

【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18年4月27日(2006.4.27)

【公表番号】特表2002-506061(P2002-506061A)

【公表日】平成14年2月26日(2002.2.26)

【出願番号】特願2000-535629(P2000-535629)

【国際特許分類】

C 0 7 D 243/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 5/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/04 (2006.01)

A 6 1 P 7/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 21/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 243/02

A 6 1 K 31/551

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	1/18	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	5/00	
A 6 1 P	7/04	
A 6 1 P	7/06	
A 6 1 P	9/02	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	17/14	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	19/08	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	21/04	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	31/12	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	43/00	1 0 7
A 6 1 P	43/00	1 1 1
C 0 7 D	401/12	
C 0 7 D	401/14	
C 0 7 D	403/04	
C 0 7 D	405/12	
C 0 7 D	405/14	

【手続補正書】

【提出日】平成18年3月6日(2006.3.6)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

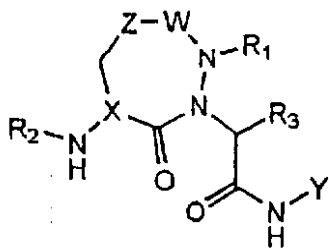
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】以下の式(Ⅰ)により表わされる化合物であって：

【化1】



【化 2】

$$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{R}^5 - \text{C} - (\text{CH}_2)_m - \text{CH}(\text{CH}_3) - \text{C}(=\text{O})\text{R}^6 \end{array}$$

または

Xは、 $-\text{C}(\text{H})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^8)-$ 、または

【化 3】


$$\begin{aligned} R^2 \text{ は、} & -C(O)R^8, -C(O)C(O)R^8, -S(O)_2R^8, -S(O)R^8, \\ & -C(O)OR^8, -C(O)N(H)R^8, -S(O)_2N(H)R^8, -S(O)N(H)R^8, \\ & -C(O)C(O)N(H)R^8, -C(O)CH=CHR^8, -C(O)CH_2OR^8, \\ & -C(O)CH_2N(H)R^8, -C(O)N(R^8)_2, -S(O)_2N(R^8)_2, \\ & -S(O)N(R^8)_2, -C(O)C(O)N(R^8)_2, - \end{aligned}$$

$C(O)CH_2N(R^8)_2$ 、 $-CH_2-R^8$ 、 $-CH_2$ -アルケニル- R^8 、または $-CH_2$ -アルキニル- R^8 であり；

R^3 は、 $-H$ 、 $-R^{21}$ 、 $-アルキル-R^{21}$ 、 $-アルケニル-R^{21}$ 、 $-アルキニル-R^{21}$ 、アルキル、またはアミノ酸側鎖であり；

各 R^4 は、独立して、 $-OH$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-CO_2H$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-N(H)C(O)H$ 、 $-N(H)C(O)NH_2$ 、 $-アルキル$ 、 $-シクロアルキル$ 、 $-パーフルオロアルキル$ 、 $-O-アルキル$ 、 $-N(H)アルキル$ 、 $-N(アルキル)_2$ 、 $-C(O)N(H)アルキル$ 、 $-C(O)N(アルキル)_2$ 、 $-N(H)C(O)アルキル$ 、 $-N(H)C(O)N(H)アルキル$ 、 $-N(H)C(O)N(アルキル)_2$ 、 $-S-アルキル$ 、 $-S(O)_2アルキル$ 、 $-S(O)アルキル$ 、 $-C(O)アルキル$ 、 $-CH_2NH_2$ 、 $-CH_2N(H)アルキル$ 、 $-CH_2N(アルキル)_2$ 、または $-N(H)C(O)Oアルキル$ であり；

R^5 は、 $-OH$ 、 $-OR^8$ 、 $-N(H)OH$ 、または $-N(H)SO_2R^8$ であり；

R^6 は、 $-H$ 、 $-CH_2OR^9$ 、 $-CH_2SR^{10}$ 、 $-CH_2N(H)R^9$ 、 $-CH_2N(R^9)R^{11}$ 、 $-C(H)N_2$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CH_2Cl$ 、 $-CH_2Br$ 、 $-CH_2I$ 、 $-C(O)N(R^{11})_2$ 、 $-R^{13}$ または $-R^{14}$ であり；

各 R^8 は、独立して、 $-アルキル$ 、 $-シクロアルキル$ 、 $-アリール$ 、 $-ヘテロアリール$ 、 $-ヘテロシクリル$ 、 $-アルキルシクロアルキル$ 、 $-アルキルアリール$ 、 $-アルキルヘテロアリール$ 、または $-アルキルヘテロシクリル$ であり；

R^9 は、 $-H$ 、 $-C(O)アリール$ 、 $-C(O)ヘテロアリール$ 、 $-C(O)アルキルアリール$ 、 $-C(O)アルキルヘテロアリール$ 、 $-アルキルアリール$ 、 $-アルキルヘテロアリール$ 、 $-アリール$ 、 $-ヘテロアリール$ 、または $-P(O)(R^{15})_2$ であり；

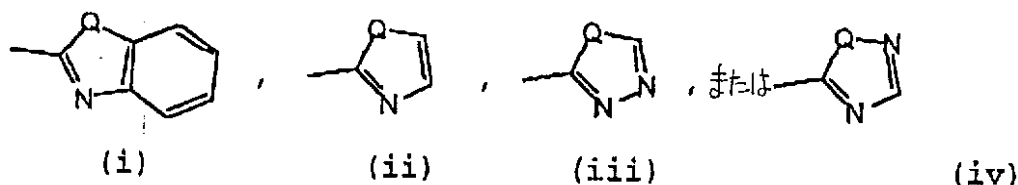
R^{10} は、 $-アルキルアリール$ または $-アルキルヘテロアリール$ であり；

各 R^{11} は、独立して、 $-H$ 、 $-アルキル$ 、 $-アリール$ 、 $-ヘテロアリール$ 、 $-シクロアルキル$ 、 $-アルキルアリール$ または $-アルキルヘテロアリール$ であり；

R^{13} は、 $-アルキルアリール$ または $-アルキルヘテロアリール$ であり；

R^{14} は、以下であり：

【化4】



ここで、 Q は、 $-O-$ または $-S-$ であり、(i)の任意の水素原子は、必要に応じて、 $-R^{17}$ で置換されており、そして(ii)、(iii)、および(iv)の任意の水素原子は、必要に応じて、 $-R^{17}$ 、 $-R^{18}$ または $-アルキル-R^{18}$ で置換されており；

各 R^{15} は、独立して、 $-H$ 、 $-OH$ 、 $-アルキル$ 、 $-アリール$ 、 $-ヘテロアリール$ 、 $-シクロアルキル$ 、 $-アルキルアリール$ 、 $-アルキルヘテロアリール$ 、 $-Oアルキル$ 、 $-Oアリール$ 、 $-Oヘテロアリール$ 、 $-Oアルキルアリール$ または $-Oアルキルヘテロアリール$ であり；

各 R^{17} は、独立して、 $-OH$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-CO_2H$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-N(H)C(O)H$ 、 $-N(H)C(O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-C(O)H$ 、 $-アルキル$ 、 $-シクロアルキル$ 、 $-パーフルオロアルキル$ 、 $-O-アルキル$ 、 $-N(H)アルキル$ 、 $-N(アルキル)_2$ 、 $-CO_2アルキル$ 、 $-C(O)N(H)アルキル$ 、 $-C(O)N(アルキル)_2$ 、 $-N(H)C(O)アルキル$ 、 $-N(H)C(O)N(H)アルキル$ 、 $-N(H)C(O)N(アルキル)_2$ 、

