

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】令和2年12月24日(2020.12.24)

【公表番号】特表2018-524334(P2018-524334A)

【公表日】平成30年8月30日(2018.8.30)

【年通号数】公開・登録公報2018-033

【出願番号】特願2017-567099(P2017-567099)

【国際特許分類】

C 0 7 D 207/34 (2006.01)

C 1 2 N 9/99 (2006.01)

C 1 2 Q 1/66 (2006.01)

C 1 2 N 9/02 (2006.01)

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

C 0 7 D 209/42 (2006.01)

C 0 7 D 491/048 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 207/34 C S P

C 1 2 N 9/99 Z N A

C 1 2 Q 1/66

C 1 2 N 9/02

C 0 7 D 495/04 1 0 3

C 0 7 D 209/42

C 0 7 D 491/048

【誤訳訂正書】

【提出日】令和2年11月16日(2020.11.16)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

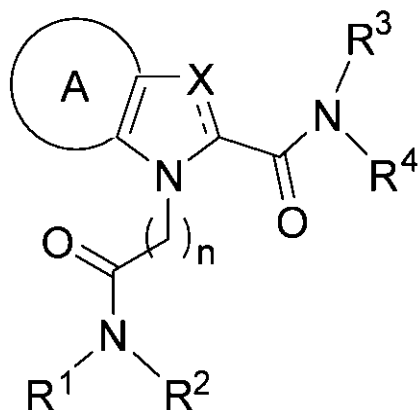
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物、またはその塩であって：



( I )

式中：

点線は、結合の存在または不在を表し；

Xは、C H、N、O、またはSであり；

前記点線が結合の存在を表す場合、Xは、C HまたはNであり、前記点線が結合の不在を表す場合、Xは、OまたはSであり；

Aは、任意で置換されたフェニル環、または任意で置換された5または6員のヘテロアリール環であり；

R<sup>1</sup>は、水素、任意で置換されたC<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>アルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアリールアルキル、任意で置換されたアルコシアルキル及び任意で置換されたアルコシアルコシアルキルからなる群から選択され；及び

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、各々独立して、水素、任意で置換されたC<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>アルキル、任意で置換されたC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>-シクロアルキル、任意で置換されたC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>-シクロアルキルアルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたアリールアルキル、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたヘテロアリールアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、及び任意で置換されたヘテロシクリルアルキルからなる群から選択され；またはR<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、それらが結合している窒素原子と一緒に、任意で置換された環と一緒に形成し；並びに

(a) Aが、5員のヘテロアリール環、任意でチエニル環もしくはフラニル環であり；R<sup>2</sup>が、任意で置換されたアリールであり；及び

nが、0、1、2、3、4もしくは5であり；または

(b) Aが、フェニル環であり；

R<sup>2</sup>が、任意で置換されたアリールであり；及び

nが、0である

のいずれかである、前記化合物、またはその塩。

【請求項2】

Aが5員のヘテロアリール環である場合、nが、1である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

前記点線が、結合の存在を表し、Xが、C Hである、請求項1～2のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項4】

R<sup>1</sup>が、水素、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>アルキル、ハロ - C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキル、アルコシアルコシアルキル、及びアリールアルキルからなる群から選択され；任意で、R<sup>1</sup>が、水素、エチル、n - ヘキシル、2 - (2 - メトキシエトキシ)エチル及びベンジルからなる群から選択され；さらに任意で、R<sup>1</sup>が、エチルである、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項5】

R<sup>2</sup>が、置換フェニルであり；任意で、R<sup>2</sup>が、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル、シアノ、アミド、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシ、及びヒドロシアルキルからなる群から選択される1つの置換基で置換されたフェニルであり；さらに任意で、R<sup>2</sup>が、1つのメチル基で置換されたフェニルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が、それらが結合している窒素原子と一緒に、任意で置換された環と一緒に形成し；任意で、前記環が、任意で置換された単環式の複素環であり；さらに任意で、前記任意で置換された単環式の複素環が、任意で置換されたピロリジン、ピペリジン及びピペラジンからなる群から選択され；さらにまた任意で、前記任意で置換された単環式の複素環が、未置換ピロリジン、未置換ピペリジン、1つの置換基で置換されたピペリジン、または1つの置換基で置換されたピペラジンからなる群から選択される、請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項7】

