

【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20年7月10日(2008.7.10)

【公表番号】特表2008-500366(P2008-500366A)

【公表日】平成20年1月10日(2008.1.10)

【年通号数】公開・登録公報2008-001

【出願番号】特願2007-515355(P2007-515355)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/122 (2006.01)

A 6 1 K 31/4523 (2006.01)

A 6 1 K 31/365 (2006.01)

A 6 1 K 31/395 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

C 0 7 D 313/00 (2006.01)

C 0 7 D 225/02 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/122

A 6 1 K 31/4523

A 6 1 K 31/365

A 6 1 K 31/395

A 6 1 P 35/04

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 17/02

C 0 7 D 401/06

C 0 7 D 313/00

C 0 7 D 225/02

【手続補正書】

【提出日】平成20年5月23日(2008.5.23)

【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

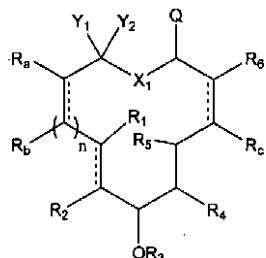
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

被験体において転移性の結腸癌および／もしくは卵巣癌を処置するか、または予防するための組成物であって、該組成物は、構造：

【化1】



(I)

を有する化合物またはその薬学的に受容可能な塩の治療有効量を含み；

R_1 および R_2 は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)_{1~2}R^{1A}、-NO₂、-COR^{1A}、-CO₂R^{1A}、-NR^{1A}C(=O)R^{1B}、-NR^{1A}C(=O)OR^{1B}、-CONR^{1A}R^{1B}、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリールの部分、または-WR^{1A}であるか；または R_1 および R_2 は、 R_1 および R_2 が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、-O-、-S-または-NR^{1C}-であり、R^{1A}、R^{1B}およびR^{1C}の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R_3 は、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分；またはプロドラッグ部分もしくは酸素保護基であり；

R_4 は、ハロゲン、-OR^{4A}、-OC(=O)R^{4A}または-NR^{4A}R^{4B}であり；ここでR^{4A}およびR^{4B}は、独立して、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分；プロドラッグ部分、窒素保護基または酸素保護基であるか；またはR^{4A}およびR^{4B}は、R^{4A}およびR^{4B}が結合される窒素原子と一緒にになって、複素環式部分もしくはヘテロアリール部分を形成し；

R_5 は、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分であり；

R_6 は、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)_{1~2}R^{6A}、-NO₂、-COR^{6A}、-CO₂R^{6A}、-NR^{6A}C(=O)R^{6B}、-NR^{6A}C(=O)OR^{6B}、-CONR^{6A}R^{6B}、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または-WR^{6A}であるか；または R_6 および R_c は、 R_6 および R_c が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、-O-、-S-または-NR^{6C}-であり、R^{6A}、R^{6B}およびR^{6C}の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R_a 、および R_b の各出現は、独立して、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)_{1~2}R^{a1}、-NO₂、-COR^{a1}、-CO₂R^{a1}、-NR^{a1}C(=O)R^{a2}、-NR^{a1}C(=O)OR^{a2}、-CONR^{a1}R^{a2}、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または-WR^{a1}であるか；または R_a 、および R_b の隣接した出現は、 R_a 、および R_b の隣接した出現が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、-O-、-S-または-NR^{a3}-であり、R^{a1}、R^{a2}およびR^{a3}の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R_c は、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)_{1~2}R^{c1}、-NO₂、-COR^{c1}

、 $-CO_2R^c$ 、 $-NRC^1C(=O)R^c$ 、 $-NRC^1C(=O)OR^c$ 、 $-CONR^cR^c$ ；脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または $-WR^c$ であるか；または R_c および R_6 は、 R_c および R_6 が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NRC^3-$ であり、 R^c 、 R^c および R^c の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

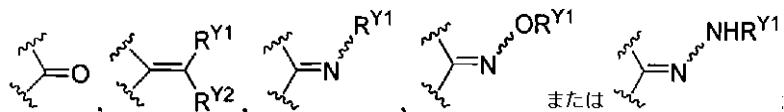
n は、1～5の整数であり；

X_1 は、O、S、 NRC^1 または $CR^X_1R^X_2$ であり；ここで R^X_1 および R^X_2 は、独立して、水素、ハロゲン、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または窒素保護基であり；

Qは、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-S(O)_{1~2}R^Q$ 、 $-NO_2$ 、 $-COR^Q$ 、 $-CO_2R^Q$ 、 $-NRC^Q_1C(=O)R^Q$ 、 $-NRC^Q_1C(=O)OR^Q$ 、 $-CONR^Q_1R^Q$ ；脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または $-WR^Q$ であり；ここでWは、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NRC^Q_3-$ であり、 R^Q 、 R^Q および R^Q の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；そして

Y^1 および Y^2 は、独立して、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分；または $-WR^Y$ であるか；または Y_1 および Y_2 は、 Y_1 および Y_2 が結合される炭素原子と一緒に構造：

【化2】



を有する部分を形成し；ここでWは、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NRC^Y_2-$ であり、 R^Y_1 および R^Y_2 の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

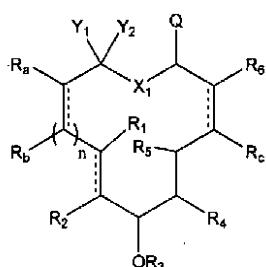
該化合物は、結腸腫瘍および/または卵巣腫瘍の転移を阻害するのに有効な量で存在する、

組成物。

【請求項2】

被験体において結腸癌および/もしくは卵巣癌を処置するか、または予防するための組成物であって、該組成物は、構造：

【化3】



(I)

を有する化合物またはその薬学的に受容可能な塩の治療有効量を含み；

R_1 および R_2 は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-S(O)_{1~2}R^{1A}$ 、 $-NO_2$ 、 $-COR^{1A}$ 、 $-CO_2R^{1A}$ 、 $-NRC^{1A}C(=O)R^{1B}$ 、 $-NRC^{1A}C(=O)OR^{1B}$ 、 $-CONR^{1A}R^{1B}$ 、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環

式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリールの部分、または $-WR^{1A}$ であるか；または R_1 および R_2 は、 R_1 および R_2 が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NR^{1C}-$ であり、 R^{1A} 、 R^{1B} および R^{1C} の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R_3 は、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分；またはプロドラッグ部分もしくは酸素保護基であり；

R_4 は、ハロゲン、 $-OR^{4A}$ 、 $-OC(=O)R^{4A}$ または $-NR^{4A}R^{4B}$ であり；ここで R^{4A} および R^{4B} は、独立して、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分；プロドラッグ部分、窒素保護基または酸素保護基であるか；または R^{4A} および R^{4B} は、 R^{4A} および R^{4B} が結合される窒素原子と一緒にになって、複素環式部分もしくはヘテロアリール部分を形成し；

R_5 は、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分であり；

R_6 は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-S(O)_{1~2}R^{6A}$ 、 $-NO_2$ 、 $-COR^{6A}$ 、 $-CO_2R^{6A}$ 、 $-NR^{6A}C(=O)R^{6B}$ 、 $-NR^{6A}C(=O)OR^{6B}$ 、 $-CONR^{6A}R^{6B}$ 、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または $-WR^{6A}$ であるか；または R_6 および R_c は、 R_6 および R_c が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NR^{6C}-$ であり、 R^{6A} 、 R^{6B} および R^{6C} の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R_a 、および R_b の各出現は、独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-S(O)_{1~2}R^{a1}$ 、 $-NO_2$ 、 $-COR^{a1}$ 、 $-CO_2R^{a1}$ 、 $-NR^{a1}C(=O)R^{a2}$ 、 $-NR^{a1}C(=O)OR^{a2}$ 、 $-CONR^{a1}R^{a2}$ 、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または $-WR^{a1}$ であるか；または R_a 、および R_b の隣接した出現は、 R_a 、および R_b の隣接した出現が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NR^{a3}-$ であり、 R^{a1} 、 R^{a2} および R^{a3} の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R_c は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-S(O)_{1~2}R^{c1}$ 、 $-NO_2$ 、 $-COR^{c1}$ 、 $-CO_2R^{c1}$ 、 $-NR^{c1}C(=O)R^{c2}$ 、 $-NR^{c1}C(=O)OR^{c2}$ 、 $-CONR^{c1}R^{c2}$ ；脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または $-WR^{c1}$ であるか；または R_c および R_6 は、 R_c および R_6 が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NR^{c3}-$ であり、 R^{c1} 、 R^{c2} および R^{c3} の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

n は、1～5の整数であり；

X_1 は、O、S、 NR^{X1} または $CR^{X1}R^{X2}$ であり；ここで R^{X1} および R^{X2} は、独立して、水素、ハロゲン、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または窒素保護基であり；

Q は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-S(O)_{1~2}R^{Q1}$ 、 $-NO_2$ 、 $-COR^{Q1}$ 、 $-CO_2R^{Q1}$ 、 $-NR^{Q1}C(=O)R^{Q2}$ 、 $-NR^{Q1}C(=O)OR^{Q2}$ 、 $-CO$

$\text{N R}^{\text{Q}1}\text{R}^{\text{Q}2}$ 、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または $-\text{W R}^{\text{Q}1}$ であり；ここでWは、独立して、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ または $-\text{N R}^{\text{Q}3}-$ であり、 $\text{R}^{\text{Q}1}$ 、 $\text{R}^{\text{Q}2}$ および $\text{R}^{\text{Q}3}$ の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；そして

Y_1 および Y_2 は、独立して、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分；または $-\text{W R}^{\text{Y}1}$ であるか；または Y_1 および Y_2 は、 Y_1 および Y_2 が結合される炭素原子と一緒に、構造：

【化4】



を有する部分を形成し；ここでWは、独立して、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ または $-\text{N R}^{\text{Y}2}-$ であり、 $\text{R}^{\text{Y}1}$ および $\text{R}^{\text{Y}2}$ の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

該化合物は、結腸腫瘍および/または卵巣腫瘍の細胞増殖を阻害するのに有効な量で存在する、

組成物。

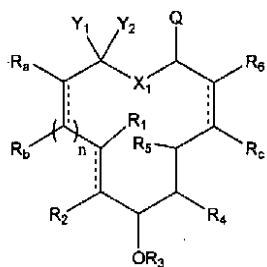
【請求項3】

被験体において結腸癌および/または卵巣癌を処置するか、または予防するための組成物であって、該組成物は、以下：

薬学的に受容可能なキャリア、アジュバント、またはビヒクル；および

構造：

【化5】



(I)

を有する化合物またはその薬学的に受容可能な塩の治療有効量、

を含み；

R_1 および R_2 は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、 $-\text{C N}$ 、 $-\text{S(O)}_1\sim_2 \text{R}^1\text{A}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{COR}^1\text{A}$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^1\text{A}$ 、 $-\text{NR}^1\text{A}\text{C}(=\text{O})\text{R}^1\text{B}$ 、 $-\text{NR}^1\text{A}\text{C}(=\text{O})\text{OR}^1\text{B}$ 、 $-\text{CONR}^1\text{A}\text{R}^1\text{B}$ 、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリールの部分、または $-\text{WR}^1\text{A}$ であるか；または R_1 および R_2 は、 R_1 および R_2 が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ または $-\text{NR}^1\text{C}-$ であり、 R^1A 、 R^1B および R^1C の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R_3 は、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分；またはプロドラッグ部分もしくは酸素保護基であり；

R_4 は、ハロゲン、 $-\text{OR}^4\text{A}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^4\text{A}$ または $-\text{NR}^4\text{A}\text{R}^4\text{B}$ であり；ここで R^4A および R^4B は、独立して、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分；プロドラッグ部分、窒

