

【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】令和7年3月24日(2025.3.24)

【公開番号】特開2024-125338(P2024-125338A)

【公開日】令和6年9月18日(2024.9.18)

【年通号数】公開公報(特許)2024-175

【出願番号】特願2024-98452(P2024-98452)

【国際特許分類】

C 0 7 H 15/203(2006.01)

10

C 0 7 D 309/10(2006.01)

C 0 7 H 17/075(2006.01)

A 6 1 P 25/00(2006.01)

A 6 1 P 3/10(2006.01)

A 6 1 P 13/12(2006.01)

A 6 1 P 27/02(2006.01)

A 6 1 P 9/00(2006.01)

A 6 1 P 35/00(2006.01)

A 6 1 P 43/00(2006.01)

A 6 1 K 9/06(2006.01)

20

A 6 1 K 31/7034(2006.01)

A 6 1 K 31/165(2006.01)

A 6 1 K 31/351(2006.01)

A 6 1 K 31/7048(2006.01)

A 6 1 K 9/127(2025.01)

A 6 1 K 9/08(2006.01)

A 6 1 K 9/12(2006.01)

A 6 1 K 9/72(2006.01)

C 1 2 Q 1/02(2006.01)

【F I】

30

C 0 7 H 15/203 C S P

C 0 7 D 309/10 Z N A

C 0 7 H 17/075

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

40

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 31/7034

A 6 1 K 31/165

A 6 1 K 31/351

A 6 1 K 31/7048

A 6 1 K 9/127

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/12

A 6 1 K 9/72

C 1 2 Q 1/02

50

C O 7 D 3 0 9 / 1 0

C O 7 H 1 5 / 2 0 3

Z N A

【手続補正書】

【提出日】令和7年3月13日(2025.3.13)

【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

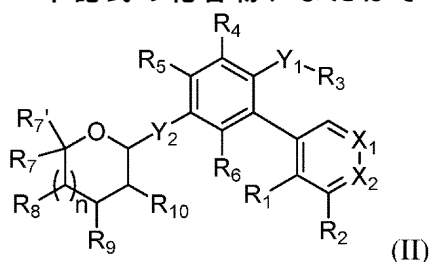
【補正の内容】

10

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式の化合物、またはその薬学的に許容される塩:



(II)

20

式中:

 n は、0、1、または2であり、 Y_1 は、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -, -C(O)-アルカンジイル ($c \leq 6$) -, またはこれらの基のいずれかの置換型であり、 Y_2 は、 CH_2 、O、またはSであり、 R_1 は、水素、アミノ、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アミド ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルスルホニル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

30

 R_2 は、水素、アミノ、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アリール ($c \leq 12$)、アラルキル ($c \leq 12$)、アミド ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルチオ ($c \leq 6$)、アルキルスルホニル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、 R_2 および R_{15} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、 R_3 は、-NR₁₁R_{11'}または-C(O)NR₁₂R_{12'}であり、式中: R_{11} および R_{11}' は、それぞれ独立して、水素、アルキル ($c \leq 6$)、置換アルキル ($c \leq 6$)、アシル ($c \leq 6$)、または置換アシル ($c \leq 6$) であり、

40

 R_{12} および R_{12}' は、それぞれ独立して、水素、アルキル ($c \leq 6$)、または置換アルキル ($c \leq 6$) であり、 R_4 、 R_5 、および R_6 は、それぞれ独立して、水素、ハロ、アルキル ($c \leq 6$)、置換アルキル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、置換アルコキシ ($c \leq 6$)、アシルオキシ ($c \leq 6$)、または置換アシルオキシ ($c \leq 6$) であり、 R_7 は、カルボキシ、もしくはアルキル ($c_3 \sim 8$)、アルケニル ($c \leq 8$)、アルキニル ($c \leq 8$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アリール ($c \leq 12$)、ヘテロアリール ($c \leq 12$)、アラルキル ($c \leq 12$)、ヘテロアラルキル ($c \leq 12$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$)-OR₁₃、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、式中: R_{13} は、アラルキル ($c \leq 12$) または置換アラルキル ($c \leq 12$) であり、

50

R_7' は、水素、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 8$)、アルケニル ($c \leq 8$)、アルキニル ($c \leq 8$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アリール ($c \leq 12$)、ヘテロアリール ($c \leq 12$)、アラルキル ($c \leq 12$)、ヘテロアラルキル ($c \leq 12$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -OR₁₃、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、式中:

R_{13} は、アラルキル ($c \leq 12$) または置換アラルキル ($c \leq 12$) であり、または

R_7 および R_7' は一緒になって、-アルカンジイル ($c \leq 7$) -、-アルケンジイル ($c \leq 7$) -、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_8 、 R_9 、および R_{10} は、それぞれ独立して、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アシル ($c \leq 6$)、アシルオキシ ($c \leq 6$)、アラルキル ($c \leq 12$)、アラルコキシ ($c \leq 12$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

X_1 は、CR₁₄またはNであり、式中:

R_{14} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルアミノ ($c \leq 6$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、または

R_{14} および R_{15} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルケンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

X_2 は、CR₁₅またはNであり、式中:

R_{15} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルアミノ ($c \leq 6$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

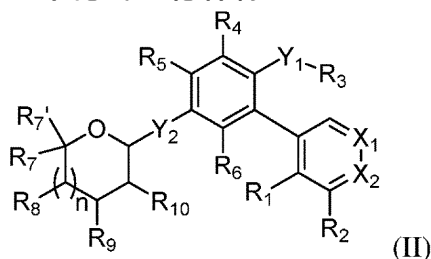
R_{15} および R_{14} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルケンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり、または

