

【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21年9月10日(2009.9.10)

【公表番号】特表2009-505960(P2009-505960A)

【公表日】平成21年2月12日(2009.2.12)

【年通号数】公開・登録公報2009-006

【出願番号】特願2008-524052(P2008-524052)

【国際特許分類】

C 07 D 249/06	(2006.01)
A 61 K 31/4192	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
C 07 D 405/04	(2006.01)
C 07 D 401/10	(2006.01)
A 61 K 31/4439	(2006.01)
A 61 K 31/4709	(2006.01)
A 61 K 31/4725	(2006.01)
C 07 D 403/04	(2006.01)
C 07 D 413/10	(2006.01)
A 61 K 31/422	(2006.01)
C 07 D 401/04	(2006.01)
A 61 K 31/501	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
C 07 D 405/14	(2006.01)
A 61 K 38/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 249/06	5 0 1
A 61 K 31/4192	
A 61 P 43/00	1 2 3
A 61 P 35/00	
C 07 D 405/04	C S P
C 07 D 401/10	
A 61 K 31/4439	
A 61 K 31/4709	
A 61 K 31/4725	
C 07 D 403/04	
C 07 D 413/10	
A 61 K 31/422	
C 07 D 401/04	
A 61 K 31/501	
A 61 K 31/506	
C 07 D 405/14	
A 61 K 37/02	

【手続補正書】

【提出日】平成21年7月23日(2009.7.23)

【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

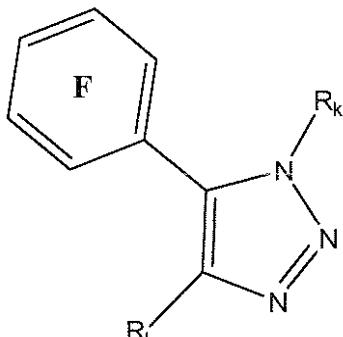
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式(i)～(vii)からなる群より選択される有効量の化合物を細胞に接触させるステップを含む、細胞中のチューブリンポリマー化を抑制する方法：

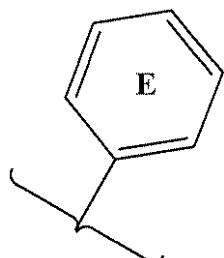
(i)



(VII)

またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラストレートもしくはプロドラッグ：

式中、RkまたはR1の1つは-Hであり、他方は

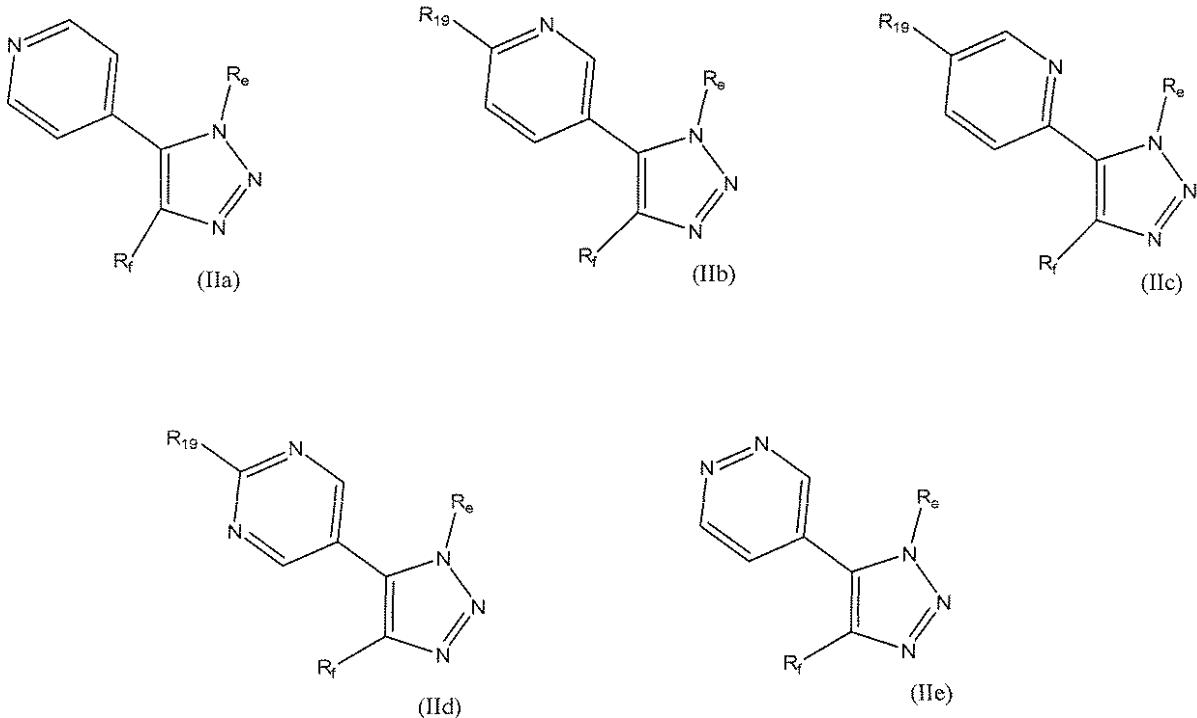


であり、

環EまたはFの1つは3つまたは4つの置換基で置換され、他方は1つ以上の置換基で置換され、

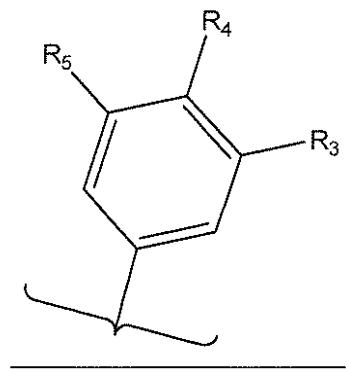
Rkが-Hの場合は、環Eが4-アミノフェニルではない；

(ii)



またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグ：式中、

R<sub>e</sub> または R<sub>f</sub> の1つは-Hであり、他方は



であり；

R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、およびR<sub>5</sub>はそれぞれ独立して、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>であり；

各発現に対するR<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で置換されたヘテロアラルキルであり；

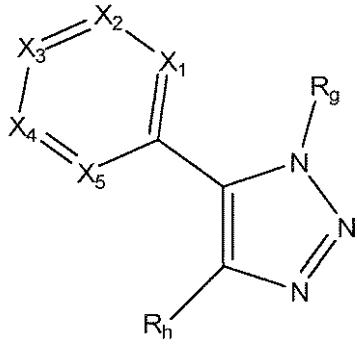
各発現に対する  $R_{10}$  および  $R_{11}$  は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換

されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、もしくは任意で置換されたヘテロアラルキルであるか；またはそれらが結合する窒素と共に、 $R_{10}$ および $R_{11}$ は任意で置換されたヘテロシクリルもしくは任意で置換されたヘテロアリールを形成し；

$R_{19}$ は-H、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-N<sub>1</sub> $R_{10}R_{11}$ 、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>1</sub>であり；

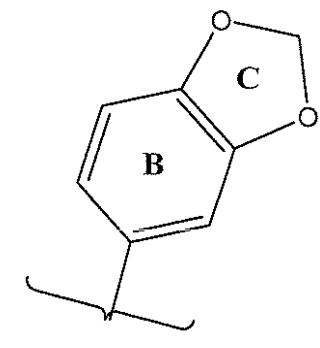
$p$ は1または2である；

(iii)



またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラストレート、もしくはプロドラッグ：式中、

$R_g$ または $R_h$ の1つは-Hであり、他方は



であり；

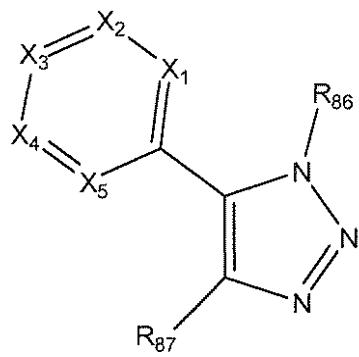
$X_1$ 、 $X_2$ 、 $X_3$ 、 $X_4$ 、および $X_5$ の少なくとも2つが $CR_{14}$ であるという条件で、 $X_1$ 、 $X_2$ 、 $X_3$ 、および $X_4$ はそれぞれ独立してNまたは $CR_{14}$ であり；

$R_{14}$ は-Hまたは置換基であり；

環Bは1つから3つの置換基で任意で置換され；

環Cは1つまたは2つの置換基で任意で置換される；

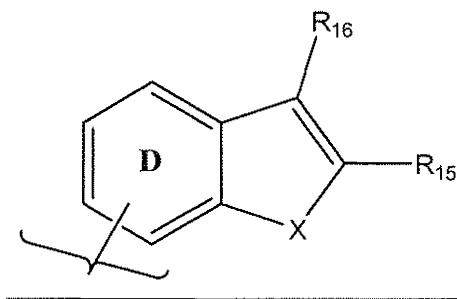
(iv)



(XIX)

またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレート、もしくはプロドラッグ：  
式中、

R<sub>86</sub> または R<sub>87</sub> の1つは-Hであり、他方は



であり；

環Dは1つから3つの置換基で任意で置換され；

Xは0またはNR<sub>20</sub>であり；

X<sub>1</sub>、X<sub>2</sub>、X<sub>3</sub>、X<sub>4</sub>、およびX<sub>5</sub>の少なくとも2つがCR<sub>14</sub>であるという条件で、X<sub>1</sub>、X<sub>2</sub>、X<sub>3</sub>、X<sub>4</sub>、およびX<sub>5</sub>はそれぞれ独立して、NまたはCR<sub>14</sub>であり；

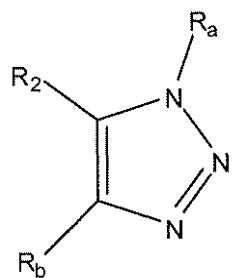
各発現に対するR<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で置換されたヘテロアラルキルであり；

各発現に対するR<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、もしくは任意で置換されたヘテロアラルキルであるか；またはそれらが結合する窒素と共に、R<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>は任意で置換されたヘテロシクリルもしくは任意で置換されたヘテロアリールを形成し；

R<sub>14</sub>、R<sub>15</sub>、およびR<sub>16</sub>はそれぞれ独立して、-Hまたは置換基であり；

R<sub>20</sub>は-H、任意で置換されたアルキル、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、または-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>である；

(v)

