

【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8月3日(2006.8.3)

【公表番号】特表2002-516865(P2002-516865A)  
 【公表日】平成14年6月11日(2002.6.11)  
 【出願番号】特願2000-551779(P2000-551779)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 498/22 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/553 (2006.01)**  
**A 6 1 P 9/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 9/10 (2006.01)**  
**A 6 1 P 11/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 13/08 (2006.01)**  
**A 6 1 P 15/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 17/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 17/06 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/08 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/14 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/16 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/28 (2006.01)**  
**A 6 1 P 27/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 29/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 35/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 D 498/22  
 A 6 1 K 31/553  
 A 6 1 P 9/00  
 A 6 1 P 9/10  
 A 6 1 P 11/00  
 A 6 1 P 13/08  
 A 6 1 P 15/00  
 A 6 1 P 17/02  
 A 6 1 P 17/06  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 25/08  
 A 6 1 P 25/14  
 A 6 1 P 25/16  
 A 6 1 P 25/28  
 A 6 1 P 27/02  
 A 6 1 P 29/00 1 0 1  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 43/00  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成18年6月1日(2006.6.1)

【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

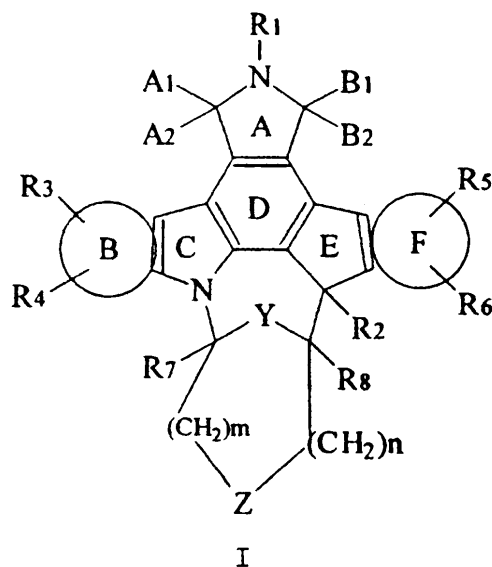
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 式 I で表される化合物：

【化1】



式中：

環 B 及び環 F は、独立して、そして各々それらが結合している炭素原子と一緒にあって、  
a) 1 ~ 3 個の炭素原子が窒素原子で置換されていてもよい不飽和の 6 員の炭素環式芳香環；

b) 不飽和の 5 員の炭素環式芳香環；及び

c) 1) 1 個の炭素原子が酸素、窒素もしくは硫黄原子で置換されているか；

2) 2 個の炭素原子が硫黄と窒素原子、酸素と窒素原子もしくは 2 個の窒素原子で置換されているか；または

3) 3 個の炭素原子が 3 個の窒素原子で置換されているいずれかの不飽和の 5 員の炭素環式芳香環；

よりなる群から選択され；

R<sub>1</sub> は、

a) H、1 ~ 4 個の炭素を有する置換されたもしくは未置換のアルキル、置換されたもしくは未置換のアリール、置換されたもしくは未置換のアリールアルキル、置換されたもしくは未置換のヘテロアリールまたは置換されたもしくは未置換のヘテロアリールアルキル；

b) - C(=O)R<sup>9</sup>、ここで、R<sup>9</sup> はアルキル、アリール及びヘテロアリールよりなる群から選択される；

c) - OR<sup>10</sup>、ここで、R<sup>10</sup> は H 及び 1 ~ 4 個の炭素を有するアルキルよりなる群から選択される；

d) - C(=O)NH<sub>2</sub>、- NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>、- (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>、- (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OR<sup>10</sup>、- O(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OR<sup>10</sup> 及び - O(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>、ここで、p は 1 ~ 4 であり；そして 1) R<sup>11</sup> 及び R<sup>12</sup> は各々独立して H 及び 1 ~ 4 個の炭素を有するアルキルよりなる群から選択されるか；または

2) R<sup>11</sup> 及び R<sup>12</sup> は一緒になって式 - (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub> - X<sup>1</sup> - (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub> - の連結基を形成し、ここで、X<sup>1</sup> は - O -、- S - 及び - CH<sub>2</sub> - よりなる群から選択される；

よりなる群から選択され；

$R^2$ はH、1～4個の炭素を有するアルキル、-OH、1～4個の炭素を有するアルコキシ、 $-OC(=O)R^9$ 、 $-OC(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-O(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$ 、 $-O(CH_2)_pOR^{10}$ 、6～10個の炭素を有する置換されたまたは未置換のアリールアルキル及び置換されたまたは未置換のヘテロアリールアルキルよりなる群から選択され；

