

【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19年6月7日(2007.6.7)

【公表番号】特表2006-523233(P2006-523233A)

【公表日】平成18年10月12日(2006.10.12)

【年通号数】公開・登録公報2006-040

【出願番号】特願2006-509369(P2006-509369)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/122	(2006.01)
A 6 1 K	31/365	(2006.01)
A 6 1 K	31/4523	(2006.01)
A 6 1 K	31/395	(2006.01)
A 6 1 K	31/4188	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/04	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	9/14	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	27/06	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)
A 6 1 P	27/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	7/04	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/075	(2006.01)
A 6 1 K	31/15	(2006.01)
C 07 C	49/753	(2006.01)
C 07 C	43/196	(2006.01)
C 07 C	251/44	(2006.01)
C 07 D	405/06	(2006.01)
C 07 D	313/00	(2006.01)
C 07 D	225/02	(2006.01)
C 07 D	495/04	(2006.01)
C 07 F	7/08	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/122
A 6 1 K	31/365
A 6 1 K	31/4523
A 6 1 K	31/395
A 6 1 K	31/4188
A 6 1 P	35/00
A 6 1 P	35/04
A 6 1 P	27/02
A 6 1 P	9/14

A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 27/06
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 27/16
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 7/04
 A 6 1 P 43/00 1 0 5
 A 6 1 K 31/075
 A 6 1 K 31/15
 C 0 7 C 49/753 B
 C 0 7 C 43/196
 C 0 7 C 251/44
 C 0 7 D 405/06
 C 0 7 D 313/00
 C 0 7 D 225/02
 C 0 7 D 495/04 1 0 3
 C 0 7 F 7/08 A

【手続補正書】

【提出日】平成19年3月26日(2007.3.26)

【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

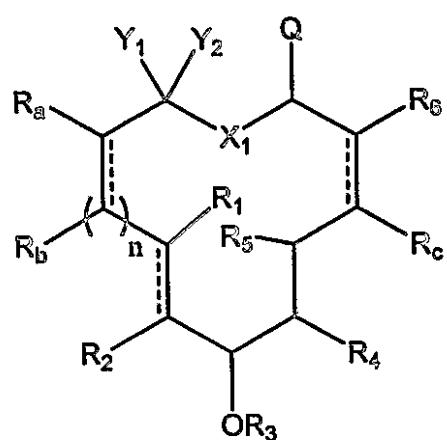
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

薬学的に受容可能な担体、アジュバントまたはビヒクル；および治療上有効量の以下の構造：

【化1】



(I)

[式中、R₁およびR₂は、各々、独立して、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)₁₋₂R^{1A}、-NO₂、-COR^{1A}、-CO₂R^{1A}、-NR^{1A}C(=O)OR^{1B}、-NR^{1A}C(=O)OR^{1B}、-CONR^{1A}R^{1B}、脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基、または-WR^{1A}であり；ここで、Wは、独立して、-O-、-S-または-NR^{1C}-であり、ここで、R^{1A}、R^{1B}およびR^{1C}の各存在は、独立して、水素、脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基であり；あるいはR₁およびR₂は、それらが結合している炭素原子と一緒にになって、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基を形成し；

R₃は水素、脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基；またはプロドラッグ基また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、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基；プロドラッグ基、窒素保護基または酸素保護基であり；あるいはR^{4A}およびR^{4B}は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、複素環もしくはヘテロアリール基を形成し；

R₅は水素、脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基であり；

R₆は水素、ハロゲン、-CN、-S(O)₁₋₂R^{6A}、-NO₂、-COR^{6A}、-CO₂R^{6A}、-NR^{6A}C(=O)R^{6B}、-NR^{6A}C(=O)OR^{6B}、-CO NR^{6A}R^{6B}、脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基、または-WR^{6A}であり；ここで、Wは、独立して、-O-、-S-または-NR^{6C}-であり、ここで、R^{6A}、R^{6B}およびR^{6C}の各存在は、独立して、水素、または脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基であり；あるいはR₆およびR_cは、それらが結合している炭素原子と一緒にになって、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基を形成し；

R_a、およびR_bの各存在は、独立して、水素、ハロゲン、-CN、-S(O)₁₋₂R^{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、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基、または-WR^{a1}であり；ここで、Wは、独立して、-O-、-S-または-NR^{a3}-であり、ここで、R^{a1}、R^{a2}およびR^{a3}の各存在は、独立して、水素、または脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテ罗脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基であり；あるいはR_a、およびR_bの隣接する存在は、それらが結合している炭素原子と一緒にになって、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基を形成し；

R_cは水素、ハロゲン、-CN、-S(O)₁₋₂R^{c1}、-NO₂、-COR^{c1}、-CO₂R^{c1}、-NR^{c1}C(=O)R^{c2}、-NR^{c1}C(=O)OR^{c2}、-CO NR^{c1}R^{c1}；脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリールまたは-WR^{c1}であり；ここで、Wは、独立して、-O-、-S-または-NR^{c3}-であり、ここで、R^{c1}、R^{c2}およびR^{c3}の各存在は、独立して、水素、または脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテ罗脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基であり；あるいはR_cおよびR₆は、それらが結合している炭素原子と一緒にになって、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基を形成し；

nは1ないし5の整数であり；

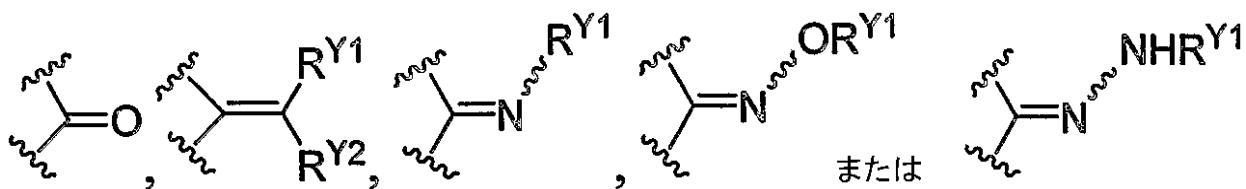
X₁はO、S、NR^{X1}またはCR^{X1}R^{X2}であり；ここで、R^{X1}およびR^{X2}は、独立して、水素、ハロゲン、脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテ罗脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基、または窒素保護基であり；

Qは水素、ハロゲン、-CN、-S(O)₁₋₂R^{Q1}、-NO₂、-COR^{Q1}、-CO₂R^{Q1}、-NR^{Q1}C(=O)R^{Q1}、-NR^{Q1}C(=O)OR^{Q2}、-CON

R^{Q1} R^{Q2} 、脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基、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、ここで、 R^{Q1} 、 R^{Q2} および R^{Q3} の各存在は、独立して、水素、または脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基であり；および

Y_1 および Y_2 は、独立して、水素、脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基；または $-WR^{Y1}$ であり；ここで、Wは、独立して、-O-、-S-または- $NR^{Y2}-$ であり、ここで、 R^{Y1} および R^{Y2} の各存在は、独立して、水素、または脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基であり；あるいは Y_1 および Y_2 は、それらが結合している炭素原子と一緒にになって、以下の構造：

【化2】



を有する基を形成する】

を有する化合物を含む薬学的組成物であって、これによって、該組成物は約0.1mg/kgないし約50mg/kg体重の間の投与量にて被験体に投与されるように処方される、薬学的組成物。

【請求項2】

前記投与量は1mg/kgないし約50mg/kg体重の間である、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

前記投与量は0.1mg/kgないし約40mg/kg体重の間である、請求項1に記載の組成物。

【請求項4】

前記投与量は1mg/kgないし約40mg/kg体重の間である、請求項1に記載の組成物。

【請求項5】

前記投与量は0.1mg/kgないし約30mg/kg体重の間である、請求項1に記載の組成物。

【請求項6】

前記投与量は5mg/kgないし約30mg/kg体重の間である、請求項1に記載の組成物。

【請求項7】

前記投与量は1mg/kgないし約30mg/kg体重の間である、請求項1に記載の組成物。

【請求項8】

前記投与量は0.1mg/kgないし約20mg/kg体重の間である、請求項1に記載の組成物。

【請求項9】

前記投与量は1mg/kgないし約20mg/kg体重の間である、請求項1に記載の組成物。

【請求項10】

前記投与量は10mg/kg体重以上である、請求項1に記載の組成物。

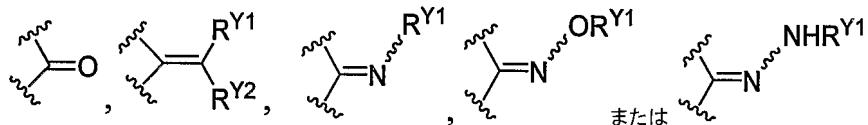
【請求項11】

R_1 および R_2 は、各々、独立して、水素または置換されたもしくは置換されていない低級アルキルであり；あるいは R_1 および R_2 は、それらが結合してい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されたもしくは置換されていないシクロプロピル基を形成し；

R_3 は水素、または置換されたもしくは置換されていない低級アルキルまたはアリール；プロドラッグ基また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、または置換されたもしくは置換されていない低級アルキル；プロドラッグ基、窒素保護基または酸素保護基であり；あるいは R^{4A} および R^{4B} は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、複素環もしくはヘテロアリール基を形成し；あるいは R_4 は、それらが結合している炭素原子と一緒にになって、以下の構造：

【化3】



を有する基を形成し；

R_5 および R_6 は、各々、独立して、水素または置換されたもしくは置換されていない低級アルキルであり；あるいは R_5 および R_c は、それらが結合してい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されたもしくは置換されていないシクロプロピル基を形成し；

R_a 、および R_b の各存在は、独立して、水素、ハロゲン、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、アリールもしくはヘテロアリール基、または $-WR^{a1}$ であり；ここで、Wは、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NR^{a3}-$ であり、ここで、 R^{a1} 、および R^{a3} の各存在は、独立して、水素、またはアルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールもしくはヘテロアリール基であり；あるいは R_a 、および R_b の隣接する存在が一緒にになって、エポキシド、アジリジンまたは置換されたもしくは置換されていないシクロプロピル基を形成し；

R_c は水素、ハロゲン、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、アリールもしくはヘテロアリール基、または $-WR^{c1}$ であり；ここで、Wは、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NR^{c3}-$ であり、ここで、 R^{c1} および R^{c3} の各存在は、独立して、水素、またはアルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールもしくはヘテロアリール基であり；あるいは R_c および R_6 は、それらが結合している炭素原子と一緒にになって、エポキシド、アジリジン、または置換されたもしくは置換されていないシクロプロピル基を形成し；

n は 1 ないし 5 の整数であり；

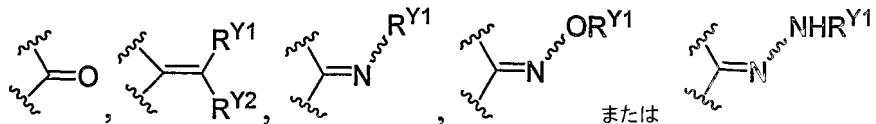
X_1 は O 、 S 、 NR^{X1} または $CR^{X1}R^{X2}$ であり；ここで、 R^{X1} および R^{X2} は、独立して、水素、ハロゲン、置換されたもしくは置換されていないアルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールもしくはヘテロアリール、または窒素保護基であり；