R_{15} および R_2 は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり、

これらの用語のいずれかが「置換」なる修飾語とともに用いられる場合、1つまたは複数の水素原子は、独立して-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-NH₂、-NO₂、-CO₂H、-CO₂CH₃、-CN、-SH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-C(O)CH₃、-NHCH₃、-NHCH₂CH₃、-N(CH₃)₂、-C(O)NH₂、-C(O)NHCH₃、-C(O)N(CH₃)₂、-OC(O)CH₃、-NHC(O)CH₃、-S(O)₂OH、または-S(O)₂NH₂に置き換えられている。

【請求項2】

下記式の化合物、またはその薬学的に許容される塩:



式中:

n は、0、1、または2であり、

Y_1 は、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -、-C(O)-アルカンジイル ($c \leq 6$) -、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

Y_2 は、CH₂またはSであり、

R_1 は、水素、アミノ、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アミド ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルスルホニル ($c \leq 6$)、ま

たはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_2 は、水素、アミノ、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アリール ($c \leq 12$)、アラルキル ($c \leq 12$)、アミド ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルチオ ($c \leq 6$)、アルキルスルホニル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_2 および R_{15} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_3 は、 $-NR_{11}R_{11}'$ または $-C(O)NR_{12}R_{12}'$ であり、式中：

R_{11} および R_{11}' は、それぞれ独立して、水素、アルキル ($c \leq 6$)、置換アルキル ($c \leq 6$)、アシル ($c \leq 6$)、または置換アシル ($c \leq 6$) であり、

R_{12} および R_{12}' は、それぞれ独立して、水素、アルキル ($c \leq 6$)、または置換アルキル ($c \leq 6$) であり、

R_4 、 R_5 、および R_6 は、それぞれ独立して、水素、ハロ、アルキル ($c \leq 6$)、置換アルキル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、置換アルコキシ ($c \leq 6$)、アシルオキシ ($c \leq 6$)、または置換アシルオキシ ($c \leq 6$) であり、

R_7 および R_7' は、それぞれ独立して、水素、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 8$)、アルケニル ($c \leq 8$)、アルキニル ($c \leq 8$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アリール ($c \leq 12$)、ヘテロアリール ($c \leq 12$)、アラルキル ($c \leq 12$)、ヘテロアラルキル ($c \leq 12$)、 $-アルカンジイル$ ($c \leq 6$) $-OR_{13}$ 、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、式中：

R_{13} は、アラルキル ($c \leq 12$) または置換アラルキル ($c \leq 12$) であり、

R_7 および R_7' は一緒になって、 $-アルカンジイル$ ($c \leq 7$)、 $-アルケンジイル$ ($c \leq 7$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_8 、 R_9 、および R_{10} は、それぞれ独立して、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アシル ($c \leq 6$)、アシルオキシ ($c \leq 6$)、アラルキル ($c \leq 12$)、アラルコキシ ($c \leq 12$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

X_1 は、 CR_{14} または N であり、式中：

R_{14} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルアミノ ($c \leq 6$)、 $-アルカンジイル$ ($c \leq 6$)、 $-ヘテロシクロアルキル$ ($c \leq 8$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、または

R_{14} および R_{15} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルケンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

X_2 は、 CR_{15} または N であり、式中：

R_{15} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルアミノ ($c \leq 6$)、 $-アルカンジイル$ ($c \leq 6$)、 $-ヘテロシクロアルキル$ ($c \leq 8$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

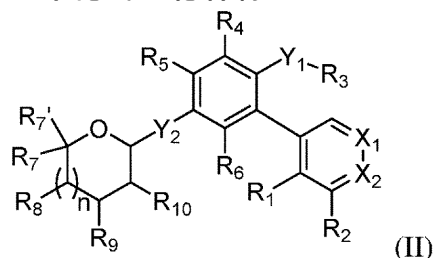
R_{15} および R_{14} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルケンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり、または

R_{15} および R_2 は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり、

これらの用語のいずれかが「置換」なる修飾語とともに用いられる場合、1つまたは複数の水素原子は、独立して $-OH$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-NH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2CH_3$ 、 $-CN$ 、 $-SH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-C(O)CH_3$ 、 $-NHCH_3$ 、 $-NHCH_2CH_3$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(O)NHCH_3$ 、 $-C(O)N(CH_3)_2$ 、 $-OC(O)CH_3$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 、 $-S(O)_2OH$ 、または $-S(O)_2NH_2$ に置き換えられている。

【請求項3】

下記式の化合物、またはその薬学的に許容される塩：



式中：

n は、0、1、または2であり、

Y_1 は、置換-アルカンジイル ($c \leq 6$) -、-C(O)-アルカンジイル ($c \leq 6$) -、または置換-C(O)-アルカンジイル ($c \leq 6$) -であり、

Y_2 は、 CH_2 、O、またはSであり、

R_1 は、水素、アミノ、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アミド ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルスルホニル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_2 は、水素、アミノ、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アリール ($c \leq 12$)、アラルキル ($c \leq 12$)、アミド ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルチオ ($c \leq 6$)、アルキルスルホニル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_2 および R_{15} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_3 は、-NR₁₁R₁₁'または-C(O)NR₁₂R₁₂'であり、式中：

R_{11} および R_{11}' は、それぞれ独立して、水素、アルキル ($c \leq 6$)、置換アルキル ($c \leq 6$)、アシル ($c \leq 6$)、または置換アシル ($c \leq 6$) であり、

R_{12} および R_{12}' は、それぞれ独立して、水素、アルキル ($c \leq 6$)、または置換アルキル ($c \leq 6$) であり、

R_4 、 R_5 、および R_6 は、それぞれ独立して、水素、ハロ、アルキル ($c \leq 6$)、置換アルキル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、置換アルコキシ ($c \leq 6$)、アシルオキシ ($c \leq 6$)、または置換アシルオキシ ($c \leq 6$) であり、