$R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 及び $R^6$ は各々独立して、

a) H、アリール、ヘテロアリール、F、Cl、Br、I、-CN、 $CF_3$ 、 $-NO_2$ 、-OH、 $-OR^9$ 、 $-O(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$ 、 $-OC(=O)R^9$ 、 $-OC(=O)NR^2R^7$ 、 $-OC(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-O(CH_2)_pOR^{10}$ 、 $-CH_2OR^{10}$ 、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-NR^{10}S(=O)_2R^9$ 、 $-NR^{10}C(=O)R^9$ ；

b)  $-CH_2OR^{14}$ 、ここで、 $R^{14}$ はカルボキシル基のヒドロキシル基が除かれた後のアミノ酸の残基である；

c)  $-NR^{10}C(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-C(=O)R^2$ 、 $-C(=O)NR^1R^{12}$ 、 $-CH=NOR^2$ 、 $-CH=NR^9$ 、 $-(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$ 、 $-(CH_2)_pNHR^{14}$ または $-CH=NNR^2R^{2A}$ 、ここで、 $R^{2A}$ は $R^2$ と同じである；

d)  $-S(O)_yR^2$ 、 $-(CH_2)_pS(O)_yR^9$ 、 $-CH_2S(O)_yR^{14}$ 、ここで、 $y$ は0、1または2である；

e) 1～8個の炭素を有するアルキル、2～8個の炭素を有するアルケニル及び2～8個の炭素を有するアルキニル、ここで、

1) 各アルキル、アルケニルもしくはアルキニル基は未置換であるか；または

2) 各アルキル、アルケニルもしくはアルキニル基は、6～10個の炭素を有するアリール、ヘテロアリール、アリールアルコキシ、ヘテロシクロアルコキシ、ヒドロキシアルコキシ、アルキルオキシ-アルコキシ、ヒドロキシアルキルチオ、アルコキシ-アルキルチオ、F、Cl、Br、I、-CN、 $-NO_2$ 、-OH、 $-OR^9$ 、 $-X^2(CH_2)_pNR^1R^{12}$ 、 $-X^2(CH_2)_pC(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-X^2(CH_2)_pOC(=O)NR^{11}R^1$ 、 $-X^2(CH_2)_pCO_2R^9$ 、 $-X^2(CH_2)_pS(O)_yR^9$ 、 $-X^2(CH_2)_pNR^{10}C(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-OC(=O)R^9$ 、 $-OCONHR^2$ 、 $-O$ -テトラヒドロピラニル、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-NR^{10}C(=O)R^9$ 、 $-NR^{10}CO_2R^9$ 、 $-NR^{10}C(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-NHC(=NH)NH_2$ 、 $NR^{10}S(O)_2R^9$ 、 $-S(O)_yR^9$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-C(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-C(=O)R^2$ 、 $-CH_2OR^{10}$ 、 $-CH=NNR^2R^{2A}$ 、 $-CH=NOR^2$ 、 $-CH=NR^9$ 、 $-CH=NNHCH(N=NH)NH_2$ 、 $-S(=O)_2NR^2R^{2A}$ 、 $-P(=O)(OR^{10})_2$ 、 $-OR^{14}$ 及び5～7個の炭素を有する単糖よりなる群から選択される1～3個の基で置換されており、ここで、単糖の各ヒドロキシル基は独立して未置換であるかまたはH、1～4個の炭素を有するアルキル、2～5個の炭素を有するアルキルカルボニルオキシもしくは1～4個の炭素を有するアルコキシで置換されており；

$X^2$ はO、Sまたは $NR^{10}$ である；

よりなる群から選択され；

$R^7$ 及び $R^8$ は各々独立してH、1～4個の炭素を有するアルキル、1～4個の炭素を有するアルコキシ、6～10個の炭素を有する置換されたもしくは未置換のアリールアルキル、置換されたもしくは未置換のヘテロアリールアルキル、 $-(CH_2)_pOR^{10}$ 、 $-(CH_2)_pOC(=O)NR^{11}R^{12}$ 及び $-(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$ よりなる群から選択されるか；または $R^7$ 及び $R^8$ は一緒になって式 $-CH_2-X^3-CH_2-$ の連結基を形成し、ここで、 $X^3$ は $X^2$ または結合であり；

$m$ 及び $n$ は各々独立して0、1または2であり；

$Y$ は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-N(R^{10})-$ 、 $-N^+(O^-)(R^{10})-$ 、 $-N(OR^{10})-$ 及び $-CH_2-$ よりなる群から選択され；

$Z$ は結合、 $-O-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-S-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-CH(OR^{10})-$ 、 $-N(R^{10})-$ 、 $-N(OR^{10})-$ 、 $CH(NR^{11}R^{12})-$ 、 $-C(=O)N(R^{17})-$ 、 $-N(R^{17})C(=O)-$ 、 $-N(S(O)_yR^9)-$ 、 $-N(S(O)_yNR^{11}R^{12})-$

、 $-N(C(=O)R^{17})-$ 、 $-C(R^{15}R^{16})-$ 、 $-N^+(O^-)(R^{10})-$ 、 $-CH(OH)-CH(OH)-$ 及び $-CH(O(C=O)R^9)CH(OC(=O)R^{9A})-$ よりなる群から選択され、ここで、 $R^{9A}$ は $R^9$ と同じであり；

