

【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10月23日(2008.10.23)

【公表番号】特表2008-512380(P2008-512380A)

【公表日】平成20年4月24日(2008.4.24)

【年通号数】公開・登録公報2008-016

【出願番号】特願2007-530399(P2007-530399)

【国際特許分類】

C 0 7 D	209/12	(2006.01)
C 0 7 D	471/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/437	(2006.01)
A 6 1 K	31/404	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 P	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/10	(2006.01)
A 6 1 P	19/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)
A 6 1 P	15/06	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
C 4 0 B	50/00	(2006.01)
C 4 0 B	40/04	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D	209/12	C S P
C 0 7 D	471/04	1 0 4 Z
A 6 1 K	31/437	Z C C
A 6 1 K	31/404	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	1/00	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	1/04	

A 6 1 P 17/00
A 6 1 P 19/10
A 6 1 P 19/00
A 6 1 P 35/02
A 6 1 P 15/06
A 6 1 P 43/00 1 1 1
C 4 0 B 50/00
C 4 0 B 40/04

【手続補正書】

【提出日】平成20年9月1日(2008.9.1)

【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

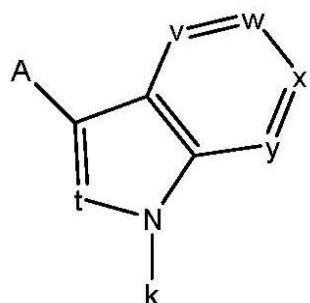
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の化学構造：

【化1】



[式中、

kは、-CR⁶R⁷R^{1~9}, -C(Z)R⁸, -C(Z)NR^{1~2}R^{1~3}, -S(O)₂NR^{1~2}R^{1~3}, および-S(O)₂R^{1~4}からなる群より選択され；Zは、O, S, またはNR⁹であり；

