

【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22年10月21日 (2010.10.21)

【公表番号】特表2010-503674(P2010-503674A)

【公表日】平成22年2月4日 (2010.2.4)

【年通号数】公開・登録公報2010-005

【出願番号】特願2009-528287(P2009-528287)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4192 (2006.01)

C 0 7 D 249/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/42 (2006.01)

A 6 1 K 31/425 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

C 0 7 D 261/08 (2006.01)

C 0 7 D 275/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 15/08 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 31/22 (2006.01)

A 6 1 P 33/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/04 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

A 6 1 P 5/14 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/4192

C 0 7 D 249/06 5 0 1

A 6 1 K 31/42

A 6 1 K 31/425

A 6 1 P 9/00

C 0 7 D 261/08

C 0 7 D 275/02

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 21/00
 A 6 1 P 1/16
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 13/08
 A 6 1 P 15/08
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 31/04
 A 6 1 P 17/02
 A 6 1 P 31/22
 A 6 1 P 33/02
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 1/00
 A 6 1 P 15/00
 A 6 1 P 1/02
 A 6 1 P 11/04
 A 6 1 P 11/02
 A 6 1 P 5/14
 A 6 1 P 7/02

【手続補正書】

【提出日】平成22年9月2日(2010.9.2)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

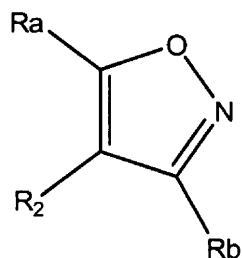
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)



(I)

で表される化合物あるいは、その薬学的に許容される塩、溶媒和物、包接化合物およびプロドラッグの有効量を含む、血管形成を治療または阻害するための医薬組成物：

式中、

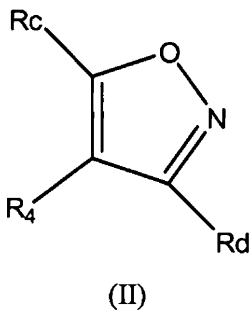
R_a または R_b のうちの 1 つは -H であり、他方は、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールであり、かつ

R_2 は、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよい 2, 3 - ジヒドロ - ベ

ンゾ〔 1 , 4 〕ジオキシニル、置換されていてもよいベンゾ〔 1 , 3 〕ジオキシリル、置換されていてもよいピフェニル、置換されていてもよい 4 - ピリジニル - フェニル、置換されていてもよいキノリニル、置換されていてもよいイソキノリニル、置換されていてもよい 1 H - インドリル、置換されていてもよいピリジニル、置換されていてもよいオキサゾリル、置換されていてもよいイソキサゾリル、置換されていてもよいチアゾリル、置換されていてもよいイソチアゾリル、置換されていてもよいイミダゾリル、置換されていてもよいピロリル、置換されていてもよいピラゾリル、置換されていてもよいフラニル、置換されていてもよいチオフエニル、置換されていてもよいチアジアゾリル、置換されていてもよいオキサジアゾリル、置換されていてもよいクロマニル、置換されていてもよいイソクロマニル、置換されていてもよいピリダジニル、置換されていてもよいピリミジニル、置換されていてもよいピラジニル、置換されていてもよいベンゾチオフエニル、置換されていてもよい 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾチオフエニル、置換されていてもよいベンゾフラニル、置換されていてもよい 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾフラニル、置換されていてもよい 1 H - ベンゾイミダゾリル、置換されていてもよいベンゾチアゾリル、置換されていてもよいベンゾオキサゾリル、置換されていてもよい 1 H - ベンゾトリアゾリル、置換されていてもよい 1 H - インダゾリル、置換されていてもよい 9 H - プリニル、置換されていてもよいピロロピリミジニル、置換されていてもよいピロロピラジニル、置換されていてもよいピロロピリダジニル、置換されていてもよいイミダゾピラジニルまたは置換されていてもよいイミダゾールピリダジニルである。

【請求項 2】

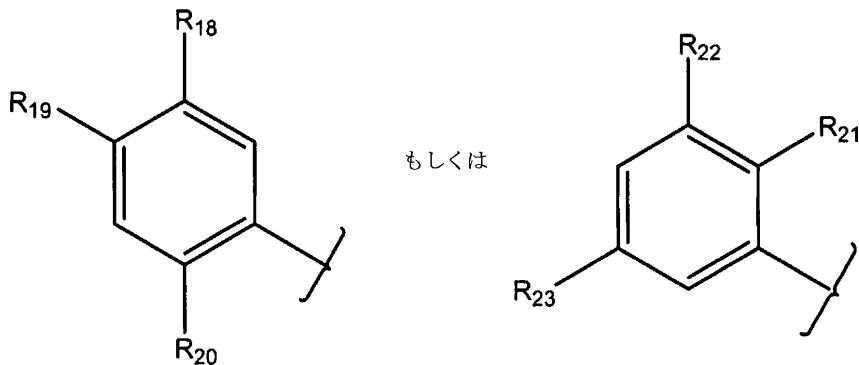
式 (I I)



で表される化合物あるいは、その薬学的に許容される塩、溶媒和物、包接化合物およびプロドラッグの有効量を含む、血管形成を治療または阻害するための医薬組成物：

式中、

R_c または R_d のうちの 1 つが - H であり、他方は、置換されていてもよいヘテロアリール、非置換のフェニルまたは以下の式



のうちの 1 つで表される置換フェニルであり、

R₄ は、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールであり、

R₁₈、R₁₉、R₂₂ および R₂₃ は、各々独立して、ハロ、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換さ

れていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、 $-OR_7$ 、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ であり、

R_{20} は、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、 $-OR_{17}$ 、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ であり、

R_{21} は、ハロ、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、 $-OR_{17}$ 、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ であり、

R_7 および R_8 は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

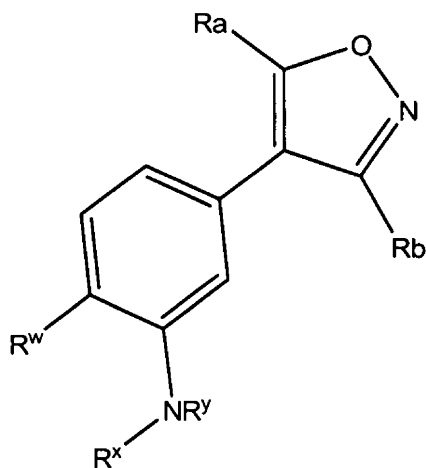
R_{10} および R_{11} は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルもしくは置換されていてもよいヘテロアラルキルであるか、または R_{10} および R_{11} は、それらが結合する窒素と一緒にあって、置換されていてもよいヘテロシクリルもしくは置換されていてもよいヘテロアリールを形成し、

R_{17} は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、かつ

p は 1 または 2 である。

【請求項 3】

化合物が、式 (IA)



(IA)

で表され、
式中、

R^x は、 $(R^{aa})_m$ 、 $-R^{aa}-C(O)(CH_2)_n C(O)OH$ 、 $-C(O)(CH_2)_n C(O)OH$ 、 $-C(O)YR^z$ 、 $-C(O)NH-R^{aa}$ または $-(R^{aa})_q C(O)(Y_1)$ であり、

R^y は、 $-H$ または低級アルキルであり、

R^w は、 $-H$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、

R_7 は、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアララルキルまたは置換されていてもよいヘテロアララルキルであり、

R^{aa} は、アミノ酸残基またはアミノ酸残基類似体であり、

Y は、 CH_2 、 O または NH であり、

R^z は、 $Alk-NH_2$ 、 $Alk-C(O)OH$ 、 Het または Y_1 であり、

Alk は、置換されていてもよいアルキレンであり、

Het は、置換されていてもよいヘテロアルキルであり、

Y_1 は、分子量 60,000 ダルトン未満の水溶性ポリマーであり、

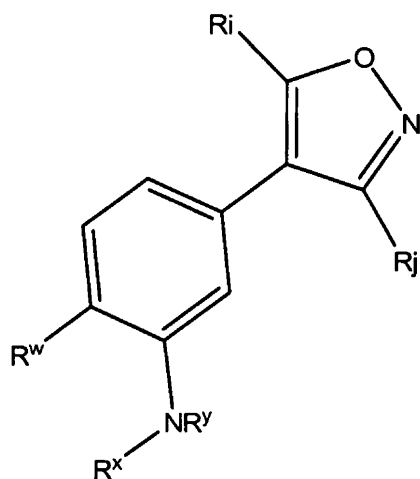
n は、1、2、3 または 4 であり、

m は、1 から 10 の整数であり、かつ

q は 0 または 1 である、請求項 1 に記載の 医薬組成物。

【請求項 4】

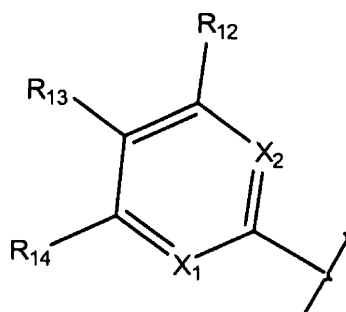
化合物が、式 (VA)



(VA)

で表され、
式中、

R_i または R_j のうちの 1 つが - H であり、他方は、以下の式



で表され、

X_1 および X_2 は各々独立して、CH または N であり、

R_{12} 、 R_{13} および R_{14} は各々独立して、ハロ、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、 $-OR_7$ 、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ であり、

R_8 は、それぞれについて独立して、- H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

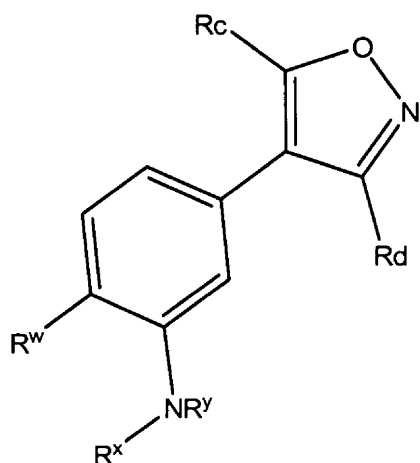
R_{10} および R_{11} は、それぞれについて独立して、- H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルもしくは置換されていてもよいヘテロアラルキルであるか、または R_{10} および R_{11} が、それらが結合する窒素と一緒にあって、置換さ

れていてもよいヘテロシクリルもしくは置換されていてもよいヘテロアリールを形成し、かつ

p は 1 または 2 である、請求項 3 に記載の 医薬組成物。

【請求項 5】

化合物が、式 (I I A)