R_7 および R_7' は、それぞれ独立して、水素、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 8$)、アルケニル ($c \leq 8$)、アルキニル ($c \leq 8$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アリール ($c \leq 12$)、ヘテロアリール ($c \leq 12$)、アラルキル ($c \leq 12$)、ヘテロアラルキル ($c \leq 12$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$)-OR₁₃、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、式中：

R_{13} は、アラルキル ($c \leq 12$) または置換アラルキル ($c \leq 12$) であり、または

R_7 および R_7' は一緒になって、-アルカンジイル ($c \leq 7$) -、-アルケンジイル ($c \leq 7$) -、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_8 、 R_9 、および R_{10} は、それぞれ独立して、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アシル ($c \leq 6$)、アシルオキシ ($c \leq 6$)、アラルキル ($c \leq 12$)、アラルコキシ ($c \leq 12$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

X_1 は、CR₁₄またはNであり、式中：

R_{14} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルアミノ ($c \leq 6$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$)-ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、または

R_{14} および R_{15} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルケンジイル ($c \leq 6$)

10

20

30

40

50

、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

X_2 は、 CR_{15} またはNであり、式中：

R_{15} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルアミノ ($c \leq 6$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

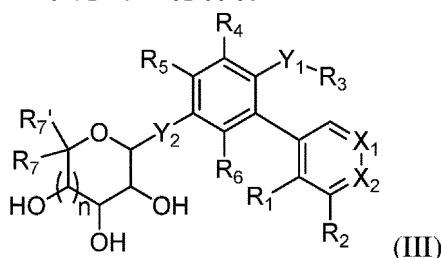
R_{15} および R_{14} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルケンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり、または

R_{15} および R_2 は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり、

これらの用語のいずれかが「置換」なる修飾語とともに用いられる場合、1つまたは複数の水素原子は、独立して-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-NH₂、-NO₂、-CO₂H、-CO₂CH₃、-CN、-SH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-C(O)CH₃、-NHCH₃、-NHCH₂CH₃、-N(CH₃)₂、-C(O)NH₂、-C(O)NHCH₃、-C(O)N(CH₃)₂、-OC(O)CH₃、-NHC(O)CH₃、-S(O)₂OH、または-S(O)₂NH₂に置き換えられている。

【請求項4】

下記式の化合物、またはその薬学的に許容される塩：



式中：

n は、1または2であり、

Y_1 は、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -、-C(O)-アルカンジイル ($c \leq 6$) -、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

Y_2 は、CH₂、O、またはSであり、

R_1 は、水素、アミノ、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アミド ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルスルホニル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_2 は、水素、アミノ、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アリール ($c \leq 12$)、アラールキル ($c \leq 12$)、アミド ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルチオ ($c \leq 6$)、アルキルスルホニル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_2 および R_{15} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_3 は、-NR₁₁R_{11'}または-C(O)NR₁₂R_{12'}であり、式中：

R_{11} および R_{11}' は、それぞれ独立して、水素、アルキル ($c \leq 6$)、置換アルキル ($c \leq 6$)、アシル ($c \leq 6$)、または置換アシル ($c \leq 6$)であり、

R_{12} および R_{12}' は、それぞれ独立して、水素、アルキル ($c \leq 6$)、または置換アルキル ($c \leq 6$)であり、

R_4 、 R_5 、および R_6 は、それぞれ独立して、水素、ハロ、アルキル ($c \leq 6$)、置換アルキル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、置換アルコキシ ($c \leq 6$)、アシルオキシ ($c \leq 6$)、または置換アシルオキシ ($c \leq 6$)であり、

R_7 および R_7' は、それぞれ独立して、水素、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 8$)、アルケニル ($c \leq 8$)、アルキニル ($c \leq 8$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アリール ($c \leq 12$)、ヘテロアリール ($c \leq 12$)、アラルキル ($c \leq 12$)、ヘテロアラルキル ($c \leq 12$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$) - OR_{13} 、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、式中:

R_{13} は、アラルキル ($c \leq 12$) または置換アラルキル ($c \leq 12$) であり、または

R_7 および R_7' は一緒になって、-アルカンジイル ($c \leq 7$) -、-アルケンジイル ($c \leq 7$) -、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

X_1 は、 CR_{14} または N であり、式中:

R_{14} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルアミノ ($c \leq 6$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、または

R_{14} および R_{15} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルケンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

X_2 は、 CR_{15} または N であり、式中:

R_{15} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルアミノ ($c \leq 6$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

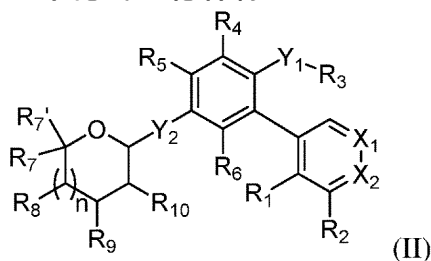
R_{15} および R_{14} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルケンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり、または

R_{15} および R_2 は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり、

これらの用語のいずれかが「置換」なる修飾語とともに用いられる場合、1つまたは複数の水素原子は、独立して -OH、-F、-Cl、-Br、-I、-NH₂、-NO₂、-CO₂H、-CO₂CH₃、-CN、-SH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-C(O)CH₃、-NHCH₃、-NHCH₂CH₃、-N(CH₃)₂、-C(O)NH₂、-C(O)NHCH₃、-C(O)N(CH₃)₂、-OC(O)CH₃、-NHC(O)CH₃、-S(O)₂OH、または -S(O)₂NH₂ に置き換えられている。

