

【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6月5日 (2008.6.5)

【公表番号】特表2003-531916(P2003-531916A)

【公表日】平成15年10月28日 (2003.10.28)

【出願番号】特願2001-580936(P2001-580936)

【国際特許分類】

C 07 J 41/00 (2006.01)

A 61 K 31/56 (2006.01)

A 61 K 31/566 (2006.01)

A 61 K 31/57 (2006.01)

A 61 K 31/58 (2006.01)

A 61 P 9/06 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 P 11/06 (2006.01)

A 61 P 17/02 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 31/18 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 37/08 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

C 07 J 43/00 (2006.01)

C 07 J 71/00 (2006.01)

【 F I 】

C 07 J 41/00

A 61 K 31/56

A 61 K 31/566

A 61 K 31/57

A 61 K 31/58

A 61 P 9/06

A 61 P 9/10

A 61 P 11/00

A 61 P 11/06

A 61 P 17/02

A 61 P 29/00

A 61 P 31/18

A 61 P 35/00

A 61 P 37/08

A 61 P 43/00 1 2 3

C 07 J 43/00

C 07 J 71/00

【手続補正書】

【提出日】平成20年4月17日 (2008.4.17)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

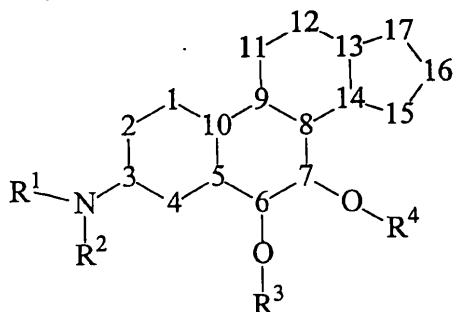
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 単離物または混合物中における、以下の構造式

【化 1】



の化合物ならびにその薬学的に受容可能な塩、溶媒化合物、および立体異性体であって、ここで、各存在において、独立して、

R¹ および R² は、水素、ニトロまたはオキシムを形成するような酸素、アミノ、-S、O₃-R および 1 ~ 30 個の炭素を有しかつ窒素、酸素、リン、ケイ素および硫黄から選択される 1 ~ 6 個のヘテロ原子を必要に応じて含む有機基から選択され、ここで、R² は、数字 3 への直接結合であり得るか、または R¹ および R² は、それらの両方が結合される N と一緒になって、1 ~ 30 個の炭素を有しかつ窒素、酸素およびケイ素から選択される 1 ~ 6 個のヘテロ原子を必要に応じて含む有機基の一部であり得る複素環式構造を形成し得るか、あるいは、R¹ は、数字 2 に対する 2 原子または 3 原子の鎖であり得、その結果 -N-R¹- が環 A に縮合された二環式構造の一部を形成し；

R³ および R⁴ は、カルボニル基を形成するような、それぞれ 6 および 7 への直接結合、水素または、R³ および / もしくは R⁴ が、ヒドロキシル保護基もしくはカルボニル保護基の一部であるような保護基から選択され；

数字 1 ~ 17 は各々、炭素を表し、ここで、数字 1、2、4、11、12、15、16 および 17 の炭素は、独立して、以下の (a) または (b) で置換され得；

(a) = O、= C(R⁵)(R⁵)、= C=C(R⁵)(R⁵)、- C(R⁵)(R⁵)(C(R⁵)(R⁵))_n -、および - (O(C(R⁵)(R⁵))_nO) - のうちの 1 つであり、ここで、n は、1 ~ 6 の範囲であるか；または、

(b) - X、- N(R¹)(R²)、- R⁵ および - OR⁶ から独立して選択されるうちの 2 つ；

そしてここで、数字 5、8、9、10、13 および 14 の炭素は、独立して、- X、- R⁵、- N(R¹)(R²)、または - OR⁶ のうちの 1 つで置換され得；

示されるような - OR³ および - OR⁴ 基に加えて、炭素 6 および 7 の各々は、独立して、- X、- N(R¹)(R²)、- R⁵、または - OR⁶ のうちの 1 つで置換され得；

環 A、B、C、および D の各々は、独立して、完全に飽和か、部分的に飽和か、または完全に不飽和であり；

各存在における R⁵ は、独立して、H、X、ならびにホウ素、ハロゲン、窒素、酸素、ケイ素および硫黄からなる群より選択される少なくとも 1 個のヘテロ原子を必要に応じて含む得る C₁ - C₃₀ の有機部分から選択され；ここで、2 つのジェミナル R⁵ 基は共に、それら両方が結合される炭素原子とともに環を形成し得；