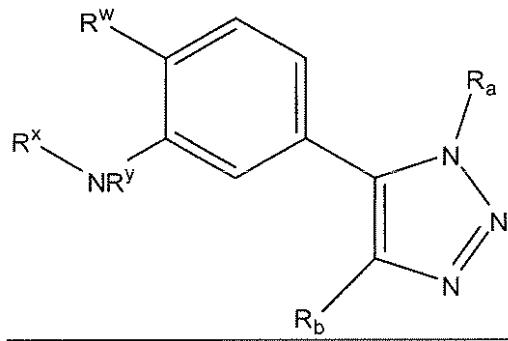


(I)

またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレート、およびプロドラッグ：  
式中、

R<sub>b</sub>は-Hであり、R<sub>a</sub>はアクリジニルではないという条件で、R<sub>a</sub>は任意で置換されたアリールまたは任意で置換されたヘテロアリールであり；

R<sub>2</sub>は任意で置換されたアリールまたは任意で置換されたヘテロアリールである；  
(vi)



(IA)

またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレート、もしくはプロドラッグ：  
式中、

R<sub>a</sub>またはR<sub>b</sub>の1つは-Hであり、他方は任意で置換されたアリールまたは任意で置換されたヘテロアリールであり；

R<sup>X</sup>は(R<sup>a a</sup>)<sub>m</sub>、-R<sup>a a</sup>-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C(O)OH、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C(O)OH、-C(O)YR<sup>Z</sup>、-C(O)NH-R<sup>a a</sup>、または-(R<sup>a a</sup>)<sub>q</sub>C(O)(Y<sub>1</sub>)であり；

R<sup>Y</sup>は-Hまたは低級アルキルであり；

R<sup>W</sup>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<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、ニトロ、アルキルエステル、またはヒドロキシルであり；

各発現に対するR<sub>7</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で置換されたヘテロアラルキルであり；

R<sup>a a</sup>はアミノ酸残基またはアミノ酸残基の類似体であり；

YはCH<sub>2</sub>、O、またはNHであり；

R<sup>Z</sup>はAlk-NH<sub>2</sub>、Alk-C(O)OH、Het、またはY<sub>1</sub>であり；

Alkは任意で置換されたアルキレンであり；

Hetは任意で置換されたヘテロアルキルであり；

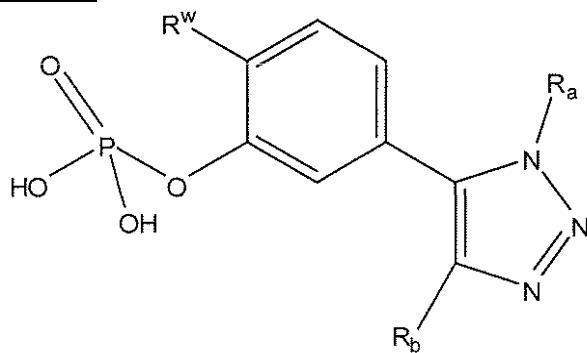
Y<sub>1</sub>は分子量が60,000ダルトン未満の水溶性ポリマーであり；

nは1、2、3、または4であり；

mは1から10の整数であり；

qは0または1である；

(vii)



(IB)

またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレート、もしくはプロドラッグ：  
式中、

R<sub>a</sub>またはR<sub>b</sub>の1つは-Hであり、他方は任意で置換されたアリールまたは任意で置換されたヘテロアリールであり；

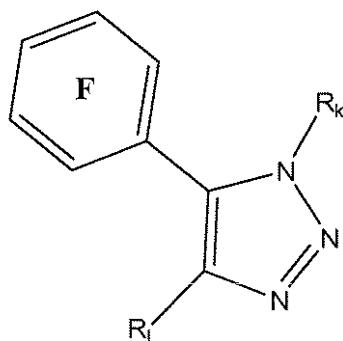
R<sup>w</sup>は-H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、ニトロ、アルキルエステル、またはヒドロキシルであり；

各発現に対するR<sub>7</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で置換されたヘテロアラルキルである。

【請求項2】

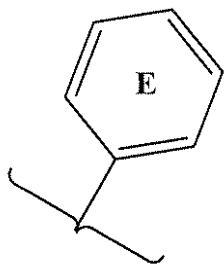
下記式(i)～(vii)からなる群より選択される有効量の化合物を対象へ投与するステップを含む、対象の増殖性疾患を治療または予防する方法：

(i)



(VII)

またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグ：  
式中、R<sub>k</sub>またはR<sub>1</sub>の1つは-Hであり、他方は

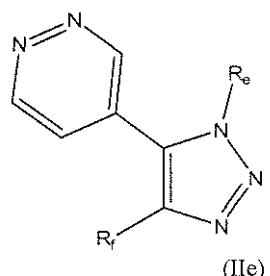
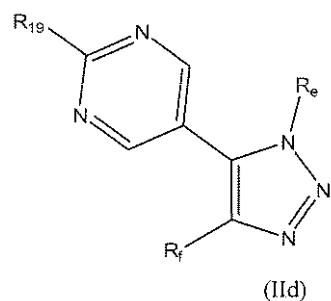
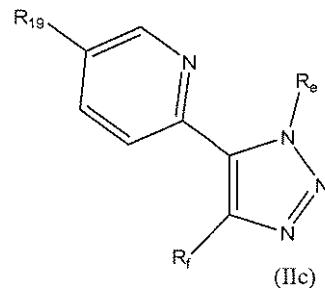
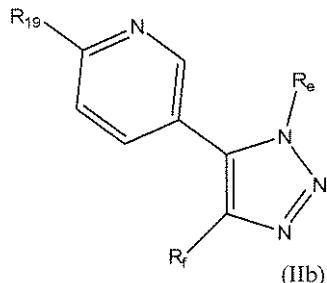
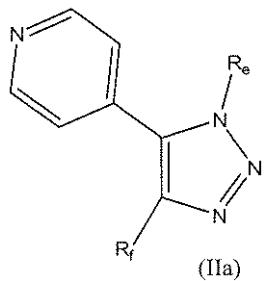


であり、

環EまたはFの1つは3つまたは4つの置換基で置換され、他方は1つ以上の置換基で置換され、

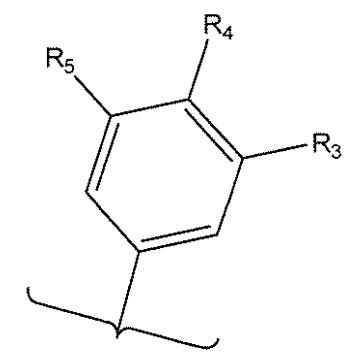
$R_k$  が-Hの場合、環Eは4-アミノフェニルではない；

(ii)



またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグ；  
式中、

$R_e$  または  $R_f$  の1つは-Hであり、他方は



であり；

$R_3$ 、 $R_4$ 、および  $R_5$  はそれぞれ独立して、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換

されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>であり；

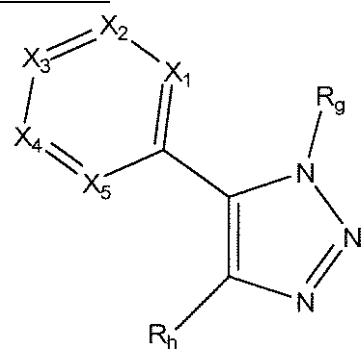
各発現に対するR<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で置換されたヘテロアラルキルであり；

各発現に対するR<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、もしくは任意で置換されたヘテロアラルキルであるか；またはそれらが結合する窒素と共に、R<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>は任意で置換されたヘテロシクリルもしくは任意で置換されたヘテロアリールを形成し；

R<sub>19</sub>は-H、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>であり；

pは1または2である；

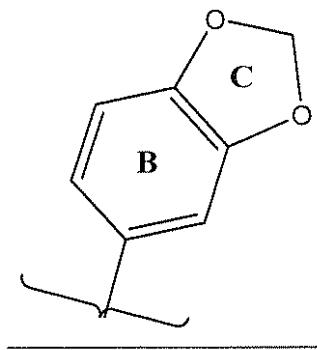
(iii)



(IV)

またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレート、もしくはプロドラッグ：式中、

R<sub>9</sub>またはR<sub>h</sub>の1つは-Hであり、他方は



であり；

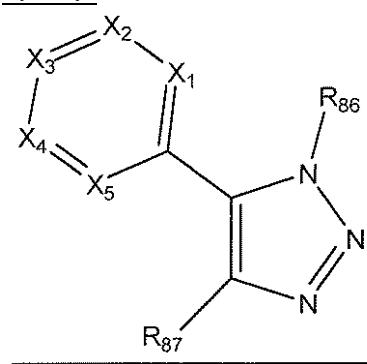
$X_1, X_2, X_3, X_4$ 、および $X_5$ の少なくとも2つが $CR_{14}$ であるという条件で、 $X_1, X_2, X_3, X_4$ はそれぞれ独立してNまたは $CR_{14}$ であり；

$R_{14}$ は-Hまたは置換基であり；

環Bは1つから3つの置換基で任意で置換され；

環Cは1つまたは2つの置換基で任意で置換される；

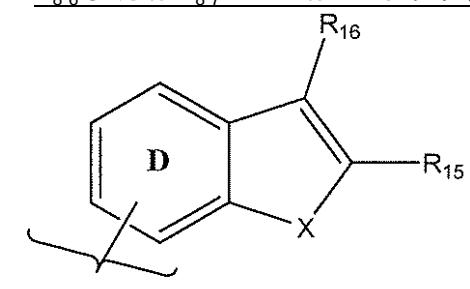
(iv)



(XIX)

またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレート、もしくはプロドラッグ；式中、

$R_{86}$ または $R_{87}$ の1つは-Hであり、他方は



であり；

環Dは1つから3つの置換基で任意で置換され；

$X$ は0または $NR_{20}$ であり；

$X_1, X_2, X_3, X_4$ 、および $X_5$ の少なくとも2つが $CR_{14}$ であるという条件で、 $X_1, X_2, X_3, X_4$ 、および $X_5$ はそれぞれ独立して、Nまたは $CR_{14}$ であり；

各発現に対する $R_7$ および $R_8$ は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で

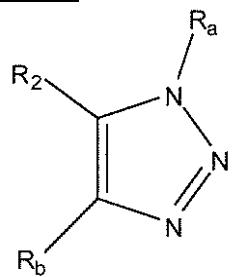
置換されたヘテロアラルキルであり；

各発現に対するR<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、もしくは任意で置換されたヘテロアラルキルであるか；またはそれらが結合する窒素と共に、R<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>は任意で置換されたヘテロシクリルもしくは任意で置換されたヘテロアリールを形成し；