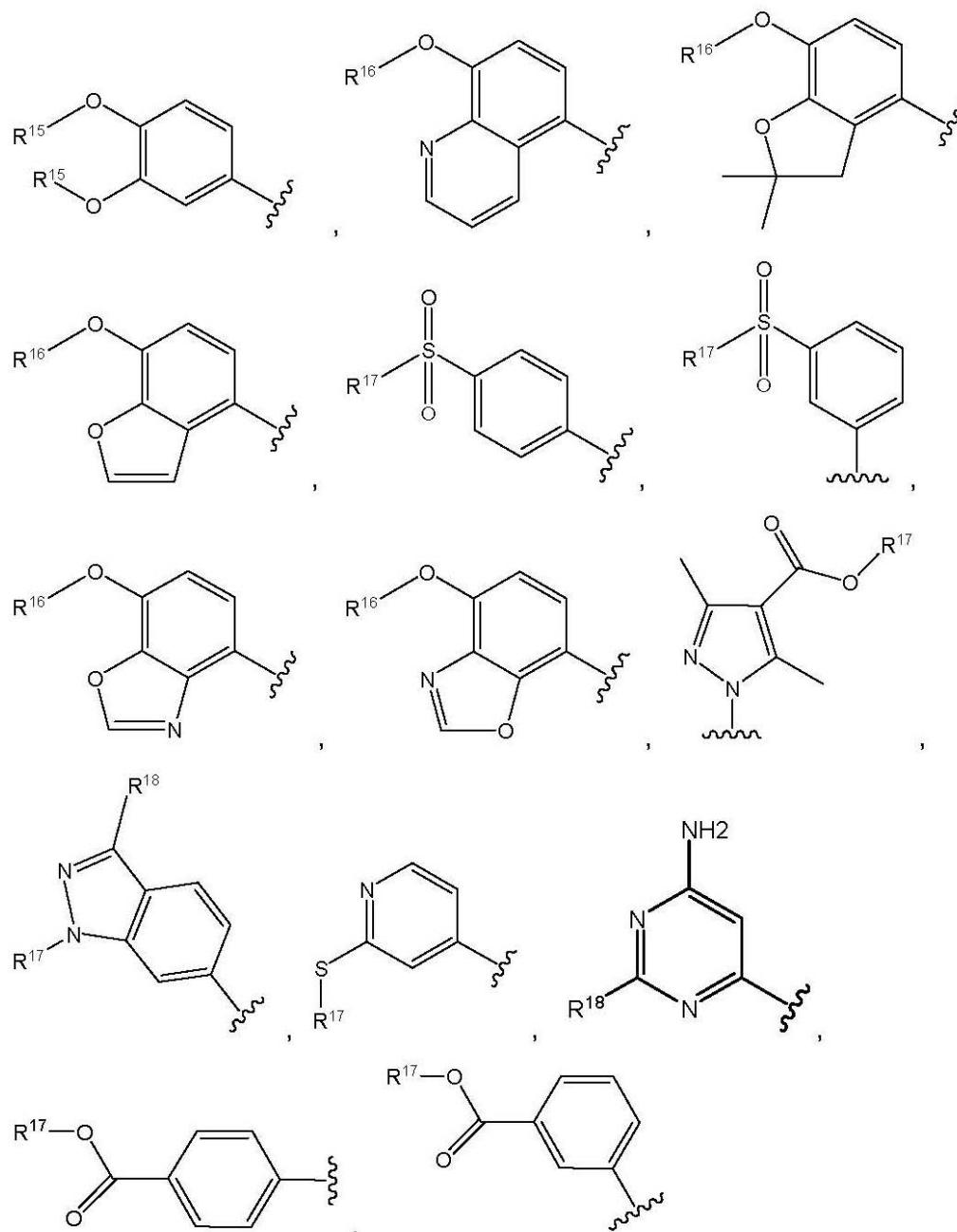
tはCHであり；

yは、NまたはCHであり；

v, wおよびxはCHであり；

Aは、以下からなる群より選択される構造を有しており：

【化2】



R⁶ および R⁷ は、独立して、水素、任意に置換されていてもよい低級アルキル、任意に置換されていてもよい低級アルケニル、任意に置換されていてもよい低級アルキニル、任意に置換されていてもよいシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル、任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル、任意に置換されていてもよいアリール、任意に置換されていてもよいアラルキル、任意に置換されていてもよいヘテロアリール、および任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択され；

R⁸ は、それぞれの場合に独立して、-OR⁹、任意に置換されていてもよい低級アルキル、任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、R⁸ がアルケニルであるとき、そのアルケン炭素はC(Z)には結合していない）、任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、R⁸ がアルキニルであるとき、そのアルキン炭素はC(Z)には結合していない），任意に置換されていてもよいシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル、任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル、任意に置換されていてもよいア

リール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，および任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択され；R⁹は、それぞれの場合に独立して、水素，任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、R⁹がアルケニルであるとき，そのアルケン炭素はO，NまたはSには結合していない），任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、R⁹がアルキニルであるとき，そのアルキン炭素はO，NまたはSには結合していない），任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択され；

R¹⁰およびR¹¹は、それぞれの場合に独立して、水素，任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、R¹⁰および/またはR¹¹がアルケニルであるとき，そのアルケン炭素は窒素には結合していない），任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、R¹⁰および/またはR¹¹がアルキニルであるとき，そのアルキン炭素は窒素には結合していない），任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，任意に置換されていてもよいヘテロアラルキル，-C(Z)R⁸，-C(Z)NR¹²R¹³，-S(O)₂NR¹²R¹³，および-S(O)₂R¹⁴からなる群より選択されるか；または

R¹⁰およびR¹¹は、これらが結合している窒素と一緒にになって、5-7員の任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルまたは任意に置換されていてもよいヘテロアリール環を形成し；

R¹²およびR¹³は、それぞれの場合に独立して、水素，任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、R¹²および/またはR¹³がアルケニルであるとき，そのアルケン炭素は窒素には結合していない），任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、R¹²および/またはR¹³がアルキニルであるとき，そのアルキン炭素は窒素には結合していない），任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，および任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択されるか；または

R¹²およびR¹³は、これらが結合している窒素と一緒にになって、5-7員の任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルまたは任意に置換されていてもよいヘテロアリール環を形成し；

R¹⁴は、それぞれの場合に独立して、任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、R¹⁴がアルケニルであるとき，そのアルケン炭素は-S(O)₂-には結合していない），任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、R¹⁴がアルキニルであるとき，そのアルキン炭素は-S(O)₂-には結合していない），任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，および任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択され；

R¹⁵は、それぞれの場合に独立して、任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意

に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、 $R^{1\sim 5}$ がアルケニルであるとき、そのアルケン炭素は酸素には結合していない）、任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、 $R^{1\sim 5}$ がアルキニルであるとき、そのアルキン炭素は酸素には結合していない），任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，任意に置換されていてもよいヘテロアラルキル， $-C(Z)R^8$ ，および $-C(Z)NR^{1\sim 2}R^{1\sim 3}$ からなる群より選択されるか；または

各 $R^{1\sim 5}$ は、これらが結合している酸素と一緒にになって、フェニル環に縮合している 5-7 員の任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル環を形成し；

$R^{1\sim 6}$ は、任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、 $R^{1\sim 6}$ がアルケニルであるとき、そのアルケン炭素は酸素には結合していない），任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、 $R^{1\sim 6}$ がアルキニルであるとき、そのアルキン炭素は酸素には結合していない），任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，任意に置換されていてもよいヘテロアラルキル， $-C(Z)R^8$ ，および $-C(Z)NR^{1\sim 2}R^{1\sim 3}$ からなる群より選択され；