R<sup>3</sup>が、水素である、請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項 8】

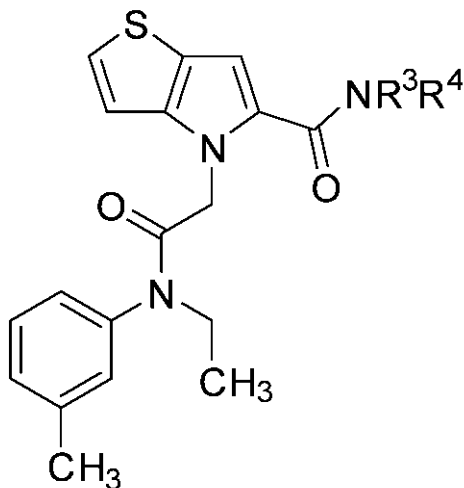
$R^4$ が、未置換  $C_1 - C_8$ アルキル、ハロ -  $C_1 - C_8$  - アルキル、カルボキシ -  $C_1 - C_8$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシカルボニル -  $C_1 - C_8$  - アルキル、任意で置換されたフェニル、任意で置換された  $C_5 - C_6$ シクロアルキル、任意で置換された  $C_5 - C_6$  - シクロアルキルアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたヘテロアリーラルキル、及び任意で置換されたヘテロシクリルアルキルからなる群から選択され；任意で、 $R^4$ が、未置換であるかまたは1つの置換基で置換されたフェニルであり；さらに任意で、前記置換基が、 $C_1 - C_4$  - アルコキシカルボニル、及び  $C_1 - C_4$  - アルコキシカルボニル -  $C_1 - C_4$  - アルキルからなる群から選択される、請求項 1 ~ 5 及び 7 のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項 9】

$R^4$ が、カルボキシ、 $C_1 - C_4$  - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_8$  - アルキルアミド、ヒドロキシ -  $C_1 - C_8$  - アルキルアミド、アミド、任意で置換されたアミノ -  $C_1 - C_8$  - アルキルアミド、 $C_1 - C_4$  - ジアルキルアミノ -  $C_1 - C_8$  - アルキルアミド、カルボキシ -  $C_1 - C_8$  - アルキルアミド、スルホン酸 -  $C_1 - C_8$  - アルキルアミド、スルホネート -  $C_1 - C_8$  - アルキルアミド、 $C_1 - C_4$  - アルキルカルボニル -  $C_1 - C_8$  - アルキルアミド、任意で置換された  $C_3 - C_6$  - シクロアルキルアミド、及び任意で置換されたヘテロシクリルアミドからなる群から選択される1つの置換基で置換されるシクロヘキシルである、請求項 1 ~ 5 及び 7 のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項 10】

前記化合物が、式 ( I a ) :

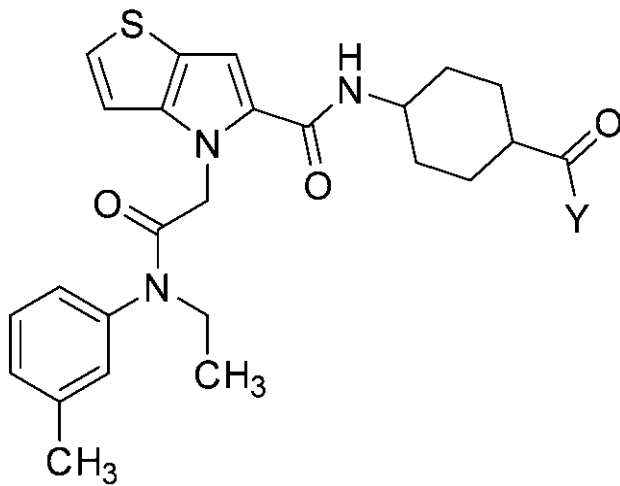


( I a )

を有する、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 11】

前記化合物が、式 ( I b ) を有し :



( I b )

式中：

Y が、 $-NR^aR^b$  及び  $-OR^c$  からなる群から選択され；

$R^a$  及び  $R^b$  が、各々独立して、水素、任意で置換された  $C_1 - C_8$  アルキル、任意で置換された  $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、及び任意で置換されたヘテロシクリルからなる群から選択され；または  $R^a$  及び  $R^b$  が、それらが結合している窒素原子と一緒に、任意で置換された環と一緒に形成し；及び

$R^c$  は、水素及び任意で置換された  $C_1 - C_4$  アルキルからなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 2】

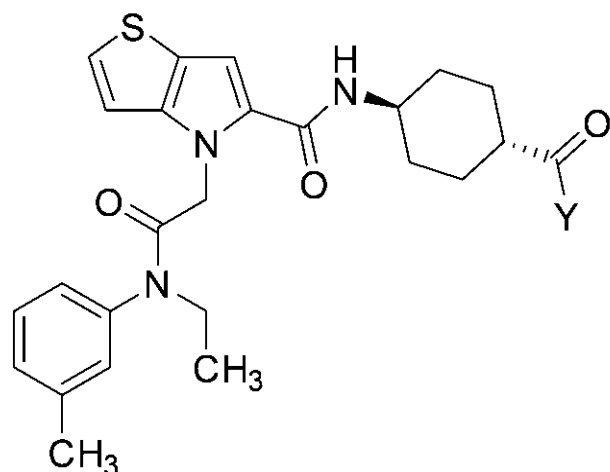
Y が、 $-OR^c$  であり、任意で、 $R^c$  が、水素及びメチルからなる群から選択され、もしくは Y が、 $-NR^aR^b$  であり；任意で、 $R^a$  及び  $R^b$  が、それらが結合している窒素原子と一緒に、任意で置換された環と一緒に形成し；さらに任意で、前記環が、任意で置換された単環式の複素環であり；さらに任意で、前記任意で置換された単環式の複素環が、任意で置換されたピペリジンであり、任意で、前記任意で置換された単環式の複素環が、未置換ピペリジン及び 1 つの置換基で置換されたピペリジンからなる群から選択される、請求項 1 1 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