Q は水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-S(O)_1-2R^{Q1}$ 、 $-NO_2$ 、 $-COR^{Q1}$ 、 $-CO_2R^{Q1}$ 、 $-NR^{Q1}C(=O)R^{Q2}$ 、 $-NR^{Q1}C(=O)OR^{Q2}$ 、 $-CONR^{Q1}R^{Q2}$ 、脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基、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、ここで、 R^{Q1} 、 R^{Q2} および R^{Q3} の各存在は、独立して、水素、または脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基であり；

Y_1 および Y_2 は、独立して、水素、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、アリールもしくはヘテロアリール基；または $-WR^{Y_1}$ であり；ここで、Wは、独立して、-O-、-S-または-NR^{Y_2}-であり、ここで、R^{Y_1}およびR^{Y_2}の各存在は、独立して、水素、またはアルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールもしくはヘテロアリール基であり；あるいはY₁およびY₂は、それらが結合している炭素原子と一緒にになって、以下の構造：

【化4】

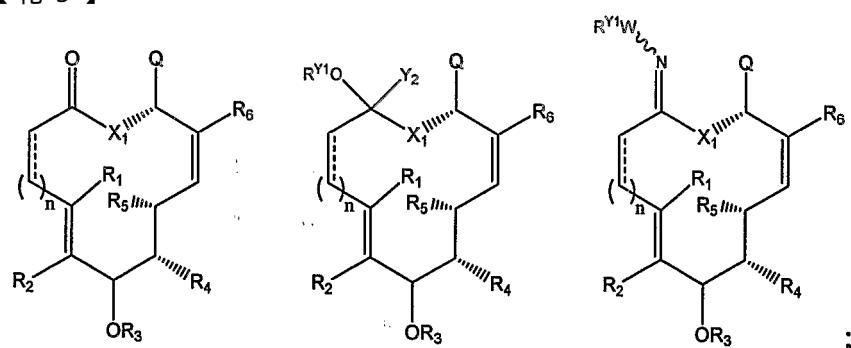


を有する基を形成する、請求項1に記載の組成物。

【請求項12】

R_a、R_bおよびR_cは、各々、水素であって、前記化合物が以下の構造：

【化5】



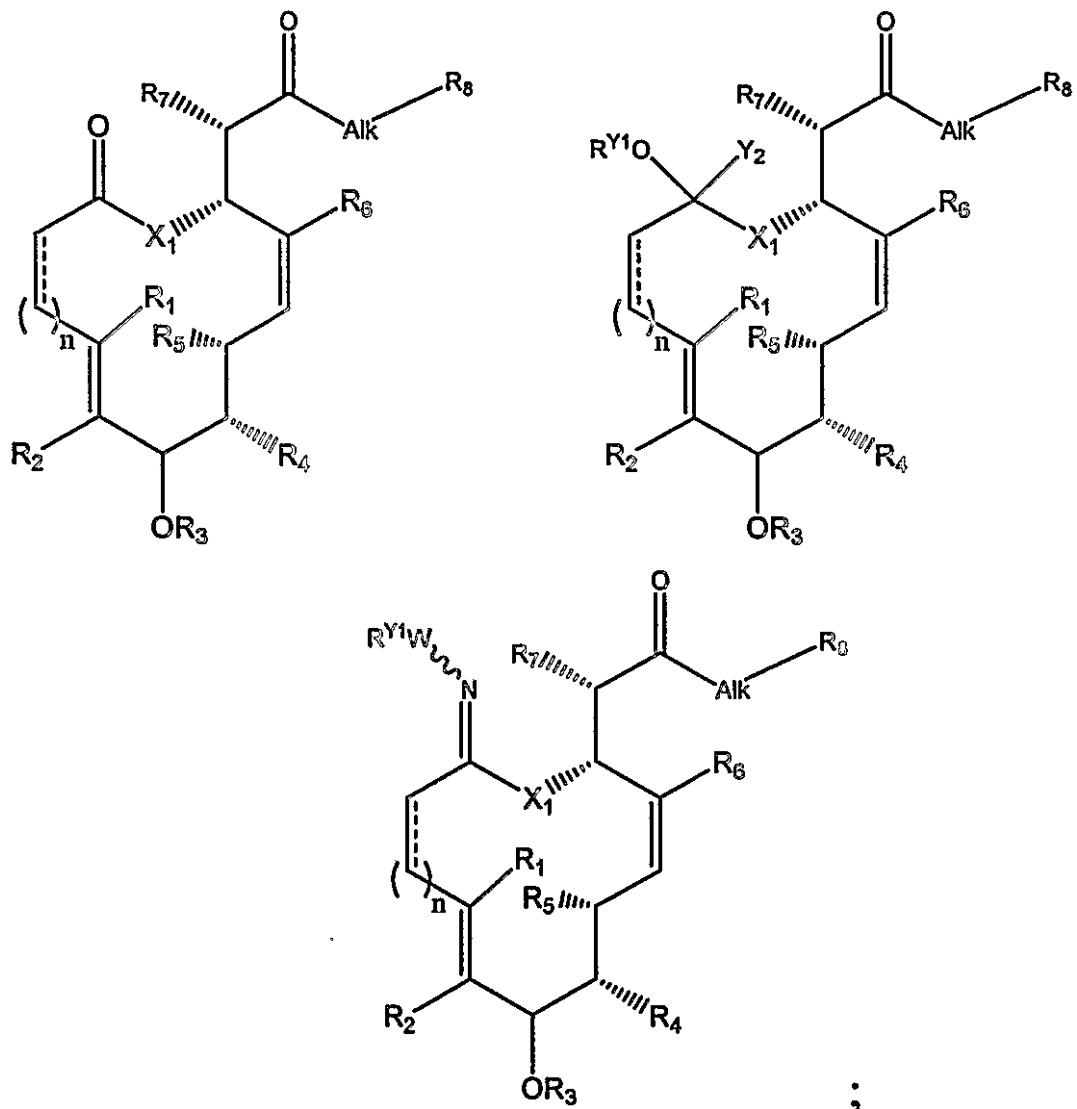
[式中、R₁ないしR₆、Y₂、X₁、nおよびQは、請求項1に定義した通りであり；WはOまたはNHであり；R^{Y_1}は水素、または脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基である]

のうちの1つを有する、請求項1に記載の組成物。

【請求項13】

R_a、R_bおよびR_cは、各々、水素であり、Qがカルボニル含有基であり、および前記化合物が以下の構造：

【化6】



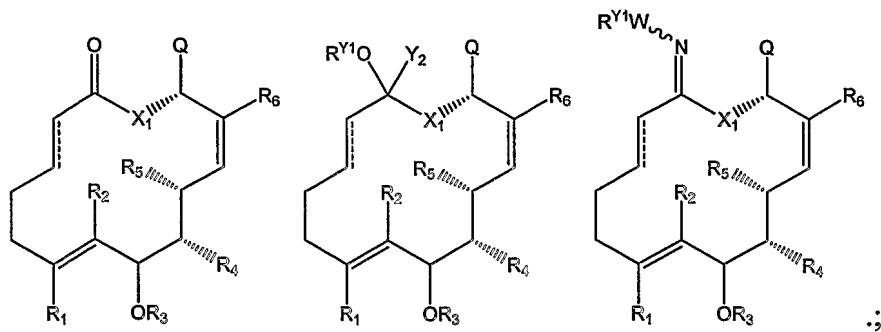
[式中、R₁ないしR₆、Y₂、X₁、およびnは、請求項1で定義した通りであり；WはOまたはNHであり；R^{Y1}は水素、または脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基であり；R₇は置換されたもしくは置換されていない低級アルキルもしくはヘテロアルキル基であり；R₈は置換されたもしくは置換されていないアルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、もしくはヘテロアリール基であり；Alkは置換されたもしくは置換されていないC₀～₆アルキリデンもしくはC₀～₆アルケニリデン鎖であり、ここで、2つまでの隣接しないメチレン単位は、独立して、所望により、CO、CO₂、COCO、CONR^{Z1}、OCONR^{Z1}、NR^{Z1}NR^{Z2}、NR^{Z1}NR^{Z2}CO、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}によって置換されていてもよく；ここで、R^{Z1}およびR^{Z2}の各存在は、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]

のうちの1つを有する、請求項1に記載の組成物。

【請求項14】

R_a、R_bおよびR_cは、各々、水素であり、nが3であって、前記化合物が以下の構造：

【化7】



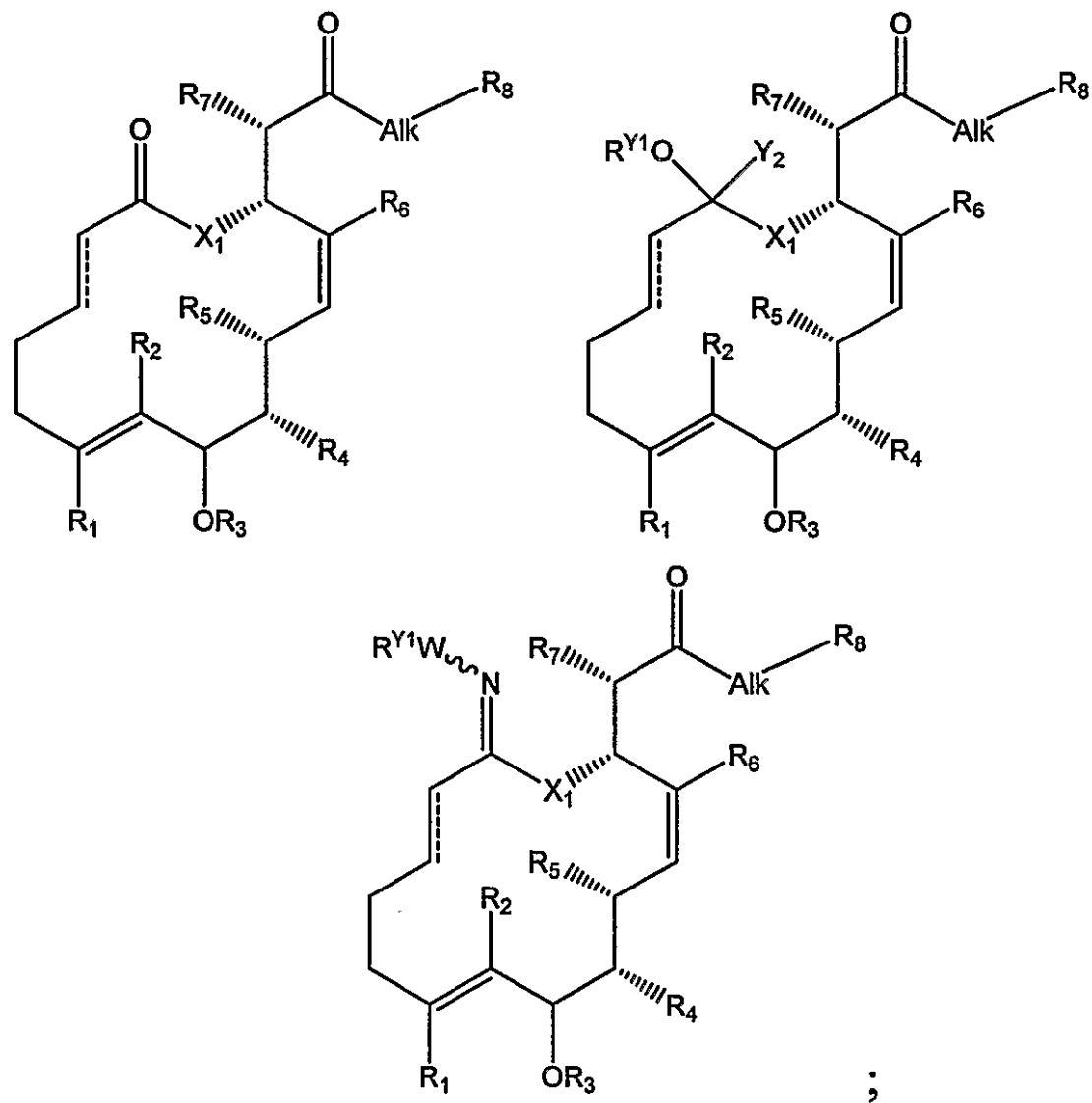
[式中、R₁ないしR₆、Y₂、QおよびX₁は、請求項1に定義した通りであり；YはOまたはNHであり；R^{Y1}は水素、脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基である]

