

【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2006-515560(P2006-515560A)

【公表日】平成18年6月1日(2006.6.1)

【年通号数】公開・登録公報2006-021

【出願番号】特願2004-512682(P2004-512682)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/137 (2006.01)

A 6 1 K 31/351 (2006.01)

A 6 1 K 31/4025 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/00 (2006.01)

A 6 1 P 39/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 309/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/137

A 6 1 K 31/351

A 6 1 K 31/4025

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 31/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/00

A 6 1 P 39/00

A 6 1 P 43/00

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 309/04

【手続補正書】

【提出日】平成18年6月14日(2006.6.14)

【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

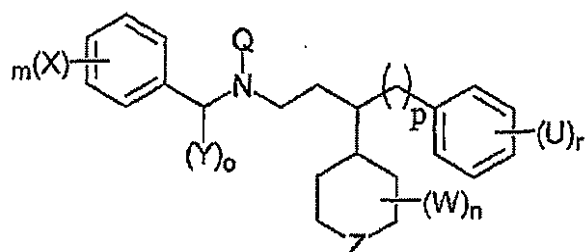
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

癌または新生物疾患を治療または予防するための医薬の製造における、式(1)：

## 【化 1】



(I)

〔式中、

X、W、およびUは、それぞれ独立して、H、ハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、アルコキシ、アルキルアミノ、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルホニル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、置換もしくは無置換アリール、置換もしくは無置換ヘテロアリール、置換もしくは無置換ヘテロ環、置換もしくは無置換シクロアルキル、 $-C(=O)OR_1$ 、 $-OC(=O)R_1$ 、 $-C(=O)NR_1R_2$ 、 $-C(=O)NR_1OR_2$ 、 $-SO_2NR_1R_2$ 、 $-NR_1SO_2R_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR_1R_2$ 、 $-NR_1C(=O)R_2$ 、 $-NR_1C(=O)(CH_2)_qOR_2$ 、 $-NR_1C(=O)(CH_2)_qR_2$ 、 $NR_1C(=O)(CH_2)_qNR_1R_2$ 、 $-O(CH_2)_qNR_1R_2$ であり；

$R_1$ および $R_2$ は、独立して、Hまたは分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；

Yは、それぞれ独立して、H、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであるか、またはoが1であるとき、Yは( $=O$ )であってもよく；

Zは、CまたはOであり；

Qは、H、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；

mは、0～5であり；

nは、0～8であり；

oは、0～2であり；

pは、0～2であり；

qは、0～5であり；そして

rは、0～5である〕

で示される化合物または製薬上許容されるその塩の使用。

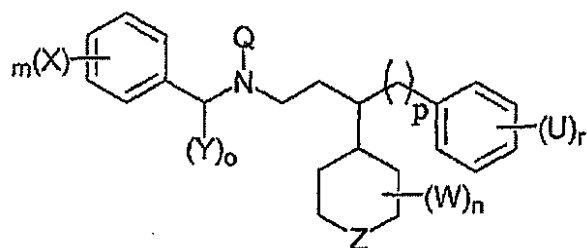
## 【請求項 2】

前記癌が、乳房、卵巣、精巣、前立腺、頭部、頸部、眼、皮膚、口腔、咽喉、食道、胸部、骨、肺、結腸、S状結腸、直腸、胃、腎臓、肝臓、脾臓、脳、腸、心臓、または副腎の癌である、請求項 1 に記載の使用。

## 【請求項 3】

癌細胞または新生物細胞の増殖を *in vitro* で阻害する方法であって、癌細胞または新生物細胞を有効量の式 (I)：

## 【化 2】



(I)

〔式中、

X、W、およびUは、それぞれ独立して、H、ハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、アルコ

キシ、アルキルアミノ、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルホニル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、置換もしくは無置換アリール、置換もしくは無置換ヘテロアリール、置換もしくは無置換ヘテロ環、置換もしくは無置換シクロアルキル、 $-C(=O)OR_1$ 、 $-OC(=O)R_1$ 、 $-C(=O)NR_1R_2$ 、 $-C(=O)NR_1OR_2$ 、 $-SO_2NR_1R_2$ 、 $-NR_1SO_2R_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR_1R_2$ 、 $-NR_1C(=O)R_2$ 、 $-NR_1C(=O)(CH_2)_qOR_2$ 、 $-NR_1C(=O)(CH_2)_qR_2$ 、 $NR_1C(=O)(CH_2)_qNR_1R_2$ 、 $-O(CH_2)_qNR_1R_2$ であり；