—S(O)₂N(H)アルキル、—S(O)N(H)アルキル、—S(O)₂N(アルキル)₂、—S(O)N(アルキル)₂、—S—アルキル、—S(O)₂アルキル、—S(O)アルキルまたは—C(O)アルキルであり；

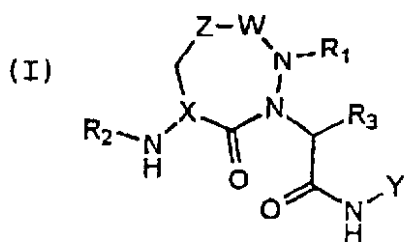
各R^{1 8}は、独立して、—アリール、—ヘテロアリール、—アルキルアリール、—アルキルヘテロアリール、—O—アリール、—O—ヘテロアリール、—O—アルキルアリール、—O—アルキルヘテロアリール、—N(H)アリール、—N(アリール)₂、—N(H)ヘテロアリール、—N(ヘテロアリール)₂、—N(H)アルキルアリール、—N(アルキルアリール)₂、—N(H)アルキルヘテロアリール、—N(アルキルヘテロアリール)₂、—S—アリール、—S—ヘテロアリール、—S—アルキルアリール、—S—アルキルヘテロアリール、—C(O)アリール、—C(O)ヘテロアリール、—C(O)アルキルアリール、—C(O)アルキルヘテロアリール、—CO₂アリール、—CO₂ヘテロアリール、—CO₂アルキルアリール、—CO₂アルキルヘテロアリール、—C(O)N(H)アリール、—C(O)N(アリール)₂、—C(O)N(H)ヘテロアリール、—C(O)N(ヘテロアリール)₂、—C(O)N(H)アルキルアリール、—C(O)N(アルキルアリール)₂、—C(O)N(H)アルキルヘテロアリール、—C(O)N(アルキルヘテロアリール)₂、—S(O)₂—アリール、—S(O)—アリール、—S(O)₂—ヘテロアリール、—S(O)—ヘテロアリール、—S(O)₂—アルキルアリール、—S(O)—アルキルアリール、—S(O)₂—アルキルヘテロアリール、—S(O)—アルキルヘテロアリール、—S(O)₂N(H)—アリール、—S(O)N(H)—アリール、—S(O)₂NH—ヘテロアリール、—S(O)NH—ヘテロアリール、—S(O)₂N(H)—アルキルアリール、—S(O)N(H)—アルキルアリール、—S(O)₂N(H)—アルキルヘテロアリール、—S(O)N(H)—アルキルヘテロアリール、—S(O)₂N(アリール)₂、—S(O)N(アリール)₂、—S(O)₂N(ヘテロアリール)₂、—S(O)N(ヘテロアリール)₂、—S(O)₂N(アルキルアリール)₂、—S(O)N(アルキルアリール)₂、—S(O)₂N(アルキルヘテロアリール)₂、—S(O)N(アルキルヘテロアリール)₂、—N(H)C(O)N(H)アリール、—N(H)C(O)N(H)ヘテロアリール、—N(H)C(O)N(H)アルキルアリール、—N(H)C(O)N(H)アルキルヘテロアリール、—N(H)C(O)N(アリール)₂、—N(H)C(O)N(ヘテロアリール)₂、—N(H)C(O)N(アルキルアリール)₂または—N(H)C(O)N(アルキルヘテロアリール)₂であり；そして

各R^{2 1}は、独立して、—アリール、—ヘテロアリール、—シクロアルキル、またはヘテロシクリルであり、ここで、任意の炭素原子に結合する水素原子は、必要に応じて、R⁴によって置換され、そして任意の窒素原子に結合する水素原子は、必要に応じてR²によって置換されている、

化合物。

【請求項2】 以下の式(I)により表わされる化合物であって：

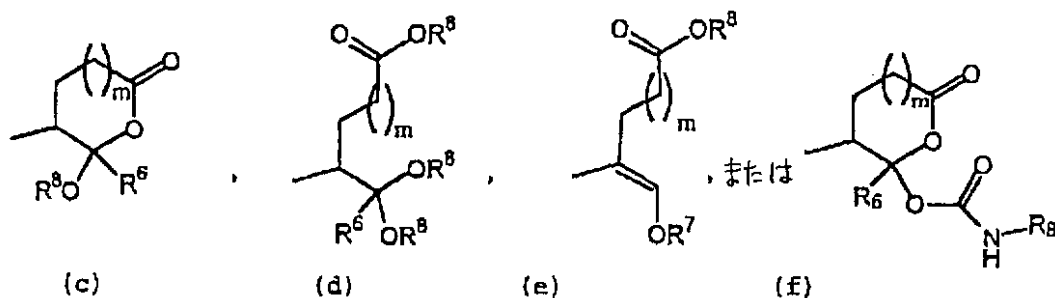
【化5】



ここで、

Yは、以下であり：

【化6】



mは、0または1であり；

Wは、 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-$ 、または $-\text{S}(\text{O})-$ ；であり；

Xは、 $-\text{C}(\text{H})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^8)-$ 、または

【化7】



であり；

Zは、 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、または $-\text{N}(\text{R}^1)-$ であり、ここでZが $-\text{N}(\text{R}^1)-$ であるならば、Wは $-\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-$ ；または $-\text{S}(\text{O})-$ であり；

各 R^1 は、独立して、 $-\text{H}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^8$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^8$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^8$ 、 $-\text{R}^{2,1}$ 、 $-\text{アルキル}-\text{R}^{2,1}$ 、 $-\text{アルケニル}-\text{R}^{2,1}$ 、 $-\text{アルキニル}-\text{R}^{2,1}$ 、 $-\text{アルキル}$ であり；

R^2 は、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^8$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{C}(\text{O})\text{R}^8$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^8$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^8$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^8$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})\text{R}^8$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{H})\text{R}^8$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{H})\text{R}^8$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})\text{R}^8$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{CH}=\text{CHR}^8$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{OR}^8$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{N}(\text{H})\text{R}^8$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^8)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^8)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^8)_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^8)_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^8)_2$ 、 $-\text{CH}_2-\text{R}^8$ 、 $-\text{CH}_2-\text{アルケニル}-\text{R}^8$ 、または $-\text{CH}_2-\text{アルキニル}-\text{R}^8$ であり；

R^3 は、 $-\text{H}$ 、 $-\text{R}^{2,1}$ 、 $-\text{アルキル}-\text{R}^{2,1}$ 、 $-\text{アルケニル}-\text{R}^{2,1}$ 、 $-\text{アルキニル}-\text{R}^{2,1}$ 、 $-\text{アルキル}$ 、またはアミノ酸側鎖であり；

各 R^4 は、独立して、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{I}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{アルキル}$ 、 $-\text{シクロアルキル}$ 、 $-\text{パーフルオロアルキル}$ 、 $-\text{O}-\text{アルキル}$ 、 $-\text{N}(\text{H})\text{アルキル}$ 、 $-\text{N}(\text{アルキル})_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})\text{アルキル}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{アルキル})_2$ 、 $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{アルキル}$ 、 $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})\text{アルキル}$ 、 $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{アルキル})_2$ 、 $-\text{S}-\text{アルキル}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{アルキル}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{アルキル}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{アルキル}$ 、 $-\text{CH}_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{H})\text{アルキル}$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{アルキル})_2$ 、または $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{Oアルキル}$ であり；