R<sub>14</sub>、R<sub>15</sub>、およびR<sub>16</sub>はそれぞれ独立して、-Hまたは置換基であり；

R<sub>20</sub>は-H、任意で置換されたアルキル、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、または-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>である；

(v)



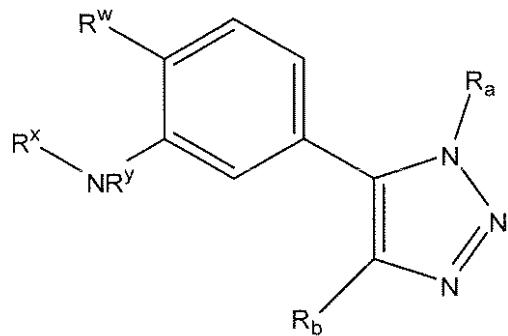
(I)

またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレート、およびプロドラッグ：式中、

R<sub>b</sub>は-Hであり、R<sub>a</sub>はアクリジニルではないという条件で、R<sub>a</sub>は任意で置換されたアリールまたは任意で置換されたヘテロアリールであり；

R<sub>2</sub>は任意で置換されたアリールまたは任意で置換されたヘテロアリールである；

(vi)



(IA)

またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレート、もしくはプロドラッグ：式中、

R<sub>a</sub>またはR<sub>b</sub>の1つは-Hであり、他方は任意で置換されたアリールまたは任意で置換されたヘテロアリールであり；

R<sup>x</sup>は(R<sup>a a</sup>)<sub>m</sub>、-R<sup>a a</sup>-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C(O)OH、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C(O)OH、-C(O)YR<sup>z</sup>、-C(O)NH-R<sup>a a</sup>、または-(R<sup>a a</sup>)<sub>q</sub>C(O)(Y<sub>1</sub>)であり；

R<sup>y</sup>は-Hまたは低級アルキルであり；

R<sup>w</sup>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<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、ニトロ、アルキルエステル、またはヒドロキシルであり；

各発現に対するR<sub>7</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で置換されたヘテロアラルキルであり；

R<sup>a</sup>はアミノ酸残基またはアミノ酸残基の類似体であり；

YはCH<sub>2</sub>、O、またはNHであり；

R<sup>z</sup>はAlk-NH<sub>2</sub>、Alk-C(O)OH、Het、またはY<sub>1</sub>であり；

Alkは任意で置換されたアルキレンであり；

Hetは任意で置換されたヘテロアルキルであり；

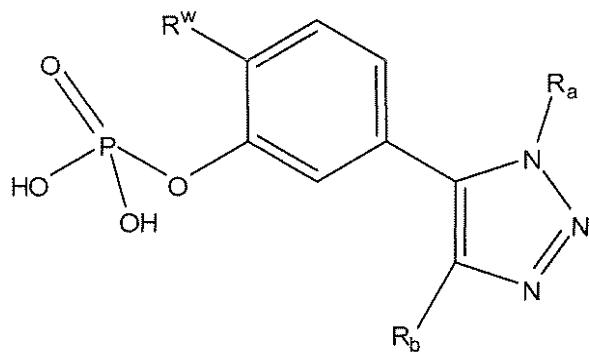
Y<sub>1</sub>は分子量が60,000ダルトン未満の水溶性ポリマーであり；

nは1、2、3、または4であり；

mは1から10の整数であり；

qは0または1である；

(vii)



(IB)

またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラストレート、およびプロドラッグ：式中、

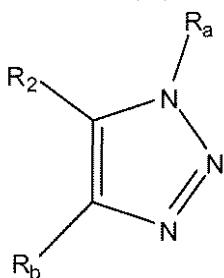
R<sub>a</sub>またはR<sub>b</sub>の1つは-Hであり、他方は任意で置換されたアリールまたは任意で置換されたヘテロアリールであり；

R<sup>w</sup>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<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、ニトロ、アルキルエステル、またはヒドロキシルであり；

各発現に対するR<sub>7</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で置換されたヘテロアラルキルである。

【請求項3】

下記式(I)で示される有効量の化合物：



(I)

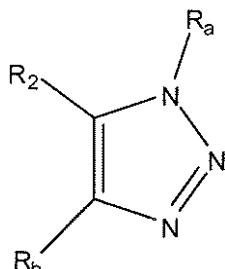
またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラストレートもしくはプロドラッグに新生血管系を接触させるステップを含む、新生血管系中の血流を遮断、閉塞または他の様式で妨害する方法であって、

式中、 $R_a$ がアクリジニルではないという条件で、 $R_a$ または $R_b$ の1つは-Hであり、他方は任意で置換されたアリール、または任意で置換されたヘテロアリールであり、

$R_2$ は任意で置換されたアリールまたは任意で置換されたヘテロアリールである、方法。

【請求項4】

下記式(I)で示される有効量の化合物：



(I)

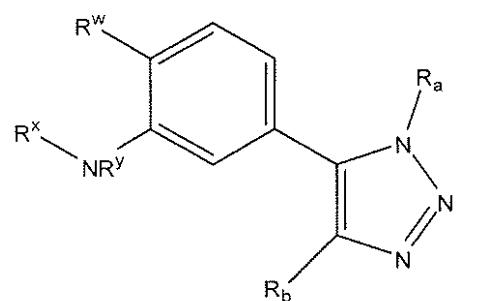
またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラストレートもしくはプロドラッグを対象へ投与するステップを含む、対象の黄斑変性症を治療または予防する方法であって、

式中、 $R_a$ がアクリジニルではないという条件で、 $R_a$ または $R_b$ の1つは-Hであり、他方は任意で置換されたアリール、または任意で置換されたヘテロアリールであり、

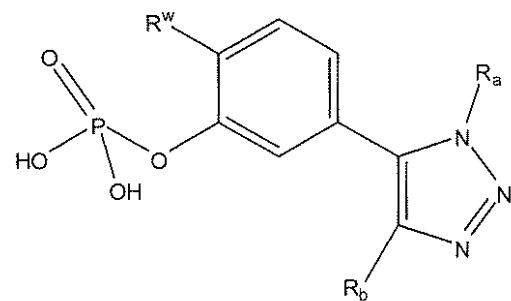
$R_2$ は任意で置換されたアリールまたは任意で置換されたヘテロアリールである、方法。

【請求項5】

化合物が下記式(IA)または式(IB)で示され、



(IA)



(IB)

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、

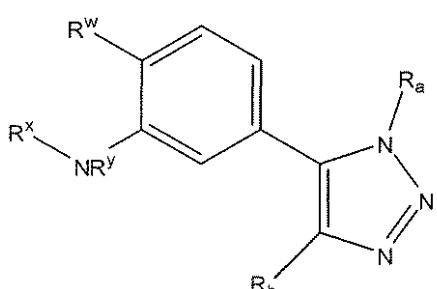
各発現に対する $R_7$ は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で置換されたヘテロアラルキルであり、

$R^{aa}$ はアミノ酸残基またはアミノ酸残基の類似体であり、

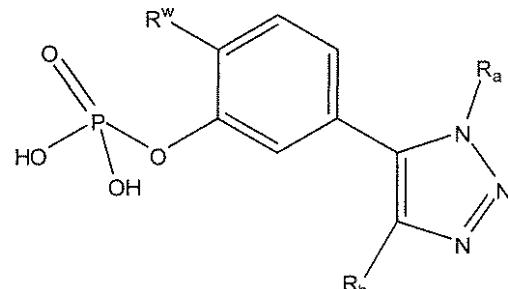
YはCH<sub>2</sub>、OまたはNHであり、  
 R<sup>Z</sup>はAlk-NH<sub>2</sub>、Alk-C(O)OH、HetまたはY<sub>1</sub>であり、  
 Alkは任意で置換されたアルキレンであり、  
 Hetは任意で置換されたヘテロアルキルであり、  
 Y<sub>1</sub>は分子量が60,000ダルトン未満の水溶性ポリマーであり、  
 nは1、2、3または4であり、  
 mは1から10の整数であり、  
 qは0または1である、請求項3記載の方法。

## 【請求項6】

化合物が下記式(IA)または式(IB)で示され、



(IA)



(IB)

## 式中、

R<sup>X</sup>は(R<sup>a a</sup>)<sub>m</sub>、-R<sup>a a</sup>-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C(O)OH、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C(O)OH、-C(O)YR<sup>Z</sup>、-C(O)NH-R<sup>a a</sup>または-(R<sup>a a</sup>)<sub>q</sub>C(O)(Y<sub>1</sub>)であり、

R<sup>Y</sup>は-Hまたは低級アルキルであり、

R<sup>W</sup>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<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、

各発現に対するR<sub>7</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で置換されたヘテロアラルキルであり、

R<sup>a a</sup>はアミノ酸残基またはアミノ酸残基の類似体であり、

YはCH<sub>2</sub>、OまたはNHであり、

R<sup>Z</sup>はAlk-NH<sub>2</sub>、Alk-C(O)OH、HetまたはY<sub>1</sub>であり、

Alkは任意で置換されたアルキレンであり、

Hetは任意で置換されたヘテロアルキルであり、

Y<sub>1</sub>は分子量が60,000ダルトン未満の水溶性ポリマーであり、

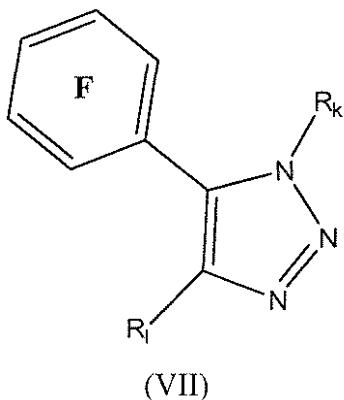
nは1、2、3または4であり、

mは1から10の整数であり、

qは0または1である、請求項4記載の方法。

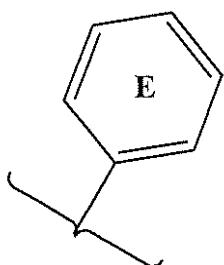
## 【請求項7】

下記式(VII)で示される化合物：



またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグであつて、

式中、R<sub>k</sub>またはR<sub>l</sub>の1つは-Hであり、他方は



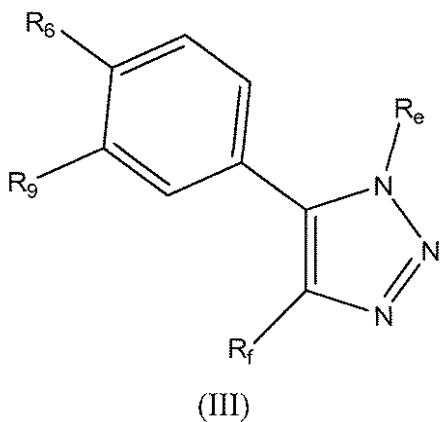
であり、

環EまたはFの1つは3つまたは4つの置換基で置換され、他方は1つ以上の置換基で置換され、

R<sub>k</sub>が-Hの場合、環Eは4-アミノフェニルではない、化合物、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグ。