$R_1$ および $R_2$ は、独立して、Hまたは分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；

Yは、それぞれ独立して、H、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであるか、またはoが1であるとき、Yは(=O)であってもよく；

Zは、CまたはOであり；

Qは、H、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；

mは、0～5であり；

nは、0～8であり；

oは、0～2であり；

pは、0～2であり；

qは、0～5であり；そして

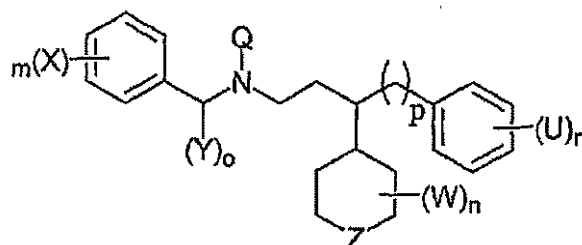
rは、0～5である；

で示される化合物または製薬上許容されるその塩に接触させることを含む、上記方法。

#### 【請求項4】

急性もしくは慢性腎不全、炎症疾患、老化作用、感染症、免疫障害、または心臓血管疾患を治療または予防するための医薬の製造における、式(I)：

#### 【化3】



(I)

〔式中、

X、W、およびUは、それぞれ独立して、H、ハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、アルコキシ、アルキルアミノ、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルホニル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、置換もしくは無置換アリール、置換もしくは無置換ヘテロアリール、置換もしくは無置換ヘテロ環、置換もしくは無置換シクロアルキル、 $-C(=O)OR_1$ 、 $-OC(=O)R_1$ 、 $-C(=O)NR_1R_2$ 、 $-C(=O)NR_1OR_2$ 、 $-SO_2NR_1R_2$ 、 $-NR_1SO_2R_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR_1R_2$ 、 $-NR_1C(=O)R_2$ 、 $-NR_1C(=O)(CH_2)_qOR_2$ 、 $-NR_1C(=O)(CH_2)_qR_2$ 、 $NR_1C(=O)(CH_2)_qNR_1R_2$ 、 $-O(CH_2)_qNR_1R_2$ であり；

$R_1$ および $R_2$ は、独立して、Hまたは分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；

Yは、それぞれ独立して、H、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであるか、またはoが1であるとき、Yは(=O)であってもよく；

Zは、CまたはOであり；

Qは、H、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；

mは、0～5であり；

nは、0～8であり；

oは、0～2であり；

pは、0～2であり；

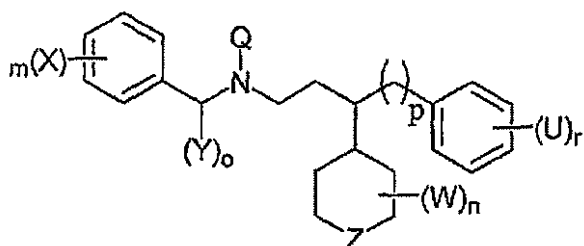
qは、0～5であり；そして  
rは、0～5である]

で示される化合物または製薬上許容されるその塩の使用。

【請求項5】

リガーゼ活性のモジュレーションに応答する疾患を治療または予防するための医薬の製造における、式(I)：

【化4】



(I)

〔式中、

X、W、およびUは、それぞれ独立して、H、ハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、アルコキシ、アルキルアミノ、分枝状もしくは非分枝状C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニル、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルホニル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、置換もしくは無置換アリール、置換もしくは無置換ヘテロアリール、置換もしくは無置換ヘテロ環、置換もしくは無置換シクロアルキル、-C(=O)OR<sub>1</sub>、-OC(=O)R<sub>1</sub>、-C(=O)NR<sub>1</sub>R<sub>2</sub>、-C(=O)NR<sub>1</sub>OR<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NR<sub>1</sub>R<sub>2</sub>、-NR<sub>1</sub>SO<sub>2</sub>R<sub>2</sub>、-CN、-NO<sub>2</sub>、-NR<sub>1</sub>R<sub>2</sub>、-NR<sub>1</sub>C(=O)R<sub>2</sub>、-NR<sub>1</sub>C(=O)(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>OR<sub>2</sub>、-NR<sub>1</sub>C(=O)(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sub>2</sub>、NR<sub>1</sub>C(=O)(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>NR<sub>1</sub>R<sub>2</sub>、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>NR<sub>1</sub>R<sub>2</sub>であり；

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は、独立して、Hまたは分枝状もしくは非分枝状C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキルであり；

