

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成19年11月29日(2007.11.29)

【公表番号】特表2007-509847(P2007-509847A)

【公表日】平成19年4月19日(2007.4.19)

【年通号数】公開・登録公報2007-015

【出願番号】特願2006-535596(P2006-535596)

【国際特許分類】

<b>C 0 7 C</b>	<b>39/16</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>C 0 7 C</b>	<b>39/21</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>C 0 7 C</b>	<b>39/27</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>C 0 7 C</b>	<b>43/23</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 K</b>	<b>31/085</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>C 0 7 D</b>	<b>211/22</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>17/00</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>17/06</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>17/12</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>17/02</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>37/08</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>17/16</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>17/08</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>17/10</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>17/14</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>35/00</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>35/02</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>37/00</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>37/06</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>3/10</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>25/00</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>1/04</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>11/06</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>19/02</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>29/00</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>25/28</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>3/14</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>3/02</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>5/18</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>13/12</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>19/10</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>35/04</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>19/00</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>3/00</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>1/14</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>25/06</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>1/08</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>1/02</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>1/10</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>21/00</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 6 1 P</b>	<b>13/02</b>	<b>(2006.01)</b>

**A 6 1 P 1/18 (2006.01)**  
**A 6 1 P 9/12 (2006.01)**  
**A 6 1 P 9/06 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/18 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/26 (2006.01)**  
**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**  
**A 6 1 K 45/06 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/445 (2006.01)**  
**C 1 2 N 15/09 (2006.01)**

## 【 F I 】

C 0 7 C 39/16 C S P  
C 0 7 C 39/21 Z N A  
C 0 7 C 39/27  
C 0 7 C 43/23 D  
A 6 1 K 31/085  
C 0 7 D 211/22  
A 6 1 P 17/00  
A 6 1 P 17/06  
A 6 1 P 17/12  
A 6 1 P 17/02  
A 6 1 P 37/08  
A 6 1 P 17/16  
A 6 1 P 17/08  
A 6 1 P 17/10  
A 6 1 P 17/14  
A 6 1 P 35/00  
A 6 1 P 35/02  
A 6 1 P 37/00  
A 6 1 P 37/06  
A 6 1 P 3/10  
A 6 1 P 25/00  
A 6 1 P 1/04  
A 6 1 P 11/06  
A 6 1 P 19/02  
A 6 1 P 29/00 1 0 1  
A 6 1 P 25/28  
A 6 1 P 3/14  
A 6 1 P 3/02 1 0 2  
A 6 1 P 5/18  
A 6 1 P 13/12  
A 6 1 P 19/10  
A 6 1 P 29/00  
A 6 1 P 35/04  
A 6 1 P 19/00  
A 6 1 P 3/00  
A 6 1 P 1/14  
A 6 1 P 25/06  
A 6 1 P 1/08  
A 6 1 P 1/02  
A 6 1 P 1/10

A 6 1 P 21/00  
 A 6 1 P 13/02  
 A 6 1 P 1/18  
 A 6 1 P 9/12  
 A 6 1 P 9/06  
 A 6 1 P 25/18  
 A 6 1 P 25/26  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1  
 A 6 1 P 43/00 1 2 1  
 A 6 1 K 45/06  
 A 6 1 K 31/445  
 C 0 7 C 43/23 E  
 C 1 2 N 15/00 A

## 【手続補正書】

【提出日】平成19年10月12日(2007.10.12)

## 【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

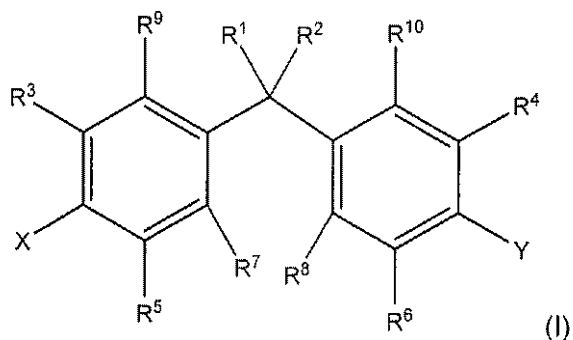
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



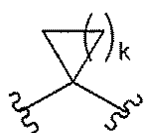
を有する化合物であって、その単一の異性体、異性体の混合物、もしくは異性体のラセミ混合物として；その溶媒和物もしくは多形体として；またはそのプロドラッグもしくは代謝物として；またはその薬学的に受容可能な塩としてのものであり；

ここで：

$R^1$  および  $R^2$  は、各々独立して、ハロ、ハロアルキル、プソイドハロ、必要に応じて置換されているアルキル、必要に応じて置換されているアルケニル、必要に応じて置換されているアルキニル、必要に応じて置換されているシクロアルキル、必要に応じて置換されているヘテロシクリル、必要に応じて置換されているアリールまたは必要に応じて置換されているヘテロアリールであるか；あるいは

$R^1$  および  $R^2$  は、それらが結合している炭素原子と一緒に、

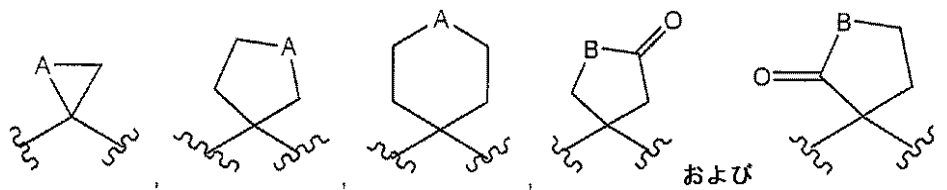
【化2】



からなる必要に応じて置換されているシクロアルキルを形成し、ここでkは、1～6の整数であるか；あるいは

$R^1$  および  $R^2$  は、それらが結合している炭素原子と一緒に、

【化3】



からなる群より選択される必要に応じて置換されているヘテロシクリルを形成し、ここでAは、 $-O-$ 、 $-NR^x-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ または $-S(O)_2-$ であり、ここで $R^x$ は、水素、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、 $-R^{14}-C(J)R^{15}$ 、 $-R^{14}-C(J)OR^{15}$ 、 $-R^{14}-C(J)R^{16}OR^{15}$ 、 $-R^{14}-C(J)SR^{16}$ 、 $-R^{14}-C(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-R^{14}-C(J)N(R^{17})N(R^{18})R^{19}$ 、 $-R^{14}-C(J)N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-R^{14}-S(O)_pN(R^{18})R^{19}$ または $-R^{14}-S(O)_pR^{20}$ であり；そしてBは、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NR^y-$ であり、ここで $R^y$ は、水素、アルキル、ハロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；そして各pは独立して、0～2であり；

$R^3$  および  $R^4$  は、各々独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、ハロ、プソイドハロ、ハロアルキル、ニトロ、シアノ、アジド、 $-R^{14}-R^{15}$ 、 $-R^{14}-N(R^{18})R^{19}$ 、 $-R^{14}-SR^{15}$ 、 $-R^{14}-OC(J)R^{15}$ 、 $-R^{14}-NR^{17}C(J)R^{15}$ 、 $-R^{14}-OC(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-R^{14}-NR^{17}C(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-R^{14}-NR^{17}C(J)OR^{15}$ 、 $-R^{14}-C(J)R^{15}$ 、 $-R^{14}-C(J)OR^{15}$ 、 $-R^{14}-C(J)SR^{16}$ 、 $-R^{14}-C(J)N(R^{18})R^{19}$ または $-R^{14}C(J)N(R^{17})N(R^{18})R^{19}$ であり；

$R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$  は、各々独立して、水素、ハロ、ヒドロキシ、アミノ、プソイドハロ、シアノ、ニトロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシまたはハロアルコキシであり；