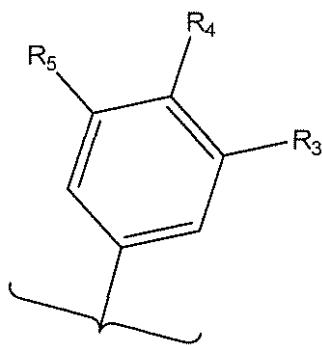
【請求項 8】

化合物が下記構造式(III)：



で示されるか、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグであり、

式中、R<sub>e</sub>またはR<sub>f</sub>の1つは-Hであり、他方は



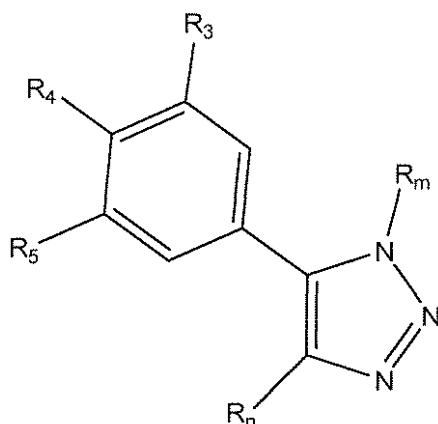
であり、

$R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ および $R_6$ はそれぞれ独立して、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、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、

$R_9$ は-H、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、 $-OR_7$ 、 $-NR_1R_{11}$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ もしくは $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ であるか；または $R_6$ および $R_9$ が共に $-OCH_2O-$ もしくは $-OCH_2CH_2O-$ を形成する、請求項7記載の化合物。

【請求項9】

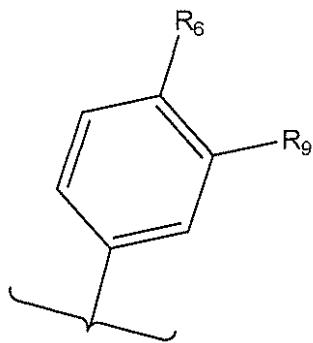
化合物が下記構造式(VIII)：



(VIII)

で示されるか、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグであり、

式中、 $R_m$ または $R_n$ の1つは-Hであり、他方は



であり、

$R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ および $R_6$ はそれぞれ独立して、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>であり、

$R_9$ は-H、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>もしくは-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>であるか；または $R_6$ および $R_9$ が共に-OCH<sub>2</sub>O-もしくは-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-を形成する、請求項7記載の化合物。

#### 【請求項10】

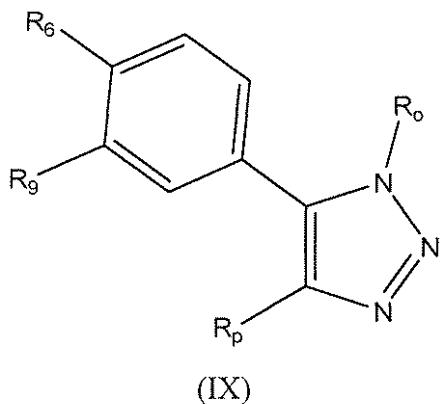
$R_6$ は低級アルキル、低級アルコキシ、低級アルキルスルファニル、-OH、-SH、-NH<sub>2</sub>、ハロ、低級ジアルキルアミノ、低級アルキルアミノ、ニトロ、シアノ、ピリジニル、カルボキシ、低級アルコキシカルボニル、オキサゾリル、-SP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-OP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-OC(O)R<sub>12</sub>、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sub>12</sub>)、テトラゾリル、1-メチル-テトラゾリル、-NHC(O)R<sub>12</sub>または-NHC(O)CH(R<sub>21</sub>)NH<sub>2</sub>であり、各発現に対する $R_{12}$ は独立して-Hまたは低級アルキルであり、 $R_{21}$ はHまたはアミノ酸側鎖であり、

$R_9$ は-H、ハロ、-OH、-SH、-NH<sub>2</sub>、カルボキシ、-OP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-NHC(O)R<sub>12</sub>、-NHC(O)CH(R<sub>21</sub>)NH<sub>2</sub>、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sub>12</sub>)、低級アルコキシカルボニルまたは低級アルコキシであり、

$R_3$ 、 $R_4$ および $R_5$ はそれぞれ独立して、低級アルキル、低級アルコキシまたは-OHである、請求項8または9記載の化合物。

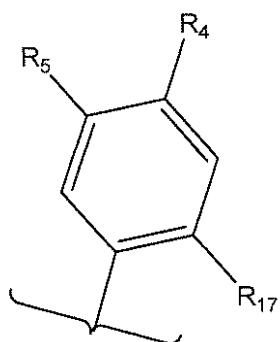
#### 【請求項11】

化合物が下記構造式(IX)：



で示されるか、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグであり、

式中、RoまたはRpの1つは-Hであり、他方は



であり、

R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>およびR<sub>17</sub>はそれぞれ独立して、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>であり、

R<sub>9</sub>は-H、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>もしくは-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>であるか；またはR<sub>6</sub>およびR<sub>9</sub>が共に-OCH<sub>2</sub>O-もしくは-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-を形成する、請求項7記載の化合物。

#### 【請求項 1 2】

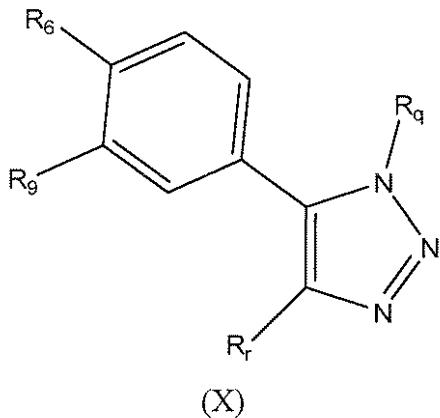
R<sub>6</sub>は低級アルキル、低級アルコキシ、低級アルキルスルファニル、-OH、-SH、-NH<sub>2</sub>、ハロ、低級ジアルキルアミノ、低級アルキルアミノ、ニトロ、シアノ、ピリジニル、カルボキシ、低級アルコキシカルボニル、オキサゾリル、-SP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-OP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-OC(O)R<sub>12</sub>、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sub>12</sub>)、テトラゾリル、1-メチル-テトラゾリル、-NHC(O)R<sub>12</sub>または-NHC(O)CH(R<sub>21</sub>)NH<sub>2</sub>であり、各発現に対するR<sub>12</sub>は独立して-Hまたは低級アルキルであり、R<sub>21</sub>はHまたはアミノ酸側鎖であり、

$R_9$ は-H、ハロ、-OH、-SH、-NH<sub>2</sub>、カルボキシ、-OP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-NHC(O)R<sub>12</sub>、-NHC(O)CH(R<sub>21</sub>)NH<sub>2</sub>、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sub>12</sub>)、低級アルコキシカルボニルまたは低級アルコキシであり、

$R_4$ 、 $R_5$ および $R_{17}$ はそれぞれ独立して、低級アルキル、低級アルコキシまたは-OHである、請求項11記載の化合物。

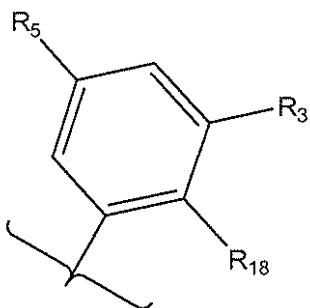
【請求項13】

化合物が下記構造式(X)：



で示されるか、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグであり、

式中、 $R_q$ または $R_f$ の1つは-Hであり、他方は



であり、

$R_3$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ および $R_{18}$ はそれぞれ独立して、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたヘテロアラルキル、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>であり、

$R_9$ は-H、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>1</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>もしくは-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>であるか；または $R_6$ および $R_9$ が共に-OCH<sub>2</sub>O-もしくは-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-を形成する、請求項7記載の化合物。

【請求項14】

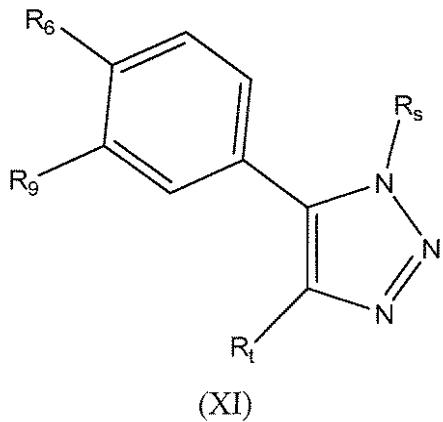
$R_6$ は低級アルキル、低級アルコキシ、低級アルキルスルファニル、-OH、-SH、-NH<sub>2</sub>、ハロ、低級ジアルキルアミノ、低級アルキルアミノ、ニトロ、シアノ、ピリジニル、カルボキシ、低級アルコキシカルボニル、オキサゾリル、-SP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-OP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-OC(O)R<sub>12</sub>、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sub>12</sub>)、テトラゾリル、1-メチル-テトラゾリル、-NHC(O)R<sub>12</sub>または-NHC(O)CH(R<sub>21</sub>)NH<sub>2</sub>であり、各発現に対する $R_{12}$ は独立して-Hまたは低級アルキルであり、 $R_{21}$ はHまたはアミノ酸側鎖であり、

$R_9$ は-H、ハロ、-OH、-SH、-NH<sub>2</sub>、カルボキシ、-OP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-NHC(O)R<sub>12</sub>、-NHC(O)CH(R<sub>21</sub>)NH<sub>2</sub>、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sub>12</sub>)、低級アルコキシカルボニルまたは低級アルコキシであり、

$R_4$ 、 $R_5$ および $R_{18}$ はそれぞれ独立して、低級アルキル、低級アルコキシまたは-OHである、請求項13記載の化合物。

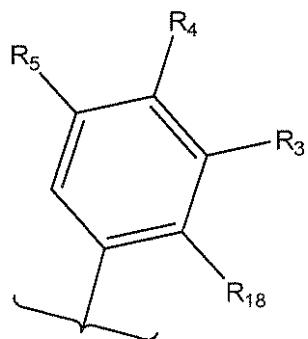
【請求項15】

化合物が下記構造式(XI)：



で示されるか、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグであり、

式中、 $R_s$ または $R_t$ の1つは-Hであり、他方は



であり、

$R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ および $R_{18}$ はそれぞれ独立して、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>であり、

