

【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19年3月29日(2007.3.29)

【公表番号】特表2003-529537(P2003-529537A)

【公表日】平成15年10月7日(2003.10.7)

【出願番号】特願2000-598503(P2000-598503)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)
A 6 1 K 31/407 (2006.01)
A 6 1 K 31/4745 (2006.01)
A 6 1 K 31/5025 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 11/00 (2006.01)
A 6 1 P 13/08 (2006.01)
A 6 1 P 15/00 (2006.01)
A 6 1 P 17/02 (2006.01)
A 6 1 P 17/06 (2006.01)
A 6 1 P 19/02 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 25/02 (2006.01)
A 6 1 P 25/08 (2006.01)
A 6 1 P 25/14 (2006.01)
A 6 1 P 25/16 (2006.01)
A 6 1 P 25/28 (2006.01)
A 6 1 P 27/02 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 31/18 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/06 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
C 0 7 D 519/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 487/04 1 3 7
 C 0 7 D 487/04 1 4 0
 A 6 1 K 31/407
 A 6 1 K 31/4745
 A 6 1 K 31/5025
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 13/08
 A 6 1 P 15/00
 A 6 1 P 17/02
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 25/02
 A 6 1 P 25/08
 A 6 1 P 25/14
 A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 C 0 7 D 519/00 3 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成19年2月8日(2007.2.8)

【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

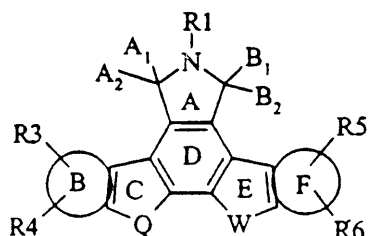
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I:

【化1】



[式中:]

環B及び環Fは独立して、且つそれぞれそれらが結合している炭素原子と一緒に
 なる:

a) 1~3個の炭素原子が窒素原子により置き換えられていることができる不飽和6
 -員炭素環式芳香環;

b) 不飽和5-員炭素環式芳香環;及び

c) 1) 1個の炭素原子が酸素、窒素又は硫黄原子で置き換えられているか;

2) 2個の炭素原子が硫黄及び窒素原子、酸素及び窒素原子又は2個の窒素原子
 で置き換えられているか;あるいは

3) 3個の炭素原子が3個の窒素原子で置き換えられている

不飽和5-員炭素環式芳香環

より成る群から選ばれ、

R¹は:

a) H、1~4個の炭素を有する置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換
 アリール、置換もしくは非置換アリールアルキル、置換もしくは非置換ヘテロアリール又
 は置換もしくは非置換ヘテロアリールアルキル;

b) R⁹がアルキル、アリール及びヘテロアリールより成る群から選ばれる-C(=O)R⁹;

c) R¹⁰がH及び1~4個の炭素を有するアルキルより成る群から選ばれる-OR¹⁰;

d) pが1~4であり;且つ

1) R¹¹及びR¹²がそれぞれ独立してH及び1~4個の炭素を有するアルキル

より成る群から選ばれるか；又は

2) $R^{1\ 1}$ と $R^{1\ 2}$ が一緒になって式 $-(CH_2)_2-X^1-(CH_2)_2-$ の結合基を形成し、ここで X^1 は $-O-$ 、 $-S-$ 及び $-CH_2-$ より成る群から選ばれる $-C(=O)NH_2$ 、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-(CH_2)_pNR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-(CH_2)_pOR^{1\ 0}$ 、 $-O(CH_2)_pOR^{1\ 0}$ 及び $-O(CH_2)_pNR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ より成る群から選ばれ、

R^2 は H、1～4個の炭素を有するアルキル、 $-OH$ 、1～4個の炭素を有するアルコキシ、 $-OC(=O)R^9$ 、 $-OC(=O)NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-O(CH_2)_pNR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-O(CH_2)_pOR^{1\ 0}$ 、6～10個の炭素を有する置換もしくは非置換アリアルアルキル及び置換もしくは非置換ヘテロアリアルアルキルより成る群から選ばれ；