Xは $R^{25}$ であり；

Yは独立して、 $R^{30}$ 、 $-OR^{31}$ 、 $-SR^{32}$ または $-N(R^{33})(R^{34})$ であり；

$R^{25}$  および  $R^{30}$  は、各々独立して、以下：

(i) 必要に応じて置換されているアルキルであって、該アルキルは、1～10個の置換基で置換され得、該置換基は、各々独立して、ハロ、プソイドハロ、ニトロ、シアノ、チオキソ、アジド、アミジノ、グアニジノ、必要に応じて置換されているシクロアルキル、必要に応じて置換されているシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されているヘテロシクリル、必要に応じて置換されているヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されているアリール、必要に応じて置換されているアラルキル、必要に応じて置換されているヘテロアリール、必要に応じて置換されているヘテロアラルキル、 $-OR^{15}$ 、 $-OR^{16}OR^{15}$ 、 $-N(R^{18})R^{19}$ 、 $-N(R^{17})N(R^{18})R^{19}$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-SR^{16}SR^{15}$ 、 $-N(R^{17})N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-OC(J)R^{15}$ 、 $-NR^{17}C(J)R^{15}$ 、 $-OC(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-NR^{17}C(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-NR^{17}C(J)OR^{15}$ 、 $-OC(J)OR^{15}$ 、 $-P(R^{21})_2$ 、 $-P(O)(R^{21})_2$ 、 $-OP(O)(R^{21})_2$ 、 $-C(J)R^{15}$ 、 $-C(J)OR^{15}$ 、 $-C(J)SR^{16}$ 、 $-C(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-C(J)N(R^{17})N(R^{18})R^{19}$ 、 $-C(J)N(R^{17})N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-C(R^{17})=NOR^{15}$ 、 $-C(R^{17})=NR^{17}$ 、 $-C(R^{17})=NN(R^{17})$ 、

$R^{18}$  )  $R^{19}$  および  $-C (=NR^{17})N(R^{18})R^{19}$  からなる群より選択される、アルキル；または

(ii) 必要に応じて置換されているアルケニルもしくは必要に応じて置換されているアルキニルであって、これらのいずれかは、1~10個の置換基で置換され得、該置換基は、各々独立して、オキソ、チオキソ、ハロ、プソイドハロ、ニトロ、シアノ、アジド、アミジノ、グアニジノ、 $-OR^{15}$ 、 $-OR^{16}OR^{15}$ 、 $-N(R^{18})R^{19}$ 、 $-N(R^{17})N(R^{18})R^{19}$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-SR^{16}SR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{20}$ 、 $-N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-N(R^{17})N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-OC(J)R^{15}$ 、 $-NR^{17}C(J)R^{15}$ 、 $-OC(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-NR^{17}C(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-NR^{17}C(J)OR^{15}$ 、 $-OC(J)OR^{15}$ 、 $-P(R^{21})_2$ 、 $-P(O)(R^{21})_2$ 、 $-OP(O)(R^{21})_2$ 、 $-C(J)R^{15}$ 、 $-C(J)OR^{15}$ 、 $-C(J)SR^{16}$ 、 $-C(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-C(J)N(R^{17})N(R^{18})R^{19}$ 、 $-C(J)N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-C(J)N(R^{17})N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-C(R^{17})=NOR^{15}$ 、 $-C(R^{17})=NR^{17}$ 、 $-C(R^{17})=NN(R^{18})R^{19}$ 、 $-C(=NR^{17})N(R^{18})R^{19}$ 、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリーールおよびヘテロアリーールからなる群より選択される、アルケニルもしくはアルキニル；

のような(i)または(ii)から選択され；

$R^{31}$ 、 $R^{32}$ 、 $R^{33}$  および  $R^{34}$  は、各々独立して、必要に応じて置換されているアルキル、必要に応じて置換されているアルケニル、必要に応じて置換されているアルキニルまたは必要に応じて置換されているシクロアルキルであり；これらの全ては、1~10個の置換基で置換され得、該置換基は、各々独立して、オキソ、ハロ、プソイドハロ、ニトロ、シアノ、アジド、アミジノ、グアニジノ、 $-OR^{15}$ 、 $-OR^{16}OR^{15}$ 、 $-N(R^{18})R^{19}$ 、 $-N(R^{17})N(R^{18})R^{19}$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-SR^{16}SR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{20}$ 、 $-N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-N(R^{17})N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-OC(J)R^{15}$ 、 $-NR^{17}C(J)R^{15}$ 、 $-OC(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-NR^{17}C(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-NR^{17}C(J)OR^{15}$ 、 $-OC(J)OR^{15}$ 、 $-P(R^{21})_2$ 、 $-P(O)(R^{21})_2$ 、 $-OP(O)(R^{21})_2$ 、 $-C(J)R^{15}$ 、 $-C(J)OR^{15}$ 、 $-C(J)SR^{16}$ 、 $-C(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-C(J)N(R^{17})N(R^{18})R^{19}$ 、 $-C(J)N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-C(J)N(R^{17})N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-C(R^{17})=NOR^{15}$ 、 $-C(R^{17})=NR^{17}$ 、 $-C(R^{17})=NN(R^{18})R^{19}$ 、 $-C(=NR^{17})N(R^{18})R^{19}$ 、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリーールおよびヘテロアリーールからなる群より選択され、そして $R^{34}$ はさらに水素であり得；

各 $R^{14}$ は独立して、直接結合であるか、またはアルキレンであり；

各 $R^{15}$ および $R^{17}$ は独立して、水素、必要に応じて置換されているアルキル、必要に応じて置換されているアルケニル、必要に応じて置換されているアルキニル、必要に応じて置換されているシクロアルキル、必要に応じて置換されているヘテロシクリル、必要に応じて置換されているアリーールまたは必要に応じて置換されているヘテロアリーールであり、これらの全ては、置換されている場合、1~5個の置換基で置換され、該置換基は各々独立して、ハロ、シアノ、ヒドロキシおよびアミノから選択され；

各 $R^{16}$ および $R^{20}$ は独立して、必要に応じて置換されているアルキル、必要に応じて置換されているアルケニル、必要に応じて置換されているアルキニル、必要に応じて置換されているシクロアルキル、必要に応じて置換されているヘテロシクリル、必要に応じて置換されているアリーールまたは必要に応じて置換されているヘテロアリーールであり、これらの全ては、置換されている場合、1~5個の置換基で置換され、該置換基は各々独立して、ハロ、ヒドロキシ、アルコキシおよびアミノから選択され；そして

各 $R^{18}$ および $R^{19}$ は独立して、水素、必要に応じて置換されているアルキル、必要

に応じて置換されているアルケニル、必要に応じて置換されているアルキニル、必要に応じて置換されているシクロアルキル、必要に応じて置換されているヘテロシクリル、必要に応じて置換されているアリールまたは必要に応じて置換されているヘテロアリールであり、これらの全ては、置換されている場合、1～5個の置換基で置換され、該置換基は各々独立して、ハロ、ヒドロキシ、アルコキシおよびアミノから選択されるか；

あるいは、 $R^{18}$  および  $R^{19}$  は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールを形成し；

各  $R^{21}$  は独立して、アルキル、 $-OR^{22}$  または  $-N(R^{23})R^{24}$  であり；

$R^{22}$  は、水素、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリールまたはアラルキルであり；

$R^{23}$  および  $R^{24}$  は、各々独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、アルキニルまたはシクロアルキルであるか；あるいは

$R^{23}$  および  $R^{24}$  は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールを形成し；