【請求項 5】

下記式の化合物、またはその薬学的に許容される塩:



式中:

n は、0、1、または2であり、

Y_1 は、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -、-C(O)-アルカンジイル ($c \leq 6$) -、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

Y_2 は、CH₂、O、またはSであり、

R_1 は、水素、アミノ、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アミド ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルスルホニル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_2 は、水素、アミノ、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、

アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アリール ($c \leq 12$)、アラルキル ($c \leq 12$)、アミド ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルチオ ($c \leq 6$)、アルキルスルホニル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_2 および R_{15} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_3 は、 $-NR_{11}R_{11}'$ または $-C(O)NR_{12}R_{12}'$ であり、式中：

R_{11} および R_{11}' は、それぞれ独立して、水素、アルキル ($c \leq 6$)、置換アルキル ($c \leq 6$)、アシル ($c \leq 6$)、または置換アシル ($c \leq 6$) であり、

R_{12} および R_{12}' は、それぞれ独立して、水素、アルキル ($c \leq 6$)、または置換アルキル ($c \leq 6$) であり、

R_4 、 R_5 、および R_6 は、それぞれ独立して、水素、ハロ、アルキル ($c \leq 6$)、置換アルキル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、置換アルコキシ ($c \leq 6$)、アシルオキシ ($c \leq 6$)、または置換アシルオキシ ($c \leq 6$) であり、

R_7 は、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 8$)、アルケニル ($c \leq 8$)、アルキニル ($c \leq 8$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アリール ($c \leq 12$)、ヘテロアリール ($c \leq 12$)、アラルキル ($c \leq 12$)、ヘテロアラルキル ($c \leq 12$)、 $-アルカンジイル$ ($c \leq 6$) $-OR_{13}$ 、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、式中：

R_{13} は、アラルキル ($c \leq 12$) または置換アラルキル ($c \leq 12$) であり、

R_7' は、水素、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 8$)、アルケニル ($c \leq 8$)、アルキニル ($c \leq 8$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アリール ($c \leq 12$)、ヘテロアリール ($c \leq 12$)、アラルキル ($c \leq 12$)、ヘテロアラルキル ($c \leq 12$)、 $-アルカンジイル$ ($c \leq 6$) $-OR_{13}$ 、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、式中：

R_{13} は、アラルキル ($c \leq 12$) または置換アラルキル ($c \leq 12$) であり、または

R_7 および R_7' は一緒になって、 $-アルカンジイル$ ($c \leq 7$)、 $-アルケンジイル$ ($c \leq 7$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_8 は、ハロ、アルコキシ ($c_3 \sim 6$)、アシルオキシ ($c \leq 6$)、アラルコキシ ($c \leq 12$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_9 および R_{10} は、それぞれ独立して、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アシル ($c \leq 6$)、アシルオキシ ($c \leq 6$)、アラルキル ($c \leq 12$)、アラルコキシ ($c \leq 12$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

X_1 は、 CR_{14} または N であり、式中：

R_{14} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルアミノ ($c \leq 6$)、 $-アルカンジイル$ ($c \leq 6$) $-ヘテロシクロアルキル$ ($c \leq 8$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、または

R_{14} および R_{15} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルケンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

X_2 は、 CR_{15} または N であり、式中：

R_{15} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルアミノ ($c \leq 6$)、 $-アルカンジイル$ ($c \leq 6$) $-ヘテロシクロアルキル$ ($c \leq 8$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_{15} および R_{14} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルケンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり、または

R_{15} および R_2 は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり、

これらの用語のいずれかが「置換」なる修飾語とともに用いられる場合、1つまたは複数の水素原子は、独立して $-OH$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-NH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2CH$

10

20

30

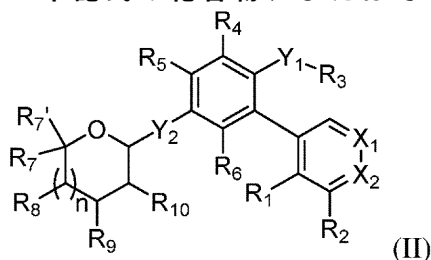
40

50

3、-CN、-SH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-C(O)CH₃、-NHCH₃、-NHCH₂CH₃、-N(CH₃)₂、-C(O)NH₂、-C(O)NHCH₃、-C(O)N(CH₃)₂、-OC(O)CH₃、-NHC(O)CH₃、-S(O)₂OH、または-S(O)₂NH₂に置き換えられている。

【請求項6】

下記式の化合物、またはその薬学的に許容される塩：



10

式中：

nは、0、1、または2であり、

Y₁は、-アルカンジイル (c ≤ 6) -、-C(O)-アルカンジイル (c ≤ 6) -、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

Y₂は、CH₂、O、またはSであり、

R₁は、水素、アミノ、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、もしくはアルキル (c ≤ 6)、アルケニル (c ≤ 6)、アルキニル (c ≤ 6)、シクロアルキル (c ≤ 8)、ヘテロシクロアルキル (c ≤ 8)、アミド (c ≤ 6)、アルコキシ (c ≤ 6)、アルキルスルホニル (c ≤ 6)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

20

R₂は、水素、アミノ、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、もしくはアルキル (c ≤ 6)、アルケニル (c ≤ 6)、アルキニル (c ≤ 6)、シクロアルキル (c ≤ 8)、ヘテロシクロアルキル (c ≤ 8)、アリール (c ≤ 12)、アラールキル (c ≤ 12)、アミド (c ≤ 6)、アルコキシ (c ≤ 6)、アルキルチオ (c ≤ 6)、アルキルスルホニル (c ≤ 6)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R₂およびR₁₅は一緒になって、アルカンジイル (c ≤ 6)、アルコキシジイル (c ≤ 6)、アルキルアミノジイル (c ≤ 6)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R₃は、-NR₁₁R_{11'}または-C(O)NR₁₂R_{12'}であり、式中：

