

【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24年7月5日(2012.7.5)

【公表番号】特表2010-520884(P2010-520884A)

【公表日】平成22年6月17日(2010.6.17)

【年通号数】公開・登録公報2010-024

【出願番号】特願2009-552912(P2009-552912)

【国際特許分類】

C 0 7 D 219/02 (2006.01)

A 6 1 P 7/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/02 (2006.01)

C 0 7 D 333/76 (2006.01)

A 6 1 K 31/381 (2006.01)

C 0 7 D 307/91 (2006.01)

A 6 1 K 31/343 (2006.01)

A 6 1 K 31/155 (2006.01)

C 0 7 D 327/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/39 (2006.01)

C 0 7 D 311/86 (2006.01)

A 6 1 K 31/352 (2006.01)

A 6 1 K 31/473 (2006.01)

C 0 7 D 337/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/38 (2006.01)

C 0 7 D 311/82 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 C 335/32 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 219/02 C S P

A 6 1 P 7/06

A 6 1 P 3/02

C 0 7 D 333/76

A 6 1 K 31/381

C 0 7 D 307/91

A 6 1 K 31/343

A 6 1 K 31/155

C 0 7 D 327/08

A 6 1 K 31/39

C 0 7 D 311/86

A 6 1 K 31/352

A 6 1 K 31/473

C 0 7 D 337/10

A 6 1 K 31/38

C 0 7 D 311/82

A 6 1 P 43/00 1 2 3

C 0 7 C 335/32

【手続補正書】

【提出日】平成23年2月24日(2011.2.24)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0007

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0007】

発明の概要

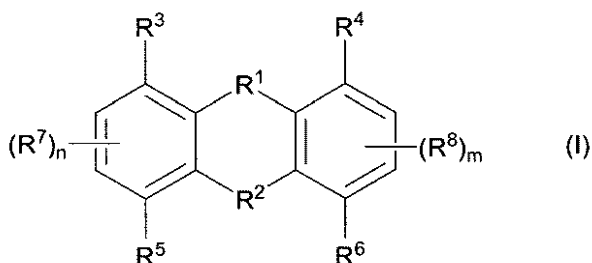
本発明は、本発明の三環式化合物および鉄障害の処置のための該化合物を含む医薬組成物に関する。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目1)

式(I)：

【化41】



(式中：

$n$  および  $m$  は、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  および  $R^2$  は、各々独立して、直接結合、 $-C(R^9)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-N(R^9)-$  または  $-CH_2-R^{10}-CH_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  は異なり、各々独立して、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、もしくは  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択されるか；

または  $R^3$  および  $R^4$  は同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、もしくは  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  は異なり、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{14})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 であるか；

または  $R^5$  および  $R^6$  は同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{14})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^7$  および  $R^8$  は、独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアル

キル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{11}$   
 $-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^5-OS(O)_2R^{15}$ 、 $-R^{11}$   
 $-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_pR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}$   
 $-C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-OC(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}$   
 $-C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-N=C(R^{15})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}$   
 $-N(R^{14})C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(=NR^{14})N(R^{14})_2$ 、および $-R^{11}-N(R^{14})C(N=C(R^{14})_2)N(R^{14})_2$ からなる群より選択され、ここで、各 p は独立して 0、1 または 2 であり、各 t は独立して 1 または 2 である；

各  $R^9$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

$R^{10}$  は、 $-C(R^9)_2$ 、 $-S-$ 、 $-O-$  または  $-N(R^9)-$  である；

各  $R^{11}$  は、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  は、独立して、水素、アルキル、または  $-OR^9$  である；

各  $R^{14}$  は、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $R^{15}$  は、アルキルである）

の化合物であって、その立体異性体、鏡像異性体、互変異性体もしくはその混合物としての化合物；

またはその薬学的に許容され得る塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ。

(項目 2)

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  および  $R^2$  が、各々独立して、直接結合、 $-C(R^9)_2$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-N(R^9)-$  または  $-CH_2-R^{10}-CH_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  が同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{14})_2$  から選択され、ここで、各 t は独立して 1 もしくは 2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキ

ル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^5-OS(O)_2R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_pR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-OC(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-N=C(R^{15})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(=NR^{14})N(R^{14})_2$ 、および $-R^{11}-N(R^{14})C(N=C(R^{14})_2)N(R^{14})_2$ からなる群より選択され、ここで、各pは独立して0、1または2であり、各tは独立して1または2である；

各 $R^9$ が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

$R^{10}$ が、 $-C(R^9)_2$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ または $-N(R^9)-$ である；

各 $R^{11}$ が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各 $R^{12}$ および $R^{13}$ が独立して、水素、アルキル、または $-OR^9$ である；

各 $R^{14}$ が独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各 $R^{15}$ が、アルキルである、

項目1に記載の化合物。

(項目3)

nおよびmが、各々独立して0、1または2である；

$R^1$ が $-S-$ である；

$R^2$ が直接結合である；

$R^3$ および $R^4$ が同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ または $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ から選択される；

$R^5$ および $R^6$ が同じであり、水素、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ または $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ から選択される；

各 $R^7$ および $R^8$ が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各 $R^9$ が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールア

ルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

項目 2 に記載の化合物。

(項目 4)

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-S-$  である；

$R^2$  が直接結合である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素または  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

項目 3 に記載の化合物。

(項目 5)

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-S-$  である；

$R^2$  が直接結合である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  がともに水素である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

項目 4 に記載の化合物。

(項目 6)

ジベンゾ [b, d] チオフェン - 4, 6 - ジイルビス (メチレン) ジカルバムイミドチオアート；

(2 - フルオロジベンゾ [b, d] チオフェン - 4, 6 - ジイル) ビス (メチレン) ジカルバムイミドチオアート；

(3, 7 - ジプロモジベンゾ [b, d] チオフェン - 4, 6 - ジイル) ビス (メチレン) ジカルバムイミドチオアート；

(2 - クロロ - 8 - フルオロジベンゾ [b, d] チオフェン - 4, 6 - ジイル) ビス (メチレン) ジカルバムイミドチオアート；および

(3 - プロモジベンゾ [b, d] チオフェン - 4, 6 - ジイル) ビス (メチレン) ジカルバムイミドチオアート

からなる群より選択される、項目 5 に記載の化合物。

(項目 7)

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が直接結合である；

$R^2$  が  $-S-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  がともに水素である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキル

からなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

項目 2 に記載の化合物。

(項目 8)

ジベンゾ [b, d] チオフェン - 1, 9 - ジイルビス (メチレン) ジカルバムイミドチオアートである、項目 7 に記載の化合物。

(項目 9)

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-O-$  である；

$R^2$  が直接結合または  $-C(O)-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  が同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

項目 2 に記載の化合物。

(項目 10)

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-O-$  である；

$R^2$  が直接結合または  $-C(O)-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素または  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

項目 9 に記載の化合物。

(項目 11)

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-O-$  である；

$R^2$  が直接結合または  $-C(O)-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；  
 $R^5$  および  $R^6$  がともに水素である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラールキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

項目 10 に記載の化合物。

(項目 12)

(9-オキソ-9H-キサンテン-4,5-ジイル)ビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート；

ジベンゾ[b,d]フラン-4,6-ジイルビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート；

(3,7-ジメチルジベンゾ[b,d]フラン-4,6-ジイル)ビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート；

(3,7-ジクロロジベンゾ[b,d]フラン-4,6-ジイル)ビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート；

(3,7-ジブロモジベンゾ[b,d]フラン-4,6-ジイル)ビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート；

(2-フルオロジベンゾ[b,d]フラン-4,6-ジイル)ビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート；および

(2,8-ジブロモジベンゾ[b,d]フラン-4,6-ジイル)ビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート

からなる群より選択される、項目 11 に記載の化合物。

(項目 13)

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が直接結合である；

$R^2$  が直接結合である；

$R^3$  および  $R^4$  が同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラールキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

項目 2 に記載の化合物。

(項目 14)

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が直接結合である；  
 $R^2$  が直接結合である；  
 $R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；  
 $R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素または  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})$   
 $R^{13}$  から選択される；  
各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキル  
からなる群より選択される；  
各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換さ  
れたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；  
各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに  
各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、  
項目 13 に記載の化合物。

(項目 15)

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；  
 $R^1$  が直接結合である；  
 $R^2$  が直接結合である；  
 $R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；  
 $R^5$  および  $R^6$  がともに水素である；  
各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキル  
からなる群より選択される；  
各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換さ  
れたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；  
各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに  
各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、  
、項目 14 に記載の化合物。

(項目 16)

ビフェニレン-1, 8-ジイルビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート；および  
(3, 6-ジフルオロビフェニレン-1, 8-ジイル)ビス(メチレン)ジカルバムイミ  
ドチオアート  
からなる群より選択される、項目 15 に記載の化合物。

(項目 17)

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；  
 $R^1$  が直接結合である；  
 $R^2$  が直接結合である；  
 $R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；  
 $R^5$  および  $R^6$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；  
各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキル  
からなる群より選択される；  
各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換さ  
れたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；  
各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに  
各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、  
、項目 14 に記載の化合物。

(項目 18)

ビフェニレン-1, 4, 5, 8-テトライルテトラキス(メチレン)テトラカルバムイミ  
ドチオアートである、項目 17 に記載の化合物。

(項目 19)

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；  
 $R^1$  が  $-C(O)-$  である；  
 $R^2$  が直接結合である；



$R^3$  および  $R^4$  が同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラールキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、  
項目 2 に記載の化合物。

(項目 20)

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-C(O)-$  である；

$R^2$  が直接結合である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素または  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラールキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

項目 19 に記載の化合物。

(項目 21)

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-C(O)-$  である；

$R^2$  が直接結合である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  がともに水素である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラールキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

項目 20 に記載の化合物。

(項目 22)

2 - (8 - カルバムイミドイルスルファニルメチル - 9 - オキソ - 9H - フルオレン - 1 - イルメチル) - イソチオ尿素である、項目 21 に記載の化合物。

(項目 23)

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

R<sup>1</sup> が直接結合である；

R<sup>2</sup> が - C ( O ) - である；

R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> がともに - R<sup>1 1</sup> - S - C ( = N R<sup>1 2</sup> ) N ( R<sup>1 2</sup> ) R<sup>1 3</sup> である；

R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> がともに水素である；

各 R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> が独立して、- R<sup>1 1</sup> - O R<sup>9</sup>、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各 R<sup>9</sup> が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各 R<sup>1 1</sup> が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各 R<sup>1 2</sup> および R<sup>1 3</sup> が独立して、水素、アルキルまたは - O R<sup>9</sup> である、

項目 2 に記載の化合物。

( 項目 2 4 )

( 9 - オキソ - 9 H - フルオレン - 4 , 5 - ジイル ) ビス ( メチレン ) ジカルバムイミドチオアートである、項目 2 3 に記載の化合物。

( 項目 2 5 )

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

R<sup>1</sup> が - O - である；

R<sup>2</sup> が - C ( R<sup>9</sup> )<sub>2</sub> - である；

R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> が同じであり、- R<sup>1 1</sup> - S - C ( = N R<sup>1 2</sup> ) N ( R<sup>1 2</sup> ) R<sup>1 3</sup>、- R<sup>1 1</sup> - O - C ( = N R<sup>1 2</sup> ) N ( R<sup>1 2</sup> ) R<sup>1 3</sup>、- R<sup>1 1</sup> - C ( = N R<sup>1 2</sup> ) N ( R<sup>1 2</sup> ) R<sup>1 3</sup> または - R<sup>1 1</sup> - N ( R<sup>9</sup> ) - C ( = N R<sup>1 2</sup> ) N ( R<sup>1 2</sup> ) R<sup>1 3</sup> から選択される；

R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> が同じであり、水素、- R<sup>1 1</sup> - S - C ( = N R<sup>1 2</sup> ) N ( R<sup>1 2</sup> ) R<sup>1 3</sup>、- R<sup>1 1</sup> - O - C ( = N R<sup>1 2</sup> ) N ( R<sup>1 2</sup> ) R<sup>1 3</sup>、- R<sup>1 1</sup> - C ( = N R<sup>1 2</sup> ) N ( R<sup>1 2</sup> ) R<sup>1 3</sup> または - R<sup>1 1</sup> - N ( R<sup>9</sup> ) - C ( = N R<sup>1 2</sup> ) N ( R<sup>1 2</sup> ) R<sup>1 3</sup> から選択される；

各 R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> が独立して、- R<sup>1 1</sup> - O R<sup>9</sup>、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各 R<sup>9</sup> が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各 R<sup>1 1</sup> が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各 R<sup>1 2</sup> および R<sup>1 3</sup> が独立して、水素、アルキルまたは - O R<sup>9</sup> である、

項目 2 に記載の化合物。

( 項目 2 6 )

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

R<sup>1</sup> が - O - である；

R<sup>2</sup> が - C ( R<sup>9</sup> )<sub>2</sub> - である；

R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> がともに - R<sup>1 1</sup> - S - C ( = N R<sup>1 2</sup> ) N ( R<sup>1 2</sup> ) R<sup>1 3</sup> である；

R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> が同じであり、水素または - R<sup>1 1</sup> - S - C ( = N R<sup>1 2</sup> ) N ( R<sup>1 2</sup> ) R<sup>1 3</sup> から選択されるから選択される；

各 R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> が独立して、- R<sup>1 1</sup> - O R<sup>9</sup>、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各 R<sup>9</sup> が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各 R<sup>1 1</sup> が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、  
項目 25 に記載の化合物。

(項目 27)

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-O-$  である；

$R^2$  が  $-C(R^9)_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  がともに水素である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキル  
からなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換さ  
れたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、  
項目 26 に記載の化合物。

(項目 28)