$R^{1\sim 7}$ は、任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、 $R^{1\sim 7}$ がアルケニルであるとき、そのアルケン炭素は N, O，または S には結合していない）、任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、 $R^{1\sim 7}$ がアルキニルであるとき、そのアルキン炭素は N, O，または S には結合していない）、任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^{1\sim 8}$ は、任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル，任意に置換されていてもよい低級アルキニル，任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，任意に置換されていてもよいヘテロアラルキル， $-C(Z)R^8$ ， $-OR^9$ ， $-SR^9$ ， $-NR^{1\sim 0}R^{1\sim 1}$ ， $-C(Z)NR^{1\sim 2}R^{1\sim 3}$ ， $-S(O)_2NR^{1\sim 2}R^{1\sim 3}$ ，および $-S(O)_2R^{1\sim 4}$ からなる群より選択され；および

$R^{1\sim 9}$ は、任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル，任意に置換されていてもよい低級アルキニル，任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，および任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択される】

を有する化合物、これらのすべての塩、プロドラッグ、互変異性体および異性体。

【請求項 2】

y が C H である、請求項 1 記載の化合物。

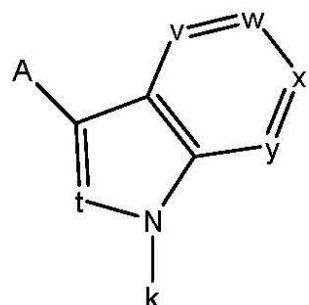
【請求項 3】

y が N である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 4】

以下の化学構造：

【化 3】



[式中、

k は、 $-CR^6R^7R^{1\sim 9}$ ， $-C(Z)R^8$ ， $-C(Z)NR^{1\sim 2}R^{1\sim 3}$ ， $-S(O)_2NR^{1\sim 2}R^{1\sim 3}$ ，および $-S(O)_2R^{1\sim 4}$ からなる群より選択され；