30

R₁₁およびR_{11'}は、それぞれ独立して、水素、アルキル (c ≤ 6)、置換アルキル (c ≤ 6) であり、

R₁₂およびR_{12'}は、それぞれ独立して、水素、アルキル (c ≤ 6)、または置換アルキル (c ≤ 6) であり、

R₄、R₅、およびR₆は、それぞれ独立して、水素、ハロ、アルキル (c ≤ 6)、置換アルキル (c ≤ 6)、アルコキシ (c ≤ 6)、置換アルコキシ (c ≤ 6)、アシルオキシ (c ≤ 6)、または置換アシルオキシ (c ≤ 6) であり、

R₇およびR_{7'}は、それぞれ独立して、水素、カルボキシ、もしくはアルキル (c ≤ 8)、アルケニル (c ≤ 8)、アルキニル (c ≤ 8)、シクロアルキル (c ≤ 8)、ヘテロシクロアルキル (c ≤ 8)、アリール (c ≤ 12)、ヘテロアリール (c ≤ 12)、アラールキル (c ≤ 12)、ヘテロアラールキル (c ≤ 12)、-アルカンジイル (c ≤ 6) -OR₁₃、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、式中：

40

R₁₃は、アルキル (c ≤ 12)、置換アルキル (c ≤ 12)、アラールキル (c ≤ 12)、または置換アラールキル (c ≤ 12) であり、

R₇およびR_{7'}は一緒になって、-アルカンジイル (c ≤ 7) -、-アルケンジイル (c ≤ 7) -、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R₈、R₉、およびR₁₀は、それぞれ独立して、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル (c ≤ 6)、アルコキシ (c ≤ 6)、アシル (c ≤ 6)、アシルオキシ (c ≤ 6)、アラールキル (c ≤ 12)、アラールコキシ (c ≤ 12)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

X₁は、CR₁₄またはNであり、式中：

50

R₁₄は、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルアミノ ($c \leq 6$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、または

R₁₄およびR₁₅は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルケンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

X₂は、CR₁₅またはNであり、式中:

R₁₅は、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルアミノ ($c \leq 6$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

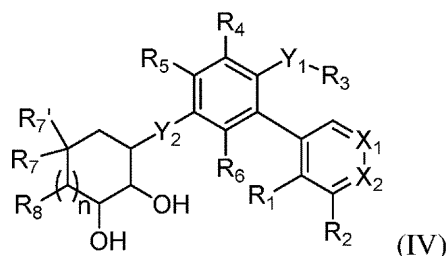
R₁₅およびR₁₄は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルケンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり、または

R₁₅およびR₂は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり、

これらの用語のいずれかが「置換」なる修飾語とともに用いられる場合、1つまたは複数の水素原子は、独立して-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-NH₂、-NO₂、-CO₂H、-CO₂CH₃、-CN、-SH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-C(O)CH₃、-NHCH₃、-NHCH₂CH₃、-N(CH₃)₂、-C(O)NH₂、-C(O)NHCH₃、-C(O)N(CH₃)₂、-OC(O)CH₃、-NHC(O)CH₃、-S(O)₂OH、または-S(O)₂NH₂に置き換えられている。

【請求項7】

下記式の化合物、またはその薬学的に許容される塩:



式中:

nは、0、1、または2であり、

Y₁は、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -、-C(O)-アルカンジイル ($c \leq 6$) -、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

Y₂は、CH₂、O、またはSであり、

R₁は、水素、アミノ、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アミド ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルスルホニル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R₂は、水素、アミノ、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アリール ($c \leq 12$)、アラールキル ($c \leq 12$)、アミド ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルチオ ($c \leq 6$)、アルキルスルホニル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R₂およびR₁₅は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R₃は、-NR₁₁R_{11'}または-C(O)NR₁₂R_{12'}であり、式中:

R₁₁およびR_{11'}は、それぞれ独立して、水素、アルキル ($c \leq 6$)、置換アルキル ($c \leq 6$)、アシル ($c \leq 6$)、または置換アシル ($c \leq 6$) であり、

R_{12} および R_{12}' は、それぞれ独立して、水素、アルキル ($c \leq 6$)、または置換アルキル ($c \leq 6$) であり、

R_4 、 R_5 、および R_6 は、それぞれ独立して、水素、ハロ、アルキル ($c \leq 6$)、置換アルキル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、置換アルコキシ ($c \leq 6$)、アシルオキシ ($c \leq 6$)、または置換アシルオキシ ($c \leq 6$) であり、

R_7 は、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 8$)、アルケニル ($c \leq 8$)、アルキニル ($c \leq 8$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アリール ($c \leq 12$)、ヘテロアリール ($c \leq 12$)、アラルキル ($c \leq 12$)、ヘテロアラルキル ($c \leq 12$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -OR₁₃、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、式中：

R_{13} は、アルキル ($c \leq 12$)、置換アルキル ($c \leq 12$)、アラルキル ($c \leq 12$)、または置換アラルキル ($c \leq 12$) であり、

R_7' は、水素、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 8$)、アルケニル ($c \leq 8$)、アルキニル ($c \leq 8$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アリール ($c \leq 12$)、ヘテロアリール ($c \leq 12$)、アラルキル ($c \leq 12$)、ヘテロアラルキル ($c \leq 12$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -OR₁₃、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、式中：

R_{13} は、アルキル ($c \leq 12$)、置換アルキル ($c \leq 12$)、アラルキル ($c \leq 12$)、または置換アラルキル ($c \leq 12$) であり、