R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 はそれぞれ独立して：

a) H、アリアル、ヘテロアリアル、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 CF_3 、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $-OR^9$ 、 $-O(CH_2)_pNR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-OC(=O)R^9$ 、 $-OC(=O)NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-O(CH_2)_pOR^{1\ 0}$ 、 $-CH_2OR^{1\ 0}$ 、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-NR^{1\ 0}S(=O)_2R^9$ 、 $-NR^{1\ 0}C(=O)R^9$ 、

b) $R^{1\ 4}$ がカルボキシル基のヒドロキシル基が除去された後のアミノ酸の残基である $-CH_2OR^{1\ 4}$ ；

c) $-NR^{1\ 0}C(=O)NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-C(=O)R^2$ 、 $-C(=O)NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-CH=NOR^2$ 、 $-CH=NR^9$ 、 $-(CH_2)_pNR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-(CH_2)_pNHR^{1\ 4}$ 又は $R^{2\ A}$ が R^2 と同じである $-CH=NNR^2R^{2\ A}$ ；

d) y が 0、1 又は 2 である $-S(O)_yR^2$ 、 $-(CH_2)_pS(O)_yR^9$ 、 $-CH_2S(O)_yR^{1\ 4}$ ；

e) 1) それぞれのアルキル、アルケニルもしくはアルキニル基が非置換であるか；あるいは

2) それぞれのアルキル、アルケニルもしくはアルキニル基が 6～10個の炭素を有するアリアル、ヘテロアリアル、アリアルアルコキシ、ヘテロシクロアルコキシ、ヒドロキシルアルコキシ、アルキルオキシ-アルコキシ、ヒドロキシアルキルチオ、アルコキシ-アルキルチオ、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $-OR^9$ 、 $-X^2(CH_2)_pNR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-X^2(CH_2)_pC(=O)NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-X^2(CH_2)_pOC(=O)NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-X^2(CH_2)_pCO_2R^9$ 、 $X^2(CH_2)_pS(O)_yR^9$ 、 $-X^2(CH_2)_pNR^{1\ 0}C(=O)NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-OC(=O)R^9$ 、 $-OCONHR^2$ 、 $-O$ -テトラヒドロピラニル、 $-NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-NR^{1\ 0}CO_2R^9$ 、 $-NR^{1\ 0}C(=O)NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-NHC(=NH)NH_2$ 、 $NR^{1\ 0}C(=O)R^9$ 、 $-NR^{1\ 0}S(O)_2R^9$ 、 $-S(O)_yR^9$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-C(=O)NR^{1\ 1}R^{1\ 2}$ 、 $-C(=O)R^2$ 、 $-CH_2OR^{1\ 0}$ 、 $-CH=NNR^2R^{2\ A}$ 、 $-CH=NOR^2$ 、 $-CH=NR^9$ 、 $-CH=NNHCH(N=NH)NH_2$ 、 $-S(=O)_2NR^2R^{2\ A}$ 、 $-P(=O)(OR^{1\ 0})_2$ 、 $-OR^{1\ 4}$ 及び 5～7個の炭素を有する単糖より成る群から選ばれる 1～3個の基で置換されており、ここで単糖のそれぞれのヒドロキシル基は独立して非置換であるか、又は H、1～4個の炭素を有するアルキル、2～5個の炭素を有するアルキルカルボニルオキシもしくは 1～4個の炭素を有するアルコキシで置き換えられており；

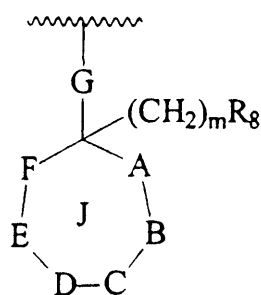
X^2 は O、S 又は $NR^{1\ 0}$ である；

1～8個の炭素を有するアルキル、2～8個の炭素を有するアルケニル及び 2～8個の炭素を有するアルキニル

より成る群から選ばれ；

R^7 は

【化 2】



であり、

ここで：

mは0～4であり；

Gは結合；又は1～4個の炭素を有するアルキレンであり、ここでアルキレン基は非置換であるか、又は $\text{NR}^{11A}\text{R}^{12A}$ もしくは OR^{19} で置換されており；

