

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成19年5月10日(2007.5.10)

【公表番号】特表2006-523704(P2006-523704A)

【公表日】平成18年10月19日(2006.10.19)

【年通号数】公開・登録公報2006-041

【出願番号】特願2006-510018(P2006-510018)

【国際特許分類】

C 0 7 D	217/06	(2006.01)
C 0 7 D	401/08	(2006.01)
C 0 7 D	471/04	(2006.01)
C 0 7 D	519/00	(2006.01)
C 0 7 D	487/08	(2006.01)
C 0 7 D	409/08	(2006.01)
C 0 7 D	413/08	(2006.01)
C 0 7 D	491/08	(2006.01)
C 0 7 D	401/14	(2006.01)
A 6 1 K	31/4725	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
A 6 1 K	31/4545	(2006.01)
A 6 1 K	31/438	(2006.01)
A 6 1 K	31/4375	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 K	31/5386	(2006.01)
A 6 1 K	31/551	(2006.01)
A 6 1 K	31/553	(2006.01)
A 6 1 K	31/506	(2006.01)
A 6 1 K	31/55	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/02	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/02	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	21/04	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	5/14	(2006.01)
A 6 1 P	19/08	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/04	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 35/02 (2006.01)
A 6 1 P 7/00 (2006.01)
A 6 1 P 31/18 (2006.01)
A 6 1 P 31/12 (2006.01)
A 6 1 P 37/04 (2006.01)
A 6 1 P 33/00 (2006.01)
A 6 1 P 33/10 (2006.01)
A 6 1 P 31/22 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 217/06
 C 0 7 D 401/08 C S P
 C 0 7 D 471/04 1 1 3
 C 0 7 D 519/00 3 1 1
 C 0 7 D 519/00 3 0 1
 C 0 7 D 487/08
 C 0 7 D 409/08
 C 0 7 D 413/08
 C 0 7 D 491/08
 C 0 7 D 401/14
 A 6 1 K 31/4725
 A 6 1 K 31/496
 A 6 1 K 31/4545
 A 6 1 K 31/438
 A 6 1 K 31/4375
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 K 31/5386
 A 6 1 K 31/551
 A 6 1 K 31/553
 A 6 1 K 31/506
 A 6 1 K 31/55
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 31/04
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 11/02
 A 6 1 P 37/08
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 21/00
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 21/04
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 5/14
 A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 17/04
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 9/10 1 0 1
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 7/00
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 37/04
 A 6 1 P 33/00
 A 6 1 P 33/10
 A 6 1 P 31/22

【手続補正書】

【提出日】平成19年3月15日(2007.3.15)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

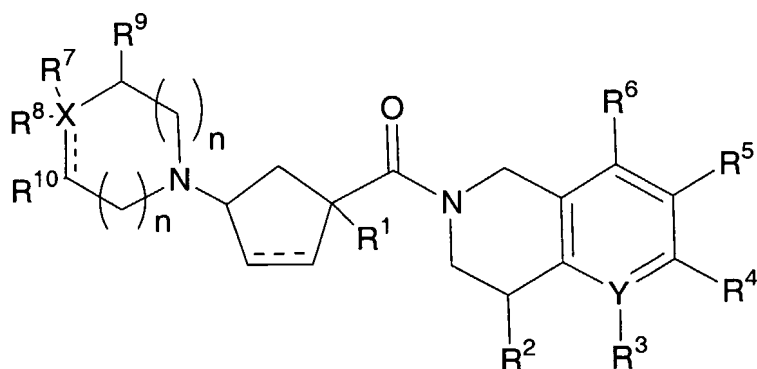
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物ならびに製薬上許容されるその塩およびその各ジアステレオマー

【化1】



式I

[式中、

XはC、N、O、SおよびSO₂からなる群から選択され、

YはNまたはCであり、

R¹は水素、-C₁~6アルキル、-C₀~6アルキル-O-C₁~6アルキル、-C₀~6アルキル-S-C₁~6アルキル、-(C₀~6アルキル)-(C₃~7シクロアルキル)-(C₀~6アルキル)、ヒドロキシ、複素環、-CN、-NR^{1 2}R^{1 2}、-NR^{1 2}COR^{1 3}、-NR^{1 2}SO₂R^{1 4}、-COR^{1 1}、-CONR^{1 2}R^{1 2}およびフェニルからなる群から選択され、

