

【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

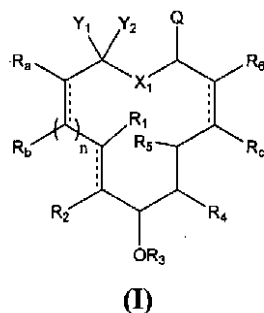
【補正の内容】

【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】



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、 $-CN$ 、 $-S(O)_{1-2}R^{1A}$ 、 $-NO_2$ 、 $-COR^{1A}$ 、 $-CO_2R^{1A}$ 、 $-NR^{1A}C(=O)R^{1B}$ 、 $-NR^{1A}C(=O)OR^{1B}$ 、 $-CONR^{1A}R^{1B}$ 、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あって、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あって、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あって、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あって、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、 $-CN$ 、 $-S(O)_{1-2}R^{c1}$ 、 $-NO_2$ 、 $-COR^{c1}$

、 $-\text{CO}_2\text{R}^{\text{c}1}$ 、 $-\text{NR}^{\text{c}1}\text{C}(=\text{O})\text{R}^{\text{c}2}$ 、 $-\text{NR}^{\text{c}1}\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{\text{c}2}$ 、 $-\text{CONR}^{\text{c}1}\text{R}^{\text{c}2}$ ；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 $-\text{WR}^{\text{c}1}$ であるか；または $\text{R}_\text{c}$ および $\text{R}_6$ は、 $\text{R}_\text{c}$ および $\text{R}_6$ が結合される炭素原子と一緒に、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 $-\text{NR}^{\text{c}3}-$ であり、 $\text{R}^{\text{c}1}$ 、 $\text{R}^{\text{c}2}$ および $\text{R}^{\text{c}3}$ 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；

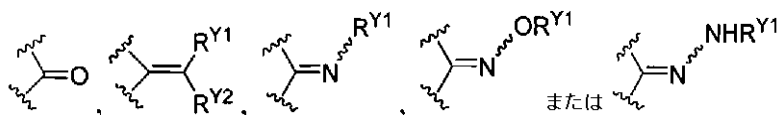
$n$ は、1～5の整数であり；

$\text{X}_1$ は、 $\text{O}$ 、 $\text{S}$ 、 $\text{NR}^{\text{x}1}$ または $\text{CR}^{\text{x}1}\text{R}^{\text{x}2}$ であり；ここで $\text{R}^{\text{x}1}$ および $\text{R}^{\text{x}2}$ 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、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_{1-2}\text{R}^{\text{Q}1}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{COR}^{\text{Q}1}$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^{\text{Q}1}$ 、 $-\text{NR}^{\text{Q}1}\text{C}(=\text{O})\text{R}^{\text{Q}2}$ 、 $-\text{NR}^{\text{Q}1}\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{\text{Q}2}$ 、 $-\text{CONR}^{\text{Q}1}\text{R}^{\text{Q}2}$ 、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 $-\text{WR}^{\text{Q}1}$ であり；ここでWは、独立して、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ または $-\text{NR}^{\text{Q}3}-$ 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

$\text{Y}^1$ および $\text{Y}^2$ 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 $-\text{WR}^{\text{Y}1}$ であるか；または $\text{Y}_1$ および $\text{Y}_2$ は、 $\text{Y}_1$ および $\text{Y}_2$ 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、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ または $-\text{NR}^{\text{Y}2}-$ 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；

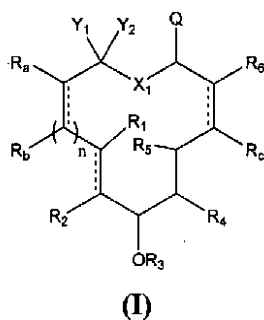
該化合物は、結腸腫瘍および/または卵巣腫瘍の転移を阻害するのに有効な量で存在する、

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】



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；

$\text{R}_1$ および $\text{R}_2$ は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_{1-2}\text{R}^{1\text{A}}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{COR}^{1\text{A}}$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^{1\text{A}}$ 、 $-\text{NR}^{1\text{A}}\text{C}(=\text{O})\text{R}^{1\text{B}}$ 、 $-\text{NR}^{1\text{A}}\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{1\text{B}}$ 、 $-\text{CONR}^{1\text{A}}\text{R}^{1\text{B}}$ 、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  $-WR^{1A}$  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；

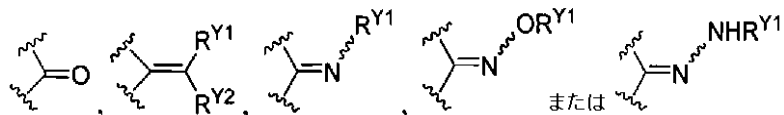
$X_1$  は、 $O$ 、 $S$ 、 $NR^{x1}$  または  $CR^{x1}R^{x2}$  であり；ここで  $R^{x1}$  および  $R^{x2}$  は、独立して、水素、ハロゲン、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分、または窒素保護基であり；

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

$\text{NR}^{\text{Q}1}\text{R}^{\text{Q}2}$ 、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  $-\text{WR}^{\text{Q}1}$  であり；ここでWは、独立して、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ または  $-\text{NR}^{\text{Q}3}-$ 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

$\text{Y}_1$ および $\text{Y}_2$ 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  $-\text{WR}^{\text{Y}1}$  であるか；または  $\text{Y}_1$ および $\text{Y}_2$ は、 $\text{Y}_1$ および $\text{Y}_2$ 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  $-\text{NR}^{\text{Y}2}-$ 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。

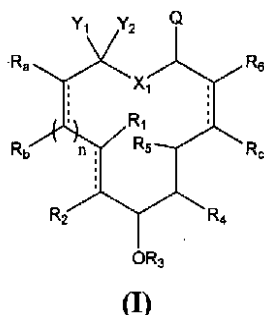
【請求項3】

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；

$\text{R}_1$ および $\text{R}_2$ は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_{1-2}\text{R}^{1\text{A}}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{COR}^{1\text{A}}$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^{1\text{A}}$ 、 $-\text{NR}^{1\text{A}}\text{C}(=\text{O})\text{R}^{1\text{B}}$ 、 $-\text{NR}^{1\text{A}}\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{1\text{B}}$ 、 $-\text{CONR}^{1\text{A}}\text{R}^{1\text{B}}$ 、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  $\text{R}_1$ および $\text{R}_2$ は、 $\text{R}_1$ および $\text{R}_2$ 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、 $\text{R}^{1\text{A}}$ 、 $\text{R}^{1\text{B}}$ および $\text{R}^{1\text{C}}$ 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；

$\text{R}_3$ 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；

$\text{R}_4$ 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 $\text{R}^{4\text{A}}$ および $\text{R}^{4\text{B}}$ 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あって、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あって、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あって、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あって、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；

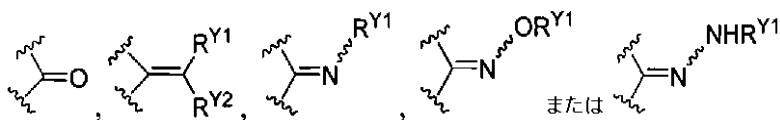
$n$  は、1～5の整数であり；

$X_1$  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 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。

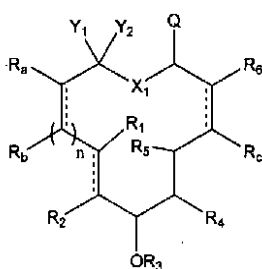
## 【請求項 6】

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】



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あって、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あって、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あって、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；