(IIA)

で表され、

式中、

R^x は、 $(R^{aa})_m$ 、 $-R^{aa}-C(O)(CH_2)_n C(O)OH$ 、 $-C(O)(CH_2)_n C(O)OH$ 、 $-C(O)YR^z$ 、 $-C(O)NH-R^{aa}$ または $-(R^{aa})_q C(O)(Y_1)$ であり、

R^y は、 $-H$ または低級アルキルであり、

R^w は、 $-H$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、

R^{aa} は、アミノ酸残基またはアミノ酸残基類似体であり、

Y は、 CH_2 、 O または NH であり、

R^z は、 $Alk-NH_2$ 、 $Alk-C(O)OH$ 、 Het または Y_1 であり、

Alk は、置換されていてもよいアルキレンであり、

Het は、置換されていてもよいヘテロアルキルであり、

Y_1 は、分子量 60,000 ダルトン未満の水溶性ポリマーであり、

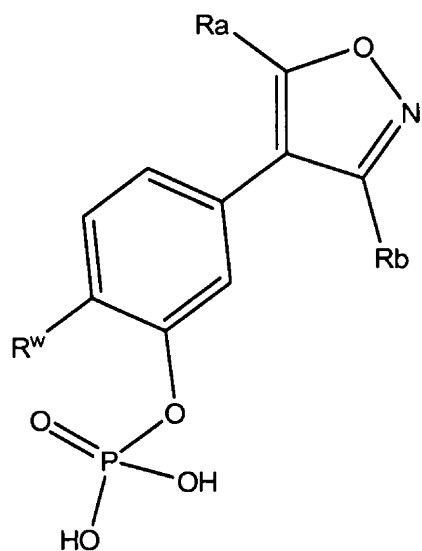
n は、1、2、3 または 4 であり、

m は、1 から 10 の整数であり、かつ

q は 0 または 1 である、請求項 2 に記載の 医薬組成物。

【請求項 6】

化合物が、式 (I B)



(IB)

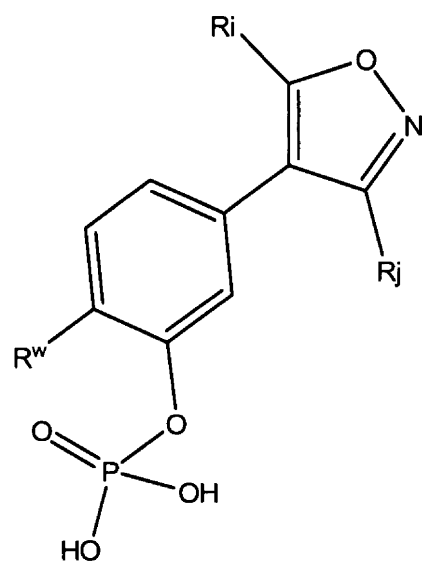
で表され、
式中、

R^w は、- H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、- OP(O)(OR₇)₂、- SP(O)(OR₇)₂、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、かつ

R_7 は、- H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラールキルまたは置換されていてもよいヘテロアラールキルである、請求項 1 に記載の 医薬組成物。

【請求項 7】

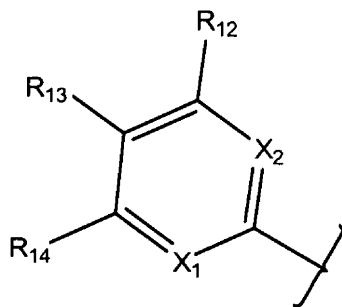
化合物が、式 (VB)



(VB)

で表され、
式中、

R_i または R_j のうちの 1 つが - H であり、他方は、以下の式



で表され、

X_1 および X_2 は各々独立して、CH または N であり、

R_{12} 、 R_{13} および R_{14} は各々独立して、ハロ、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、 $-OR_7$ 、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ であり、

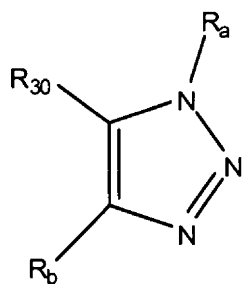
R_8 は、それぞれについて独立して、- H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

R_{10} および R_{11} は、それぞれについて独立して、- H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルもしくは置換されていてもよいヘテロアラルキルであるか、または R_{10} および R_{11} が、それらが結合する窒素と一緒にあって、置換されていてもよいヘテロシクリルもしくは置換されていてもよいヘテロアリールを形成し、かつ

p は 1 または 2 である、請求項 6 に記載の 医薬組成物。

【請求項 8】

式 (XI)



(XI)

で表される化合物あるいは、その薬学的に許容される塩、溶媒和物、包接化合物またはプロドラッグの有効量を含む、血管形成を治療または阻害するための 医薬組成物：

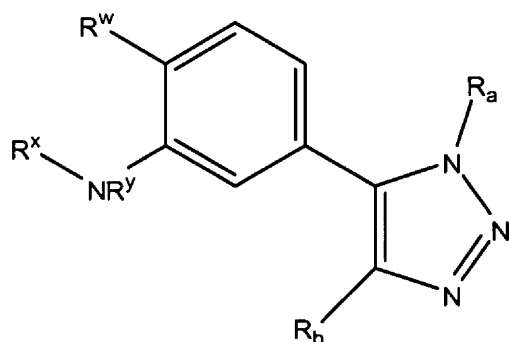
式中、

R_a または R_b のうちの 1 つが -H であり、他方は、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールであり、ただし、 R_a はアクリジニルではなく、かつ