R^{11A} 及び R^{12A} は R^{11} 及び R^{12} と同じであり；

R^{19} はH、アルキル、アシル及び $\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{11A}\text{R}^{12A}$ より成る群から選ばれ；

R^8 は $\text{O}(\text{C}=\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ 、 $-\text{CN}$ 、アシルオキシ、アルケニル、 $-\text{O}-\text{C}\text{H}_2-\text{O}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-\text{CH}_3$ 、ハロゲン及び R^{1A} より成る群から選ばれ、ここで R^{1A} は R^1 と同じであり；

A及びBは独立してO、N、S、 CHR^{17} 、 $\text{C}(\text{OH})\text{R}^{17}$ 、 $\text{C}(=\text{O})$ 及び $\text{C}\text{H}_2=\text{C}$ より成る群から選ばれるか；あるいはAとBは一緒になって $-\text{CH}=\text{CH}-$ を形成することができ；

C及びDは独立して結合、O、N、S、 CHR^{17} 、 $\text{C}(\text{OH})\text{R}^{17}$ 、 $\text{C}(=\text{O})$ 及び $\text{C}\text{H}_2=\text{C}$ より成る群から選ばれ；

E及びFは独立して結合、O、N、S、 $\text{C}(=\text{O})$ 及び $\text{CH}(\text{R}^{17})$ より成る群から選ばれ；

R^{17} はH、置換もしくは非置換アルキル、アルコキシカルボニル及び置換もしくは非置換アルコキシより成る群から選ばれ；

ここで：

1) 環Jは0～3個の環複素原子を含有し；

2) 環Jのいずれか2個の隣接ヒドロキシル基はジオキソラン環において結合していることができ；

3) 環Jのいずれか2個の隣接環炭素原子は結合して縮合アリールもしくはヘテロアリール環を形成することができ；

4) 環Jのいずれか2個の隣接環窒素原子は結合して縮合複素環式環を形成することができ、それは1～3個のアルキルもしくはアリール基で置換されていることができ；

但し：

1) A、B、C、D、E又はFの一つは少なくとも1個の飽和している炭素原子を含有し；

2) 環Jは2個の隣接環O原子を含有せず；

3) 環Jは最高で2個の環 $\text{C}(=\text{O})$ 基を含有し；

4) Gが結合である場合、B、C、D及びEはそれぞれZがアルキル又はアルキル-OHである場合の-OZ置換基を有さず；

QはO、S、 NR^{13} 、 R^{7A} が R^7 と同じである NR^{7A} 、 CHR^{15} 、 $\text{X}^3\text{CH}(\text{R}^{15})$ 及び $\text{CH}(\text{R}^{15})\text{X}^3$ より成る群から選ばれ、ここで X^3 は $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2-$ 、 NR^{7A} 及び NR^{13} より成る群から選ばれ；

Wは CR^{18}R^7 及び CHR^2 より成る群から選ばれ；

R^{13} はH、 $-\text{SO}_2\text{R}^9$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^1$