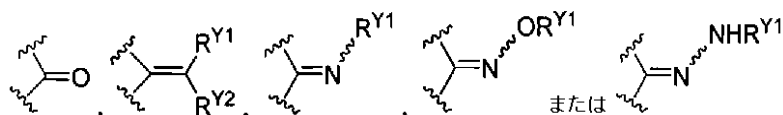
$n$  は、1～5の整数であり；

$X_1$  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】





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。

**【請求項 8】**

【化 9】

(I)

R<sub>a</sub>、およびR<sub>b</sub>の各出現は、独立して、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)<sub>1-2</sub>  
R<sup>a1</sup>、-NO<sub>2</sub>、-COR<sup>a1</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>a1</sup>、-NR<sup>a1</sup>C(=O)R<sup>a2</sup>、-N  
R<sup>a1</sup>C(=O)OR<sup>a2</sup>、-CONR<sup>a1</sup>R<sup>a2</sup>、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あって、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あって、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；

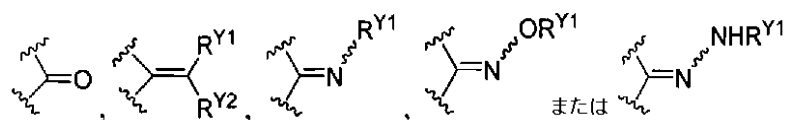
$n$  は、1～5の整数であり；

$X_1$  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：

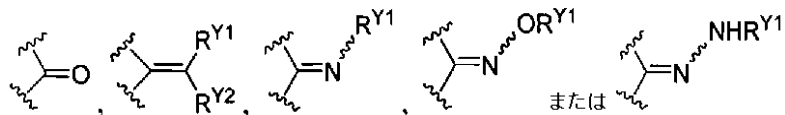
$R_1$  および  $R_2$  は、それぞれ独立して、水素または置換もしくは非置換の低級アルキルであるか；または  $R_1$  および  $R_2$  は、 $R_1$  および  $R_2$  が結合される炭素原子と一緒にあって、エポキシド、アジリジンまたは置換もしくは非置換のシクロプロピル部分を形成し；

$R_3$  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あって、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あって、以下の構造：

【化 1 1】



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  $R_6$  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あって、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、一緒にあって、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  $WR^c$  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あって、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；

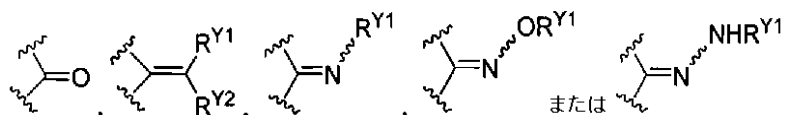
$n$  は、1 ~ 5 の整数であり；

$X_1$  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、 $-CN$ 、 $-S(O)_{1-2}R^{q1}$ 、 $-NO_2$ 、 $-COR^{q1}$ 、 $-CO_2R^{q1}$ 、 $-NR^{q1}C(=O)R^{q2}$ 、 $-NR^{q1}C(=O)OR^{q2}$ 、 $-CONR^{q1}R^{q2}$ 、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；

$Y_1$  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あって、構造：

【化 1 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  $-NR^{y2}-$  であ

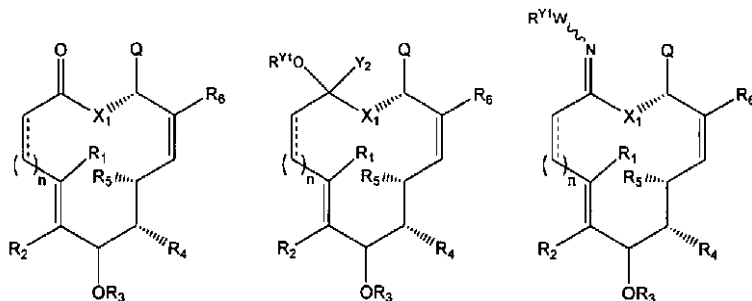
り、 $R^{Y1}$  および  $R^{Y2}$  の各出現は、独立して、水素、またはアルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロシクロアルキル部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分である、

請求項 1、2、3、7 または 8 に記載の 組成物。

【請求項 10】

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 13】



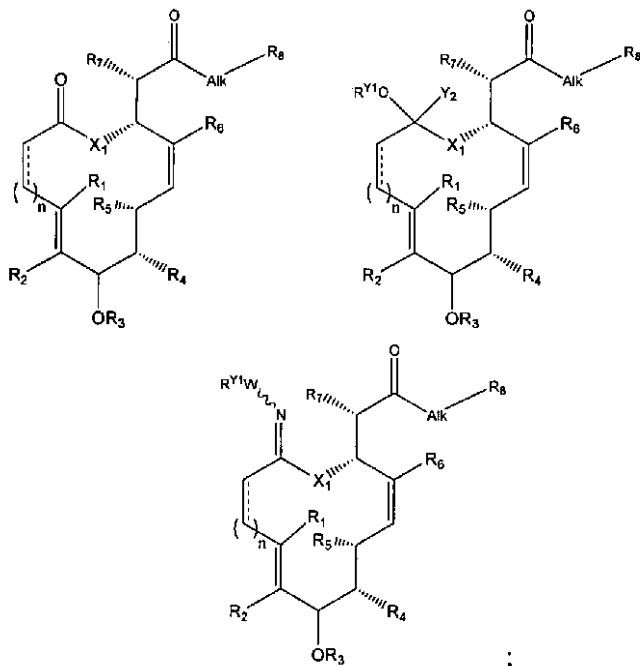
のうちの 1 つを有し；

$R_1 \sim R_6$ 、 $Y_2$ 、 $X_1$ 、 $n$  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  $R^{Y1}$  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 11】

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 14】



のうちの 1 つを有し；

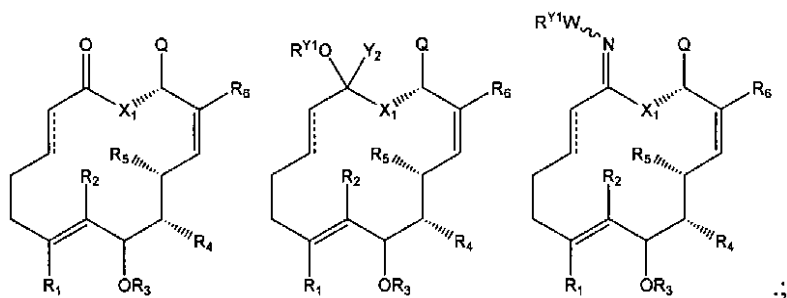
$R_1 \sim R_6$ 、 $Y_2$ 、 $X_1$ 、および  $n$  は、請求項 1 において定義されるものであり； $W$  は、 $O$  または  $NH$  であり；そして  $R^{Y1}$  は、水素、または脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、脂環式部分、複素環式部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分であり； $R_7$  は、置換もしくは非置換の低級アルキル部分または低級ヘテロアルキル部分であり； $R_8$  は、置換もしくは非置換のアルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロ

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 Alk は、置換もしくは非置換の  $C_0 \sim 6$  アルキリデン鎖または  $C_0 \sim 6$  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、CO<sub>2</sub>、COCO、CONR<sup>Z1</sup>、OCONR<sup>Z1</sup>、NR<sup>Z1</sup>NR<sup>Z2</sup>、NR<sup>Z1</sup>NR<sup>Z2</sup>CO、NR<sup>Z1</sup>CO、NR<sup>Z1</sup>CO<sub>2</sub>、NR<sup>Z1</sup>CONR<sup>Z2</sup>、SO、SO<sub>2</sub>、NR<sup>Z1</sup>SO<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NR<sup>Z1</sup>、NR<sup>Z1</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>Z2</sup>、O、S、またはNR<sup>Z1</sup>によって必要に応じて置換され；R<sup>Z1</sup>およびR<sup>Z2</sup>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、  
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<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>およびR<sub>c</sub>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】