Z は、O，S，または NR⁹ であり；

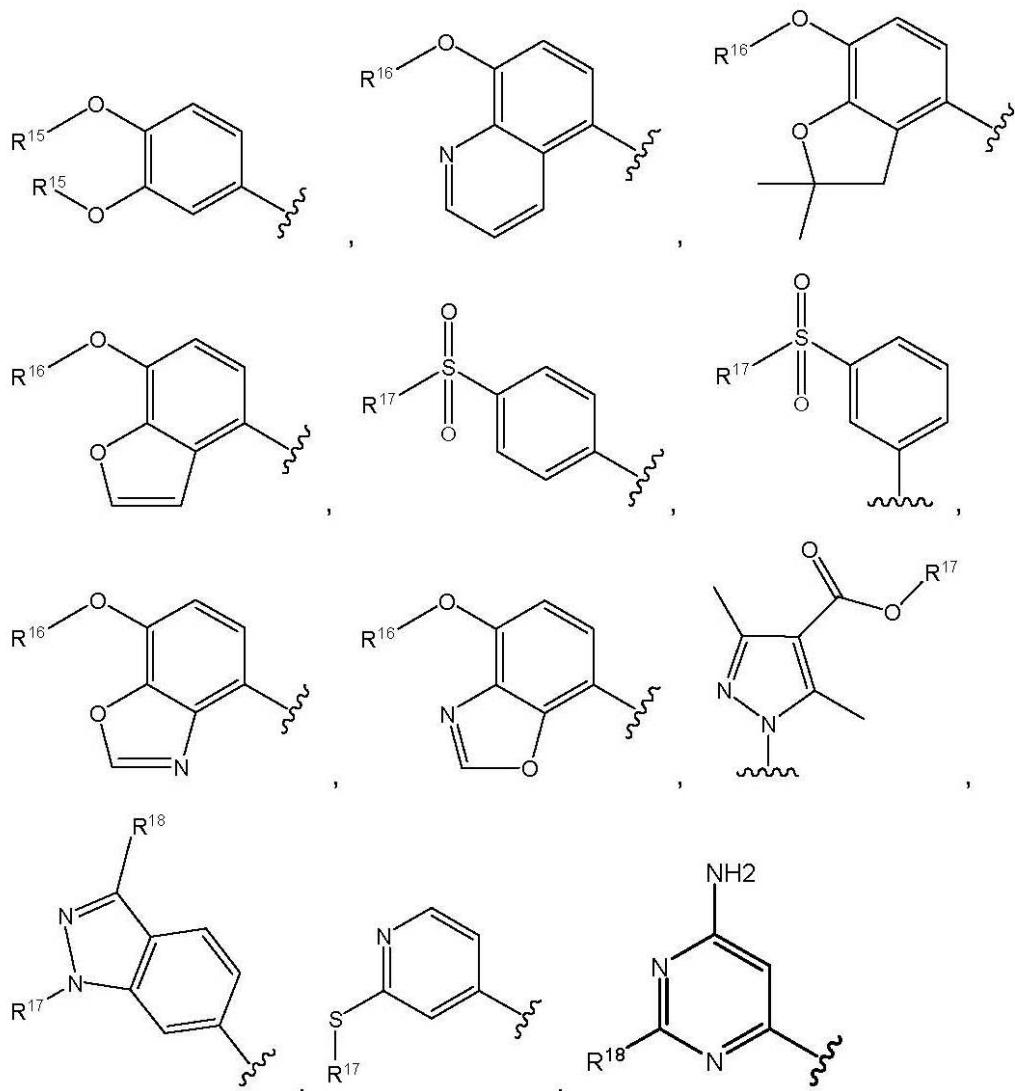
t は、N または CH であり；

y は N または CH であり，ただし、*t* および *y* の両方ともが N ではなく；

v，*w* および *x* は CH であり；

A は、以下からなる群より選択される構造を有し：

【化4】



R⁶およびR⁷は、独立して、水素、任意に置換されていてもよい低級アルキル、任意に置換されていてもよい低級アルケニル、任意に置換されていてもよい低級アルキニル、任意に置換されていてもよいシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル、任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル、任意に置換されていてもよいアリール、任意に置換されていてもよいアラルキル、任意に置換されていてもよいヘテロアリール、および任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択され；

R⁸は、それぞれの場合に独立して、-OR⁹、任意に置換されていてもよい低級アルキル、任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、R⁸がアルケニルであるとき、そのアルケン炭素はC(Z)には結合していない）、任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、R⁸がアルキニルであるとき、そのアルキン炭素はC(Z)には結合していない），任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル、任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル、任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル、任意に置換されていてもよいアリール、任意に置換されていてもよいアラルキル、任意に置換されていてもよいヘテロアリール、および任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択され；

R⁹は、それぞれの場合に独立して、水素、任意に置換されていてもよい低級アルキル、任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、R⁹がアルケニルであるとき、そのアルケン炭素はO、NまたはSには結合していない），任意に置換されていてもよい低

級アルキニル（ただし、R⁹がアルキニルであるとき、そのアルキン炭素はO、NまたはSには結合していない），任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，および任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択され；

R¹₀ および R¹₁ は、それぞれの場合に独立して、水素、任意に置換されてもよい低級アルキル、任意に置換されてもよい低級アルケニル（ただし、R¹₀ および / または R¹₁ がアルケニルであるとき、そのアルケン炭素は窒素には結合していない）、任意に置換されてもよい低級アルキニル（ただし、R¹₀ および / または R¹₁ がアルキニルであるとき、そのアルキン炭素は窒素には結合していない）、任意に置換されてもよいシクロアルキル、任意に置換されてもよいシクロアルキルアルキル、任意に置換されてもよいヘテロシクロアルキル、任意に置換されてもよいヘテロシクロアルキルアルキル、任意に置換されてもよいアリール、任意に置換されてもよいアラルキル、任意に置換されてもよいヘテロアリール、任意に置換されてもよいヘテロアラルキル、-C(Z)R⁸、-C(Z)NR¹₂R¹₃、-S(O)₂NR¹₂R¹₃、および -S(O)₂R¹₄ からなる群より選択されるか；または

R^{1-0} および R^{1-1} は、これらが結合している窒素と一緒にになって、5 - 7員の任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルまたは任意に置換されていてもよいヘテロアリール環を形成し；

R^{1-2} および R^{1-3} は、それぞれの場合に独立して、水素、任意に置換されてもよい低級アルキル、任意に置換されてもよい低級アルケニル（ただし、 R^{1-2} および／または R^{1-3} がアルケニルであるとき、そのアルケン炭素は窒素には結合していない）、任意に置換されてもよい低級アルキニル（ただし、 R^{1-2} および／または R^{1-3} がアルキニルであるとき、そのアルキン炭素は窒素には結合していない）、任意に置換されてもよいシクロアルキル、任意に置換されてもよいシクロアルキルアルキル、任意に置換されてもよいヘテロシクロアルキル、任意に置換されてもよいヘテロシクロアルキルアルキル、任意に置換されてもよいアリール、任意に置換されてもよいアラルキル、任意に置換されてもよいヘテロアリール、および任意に置換されてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択されるか；または

R^{1-2} および R^{1-3} は、これらが結合している窒素と一緒にになって、5 - 7員の任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルまたは任意に置換されていてもよいヘテロアリール環を形成し；

