

【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2月15日(2007.2.15)

【公表番号】特表2006-513221(P2006-513221A)

【公表日】平成18年4月20日(2006.4.20)

【年通号数】公開・登録公報2006-016

【出願番号】特願2004-563939(P2004-563939)

【国際特許分類】

C 0 7 D 231/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/4155 (2006.01)

A 6 1 K 31/415 (2006.01)

C 0 7 D 409/06 (2006.01)

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/02 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/32 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 231/12 Z

C 0 7 D 405/06 C S P

A 6 1 K 31/4155

A 6 1 K 31/415

C 0 7 D 409/06

C 0 7 D 403/06

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/02

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 25/32

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/12

【手続補正書】

【提出日】平成18年12月19日(2006.12.19)

【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

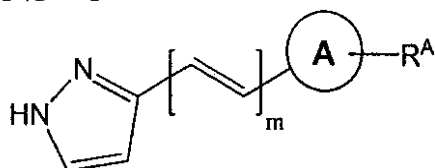
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

以下の構造：

【化 1】

〔式中、 m は1～3の整数であり；

A は、任意でN、O又はSから選択される1～4個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された芳香族又は非芳香族5～6員環の単環式環；又は、任意でN、O又はSから選択される1～6個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された芳香族又は非芳香族8～12員環の二環式環を表し；及び

R^A は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、任意で置換された脂肪族、ヘテロ脂肪族、芳香族、ヘテロ芳香族部分； $-OR^R$ 、 $-S(=O)_nR^d$ 、 $-NR^b$ 、 R^c 、及び $-C(=O)R^a$ からなる群から選択される1個以上の置換基であり；ここで、 n は0～2であり、 R^R は、任意で置換された脂肪族、ヘテロ脂肪族、芳香族、ヘテロ芳香族部分であり；

R^a は各場合について、独立して、水素、ヒドロキシ、任意で置換された脂肪族、ヘテロ脂肪族、アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；

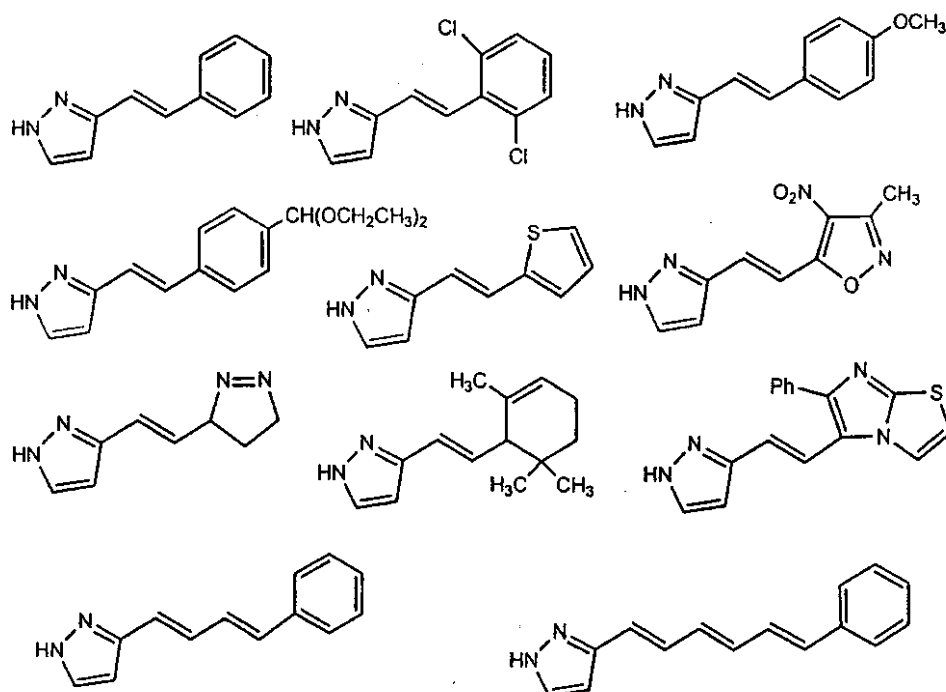
R^b 及び R^c は、各場合について、独立して、水素；ヒドロキシ； SO_2R^d ；任意で置換された脂肪族、ヘテロ脂肪族、アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；

R^d は、各場合について、独立して、水素； $-N(R^e)_2$ ；任意で置換された脂肪族、アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；及び

R^e は、各場合について、独立して、水素又は任意で置換された脂肪族であり；

但し、該化合物が、以下の構造のいずれも有さない：

【化 2】

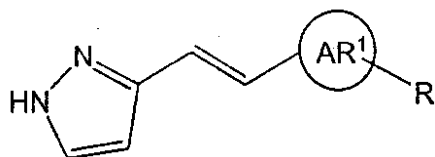


〕を有する単離された化合物、それらの互変異性体；又はそれらの薬学的に許容可能な誘導体。

【請求項 2】

m が 1 であり、前記化合物が以下の構造：

【化 3】



を有し、ここで、 AR^1 が、必要に応じて置換されたアリール部分またはヘテロアリール分であり；そして R が、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-CN$ ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=O)R^a$ ； $-NR^bR^c$ ； $-S(O)_nR^d$ ($n = 0 \sim 2$)；任意でハロゲン及び $C_1 \sim 6$ アルキルから独立して選択された 1 つ以上の置換基で置換された $C_1 \sim 6$ アルコキシ；N、O 及び S からなる群から選択される 1 ～ 3 個のヘテロ原子を任意で含有する、任意で置換された縮合芳香族又は非芳香族 5 ～ 6 員単環式環；及び各々、独立してハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、又は $C_3 \sim 6$ シクロアルキルからなる群から選択される 1 つ以上の置換基であり；

ここで、 R^a は各々において、独立して、水素、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、及び $-NR^bR^c$ からなる群から選択され

ここで、 $C_1 \sim 6$ アルキル及び $C_1 \sim 6$ アルコキシは、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換され；

R^b 及び R^c は各々において、独立して、水素；ヒドロキシ； SO_2R^d ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ及び $N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルコキシ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されたアリール；及び、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され；

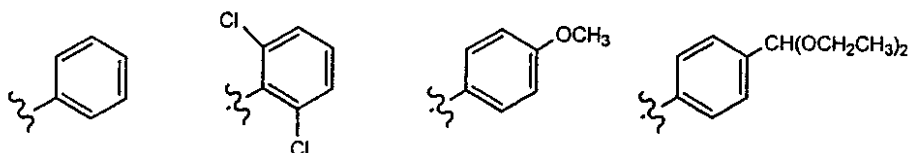
R^d は各々において、独立して、水素； $-N(R^e)_2$ ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル；アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；及び

R^e は各々において、独立して、水素又は $C_1 \sim 6$ アルキルである、
請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

AR^1 がフェニル又はナフチルであり、但し、 AR^1 が以下

【化 4】

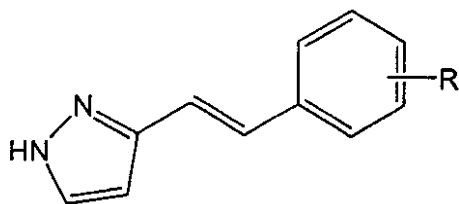


の構造ではない、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

A R¹ がフェニルであり、前記化合物が以下の構造：

【化 5】



〔式中、Rは、ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ；CN；アリール；ヘテロアリール；-C(=O)R^a；-NR^bR^c；-S(O)_nR^d（n=0～2）；任意でハロゲン及びC₁～6アルキルから独立して選択された1つ以上の置換基で置換されたC₁～6アルコキシ；N、O及びSからなる群から選択される1～3個のヘテロ原子を任意で含有する、任意で置換された縮合芳香族又は非芳香族5～6員単環式環；及び各々、独立してハロゲン、ヒドロキシ、C₁～5アルコキシ、ニトロ、及び-N(R^e)₂から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された、C₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、C₂～6アルキニル、又はC₃～6シクロアルキルからなる群から選択される1つ以上の置換基であり；

ここで、R^aは各々において、独立して、水素、ヒドロキシ、C₁～6アルキル、C₁～6アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、及びNR^bR^cからなる群から選択され、

ここで、C₁～6アルキル及びC₁～6アルコキシは、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁～5アルコキシ、ニトロ、及び-N(R^e)₂から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換され；

R^b及びR^cは各々において、独立して、水素；ヒドロキシ；-SO₂R^d；ハロゲン、ヒドロキシ、C₁～5アルコキシ、ニトロ、及び-N(R^e)₂から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換されたC₁～6アルキル；ハロゲン、ヒドロキシ、C₁～5アルコキシ、ニトロ及び-N(R^e)₂から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換されたC₁～6アルコキシ；ハロゲン、ヒドロキシ、C₁～4アルキル、C₁～5アルコキシ、ニトロ、及び-N(R^e)₂から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換されたアリール；及び、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁～4アルキル、C₁～5アルコキシ、ニトロ、及び-N(R^e)₂から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され；

R^dは各々において、独立して、水素；-N(R^e)₂；ハロゲン、ヒドロキシ、C₁～5アルコキシ、ニトロ、及び-N(R^e)₂から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換されたC₁～6アルキル；アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；及び