$R^a$  が、水素であり、任意で、 $R^b$  が、水素、任意で置換された  $C_1 - C_8$  アルキル、任意で置換された  $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、及び任意で置換されたヘテロシクリル；、 $C_1 - C_6$  アルキル、ヒドロキシアルキル、任意で置換されたアミノアルキル、カルボキシアルキル、スルホン酸 - アルキル、スルホネート - アルキル、アルキルカルボニルアルキル、及び任意で置換された 6 員のヘテロシクリルからなる群から選択される、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

前記化合物が、以下の式 ( I b ' )



## ( I b ' )

を有する、請求項 1 1 ~ 1 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

## 【請求項 1 5】

- N - シクロヘキシル - 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;
- N - エチル - 2 - ( 5 - ( ピロリジン - 1 - カルボニル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 4 - イル ) - N - ( m - トリル ) アセトアミド ;
- N - エチル - 2 - ( 5 - ( ピペリジン - 1 - カルボニル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 4 - イル ) - N - ( m - トリル ) アセトアミド ;
- 1 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボニル ) ピペリジン - 4 - カルボン酸エチル ;
- 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - N - フェニル - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;
- 2 - ( 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) フェニル ) 酢酸エチル ;
- 3 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) 安息香酸メチル ;
- メチル - シス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボキシレート ;
- 8 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) オクタン酸 ;
- 6 - ( 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) ピペリジン - 1 - イル ) - 6 - オキシヘキサン酸 ;
- トランス - メチル - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボキシレート ;
- トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボン酸 ;
- N - ( トランス - 4 - ( ブチルカルバモイル ) シクロヘキシル ) - 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;
- 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - N - ( トランス - 4 - ( ( 2 - ヒドロキシエチル ) カルバモイル ) シクロヘキシル ) - 4 H - チエノ [ 3 ,

2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;

N - ( トランス - 4 - ( ( 2 - ( ジメチルアミノ ) エチル ) カルバモイル ) シクロヘキシル ) - 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;

4 - ( トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボキサミド ) ブタン酸 ;

N - ( トランス - 4 - カルバモイルシクロヘキシル ) - 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;

4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - N - ( トランス - 4 - ( ヘキシルカルバモイル ) シクロヘキシル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;

1 - ( トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボニル ) ピペリジン - 4 - カルボン酸エチル ;

6 - ( トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボキサミド ) ヘキサン酸メチル ;

6 - ( トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボキサミド ) ヘキサン酸 ;

1 - ( トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボニル ) ピペリジン - 4 - カルボン酸 ;

8 - ( トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボキサミド ) オクタン酸 ;

N - ( トランス - 4 - ( シクロヘキシルカルバモイル ) シクロヘキシル ) - 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;

4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - N - ( トランス - 4 - ( ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル ) カルバモイル ) シクロヘキシル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;

4 - ( トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボキサミド ) ピペリジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチル ;

4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - N - ( トランス - 4 - ( ピペリジン - 4 - イルカルバモイル ) シクロヘキシル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;

N - ( トランス - 4 - ( ( 1 - アセチルピペリジン - 4 - イル ) カルバモイル ) シクロヘキシル ) - 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;

( 6 - ( トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボキサミド ) ヘキシル ) カルバミン酸 tert - ブチル ;

N - ( トランス - 4 - ( ( 6 - ( 3 ' , 6 ' - ジヒドロキシ - 3 - オキシ - 3 H - スピロ [ イソベンゾフラン - 1 , 9 ' - キサンテン ] - 5 ( 6 ) - カルボキサミド ) ヘキシル ) カルバモイル ) シクロヘキシル ) - 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;

N - (トランス - 4 - ( ( 6 - アミノヘキシル ) カルバモイル ) シクロヘキシル ) - 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミドヒドロクロリド ;

4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - N - ( トランス - 4 - ( ( 6 - ヒドロキシヘキシル ) カルバモイル ) シクロヘキシル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;

メチル - トランス - 4 - ( トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサ - 1 - カルボキサミド ) シクロヘキサ - 1 - カルボキシレート ;

