

【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24年11月22日 (2012.11.22)

【公表番号】特表2009-518296(P2009-518296A)

【公表日】平成21年5月7日 (2009.5.7)

【年通号数】公開・登録公報2009-018

【出願番号】特願2008-543461(P2008-543461)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 513/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/433 (2006.01)

A 6 1 K 31/5025 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

A 6 1 K 31/549 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 487/04 1 4 5

C 0 7 D 513/04 3 2 5

C 0 7 D 513/04 C S P

C 0 7 D 513/04 3 7 5

A 6 1 P 43/00 1 2 3

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 35/04

A 6 1 K 31/433

A 6 1 K 31/5025

A 6 1 K 31/551

A 6 1 K 31/549

【誤訳訂正書】

【提出日】平成24年10月4日 (2012.10.4)

【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

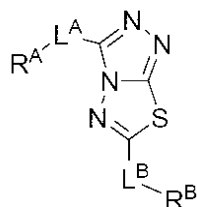
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

次式を有する化合物、又はその薬学的に許容できる塩：

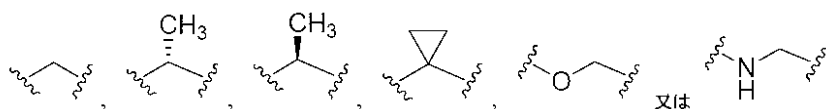
【化 3】



(I - a)

式中、 L^A は次式

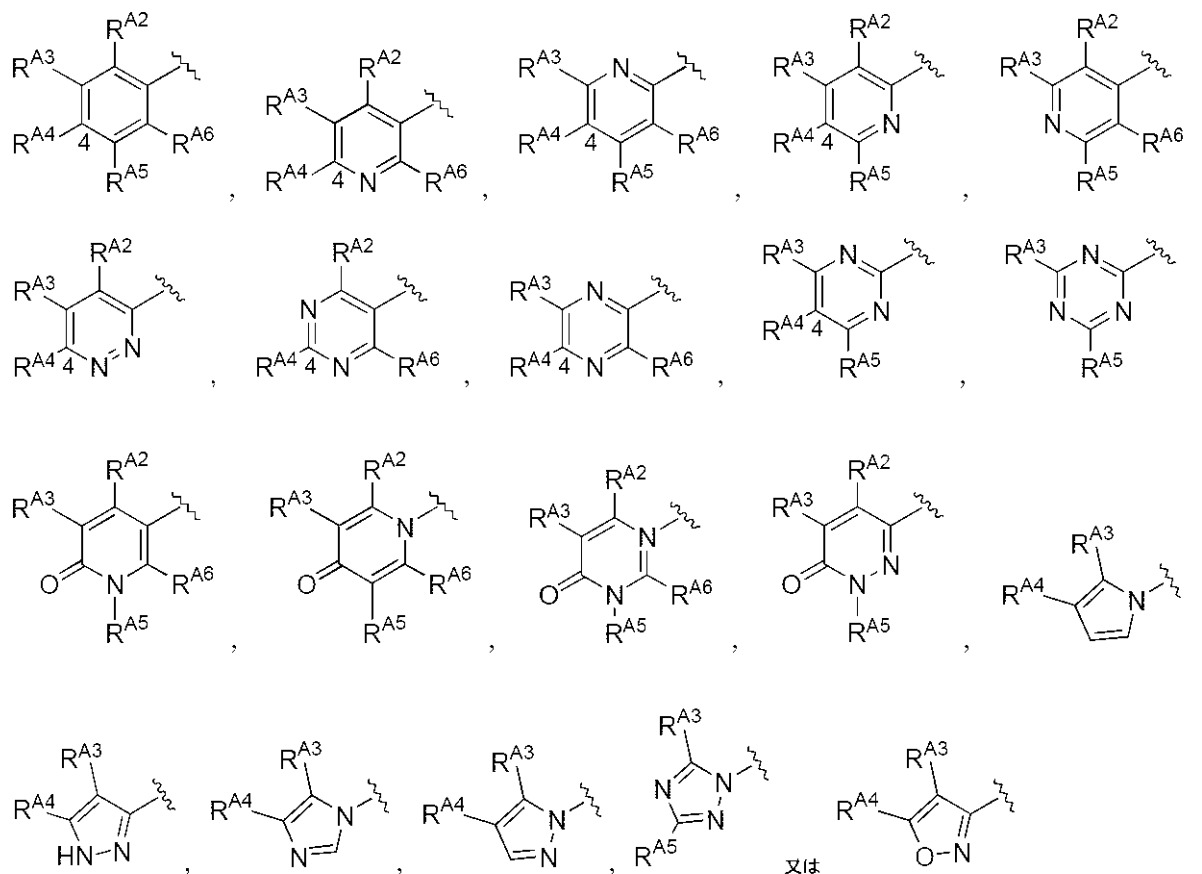
【化 7】



から選ばれ；

 R^A は次式から選ばれ

【化 2】



式中、 R^{A2} 及び R^{A6} のそれぞれは独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-C(O)OR^{++}$ 、 $-C(O)R^{++}$ 、 $-C(O)N(R^{++})_2$ 、 $-C(S)N(R^{++})_2$ 、 $-C(NH)N(R^{++})_2$ 、 $-OR^{++}$ 、 $-O$ (ハロ (C_{1-4} 脂肪族))、 $-OC(O)N(R^{++})_2$ 、 $-SR^{++}$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{++})_2$ 、 $-N(R^{++})C(O)(R^{++})$ 、 $-N(R^{++})C(O)N(R^{++})_2$ 、 $-N(R^{++})C(O)OR^{++}$ 、 $-N(R^{++})N(R^{++})C(O)R^{++}$ 、 $-N(R^{++})N(R^{++})C(O)N(R^{++})_2$ 、 $-N(R^{++})N(R^{++})C(O)OR^{++}$ 、 $-N(R^{++})S(O)_2N(R^{++})_2$ 、 $-N(R^{++})S(O)_2R^{++}$ 、 $-S(O)_2R^{++}$ 、 $-S(O)_2N(R^{++})_2$ 、 $-S(O)R^{++}$ および C_{1-4} 脂肪族から選ばれ、当該 C_{1-4}

脂肪族は適宜、ハロゲン、 $-OR^{++}$ 、 $-SR^{++}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N(R^{++})_2$ 、又は $-N(R^{++})C(O)(R^{++})$ から独立して選ばれる置換基で置換され；

R^{A3} は R^{Ar} であり；又は R^{A3} 、 R^{A4} 及びそれらが結合する炭素は、4個以下の R^{Ar} の独立した存在で適宜置換される6員アリール、あるいは少なくとも1のO、N、又はSを含む5-6員ヘテロシクリル又はヘテロアリール環を形成し、前記ヘテロシクリル又はヘテロアリール環は3個以下の R^{Ar} の独立した存在で適宜置換され；

R^{A4} は $-OH$ 、 $-B(OR^*)_2$ 、 $-SR^*$ 、 $-N(R^*)_2$ 、 $-N(R^*)C(OR^*)$ 、 $-N(R^*)C(O)N(R^*)_2$ 、 $-N(R^*)C(O)OR^*$ 、 $-N(R^*)N(R^*)C(O)R^*$ 、 $-N(R^*)N(R^*)C(O)N(R^*)_2$ 、 $-N(R^*)N(R^*)C(O)OR^*$ 、 $-N(R^*)S(O)_2N(R^*)_2$ 、 $-N(R^*)S(O)_2R^*$ 、 $-C(O)OR^*$ 、 $-C(O)N(R^*)_2$ であり；

R^{A5} は水素又は R^{Ar} であり；

L^B は、共有結合または $-N(R^*)-$ であり；

R^B はハロゲン； NH_2 ；適宜で置換された C_{1-8} 脂肪族基；6-10員アリール環；3-7員炭素環式環；窒素、酸素及び硫黄から独立して選ばれる1-4ヘテロ原子を有する5-10員ヘテロアリール環；又は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選ばれる1-4ヘテロ原子を有する3-10員ヘテロシクリル環であり、前記アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリル環はそれぞれ適宜5以下の R^{Ar} の独立した存在で置換され；