R^{1-4} は、それぞれの場合に独立して、任意に置換されていてもよい低級アルキル、任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、 R^{1-4} がアルケニルであるとき、そのアルケン炭素は -S(=O)₂- には結合していない）、任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、 R^{1-4} がアルキニルであるとき、そのアルキン炭素は -S(=O)₂- には結合していない）、任意に置換されていてもよいシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル、任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、任意に置換されていてもよいアリール、任意に置換されていてもよいアラルキル、任意に置換されていてもよいヘテロアリール、および任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択され：

R^1 ~ R^5 は、それぞれの場合に独立して、任意に置換されていてもよい低級アルキル、任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、 R^1 ~ R^5 がアルケニルであるとき、そのアルケン炭素は酸素には結合していない）、任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、 R^1 ~ R^5 がアルキニルであるとき、そのアルキン炭素は酸素には結合していない）、任意に置換されていてもよいシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル、任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、任意に置換されて

いてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，任意に置換されていてもよいヘテロアラルキル，-C(Z)R⁸，および-C(Z)NR¹R²からなる群より選択されるか；または

各R¹は、これらが結合している酸素と一緒にになって，フェニル環に縮合している5-7員の任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル環を形成し；

R¹は、任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、R¹がアルケニルであるとき，そのアルケン炭素は酸素には結合していない），任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、R¹がアルキニルであるとき，そのアルキン炭素は酸素には結合していない），任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，任意に置換されていてもよいヘテロアラルキル，-C(Z)R⁸，および-C(Z)NR¹R²からなる群より選択され；

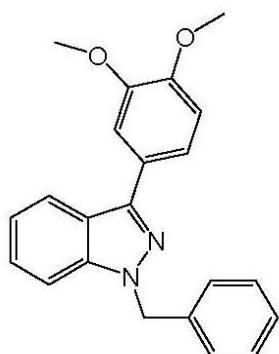
R¹は、任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、R¹がアルケニルであるとき，そのアルケン炭素はN，O，またはSには結合していない）、任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、R¹がアルキニルであるとき，そのアルキン炭素はN，O，またはSには結合していない）、任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択され；

R¹は、任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル，任意に置換されていてもよい低級アルキニル，任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，任意に置換されていてもよいヘテロアラルキル，-C(Z)R⁸，-OR⁹，-SR⁹，-NR¹R²，-C(Z)NR¹R²，-S(O)₂NR¹R²，および-S(O)₂R¹からなる群より選択され；および

R¹は、任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル，任意に置換されていてもよい低級アルキニル，任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，および任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択され；

ただし、化合物は以下

【化5】



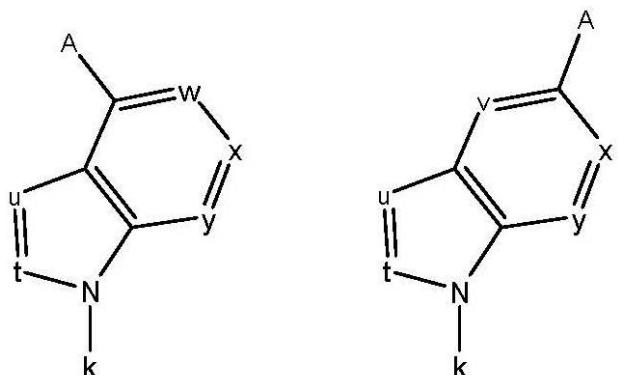
の化合物ではない】

を有する化合物、これらのすべての塩、プロドラッグ、互変異性体および異性体。

【請求項5】

以下：

【化6】



〔式中、

kは、 $-CR^6R^7R^{1-9}$ 、 $-C(Z)R^8$ 、 $-C(Z)NR^{1-2}R^{1-3}$ 、 $-S(O)_2NR^{1-2}R^{1-3}$ 、および $-S(O)_2R^{1-4}$ からなる群より選択され；