トランス - 4 - ( トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサ - 1 - カルボキサミド ) シクロヘキサ - 1 - カルボン酸 ;

( 11S , 14S , 17S ) - 17 - アセトアミド - 11 , 14 - ビス ( カルボキシメチル ) - 1 - ( トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキシル ) - 1 , 10 , 13 , 16 - テトラオキソ - 2 , 9 , 12 , 15 - テトラアザノナデカン - 19 - オイック酸 ;

4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - N - メチル - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;

N - シクロペンチル - 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;

4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - N - ( ピリジン - 4 - イルメチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;

4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - N - ( 3 - モルフオリノプロピル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;

N - エチル - 2 - ( 5 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - カルボニル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 4 - イル ) - N - ( m - トリル ) アセトアミド ;

4 - ( 2 - オキソ - 2 - ( m - トリルアミノ ) エチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボン酸メチル ;

N - シクロヘキシル - 4 - ( 2 - オキソ - 2 - ( m - トリルアミノ ) エチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;

N - シクロヘキシル - 4 - ( 2 - ( ( 2 - ( 2 - メトキシエトキシ ) エチル ) ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;

メチル - トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( ( 2 - ( 2 - メトキシエトキシ ) エチル ) ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサ - 1 - カルボキシレート ;

4 - ( 2 - ( ヘキシル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボン酸メチル ;

N - シクロヘキシル - 4 - ( 2 - ( ヘキシル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;

メチル - トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( ヘキシル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサ - 1 - カルボキシレート ;

4 - ( 2 - ( ベンジル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボン酸メチル ;

6 - ( シス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサ - 1 - カルボキサミド ) ヘキサ酸 ;

6 - ( トランス - 4 - ( ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエ

チル) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド) メチル) シクロヘキサ  
ン - 1 - カルボキサミド) ヘキサ酸メチル ;

6 - ( トランス - 4 - ( ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエ  
チル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド) メチル) シクロヘ  
キサ - 1 - カルボキサミド) ヘキサ酸 ;

6 - ( トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチ  
ル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド) シクロヘキサ - 1  
- カルボキサミド) ヘキサ - 1 - スルホン酸ナトリウム ;

6 - ( トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチ  
ル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド) シクロヘキサ - 1  
- カルボキサミド) ヘキサ - 1 - スルホン酸カリウム ;

トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( ヘキシル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル )  
- 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド) シクロヘキサ - 1 - カ  
ルボン酸 ;

トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( フェニル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4  
H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド) シクロヘキサ - 1 - カルボ  
ン酸メチル ;

トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( ( 3 - シアノフェニル ) ( エチル ) アミノ ) - 2 - オキ  
ソエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド) シクロヘキサ  
ン - 1 - カルボン酸メチル ;

トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( ( 3 - カルバモイルフェニル ) ( エチル ) アミノ ) - 2  
- オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド) シクロ  
ヘキサ - 1 - カルボン酸メチル ;

トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( 3 - エチルフェニル ) アミノ ) - 2 - オキシエ  
チル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド) シクロヘキサ -  
1 - カルボン酸メチル ;

トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( 3 - メトキシフェニル ) アミノ ) - 2 - オキシ  
エチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド) シクロヘキサ  
ン - 1 - カルボン酸メチル ;

トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( o - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) -  
4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド) シクロヘキサ - 1 - カル  
ボン酸メチル ;

トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( 6 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 1 ( 2 H ) -  
イル ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミ  
ド) シクロヘキサ - 1 - カルボン酸メチル ;

トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( p - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) -  
4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド) シクロヘキサ - 1 - カル  
ボン酸メチル ;

トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( 4 - ( ヒドロキシメチル ) フェニル ) アミノ )  
- 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド) シ  
クロヘキサ - 1 - カルボン酸メチル ;

トランス - 4 - ( 1 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) -  
1 H - インドール - 2 - カルボキサミド) シクロヘキサ - 1 - カルボン酸メチル ;

トランス - 4 - ( 1 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) -  
6 - メトキシ - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド) シクロヘキサ - 1 - カルボン  
酸メチル ;

トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) -  
4 H - フロ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド) シクロヘキサ - 1 - カルボ  
ン酸メチル ;

4 - ( 2 - ( エチル ( 3 - エチルフェニル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - N - ( ト

ランス - 4 - ( ( 6 - ヒドロキシヘキシル ) カルバモイル ) シクロヘキシル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ;

6 - ( トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( 3 - エチルフェニル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボキサミド ) ヘキサン - 1 - スルホン酸ナトリウム ;

トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( 3 - イソプロピルフェニル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボン酸メチル ;

トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( 3 - ( ヒドロキシメチル ) フェニル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボン酸メチル ;

トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( ( 3 - ( プロモメチル ) フェニル ) ( エチル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボン酸メチル ;

トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( ( 3 - ( ジメチルアミノ ) フェニル ) ( エチル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボン酸メチル ;

トランス - 4 - ( 4 - ( 2 - ( エチル ( 3 - イソブチルフェニル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 4 H - チエノ [ 3 , 2 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボン酸メチル ;

トランス - 4 - ( 1 - ( 2 - ( エチル ( 3 - エチルフェニル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボン酸メチル ;

1 - ( 2 - ( エチル ( 3 - エチルフェニル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - N - ( トランス - 4 - ( ( 6 - ヒドロキシヘキシル ) カルバモイル ) シクロヘキシル ) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

6 - ( トランス - 4 - ( 1 - ( 2 - ( エチル ( 3 - エチルフェニル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボキサミド ) ヘキサン - 1 - スルホン酸ナトリウム ;

トランス - 4 - ( 1 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボン酸メチル ; 及び

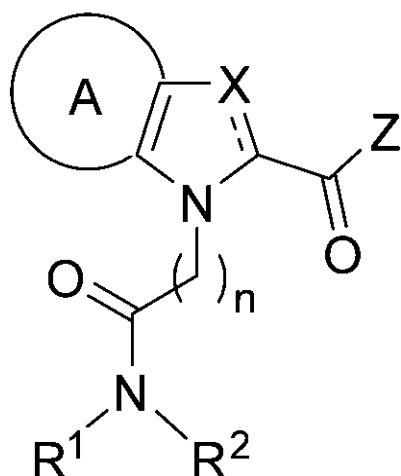
トランス - 4 - ( 6 - ( 2 - ( エチル ( m - トリル ) アミノ ) - 2 - オキシエチル ) - 6 H - チエノ [ 2 , 3 - b ] ピロール - 5 - カルボキサミド ) シクロヘキサン - 1 - カルボン酸メチル

からなる群から選択される、化合物。

【請求項 16】

Oplorphorus 由来ルシフェラーゼの阻害方法であって、

前記 Oplorphorus 由来ルシフェラーゼを式 ( I I ) の化合物 :



( I I )

と接触させることを含み、

式中：

点線が、結合の存在または不在を表し；

n が、0、1、2、3、4、または5であり；

X が、CH、N、O、またはSであり；

前記点線が結合の存在を表す場合、X が、CHまたはNであり、前記点線が結合の不在を表す場合、X が、OまたはSであり；

A が、任意で置換されたフェニル環、または任意で置換された5または6員のヘテロアリール環であり；

R<sup>1</sup> が、水素、任意で置換されたC<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>アルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアリールアルキル、任意で置換されたアルコキシアルキル及び任意で置換されたアルコキシアルコキシアルキルからなる群から選択され；

R<sup>2</sup> が、任意で置換されたアリールであり；

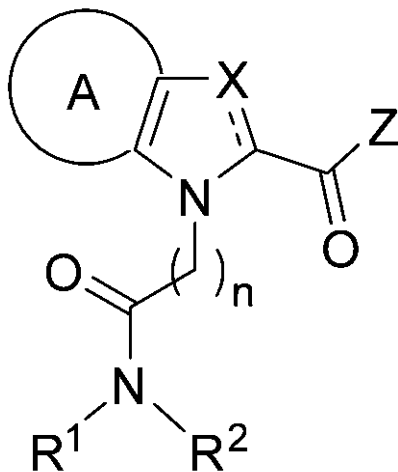
Z が、-NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>であり；及び

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が、各々独立して、水素、任意で置換されたC<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>アルキル、任意で置換されたC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>-シクロアルキル、任意で置換されたC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>-シクロアルキルアルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたアリールアルキル、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたヘテロアリールアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、及び任意で置換されたヘテロシクリルアルキルからなる群から選択され；またはR<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、それらが結合している窒素原子と一緒に、任意で置換された環と一緒に形成し；任意で、前記Op1ophorus由来ルシフェラーゼが、配列番号2のポリペプチド配列を含む、前記方法。

【請求項17】

試料中のOp1ophorus由来ルシフェラーゼの発光の調節方法であって、

(a) 前記試料をセレンテラジン基質及び式(II)の化合物；



( I I )

式中：

点線が、結合の存在または不在を表し；

$n$ が、0、1、2、3、4、または5であり；

$X$ が、CH、N、O、またはSであり；

前記点線が結合の存在を表す場合、 $X$ が、CHまたはNであり、前記点線が結合の不在を表す場合、 $X$ が、OまたはSであり；

$A$ が、任意で置換されたフェニル環、または任意で置換された5または6員のヘテロアリール環であり；

$R^1$ が、水素、任意で置換された $C_1 - C_8$ アルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアリールアルキル、任意で置換されたアルコシアルキル及び任意で置換されたアルコシアルコシアルキルからなる群から選択され；