¹R^{1 2}、炭素数が1～8のアルキル、2～8個の炭素を有するアルケニル及び2～8個の炭素を有するアルキニルより成る群から選ばれ；且つ

1) アルキル、アルケニルもしくはアルキニル基は非置換であるか；あるいは

2) アルキル、アルケニルもしくはアルキニル基は独立して6～10個の炭素を有するアリール、ヘテロアリール、アリールアルコキシ、ヘテロシクロアルコキシ、ヒドロキシルアルコキシ、アルキルオキシ-アルコキシ、ヒドロキシルアルキルチオ、アルコキシ-アルキルチオ、F、Cl、Br、I、-CN、-NO₂、-OH、-OR⁹、-X²(CH₂)_pNR^{1 1}R^{1 2}、-X²(CH₂)_pC(=O)NR^{1 1}R^{1 2}、-X²(CH₂)_pOC(=O)NR^{1 1}R^{1 2}、-X²(CH₂)_pCO₂R⁹、X²(CH₂)_pS(O)_yR⁹、-X²(CH₂)_pNR^{1 0}C(=O)NR^{1 1}R^{1 2}、-OC(=O)R⁹、-OCONHR²、-O-テトラヒドロピラニル、-NR^{1 1}R^{1 2}、-NR^{1 0}CO₂R⁹、-NR^{1 0}C(=O)NR^{1 1}R^{1 2}、-NHC(=NH)NH₂、NR^{1 0}C(=O)R⁹、-NR^{1 0}S(O)₂R⁹、-S(O)_yR⁹、-CO₂R²、-C(=O)NR^{1 1}R^{1 2}、-C(=O)R²、-CH₂OR^{1 0}、-CH=NNR²R^{2 A}、-CH=NO²R²、-CH=NR⁹、-CH=NNHCH(N=NH)NH₂、-S(=O)₂NR²R^{2 A}、-P(=O)(OR^{1 0})₂、-OR^{1 4}及び5～7個の炭素を有する単糖より成る群から選ばれる1～3個の基で置換されており、ここで単糖のそれぞれのヒドロキシル基は独立して非置換であるか、又はH、1～4個の炭素を有するアルキル、2～5個の炭素を有するアルキルカルボニルオキシもしくは1～4個の炭素を有するアルコキシで置き換えられており；

R^{1 5}はH、OR^{1 0}、SR^{1 0}、R^{7 A}及びR^{1 6}より成る群から選ばれ；

R^{1 6}は炭素数が1～4のアルキル；フェニル；ナフチル；7～15個の炭素を有するアリールアルキル、-SO₂R⁹、-CO₂R⁹、-C(=O)R⁹、1～8個の炭素を有するアルキル；2～8個の炭素を有するアルケニル及び2～8個の炭素を有するアルキニルより成る群から選ばれ、ここで

1) それぞれのアルキル、アルケニルもしくはアルキニル基は非置換であるか；あるいは

2) それぞれのアルキル、アルケニルもしくはアルキニル基は6～10個の炭素を有するアリール、ヘテロアリール、アリールアルコキシ、ヘテロシクロアルコキシ、ヒドロキシルアルコキシ、アルキルオキシ-アルコキシ、ヒドロキシルアルキルチオ、アルコキシ-アルキルチオ、F、Cl、Br、I、-CN、-NO₂、-OH、-OR⁹、-X²(CH₂)_pNR^{1 1}R^{1 2}、-X²(CH₂)_pC(=O)NR^{1 1}R^{1 2}、-X²(CH₂)_pOC(=O)NR^{1 1}R^{1 2}、-X²(CH₂)_pCO₂R⁹、X²(CH₂)_pS(O)_yR⁹、-X²(CH₂)_pNR^{1 0}C(=O)NR^{1 1}R^{1 2}、-OC(=O)R⁹、-OCONHR²、-O-テトラヒドロピラニル、-NR^{1 1}R^{1 2}、-NR^{1 0}CO₂R⁹、-NR^{1 0}C(=O)NR^{1 1}R^{1 2}、-NHC(=NH)NH₂、NR^{1 0}C(=O)R⁹、-NR^{1 0}S(O)₂R⁹、-S(O)_yR⁹、-CO₂R²、-C(=O)NR^{1 1}R^{1 2}、-C(=O)R²、-CH₂OR^{1 0}、-CH=NNR²R^{2 A}、-CH=NO²R²、-CH=NR⁹、-CH=NNHCH(N=NH)NH₂、-S(=O)₂NR²R^{2 A}、-P(=O)(OR^{1 0})₂、-OR^{1 4}及び5～7個の炭素を有する単糖より成る群から選ばれる1～3個の基で置換されており、ここで単糖のそれぞれのヒドロキシル基は独立して非置換であるか、又はH、1～4個の炭素を有するアルキル、2～5個の炭素を有するアルキルカルボニルオキシもしくは1～4個の炭素を有するアルコキシで置き換えられており；