$R_9$ は-H、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘ

テロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>1</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>である、またはR<sub>6</sub>およびR<sub>9</sub>が共に、-OCH<sub>2</sub>O-または-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-を形成する、請求項7記載の化合物。

【請求項16】

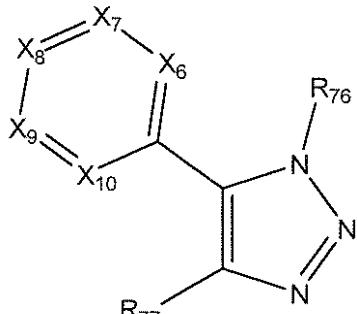
R<sub>6</sub>は低級アルキル、低級アルコキシ、低級アルキルスルファニル、-OH、-SH、-NH<sub>2</sub>、ハロ、低級ジアルキルアミノ、低級アルキルアミノ、ニトロ、シアノ、ピリジニル、カルボキシ、低級アルコキシカルボニル、オキサゾリル、-SP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-OP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-OC(O)R<sub>12</sub>、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sub>12</sub>)、テトラゾリル、1-メチル-テトラゾリル、-NHC(O)R<sub>12</sub>または-NHC(O)CH(R<sub>21</sub>)NH<sub>2</sub>であり、各発現に対するR<sub>12</sub>は独立して-Hまたは低級アルキルであり、R<sub>21</sub>はHまたはアミノ酸側鎖であり、

R<sub>9</sub>は-H、ハロ、-OH、-SH、-NH<sub>2</sub>、カルボキシ、-OP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-NHC(O)R<sub>12</sub>、-NHC(O)CH(R<sub>21</sub>)NH<sub>2</sub>、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sub>12</sub>)、低級アルコキシカルボニルまたは低級アルコキシであり、

R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>およびR<sub>18</sub>はそれぞれ独立して、低級アルキル、低級アルコキシまたは-OHである、請求項15記載の化合物。

【請求項17】

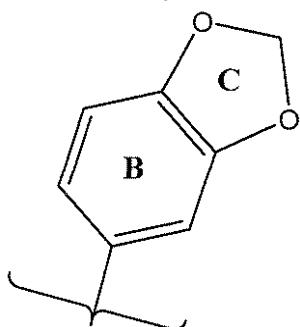
下記式(XIV)で示される化合物：



(XIV)

またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラストレートもしくはプロドラッグであつて、

式中、R<sub>76</sub>またはR<sub>77</sub>の1つは-Hであり、他方は



であり、

X<sub>6</sub>、X<sub>7</sub>、X<sub>8</sub>、X<sub>9</sub>およびX<sub>10</sub>の少なくとも1つがNであり、X<sub>6</sub>、X<sub>7</sub>、X<sub>8</sub>、X<sub>9</sub>およびX<sub>10</sub>の少なくとも2つがCR<sub>14</sub>であるという条件で、X<sub>6</sub>、X<sub>7</sub>、X<sub>8</sub>、X<sub>9</sub>およびX<sub>10</sub>はそれぞれ独立してNまたはCR<sub>14</sub>であり、

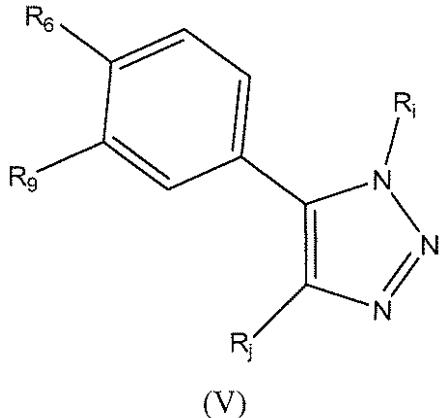
R<sub>14</sub>は-Hまたは置換基であり、

環Bは1つから3つの置換基で任意で置換され、

環Cは1つまたは2つの置換基で任意で置換される、化合物、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグ。

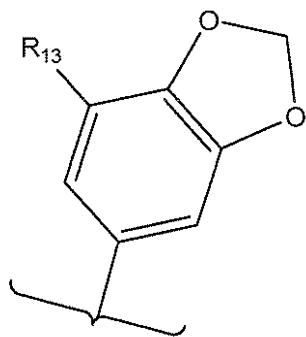
【請求項 1 8】

化合物が下記構造式(V)：



で示されるか、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグであり、

式中、R<sub>i</sub>またはR<sub>j</sub>の1つは-Hであり、他方は



であり、

R<sub>6</sub>はハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>であり、

R<sub>9</sub>は-H、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>である、またはR<sub>6</sub>およびR<sub>9</sub>が共に、-OCH<sub>2</sub>O-または-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-を形成し、

R<sub>13</sub>は-H、アルキル、アルコキシ、ハロ、ニトロ、シアノ、-OH、-NH<sub>2</sub>、アルキルアミノまたはジアルキルアミノである、請求項17記載の化合物。

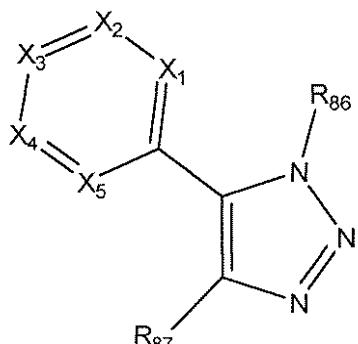
## 【請求項 19】

$R_6$ は低級アルキル、低級アルコキシ、低級アルキルスルファニル、-OH、-SH、-NH<sub>2</sub>、ハロ、低級ジアルキルアミノ、低級アルキルアミノ、ニトロ、シアノ、ピリジニル、カルボキシ、低級アルコキシカルボニル、オキサゾリル、-SP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-OP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-OC(O)R<sub>12</sub>、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sub>12</sub>)、テトラゾリル、1-メチル-テトラゾリル、-NHC(O)R<sub>12</sub>または-NHC(O)CH(R<sub>21</sub>)NH<sub>2</sub>であり、各発現に対するR<sub>12</sub>は独立して-Hまたは低級アルキルであり、R<sub>21</sub>はHまたはアミノ酸側鎖であり、

$R_9$ は-H、ハロ、-OH、-SH、-NH<sub>2</sub>、カルボキシ、-OP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-NHC(O)R<sub>12</sub>、-NHC(O)CH(R<sub>21</sub>)NH<sub>2</sub>、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sub>12</sub>)、低級アルコキシカルボニルまたは低級アルコキシである、請求項18記載の化合物。

## 【請求項 20】

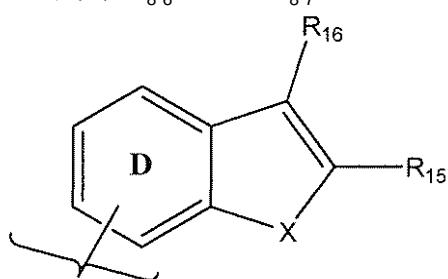
下記式(XIX)で示される化合物：



(XIX)

またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラストレートもしくはプロドラッグであつて、

式中、R<sub>86</sub>またはR<sub>87</sub>の1つは-Hであり、他方は



であり、

環Dは1つから3つの置換基で任意で置換され、

XはOまたはNR<sub>20</sub>であり、

X<sub>1</sub>、X<sub>2</sub>、X<sub>3</sub>、X<sub>4</sub>およびX<sub>5</sub>の少なくとも2つがCR<sub>14</sub>であるという条件で、X<sub>1</sub>、X<sub>2</sub>、X<sub>3</sub>、X<sub>4</sub>およびX<sub>5</sub>はそれぞれ独立して、NまたはCR<sub>14</sub>であり、

R<sub>14</sub>、R<sub>15</sub>およびR<sub>16</sub>はそれぞれ独立して、-Hまたは置換基であり、

R<sub>20</sub>は、-H、任意で置換されたアルキル、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>または-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>であり、

各発現に対するR<sub>7</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で置換されたヘテロアラルキルであり、

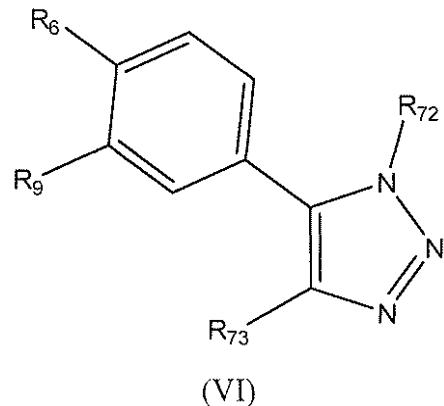
各発現に対するR<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換

されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で置換されたヘテロアラルキルであるか、またはそれらが結合する窒素と共に、 $R_{10}$ および $R_{11}$ は任意で置換されたヘテロシクリルまたは任意で置換されたヘテロアリールを形成し、

$p$ は1または2である、化合物、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグ。

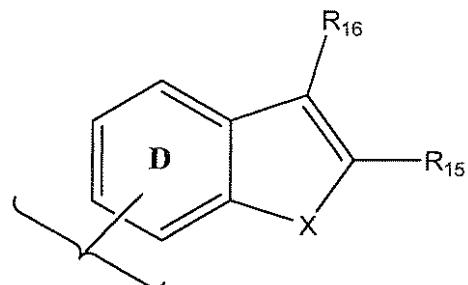
【請求項 21】

化合物が下記式(VI)：



で示されるか、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグであり、

式中、 $R_{72}$ または $R_{73}$ の1つは-Hであり、他方は



であり、

$X$ は0または $NR_{20}$ であり、

各発現に対する $R_8$ は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で置換されたヘテロアラルキルであり、

環Dは、非置換であるか、またはハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、もしくは-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>から独立して選択される1つから3つの置換基によって置換され；

R<sub>15</sub>およびR<sub>16</sub>はそれぞれ独立して-Hであるか、またはハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、もしくは-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>から成る群より選択される置換基であり；