R^eは各々において、独立して、水素又はC₁～6アルキルであり；

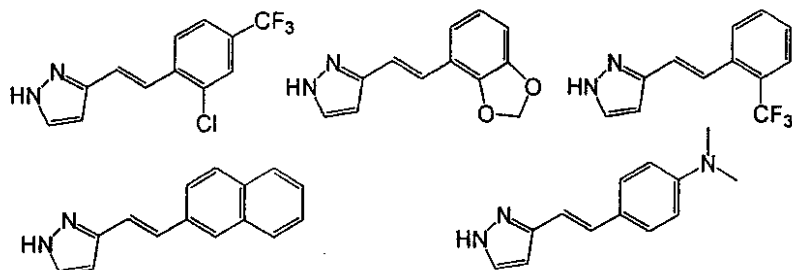
但し、Rは、2,6-ジクロロ、4-メトキシ、または4-(gem-ジエトキシ)メチルではない]

を有する、請求項2に記載の化合物。

【請求項 5】

以下の構造：

【化 6】

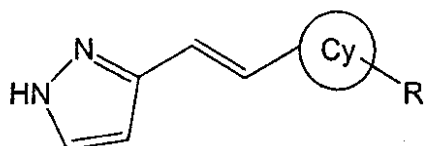


のいずれか 1 つを有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

m が 1 であり、前記化合物が以下の構造：

【化 7】



〔式中、Cy はヘテロ環状部分であり；R は、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ；
-CN；アリール；ヘテロアリール；-C(=O)R^a；-NR^bR^c；-S(O)_nR^d (n = 0 ~ 2)；任意でハロゲン及び C₁ ~ 6 アルキルから独立して選択された 1 つ以上の置換基で置換された C₁ ~ 6 アルコキシ；N、O 及び S からなる群から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を任意で含有する、任意で置換された縮合芳香族又は非芳香族 5 ~ 6 員単環式環；及び各々、独立してハロゲン、ヒドロキシ、C₁ ~ 5 アルコキシ、ニトロ、及び -N(R^e)₂ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された、C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、又は C₃ ~ 6 シクロアルキルからなる群から選択される 1 つ以上の置換基であり；

ここで、R^a は各々において、独立して、水素、ヒドロキシ、C₁ ~ 6 アルキル、C₁ ~ 6 アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、及び NR^bR^c からなる群から選択され、

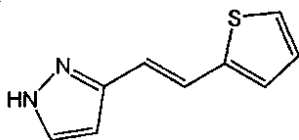
ここで、C₁ ~ 6 アルキル及び C₁ ~ 6 アルコキシは、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁ ~ 5 アルコキシ、ニトロ、及び -N(R^e)₂ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換され；

R^b 及び R^c は各々において、独立して、水素；ヒドロキシ；-SO₂R^d；ハロゲン、ヒドロキシ、C₁ ~ 5 アルコキシ、ニトロ、及び -N(R^e)₂ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された C₁ ~ 6 アルキル；ハロゲン、ヒドロキシ、C₁ ~ 5 アルコキシ、ニトロ及び -N(R^e)₂ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された C₁ ~ 6 アルコキシ；ハロゲン、ヒドロキシ、C₁ ~ 4 アルキル、C₁ ~ 5 アルコキシ、ニトロ、及び -N(R^e)₂ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されたアリール；及び、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁ ~ 4 アルキル、C₁ ~ 5 アルコキシ、ニトロ、及び -N(R^e)₂ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され；

R^d は各々において、独立して、水素；-N(R^e)₂；ハロゲン、ヒドロキシ、C₁ ~ 5 アルコキシ、ニトロ、及び -N(R^e)₂ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された C₁ ~ 6 アルキル；アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；及び

R^e は各々において、独立して、水素又は C₁ ~ 6 アルキルであり、
但し、該化合物が、以下の構造：

【化 8】



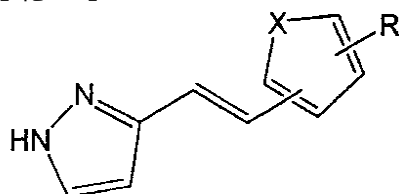
を有さない]

を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

前記化合物が、以下の構造：

【化 9】



〔式中、Xは、O、S又は NR^{N} (R^{N} は、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、- (アルキル) アリール、- (アルキル) ヘテロアリール、アシル又は窒素保護基である) であり；及び

Rは、水素、ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ；-CN；アリール；ヘテロアリール；-C(=O) R^{a} ；- $\text{NR}^{\text{b}}\text{R}^{\text{c}}$ ；-S(O) R^{d} ($n=0\sim 2$)；任意でハロゲン及び $\text{C}_1\sim 6$ アルキルから独立して選択された1つ以上の置換基で置換された $\text{C}_1\sim 6$ アルコキシ；N、O及びSからなる群から選択される1～3個のヘテロ原子を任意で含有する、任意で置換された縮合芳香族又は非芳香族5～6員単環式環；及び各々、独立してハロゲン、ヒドロキシ、 $\text{C}_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $\text{N}(\text{R}^{\text{e}})_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された、 $\text{C}_1\sim 6$ アルキル、 $\text{C}_2\sim 6$ アルケニル、 $\text{C}_2\sim 6$ アルキニル、又は $\text{C}_3\sim 6$ シクロアルキルからなる群から選択される1つ以上の置換基であり；

ここで、 R^{a} は各々において、独立して、水素、ヒドロキシ、 $\text{C}_1\sim 6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、及び- $\text{NR}^{\text{b}}\text{R}^{\text{c}}$ からなる群から選択され、

ここで、 $\text{C}_1\sim 6$ アルキル及び $\text{C}_1\sim 6$ アルコキシは、ハロゲン、ヒドロキシ、 $\text{C}_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び- $\text{N}(\text{R}^{\text{e}})_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換され；

R^{b} 及び R^{c} は各々において、独立して、水素；ヒドロキシ；-SO R^{d} ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $\text{C}_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び- $\text{N}(\text{R}^{\text{e}})_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された $\text{C}_1\sim 6$ アルキル；ハロゲン、ヒドロキシ、 $\text{C}_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ及び- $\text{N}(\text{R}^{\text{e}})_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された $\text{C}_1\sim 6$ アルコキシ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $\text{C}_1\sim 4$ アルキル、 $\text{C}_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び- $\text{N}(\text{R}^{\text{e}})_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換されたアリール；及び、ハロゲン、ヒドロキシ、 $\text{C}_1\sim 4$ アルキル、 $\text{C}_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び- $\text{N}(\text{R}^{\text{e}})_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され；

R^{d} は各々において、独立して、水素；- $\text{N}(\text{R}^{\text{e}})_2$ ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $\text{C}_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び- $\text{N}(\text{R}^{\text{e}})_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された $\text{C}_1\sim 6$ アルキル；アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；及び

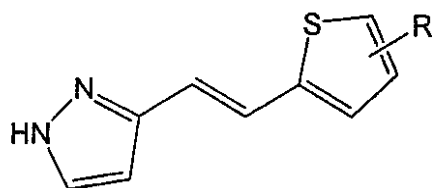
R^{e} は各々において、独立して、水素又は $\text{C}_1\sim 6$ アルキルであり、
但し、XがSである場合、Rは水素ではない]

を有する、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

前記化合物が、以下の構造：

【化 10】

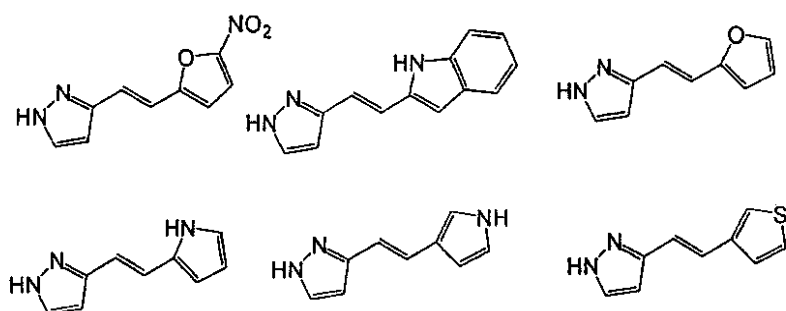


を有し、Rが請求項6に記載の通りであり、但し、Rが水素ではない、請求項7に記載の化合物、それらの互変異性体；又はそれらのプロドラッグ、塩、水和物、又はエステル。

【請求項 9】

以下の構造：

【化 11】

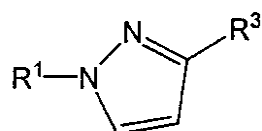


のいずれか1つを有する、請求項7に記載の化合物。

【請求項 10】

以下の構造：

【化 12】



〔式中、 R^1 は、 $-SO_2AL^2$ 、 $C(=O)(CH_2)_mAL^2$ 、 $C(=O)OAL^2$ 、 $-C(=O)NHAL^2$ 、 $-SO_2$ アリール、 $-C(=O)(CH_2)_m$ アリール、 $-C(=O)O$ アリール、 $-C(=O)O$ ヘテロ環、 $-C(=O)(CH_2)_m$ ヘテロ環、または $-C(=O)NH$ アリールであり；ここで m は 0 ~ 3 の整数であり； AL^2 は、脂肪族又は脂環式部分であり；及び、 AL^2 、アリール及びヘテロ環部分は、独立して、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-CN$ ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、又は $-S(O)_nR^d$ ($n = 0 \sim 2$)；ハロゲン及び $C_1 \sim 6$ アルキルから独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルコキシ；N、O及びSからなる群から選択される0 ~ 3個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された縮合二環式8 ~ 12員環の芳香族又は脂環式環；独立してハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換され、そして $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、 $-S(O)_nR^d$ ($n = 0 \sim 2$)、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、ハロ $C_1 \sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール及びヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1 ~ 3個の置換基でさらに任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、又は $C_3 \sim 6$ シクロアルキル；または $COCH_2OC_2H_5OCH_3$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換され；及び