素保護基または酸素保護基であるか；またはR^{4A}およびR^{4B}は、R^{4A}およびR^{4B}が結合される窒素原子と一緒にになって、複素環式部分もしくはヘテロアリール部分を形成し；

R₅は、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分であり；

R₆は、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)_{1~2}R^{6A}、-NO₂、-COR^{6A}、-CO₂R^{6A}、-NR^{6A}C(=O)R^{6B}、-NR^{6A}C(=O)OR^{6B}、-CONR^{6A}R^{6B}、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または-WR^{6A}であるか；またはR₆およびR_cは、R₆およびR_cが結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、-O-、-S-または-NR^{6C}-であり、R^{6A}、R^{6B}およびR^{6C}の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R_a、およびR_bの各出現は、独立して、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)_{1~2}R^{a1}、-NO₂、-COR^{a1}、-CO₂R^{a1}、-NR^{a1}C(=O)R^{a2}、-NR^{a1}C(=O)OR^{a2}、-CONR^{a1}R^{a2}、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または-WR^{a1}であるか；またはR_a、およびR_bの隣接した出現は、R_a、およびR_bの隣接した出現が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、-O-、-S-または-NR^{a3}-であり、R^{a1}、R^{a2}およびR^{a3}の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R_cは、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)_{1~2}R^{c1}、-NO₂、-COR^{c1}、-CO₂R^{c1}、-NR^{c1}C(=O)R^{c2}、-NR^{c1}C(=O)OR^{c2}、-CONR^{c1}R^{c2}；脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または-WR^{c1}であるか；またはR_cおよびR₆は、R_cおよびR₆が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、-O-、-S-または-NR^{c3}-であり、R^{c1}、R^{c2}およびR^{c3}の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

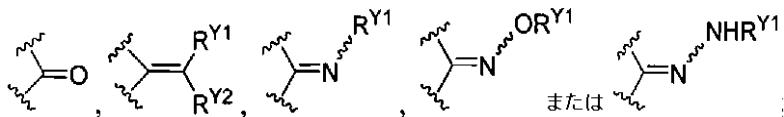
nは、1~5の整数であり；

X₁は、O、S、NR^{X1}またはCR^{X1}R^{X2}であり；ここでR^{X1}およびR^{X2}は、独立して、水素、ハロゲン、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または窒素保護基であり；

Qは、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)_{1~2}R^{Q1}、-NO₂、-COR^{Q1}、-CO₂R^{Q1}、-NR^{Q1}C(=O)R^{Q2}、-NR^{Q1}C(=O)OR^{Q2}、-CONR^{Q1}R^{Q2}、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または-WR^{Q1}であり；ここでWは、独立して、-O-、-S-または-NR^{Q3}-であり、R^{Q1}、R^{Q2}およびR^{Q3}の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；そして

Y¹およびY²は、独立して、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分；または-WR^{Y1}であるか；またはY₁およびY₂は、Y₁およびY₂が結合される炭素原子と一緒に、構造：

【化6】



を有する部分を形成し；ここでWは、独立して、-O-、-S-または-NR^{Y2}-であり、R^{Y1}およびR^{Y2}の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

該組成物は、体重1kgあたり約0.01mg～約200mgの間の投薬量での被験体に対する投与のために処方される、

組成物。

【請求項4】

前記投薬量は、体重1kgあたり約20mg～約60mgの間である、請求項3に記載の組成物。

【請求項5】

前記投薬量は、体重1kgあたり約5mg～約20mgの間である、請求項3に記載の組成物。

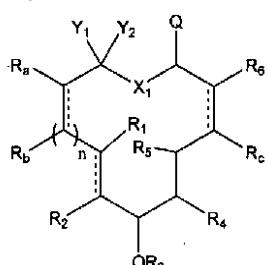
【請求項6】

前記投薬量は、体重1kgあたり約150mg～約250mgの間である、請求項3に記載の組成物。

【請求項7】

被験体において創傷の治癒を促進することで創傷を処置するための組成物であって、該組成物は、構造：

【化7】



(I)

を有する化合物またはその薬学的に受容可能な塩の治療有効量を含み；

R₁およびR₂は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)_{1～2}R^{1A}、-NO₂、-COR^{1A}、-CO₂R^{1A}、-NR^{1A}C(=O)R^{1B}、-NR^{1A}C(=O)OR^{1B}、-CONR^{1A}R^{1B}、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリールの部分、または-WR^{1A}であるか；またはR₁およびR₂は、R₁およびR₂が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、-O-、-S-または-NR^{1C}-であり、R^{1A}、R^{1B}およびR^{1C}の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R₃は、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分；またはプロドラッグ部分もしくは酸素保護基であり；

R₄は、ハロゲン、-OR^{4A}、-OC(=O)R^{4A}または-NR^{4A}R^{4B}であり；ここでR^{4A}およびR^{4B}は、独立して、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分；プロドラッグ部分、窒素保護基または酸素保護基であるか；またはR^{4A}およびR^{4B}は、R^{4A}およびR^{4B}が結合される窒素原子と一緒にになって、複素環式部分もしくはヘテロアリール部分を形成

し；

R_5 は、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分であり；

R_6 は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-S(O)_{1~2}R^{6A}$ 、 $-NO_2$ 、 $-COR^{6A}$ 、 $-CO_2R^{6A}$ 、 $-NR^{6A}C(=O)R^{6B}$ 、 $-NR^{6A}C(=O)OR^{6B}$ 、 $-CONR^{6A}R^{6B}$ 、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または $-WR^{6A}$ であるか；または R_c および R_a は、 R_6 および R_c が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここで W は、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NR^{6C}-$ であり、 R^{6A} 、 R^{6B} および R^{6C} の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R_a 、および R_b の各出現は、独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-S(O)_{1~2}R^{a1}$ 、 $-NO_2$ 、 $-COR^{a1}$ 、 $-CO_2R^{a1}$ 、 $-NR^{a1}C(=O)R^{a2}$ 、 $-NR^{a1}C(=O)OR^{a2}$ 、 $-CONR^{a1}R^{a2}$ 、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または $-WR^{a1}$ であるか；または R_a 、および R_b の隣接した出現は、 R_a 、および R_b の隣接した出現が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここで W は、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NR^{a3}-$ であり、 R^{a1} 、 R^{a2} および R^{a3} の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R_c は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-S(O)_{1~2}R^{c1}$ 、 $-NO_2$ 、 $-COR^{c1}$ 、 $-CO_2R^{c1}$ 、 $-NR^{c1}C(=O)R^{c2}$ 、 $-NR^{c1}C(=O)OR^{c2}$ 、 $-CONR^{c1}R^{c2}$ ；脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または $-WR^{c1}$ であるか；または R_c および R_6 は、 R_c および R_6 が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここで W は、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NR^{c3}-$ であり、 R^{c1} 、 R^{c2} および R^{c3} の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

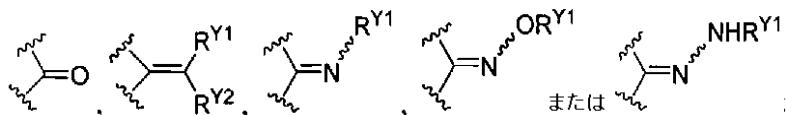
n は、1～5の整数であり；

X_1 は、O、S、 NR^{X1} または $CR^{X1}R^{X2}$ であり；ここで R^{X1} および R^{X2} は、独立して、水素、ハロゲン、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または窒素保護基であり；

Q は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-S(O)_{1~2}R^{Q1}$ 、 $-NO_2$ 、 $-COR^{Q1}$ 、 $-CO_2R^{Q1}$ 、 $-NR^{Q1}C(=O)R^{Q2}$ 、 $-NR^{Q1}C(=O)OR^{Q2}$ 、 $-CONR^{Q1}R^{Q2}$ 、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または $-WR^{Q1}$ であり；ここで W は、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NR^{Q3}-$ であり、 R^{Q1} 、 R^{Q2} および R^{Q3} の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；そして

Y^1 および Y^2 は、独立して、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分；または $-WR^{Y1}$ であるか；または Y_1 および Y_2 は、 Y_1 および Y_2 が結合される炭素原子と一緒に、構造：

【化8】



を有する部分を形成し；ここでWは、独立して、-O-、-S-または-NR^{Y2}-であり、R^{Y1}およびR^{Y2}の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

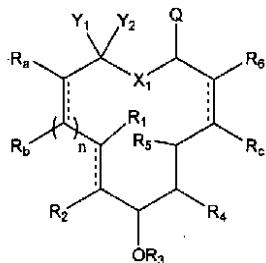
該化合物は、細胞遊走を増強するのに有効な量で存在する、

組成物。

【請求項 8】

被験体において腹水を処置するか、または予防するための組成物であつて、該組成物は、構造：

【化9】



(I)

を有する化合物またはその薬学的に受容可能な塩の治療有効量を含み；

R₁およびR₂は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)_{1~2}R^{1A}、-NO₂、-COR^{1A}、-CO₂R^{1A}、-NR^{1A}C(=O)R^{1B}、-NR^{1A}C(=O)OR^{1B}、-CONR^{1A}R^{1B}、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリールの部分、または-WR^{1A}であるか；またはR₁およびR₂は、R₁およびR₂が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、-O-、-S-または-NR^{1C}-であり、R^{1A}、R^{1B}およびR^{1C}の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R₃は、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分；またはプロドラッグ部分もしくは酸素保護基であり；

R₄は、ハロゲン、-OR^{4A}、-OC(=O)R^{4A}または-NR^{4A}R^{4B}であり；ここでR^{4A}およびR^{4B}は、独立して、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分；プロドラッグ部分、窒素保護基または酸素保護基であるか；またはR^{4A}およびR^{4B}は、R^{4A}およびR^{4B}が結合される窒素原子と一緒にになって、複素環式部分もしくはヘテロアリール部分を形成し；

R₅は、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分であり；

R₆は、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)_{1~2}R^{6A}、-NO₂、-COR^{6A}、-CO₂R^{6A}、-NR^{6A}C(=O)R^{6B}、-NR^{6A}C(=O)OR^{6B}、-CONR^{6A}R^{6B}、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または-WR^{6A}であるか；またはR₆およびR_cは、R₆およびR_cが結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、-O-、-S-または-NR^{6C}-であり、R^{6A}、R^{6B}およびR^{6C}の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R_a、およびR_bの各出現は、独立して、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)_{1~2}R^{a1}、-NO₂、-COR^{a1}、-CO₂R^{a1}、-NR^{a1}C(=O)R^{a2}、-NR^{a1}C(=O)OR^{a2}、-CONR^{a1}R^{a2}、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂

環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または $-WR^{a1}$ であるか；または R_a 、および R_b の隣接した出現は、 R_a 、および R_b の隣接した出現が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NR^{a3}$ であり、 R^{a1} 、 R^{a2} および R^{a3} の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R_c は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-S(O)_{1~2}R^{c1}$ 、 $-NO_2$ 、 $-COR^{c1}$ 、 $-CO_2R^{c1}$ 、 $-NRC^1C(=O)R^{c2}$ 、 $-NRC^1C(=O)OR^{c2}$ 、 $-CONR^{c1}R^{c2}$ ；脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または $-WR^{c1}$ であるか；または R_c および R_6 は、 R_c および R_6 が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NR^{c3}$ であり、 R^{c1} 、 R^{c2} および R^{c3} の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