ZはO、S、またはNR⁹であり；

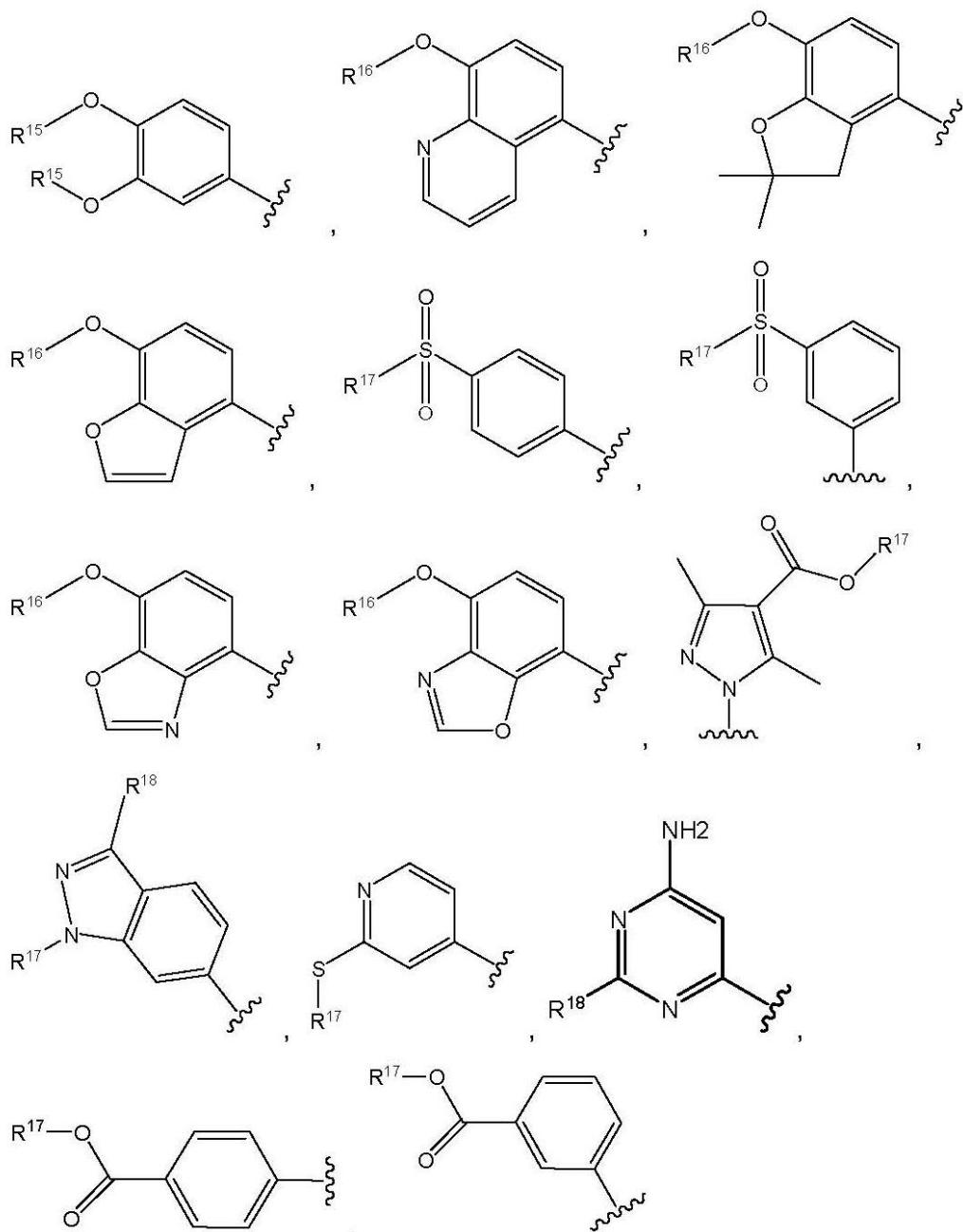
tはNまたはCHであり；

yはNまたはCHであり、ただし、tおよびyの両方ともがNではなく；

u、v、wおよびxはCHであり；

Aは、以下からなる群より選択される構造を有し：

【化7】



R^6 および R^7 は、独立して、水素、任意に置換されていてもよい低級アルキル、任意に置換されていてもよい低級アルケニル、任意に置換されていてもよい低級アルキニル、任意に置換されていてもよいシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル、任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル、任意に置換されていてもよいアリール、任意に置換されていてもよいアラルキル、任意に置換されていてもよいヘテロアリール、および任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択され；

R^8 は、それぞれの場合に独立して、 $-OR^9$ 、任意に置換されていてもよい低級アルキル、任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、 R^8 がアルケニルであるとき、そのアルケン炭素は C (Z) には結合していない）、任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、 R^8 がアルキニルであるとき、そのアルキン炭素は C (Z) には結合していない），任意に置換されていてもよいシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル、任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル、任意に置換されていてもよいア

リール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，および任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択され； R^9 は、それぞれの場合に独立して、水素，任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、 R^9 がアルケニルであるとき，そのアルケン炭素はO，NまたはSには結合していない），任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、 R^9 がアルキニルであるとき，そのアルキン炭素はO，NまたはSには結合していない），任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択され；

R^{10} および R^{11} は、それぞれの場合に独立して、水素，任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、 R^{10} および/または R^{11} がアルケニルであるとき，そのアルケン炭素は窒素には結合していない），任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、 R^{10} および/または R^{11} がアルキニルであるとき，そのアルキン炭素は窒素には結合していない），任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，任意に置換されていてもよいヘテロアラルキル，-C(Z)R⁸，-C(Z)NR¹²R¹³，-S(O)₂NR¹²R¹³，および-S(O)₂R¹⁴からなる群より選択されるか；または