各 J は独立して、O または S であり；

ただし、 $R^1$  および  $R^2$  が置換シクロヘキシルを形成する場合、該シクロヘキシルは、gem-ジアリール置換基に対して4位で置換されている場合、ハロ、シアノ、必要に応じて置換されているアルキル、必要に応じて置換されているアルケニル、必要に応じて置換されているアルキニル、必要に応じて置換されているアリールおよび必要に応じて置換されているヘテロアリールからなる群より選択される置換基で置換されており；そして

ただし、 $R^{25}$  または  $R^{30}$  のいずれもが：

- $CH_2COOH$ ；
- $CH_2-5$ -テトラゾリル；
- $CH_2COOMe$ ；
- $CH_2COOEt$ ；
- $CH_2NH(CH_2COOH)$ ；
- $CH_2N(C(O)Me)(CH_2COOH)$ ；
- $CH_2-N$ -ピロリジン-2-オン；
- $CH_2-(1$ -メチルピロリジン-2-オン-3-イル)；
- $CH_2COOH$ ；
- $CH_2C(O)NH_2$ ；
- $CH_2C(O)NMe_2$ ；
- $CH_2C(O)NHMe$ ；
- $CH_2C(O)-N$ -ピロリジン；
- $CH(OH)COOH$ ；
- $CH(OH)C(O)NH_2$ ；
- $CH(OH)C(O)NHMe$ ；
- $CH(OH)C(O)NMe_2$ ；
- $CH(OH)C(O)NEt_2$ ；
- $CH_2CH_2COOH$ ；
- $CH_2CH_2COOMe$ ；
- $CH_2CH_2COOEt$ ；
- $CH_2CH_2COOMe$ ；
- $CH_2CH_2COOEt$ ；
- $CH_2CH_2C(O)NH_2$ ；
- $CH_2CH_2C(O)NHMe$ ；
- $CH_2CH_2C(O)NMe_2$ ；または
- $CH_2CH_2-5$ -テトラゾリル

でない、  
化合物。

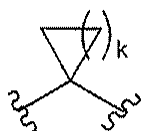
## 【請求項 2】

請求項 1 に記載の化合物であって、ここで：

$R^1$  および  $R^2$  は、各々独立して、ハロ、ハロアルキル、プソイドハロ、必要に応じて置換されているアルキル、必要に応じて置換されているアルケニル、必要に応じて置換されているアルキニル、必要に応じて置換されているシクロアルキル、必要に応じて置換されているヘテロシクリル、必要に応じて置換されているアリールまたは必要に応じて置換されているヘテロアリールであるか；あるいは

$R^1$  および  $R^2$  は、それらが結合している炭素原子と一緒に、

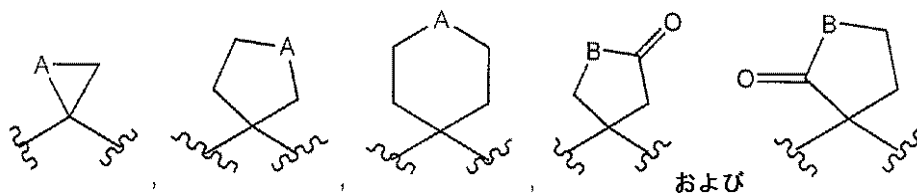
## 【化 4】



からなるシクロアルキルを形成し、ここで  $k$  は 1 ~ 6 の整数であるか；あるいは

$R^1$  および  $R^2$  は、それらが結合している炭素原子と一緒に、

## 【化 5】



からなる群より選択される必要に応じて置換されているヘテロシクリルを形成し、ここで、 $A$  は、 $-O-$ 、 $-NR^x-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$  または  $-S(O)_2-$  であり、 $R^x$  は、水素、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、 $-R^{14}-C(J)R^{15}$ 、 $-R^{14}-C(J)OR^{15}$ 、 $-R^{14}-C(J)R^{16}OR^{15}$ 、 $-R^{14}-C(J)SR^{16}$ 、 $-R^{14}-C(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-R^{14}-C(J)N(R^{17})N(R^{18})R^{19}$ 、 $-R^{14}-C(J)N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-R^{14}-S(O)_pN(R^{18})R^{19}$  または  $-R^{14}-S(O)_pR^{20}$  であり；そして  $B$  は、 $-O-$ 、 $-S-$  または  $-NR^y-$  であり、 $R^y$  は、水素、アルキル、ハロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；そして各  $p$  は独立して、0 ~ 2 であり；

$R^{25}$  および  $R^{30}$  は、各々独立して、以下：

(i) 必要に応じて置換されているアルキルであって、該アルキルは、1 ~ 10 個の置換基で置換され得、該置換基は、各々独立して、ハロ、プソイドハロ、ニトロ、シアノ、チオキソ、アジド、アミジノ、グアニジノ、必要に応じて置換されているシクロアルキル、必要に応じて置換されているヘテロシクリル、必要に応じて置換されているアリール、必要に応じて置換されているヘテロアリール、必要に応じて置換されているヘテロアラキル、 $-OR^{15}$ 、 $-OR^{16}OR^{15}$ 、 $-N(R^{18})R^{19}$ 、 $-N(R^{17})N(R^{18})R^{19}$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-SR^{16}SR^{15}$ 、 $-N(R^{17})N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-OC(J)R^{15}$ 、 $-NR^{17}C(J)R^{15}$ 、 $-OC(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-NR^{17}C(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-NR^{17}C(J)OR^{15}$ 、 $-OC(J)OR^{15}$ 、 $-P(R^{21})_2$ 、 $-P(O)(R^{21})_2$ 、 $-OP(O)(R^{21})_2$ 、 $-C(J)R^{15}$ 、 $-C(J)SR^{16}$ 、 $-C(J)N(R^{17})N(R^{18})R^{19}$ 、 $-C(J)N(R^{17})N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-C(R^{17})=NOR^{15}$ 、 $-C(R^{17})=NR^{17}$ 、 $-C(R^{17})=NN(R^{18})R^{19}$  および  $-C(=NR^{17})N(R^{18})R^{19}$  からなる群より選択される、アルキル；

(ii) 置換プロピル、置換ブチルまたは置換ペンチルであって、該必要に応じて置換されているプロピル、該必要に応じて置換されているブチルまたは該必要に応じて置換さ

れているペンチルはさらに、 $-C(J)OR^{15}$ 、 $-C(J)N(R^{18})R^{19}$  および必要に応じて置換されているヘテロアリールからなる群より選択される置換基で置換され得る、置換プロピル、置換ブチルまたは置換ペンチル；あるいは

(iii) 必要に応じて置換されているアルケニルまたは必要に応じて置換されているアルキニルであって、これらのいずれかは、1~10個の置換基で置換され得、該置換基は、各々独立して、オキソ、チオキソ、ハロ、プソイドハロ、ニトロ、シアノ、アジド、アミジノ、グアニジノ、 $-OR^{15}$ 、 $-OR^{16}OR^{15}$ 、 $-N(R^{18})R^{19}$ 、 $-N(R^{17})N(R^{18})R^{19}$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-SR^{16}SR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{20}$ 、 $-N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-N(R^{17})N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-OC(J)R^{15}$ 、 $-NR^{17}C(J)R^{15}$ 、 $-OC(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-NR^{17}C(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-NR^{17}C(J)OR^{15}$ 、 $-OC(J)OR^{15}$ 、 $-P(R^{21})_2$ 、 $-P(O)(R^{21})_2$ 、 $-OP(O)(R^{21})_2$ 、 $-C(J)R^{15}$ 、 $-C(J)OR^{15}$ 、 $-C(J)SR^{16}$ 、 $-C(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-C(J)N(R^{17})N(R^{18})R^{19}$ 、 $-C(J)N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-C(J)N(R^{17})N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-C(R^{17})=NOR^{15}$ 、 $-C(R^{17})=NR^{17}$ 、 $-C(R^{17})=NN(R^{18})R^{19}$ 、 $-C(=NR^{17})N(R^{18})R^{19}$ 、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択される、アルケニルまたはアルキニルのような(i)、(ii)または(iii)から選択され；