R_{30} は、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールである。

【請求項 9】

化合物が、式 (XIA)



(XIA)

で表され、

式中、

R^x は、 $(R^{aa})_m$ 、 $-R^{aa}-C(O)(CH_2)_nC(O)OH$ 、 $-C(O)(CH_2)_nC(O)OH$ 、 $-C(O)YR^z$ 、 $-C(O)NH-R^{aa}$ または $-(R^{aa})_qC(O)(Y_1)$ であり、

R^y は、-H または低級アルキルであり、

R^w は、-H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、

R_7 は、それぞれについて独立して、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアララルキルまたは置換されていてもよいヘテロアララルキルであり、

R^{aa} は、アミノ酸残基またはアミノ酸残基類似体であり、

Y は、 CH_2 、O または NH であり、

R^z は、 $Alk-NH_2$ 、 $Alk-C(O)OH$ 、Het または Y_1 であり、

Alk は、置換されていてもよいアルキレンであり、

Het は、置換されていてもよいヘテロアルキルであり、

Y_1 は、分子量 60,000 ダルトン未満の水溶性ポリマーであり、

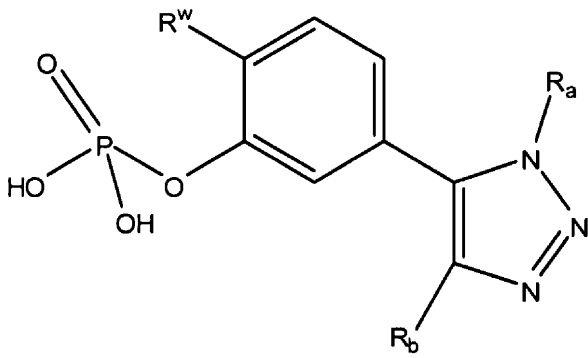
n は、1、2、3 または 4 であり、

m は、1 から 10 の整数であり、かつ

q は 0 または 1 である、請求項 8 に記載の 医薬組成物。

【請求項 10】

化合物が、式 (XIB)



(XIB)

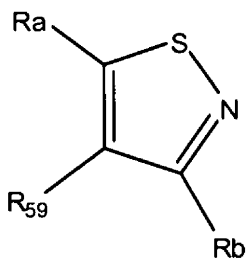
で表され、
式中、

R^w は、- H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、- OP(O)(OR₇)₂、- SP(O)(OR₇)₂、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、

R₇ は、それぞれについて独立して、- H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルである、請求項 8 に記載の 医薬組成物。

【請求項 11】

式 (XXXI)



(XXXI)

で表される化合物、あるいはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、包接化合物またはプロドラッグの有効量を含む、血管形成を治療または阻害する ための医薬組成物：

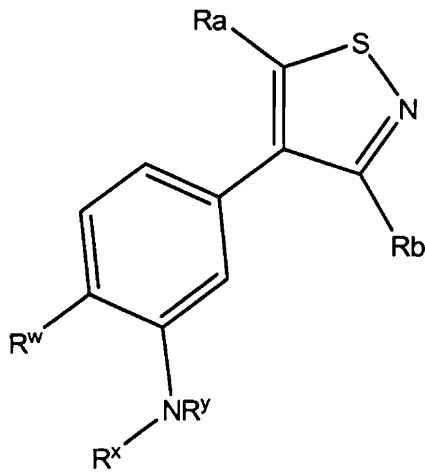
式中、

R_a または R_b のうちの 1 つが - H であり、他方は、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールであり、かつ

R₅₉ は、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールであり、ただし、R₅₉ は非置換のフェニルではない。

【請求項 12】

化合物が、式 (XXXIA)



(XXXIA)

で表され、
式中、

R^x は、 $(R^{aa})_m$ 、 $-R^{aa}-C(O)(CH_2)_n C(O)OH$ 、 $-C(O)(CH_2)_n C(O)OH$ 、 $-C(O)YR^z$ 、 $-C(O)NH-R^{aa}$ または $-(R^{aa})_q C(O)(Y_1)$ であり、

R^y は、 $-H$ または低級アルキルであり、

R^w は、 $-H$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、

R_7 は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

R^{aa} は、アミノ酸残基またはアミノ酸残基類似体であり、

Y は、 CH_2 、 O または NH であり、

R^z は、 $Alk-NH_2$ 、 $Alk-C(O)OH$ 、 Het または Y_1 であり、

Alk は、置換されていてもよいアルキレンであり、

Het は、置換されていてもよいヘテロアルキルであり、

Y_1 は、分子量 60,000 ダルトン未満の水溶性ポリマーであり、

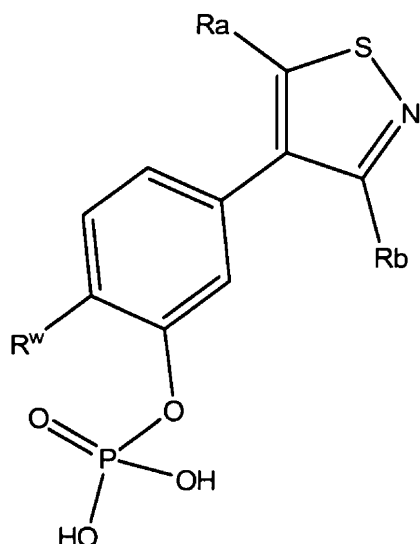
n は、1、2、3 または 4 であり、

m は、1 から 10 の整数であり、かつ

q は 0 または 1 である、請求項 11 に記載の 医薬組成物。

【請求項 13】

化合物が、式 (XXXIB)