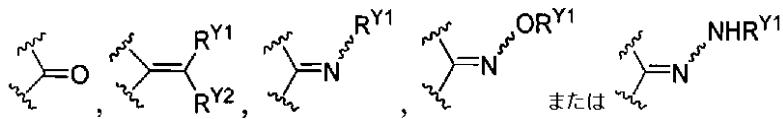
n は、1～5の整数であり；

X_1 は、O、S、 NR^{X1} または $CRR^{X1}R^{X2}$ であり；ここで R^{X1} および R^{X2} は、独立して、水素、ハロゲン、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または窒素保護基であり；

Q は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-S(O)_{1~2}R^{Q1}$ 、 $-NO_2$ 、 $-COR^{Q1}$ 、 $-CO_2R^{Q1}$ 、 $-NRC^1C(=O)R^{Q2}$ 、 $-NRC^1C(=O)OR^{Q2}$ 、 $-CONR^{Q1}R^{Q2}$ ；脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または $-WR^{Q1}$ であり；ここでWは、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NR^{Q3}$ であり、 R^{Q1} 、 R^{Q2} および R^{Q3} の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；そして

Y^1 および Y^2 は、独立して、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分；または $-WR^{Y1}$ であるか；または Y_1 および Y_2 は、 Y_1 および Y_2 が結合される炭素原子と一緒に構造：

【化10】



を有する部分を形成し；ここでWは、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NR^{Y2}$ であり、 R^{Y1} および R^{Y2} の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

該化合物は、腹水を処置するか、または予防するのに有効な量で存在する、

組成物。

【請求項9】

前記化合物において、以下：

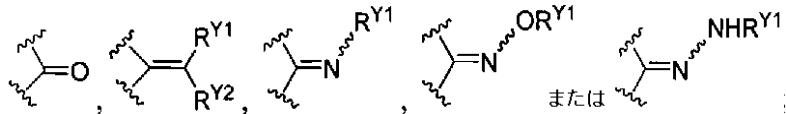
R_1 および R_2 は、それぞれ独立して、水素または置換もしくは非置換の低級アルキルであるか；または R_1 および R_2 は、 R_1 および R_2 が結合される炭素原子と一緒にになって、エポキシド、アジリジンまたは置換もしくは非置換のシクロプロピル部分を形成し；

R_3 は、水素、あるいは置換もしくは非置換の低級アルキルまたは低級アリール；プロドラッグ部分もしくは酸素保護基であり；

R^4 は、ハロゲン、 $-OR^{4A}$ 、 $-OC(=O)R^{4A}$ または $-NR^{4A}R^{4B}$ であり；ここで R^{4A} および R^{4B} は、独立して、水素、または置換もしくは非置換の低級アルキル；プロドラッグ部分、窒素保護基もしくは酸素保護基であるか；または R^{4A} および

R^{4B} は、 R^{4A} および R^{4B} が結合される窒素原子と一緒にになって、複素環式部分またはヘテロアリール部分を形成するか；または R_4 は、 R_4 が結合される炭素原子と一緒にになって、以下の構造：

【化11】



を有する部分を形成し；

R_5 および R_6 は、それぞれ独立して、水素または置換もしくは非置換の低級アルキルであるか；または R_c および R_c は、 R_c および R_c が結合される炭素原子と一緒にになって、エポキシド、アジリジンまたは置換もしくは非置換のシクロプロピル部分を形成し；

R_a 、および R_b の各出現は、独立して、水素、ハロゲン、アルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロシクロアルキル部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または WR^{a1} であるか；または R_a 、および R_b の隣接した出現は、一緒にになって、エポキシド、アジリジンまたは置換もしくは非置換のシクロプロピル部分を形成し；ここで W は、独立して、-O-、-S- または -NR^{a3}- であり、 R^{a1} の各出現、および R^{a3} は、独立して、水素、またはアルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロシクロアルキル部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R_c は、水素、ハロゲン、アルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロシクロアルキル部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または -WR^{c1} であるか；または R_c および R_c は、 R_c および R_c が結合される炭素原子と一緒にになって、エポキシド、アジリジンまたは置換もしくは非置換のシクロプロピル部分を形成し；ここで W は、独立して、-O-、-S- または -NR^{c3}- であり、 R^{c1} および R^{c3} の各出現は、独立して、水素、またはアルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロシクロアルキル部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

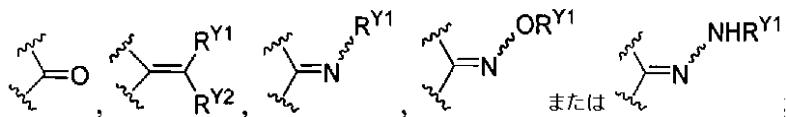
n は、1～5 の整数であり；

X_1 は、O、S、NR^{X1} または CR^{X1}R^{X2} であり；ここで R^{X1} および R^{X2} は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換のアルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールまたはヘテロアリール、あるいは窒素保護基であり；

Q は、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)_{1～2}R^{Q1}、-NO₂、-COR^{Q1}、-CO₂R^{Q1}、-NR^{Q1}C(=O)R^{Q2}、-NR^{Q1}C(=O)OR^{Q2}、-CO NR^{Q1}R^{Q2}、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または -WR^{Q1} であり；ここで W は、独立して、-O-、-S- または -NR^{Q3}- であり、 R^{Q1} 、 R^{Q2} および R^{Q3} の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

Y_1 および Y_2 は、独立して、水素、アルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロシクロアルキル部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分；または -WR^{Y1} であるか；または Y_1 および Y_2 は、 Y_1 および Y_2 が結合される炭素原子と一緒にになって、構造：

【化12】



を有する部分を形成し；ここで W は、独立して、-O-、-S- または -NR^{Y2}- であ

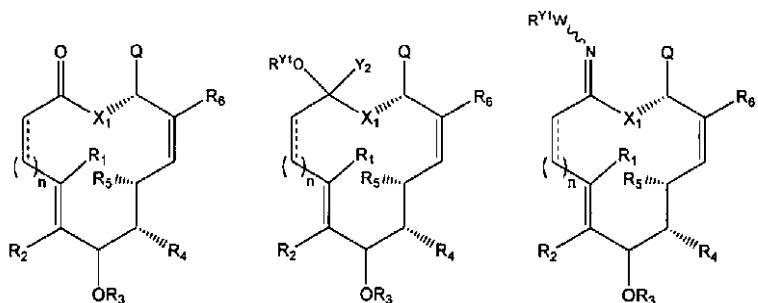
り、 R^{Y_1} および R^{Y_2} の各出現は、独立して、水素、またはアルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロシクロアルキル部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分である。

請求項 1、2、3、7 または 8 に記載の組成物。

【請求項 1 0】

前記化合物において、 R_a 、 R_b および R_c は、それぞれ水素であり、そして該化合物は、以下の構造：

【化 1 3】



のうちの 1 つを有し；

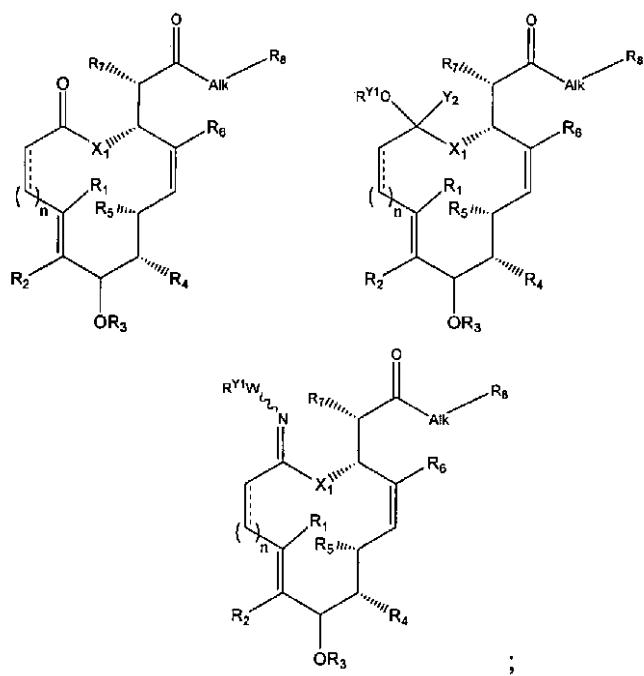
$R_1 \sim R_6$ 、 Y_2 、 X_1 、 n および Q は、請求項 1 において定義されるものであり； W は、O または NH であり；そして R^{Y_1} は、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分である。

請求項 1、2、3、7 または 8 に記載の組成物。

【請求項 1 1】

前記化合物において、 R_a 、 R_b および R_c は、それぞれ水素であり、 Q は、カルボニル含有部分であり、そして該化合物は、以下の構造：

【化 1 4】



；

のうちの 1 つを有し；

$R_1 \sim R_6$ 、 Y_2 、 X_1 、および n は、請求項 1 において定義されるものであり； W は、O または NH であり；そして R^{Y_1} は、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり； R_7 は、置換もしくは非置換の低級アルキル部分または低級ヘテロアルキル部分であり； R_8 は、置換もしくは非置換のアルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロ

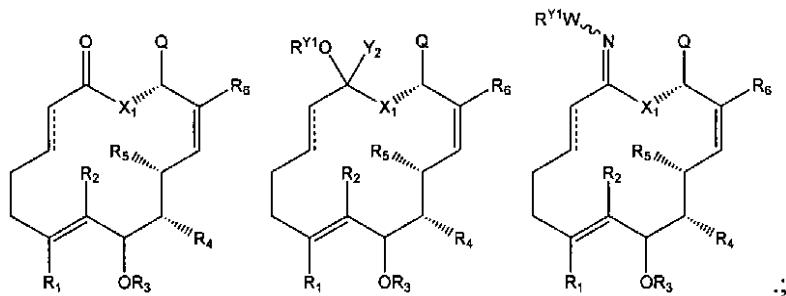
シクロアルキル部分、アリール部分またはヘテロアリール部分であり；そしてA1kは、置換もしくは非置換のC₀～₆アルキリデン鎖またはC₀～₆アルケニリデン鎖であり、ここで2つまでの隣接していないメチレン単位は、独立して、CO、CO₂、COCO、CONR^{Z1}、OCONR^{Z1}、NR^{Z1}NR^{Z2}、NR^{Z1}NR^{Z2}CO、NR^{Z1}CO、NR^{Z1}CO₂、NR^{Z1}CONR^{Z2}、SO、SO₂、NR^{Z1}SO₂、SO₂NR^{Z1}、NR^{Z1}SO₂NR^{Z2}、O、S、またはNR^{Z1}によって必要に応じて置換され；R^{Z1}およびR^{Z2}の各出現は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはアシリルである。

請求項1、2、3、7または8に記載の組成物。

【請求項12】

前記化合物において、R_a、R_bおよびR_cは、それぞれ水素であり、nは、3であり、そして該化合物は、以下の構造：

【化15】



のうちの1つを有し；

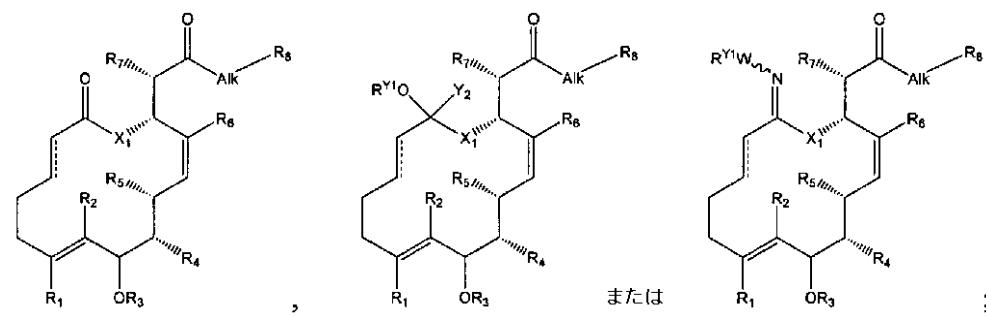
R₁～R₆、Y₂、QおよびX₁は、請求項1において定義されるものであり；Wは、OまたはNHであり；そしてRY¹は、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分である。