$R^2$ が、任意で置換されたアリールであり；

$Z$ が、 $-NR^3R^4$ であり；及び

$R^3$ 及び $R^4$ が、各々独立して、水素、任意で置換された $C_1 - C_8$ アルキル、任意で置換された $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、任意で置換された $C_3 - C_8$ -シクロアルキルアルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたアリールアルキル、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたヘテロアリールアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、及び任意で置換されたヘテロシクリルアルキルからなる群から選択され；または $R^3$ 及び $R^4$ は、それらが結合している窒素原子と一緒に、任意で置換された環と一緒に形成する；

と接触させること；並びに

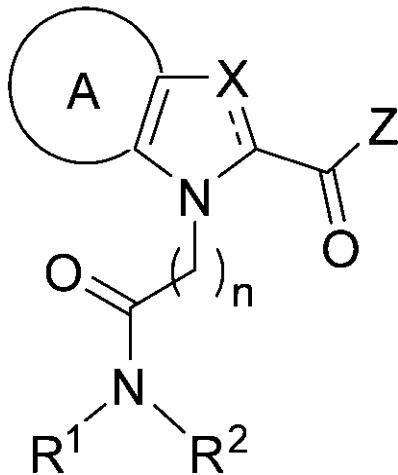
(b) 前記試料中の発光を検出すること、  
を含み、

式(II)の化合物が、前記Oplophorus由来ルシフェラーゼからの発光の減少を引き起こす、前記方法。

【請求項18】

試料中の第1のタンパク質と第2のタンパク質の間の相互作用を検出する方法であって、

(a) 試料をセレンテラジン基質及び式(II)の化合物；



( I I )

式中：

点線が、結合の存在または不在を表し；

nが、0、1、2、3、4、または5であり；

Xが、CH、N、O、またはSであり；

前記点線が結合の存在を表す場合、Xが、CHまたはNであり、前記点線が結合の不在を表す場合、Xが、OまたはSであり；

Aが、任意で置換されたフェニル環、または任意で置換された5または6員のヘテロアリアル環であり；

R<sup>1</sup>が、水素、任意で置換されたC<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>アルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアリールアルキル、任意で置換されたアルコキシアリール及び任意で置換されたアルコキシアリールアルキルからなる群から選択され；

R<sup>2</sup>が、任意で置換されたアリールであり；

Zが、-NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>であり；及び

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が、各々独立して、水素、任意で置換されたC<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>アルキル、任意で置換されたC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>-シクロアルキル、任意で置換されたC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>-シクロアルキルアルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたアリールアルキル、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたヘテロアリールアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、及び任意で置換されたヘテロシクリルアルキルからなる群から選択され；またはR<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、それらが結合している窒素原子と一緒に、任意で置換された環と一緒に形成する；

と接触させること、前記試料は、

( i ) O p l o p h o r u s 由来ルシフェラーゼの第1の断片及び第1のタンパク質を含む第1の融合タンパク質をコードする第1のポリヌクレオチド；及び

( i i ) 前記 O p l o p h o r u s 由来ルシフェラーゼの第2の断片及び第2のタンパク質を含む第2の融合タンパク質をコードする第2のポリヌクレオチドを含み；並びに

( b ) 前記試料中の発光を検出すること、

を含み、

発光の検出が、前記第1のタンパク質と前記第2のタンパク質の間の相互作用を示す、前記方法。

【請求項19】

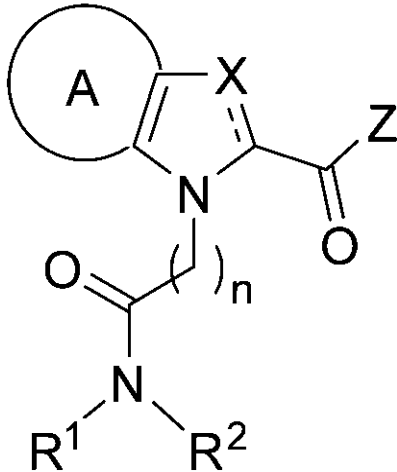
前記試料を式( I I )の化合物と接触させる前に、前記試料を前記セレンテラジン基質と接触させること；任意で、前記第1のタンパク質と第2のタンパク質が相互作用する場合、前記 O p l o p h o r u s 由来ルシフェラーゼの前記第1の断片及び前記 O p l o p

horus由来ルシフェラーゼの前記第2の断片が、前記セレンテラジン基質に安定して結合することが可能な完全長酵素を再構成することを含む、請求項17~18のいずれか1項に記載の方法。

【請求項20】

試料中の第1のタンパク質と第2のタンパク質の間の相互作用を検出する方法であって、

(a) 試料をセレンテラジン基質及び式(II)の化合物：



(II)