Yは、それぞれ独立して、H、分枝状もしくは非分枝状C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキルであるか、またはoが1であるとき、Yは(=O)であってもよく；

Zは、CまたはOであり；

Qは、H、分枝状もしくは非分枝状C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキルであり；

mは、0～5であり；

nは、0～8であり；

oは、0～2であり；

pは、0～2であり；

qは、0～5であり；そして

rは、0～5である]

で示される化合物または製薬上許容されるその塩の使用。

【請求項6】

前記リガーゼ活性が阻害されることを特徴とする、請求項5に記載の使用。

【請求項7】

前記リガーゼ活性が活性化されることを特徴とする、請求項5に記載の使用。

【請求項8】

前記リガーゼがE3ユビキチン-タンパク質リガーゼである、請求項5に記載の使用。

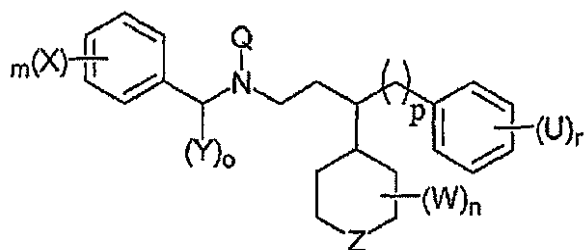
【請求項9】

前記リガーゼ活性が阻害されることを特徴とする、請求項8に記載の使用。

【請求項10】

細胞内p27/kip1レベルのモジュレーションに応答する疾患を治療または予防するための医薬の製造における、式(I)：

## 【化 5】



(I)

〔式中、

X、W、およびUは、それぞれ独立して、H、ハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、アルコキシ、アルキルアミノ、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルホニル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、置換もしくは無置換アリール、置換もしくは無置換ヘテロアリール、置換もしくは無置換ヘテロ環、置換もしくは無置換シクロアルキル、 $-C(=O)OR_1$ 、 $-OC(=O)R_1$ 、 $-C(=O)NR_1R_2$ 、 $-C(=O)NR_1OR_2$ 、 $-SO_2NR_1R_2$ 、 $-NR_1SO_2R_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR_1R_2$ 、 $-NR_1C(=O)R_2$ 、 $-NR_1C(=O)(CH_2)_qOR_2$ 、 $-NR_1C(=O)(CH_2)_qR_2$ 、 $NR_1C(=O)(CH_2)_qNR_1R_2$ 、 $-O(CH_2)_qNR_1R_2$ であり；

$R_1$ および $R_2$ は、独立して、Hまたは分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；

Yは、それぞれ独立して、H、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであるか、または $o$ が1であるとき、Yは $(=O)$ であってもよく；

Zは、CまたはOであり；

Qは、H、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；

$m$ は、0～5であり；

$n$ は、0～8であり；

$o$ は、0～2であり；

$p$ は、0～2であり；

$q$ は、0～5であり；そして

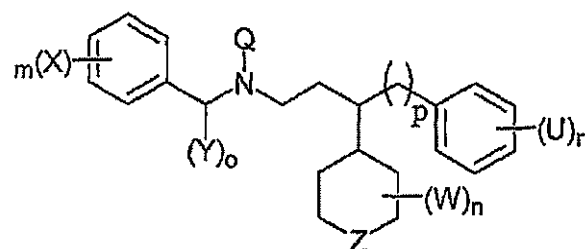
$r$ は、0～5である〕

で示される化合物または製薬上許容されるその塩の使用。

## 【請求項 11】

細胞増殖をモジュレートするための医薬の製造における、式(I)：

## 【化 6】



(I)

〔式中、

X、W、およびUは、それぞれ独立して、H、ハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、アルコキシ、アルキルアミノ、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルホニル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、置換もしくは無置換アリール、置換もしくは無置換ヘテロアリール、置換もしくは無置換ヘテロ環、置換もしくは無置換シクロアルキル、 $-C(=O)OR_1$ 、 $-OC(=O)R_1$ 、 $-C(=O)NR_1R_2$ 、 $-C(=O)NR_1OR_2$ 、 $-SO_2NR_1R_2$ 、

$-\text{NR}_1\text{SO}_2\text{R}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{NR}_1\text{R}_2$ 、 $-\text{NR}_1\text{C}(=\text{O})\text{R}_2$ 、 $-\text{NR}_1\text{C}(=\text{O})(\text{CH}_2)_q\text{OR}_2$ 、 $-\text{NR}_1\text{C}(=\text{O})(\text{CH}_2)_q\text{R}_2$ 、 $\text{NR}_1\text{C}(=\text{O})(\text{CH}_2)_q\text{NR}_1\text{R}_2$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_q\text{NR}_1\text{R}_2$ であり；