$R^{31}$ 、 $R^{32}$ 、 $R^{33}$  および  $R^{34}$  は、各々独立して、必要に応じて置換されているアルキル、必要に応じて置換されているアルケニル、必要に応じて置換されているシクロアルキルであり；これらの全ては、1~10個の置換基で必要に応じて置換され得、該置換基は、各々独立して、オキソ、ハロ、プソイドハロ、ニトロ、シアノ、アジド、アミジノ、グアニジノ、 $-OR^{15}$ 、 $-OR^{16}OR^{15}$ 、 $-N(R^{18})R^{19}$ 、 $-N(R^{17})N(R^{18})R^{19}$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-SR^{16}SR^{15}$ 、 $-S(O)_pR^{20}$ 、 $-N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-N(R^{17})N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-OC(J)R^{15}$ 、 $-NR^{17}C(J)R^{15}$ 、 $-OC(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-NR^{17}C(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-NR^{17}C(J)OR^{15}$ 、 $-OC(J)OR^{15}$ 、 $-P(R^{21})_2$ 、 $-P(O)(R^{21})_2$ 、 $-OP(O)(R^{21})_2$ 、 $-C(J)R^{15}$ 、 $-C(J)OR^{15}$ 、 $-C(J)SR^{16}$ 、 $-C(J)N(R^{18})R^{19}$ 、 $-C(J)N(R^{17})N(R^{18})R^{19}$ 、 $-C(J)N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-C(J)N(R^{17})N(R^{17})S(O)_pR^{20}$ 、 $-C(R^{17})=NOR^{15}$ 、 $-C(R^{17})=NR^{17}$ 、 $-C(R^{17})=NN(R^{18})R^{19}$ 、 $-C(=NR^{17})N(R^{18})R^{19}$ 、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、そして  $R^{34}$  はさらに水素であり得；

$R^{15}$ 、 $R^{16}$ 、 $R^{17}$ 、 $R^{18}$ 、 $R^{19}$ 、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、請求項1に記載された通りである、化合物。

### 【請求項3】

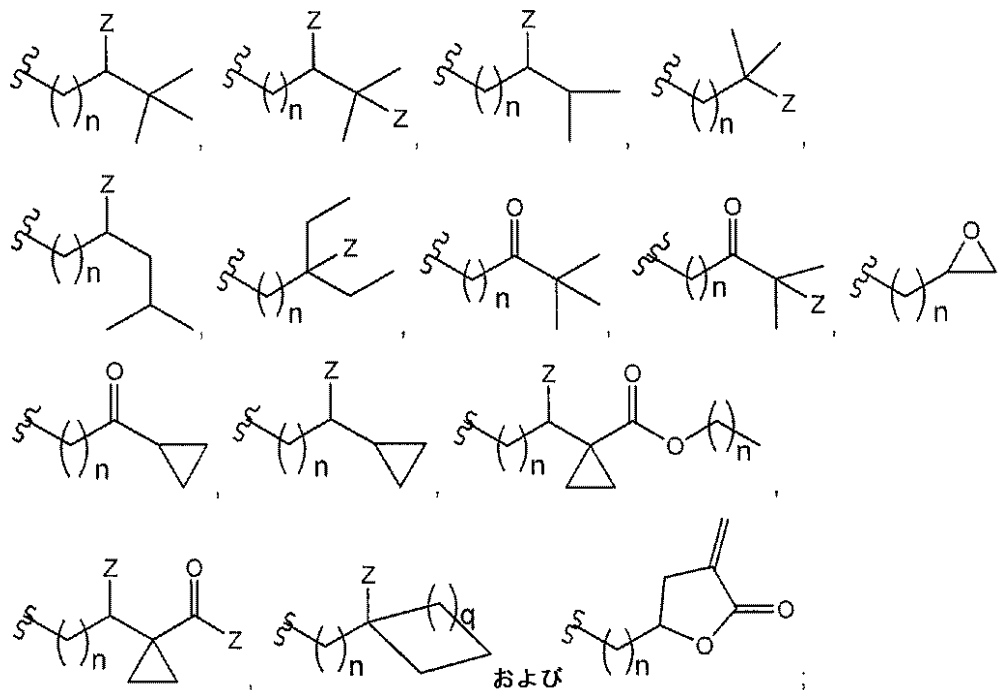
請求項2に記載の化合物であって、 $R^{25}$ 、 $R^{30}$ 、 $R^{31}$ 、 $R^{32}$ 、 $R^{33}$  および  $R^{34}$  は、各々独立して、群a)もしくは群b)から選択される必要に応じて置換されているアルキル、群c)もしくは群d)から選択される必要に応じて置換されているアルケニル、または群e)もしくは群f)から選択される必要に応じて置換されているアルキニルであり；

$R^{31}$ 、 $R^{32}$ 、 $R^{33}$  および  $R^{34}$  はさらに、群g)から選択される必要に応じて置換されているシクロアルキルであり得；