R^6 は、 $-\text{H}$ 、 $-\text{CH}_2\text{OR}^9$ 、 $-\text{CH}_2\text{SR}^{1,0}$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{H})\text{R}^9$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^9)\text{R}^{1,1}$ 、 $-\text{C}(\text{H})\text{N}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $-\text{CH}_2\text{Br}$ 、 $-\text{CH}_2\text{I}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{1,1})_2$ 、 $-\text{R}^{1,3}$ または $-\text{R}^{1,4}$ であり；

R^7 は、 $-\text{C}(\text{O})\text{アルキル}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{シクロアルキル}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{アルケニル}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{アルキニル}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{アルキルアリール}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{アルキルヘテロアリール}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{ヘテロ環}$ 、または $-\text{C}(\text{O})\text{アルキルヘテロ環}$ であり；

各 R^8 は、独立して、—アルキル、—シクロアルキル、—アリール、—ヘテロアリール、—ヘテロシクリル、—アルキルシクロアルキル、—アルキルアリール、—アルキルヘテロアリールまたは—アルキルシクリルであり；

R^9 は、—H、—C(O)アリール、—C(O)ヘテロアリール、—C(O)アルキルアリール、—C(O)アルキルヘテロアリール、—アルキルアリール、—アルキルヘテロアリール、—アリール、—ヘテロアリールまたは—P(O)(R^{15})₂であり；

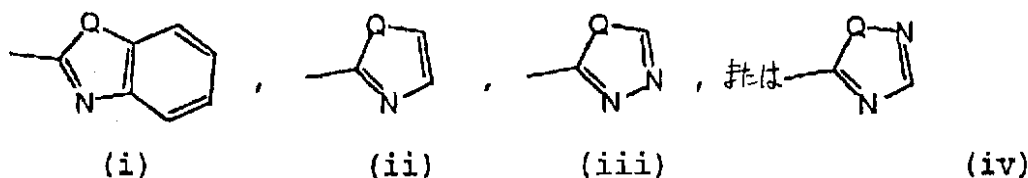
R^{10} は、—アルキルアリールまたは—アルキルヘテロアリールであり；

各 R^{11} は、独立して、—H、—アルキル、—アリール、—ヘテロアリール、—シクロアルキル、—アルキルアリールまたは—アルキルヘテロアリールであり；

R^{13} は、—アルキルアリールまたは—アルキルヘテロアリールであり；

R^{14} は、以下であり；

【化8】



ここで、Qは、—O—または—S—であり、(i)の任意の水素原子は、必要に応じて、— R^{17} で置換されており、そして(ii)、(iii)、および(iv)の任意の水素原子は、必要に応じて、— R^{17} 、— R^{18} または—アルキル— R^{18} で置換されており；

各 R^{15} は、独立して、—H、—OH、—アルキル、—アリール、—ヘテロアリール、—シクロアルキル、—アルキルアリール、—アルキルヘテロアリール、—Oアルキル、—Oアリール、—Oヘテロアリール、—Oアルキルアリールまたは—Oアルキルヘテロアリールであり；

各 R^{17} は、独立して、—OH、—F、—Cl、—Br、—I、—NO₂、—CN、—NH₂、—CO₂H、—C(O)NH₂、—N(H)C(O)H、—N(H)C(O)NH₂、—SO₂NH₂、—C(O)H、—アルキル、—シクロアルキル、—パーフルオロアルキル、—O—アルキル、—N(H)アルキル、—N(アルキル)₂、—CO₂アルキル、—C(O)N(H)アルキル、—C(O)N(アルキル)₂、—N(H)C(O)アルキル、—N(H)C(O)N(H)アルキル、—N(H)C(O)N(アルキル)₂、—S(O)₂N(H)アルキル、—S(O)N(H)アルキル、—S(O)₂N(アルキル)₂、—S(O)N(アルキル)₂、—S—アルキル、—S(O)₂アルキル、—S(O)アルキルまたは—C(O)アルキルであり；

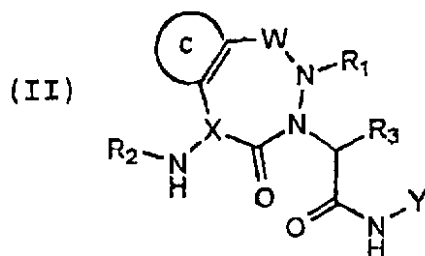
各 R^{18} は、独立して、—アリール、—ヘテロアリール、—アルキルアリール、—アルキルヘテロアリール、—O—アリール、—O—ヘテロアリール、—O—アルキルアリール、—O—アルキルヘテロアリール、—N(H)アリール、—N(アリール)₂、—N(H)ヘテロアリール、—N(ヘテロアリール)₂、—N(H)アルキルアリール、—N(アルキルアリール)₂、—N(H)アルキルヘテロアリール、—N(アルキルヘテロアリール)₂、—S—アリール、—S—ヘテロアリール、—S—アルキルアリール、—S—アルキルヘテロアリール、—C(O)アリール、—C(O)ヘテロアリール、—C(O)アルキルアリール、—C(O)アルキルヘテロアリール、—CO₂アリール、—CO₂ヘテロアリール、—CO₂アルキルアリール、—CO₂アルキルヘテロアリール、—C(O)N(H)アリール、—C(O)N(アリール)₂、—C(O)N(H)ヘテロアリール、—C(O)N(ヘテロアリール)₂、—C(O)N(H)アルキルアリール、—C(O)N(アルキルアリール)₂、—C(O)N(H)アルキルヘテロアリール、—C(O)N(アルキルヘテロアリール)₂、—S(O)₂—アリール、—S(O)—アリール、—S(

$O)_2$ -ヘテロアリール、 $-S(O)-$ ヘテロアリール、 $-S(O)_2$ -アルキルアリール、 $-S(O)-$ アルキルアリール、 $-S(O)_2$ -アルキルヘテロアリール、 $-S(O)-$ アルキルヘテロアリール、 $-S(O)_2 N(H)-$ アリール、 $-S(O) N(H)-$ アリール、 $-S(O)_2 NH-$ ヘテロアリール、 $-S(O) NH-$ ヘテロアリール、 $-S(O)_2 N(H)-$ アルキルアリール、 $-S(O) N(H)-$ アルキルアリール、 $-S(O)_2 N(H)-$ アルキルヘテロアリール、 $-S(O) N(H)-$ アルキルヘテロアリール、 $-S(O)_2 N(アール)$ $_2$ 、 $-S(O) N(アール)$ $_2$ 、 $-S(O)_2 N(ヘテロアリール)$ $_2$ 、 $-S(O) N(ヘテロアリール)$ $_2$ 、 $-S(O)_2 N(アルキルアリール)$ $_2$ 、 $-S(O) N(アルキルアリール)$ $_2$ 、 $-S(O)_2 N(アルキルヘテロアリール)$ $_2$ 、 $-S(O) N(アルキルヘテロアリール)$ $_2$ 、 $-N(H) C(O) N(H)$ アリール、 $-N(H) C(O) N(H)$ ヘテロアリール、 $-N(H) C(O) N(H)$ アルキルアリール、 $-N(H) C(O) N(H)$ アルキルヘテロアリール、 $-N(H) C(O) N(アール)$ $_2$ 、 $-N(H) C(O) N(ヘテロアリール)$ $_2$ 、 $-N(H) C(O) N(アルキルアリール)$ $_2$ または $-N(H) C(O) N(アルキルヘテロアリール)$ $_2$ であり；そして