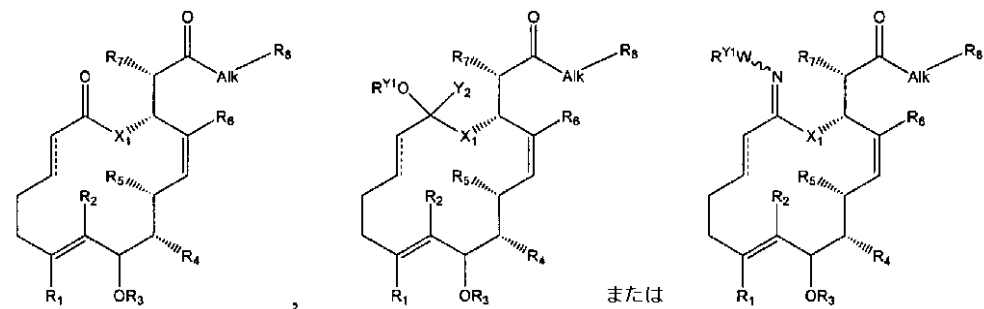
のうちの1つを有し；

R<sub>1</sub> ~ R<sub>6</sub>、Y<sub>2</sub>、QおよびX<sub>1</sub>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<sup>Y1</sup>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<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>およびR<sub>c</sub>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；

R<sub>1</sub> ~ R<sub>6</sub>、X<sub>1</sub>およびY<sub>2</sub>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；R<sup>Y1</sup>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<sub>7</sub>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<sub>8</sub>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Alkは、置換もしくは非置換の  $C_0 \sim 6$  アルキリデン鎖または  $C_0 \sim 6$  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、CO<sub>2</sub>、COCO、CONR<sup>Z1</sup>、OCONR<sup>Z1</sup>、NR<sup>Z1</sup>NR<sup>Z2</sup>、NR<sup>Z1</sup>NR<sup>Z2</sup>CO、NR<sup>Z1</sup>CO、NR<sup>Z1</sup>CO<sub>2</sub>、NR<sup>Z1</sup>CONR<sup>Z2</sup>、SO、SO<sub>2</sub>、NR<sup>Z1</sup>SO<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NR<sup>Z1</sup>、NR<sup>Z1</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>Z2</sup>、O、S、またはNR<sup>Z1</sup>によって必要に応じて置換され；R<sup>Z1</sup>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り；そして  $R_8$  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、 $NH_2$  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。

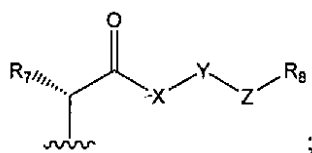
【請求項 20】

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<sup>Z1</sup>-、-CHOR<sup>Z1</sup>、-CHNR<sup>Z1</sup>R<sup>Z2</sup>、C=S、C=N(R<sup>Y1</sup>) もしくは -CH(Hal)；あるいは置換もしくは非置換の C<sub>0-6</sub> アルキリデン鎖または C<sub>0-6</sub> 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、CO<sub>2</sub>、COCO、CONR<sup>Z1</sup>、OCONR<sup>Z1</sup>、NR<sup>Z1</sup>NR<sup>Z2</sup>、NR<sup>Z1</sup>NR<sup>Z2</sup>CO、NR<sup>Z1</sup>CO、NR<sup>Z1</sup>CO<sub>2</sub>、NR<sup>Z1</sup>CONR<sup>Z2</sup>、SO、SO<sub>2</sub>、NR<sup>Z1</sup>SO<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NR<sup>Z1</sup>、NR<sup>Z1</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>Z2</sup>、O、S、または NR<sup>Z1</sup> 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<sup>Z1</sup> および R<sup>Z2</sup> 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<sup>Z1</sup> および R<sup>Z2</sup> は、R<sup>Z1</sup> および R<sup>Z2</sup> が結合される窒素原子と一緒にあって、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：

R7[C@H](\*)C(=O)CC(RY)R8

R<sub>7</sub> 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<sub>8</sub> は、置換もしくは非置換の炭素環式部分、複素環式部分、アリアル部分またはヘテロアリアル部分であり；そしてR<sup>Y</sup> は、水素、ハロゲン、-OR<sup>Y1</sup> または-NR<sup>Y1</sup>NR<sup>Y2</sup> であり；R<sup>Y1</sup> およびR<sup>Y2</sup> は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリアル、ヘテロアリアルまたはアシルであるか、またはR<sup>Y1</sup> およびR<sup>Y2</sup> は、R<sup>Y1</sup> およびR<sup>Y2</sup> が結合される窒素原子と一緒にあって、複素環式部分またはヘテロアリアル部分を形成する、請求項 21 に記載の組成物。

前記化合物において、 $R_8$  は、以下：

Chemical structures 1-12 are shown, representing various heterocyclic rings and their derivatives. The structures are defined as follows:

- 1: A benzene ring with a substituent  $(R^{8A})_p$  and a wavy line indicating a connection point.
- 2: A pyridine ring with a substituent  $(R^{8A})_p$  and a wavy line indicating a connection point.
- 3: A furan ring with a substituent  $(R^{8A})_p$  and a wavy line indicating a connection point.
- 4: A thiophene ring with a substituent  $(R^{8A})_p$  and a wavy line indicating a connection point.
- 5: A pyridine ring with a substituent  $(R^{8A})_p$  and a substituent  $R^{8B}$  on the nitrogen atom. A wavy line indicates a connection point.
- 6: An imidazole ring with a substituent  $(R^{8A})_p$  and a wavy line indicating a connection point.
- 7: An oxazole ring with a substituent  $(R^{8A})_p$  and a wavy line indicating a connection point.
- 8: A thiazole ring with a substituent  $(R^{8A})_p$  and a wavy line indicating a connection point.
- 9: A tetrahydrofuran ring with a substituent  $(R^{8A})_p$  and a substituent  $q$  on the oxygen atom. A wavy line indicates a connection point.
- 10: A tetrahydrothiophene ring with a substituent  $(R^{8A})_p$  and a substituent  $q$  on the sulfur atom. A wavy line indicates a connection point.
- 11: A piperidine ring with a substituent  $(R^{8A})_p$  and a substituent  $R^{8B}$  on the nitrogen atom. A wavy line indicates a connection point.
- 12: A pyrimidine ring with a substituent  $(R^{8A})_p$  and a substituent  $R^{8B}$  on the nitrogen atom. A wavy line indicates a connection point.