$R^{15}$ 及び $R^{16}$ は独立して $H$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)R^{10}$ 、 $-O(C=O)R^9$ 、ヒドロキシアルキル及び $-CO_2R^{10}$ よりなる群から選択され；

$R^{17}$ は $H$ 、アルキル、アリール及びヘテロアリールよりなる群から選択され；

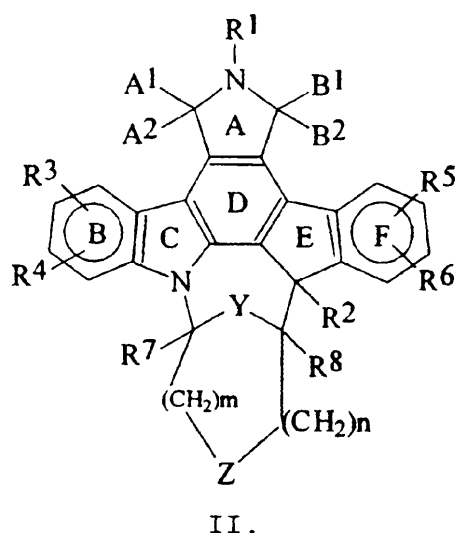
$A^1$ 及び $A^2$ は $H$ 、 $H$ ； $H$ 、 $OR^2$ ； $H$ 、 $-SR^2$ ； $H$ 、 $-N(R^2)_2$ ；並びに $A^1$ と $A^2$ が一緒になって $=O$ 、 $=S$ 及び $=NR^2$ よりなる群から選択される成分を形成する基よりなる群から選択され；

$B^1$ 及び $B^2$ は $H$ 、 $H$ ； $H$ 、 $-OR^2$ ； $H$ 、 $-SR^2$ ； $H$ 、 $-N(R^2)_2$ ；並びに $B^1$ と $B^2$ が一緒になって $=O$ 、 $=S$ 及び $=NR^2$ よりなる群から選択される成分を形成する基よりなる群から選択され；

ただし、対 $A^1$ 及び $A^2$ または $B^1$ 及び $B^2$ の少なくとも1つは $=O$ を形成する。

【請求項2】 式：

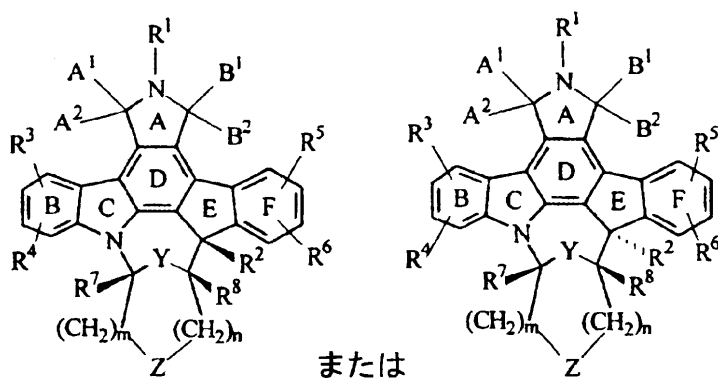
【化2】



で表される請求項1記載の化合物。

【請求項3】 式：

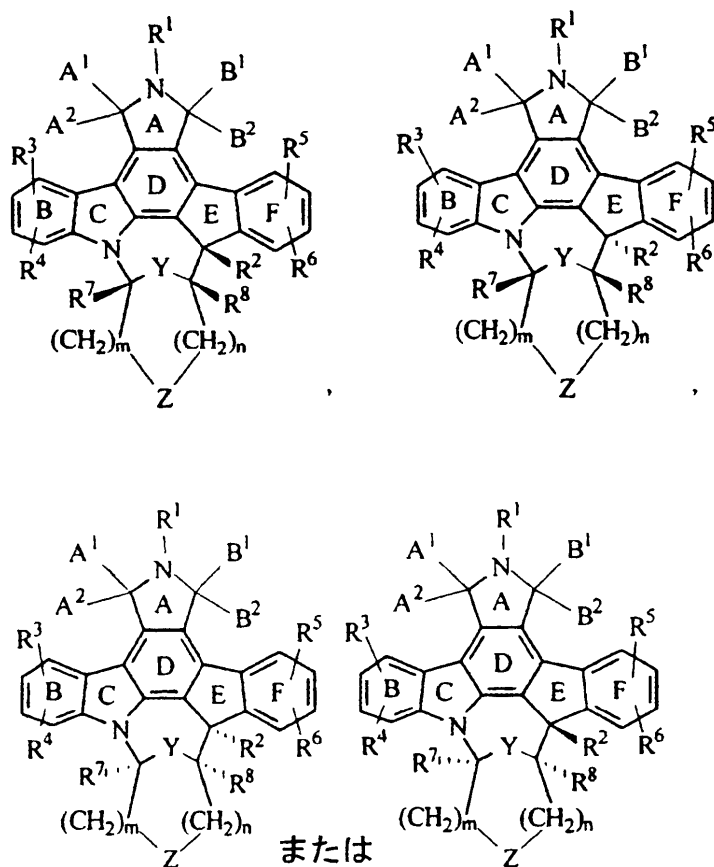
【化3】



のジアステレオマーである請求項2記載の化合物。

【請求項4】 式：

【化4】



の鏡像異性体である請求項 2 記載の化合物。

【請求項 5】  $R^1$  が H である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 6】  $R^2$  が H、ヒドロキシルまたは置換されたもしくは未置換のアルキルである請求項 1 記載の化合物。