R⁶ は、H または保護基であり、その結果、- OR⁶ は、保護されたヒドロキシル基であり、ここで、ビシナル - OR⁶ 基は、ビシナルヒドロキシル基を保護する環式構造を共に形成し得；そして、ここでジェミナル - OR⁶ 基は共に、カルボニル基を保護する環式構造を形成し得；そして、

X は、フッ化物、塩化物、臭化物およびヨウ化物を表すが；プレグナン - 6, 7 - ジオール - 3 - オン、3 - オキシム、6, 7 - ジアセテート (6, 7)；3 - セミカルバゾニルヘルボール酸；メチルヘルボネート酸の 2, 4 - ジニトロフェニルヒドラゾン；ヘルボール酸 2, 4 - ジニトロフェニルヒドラゾン；およびメチルヘルボリネートの 2, 4

- ジニトロフェニルヒドラゾンを含まない、化合物ならびに薬学的に受容可能な塩、溶媒化合物、立体異性体およびそれらのプロドラッグ。

【請求項 2】 請求項 1 に記載の化合物であって、ここで、

数字 1 ~ 16 の各々は、炭素を表し、ここで数字 1、2、4、11、12、15 および 16 の炭素は、独立して、以下の (a) または (b) で置換され得： (a) = O、= C(R⁵)(R⁵)、= C=C(R⁵)(R⁵)、- C(R⁵)(R⁵)(C(R⁵)(R⁵))_n -、および - (O(C(R⁵)(R⁵))_nO) - のうちの 1 つであり、ここで、n は、1 ~ 6 の範囲であるか；または、

(b) - X、- N(R¹)(R²)、- R⁵ および - OR⁶ から独立して選択されるうちの 2 つ；そして、

数字 17 は、以下の (a) または (b) で置換された炭素を表し：

(a) = C(R^{5a})(R^{5a})、= C=C(R^{5a})(R^{5a})、および - C(R^{5a})(R^{5a})(C(R^{5a})(R^{5a}))_n - のうちの 1 つであり、ここで、n は、1 ~ 6 の範囲であるか；または、

(b) - X、- N(R¹)(R²)、および - R^{5a} から独立して選択されるうちの 2 つ；

ここで、各存在における R^{5a} は、独立して、H、X、ならびにホウ素、ハロゲン、窒素、ケイ素および硫黄からなる群より選択される少なくとも 1 つのヘテロ原子を必要に応じて含み得る C₁₋₃₀ の有機部分から選択され；ここで、2 つのジェミナル R⁵ 基は共に、それら両方が結合される炭素原子とともに環を形成し得る、化合物。

【請求項 3】 各存在における R^{5a} が、独立して、C₁₋₃₀ の炭化水素、C₁₋₃₀ のハロカーボン、C₁₋₃₀ のヒドロハロカーボン、H、および X から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】 各存在における R^{5a} が、独立して、C₁₋₁₀ の炭化水素、C₁₋₁₀ のハロカーボン、C₁₋₁₀ のヒドロハロカーボン、H、および X から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 5】 請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物であって、ここで、R¹ および R² は、水素、ニトロまたはオキシムを形成するような酸素、アミノ、-SO₃-R および 1 ~ 30 個の炭素を有しかつ酸素、リン、ケイ素および硫黄から選択される 1 ~ 6 個のヘテロ原子を必要に応じて含む有機基から選択され、ここで、R² は、数字 3 への直接結合であり得るか、または R¹ および R² は、それらの両方が結合される N と一緒になって、1 ~ 30 個の炭素を有しかつ酸素およびケイ素から選択される 1 ~ 6 個のヘテロ原子を必要に応じて含む有機基の一部であり得る複素環式構造を形成し得るか；あるいは、R¹ は、数字 2 に対する 2 原子または 3 原子の鎖であり得、その結果 -N-R¹- が環 A に縮合された二環式構造の一部を形成する、化合物。

【請求項 6】 請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物であって、ここで、

数字 1、2、4、11、12、15 および 16 の炭素の各々は、該炭素が不飽和結合の一部でない場合、2 個の水素で置換され；

数字 5、8、9 および 14 の炭素の各々は、該炭素が不飽和結合の一部でない場合、1 個の水素で置換され；

数字 10 の炭素は、メチルで置換され；そして、

数字 13 の炭素は、該炭素が不飽和結合の一部でない場合、メチルで置換されている、化合物。

【請求項 7】 請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物であって、ここで、

数字 1、2、4、11、12、15 および 16 の炭素の各々は、2 個の水素で置換され；

数字 5、8、9 および 14 の炭素の各々は、1 個の水素で置換され；

数字 10 の炭素は、メチルで置換され；そして、

数字 13 の炭素は、該炭素が不飽和結合の一部でない場合、メチルで置換されている、化合物。

【請求項 8】 請求項 1 に記載の化合物であって、ここで、

R^1 および R^2 は、水素であり；

R^3 および R^4 は、カルボニル基を形成するような、それぞれ 6 または 7 との直接結合、水素または、 R^3 および / もしくは R^4 が、ヒドロキシル保護基もしくはカルボニル保護基の一部であるような保護基から選択され；示されるような $-OR^3$ および $-OR^4$ 基に加えて、炭素 6 および 7 の各々は、 $-OR^3$ または $-OR^4$ 基がカルボニル基を表すことに起因して除外されない場合、水素で置換され；