請求項1、2、3、7または8に記載の組成物。

【請求項13】

前記化合物において、R_a、R_bおよびR_cは、それぞれ水素であり、nは、3であり、Qは、カルボニル含有部分であり、そして該化合物は、以下の構造：

【化16】



のうちの1つを有し；

R₁～R₆、X₁およびY₂は、請求項1において定義されるものであり；Wは、OまたはNHであり；RY¹は、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；R₇は、置換もしくは非置換の低級アルキル部分または低級ヘテロアルキル部分であり；R₈は、置換もしくは非置換のアルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロシクロアルキル部分、アリール部分またはヘテロアリール部分であり；そしてA1kは、置換もしくは非置換のC₀～₆アルキリデン鎖またはC₀～₆アルケニリデン鎖であり、ここで2つまでの隣接していないメチレン単位は、独立して、CO、CO₂、COCO、CONR^{Z1}、OCONR^{Z1}、NR^{Z1}NR^{Z2}、NR^{Z1}NR^{Z2}CO、NR^{Z1}CO、NR^{Z1}CO₂、NR^{Z1}CONR^{Z2}、SO、SO₂、NR^{Z1}SO₂、SO₂NR^{Z1}、NR^{Z1}SO₂NR^{Z2}、O、S、またはNR^{Z1}によって必要に応じて置換され；R^{Z1}お

および R^{Z_2} の各出現は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはアシルであり；そして R_g は、置換もしくは非置換のアルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロシクロアルキル部分、アリール部分またはヘテロアリール部分である、請求項 1、2、3、7 または 8 に記載の組成物。

【請求項 14】

前記化合物において、 R_1 および R_2 は、それぞれ水素である、請求項 1～3 および請求項 7～13 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 15】

前記化合物において、 R_5 および R_6 は、それぞれメチルである、請求項 1～3 および請求項 7～13 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 16】

前記化合物において、 R_3 は、低級アルキルである、請求項 1～3 および請求項 7～13 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 17】

前記化合物において、 R_3 は、メチルである、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 18】

前記化合物において、 R_4 は、OH、NH₂ またはハロゲンである、請求項 1～3 および請求項 7～13 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 19】

前記化合物において、 R_7 は、低級アルキルである、請求項 11 または 13 に記載の組成物。

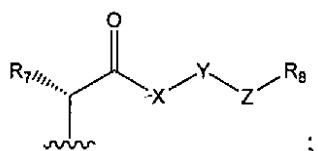
【請求項 20】

前記化合物において、 R_7 は、メチルである、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 21】

前記化合物において、Q は、構造：

【化 17】



を有し；

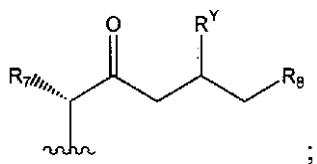
R_7 は、置換もしくは非置換の、直鎖状または分枝状の、環式低級アルキル部分あるいは非環式低級アルキル部分であり； R_8 は、置換もしくは非置換の炭素環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分であり；そして X、Y および Z は、独立して、結合、-O-、-S-、-C(=O)-、-NR^{Z1}-、-CHOR^{Z1}、-CHNR^{Z1}R^{Z2}、C=S、C=N(R^{Y1}) もしくは -CH(Ha1)；あるいは置換もしくは非置換の C_{0～6} アルキリデン鎖または C_{0～6} アルケニリデン鎖であり、ここで 2 つまでの隣接していないメチレン単位は、独立して、CO、CO₂、COCO、CONR^{Z1}、OCONR^{Z1}、NR^{Z1}NR^{Z2}、NR^{Z1}NR^{Z2}CO、NR^{Z1}CO、NR^{Z1}CO₂、NR^{Z1}CONR^{Z2}、SO、SO₂、NR^{Z1}SO₂、SO₂NR^{Z1}、NR^{Z1}SO₂NR^{Z2}、O、S、または NR^{Z1} によって必要に応じて置換され；Ha1 は、F、Cl、Br および I から選択されるハロゲンであり；そして R^{Z1} および R^{Z2} の各出現は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはアシルであるか；または R^{Z1} および R^{Z2} は、R^{Z1} および R^{Z2} が結合される窒素原子と一緒にになって、複素環式部分もしくはヘテロアリール部分；および薬学的に受容可能な誘導体を形成する。

請求項 1～3、7、8、10 および 12 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 22】

前記化合物において、Q は、構造：

【化18】



を有し；

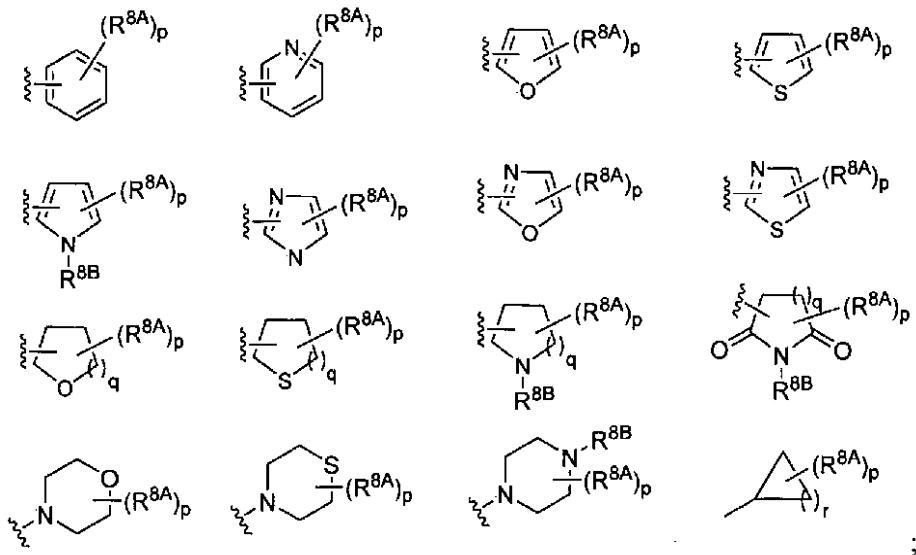
R_7 は、置換もしくは非置換の、直鎖状または分枝状の、環式低級アルキル部分あるいは非環式低級アルキル部分であり； R_8 は、置換もしくは非置換の炭素環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分であり；そして RY は、水素、ハロゲン、 $-OR^{Y1}$ または $-NR^{Y1}NR^{Y2}$ であり； R^{Y1} および R^{Y2} は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはアシルであるか、または R^{Y1} および R^{Y2} は、 R^{Y1} および R^{Y2} が結合される窒素原子と一緒にになって、複素環式部分またはヘテロアリール部分を形成する。

請求項21に記載の組成物。

【請求項23】

前記化合物において、 R_8 は、以下：

【化19】



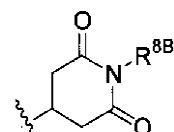
のうちの1つであり；

p は、0～5の整数であり； q は、1または2であり、 r は、1～6の整数であり； R^{8A} の書く出現は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、-(アルキル)アリールまたは-(アルキル)ヘテロアリール、 $-OR^{8C}$ 、 $-SR^{8C}$ 、 $-N(R^{8C})_2$ 、 $-SO_2N(R^{8C})_2$ 、 $-(C=O)N(R^{8C})_2$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-(C=O)OR^{8C}$ 、 $-N(R^{8C})(C=O)R^{8D}$ であり、 R^{8C} および R^{8D} の各出現は、独立して、水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、-(アルキル)アリールまたは-(アルキル)ヘテロアリールであり；そして R^{8B} の各出現は、独立して、水素または低級アルキルである、請求項11、13、21および22のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項24】

前記化合物において、 R_8 は、構造：

【化20】



を有し；

R^{8B} は、水素または低級アルキルである、
請求項 23 に記載の組成物。

【請求項 25】

前記化合物において、 n は、3 である、請求項 1、2、3、7、8、10 または 11 に記載の組成物。

【請求項 26】

前記化合物において、 Y_1 は、 OR^{Y1} であり、そして Y_2 は、低級アルキルであり； R^{Y1} は、水素または低級アルキルである、請求項 10、11、12 または 13 に記載の組成物。

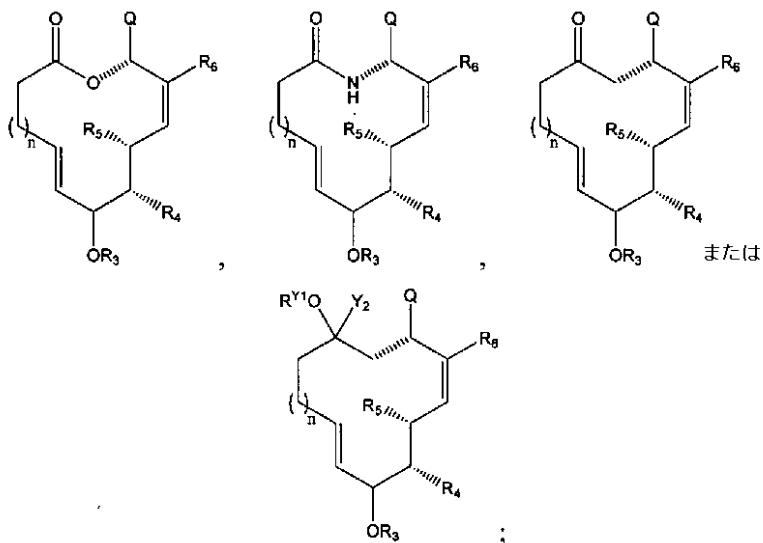
【請求項 27】

前記化合物において、 Y_1 は、 OH であり、そして Y_2 は、 CF_3 である、請求項 26 に記載の組成物。

【請求項 28】

前記化合物において、 R_a 、 R_b および R_c は、それぞれ水素であり、そして前記化合物は、構造：

【化 21】



のうちの 1 つまたはその薬学的に受容可能な誘導体を有し；

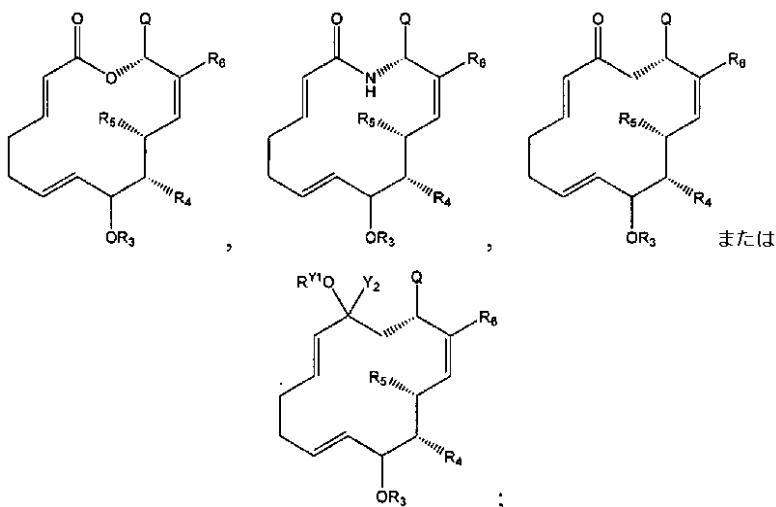
$R_3 \sim R_6$ 、 n および Q は、請求項 19 において定義されるものであり；そして Y_2 および R^{Y1} は独立して、水素または低級アルキルである、