2 - (2, 7 - ジ - tert - ブチル - 5 - カルバムイミドイルスルファニルメチル - 9  
, 9 - ジメチル - 9H - キサンテン - 4 - イルメチル) - イソチオ尿素である、項目 27  
に記載の化合物。

(項目 29)

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-O-$  である；

$R^2$  が  $-S-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  が同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、  
 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から  
選択される；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、  
 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$   
から選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキル  
からなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアル  
キル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル  
アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意  
選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、  
任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールア  
ルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、  
項目 2 に記載の化合物。

(項目 30)

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-O-$  である；

$R^2$  が  $-S-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素または  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$   
から選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキル

からなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、  
項目 29 に記載の化合物。

(項目 31)

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-O-$  である；

$R^2$  が  $-S-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  がともに水素である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、  
項目 30 に記載の化合物。

(項目 32)

フェノキサチン - 4, 6 - ジイルビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアートである、  
項目 31 に記載の化合物。

(項目 33)

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が直接結合である；

$R^2$  が  $-CH_2-S-CH_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  が同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、  
項目 2 に記載の化合物。

(項目 34)

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が直接結合である；

$R^2$  が  $-CH_2-S-CH_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素または  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

項目 3 3 に記載の化合物。

(項目 3 5)

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が直接結合である；

$R^2$  が  $-CH_2-S-CH_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  がともに水素である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

項目 3 4 に記載の化合物。

(項目 3 6)

(5, 7 - ジヒドロジベンゾ [c, e] チエピン - 1, 11 - ジイル) ビス (メチレン) ジカルバムイミドチオアートである、項目 3 5 に記載の化合物。

(項目 3 7)

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  および  $R^2$  が、各々独立して、直接結合、 $-C(R^9)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-N(R^9)-$  または  $-CH_2-R^{10}-CH_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  が異なっており、各々独立して、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  が異なっており、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{14})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^5-OS(O)_2R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_pR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-OC(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}$

- C ( S ) O R <sup>1 4</sup>、 - R <sup>1 1</sup> - C ( O ) N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、 - R <sup>1 1</sup> - C ( S ) N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、 - N = C ( R <sup>1 5</sup> ) <sub>2</sub>、 - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) C ( O ) R <sup>1 5</sup>、 - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) C ( S ) R <sup>1 5</sup>、 - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) C ( O ) O R <sup>1 4</sup>、 - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) C ( S ) O R <sup>1 4</sup>、 - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) C ( O ) N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、 - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) C ( S ) N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、 - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) S ( O ) <sub>t</sub> R <sup>1 4</sup>、 - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) S ( O ) <sub>t</sub> N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、 - R <sup>1 1</sup> - S ( O ) <sub>t</sub> N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、 - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) C ( = N R <sup>1 4</sup> ) N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、および - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) C ( N = C ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub> ) N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub> からなる群より選択され、ここで、各 p は独立して 0、1 または 2 であり、各 t は独立して 1 または 2 である；

各 R <sup>9</sup> が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

R <sup>1 0</sup> が、- C ( R <sup>9</sup> ) <sub>2</sub> -、- S -、- O - または - N ( R <sup>9</sup> ) - である；

各 R <sup>1 1</sup> が、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各 R <sup>1 2</sup> および R <sup>1 3</sup> が独立して、水素、アルキルまたは - O R <sup>9</sup> である；

各 R <sup>1 4</sup> が、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各 R <sup>1 5</sup> が、アルキルである、

項目 1 に記載の化合物。

( 項目 3 8 )

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

R <sup>1</sup> および R <sup>2</sup> が、各々独立して、直接結合、- C ( R <sup>9</sup> ) <sub>2</sub> -、- S -、- O -、- C ( O ) -、- N ( R <sup>9</sup> ) - または - C H <sub>2</sub> - R <sup>1 0</sup> - C H <sub>2</sub> - である；

R <sup>3</sup> および R <sup>4</sup> が異なり、各々独立して、- R <sup>1 1</sup> - S - C ( = N R <sup>1 2</sup> ) N ( R <sup>1 2</sup> ) R <sup>1 3</sup>、- R <sup>1 1</sup> - O - C ( = N R <sup>1 2</sup> ) N ( R <sup>1 2</sup> ) R <sup>1 3</sup>、- R <sup>1 1</sup> - C ( = N R <sup>1 2</sup> ) N ( R <sup>1 2</sup> ) R <sup>1 3</sup> または - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>9</sup> ) - C ( = N R <sup>1 2</sup> ) N ( R <sup>1 2</sup> ) R <sup>1 3</sup> から選択される；

R <sup>5</sup> および R <sup>6</sup> が同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、- R <sup>1 1</sup> - C N、- R <sup>1 1</sup> - N O <sub>2</sub>、- R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、- R <sup>1 1</sup> - C ( O ) O R <sup>1 4</sup>、- R <sup>1 1</sup> - C ( O ) N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、- R <sup>1 1</sup> - S - C ( = N R <sup>1 2</sup> ) N ( R <sup>1 2</sup> ) R <sup>1 3</sup>、- R <sup>1 1</sup> - O - C ( = N R <sup>1 2</sup> ) N ( R <sup>1 2</sup> ) R <sup>1 3</sup>、- R <sup>1 1</sup> - C ( = N R <sup>1 2</sup> ) N ( R <sup>1 2</sup> ) R <sup>1 3</sup>、- R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>9</sup> ) - C ( = N R <sup>1 2</sup> ) N ( R <sup>1 2</sup> ) R <sup>1 3</sup>、- N ( R <sup>1 4</sup> ) S ( O ) <sub>t</sub> R <sup>1 5</sup>、- S ( O ) <sub>t</sub> O R <sup>1 5</sup>、- S ( O ) <sub>p</sub> R <sup>1 4</sup>、または - S ( O ) <sub>t</sub> N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub> から選択され、ここで、各 t は独立して 1 もしくは 2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 である；

各 R <sup>7</sup> および R <sup>8</sup> が独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、- R <sup>1 1</sup> - C N、- R <sup>1 1</sup> - N O <sub>2</sub>、- R <sup>1 1</sup> - O R <sup>9</sup>、- R <sup>5</sup> - O S ( O ) <sub>2</sub> R <sup>1 5</sup>、- R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、- R <sup>1 1</sup> - S ( O ) <sub>p</sub> R <sup>1 4</sup>、- R <sup>1 1</sup> - C ( O ) R <sup>1 4</sup>、- R <sup>1 1</sup> - C ( S ) R <sup>1 5</sup>、- R <sup>1 1</sup> - C ( O ) O R <sup>1 4</sup>、- R <sup>1 1</sup> - O C ( O ) R <sup>1 4</sup>、- R <sup>1 1</sup> - C ( S ) O R <sup>1 4</sup>、- R <sup>1 1</sup> - C ( O ) N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、- R <sup>1 1</sup> - C ( S ) N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、- N = C ( R <sup>1 5</sup> ) <sub>2</sub>、- R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) C ( O ) R <sup>1 5</sup>、- R <sup>1 1</sup> - N

$(R^{14})C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(=NR^{14})N(R^{14})_2$ 、および  $-R^{11}-N(R^{14})C(N=C(R^{14})_2)N(R^{14})_2$  からなる群より選択され、ここで、各 p は独立して 0、1 または 2 であり、各 t は独立して 1 または 2 である；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

$R^{10}$  が、 $-C(R^9)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$  または  $-N(R^9)-$  である；

各  $R^{11}$  が、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である；

各  $R^{14}$  が、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $R^{15}$  が、アルキルである、

項目 1 に記載の化合物。

(項目 39)

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  および  $R^2$  が、各々独立して、直接結合、 $-C(R^9)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-N(R^9)-$  または  $-CH_2-R^{10}-CH_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  が同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  が異なっており、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{14})_2$  から選択され、ここで、各 t は独立して 1 もしくは 2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^5-OS(O)_2R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_pR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-OC(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-N=C(R^{15})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-$

$-N(R^{14})C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(=NR^{14})N(R^{14})_2$ 、および  $-R^{11}-N(R^{14})C(N=C(R^{14})_2)N(R^{14})_2$  からなる群より選択され、ここで、各  $p$  は独立して 0、1 または 2 であり、各  $t$  は独立して 1 または 2 である；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

$R^{10}$  が、 $-C(R^9)_2$ 、 $-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$  または  $-N(R^9)-$  である；

各  $R^{11}$  が、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である；

各  $R^{14}$  が、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

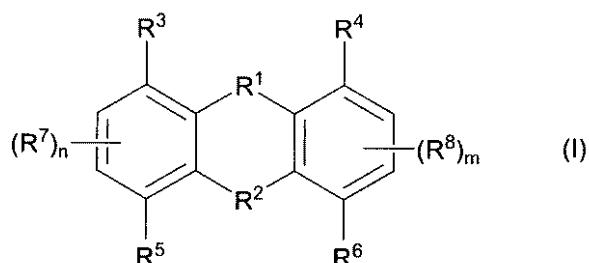
各  $R^{15}$  が、アルキルである、

項目 1 に記載の化合物。

(項目 40)

薬学的に許容され得る賦形剤と、式 (I)：

【化 42】



(式中：

$n$  および  $m$  は、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  および  $R^2$  は、各々独立して、直接結合、 $-C(R^9)_2$ 、 $-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-N(R^9)-$  または  $-CH_2-R^{10}-CH_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  は異なっており、各々独立して、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、もしくは  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

または  $R^3$  および  $R^4$  は同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、もしくは  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  は異なっており、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{14})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは



2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 であるか；

または  $R^5$  および  $R^6$  は同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}$ 、 $-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{14})_2$  から選択され、ここで、各 t は独立して 1 もしくは 2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^5-OS(O)_2R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_pR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-OC(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-N=C(R^{15})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(=NR^{14})N(R^{14})_2$ 、および  $-R^{11}-N(R^{14})C(N=C(R^{14})_2)N(R^{14})_2$  からなる群より選択され、ここで、各 p は独立して 0、1 または 2 であり、各 t は独立して 1 または 2 である；

各  $R^9$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

$R^{10}$  は、 $-C(R^9)_2$ 、 $-S$ 、 $-O$  または  $-N(R^9)$  である；

各  $R^{11}$  は、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  は独立して、水素、アルキル、または  $-OR^9$  である；

各  $R^{14}$  は、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $R^{15}$  は、アルキルである）

の化合物であって、その立体異性体、鏡像異性体、互変異性体もしくはその混合物としての化合物；

またはその薬学的に許容され得る塩、溶媒和物もしくはプロドラッグを含む医薬組成物。

(項目 41)

治療有効量の式 (I)：

(I)

各  $R^7$  および  $R^8$  は独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラールキル、任意選択的に置換されたアラールケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{11}$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^5-OS(O)_2R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_pR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-OC(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-N=C(R^{15})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N$

$R^{14})C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(=NR^{14})N(R^{14})_2$ 、および  $-R^{11}-N(R^{14})C(N=C(R^{14})_2)N(R^{14})_2$  からなる群より選択され、ここで、各  $p$  は独立して 0、1 または 2 であり、各  $t$  は独立して 1 または 2 である；

各  $R^9$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

$R^{10}$  は、 $-C(R^9)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$  または  $-N(R^9)-$  である；

各  $R^{11}$  は、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  は独立して、水素、アルキル、または  $-OR^9$  である；

各  $R^{14}$  は、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $R^{15}$  は、アルキルである；

の化合物であって、その立体異性体、鏡像異性体、互変異性体もしくはその混合物としての化合物；

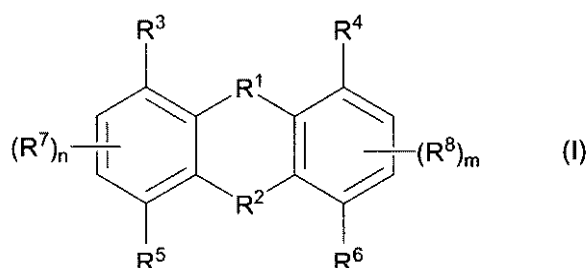
またはその薬学的に許容され得る塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ

を哺乳動物に投与することを含む、該哺乳動物の鉄障害を処置する方法。

(項目 42)

哺乳動物の鉄障害と関連する疾患または病状を処置する方法であって、該処置を必要とする哺乳動物に、治療有効量の式 (I)：

【化 44】



(式中：

$n$  および  $m$  は、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  および  $R^2$  が、各々独立して、直接結合、 $-C(R^9)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-N(R^9)-$  または  $-CH_2-R^{10}-CH_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  は異なっており、各々独立して、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、もしくは  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

または  $R^3$  および  $R^4$  は同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、もしくは  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  は異なっており、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)$

$OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または $-S(O)_tN(R^{14})_2$ から選択され、ここで、各 $t$ は独立して1もしくは2であり、各 $p$ は0、1もしくは2であるか；

または $R^5$ および $R^6$ は同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または $-S(O)_tN(R^{14})_2$ から選択され、ここで、各 $t$ は独立して1もしくは2であり、各 $p$ は0、1もしくは2である；

各 $R^7$ および $R^8$ は独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^5-OS(O)_2R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_pR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-OC(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-N=C(R^{15})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(=NR^{14})N(R^{14})_2$ 、および $-R^{11}-N(R^{14})C(N=C(R^{14})_2)N(R^{14})_2$ からなる群より選択され、ここで、各 $p$ は独立して0、1または2であり、各 $t$ は独立して1または2である；

各 $R^9$ は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

$R^{10}$ は、 $-C(R^9)_2$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ または $-N(R^9)-$ である；

各 $R^{11}$ は、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各 $R^{12}$ および $R^{13}$ は独立して、水素、アルキル、または $-OR^9$ である；

各 $R^{14}$ は、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各 $R^{15}$ は、アルキルである；