数字 1、2、4、11、12、15 および 16 の炭素の各々は、該炭素が不飽和結合の一部でない場合、2 個の水素で置換され；

数字 5、8、9 および 14 の炭素の各々は、該炭素が不飽和結合の一部でない場合、1 個の水素で置換され；

数字 10 の炭素は、メチルで置換され；そして、

数字 13 の炭素は、該炭素が不飽和結合の一部でない場合、メチルで置換され；

数字 17 の炭素は、以下の (a) または (b) で置換され：

(a) = O、= C(R^5)(R^5)、= C = C(R^5)(R^5)、- C(R^5)(R^5)(C(R^5)(R^5))_n -、および - (O(C(R^5)(R^5))_nO) - のうちの 1 つであり、ここで、n は、1 ~ 6 の範囲であるか；または、

(b) - X、- N(R^1)(R^2)、- R^5 および - OR^6 から独立して選択されるうちの 2 つ；

環 A、B、C、および D の各々は、独立して、完全に飽和か、部分的に飽和か、または完全に不飽和であり；

各存在における R^5 は、独立して、H、X、ならびにホウ素、ハロゲン、窒素、酸素、ケイ素および硫黄からなる群より選択される少なくとも 1 つのヘテロ原子を必要に応じて含み得る C_{1-30} の有機部分から選択され；ここで、2 つのジェミナル R^5 基は共に、それら両方が結合される炭素原子とともに環を形成し得；

R^6 は、H、または $-OR^6$ が保護されたヒドロキシル基であるような保護基であり、ここで、ビシナル $-OR^6$ 基は、ビシナルヒドロキシ基を保護する環式構造を共に形成し得、そして、ここでジェミナル $-OR^6$ 基は共に、カルボニル基を保護する環式構造を形成し得；そして、

X は、フッ化物、塩化物、臭化物およびヨウ化物を表す、化合物。

【請求項 9】 請求項 8 に記載の化合物であって、ここで、

R^1 および R^2 は、水素であり；

R^3 および R^4 は、水素、ならびに R^3 および / または R^4 がヒドロキシル保護基の一部であるような保護基から選択され；

数字 1、2、4、11、12、15 および 16 の炭素の各々は、2 個の水素で置換され；

数字 5、8、9 および 14 の炭素の各々は、1 個の水素で置換され；

数字 10 の炭素は、メチルで置換され；そして、

数字 13 の炭素は、該炭素が不飽和結合の一部でない場合、メチルで置換され；

数字 17 の炭素は、以下の (a) または (b) で置換され：

(a) = C(R^5)(R^5)、および = C = C(R^5)(R^5) のうちの 1 つであるか；または、

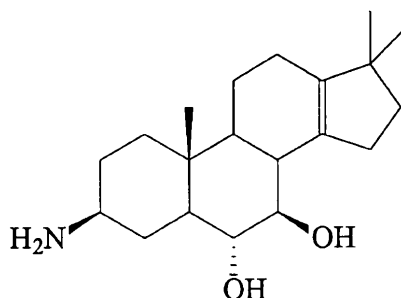
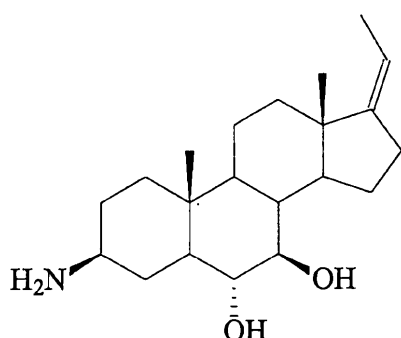
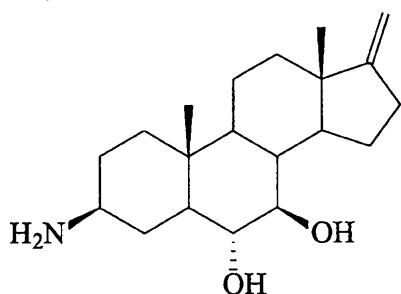
(b) - X、- N(R^1)(R^2)、および - R^5 から独立して選択されるうちの 2 つ；