R^{10} および R^{11} は、これらが結合している窒素と一緒にになって、5-7員の任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルまたは任意に置換されていてもよいヘテロアリール環を形成し；

R^{12} および R^{13} は、それぞれの場合に独立して、水素，任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、 R^{12} および/または R^{13} がアルケニルであるとき，そのアルケン炭素は窒素には結合していない），任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、 R^{12} および/または R^{13} がアルキニルであるとき，そのアルキン炭素は窒素には結合していない），任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，および任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択されるか；または

R^{12} および R^{13} は、これらが結合している窒素と一緒にになって、5-7員の任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルまたは任意に置換されていてもよいヘテロアリール環を形成し；

R^{14} は、それぞれの場合に独立して、任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、 R^{14} がアルケニルであるとき，そのアルケン炭素は-S(O)₂-には結合していない），任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、 R^{14} がアルキニルであるとき，そのアルキン炭素は-S(O)₂-には結合していない）、任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，および任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択され；

R^{15} は、それぞれの場合に独立して、任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意

に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、 $R^{1\sim 5}$ がアルケニルであるとき、そのアルケン炭素は酸素には結合していない）、任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、 $R^{1\sim 5}$ がアルキニルであるとき、そのアルキン炭素は酸素には結合していない），任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，任意に置換されていてもよいヘテロアラルキル， $-C(Z)R^8$ ，および $-C(Z)NR^{1\sim 2}R^{1\sim 3}$ からなる群より選択されるか；または

各 $R^{1\sim 5}$ は、これらが結合している酸素と一緒にになって、フェニル環に縮合している 5-7 員の任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル環を形成し；

$R^{1\sim 6}$ は、任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、 $R^{1\sim 6}$ がアルケニルであるとき、そのアルケン炭素は酸素には結合していない），任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、 $R^{1\sim 6}$ がアルキニルであるとき、そのアルキン炭素は酸素には結合していない），任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，任意に置換されていてもよいヘテロアラルキル， $-C(Z)R^8$ ，および $-C(Z)NR^{1\sim 2}R^{1\sim 3}$ からなる群より選択され；

$R^{1\sim 7}$ は、任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル（ただし、 $R^{1\sim 7}$ がアルケニルであるとき、そのアルケン炭素は N, O，または S には結合していない）、任意に置換されていてもよい低級アルキニル（ただし、 $R^{1\sim 7}$ がアルキニルであるとき、そのアルキン炭素は N, O，または S には結合していない）、任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^{1\sim 8}$ は、任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル，任意に置換されていてもよい低級アルキニル，任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，任意に置換されていてもよいヘテロアラルキル， $-C(Z)R^8$ ， $-OR^9$ ， $-SR^9$ ， $-NR^{1\sim 0}R^{1\sim 1}$ ， $-C(Z)NR^{1\sim 2}R^{1\sim 3}$ ， $-S(O)_2NR^{1\sim 2}R^{1\sim 3}$ ，および $-S(O)_2R^{1\sim 4}$ からなる群より選択され；および

$R^{1\sim 9}$ は、任意に置換されていてもよい低級アルキル，任意に置換されていてもよい低級アルケニル，任意に置換されていてもよい低級アルキニル，任意に置換されていてもよいシクロアルキル，任意に置換されていてもよいシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル，任意に置換されていてもよいアリール，任意に置換されていてもよいアラルキル，任意に置換されていてもよいヘテロアリール，および任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルからなる群より選択される】

からなる群より選択される化学構造を有する化合物、これらのすべての塩，プロドラッグ，互変異性体および異性体。

【請求項 6】

t および y が C H である、請求項 5 記載の化合物。

【請求項 7】

t が CH であり、 y が N である、 請求項 5 記載の化合物。

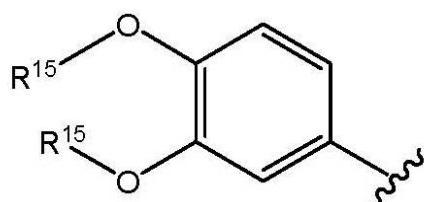
【請求項 8】

式中、 k は、 $-CH_2R^{1-9}$ ， $-C(Z)R^8$ ， $-C(Z)NR^{1-2}R^{1-3}$ ， $-S(O)_{2-NR^{1-2}R^{1-3}}$ ， および $-S(O)_2R^{1-4}$ からなる群より選択され； R^8 ， R^{1-2} ， R^{1-3} ， R^{1-4} ， および R^{1-9} は、 任意に置換されていてもよい低級アルキル， アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され， ここで、 アリールおよびヘテロアリールは、 ハロゲン， 任意に置換されていてもよい低級アルキル， 任意に置換されていてもよい低級アルコキシ， 任意に置換されていてもよい低級チオアルキル， 任意に置換されていてもよいアリールオキシ， 任意に置換されていてもよいヘテロアリールオキシ， 任意に置換されていてもよいアミノ， 任意に置換されていてもよいカルボキシリル， 任意に置換されていてもよいアルキルスルホニルアミノ， シアノおよびニトロからなる群より選択される 1 - 3 個の置換基で任意に置換されていてもよい、 請求項 3 または 7 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 9】