Rはハロゲン、 $-R^0$ 、 $-OR^0$ 、 $-SR^0$ 、 $-OC(O)(C_{1-8} \text{脂肪族})$ 、適宜 R^0 で置換されたPh、適宜 R^0 で置換された $-O(Ph)$ 、適宜 R^0 で置換された $-CH_2(Ph)$ 、適宜 R^0 で置換された $-CH_2CH_2(Ph)$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N(R^0)_2$ 、 $-NR^0C(O)R^0$ 、 $-NR^0C(O)N(R^0)_2$ 、 $-NR^0C(O)OR^0$ 、 $-NR^0NR^0C(O)R^0$ 、 $-NR^0NR^0C(O)N(R^0)_2$ 、 $-NR^0NR^0C(O)OR^0$ 、 $-C(O)C(O)R^0$ 、 $-C(O)CH_2C(O)R^0$ 、 $-C(O)OR^0$ 、 $-C(O)R^0$ 、 $-C(O)N(R^0)_2$ 、 $-OC(O)N(R^0)_2$ 、 $-S(O)_2R^0$ 、 $-S(O)_2N(R^0)_2$ 、 $-S(O)R^0$ 、 $-NR^0S(O)_2N(R^0)_2$ 、 $-NR^0S(O)_2R^0$ 、 $-C(=S)N(R^0)_2$ 、 $-C(=NH)-N(R^0)_2$ 、又は $-(CH_2)_yNHC(O)R^0$ であり、yは1から4であり；あるいは同一炭素原子上に共に存在する2個のRは、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=NNHR^*$ 、 $=NN(R^*)_2$ 、 $=NNHC(O)R^*$ 、 $=NNHC(O)O(C_{1-8} \text{脂肪族})$ 、 $=NNHS(O)_2(C_{1-8} \text{脂肪族})$ 、又は $=NR^*$ であり；

R^{Ar} はそれぞれ独立して、ハロゲン、 $-R^0$ 、 $-OR^0$ 、 $-SR^0$ 、 $-OC(O)(C_{1-8} \text{脂肪族})$ 、適宜5個までの $-R^0$ で置換されたPh、適宜5個までの $-R^0$ で置換された $-CH_2(Ph)$ 、適宜5個までの $-R^0$ で置換された $-(CH_2)_y(Ph)$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N(R^0)_2$ 、 $-NR^0C(O)R^0$ 、 $-NR^0C(O)N(R^0)_2$ 、 $-NR^0C(O)OR^0$ 、 $-NR^0NR^0C(O)R^0$ 、 $-NR^0NR^0C(O)N(R^0)_2$ 、 $-NR^0NR^0C(O)OR^0$ 、 $-C(O)CH_2C(O)R^0$ 、 $-C(O)OR^0$ 、 $-C(O)R^0$ 、 $-C(O)N(R^0)_2$ 、 $-OC(O)N(R^0)_2$ 、 $-S(O)_2R^0$ 、 $-S(O)_2N(R^0)_2$ 、 $-S(O)R^0$ 、 $-NR^0S(O)_2N(R^0)_2$ 、 $-NR^0S(O)_2R^0$ 、 $-C(S)N(R^0)_2$ 、 $-C(NH)N(R^0)_2$ 、及び $-(CH_2)_yNHC(O)R^0$ から選ばれ、yは1から4であり；あるいは、2個の隣接する R^{Ar} 基は一緒になって1,2-メチレンジオキシ又は1,2-エチレンジオキシであり；

R^{++} はそれぞれ独立して水素又は C_{1-4} 脂肪族であり；

R^* はそれぞれ独立して、水素、又は適宜5個までの $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-4} \text{脂肪族})$ 、 $-N(C_{1-4} \text{脂肪族})_2$ 、ハロゲン、 C_{1-4} 脂肪族、 $-OH$ 、 $-O(C_{1-4} \text{脂肪族})$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)O(C_{1-4} \text{脂肪族})$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(O)NH(C_{1-4} \text{脂肪族})$ 、 $-C(O)N(C_{1-4} \text{脂肪族})_2$ 、 $-O(ハロ(C_{1-4} \text{脂肪族}))$ 、もしくはハロ($C_{1-4} \text{脂肪族})$ の独立した存在で

R[○]はそれぞれ独立に、水素、適宜置換されたC₁ - 6 脂肪族、非置換5 - 6 員ヘテロアリール又はヘテロシクリル環、- Ph、又は- O (Ph)であり、ここで前記適宜置換されたR[○]の脂肪族のそれぞれの置換基は、独立して、- NH₂、- NH (C₁ - 4 脂肪族)、- N (C₁ - 4 脂肪族)₂、ハロゲン、C₁ - 4 脂肪族、- OH、- O (C₁ - 4 脂肪族)、- NO₂、- CN、- C (O) OH、- C (O) O (C₁ - 4 脂肪族)、- C (O) NH₂、- C (O) NH (C₁ - 4 脂肪族)、- C (O) N (C₁ - 4 脂肪族)₂、- O (ハロ (C₁ - 4 脂肪族))、又はハロ (C₁ - 4 脂肪族)であり；あるいは、同一の窒素上の2個のR[○]は当該窒素と共に、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選ばれるヘテロ原子を1 - 3個有する5 - 8員ヘテロシクリル又はヘテロアリール環を形成する、化合物、又はその薬学的に許容できる塩。

 R^A は次式

A chemical structure of a benzene ring with six substituents. The substituents are labeled R^{A2} (top), R^{A3} (top-left), R^{A4} (bottom-left), R^{A5} (bottom), R^{A6} (bottom-right), and a wavy line (top-right). The number 4 is located near the R^{A4} substituent.

R^A 4 はOHである、請求項1に記載の化合物。

R^{A3} 、 R^{A4} 及びこれらが結合する炭素は次式

式中、 R^{A7} のそれぞれは、独立して、水素、 $-R^0$ 、 $-R(-N(R^0))_2$ 、 $-NR^0C(O)R^0$ 、 $-NR^0C(O)N(R^0)_2$ 、 $-NR^0CO_2R^0$ 、 $-C(O)C$

$H_2C(O)R^0$ 、 $-CO_2R^0$ 、 $-C(O)R^0$ 、 $-C(O)N(R^0)_2$ 、 $-S(O)_2R^0$ 、 $-C(=S)N(R^0)_2$ 、 $-C(=NH)-N(R^0)_2$ 、又は $-(CH_2)_yNHC(O)R^0$ であり；

R^{A8} のそれぞれは、水素であり；

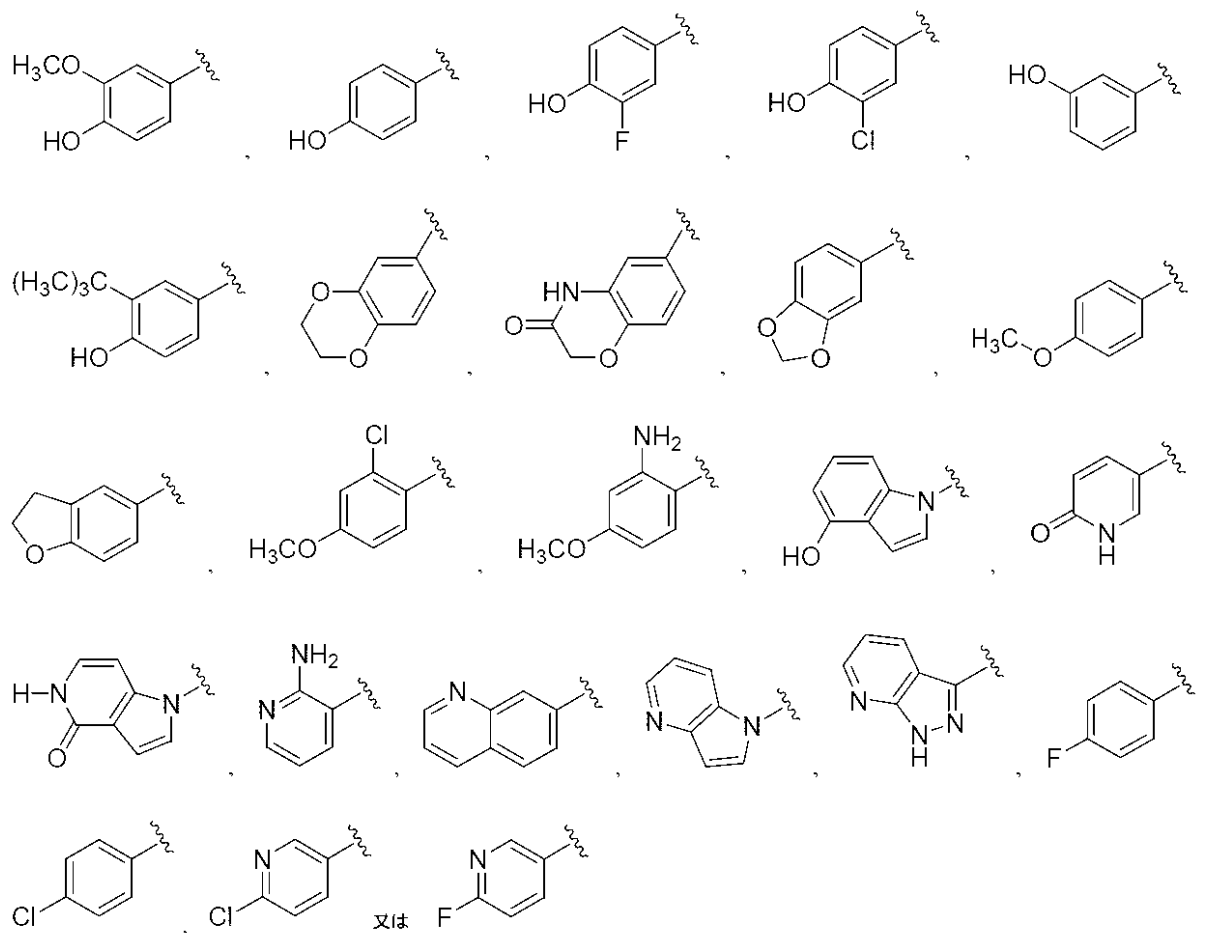
R^{A9} のそれぞれは、水素であり；

前記ヘテロシクリル又はヘテロアリール環は、図示の4位で R^A に結合する、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