R^{1 8}はR²、炭素数が1～4のチオアルキル及びハロゲンより成る群から選ばれ；

A¹及びA²はH、H；H、OR²；H、-SR²；H、-N(R²)₂；ならびにA¹とA²が一緒になって=O、=S及び=NR²より成る群から選ばれる部分を形成している基より成る群から選ばれ；

B¹及びB²はH、H；H、-OR²；H、-SR²；H、-N(R²)₂；ならびにB¹とB²が一緒になって=O、=S及び=NR²より成る群から選ばれる部分を形成し

ている基より成る群から選ばれ；但し A^1 と A^2 又は B^1 と B^2 の対の少なくとも1つは $=O$ を形成し；

但し、 Q が NH 又は NR^{7A} であり、 R^7 もしくは R^{7A} の基のいずれかにおいて m が 0 であり、 G が結合であり、 R^8 が H であり、 R^7 もしくは R^{7A} が 5 - もしくは 6 - 員環の位置 A において1つの環複素酸素原子を含有する場合、 B は R^{17} が置換もしくは非置換アルキルである CHR^{17} であることはできず；且つ

さらに但し、式 I の化合物は R^7 もしくは R^{7A} 基の一方又は R^7 及び R^{7A} 基の両方を含有する]
を有する化合物。

【請求項2】

A 及び B が独立して O 、 N 、 S 、 CHR^{17} 、 $C(OH)R^{17}$ 、 $C(=O)$ 及び $CH_2=C$ より成る群から選ばれ；

R^{17} が H 、置換もしくは非置換アルキル及び置換もしくは非置換アルコキシより成る群から選ばれ；ここで：

1) 環 J は $0 \sim 3$ 個の環複素原子を含有し；

2) 環 J のいずれか2個の隣接ヒドロキシル基がジオキソラン環において結合していることができ；

3) 環 J のいずれか2個の隣接環炭素原子が結合して縮合アリールもしくはヘテロアリール環を形成することができ；

但し：

1) A 、 B 、 C 、 D 、 E 又は F の一つは少なくとも1個の飽和している炭素原子を含有し、

2) 環 J は2個の隣接環 O 原子を含有せず；

3) 環 J は最高で2個の環 $C(=O)$ 基を含有し；

4) G が結合である場合、 B 、 C 、 D 及び E はそれぞれ Z がアルキル又はアルキル- OH である場合の $-OZ$ 置換基を有さず；

R^8 が $O(C=O)NR^{11}R^{12}$ 、アシルオキシ、アルケニル、 $-O-CH_2-O-(CH_2)_2-O-CH_3$ 、ハロゲン及び R^{1A} より成る群から選ばれ、ここで R^{1A} は R^1 と同じである

請求項1の化合物。

【請求項3】

A_1 、 A_2 又は B_1 、 B_2 の一方が H 、 H であり、他方が $=O$ である請求項2の化合物。

【請求項4】

Q が NR^{13} 又は NR^{7A} である請求項2の化合物。

【請求項5】

Q が NR^{7A} である請求項4の化合物。

【請求項6】

W が $CR^{18}R^7$ である請求項2の化合物。

【請求項7】

R^7 が 3 -、 4 -、 5 - もしくは 6 - 員炭素環式環、又は1個もしくは2個の環 O 、 N もしくは S 原子を含有する 5 - もしくは 6 - 員複素環式環である請求項2の化合物。

【請求項8】

R^7 が1個の環 O 、 N もしくは S 複素原子を有する複素環式環である請求項7の化合物。

【請求項9】

G が結合又は CH_2 である請求項2の化合物。

【請求項10】

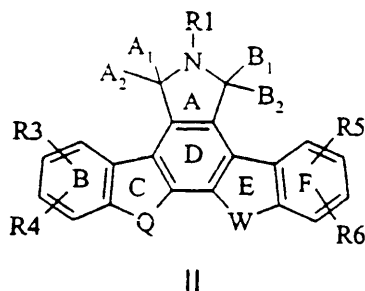
R^8 が H 、 OH 、ハロゲン、エテニル、アシルオキシ、アルコキシ、置換もしくは非置換フェニル、置換もしくは非置換ヘテロアリール又はヒドロキシアルキルである請求項2