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<sup>8 A</sup> 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<sup>8 C</sup>、- SR<sup>8 C</sup>、- N (R<sup>8 C</sup>)<sub>2</sub>、- SO<sub>2</sub> N (R<sup>8 C</sup>)<sub>2</sub>、- (C = O) N (R<sup>8 C</sup>)<sub>2</sub>、ハロゲン、- CN、- NO<sub>2</sub>、- (C = O) OR<sup>8 C</sup>、- N (R<sup>8 C</sup>) (C = O) R<sup>8 D</sup> であり、R<sup>8 C</sup> および R<sup>8 D</sup> 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<sup>8 B</sup> 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 1 1、1 3、2 1 および 2 2 のいずれか 1 項に記載の組成物。

前記化合物において、 $R_8$ は、構造：

O=C1CC(R8B)CC(=O)N1R8B

を有し；

$R^8$  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。

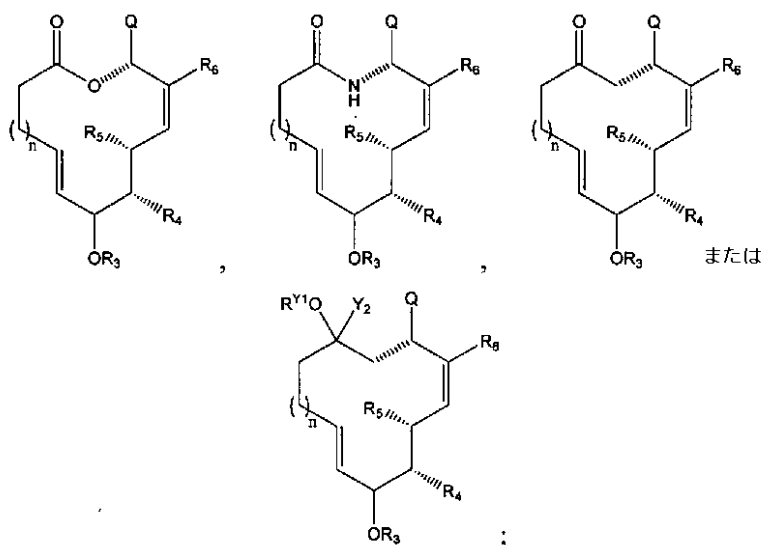
【請求項 27】

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、

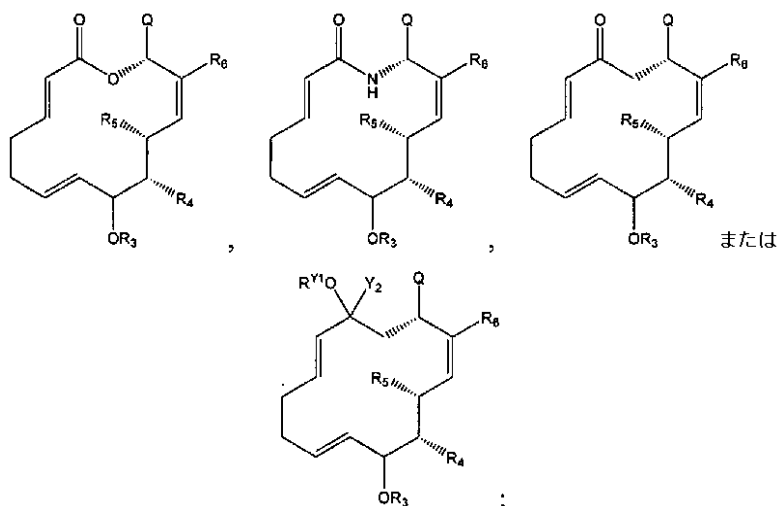
請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 29】

前記化合物は、構造：



## 【化 2 2】



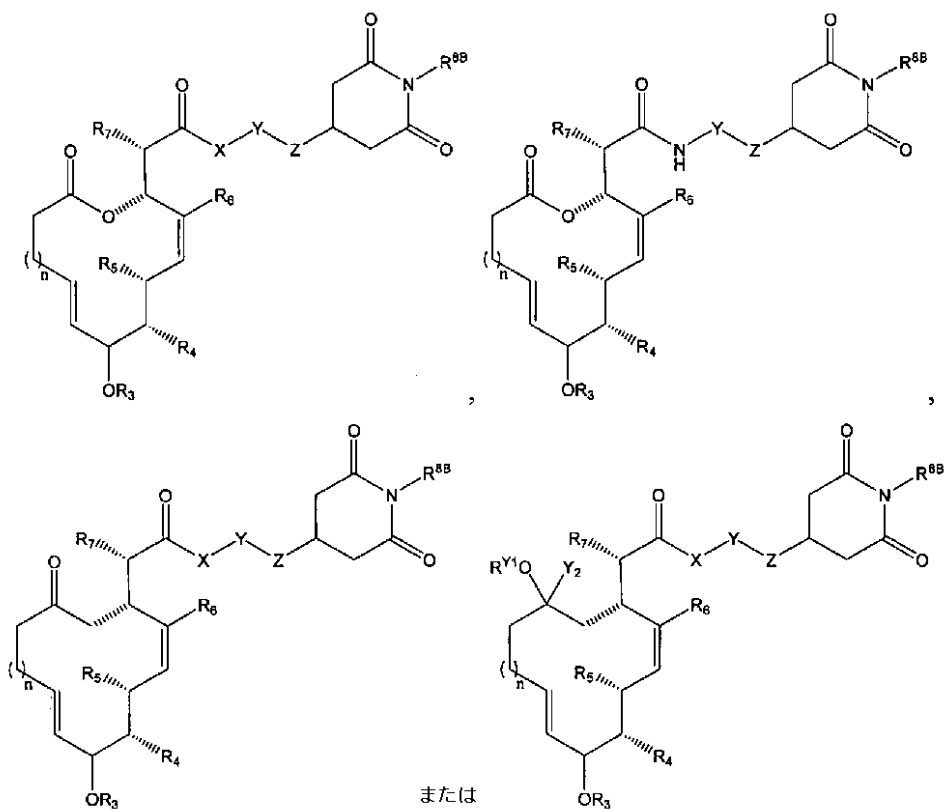
またはその薬学的に受容可能な誘導体を有し；

$R_3 \sim R_6$  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  $R^{Y1}$  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 2 3】



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 19 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； $R_7$  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、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-NR^{Z1}-$ 、 $-CHOR^{Z1}$ 、 $-CHNR^{Z1}R^{Z2}$ 、 $C=S$ 、

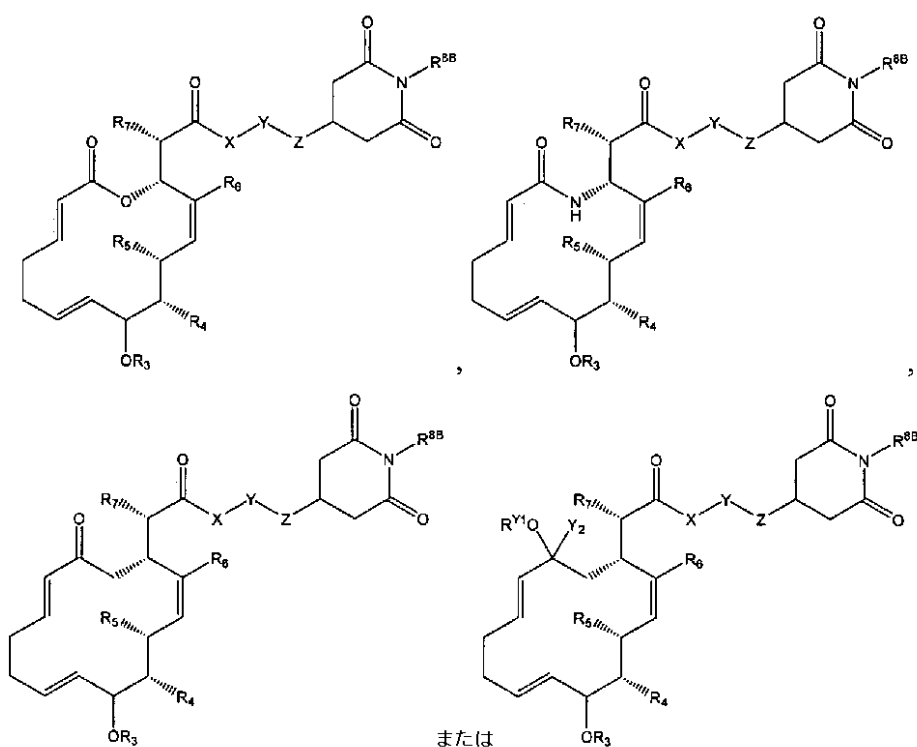
$C = N(R^{Y1})$  もしくは  $-CH(Hal)$  ; あるいは置換もしくは非置換の  $C_{0-6}$  アルキリデン鎖または  $C_{0-6}$  アルケニリデン鎖であり、ここで2つまでの隣接していないメチレン単位は、独立して、 $CO$ 、 $CO_2$ 、 $COCO$ 、 $CONR^{Z1}$ 、 $ONR^{Z1}$ 、 $NR^{Z1}NR^{Z2}$ 、 $NR^{Z1}NR^{Z2}CO$ 、 $NR^{Z1}CO$ 、 $NR^{Z1}CO_2$ 、 $NR^{Z1}CONR^{Z2}$ 、 $SO$ 、 $SO_2$ 、 $NR^{Z1}SO_2$ 、 $SO_2NR^{Z1}$ 、 $NR^{Z1}SO_2NR^{Z2}$ 、 $O$ 、 $S$ 、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あって、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；