のうちの1つを有する、請求項1に記載の組成物。

【請求項15】

R_a、R_bおよびR_cは、各々、水素であり、nが3であり、Qがカルボニル含有基であって、前記化合物が以下の構造：

【化8】



[式中、R₁ないしR₆、X₁およびY₂は、請求項1に定義されたとおりであり；WはOまたはNHであり；R^{Y₁}は水素、または脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、アリールもしくはヘテロアリール基であり；R₇は置換されたもしくは置換されていない低級アルキルもしくはヘテロアルキル基であり；R₈は置換されたもしくは置換されていないアルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールもしくはヘテロアリール基であり；およびA1kは置換されたもしくは置換されていないC₀～₆アルキリデンもしくはC₀～₆アルケニリデン鎖であり、ここで、2つまでの隣接しないメチレン単位は、独立して、所望により、CO、CO₂、COCO、CONR^{Z₁}、OCONR^{Z₁}、NR^{Z₁}NR^{Z₂}、NR^{Z₁}NR^{Z₂}CO、NR^{Z₁}CO、NR^{Z₁CO₂、NR^{Z₁}CONR^{Z₂}、SO、SO₂、NR^{Z₁}SO₂、SO₂NR^{Z₁}、NR^{Z₁SO₂NR^{Z₂、O、SまたはNR^{Z₁}によって置換されていてもよく；ここで、R^{Z₁}およびR^{Z₂}の各存在は、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；およびR₈は置換されたもしくは置換されていないアルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールもしくはヘテロアリール基である]}}}

のうちの1つを有する、請求項1に記載の組成物。

【請求項16】

R₁およびR₂は、各々、水素である、請求項1および11ないし15いずれか1に記載の組成物。

【請求項17】

R₅およびR₆は、各々、メチルである、請求項1および11ないし15いずれか1に記載の組成物。

【請求項18】

R₃は低級アルキルである、請求項1および11ないし15いずれか1に記載の組成物。

【請求項19】

R₃はメチルである、請求項18に記載の組成物。

【請求項20】

R₄はOH、NH₂またはハロゲンである、請求項1および11ないし15いずれか1に記載の組成物。

【請求項21】

R₇は低級アルキルである、請求項13または15に記載の組成物。

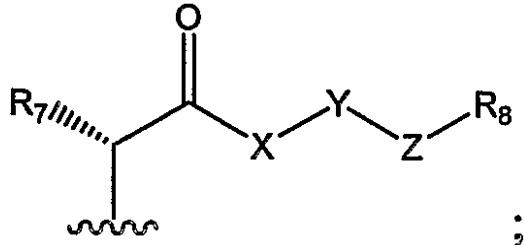
【請求項22】

R₇はメチルである、請求項21に記載の組成物。

【請求項23】

Qは以下の構造：

【化9】



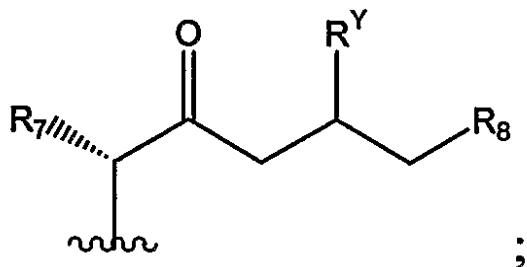
[式中、R₇が置換されたもしくは置換されていない、直鎖もしくは分岐鎖、環式または非環式低級アルキル基であり；R₈が置換されたもしくは置換されていない炭素環、複素環、アリールもしくはヘテロアリール基であり；X、YおよびZは、独立して、結合、-O-、-S-、-C(=O)-、-NR^{Z₁}-、-CHOR^{Z₁}、-CHNR^{Z₁}R^{Z₂}

、 C = S、 C = N (R^Y¹) または - C H (H a l) ; または置換されたもしくは置換されていない C₀ - 6 アルキリデンもしくは C₀ - 6 アルケニリデン鎖であり、ここで、2つまでの隣接しないメチレン単位は、独立して、所望により、 CO、 CO₂、 COCO、 CONR^Z¹、 OCONR^Z¹、 NR^Z¹NR^Z²、 NR^Z¹NR^Z²CO、 NR^Z¹C O、 NR^Z¹CO₂、 NR^Z¹CONR^Z²、 SO、 SO₂、 NR^Z¹SO₂、 SO₂N R^Z¹、 NR^Z¹SO₂NR^Z²、 O、 S または NR^Z¹ によって置換されていてもよく；ここで、 Hal は F、 Cl、 Br および I から選択されるハロゲンであり；および R^Z¹ および R^Z² の各存在は、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；あるいは R^Z¹ および R^Z² は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、複素環もしくはヘテロアリール基を形成する] またはその薬学的に受容可能な誘導体を有する、請求項 1、11ないし 12 および 14 いずれか 1 に記載の組成物。

【請求項 2 4】

Q は以下の構造：

【化 1 0】



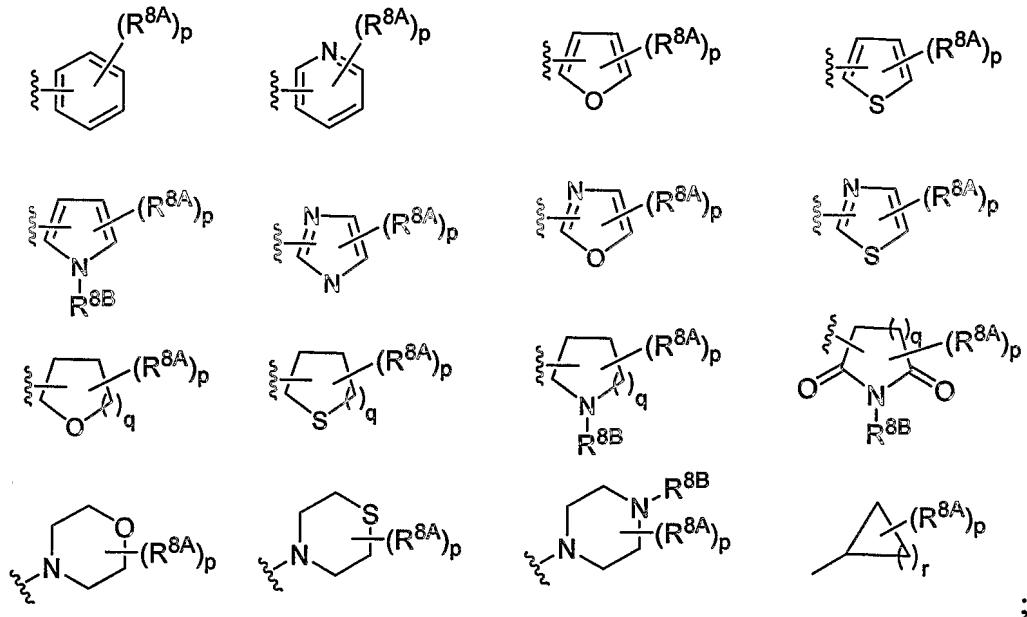
[式中、 R₇ は置換されたもしくは置換されていない、直鎖または分岐鎖、環式もしくは非環式の低級アルキル基であり； R₈ は置換されたもしくは置換されていない炭素環、複素環、アリールもしくはヘテロアリール基であり； R^Y は水素、ハロゲン、 - OR^Y¹ または - NR^Y¹NR^Y² であり；ここで、 R^Y¹ および R^Y² は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリールもしくはアシルであり、あるいは R^Y¹ および R^Y² は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、複素環もしくはヘテロアリール基を形成する]

を有する、請求項 2 3 に記載の組成物。

【請求項 2 5】

R₈ は：

【化11】



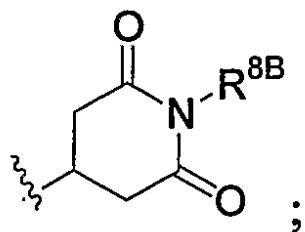
[式中、pは0ないし5の整数であり；qは1または2であり、rは1ないし6の整数であり；R^{8A}の各存在は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、-(アルキル)アリール、もしくは-(アルキル)ヘテロアリール、-OR^{8C}、-SR^{8C}、-N(R^{8C})₂、-SO₂N(R^{8C})₂、-(C=O)N(R^{8C})₂、ハロゲン、-CN、-NO₂、-(C=O)OR^{8C}、-N(R^{8C})(C=O)R^{8D}であり、ここで、R^{8C}およびR^{8D}の各存在は、独立して、水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、-(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；R^{8B}の各存在は、独立して、水素または低級アルキルである]

のうちの1つである、請求項13、15、23および24いずれか1に記載の組成物。

【請求項26】

R₈は以下の構造：

【化12】



[式中、R^{8B}は水素または低級アルキルである]