各 $R^{2,1}$ は、独立して、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール、 $-$ シクロアルキル、またはヘテロシクリルであり、ここで、任意の炭素原子に結合する水素原子は、必要に応じて、 R^4 によって置換され、そして任意の窒素原子に結合する水素原子は、必要に応じて R^2 によって置換されている、化合物。

【請求項 3】 以下の式 (II) により表わされる化合物であって：

【化 9】

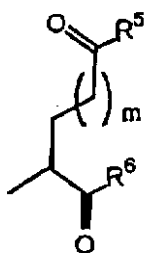


ここで、

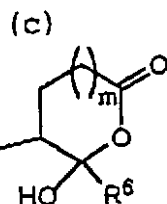
Y は、以下であり：

【化 10】

(a)



, または



Cは、アリール環またはヘテロアリール環であり、ここで、該C環に結合している任意の水素原子は、必要に応じて、 $-R^4$ で置換されており；

mは、0または1であり；

Wは、 $-CH_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、または $-S(O)-$ ；であり；

Xは、 $-C(H)-$ 、 $-C(R^8)-$ 、または

【化11】



であり；

各 R^1 は、独立して、 $-H$ 、 $-C(O)R^8$ 、 $-S(O)_2R^8$ 、 $-S(O)R^8$ 、 $-R^{2,1}$ 、 $-アルキル-R^{2,1}$ 、 $-アルケニル-R^{2,1}$ 、 $-アルキニル-R^{2,1}$ 、 $-アルキル$ であり；

R^2 は、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)C(O)R^8$ 、 $-S(O)_2R^8$ 、 $-S(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^8$ 、 $-C(O)N(H)R^8$ 、 $-S(O)_2N(H)-R^8$ 、 $-S(O)N(H)-R^8$ 、 $-C(O)C(O)N(H)R^8$ 、 $-C(O)CH=CHR^8$ 、 $-C(O)CH_2OR^8$ 、 $-C(O)CH_2N(H)R^8$ 、 $-C(O)N(R^8)_2$ 、 $-S(O)_2N(R^8)_2$ 、 $-S(O)N(R^8)_2$ 、 $-C(O)C(O)N(R^8)_2$ 、 $-C(O)CH_2N(R^8)_2$ 、 $-CH_2-R^8$ 、 $-CH_2-アルケニル-R^8$ 、または $-CH_2-アルキニル-R^8$ であり；

R^3 は、 $-H$ 、 $-R^{2,1}$ 、 $-アルキル-R^{2,1}$ 、 $-アルケニル-R^{2,1}$ 、 $-アルキニル-R^{2,1}$ 、 $-アルキル$ 、またはアミノ酸側鎖であり；

各 R^4 は、独立して、 $-OH$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-CO_2H$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-N(H)C(O)H$ 、 $-N(H)C(O)NH_2$ 、 $-アルキル$ 、 $-シクロアルキル$ 、 $-パーフルオロアルキル$ 、 $-O-アルキル$ 、 $-N(H)アルキル$ 、 $-N(アルキル)_2$ 、 $-C(O)N(H)アルキル$ 、 $-C(O)N(アルキル)_2$ 、 $-N(H)C(O)アルキル$ 、 $-N(H)C(O)N(H)アルキル$ 、 $-N(H)C(O)N(アルキル)_2$ 、 $-S-アルキル$ 、 $-S(O)_2アルキル$ 、 $-S(O)アルキル$ 、 $-C(O)アルキル$ 、 $-CH_2NH_2$ 、 $-CH_2N(H)アルキル$ 、 $-CH_2N(アルキル)_2$ 、または $-N(H)C(O)Oアルキル$ であり；

R^5 は、 $-OH$ 、 $-OR^8$ 、 $-N(H)OH$ 、または $-N(H)SO_2R^8$ であり；

R^6 は、 $-H$ 、 $-CH_2OR^9$ 、 $-CH_2SR^{10}$ 、 $-CH_2N(H)R^9$ 、 $-CH_2N(R^9)R^{11}$ 、 $-C(H)N_2$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CH_2Cl$ 、 $-CH_2Br$ 、 $-CH_2I$ 、 $-C(O)N(R^{11})_2$ 、 $-R^{13}$ または $-R^{14}$ であり；

各 R^8 は、独立して、 $-アルキル$ 、 $-シクロアルキル$ 、 $-アリール$ 、 $-ヘテロアリール$ 、 $-ヘテロシクリル$ 、 $-アルキルシクロアルキル$ 、 $-アルキルアリール$ 、 $-アルキルヘテロアリール$ または $-アルキルヘテロシクリル$ であり；

R^9 は、 $-H$ 、 $-C(O)アリール$ 、 $-C(O)ヘテロアリール$ 、 $-C(O)アルキルアリール$ 、 $-C(O)アルキルヘテロアリール$ 、 $-アルキルアリール$ 、 $-アルキルヘテロアリール$ 、 $-アリール$ 、 $-ヘテロアリール$ または $-P(O)(R^{15})_2$ であり；

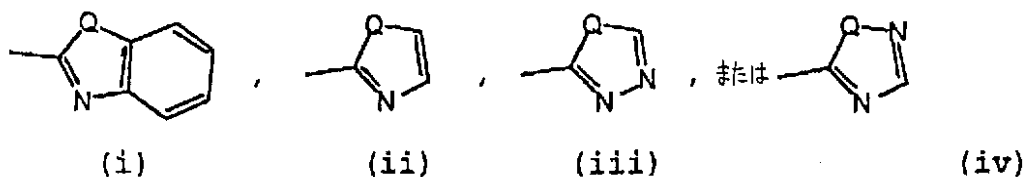
R^{10} は、 $-アルキルアリール$ または $-アルキルヘテロアリール$ であり；

各 R^{11} は、独立して、 $-H$ 、 $-アルキル$ 、 $-アリール$ 、 $-ヘテロアリール$ 、 $-シクロアルキル$ 、 $-アルキルアリール$ または $-アルキルヘテロアリール$ であり；

R^{13} は、 $-アルキルアリール$ または $-アルキルヘテロアリール$ であり；

R^{14} は、以下であり：

【化12】



ここで、 Q は、 $-O-$ または $-S-$ であり、(i) の任意の水素原子は、必要に応じて、 $-R^{17}$ で置換されており、そして (ii)、(iii)、および (iv) の任意の水素原子は、必要に応じて、 $-R^{17}$ 、 $-R^{18}$ または $-アルキル-R^{18}$ で置換されており；

各 R^{15} は、独立して、 $-H$ 、 $-OH$ 、 $-アルキル$ 、 $-アリール$ 、 $-ヘテロアリール$ 、 $-シクロアルキル$ 、 $-アルキルアリール$ 、 $-アルキルヘテロアリール$ 、 $-Oアルキル$ 、 $-Oアリール$ 、 $-Oヘテロアリール$ 、 $-Oアルキルアリール$ または $-Oアルキルヘテロアリール$ であり；