R^{1 1}は独立にヒドロキシ、水素、C₁~6アルキル、-O-C₁~6アルキル、ベンジル、フェニルおよびC₃~6シクロアルキルからなる群から選択され、ここで前記アルキル、フェニル、ベンジルおよびシクロアルキル基は非置換でも1~3個の置換基で置換されたものでもよく、その置換基は独立にハロ、ヒドロキシ、C₁~3アルキル、C₁~

$_3$ アルコキシ、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2-C_1-6$ アルキルおよびトリフルオロメチルからなる群から選択され、

R^{12} は水素、 C_1-6 アルキル、ベンジル、フェニルおよび C_3-6 シクロアルキルからなる群から選択され、ここでアルキル、フェニル、ベンジルおよびシクロアルキル基は非置換でも1~3個の置換基で置換されたものでもよく、その置換基は独立にハロ、ヒドロキシ、 C_1-3 アルキル、 C_1-3 アルコキシ、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2-C_1-6$ アルキルおよびトリフルオロメチルからなる群から選択され、

R^{13} は水素、 C_1-6 アルキル、 $-O-C_1-6$ アルキル、ベンジル、フェニルおよび C_3-6 シクロアルキルからなる群から選択され、ここでアルキル、フェニル、ベンジルおよびシクロアルキル基は非置換でも1~3個の置換基で置換されたものでもよく、その置換基は独立にハロ、ヒドロキシ、 C_1-3 アルキル、 C_1-3 アルコキシ、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2-C_1-6$ アルキルおよびトリフルオロメチルからなる群から選択され、

R^{14} はヒドロキシ、 C_1-6 アルキル、 $-O-C_1-6$ アルキル、ベンジル、フェニルおよび C_3-6 シクロアルキルからなる群から選択され、ここでアルキル、フェニル、ベンジルおよびシクロアルキル基は非置換でも1~3個の置換基で置換されたものでもよく、その置換基は独立にハロ、ヒドロキシ、 C_1-3 アルキル、 C_1-3 アルコキシ、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2-C_1-6$ アルキルおよびトリフルオロメチルからなる群から選択され、

前記アルキルおよび前記シクロアルキルが非置換であるかまたは1~7個の置換基で置換されており、前記置換基は独立に

- (a) ハロ、
- (b) ヒドロキシ、
- (c) $-O-C_1-3$ アルキル、
- (d) トリフルオロメチル、
- (f) C_1-3 アルキル、
- (g) $-O-C_1-3$ アルキル、
- (h) $-COR^{11}$ 、
- (i) $-SO_2R^{14}$ 、
- (j) $-NHCOCH_3$ 、
- (k) $-NH SO_2CH_3$ 、
- (l) 複素環、
- (m) $=O$ および
- (n) $-CN$

からなる群から選択され、

また前記フェニルおよび複素環は非置換であるか1~3個の置換基で置換されており、前記置換基は独立にハロ、ヒドロキシ、 C_1-3 アルキル、 C_1-3 アルコキシおよびトリフルオロメチルからなる群から選択され、

R^2 は

- (a) 水素、
- (b) ヒドロキシ、
- (c) ハロ、
- (d) C_1-3 アルキル、(アルキルは非置換であるかまたは独立にフルオロおよびヒドロキシから選択される1~6個の置換基で置換されている)
- (e) $-NR^{12}R^{12}$ 、
- (f) $-COR^{11}$ 、
- (g) $-CONR^{12}R^{12}$ 、
- (h) $-NR^{12}COR^{13}$ 、
- (i) $-OCONR^{12}R^{12}$ 、
- (j) $-NR^{12}CONR^{12}R^{12}$ 、
- (k) 複素環、

- (l) - C N、
 (m) - $\text{NR}^{1\ 2} - \text{SO}_2 - \text{NR}^{1\ 2} \text{R}^{1\ 2}$ 、
 (n) - $\text{NR}^{1\ 2} - \text{SO}_2 - \text{R}^{1\ 4}$ 、
 (o) - $\text{SO}_2 - \text{NR}^{1\ 2} \text{R}^{1\ 2}$ および
 (p) = O、(R^2 は二重結合を介して環に結合している)

からなる群から選択され、

R^3 は酸素であり、または Y が N の場合は不在であり、

R^3 は Y が C の場合は、

(a) 水素、

(b) ヒドロキシ、

(c) ハロ、

(d) $\text{C}_{1\sim3}$ アルキル (アルキルは非置換であるかまたは独立にフルオロ、ヒドロキシおよび $-\text{COR}^{1\ 1}$ から選択される 1 ~ 6 個の置換基で置換されている)