$R_3 \sim R_6$  は、請求項19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； $R_7$  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、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-NR^{Z1}-$ 、 $-CHOR^{Z1}$ 、 $-CHNR^{Z1}R^{Z2}$ 、 $C=S$ 、 $C=N(R^{Y1})$  もしくは  $-CH(Hal)$  ; あるいは置換もしくは非置換の  $C_{0-6}$  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、 $CO$ 、 $CO_2$ 、 $COCO$ 、 $CONR^{Z1}$ 、 $ONR^{Z1}$ 、 $NR^{Z1}NR^{Z2}$ 、 $NR^{Z1}NR^{Z2}CO$ 、 $NR^{Z1}CO$ 、 $NR^{Z1}CO_2$ 、 $NR^{Z1}CONR^{Z2}$ 、 $SO$ 、 $SO_2$ 、 $NR^{Z1}SO_2$ 、 $SO_2NR^{Z1}$ 、 $NR^{Z1}SO_2NR^{Z2}$ 、 $O$ 、 $S$ 、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あって、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】

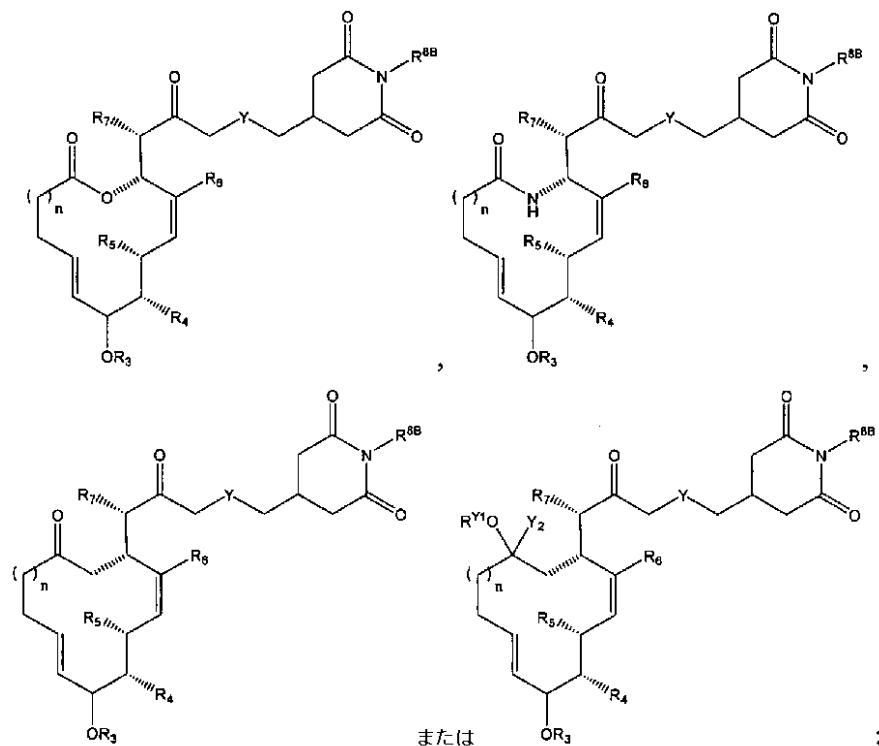
前記化合物において、 $-X-Y-Z$  は、共に部分  $-CH_2-Y-CH_2-$  を表し； $Y$  は、 $-CHOR^{Y1}$ 、 $-CHNR^{Y1}R^{Y2}$ 、 $C=O$ 、 $C=S$ 、 $C=N(R^{Y1})$  または  $-CH(Hal)$  であり； $Hal$  は、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$  および  $I$  から選択されるハロゲンであり；そして  $R^{Y1}$  および  $R^{Y2}$  は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはアシルであるか、または  $R^{Y1}$  および  $R^{Y2}$  は、 $R^{Y1}$  および  $R^{Y2}$  が結合される窒素原子と一緒にあって、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；

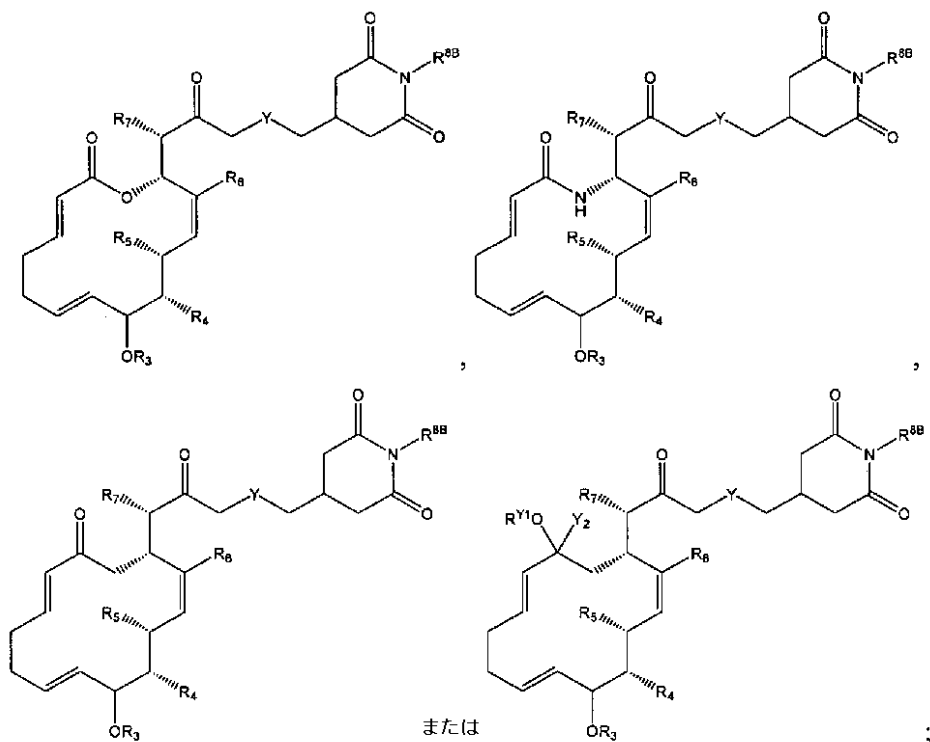
$R_3 \sim R_6$  および  $n$  は、請求項 19 に定義されるものであり； $Y_2$  および  $R^{Y1}$  は、独立して、水素または低級アルキルであり； $R_7$  は、置換もしくは非置換の、直鎖状または分枝状の、環式低級アルキル部分あるいは非環式低級アルキル部分であり； $R^{8B}$  は、水素または低級アルキルであり；そして  $Y$  は、 $-CHOR^{Y1}$ 、 $-CHNR^{Y1}R^{Y2}$ 、 $C=O$ 、 $C=S$ 、 $C=N(R^{Y1})$  または  $-CH(Hal)$  であり； $Hal$  は、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$  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あって、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 2 6】