$\text{R}_1$ および $\text{R}_2$ は、独立して、Hまたは分枝状もしくは非分枝状 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキルであり；

$\text{Y}$ は、それぞれ独立して、H、分枝状もしくは非分枝状 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキルであるか、または $o$ が1であるとき、 $\text{Y}$ は $(=\text{O})$ であってもよく；

$\text{Z}$ は、CまたはOであり；

$\text{Q}$ は、H、分枝状もしくは非分枝状 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキルであり；

$m$ は、0～5であり；

$n$ は、0～8であり；

$o$ は、0～2であり；

$p$ は、0～2であり；

$q$ は、0～5であり；そして

$r$ は、0～5である；

で示される化合物または製薬上許容されるその塩の使用。

【請求項12】

前記細胞増殖が阻害されることを特徴とする、請求項11に記載の使用。

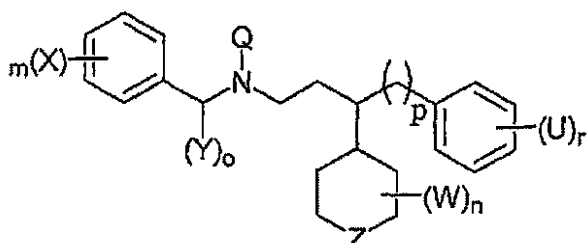
【請求項13】

前記細胞が非癌細胞である、請求項11に記載の使用。

【請求項14】

細胞、血液、組織、器官、または生物を保存する方法であって、該血液、組織、または器官を有効量の式(I)：

【化7】



(I)

〔式中、

$X$ 、 $W$ 、および $U$ は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、アルコキシ、アルキルアミノ、分枝状もしくは非分枝状 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルキニル、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルホニル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、置換もしくは無置換アリール、置換もしくは無置換ヘテロアリール、置換もしくは無置換ヘテロ環、置換もしくは無置換シクロアルキル、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_1$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_1$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_1\text{R}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_1\text{OR}_2$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}_1\text{R}_2$ 、 $-\text{NR}_1\text{SO}_2\text{R}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{NR}_1\text{R}_2$ 、 $-\text{NR}_1\text{C}(=\text{O})\text{R}_2$ 、 $-\text{NR}_1\text{C}(=\text{O})(\text{CH}_2)_q\text{OR}_2$ 、 $-\text{NR}_1\text{C}(=\text{O})(\text{CH}_2)_q\text{R}_2$ 、 $\text{NR}_1\text{C}(=\text{O})(\text{CH}_2)_q\text{NR}_1\text{R}_2$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_q\text{NR}_1\text{R}_2$ であり；

$\text{R}_1$ および $\text{R}_2$ は、独立して、Hまたは分枝状もしくは非分枝状 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキルであり；

$\text{Y}$ は、それぞれ独立して、H、分枝状もしくは非分枝状 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキルであるか、または $o$ が1であるとき、 $\text{Y}$ は $(=\text{O})$ であってもよく；

$\text{Z}$ は、CまたはOであり；

$\text{Q}$ は、H、分枝状もしくは非分枝状 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキルであり；

$m$ は、0～5であり；

$n$ は、0～8であり；

$o$ は、0～2であり；

$p$ は、0～2であり；

$q$ は、0～5であり；そして

rは、0～5である]