R<sub>6</sub>は低級アルキル、低級アルコキシ、低級アルキルスルファニル、-OH、-SH、-NH<sub>2</sub>、ハロ、低級ジアルキルアミノ、低級アルキルアミノ、ニトロ、シアノ、ピリジニル、カルボキシ、低級アルコキシカルボニル、オキサゾリル、-SP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-OP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-OC(O)R<sub>12</sub>、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sub>12</sub>)、テトラゾリル、1-メチル-テトラゾリル、-NHC(O)R<sub>12</sub>、または-NHC(O)CH(R<sub>21</sub>)NH<sub>2</sub>であり、各発現に対するR<sub>12</sub>は独立して-Hまたは低級アルキルであり；R<sub>21</sub>はHまたはアミノ酸側鎖であり；

R<sub>9</sub>は-H、ハロ、-OH、-SH、-NH<sub>2</sub>、カルボキシ、-OP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>12</sub>)<sub>2</sub>、-NHC(O)R<sub>12</sub>、-NHC(O)CH(R<sub>21</sub>)NH<sub>2</sub>、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sub>12</sub>)、低級アルコキシカルボニル、または低級アルコキシである。

請求項20記載の化合物。

【請求項22】

Xは0またはNR<sub>20</sub>であり、

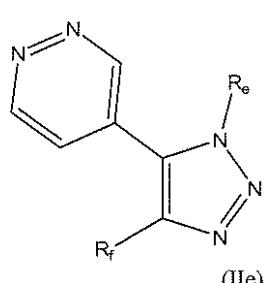
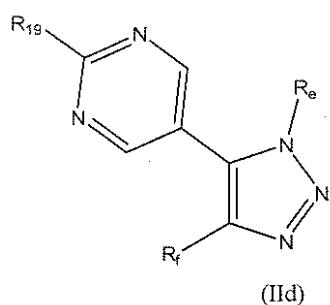
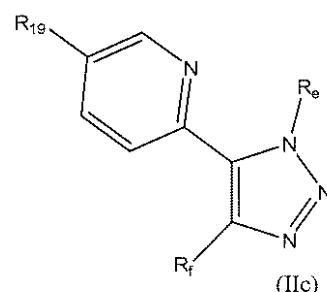
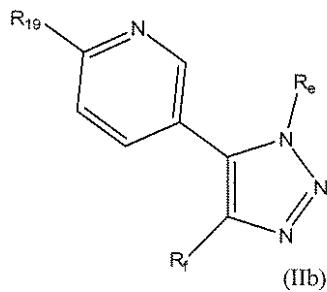
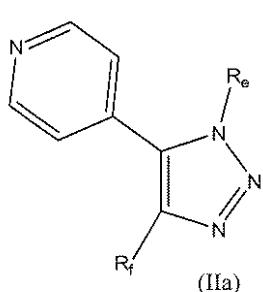
環Dは非置換であり、

R<sub>20</sub>は-Hまたは低級アルキルであり、

R<sub>15</sub>およびR<sub>16</sub>は-Hである、請求項21記載の化合物。

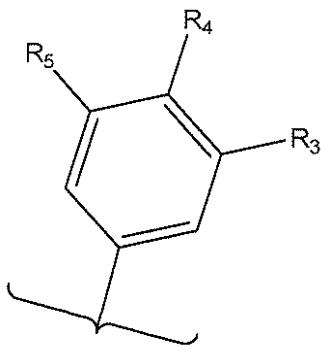
【請求項23】

下記式の1つで示される化合物：



またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグであって、

式中、R<sub>e</sub>またはR<sub>f</sub>の1つは-Hであり、他方は



であり、

$R_3$ 、 $R_4$ および $R_5$ はそれぞれ独立して、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、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、

各発現に対する $R_7$ および $R_8$ はそれぞれ独立して、 $-H$ 、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で置換されたヘテロアラルキルであり、

各発現に対する $R_{10}$ および $R_{11}$ は独立して、 $-H$ 、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、もしくは任意で置換されたヘテロアラルキルであるか；またはそれらが結合する窒素と共に、 $R_{10}$ および $R_{11}$ は任意で置換されたヘテロシクリルもしくは任意で置換されたヘテロアリールを形成し、

$R_{19}$ は $-H$ 、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、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、

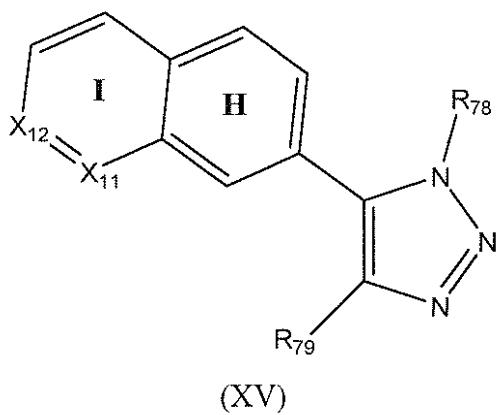
$p$ は1または2である、化合物、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラストレートもしくはプロドラッグ。

#### 【請求項 2 4】

$R_3$ 、 $R_4$ および $R_5$ はそれぞれ独立して、メチル、エチルまたはメトキシである、請求項23記載の化合物。

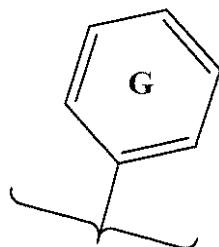
#### 【請求項 2 5】

下記式(XV)で示される化合物：



またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグであつて、

式中、R<sub>78</sub>またはR<sub>79</sub>の1つは-Hであり、他方は



であり、

環Gは1つから5つの置換基で任意で置換され、

環Hは1つから3つの置換基で任意で置換され、

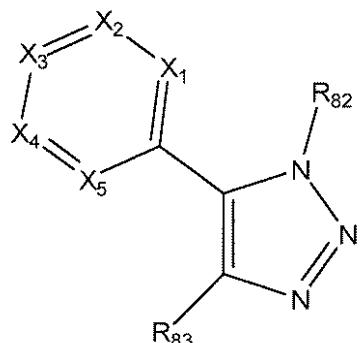
環Iは1つまたは2つの置換基で任意で置換され、

X<sub>9</sub>またはX<sub>10</sub>の少なくとも1つがNであるということを条件に、X<sub>11</sub>およびX<sub>12</sub>はそれぞれ独立してNまたはCR<sub>14</sub>であり、

R<sub>14</sub>は-Hまたは置換基である、化合物、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグ。

【請求項 2 6】

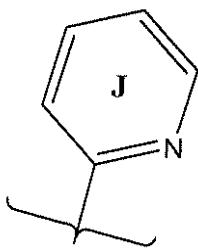
下記式(XVII)で示される化合物：



(XVII)

またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグであつて、

式中、R<sub>82</sub>またはR<sub>83</sub>の1つは-Hであり、他方は



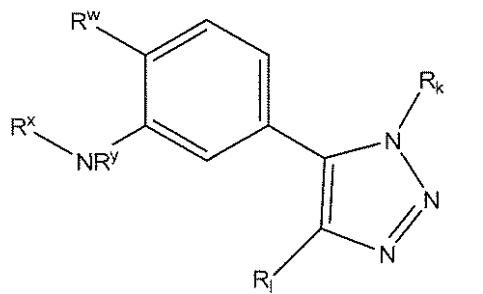
であり、

環Jは3つまたは4つの置換基で置換され、  
 $X_1$ 、 $X_2$ 、 $X_3$ 、 $X_4$ および $X_5$ の少なくとも2つが $CR_{14}$ であるという条件で、 $X_1$ 、 $X_2$ 、 $X_3$ 、 $X_4$ および $X_5$ はそれぞれ独立して、Nまたは $CR_{14}$ であり、

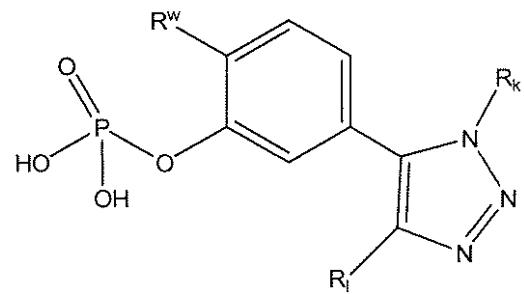
$R_{14}$ は-Hまたは置換基である、化合物、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグ。

**【請求項 27】**

下記式(VIIA)もしくは式(VIIB)で示されるか、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグである、請求項7記載の化合物：

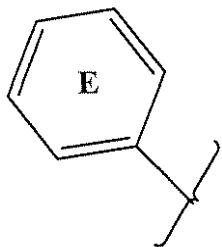


(VIIA)



(VIIB)

式中、 $R_k$ または $R_i$ の1つは-Hであり、他方は



であり、

環Eは1つ以上の置換基で置換され、  
 $R^x$ 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、

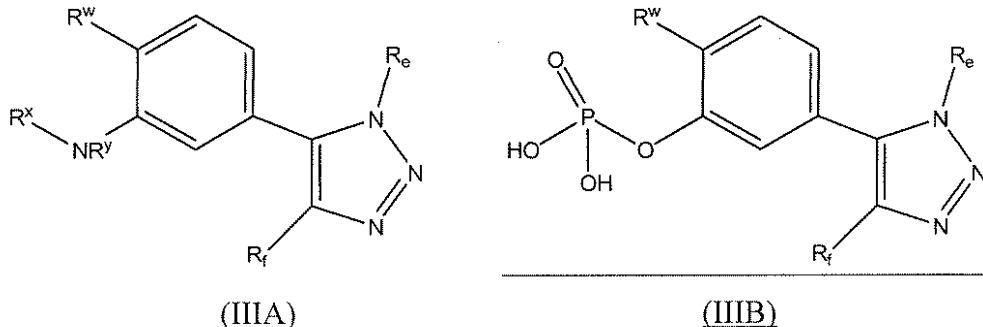
$R^w$ は-H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、

各発現に対する $R_7$ は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で置換された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の類似体であり、  
 $Y$ 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、  
 $Alk$ は任意で置換されたアルキレンであり、  
 $Het$ は任意で置換されたヘテロアルキルであり、  
 $Y_1$ は分子量が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、  
 $q$ は0または1である。

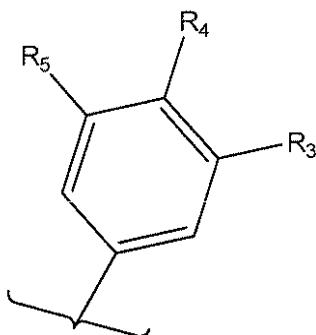
## 【請求項 28】

化合物が下記構造式(IIIA)もしくは式(IIIB)：



で示されるか、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグであり、

式中、 $R_e$ または $R_f$ の1つは $-H$ であり、他方は



であり、

$R_3$ 、 $R_4$ および $R_5$ はそれぞれ独立して、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、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 $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ である、請求項27記載の化合物。