請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 29】

前記化合物は、構造：

【化22】



またはその薬学的に受容可能な誘導体を有し；

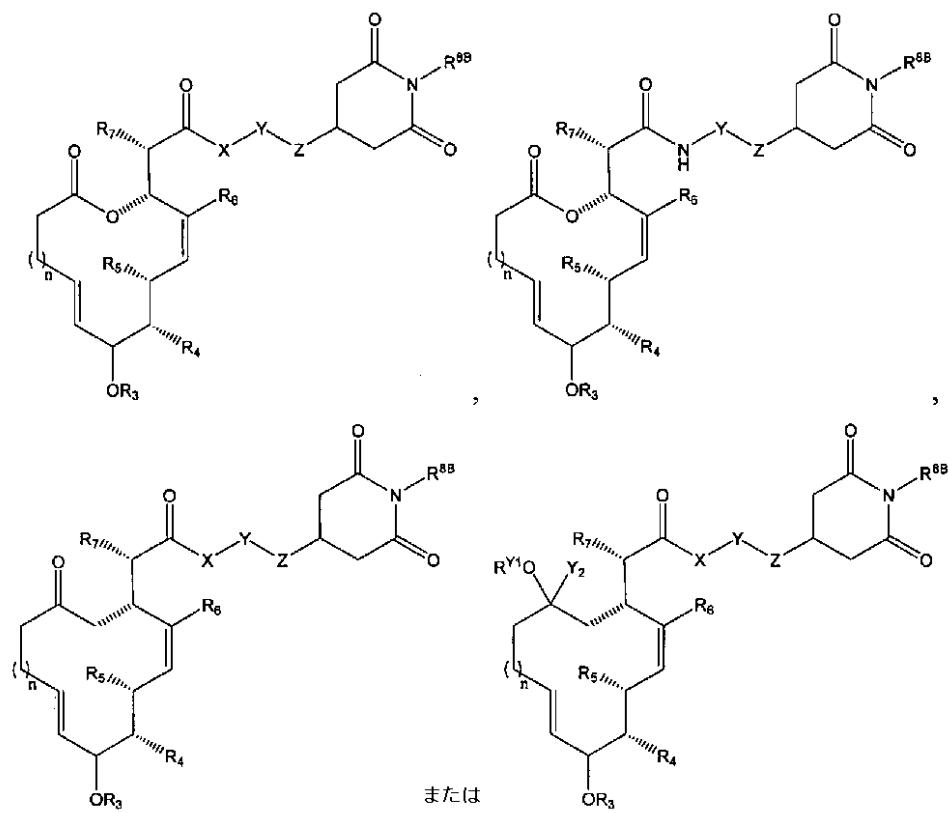
$R_3 \sim R_6$ および Q は、請求項1において定義されるものであり；そして Y_2 および R^{Y_1} は、独立して、水素または低級アルキルである、

請求項1、2または3に記載の組成物。

【請求項30】

前記化合物は、構造：

【化23】



またはその薬学的に受容可能な誘導体を有し；

$R_3 \sim R_6$ および n は、請求項1～9に定義されるものであり； Y_2 および R^{Y_1} は、独立して、水素または低級アルキルであり； R_7 は、置換もしくは非置換の、直鎖状または分枝状の、環式低級アルキル部分あるいは非環式低級アルキル部分であり； R^{8B} は、水素または低級アルキルであり；そして X 、 Y および Z は、独立して、結合、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-NR^{Z_1}-$ 、 $-CHOR^{Z_1}$ 、 $-CHNR^{Z_1}R^{Z_2}$ 、 $C=S$ 、

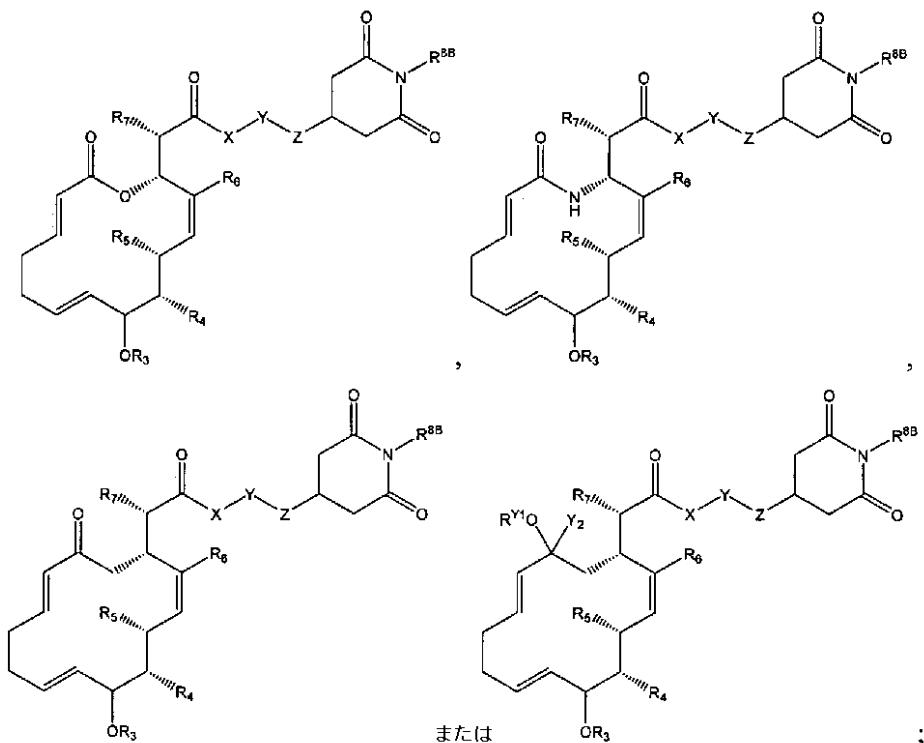
$C = N (R^{Y_1})$ もしくは $-CH(Hal)$; あるいは置換もしくは非置換の C_{0-6} アルキリデン鎖または C_{0-6} アルケニリデン鎖であり、ここで 2つまでの隣接していないメチレン単位は、独立して、CO、CO₂、COCO、CONR^{Z1}、OCONR^{Z1}、NR^{Z1}NR^{Z2}、NR^{Z1}NR^{Z2}CO、NR^{Z1}CO、NR^{Z1}CO₂、NR^{Z1}CONR^{Z2}、SO、SO₂、NR^{Z1}SO₂、SO₂NR^{Z1}、NR^{Z1}SO₂NR^{Z2}、O、S、またはNR^{Z1}によって必要に応じて置換され；Halは、F、Cl、BrおよびIから選択されるハロゲンであり；そしてR^{Z1}およびR^{Z2}の各出現は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはアシリルであるか；またはR^{Z1}およびR^{Z2}は、R^{Z1}およびR^{Z2}が結合される窒素原子と一緒にになって、複素環式部分またはヘテロアリール部分を形成する。

請求項10に記載の組成物。

【請求項31】

前記化合物は、構造：

【化24】



またはその薬学的に受容可能な誘導体を有し；

R₃～R₆は、請求項19に定義されるものであり；Y₂およびR^{Y1}は、独立して、水素または低級アルキルであり；R₇は、置換もしくは非置換の、直鎖状または分枝状の、環式低級アルキル部分あるいは非環式低級アルキル部分であり；R^{8B}は、水素または低級アルキルであり；そしてX、YおよびZは、独立して、結合、-O-、-S-、-C(=O)-、-NR^{Z1}-、-CHOR^{Z1}、-CHNR^{Z1}R^{Z2}、C=S、C=N(R^{Y1})もしくは-CH(Hal)；あるいは置換もしくは非置換のC₀₋₆アルキリデン鎖またはC₀₋₆アルケニリデン鎖であり、ここで2つまでの隣接していないメチレン単位は、独立して、CO、CO₂、COCO、CONR^{Z1}、OCONR^{Z1}、NR^{Z1}NR^{Z2}、NR^{Z1}NR^{Z2}CO、NR^{Z1}CO、NR^{Z1}CO₂、NR^{Z1}CONR^{Z2}、SO、SO₂、NR^{Z1}SO₂、SO₂NR^{Z1}、NR^{Z1}SO₂NR^{Z2}、O、S、またはNR^{Z1}によって必要に応じて置換され；Halは、F、Cl、BrおよびIから選択されるハロゲンであり；そしてR^{Z1}およびR^{Z2}の各出現は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはアシリルであるか；またはR^{Z1}およびR^{Z2}は、R^{Z1}およびR^{Z2}が結合される窒素原子と一緒にになって、複素環式部分またはヘテロアリール部分を形成する。

請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 32】

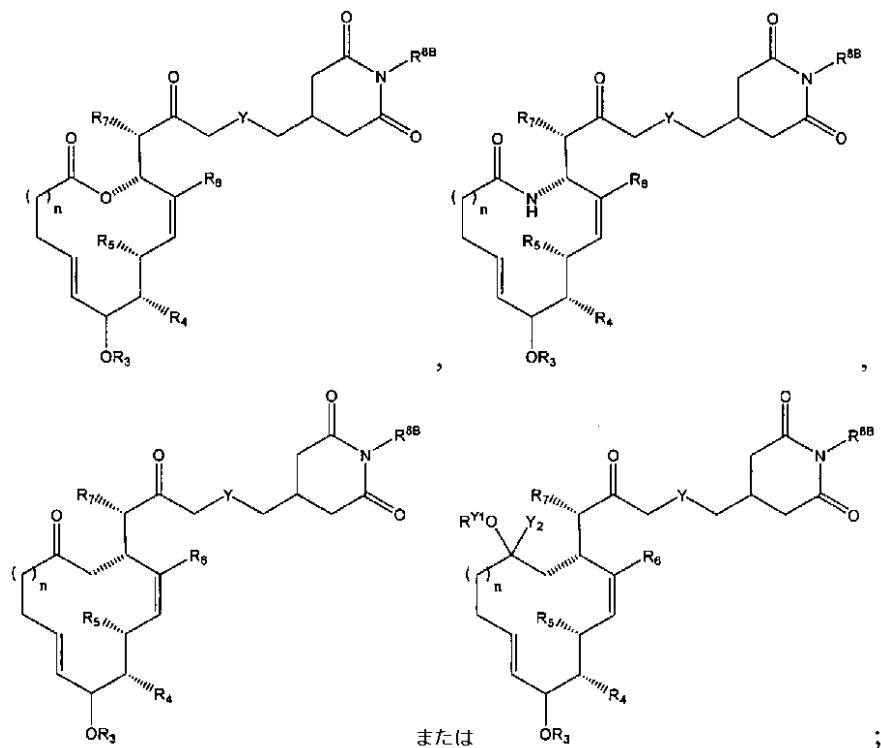
前記化合物において、-X-Y-Zは、共に部分-CH₂-Y-CH₂-を表し；Yは、-CHOR^{Y1}、-CHNR^{Y1}R^{Y2}、C=O、C=S、C=N(R^{Y1})または-CH(Hal)であり；Halは、F、Cl、BrおよびIから選択されるハロゲンであり；そしてR^{Y1}およびR^{Y2}は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはアシルであるか、またはR^{Y1}およびR^{Y2}は、R^{Y1}およびR^{Y2}が結合される窒素原子と一緒にになって、複素環式部分またはヘテロアリール部分を形成する。