を有する、請求項25に記載の組成物。

【請求項27】

nは3である、請求項1、11、12または13に記載の組成物。

【請求項28】

Y₁はOR^{Y1}であって、Y₂は低級アルキルであり；ここで、R^{Y1}は水素または低級アルキルである、請求項12、13、14または15に記載の組成物。

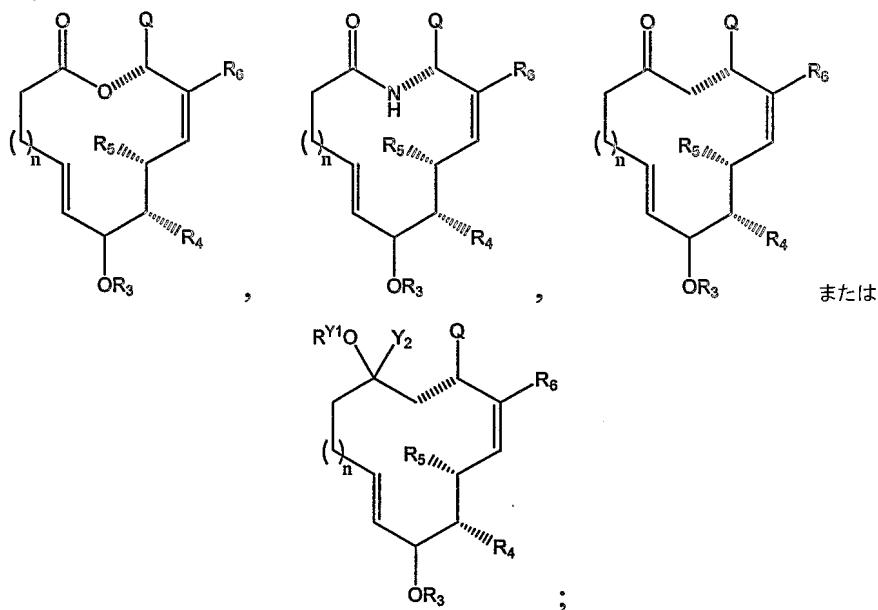
【請求項29】

Y₁はOHであって、Y₂はCF₃である、請求項28に記載の組成物。

【請求項30】

R_a 、 R_b および R_c は、各々、水素であって、前記化合物が以下の構造：

【化13】



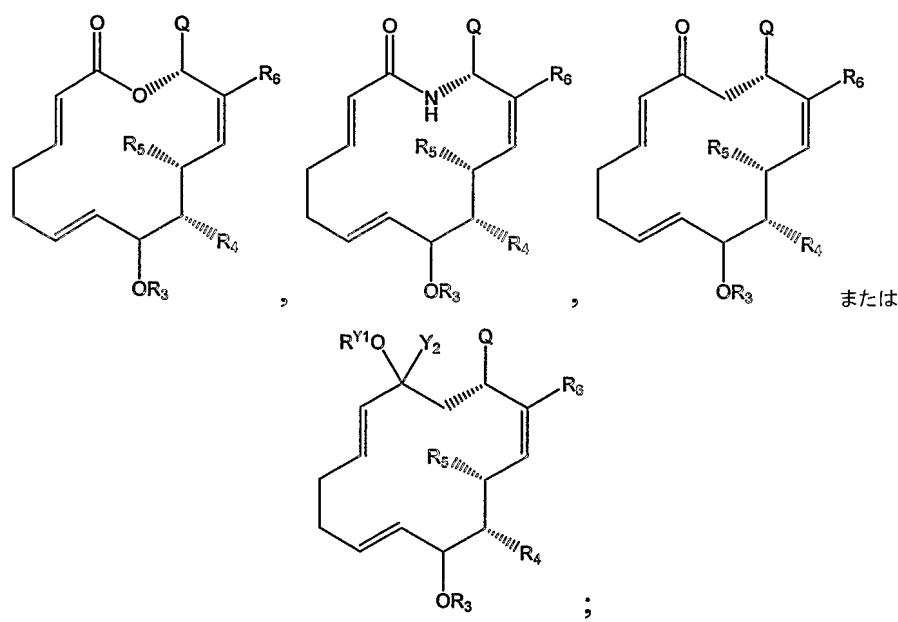
[式中、 R_3 ないし R_6 、 n および Q は、請求項1で定義したとおりであり； Y_2 および $R^{Y_1}O$ は、独立して、水素または低級アルキルである]

またはその薬学的に受容可能な誘導体のうちの1つを有する、請求項11に記載の組成物。

【請求項31】

前記化合物が以下の構造：

【化14】



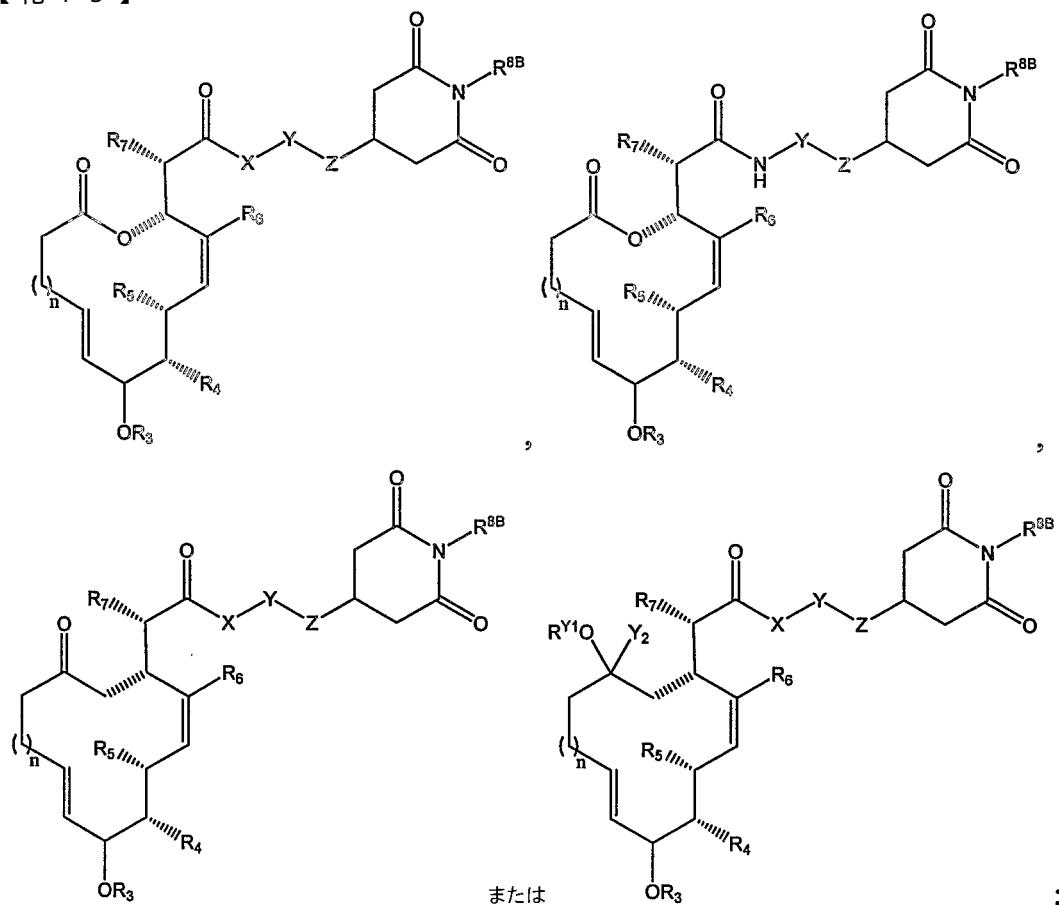
[式中、 R_3 ないし R_6 および Q は、請求項11で定義したとおりであり； Y_2 および $R^{Y_1}O$ は、独立して、水素または低級アルキルである]

またはその薬学的に受容可能な誘導体を有する、請求項1に記載の組成物。

【請求項32】

前記化合物が以下の構造：

【化15】



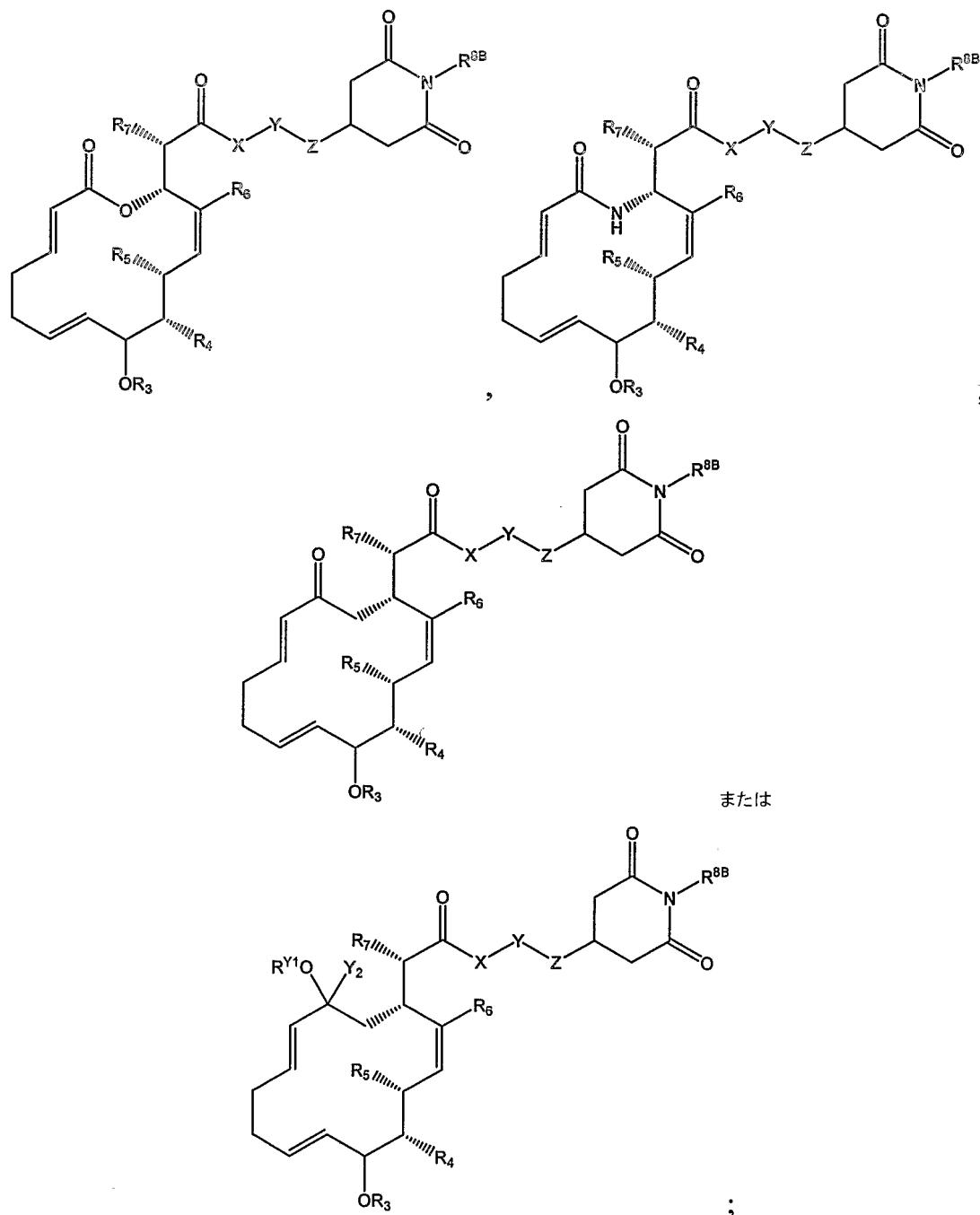
[式中、 R_3 ないし R_6 および n は、請求項11で定義したとおりであり； Y_2 および R^{Y_1} は、独立して、水素または低級アルキルであり； R_7 は置換されたもしくは置換されていない、直鎖もしくは分岐鎖、環式または非環式の低級アルキル基であり； R^{8B} は水素または低級アルキルであり；および X 、 Y および Z は、独立して、結合、-O-、-S-、-C(=O)-、-NR^{Z1}-、-CHOR^{Z1}、-CHNR^{Z1}R^{Z2}、C=S、C=N(R^{Y_1})または-CH(Hal)；または置換されたもしくは置換されていない C_{0-6} アルキリデンもしくは C_{0-6} アルケニリデン鎖であり、ここで、2つまでの隣接しないメチレン単位は、独立して、所望により、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}によって置換されてもよく；ここで、HalはF、Cl、BrおよびIから選択されるハロゲンであり；およびR^{Z1}およびR^{Z2}の各存在は、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；あるいはR^{Z1}およびR^{Z2}は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、複素環またはヘテロアリール基を形成する]