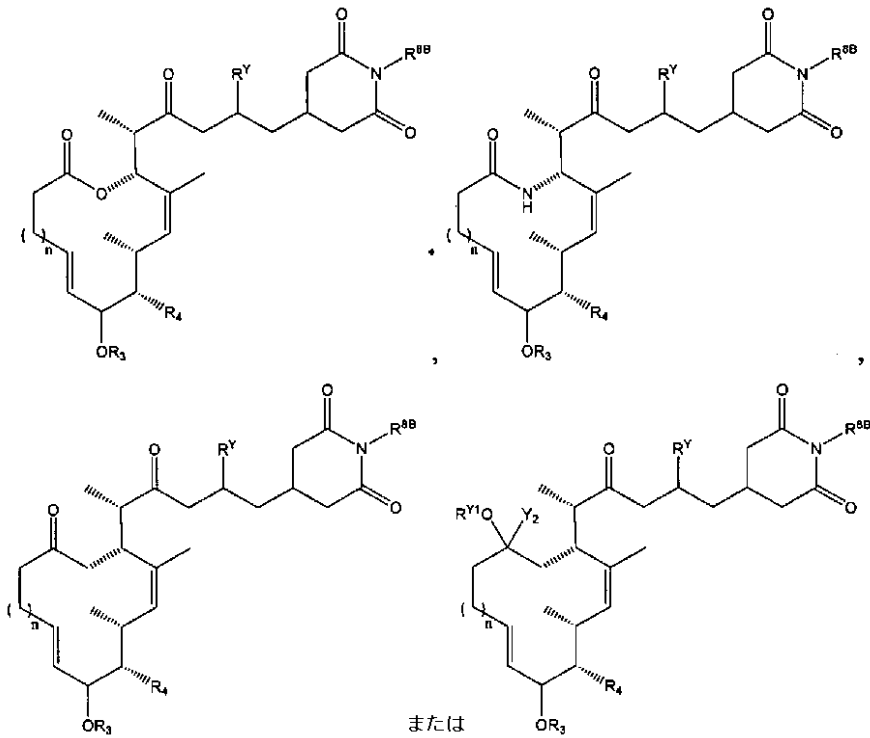
を有し；

$R_3 \sim R_6$  は、請求項 19 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； $R_7$  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、 $-CHOR^{Y1}$ 、 $-CHNR^{Y1}R^{Y2}$ 、 $C=O$ 、 $C=S$ 、 $C=N(R^{Y1})$  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あって、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】



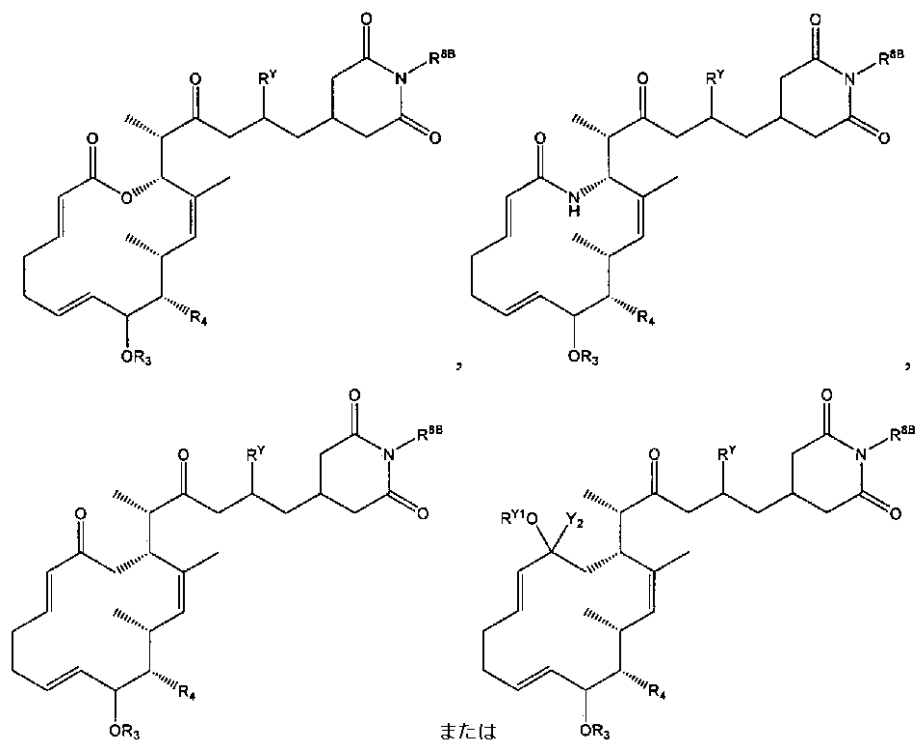
を有し；

$n$ 、 $R_3$  および  $R_4$  は、請求項 19 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、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 36】

前記化合物は、構造：

## 【化 2 8】



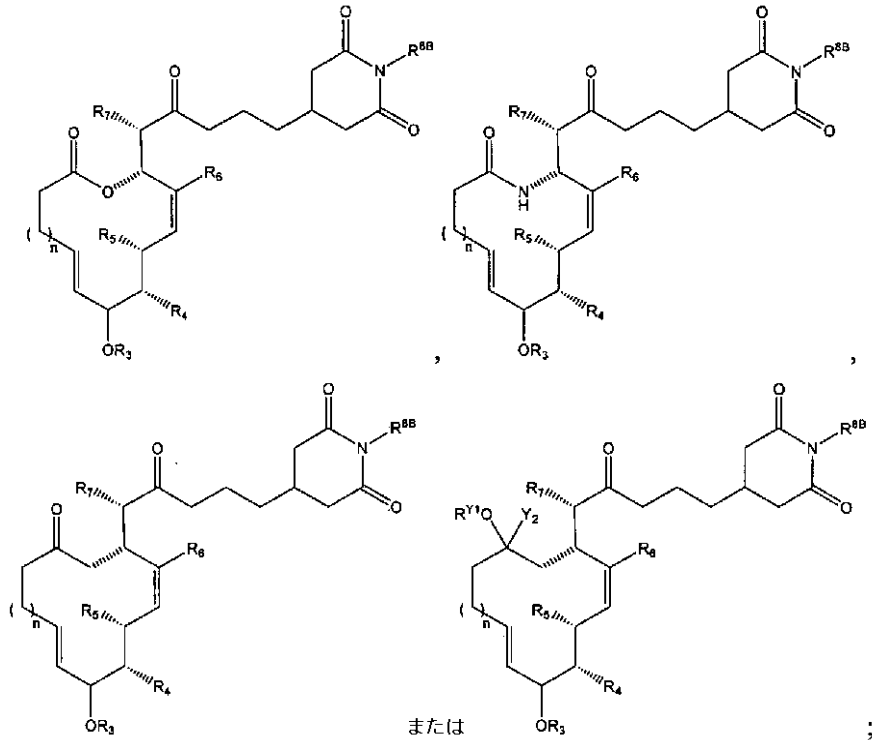
を有し；

$R_3$  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  $R^{Y1}$  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、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 2 9】