R^3 は、*cis* 又は *trans* の $CHCH$ アリール、 $CHCH$ ヘテロ環、フェノキシフェニル、又はヘテロ環基であり、ここで、前記アリール、ヘテロ環又はフェノキシフェニル

ル部分は、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-CN$ ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、又は $-S(O)_nR^d$ ($n=0\sim 2$)；任意でハロゲン及び $C_1\sim 6$ アルキルから独立して選択される1つ以上の置換基で置換された $C_1\sim 6$ アルコキシ；N、O及びSからなる群から選択される0～3個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された縮合二環式8～12員環の芳香族又は脂環式環；独立してハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換され、そして $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、 $-S(O)_nR^d$ ($n=0\sim 2$)、ヒドロキシ、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、ハロ $C_1\sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール及びヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基でさらに任意で置換される、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、又は $C_3\sim 6$ シクロアルキルから独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換されてもよく；

ここで、 R^a は、水素、ヒドロキシ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、及び NR^bR^c からなる群から選択され、ここで、 $C_1\sim 6$ アルキル及び $C_1\sim 6$ アルコキシは、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換され；

R^b 及び R^c は、独立して、水素；ヒドロキシ； $-SO_2R^d$ ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された $C_1\sim 6$ アルキル；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された $C_1\sim 6$ アルコキシ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1\sim 4$ アルキル、 $C_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換されたアリール；及び、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1\sim 4$ アルキル、 $C_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され；

R^d は、水素； $-N(R^e)_2$ ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された $C_1\sim 6$ アルキル；アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；及び

R^e は水素又は $C_1\sim 6$ アルキルであり；

但し、 R^1 が $-SO_2AL^2$ 、 $-C(=O)AL^2$ 、 $-C(=O)NHAL^2$ 、 $-SO_2$ アリール、 $C(=O)$ アリール、又は $-C(=O)NH$ アリールである場合、 R^3 は、 $-CH=CH$ ヘテロアリール、フェノキシフェニル、ヘテロアリールまたはアリール置換ヘテロアリールではなく、ここで、 AL^2 が、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_3\sim 6$ シクロアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_3\sim 6$ シクロアルコキシであり；該アリール基およびヘテロアリール基のそれぞれが、独立して、必要に応じて、ハロゲン、 $C_1\sim 4$ アルキル、 $C_3\sim 4$ シクロアルキル、 $C_1\sim 4$ アルコキシ、 $C_3\sim 4$ シクロアルコキシ、 $-CF_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NHC_1\sim 6$ アルキル、 $-N(C_1\sim 6$ アルキル) $_2$ 、 $-NHC_3\sim 6$ シクロアルキル、 $-N(C_3\sim 6$ シクロアルキル) $_2$ 、 $-N(C_1\sim 6$ アルキル) $C_3\sim 6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールからなる群より独立して選択される1つ以上の置換基で置換され；該(シクロ)アルキル部分および(シクロ)アルコキシ部分のそれぞれが、非置換である]

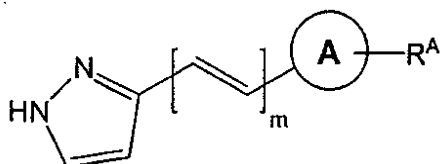
を有する単離された化合物、それらの $C(5)$ -位置異性体；又はそれらのプロドラッグ、塩、水和物、又はエステル。

【請求項11】

薬学的に許容可能なキャリア又は希釈剤；及び

以下の構造：

【化 1 3】



〔式中、 m は1～3の整数であり；

A は、任意でN、O又はSから選択される1～4個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された芳香族又は非芳香族5～6員環の単環式環；又は、任意でN、O又はSから選択される1～6個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された芳香族又は非芳香族8～12員環の二環式環を表し；及び

R^A は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、任意で置換された脂肪族、ヘテロ脂肪族、芳香族、ヘテロ芳香族部分； $-OR^R$ 、 $-S(=O)_n R^d$ 、 $-NR^b R^c$ 、及び $-C(=O)R^a$ からなる群から選択される1個又は2個の置換基であり；ここで、 n は0～2であり、 R^R は、任意で置換された脂肪族、ヘテロ脂肪族、芳香族、ヘテロ芳香族部分であり；

R^a は各々において、独立して、水素、ヒドロキシ、任意で置換された脂肪族、ヘテロ脂肪族、アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；

R^b 及び R^c は各々において、独立して、水素；ヒドロキシ； $-SO_2 R^d$ ；任意で置換された脂肪族、ヘテロ脂肪族、アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；

R^d は各々において、独立して、水素； $-N(R^e)_2$ ；任意で置換された脂肪族、アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；及び

R^e は各々において、独立して、水素又は任意で置換された脂肪族である〕
を有する化合物、それらの互変異性体；又はそれらの薬学的に許容可能な誘導体を含む、HGF/SF模倣薬学的組成物。

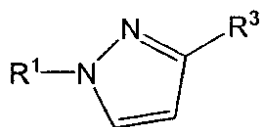
【請求項 1 2】

HGF/SF模倣薬学的組成物であって、以下：

薬学的に受容可能なキャリアまたは希釈剤；および

以下の構造：

【化 1 4】



〔式中、 R^1 は、 $-SO_2 AL^2$ 、 $C(=O)(CH_2)_m AL^2$ 、 $C(=O)OAL^2$ 、 $-C(=O)NHAL^2$ 、 $-SO_2$ アリール、 $-C(=O)(CH_2)_m$ アリール、 $-C(=O)O$ アリール、 $-C(=O)O$ ヘテロ環、 $-C(=O)(CH_2)_m$ ヘテロ環、または $-C(=O)NH$ アリールであり；ここで m は0～3の整数であり； AL^2 は、脂肪族又は脂環式部分であり；及び、 AL^2 、アリール及びヘテロ環部分は、独立して、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-CN$ ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^b R^c$ 、又は $-S(O)_n R^d$ ($n=0\sim 2$)；ハロゲン及び C_{1-6} アルキルから独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された C_{1-6} アルコキシ；N、O及びSからなる群から選択される0～3個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された縮合二環式8～12員環の芳香族又は脂環式環；独立してハロゲン、ヒドロキシ、 C_{1-5} アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換され、そして $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^b R^c$ 、 $-S(O)_n R^d$ ($n=0\sim 2$)、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルコキシ、ハロ C_{1-6} アルコキシ、アリール、ヘテロアリール及びヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基でさらに任意で置換された C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、又は C_{3-6} シクロアルキル；または $COCH_2OC_2H_5OCH_3$ から独立して選択さ

れる 1 つ以上の置換基で任意で置換され；及び

R^3 は、*c i s* 又は *t r a n s* の $C H C H$ アリール、 $C H C H$ ヘテロ環、フェノキシフェニル、又はヘテロ環基であり、ここで、前記アリール、ヘテロ環又はフェノキシフェニル部分は、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-C N$ ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、又は $-S(O)_nR^d$ ($n = 0 \sim 2$)；任意でハロゲン及び $C_1 \sim 6$ アルキルから独立して選択される 1 つ以上の置換基で置換された $C_1 \sim 6$ アルコキシ； N 、 O 及び S からなる群から選択される 0 ～ 3 個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された縮合二環式 8 ～ 12 員環の芳香族又は脂環式環；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換され、そして $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、 $-S(O)_nR^d$ ($n = 0 \sim 2$)、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、ハロ $C_1 \sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール及びヘテロシクリルからなる群から独立して選択される 1 ～ 3 個の置換基でさらに任意で置換される、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、又は $C_3 \sim 6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されてもよく；

ここで、 R^a は、水素、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、及び NR^bR^c からなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim 6$ アルキル及び $C_1 \sim 6$ アルコキシは、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換され；

R^b 及び R^c は、独立して、水素；ヒドロキシ； $-SO_2R^d$ ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルコキシ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されたアリール；及び、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され；

R^d は、水素； $-N(R^e)_2$ ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル；アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；及び