で示される化合物または製薬上許容されるその塩に接触させることを含む、上記方法。

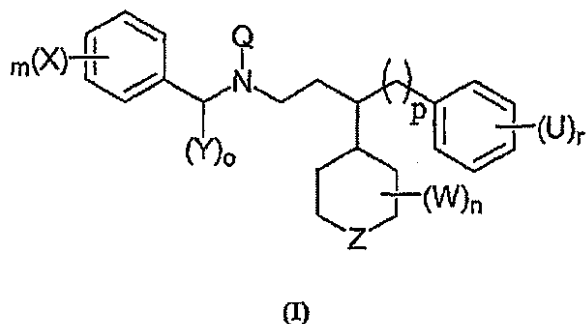
【請求項15】

前記細胞、血液、組織、または器官が低温保存される、請求項14に記載の方法。

【請求項16】

化学療法または放射線療法の副作用を治療または予防するための医薬の製造における、式(1)：

【化8】



[式中、

X、W、およびUは、それぞれ独立して、H、ハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、アルコキシ、アルキルアミノ、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルホニル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、置換もしくは無置換アリール、置換もしくは無置換ヘテロアリール、置換もしくは無置換ヘテロ環、置換もしくは無置換シクロアルキル、 $-C(=O)OR_1$ 、 $-OC(=O)R_1$ 、 $-C(=O)NR_1R_2$ 、 $-C(=O)NR_1OR_2$ 、 $-SO_2NR_1R_2$ 、 $-NR_1SO_2R_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR_1R_2$ 、 $-NR_1C(=O)R_2$ 、 $-NR_1C(=O)(CH_2)_qOR_2$ 、 $-NR_1C(=O)(CH_2)_qR_2$ 、 $NR_1C(=O)(CH_2)_qNR_1R_2$ 、 $-O(CH_2)_qNR_1R_2$ であり；

$R_1$ および $R_2$ は、独立して、Hまたは分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；

Yは、それぞれ独立して、H、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであるか、またはoが1であるとき、Yは $(=O)$ であってもよく；

Zは、CまたはOであり；

Qは、H、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；

mは、0～5であり；

nは、0～8であり；

oは、0～2であり；

pは、0～2であり；

qは、0～5であり；そして

rは、0～5である]

で示される化合物または製薬上許容されるその塩の使用。

【請求項17】

前記副作用が脱毛である、請求項16に記載の使用。

【請求項18】

前記副作用が低血球数である、請求項16に記載の使用。

【請求項19】

前記副作用が悪心である、請求項16に記載の使用。

【請求項20】

前記副作用が下痢である、請求項16に記載の使用。

【請求項21】

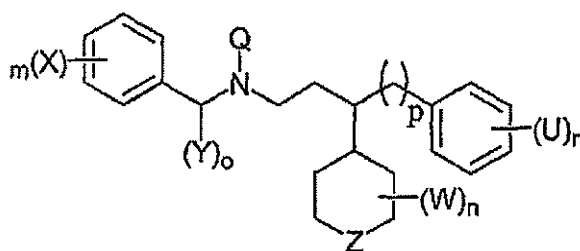
前記副作用が口腔病変である、請求項16に記載の使用。

【請求項22】

哺乳動物幹細胞の分化または成熟を調節または制御するための医薬の製造における、式

(I) :

【化 9】



(I)

〔式中、

X、W、およびUは、それぞれ独立して、H、ハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、アルコキシ、アルキルアミノ、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルホニル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、置換もしくは無置換アリール、置換もしくは無置換ヘテロアリール、置換もしくは無置換ヘテロ環、置換もしくは無置換シクロアルキル、 $-C(=O)OR_1$ 、 $-OC(=O)R_1$ 、 $-C(=O)NR_1R_2$ 、 $-C(=O)NR_1OR_2$ 、 $-SO_2NR_1R_2$ 、 $-NR_1SO_2R_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR_1R_2$ 、 $-NR_1C(=O)R_2$ 、 $-NR_1C(=O)(CH_2)_qOR_2$ 、 $-NR_1C(=O)(CH_2)_qR_2$ 、 $NR_1C(=O)(CH_2)_qNR_1R_2$ 、 $-O(CH_2)_qNR_1R_2$ であり；

$R_1$ および $R_2$ は、独立して、Hまたは分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；

Yは、それぞれ独立して、H、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであるか、またはoが1であるとき、Yは $(=O)$ であってもよく；

Zは、CまたはOであり；

Qは、H、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；

mは、0～5であり；

nは、0～8であり；

oは、0～2であり；

pは、0～2であり；

qは、0～5であり；そして

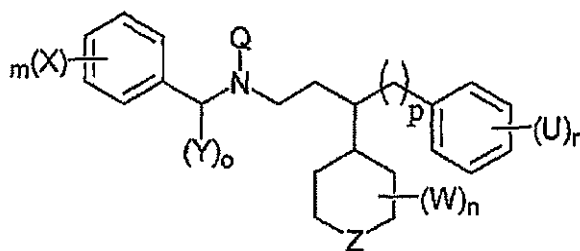
rは、0～5である〕

で示される化合物または製薬上許容されるその塩の使用。

【請求項 23】

リガーゼのモジュレーションに関連する疾患の治療に好適な医薬組成物であって、式(I)

【化 10】



(I)

〔式中、

X、W、およびUは、それぞれ独立して、H、ハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、アルコキシ、アルキルアミノ、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルホニル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、置換もしくは無置換アリール