環 A、B、C、および D の各々は、独立して、完全に飽和か、または部分的に飽和であり；

各存在における R^5 は、独立して、H、X、ならびに、 C_{1-30} の炭化水素、 C_{1-30} のハロカーボンおよび C_{1-30} のヒドロハロカーボンから選択され；そして、

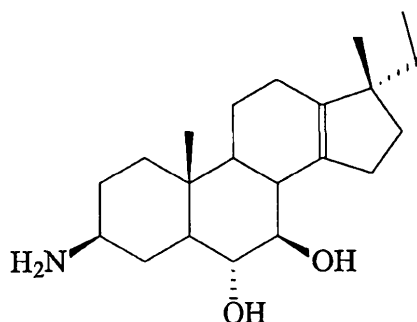
X は、フッ化物、塩化物、臭化物およびヨウ化物を表す、化合物。

【請求項 10】 請求項 9 に記載の化合物であって、ここで、



【請求項 14】 以下の構造式：

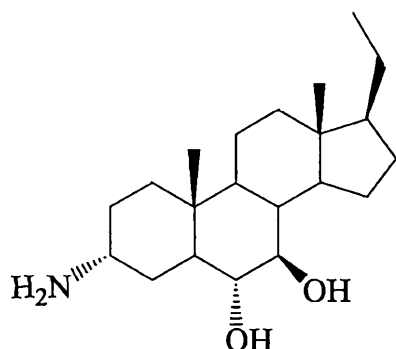
【化 5】



である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 15】 以下の構造式：

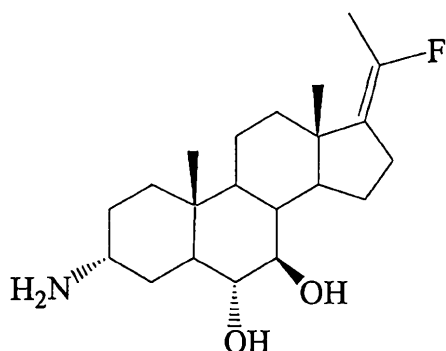
【化 6】



である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 16】 以下の構造式：

【化 7】



である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 17】 請求項 1 に記載の化合物であって、ここで、17 は、 $=C(R^5)$ (R^5) で置換され、そして R^5 は、水素、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル、および $-CO_2-C_{1-6}$ アルキルから選択される、化合物。

【請求項 18】 17 が、 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルで置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 19】 17 が、 $-OR^6$ または $=O$ で置換され、ここで、 R^6 が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

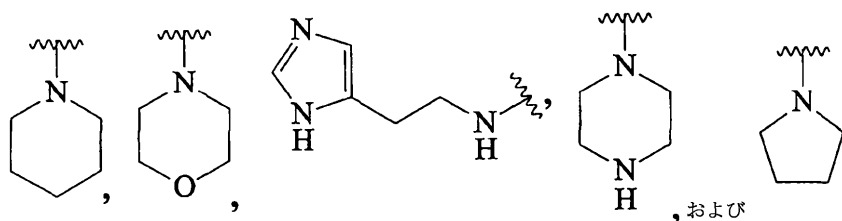
【請求項 20】 R^1 が、 $-C(=O)-R^7$ 、 $-C(=O)NH-R^7$ 、 $-SO_2-R^7$ から選択され；ここで、 R^7 が、アルキル、ヘテロアルキル、アリールおよびヘテロアリールから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 21】 R^7 が C_{1-10} ヒドロカルビルから選択される、請求項 20 に記載の化合物。

【請求項 22】 R^7 がビオチンを含む、請求項 20 に記載の化合物。

【請求項 23】 $(R^1)(R^2)N-$ が、以下：

【化 8】



から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 4】 R^1 が水素であり、そして R^2 が炭素環を含む、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 5】 前記炭素環がフェニルである、請求項 2 4 に記載の化合物。

【請求項 2 6】 R^2 が、3 - メチルフェニル；4 - ヒドロキシフェニル；および 4 - スルホンアミドフェニルから選択される、請求項 2 5 に記載の化合物。

【請求項 2 7】 R^1 が水素であり、そして R^2 が C_{1-10} ヒドロカルビルを含む、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 8】 R^1 が水素であり、そして R^2 がヘテロアルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 9】 請求項 2 8 に記載の化合物であって、ここで、 R^2 は、 C_{1-10} アルキル - W - C_{1-10} アルキレン - であって、ここで W は、O および NH；HO - C_{1-10} アルキレン - から選択されるもの；ならびに HO - C_{1-10} アルキレン - W - C_{1-10} アルキレン - であって、ここで、W は、O および NH から選択されるもの、から選択される、化合物。