またはその薬学的に受容可能な誘導体を有する、請求項11に記載の組成物。

【請求項33】

前記化合物が以下の構造：

【化16】



[式中、R₃ないしR₆は、請求項11で定義したとおりであり；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は置換されたもしくは置換されていない、直鎖もしくは分岐鎖、環式もしくは非環式の低級アルキル基であり；R^{8B}は水素または低級アルキルであり；および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})または-CH(Hal)；置換されたもしくは置換されていないC₀～₆アルキリデンもしくはC₀～₆アルケニリデン鎖であり、ここで、2つまでの隣接しないメチレン単位は、独立して、所望により、CO、CO₂、COCO、CONR^{Z₁}、OCONR^{Z₁}、NR^{Z₁}NR^{Z₂}、NR^{Z₁}NR^{Z₂CO、NR^{Z₁CO、NR^{Z₁CO₂、NR^{Z₁CONR^{Z₂}、SO、SO₂、NR^{Z₁SO₂、SO₂NR^{Z₁、NR^{Z₁SO₂NR^{Z₂、O、SまたはNR^{Z₁}によって置換されていてもよく；ここで、HalはF、Cl、BrおよびIから選択されるハロゲンであり；およびR^{Z₁}およびR^{Z₂}の各存在}}}}}}}}

は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリールもしくはアシルであり；あるいは R^{Z_1} および R^{Z_2} は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、複素環もしくはヘテロアリール基を形成する】

またはその薬学的に受容可能な誘導体を有する、請求項11に記載の組成物。

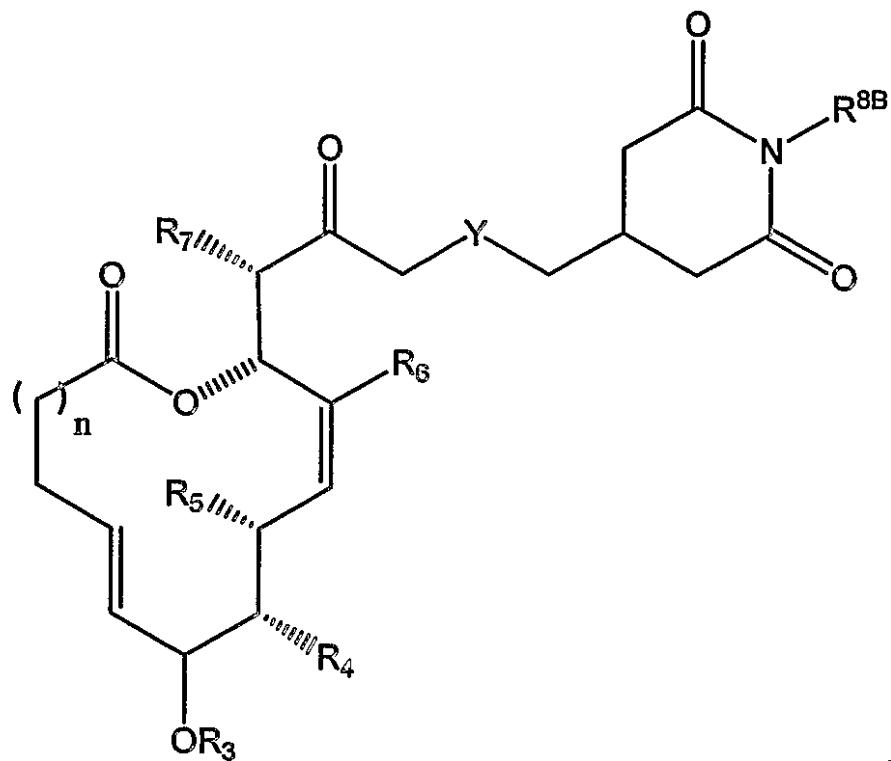
【請求項34】

-X-Y-Zが一緒にになって基-CH₂-Y-CH₂-を表し；ここで、Yが-CHOR^{Y1}、-CHNR^{Y1}R^{Y2}、C=O、C=S、C=N(R^{Y1})または-CH(Hal)であり；ここで、HalはF、Cl、BrおよびIから選択されるハロゲンであり；および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り、あるいはR^{Y1}およびR^{Y2}は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、複素環もしくはヘテロアリール基を形成する、請求項32または33に記載の組成物。