R^e は水素又は $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

但し、 R^1 が $-SO_2AL^2$ 、 $-C(=O)AL^2$ 、 $-C(=O)NHAL^2$ 、 $-SO_2$ アリール、 $C(=O)$ アリール、又は $C(=O)NH$ アリールである場合、 R^3 は、 $-CH=CH$ ヘテロアリール、フェノキシフェニル、ヘテロアリールまたはアリール置換ヘテロアリールではなく、ここで、 AL^2 が、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、 $C_3 \sim 6$ シクロアルコキシであり；該アリール基およびヘテロアリール基のそれぞれが、独立して、必要に応じて、ハロゲン、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_3 \sim 4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_3 \sim 4$ シクロアルコキシ、 $-CF_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NHC_1 \sim 6$ アルキル、 $-N(C_1 \sim 6$ アルキル) $_2$ 、 $-NHC_3 \sim 6$ シクロアルキル、 $-N(C_3 \sim 6$ シクロアルキル) $_2$ 、 $-N(C_1 \sim 6$ アルキル) $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールからなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基で置換され；該(シクロ)アルキル部分および(シクロ)アルコキシ部分のそれぞれが、非置換である；

を有する化合物、それらの $C(5)$ -位置異性体；又はそれらのプロドラッグ、塩、水和物、又はエステル

を含有する、 HGF/SF 模倣薬学的組成物。

【請求項 13】

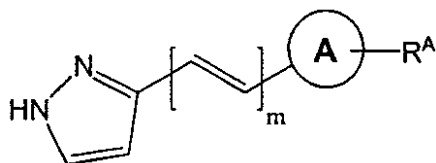
(a) 患者；又は

(b) 生物学的サンプル

の HGF / SF 活性を調整するための薬学的組成物であって、
該薬学的組成物が、

- a) 請求項 1 1 に記載の組成物；又は
b) 以下の構造：

【化 1 5】



〔式中、m は 1 ～ 3 の整数であり；

A は、任意で N、O 又は S から選択される 1 ～ 4 個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された芳香族又は非芳香族 5 ～ 6 員環の単環式環；又は、任意で N、O 又は S から選択される 1 ～ 6 個のヘテロ原子を含有する、任意で、置換された芳香族又は非芳香族 8 ～ 12 員環の二環式環を表し；及び

R^A は、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、任意で置換された脂肪族、ヘテロ脂肪族、芳香族、ヘテロ芳香族部分； $-OR^R$ 、 $-S(=O)_n R^d$ 、 $-NR^b$ 、 R^c 、及び $-C(=O)R^a$ からなる群から選択される 1 個以上の置換基であり；ここで、n は 0 ～ 2 であり、 R^R は、任意で置換された脂肪族、ヘテロ脂肪族、芳香族、ヘテロ芳香族部分であり；

R^a は各々において、独立して、水素、ヒドロキシ、脂肪族、ヘテロ脂肪族、アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；

R^b 及び R^c は各々において、独立して、水素；ヒドロキシ； $-SO_2 R^d$ ；脂肪族、ヘテロ脂肪族、アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；

R^d は各々において、独立して、水素； $-N(R^e)_2$ ；脂肪族、アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；及び

R^e は各々において、独立して、水素又は脂肪族である〕

を有する化合物、それらの互変異性体；又はそれらの薬学的に許容可能な誘導体を含有し

患者に投与するかまたは生物学的サンプルに接触させるために処方されている、薬学的組成物。

【請求項 1 4】

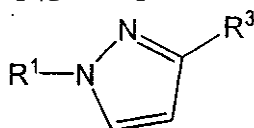
- (a) 患者；又は
(b) 生物学的サンプル

の HGF / SF 活性を調整するための薬学的組成物であって、

該薬学的組成物は、

- c) 請求項 1 2 に記載の組成物；又は
d) 以下の構造：

【化 1 6】



〔式中、 R^1 は、 $-SO_2 AL^2$ 、 $C(=O)(CH_2)_m AL^2$ 、 $C(=O)OAL^2$ 、 $-C(=O)NHAL^2$ 、 $-SO_2$ アリール、 $-C(=O)(CH_2)_m$ アリール、 $-C(=O)O$ アリール、 $-C(=O)O$ ヘテロ環、 $-C(=O)(CH_2)_m$ ヘテロ環、または $-C(=O)NH$ アリールであり；ここで m は 0 ～ 3 の整数であり； AL^2 は、脂肪族又は脂環式部分であり；及び、 AL^2 、アリール及びヘテロ環部分は、独立して、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-CN$ ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^b R^c$ 、又は $-S(O)_n R^d$ ($n = 0 \sim 2$)；ハロゲン及び C_{1-6} ア

ルキルから独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルコキシ；N、O及びSからなる群から選択される0～3個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された縮合二環式8～12員環の芳香族又は脂環式環；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換され、そして $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、 $-S(O)_nR^d$ ($n=0 \sim 2$)、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、ハロ $C_1 \sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール及びヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基でさらに任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、又は $C_3 \sim 6$ シクロアルキル；又は $COCH_2OC_2H_5OCH_3$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換され；及び

R^3 は、*cis*又は*trans*の $CHCH$ アリール、 $CHCH$ ヘテロ環、フェノキシフェニル、又はヘテロ環基であり、ここで、該アリール、ヘテロ環又はフェノキシフェニル部分は、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-CN$ ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、又は $-S(O)_nR^d$ ($n=0 \sim 2$)；任意でハロゲン及び $C_1 \sim 6$ アルキルから独立して選択された1つ以上の置換基で置換された $C_1 \sim 6$ アルコキシ；N、O及びSからなる群から選択される0～3個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された縮合二環式8～12員の芳香族又は脂環式環；及び独立してハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、又は $C_3 \sim 6$ シクロアルキルから独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換されてもよく；

ここで、 R^a は、水素、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、及び NR^bR^c からなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim 6$ アルキル及び $C_1 \sim 5$ アルコキシは、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換され；

R^b 及び R^c は各々において、独立して、水素；ヒドロキシ； $-SO_2R^d$ ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルコキシ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換されたアリール；及び、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され；

R^d は、水素； $-N(R^e)_2$ ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル；アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；及び

R^e は水素又は $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

但し、 R^1 が $-SO_2AL^2$ 、 $-C(=O)AL^2$ 、 $-C(=O)NHAL^2$ 、 $-SO_2$ アリール、 $C(=O)$ アリール、又は $-C(=O)NH$ アリールである場合、 R^3 は、 $-CH=CH$ ヘテロ、フェノキシフェニル、ヘテロ、またはアリール置換ヘテロアリールではなく、ここで、 AL^2 が、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、 $C_3 \sim 6$ シクロアルコキシであり；該アリール基およびヘテロアリール基のそれぞれが、独立して、必要に応じて、ハロゲン、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_3 \sim 4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_3 \sim 4$ シクロアルコキシ、 $-CF_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NHC_1 \sim 6$ アルキル、 $-N(C_1 \sim 6$ アルキル) $_2$ 、 $-NHC_3 \sim 6$ シクロアルキル、 $-N(C_3 \sim 6$ シクロアルキル) $_2$ 、 $-N(C_1 \sim 6$ アルキル) $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールからなる群より独立して選択される1つ以上の置換基で置換され；該(シクロ)アルキル部分および(シクロ)アルコキシ部分のそれぞれが、非置換である]

を有する化合物、それらの C (5) - 位置異性体；又はそれらのプロドラッグ、塩、水和物、又はエステル
 を含有し、患者に投与するかまたは生物学的サンプルに接触させるために処方されている、
 薬学的組成物。

【請求項 1 5】

前記化合物が H G F / S F 活性を有する、請求項 1 または 1 0 に記載の化合物、あるいは請求項 1 1 または 1 2 に記載の組成物。

【請求項 1 6】

前記化合物が抗繊維化活性又は抗アポトーシス活性を有する、請求項 1 または 1 0 に記載の化合物、あるいは請求項 1 1 または 1 2 に記載の組成物。

【請求項 1 7】

請求項 1 に記載の化合物、あるいは請求項 1 1 または 1 3 に記載の組成物であって、 R^A が、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-CN$ ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=O)R^a$ ； $-NR^bR^c$ ； $-S(O)_nR^d$ ($n=0\sim 2$)；任意でハロゲン及び $C_{1\sim 6}$ アルキルから独立して選択された 1 つ以上の置換基で置換された $C_{1\sim 6}$ アルコキシ；各々が独立してハロゲン、ヒドロキシ、 $C_{1\sim 5}$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{2\sim 6}$ アルケニル、 $C_{2\sim 6}$ アルキニル、又は $C_{3\sim 6}$ シクロアルキルからなる群から選択される 1 つ以上の置換基であり；

ここで、 R^a は各々において、独立して、水素、ヒドロキシ、 $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{1\sim 6}$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、及び NR^bR^c からなる群から選択され、

ここで、 $C_{1\sim 6}$ アルキル及び $C_{1\sim 6}$ アルコキシは、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_{1\sim 5}$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換され；

R^b 及び R^c は各々において、独立して、水素；ヒドロキシ； $-SO_2R^d$ ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_{1\sim 5}$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_{1\sim 6}$ アルキル；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_{1\sim 5}$ アルコキシ、ニトロ及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_{1\sim 6}$ アルコキシ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、 $C_{1\sim 5}$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されたアリール；及び、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、 $C_{1\sim 5}$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され；