【請求項 3 0】 R^1 が水素であり、そして R^2 が $-CH_2-R^7$ であり、ここで R^7 が、アルキル、ヘテロアルキル、アリールおよびヘテロアリールから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3 1】 R^7 が、アルキル - 置換フェニル；ハロゲン - 置換フェニル；アルコキシ - 置換フェニル；アリールオキシ - 置換フェニル；およびニトロ - 置換フェニル；から選択される、請求項 3 0 に記載の化合物。

【請求項 3 2】 R^1 および R^2 の各々が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3 3】 R^3 および R^4 の各々が水素である、請求項 1 または 3 2 に記載の化合物。

【請求項 3 4】 請求項 3 2 または 3 3 に記載の化合物であって、ここで、数字 1 7 の炭素が、以下の (a) または (b) で置換され：

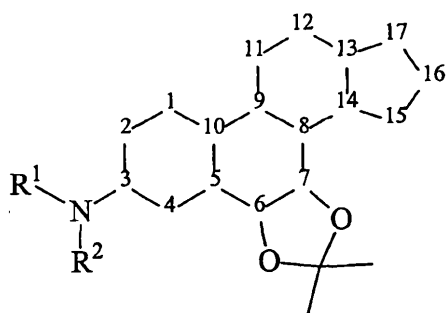
(a) $C(R^{5a})(R^{5a})$ 、 $=C=C(R^{5a})(R^{5a})$ 、および $-C(R^{5a})(R^{5a})(C(R^{5a})(R^{5a}))_n$ - のうちの 1 つであり、ここで、n は、1 ~ 6 の範囲であるか；または、

(b) $-X$ 、 $-N(R^1)(R^2)$ 、および $-R^{5a}$ から独立して選択されるうちの 2 つ；

ここで、各存在における R^{5a} は、独立して、H、X、ならびにホウ素、ハロゲン、窒素、ケイ素および硫黄からなる群より選択される少なくとも 1 つのヘテロ原子を必要に応じて含み得る C_{1-30} の有機部分から選択され；ここで、2 つのジェミナル R^{5a} 基は共に、それら両方が結合される炭素原子とともに環を形成し得る、化合物。

【請求項 3 5】 R^3 および R^4 が共に、以下の構造式：

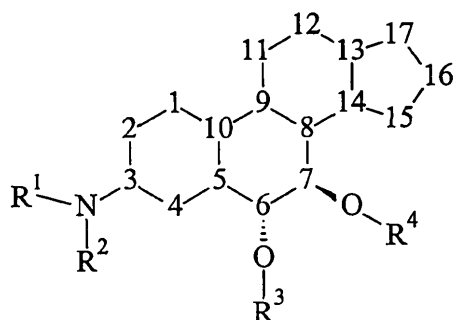
【化 9】



のケタールを形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 36】 -OR³ および -OR⁴ が、以下：

【化 10】



で示される立体化学を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 37】 -N(R¹)(R²) が塩の形態である、請求項 1 に記載の化合物

。

【請求項 38】 -N(R¹)(R²) が、塩の形態であり、かつ該塩がハロゲン塩または酢酸塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 39】 数字 10 および 13 の炭素の少なくとも 1 個がメチルで置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 40】 請求項 1 に記載の化合物であって、R¹ および R² の各々は、独立して、水素ならびに 1 ~ 20 個の炭素を有しかつ窒素、酸素、ケイ素および硫黄から選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を必要に応じて含む有機基から選択される、化合物。

【請求項 41】 請求項 1 に記載の化合物であって、ここで、

R¹ および R² は、独立して、水素、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹ および R¹² から選択され、ここで、R⁸ は、アルキル、ヘテロアルキル、アリールおよびヘテロアリールから選択され；R⁹ は、(R⁸)_r-アルキレン、(R⁸)_r-ヘテロアルキレン、(R⁸)_r-アリーレン、および(R⁸)_r-ヘテロアリーレンから選択され；R¹⁰ は、(R⁹)_r-アルキレン、(R⁹)_r-ヘテロアルキレン、(R⁹)_r-アリーレン、および(R⁹)_r-ヘテロアリーレンから選択され；R¹¹ は、(R¹⁰)_r-アルキレン、(R¹⁰)_r-ヘテロアルキレン、(R¹⁰)_r-アリーレン、および(R¹⁰)_r-ヘテロアリーレンから選択され；R¹² は、(R¹¹)_r-アルキレン、(R¹¹)_r-ヘテロアルキレン、(R¹¹)_r-アリーレン、および(R¹¹)_r-ヘテロアリーレンから選択され、そして、r は、0、1、2、3、4 および 5 から選択され、但し、R¹ および R² は、共通原子と共に環を形成するように、該共通原子と連結され得る、化合物。