請求項 30 または 31 に記載の組成物。

【請求項 33】

前記化合物は、構造：

【化 25】



を有し；

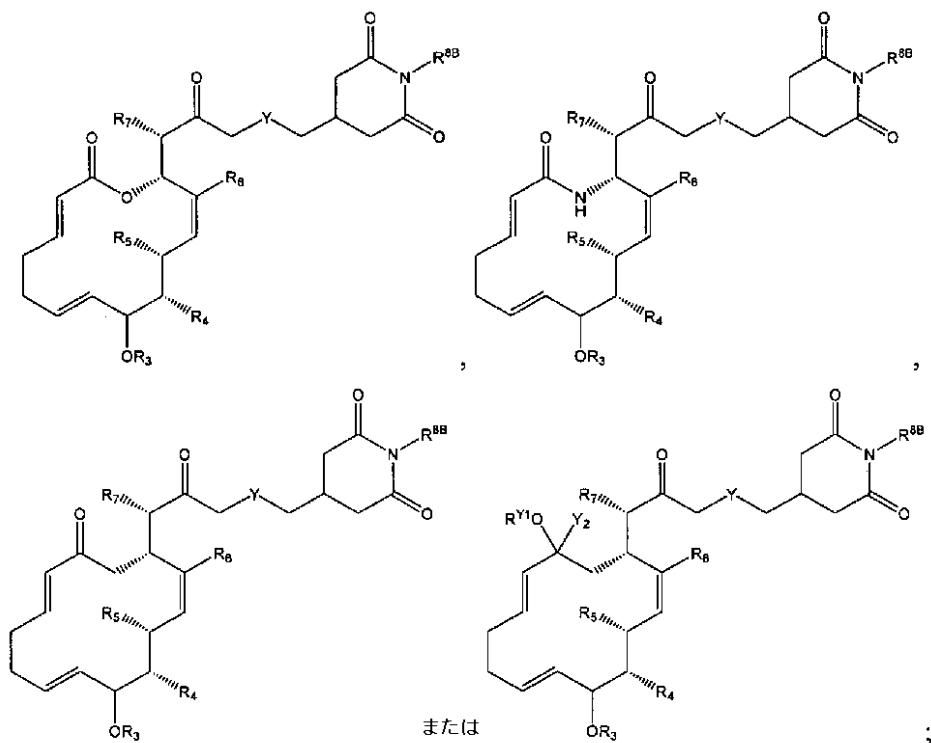
R₃～R₆ および n は、請求項 19 に定義されるものであり；Y₂ および R^{Y1} は、独立して、水素または低級アルキルであり；R₇ は、置換もしくは非置換の、直鎖状または分枝状の、環式低級アルキル部分あるいは非環式低級アルキル部分であり；R^{8B} は、水素または低級アルキルであり；そして Y は、-CHOR^{Y1}、-CHNR^{Y1}R^{Y2}、C=O、C=S、C=N(R^{Y1})または-CH(Hal)であり；Hal は、F、Cl、Br および I から選択されるハロゲンであり；そして R^{Y1} および R^{Y2} は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはアシルであるか、または R^{Y1} および R^{Y2} は、R^{Y1} および R^{Y2} が結合される窒素原子と一緒にになって、複素環式部分またはヘテロアリール部分を形成する。

請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 34】

前記化合物は、構造：

【化26】



を有し；

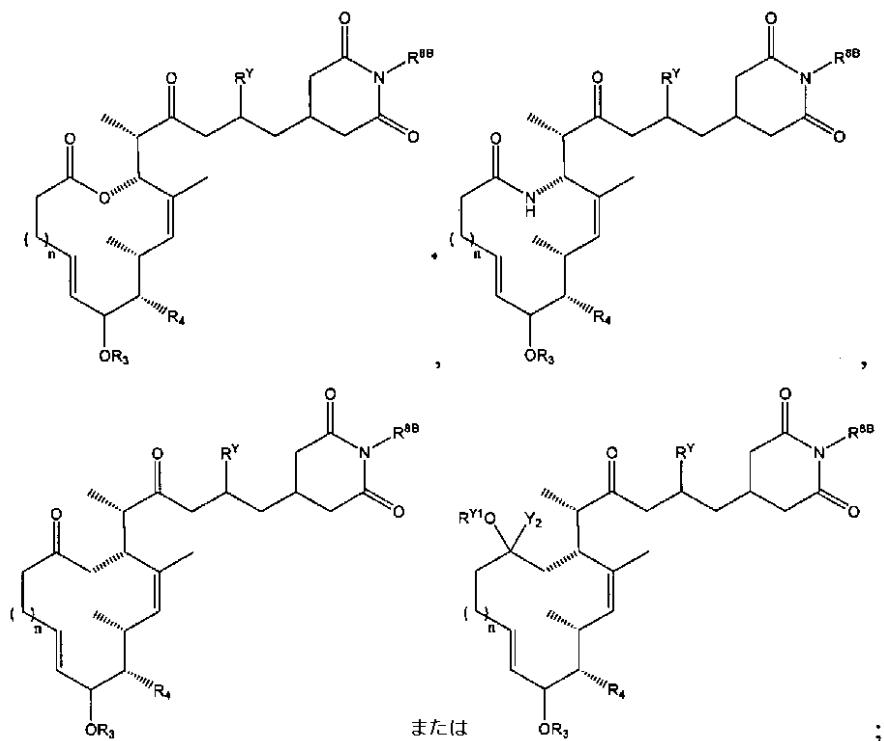
$R_3 \sim R_6$ は、請求項 1 9 に定義されるものであり； Y_2 および R^{Y_1} は、独立して、水素または低級アルキルであり； R_7 は、置換もしくは非置換の、直鎖状または分枝状の、環式低級アルキル部分あるいは非環式低級アルキル部分であり； R^{8B} は、水素または低級アルキルであり；そして Y は、 $-CHOR^{Y_1}$ 、 $-CHNR^{Y_1}R^{Y_2}$ 、 $C=O$ 、 $C=S$ 、 $C=N(R^{Y_1})$ または $-CH(Hal)$ であり； Hal は、 F 、 Cl 、 Br および I から選択されるハロゲンであり；そして R^{Y_1} および R^{Y_2} は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはアシルであるか、または R^{Y_1} および R^{Y_2} は、 R^{Y_1} および R^{Y_2} が結合される窒素原子と一緒にになって、複素環式部分またはヘテロアリール部分を形成する、

請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 35】

前記化合物は、構造：

【化27】



を有し；

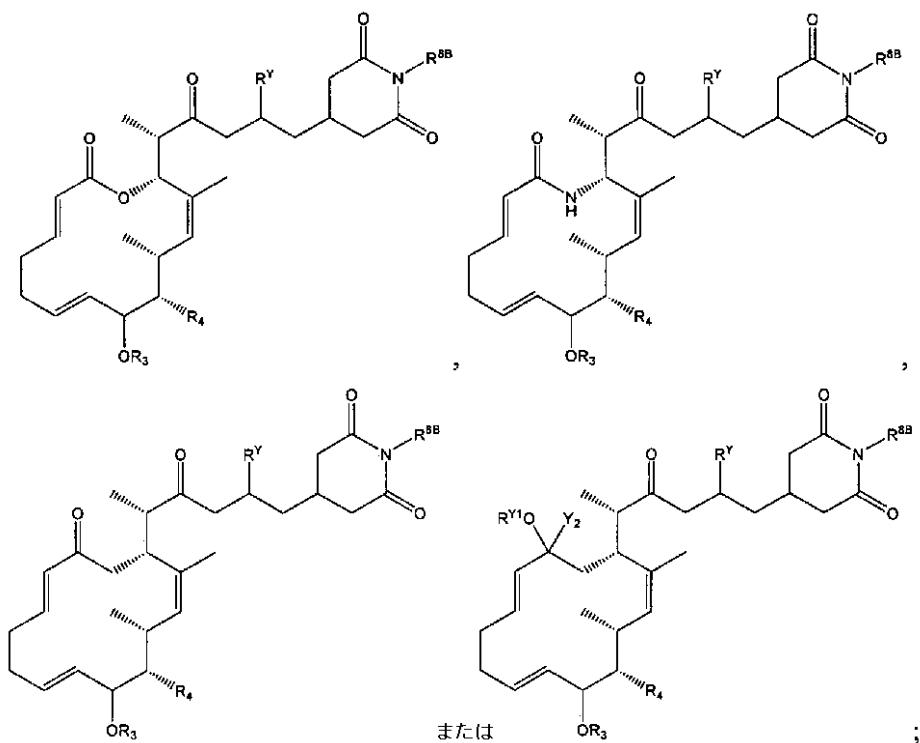
n 、 R_3 および R_4 は、請求項 1 9 に定義されるものであり； Y_2 および R^{Y1} は、独立して、水素または低級アルキルであり； R^{8B} は、水素または低級アルキルであり；そして R^Y は、水素、ハロゲン、 $-OR^{Y1}$ または $-NR^{Y1}NR^{Y2}$ であり； R^{Y1} および R^{Y2} は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはアシルであるか、または R^{Y1} および R^{Y2} は、 R^{Y1} および R^{Y2} が結合される窒素原子と一緒にになって、複素環式部分またはヘテロアリール部分を形成する、

請求項 1 0 に記載の組成物。

【請求項 3 6】

前記化合物は、構造：

【化28】



を有し；

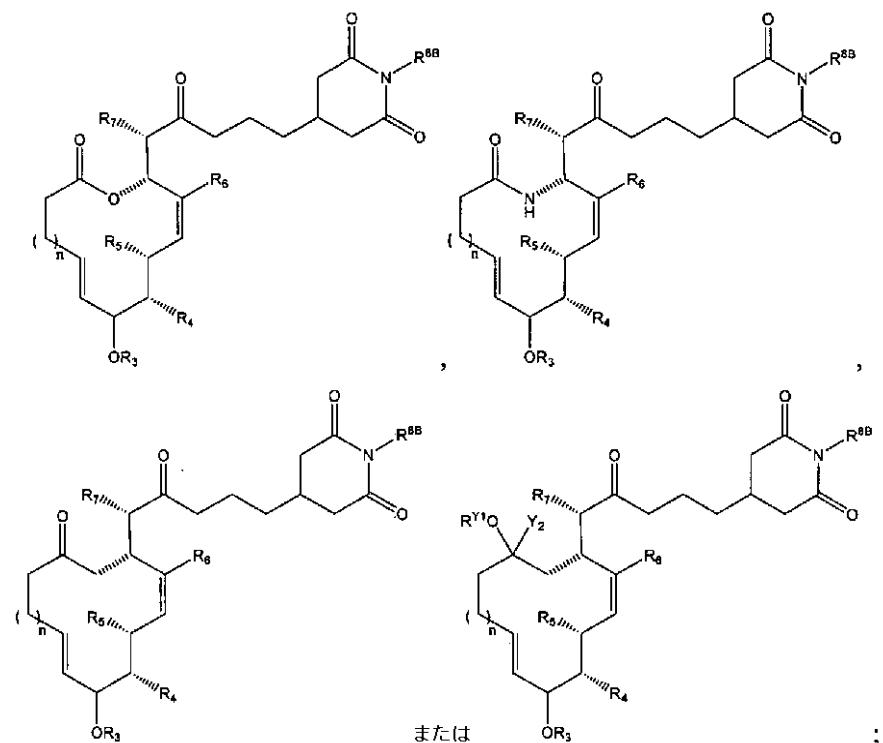
R_3 および R_4 は、請求項19に定義されるものであり； Y_2 および $R^{Y\ 1}$ は、独立して、水素または低級アルキルであり； $R^{8\ B}$ は、水素または低級アルキルであり；そして R^Y は、水素、ハロゲン、-OR^{Y¹} または-NR^{Y¹}NR^{Y²} であり； $R^{Y\ 1}$ および $R^{Y\ 2}$ は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはアシルであるか、または $R^{Y\ 1}$ および $R^{Y\ 2}$ は、 $R^{Y\ 1}$ および $R^{Y\ 2}$ が結合される窒素原子と一緒にになって、複素環式部分またはヘテロアリール部分を形成する、