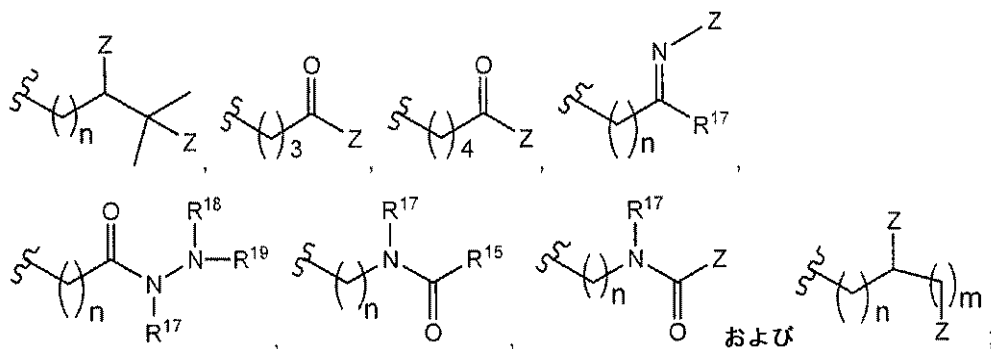
$R^{34}$  はさらに水素であり得；

群(a)は、

【化6】



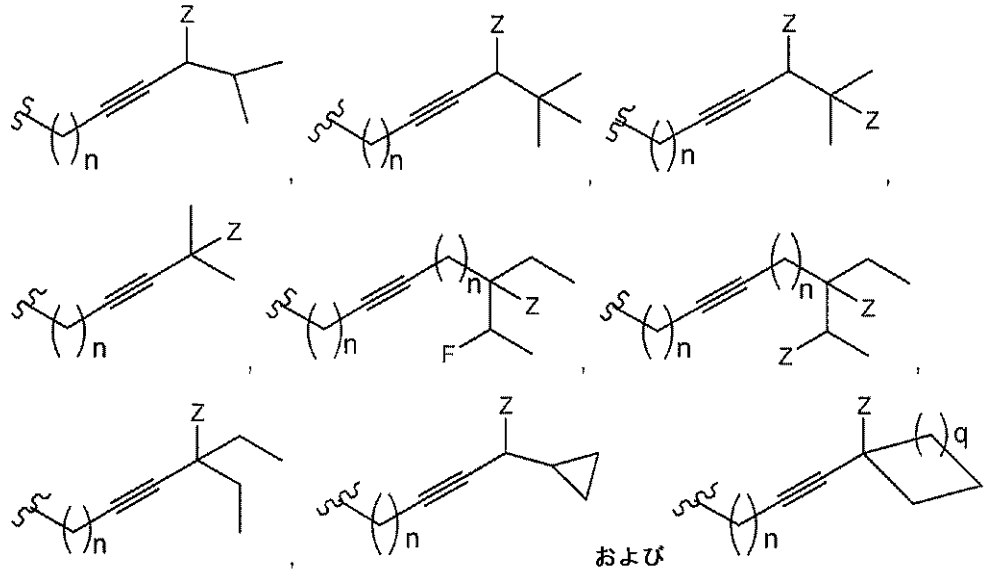
からなり  
群 ( b ) は、  
【化7】



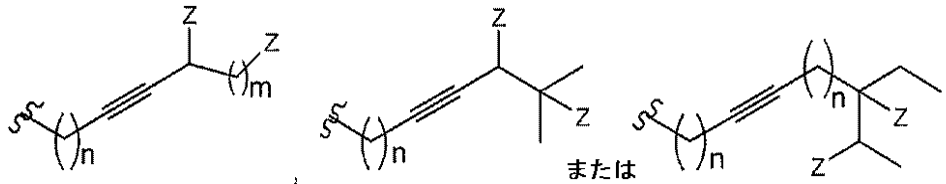
からなり、  
群 ( c ) は、



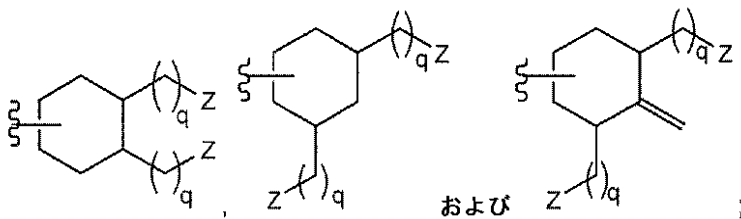
## 【化10】



からなり、  
群 ( f ) は、  
【化11】



からなり、そして  
群 ( g ) は、  
【化12】



からなり、  
各 Z は、独立して、OH、OR、NH<sub>2</sub>、NHR、N(R)(R)であり、ここで R は、各々独立して、アルキルまたはハロアルキルであり；各 n は、独立して 0 ~ 4 の整数であり；各 m は、独立して、1 ~ 2 の整数であり、そして各 q は、独立して、0 ~ 4 の整数であり；

群 a)、b)、c)、d)、e)、f) および g) の任意の成員は、必要に応じてハロゲン化され得る、  
化合物。

## 【請求項4】

請求項3に記載の化合物であって、ここで：

X は R<sup>2 5</sup> であり；

Y は -SR<sup>3 2</sup> または -N(R<sup>3 3</sup>)(R<sup>3 4</sup>) であり；

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、各々独立して、アルキルまたはハロアルキルであり；

R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> は、各々独立して、水素、ハロ、プソイドハロ、アルキルまたはハロア

ルキルであり；

$R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$  は、水素であり；そして

$R^{25}$ 、 $R^{32}$ 、 $R^{33}$  および  $R^{34}$  は、請求項 3 で記載されたとおりである、

化合物。

【請求項 5】

請求項 3 に記載の化合物であって、ここで：

X は  $R^{25}$  であり；

Y は  $-OR^{31}$  であり；

$R^1$  および  $R^2$  は、各々独立して、アルキルまたはハロアルキルであり；

$R^3$  および  $R^4$  は、各々独立して、水素、ハロ、プソイドハロ、アルキルまたはハロア

ルキルであり；

$R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$  は、水素であり；そして

$R^{25}$  および  $R^{31}$  は、請求項 3 で記載されたとおりである、

化合物。

【請求項 6】

$R^{25}$  が、群 (a) から選択される必要に応じて置換されているアルキルであり、そして

$R^{31}$  が、群 (b) から選択される必要に応じて置換されているアルキルである、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

$R^3$  および  $R^4$  は、各々独立して、ハロ、アルキルまたはハロアルキルである、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

請求項 7 に記載の化合物であって、該化合物は、以下：

3 - (4 - {1 - エチル - 1 - [4 - (3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブチル) - 3 - メチルフェニル] - プロピル} - 2 - メチルフェノキシ) - プロパン - 1, 2 (S) - ジオール；

3 - (4 - {1 - エチル - 1 - [4 - (3 - エチル - 3 - ヒドロキシペンチル) - 3 - メチルフェニル] - プロピル} - 2 - メチル - フェノキシ) - プロパン - 1, 2 (S) - ジオール；

3 - (4 - {1 - エチル - 1 - [4 - (3 - ヒドロキシ - 5 - メチルヘキシル) - 3 - メチルフェニル] - プロピル} - 2 - メチル - フェノキシ) - プロパン - 1, 2 (S) - ジオール；

3 - (4 - {1 - エチル - 1 - [4 - (3 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンチル) - 3 - メチルフェニル] - プロピル} - 2 - メチル - フェノキシ) - プロパン - 1, 2 (S) - ジオール；

3 - (2 - エチル - 4 - {1 - エチル - 1 - [4 - (3 - ヒドロキシ - 4, 4 - ジメチルペンチル) - 3 - メチルフェニル] - プロピル} - フェノキシ) - プロパン - 1, 2 (S) - ジオール；

3 - (4 - {1 - エチル - 1 - [4 - (3 - ヒドロキシ - 4, 4 - ジメチルペンチル) - 3 - メチルフェニル] - プロピル} - 2 - メチル - フェノキシ) - プロパン - 1, 2 (S) - ジオール；

3 - [4 - (1 - エチル - 1 - {4 - [3 (S) - ヒドロキシ - 4, 4 - ジメチルペンチル] - 3 - メチルフェニル} - プロピル) - 2 - メチル - フェノキシ] - プロパン - 1, 2 (S) - ジオール；および

3 - [4 - (1 - エチル - 1 - {4 - [3 (R) - ヒドロキシ - 4, 4 - ジメチルペンチル] - 3 - メチルフェニル} - プロピル) - 2 - メチル - フェノキシ] - プロパン - 1, 2 (S) - ジオール

からなる群より選択される、化合物。

【請求項 9】

$R^3$  が、水素またはハロであり、そして  $R^4$  が、アルキル、ハロまたはハロアルキルであ

る、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 10】

前記化合物が、3 - ( 4 - { 1 - エチル - 1 - [ 4 - ( 3 - ヒドロキシ - 4 , 4 - ジメチルペンチル ) - フェニル ] - プロピル } - 2 - メチルフェノキシ ) - プロパン - 1 , 2 ( S ) - ジオールである、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

$R^3$  が、アルキル、ハロまたはハロアルキルであり、そして  $R^4$  が、水素またはハロである、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 12】

前記化合物が、3 - ( 4 - { 1 - エチル - 1 - [ 4 - ( 3 - ヒドロキシ - 4 , 4 - ジメチル - ペンチル ) - 3 - メチル - フェニル ] - プロピル } - フェノキシ ) - プロパン - 1 , 2 ( S ) - ジオールである、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】

$R^{2\ 5}$  が、群 ( c ) または群 ( d ) から選択される必要に応じて置換されているアルケニルであり、 $R^{3\ 1}$  が、群 ( a ) または群 ( b ) から選択される必要に応じて置換されているアルキルである、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 14】

$R^3$  および  $R^4$  は、各々独立して、アルキルまたはハロアルキルである、請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 15】