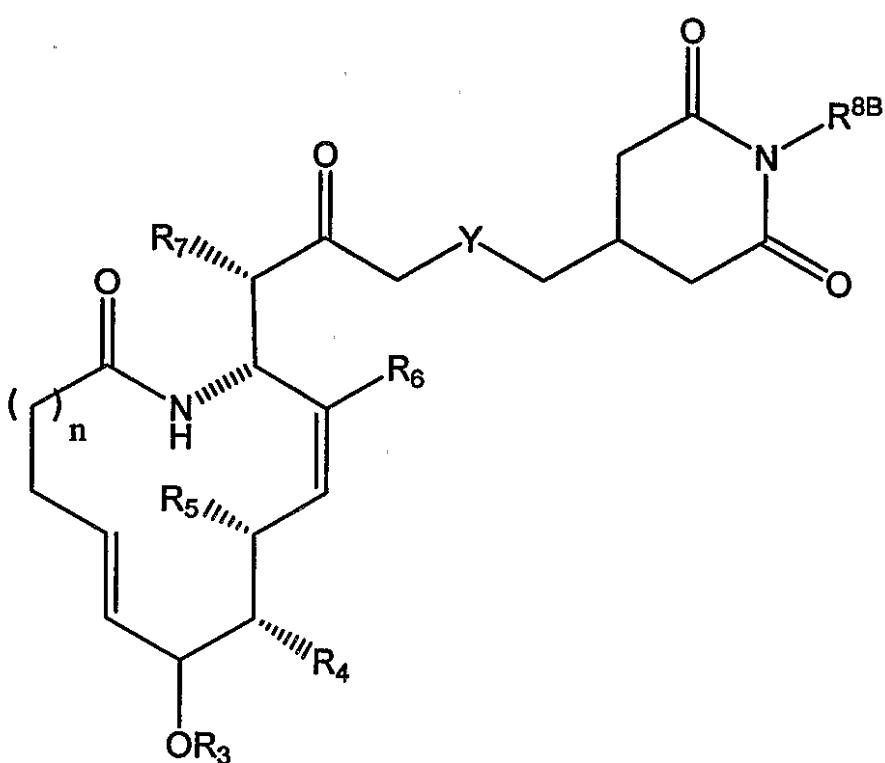
【請求項35】

前記化合物が以下の構造：

【化17】

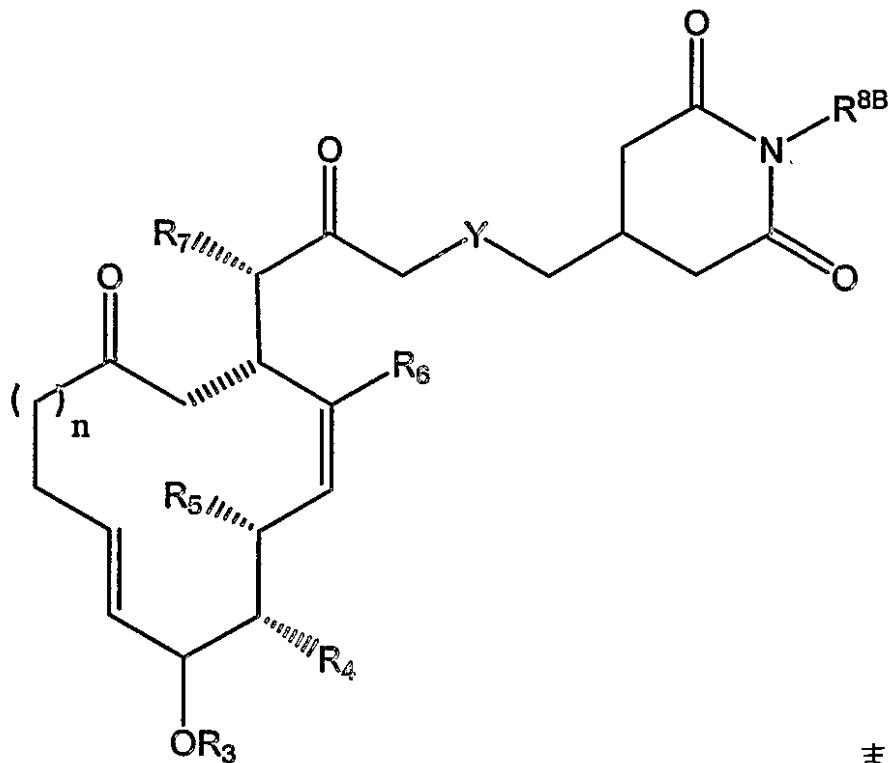


,

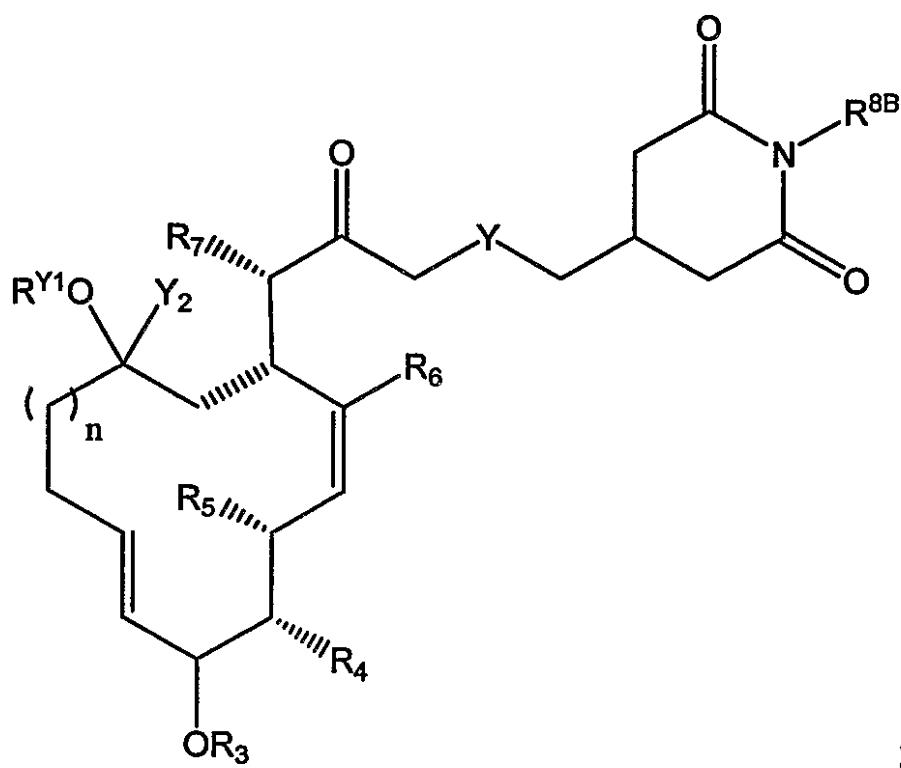


,

【化18】



または



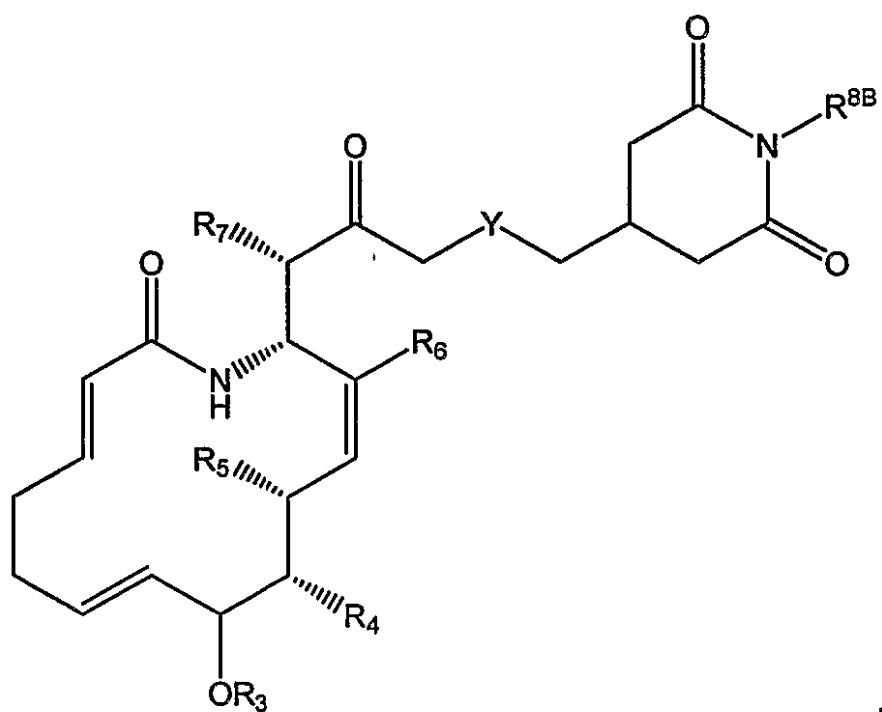
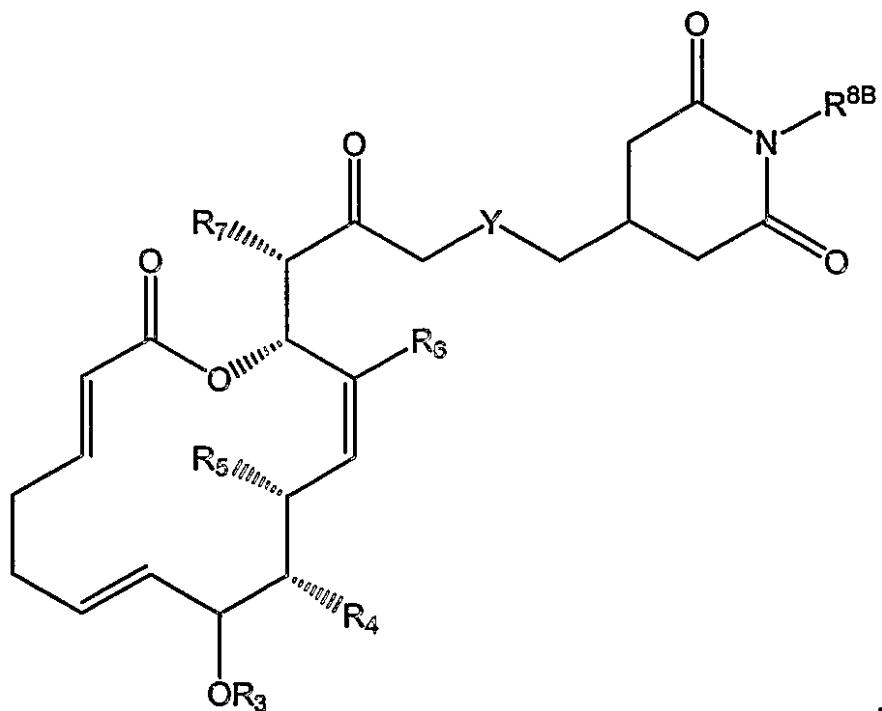
[式中、R₃ないしR₆およびnは、請求項11で定義したとおりであり；Y₂およびR^{Y₁}は、独立して、水素または低級アルキルであり；R₇は置換されたもしくは置換されていない、直鎖もしくは分岐鎖、環式もしくは非環式の低級アルキル基であり；R^{8B}は水素または低級アルキルであり；およびYは-C_nH_mO R^{Y₁}、-C_nH_mN R^{Y₁} R^{Y₂}、C=O、C=S、C=N(R^{Y₁})または-C_nH(Hal)であり；ここで、HalはF、Cl、BrおよびIから選択されるハロゲンであり；およびR^{Y₁}およびR^{Y₂}は、独立

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り、あるいは R^Y_1 および R^Y_2 は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、複素環もしくはヘテロアリール基を形成する] を有する、請求項 1.1 に記載の組成物。