請求項10に記載の組成物。

【請求項37】

前記化合物は、構造：

【化29】



を有し；

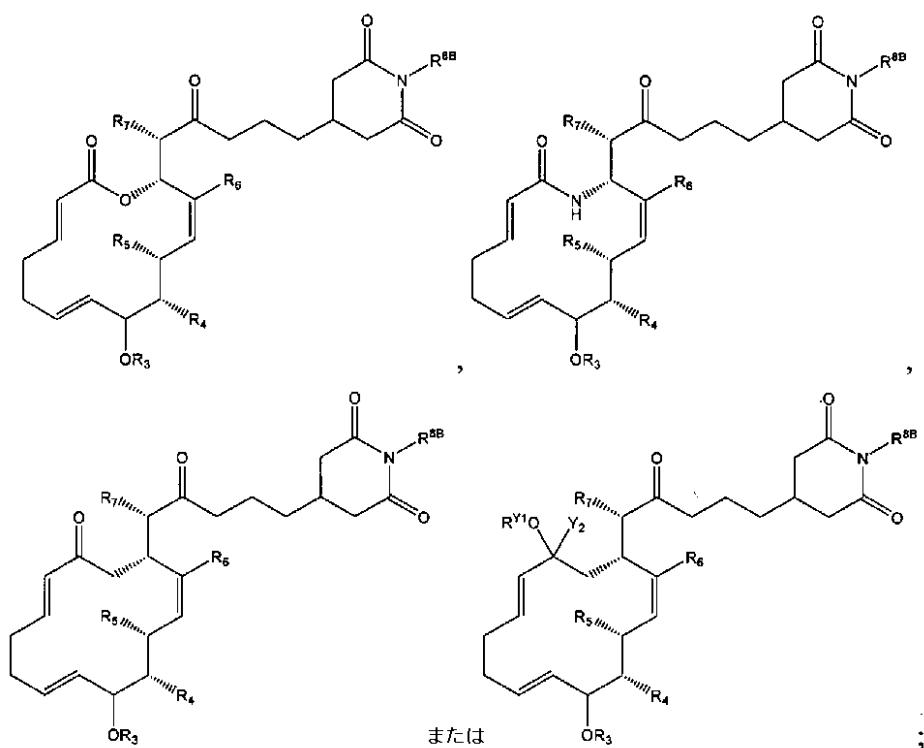
$R_3 \sim R_6$ および n は、請求項19に定義されるものであり； Y_2 および R^{Y_1} は、独立して、水素または低級アルキルであり； R_7 は、置換もしくは非置換の、直鎖状または分枝状の、環式低級アルキル部分あるいは非環式低級アルキル部分であり；そして R^{8B} は、水素または低級アルキルである、

請求項10に記載の組成物。

【請求項38】

前記化合物は、構造：

【化30】



を有し；

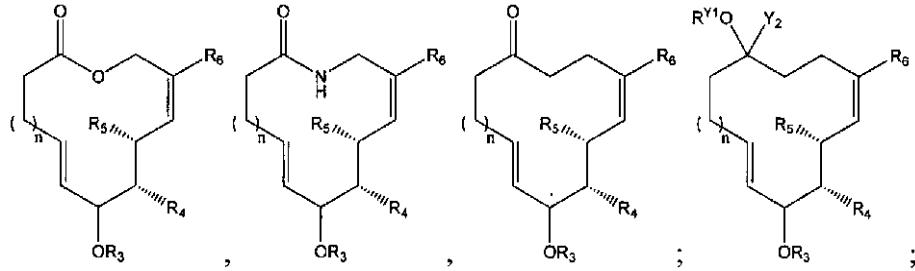
$R_3 \sim R_6$ は、請求項 1 9 に定義されるものであり； Y_2 および R^{Y_1} は、独立して、水素または低級アルキルであり； R_7 は、置換もしくは非置換の、直鎖状または分枝状の、環式低級アルキル部分あるいは非環式低級アルキル部分であり；そして R^{8B} は、水素または低級アルキルである、

請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 3 9】

前記化合物は、構造：

【化 3 1】



を有し；

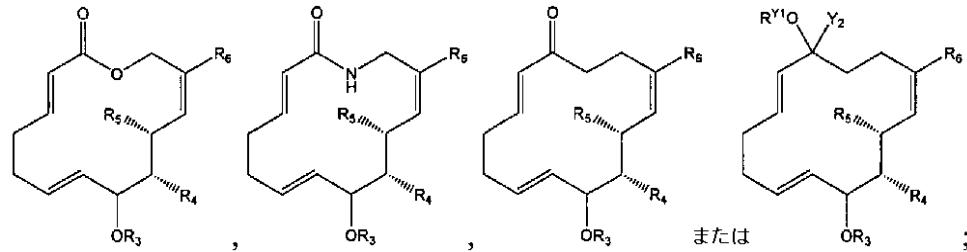
$R_3 \sim R_6$ および n は、請求項 1 に定義されるものであり； Y_2 および R^{Y_1} は、独立して、水素または低級アルキルである、

請求項 1、2 または 3 に記載の組成物。

【請求項 4 0】

前記化合物は、構造：

【化 3 2】



を有し；

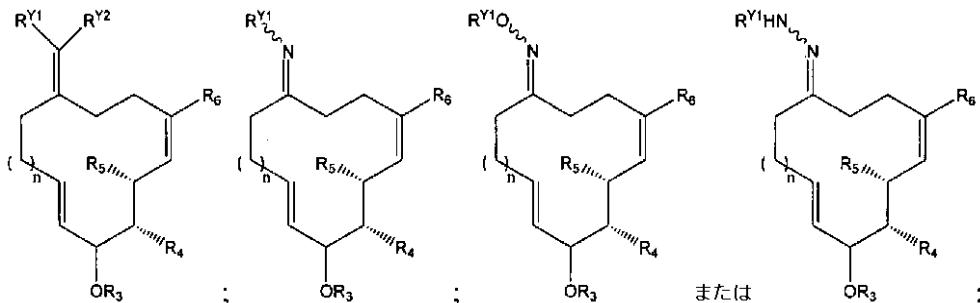
$R_3 \sim R_6$ は、請求項 1 に定義されるものであり；そして Y_2 および R^{Y_1} は、独立して、水素または低級アルキルである、

請求項 1、2 または 3 に記載の組成物。

【請求項 4 1】

前記化合物は、構造：

【化 3 3】



を有し；

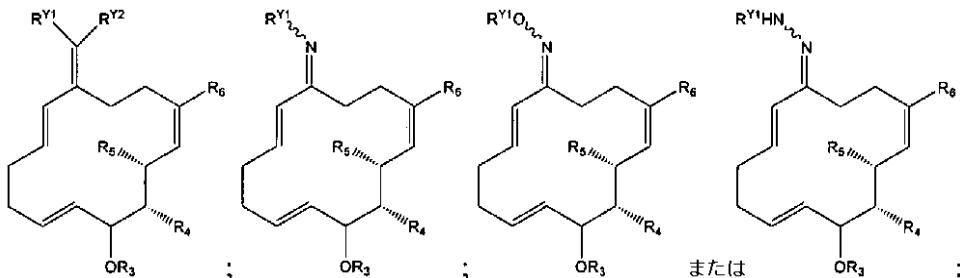
$R_3 \sim R_6$ および n は、請求項 1 に定義されるものであり；そして Y_2 および R^{Y_1} は、独立して、水素または低級アルキルである、

請求項 1、2 または 3 に記載の組成物。

【請求項 4 2】

前記化合物は、以下の構造：

【化 3 4】



を有し；

$R_3 \sim R_6$ は、請求項 1 に定義されるものであり；そして Y_2 および R^{Y_1} は、独立して、水素または低級アルキルである、

請求項 1、2 または 3 に記載の組成物。

【請求項 4 3】

前記化合物において、 R_5 および R_6 は、それぞれ低級アルキルである、請求項 3 9 ~ 4 2 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 4 4】

前記化合物において、 R_5 および R_6 は、それぞれメチルである、請求項 4 3 に記載の組成物。

【請求項 4 5】

前記化合物において、 R_3 は、低級アルキルである、請求項 3 9 ~ 4 2 のいずれか 1 項に記載の組成物。

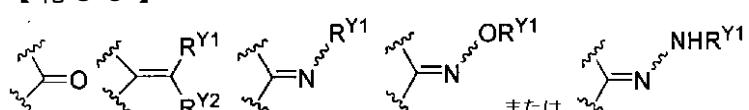
【請求項 4 6】

前記化合物において、 R_3 は、メチルである、請求項 4 5 に記載の組成物。

【請求項 4 7】

前記化合物において、 R_4 は、ヒドロキシル、低級アルコキシ、アシロキシ、アミノまたはハロゲンであるか、または R_4 は、 R_4 が結合される炭素原子と一緒にになって、構造：

【化 3 5】



を有する部分を形成し； R^{Y_1} および Y_2 は、独立して、水素、低級アルキル、アリールまたはヘテロアリールである、請求項 3 9 ~ 4 2 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 4 8】

前記化合物において、 R_4 は、 $O H$ 、 $O A c$ 、 $N H_2$ または F であるか、または R_4 は、 R_4 が結合される炭素原子と一緒にになって、構造：

【化 3 6】

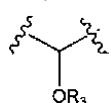


を有する部分を形成する、請求項 4 7 に記載の組成物。

【請求項 4 9】

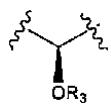
前記化合物において、立体中心：

【化 3 7】



は、以下の立体化学：

【化38】

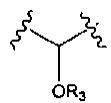


を有する、請求項39～42のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項50】

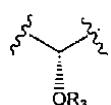
前記化合物において、立体中心：

【化39】



は、以下の立体化学：

【化40】



を有する、請求項39～42のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項51】

前記化合物において、Y₂は、1個～3個のハロゲン原子によって必要に応じて置換される低級アルキルであり、そしてR^{Y1}は、水素または低級アルキルである、請求項47に記載の組成物。

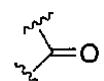
【請求項52】

前記化合物において、Y₂は、1個～3個のハロゲン原子によって必要に応じて置換される低級アルキルであり、そしてR^{Y1}は、水素または低級アルキルである、請求項39～42のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項53】

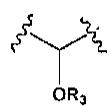
前記化合物において、Y₂は、1個～3個のハロゲン原子によって必要に応じて置換される低級アルキルであり、そしてR^{Y1}は、水素または低級アルキルであり；R₃、R₅およびR₆は、それぞれメチルであり；R₄は、OH、OAc、NH₂またはFであるか、またはR₄は、R₄が結合される炭素原子と一緒にになって、構造：

【化41】



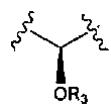
を有する部分を形成し；そして立体中心：

【化42】



は、以下の立体化学：

【化43】

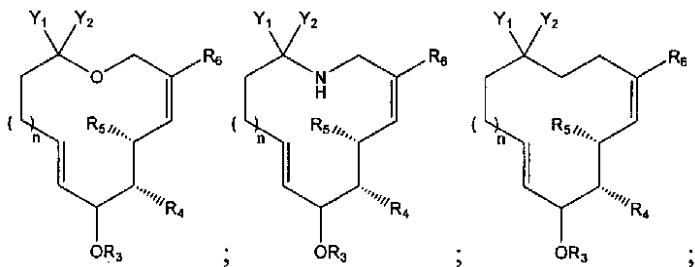


を有する、請求項39～42のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項54】

前記化合物は、構造：

【化44】



のうちの 1 つを有し；

Y_1 および Y_2 は、独立して、水素、アルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロシクロアルキル部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分；または -WR^{Y1} であるか；または Y_1 および Y_2 は、 Y_1 および Y_2 が結合される炭素原子と一緒にになって、構造：