【請求項 7】  $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  及び  $R^6$  が独立して H、置換されたもしくは未置換のアルキル、ハロゲン、置換されたもしくは未置換のアルコキシ、置換されたもしくは未置換のアミノまたは置換されたもしくは未置換のアリールである請求項 1 の化合物。

【請求項 8】  $R^7$  及び  $R^8$  が独立して H または置換されたもしくは未置換のアルキルである請求項 1 記載の化合物。

【請求項 9】 Y が O である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 10】 Z が結合、O、S または置換されたもしくは未置換の N である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 11】 m 及び n が独立して 1 または 2 である請求項 1 記載の化合物。

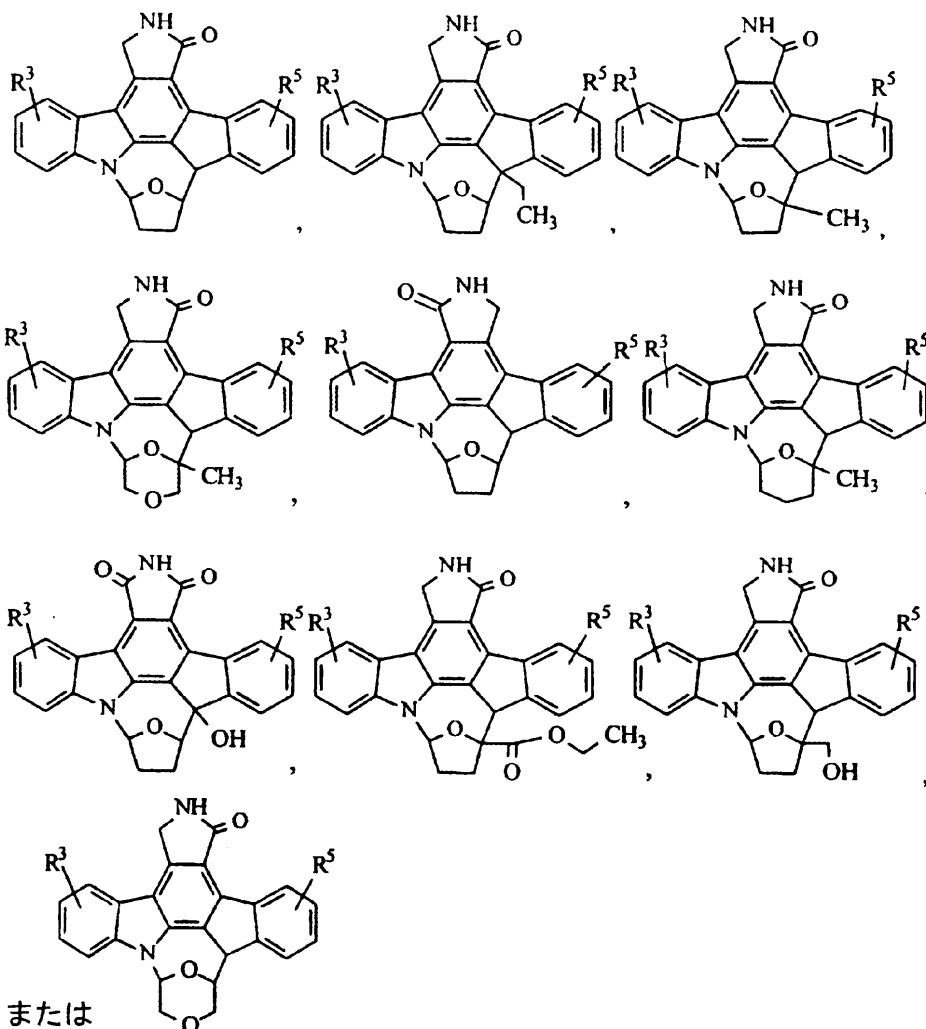
【請求項 12】 Y が O であり、Z が結合または O であり、そして m 及び n が独立して 1 または 2 である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 13】  $A^1 A^2$  及び  $B^1 B^2$  が独立して = O または H, H である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 14】  $R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^6$  及び  $R^7$  が各々 H であり、Y が O であり、n が 1 であり、 $A^1 A^2$  及び  $B^1 B^2$  が独立して = O または H, H であり、 $R^2$  が H、OH または低級アルキルであり、 $R^3$  が H または置換されたアルキルであり、 $R^5$  及び  $R^8$  が独立して H またはアルコキシであり、Z が結合または O であり、そして m が 1 または 2 である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 15】 下記式のいずれかで表される化合物：