ル、置換もしくは無置換ヘテロアリール、置換もしくは無置換ヘテロ環、置換もしくは無置換シクロアルキル、 $-C(=O)OR_1$ 、 $-OC(=O)R_1$ 、 $-C(=O)NR_1R_2$ 、 $-C(=O)NR_1OR_2$ 、 $-SO_2NR_1R_2$ 、 $-NR_1SO_2R_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR_1R_2$ 、 $-NR_1C(=O)R_2$ 、 $-NR_1C(=O)(CH_2)_qOR_2$ 、 $-NR_1C(=O)(CH_2)_qR_2$ 、 $NR_1C(=O)(CH_2)_qNR_1R_2$ 、 $-O(CH_2)_qNR_1R_2$ であり；

$R_1$ および $R_2$ は、独立して、Hまたは分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；

Yは、それぞれ独立して、H、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであるか、またはoが1であるとき、Yは(=O)であってもよく；

Zは、Oであり；

Qは、H、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；

mは、0～5であり；

nは、0～8であり；

oは、0～2であり；

pは、0～2であり；

qは、0～5であり；そして

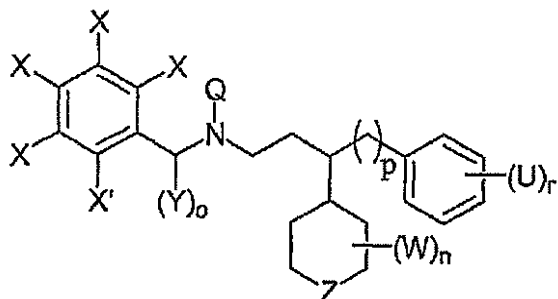
rは、0～5である；

で示される化合物または製薬上許容されるその塩と、製薬上許容される担体と、を含む、上記医薬組成物。

#### 【請求項24】

リガーゼのモジュレーションに関連する疾患の治療に好適な医薬組成物であって、式(I)

#### 【化11】



(III)

〔式中、

X、W、およびUは、それぞれ独立して、H、ハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、アルコキシ、アルキルアミノ、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルホニル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、置換もしくは無置換アリール、置換もしくは無置換ヘテロアリール、置換もしくは無置換ヘテロ環、置換もしくは無置換シクロアルキル、 $-C(=O)OR_1$ 、 $-OC(=O)R_1$ 、 $-C(=O)NR_1R_2$ 、 $-C(=O)NR_1OR_2$ 、 $-SO_2NR_1R_2$ 、 $-NR_1SO_2R_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR_1R_2$ 、 $-NR_1C(=O)R_2$ 、 $-NR_1C(=O)(CH_2)_qOR_2$ 、 $-NR_1C(=O)(CH_2)_qR_2$ 、 $NR_1C(=O)(CH_2)_qNR_1R_2$ 、 $-O(CH_2)_qNR_1R_2$ であり；

X'は、H、ヒドロキシ、カルボキシ、アルコキシ、アルキルアミノ、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、ハロアルキル、アシルオキシ、チオアルキル、スルホニル、スルフィニルアルキル、スルホニルアルキル、ヒドロキシアルキル、置換もしくは無置換アリール、置換もしくは無置換ヘテロアリール、置換もしくは無置換ヘテロ環、置換もしくは無置換シクロアルキル、 $-C(=O)OR_1$ 、 $-OC(=O)R_1$ 、 $-C(=O)NR_1R_2$ 、 $-C(=O)NR_1OR_2$ 、 $-SO_2NR_1R_2$ 、 $-NR_1SO_2R_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR_1R_2$ 、 $-NR_1C(=O)R_2$ 、 $-NR_1C(=O)(CH_2)_qOR_2$ 、 $-NR_1C(=O)(CH_2)_qR_2$ 、 $NR_1C(=O)(CH_2)_qNR_1R_2$ 、 $-O(CH_2)_qNR_1R_2$ であり；

$R_1$ および $R_2$ は、独立して、Hまたは分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；

Yは、それぞれ独立して、H、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであるか、またはoが1であるとき、Yは(=0)であってもよく；

Zは、CまたはOであり；

Qは、H、分枝状もしくは非分枝状 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり；

nは、0～8であり；

oは、0～2であり；

pは、0～2であり；

qは、0～5であり；

rは、0～5であり；そして

X、X'、U、またはWのうちの1つは、Hでない]

で示される化合物または製薬上許容されるその塩と、製薬上許容される担体と、を含む、上記医薬組成物。