A が以下の構造：

【化 8】



を有する、 請求項 3 または 7 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 10】

k は $-CH_2R^{1-9}$ ， $-C(Z)R^8$ ， $-C(Z)NR^{1-2}R^{1-3}$ ， $-S(O)_{2-NR^{1-2}R^{1-3}}$ ， および $-S(O)_2R^{1-4}$ からなる群より選択され； および R^8 ， R^{1-2} ， R^{1-3} ， R^{1-4} ， および R^{1-9} は、 任意に置換されていてもよい低級アルキル， アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され， ここで、 アリールおよびヘテロアリールは、 ハロゲン， 任意に置換されていてもよい低級アルキル， 任意に置換されていてもよい低級アルコキシ， 任意に置換されていてもよい低級チオアルキル， 任意に置換されていてもよいアリールオキシ， 任意に置換されていてもよいヘテロアリールオキシ， 任意に置換されていてもよいアミノ， 任意に置換されていてもよいカルボキシリル， 任意に置換されていてもよいアルキルスルホニルアミノ， シアノおよびニトロからなる群より選択される 1 - 3 個の置換基で任意に置換されていてもよい、 請求項 9 記載の化合物。

【請求項 11】

R^{1-5} は、 それぞれの場合に独立して、 任意に置換されていてもよい低級アルキル， 任意に置換されていてもよいシクロアルキル， 任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル， 任意に置換されていてもよいアリール， および任意に置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択されるか、 または各 R^{1-5} は、 これらが結合している酸素と一緒にになって、 フェニル環と縮合した 5 - 7 員の任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル環を形成してもよい、 請求項 10 記載の化合物。

【請求項 12】

R^{1-5} が任意に置換されていてもよい低級アルキルであるとき、 低級アルキルは、 フルオロ， 任意に置換されていてもよいシクロアルキル， 任意に置換されていてもよいヘテロシクロアルキル， 任意に置換されていてもよいアリールおよび任意に置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択される 1 - 3 個の置換基で任意に置換されていてもよい、 請求項 11 記載の化合物。

【請求項 13】

請求項 1 - 12 のいずれかに記載の化合物および薬学的に許容しうる担体を含む組成物。

【請求項 14】

P D E 4 B の調節が治療上の利益を与える疾病または状態に罹患しているかまたはそのリスクを有する被験者を治療するための医薬組成物であって，

有効量の請求項 1 - 12 のいずれかに記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 15】

前記化合物がヒトへの投与用に認可されている，請求項 14 記載の医薬組成物。

【請求項 16】

前記疾病または状態は，P D E 4 B 媒介性疾病または状態である，請求項 15 記載の医薬組成物。

【請求項 17】

前記疾病または状態が，喘息，気管支炎，アレルギー性気管支炎，慢性閉塞性肺疾患，囊胞性線維症，特発性肺線維症，サルコイドーシス，肺高血圧症，アレルギー性気管支炎，気腫，アルツハイマー病，パーキンソン病，ハンティングトン舞踏病，多発性硬化症，慢性関節リウマチ，クローン病，脳虚血，炎症性腸疾患，潰瘍性大腸炎，アトピー性皮膚炎，骨粗鬆症，大理石骨病，パジェット病，散在性大細胞B細胞リンパ腫，慢性リンパ球性白血病，急性リンパ芽球性白血病，重症急性呼吸器症候群，および早期陣痛からなる群より選択される，請求項 15 記載の医薬組成物。

【請求項 18】

請求項 13 記載の組成物を含むキット。

【請求項 19】

前記組成物がヒトへの投与について認可されたものであることを示す文書をさらに含む，請求項 18 記載のキット。

【請求項 20】

前記組成物が，喘息，気管支炎，アレルギー性気管支炎，慢性閉塞性肺疾患，囊胞性線維症，特発性肺線維症，サルコイドーシス，肺高血圧症，アレルギー性気管支炎，気腫，アルツハイマー病，パーキンソン病，ハンティングトン舞踏病，多発性硬化症，慢性関節リウマチ，クローン病，脳虚血，炎症性腸疾患，潰瘍性大腸炎，アトピー性皮膚炎，骨粗鬆症，大理石骨病，パジェット病，散在性大細胞B細胞リンパ腫，慢性リンパ球性白血病，急性リンパ芽球性白血病，重症急性呼吸器症候群，および早期陣痛からなる群より選択される適応症について認可されたものである，請求項 19 記載のキット。