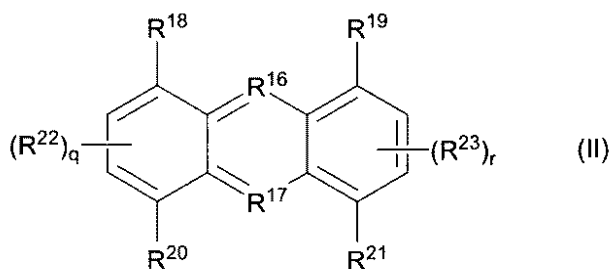
の化合物であって、その立体異性体、鏡像異性体、互変異性体もしくはその混合物としての化合物；

またはその薬学的に許容され得る塩、溶媒和物もしくはプロドラッグを投与することを含む、方法。

(項目43)

式 ( I I ) :

【化 4 5】



( 式中 :

q および r は、各々独立して 0、1 または 2 である ;

R<sup>16</sup> および R<sup>17</sup> は、各々独立して、= C ( R<sup>24</sup> ) - または = N - である ;

R<sup>18</sup> および R<sup>19</sup> は異なり、各々独立して、- R<sup>25</sup> - S - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - O - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup> または - R<sup>25</sup> - N ( R<sup>9</sup> ) - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup> から選択されるか ;

または R<sup>18</sup> および R<sup>19</sup> が同じであり、- R<sup>25</sup> - S - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - O - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup> または - R<sup>25</sup> - N ( R<sup>9</sup> ) - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup> から選択される ;

R<sup>20</sup> および R<sup>21</sup> は異なり、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、- R<sup>25</sup> - C N、- R<sup>25</sup> - N O<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - N ( R<sup>28</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - C ( O ) O R<sup>28</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( O ) N ( R<sup>28</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - S - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - O - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - N ( R<sup>9</sup> ) - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- N ( R<sup>28</sup> ) S ( O )<sub>t</sub> R<sup>29</sup>、- S ( O )<sub>t</sub> O R<sup>29</sup>、- S ( O )<sub>p</sub> R<sup>28</sup>、または - S ( O )<sub>t</sub> N ( R<sup>28</sup> )<sub>2</sub> から選択され、ここで、各 t は独立して 1 もしくは 2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 であるか ;

または R<sup>20</sup> および R<sup>21</sup> は同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、- R<sup>25</sup> - C N、- R<sup>25</sup> - N O<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - N ( R<sup>28</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - C ( O ) O R<sup>28</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( O ) N ( R<sup>28</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - S - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - O - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - N ( R<sup>9</sup> ) - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- N ( R<sup>28</sup> ) S ( O )<sub>t</sub> R<sup>29</sup>、- S ( O )<sub>t</sub> O R<sup>29</sup>、- S ( O )<sub>p</sub> R<sup>28</sup>、または - S ( O )<sub>t</sub> N ( R<sup>28</sup> )<sub>2</sub> から選択され、ここで、各 t は独立して 1 もしくは 2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 である ;

各 R<sup>22</sup> および R<sup>23</sup> は独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラキル、任意選択的に置換されたアラケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、- R<sup>25</sup> - C N、- R<sup>25</sup> - N O<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - O R<sup>24</sup>、- R<sup>25</sup> - O S ( O )<sub>2</sub> R<sup>29</sup>、- R<sup>25</sup> - N ( R<sup>28</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - S ( O )<sub>p</sub> R<sup>28</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( O ) R<sup>28</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( S ) R<sup>29</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( O ) O R<sup>28</sup>、- R<sup>25</sup> - O C ( O ) R<sup>28</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( S ) O R<sup>28</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( O ) N ( R<sup>28</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - C ( S ) N ( R<sup>28</sup> )<sub>2</sub>、- N = C ( R<sup>29</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - N ( R<sup>28</sup> ) C ( O ) R<sup>29</sup>、- R

$R^{25} - N(R^{28})C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})S(O)_tR^{28}$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(=NR^{28})N(R^{28})_2$ 、および  $-R^{25} - N(R^{28})C(N=C(R^{28})_2)N(R^{28})_2$  からなる群より選択され、ここで、各 p は独立して 0、1 または 2 であり、各 t は独立して 1 または 2 である；

各  $R^{24}$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{25}$  は、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  は独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{24}$  である；

各  $R^{28}$  は、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $R^{29}$  は、アルキルである）

の化合物であって、その立体異性体、鏡像異性体、互変異性体もしくはその混合物としての化合物；

またはその薬学的に許容され得る塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ。

(項目 44)

q および r が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  および  $R^{17}$  が、各々独立して、 $=C(R^{24})$  - または  $=N$  - である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  が同じであり、 $-R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - O - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25} - N(R^9) - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  が同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{25} - CN$ 、 $-R^{25} - NO_2$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25} - C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - O - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - N(R^9) - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-N(R^{28})S(O)_tR^{29}$ 、 $-S(O)_tOR^{29}$ 、 $-S(O)_pR^{28}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{28})_2$  から選択され、ここで、各 t は独立して 1 もしくは 2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  が独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{25} - CN$ 、 $-R^{25} - NO_2$ 、 $-R^{25} - OR^{24}$ 、 $-R^{25} - OS(O)_2R^{29}$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - S(O)_pR^{28}$ 、 $-R^{25} - C(O)R^{28}$ 、 $-R^{25} - C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25} - C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25} - OC(O)R^{28}$ 、 $-R^{25} - C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25} - C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-N=C(R^{29})_2$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(O)R^{29}$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(O)N(R^{28})_2$ 、

$-R^{25} - N(R^{28})C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})S(O)_t R^{28}$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})S(O)_t N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - S(O)_t N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(=NR^{28})N(R^{28})_2$ 、および  $-R^{25} - N(R^{28})C(N=C(R^{28})_2)N(R^{28})_2$  からなる群より選択され、ここで、各 p は独立して 0、1 または 2 であり、各 t は独立して 1 または 2 である；

各  $R^{24}$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{25}$  が、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{24}$  である；

各  $R^{28}$  が、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $R^{29}$  がアルキルである、

項目 4 3 に記載の化合物。

(項目 4 5)

q および r が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  および  $R^{17}$  が各々、 $=C(R^{24})-$  である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  が同じであり、 $-R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - O - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25} - N(R^{24}) - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  が同じであり、水素、 $-R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - O - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25} - N(R^{24}) - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  が独立して、 $-R^{25} - OR^{24}$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^{24}$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{25}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{24}$  である、

項目 4 4 に記載の化合物。

(項目 4 6)

q および r が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  および  $R^{17}$  が各々、 $=C(R^{24})-$  である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  が同じであり、 $-R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - O - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25} - N(R^{24}) - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  が同じであり、水素、 $-R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - O - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25} - N(R^{24}) - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$

）  $R^{2\ 7}$  から選択される；

各  $R^{2\ 2}$  および  $R^{2\ 3}$  が独立して、 $-R^{2\ 5}-OR^{2\ 4}$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^{2\ 4}$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{2\ 5}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{2\ 6}$  および  $R^{2\ 7}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{2\ 4}$  である、

項目 4 5 に記載の化合物。

(項目 4 7)

q および r が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{1\ 6}$  および  $R^{1\ 7}$  が各々、 $=C(R^{2\ 4})-$  である；

$R^{1\ 8}$  および  $R^{1\ 9}$  がともに  $-R^{2\ 5}-S-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$  である；

$R^{2\ 0}$  および  $R^{2\ 1}$  がともに水素である；

各  $R^{2\ 2}$  および  $R^{2\ 3}$  が独立して、 $-R^{2\ 5}-OR^{2\ 4}$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^{2\ 4}$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{2\ 5}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{2\ 6}$  および  $R^{2\ 7}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{2\ 4}$  である、

項目 4 6 に記載の化合物。

(項目 4 8)

アントラセン - 1, 8 - ジイルピス (メチレン) ジカルバムイミドチオアートである、項目 4 7 に記載の化合物。

(項目 4 9)

q および r が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{1\ 6}$  が、 $=N-$  である；

$R^{1\ 7}$  が、 $=C(R^{2\ 4})-$  である；

$R^{1\ 8}$  および  $R^{1\ 9}$  が同じであり、 $-R^{2\ 5}-S-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$ 、 $-R^{2\ 5}-O-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$ 、 $-R^{2\ 5}-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$  または  $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 4})-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$  から選択される；

$R^{2\ 0}$  および  $R^{2\ 1}$  が同じであり、水素、 $-R^{2\ 5}-S-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$ 、 $-R^{2\ 5}-O-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$ 、 $-R^{2\ 5}-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$  または  $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 4})-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$

）  $R^{2\ 7}$  から選択される；

各  $R^{2\ 2}$  および  $R^{2\ 3}$  が独立して、 $-R^{2\ 5}-OR^{2\ 4}$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^{2\ 4}$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{2\ 5}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{2\ 6}$  および  $R^{2\ 7}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{2\ 4}$  である、

項目 4 4 に記載の化合物。

(項目 5 0)

q および r が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{1\ 6}$  が、 $=N-$  である；



$R^{17}$  が、 $= C(R^{24}) -$  である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  が同じであり、 $- R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $- R^{25} - O - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $- R^{25} - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $- R^{25} - N(R^{24}) - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  が同じであり、水素、 $- R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $- R^{25} - O - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $- R^{25} - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $- R^{25} - N(R^{24}) - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  が独立して、 $- R^{25} - OR^{24}$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^{24}$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラールキルである；

各  $R^{25}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $- OR^{24}$  である、  
項目 49 に記載の化合物。

(項目 51)

q および r が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  が、 $= N -$  である；

$R^{17}$  が、 $= C(R^{24}) -$  である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  がともに  $- R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  である；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  がともに水素である；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  が独立して、 $- R^{25} - OR^{24}$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^{24}$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラールキルである；

各  $R^{25}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $- OR^{24}$  である、  
項目 50 に記載の化合物。

(項目 52)

アクリジン - 4, 5 - ジイルビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート；および  
(9 - メチルアクリジン - 4, 5 - ジイル)ビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート

からなる群より選択される、項目 51 に記載の化合物。

(項目 53)

q および r が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  および  $R^{17}$  が、各々独立して、 $= C(R^{24}) -$  または  $= N -$  である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  が異なり、各々独立して、 $- R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $- R^{25} - O - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $- R^{25} - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $- R^{25} - N(R^9) - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  が異なり、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $- R^{25} - CN$ 、 $- R^{25} - NO_2$ 、 $- R^{25} - N(R^{28})_2$ 、 $- R^{25} - C(O)OR^{28}$ 、 $- R^{25} - C(O)N(R^{28})_2$ 、 $- R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $- R^{25} - O - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $- R^{25} - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $- R^{25} - N(R^9) - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $- N(R^{28})S(O)_tR^{29}$ 、 $- S(O)_tOR^{29}$ 、 $- S(O)_pR^{28}$ 、または  $- S(O)_tN(R^{28})_2$  から選択され、ここで、各 t は独立して 1 もしくは 2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  が独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-OR^{24}$ 、 $-R^{25}-OS(O)_2R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S(O)_pR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)R^{28}$ 、 $-R^{25}-C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-OC(O)R^{28}$ 、 $-R^{25}-C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-N=C(R^{29})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})S(O)_tR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(=NR^{28})N(R^{28})_2$ 、および  $-R^{25}-N(R^{28})C(N=C(R^{28})_2)N(R^{28})_2$  からなる群より選択され、ここで、各  $p$  は独立して 0、1 または 2 であり、各  $t$  は独立して 1 または 2 である；

各  $R^{24}$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{25}$  が、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{24}$  である；

各  $R^{28}$  が、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $R^{29}$  がアルキルである、

項目 43 に記載の化合物。

(項目 54)

$q$  および  $r$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  および  $R^{17}$  が、各々独立して、 $=C(R^{24})$  - または  $=N-$  である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  が異なり、各々独立して、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  が同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-N(R^{28})S(O)_tR^{29}$ 、 $-S(O)_tOR^{29}$ 、 $-S(O)_pR^{28}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{28})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  が独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、

換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-OR^{24}$ 、 $-R^{25}-OS(O)_2R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S(O)_pR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)R^{28}$ 、 $-R^{25}-C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-OC(O)R^{28}$ 、 $-R^{25}-C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-N=C(R^{29})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})S(O)_tR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(=NR^{28})N(R^{28})_2$ 、および  $-R^{25}-N(R^{28})C(N=C(R^{28})_2)N(R^{28})_2$  からなる群より選択され、ここで、各 p は独立して 0、1 または 2 であり、各 t は独立して 1 または 2 である；

各  $R^{24}$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{25}$  が、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{24}$  である；

各  $R^{28}$  が、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $R^{29}$  がアルキルである、

項目 43 に記載の化合物。

(項目 55)

q および r が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  および  $R^{17}$  が、各々独立して、 $=C(R^{24})$  - または  $=N$  - である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  が同じであり、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  が異なっており、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-N(R^{28})S(O)_tR^{29}$ 、 $-S(O)_tOR^{29}$ 、 $-S(O)_pR^{28}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{28})_2$  から選択され、ここで、各 t は独立して 1 もしくは 2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  が独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-OR^{24}$ 、 $-R^{25}-OS(O)_2R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S(O)_pR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)R^{28}$ 、 $-$

$R^{25} - C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25} - C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25} - OC(O)R^{28}$ 、  
 $-R^{25} - C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25} - C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-N=C(R^{29})_2$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(O)R^{29}$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(O)N(R^{28})_2$ 、  
 $-R^{25} - N(R^{28})C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})S(O)_tR^{28}$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(=NR^{28})N(R^{28})_2$ 、および  $-R^{25} - N(R^{28})C(N=C(R^{28})_2)N(R^{28})_2$  からなる群より選択され、ここで、各 p は独立して 0、1 または 2 であり、各 t は独立して 1 または 2 である；

各  $R^{24}$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{25}$  が、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{24}$  である；