式中：

点線が、結合の存在または不在を表し；

nが、0、1、2、3、4、または5であり；

Xが、CH、N、O、またはSであり；

前記点線が結合の存在を表す場合、Xが、CHまたはNであり、前記点線が結合の不在を表す場合、Xが、OまたはSであり；

Aが、任意で置換されたフェニル環、または任意で置換された5または6員のヘテロアリール環であり；

R<sup>1</sup>が、水素、任意で置換されたC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアリールアルキル、任意で置換されたアルコキシアリール及び任意で置換されたアルコキシアリールアルキルからなる群から選択され；

R<sup>2</sup>が、任意で置換されたアリールであり；

Zが、-NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>であり；及び

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が、各々独立して、水素、任意で置換されたC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキル、任意で置換されたC<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、任意で置換されたC<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキルアルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたアリールアルキル、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたヘテロアリールアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、及び任意で置換されたヘテロシクリルアルキルからなる群から選択され；またはR<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、それらが結合している窒素原子と一緒に、任意で置換された環と一緒に形成する；

と接触させること、前記試料は：

(i) 生物発光ドナーであるOplophorus由来ルシフェラーゼ及び第1のタンパク質を含む第1の融合タンパク質をコードする第1のポリヌクレオチド；及び

(ii) 蛍光アクセプター分子及び第2のタンパク質を含む第2の融合タンパク質をコードする第2のポリヌクレオチド  
を含み；

(b) 前記生物発光ドナーと前記蛍光アクセプターの相互作用または近接を示す、前記

試料中の生物発光共鳴エネルギー移動 (BRET) を検出することを含む、前記方法。

【請求項 21】

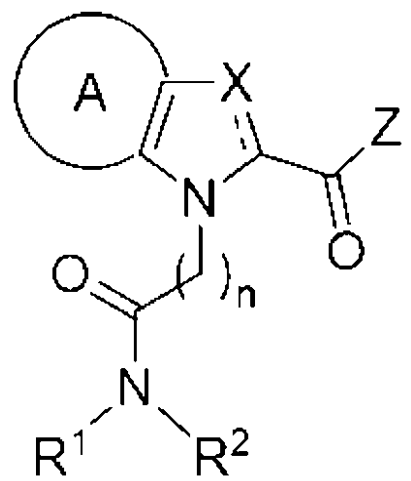
前記試料が、細胞を含み；任意で、前記細胞が、前記 *Op1ophorus* 由来ルシフェラーゼを含むか、または発現するかである、請求項 17 ~ 20 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 22】

前記セレンテラジン基質が、セレンテラジン、セレンテラジン誘導体、セレンテラジンアナログ、プロセレンテラジン、またはキノンマスクされたセレンテラジンである、請求項 17 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 23】

第 1 の標的タンパク質及び生物発光ドナー分子を含む第 1 の融合タンパク質、ここで前記生物発光ドナー分子は、*Op1ophorus* 由来ルシフェラーゼである；第 2 の標的タンパク質及び蛍光アクセプター分子を含む第 2 の融合タンパク質；セレンテラジン基質、及び式 (II) の化合物；



(II)

式中：

点線が、結合の存在または不在を表し；

n が、0、1、2、3、4、または 5 であり；

X が、CH、N、O、または S であり；

前記点線が結合の存在を表す場合、X が、CH または N であり、前記点線が結合の不在を表す場合、X が、O または S であり；

A が、任意で置換されたフェニル環、または任意で置換された 5 または 6 員のヘテロアリール環であり；

R<sup>1</sup> が、水素、任意で置換された C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> アルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアリールアルキル、任意で置換されたアルコキシアリール及び任意で置換されたアルコキシアリールアルキルからなる群から選択され；

R<sup>2</sup> が、任意で置換されたアリールであり；

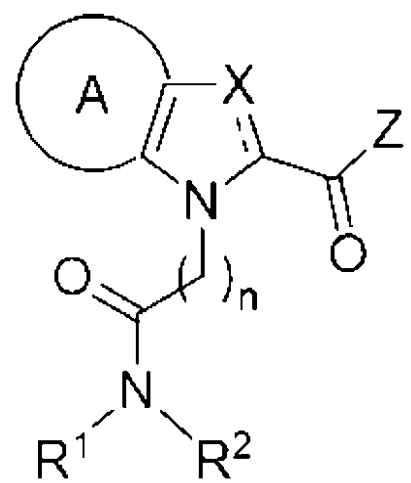
Z が、-NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup> であり；及び

R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> が、各々独立して、水素、任意で置換された C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> アルキル、任意で置換された C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、任意で置換された C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルアルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたアリールアルキル、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたヘテロアリールアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、及び任意で置換されたヘテロシクリルアルキルからなる群から選択され；または R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> は、それらが結合している窒素原子と一緒に、任意で置換された環と一緒に形成