(e) - $\text{NR}^{1\ 2} \text{R}^{1\ 2}$ 、

(f) - $\text{COR}^{1\ 1}$ 、

(g) - $\text{CONR}^{1\ 2} \text{R}^{1\ 2}$ 、

(h) - $\text{NR}^{1\ 2} \text{COR}^{1\ 3}$ 、

(i) - $\text{OCONR}^{1\ 2} \text{R}^{1\ 2}$ 、

(j) - $\text{NR}^{1\ 2} \text{CONR}^{1\ 2} \text{R}^{1\ 2}$ 、

(k) - 複素環、

(l) - C N

(m) - $\text{NR}^{1\ 2} - \text{SO}_2 - \text{NR}^{1\ 2} \text{R}^{1\ 2}$ 、

(n) - $\text{NR}^{1\ 2} - \text{SO}_2 - \text{R}^{1\ 4}$ 、

(o) - $\text{SO}_2 - \text{NR}^{1\ 2} \text{R}^{1\ 2}$ および

(p) ニトロ

から選択され、

R^4 は

(a) 水素、

(b) $\text{C}_{1\sim6}$ アルキル、

(c) トリフルオロメチル、

(d) トリフルオロメトキシ、

(e) クロロ、

(f) フルオロ、

(g) プロモおよび

(h) フェニル

からなる群から選択され、

R^5 は

(a) $\text{C}_{1\sim6}$ アルキル (アルキルは非置換でも 1 ~ 6 個のフルオロで置換されたものでもよく、場合によってはヒドロキシルで置換されたものでもよい)

(b) - O - $\text{C}_{1\sim6}$ アルキル (アルキルは非置換でも 1 ~ 6 個のフルオロで置換されたものでもよい)

(c) - CO - $\text{C}_{1\sim6}$ アルキル (アルキルは非置換でも 1 ~ 6 個のフルオロで置換されたものでもよい)

(d) - S - $\text{C}_{1\sim6}$ アルキル (アルキルは非置換でも 1 ~ 6 個のフルオロで置換されたものでもよい)

(e) - ピリジル (非置換でもハロ、トリフルオロメチル、 $\text{C}_{1\sim4}$ アルキルおよび $\text{COR}^{1\ 1}$ からなる群から選択される 1 個または複数の置換基で置換されたものでもよい)

(f) フルオロ、

(g) クロロ、

(h) プロモ、

(i) - $C_4 \sim 6$ シクロアルキル、
 (j) - $O - C_4 \sim 6$ シクロアルキル、
 (k) フェニル (非置換でもハロ、トリフルオロメチル、 $C_1 \sim 4$ アルキルおよび COR^{11} からなる群から選択される 1 種または複数の置換基で置換されたものでもよい)、
 (l) - O - フェニル (非置換でもハロ、トリフルオロメチル、 $C_1 \sim 4$ アルキルおよび COR^{11} からなる群から選択される 1 種または複数の置換基で置換されたものでもよい)、

(m) - $C_3 \sim 6$ シクロアルキル (アルキルは非置換でも $\sim 1 \sim 6$ 個のフルオロで置換されたものでもよい)、

(n) - $O - C_3 \sim 6$ シクロアルキル (アルキルは非置換でも $1 \sim 6$ 個のフルオロで置換されたものでもよい)、

(o) - 複素環、

(p) - CN および

(q) - COR^{11}

からなる群から選択され、

R^6 は

(a) 水素、

(b) $C_1 \sim 6$ アルキル、

(c) トリフルオロメチル、

(d) フルオロ、

(e) クロロおよび

(f) ブロモ

から選択され、

R^7 は水素、($C_0 \sim 6$ アルキル) - フェニル、($C_0 \sim 6$ アルキル) - 複素環、($C_0 \sim 6$ アルキル) - $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、($C_0 \sim 6$ アルキル) - COR^{11} 、($C_0 \sim 6$ アルキル) - (アルケン) - COR^{11} 、($C_0 \sim 6$ アルキル) - SO_3H 、($C_0 \sim 6$ アルキル) - $W - C_0 \sim 4$ アルキル、($C_0 \sim 6$ アルキル) - $CONR^{12}$ - フェニル、($C_0 \sim 6$ アルキル) - $CONR^{15}$ - $V - COR^{11}$ 、および不在 (X が O 、 S 、または SO_2 の場合) から選択され、ここで V は $C_1 \sim 6$ アルキルまたはフェニルであり、 W は単結合、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-CO-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-CONR^{12}$ - および $-NR^{12}$ - からなる群から選択され、

ここで、 R^{15} は水素、 $C_1 \sim 4$ アルキルであってもよく、または R^{15} が $1 \sim 5$ 個の炭素鎖を介して V の炭素の 1 つに結合して環を形成し、