各  $R^{28}$  が、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

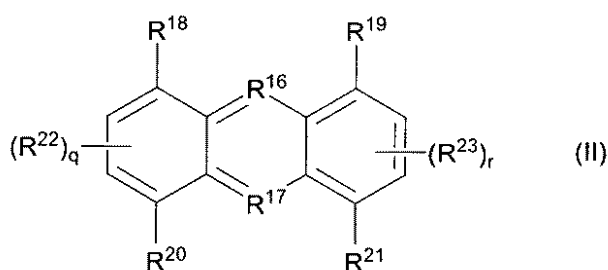
各  $R^{29}$  がアルキルである、

項目 43 に記載の化合物。

(項目 56)

薬学的に許容され得る賦形剤と、式 (II)：

【化 46】



(式中：

q および r は、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  および  $R^{17}$  は、各々独立して、 $=C(R^{24})$  - または  $=N$  - である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  は異なり、各々独立して、 $-R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - O - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25} - N(R^9) - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択されるか；

または  $R^{18}$  および  $R^{19}$  は同じであり、 $-R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - O - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25} - N(R^9) - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  は異なり、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{25} - CN$ 、 $-R^{25} - NO_2$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25} - C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - O - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - N(R^9) - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-N(R^{28})S(O)_tR^{29}$ 、 $-S(O)_tOR^{29}$ 、 $-S(O)_pR^{28}$ 、または $-S(O)_tN(R^{28})_2$ から選択され、ここで、各 $t$ は独立して1もしくは2であり、各 $p$ は0、1もしくは2であるか；

または $R^{20}$ および $R^{21}$ は同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-N(R^{28})S(O)_tR^{29}$ 、 $-S(O)_tOR^{29}$ 、 $-S(O)_pR^{28}$ 、または $-S(O)_tN(R^{28})_2$ から選択され、ここで、各 $t$ は独立して1もしくは2であり、各 $p$ は0、1もしくは2である；

各 $R^{22}$ および $R^{23}$ は独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-OR^{24}$ 、 $-R^{25}-OS(O)_2R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S(O)_pR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)R^{28}$ 、 $-R^{25}-C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-OC(O)R^{28}$ 、 $-R^{25}-C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-N=C(R^{29})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})S(O)_tR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(=NR^{28})N(R^{28})_2$ 、および $-R^{25}-N(R^{28})C(N=C(R^{28})_2)N(R^{28})_2$ からなる群より選択され、ここで、各 $p$ は独立して0、1または2であり、各 $t$ は独立して1または2である；

各 $R^{24}$ は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各 $R^{25}$ は、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各 $R^{26}$ および $R^{27}$ は独立して、水素、アルキルまたは $-OR^{24}$ である；

各 $R^{28}$ は、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各 $R^{29}$ は、アルキルである）

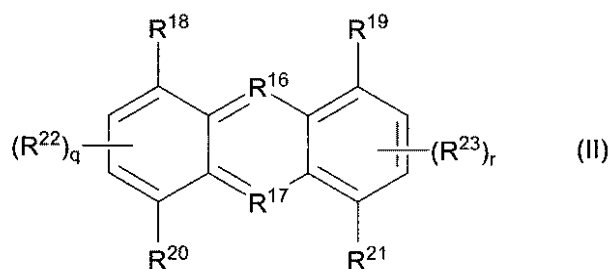
の化合物であって、その立体異性体、鏡像異性体、互変異性体もしくはその混合物としての化合物；

またはその薬学的に許容され得る塩、溶媒和物もしくはプロドラッグを含む医薬組成物。

(項目57)

治療有効量の式(II)：

## 【化 4 7】



(式中：

$q$  および  $r$  は、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  および  $R^{17}$  は、各々独立して、 $=C(R^{24})$  - または  $=N$  - である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  は異なり、各々独立して、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択されるか；

または  $R^{18}$  および  $R^{19}$  は同じであり、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  が異なり、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-N(R^{28})S(O)_tR^{29}$ 、 $-S(O)_tOR^{29}$ 、 $-S(O)_pR^{28}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{28})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 であるか；

または  $R^{20}$  および  $R^{21}$  は同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-N(R^{28})S(O)_tR^{29}$ 、 $-S(O)_tOR^{29}$ 、 $-S(O)_pR^{28}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{28})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  は独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラールキル、任意選択的に置換されたアラールケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-OR^{24}$ 、 $-R^{25}-OS(O)_2R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S(O)_pR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)R^{28}$ 、 $-R^{25}-C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-OC(O)R^{28}$ 、 $-R^{25}-C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-N=C(R^{29})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)N(R^{28})_2$ 、

-  $R^{25} - N(R^{28})C(S)N(R^{28})_2$ 、 $- R^{25} - N(R^{28})S(O)_t R^{28}$ 、 $- R^{25} - N(R^{28})S(O)_t N(R^{28})_2$ 、 $- R^{25} - S(O)_t N(R^{28})_2$ 、 $- R^{25} - N(R^{28})C(=NR^{28})N(R^{28})_2$ 、および  $- R^{25} - N(R^{28})C(N=C(R^{28})_2)N(R^{28})_2$  からなる群より選択され、ここで、各  $p$  は独立して 0、1 または 2 であり、各  $t$  は独立して 1 または 2 である；

各  $R^{24}$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{25}$  は、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  は独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{24}$  である；

各  $R^{28}$  は、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $R^{29}$  は、アルキルである）

の化合物であって、その立体異性体、鏡像異性体、互変異性体もしくはその混合物としての化合物；

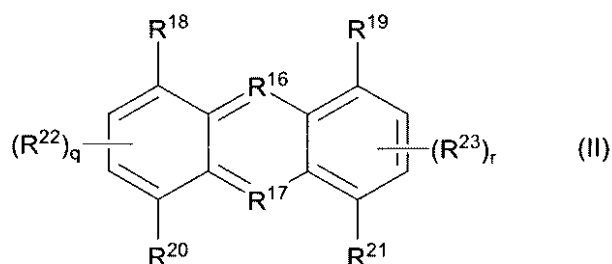
またはその薬学的に許容され得る塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ

を哺乳動物に投与することを含む、該哺乳動物の鉄障害を処置する方法。

(項目 58)

哺乳動物の鉄障害と関連する疾患または病状を処置する方法であって、該処置を必要とする哺乳動物に、治療有効量の式 (II)：

【化 48】



(式中：

$q$  および  $r$  は、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  および  $R^{17}$  は、各々独立して、 $=C(R^{24})$  - または  $=N$  - である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  は異なっており、各々独立して、 $-R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - O - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25} - N(R^9) - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択されるか；

または  $R^{18}$  および  $R^{19}$  は同じであり、 $-R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - O - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25} - N(R^9) - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  は異なっており、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{25} - CN$ 、 $-R^{25} - NO_2$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25} - C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - O - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25} - N(R^9) - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{2\ 7}$ 、 $-N(R^{2\ 8})S(O)_t R^{2\ 9}$ 、 $-S(O)_t OR^{2\ 9}$ 、 $-S(O)_p R^{2\ 8}$ 、または $-S(O)_t N(R^{2\ 8})_2$ から選択され、ここで、各 $t$ は独立して1もしくは2であり、各 $p$ は0、1もしくは2であるか；

または $R^{2\ 0}$ および $R^{2\ 1}$ は同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{2\ 5}-CN$ 、 $-R^{2\ 5}-NO_2$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})_2$ 、 $-R^{2\ 5}-C(O)OR^{2\ 8}$ 、 $-R^{2\ 5}-C(O)N(R^{2\ 8})_2$ 、 $-R^{2\ 5}-S-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$ 、 $-R^{2\ 5}-O-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$ 、 $-R^{2\ 5}-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^9)-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$ 、 $-N(R^{2\ 8})S(O)_t R^{2\ 9}$ 、 $-S(O)_t OR^{2\ 9}$ 、 $-S(O)_p R^{2\ 8}$ 、または $-S(O)_t N(R^{2\ 8})_2$ から選択され、ここで、各 $t$ は独立して1もしくは2であり、各 $p$ は0、1もしくは2である；

各 $R^{2\ 2}$ および $R^{2\ 3}$ は独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{2\ 5}-CN$ 、 $-R^{2\ 5}-NO_2$ 、 $-R^{2\ 5}-OR^{2\ 4}$ 、 $-R^{2\ 5}-OS(O)_2 R^{2\ 9}$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})_2$ 、 $-R^{2\ 5}-S(O)_p R^{2\ 8}$ 、 $-R^{2\ 5}-C(O)R^{2\ 8}$ 、 $-R^{2\ 5}-C(S)R^{2\ 9}$ 、 $-R^{2\ 5}-C(O)OR^{2\ 8}$ 、 $-R^{2\ 5}-OC(O)R^{2\ 8}$ 、 $-R^{2\ 5}-C(S)OR^{2\ 8}$ 、 $-R^{2\ 5}-C(O)N(R^{2\ 8})_2$ 、 $-R^{2\ 5}-C(S)N(R^{2\ 8})_2$ 、 $-N=C(R^{2\ 9})_2$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})C(O)R^{2\ 9}$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})C(S)R^{2\ 9}$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})C(O)OR^{2\ 8}$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})C(S)OR^{2\ 8}$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})C(O)N(R^{2\ 8})_2$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})C(S)N(R^{2\ 8})_2$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})S(O)_t R^{2\ 8}$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})S(O)_t N(R^{2\ 8})_2$ 、 $-R^{2\ 5}-S(O)_t N(R^{2\ 8})_2$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})C(=NR^{2\ 8})N(R^{2\ 8})_2$ 、および $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})C(N=C(R^{2\ 8})_2)N(R^{2\ 8})_2$ からなる群より選択され、ここで、各 $p$ は独立して0、1または2であり、各 $t$ は独立して1または2である；

各 $R^{2\ 4}$ は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各 $R^{2\ 5}$ は、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各 $R^{2\ 6}$ および $R^{2\ 7}$ は独立して、水素、アルキルまたは $-OR^{2\ 4}$ である；

各 $R^{2\ 8}$ は、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各 $R^{2\ 9}$ は、アルキルである）

の化合物であって、その立体異性体、鏡像異性体、互変異性体もしくはその混合物としての化合物；

またはその薬学的に許容され得る塩、溶媒和物もしくはプロドラッグを投与することを含む、方法。

【手続補正2】

【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



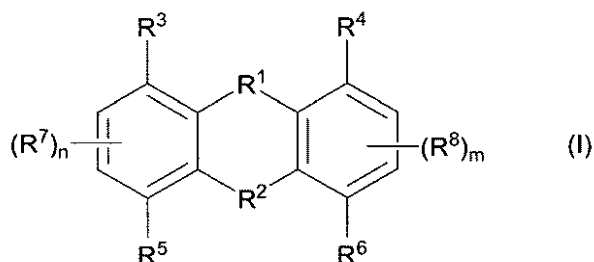
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 4 1】



(式中 :

n および m は、各々独立して 0、1 または 2 である ;

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、各々独立して、直接結合、- C ( R<sup>9</sup> )<sub>2</sub> -、- S -、- O -、- C ( O ) -、- N ( R<sup>9</sup> ) - または - CH<sub>2</sub> - R<sup>10</sup> - CH<sub>2</sub> - である ;R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> は異なり、各々独立して、- R<sup>11</sup> - S - C ( = N R<sup>12</sup> ) N ( R<sup>12</sup> ) R<sup>13</sup>、- R<sup>11</sup> - O - C ( = N R<sup>12</sup> ) N ( R<sup>12</sup> ) R<sup>13</sup>、- R<sup>11</sup> - C ( = N R<sup>12</sup> ) N ( R<sup>12</sup> ) R<sup>13</sup>、もしくは - R<sup>11</sup> - N ( R<sup>9</sup> ) - C ( = N R<sup>12</sup> ) N ( R<sup>12</sup> ) R<sup>13</sup> から選択される ;または R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> は同じであり、- R<sup>11</sup> - S - C ( = N R<sup>12</sup> ) N ( R<sup>12</sup> ) R<sup>13</sup>、- R<sup>11</sup> - O - C ( = N R<sup>12</sup> ) N ( R<sup>12</sup> ) R<sup>13</sup>、- R<sup>11</sup> - C ( = N R<sup>12</sup> ) N ( R<sup>12</sup> ) R<sup>13</sup>、もしくは - R<sup>11</sup> - N ( R<sup>9</sup> ) - C ( = N R<sup>12</sup> ) N ( R<sup>12</sup> ) R<sup>13</sup> から選択される ;R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は異なり、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、- R<sup>11</sup> - CN、- R<sup>11</sup> - NO<sub>2</sub>、- R<sup>11</sup> - N ( R<sup>14</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>11</sup> - C ( O ) OR<sup>14</sup>、- R<sup>11</sup> - C ( O ) N ( R<sup>14</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>11</sup> - S - C ( = N R<sup>12</sup> ) N ( R<sup>12</sup> ) R<sup>13</sup>、- R<sup>11</sup> - O - C ( = N R<sup>12</sup> ) N ( R<sup>12</sup> ) R<sup>13</sup>、- R<sup>11</sup> - C ( = N R<sup>12</sup> ) N ( R<sup>12</sup> ) R<sup>13</sup>、- R<sup>11</sup> - N ( R<sup>9</sup> ) - C ( = N R<sup>12</sup> ) N ( R<sup>12</sup> ) R<sup>13</sup>、- N ( R<sup>14</sup> ) S ( O )<sub>t</sub> R<sup>15</sup>、- S ( O )<sub>t</sub> OR<sup>15</sup>、- S ( O )<sub>p</sub> R<sup>14</sup>、または - S ( O )<sub>t</sub> N ( R<sup>14</sup> )<sub>2</sub> から選択され、ここで、各 t は独立して 1 もしくは 2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 である ;または R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、- R<sup>11</sup> - CN、- R<sup>11</sup> - NO<sub>2</sub>、- R<sup>11</sup> - N ( R<sup>14</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>11</sup> - C ( O ) OR<sup>14</sup>、- R<sup>11</sup> - C ( O ) N ( R<sup>14</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>11</sup> - S - C ( = N R<sup>12</sup> ) N ( R<sup>12</sup> ) R<sup>13</sup>、- R<sup>11</sup> - O - C ( = N R<sup>12</sup> ) N ( R<sup>12</sup> ) R<sup>13</sup>、- R<sup>11</sup> - C ( = N R<sup>12</sup> ) N ( R<sup>12</sup> ) R<sup>13</sup>、- R<sup>11</sup> - N ( R<sup>9</sup> ) - C ( = N R<sup>12</sup> ) N ( R<sup>12</sup> ) R<sup>13</sup>、- N ( R<sup>14</sup> ) S ( O )<sub>t</sub> R<sup>15</sup>、- S ( O )<sub>t</sub> OR<sup>15</sup>、- S ( O )<sub>p</sub> R<sup>14</sup>、または - S ( O )<sub>t</sub> N ( R<sup>14</sup> )<sub>2</sub> から選択され、ここで、各 t は独立して 1 もしくは 2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 である ;各 R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> は、独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラールキル、任意選択的に置換されたアラールケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、- R<sup>11</sup> - CN、- R<sup>11</sup> - NO<sub>2</sub>、- R<sup>11</sup> - OR<sup>9</sup>、- R<sup>5</sup> - OS ( O )<sub>2</sub> R<sup>15</sup>、- R<sup>11</sup> - N ( R<sup>14</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>11</sup> - S ( O )<sub>p</sub> R<sup>14</sup>、- R<sup>11</sup> - C ( O ) R<sup>14</sup>、- R<sup>11</sup> - C ( S ) R<sup>15</sup>、- R<sup>11</sup> - C ( O ) OR<sup>14</sup>、- R<sup>11</sup> - OC ( O ) R<sup>14</sup>、- R<sup>11</sup>