R^A は次式

【化11】

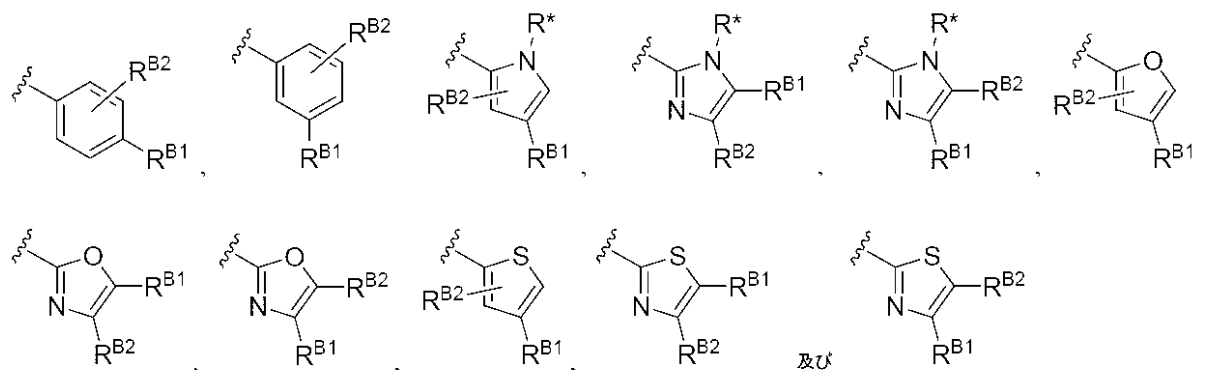


から選ばれる、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

R^B は次式

【化12】



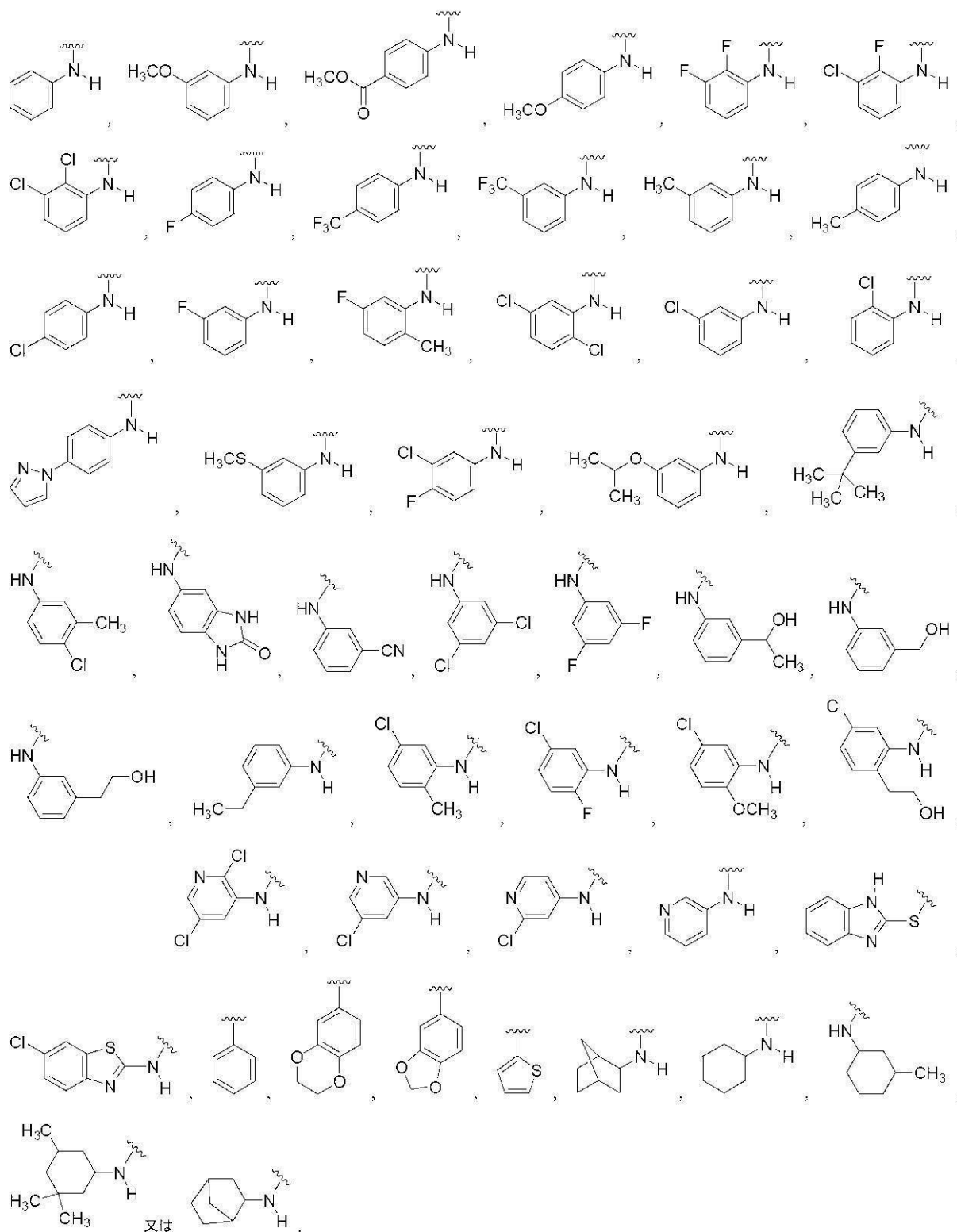
から選ばれ、

式中、 R^{B1} 及び R^{B2} はそれぞれ独立して水素又は R^A である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

$L^B R^B$ は次式

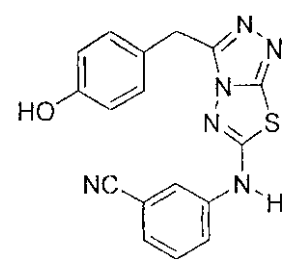
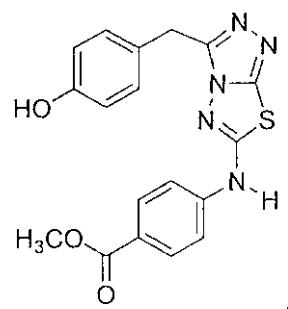
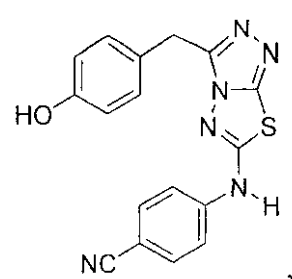
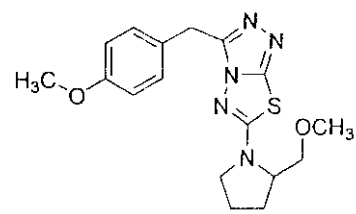
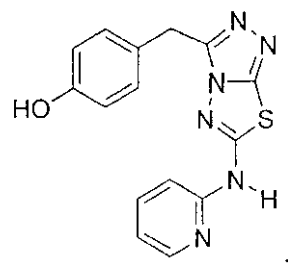
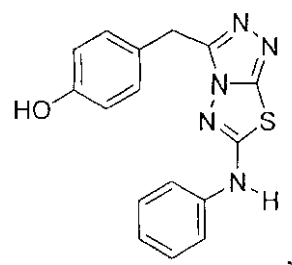
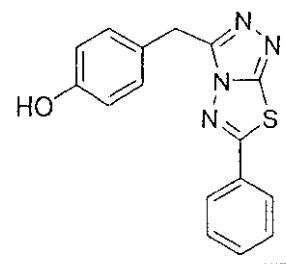
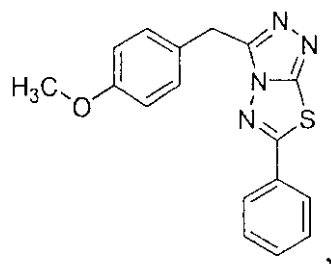
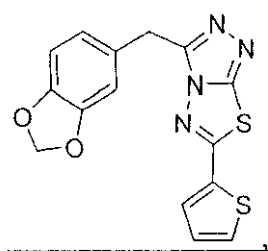
【化 13】