$C_0 \sim 6$ アルキルは非置換でも $1 \sim 5$ 個の置換基で置換されたものでもよく、前記置換基は独立に

(a) ハロ、

(b) ヒドロキシ、

(c) - $C_0 \sim 6$ アルキル、

(d) - $O - C_1 \sim 3$ アルキル、

(e) トリフルオロメチルおよび

(f) - $C_0 \sim 2$ アルキル - フェニル

から選択され、

前記フェニル、複素環、シクロアルキル、 $C_0 \sim 4$ アルキルは非置換でも $1 \sim 5$ 個の置換基で置換されたものでもよく、前記置換基は独立に

(a) ハロ、

(b) トリフルオロメチル、

(c) ヒドロキシ、

(d) $C_1 \sim 3$ アルキル、

(e) - $O - C_1 \sim 3$ アルキル、

(f) - $C_0 \sim 3 - COR^{11}$ 、

- (g) - CN、
 - (h) - $\text{NR}^{1\ 2} \text{R}^{1\ 2}$ 、
 - (i) - $\text{CONR}^{1\ 2} \text{R}^{1\ 2}$ および
 - (j) - C_{0-3} - 複素環
- からなる群から選択され、

あるいはフェニルおよび複素環は別の複素環と縮合していてもよく、それ自体は非置換でも独立にヒドロキシ、ハロ、 $-\text{COR}^{1\ 1}$ 、 $-\text{C}_{1-3}$ アルキルから選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換されたものでもよく、

アルケン是非置換でも独立に

- (a) ハロ、
- (b) トリフルオロメチル、
- (c) C_{1-3} アルキル、
- (d) フェニルおよび
- (e) 複素環

からなる群から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたものでもよく、
 R^8 は

- (a) 水素、
- (b) X が O、S、 SO_2 または N である場合あるいは二重結合が R^7 および $\text{R}^{1\ 0}$ が付いている炭素に結合している場合には不在、
- (c) ヒドロキシ、
- (d) C_{1-6} アルキル、
- (e) C_{1-6} アルキル - ヒドロキシ、
- (f) $-\text{O}-\text{C}_{1-3}$ アルキル、
- (g) $-\text{COR}^{1\ 1}$ 、
- (h) $-\text{CONR}^{1\ 2} \text{R}^{1\ 2}$ および
- (i) - CN

からなる群から選択され、

あるいは R^7 と R^8 は一緒になって、

- (a) 1H - インデン、
- (b) 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン、
- (c) 2, 3 - ジヒドロ - ベンゾフラン、
- (d) 1, 3 - ジヒドロ - イソベンゾフラン、
- (e) 2, 3 - ジヒドロベンゾチオフラン、
- (f) 1, 3 - ジヒドロ - イソベンゾチオフラン、
- (g) 6H - シクロペンタ [d] イソオキサゾール - 3 - オール、
- (h) シクロペンタンおよび
- (i) シクロヘキサン

からなる群から選択される環を形成し、

ここで形成された前記環は非置換でも独立に

- (a) ハロ、
- (b) トリフルオロメチル、
- (c) ヒドロキシ、
- (d) C_{1-3} アルキル、
- (e) $-\text{O}-\text{C}_{1-3}$ アルキル、
- (f) $-\text{C}_{0-3}-\text{COR}^{1\ 1}$ 、
- (g) - CN、
- (h) $-\text{NR}^{1\ 2} \text{R}^{1\ 2}$ 、
- (i) $-\text{CONR}^{1\ 2} \text{R}^{1\ 2}$ および
- (j) $-\text{C}_{0-3}$ - 複素環

からなる群から選択される 1 ~ 5 個の置換基で置換されたものでもよく、

あるいは R^7 と R^9 または R^8 と R^{10} は一緒になってフェニルまたは複素環となる環を形成していてもよく、前記環は非置換でも独立に

- (a) ハロ、
- (b) トリフルオロメチル、
- (c) ヒドロキシ、
- (d) C_{1-3} アルキル、
- (e) $-O-C_{1-3}$ アルキル、
- (f) $-COR^{11}$ 、
- (g) $-CN$ 、
- (h) $-NR^{12}R^{12}$ および
- (i) $-CONR^{12}R^{12}$

からなる群から選択される 1 ~ 7 個の置換基で置換されたものでもよく、 R^9 および R^{10} は独立に

- (a) 水素、
- (b) ヒドロキシ、
- (c) C_{1-6} アルキル、
- (d) C_{1-6} アルキル $-COR^{11}$ 、
- (e) C_{1-6} アルキル $-ヒドロキシ$ 、
- (f) $-O-C_{1-3}$ アルキル、
- (g) $=O$ (R^9 または R^{10} は二重結合を介して環に結合している) および
- (h) ハロ

