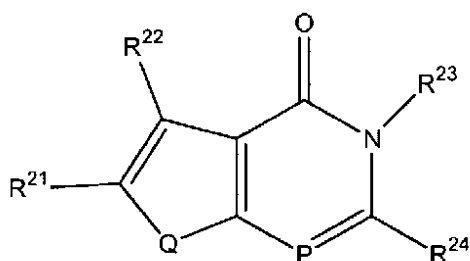
各 Y が N であり；そして

R^{16} 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、組成物。

【請求項 42】

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って、該組成物は、式 (I I)：

【化 3】



式 (III)

を有する化合物の有効量を含み、

ここで、

R^{21} は、ハロ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ 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、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキルであるか；または R^{22} 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、 $C_5 \sim C_{10}$ 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；これらの各々は、1～5個の R^{25} と必要に応じて置換され得；

R^{22} は、ハロ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ 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、 $C_5 \sim C_{10}$ ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{12}$ アラルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ヘテロアラルキルであるか；または R^{21} 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、 $C_5 \sim C_{10}$ 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；これらの各々は1～5個の R^{26} により必要に応じて置換され；

$R^{2\ 3}$ 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；

$R^{2\ 4}$ 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、アシルまたはアミジルであり；これらの各々は $R^{2\ 7}$ により必要に応じて置換され；

各 $R^{2\ 5}$ および $R^{2\ 6}$ 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、 $S(O)N(R^{2\ 8})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{2\ 8})_2$ 、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；

$R^{2\ 7}$ 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、 $S(O)N(R^{2\ 8})_2$ 、 $S(O)_2N(R^{2\ 8})_2$ 、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；

$R^{2\ 8}$ 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 $NR^{2\ 9}$ であり；

$R^{2\ 9}$ 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 $CR^{3\ 0}$ であり；そして

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

【請求項 43】

$R^{2\ 1}$ 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

ロアリールを形成する、請求項 4 2 に記載の組成物。

【請求項 4 4】

$R^{2\ 1}$ 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 4 3 に記載の組成物。

【請求項 4 5】

$R^{2\ 3}$ 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 4 2 に記載の組成物。

【請求項 4 6】

$R^{2\ 3}$ 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 4 5 に記載の組成物。

【請求項 4 7】

$R^{2\ 4}$ 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、メルカプト、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 4 2 に記載の組成物。

【請求項 4 8】

$R^{2\ 4}$ 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 4 7 に記載の組成物。

【請求項 4 9】

$R^{2\ 4}$ 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 4 8 に記載の組成物。

【請求項 5 0】

$R^{2\ 4}$ 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 4 9 に記載の組成物。

【請求項 5 1】

X が S である、請求項 4 2 に記載の組成物。

【請求項 5 2】

Y が N である、請求項 4 2 に記載の組成物。

【請求項 5 3】

請求項 4 2 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、 $C_7 \sim C_{12}$ 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り；

$R^{2,4}$ 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り；

$R^{2,7}$ 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、

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

$R^{2,3}$ が、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ 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、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノまたは $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノであり；

$R^{2,4}$ 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り；

$R^{2,7}$ が、カルボキシ、カルボキシレート、 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 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニルであり；

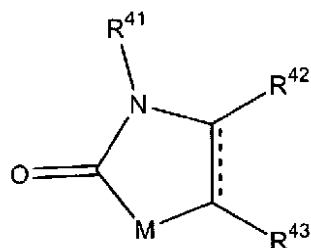
Q が S であり；そして

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 (I V)：

【化 4】



式 (IV)

を有する化合物の有効量を含み、

ここで、

$R^{4,1}$ 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、 $C_3 \sim$

C₈ シクロアルキル、C₃ ~ C₈ ヘテロシクリル、C₂ ~ C₁₂ アルケニル、C₂ ~ C₁₂ アルキニル、C₅ ~ C₁₀ シクロアルケニル、C₅ ~ C₁₀ 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、C₁ ~ C₆ アルキルアミノ、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノ、アシル、アミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₁₀ アルコキシカルボニルまたは C₁ ~ C₁₀ 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、C₅ ~ C₁₀ シクロアルキル、C₅ ~ C₁₀ ヘテロシクリル、C₅ ~ C₁₀ シクロアルケニル、C₅ ~ C₁₀ ヘテロシクロアルケニル、C₆ ~ C₁₀ アリールまたは C₆ ~ C₁₀ 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、C₁ ~ C₁₀ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₁ ~ C₁₀ アルコキシ、C₁ ~ C₆ ハロアルコキシ、C₆ ~ C₁₀ アリール、C₅ ~ C₁₀ ヘテロアリール、C₇ ~ C₁₂ アラルキル、C₇ ~ C₁₂ ヘテロアラルキル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₃ ~ C₈ ヘテロシクリル、C₂ ~ C₁₂ アルケニル、C₂ ~ C₁₂ アルキニル、C₅ ~ C₁₀ シクロアルケニル、C₅ ~ C₁₀ ヘテロシクロアルケニル、C₆ ~ C₁₀ アリールオキシ、C₅ ~ C₁₀ 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、C₁ ~ C₆ アルキルアミノ、C₁ ~ C₆ 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、SO₃H、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、C₁ ~ C₄ アルキレンジオキシ、アシル、アミド、アミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₁₀ アルコキシカルボニル、C₁ ~ C₁₀ チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルヒドラジノカルボニル、C₁ ~ C₆ 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、C₁ ~ C₁₀ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₁ ~ C₁₀ アルコキシ、C₁ ~ C₆ ハロアルコキシ、C₂ ~ C₁₂ アルケニル、C₂ ~ C₁₂ 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、C₁ ~ C₆ アルキルアミノ、C₁ ~ C₆ 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、SO₃H、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、C₁ ~ C₄ アルキレンジオキシ、アシル、アミド、アミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₁₀ アルコキシカルボニル、C₁ ~ C₁₀ チオアルコキシカルボニル、ヒドラジノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルヒドラジノカルボニル、C₁ ~ C₆ 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、C₁ ~ C₁₀ アルキル、C₆ ~ C₁₀ アリール、C₅ ~ C₁₀ ヘテロアリール、C₇ ~ C₁₂ アラルキル、C₇ ~ C₁₂ ヘテロアラルキル、C₂ ~ C₁₂ アルケニル、C₂ ~ C₁₂ アルキニルまたは C₅ ~ C₁₀ 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、C₁ ~ C₁₀ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₁ ~ C₁₀ アルコキシ、C₁ ~ C₆ ハロアルコキシ、C₂ ~ C₁₂ アルケニル、C₂ ~ C₁₂ アルキニル、カルボキシ、カルボキシレート、アミノ、C₁ ~ C₆ アルキルアミノ、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノ、アシル、アミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ ジアルキルアミノカルボニルまたは C₁ ~ C₁₀ 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、C₆ ~ C₁₀ アリールまたは C₆ ~ C₁₀ 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。