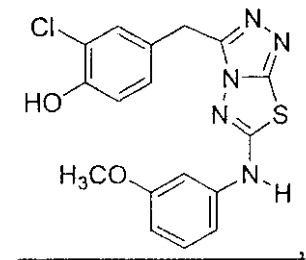
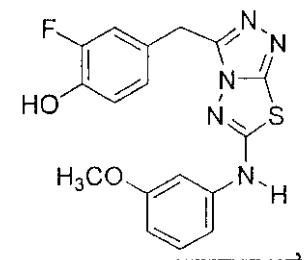
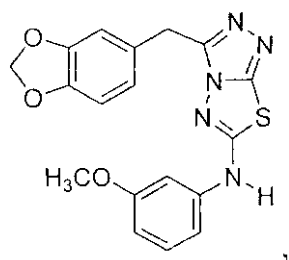
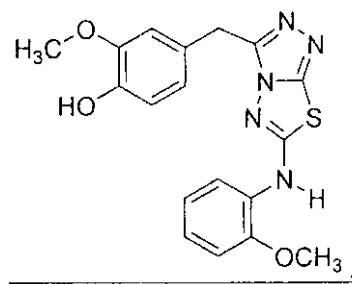
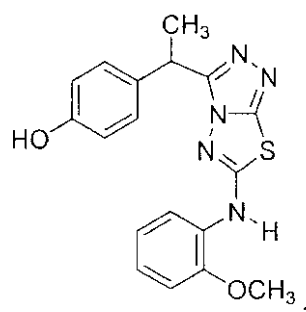
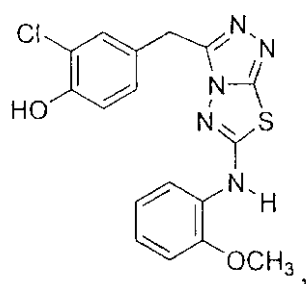
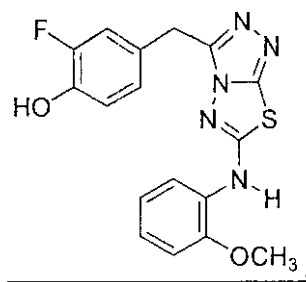
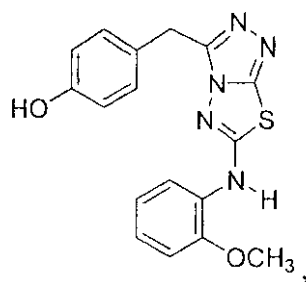
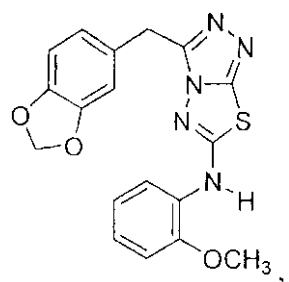
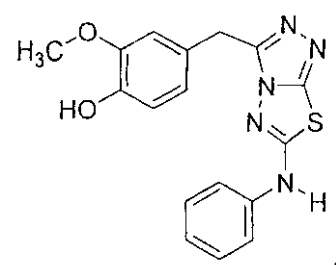
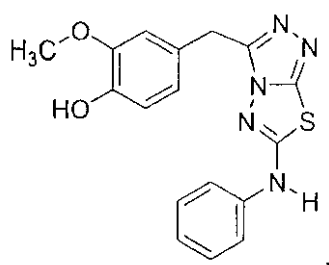
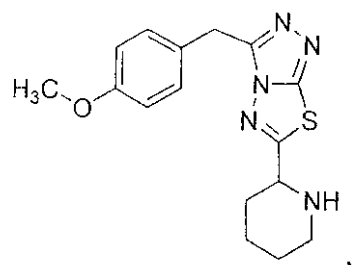
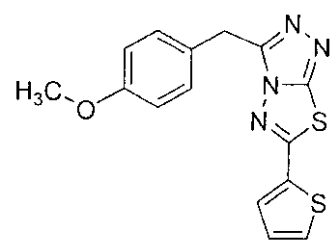
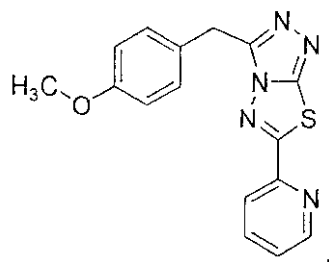
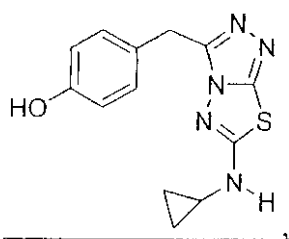
から選ばれる、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

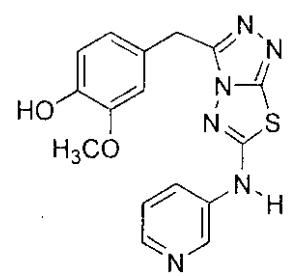
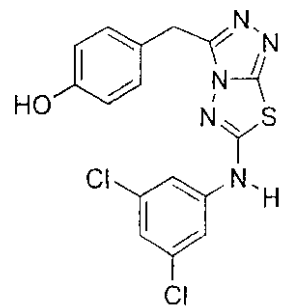
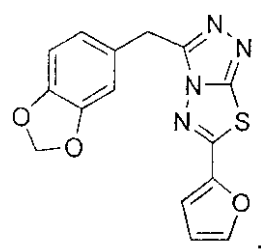
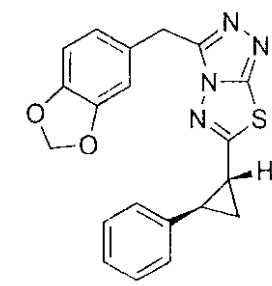
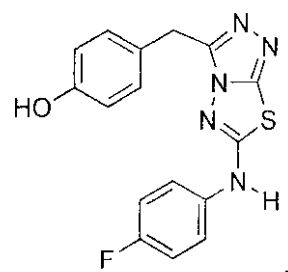
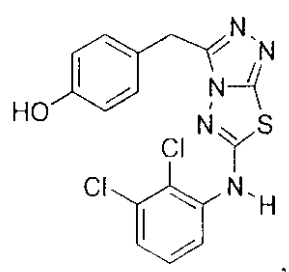
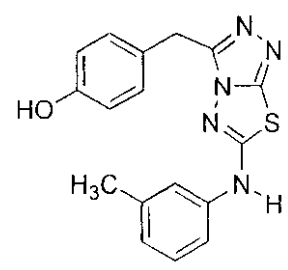
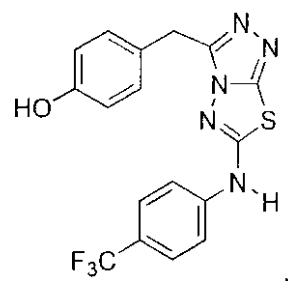
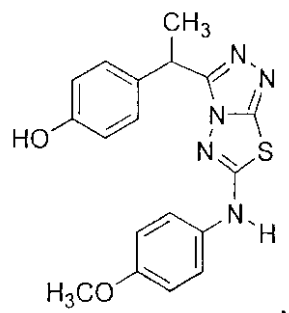
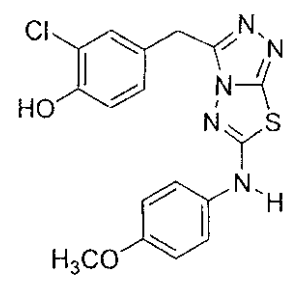
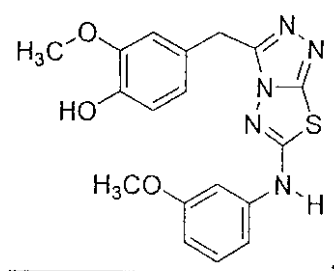
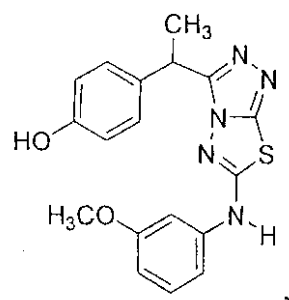
【化 1 4】