以下：

( Z ) - 3 - ( 4 - { 1 - エチル - 1 - [ 4 - ( 3 - ヒドロキシ - 4 , 4 - ジメチルペンチ - 1 - エニル ) - 3 - メチルフェニル ] - プロピル } - 2 - メチルフェノキシ ) - プロパン - 1 , 2 ( S ) - ジオール；

( E ) - 3 - ( 4 - { 1 - エチル - 1 - [ 4 - ( 3 - ヒドロキシ - 4 , 4 - ジメチルペンチ - 1 - エニル ) - 3 - メチルフェニル ] - プロピル } - 2 - メチルフェノキシ ) - プロパン - 1 , 2 ( S ) - ジオール；および

( E ) - 3 - ( 4 - { 1 - エチル - 1 - [ 4 - ( 3 - エチル - 3 - ヒドロキシペンチ - 1 - エニル ) - 3 - メチルフェニル ] - プロピル } - 2 - メチルフェノキシ ) - プロパン - 1 , 2 ( S ) - ジオール

からなる群より選択される、請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 16】

$R^3$  が、アルキルまたはハロアルキルであり、そして  $R^4$  が水素またはハロである、請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 17】

$R^{2\ 5}$  が、群 ( e ) または群 ( f ) から選択される必要に応じて置換されているアルキニルであり、そして  $R^{3\ 1}$  が、群 ( a ) または群 ( b ) から選択される必要に応じて置換されているアルキルである、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 18】

$R^3$  および  $R^4$  が、各々独立して、アルキルまたはハロアルキルである、請求項 17 に記載の化合物。

【請求項 19】

以下：

3 - ( 4 - { 1 - エチル - 1 - [ 4 - ( 3 - ヒドロキシ - 4 , 4 - ジメチルペンチ - 1 - イニル ) - 3 - メチルフェニル ] - プロピル } - 2 - メチルフェノキシ ) - プロパン - 1 , 2 ( S ) - ジオール；

3 - ( 4 - { 1 - エチル - 1 - [ 4 - ( 3 ( R ) - ヒドロキシ - 4 , 4 - ジメチルペンチ - 1 - イニル ) - 3 - メチルフェニル ] - プロピル } - 2 - メチルフェノキシ ) - プロパン - 1 , 2 ( S ) - ジオール；

3 - ( 4 - { 1 - エチル - 1 - [ 4 - ( 3 ( S ) - ヒドロキシ - 4 , 4 - ジメチルペンチ

- 1 - イニル) - 3 - メチルフェニル] - プロピル} - 2 - メチルフェノキシ) - プロパン - 1, 2 (S) - ジオール; および  
 3 - ( 4 - { 1 - エチル - 1 - [ 4 - ( 3 - エチル - 3 - ヒドロキシペント - 1 - イニル ) - 3 - メチル - フェニル ] - プロピル } - 2 - メチルフェノキシ) - プロパン - 1, 2 (S) - ジオール

からなる群より選択される、請求項 18 に記載の化合物。

【請求項 20】

X が  $R^{2,5}$  であり;

Y が  $R^{3,0}$  であり; そして

$R^{2,5}$  および  $R^{3,0}$  が、請求項 1 で記載されたとおりである、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 21】

請求項 20 に記載の化合物であって、ここで:

$R^1$  および  $R^2$  は、各々独立して、必要に応じて置換されているアルキルまたはハロアルキルであり;

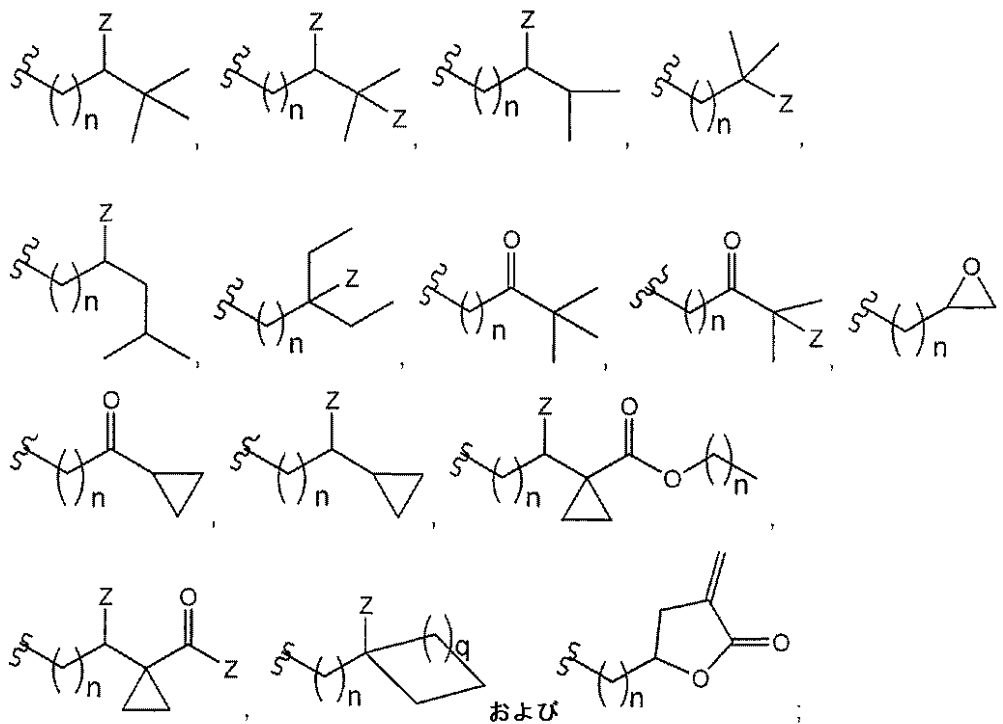
$R^3$  および  $R^4$  は、各々独立して、水素、ハロ、プソイドハロ、アルキルまたはハロアルキルであり;

$R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$  は、水素であり;

$R^{2,5}$  および  $R^{3,0}$  は、各々独立して、群 a) もしくは群 b) から選択される置換アルキル、群 c) もしくは群 d) から選択される置換アルケニル、または群 e) もしくは群 f) から選択される置換アルキニルであり;