からなる群から選択され、

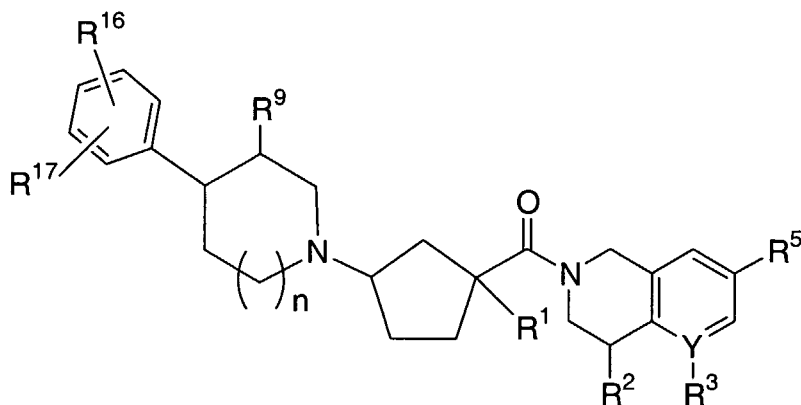
n は 0、1 および 2 から選択され、

破線は単結合または二重結合を表す]。

【請求項 2】

式 I a を有する請求項 1 に記載の化合物ならびに製薬上許容されるそれらの塩および各ジアステレオマー

【化 2】



Ia

[式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^9 、 Y および n は請求項 1 に記載の通りであり、 R^{16} および R^{17} は独立に

- (a) 水素、
- (b) ハロ、
- (c) トリフルオロメチル、
- (d) ヒドロキシ、
- (e) C_{1-3} アルキル、
- (f) $-O-C_{1-3}$ アルキル、

(g) - C₀ - ₃ - CO₂ H、

(h) - C₀ - ₃ - CO₂ C₁ - ₃ アルキル、

(i) - CNおよび

(j) - C₀ - ₃ - 複素環

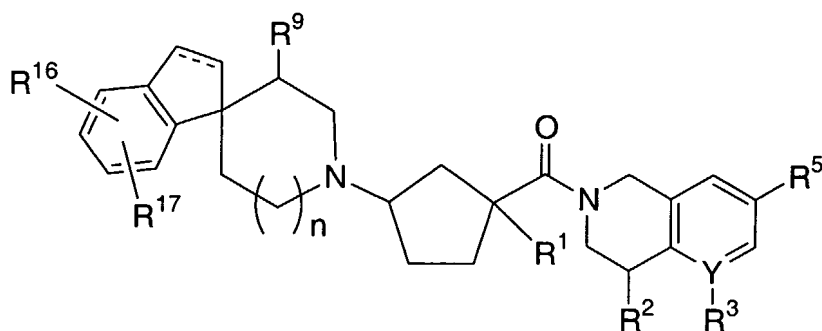
からなる群から選択されるか、

または R¹⁶ と R¹⁷ は一緒になってフェニル環に縮合した複素環を形成し、その環自体は非置換でも独立にヒドロキシ、ハロ、-COR¹¹ および -C₁ - ₃ アルキルから選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換されたものでもよい]。