(XXXIB)

で表され、式中、

R^w は、- H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、- OP(O)(OR₇)₂、- SP(O)(OR₇)₂、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、かつ

R_7 は、それぞれについて独立して、- H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアララルキルまたは置換されていてもよいヘテロアララルキルである、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0017

【補正方法】変更

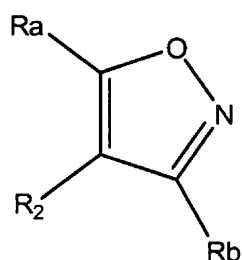
【補正の内容】

【0017】

本発明の方法はいずれも、本発明の化合物単独で実施してもよいし、他の抗血管形成剤などの他の作用剤と併用して実施してもよい。

[請求項101]

式(I)



(I)

で表される化合物あるいは、その薬学的に許容される塩、溶媒和物、包接化合物およびプロドラッグの有効量を被験体に投与する段階を含む、血管形成の治療または阻害を必要と

する被験体で、血管形成を治療または阻害する方法：

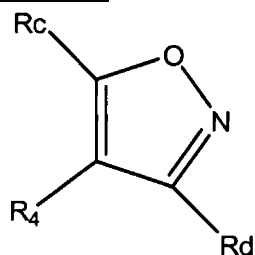
式中、

R_a または R_b のうちの1つは-Hであり、他方は、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールであり、かつ

R_2 は、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよい2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]ジオキシル、置換されていてもよいベンゾ[1,3]ジオキソリル、置換されていてもよいビフェニル、置換されていてもよい4-ピリジニル-フェニル、置換されていてもよいキノリニル、置換されていてもよいイソキノリニル、置換されていてもよい1H-インドリル、置換されていてもよいピリジニル、置換されていてもよいオキサゾリル、置換されていてもよいイソキサゾリル、置換されていてもよいチアゾリル、置換されていてもよいイソチアゾリル、置換されていてもよいイミダゾリル、置換されていてもよいピロリル、置換されていてもよいピラゾリル、置換されていてもよいフラニル、置換されていてもよいチオフエニル、置換されていてもよいチアジアゾリル、置換されていてもよいオキサジアゾリル、置換されていてもよいクロマニル、置換されていてもよいイソクロマニル、置換されていてもよいピリダジニル、置換されていてもよいピリミジニル、置換されていてもよいピラジニル、置換されていてもよいベンゾチオフエニル、置換されていてもよい2,3-ジヒドロ-ベンゾチオフエニル、置換されていてもよいベンゾフラニル、置換されていてもよい2,3-ジヒドロ-ベンゾフラニル、置換されていてもよい1H-ベンゾイミダゾリル、置換されていてもよいベンゾチアゾリル、置換されていてもよいベンゾオキサゾリル、置換されていてもよい1H-ベンゾトリアゾリル、置換されていてもよい1H-インダゾリル、置換されていてもよい9H-プリーニル、置換されていてもよいピロロピリミジニル、置換されていてもよいピロロピラジニル、置換されていてもよいピロロピリダジニル、置換されていてもよいイミダゾピラジニルまたは置換されていてもよいイミダゾールピリダジニルである。

[請求項102]

式(II)

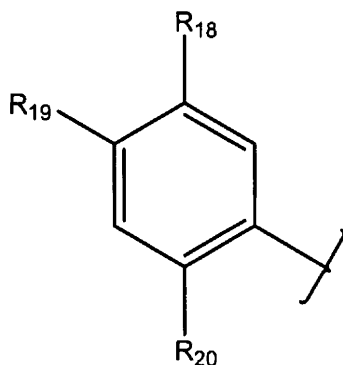


(II)

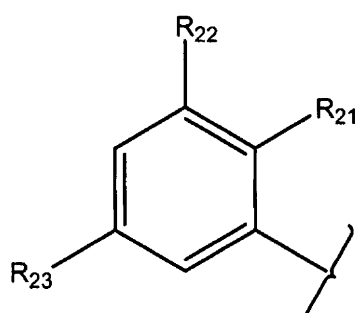
で表される化合物あるいは、その薬学的に許容される塩、溶媒和物、包接化合物およびプロドラッグの有効量を被験体に投与する段階を含む、血管形成の治療または阻害を必要とする被験体で、血管形成を治療または阻害する方法：

式中、

R_c または R_d のうちの1つが-Hであり、他方は、置換されていてもよいヘテロアリール、非置換のフェニルまたは以下の式



もしくは



のうちの1つで表される置換フェニルであり、

R_4 は、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールであり、

R_{18} 、 R_{19} 、 R_{22} および R_{23} は、各々独立して、ハロ、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、 $-OR_7$ 、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ であり、

R_{20} は、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、 $-OR_{17}$ 、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ であり、