$^1 - C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11} - C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11} - C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-N=C(R^{15})_2$ 、 $-R^{11} - N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-R^{11} - N(R^{14})C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11} - N(R^{14})C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11} - N(R^{14})C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11} - N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11} - N(R^{14})C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11} - N(R^{14})S(O)_tR^{14}$ 、 $-R^{11} - N(R^{14})S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11} - S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11} - N(R^{14})C(=NR^{14})N(R^{14})_2$ 、および  $-R^{11} - N(R^{14})C(N=C(R^{14})_2)N(R^{14})_2$  からなる群より選択され、ここで、各 p は独立して 0、1 または 2 であり、各 t は独立して 1 または 2 である；

各  $R^9$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

$R^{10}$  は、 $-C(R^9)_2$ 、 $-S-$ 、 $-O-$  または  $-N(R^9)-$  である；

各  $R^{11}$  は、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  は、独立して、水素、アルキル、または  $-OR^9$  である；

各  $R^{14}$  は、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $R^{15}$  は、アルキルである）

の化合物であって、その立体異性体、鏡像異性体、互変異性体もしくはその混合物としての化合物；

またはその薬学的に許容され得る塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ。

#### 【請求項 2】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  および  $R^2$  が、各々独立して、直接結合、 $-C(R^9)_2$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-N(R^9)-$  または  $-CH_2-R^{10}-CH_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  が同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{14})_2$  から選択され、ここで、各 t は独立して 1 もしくは 2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^5-OS(O)_2R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_pR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-OC(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}$

- C ( S ) O R <sup>1 4</sup>、 - R <sup>1 1</sup> - C ( O ) N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、 - R <sup>1 1</sup> - C ( S ) N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、 - N = C ( R <sup>1 5</sup> ) <sub>2</sub>、 - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) C ( O ) R <sup>1 5</sup>、 - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) C ( S ) R <sup>1 5</sup>、 - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) C ( O ) O R <sup>1 4</sup>、 - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) C ( S ) O R <sup>1 4</sup>、 - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) C ( O ) N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、 - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) C ( S ) N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、 - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) S ( O ) <sub>t</sub> R <sup>1 4</sup>、 - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) S ( O ) <sub>t</sub> N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、 - R <sup>1 1</sup> - S ( O ) <sub>t</sub> N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、 - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) C ( = N R <sup>1 4</sup> ) N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub>、および - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>1 4</sup> ) C ( N = C ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub> ) N ( R <sup>1 4</sup> ) <sub>2</sub> からなる群より選択され、ここで、各 p は独立して 0、1 または 2 であり、各 t は独立して 1 または 2 である；

各 R <sup>9</sup> が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

R <sup>1 0</sup> が、 - C ( R <sup>9</sup> ) <sub>2</sub> -、 - S -、 - O - または - N ( R <sup>9</sup> ) - である；

各 R <sup>1 1</sup> が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各 R <sup>1 2</sup> および R <sup>1 3</sup> が独立して、水素、アルキル、または - O R <sup>9</sup> である；

各 R <sup>1 4</sup> が独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各 R <sup>1 5</sup> が、アルキルである、

請求項 1 に記載の化合物。

#### 【請求項 3】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

R <sup>1</sup> が - S - である；

R <sup>2</sup> が直接結合である；

R <sup>3</sup> および R <sup>4</sup> が同じであり、 - R <sup>1 1</sup> - S - C ( = N R <sup>1 2</sup> ) N ( R <sup>1 2</sup> ) R <sup>1 3</sup>、 - R <sup>1 1</sup> - O - C ( = N R <sup>1 2</sup> ) N ( R <sup>1 2</sup> ) R <sup>1 3</sup>、 - R <sup>1 1</sup> - C ( = N R <sup>1 2</sup> ) N ( R <sup>1 2</sup> ) R <sup>1 3</sup> または - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>9</sup> ) - C ( = N R <sup>1 2</sup> ) N ( R <sup>1 2</sup> ) R <sup>1 3</sup> から選択される；

R <sup>5</sup> および R <sup>6</sup> が同じであり、水素、 - R <sup>1 1</sup> - S - C ( = N R <sup>1 2</sup> ) N ( R <sup>1 2</sup> ) R <sup>1 3</sup>、 - R <sup>1 1</sup> - O - C ( = N R <sup>1 2</sup> ) N ( R <sup>1 2</sup> ) R <sup>1 3</sup>、 - R <sup>1 1</sup> - C ( = N R <sup>1 2</sup> ) N ( R <sup>1 2</sup> ) R <sup>1 3</sup> または - R <sup>1 1</sup> - N ( R <sup>9</sup> ) - C ( = N R <sup>1 2</sup> ) N ( R <sup>1 2</sup> ) R <sup>1 3</sup> から選択される；

各 R <sup>7</sup> および R <sup>8</sup> が独立して、 - R <sup>1 1</sup> - O R <sup>9</sup>、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各 R <sup>9</sup> が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各 R <sup>1 1</sup> が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各 R <sup>1 2</sup> および R <sup>1 3</sup> が独立して、水素、アルキルまたは - O R <sup>9</sup> である、

請求項 2 に記載の化合物。

#### 【請求項 4】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

R <sup>1</sup> が - S - である；

R <sup>2</sup> が直接結合である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；  
 $R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素または  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、  
 請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-S-$  である；

$R^2$  が直接結合である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  がともに水素である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、  
 請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

ジベンゾ [b, d] チオフェン - 4, 6 - ジイルビス (メチレン) ジカルバムイミドチオアート；

(2 - フルオロジベンゾ [b, d] チオフェン - 4, 6 - ジイル) ビス (メチレン) ジカルバムイミドチオアート；

(3, 7 - ジブromोजibenzo [b, d] チオフェン - 4, 6 - ジイル) ビス (メチレン) ジカルバムイミドチオアート；

(2 - クロロ - 8 - フルオロジベンゾ [b, d] チオフェン - 4, 6 - ジイル) ビス (メチレン) ジカルバムイミドチオアート；および

(3 - ブromोजibenzo [b, d] チオフェン - 4, 6 - ジイル) ビス (メチレン) ジカルバムイミドチオアート

からなる群より選択される、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が直接結合である；

$R^2$  が  $-S-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  がともに水素である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、  
 請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 8】

ジベンゾ [b, d] チオフェン - 1, 9 - ジイルビス (メチレン) ジカルバムイミドチオ

アートである、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が - O - である；

$R^2$  が直接結合または - C ( O ) - である；

$R^3$  および  $R^4$  が同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラールキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 10】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が - O - である；

$R^2$  が直接結合または - C ( O ) - である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素または  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラールキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が - O - である；

$R^2$  が直接結合または - C ( O ) - である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  がともに水素である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラールキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

(9 - オキソ - 9H - キサンテン - 4, 5 - ジイル)ビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート;

ジベンゾ [b, d] フラン - 4, 6 - ジイルビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート;

(3, 7 - ジメチルジベンゾ [b, d] フラン - 4, 6 - ジイル)ビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート;

(3, 7 - ジクロロ 1 ジベンゾ [b, d] フラン - 4, 6 - ジイル)ビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート;

(3, 7 - ジブロモジベンゾ [b, d] フラン - 4, 6 - ジイル)ビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート;

(2 - フルオロジベンゾ [b, d] フラン - 4, 6 - ジイル)ビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート; および

(2, 8 - ジブロモジベンゾ [b, d] フラン - 4, 6 - ジイル)ビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート

からなる群より選択される、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である;

$R^1$  が直接結合である;

$R^2$  が直接結合である;

$R^3$  および  $R^4$  が同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される;

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される;

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される;

各  $R^9$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラールキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである;

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である; ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 14】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である;

$R^1$  が直接結合である;

$R^2$  が直接結合である;

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である;

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素または  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される;

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される;

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換さ

れたアリアルまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 15】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が直接結合である；

$R^2$  が直接結合である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  がともに水素である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコシアルキル、任意選択的に置換されたアリアルまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 16】

ビフェニレン-1, 8-ジイルビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート；および  
(3, 6-ジフルオロビフェニレン-1, 8-ジイル)ビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート

からなる群より選択される、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 17】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が直接結合である；

$R^2$  が直接結合である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコシアルキル、任意選択的に置換されたアリアルまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 18】

ビフェニレン-1, 4, 5, 8-テトライルテトラキス(メチレン)テトラカルバムイミドチオアートである、請求項 17 に記載の化合物。

【請求項 19】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-C(O)-$  である；

$R^2$  が直接結合である；

$R^3$  および  $R^4$  が同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、  
 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、  
 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 20】

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-C(O)-$  である；

$R^2$  が直接結合である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素または  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、請求項 19 に記載の化合物。

【請求項 21】

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-C(O)-$  である；

$R^2$  が直接結合である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  がともに水素である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、請求項 20 に記載の化合物。

【請求項 22】

2 - (8 - カルバムイミドイルスルファニルメチル - 9 - オキソ - 9H - フルオレン - 1 - イルメチル) - イソチオ尿素である、請求項 21 に記載の化合物。

【請求項 23】

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が直接結合である；

$R^2$  が  $-C(O)-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  がともに水素である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換さ



れたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに  
各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

(9 - オキソ - 9H - フルオレン - 4, 5 - ジイル)ビス(メチレン)ジカルバムイミド  
チオアートである、請求項 2 3 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-O-$  である；

$R^2$  が  $-C(R^9)_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  が同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、  
 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から  
選択される；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、  
 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から  
選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキル  
からなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアル  
キル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル  
アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意  
選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、  
任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールア  
ルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに  
各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 2 6】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-O-$  である；

$R^2$  が  $-C(R^9)_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素または  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から  
選択されるから選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキル  
からなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換さ  
れたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに  
各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

請求項 2 5 に記載の化合物。

【請求項 2 7】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-O-$  である；

$R^2$  が  $-C(R^9)_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  がともに水素である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、請求項 26 に記載の化合物。

【請求項 28】

2 - (2, 7 - ジ - tert - ブチル - 5 - カルバムイミドイルスルファニルメチル - 9, 9 - ジメチル - 9H - キサンテン - 4 - イルメチル) - イソチオ尿素である、請求項 27 に記載の化合物。

【請求項 29】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-O-$  である；

$R^2$  が  $-S-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  が同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 30】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が  $-O-$  である；

$R^2$  が  $-S-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素または  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、請求項 29 に記載の化合物。

【請求項 31】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が - O - である ;

$R^2$  が - S - である ;

$R^3$  および  $R^4$  がともに -  $R^{11}$  - S - C ( = NR<sup>12</sup> ) N (  $R^{12}$  )  $R^{13}$  である ;

$R^5$  および  $R^6$  がともに水素である ;

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、-  $R^{11}$  - OR<sup>9</sup>、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される ;

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである ;

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である ; ならびに

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは - OR<sup>9</sup> である、

請求項 30 に記載の化合物。

【請求項 32】

フェノキサチン - 4 , 6 - ジイルビス ( メチレン ) ジカルバムイミドチオアートである、請求項 31 に記載の化合物。

【請求項 33】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である ;

$R^1$  が直接結合である ;

$R^2$  が - CH<sub>2</sub> - S - CH<sub>2</sub> - である ;

$R^3$  および  $R^4$  が同じであり、-  $R^{11}$  - S - C ( = NR<sup>12</sup> ) N (  $R^{12}$  )  $R^{13}$ 、  
-  $R^{11}$  - O - C ( = NR<sup>12</sup> ) N (  $R^{12}$  )  $R^{13}$ 、-  $R^{11}$  - C ( = NR<sup>12</sup> ) N (  $R^{12}$  )  $R^{13}$  または -  $R^{11}$  - N (  $R^9$  ) - C ( = NR<sup>12</sup> ) N (  $R^{12}$  )  $R^{13}$  から選択される ;