R_7 および R_7' は一緒になって、-アルカンジイル ($c \leq 7$) -、-アルケンジイル ($c \leq 7$) -、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_8 は、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アシル ($c \leq 6$)、アシルオキシ ($c \leq 6$)、アラルキル ($c \leq 12$)、アラルコキシ ($c \leq 12$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

X_1 は、CR₁₄またはNであり、式中：

R_{14} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルアミノ ($c \leq 6$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、または

R_{14} および R_{15} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルケンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

X_2 は、CR₁₅またはNであり、式中：

R_{15} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルアミノ ($c \leq 6$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_{15} および R_{14} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルケンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり、または

R_{15} および R_2 は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり、

これらの用語のいずれかが「置換」なる修飾語とともに用いられる場合、1つまたは複数の水素原子は、独立して-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-NH₂、-NO₂、-CO₂H、-CO₂CH₃、-CN、-SH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-C(O)CH₃、-NHCH₃、-NHCH₂CH₃、-N(CH₃)₂、-C(O)NH₂、-C(O)NHCH₃、-C(O)N(CH₃)₂、-OC(O)CH₃、-NHC(O)CH₃、-S(O)₂OH、または-S(O)₂NH₂に置き換えられている。

【請求項 8】

下記式の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

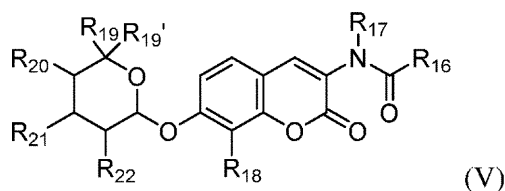
10

20

30

40

50



式中：

R₁₆は、アルキル (c ≤ 12)、シクロアルキル (c ≤ 12)、アリール (c ≤ 18)、ヘテロアリール (c ≤ 18)、またはそれらの置換型であり、

R₁₇およびR₁₈は、それぞれ独立して、水素、アルキル (C_{≤8})、または置換アルキル (C_{≤8}) であり、

R₁₉は、カルボキシ、もしくはアルキル (C_≤8)、アルケニル (C_≤8)、アルキニル (C_≤8)、シクロアルキル (C_≤8)、ヘテロシクロアルキル (C_≤8)、アリール (C_≤12)、ヘテロアリール (C_≤12)、アラルキル (C_≤12)、ヘテロアラルキル (C_≤12)、-アルカンジイル (C_≤6) -OR₁₃、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、式中:

R₁₃は、アルキル (C₁~12)、置換アルキル (C₁~12)、アラルキル (C₁~12)、または置換 であり、

R₁₉'は、水素、カルボキシ、もしくはアルキル (C ≤ 8)、アルケニル (C ≤ 8)、アルキニル (C ≤ 8)、シクロアルキル (C ≤ 8)、ヘテロシクロアルキル (C ≤ 8)、アリール (C ≤ 12)、ヘテロアリール (C ≤ 12)、アラルキル (C ≤ 12)、ヘテロアラルキル (C ≤ 12)、-アルカンジイル (C ≤ 6) -OR₁₃、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、式中:

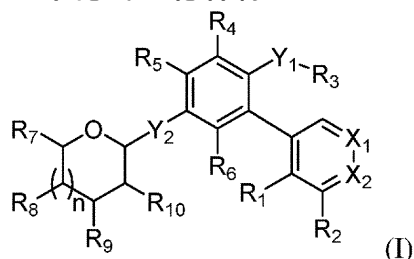
R₁₃は、アルキル (C₁~C₁₂)、置換アルキル (C₁~C₁₂)、アラルキル (C₁~C₁₂)、または置換アラルキル (C₁~C₁₂) であり、

R₂₀、R₂₁、およびR₂₂は、それぞれ独立して、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル (C ≤ 6)、アルコキシ (C ≤ 6)、アシル (C ≤ 6)、アシルオキシ (C ≤ 6)、アラルキル (C ≤ 12)、アラルコキシ (C ≤ 12)、またはこれらの基のいずれかの置換型、もしくは保護されたヒドロキシ基であり、

これらの用語のいずれかが「置換」なる修飾語とともに用いられる場合、1つまたは複数の水素原子は、独立して-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-NH₂、-NO₂、-CO₂H、-CO₂CH₃、-CN、-SH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-C(O)CH₃、-NHCH₃、-NHCH₂CH₃、-N(CH₃)₂、-C(O)NH₂、-C(O)NHCH₃、-C(O)N(CH₃)₂、-OC(O)CH₃、-NHC(O)CH₃、-S(O)₂OH、または-S(O)₂NH₂に置き換えられている。

【請求項 9】

下記式の化合物、またはその薬学的に許容される塩:



式中：

n は、0、1、または2であり、

Y₁は、-アルカンジイル (c ≤ 6) -, -C(=O)-アルカンジイル (c ≤ 6) -, またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

Y₂は、CH₂、O、またはSであり、

R₁は、水素、アミノ、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、もしくはアルキル (c ≤ 6)、アルケニル (c ≤ 6)、アルキニル (c ≤ 6)、シクロアルキル (c ≤ 8)、ヘテロシクロアルキル (c ≤ 8)、アミド (c ≤ 6)、アルコキシ (c ≤ 6)、アルキルスルホニル (c ≤ 6)、ま

たはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R₂は、水素、アミノ、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、もしくはアルキル (c ≤ 6)、アルケニル (c ≤ 6)、アルキニル (c ≤ 6)、シクロアルキル (c ≤ 8)、ヘテロシクロアルキル (c ≤ 8)、アリール (c ≤ 12)、アラルキル (c ≤ 12)、アミド (c ≤ 6)、アルコキシ (c ≤ 6)、アルキルチオ (c ≤ 6)、アルキルスルホニル (c ≤ 6)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R₂およびR₁₅は一緒になって、アルカンジイル (c ≤ 6)、アルコキシジイル (c ≤ 6)、アルキルアミノジイル (c ≤ 6)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R₃は、-NR₁₁R₁₁'または-C(O)NR₁₂R₁₂'であり、式中:

R₁₁およびR₁₁'は、それぞれ独立して、水素、アルキル (c ≤ 6)、置換アルキル (c ≤ 6)、アシル (c ≤ 6)、または置換アシル (c ≤ 6) であり、

R₁₂およびR₁₂'は、それぞれ独立して、水素、アルキル (c ≤ 6)、または置換アルキル (c ≤ 6) であり、

R₄、R₅、およびR₆は、それぞれ独立して、水素、ハロ、アルキル (c ≤ 6)、置換アルキル (c ≤ 6)、アルコキシ (c ≤ 6)、置換アルコキシ (c ≤ 6)、アシルオキシ (c ≤ 6)、または置換アシルオキシ (c ≤ 6) であり、

R₇は、カルボキシ、もしくはアルキル (c ≤ 6)、アルケニル (c ≤ 8)、アルキニル (c ≤ 8)、シクロアルキル (c ≤ 8)、ヘテロシクロアルキル (c ≤ 8)、アリール (c ≤ 12)、ヘテロアリール (c ≤ 12)、アラルキル (c ≤ 12)、ヘテロアラルキル (c ≤ 12)、-アルカンジイル (c ≤ 6) -OR₁₃、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、式中:

R₁₃は、アルキル (c ≤ 12)、置換アルキル (c ≤ 12)、アラルキル (c ≤ 12)、または置換アラルキル (c ≤ 12) であり、

R₈、R₉、およびR₁₀は、それぞれ独立して、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル (c ≤ 6)、アルコキシ (c ≤ 6)、アシル (c ≤ 6)、アシルオキシ (c ≤ 6)、アラルキル (c ≤ 12)、アラルコキシ (c ≤ 12)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

X₁は、CR₁₄またはNであり、式中:

R₁₄は、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル (c ≤ 6)、アルケニル (c ≤ 6)、アルキニル (c ≤ 6)、アルコキシ (c ≤ 6)、アルキルアミノ (c ≤ 6)、-アルカンジイル (c ≤ 6) -ヘテロシクロアルキル (c ≤ 8)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、または

R₁₄およびR₁₅は一緒になって、アルカンジイル (c ≤ 6)、アルケンジイル (c ≤ 6)、アルコキシジイル (c ≤ 6)、アルキルアミノジイル (c ≤ 6)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

X₂は、CR₁₅またはNであり、式中:

R₁₅は、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル (c ≤ 6)、アルケニル (c ≤ 6)、アルキニル (c ≤ 6)、アルコキシ (c ≤ 6)、アルキルアミノ (c ≤ 6)、-アルカンジイル (c ≤ 6) -ヘテロシクロアルキル (c ≤ 8)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R₁₅およびR₁₄は一緒になって、アルカンジイル (c ≤ 6)、アルケンジイル (c ≤ 6)、アルコキシジイル (c ≤ 6)、アルキルアミノジイル (c ≤ 6)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり、または

R₁₅およびR₂は一緒になって、アルカンジイル (c ≤ 6)、アルコキシジイル (c ≤ 6)、アルキルアミノジイル (c ≤ 6)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり、

これらの用語のいずれかが「置換」なる修飾語とともに用いられる場合、1つまたは複数の水素原子は、独立して-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-NH₂、-NO₂、-CO₂H、-CO₂CH₃、-CN、-SH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-C(O)CH₃、-NHCH₃、-NHCH₂CH₃、-N(CH₃)₂、-C(O)NH₂、-C(O)NHCH₃、-C(O)N(CH₃)₂、-OC(O)CH₃、-NHC(O)CH₃、-S(O)₂OH、または-S(O)₂NH₂に置き換えられている。

【請求項 10】

下記式の化合物、またはその薬学的に許容される塩:

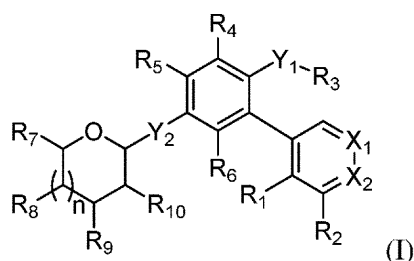
10

20

30

40

50



式中：

n は、0、1、または2であり、

Y_1 は、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -、-C(O)-アルカンジイル ($c \leq 6$) -、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

Y_2 は、 CH_2 、O、またはSであり、

R_1 は、水素、アミノ、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アミド ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルスルホニル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_2 は、水素、アミノ、ハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アリール ($c \leq 12$)、アラールキル ($c \leq 12$)、アミド ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルチオ ($c \leq 6$)、アルキルスルホニル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_2 および R_{15} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_3 は、-NR₁₁R_{11'}または-C(O)NR₁₂R_{12'}であり、式中：

R_{11} および R_{11}' は、それぞれ独立して、水素、アルキル ($c \leq 6$)、置換アルキル ($c \leq 6$)、アシル ($c \leq 6$)、または置換アシル ($c \leq 6$) であり、

R_{12} および R_{12}' は、それぞれ独立して、水素、アルキル ($c \leq 6$)、または置換アルキル ($c \leq 6$) であり、

R_4 、 R_5 、および R_6 は、それぞれ独立して、水素、ハロ、アルキル ($c \leq 6$)、置換アルキル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、置換アルコキシ ($c \leq 6$)、アシルオキシ ($c \leq 6$)、または置換アシルオキシ ($c \leq 6$) であり、