各 R^{17} は、独立して、 $-OH$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-CO_2H$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-N(H)C(O)H$ 、 $-N(H)C(O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-C(O)H$ 、 $-アルキル$ 、 $-シクロアルキル$ 、 $-パーフルオロアルキル$ 、 $-Oアルキル$ 、 $-N(H)アルキル$ 、 $-N(アルキル)_2$ 、 $-CO_2アルキル$ 、 $-C(O)N(H)アルキル$ 、 $-C(O)N(アルキル)_2$ 、 $-N(H)C(O)アルキル$ 、 $-N(H)C(O)N(H)アルキル$ 、 $-N(H)C(O)N(アルキル)_2$ 、 $-S(O)_2N(H)アルキル$ 、 $-S(O)N(H)アルキル$ 、 $-S(O)_2N(アルキル)_2$ 、 $-S(O)N(アルキル)_2$ 、 $-Sアルキル$ 、 $-S(O)_2アルキル$ 、 $-S(O)アルキル$ または $-C(O)アルキル$ であり；

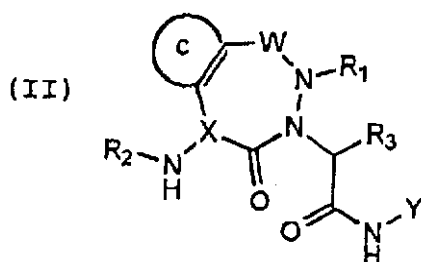
各 R^{18} は、独立して、 $-アリール$ 、 $-ヘテロアリール$ 、 $-アルキルアリール$ 、 $-アルキルヘテロアリール$ 、 $-Oアリール$ 、 $-Oヘテロアリール$ 、 $-Oアルキルアリール$ 、 $-Oアルキルヘテロアリール$ 、 $-N(H)アリール$ 、 $-N(アリール)_2$ 、 $-N(H)ヘテロアリール$ 、 $-N(ヘテロアリール)_2$ 、 $-N(H)アルキルアリール$ 、 $-N(アルキルアリール)_2$ 、 $-N(H)アルキルヘテロアリール$ 、 $-N(アルキルヘテロアリール)_2$ 、 $-Sアリール$ 、 $-Sヘテロアリール$ 、 $-Sアルキルアリール$ 、 $-Sアルキルヘテロアリール$ 、 $-C(O)アリール$ 、 $-C(O)ヘテロアリール$ 、 $-C(O)アルキルアリール$ 、 $-C(O)アルキルヘテロアリール$ 、 $-CO_2アリール$ 、 $-CO_2ヘテロ$

アリール、 $-\text{CO}_2$ アルキルアリール、 $-\text{CO}_2$ アルキルヘテロアリール、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})$ アリール、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{アリール})_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})$ ヘテロアリール、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{ヘテロアリール})_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})$ アルキルアリール、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{アルキルアリール})_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})$ アルキルヘテロアリール、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{アルキルヘテロアリール})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2$ -アリール、 $-\text{S}(\text{O})$ -アリール、 $-\text{S}(\text{O})_2$ -ヘテロアリール、 $-\text{S}(\text{O})$ -ヘテロアリール、 $-\text{S}(\text{O})_2$ -アルキルアリール、 $-\text{S}(\text{O})$ -アルキルアリール、 $-\text{S}(\text{O})_2$ -アルキルヘテロアリール、 $-\text{S}(\text{O})$ -アルキルヘテロアリール、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{H})$ -アリール、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{H})$ -アリール、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}$ -ヘテロアリール、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}$ -ヘテロアリール、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{H})$ -アルキルアリール、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{H})$ -アルキルアリール、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{H})$ -アルキルヘテロアリール、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{H})$ -アルキルヘテロアリール、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{アリール})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{アリール})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{ヘテロアリール})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{ヘテロアリール})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{アルキルアリール})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{アルキルアリール})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{アルキルヘテロアリール})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{アルキルヘテロアリール})_2$ 、 $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})$ アリール、 $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})$ ヘテロアリール、 $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})$ アルキルアリール、 $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})$ アルキルヘテロアリール、 $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{アリール})_2$ 、 $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{ヘテロアリール})_2$ 、 $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{アルキルアリール})_2$ または $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{アルキルヘテロアリール})_2$ であり；そして

各 R^{2-1} は、独立して、-アリール、-ヘテロアリール、-シクロアルキル、またはヘテロシクリルであり、ここで、任意の炭素原子に結合する水素原子は、必要に応じて、 R^4 によって置換され、そして任意の窒素原子に結合する水素原子は、必要に応じて R^2 によって置換されている、化合物。

【請求項 4】 以下の式 (II) により表わされる化合物であって：

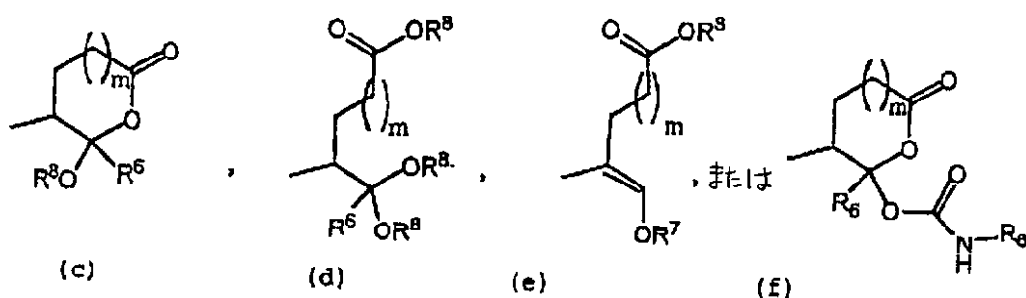
【化 1 3】



ここで、

Y は、以下であり：

【化 1 4】



Cは、アリール環またはヘテロアリール環であり、ここで、該C環に結合している任意の水素原子は、必要に応じて、 $-R^4$ で置換されており；

mは、0または1であり；

Wは、 $-CH_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、または $-S(O)-$ ；であり；

Xは、 $-C(H)-$ 、 $-C(R^8)-$ 、または

【化15】



であり；

各 R_1 は、独立して、 $-H$ 、 $-C(O)R^8$ 、 $-S(O)_2R^8$ 、 $-S(O)R^8$ 、 $-R^{21}$ 、 $-アルキル-R^{21}$ 、 $-アルケニル-R^{21}$ 、 $-アルキニル-R^{21}$ 、 $-アルキル$ であり；

R^2 は、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)C(O)R^8$ 、 $-S(O)_2R^8$ 、 $-S(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^8$ 、 $-C(O)N(H)R^8$ 、 $-S(O)_2N(H)-R^8$ 、 $-S(O)N(H)-R^8$ 、 $-C(O)C(O)N(H)R^8$ 、 $-C(O)CH=CHR^8$ 、 $-C(O)CH_2OR^8$ 、 $-C(O)CH_2N(H)R^8$ 、 $-C(O)N(R^8)_2$ 、 $-S(O)_2N(R^8)_2$ 、 $-S(O)N(R^8)_2$ 、 $-C(O)C(O)N(R^8)_2$ 、 $-C(O)CH_2N(R^8)_2$ 、 $-CH_2-R^8$ 、 $-CH_2-アルケニル-R^8$ 、または $-CH_2-アルキニル-R^8$ であり；

R^3 は、 $-H$ 、 $-R^{21}$ 、 $-アルキル-R^{21}$ 、 $-アルケニル-R^{21}$ 、 $-アルキニル-R^{21}$ 、 $アルキル$ 、またはアミノ酸側鎖であり；