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素、-  $R^{11}$  - S - C ( = NR<sup>12</sup> ) N (  $R^{12}$  )  $R^{13}$ 、  
-  $R^{11}$  - O - C ( = NR<sup>12</sup> ) N (  $R^{12}$  )  $R^{13}$ 、-  $R^{11}$  - C ( = NR<sup>12</sup> ) N (  $R^{12}$  )  $R^{13}$  または -  $R^{11}$  - N (  $R^9$  ) - C ( = NR<sup>12</sup> ) N (  $R^{12}$  )  $R^{13}$  から選択される ;

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、-  $R^{11}$  - OR<sup>9</sup>、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される ;

各  $R^9$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである ;

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である ; ならびに

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは - OR<sup>9</sup> である、

請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 34】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である ;

$R^1$  が直接結合である ;

$R^2$  が - CH<sub>2</sub> - S - CH<sub>2</sub> - である ;

$R^3$  および  $R^4$  がともに -  $R^{11}$  - S - C ( = NR<sup>12</sup> ) N (  $R^{12}$  )  $R^{13}$  である ;

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素または -  $R^{11}$  - S - C ( = NR<sup>12</sup> ) N (  $R^{12}$  )  $R^{13}$  から選択される ;

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、-  $R^{11}$  - OR<sup>9</sup>、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される ;

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである ;

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である ; ならびに

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは - OR<sup>9</sup> である、

請求項 3 3 に記載の化合物。

【請求項 3 5】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  が直接結合である；

$R^2$  が  $-CH_2-S-CH_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  がともに  $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

$R^5$  および  $R^6$  がともに水素である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、 $-R^{11}-OR^9$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{11}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である、

請求項 3 4 に記載の化合物。

【請求項 3 6】

(5, 7 - ジヒドロジベンゾ [c, e] チエピン - 1, 11 - ジイル) ビス (メチレン) ジカルバムイミドチオアートである、請求項 3 5 に記載の化合物。

【請求項 3 7】

n および m が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  および  $R^2$  が、各々独立して、直接結合、 $-C(R^9)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-N(R^9)-$  または  $-CH_2-R^{10}-CH_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  が異なり、各々独立して、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  が異なり、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{14})_2$  から選択され、ここで、各 t は独立して 1 もしくは 2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^5-OS(O)_2R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_pR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-OC(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-N=C(R^{15})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(=NR^{14})N(R^{14})_2$ 、および  $-R^{11}-N(R^{14})C(N=C(R^{14})_2)N(R^{14})_2$  からなる群より選択され、ここで、各 p は

独立して 0、1 または 2 であり、各  $t$  は独立して 1 または 2 である；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

$R^{10}$  が、 $-C(R^9)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$  または  $-N(R^9)-$  である；

各  $R^{11}$  が、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である；

各  $R^{14}$  が、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $R^{15}$  が、アルキルである、

請求項 1 に記載の化合物。

#### 【請求項 38】

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  および  $R^2$  が、各々独立して、直接結合、 $-C(R^9)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-N(R^9)-$  または  $-CH_2-R^{10}-CH_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  が異なり、各々独立して、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  が同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{14})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^5-OS(O)_2R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_pR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-OC(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-N=C(R^{15})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(=NR^{14})N(R^{14})_2$ 、および  $-R^{11}-N(R^{14})C(N=C(R^{14})_2)N(R^{14})_2$  からなる群より選択され、ここで、各  $p$  は独立して 0、1 または 2 であり、各  $t$  は独立して 1 または 2 である；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアル

キル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

$R^{10}$  が、 $-C(R^9)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$  または  $-N(R^9)-$  である；

各  $R^{11}$  が、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^9$  である；

各  $R^{14}$  が、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $R^{15}$  が、アルキルである、

請求項 1 に記載の化合物。

### 【請求項 39】

$n$  および  $m$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  および  $R^2$  が、各々独立して、直接結合、 $-C(R^9)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-N(R^9)-$  または  $-CH_2-R^{10}-CH_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  が同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  または  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  が異なり、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{14})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^5-OS(O)_2R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_pR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-OC(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-N=C(R^{15})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(=NR^{14})N(R^{14})_2$ 、および  $-R^{11}-N(R^{14})C(N=C(R^{14})_2)N(R^{14})_2$  からなる群より選択され、ここで、各  $p$  は独立して 0、1 または 2 であり、各  $t$  は独立して 1 または 2 である；

各  $R^9$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意

選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

$R^{10}$  が、 $-C(R^9)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ または $-N(R^9)-$ である；

各  $R^{11}$  が、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  が独立して、水素、アルキルまたは $-OR^9$ である；

各  $R^{14}$  が、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

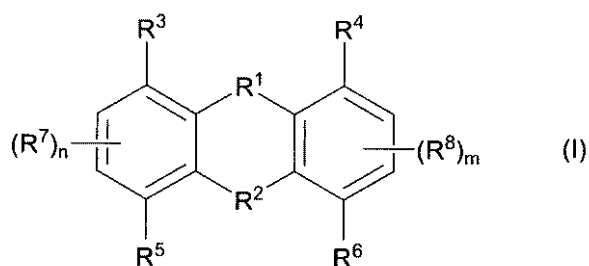
各  $R^{15}$  が、アルキルである、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 40】

薬学的に許容され得る賦形剤と、式 (I)：

【化 42】



(式中：

$n$  および  $m$  は、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  および  $R^2$  は、各々独立して、直接結合、 $-C(R^9)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-N(R^9)-$ または $-CH_2-R^{10}-CH_2-$ である；

$R^3$  および  $R^4$  は異なり、各々独立して、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、もしくは $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ である；

または  $R^3$  および  $R^4$  は同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、もしくは $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  は異なり、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または $-S(O)_tN(R^{14})_2$ から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 であるか；

または  $R^5$  および  $R^6$  は同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または $-S(O)_tN(R^{14})_2$ から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^7$  および  $R^8$  が独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^5-OS(O)_2R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_pR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-OC(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-N=C(R^{15})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(=NR^{14})N(R^{14})_2$ 、および  $-R^{11}-N(R^{14})C(N=C(R^{14})_2)N(R^{14})_2$  からなる群より選択され、ここで、各  $p$  は独立して 0、1 または 2 であり、各  $t$  は独立して 1 または 2 である；

各  $R^9$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

$R^{10}$  は、 $-C(R^9)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$  または  $-N(R^9)-$  である；

各  $R^{11}$  は、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  は独立して、水素、アルキル、または  $-OR^9$  である；

各  $R^{14}$  は、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $R^{15}$  は、アルキルである）

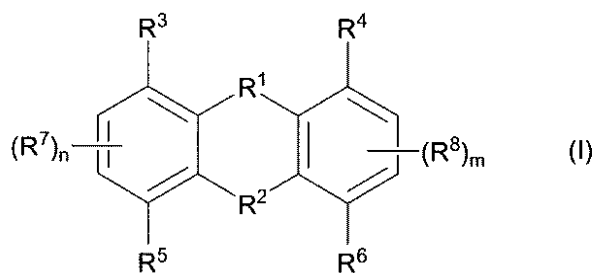
の化合物であって、その立体異性体、鏡像異性体、互変異性体もしくはその混合物としての化合物；

またはその薬学的に許容され得る塩、溶媒和物もしくはプロドラッグを含む医薬組成物。

【請求項 41】

治療有効量の式 (I)：

【化 43】



(式中：

$n$  および  $m$  は、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  および  $R^2$  は、各々独立して、直接結合、 $-C(R^9)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-N(R^9)-$  または  $-CH_2-R^{10}-CH_2-$  である；



$R^3$  および  $R^4$  は異なっており、各々独立して、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、もしくは  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択されるか；

または  $R^3$  および  $R^4$  は同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、もしくは  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  は異なっており、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{14})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 であるか；

または  $R^5$  および  $R^6$  は同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{14})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^7$  および  $R^8$  は独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^5-OS(O)_2R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_pR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-OC(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-N=C(R^{15})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(=NR^{14})N(R^{14})_2$ 、および  $-R^{11}-N(R^{14})C(N=C(R^{14})_2)N(R^{14})_2$  からなる群より選択され、ここで、各  $p$  は独立して 0、1 または 2 であり、各  $t$  は独立して 1 または 2 である；

各  $R^9$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

$R^{10}$  は、 $-C(R^9)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$  または  $-N(R^9)-$  である；

各  $R^{11}$  は、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  は独立して、水素、アルキル、または  $-OR^9$  である；

各  $R^{14}$  は、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $R^{15}$  は、アルキルである）

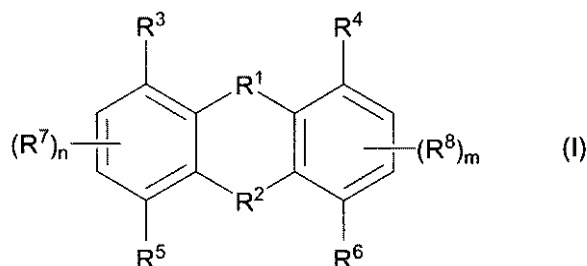
の化合物であって、その立体異性体、鏡像異性体、互変異性体もしくはその混合物としての化合物；

またはその薬学的に許容され得る塩、溶媒和物もしくはプロドラッグを含む、哺乳動物の鉄障害を処置するための組成物。

【請求項 42】

哺乳動物の鉄障害と関連する疾患または病状を処置するための組成物であって、該組成物は、治療有効量の式 (I)：

【化 44】



(式中：

$n$  および  $m$  は、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^1$  および  $R^2$  が、各々独立して、直接結合、 $-C(R^9)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-N(R^9)-$  または  $-CH_2-R^{10}-CH_2-$  である；

$R^3$  および  $R^4$  は異なっており、各々独立して、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、もしくは  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  である；

または  $R^3$  および  $R^4$  は同じであり、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、もしくは  $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$  から選択される；

$R^5$  および  $R^6$  は異なっており、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{14})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 であるか；

または  $R^5$  および  $R^6$  は同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-O-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{11}-N(R^9)-C(=NR^{12})N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ 、 $-S(O)_tOR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{14}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{14})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^7$  および  $R^8$  は独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキ

ル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^5-OS(O)_2R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_pR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-OC(O)R^{14}$ 、 $-R^{11}-C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-N=C(R^{15})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)R^{15}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tR^{14}$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-R^{11}-N(R^{14})C(=NR^{14})N(R^{14})_2$ 、および $-R^{11}-N(R^{14})C(N=C(R^{14})_2)N(R^{14})_2$ からなる群より選択され、ここで、各pは独立して0、1または2であり、各tは独立して1または2である；

各 $R^9$ は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

$R^{10}$ は、 $-C(R^9)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ または $-N(R^9)-$ である；

各 $R^{11}$ は、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各 $R^{12}$ および $R^{13}$ は独立して、水素、アルキル、または $-OR^9$ である；

各 $R^{14}$ は、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各 $R^{15}$ は、アルキルである）

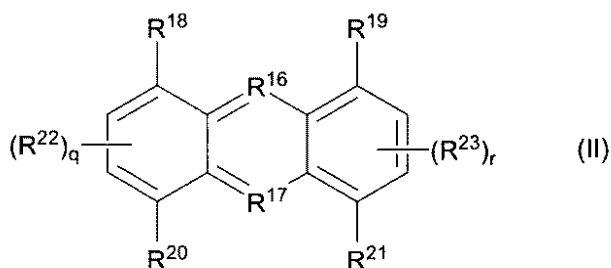
の化合物であって、その立体異性体、鏡像異性体、互変異性体もしくはその混合物としての化合物；

またはその薬学的に許容され得る塩、溶媒和物もしくはプロドラッグを含む、組成物。

【請求項43】

式(II)：

【化45】



(式中：

qおよびrは、各々独立して0、1または2である；

$R^{16}$ および $R^{17}$ は、各々独立して、 $=C(R^{24})-$ または $=N-$ である；

$R^{18}$ および $R^{19}$ は異っており、各々独立して、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-$

$C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択されるか；

または  $R^{18}$  および  $R^{19}$  が同じであり、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  は異なっており、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-N(R^{28})S(O)_tR^{29}$ 、 $-S(O)_tOR^{29}$ 、 $-S(O)_pR^{28}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{28})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 であるか；

または  $R^{20}$  および  $R^{21}$  は同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-N(R^{28})S(O)_tR^{29}$ 、 $-S(O)_tOR^{29}$ 、 $-S(O)_pR^{28}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{28})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  は独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-OR^{24}$ 、 $-R^{25}-OS(O)_2R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S(O)_pR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)R^{28}$ 、 $-R^{25}-C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-OC(O)R^{28}$ 、 $-R^{25}-C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-N=C(R^{29})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})S(O)_tR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(=NR^{28})N(R^{28})_2$ 、および  $-R^{25}-N(R^{28})C(N=C(R^{28})_2)N(R^{28})_2$  からなる群より選択され、ここで、各  $p$  は独立して 0、1 または 2 であり、各  $t$  は独立して 1 または 2 である；

各  $R^{24}$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{25}$  は、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  は独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{24}$  である；

各  $R^{28}$  は、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に

置換されたヘテロアリーールである；ならびに

各  $R^{2\ 9}$  は、アルキルである）

の化合物であって、その立体異性体、鏡像異性体、互変異性体もしくはその混合物としての化合物；

またはその薬学的に許容され得る塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ。

【請求項 4 4】

q および r が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{1\ 6}$  および  $R^{1\ 7}$  が、各々独立して、 $=C(R^{2\ 4})$  - または  $=N$  - である；

$R^{1\ 8}$  および  $R^{1\ 9}$  が同じであり、 $-R^{2\ 5}-S-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$ 、 $-R^{2\ 5}-O-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$ 、 $-R^{2\ 5}-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$  または  $-R^{2\ 5}-N(R^9)-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$  から選択される；