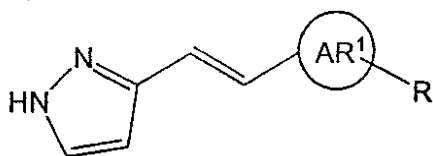
R^d は各々において、独立して、水素； $-N(R^e)_2$ ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_{1\sim 5}$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_{1\sim 6}$ アルキル；アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；及び

R^e は各々において、独立して、水素又は $C_{1\sim 6}$ アルキルである、
 化合物または組成物。

【請求項 1 8】

請求項 1 1 または 1 3 に記載の組成物であって、前記化合物において、 m が 1 であり、
 該化合物が以下の構造：

【化 1 7】



を有し、 AR^1 は任意で置換されたアリール部分またはヘテロアリール部分であり； R は、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-CN$ ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=$

$O) R^a$; $-NR^b R^c$; $-S(O)_n R^d$ ($n = 0 \sim 2$) ; 任意でハロゲン及び $C_1 \sim 6$ アルキルから独立して選択された 1 つ以上の置換基で置換された $C_1 \sim 6$ アルコキシ ; N 、 O 及び S からなる群から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を任意で含有する、任意で置換された縮合芳香族又は非芳香族 5 ~ 6 員単環式環 ; および各々、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、又は $C_3 \sim 6$ シクロアルキルからなる群から選択される 1 つ以上の置換基であり ;

ここで、 R^a は各々において、独立して、水素、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、及び $NR^b R^c$ からなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim 6$ アルキル及び $C_1 \sim 6$ アルコキシは、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換され ;

R^b 及び R^c は各々において、独立して、水素 ; ヒドロキシ ; $-SO_2 R^d$; ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル ; ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルコキシ ; ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されたアリール ; 及び、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され ;

R^d は各々において、独立して、水素 ; $N(R^e)_2$; ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、ニトロ、及び $N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル ; アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され ; 及び

R^e は各々において、独立して、水素又は $C_1 \sim 6$ アルキルである、
組成物。

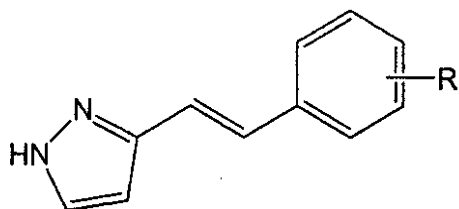
【請求項 19】

AR^1 がフェニル又はナフチルである、請求項 18 に記載の組成物。

【請求項 20】

AR^1 がフェニルであり、前記化合物が以下の構造 :

【化 18】



〔式中、 R は、ハロゲン ; ヒドロキシ ; ニトロ ; $-CN$; アリール ; ヘテロアリール ; $-C(=O)R^a$; $-NR^b R^c$; $-S(O)_n R^d$ ($n = 0 \sim 2$) ; 任意でハロゲン及び $C_1 \sim 6$ アルキルから独立して選択された 1 つ以上の置換基で置換された $C_1 \sim 6$ アルコキシ ; N 、 O 及び S からなる群から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を任意で含有する、任意で置換された縮合芳香族又は非芳香族 5 ~ 6 員単環式 ; ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、又は $C_3 \sim 6$ シクロアルキルからなる群から選択される 1 つ以上の置換基であり ;

ここで、 R^a は各々において、独立して、水素、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、及び $NR^b R^c$ からなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim 6$ アルキル及び $C_1 \sim 6$ アルコキシは、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で

任意で置換され；

R^b 及び R^c は各々において、独立して、水素；ヒドロキシ； $-SO_2R^d$ ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルコキシ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換されたアリール；及び、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され；

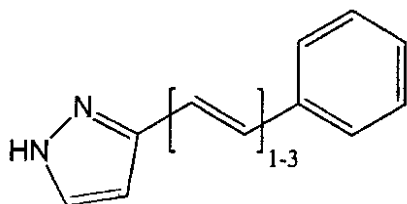
R^d は各々において、独立して、水素； $-N(R^e)_2$ ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル；アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；及び

R^e は各々において、独立して、水素又は $C_1 \sim 6$ アルキルである〕
、それらの互変異性体、またはそれらのプロドラッグ、塩、水和物、またはエステル、を有する、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 21】

前記化合物が、以下の構造：

【化 19】

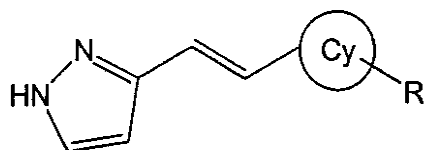


を有する、請求項 11 または 13 に記載の組成物。

【請求項 22】

m が 1 であり、前記化合物が以下の構造：

【化 20】



〔式中、 Cy はヘテロ環状部分であり； R は水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-CN$ ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=O)R^a$ ； $-NR^bR^c$ ； $-S(O)_nR^d$ ($n = 0 \sim 2$)；任意でハロゲン及び $C_1 \sim 6$ アルキルから独立して選択された1つ以上の置換基で置換された $C_1 \sim 6$ アルコキシ； N 、 O 及び S からなる群から選択される1～3個のヘテロ原子を任意で含有する、任意で置換された縮合芳香族又は非芳香族5～6員単環式環；及び各々、独立してハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、又は $C_3 \sim 6$ シクロアルキルからなる群から選択される1つ以上の置換基であり；

ここで、 R^a は各々において、独立して、水素、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、及び NR^bR^c からなる群から選択され、

ここで、 $C_1 \sim 6$ アルキル及び $C_1 \sim 6$ アルコキシは、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換され；

R^b 及び R^c は各々において、独立して、水素；ヒドロキシ； $-SO_2R^d$ ；ハロゲン

、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルコキシ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されたアリール；及び、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され；

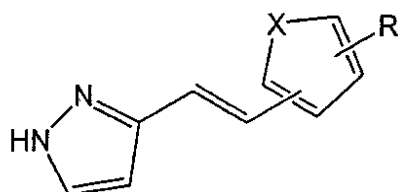
R^d は各々において、独立して、水素； $-N(R^e)_2$ ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル；アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；及び

R^e は各々において、独立して、水素又は $C_1 \sim 6$ アルキルである）、
を有する、請求項 1 1 または 1 3 に記載の組成物。

【請求項 2 3】

前記化合物が以下の構造：

【化 2 1】



〔式中、 X は、 O 、 S 又は NR^N (R^N は、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})$ アリール、 $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリール、アシル又は窒素保護基である) であり；及び

R は、水素、ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-CN$ ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=O)R^a$ ； $-NR^bR^c$ ； $-S(O)_nR^d$ ($n = 0 \sim 2$)；任意でハロゲン及び $C_1 \sim 6$ アルキルから独立して選択された 1 つ以上の置換基で置換された $C_1 \sim 6$ アルコキシ； N 、 O 及び S からなる群から選択される 1 ～ 3 個のヘテロ原子を任意で含有する、任意で置換された縮合芳香族又は非芳香族 5 ～ 6 員単環式環；及び各々、独立してハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、又は $C_3 \sim 6$ シクロアルキルからなる群から選択される 1 つ以上の置換基であり；

ここで、 R^a は各々において、独立して、水素、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、及び NR^bR^c からなる群から選択され、
ここで、 $C_1 \sim 6$ アルキル及び $C_1 \sim 6$ アルコキシは、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換され；

R^b 及び R^c は各々において、独立して、水素；ヒドロキシ； $-SO_2R^d$ ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルコキシ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されたアリール；及び、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され；

R^d は各々において、独立して、水素； $-N(R^e)_2$ ；ハロゲン、ヒドロキシ、 C_1

- 5 アルコキシ、ニトロ、及び - N (R^e)₂ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された C₁ - 6 アルキル；アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；及び

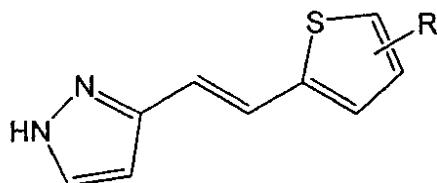
R^e は各々において、独立して、水素又は C₁ - 6 アルキルである]

、それらの互変異性体；それらのプロドラッグ、塩、水和物、またはエステルを有する、請求項 2 2 に記載の組成物。

【請求項 2 4】

前記化合物が以下の構造：

【化 2 2】

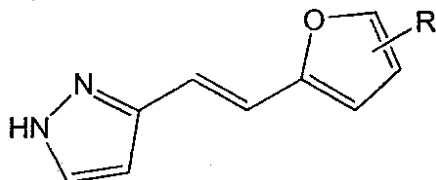


、それらの互変異性体；又はそれらのプロドラッグ、塩、水和物、又はエステルを有する、請求項 2 3 に記載の組成物。

【請求項 2 5】

前記化合物が以下の構造：

【化 2 3】

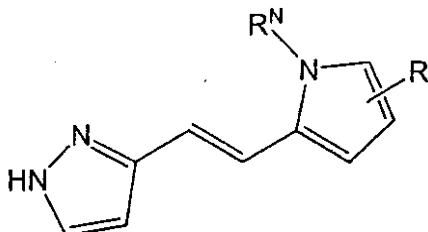


、それらの互変異性体；又はそれらのプロドラッグ、塩、水和物、又はエステルを有する、請求項 7 に記載の化合物または請求項 2 3 に記載の組成物。

【請求項 2 6】

前記化合物が以下の構造：

【化 2 4】



〔式中、R^N が、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、- (アルキル) アリール、- (アルキル) ヘテロアリール、アシル又は窒素保護基である〕