R_7 は、水素、カルボキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 8$)、アルキニル ($c \leq 8$)、シクロアルキル ($c \leq 8$)、ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、アリール ($c \leq 12$)、ヘテロアリール ($c \leq 12$)、アラールキル ($c \leq 12$)、ヘテロアラールキル ($c \leq 12$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -OR₁₃、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、式中：

R_{13} は、アルキル ($c \leq 12$)、置換アルキル ($c \leq 12$)、アラールキル ($c \leq 12$)、または置換アラールキル ($c \leq 12$) であり、

R_8 および R_9 は、それぞれ独立して、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アシル ($c \leq 6$)、アシルオキシ ($c \leq 6$)、アラールキル ($c \leq 12$)、アラールコキシ ($c \leq 12$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_{10} は、アミノ、もしくはアルキルアミノ ($c \leq 6$)、ジアルキルアミノ ($c \leq 12$)、アミド ($c \leq 12$)、またはこれら3つの基のいずれかの置換型であり、

X_1 は、CR₁₄またはNであり、式中：

R_{14} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルアミノ ($c \leq 6$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、または

R_{14} および R_{15} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルケンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、またはこれらの基のい

10

20

30

40

50

れかの置換型であり、

X_2 は、 CR_{15} またはNであり、式中：

R_{15} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c \leq 6$)、アルケニル ($c \leq 6$)、アルキニル ($c \leq 6$)、アルコキシ ($c \leq 6$)、アルキルアミノ ($c \leq 6$)、-アルカンジイル ($c \leq 6$) -ヘテロシクロアルキル ($c \leq 8$)、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、

R_{15} および R_{14} は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルケンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり、または

R_{15} および R_2 は一緒になって、アルカンジイル ($c \leq 6$)、アルコキシジイル ($c \leq 6$)、アルキルアミノジイル ($c \leq 6$)、もしくはこれらの基のいずれかの置換型であり、

これらの用語のいずれかが「置換」なる修飾語とともに用いられる場合、1つまたは複数の水素原子は、独立して-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-NH₂、-NO₂、-CO₂H、-CO₂CH₃、-CN、-SH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-C(O)CH₃、-NHCH₃、-NHCH₂CH₃、-N(CH₃)₂、-C(O)NH₂、-C(O)NHCH₃、-C(O)N(CH₃)₂、-OC(O)CH₃、-NHC(O)CH₃、-S(O)₂OH、または-S(O)₂NH₂に置き換えられている。

【請求項 1 1】

以下を含む、医薬組成物：

(A) 請求項 1～10のいずれか一項記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩；
および

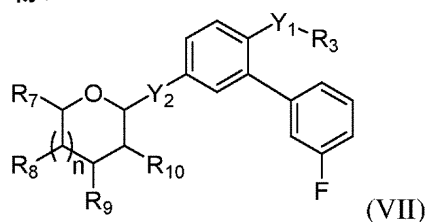
(B) 賦形剤。

【請求項 1 2】

治療有効量の、請求項 1～10のいずれか一項記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩を含む、患者の疾患または障害を治療するための医薬組成物。

【請求項 1 3】

治療有効量の下記式の化合物、またはその薬学的に許容される塩を含む、患者における神経学的障害を治療するための医薬組成物であって、該患者に経口投与される、医薬組成物：



式中：

n は、1であり、

Y_1 は、-アルカンジイル (1～6) -、または置換-アルカンジイル (1～6) であり、

Y_2 は、Oであり、

R_3 は、-NR₁₁R₁₁'または-C(O)NR₁₂R₁₂'であり、ここで：

R_{11} および R_{11}' は、それぞれ独立して、水素、アルキル ($c_1 \sim 6$)、置換アルキル ($c_1 \sim 6$)、アシル ($c_1 \sim 6$)、または置換アシル ($c_1 \sim 6$) であり、

R_{12} および R_{12}' は、それぞれ独立して、水素、アルキル ($c_1 \sim 6$)、または置換アルキル ($c_1 \sim 6$) であり、

R_7 は、アルキル ($c_1 \sim 6$)、アルケニル ($c_2 \sim 8$)、アルキニル ($c_2 \sim 8$)、シクロアルキル ($c_3 \sim 8$)、アリール ($c_6 \sim 12$)、アラルキル ($c_7 \sim 12$)、-アルカンジイル ($c_1 \sim 6$) -OR₁₃、またはこれらの基のいずれかの置換型であり、ここで：

R_{13} は、アルキル ($c_1 \sim 12$)、置換アルキル ($c_1 \sim 12$)、アラルキル ($c_7 \sim 12$)、または置換アラルキル ($c_7 \sim 12$) であり、

R_8 、 R_9 、および R_{10} は、それぞれ独立して、水素、ヒドロキシ、もしくはアルキル ($c_1 \sim 6$)、アルコキシ ($c_1 \sim 6$)、アシルオキシ ($c_1 \sim 6$)、アラルコキシ ($c_7 \sim 12$)、ま

たはこれらの基のいずれかの置換型であり、

これらの用語のいずれかが「置換」なる修飾語とともに用いられる場合、1つまたは複数の水素原子は、独立して-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-NH₂、-NO₂、-CO₂H、-CO₂CH₃、-CN、-SH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-C(O)CH₃、-NHCH₃、-NHCH₂CH₃、-N(CH₃)₂、-C(O)NH₂、-C(O)NHCH₃、-C(O)N(CH₃)₂、-OC(O)CH₃、-NHC(O)CH₃、-S(O)₂OH、または-S(O)₂NH₂に置き換えられている。

10

20

30

40

50