各 R^4 は、独立して、 $-OH$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-CO_2H$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-N(H)C(O)H$ 、 $-N(H)C(O)NH_2$ 、 $-アルキル$ 、 $-シクロアルキル$ 、 $-パーフルオロアルキル$ 、 $-O-アルキル$ 、 $-N(H)アルキル$ 、 $-N(アルキル)_2$ 、 $-C(O)N(H)アルキル$ 、 $-C(O)N(アルキル)_2$ 、 $-N(H)C(O)アルキル$ 、 $-N(H)C(O)N(H)アルキル$ 、 $-N(H)C(O)N(アルキル)_2$ 、 $-S-アルキル$ 、 $-S(O)_2アルキル$ 、 $-S(O)アルキル$ 、 $-C(O)アルキル$ 、 $-CH_2NH_2$ 、 $-CH_2N(H)アルキル$ 、 $-CH_2N(アルキル)_2$ 、または $-N(H)C(O)Oアルキル$ であり；

R^6 は、 $-H$ 、 $-CH_2OR^9$ 、 $-CH_2SR^{10}$ 、 $-CH_2N(H)R^9$ 、 $-CH_2N(R^9)R^{11}$ 、 $-C(H)N_2$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CH_2Cl$ 、 $-CH_2Br$ 、 $-CH_2I$ 、 $-C(O)N(R^{11})_2$ 、 $-R^{13}$ または $-R^{14}$ である；

R^7 は、 $-C(O)アルキル$ 、 $-C(O)シクロアルキル$ 、 $-C(O)アルケニル$ 、 $-C(O)アルキニル$ 、 $-C(O)アルキルアリール$ 、 $-C(O)アルキルヘテロアリール$ 、 $-C(O)ヘテロ環$ 、または $-C(O)アルキルヘテロ環$ であり；

各 R^8 は、独立して、 $-アルキル$ 、 $-シクロアルキル$ 、 $-アリール$ 、 $-ヘテロアリール$ 、 $-ヘテロシクリル$ 、 $-アルキルシクロアルキル$ 、 $-アルキルアリール$ 、 $-アルキルヘテロアリール$ または $-アルキルヘテロシクリル$ であり；

R^9 は、 $-H$ 、 $-C(O)アリール$ 、 $-C(O)ヘテロアリール$ 、 $-C(O)アルキルアリール$ 、 $-C(O)アルキルヘテロアリール$ 、 $-アルキルアリール$ 、 $-アルキルヘテロアリール$ 、 $-アリール$ 、 $-ヘテロアリール$ または $-P(O)(R^{15})_2$ であり；

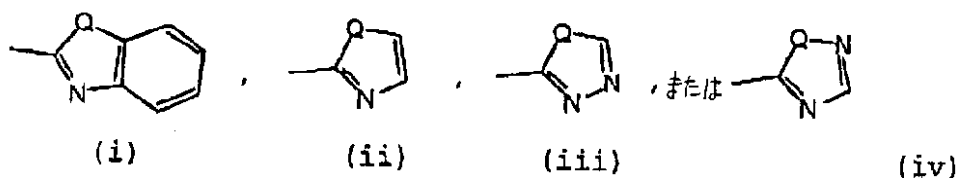
R^{10} は、 $-アルキルアリール$ または $-アルキルヘテロアリール$ であり；

各 R^{11} は、独立して、 $-H$ 、 $-アルキル$ 、 $-アリール$ 、 $-ヘテロアリール$ 、 $-シクロアルキル$ 、 $-アルキルアリール$ または $-アルキルヘテロアリール$ であり；

R^{13} は、 $-アルキルアリール$ または $-アルキルヘテロアリール$ であり；

R^{14} は、以下であり；

【化16】



ここで、Qは、 $-O-$ または $-S-$ であり、(i)の任意の水素原子は、必要に応じて、 $-R^{17}$ で置換されており、そして(ii)、(iii)、および(iv)の任意の水素原子は、必要に応じて、 $-R^{17}$ 、 $-R^{18}$ または $-アルキル-R^{18}$ で置換されており；

各 R^{15} は、独立して、 $-H$ 、 $-OH$ 、アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、アルキルアリール、アルキルヘテロアリール、 $-O$ アルキル、 $-O$ アリール、 $-O$ ヘテロアリール、 $-O$ アルキルアリールまたは $-O$ アルキルヘテロアリールであり；

各 R^{17} は、独立して、 $-OH$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-CO_2H$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-N(H)C(O)H$ 、 $-N(H)C(O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-C(O)H$ 、 $-アルキル$ 、 $-シクロアルキル$ 、 $-パーフルオロアルキル$ 、 $-O-アルキル$ 、 $-N(H)アルキル$ 、 $-N(アルキル)_2$ 、 $-CO_2アルキル$ 、 $-C(O)N(H)アルキル$ 、 $-C(O)N(アルキル)_2$ 、 $-N(H)C(O)アルキル$ 、 $-N(H)C(O)N(H)アルキル$ 、 $-N(H)C(O)N(アルキル)_2$ 、 $-S(O)_2N(H)アルキル$ 、 $-S(O)N(H)アルキル$ 、 $-S(O)_2N(アルキル)_2$ 、 $-S(O)N(アルキル)_2$ 、 $-S-アルキル$ 、 $-S(O)_2アルキル$ 、 $-S(O)アルキル$ または $-C(O)アルキル$ であり；

各 R^{18} は、独立して、 $-アリール$ 、 $-ヘテロアリール$ 、 $-アルキルアリール$ 、 $-アルキルヘテロアリール$ 、 $-O-アリール$ 、 $-O-ヘテロアリール$ 、 $-O-アルキルアリール$ 、 $-O-アルキルヘテロアリール$ 、 $-N(H)アリール$ 、 $-N(アリール)_2$ 、 $-N(H)ヘテロアリール$ 、 $-N(ヘテロアリール)_2$ 、 $-N(H)アルキルアリール$ 、 $-N(アルキルアリール)_2$ 、 $-N(H)アルキルヘテロアリール$ 、 $-N(アルキルヘテロアリール)_2$ 、 $-S-アリール$ 、 $-S-ヘテロアリール$ 、 $-S-アルキルアリール$ 、 $-S-アルキルヘテロアリール$ 、 $-C(O)アリール$ 、 $-C(O)ヘテロアリール$ 、 $-C(O)アルキルアリール$ 、 $-C(O)アルキルヘテロアリール$ 、 $-CO_2アリール$ 、 $-CO_2ヘテロアリール$ 、 $-CO_2アルキルアリール$ 、 $-CO_2アルキルヘテロアリール$ 、 $-C(O)N(H)アリール$ 、 $-C(O)N(アリール)_2$ 、 $-C(O)N(H)ヘテロアリール$ 、 $-C(O)N(ヘテロアリール)_2$ 、 $-C(O)N(H)アルキルアリール$ 、 $-C(O)N(アルキルアリール)_2$ 、 $-C(O)N(H)アルキルヘテロアリール$ 、 $-C(O)N(アルキルヘテロアリール)_2$ 、 $-S(O)_2-アリール$ 、 $-S(O)-アリール$ 、 $-S(O)_2-ヘテロアリール$ 、 $-S(O)-ヘテロアリール$ 、 $-S(O)_2-アルキルアリール$ 、 $-S(O)-アルキルアリール$ 、 $-S(O)_2-アルキルヘテロアリール$ 、 $-S(O)-アルキルヘテロアリール$ 、 $-S(O)_2N(H)-アリール$ 、 $-S(O)N(H)-アリール$ 、 $-S(O)_2NH-ヘテロアリール$ 、 $-S(O)NH-ヘテロアリール$ 、 $-S(O)_2N(H)-アルキルアリール$ 、 $-S(O)N(H)-アルキルアリール$ 、 $-S(O)_2N(H)-アルキルヘテロアリール$ 、 $-S(O)N(H)-アルキルヘテロアリール$ 、 $-S(O)_2N(アリール)_2$ 、 $-S(O)N(アリール)_2$ 、 $-S(O)_2N(ヘテロアリール)_2$ 、 $-S(O)N(ヘテロアリール)_2$ 、 $-S(O)_2N(アルキルアリール)_2$ 、 $-S(O)N(アルキルアリール)_2$ 、 $-S(O)_2N(アルキルヘテロアリール)_2$ 、 $-S(O)N(アルキルヘテロアリール)_2$ 、 $-N(H)C(O)N(H)アリール$ 、 $-N(H)C(O)N(H)ヘテロアリール$ 、 $-N(H)C(O)N(H)アルキルアリール$ 、 $-N(H)C(O)N(H)アルキルヘテロアリール$ 、 $-N(H)C(O)N(アリール)_2$ 、 $-N(H)C(O)N(ヘテロアリール)_2$ 、 $-N(H)C(O)$