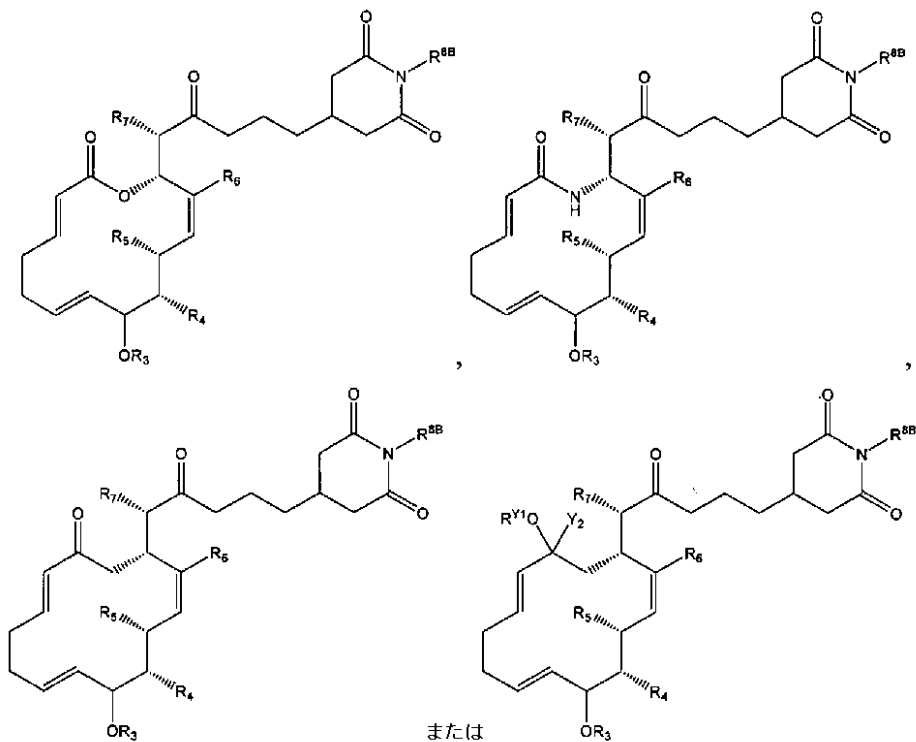
を有し；

$R_3 \sim R_6$  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  $R^{Y1}$  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】



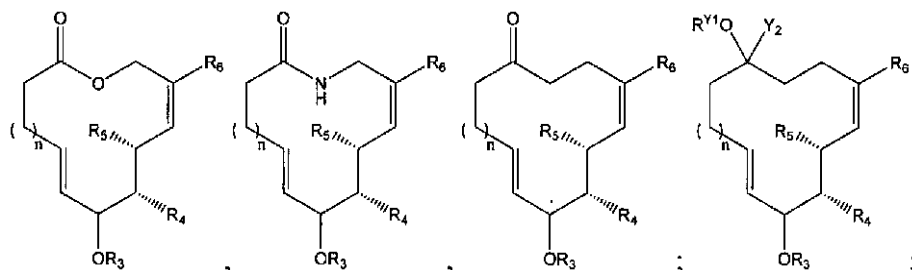
を有し；

$R_3 \sim R_6$  は、請求項 19 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； $R_7$  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 39】

前記化合物は、構造：

【化 3 1】



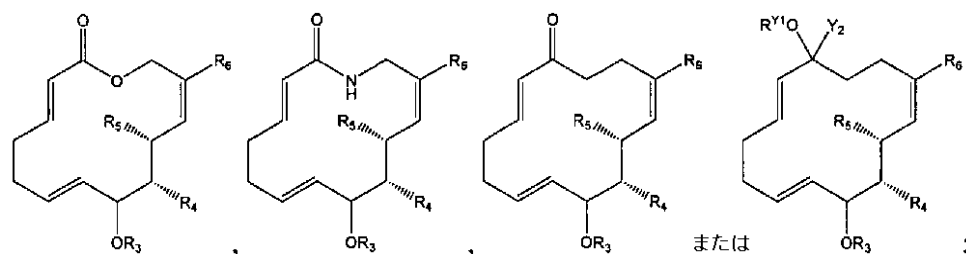
を有し；

$R_3 \sim R_6$  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  $R^{Y1}$  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 40】

前記化合物は、構造：

【化 3 2】



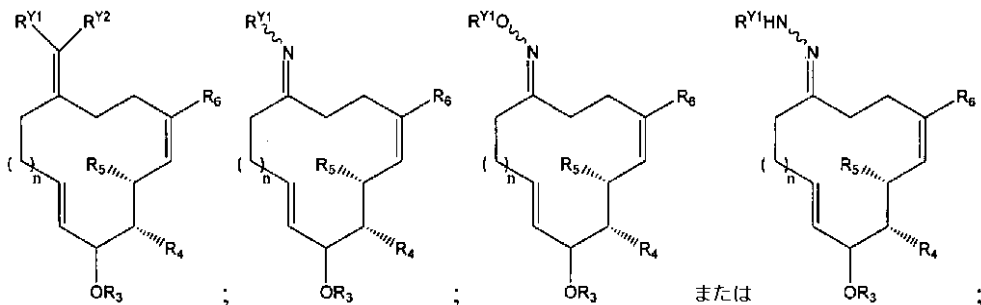
を有し；

$R_3 \sim R_6$  は、請求項 1 に定義されるものであり；そして  $Y_2$  および  $R^{Y1}$  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 41】

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  $R^{Y1}$  は、独立して、水素または低級アルキルである、

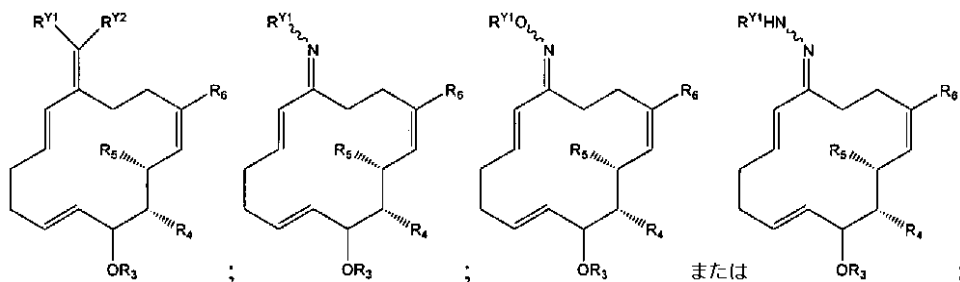


請求項 1、2 または 3 に記載の組成物。

【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  $R^{Y1}$  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。

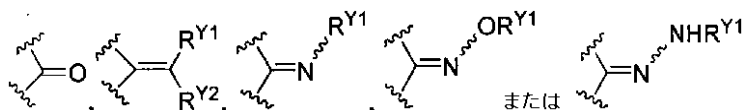
【請求項 4 6】

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、構造：

【化 3 5】



を有する部分を形成し； $R^{Y1}$  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、OH、OAc、NH<sub>2</sub> 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、構造：

【化 3 6】

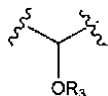


を有する部分を形成する、請求項 4 7 に記載の組成物。

【請求項 4 9】

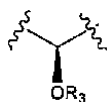
前記化合物において、立体中心：

【化 3 7】



は、以下の立体化学：

【化 3 8】

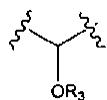


を有する、請求項 3 9 ~ 4 2 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 5 0】

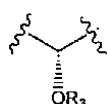
前記化合物において、立体中心：

【化 3 9】



は、以下の立体化学：

【化 4 0】



を有する、請求項 3 9 ~ 4 2 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 5 1】

前記化合物において、 $Y_2$  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  $R^{Y_1}$  は、水素または低級アルキルである、請求項 4 7 に記載の組成物。