【化 5】



上記式中、 $R^3$ 及び $R^5$ は、各々独立して、

a)  $H$ 、アリール、ヘテロアリール、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $-CN$ 、 $CF_3$ 、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $-OR^9$ 、 $-O(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$ 、 $-OC(=O)R^9$ 、 $-OC(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-OC(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-O(CH_2)_pOR^{10}$ 、 $-CH_2OR^{10}$ 、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-NR^{10}S(=O)_2R^9$ 、 $-NR^{10}C(=O)R^9$ ；

b)  $-CH_2OR^{14}$ ；

c)  $-NR^{10}C(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-C(=O)R^2$ 、 $-C(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-CH=NOR^2$ 、 $-CH=NR^9$ 、 $-(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$ 、 $-(CH_2)_pNH$ 、 $R^{14}$ または $-CH=NNR^2R^{2A}$ 、ここで、 $R^{2A}$ は $R^2$ と同じである；

d)  $-S(O)_yR^2$ 、 $-(CH_2)_pS(O)_yR^9$ 、 $-CH_2S(O)_yR^{14}$ 、ここで、 $y$ は0、1または2である；

e) 1～8個の炭素を有するアルキル、2～8個の炭素を有するアルケニル及び2～8個の炭素を有するアルキニル、ここで、

1) 各アルキル、アルケニルもしくはアルキニル基は未置換であるか；または

2) 各アルキル、アルケニルもしくはアルキニル基は、6～10個の炭素を有するアリール、ヘテロアリール、アリールアルコキシ、ヘテロシクロアルコキシ、ヒドロキシアルコキシ、アルキルオキシ-アルコキシ、ヒドロキシアルキルチオ、アルコキシ-アルキルチオ、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $-OR^9$ 、 $-X^2(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$ 、 $-X^2(CH_2)_pC(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-X^2(CH_2)_pOC(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-X^2(CH_2)_pCO_2R^9$ 、 $-X^2(CH_2)_pS(O)_yR^9$ 、 $-X^2(CH_2)_pNR^{10}C(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-OC(=O)R^9$ 、 $-OCONHR^2$ 、 $-O$ -テトラヒドロピラニ

ル、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-NR^{10}C(=O)R^9$ 、 $-NR^{10}CO_2R^9$ 、 $-NR^{10}C(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-NHC(=NH)NH_2$ 、 $NR^{10}S(O)_2R^9$ 、 $-S(O)_yR^9$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-C(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-C(=O)R^2$ 、 $-CH_2OR^{10}$ 、 $-CH=NNR^2R^{2A}$ 、 $-CH=NOR^2$ 、 $-CH=NR^9$ 、 $-CH=NNHCH(N=NH)NH_2$ 、 $-S(=O)_2NR^2R^{2A}$ 、 $-P(=O)(OR^{10})_2$ 、 $-OR^{14}$ 及び5～7個の炭素を有する単糖よりなる群から選択される1～3個の基で置換されており、ここで、単糖の各ヒドロキシル基は独立して未置換であるかまたはH、1～4個の炭素を有するアルキル、2～5個の炭素を有するアルキルカルボニルオキシもしくは1～4個の炭素を有するアルコキシで置換されており；かつ、上記において、

$R^2$ はH、1～4個の炭素を有するアルキル、 $-OH$ 、1～4個の炭素を有するアルコキシ、 $-OC(=O)R^9$ 、 $-OC(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-O(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$ 、 $-O(CH_2)_pOR^{10}$ 、6～10個の炭素を有する置換されたまたは未置換のアリールアルキル及び置換されたまたは未置換のヘテロアリールアルキルよりなる群から選択され；

$R^7$ はH、1～4個の炭素を有するアルキル、1～4個の炭素を有するアルコキシ、6～10個の炭素を有する置換されたもしくは未置換のアリールアルキル、置換されたもしくは未置換のヘテロアリールアルキル、 $-(CH_2)_pOR^{10}$ 、 $-(CH_2)_pOC(=O)NR^{11}R^{12}$ 及び $-(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$ よりなる群から選択され；

$R^9$ はアルキル、アリール及びヘテロアリールよりなる群から選択され；

$R^{10}$ はH及び1～4個の炭素を有するアルキルよりなる群から選択され；

$R^{11}$ 及び $R^{12}$ は各々独立してH及び1～4個の炭素を有するアルキルよりなる群から選択されるか；または $R^{11}$ 及び $R^{12}$ は一緒になって式 $-(CH_2)_2-X^1-(CH_2)_2-$ の連結基を形成し、ここで、 $X^1$ は $-O-$ 、 $-S-$ 及び $-CH_2-$ よりなる群から選択され；