【請求項 42】 請求項 1 または 41 に記載の化合物であって、ここで、

R³ および R⁴ は、水素、ならびに R³ および / もしくは R⁴ が、ヒドロキシル保護基の一部であるような保護基から選択され；

数字 1、2、4、11、12、15 および 16 の炭素の各々は、該炭素が不飽和結合の一部でない場合、2 個の水素で置換され；

数字 5、8、9 および 14 の炭素の各々は、該炭素が不飽和結合の一部でない場合、1 個の水素で置換され；

数字 10 の炭素は、メチルで置換され；

数字 13 の炭素は、該炭素が不飽和結合の一部でない場合、メチルで置換され；

数字 17 の炭素は、以下の (a) または (b) で置換され：

(a) = C (R⁵) (R⁵)、および = C = C (R⁵) (R⁵) のうちの 1 つ；または

(b) - R⁵ のうちの 2 つ；

環 A、B、C、および D の各々は、独立して、完全に飽和か、または部分的に飽和であり；そして、

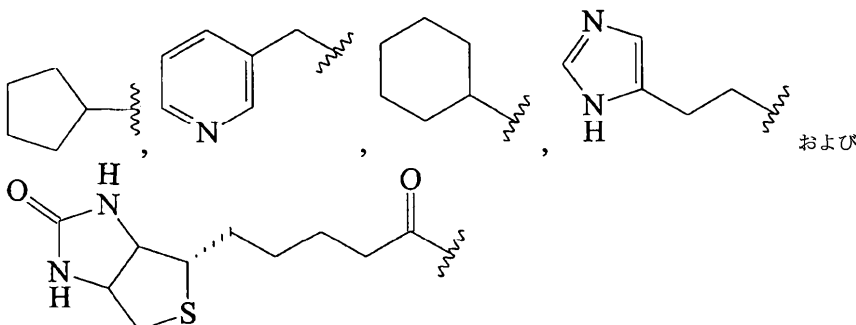
各存在における R⁵ は、独立して、H、および C₁ - C₁₀ の炭化水素から選択される、化合物。

【請求項 43】 請求項 1、4_1 または 4_2 に記載の化合物であって、

R¹ および R² は、独立して、水素、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹ および R¹² から選択され、ここで、R⁸ は、C₁ - C₁₀ のアルキル、1、2 または 3 個のヘテロ原子を含む C₁ - C₁₀ のヘテロアルキル、C₆ - C₁₀ のアリールおよび 1、2 または 3 個のヘテロ原子を含む C₃ - C₅ のヘテロアリールから選択され；R⁹ は、(R⁸)_r - C₁ - C₁₀ のアルキレン、1、2 または 3 個のヘテロ原子を含む (R⁸)_r - C₁ - C₁₀ のヘテロアルキレン、(R⁸)_r - C₆ - C₁₀ のアリーレン、および 1、2 または 3 個のヘテロ原子を含む (R⁸)_r - C₃ - C₅ のヘテロアリーレンから選択され；R¹⁰ は、(R⁹)_r - C₁ - C₁₀ のアルキレン、1、2 または 3 個のヘテロ原子を含む (R⁹)_r - C₁ - C₁₀ のヘテロアルキレン、(R⁹)_r - C₆ - C₁₀ のアリーレン、および 1、2 または 3 個のヘテロ原子を含む (R⁹)_r - C₃ - C₅ のヘテロアリーレンから選択され；R¹¹ は、(R¹⁰)_r - C₁ - C₁₀ のアルキレン、1、2 または 3 個のヘテロ原子を含む (R¹⁰)_r - C₁ - C₁₀ のヘテロアルキレン、(R¹⁰)_r - C₆ - C₁₀ のアリーレン、および 1、2 または 3 個のヘテロ原子を含む (R¹⁰)_r - C₃ - C₅ のヘテロアリーレンから選択され；R¹² は、(R¹¹)_r - C₁ - C₁₀ のアルキレン、1、2 または 3 個のヘテロ原子を含む (R¹¹)_r - C₁ - C₁₀ のヘテロアルキレン、(R¹¹)_r - C₆ - C₁₀ のアリーレン、および 1、2 または 3 個のヘテロ原子を含む (R¹¹)_r - C₃ - C₅ のヘテロアリーレンから選択され、そして、r は、0、1、2、3、4 および 5 から選択され、但し、R¹ および R² は、共通原子と共に環を形成するように、該共通原子と連結され得る、化合物。