【請求項 5 2】

前記化合物において、 $Y_2$  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  $R^{Y_1}$  は、水素また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 5 3】

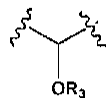
前記化合物において、 $Y_2$  は、1 個 ~ 3 個のハロゲン原子によって必要に応じて置換される低級アルキルであり、そして  $R^{Y_1}$  は、水素または低級アルキルであり； $R_3$ 、 $R_5$  および  $R_6$  は、それぞれメチルであり； $R_4$  は、OH、OAc、 $NH_2$  または F であるか、または  $R_4$  は、 $R_4$  が結合される炭素原子と一緒にあって、構造：

【化 4 1】



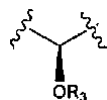
を有する部分を形成し；そして立体中心：

【化 4 2】



は、以下の立体化学：

【化 4 3】

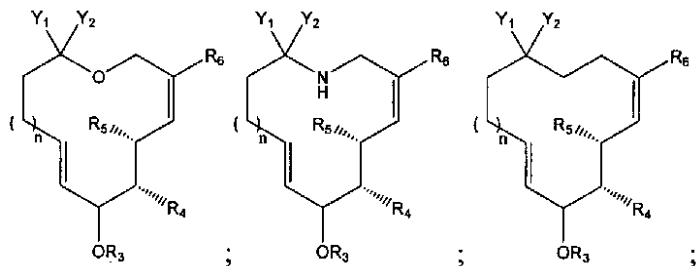


を有する、請求項 3 9 ~ 4 2 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 5 4】

前記化合物は、構造：

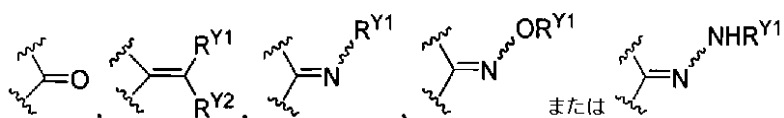
## 【化 4 4】



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あって、構造：

## 【化 4 5】



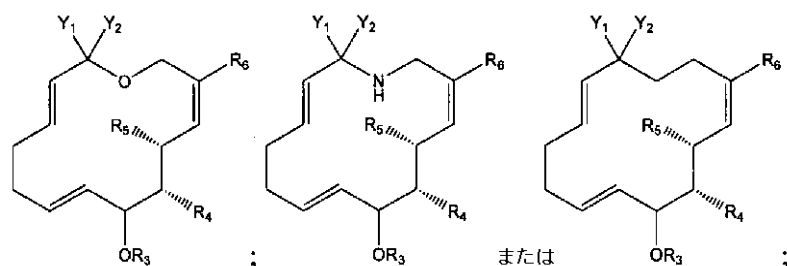
を有する部分を形成し；ここで  $W$  は、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$  または  $-NR^{Y2}-$  であり、 $R^{Y1}$  および  $R^{Y2}$  の各出現は、独立して、水素、またはアルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロシクロアルキル部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分である、

請求項 1、2、3、7 または 9 に記載の組成物。

## 【請求項 5 5】

前記化合物は、構造：

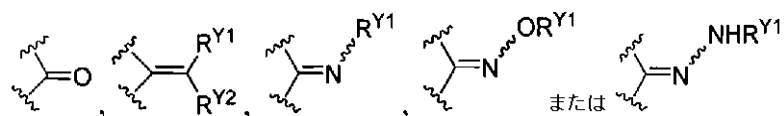
## 【化 4 6】



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あって、構造：

## 【化 4 7】



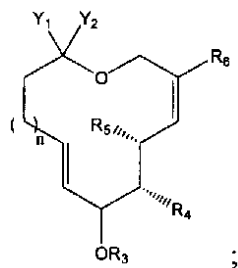
を有する部分を形成し；ここで  $W$  は、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$  または  $-NR^{Y2}-$  であり、 $R^{Y1}$  および  $R^{Y2}$  の各出現は、独立して、水素、またはアルキル部分、ヘテロアルキル部分、シクロアルキル部分、ヘテロシクロアルキル部分、アリール部分もしくはヘテロアリール部分である、

請求項 1、2、3、7 または 9 に記載の組成物。

## 【請求項 56】

前記化合物は、構造：

## 【化 48】



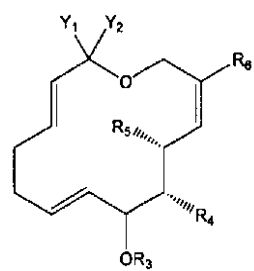
を有し；

$n$  は、3 であり；そして  $Y_1$  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 57】

前記化合物は、構造：

## 【化 49】



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 58】

$R_5$  および  $R_6$  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 59】

$R_3$  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 60】

$R_3$  は、メチルである、請求項 59 に記載の組成物。

## 【請求項 61】

$R_4$  は、OH、OAc、 $NH_2$  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あって、構造：

## 【化 50】

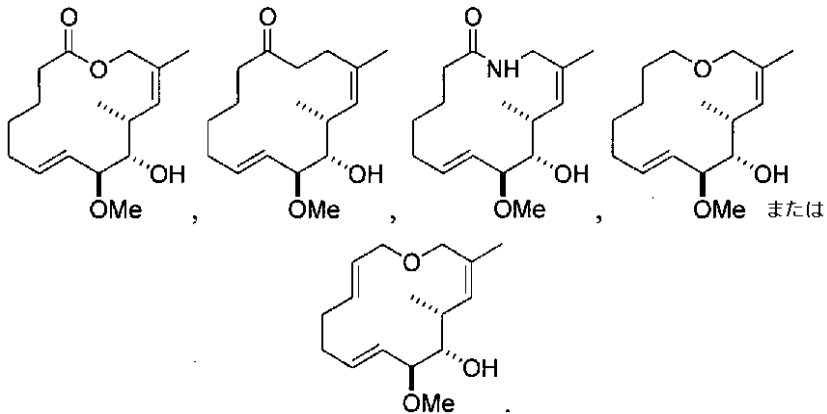


を有する部分を形成する、請求項 56 または 57 に記載の組成物。

## 【請求項 62】

前記化合物は、以下の構造：

## 【化 5 1】



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 k g あたり約 2 0 m g ~ 約 6 0 m g 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：

The diagram shows a substituted cyclohexane ring. The ring has substituents  $R_a$ ,  $R_b$ ,  $R_1$ ,  $R_2$ ,  $R_3$  (as  $OR_3$ ),  $R_4$ ,  $R_5$ ,  $R_6$ , and  $R_c$ . There is a fused ring system on the right side, with substituents  $Y_1$ ,  $Y_2$ ,  $X_1$ , and  $Q$ . A dashed line indicates a repeating unit with subscript  $n$ .

**I**

$R_a$ 、および $R_b$ の各出現は、独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-S(O)_{1-2}$   
 $R^{a1}$ 、 $-NO_2$ 、 $-COR^{a1}$ 、 $-CO_2R^{a1}$ 、 $-NR^{a1}C(=O)R^{a2}$ 、 $-N$   
 $R^{a1}C(=O)OR^{a2}$ 、 $-CONR^{a1}R^{a2}$ 、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あって、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、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；

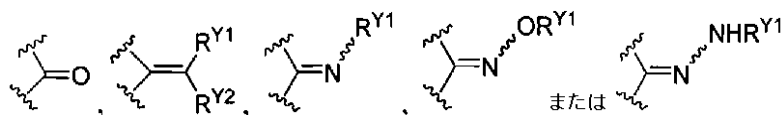
$n$  は、1～5の整数であり；

$X_1$  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。