【請求項 3】

式 I b を有する請求項 1 に記載の化合物ならびに製薬上許容されるその塩およびその各ジアステレオマー

【化 3】



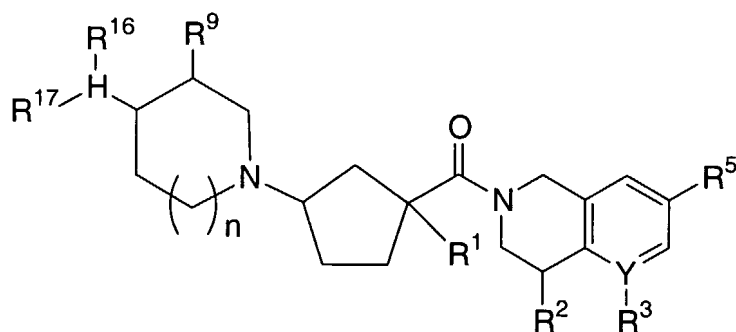
Ib

[式中、破線は単結合または二重結合を表し、R¹、R²、R³、R⁵、R⁹、R¹⁶、R¹⁷、Y および n は請求項 1 に記載の通りである]。

【請求項 4】

式 I c を有する請求項 1 に記載の化合物ならびに製薬上許容されるその塩およびその各ジアステレオマー

【化 4】



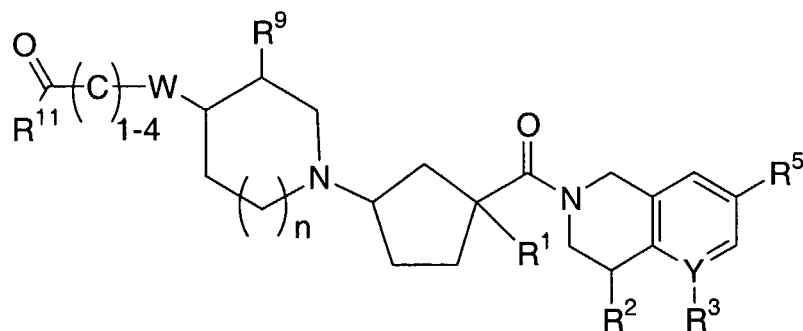
Ic

[式中、R¹、R²、R³、R⁵、R⁹、R¹⁶、R¹⁷、Y および n は請求項 1 に記載の通りであり、H は複素環である]。

【請求項 5】

式 I d を有する請求項 1 に記載の化合物ならびに製薬上許容されるその塩およびその各ジアステレオマー

【化 5】



Id

[式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^9 、 R^{11} 、Y、Wおよびnは請求項1に記載の通りであり、

前記 C_{1-4} 炭素鎖は非置換でも独立に

- (a) ハロ、
- (b) ヒドロキシ、
- (c) $-C_{0-6}$ アルキル、
- (d) $-O-C_{1-3}$ アルキル、
- (e) トリフルオロメチルおよび
- (f) $-C_{0-2}$ アルキル-フェニル

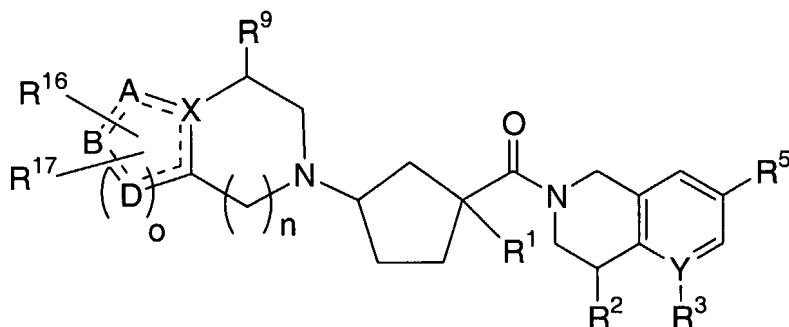
からなる群から選択される1~4個の置換基で置換されたものでもよく、

または前記 C_{1-4} 炭素鎖は C_{3-7} シクロアルキル環に含まれていてもよい]。

【請求項6】

式Ieを有する請求項1に記載の化合物ならびに製薬上許容されるその塩およびその各ジアステレオマー

【化 6】



Ie

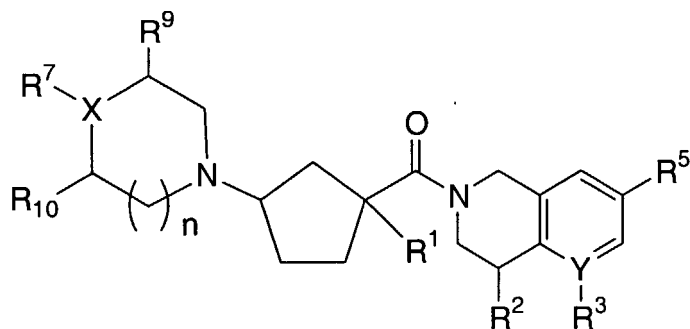
[式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^9 、 R^{16} 、 R^{17} 、X、Yおよびnは請求項1に記載の通りであり、破線は単結合または二重結合のいずれかを表すものであり、oは1または2であり得、

A、BおよびDは、独立にC、N、OまたはSから選択されて、フェニル環(X、A、B、DのすべてがCであり、 $o = 2$ の場合)を作るか、または複素環を作る(X、A、B、Dの少なくとも1つがN、OまたはSであってCでない場合)]。