$R^{14}$ はカルボキシル基のヒドロキシル基が除かれた後のアミノ酸の残基よりなる群から選択され；そして

$X^2$ はO、Sまたは $NR^{10}$ である。

【請求項16】  $R^3$ 及び $R^5$ が各々独立して、

a) H、ヘテロアリール、F、Br、 $-CN$ 、 $CF_3$ 、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $-OR^9$ 、 $-O(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$ 、 $-OC(=O)R^9$ 、 $-OC(=O)NR^2R^7$ 、 $-OC(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-O(CH_2)_pOR^{10}$ 、 $-CH_2OR^{10}$ 、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-NR^{10}S(=O)_2R^9$ 、 $-NR^{10}C(=O)R^9$ ；

c)  $-NR^{10}C(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-C(=O)R^2$ 、 $-C(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-CH=NOR^2$ 、 $-CH=NR^9$ 、 $-(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$ 、 $-(CH_2)_pNHR^{14}$ ；

d)  $-S(O)_yR^2-(CH_2)_pS(O)_yR^9$ 、 $-CH_2S(O)_yR^{14}$ 、ここで、yは0、1または2である；及び

e) 1～8個の炭素を有するアルキル、2～8個の炭素を有するアルケニル及び2～8個の炭素を有するアルキニル、ここで、

1) 各アルキル、アルケニルもしくはアルキニル基は未置換であるか；または

2) 各アルキル、アルケニルもしくはアルキニル基は、6～10個の炭素を有するアリール、ヘテロアリール、アリールアルコキシ、ヘテロシクロアルコキシ、ヒドロキシアルコキシ、アルキルオキシ-アルコキシ、ヒドロキシアルキルチオ、アルコキシ-アルキルチオ、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $-OR^9$ 、 $-X^2(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$ 、 $-X^2(CH_2)_pC(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-X^2(CH_2)_pOC(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-X^2(CH_2)_pCO_2R^9$ 、 $-X^2(CH_2)_pS(O)_yR^9$ 、 $-X^2(CH_2)_pNR^{10}C(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-OC(=O)R^9$ 、 $-OCONHR^2$ 、 $-O$ -テトラヒドロピラニル、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-NR^{10}C(=O)R^9$ 、 $-NR^{10}CO_2R^9$ 、 $-NR^{10}C(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-NHC(=NH)NH_2$ 、 $NR^{10}S(O)_2R^9$ 、 $-S(O)_yR^9$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-C(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-C(=O)R^2$ 、 $-CH_2OR^{10}$ 、 $-CH=NR^9$ 、 $-S(=O)_2NR^2R^{2A}$ 、 $-OR^{14}$ 及び5～7個の炭素を有する単糖よりなる群から選択される1～3個の基で置換されており、ここで、単糖の各ヒドロキシル基は独立して未置換であ

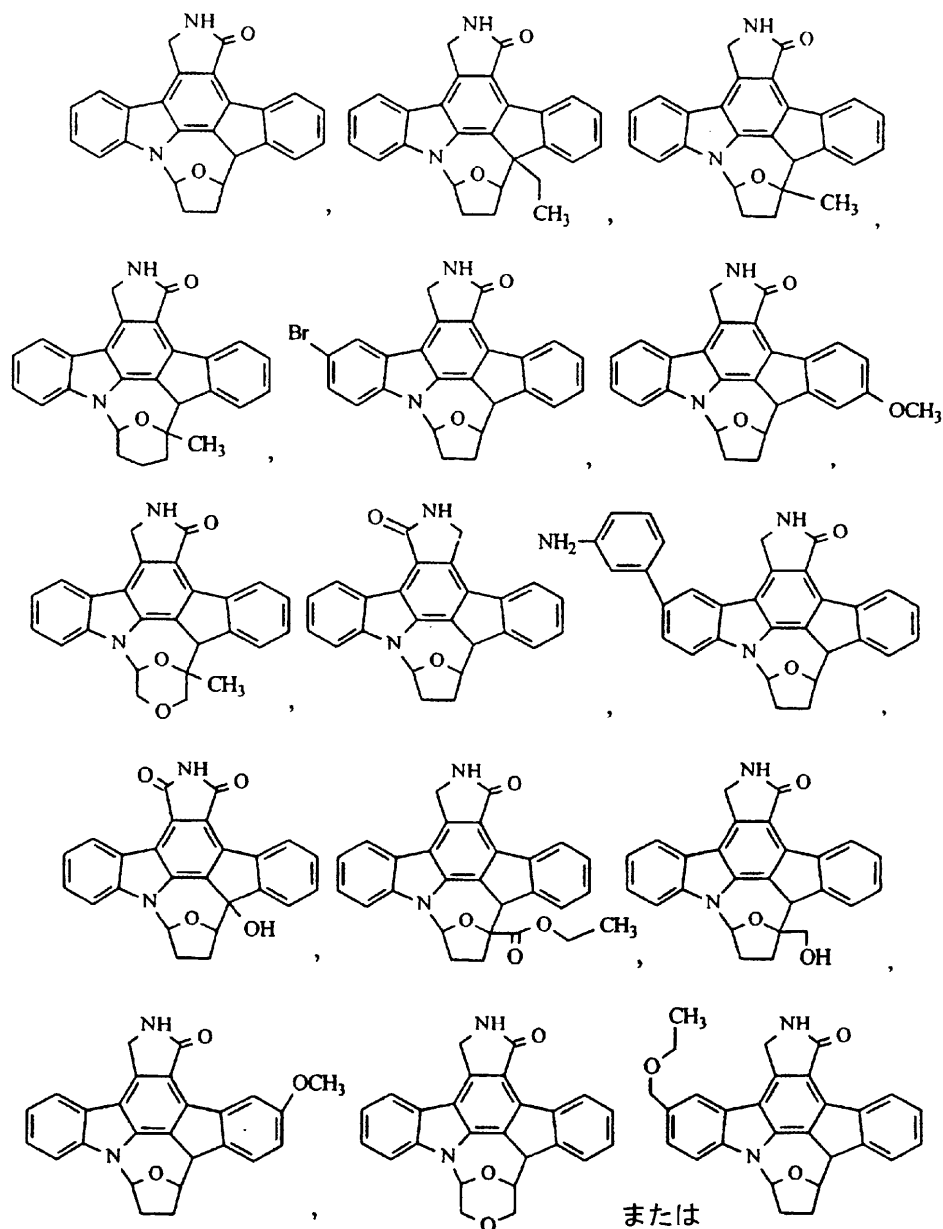
るかまたはH、1～4個の炭素を有するアルキル、2～5個の炭素を有するアルキルカルボニルオキシもしくは1～4個の炭素を有するアルコキシで置換されている：