の化合物。

【請求項 1 1】

式 I I :

【化 3】



を有する請求項 2 の化合物。

【請求項 1 2】

A_1 、 A_2 又は B_1 、 B_2 の一方が H、H であり、他方が = O である請求項 1 1 の化合物。

【請求項 1 3】

G が結合又は CH_2 である請求項 1 1 の化合物。

【請求項 1 4】

W が CH_2 又は $CR^{1-8}R^7$ である請求項 1 1 の化合物。

【請求項 1 5】

Q が NR^{1-3} 又は NR^{7-A} である請求項 1 1 の化合物。

【請求項 1 6】

R^1 、 R^4 及び R^6 が H であり； A_1 、 A_2 又は B_1 、 B_2 の一方が H、H であり、他方が = O であり； R^3 及び R^5 が独立して H、アルコキシ、ハロゲン、アルコキシアルキル、アルコキシ-アルコキシアルキル及びアルコキシ-アルコキシカルボニルより成る群から選ばれ；G が結合又は CH_2 であり；W が CH_2 又は $CR^{1-8}R^7$ であり； R^8 が H、OH、ハロゲン、エテニル、アシルオキシ、アルコキシ、置換もしくは非置換フェニル、置換もしくは非置換ヘテロアリール及びヒドロキシアルキルより成る群から選ばれ；Q が NR^{1-3} 又は NR^{7-A} である請求項 1 1 の化合物。

【請求項 1 7】

Q が NR^{1-3} であり、ここで R^{1-3} は H であり、G が結合であり；W が $CR^{1-8}R^7$ であり、ここで R^{1-8} は H 又は低級アルキルであり； R^3 及び R^5 が独立して H、アルコキシ及びアルコキシ-アルコキシカルボニルより成る群から選ばれる請求項 1 1 の化合物。

【請求項 1 8】

R^7 が 1 個の環 O、N もしくは S 複素原子を有する複素環式環である請求項 1 7 の化合物。

【請求項 1 9】

式 I I の化合物の構成変数が表 7 (ただし化合物 I I - 4 9 は除く) に従って選ばれる請求項 1 7 の化合物。

【請求項 2 0】

Q が NR^{7-A} であり； R^5 及び R^8 が H であり；W が CH_2 であり；m が 0 であり；G が結合又は CH_2 であり； R^3 が独立して H、ハロゲン、アルコキシアルキル及びアルコキシ-アルコキシアルキルより成る群から選ばれる請求項 1 1 の化合物。

【請求項 2 1】

R^{7-A} が 3 -、4 -、5 - もしくは 6 - 員炭素環式環、又は 1 個もしくは 2 個の環 O、N もしくは S 原子を含有する 5 - もしくは 6 - 員複素環式環である請求項 2 0 の化合物。

【請求項 2 2】

R^{7-A} が 1 個の環 O 原子を含有する 3 -、4 -、5 - もしくは 6 - 員複素環式環である

請求項 20 の化合物。

【請求項 23】

式 I I の化合物の構成変数が下記の表 8 に従って選ばれる請求項 20 の化合物。

【請求項 24】

R^1 、 R^3 、 R^4 及び R^6 がそれぞれ H であり； A_1 、 A_2 が H、H であり； B_1 、 B_2 が = O であり；Q が NH であり； R^5 が H 又はアルコキシであり；W が $CR^{18}R^7$ であり、ここで R^{18} は H であり；G が結合であり；m が 1 であり； R^8 が OH 又は - C (= O) R^9 であり、ここで R^9 はアルキルであり；A が O であり；B、C 及び D がそれぞれ CHR^{17} であり、ここで R^{17} は H であり；E 及び F がそれぞれ結合である請求項 11 の化合物。

【請求項 25】

R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 がそれぞれ H であり； A_1 、 A_2 が H、H であり； B_1 、 B_2 が = O であり、W が CH_2 であり、Q が NR^{7A} である請求項 1 の化合物。