群 (a) は、

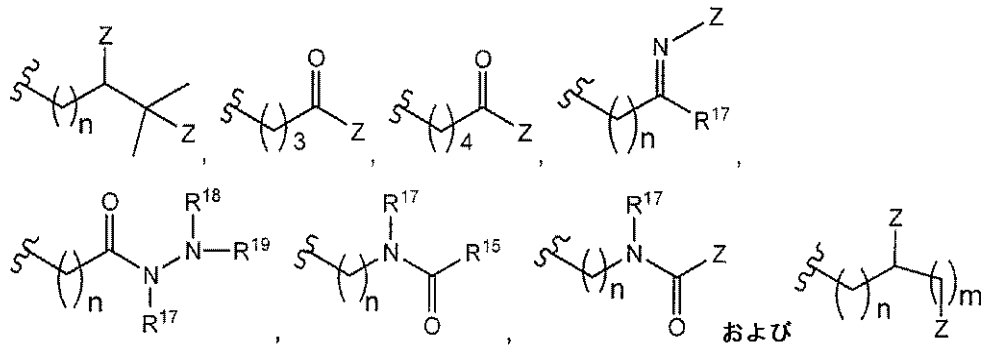
【化 13】



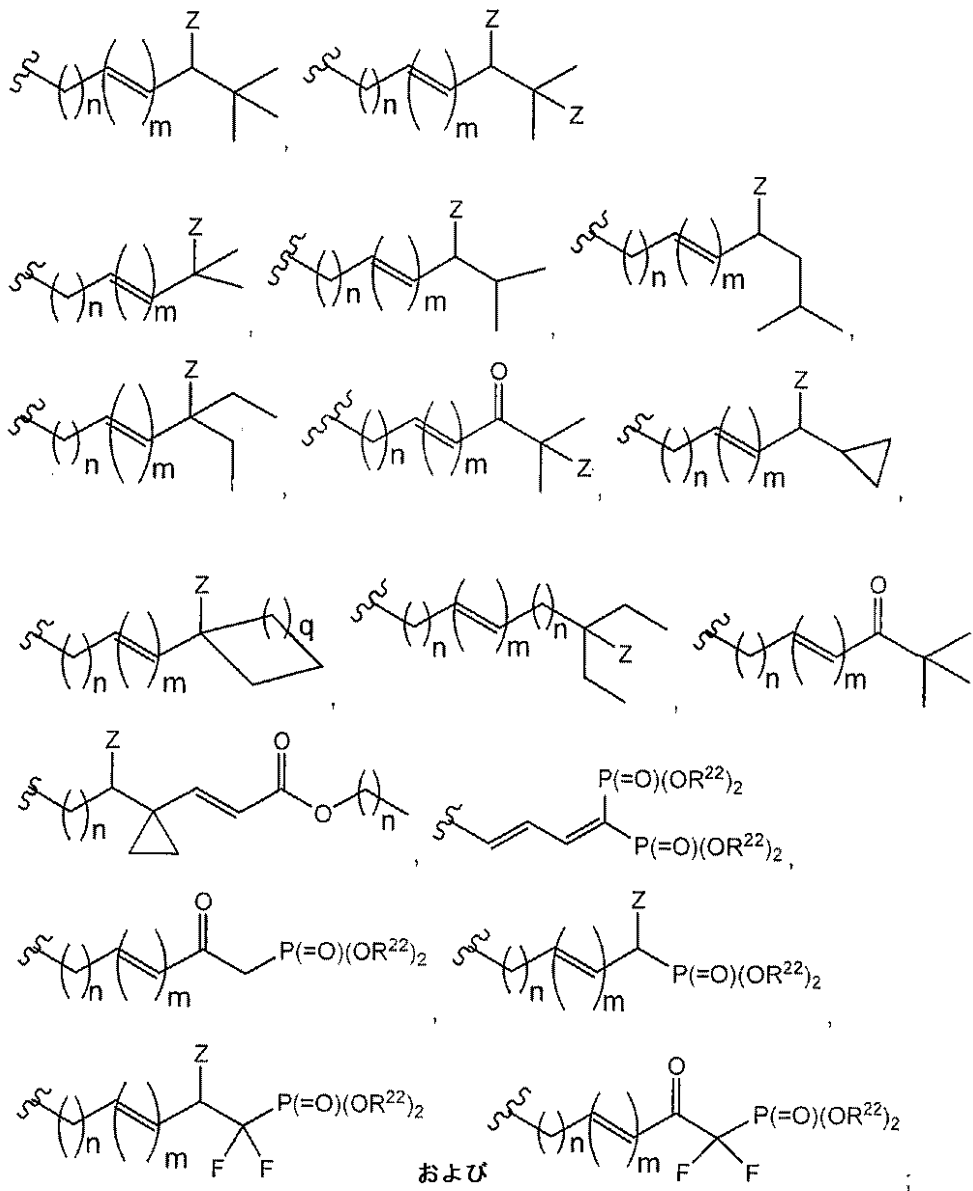
からなり、

群 (b) は、

## 【化14】

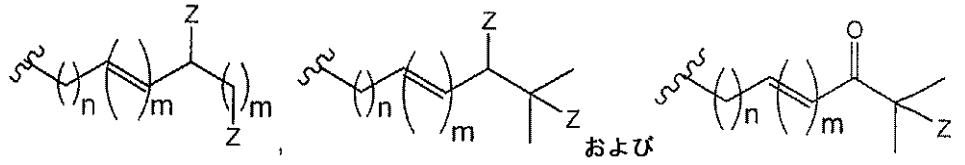


からなり、  
群(c)は、  
【化15】



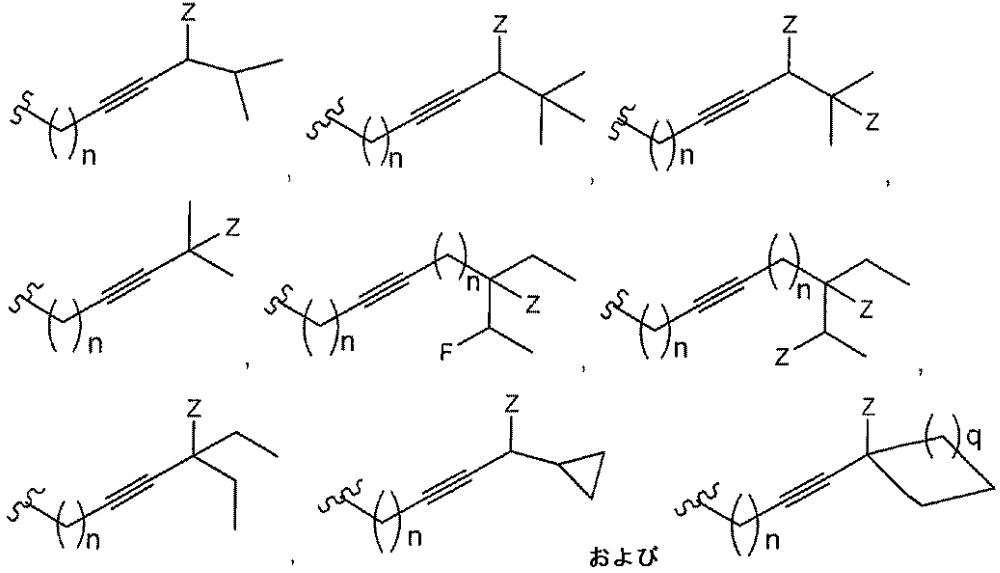
のシス立体配座およびトランス立体配座の両方からなり、  
群 ( d ) は、

【化 1 6】



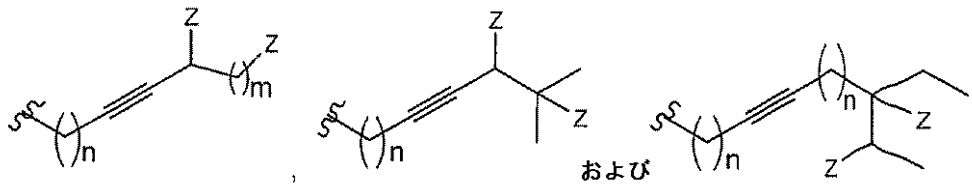
のシス立体配座およびトランス立体配座の両方からなり、  
群 ( e ) は、

【化 1 7】



からなり、  
群 ( f ) は、

【化 1 8】



からなり、

各 Z は、独立して、OH、OR、NH<sub>2</sub>、NHR、N(R)(R)であり、ここで R は、独立して、アルキルまたはハロアルキルであり；各 n は、独立して 0 ~ 4 の整数であり；各 m は、独立して、1 ~ 2 の整数であり、そして各 q は、独立して、0 ~ 4 の整数であり；

群 a)、b)、c)、d)、e)、f) および g) の任意の成員は、必要に応じてハロゲン化され得る、  
化合物。

【請求項 2 2】

R<sup>2 5</sup> は、群 a) から選択される必要に応じて置換されているアルキル、群 c) から選択される必要に応じて置換されているアルケニル、または群 e) から選択される必要に応じて置換されているアルキニルであり、そして R<sup>3 0</sup> は、群 b) から選択される必要に応じて置換されているアルキルである、請求項 2 1 に記載の化合物。