N (アルキルアリール)₂ または -N (H) C (O) N (アルキルヘテロアリール)₂ であり；そして

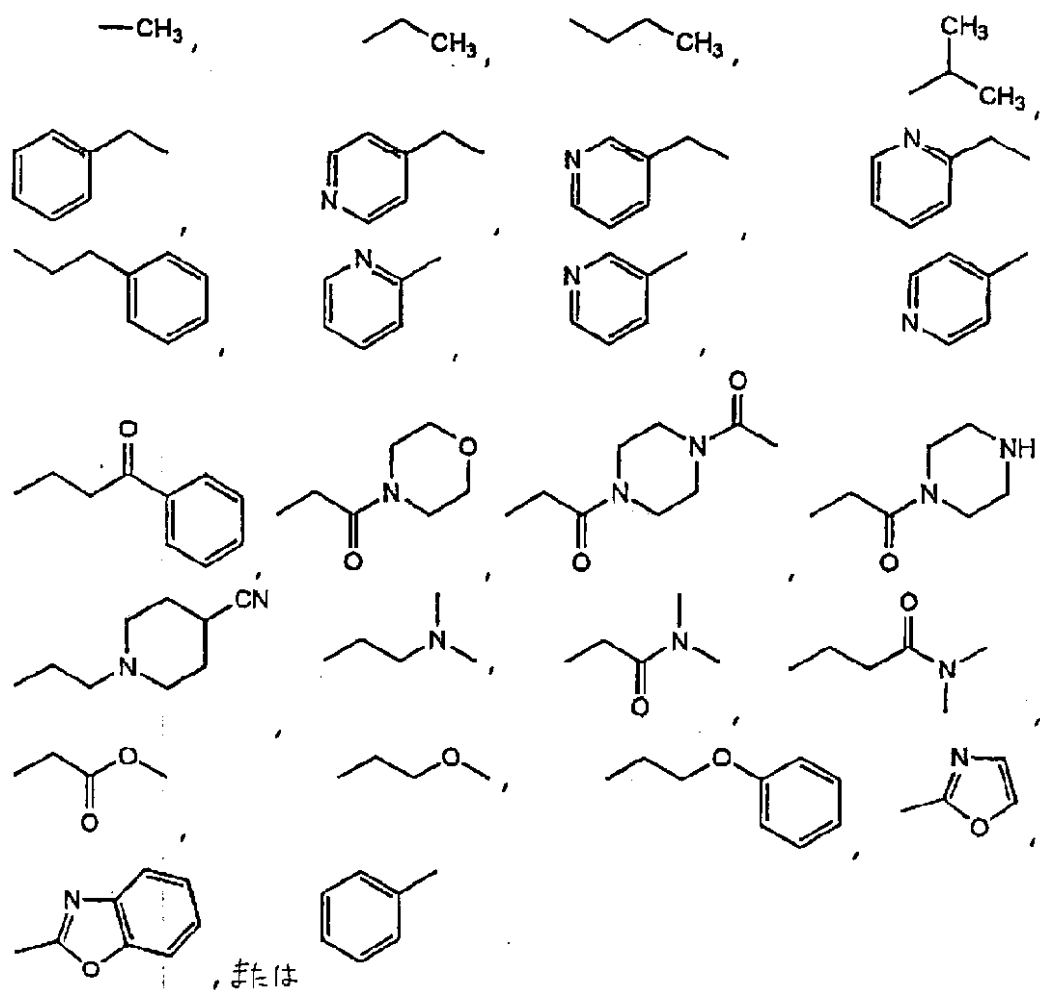
各 R^{2 1} は、独立して、-アリール、-ヘテロアリール、-シクロアルキル、またはヘテロシクリルであり、ここで、任意の炭素原子に結合する水素原子は、必要に応じて、R⁴ によって置換され、そして任意の窒素原子に結合する水素原子は、必要に応じて R² によって置換されている、

化合物。

【請求項 5】 請求項 1～4 のいずれか 1 つに記載の化合物であって、ここで R¹ がアリール、ヘテロアリール、アルキル、アルキルアリール、またはアルキルヘテロアリールである、化合物。

【請求項 6】 請求項 5 に記載の化合物であって、ここで R¹ が：

【化 1 7】



である、化合物。

【請求項 7】 請求項 1～4 のいずれか 1 つに記載の化合物であって、ここで R² が

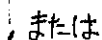
：

【化 1 8】

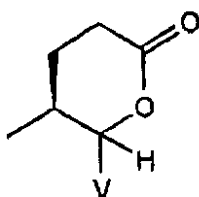


【請求項 8】 請求項 1～4 のいずれか 1 つに記載の化合物であって、ここで R³ がアミノ酸側鎖、アリール、ヘテロアリール、アルキル、アルキルアリール、またはアルキルヘテロアリールである、化合物。