、それらの互変異性体；又はそれらのプロドラッグ、塩、水和物、又はエステルを有する、請求項 7 に記載の化合物または請求項 2 3 に記載の組成物。

【請求項 2 7】

R^N が水素である、請求項 2 6 に記載の化合物または組成物。

【請求項 2 8】

前記化合物において、A L² が、アルキル部分またはシクロアルキル部分である、請求項 1 0 に記載の化合物、あるいは請求項 1 2 または 1 4 に記載の組成物。

【請求項 2 9】

前記化合物において、R¹ が、C (= O) (C H₂)_m A L²、C (= O) O A L²、C (= O) (C H₂)_m アリール、- C (= O) O アリール、- C (= O) O ヘテロ環、または C (= O) (C H₂)_m ヘテロ環であり；ここで m は 1 ~ 3 の整数であり；A L²

が、脂肪族又は脂環式部分であり；及び、 AL^2 、アリール及びヘテロ環部分は、独立して、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-CN$ ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、又は $-S(O)_nR^d$ ($n=0\sim 2$)；ハロゲン及び $C_1\sim 6$ アルキルから独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された $C_1\sim 6$ アルコキシ；N、O及びSからなる群から選択される0～3個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された縮合二環式8～12員環の芳香族又は脂環式環；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換され、そして $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、 $-S(O)_nR^d$ ($n=0\sim 2$)、ヒドロキシ、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、ハロ $C_1\sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール及びヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基でさらに任意で置換された $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、又は $C_3\sim 6$ シクロアルキル；又は $COCH_2OC_2H_5OCH_3$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換され；及び

R^3 は、*cis* 又は *trans* の $CHCH$ アリール、 $CHCH$ ヘテロ環、フェノキシフェニル、又はヘテロ環基であり、ここで、前記アリール、ヘテロ環又はフェノキシフェニル部分は、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-CN$ ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、又は $-S(O)_nR^d$ ($n=0\sim 2$)；任意でハロゲン及び $C_1\sim 6$ アルキルから独立して選択される1つ以上の置換基で置換された $C_1\sim 6$ アルコキシ；N、O又はSから選択される0～3個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された縮合二環式8～12員環の芳香族又は脂環式環；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換された $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、又は $C_3\sim 6$ シクロアルキルから独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換されてもよく；

ここで、 R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 及び R^e はそれぞれ請求項10、12および14に記載されるとおりである、

請求項10に記載の化合物、あるいは請求項12または14に記載の組成物。

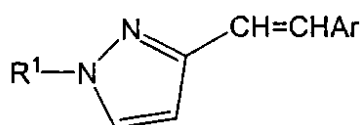
【請求項30】

請求項10に記載の化合物、あるいは請求項12または14に記載の組成物であって、化合物において、 R^3 が、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-CN$ ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、又は $-S(O)_nR^d$ ($n=0\sim 2$)；任意でハロゲン及び $C_1\sim 6$ アルキルからなる群より独立して選択された1つ以上の置換基で置換された $C_1\sim 6$ アルコキシ；N、O又はSから選択される0～3個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された縮合二環式8～12員環の芳香族又は脂環式環；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換され、そして $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、 $-S(O)_nR^d$ ($n=0\sim 2$)、ヒドロキシ、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、ハロ $C_1\sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール及びヘテロシクリルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基でさらに任意で置換された $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、又は $C_3\sim 6$ シクロアルキルからなる群から独立して選択される1つ以上の置換基で任意で置換される、*cis* 又は *trans* の $CHCH$ アリールである、化合物または組成物。

【請求項31】

請求項10に記載の化合物、あるいは請求項12または14に記載の組成物であって、前記化合物が、以下の構造：

【化25】



〔式中、 R^1 が、 SO_2AL^2 、 $C(=O)(CH_2)_mAL^2$ 、 $C(=O)OAL^2$ 、 $-C(=O)NHAL^2$ 、 $-SO_2$ アリール、 $-C(=O)(CH_2)_m$ アリール、 $C(=O)O$ アリール、 $-C(=O)O$ ヘテロ環、 $-C(=O)(CH_2)_m$ ヘテロ環、または $C(=O)NH$ アリールであり；ここで m は 1 ~ 3 の整数であり； AL^2 が、脂肪族又は脂環式部分であり；及び、 AL^2 、アリール及びヘテロ環部分は、独立して、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-CN$ ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、又は $-S(O)_nR^d$ ($n = 0 \sim 2$)；ハロゲン及び $C_1 \sim 6$ アルキルから独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルコキシ； N 、 O 又は S からなる群より選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された縮合二環式 8 ~ 12 員環の芳香族又は脂環式環；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換され、そして $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、 $-S(O)_nR^d$ ($n = 0 \sim 2$)、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、ハロ $C_1 \sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール及びヘテロシクリルからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基でさらに任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、又は $C_3 \sim 6$ シクロアルキル；又は $COCH_2OC_2H_5OCH_3$ からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換され；及び

$CHCHAr$ は、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； CN ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、又は $-S(O)_nR^d$ ($n = 0 \sim 2$)；任意でハロゲン及び $C_1 \sim 6$ アルキルから独立して選択された 1 つ以上の置換基で置換された $C_1 \sim 6$ アルコキシ； N 、 O 又は S からなる群より選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された縮合二環式 8 ~ 12 員環の芳香族又は脂環式環；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、又は $C_3 \sim 6$ シクロアルキルからなる群から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換される、*cis* 又は *trans* の $CHCH$ アリールであり；

ここで、 R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 及び R^e は請求項 10、12 および 14 に記載されるとおりである〕

それらの $C(5)$ - 位置異性体；又はそれらのプロドラッグ、塩、水和物、又はエステルを有する、化合物または組成物。

【請求項 32】

前記化合物において、 R^1 が、 $C(=O)(CH_2)_mAL^2$ 、 $C(=O)OAL^2$ 、 $-C(=O)(CH_2)_m$ アリール、 $-C(=O)O$ アリール、 $-C(=O)O$ ヘテロ環、または $C(=O)(CH_2)_m$ ヘテロ環であり；ここで m は 1 ~ 3 の整数であり； AL^2 が、脂肪族又は脂環式部分であり；及び、 AL^2 、アリール及びヘテロ環部分は、独立して、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-CN$ ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、又は $-S(O)_nR^d$ ($n = 0 \sim 2$)；ハロゲン及び $C_1 \sim 6$ アルキルから独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換される $C_1 \sim 6$ アルコキシ； N 、 O 又は S からなる群より選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された縮合二環式 8 ~ 12 員環の芳香族又は脂環式環；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換され、そして $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、 $-S(O)_nR^d$ ($n = 0 \sim 2$)、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、ハロ $C_1 \sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール及びヘテロシクリルからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基でさらに任意で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、又は $C_3 \sim 6$ シクロアルキル；又は $COCH_2OC_2H_5OCH_3$ からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換される、請求項 10 に記載の化合物、あるいは請求項 12 または 14 に記載の組成物。

【請求項 33】

前記化合物において、 R^1 が、 SO_2AL^2 、 $C(=O)AL^2$ 、 $-C(=O)NHA$

L^2 、 SO_2 アリール、 $C(=O)$ アリール、または $C(=O)NH$ アリールであり；ここで、 AL^2 が、脂肪族又は脂環式部分であり；及び、 AL^2 及びアリール部分が、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-CN$ ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、又は $-S(O)_nR^d$ ($n=0\sim 2$)；ハロゲン及び $C_1\sim 6$ アルキルから独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された $C_1\sim 6$ アルコキシ；N、O 又は S からなる群より選択される 0～3 個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された縮合二環式 8～12 員環の芳香族又は脂環式環；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換され、そして $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、 $-S(O)_nR^d$ ($n=0\sim 2$)、ヒドロキシ、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、ハロ $C_1\sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール及びヘテロシクリルからなる群からなる群より独立して選択される 1～3 個の置換基でさらに任意で置換された $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、又は $C_3\sim 6$ シクロアルキル；あるいは $COCH_2OC_2H_5OCH_3$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換される、請求項 10 に記載の化合物、あるいは請求項 12 または 14 に記載の組成物。