【請求項7】

式Ifを有する請求項1に記載の化合物ならびに製薬上許容されるその塩およびその各ジアステレオマー

【化 7】



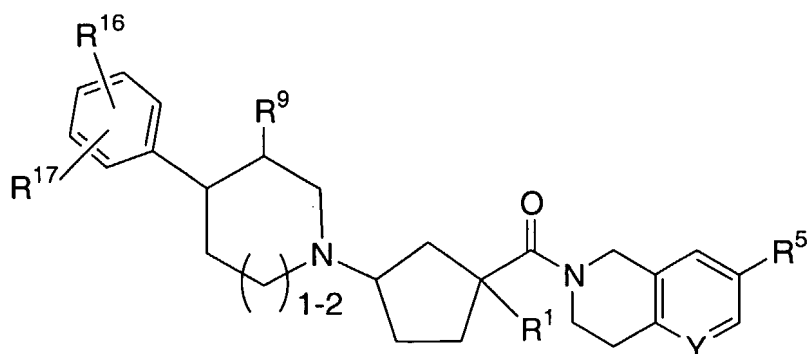
If

[式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} 、Yおよびnは請求項1に記載の通りであり、XはNまたはO（この場合は R^7 は不在である）のいずれかである]。

【請求項 8】

式 Ig を有する請求項1に記載の化合物ならびに製薬上許容されるその塩およびその各ジアステレオマー

【化 8】



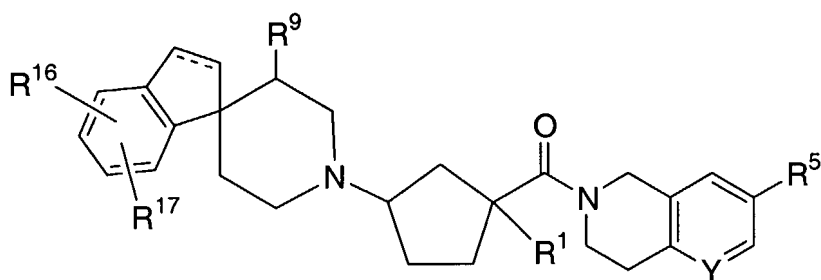
Ig

[式中、 R^1 、 R^5 、 R^9 、 R^{16} 、 R^{17} および Y は請求項1に記載の通りであり、あるいは R^{16} と R^{17} が一緒になってフェニル環と縮合した複素環を形成し、その環自体は非置換でも独立にヒドロキシ、ハロ、 $-COR^{11}$ および $-C_{1-3}$ アルキルからなる群から選択される1~2個の置換基で置換されたものでもよい]。