【請求項 26】

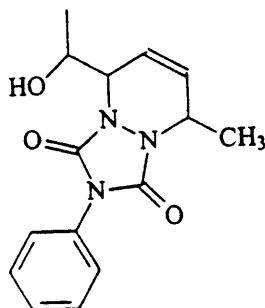
R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 がそれぞれ H であり； A_1 、 A_2 が H、H であり； B_1 、 B_2 が = O であり、Q が NH であり、W が $CR^{18}R^7$ であり、ここで R^{18} が H である請求項 1 の化合物。

【請求項 27】 G が $CHOH$ であり、m が 0 であり、 R^8 が H であり、A 及び B が - $CH=CH-$ を形成し、C が CHR^{17} であり、ここで R^{17} が - CH_3 であり、D が結合であり、E 及び F がそれぞれ N である請求項 56 の化合物。

【請求項 28】

R^7 が式：

【化 4】



を有する請求項 27 の化合物。

【請求項 29】

G がエチレンであり、m が 0 であり、 R^8 が H であり、A が NH であり、B が CHR^{17} であり、C 及び D がそれぞれ結合であり、E が CH_2 であり、F が S である請求項 25 の化合物。

【請求項 30】

請求項 1 の化合物及び製薬学的に許容され得る担体を含んでなる製薬学的組成物。

【請求項 31】

請求項 1 の化合物及び製薬学的に許容され得る担体を含んでなる前立腺障害の処置もしくは予防のための製薬学的組成物。

【請求項 32】

前立腺障害が前立腺ガン又は良性前立腺過形成である請求項 23 の製薬学的組成物。

【請求項 33】

請求項 1 の化合物及び製薬学的に許容され得る担体を含んでなる新形成、慢性関節リウマチ、肺腺維症、骨髄腺維症、異常な創傷治癒、アテローム性動脈硬化症又は再狭窄の処置もしくは予防のための製薬学的組成物。

【請求項 34】

請求項 1 の化合物及び製薬学的に許容され得る担体を含んでなるアルツハイマー病、筋

萎縮性側索硬化症、パーキンソン病、発作、虚血、ハンチントン病、A I D S 痴呆、てんかん、多発性硬化症、末梢神経障害又は脳もしくは脊髄の損傷の処置もしくは予防のための製薬学的組成物。

【請求項 3 5】

有効な阻害を生ずるのに十分な量で請求項 1 の化合物を含んでなる t r k キナーゼ、V E G F R、M L K 及び F G F R から選ばれるキナーゼの阻害剤。

【請求項 3 6】

炎症の処置のための請求項 3 5 の薬剤。

【請求項 3 7】

治療的に有効な量の請求項 1 の化合物を含んでなる前立腺障害の処置もしくは予防剤。

【請求項 3 8】

前立腺障害が前立腺ガン又は良性前立腺過形成である請求項 3 7 の薬剤。

【請求項 3 9】

血小板由来成長因子レセプターを有効阻害量の請求項 1 の化合物と接触させるのに十分な量の請求項 1 の化合物を含んでなる、ガン、子宮内膜症、乾癬、血管芽細胞腫又は眼性疾患の処置もしくは予防剤。

【請求項 4 0】

障害がガンである請求項 3 9 の薬剤。

【請求項 4 1】

障害が充実性腫瘍又は造血性もしくはリンパ性悪性疾患である請求項 4 0 の薬剤。

【請求項 4 2】

障害が眼性疾患である請求項 3 9 の薬剤。

【請求項 4 3】

眼性疾患が糖尿病性網膜症である請求項 4 2 の薬剤。

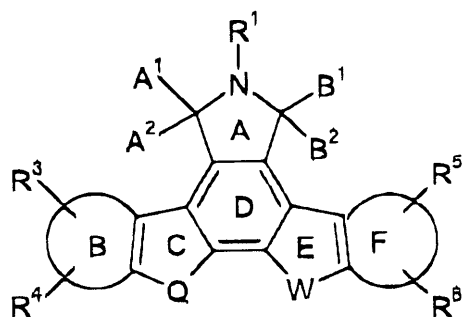
【請求項 4 4】

有効な量の請求項 1 の化合物を含んでなる、アルツハイマー病、筋萎縮性側索硬化症、パーキンソン病、発作、虚血、ハンチントン病、A I D S 痴呆、てんかん、多発性硬化症、末梢神経障害、脳もしくは脊髄の損傷、ガン、再狭窄、骨粗鬆症、炎症、脈管形成、ウイルス感染、骨もしくは造血疾患、自己免疫疾患又は移植拒絶の処置もしくは予防剤。