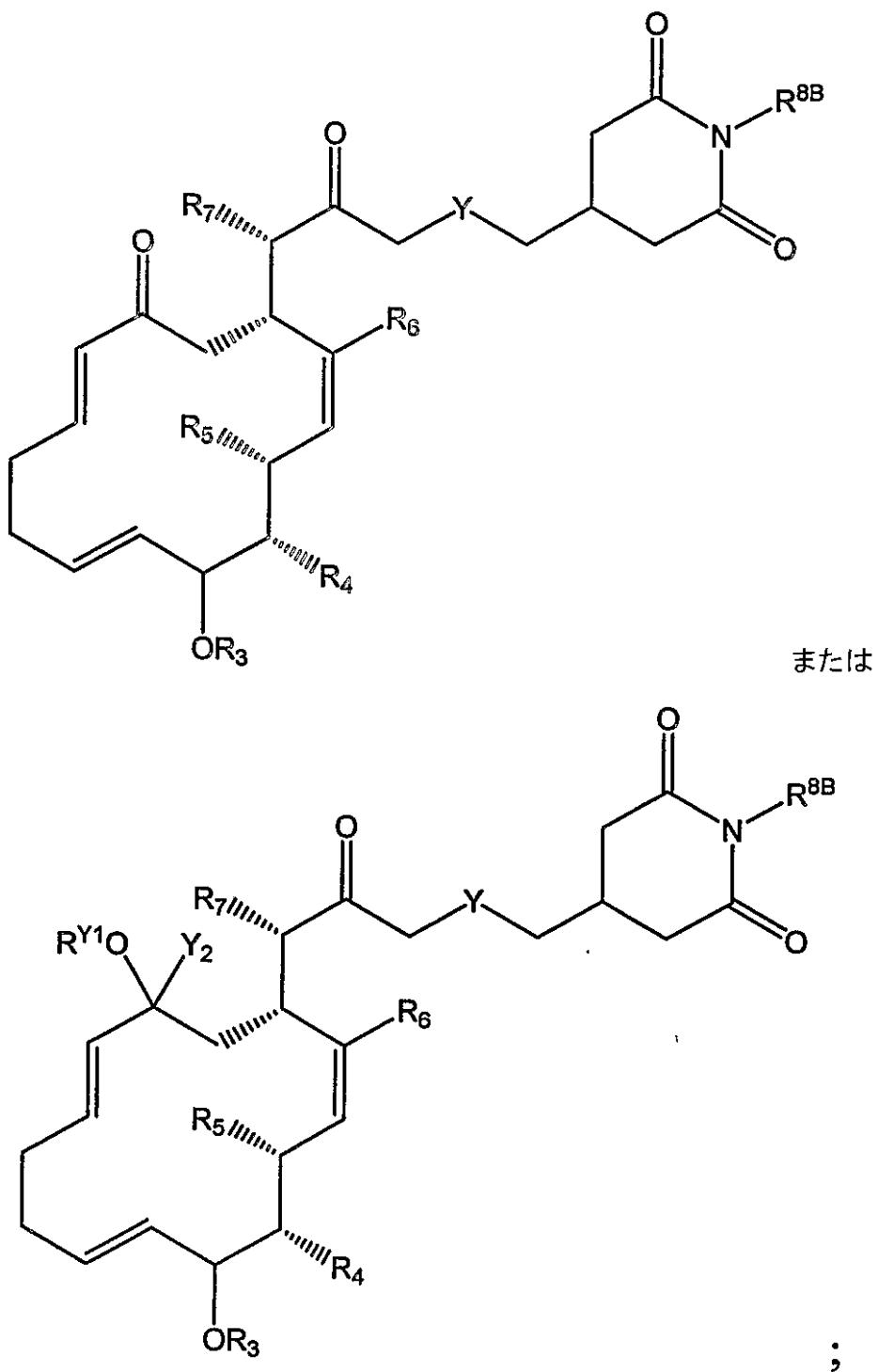
【請求項 3 6】

前記化合物が以下の構造：

【化 1 9】



【化20】



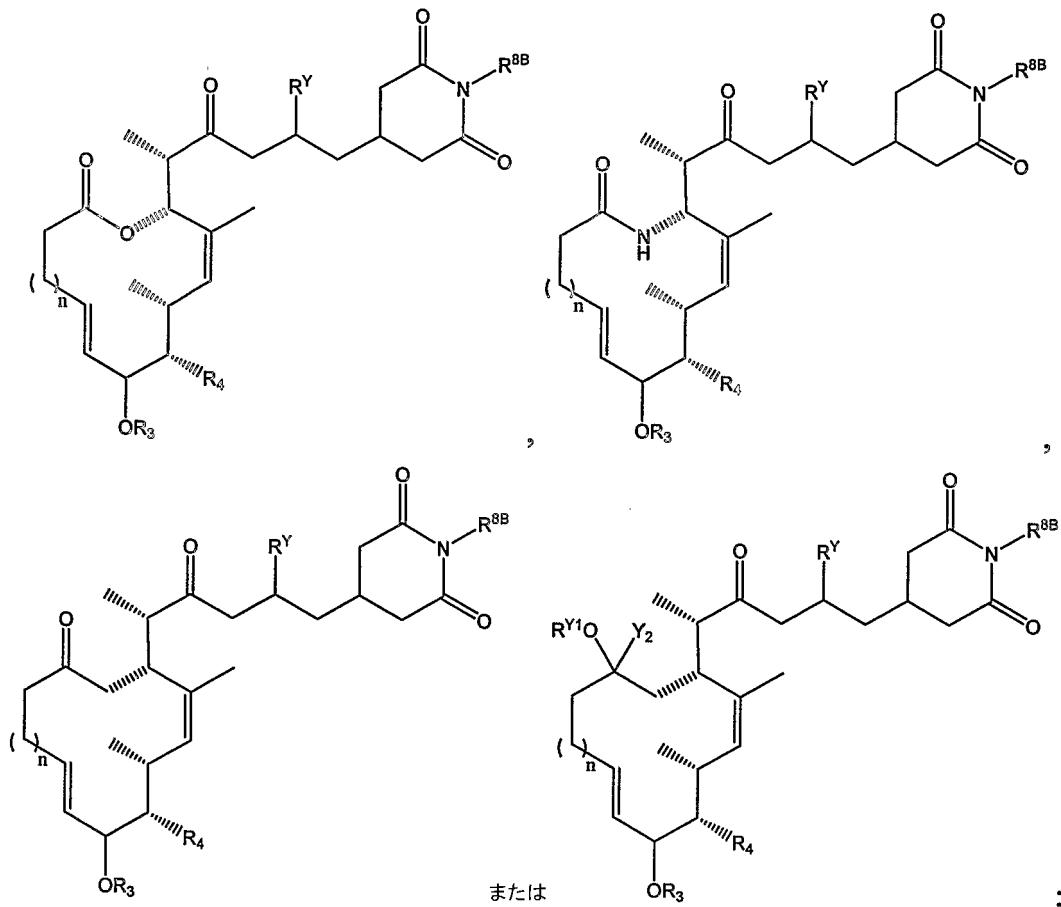
[式中、 R_3 ないし R_6 は、請求項11で定義したとおりであり； Y_2 および R^{Y_1} は、独立して、水素または低級アルキルであり； R_7 は置換されたもしくは置換されていない直鎖もしくは分岐鎖、環式もしくは非環式の低級アルキル基であり； R^{8B} は水素または低級アルキルであり；および Y は $-CHOR^{Y_1}$ 、 $-CHNR^{Y_1}R^{Y_2}$ 、 $C=O$ 、 $C=S$ 、 $C=N(R^{Y_1})$ または $-CH(Hal)$ であり；ここで、 Hal はF、Cl、BrおよびIから選択されるハロゲンであり；および R^{Y_1} および 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り、あるいは R^{Y_1} および R^{Y_2} は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、複素環もしくはヘテロアリール基を形成する]

を有する、請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 3 7】

前記化合物が以下の構造：

【化 2 1】

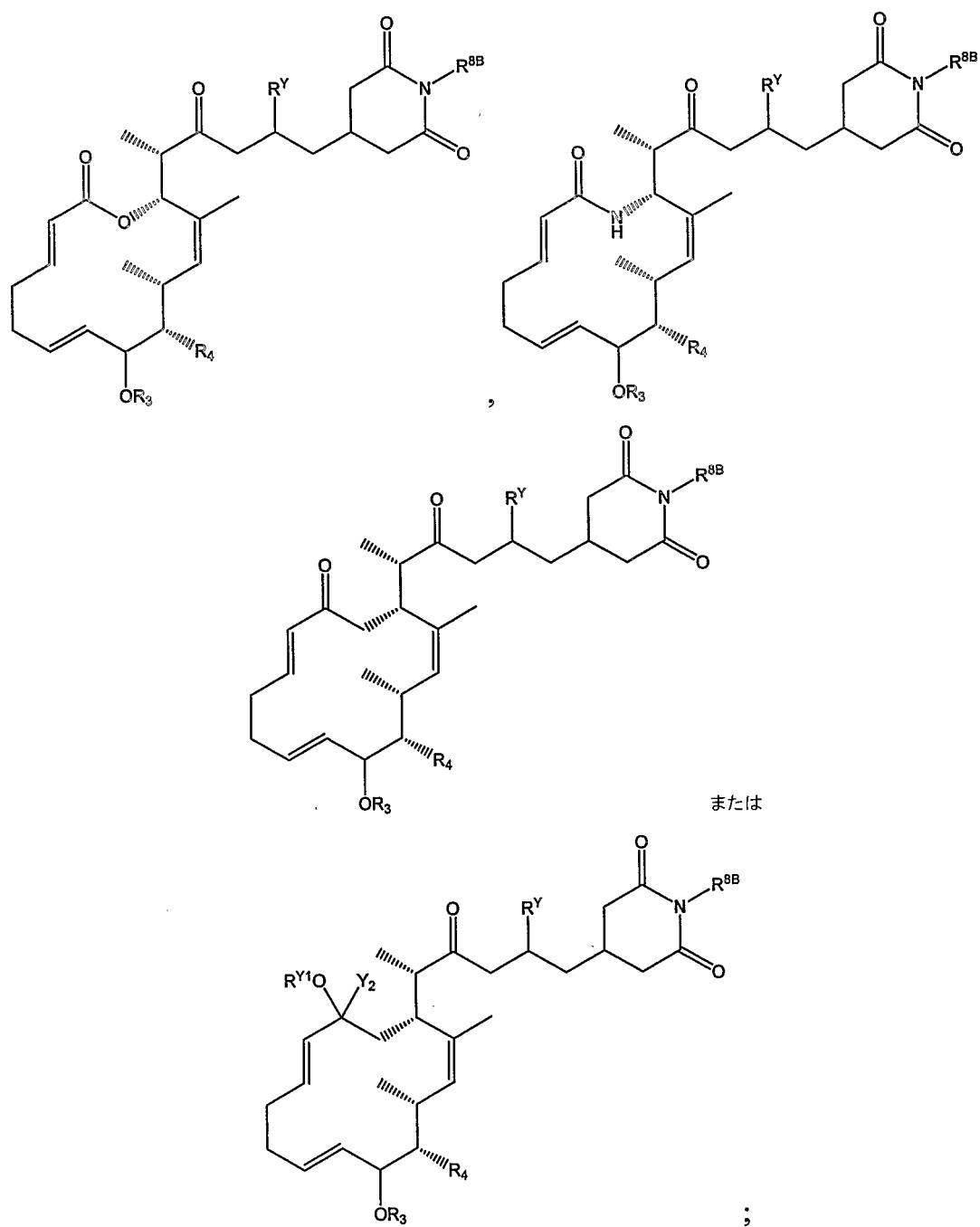


[式中、n、R₃ および R₄ は、請求項 1 1 で定義したとおりであり；Y₂ および R^{Y₁} は、独立して水素または低級アルキルであり；R^{8B} は水素または低級アルキルであり；および R^Y は水素、ハロゲン、-OR^{Y₁} または -NR^{Y₁}NR^{Y₂} であり；ここで、R^{Y₁} および R^{Y₂} は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはアシルであり、あるいは R^{Y₁} および R^{Y₂} は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、複素環またはヘテロアリール基を形成する]
を有する、請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 3 8】

前記化合物が以下の構造：

【化22】

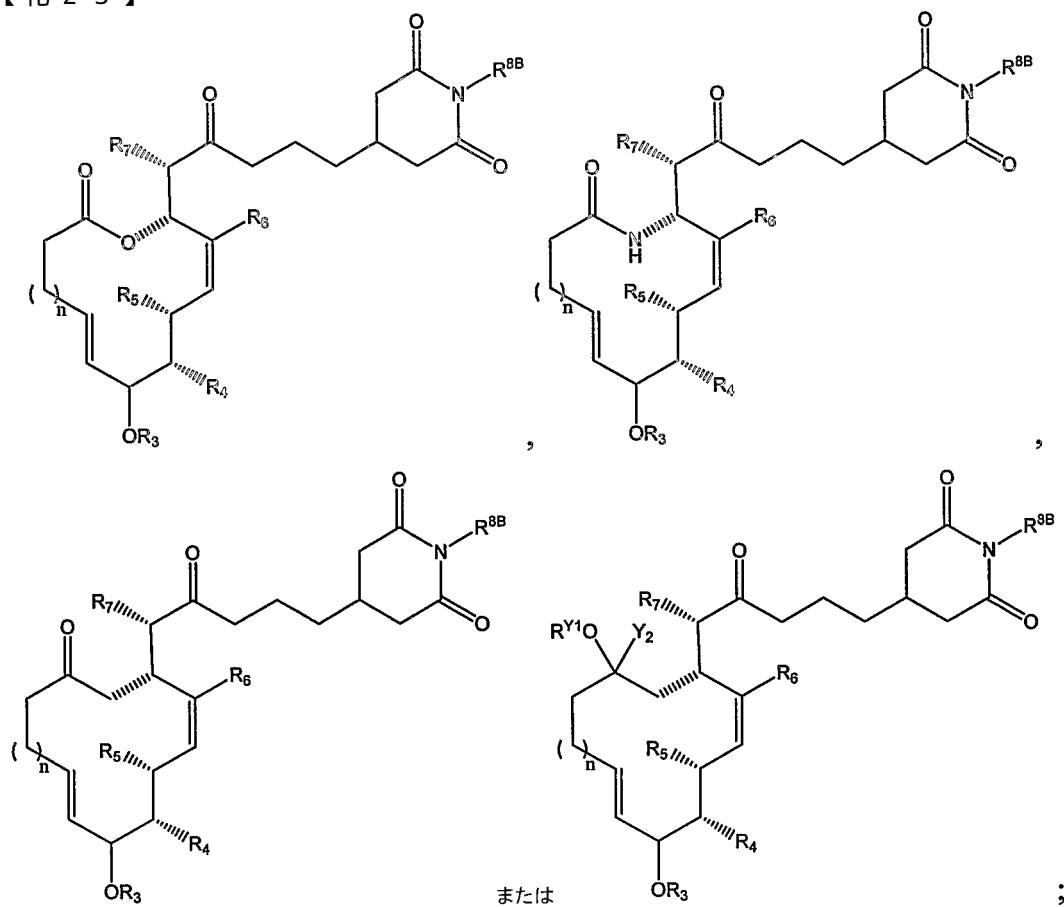


[式中、R₃ および R₄ は、請求項 11 で定義したとおりであり；Y₂ および R^{Y¹} は、独立して、水素または低級アルキルであり；R^{8B} は水素または低級アルキルであり；および R^Y は水素、ハロゲン、-OR^{Y¹} または -NR^{Y¹}NR^{Y²} であり；ここで、R^{Y¹} および R^{Y²} は、独立して、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはアシルであり、あるいは R^{Y¹} および R^{Y²} は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、複素環またはヘテロアリール基を形成する] を有する、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 39】