【請求項 9】

式 Ih を有する請求項1に記載の化合物ならびに製薬上許容されるその塩ならびにその各ジアステレオマー

【化 9】



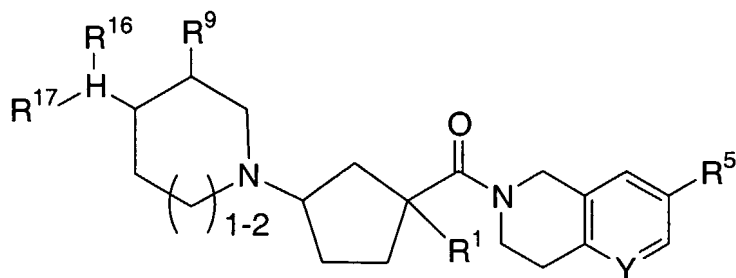
Ih

[式中、破線は単結合または二重結合を表し、 R^1 、 R^5 、 R^9 、 R^{16} 、 R^{17} および Y は本明細書で定義されたものである]。

【請求項 10】

式 I i を有する請求項 1 に記載の化合物ならびに製薬上許容されるその塩およびその各ジアステレオマー

【化 10】



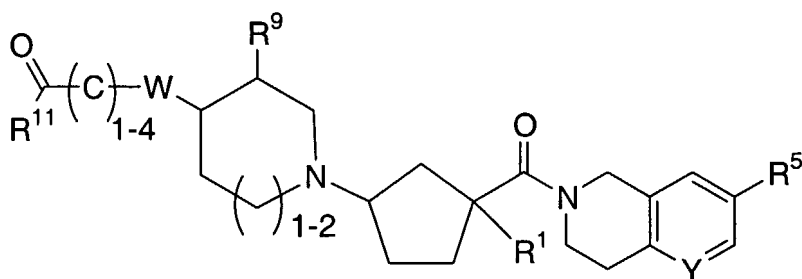
Ii

[式中、 R^1 、 R^5 、 R^9 、 R^{16} 、 R^{17} および Y は本明細書で定義の通りであり、H は複素環である]。

【請求項 11】

式 I j を有する請求項 1 に記載の化合物ならびに製薬上許容されるその塩およびその各立体異性体

【化 11】



Ij

[式中、 R^1 、 R^5 、 R^9 、 R^{11} 、Y、W は本明細書で定義の通りであり、

C_{1-4} 炭素鎖は非置換でも独立に

(a) ハロ、

(b) ヒドロキシ、

(c) $-C_{0-6}$ アルキル、

(d) $-O-C_{1-3}$ アルキル、

(e) トリフルオロメチルおよび

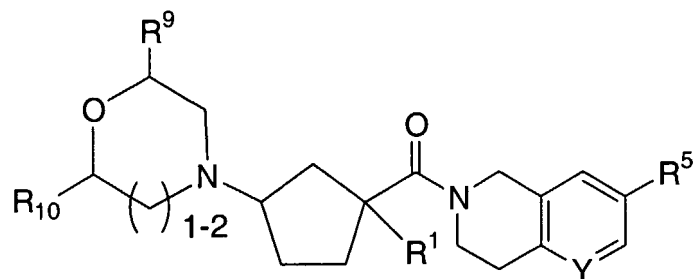
(f) $-C_{0-2}$ アルキル - フェニル

からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換されたものでもよい]。

【請求項 12】

式 I k を有する請求項 1 に記載の化合物ならびに製薬上許容されるその塩およびその各ジアステレオマー

【化 1 2】



式 I k

[式中、 R^1 、 R^5 、 R^9 、 R^{10} および Y は本明細書で定義の通りである]。

【請求項 1 3】

R^1 が - C_{1-6} アルキル、- C_{0-6} アルキル - O - C_{1-6} アルキル および - (C_{0-6} (アルキル) - (C_{3-7} シクロアルキル) - (C_{0-6} アルキル) からなる群から選択されるものであり、

アルキルおよびシクロアルキルが非置換であるかまたは 1 ~ 7 個の置換基で置換されたものであり、その置換基が独立に

- (a) ハロ、
- (b) ヒドロキシ、
- (c) - O - C_{1-3} アルキル、
- (d) トリフルオロメチル、
- (f) C_{1-3} アルキル、
- (g) - O - C_{1-3} アルキル、
- (h) - CO R^{11} 、
- (i) - CN、
- (j) - N R^{12} R^{12} および
- (k) - CO N R^{12} R^{12}

から選択されるものである請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

R^1 が下記 (1) ~ (3)

(1) 非置換のまたは 1 ~ 6 個の置換基で置換された - C_{1-6} アルキル、その置換基は独立に

- (a) ハロ、
- (b) ヒドロキシ、
- (c) - O - C_{1-3} アルキル、
- (d) トリフルオロメチルおよび
- (e) - CO R^{11}

からなる群から選択され、

(2) 非置換のまたは 1 ~ 6 個の置換基で置換された - C_{0-6} アルキル - O - C_{1-6} アルキル - 、その置換基は独立に

- (a) ハロ、
- (b) トリフルオロメチルおよび
- (c) - CO R^{11}

からなる群から選択され、ならびに

(3) 非置換のまたは 1 ~ 7 個の置換基で置換された - (C_{3-5} シクロアルキル) - (C_{0-6} アルキル)、その置換基は独立に

- (a) ハロ、
- (b) ヒドロキシ、
- (c) - O - C_{1-3} アルキル、

(d) トリフルオロメチルおよび

(e) - C O R¹ R¹

からなる群から選択され、

からなる群から選択される請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

R¹ が、

(a) C₁ ~ 6 アルキル、

(b) ヒドロキシで置換された C₁ ~ 6 アルキルおよび

(c) 1 ~ 6 個のフルオロで置換された C₁ ~ 6 アルキル

からなる群から選択される請求項 1 4 に記載の化合物。

【請求項 1 6】

R¹ が、

(a) - C H (C H₃)₂、

(b) - C H (O H) C H₃ および

(c) - C H₂ C F₃

からなる群から選択される請求項 1 5 に記載の化合物。

【請求項 1 7】

不活性な担体および請求項 1 に記載の化合物を含む薬剤組成物。

【請求項 1 8】

有効量の請求項 1 に記載の化合物を投与することを含む、哺乳動物におけるケモカイン受容体活性の調節を行う方法。

【請求項 1 9】

有効量の請求項 1 に記載の化合物を患者に投与することを含む、炎症性および免疫調節障害または疾患の治療、改善、調節またはリスクの低減のための方法。

【請求項 2 0】

有効量の請求項 1 に記載の化合物を患者に投与することを含む慢性関節リウマチの治療、改善、調節またはリスクの低減のための方法。