【請求項 44】 請求項 1、4_1 または 4_2 に記載の化合物であって、ここで、R¹ および R² は、水素、CH₃ -、CH₃ (CH₂)₂ -、CH₃ (CH₂)₄ -、CH₃ CO -、C₆H₅ CO - (CH₃)₂ CH SO₂ -、C₆H₅ SO₂ -、C₆H₅ NH CO -、CH₃ (CH₂)₂ NH CO -、CH₃ (CH₂)₂ NH (CH₂)₂ -、(CH₃)₂ N (CH₂)₂ -、HOCH₂ CH₂ -、HOCH₂ (CH₂)₄ -、HOCH₂ CH₂ NHCH₂ CH₂ -、3 - (CH₃) C₆H₄ -、4 - (OH) C₆H₄ -、4 - (H₂ NSO₂) C₆H₄ -、4 - ((CH₃)₂ CH) C₆H₄ - CH₂ -、2 - (F) C₆H₄ - CH₂ -、3 - (CF₃) C₆H₄ - CH₂ -、2 - (CH₃ O) C₆H₄ - CH₂ -、4 - (CF₃ O) C₆H₄ - CH₂ -、3 - (C₆H₅ O) C₆H₄ - CH₂ -、3 - (NO₂) C₆H₄ - CH₂ -、

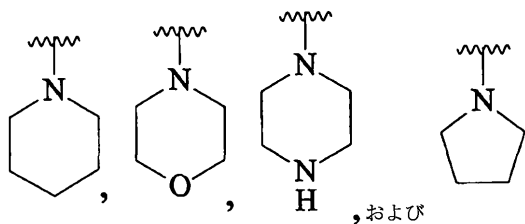
【化 11】



から選択されるか、または、R¹ および R² は、これらの両方が結合する窒素と共に連結

され、そして以下：

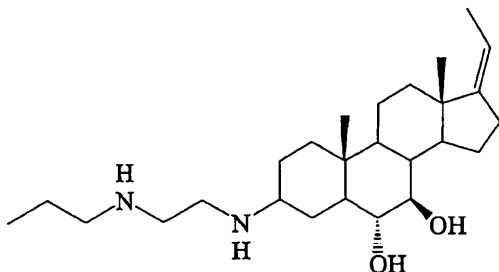
【化 1 2】



から選択される複素環を形成し得る、化合物。

【請求項 4 5】 以下の構造式：

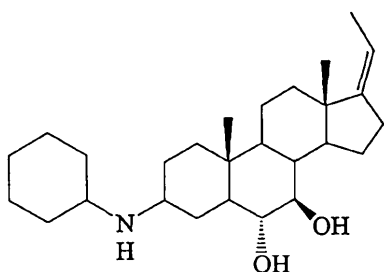
【化 1 3】



である、請求項 1 または 4 1 に記載の化合物。

【請求項 4 6】 以下の構造式：

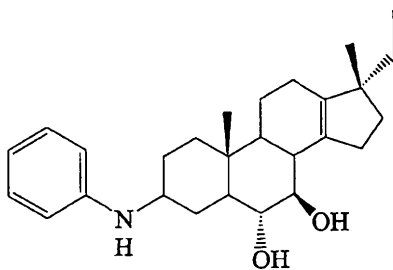
【化 1 4】



である、請求項 1 または 4 1 に記載の化合物。

【請求項 4 7】 以下の構造式：

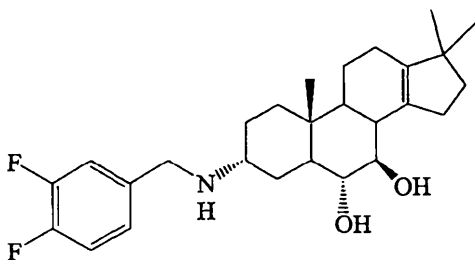
【化 1 5】



である、請求項 1 または 4 1 に記載の化合物。

【請求項 4 8】 以下の構造式：

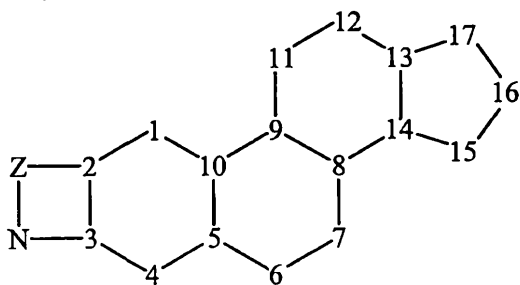
【化 1 6】



である、請求項 1 または 4 1 に記載の化合物。

【請求項 49】 請求項 1 に記載の化合物であって、ここで、 R^1 は、数字 2 に対する 2 原子または 3 原子の鎖であり、その結果、 $-N-R^1-$ は、環 A に縮合する二環式構造の一部を形成し、該化合物は、以下の構造式：