する、  
を含む、生物発光共鳴エネルギー移動 (BRET) システム。

【請求項 24】

(a) 式 (II) の化合物：



(II)

式中：

点線が、結合の存在または不在を表し；

n が、0、1、2、3、4、または5であり；

X が、CH、N、O、またはSであり；

前記点線が結合の存在を表す場合、X が、CH または N であり、前記点線が結合の不在を表す場合、X が、O または S であり；

A が、任意で置換されたフェニル環、または任意で置換された5または6員のヘテロアリール環であり；

R<sup>1</sup> が、水素、任意で置換された C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> アルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたアリールアルキル、任意で置換されたアルコシアルキル及び任意で置換されたアルコシアルコシアルキルからなる群から選択され；

R<sup>2</sup> が、任意で置換されたアリールであり；

Z が、-NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup> であり；及び

R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> が、各々独立して、水素、任意で置換された C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> アルキル、任意で置換された C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、任意で置換された C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキルアルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたアリールアルキル、任意で置換されたヘテロアリール、任意で置換されたヘテロアリールアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、及び任意で置換されたヘテロシクリルアルキルからなる群から選択され；または R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> は、それらが結合している窒素原子と一緒に、任意で置換された環と一緒に形成する；並びに

(b) Op1ophorus 由来ルシフェラーゼ；任意で、前記 Op1ophorus 由来ルシフェラーゼが、配列番号 2 のポリペプチド配列を含む；

を含むキットであり；

前記キットが、さらに任意で；

セレンテラジン基質及び/または発光アッセイを実施するための指示書

を含む、キット。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0095

【訂正方法】変更

## 【訂正の内容】

## 【0095】

いくつかの実施形態では、 $R^4$ は、カルボキシ、 $C_1 - C_4$ -アルコキシカルボニル（例えば、 $-C(O)OCH_3$ ）、 $C_1 - C_8$ -アルキルアミド（例えば、 $-C(O)NH - (CH_2)_3CH_3$ または $-C(O)NH - (CH_2)_5CH_3$ ）、ヒドロキシ- $C_1 - C_8$ -アルキルアミド（例えば、 $-C(O)NH - (CH_2)_2OH$ または $-C(O)NH - (CH_2)_6OH$ ）、アミド（すなわち、 $-CONH_2$ ）、任意で置換されたアミノ- $C_1 - C_8$ -アルキルアミド（例えば、 $-C(O)NH - (CH_2)_6NH_2$ ）、 $C_1 - C_4$ -ジアルキルアミノ- $C_1 - C_8$ -アルキルアミド（例えば、 $-C(O)NH - (CH_2)_2N(CH_3)_2$ ）、カルボキシ- $C_1 - C_8$ -アルキルアミド（例えば、 $-C(O)NH - (CH_2)_3COOH$ 、 $-C(O)NH - (CH_2)_5COOH$ または $-C(O)NH - (CH_2)_7COOH$ ）、スルホン酸- $C_1 - C_8$ -アルキルアミド（例えば、 $-C(O)NH - (CH_2)_6SO_3H$ ）、スルホネート- $C_1 - C_8$ -アルキルアミド（例えば、 $-C(O)NH - (CH_2)_6SO_3^-$ ）、 $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニル- $C_1 - C_8$ -アルキルアミド（例えば、 $-C(O)NH - (CH_2)_3COOCH_3$ 、 $-C(O)NH - (CH_2)_5COOCH_3$ または $-C(O)NH - (CH_2)_7COOCH_3$ ）、任意で置換された $C_3 - C_6$ -シクロアルキルアミド（例えば、 $-C(O)NH$ -シクロヘキシル、 $-C(O)NH$ -シクロヘキシル- $COOH$ または $-C(O)NH$ -シクロヘキシル- $COOCH_3$ ）、及びヘテロシクリルアミド（例えば、 $-C(O)NH$ -ピペリジニル、未置換またはメチル、*tert*-ブトキシカルボニルまたはアセチルで置換された）からなる群から選択される1つの置換基で置換されるシクロヘキシルである。例えば、いくつかの実施形態では、 $R^4$ は、任意で置換されたアミノ- $C_1 - C_8$ -アルキルアミド（例えば、 $-C(O)NH - (CH_2)_6NH_2$ ）であり、アミノ基は、アミノ保護基（例えば、*tert*-ブトキシカルボニル）で保護され、またはアミノ基はプロトン化され、塩（例えば、ヒドロクロリド塩）を形成し、またはアミノ基は、蛍光団（例えば、フルオロセイン）またはポリペプチド（例えば、 $-Asp - Asp - Asp$ ペプチド、末端でアセチル化されてもよい）でさらに官能化される。