よりなる群から選択される請求項15記載の化合物。

【請求項17】  $R^5$ が独立してH、 $-OR^9$ 、 $-O(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$ 、 $-OC(=O)R^9$ 、 $-OC(=O)NR^2R^7$ 、 $-OC(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-O(CH_2)_pOR^{10}$ 、 $-CH_2OR^{10}$ 、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-NR^{10}S(=O)_2R^9$ 、 $-NR^{10}C(=O)R^9$ 、 $-C(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$ 、 $-S(O)_yR^2-(CH_2)_pS(O)_yR^9$ 及び $-CH_2S(O)_yR^{14}$ よりなる群から選択され、ここで、 $y$ が0、1または2である請求項16記載の化合物。

【請求項18】 式：

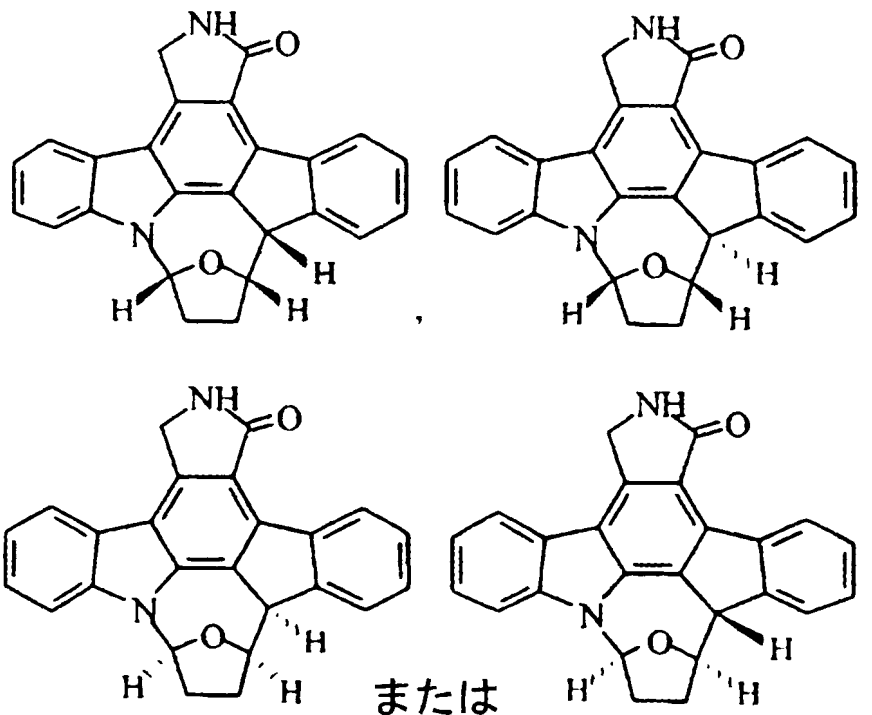
【化6】



で表される請求項17記載の化合物。

【請求項19】 式：

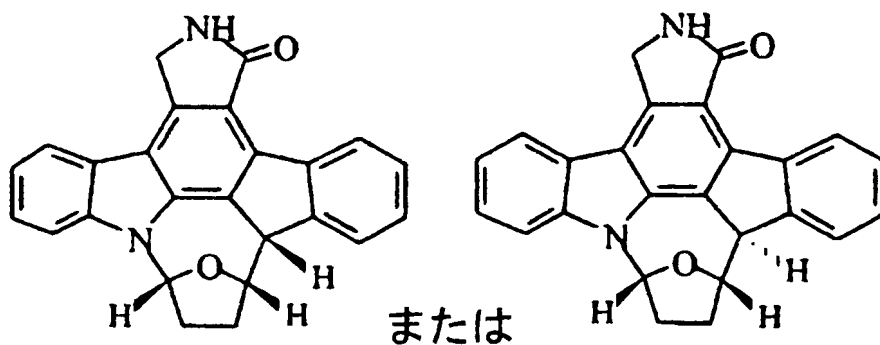
【化7】



の鏡像異性体である請求項 1 8 記載の化合物。

【請求項 2 0】 式：

【化 8】



のジアステレオマーである請求項 1 8 記載の化合物。

【請求項 2 1】 請求項 1 または請求項 1 5 記載の化合物及び製薬学的に許容しうる担体を含んでなる製薬学的組成物。

【請求項 2 2】 請求項 1 8 記載の化合物及び製薬学的に許容しうる担体を含んでなる製薬学的組成物。

【請求項 2 3】 請求項 1 または請求項 1 5 記載の化合物及び製薬学的に許容しうる担体を含んでなる前立腺疾患を処置するかまたは予防するための製薬学的組成物。

【請求項 2 4】 前立腺疾患が前立腺癌または前立腺肥大症である請求項 2 3 記載の製薬学的組成物。

【請求項 2 5】 請求項 1 または請求項 1 5 記載の化合物及び製薬学的に許容しうる担体を含んでなる血管形成性疾患を処置するかまたは予防するための製薬学的組成物。

【請求項 2 6】 血管形成性疾患が充実性腫瘍の癌、子宮内膜症、糖尿病性網膜症、

乾癬、血管芽細胞腫、眼病または黄斑変性症である請求項 25 の製薬学的組成物。