$R^{2\ 0}$  および  $R^{2\ 1}$  が同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{2\ 5}-CN$ 、 $-R^{2\ 5}-NO_2$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})_2$ 、 $-R^{2\ 5}-C(O)OR^{2\ 8}$ 、 $-R^{2\ 5}-C(O)N(R^{2\ 8})_2$ 、 $-R^{2\ 5}-S-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$ 、 $-R^{2\ 5}-O-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$ 、 $-R^{2\ 5}-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^9)-C(=NR^{2\ 6})N(R^{2\ 6})R^{2\ 7}$ 、 $-N(R^{2\ 8})S(O)_tR^{2\ 9}$ 、 $-S(O)_tOR^{2\ 9}$ 、 $-S(O)_pR^{2\ 8}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{2\ 8})_2$  から選択され、ここで、各 t は独立して 1 もしくは 2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^{2\ 2}$  および  $R^{2\ 3}$  が独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリーール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリーール、任意選択的に置換されたヘテロアリーールアルキル、 $-R^{2\ 5}-CN$ 、 $-R^{2\ 5}-NO_2$ 、 $-R^{2\ 5}-OR^{2\ 4}$ 、 $-R^{2\ 5}-OS(O)_2R^{2\ 9}$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})_2$ 、 $-R^{2\ 5}-S(O)_pR^{2\ 8}$ 、 $-R^{2\ 5}-C(O)R^{2\ 8}$ 、 $-R^{2\ 5}-C(S)R^{2\ 9}$ 、 $-R^{2\ 5}-C(O)OR^{2\ 8}$ 、 $-R^{2\ 5}-OC(O)R^{2\ 8}$ 、 $-R^{2\ 5}-C(S)OR^{2\ 8}$ 、 $-R^{2\ 5}-C(O)N(R^{2\ 8})_2$ 、 $-R^{2\ 5}-C(S)N(R^{2\ 8})_2$ 、 $-N=C(R^{2\ 9})_2$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})C(O)R^{2\ 9}$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})C(S)R^{2\ 9}$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})C(O)OR^{2\ 8}$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})C(S)OR^{2\ 8}$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})C(O)N(R^{2\ 8})_2$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})C(S)N(R^{2\ 8})_2$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})S(O)_tR^{2\ 8}$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})S(O)_tN(R^{2\ 8})_2$ 、 $-R^{2\ 5}-S(O)_tN(R^{2\ 8})_2$ 、 $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})C(=NR^{2\ 8})N(R^{2\ 8})_2$ 、および  $-R^{2\ 5}-N(R^{2\ 8})C(N=C(R^{2\ 8})_2)N(R^{2\ 8})_2$  からなる群より選択され、ここで、各 p は独立して 0、1 または 2 であり、各 t は独立して 1 または 2 である；

各  $R^{2\ 4}$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリーール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリーールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリーールアルキルである；

各  $R^{2\ 5}$  が、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{2\ 6}$  および  $R^{2\ 7}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{2\ 4}$  である；

各  $R^{2\ 8}$  が、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリーール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリーールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリーールである；ならびに

各  $R^{2\ 9}$  がアルキルである、

請求項 4 3 に記載の化合物。

【請求項 4 5】

q および r が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  および  $R^{17}$  が各々、 $=C(R^{24})-$  である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  が同じであり、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25}-N(R^{24})-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  が同じであり、水素、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25}-N(R^{24})-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  が独立して、 $-R^{25}-OR^{24}$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^{24}$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{25}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{24}$  である、

請求項 4 4 に記載の化合物。

【請求項 4 6】

q および r が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  および  $R^{17}$  が各々、 $=C(R^{24})-$  である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  が同じであり、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25}-N(R^{24})-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  が同じであり、水素、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25}-N(R^{24})-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  が独立して、 $-R^{25}-OR^{24}$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^{24}$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{25}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{24}$  である、

請求項 4 5 に記載の化合物。

【請求項 4 7】

q および r が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  および  $R^{17}$  が各々、 $=C(R^{24})-$  である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  がともに  $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  である；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  がともに水素である；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  が独立して、 $-R^{25}-OR^{24}$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^{24}$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換

されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{25}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに  
各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{24}$  である、

請求項 46 に記載の化合物。

【請求項 48】

アントラセン - 1, 8 - ジイルビス (メチレン) ジカルバムイミドチオアートである、請求項 47 に記載の化合物。

【請求項 49】

q および r が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  が、 $=N-$  である；

$R^{17}$  が、 $=C(R^{24})-$  である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  が同じであり、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25}-N(R^{24})-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  が同じであり、水素、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25}-N(R^{24})-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  が独立して、 $-R^{25}-OR^{24}$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^{24}$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{25}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに  
各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{24}$  である、

請求項 44 に記載の化合物。

【請求項 50】

q および r が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  が、 $=N-$  である；

$R^{17}$  が、 $=C(R^{24})-$  である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  が同じであり、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25}-N(R^{24})-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  が同じであり、水素、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25}-N(R^{24})-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  が独立して、 $-R^{25}-OR^{24}$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^{24}$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{25}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに  
各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{24}$  である、

請求項 49 に記載の化合物。

【請求項 51】

q および r が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  が、 $= N -$  である；

$R^{17}$  が、 $= C(R^{24}) -$  である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  がともに  $- R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  である；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  がともに水素である；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  が独立して、 $- R^{25} - OR^{24}$ 、アルキル、ハロおよびハロアルキルからなる群より選択される；

各  $R^{24}$  が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたアラルキルである；

各  $R^{25}$  が独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；ならびに

各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $- OR^{24}$  である、

請求項 50 に記載の化合物。

【請求項 52】

アクリジン - 4, 5 - ジイルビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート；および  
(9 - メチルアクリジン - 4, 5 - ジイル)ビス(メチレン)ジカルバムイミドチオアート

からなる群より選択される、請求項 51 に記載の化合物。

【請求項 53】

q および r が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  および  $R^{17}$  が、各々独立して、 $= C(R^{24}) -$  または  $= N -$  である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  が異なり、各々独立して、 $- R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $- R^{25} - O - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $- R^{25} - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $- R^{25} - N(R^9) - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  が異なり、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $- R^{25} - CN$ 、 $- R^{25} - NO_2$ 、 $- R^{25} - N(R^{28})_2$ 、 $- R^{25} - C(O)OR^{28}$ 、 $- R^{25} - C(O)N(R^{28})_2$ 、 $- R^{25} - S - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $- R^{25} - O - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $- R^{25} - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $- R^{25} - N(R^9) - C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $- N(R^{28})S(O)_tR^{29}$ 、 $- S(O)_tOR^{29}$ 、 $- S(O)_pR^{28}$ 、または  $- S(O)_tN(R^{28})_2$  から選択され、ここで、各 t は独立して 1 もしくは 2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  が独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $- R^{25} - CN$ 、 $- R^{25} - NO_2$ 、 $- R^{25} - OR^{24}$ 、 $- R^{25} - OS(O)_2R^{29}$ 、 $- R^{25} - N(R^{28})_2$ 、 $- R^{25} - S(O)_pR^{28}$ 、 $- R^{25} - C(O)R^{28}$ 、 $- R^{25} - C(S)R^{29}$ 、 $- R^{25} - C(O)OR^{28}$ 、 $- R^{25} - OC(O)R^{28}$ 、 $- R^{25} - C(S)OR^{28}$ 、 $- R^{25} - C(O)N(R^{28})_2$ 、 $- R^{25} - C(S)N(R^{28})_2$ 、 $- N=C(R^{29})_2$ 、 $- R^{25} - N(R^{28})C(O)R^{29}$ 、 $- R^{25} - N(R^{28})C(S)R^{29}$ 、 $- R^{25} - N(R^{28})C(O)OR^{28}$ 、 $- R^{25} - N(R^{28})C(S)OR^{28}$ 、 $- R^{25} - N(R^{28})C(O)N(R^{28})_2$ 、 $- R^{25} - N(R^{28})C(S)N(R^{28})_2$ 、 $- R^{25} - N(R^{28})S(O)_tR^{28}$ 、 $- R^{25} - N(R^{28})S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $- R^{25} - S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $- R^{25} - N(R^{28})C(=NR^{28})N(R^{28})_2$ 、および  $- R^{25} - N(R^{28})C(N=C(R^{28})_2)N(R^{28})_2$  からなる群より選択され、ここで



、各  $p$  は独立して 0、1 または 2 であり、各  $t$  は独立して 1 または 2 である；

各  $R^{2,4}$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{2,5}$  が、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{2,6}$  および  $R^{2,7}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{2,4}$  である；

各  $R^{2,8}$  が、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $R^{2,9}$  がアルキルである、

請求項 43 に記載の化合物。

【請求項 54】

$q$  および  $r$  が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{1,6}$  および  $R^{1,7}$  が、各々独立して、 $=C(R^{2,4})$  - または  $=N$  - である；

$R^{1,8}$  および  $R^{1,9}$  が異なり、各々独立して、 $-R^{2,5}-S-C(=NR^{2,6})N(R^{2,6})R^{2,7}$ 、 $-R^{2,5}-O-C(=NR^{2,6})N(R^{2,6})R^{2,7}$ 、 $-R^{2,5}-C(=NR^{2,6})N(R^{2,6})R^{2,7}$  または  $-R^{2,5}-N(R^9)-C(=NR^{2,6})N(R^{2,6})R^{2,7}$  から選択される；

$R^{2,0}$  および  $R^{2,1}$  が同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{2,5}-CN$ 、 $-R^{2,5}-NO_2$ 、 $-R^{2,5}-N(R^{2,8})_2$ 、 $-R^{2,5}-C(O)OR^{2,8}$ 、 $-R^{2,5}-C(O)N(R^{2,8})_2$ 、 $-R^{2,5}-S-C(=NR^{2,6})N(R^{2,6})R^{2,7}$ 、 $-R^{2,5}-O-C(=NR^{2,6})N(R^{2,6})R^{2,7}$ 、 $-R^{2,5}-C(=NR^{2,6})N(R^{2,6})R^{2,7}$ 、 $-R^{2,5}-N(R^9)-C(=NR^{2,6})N(R^{2,6})R^{2,7}$ 、 $-N(R^{2,8})S(O)_tR^{2,9}$ 、 $-S(O)_tOR^{2,9}$ 、 $-S(O)_pR^{2,8}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{2,8})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^{2,2}$  および  $R^{2,3}$  が独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{2,5}-CN$ 、 $-R^{2,5}-NO_2$ 、 $-R^{2,5}-OR^{2,4}$ 、 $-R^{2,5}-OS(O)_2R^{2,9}$ 、 $-R^{2,5}-N(R^{2,8})_2$ 、 $-R^{2,5}-S(O)_pR^{2,8}$ 、 $-R^{2,5}-C(O)R^{2,8}$ 、 $-R^{2,5}-C(S)R^{2,9}$ 、 $-R^{2,5}-C(O)OR^{2,8}$ 、 $-R^{2,5}-OC(O)R^{2,8}$ 、 $-R^{2,5}-C(S)OR^{2,8}$ 、 $-R^{2,5}-C(O)N(R^{2,8})_2$ 、 $-R^{2,5}-C(S)N(R^{2,8})_2$ 、 $-N=C(R^{2,9})_2$ 、 $-R^{2,5}-N(R^{2,8})C(O)R^{2,9}$ 、 $-R^{2,5}-N(R^{2,8})C(S)R^{2,9}$ 、 $-R^{2,5}-N(R^{2,8})C(O)OR^{2,8}$ 、 $-R^{2,5}-N(R^{2,8})C(S)OR^{2,8}$ 、 $-R^{2,5}-N(R^{2,8})C(O)N(R^{2,8})_2$ 、 $-R^{2,5}-N(R^{2,8})C(S)N(R^{2,8})_2$ 、 $-R^{2,5}-N(R^{2,8})S(O)_tR^{2,8}$ 、 $-R^{2,5}-N(R^{2,8})S(O)_tN(R^{2,8})_2$ 、 $-R^{2,5}-S(O)_tN(R^{2,8})_2$ 、 $-R^{2,5}-N(R^{2,8})C(=NR^{2,8})N(R^{2,8})_2$ 、および  $-R^{2,5}-N(R^{2,8})C(N=C(R^{2,8})_2)N(R^{2,8})_2$  からなる群より選択され、ここで、各  $p$  は独立して 0、1 または 2 であり、各  $t$  は独立して 1 または 2 である；

各  $R^{2,4}$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任

意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{25}$  が、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{24}$  である；

各  $R^{28}$  が、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $R^{29}$  がアルキルである、

請求項 43 に記載の化合物。

【請求項 55】

q および r が、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  および  $R^{17}$  が、各々独立して、 $=C(R^{24})$  - または  $=N$  - である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  が同じであり、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  が異なり、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-N(R^{28})S(O)_tR^{29}$ 、 $-S(O)_tOR^{29}$ 、 $-S(O)_pR^{28}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{28})_2$  から選択され、ここで、各 t は独立して 1 もしくは 2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  が独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-OR^{24}$ 、 $-R^{25}-OS(O)_2R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S(O)_pR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)R^{28}$ 、 $-R^{25}-C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-OC(O)R^{28}$ 、 $-R^{25}-C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-N=C(R^{29})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})S(O)_tR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(=NR^{28})N(R^{28})_2$ 、および  $-R^{25}-N(R^{28})C(N=C(R^{28})_2)N(R^{28})_2$  からなる群より選択され、ここで、各 p は独立して 0、1 または 2 であり、各 t は独立して 1 または 2 である；

各  $R^{24}$  が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{25}$  が、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  が独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{24}$  である；