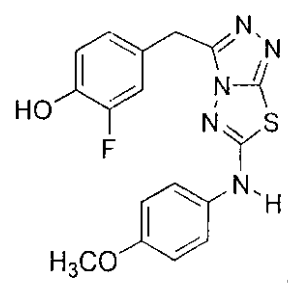
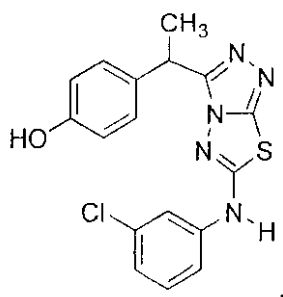
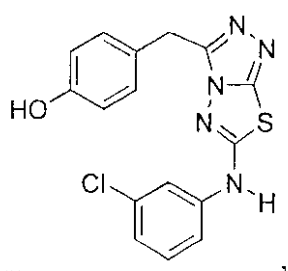
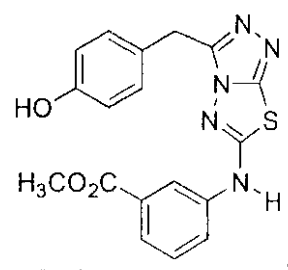
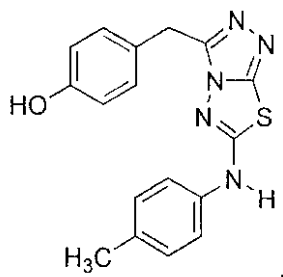
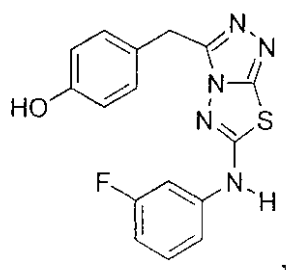
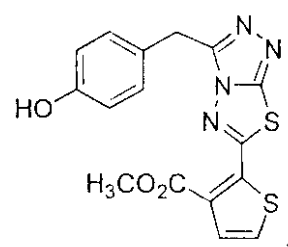
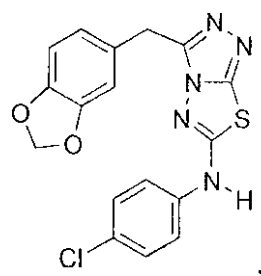
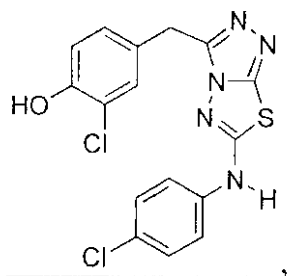
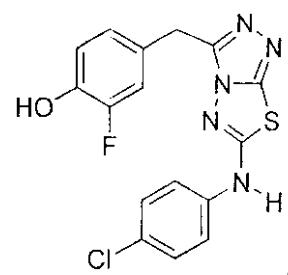
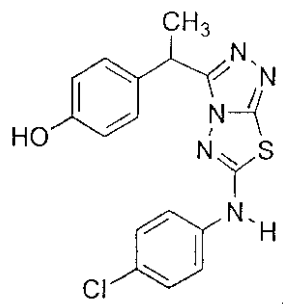
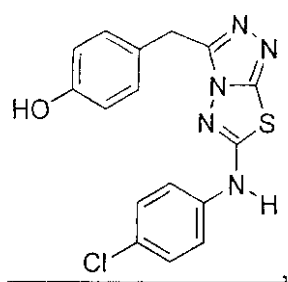
【化 15】



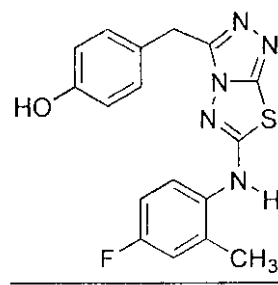
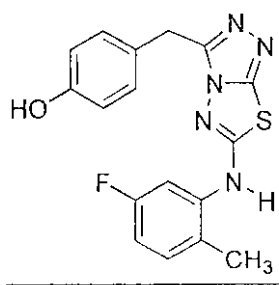
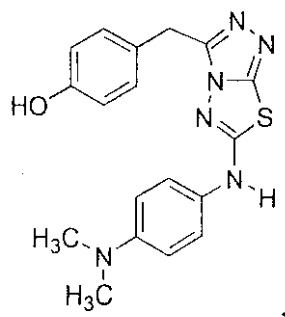
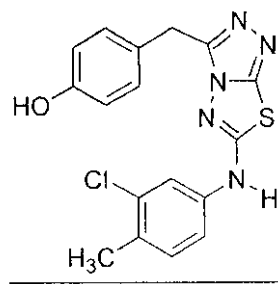
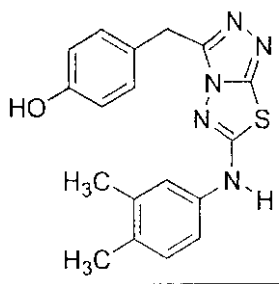
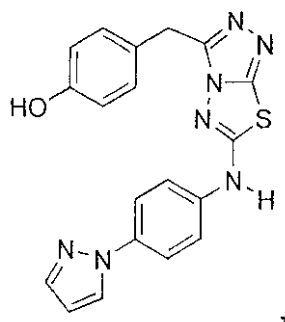
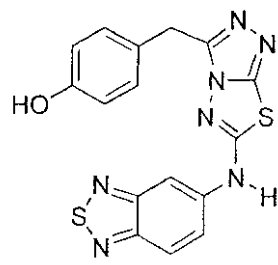
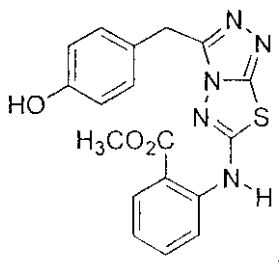
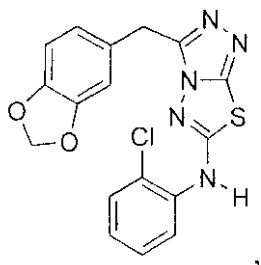
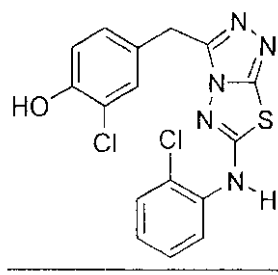
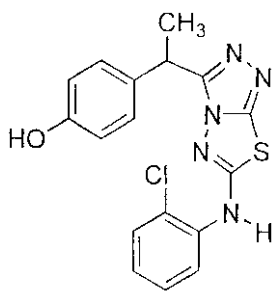
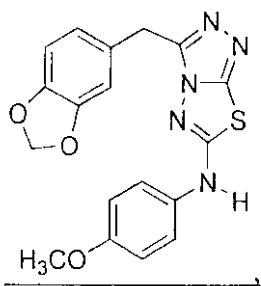
【化 16】



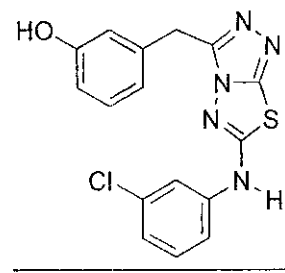
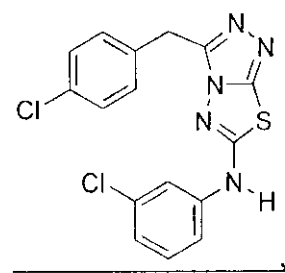
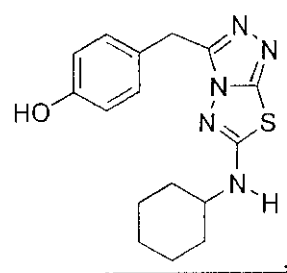
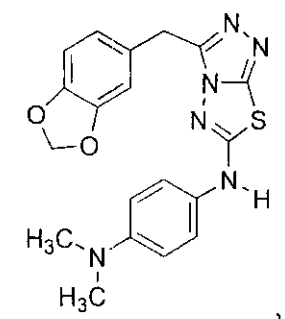
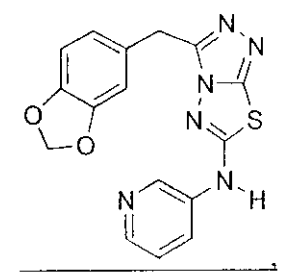
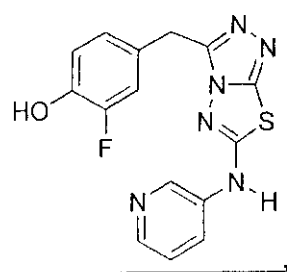
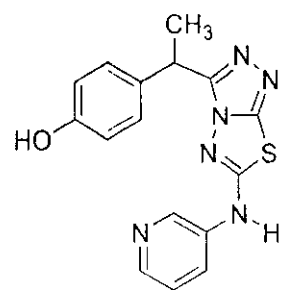
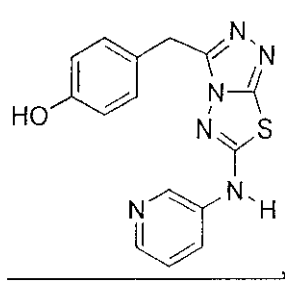
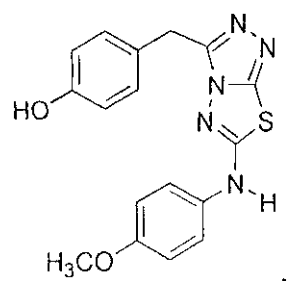
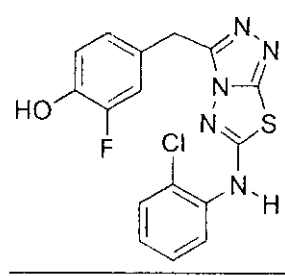
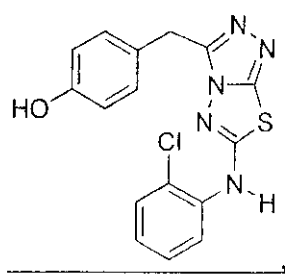
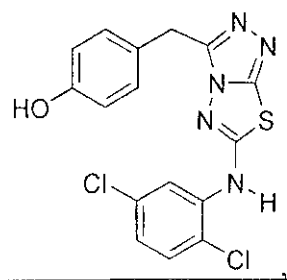
【化 17】