【請求項 4 5】

式：

【化 5】



[式中、

環 A 及び B、A¹、A²、B¹、B²、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶、Q 及び W は請求項 1 に記載したと同義であり、R⁷ はヘテロアリアルである]
を有する化合物。

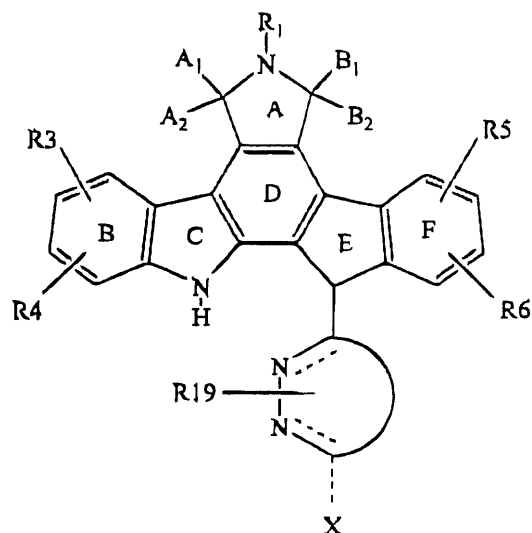
【請求項 4 6】

R⁷ がピリジルである請求項 4 5 の化合物。

【請求項 4 7】

式：

【化6】

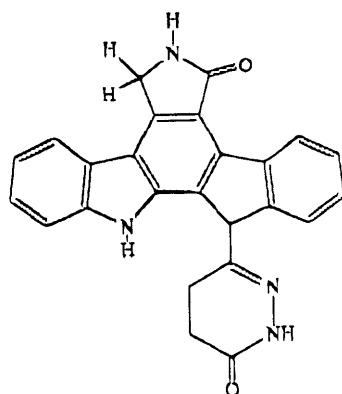


[式中、
環 A 及び B、 A_1 、 A_2 、 B_1 、 B_2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及び R^{1-9} は請求項 1 に記載したと同義であり； R^1 は請求項 1 に記載したと同義でありそしてさらに保護基または重合性支持体であることができ；X は H 又は O である]
を有する化合物。

【請求項 48】

式：

【化7】



を有する請求項 47 の化合物。

【請求項 49】

式 I I の化合物の構成変数が表 9 に従って選ばれる請求項 11 に記載の化合物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0150

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0150】

【表 1 1】

II-51d	H2	O	H	H	H	1	H	O	CH(OE1)	CH2	O	CH2	結合	シアステレオマー-0
II-52	H2	O	H	H	O	O	H	O	CH(OCH2-CH2OCH3)	CH2	CH2	結合	シアステレオマーの混合物	
II-53	H2	O	H	H	1	1	OH	O	CH2	CH2	CH2	結合	単一のシアステレオマー	
II-54	H2	O	H	H	1	1	OH	O	CH(OE1)	CH2	CH2	結合	単一のシアステレオマー	
II-55	H2	O	H	H	0	0	H	CH(COOE1)	C(=O)	CH2	CH2	結合	単一のシアステレオマー	
II-56	O	O	H	H	0	0	H	CH(COOE1)	C(=O)	CH2	CH2	結合	単一のシアステレオマー	
II-59	H2	O	H	H	0	0	H	CH2	CH2	CH2	CH2	結合	単一のシアステレオマー	
II-60	H2	O	H	H	0	0	H	C(=O)	O	CH2	CH2	結合	単一のシアステレオマー	
II-68	H2	O	H	H	1	1	OC(=O)NHE1	O	CH2	CH2	CH2	結合	単一のシアステレオマー	
II-69	H2	O	H	H	1	1	OH	O	CH2	CH2	CH2	結合	シアステレオマー-8	