R_{21} は、ハロ、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、 $-OR_{17}$ 、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ であり、

R_7 および R_8 は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

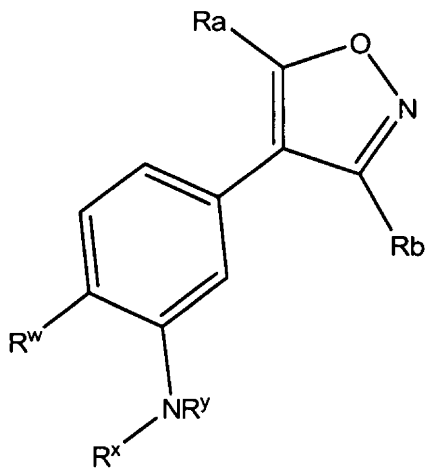
R_{10} および R_{11} は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルもしくは置換されていてもよいヘテロアラルキルであるか、または R_{10} および R_{11} は、それらが結合する窒素と一緒にあって、置換されていてもよいヘテロシクリルもしくは置換されていてもよいヘテロアリールを形成し、

R_{17} は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、かつ

p は1または2である。

[請求項103]

化合物が、式(IA)



(IA)

で表され、
式中、

R^x は、 $(R^{aa})_m$ 、 $-R^{aa}-C(O)(CH_2)_nC(O)OH$ 、 $-C(O)(CH_2)_nC(O)OH$ 、 $-C(O)YR^z$ 、 $-C(O)NH-R^{aa}$ または $-(R^{aa})_qC(O)(Y_1)$ であり、

R^y は、 $-H$ または低級アルキルであり、

R^w は、 $-H$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、

R_7 は、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアララルキルまたは置換されていてもよいヘテロアララルキルであり、

R^{aa} は、アミノ酸残基またはアミノ酸残基類似体であり、

Y は、 CH_2 、 O または NH であり、

R^z は、 $Alk-NH_2$ 、 $Alk-C(O)OH$ 、 Het または Y_1 であり、

Alk は、置換されていてもよいアルキレンであり、

Het は、置換されていてもよいヘテロアルキルであり、

Y_1 は、分子量60,000ダルトン未満の水溶性ポリマーであり、

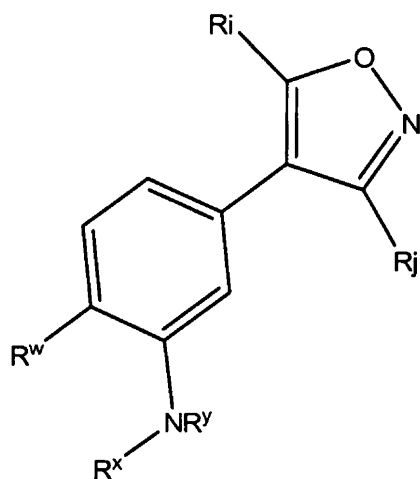
n は、1、2、3または4であり、

m は、1から10の整数であり、かつ

q は0または1である、請求項101に記載の方法。

[請求項104]

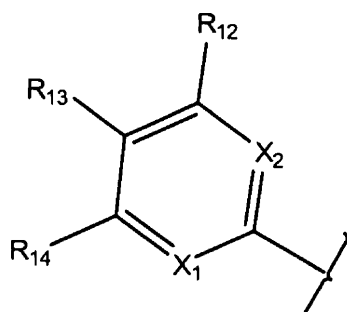
化合物が、式(VA)



(VA)

で表され、
式中、

R_i または R_j のうちの1つが -H であり、他方は、以下の式



で表され、

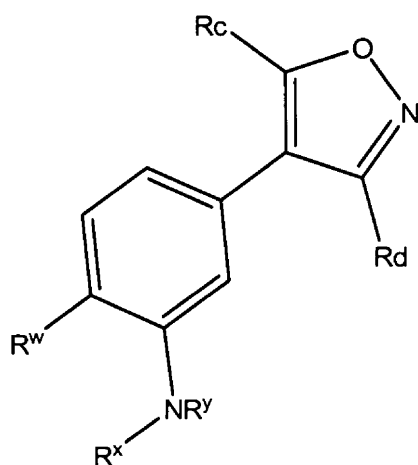
X_1 および X_2 は各々独立して、CH または N であり、

R_{12} 、 R_{13} および R_{14} は各々独立して、ハロ、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、 $-OR_7$ 、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ であり、

R_8 は、それぞれについて独立して、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

R_{10} および R_{11} は、それぞれについて独立して、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルもしくは置換されていてもよいヘテロアラルキルであるか、または R_{10} および R_{11} が、それらが結合する窒素と一緒に、置換されていてもよいヘテロシクリルもしくは置換されていてもよいヘテロアリールを形成し、かつ

p は1または2である、請求項103に記載の方法。

[請求項105]化合物が、式(IIA)

(IIA)

で表され、式中、

R^x は、 $(R^{aa})_m$ 、 $-R^{aa}-C(O)(CH_2)_nC(O)OH$ 、 $-C(O)(CH_2)_nC(O)OH$ 、 $-C(O)YR^z$ 、 $-C(O)NH-R^{aa}$ または $-(R^{aa})_qC(O)(Y_1)$ であり、