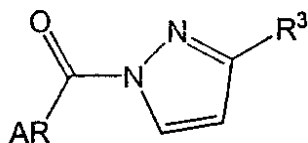
【請求項 34】

前記化合物において、 AL^2 がアルキル又はシクロアルキル部分である、請求項 31～33 のいずれか 1 項に記載の化合物または組成物。

【請求項 35】

前記化合物が以下の構造：

【化 26】



〔式中、AR が、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-CN$ ；アリール；ヘテロアリール；ヘテロ環；カルボキシエステル； $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、または $-S(O)_nR^d$ ($n=0\sim 2$)；任意でハロゲン及び $C_1\sim 6$ アルキルから独立して選択される 1 つ以上の置換基で置換された $C_1\sim 6$ アルコキシ；N、O 又は S からなる群より選択される 0～3 個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された縮合二環式 8～12 員環の芳香族又は脂環式環； $-NR^fR^g$ ；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換され、そして $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、 $-S(O)_nR^d$ ($n=0\sim 2$)、ヒドロキシ、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、ハロ $C_1\sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール及びヘテロシクリルからなる群から独立して選択される 1～3 個の置換基でさらに任意で置換された $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、又は $C_3\sim 6$ シクロアルキルからなる群から選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換される、N、O 及び S からなる群から選択される 0～3 個のヘテロ原子を含有する、任意で縮合した 3～12 員環の芳香族又は脂環式単環または二環式環であり；及び

R^3 は、水素；ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ； $-CN$ ；アリール；ヘテロアリール； $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、又は $-S(O)_nR^d$ ($n=0\sim 2$)；任意でハロゲン及び $C_1\sim 6$ アルキルから独立して選択された 1 つ以上の置換基で置換された $C_1\sim 6$ アルコキシ；N、O 又は S から選択される 0～3 個のヘテロ原子を含有する、任意で置換された縮合二環式 8～12 員環の芳香族又は脂環式環；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1\sim 5$ アルコキシ、ニトロ、及び $-N(R^e)_2$ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換され、そして $-C(=O)R^a$ 、 $-NR^bR^c$ 、 $-S(O)_nR^d$ ($n=0\sim 2$)、ヒドロキシ、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、ハロ $C_1\sim 6$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール及びヘテロシクリルからなる群から独立して選択される 1～3 個の置換基でさらに任意で置換された $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、又は C_3

-₆ シクロアルキルからなる群から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換される、*cis* 又は *trans* の CHCH ヘテロ環、フェノキシフェニル、又はヘテロ環であり、

ここで、R^a が、水素、ヒドロキシ、C₁ - ₆ アルキル、C₁ - ₆ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、及び NR^b R^c からなる群から選択され、ここで、C₁ - ₆ アルキル及び C₁ - ₆ アルコキシは、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁ - ₅ アルコキシ、ニトロ、及び - N (R^e)₂ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換され；

R^b 及び R^c は独立して、水素；ヒドロキシ；- SO₂ R^d；ハロゲン、ヒドロキシ、C₁ - ₅ アルコキシ、ニトロ、及び - N (R^e)₂ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された C₁ - ₆ アルキル；ハロゲン、ヒドロキシ、C₁ - ₅ アルコキシ、ニトロ及び - N (R^e)₂ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された C₁ - ₆ アルコキシ；ハロゲン、ヒドロキシ、C₁ - ₄ アルキル、C₁ - ₅ アルコキシ、ニトロ、及び - N (R^e)₂ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されたアリール；及び、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁ - ₄ アルキル、C₁ - ₅ アルコキシ、ニトロ、及び - N (R^e)₂ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され；

R^d は、水素；N (R^e)₂；ハロゲン、ヒドロキシ、C₁ - ₅ アルコキシ、ニトロ、及び N (R^e)₂ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された C₁ - ₆ アルキル；アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され；及び

R^e は、水素又は C₁ - ₆ アルキルであり；

R^f 及び R^g は、独立して、水素；ヒドロキシ；- SO₂ R^d；ハロゲン、ヒドロキシ、C₁ - ₅ アルコキシ、ニトロ、及び - N (R^e)₂ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された C₁ - ₆ アルキル；ハロゲン、ヒドロキシ、C₁ - ₅ アルコキシ、ニトロ及び - N (R^e)₂ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換された C₁ - ₆ アルコキシ；ハロゲン、ヒドロキシ、C₁ - ₄ アルキル、C₁ - ₅ アルコキシ、ニトロ、及び - N (R^e)₂ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されたアリール；及び、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁ - ₄ アルキル、C₁ - ₅ アルコキシ、ニトロ、及び - N (R^e)₂ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、

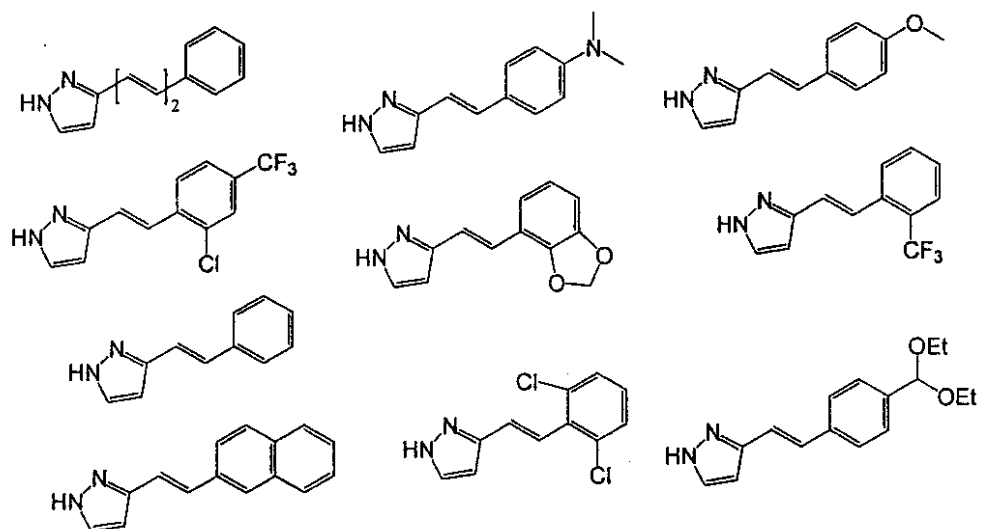
但し、AR がアリールである場合、R³ は、- CH = CH - ヘテロアリール、フェノキシフェニル、ヘテロアリールまたはアリール置換ヘテロアリールではなく、該アリール基およびヘテロアリール基のそれぞれが、独立して、必要に応じて、ハロゲン、C₁ - ₄ アルキル、C₃ - ₄ シクロアルキル、C₁ - ₄ アルコキシ、C₃ - ₄ シクロアルコキシ、- CF₃、- CHF₂、- NO₂、- OH、- NH₂、- NHC₁ - ₆ アルキル、- N (C₁ - ₆ アルキル)₂、- NHC₃ - ₆ シクロアルキル、- N (C₃ - ₆ シクロアルキル)₂、- N (C₁ - ₆ アルキル) C₃ - ₆ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールからなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基で置換され；該アルキル部分およびアルコキシ部分のそれぞれが、非置換である]

それらの C (5) - 位置異性体；又はそれらのプロドラッグ、塩、水和物、又はエステルを有する、請求項 10 に記載の化合物、あるいは請求項 12 または 14 に記載の組成物。