前記化合物が以下の構造：

【化23】



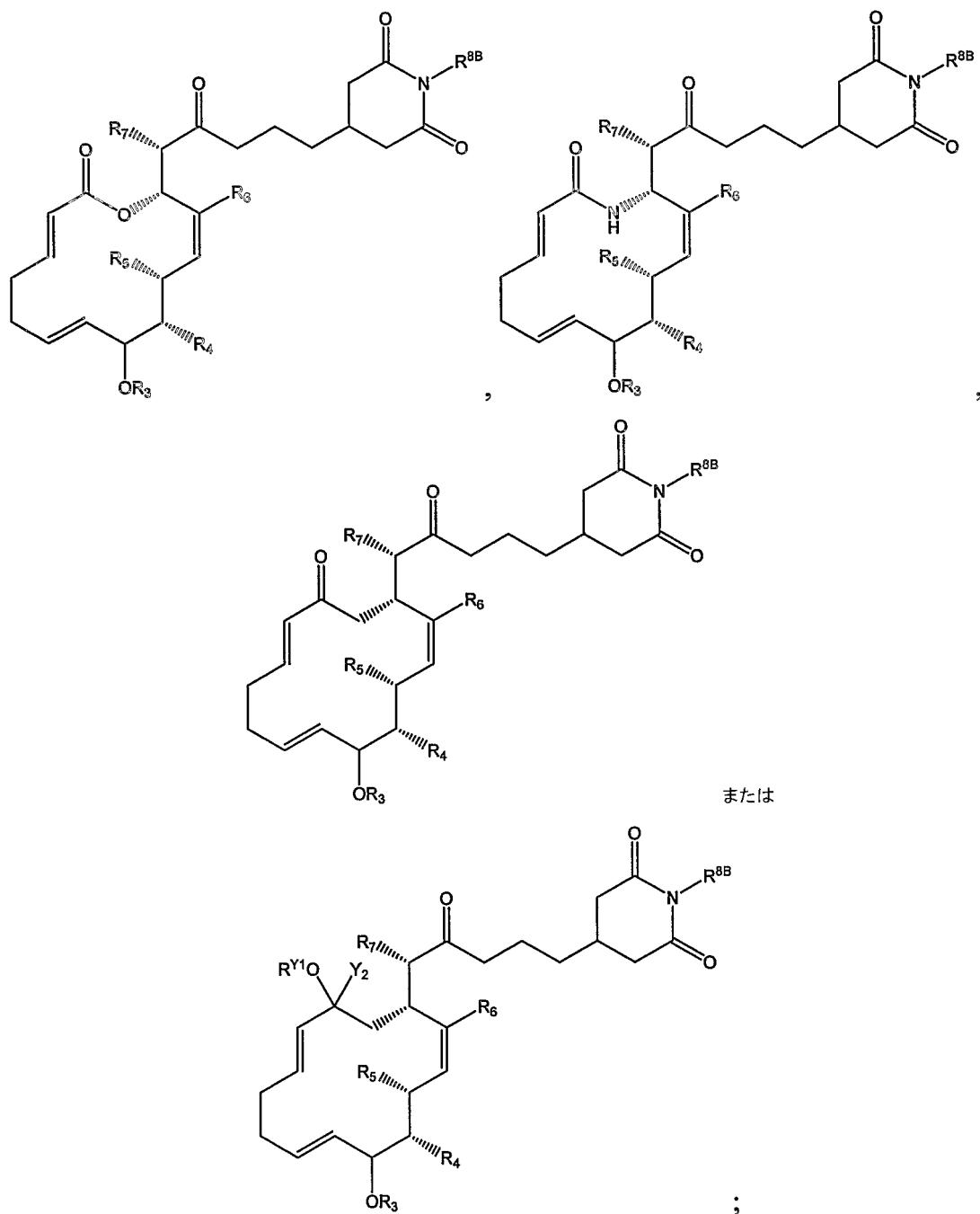
[式中、R₃ないしR₆およびnは、請求項11で定義したとおりであり；Y₂およびR^{Y₁}は、独立して、水素または低級アルキルであり；R₇は置換されたもしくは置換されていない直鎖もしくは分岐鎖、環式もしくは非環式の低級アルキル基であり；およびR^Bは水素または低級アルキルである]

を有する、請求項11に記載の組成物。

【請求項40】

前記化合物が以下の構造：

【化24】



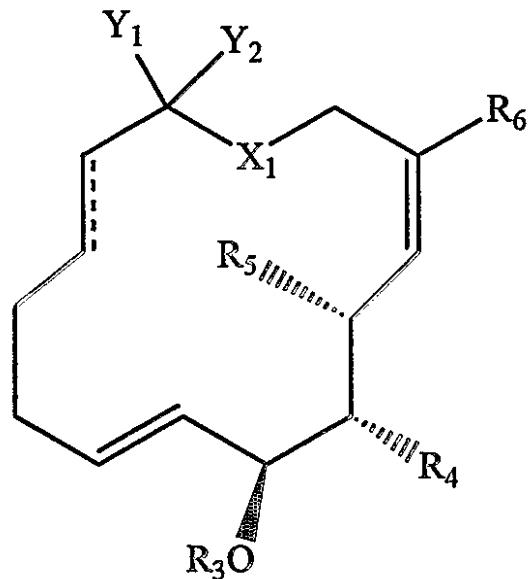
[式中、R₃ないしR₆は、請求項11で定義したとおりであり；Y₂およびR^{Y¹}は、独立して、水素または低級アルキルであり；R₇は置換されたもしくは置換されていない、直鎖もしくは分岐鎖、環式もしくは非環式の低級アルキル基であり；およびR^{8B}は水素または低級アルキルである]

を有する、請求項11に記載の組成物。

【請求項41】

前記化合物が以下の構造：

【化25】



[式中、 X_1 は CH_2 、 NH または O であり；

Y_1 および Y_2 は、独立して、 OH 、 $\text{C}(\text{R}^{Y_1})_3$ であり、あるいは Y_1 および Y_2 は、それらが結合している炭素原子と一緒にになって $-\text{C}=\text{O}$ であり、ここで、 R^{Y_1} は八口であり；

R_6 は H または低級アルキルであり；

R_5 は H または低級アルキルであり；

R_4 は OH であり；および

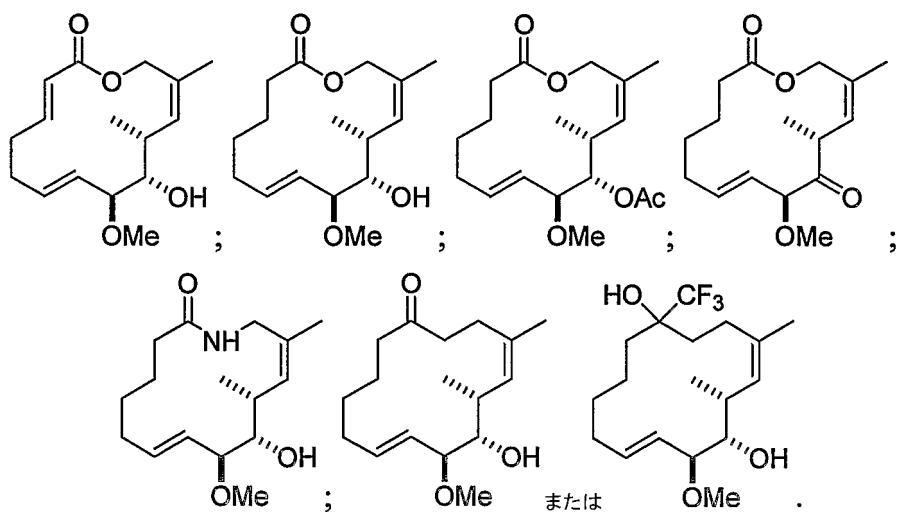
R_3 はアルキルである]

またはその薬学的に受容可能な塩を有する、請求項11に記載の組成物。

【請求項42】

前記化合物が以下の構造：

【化26】



を有する、請求項41に記載の組成物。

【請求項43】

前記化合物は、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に記載の組成物。

【請求項44】

前記化合物は、脈管形成を阻害するのに有効な量で存在する、請求項1に記載の組成物。

【請求項45】

さらに、細胞傷害剤を含む、請求項1に記載の組成物。

【請求項46】

前記細胞傷害剤が抗癌剤である、請求項45に記載の組成物。

【請求項47】

さらに、緩和剤を含む、請求項1に記載の組成物。

【請求項48】

乳癌転移を治療するための、請求項1に記載の組成物。

【請求項49】

前記組成物は、約1mg/kgないし約50mg/kg体重の間の投与量にて投与されるのに適する、請求項48に記載の組成物。

【請求項50】

前記組成物は、約0.1mg/kgないし約40mg/kg体重の間の投与量にて投与されるのに適する、請求項48に記載の組成物。

【請求項51】

前記組成物は、約1mg/kgないし約40mg/kg体重の間の投与量にて投与されるのに適する、請求項48に記載の組成物。

【請求項52】

前記組成物は、約0.1mg/kgないし約30mg/kg体重の間の投与量にて投与されるのに適する、請求項48に記載の組成物。

【請求項53】

前記組成物は、約1mg/kgないし約30mg/kg体重の間の投与量にて投与されるのに適する、請求項48に記載の組成物。

【請求項54】

前記組成物は、約5mg/kgないし約30mg/kg体重の間の投与量にて投与されるのに適する、請求項48に記載の組成物。

【請求項55】

前記組成物は、約0.1mg/kgないし約20mg/kg体重の間の投与量にて投与されるのに適する、請求項48に記載の組成物。

【請求項56】

前記組成物は、約1mg/kgないし約20mg/kg体重の間の投与量にて投与されるのに適する、請求項48に記載の組成物。

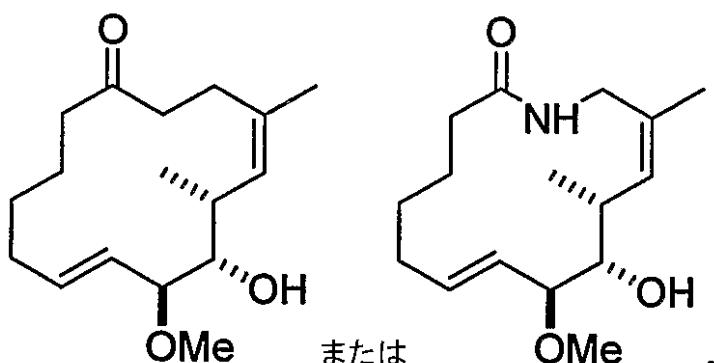
【請求項57】

前記組成物は、10mg/kg体重以上の投与量にて投与されるのに適する、請求項48に記載の組成物。

【請求項58】

前記組成物において、前記化合物が以下の構造：

【化27】



を有する、請求項 4 8 に記載の組成物。

【請求項 5 9】

前記組成物は、約 1 0 m g / k g ないし約 2 0 m g / k g 体重の間の投与量にて投与されるのに適する、請求項 5 8 に記載の組成物。

【請求項 6 0】

前記組成物は、細胞傷害剤と組み合せて投与するのに適する、請求項 4 8 に記載の組成物。

【請求項 6 1】

前記細胞傷害剤が抗癌剤である、請求項 6 0 に記載の組成物。

【請求項 6 2】

前記組成物は、緩和剤と組み合せて投与するのに適する、請求項 4 8 に記載の組成物。