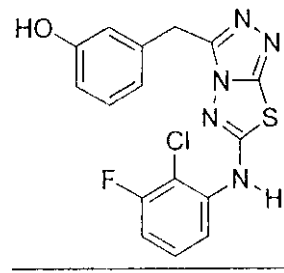
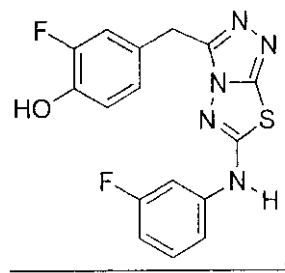
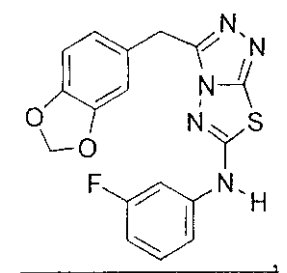
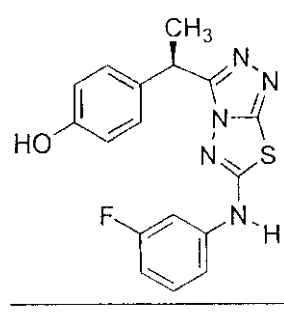
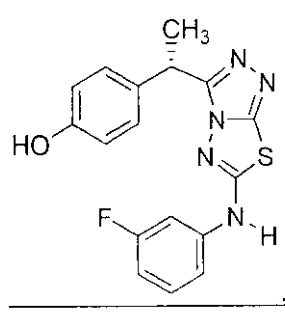
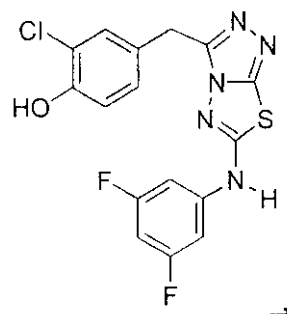
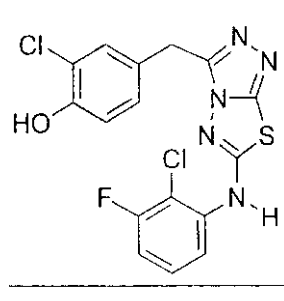
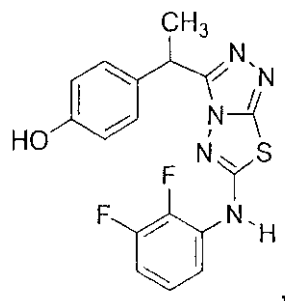
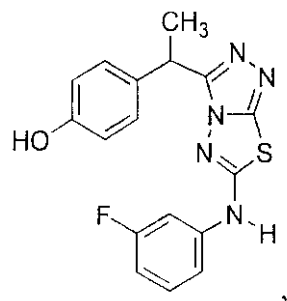
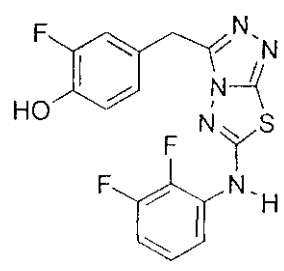
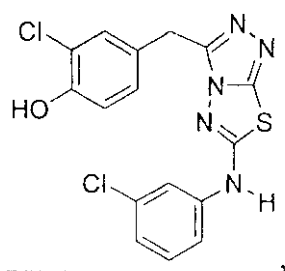
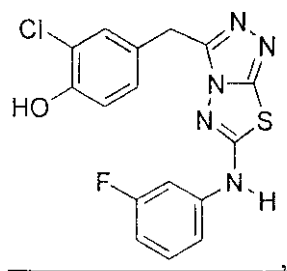
【化 18】



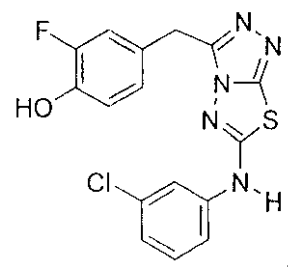
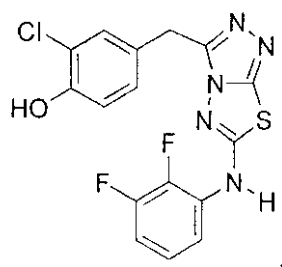
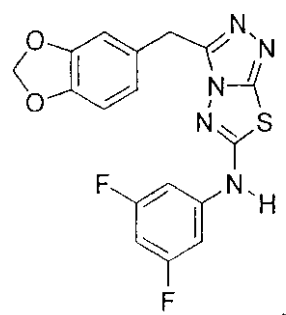
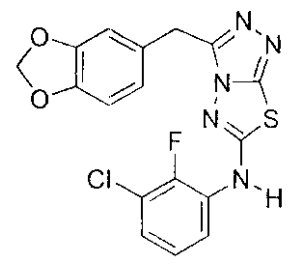
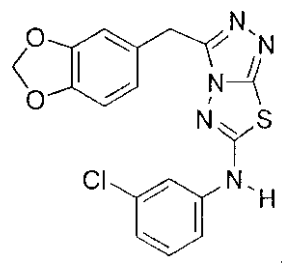
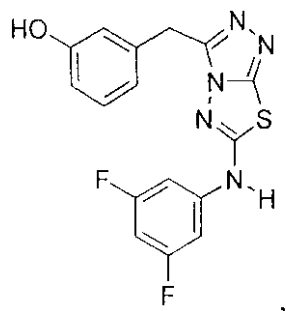
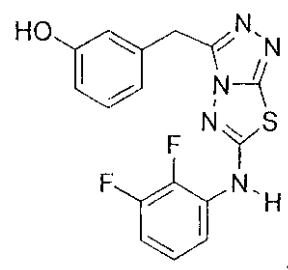
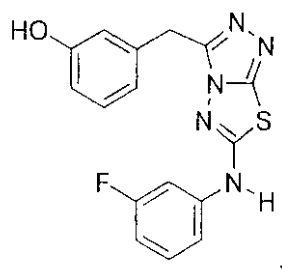
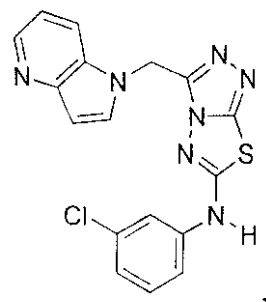
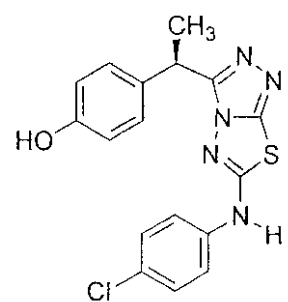
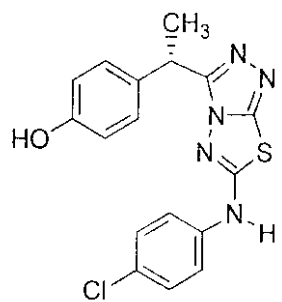
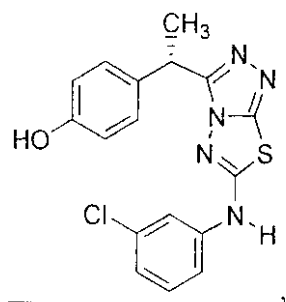
【化 19】