## 【請求項 29】

$R_3$ 、 $R_4$ および $R_5$ はそれぞれ独立して、低級アルキル、低級アルコキシまたは $-OH$ であり

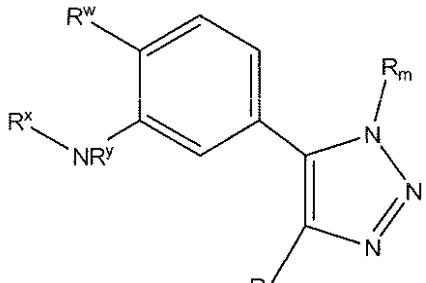
$R^X$ が $R^{aa}$ であり、かつ $R^{aa}$ がグリシン、アラニン、バリン、ロイシン、イソロイシン、セリン、トレオニン、システイン、メチオニン、フェニルアラニン、チロシン、トリプトファン、アスパラギン酸、アスパラギン、グルタミン酸、グルタミン、アルギニン、ヒスチジン、リシン、またはプロリンである、請求項28記載の化合物。

## 【請求項 3 0】

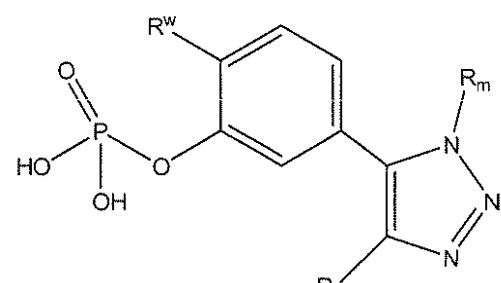
$R_3$ 、 $R_4$ および $R_5$ はそれぞれメトキシであり、  
 $R^X$ は $R^{aa}$ であり、  
 $R^Y$ は-Hであり、  
 $R^W$ はメトキシである、請求項28記載の化合物。

## 【請求項 3 1】

化合物が下記構造式(VIIIA)もしくは式(VIIIB)：



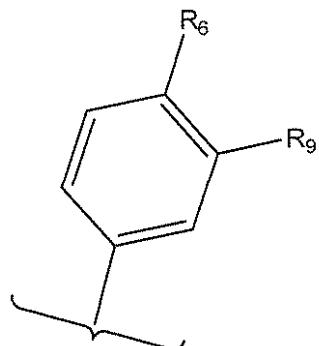
(VIIIA)



(VIIIB)

で示されるか、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグであり、

式中、 $R_m$ または $R_n$ の1つは-Hであり、他方は



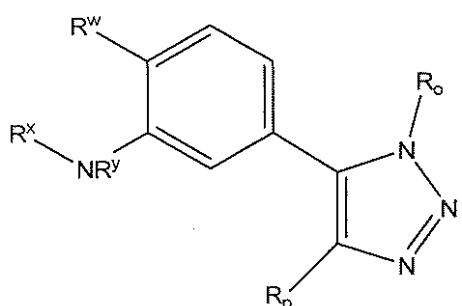
であり、

$R_6$ は独立して、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>であり、

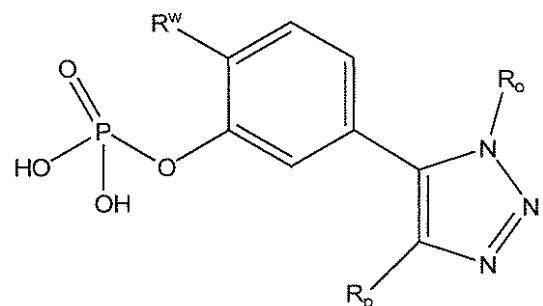
$R_9$ は-H、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>もしくは-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>であるか；または $R_6$ および $R_9$ が共に-OCH<sub>2</sub>O-もしくは-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-を形成する、請求項27記載の化合物。

## 【請求項 3 2】

化合物が下記式(IXA)もしくは式(IXB)：



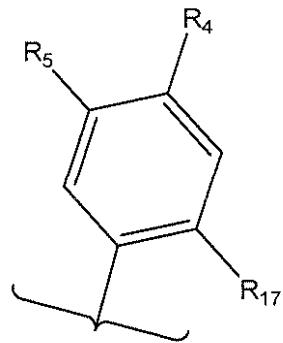
(IXA)



(IXB)

で示されるか、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグであり、

式中、R<sub>o</sub>またはR<sub>p</sub>の1つは-Hであり、他方は

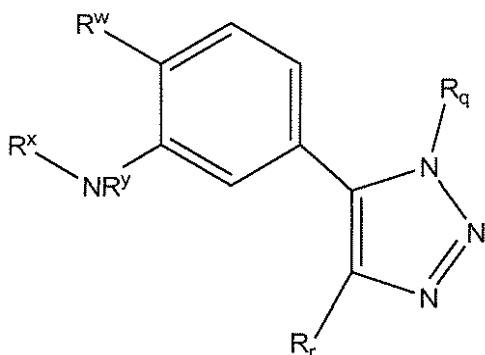


であり、

R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>およびR<sub>17</sub>はそれぞれ独立して、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>である、請求項27記載の化合物。

## 【請求項 3 3】

化合物が下記式(XA)：

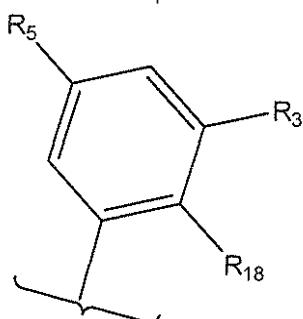


(XA)

で示されるか、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロ

ドラッグであり、

式中、 $R_q$  または  $R_t$  の1つは-Hであり、他方は

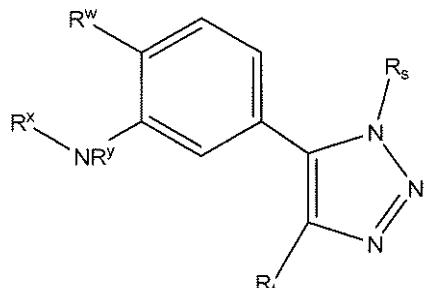


であり、

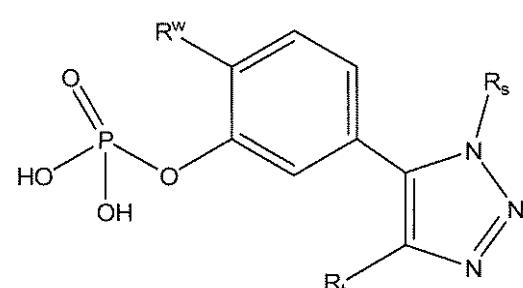
$R_3$ 、 $R_5$  および  $R_{18}$  はそれぞれ独立して、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、 $-OR_7$ 、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$  または  $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$  である、請求項27記載の化合物。

【請求項 3 4】

化合物が下記式(XIA)もしくは式(XIB)：



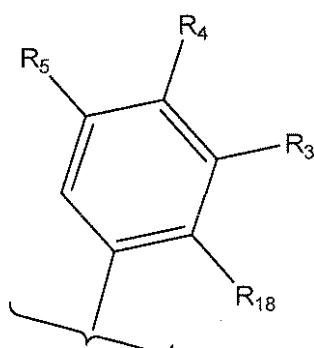
(XIA)



(XIB)

で示されるか、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグであり、

式中、 $R_s$  または  $R_t$  の1つは-Hであり、他方は



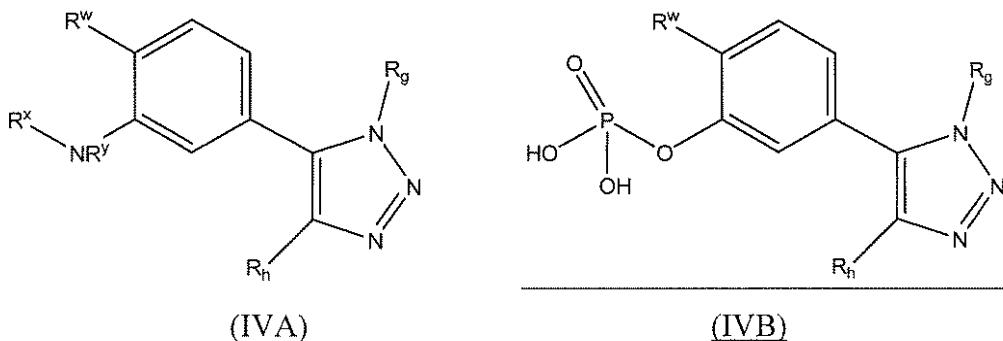
であり、

$R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$  および  $R_{18}$  はそれぞれ独立して、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で

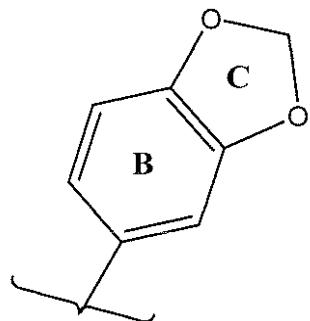
置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>である、請求項27記載の化合物。

【請求項35】

下記式(IVA)もしくは(IVB)で示されるか、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグである、請求項21記載の化合物：



式中、R<sub>g</sub>またはR<sub>h</sub>の1つは-Hであり、他方は



であり、

R<sup>x</sup>は(R<sup>aa</sup>)<sub>m</sub>、-R<sup>aa</sup>-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C(O)OH、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C(O)OH、-C(O)YR<sup>z</sup>、-C(O)NH-R<sup>aa</sup>または-(R<sup>aa</sup>)<sub>q</sub>C(O)(Y<sub>1</sub>)であり、

R<sup>y</sup>は-Hまたは低級アルキルであり、

R<sup>w</sup>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<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、

各発現に対するR<sub>7</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で置換されたヘテロアラルキルであり、