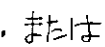
【化 1 9】



【化 2 0】



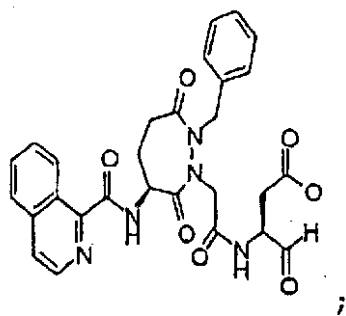
【化 2 1】



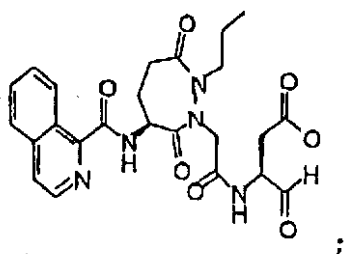
【請求項 13】 請求項 1 に記載の化合物であって、以下：

【化 2 2】

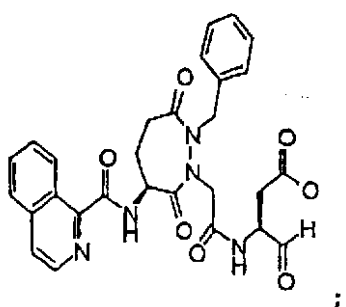
11a



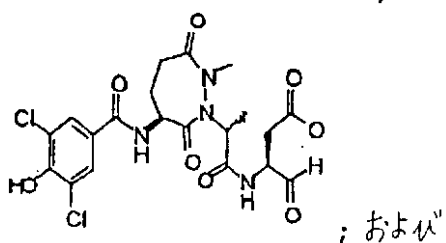
11b



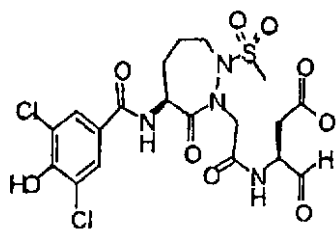
11c



20



27

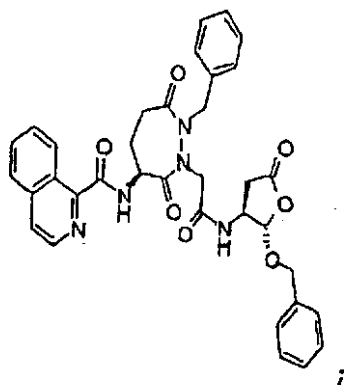


からなる群からより選択される、化合物。

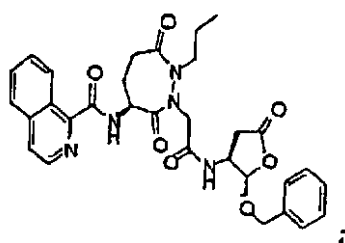
【請求項 1 4】 請求項 2 に記載の化合物であって、以下：

【化 2 3】

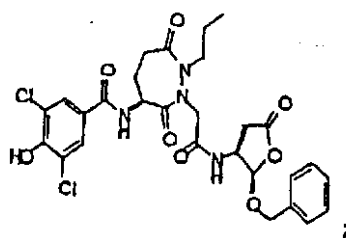
10a



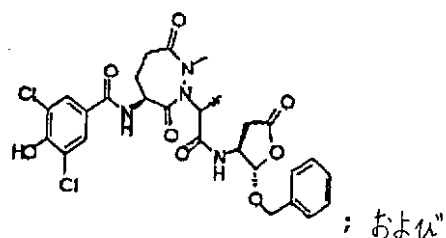
10b



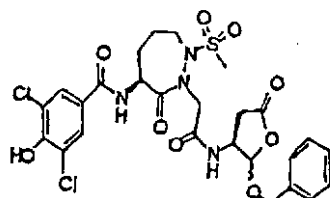
10d



19



26b



からなる群からより選択される、化合物。

【請求項 15】 薬学的組成物であって、a) 請求項 1～14 のいずれか 1 つに記載される化合物；および b) 薬学的に受容可能なキャリア、アジュバントまたはビヒクルを含有する、薬学的組成物。

【請求項 16】 疾患を処置または予防するための組成物であって、該疾患は患者における、以下の疾患：

IL-1 媒介疾患、アポトーシス媒介疾患、炎症性疾患、自己免疫性疾患、破壊性骨障害、増殖性障害、感染性疾患、変性疾患、壊死性疾患、過剰な食用アルコール摂取疾患、ウイルス媒介疾患、炎症性腹膜炎、変形性関節症、膵炎、喘息、成人性呼吸窮迫症候群、糸球体腎炎、慢性関節リウマチ、全身性エリテマトーデス、硬皮症、慢性甲状腺炎、グレーブズ病、自己免疫性胃炎、インスリン依存性糖尿病（I 型）、自己免疫性溶血性貧血、自

己免疫性好中球減少症、血小板減少症、慢性活性肝炎、重症筋無力症、炎症性腸疾患、クローン病、乾癬、対宿主性移植片病、骨粗鬆症、多発性骨髄腫関連骨障害、急性骨髄性白血病、慢性骨髄性白血病、転移性黒色腫、カポージ肉腫、多発性骨髄腫、敗血症、敗血症性ショック、細菌性赤痢、アルツハイマー病、パーキンソン病、脳性虚血、心筋虚血、棘筋萎縮症、多発性硬化症、AIDS 関連脳炎、HIV 関連脳炎、加齢、脱毛症、発作による神経学的損傷、潰瘍性大腸炎、外傷性脳損傷、臓器移植拒絶、B 型肝炎、C 型肝炎、G 型肝炎、黄熱病、デング熱または日本脳炎、
から選択される疾患であって、該組成物は、請求項 1～14 のいずれか 1 項に記載の化合物を含むか、または請求項 15 に記載の薬学的組成物である、組成物。

【請求項 17】 請求項 16 に記載の組成物であって、ここで、前記疾患が、慢性関節リウマチ、炎症性腸疾患、クローン病、潰瘍性大腸炎、炎症性腹膜炎、敗血症性ショック、肺炎、外傷性脳損傷、臓器移植拒絶、変形性関節症、喘息、乾癬、またはアルツハイマー病である、組成物。

【請求項 18】 患者における ICE-媒介性機能を阻害するための組成物であって、該組成物は、請求項 1～14 のいずれか 1 項に記載の化合物を含むか、または請求項 15 に記載の薬学的組成物である、組成物。

【請求項 19】 患者における IGF または IFN- γ の産生を低減するための組成物であって、該組成物は、請求項 1～14 のいずれか 1 項に記載の化合物を含むか、または請求項 15 に記載の薬学的組成物である、組成物。

【請求項 20】 患者における疾患を処置または予防するための医薬の製造の際の、請求項 1～14 のいずれか 1 項に記載の化合物、または請求項 15 に記載の薬学的組成物の使用であって、ここで該疾患は、以下の疾患：

IL-1 媒介疾患、アポトーシス媒介疾患、炎症性疾患、自己免疫性疾患、破壊性骨障害、増殖性障害、感染性疾患、変性疾患、壊死性疾患、過剰な食用アルコール摂取疾患、ウイルス媒介疾患、炎症性腹膜炎、変形性関節症、肺炎、喘息、成人性呼吸窮迫症候群、糸球体腎炎、慢性関節リウマチ、全身性エリテマトーデス、硬皮症、慢性甲状腺炎、グレーブズ病、自己免疫性胃炎、インスリン依存性糖尿病（I 型）、自己免疫性溶血性貧血、自己免疫性好中球減少症、血小板減少症、慢性活性肝炎、重症筋無力症、炎症性腸疾患、クローン病、乾癬、対宿主性移植片病、骨粗鬆症、多発性骨髄腫関連骨障害、急性骨髄性白血病、慢性骨髄性白血病、転移性黒色腫、カポージ肉腫、多発性骨髄腫、敗血症、敗血症性ショック、細菌性赤痢、アルツハイマー病、パーキンソン病、脳性虚血、心筋虚血、棘筋萎縮症、多発性硬化症、AIDS 関連脳炎、HIV 関連脳炎、加齢、脱毛症、発作による神経学的損傷、潰瘍性大腸炎、外傷性脳損傷、臓器移植拒絶、B 型肝炎、C 型肝炎、G 型肝炎、黄熱病、デング熱または日本脳炎、
から選択される疾患である、使用。

【請求項 21】 請求項 20 に記載の使用であって、ここで、前記疾患が、慢性関節リウマチ、炎症性腸疾患、クローン病、潰瘍性大腸炎、炎症性腹膜炎、敗血症性ショック、肺炎、外傷性脳損傷、臓器移植拒絶、変形性関節症、喘息、乾癬、またはアルツハイマー病である、使用。

【請求項 22】 患者における ICE-媒介性機能を阻害する医薬を製造する際の、請求項 1～14 のいずれか 1 項に記載の化合物、または請求項 15 に記載の薬学的組成物の使用。

【請求項 23】 患者における IGF または IFN- γ の産生を低減するための医薬を製造する際の、請求項 1～14 のいずれか 1 項に記載の化合物、または請求項 15 に記載の薬学的組成物の使用。