【化45】



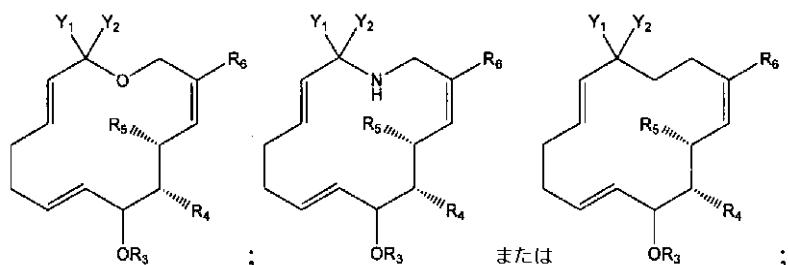
を有する部分を形成し；ここで W は、独立して、-O-、-S- または -NR^{Y2}- であり、RY^{Y1} および RY^{Y2} の各出現は、独立して、水素、またはアルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロシクロアルキル部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分である。

請求項 1、2、3、7 または 9 に記載の組成物。

【請求項55】

前記化合物は、構造：

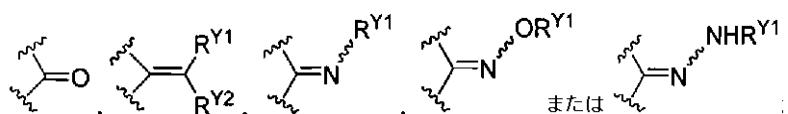
【化46】



のうちの 1 つを有し；

Y_1 および Y_2 は、独立して、水素、アルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロシクロアルキル部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分；または -WR^{Y1} であるか；または Y_1 および Y_2 は、 Y_1 および Y_2 が結合される炭素原子と一緒にになって、構造：

【化47】



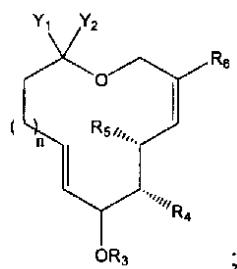
を有する部分を形成し；ここで W は、独立して、-O-、-S- または -NR^{Y2}- であり、RY^{Y1} および RY^{Y2} の各出現は、独立して、水素、またはアルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロシクロアルキル部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分である。

請求項 1、2、3、7 または 9 に記載の組成物。

【請求項 5 6】

前記化合物は、構造：

【化 4 8】



;

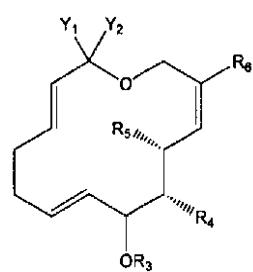
を有し；

nは、3であり；そしてY₁およびY₂は、独立して、水素、アルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロシクロアルキル部分、アリール部分またはヘテロアリール部分である、請求項54に記載の組成物。

【請求項 5 7】

前記化合物は、構造：

【化 4 9】



;

を有し；

Y₁およびY₂は、独立して、水素、アルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロシクロアルキル部分、アリール部分またはヘテロアリール部分である、請求項54に記載の組成物。

【請求項 5 8】

R₅およびR₆は、それぞれメチルである、請求項56または57に記載の組成物。

【請求項 5 9】

R₃は、低級アルキルである、請求項56または57に記載の組成物。

【請求項 6 0】

R₃は、メチルである、請求項59に記載の組成物。

【請求項 6 1】

R₄は、OH、OAc、NH₂またはハロゲンであるか、またはR₄は、R₄が結合される炭素原子と一緒にになって、構造：

【化 5 0】

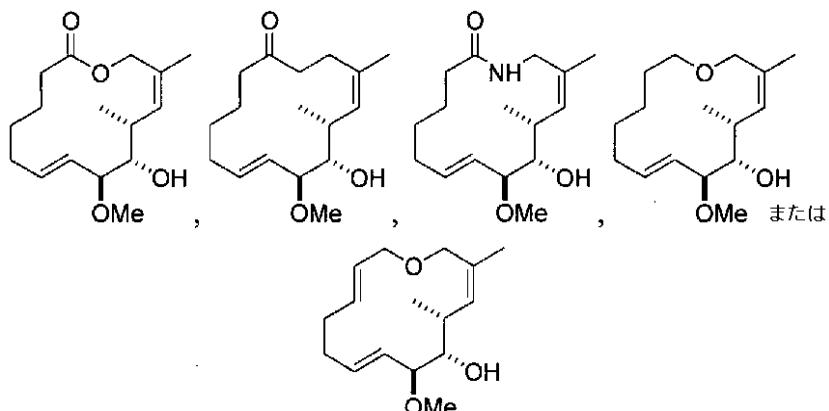


を有する部分を形成する、請求項56または57に記載の組成物。

【請求項 6 2】

前記化合物は、以下の構造：

【化51】



のうちの 1 つを有する、請求項 1、2、3、7 または 8 に記載の組成物。

【請求項 6 3】

前記化合物は、結腸腫瘍細胞の転移を阻害するのに有効な量で存在する、請求項 1、2 または 3 に記載の組成物。

【請求項 6 4】

前記化合物は、卵巣腫瘍細胞の転移を阻害するのに有効な量で存在する、請求項 1、2 または 3 に記載の組成物。

【請求項 6 5】

細胞傷害性薬剤をさらに含む、請求項 1、2 または 3 に記載の組成物。

【請求項 6 6】

前記細胞傷害性薬剤は、抗癌剤である、請求項 6 5 に記載の組成物。

【請求項 6 7】

緩和療法用薬剤をさらに含む、請求項 1、2 または 3 に記載の組成物。

【請求項 6 8】

前記組成物は、体重 1 kgあたり約 20 mg ~ 約 60 mg の間の投薬量で投与される、請求項 6 2 に記載の組成物。

【請求項 6 9】

細胞傷害性薬剤をさらに含む、請求項 6 2 に記載の組成物。

【請求項 7 0】

前記細胞傷害性薬剤は、抗癌剤である、請求項 6 9 に記載の組成物。

【請求項 7 1】

緩和療法用薬剤をさらに含む、請求項 6 2 に記載の組成物。

【請求項 7 2】

前記被験体は、哺乳動物である、請求項 1、2、3、7 または 8 に記載の組成物。

【請求項 7 3】

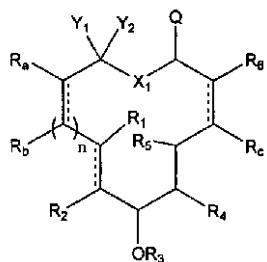
前記被験体は、ヒトである、請求項 7 2 に記載の組成物。

【請求項 7 4】

結腸癌および / または卵巣癌を処置するか、または予防するための薬学的組成物であって、該組成物は、以下：

薬学的に受容可能なキャリア、アジュバント、またはビヒクル；および
構造：

【化52】



(I)

を有する化合物またはその薬学的に受容可能な塩の治療有効量、
を含有し；

R_1 および R_2 は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)_{1~2}R^{1A}、-NO₂、-COR^{1A}、-CO₂R^{1A}、-NR^{1A}C(=O)R^{1B}、-NR^{1A}C(=O)OR^{1B}、-CONR^{1A}R^{1B}、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリールの部分、または-WR^{1A}であるか；または R_1 および R_2 は、 R_1 および R_2 が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、-O-、-S-または-NR^{1C}-であり、R^{1A}、R^{1B}およびR^{1C}の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R_3 は、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分；またはプロドラッグ部分もしくは酸素保護基であり；

R_4 は、ハロゲン、-OR^{4A}、-OC(=O)R^{4A}または-NR^{4A}R^{4B}であり；ここでR^{4A}およびR^{4B}は、独立して、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分；プロドラッグ部分、窒素保護基または酸素保護基であるか；またはR^{4A}およびR^{4B}は、R^{4A}およびR^{4B}が結合される窒素原子と一緒にになって、複素環式部分もしくはヘテロアリール部分を形成し；

R_5 は、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分であり；

R_6 は、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)_{1~2}R^{6A}、-NO₂、-COR^{6A}、-CO₂R^{6A}、-NR^{6A}C(=O)R^{6B}、-NR^{6A}C(=O)OR^{6B}、-CONR^{6A}R^{6B}、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または-WR^{6A}であるか；または R_6 および R_c は、 R_6 および R_c が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、-O-、-S-または-NR^{6C}-であり、R^{6A}、R^{6B}およびR^{6C}の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R_a 、および R_b の各出現は、独立して、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)_{1~2}R^{a1}、-NO₂、-COR^{a1}、-CO₂R^{a1}、-NR^{a1}C(=O)R^{a2}、-NR^{a1}C(=O)OR^{a2}、-CONR^{a1}R^{a2}、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または-WR^{a1}であるか；または R_a 、および R_b の隣接した出現は、 R_a 、および R_b の隣接した出現が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、-O-、-S-または-NR^{a3}-であり、R^{a1}、R^{a2}およびR^{a3}の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

R_c は、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)_{1~2}R^{c1}、-NO₂、-COR^{c1}、-CO₂R^{c1}、-NRC^{c1}C(=O)R^{c2}、-NRC^{c1}C(=O)OR^{c2}、-CONR^{c1}R^{c2}；脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または-WR^{c1}であるか；または R_c および R_6 は、 R_c および R_6 が結合される炭素原子と一緒にになって、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分またはヘテロアリール部分を形成し；ここでWは、独立して、-O-、-S-または-NR^{c3}-であり、R^{c1}、R^{c2}およびR^{c3}の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

nは、1~5の整数であり；

X_1 は、O、S、NR^{X1}またはCR^{X1}R^{X2}であり；ここでR^{X1}およびR^{X2}は、独立して、水素、ハロゲン、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または窒素保護基であり；

Q は、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)_{1~2}R^{Q1}、-NO₂、-COR^{Q1}、-CO₂R^{Q1}、-NRC^{Q1}C(=O)R^{Q2}、-NRC^{Q1}C(=O)OR^{Q2}、-CONR^{Q1}R^{Q2}；脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または-WR^{Q1}であり；ここでWは、独立して、-O-、-S-または-NR^{Q3}-であり、R^{Q1}、R^{Q2}およびR^{Q3}の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；そして

Y_1 および Y_2 は、独立して、水素、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分；または-WR^{Y1}であるか；または Y_1 および Y_2 は、 Y_1 および Y_2 が結合される炭素原子と一緒に、構造：

【化53】



を有する部分を形成し；ここでWは、独立して、-O-、-S-または-NR^{Y2}-であり、R^{Y1}およびR^{Y2}の各出現は、独立して、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり；

該組成物は、体重1kgあたり約0.01mg~約200mgの間の投薬量での被験体に対する投与のために処方される、

薬学的組成物。

【請求項75】

前記投薬量は、体重1kgあたり約20mg~約60mgの間である、請求項74に記載の組成物。

【請求項76】

前記投薬量は、体重1kgあたり約5mg~約20mgの間である、請求項74に記載の組成物。

【請求項77】

前記投薬量は、体重1kgあたり約150mg~約250mgの間である、請求項74に記載の組成物。