【請求項 36】

前記化合物が、以下の構造：

【化 2 7】

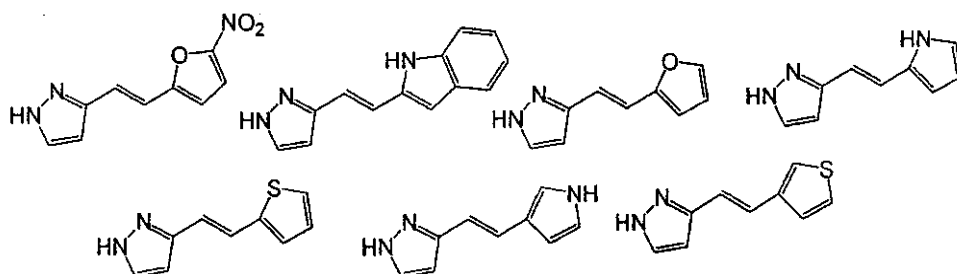


のいずれか 1 つを有する、請求項 1 1 または 1 3 に記載の組成物。

【請求項 3 7】

前記化合物が、以下の構造：

【化 2 8】

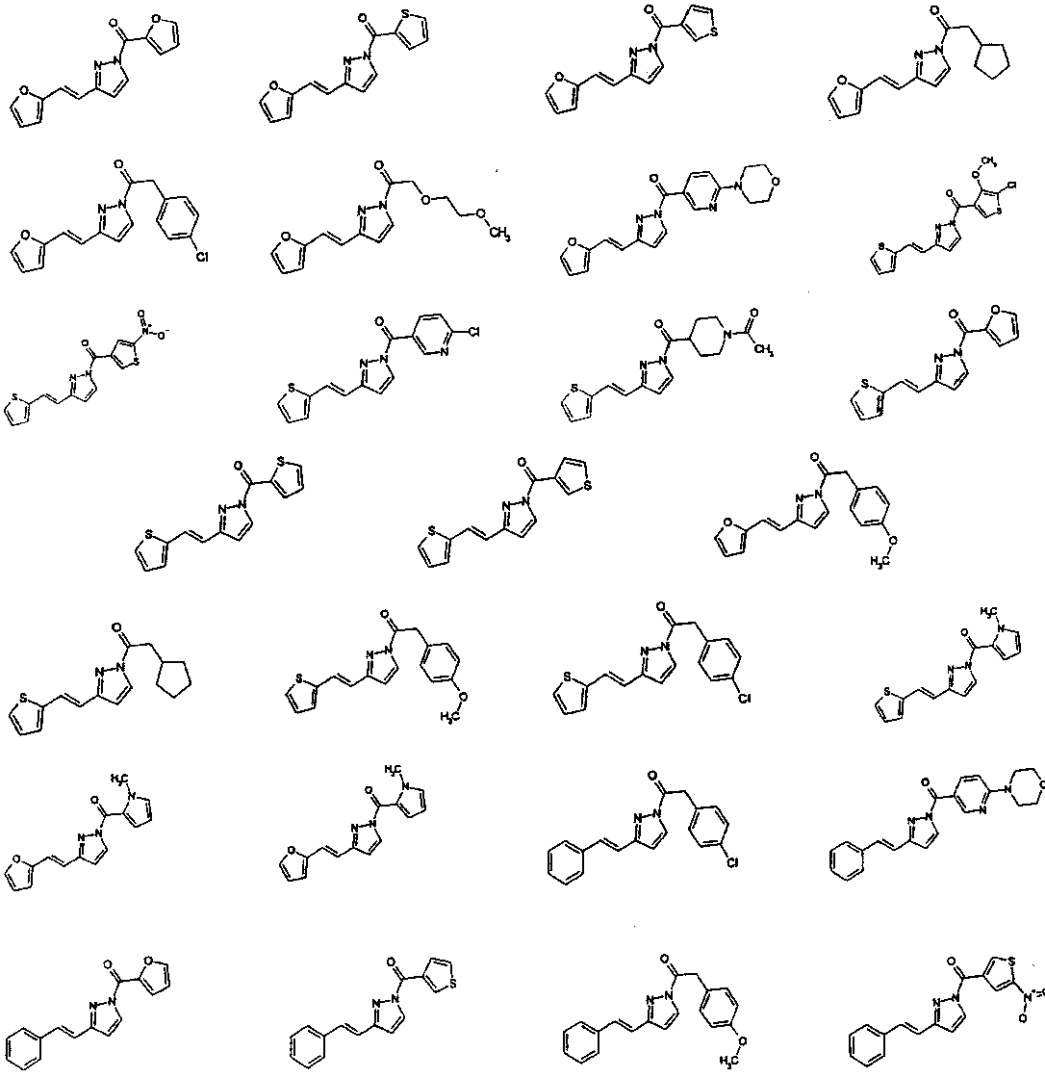


のいずれか 1 つを有する、請求項 1 1 または 1 3 に記載の組成物。

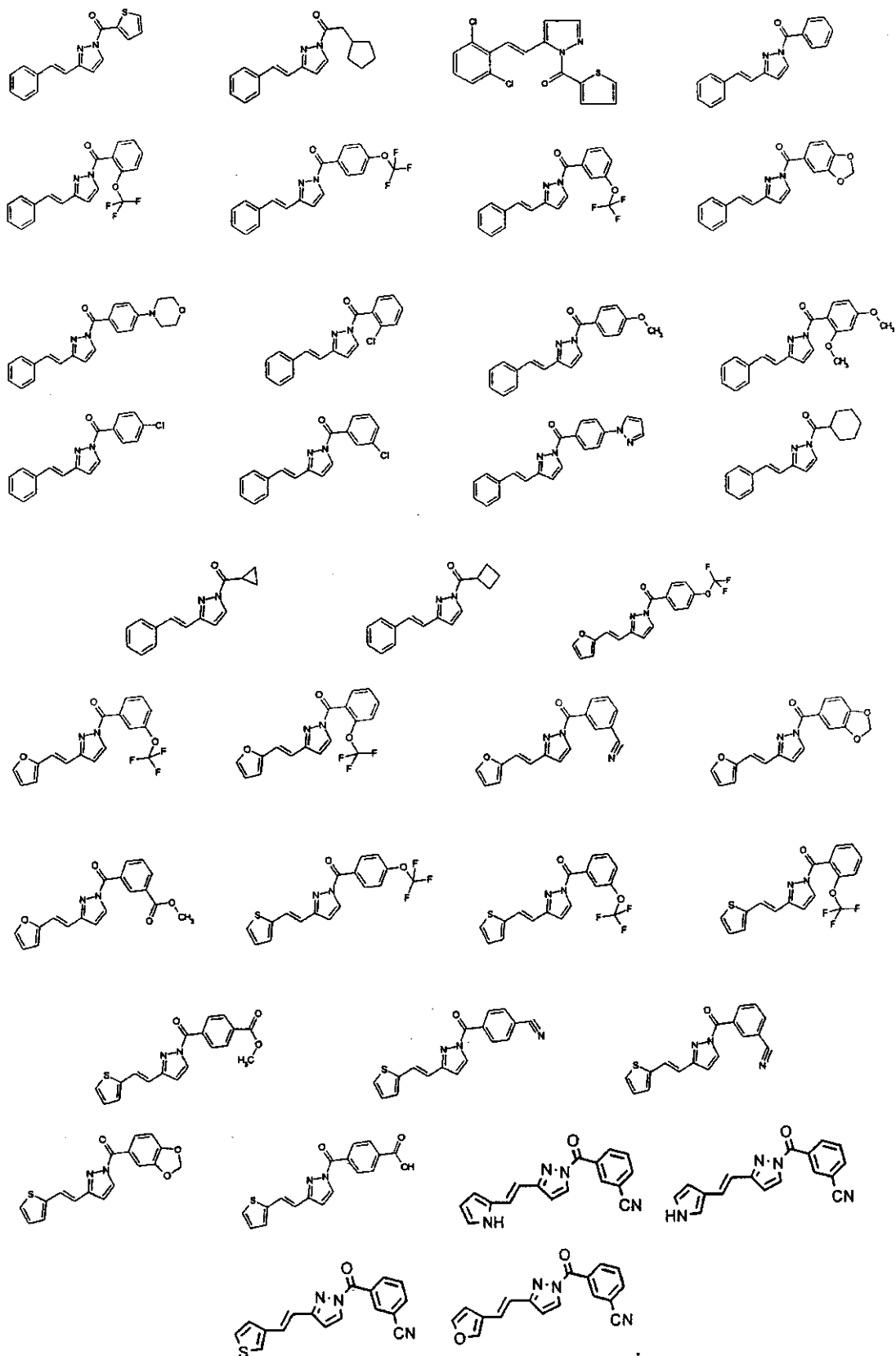
【請求項 3 8】

前記化合物が、以下の構造：

【化 29】



【化 3 0】



のいずれか 1 つを有する、請求項 10 に記載の化合物、あるいは請求項 12 または 14 に記載の組成物。

【請求項 39】

前記組成物が H G F / S F が役割を果たす状態、疾患又は障害を治療するための組成物

である、請求項 1 3 又は 1 4 に記載の薬学的組成物。

【請求項 4 0】

前記組成物が、繊維症肝疾患、肝臓虚血 - 再かん流傷害、脳梗塞、虚血性心臓疾患、腎臓疾患又は肺（肺性）繊維症から選択される疾患又は状態を治療又はその重篤度を低減させるためのものである、請求項 1 3 又は 1 4 に記載の薬学的組成物。

【請求項 4 1】

前記組成物が、C 型肝炎、B 型肝炎、デルタ肝炎、慢性アルコール中毒、非アルコール性脂肪性肝炎、肝外閉塞（胆管中の石）、胆管炎（原発性胆汁性肝硬変及び硬化性胆管炎）、自己免疫肝臓疾患、及び遺伝性代謝障害（Wilson 病、ヘモクロマトーシス、及び - 1 アンチトリプシン欠損症）；損傷した臓器及び / 又は虚血性臓器、移植又は接木；虚血 / 再かん流傷害；発作；脳血管性疾患；心筋虚血；アテローム性動脈硬化症；腎不全；腎臓繊維症及び特発性の肺性繊維症に関連する肝臓繊維症から選択される疾患又は状態を治療又はその重篤度を低減させるためのものである、請求項 1 3 又は 1 4 に記載の薬学的組成物。

【請求項 4 2】

前記組成物が、以下の治癒を促進するために傷を治療するためのものである、請求項 1 3 又は 1 4 に記載の薬学的組成物；損傷臓器及び / 又は虚血性臓器、移植又は接木の血管新生；脳、心臓、肝臓、腎臓及び他の組織及び臓器における虚血 / 再かん流障害の改善；慢性心臓虚血又は心筋層の梗塞の結果としての心筋層のかん流の正常化；血管閉塞後又は虚血性組織若しくは臓器に対する側副血管成長又は側副血管成長の増加；繊維化疾患；繊維症及び肝硬変を含む肝臓疾患；肺繊維症；造影剤による腎障害；腎臓障害に対する二次的な繊維症；腎臓外傷及び移植；慢性糖尿病及び / 又は高血圧に対する二次的な腎不全；及び / 又は真性糖尿病。