各  $R^{28}$  が、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

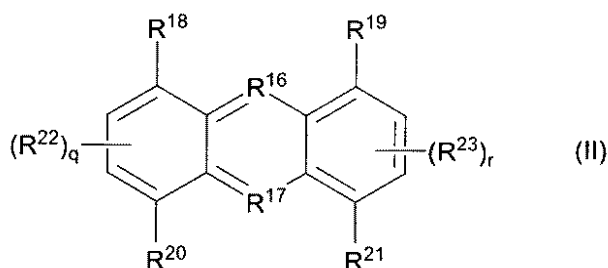
各  $R^{29}$  がアルキルである、

請求項 43 に記載の化合物。

【請求項 56】

薬学的に許容され得る賦形剤と、式 (II)：

【化 46】



(式中：

$q$  および  $r$  は、各々独立して 0、1 または 2 である；

$R^{16}$  および  $R^{17}$  は、各々独立して、 $=C(R^{24})$  - または  $=N$  - である；

$R^{18}$  および  $R^{19}$  は異なり、各々独立して、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択されるか；

または  $R^{18}$  および  $R^{19}$  は同じであり、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  または  $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  は異なり、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-N(R^{28})S(O)_tR^{29}$ 、 $-S(O)_tOR^{29}$ 、 $-S(O)_pR^{28}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{28})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 であるか；

または  $R^{20}$  および  $R^{21}$  は同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-N(R^{28})S(O)_tR^{29}$ 、 $-S(O)_tOR^{29}$ 、 $-S(O)_pR^{28}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{28})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  は独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{22}$

$^5 - \text{CN}$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{NO}_2$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{OR}^{24}$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{OS}(\text{O})_2 \text{R}^{29}$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{N}(\text{R}^{28})_2$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{S}(\text{O})_p \text{R}^{28}$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{C}(\text{O}) \text{R}^{28}$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{C}(\text{S}) \text{R}^{29}$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{C}(\text{O}) \text{OR}^{28}$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{OC}(\text{O}) \text{R}^{28}$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{C}(\text{S}) \text{OR}^{28}$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{C}(\text{O}) \text{N}(\text{R}^{28})_2$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{C}(\text{S}) \text{N}(\text{R}^{28})_2$ 、 $- \text{N}=\text{C}(\text{R}^{29})_2$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{N}(\text{R}^{28}) \text{C}(\text{O}) \text{R}^{29}$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{N}(\text{R}^{28}) \text{C}(\text{S}) \text{R}^{29}$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{N}(\text{R}^{28}) \text{C}(\text{O}) \text{OR}^{28}$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{N}(\text{R}^{28}) \text{C}(\text{S}) \text{OR}^{28}$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{N}(\text{R}^{28}) \text{C}(\text{O}) \text{N}(\text{R}^{28})_2$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{N}(\text{R}^{28}) \text{C}(\text{S}) \text{N}(\text{R}^{28})_2$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{N}(\text{R}^{28}) \text{S}(\text{O})_t \text{R}^{28}$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{N}(\text{R}^{28}) \text{S}(\text{O})_t \text{N}(\text{R}^{28})_2$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{S}(\text{O})_t \text{N}(\text{R}^{28})_2$ 、 $- \text{R}^{25} - \text{N}(\text{R}^{28}) \text{C}(=\text{NR}^{28}) \text{N}(\text{R}^{28})_2$ 、および  $- \text{R}^{25} - \text{N}(\text{R}^{28}) \text{C}(\text{N}=\text{C}(\text{R}^{28})_2) \text{N}(\text{R}^{28})_2$  からなる群より選択され、ここで、各  $p$  は独立して 0、1 または 2 であり、各  $t$  は独立して 1 または 2 である；

各  $\text{R}^{24}$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $\text{R}^{25}$  は、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $\text{R}^{26}$  および  $\text{R}^{27}$  は独立して、水素、アルキルまたは  $-\text{OR}^{24}$  である；

各  $\text{R}^{28}$  は、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $\text{R}^{29}$  は、アルキルである）

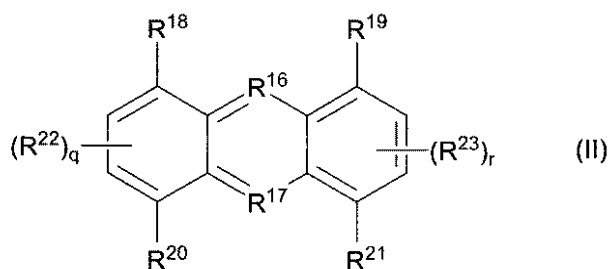
の化合物であって、その立体異性体、鏡像異性体、互変異性体もしくはその混合物としての化合物；

またはその薬学的に許容され得る塩、溶媒和物もしくはプロドラッグを含む医薬組成物。

【請求項 57】

治療有効量の式 (II)：

【化 47】



(式中：

$q$  および  $r$  は、各々独立して 0、1 または 2 である；

$\text{R}^{16}$  および  $\text{R}^{17}$  は、各々独立して、 $=\text{C}(\text{R}^{24})$  - または  $=\text{N}$  - である；

$\text{R}^{18}$  および  $\text{R}^{19}$  は異なっており、各々独立して、 $-\text{R}^{25} - \text{S} - \text{C}(=\text{NR}^{26}) \text{N}(\text{R}^{26}) \text{R}^{27}$ 、 $-\text{R}^{25} - \text{O} - \text{C}(=\text{NR}^{26}) \text{N}(\text{R}^{26}) \text{R}^{27}$ 、 $-\text{R}^{25} - \text{C}(=\text{NR}^{26}) \text{N}(\text{R}^{26}) \text{R}^{27}$  または  $-\text{R}^{25} - \text{N}(\text{R}^{29}) - \text{C}(=\text{NR}^{26}) \text{N}(\text{R}^{26}) \text{R}^{27}$  から選択されるか；

または  $\text{R}^{18}$  および  $\text{R}^{19}$  は同じであり、 $-\text{R}^{25} - \text{S} - \text{C}(=\text{NR}^{26}) \text{N}(\text{R}^{26}) \text{R}^{27}$ 、 $-\text{R}^{25} - \text{O} - \text{C}(=\text{NR}^{26}) \text{N}(\text{R}^{26}) \text{R}^{27}$ 、 $-\text{R}^{25} - \text{C}(=\text{NR}^{26}) \text{N}(\text{R}^{26}) \text{R}^{27}$  または  $-\text{R}^{25} - \text{N}(\text{R}^{29}) - \text{C}(=\text{NR}^{26}) \text{N}(\text{R}^{26}) \text{R}^{27}$  から選択される；

$R^{20}$  および  $R^{21}$  が異なり、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-N(R^{28})S(O)_tR^{29}$ 、 $-S(O)_tOR^{29}$ 、 $-S(O)_pR^{28}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{28})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 であるか；

または  $R^{20}$  および  $R^{21}$  は同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-O-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-R^{25}-N(R^9)-C(=NR^{26})N(R^{26})R^{27}$ 、 $-N(R^{28})S(O)_tR^{29}$ 、 $-S(O)_tOR^{29}$ 、 $-S(O)_pR^{28}$ 、または  $-S(O)_tN(R^{28})_2$  から選択され、ここで、各  $t$  は独立して 1 もしくは 2 であり、各  $p$  は 0、1 もしくは 2 である；

各  $R^{22}$  および  $R^{23}$  は独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたアラルケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{25}-CN$ 、 $-R^{25}-NO_2$ 、 $-R^{25}-OR^{24}$ 、 $-R^{25}-OS(O)_2R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S(O)_pR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)R^{28}$ 、 $-R^{25}-C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25}-C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-OC(O)R^{28}$ 、 $-R^{25}-C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-N=C(R^{29})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(O)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})S(O)_tR^{28}$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $-R^{25}-N(R^{28})C(=NR^{28})N(R^{28})_2$ 、および  $-R^{25}-N(R^{28})C(N=C(R^{28})_2)N(R^{28})_2$  からなる群より選択され、ここで、各  $p$  は独立して 0、1 または 2 であり、各  $t$  は独立して 1 または 2 である；

各  $R^{24}$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{25}$  は、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  は独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{24}$  である；

各  $R^{28}$  は、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $R^{29}$  は、アルキルである）

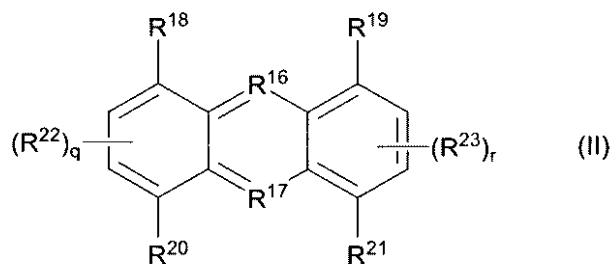
の化合物であって、その立体異性体、鏡像異性体、互変異性体もしくはその混合物としての化合物；

またはその薬学的に許容され得る塩、溶媒和物もしくはプロドラッグを含む、該哺乳動物の鉄障害を処置するための組成物。

## 【請求項 58】

哺乳動物の鉄障害と関連する疾患または病状を処置するための組成物であって、該組成物は、治療有効量の式 (II) :

## 【化 48】



(式中 :

q および r は、各々独立して 0、1 または 2 である ;

R<sup>16</sup> および R<sup>17</sup> は、各々独立して、= C (R<sup>24</sup>) - または = N - である ;

R<sup>18</sup> および R<sup>19</sup> は異なり、各々独立して、- R<sup>25</sup> - S - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - O - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup> または - R<sup>25</sup> - N ( R<sup>9</sup> ) - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup> から選択されるか ;

または R<sup>18</sup> および R<sup>19</sup> は同じであり、- R<sup>25</sup> - S - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - O - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup> または - R<sup>25</sup> - N ( R<sup>9</sup> ) - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup> から選択される ;

R<sup>20</sup> および R<sup>21</sup> は異なり、各々独立して、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、- R<sup>25</sup> - CN、- R<sup>25</sup> - NO<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - N ( R<sup>28</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - C ( O ) OR<sup>28</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( O ) N ( R<sup>28</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - S - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - O - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - N ( R<sup>9</sup> ) - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- N ( R<sup>28</sup> ) S ( O )<sub>t</sub> R<sup>29</sup>、- S ( O )<sub>t</sub> OR<sup>29</sup>、- S ( O )<sub>p</sub> R<sup>28</sup>、または - S ( O )<sub>t</sub> N ( R<sup>28</sup> )<sub>2</sub> から選択され、ここで、各 t は独立して 1 もしくは 2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 であるか ;

または R<sup>20</sup> および R<sup>21</sup> は同じであり、水素、アルキル、ハロ、ハロアルキル、- R<sup>25</sup> - CN、- R<sup>25</sup> - NO<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - N ( R<sup>28</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - C ( O ) OR<sup>28</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( O ) N ( R<sup>28</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - S - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - O - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- R<sup>25</sup> - N ( R<sup>9</sup> ) - C ( = N R<sup>26</sup> ) N ( R<sup>26</sup> ) R<sup>27</sup>、- N ( R<sup>28</sup> ) S ( O )<sub>t</sub> R<sup>29</sup>、- S ( O )<sub>t</sub> OR<sup>29</sup>、- S ( O )<sub>p</sub> R<sup>28</sup>、または - S ( O )<sub>t</sub> N ( R<sup>28</sup> )<sub>2</sub> から選択され、ここで、各 t は独立して 1 もしくは 2 であり、各 p は 0、1 もしくは 2 である ;

各 R<sup>22</sup> および R<sup>23</sup> は独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラールキル、任意選択的に置換されたアラールケニル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリール、任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキル、- R<sup>25</sup> - CN、- R<sup>25</sup> - NO<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - OR<sup>24</sup>、- R<sup>25</sup> - OS ( O )<sub>2</sub> R<sup>29</sup>、- R<sup>25</sup> - N ( R<sup>28</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - S ( O )<sub>p</sub> R<sup>28</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( O ) R<sup>28</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( S ) R<sup>29</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( O ) OR<sup>28</sup>、- R<sup>25</sup> - OC ( O ) R<sup>28</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( S ) OR<sup>28</sup>、- R<sup>25</sup> - C ( O ) N ( R<sup>28</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - C ( S ) N ( R<sup>28</sup> )<sub>2</sub>、- N = C ( R<sup>29</sup> )<sub>2</sub>、- R<sup>25</sup> - N ( R<sup>28</sup> ) C ( O ) R<sup>29</sup>、- R

$R^{25} - N(R^{28})C(S)R^{29}$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(O)OR^{28}$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(S)OR^{28}$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})C(O)N(R^{28})_2$ 、  
 $-R^{25} - N(R^{28})C(S)N(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - N(R^{28})S(O)_tR^{28}$ 、  
 $-R^{25} - N(R^{28})S(O)_tN(R^{28})_2$ 、 $-R^{25} - S(O)_tN(R^{28})_2$ 、  
 $-R^{25} - N(R^{28})C(=NR^{28})N(R^{28})_2$ 、および  $-R^{25} - N(R^{28})C(N=C(R^{28})_2)N(R^{28})_2$  からなる群より選択され、ここで、各 p は独立して 0、1 または 2 であり、各 t は独立して 1 または 2 である；

各  $R^{24}$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキル、任意選択的に置換されたシクロアルキルアルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロシクリル、任意選択的に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールアルキルである；

各  $R^{25}$  は、独立して、直接結合または直鎖もしくは分枝アルキレン鎖である；

各  $R^{26}$  および  $R^{27}$  は独立して、水素、アルキルまたは  $-OR^{24}$  である；

各  $R^{28}$  は、独立して、水素、アルキル、任意選択的に置換されたアリール、任意選択的に置換されたアラルキル、任意選択的に置換されたヘテロアリールまたは任意選択的に置換されたヘテロアリールである；ならびに

各  $R^{29}$  は、アルキルである）

の化合物であって、その立体異性体、鏡像異性体、互変異性体もしくはその混合物としての化合物；

またはその薬学的に許容され得る塩、溶媒和物もしくはプロドラッグを含む、組成物。