R<sup>aa</sup>はアミノ酸残基またはアミノ酸残基の類似体であり、

YはCH<sub>2</sub>、OまたはNHであり、

R<sup>z</sup>はAlk-NH<sub>2</sub>、Alk-C(O)OH、HetまたはY<sub>1</sub>であり、

Alkは任意で置換されたアルキレンであり、

Hetは任意で置換されたヘテロアルキルであり、

Y<sub>1</sub>は分子量が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、

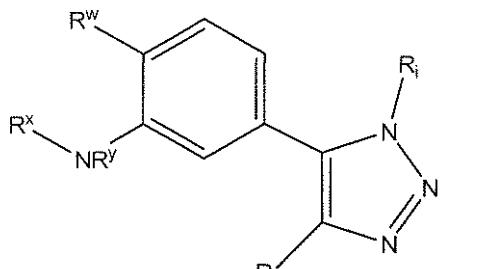
$q$ は0または1であり、

環Bは1つから3つの置換基で任意で置換され、

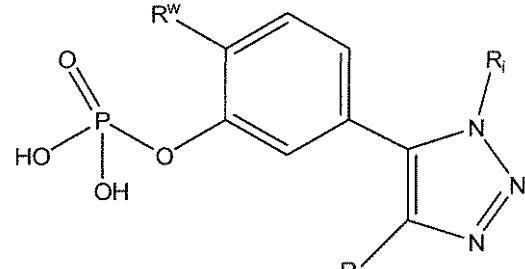
環Cは1つまたは2つの置換基で任意で置換される。

【請求項36】

化合物が下記構造式(VA)もしくは(VB)：



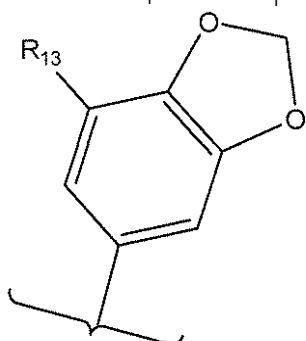
(VA)



(VB)

で示されるか、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグであり、

式中、 $R_i$ または $R_j$ の1つは-Hであり、他方は

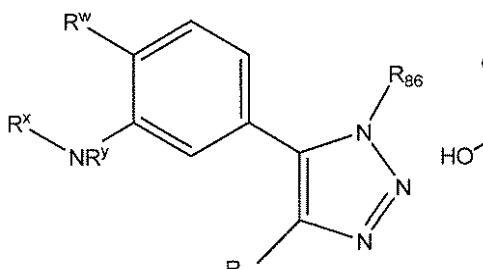


であり、

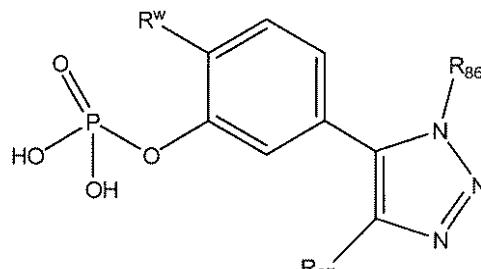
$R_{13}$ は-H、アルキル、アルコキシ、ハロ、ニトロ、シアノ、-OH、-NH<sub>2</sub>、アルキルアミノまたはジアルキルアミノである、請求項35記載の化合物。

【請求項37】

下記式(XIXA)もしくは式(XIXB)で示されるか、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグである、請求項20記載の化合物：

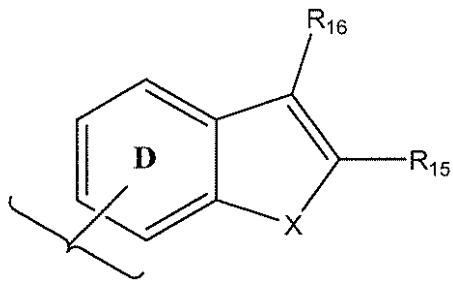


(XIXA)



(XIXB)

式中、 $R_{86}$ または $R_{87}$ の1つは-Hであり、他方は



であり、

環Dは1つから3つの置換基で任意で置換され、

XはOまたはNR<sub>20</sub>であり、

R<sup>X</sup>は(R<sup>a a</sup>)<sub>m</sub>、-R<sup>a a</sup>-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C(O)OH、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C(O)OH、-C(O)YR<sup>z</sup>、-C(O)NH-R<sup>a a</sup>または-(R<sup>a a</sup>)<sub>q</sub>C(O)(Y<sub>1</sub>)であり、

R<sup>Y</sup>は-Hまたは低級アルキルであり、

R<sup>w</sup>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<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、

各発現に対するR<sub>7</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で置換されたヘテロアラルキルであり、

R<sup>a a</sup>はアミノ酸残基またはアミノ酸残基の類似体であり、

YはCH<sub>2</sub>、OまたはNHであり、

R<sup>z</sup>はAlk-NH<sub>2</sub>、Alk-C(O)OH、HetまたはY<sub>1</sub>であり、

Alkは任意で置換されたアルキレンであり、

Hetは任意で置換されたヘテロアルキルであり、

Y<sub>1</sub>は分子量が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、

qは0または1であり、

R<sub>15</sub>およびR<sub>16</sub>はそれぞれ独立して、-Hまたは置換基であり、

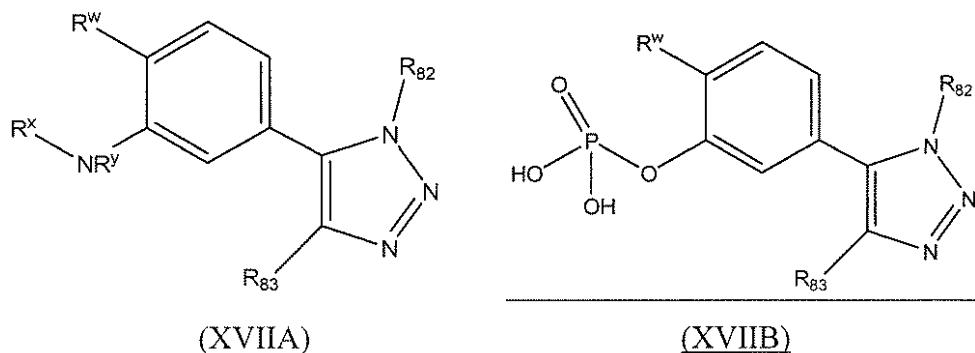
R<sub>20</sub>は-H、任意で置換されたアルキル、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>または-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>であり、

各発現に対するR<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、もしくは任意で置換されたヘテロアラルキルであるか；またはそれらが結合する窒素と共に、R<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>は任意で置換されたヘテロシクリルもしくは任意で置換されたヘテロアリールを形成し、

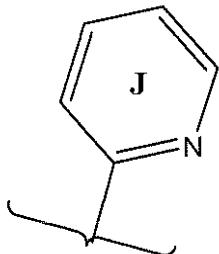
pは1または2である。

### 【請求項 3 8】

下記式(XVIIA)もしくは式(XVIIIB)で示されるか、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグである、請求項26記載の化合物：



式中、R<sub>82</sub>またはR<sub>83</sub>の1つは-Hであり、他方は



であり、

環Jは3つまたは4つの置換基で置換され、

R<sup>X</sup>は(R<sup>a a</sup>)<sub>m</sub>、-R<sup>a a</sup>-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C(O)OH、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C(O)OH、-C(O)YR<sup>z</sup>、-C(O)NH-R<sup>a a</sup>または-(R<sup>a a</sup>)<sub>q</sub>C(O)(Y<sub>1</sub>)であり、

R<sup>Y</sup>は-Hまたは低級アルキルであり、

R<sup>W</sup>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<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、ニトロ、アルキルエステルまたはヒドロキシルであり、

各発現に対するR<sub>7</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で置換されたヘテロアラルキルであり、

R<sup>a a</sup>はアミノ酸残基またはアミノ酸残基の類似体であり、

YはCH<sub>2</sub>、OまたはNHであり、

R<sup>z</sup>はAlk-NH<sub>2</sub>、Alk-C(O)OH、HetまたはY<sub>1</sub>であり、

Alkは任意で置換されたアルキレンであり、

Hetは任意で置換されたヘテロアルキルであり、

Y<sub>1</sub>は分子量が60,000ダルトン未満の水溶性ポリマーであり、

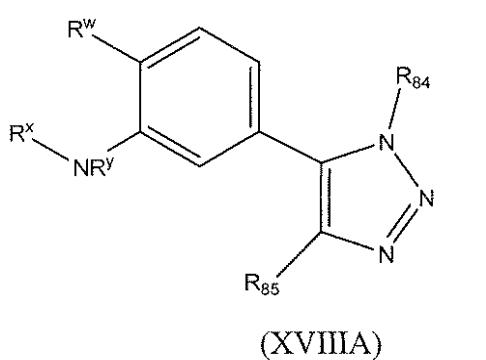
nは1、2、3または4であり、

mは1から10の整数であり、

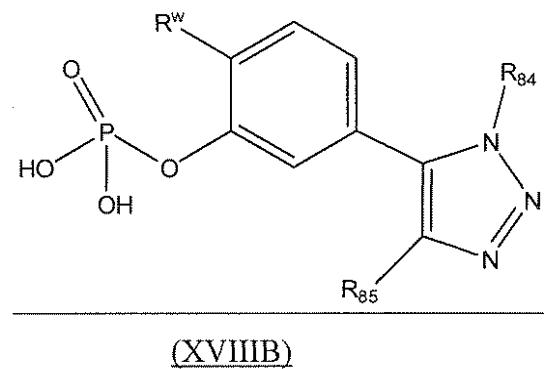
qは0または1である。

### 【請求項 3 9】

化合物が下記式(XVIIIA)もしくは式(XVIIB)：



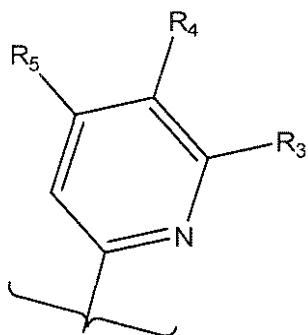
(XVIIIA)



(XVIIIB)

で示されるか、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、クラスレートもしくはプロドラッグであり、

式中、R<sub>84</sub>またはR<sub>85</sub>の1つは-Hであり、他方は



であり、

R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>およびR<sub>5</sub>はそれぞれ独立して、ハロ、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、任意で置換されたヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、グアニジノ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロアルキル、-OR<sub>7</sub>、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>であり、

各発現に対するR<sub>8</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、または任意で置換されたヘテロアラルキルであり、

各発現に対するR<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>は独立して、-H、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたシクロアルケニル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアラルキル、もしくは任意で置換されたヘテロアラルキルであるか；またはそれらが結合する窒素と共に、R<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>は任意で置換されたヘテロシクリルもしくは任意で置換されたヘテロアリールを形成し、

pは1または2である、請求項38記載の化合物。

【請求項40】

R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>およびR<sup>W</sup>はそれぞれメトキシである、請求項27記載の化合物。

【請求項41】

薬学的に許容される担体および請求項7から40のいずれか一項記載の化合物を含む、薬

学的組成物。

【請求項 4 2】

1つ以上の付加的な治療薬をさらに含む、請求項41記載の薬学的組成物。