【請求項 27】 請求項 1 または請求項 15 記載の化合物及び製薬学的に許容しうる担体を含んでなる腫瘍形成、慢性関節リウマチ、肺線維症、骨髄線維症、異常な創傷治癒、アテローム性動脈硬化症または再狭窄を処置するかまたは予防するための製薬学的組成物。

【請求項 28】 請求項 1 または請求項 15 記載の化合物及び製薬学的に許容しうる担体を含んでなるアルツハイマー病、筋萎縮性側索硬化症、パーキンソン病、脳卒中、虚血、ハンチントン病、エイズ痴呆症、癲癇、多発性硬化症、末梢ニューロパシーまたは脳もしくは脊髄の損傷を処置するかまたは予防するための製薬学的組成物。

【請求項 29】 請求項 1 または請求項 15 記載の化合物の t r k キナーゼ活性の阻害剤を提供するための使用。

【請求項 30】 t r k キナーゼが t r k A である請求項 29 記載の使用。

【請求項 31】 t r k キナーゼ活性の阻害剤が炎症を処置ものである請求項 29 記載の使用。

【請求項 32】 請求項 1 または請求項 15 記載の化合物の前立腺疾患の処置または予防用の製薬学的製剤を製造するための使用。

【請求項 33】 前立腺疾患が前立腺癌または前立腺肥大症である請求項 32 記載の使用。

【請求項 34】 請求項 1 または請求項 15 記載の化合物の血管形成性疾患の処置または予防用の製薬学的製剤を製造するための使用。

【請求項 35】 血管形成性疾患が充実性腫瘍の癌、子宮内膜症、糖尿病性網膜症、乾癬、血管芽細胞腫、眼病または黄斑変性症である請求項 34 記載の使用。

【請求項 36】 請求項 1 または請求項 15 記載の化合物の P D G F R 活性が病的症状の一因となる疾患の処置または予防用の製薬学的製剤を製造するための使用。

【請求項 37】 請求項 1 または請求項 15 記載の化合物の腫瘍形成、慢性関節リウマチ、肺線維症、骨髄線維症、異常な創傷治癒、アテローム性動脈硬化症または再狭窄の処置または予防用の製薬学的製剤を製造するための使用。

【請求項 38】 請求項 1 または請求項 15 記載の化合物の栄養因子応答細胞の異常な活性を特徴とする疾患の処置または予防用の製薬学的製剤を製造するための使用。

【請求項 39】 請求項 1 または請求項 15 記載の化合物のアルツハイマー病、筋萎縮性側索硬化症、パーキンソン病、脳卒中、虚血、ハンチントン病、エイズ痴呆症、癲癇、多発性硬化症、末梢ニューロパシーまたは脳もしくは脊髄の損傷の処置または予防用の製薬学的製剤を製造するための使用。