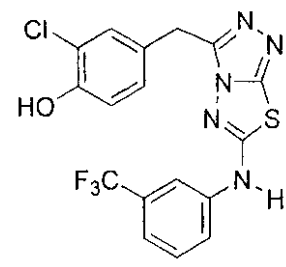
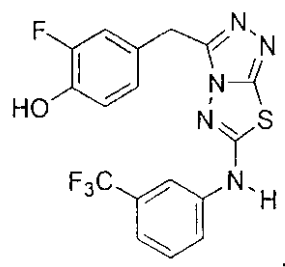
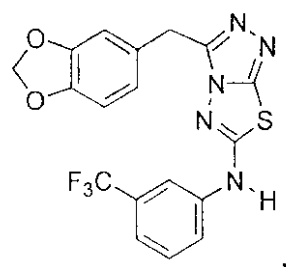
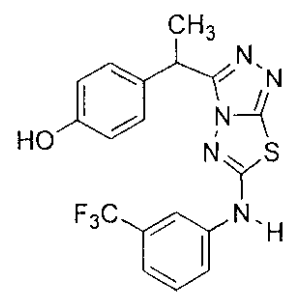
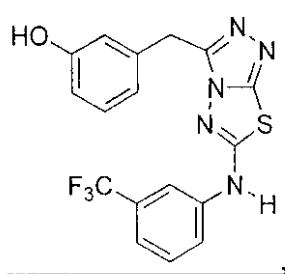
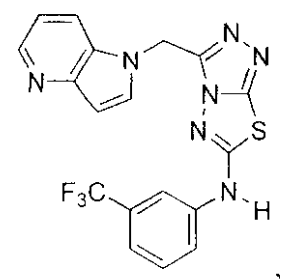
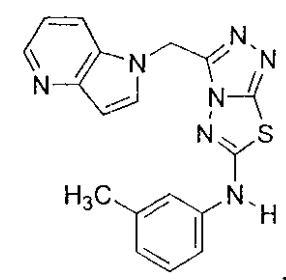
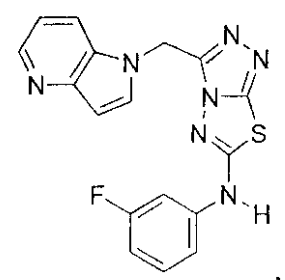
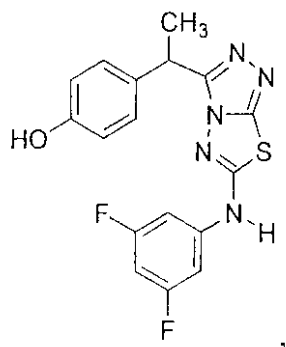
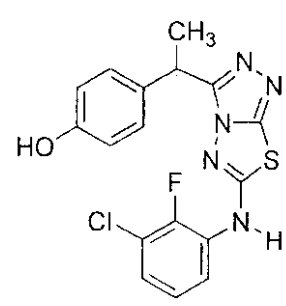
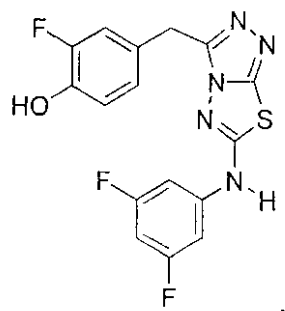
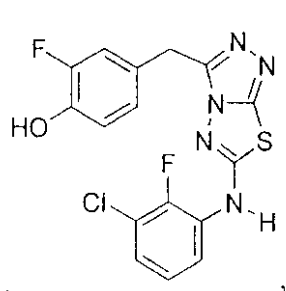
【化 20】



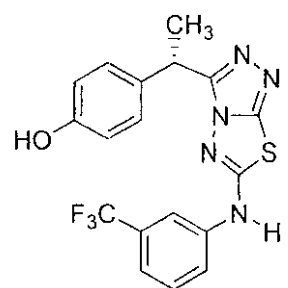
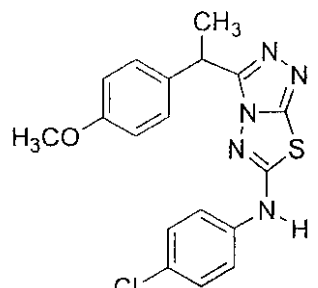
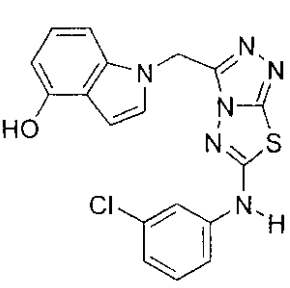
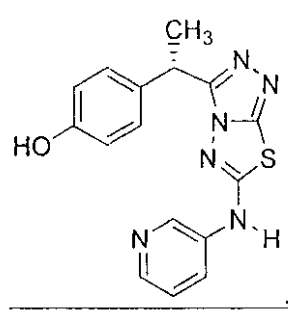
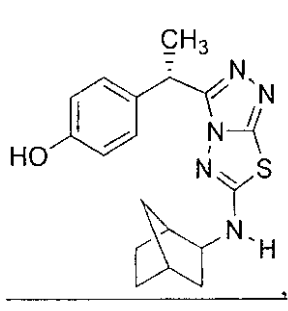
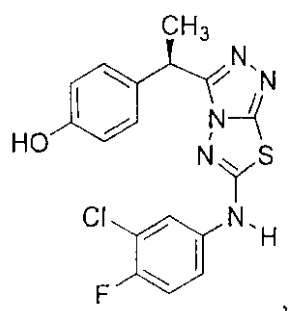
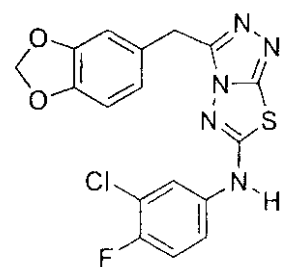
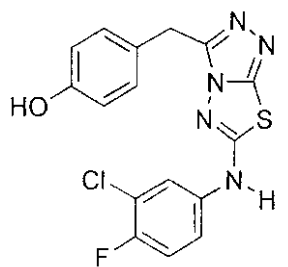
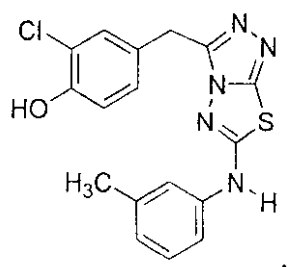
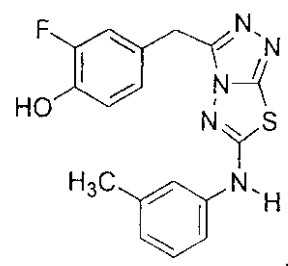
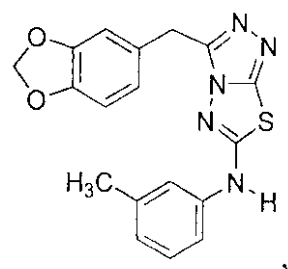
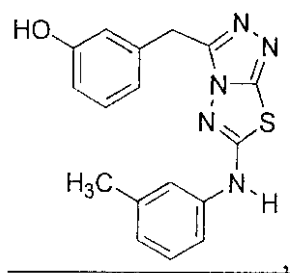
【化 2 1】



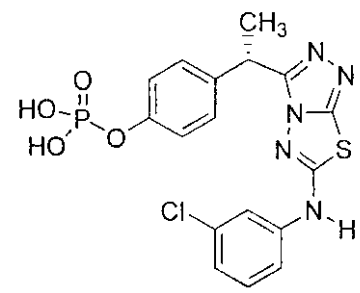
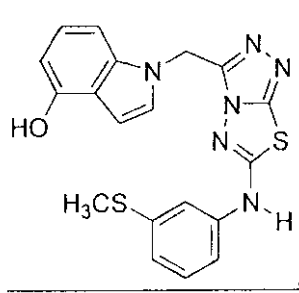
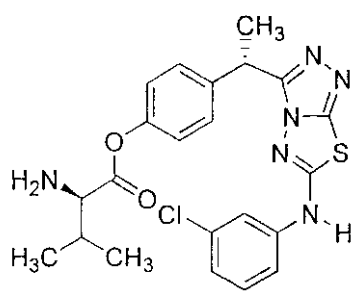
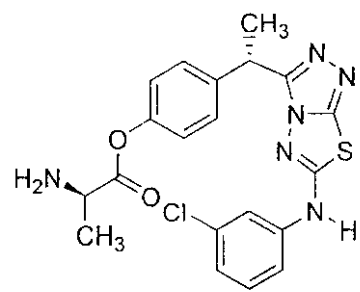
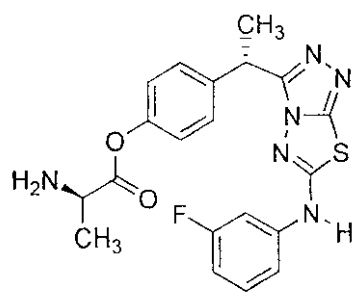
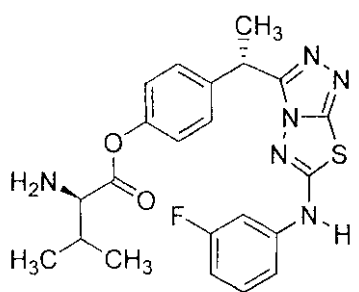
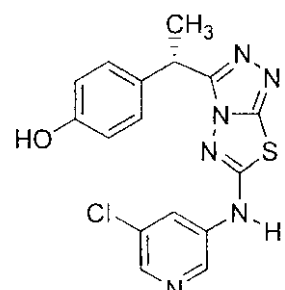
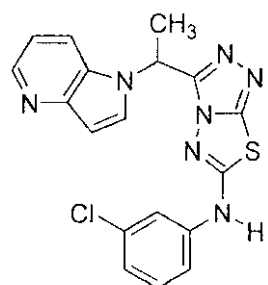
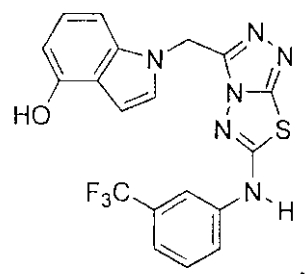
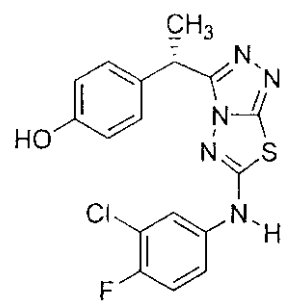
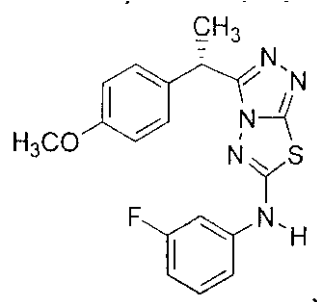
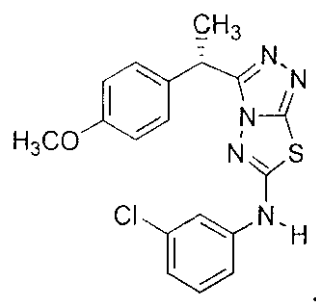
【化 2 2】