R^y は、 $-H$ または低級アルキルであり、

R^w は、 $-H$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、

R^{aa} は、アミノ酸残基またはアミノ酸残基類似体であり、

Y は、 CH_2 、 O または NH であり、

R^z は、 $Alk-NH_2$ 、 $Alk-C(O)OH$ 、 Het または Y_1 であり、

Alk は、置換されていてもよいアルキレンであり、

Het は、置換されていてもよいヘテロアルキルであり、

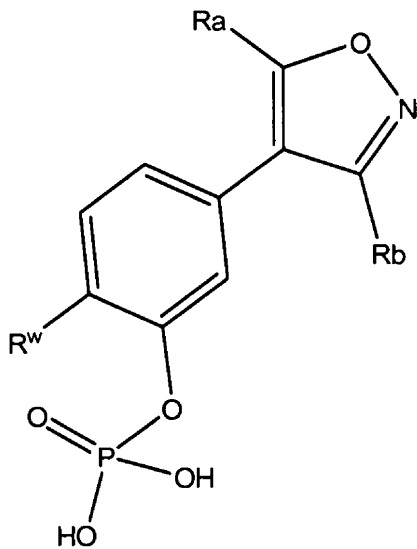
Y_1 は、分子量60,000ダルトン未満の水溶性ポリマーであり、

n は、1、2、3または4であり、

m は、1から10の整数であり、かつ

q は0または1である、請求項102に記載の方法。

[請求項106]化合物が、式(1B)



(IB)

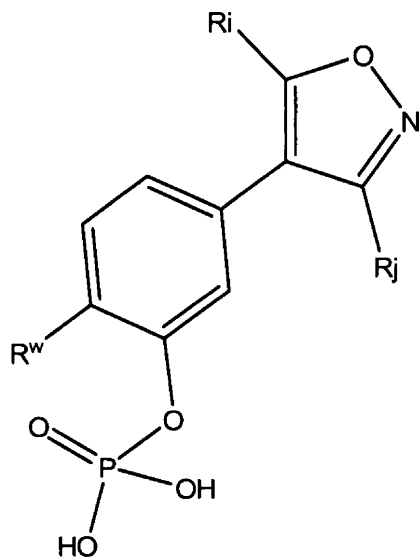
で表され、
式中、

R^wは、-H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、-OP(O)(OR₇)₂、-SP(O)(OR₇)₂、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、かつ

R₇は、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリアル、置換されていてもよいヘテロアリアル、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルである、請求項101に記載の方法。

[請求項107]

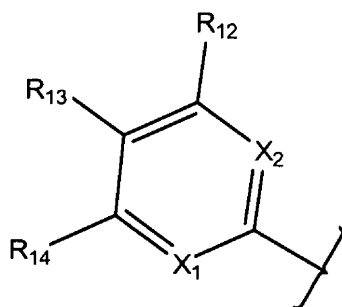
化合物が、式(VB)



(VB)

で表され、
式中、

R_iまたはR_jのうちの1つが-Hであり、他方は、以下の式



で表され、

X_1 および X_2 は各々独立して、CH または N であり、

R_{12} 、 R_{13} および R_{14} は各々独立して、ハロ、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、 $-OR_7$ 、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ であり、

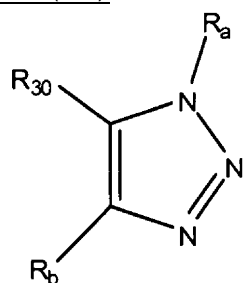
R_8 は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

R_{10} および R_{11} は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルもしくは置換されていてもよいヘテロアラルキルであるか、または R_{10} および R_{11} が、それらが結合する窒素と一緒にあって、置換されていてもよいヘテロシクリルもしくは置換されていてもよいヘテロアリールを形成し、かつ

p は 1 または 2 である、請求項 106 に記載の方法。

[請求項 108]

式 (XI)



(XI)

で表される化合物あるいは、その薬学的に許容される塩、溶媒和物、包接化合物またはプロドラッグの有効量を被験体に投与する段階を含む、血管形成の治療または阻害を必要とする被験体で、血管形成を治療または阻害する方法：

式中、

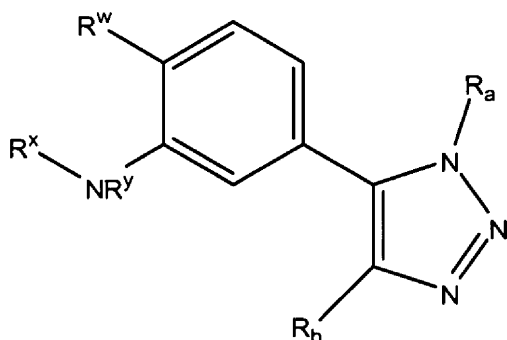
R_a または R_b のうちの 1 つが $-H$ であり、他方は、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールであり、ただし、 R_a はアクリジニルではなく、かつ

R_{30} は、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールであ

る。

[請求項109]

化合物が、式(XIA)



(XIA)

で表され、

式中、

R^x は、 $(R^{aa})_m$ 、 $-R^{aa}-C(O)(CH_2)_nC(O)OH$ 、 $-C(O)(CH_2)_nC(O)OH$ 、 $-C(O)YR^z$ 、 $-C(O)NH-R^{aa}$ または $-(R^{aa})_qC(O)(Y_1)$ であり、