【請求項 2 3】

$R^3$  および  $R^4$  が、各々独立して、アルキルまたはハロアルキルである、請求項 22 に記載の化合物。

【請求項 24】

$R^3$  が、アルキルまたはハロアルキルであり、そして  $R^4$  が水素である、請求項 22 に記載の化合物。

【請求項 25】

請求項 1 に記載の化合物であって、ここで、

X は  $R^{2,5}$  であり；

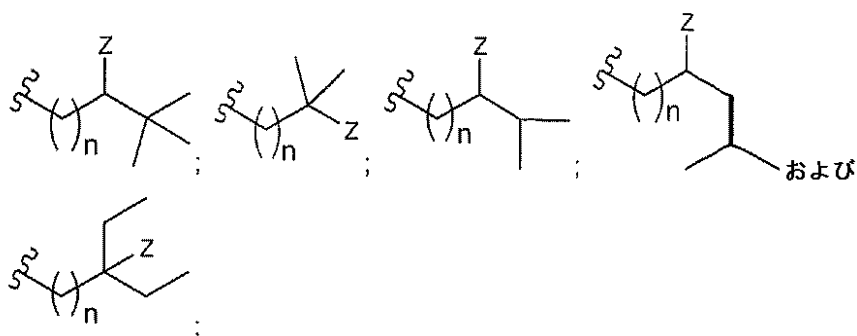
Y は  $-OR^{3,1}$  であり；

$R^1$  および  $R^2$  は、エチルであり；

$R^3$  および  $R^4$  は、メチルであり；

$R^{2,5}$  は、

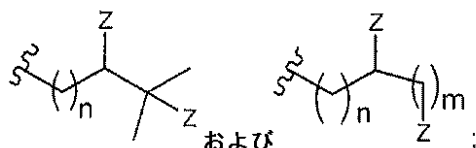
【化 19】



からなる群より選択され；そして

$R^{3,1}$  は、

【化 20】



からなる群より選択され、

各 Z は、独立して、OH、OR、 $NH_2$ 、NHR、 $N(R)(R)$  であり、ここで R は、独立して、アルキルまたはハロアルキルであり；各 n は、独立して、0 ~ 4 の整数であり、そして各 m は独立して、1 ~ 2 の整数である、化合物。

【請求項 26】

請求項 1 に記載の化合物であって、ここで：

X は  $R^{2,5}$  であり；

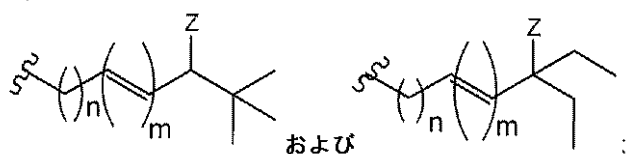
Y は  $-OR^{3,1}$  であり；

$R^1$  および  $R^2$  は、エチルであり；

$R^3$  および  $R^4$  は、メチルであり；

$R^{2,5}$  は、

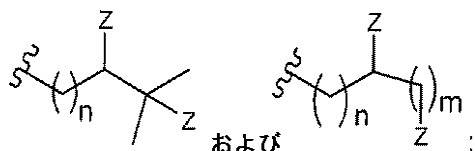
【化 21】



のシス立体配座およびトランス立体配座の両方からなる群より選択され；そして

$R^{3,1}$  は、

## 【化 2 2】



のシス立体配座およびトランス立体配座の両方からなる群より選択され；

各 Z は、独立して、OH、OR、NH<sub>2</sub>、NHR、N(R)(R)であり、ここで R は、独立して、アルキルまたはハロアルキルであり；各 n は、独立して、0 ~ 4 の整数であり、そして各 m は独立して、1 ~ 2 の整数である、化合物。

## 【請求項 27】

請求項 1 に記載の化合物であって、ここで：

X は R<sup>2 5</sup> であり；

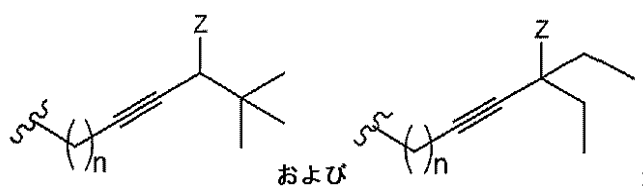
Y は -OR<sup>3 1</sup> であり；

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、エチルであり；

R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> は、メチルであり；

R<sup>2 5</sup> は、

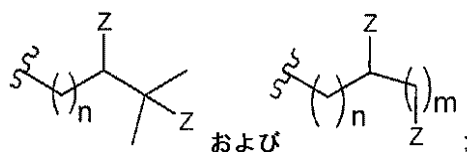
## 【化 2 3】



からなる群より選択され；そして

R<sup>3 1</sup> は、

## 【化 2 4】



からなる群より選択され、

各 Z は、独立して、OH、OR、NH<sub>2</sub>、NHR、N(R)(R)であり、ここで R は、独立して、アルキルまたはハロアルキルであり；各 n は、独立して、0 ~ 4 の整数であり、そして各 m は独立して、1 ~ 2 の整数である、化合物。

## 【請求項 28】

請求項 1 に記載の化合物と 1 種以上のさらなる成分とを含む薬学的組成物であって、該成分は、抗癌剤、抗自己免疫剤、副甲状腺ホルモン、カルシウム補充物、関節炎治療薬化合物、抗炎症化合物、マトリックスメタロプロテアーゼインヒビター、炎症誘発性サイトカインのインヒビター、NSAID、コルチコステロイド、COX-1 インヒビター、COX-2 インヒビター、アセトアミノフェンおよびイブプロフェンからなる群より選択される、薬学的組成物。

## 【請求項 29】

ビタミン D レセプター活性が関係している疾患または障害の 1 つ以上の症状を処置、予防または改善するための組成物であって、有効量の請求項 1 に記載の化合物を含有する、組成物。

## 【請求項 30】

前記疾患または障害が、副甲状腺機能亢進、腎不全、骨軟化症、腸管吸収不良症候群、骨粗しょう症、アルツハイマー病、高増殖性皮膚病、乾癬、かゆみ、ざ瘡および脂漏性皮膚

炎からなる群より選択される、請求項 29 に記載の組成物。

【請求項 31】

乳癌大腸癌、前立腺癌、卵巣癌、脳グリア腫瘍、扁平上皮癌、卵巣癌、骨髄性白血病、骨肉腫；骨髄線維症および黒色腫の 1 つ以上の症状を処置、予防または改善するための組成物であって、有効量の請求項 1 に記載の化合物を含有する、組成物。

【請求項 32】

請求項 31 に記載の組成物であって、5 - フルオロ - ウラシル、メトトレキサート、フルダラビン、微小管阻害剤、ビンクリスチン、ビンブラスチン、タキサン類、パクリタキセル、ドセタキセル、アルキル化剤、シクロファスファミド、メルファラン、バイオコロエチルイトロスウレア、ヒドロキシ尿素、白金剤、シスプラチン、カルボプラチン、オキサリプラチン、JM - 216、CI - 973、アントラサイクリン類、ドキソルピシン、ダウノルピシン、抗生物質類、マイトマイシン、イダルピシン、アドリアマイシン、ダウノマイシン)、トポイソメラーゼインヒビター類、エトポシド、カンプトテシン類、または任意の他の細胞傷害性因子、エストラムスチンリン酸塩、プレドニムスチン、ステロイド類、抗ステロイド類、エストロゲン類、抗エストロゲン類、アンドロゲン類、抗アンドロゲン類、糖質コルチコイド類およびデキサメタゾンを含む群より選択される 1 種のさらなる活性成分を含有する、組成物。

【請求項 33】

請求項 32 に記載の組成物であって、化学療法または放射線療法と組み合わせた使用に適する、組成物。