【化 17】

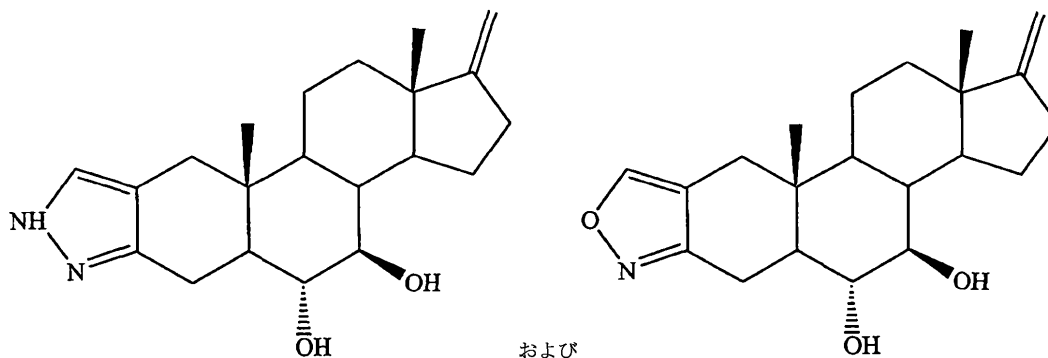


を有し、

ここで、Z は、2 または 3 個の原子を表し、安定な構造を生じる限り、独立して、C、N および O から選択され、そして Z を含む該環は、飽和であるかまたは不飽和であり得る、化合物。

【請求項 50】 以下：

【化 18】



から選択される、請求項 49 に記載の化合物。

【請求項 51】 請求項 1 ~ 50 のいずれか 1 項に記載の化合物の塩酸塩または酢酸塩。

【請求項 52】 請求項 1 ~ 50 のいずれか 1 項に記載の化合物、および薬学的に受容可能なキャリア、賦形剤または希釈剤を含有する、薬学的組成物。

【請求項 53】 炎症を治療的に処置する方法であって、該方法は、該処置を必要とする被験体に請求項 1 ~ 50 のいずれか 1 項に記載の治療学的に有効な量の化合物を投与する工程を包含する、方法。

【請求項 54】 炎症を予防的に処置する方法であって、該方法は、該処置を必要とする被験体に請求項 1 ~ 50 のいずれか 1 項に記載の予防的に有効な量の化合物を投与する工程を包含する、方法。

【請求項 55】 喘息を処置する方法であって、該方法は、該処置を必要とする被験体に請求項 1 ~ 50 のいずれか 1 項に記載の治療学的に有効な量の化合物を投与する工程を包含する、方法。

【請求項 56】 皮膚および眼の適応症を含むがこれらに限定されないアレルギー性疾患を処置する方法であって、該方法は、該処置を必要とする被験体に請求項 1 ~ 50 のいずれか 1 項に記載の治療学的に有効な量の化合物を投与する工程を包含する、方法。

【請求項 57】 慢性閉塞性肺疾患を処置する方法であって、該方法は、該処置を必要とする被験体に請求項 1 ~ 50 のいずれか 1 項に記載の治療学的に有効な量の化合物を投与する工程を包含する、方法。

【請求項 58】 アトピー性皮膚炎を処置する方法であって、該方法は、該処置を必要とする被験体に請求項 1 ~ 50 のいずれか 1 項に記載の治療学的に有効な量の化合物を

投与する工程を包含する、方法。

【請求項 59】 固形腫瘍を処置する方法であって、該方法は、該処置を必要とする被験体に請求項 1 ～ 50 のいずれか 1 項に記載の治療学的に有効な量の化合物を投与する工程を包含する、方法。

【請求項 60】 A I D S を処置する方法であって、該方法は、該処置を必要とする被験体に請求項 1 ～ 50 のいずれか 1 項に記載の治療学的に有効な量の化合物を投与する工程を包含する、方法。

【請求項 61】 虚血性再灌流障害を処置する方法であって、該方法は、該処置を必要とする被験体に請求項 1 ～ 50 のいずれか 1 項に記載の治療学的に有効な量の化合物を投与する工程を包含する、方法。

【請求項 62】 不整脈を処置する方法であって、該方法は、該処置を必要とする被験体に請求項 1 ～ 50 のいずれか 1 項に記載の治療学的に有効な量の化合物を投与する工程を包含する、方法。