R^y は、 $-H$ または低級アルキルであり、

R^w は、 $-H$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、

R_7 は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアララルキルまたは置換されていてもよいヘテロアララルキルであり、

R^{aa} は、アミノ酸残基またはアミノ酸残基類似体であり、

Y は、 CH_2 、 O または NH であり、

R^z は、 $Alk-NH_2$ 、 $Alk-C(O)OH$ 、 Het または Y_1 であり、

Alk は、置換されていてもよいアルキレンであり、

Het は、置換されていてもよいヘテロアルキルであり、

Y_1 は、分子量60,000ダルトン未満の水溶性ポリマーであり、

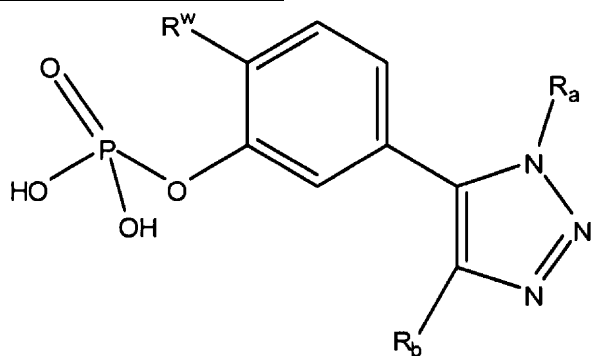
n は、1、2、3または4であり、

m は、1から10の整数であり、かつ

q は0または1である、請求項108に記載の方法。

[請求項110]

化合物が、式(XIB)



(XIB)

で表され、

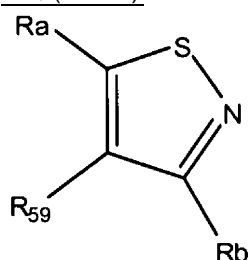
式中、

R^w は、 $-H$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、

R_7 は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルである、請求項108に記載の方法。

[請求項111]

式(XXXI)



(XXXI)

で表される化合物、あるいはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、包接化合物またはプロドラッグの有効量を被験体に投与する段階を含む、血管形成の治療または阻害を必要とする被験体で、血管形成を治療または阻害する方法：

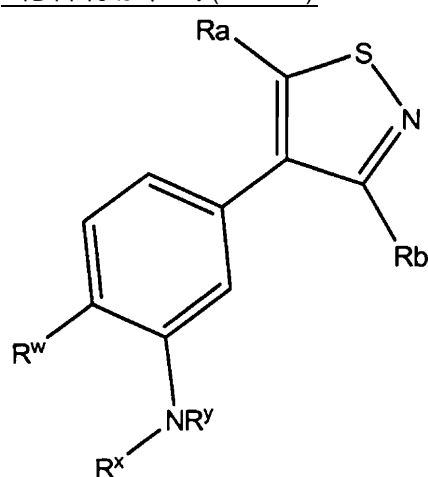
式中、

R_a または R_b のうちの1つが $-H$ であり、他方は、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールであり、かつ

R_{59} は、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールであり、ただし、 R_{59} は非置換のフェニルではない。

[請求項112]

化合物が、式(XXXIA)



(XXXIA)

で表され、

式中、

R^x は、 $(R^{aa})_m$ 、 $-R^{aa}-C(O)(CH_2)_nC(O)OH$ 、 $-C(O)(CH_2)_nC(O)OH$ 、 $-C(O)YR^z$ 、 $-C(O)NH-R^{aa}$ または $-(R^{aa})_qC(O)(Y_1)$ であり、

R^y は、 $-H$ または低級アルキルであり、

R^w は、-H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、

R_7 は、それぞれについて独立して、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアララルキルまたは置換されていてもよいヘテロアララルキルであり、

R^{aa} は、アミノ酸残基またはアミノ酸残基類似体であり、

Y は、 CH_2 、 O または NH であり、

R^z は、 $Alk-NH_2$ 、 $Alk-C(O)OH$ 、 Het または Y_1 であり、

Alk は、置換されていてもよいアルキレンであり、

Het は、置換されていてもよいヘテロアルキルであり、

Y_1 は、分子量60,000ダルトン未満の水溶性ポリマーであり、

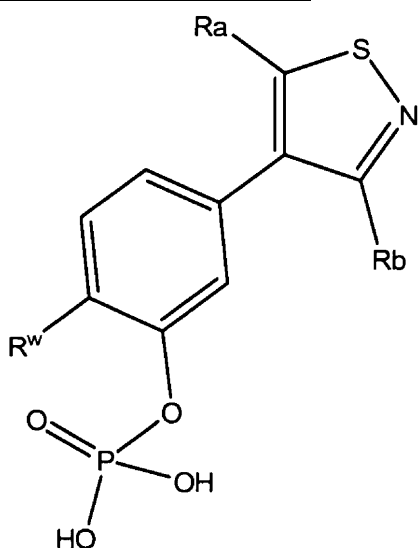
n は、1、2、3または4であり、

m は、1から10の整数であり、かつ

q は0または1である、請求項111に記載の方法。

[請求項113]

化合物が、式(XXXIB)



(XXXIB)

で表され、式中、

R^w は、-H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、かつ

R_7 は、それぞれについて独立して、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアララルキルまたは置換されていてもよいヘテロアララルキルである、請求項111に記載の方法。