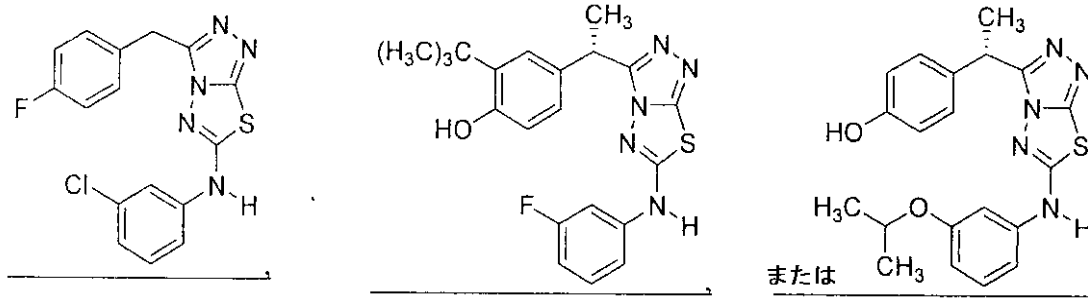
【化 2 3】



【化 2 4】



【化 2 5】



から選ばれる、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

請求項 1 から 7 のいずれか 1 項に記載の化合物及び薬学的に許容できるキャリア、佐剤又はビヒクルを含んでなる、医薬品組成物。

【請求項 9】

患者の転移癌の重症度を治療又は低減するための、請求項 1 から 7 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む組成物または請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 10】

生体試料中の c - M e t キナーゼ活性を生体外で阻害する方法であって、前記生体試料を請求項 1 から 7 のいずれか 1 項に記載の化合物、あるいは請求項 8 に記載の組成物と接触することを含んでなる、方法。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

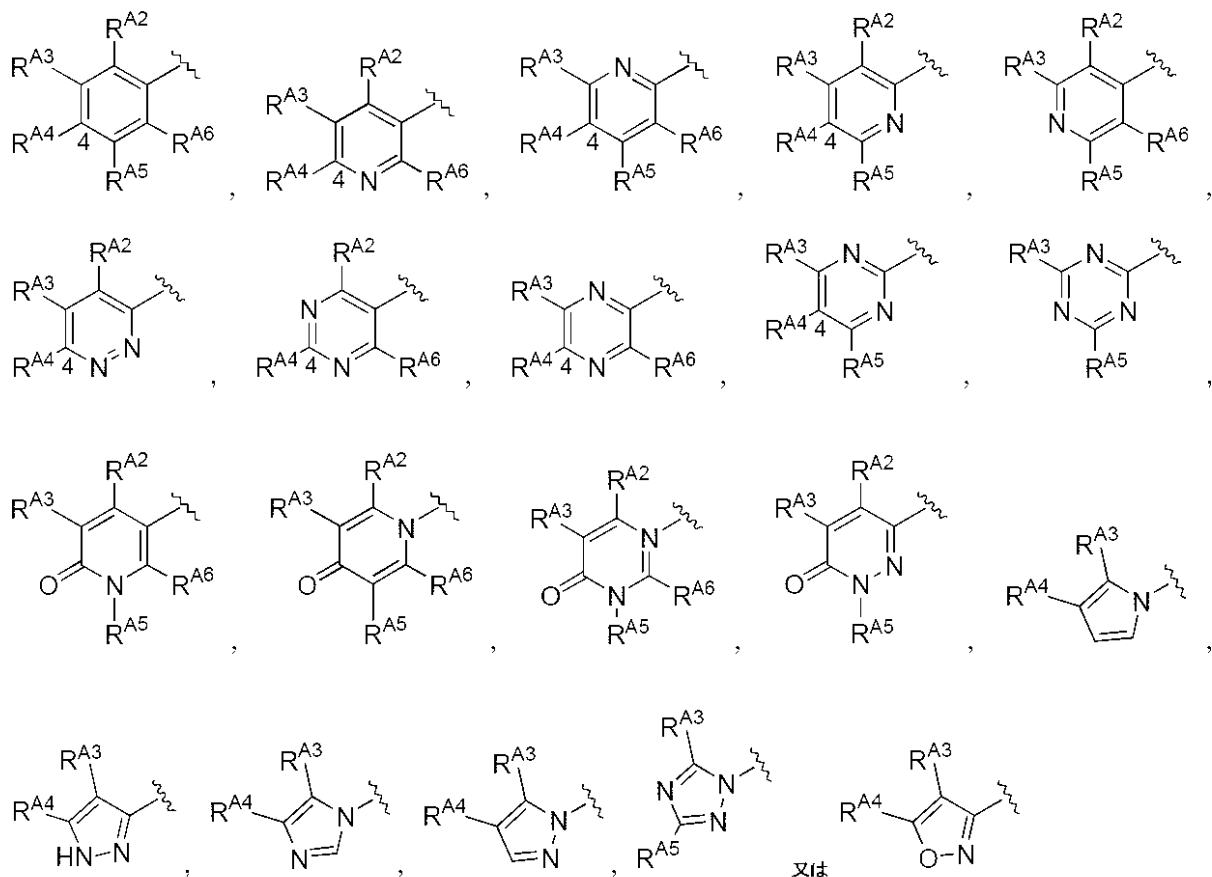
【訂正対象項目名】0 0 3 8

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 3 8】

【化 2 1】



から選ばれ：

式中、 R^{A2} 及び R^{A6} のそれぞれは独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-C(O)OR^{++}$ 、 $-C(O)R^{++}$ 、 $-C(O)N(R^{++})_2$ 、 $-C(S)N(R^{++})_2$ 、 $-C(NH)N(R^{++})_2$ 、 $-OR^{++}$ 、 $-O$ (ハロ (C_{1-4} 脂肪族))、 $-OC(O)N(R^{++})_2$ 、 $-SR^{++}$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{++})_2$ 、 $-N(R^{++})C(O)(R^{++})$ 、 $-N(R^{++})C(O)N(R^{++})_2$ 、 $-N(R^{++})C(O)OR^{++}$ 、 $-N(R^{++})N(R^{++})C(O)R^{++}$ 、 $-N(R^{++})N(R^{++})C(O)N(R^{++})_2$ 、 $-N(R^{++})N(R^{++})C(O)OR^{++}$ 、 $-N(R^{++})S(O)_2N(R^{++})_2$ 、 $-N(R^{++})S(O)_2R^{++}$ 、 $-S(O)_2R^{++}$ 、 $-S(O)_2N(R^{++})_2$ 、 $-S(O)R^{++}$ および C_{1-4} 脂肪族から選ばれ、当該 C_{1-4} 脂肪族は適宜、ハロゲン、 $-OR^{++}$ 、 $-SR^{++}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N(R^{++})_2$ 、又は $-N(R^{++})C(O)(R^{++})$ から独立して選ばれる置換基で置換され；

R^{A3} は R^{Ar} であり；又は R^{A3} 、 R^{A4} 及びそれらが結合する炭素は、4 個以下の R^{Ar} の独立した存在で適宜置換される 6 員アリール環、あるいは少なくとも 1 の O、N、又は S を含む 5 - 6 員ヘテロシクリル又はヘテロアリール環を形成し、前記ヘテロシクリル又はヘテロアリール環は 3 個以下の R^{Ar} の独立した存在で適宜置換され；

R^{A4} は $-OH$ 、 $-B(OR^*)_2$ 、 $-SR^*$ 、 $-N(R^*)_2$ 、 $-N(R^*)C(O)R^*$ 、 $-N(R^*)C(O)N(R^*)_2$ 、 $-N(R^*)C(O)OR^*$ 、 $-N(R^*)N(R^*)C(O)R^*$ 、 $-N(R^*)N(R^*)C(O)N(R^*)_2$ 、 $-N(R^*)N(R^*)C(O)OR^*$ 、 $-N(R^*)S(O)_2N(R^*)_2$ 、 $-N(R^*)S(O)_2R^*$ 、 $-C(O)OR^*$ 、 $-C(O)N(R^*)_2$ であり；

R^{A5} は水素又は R^{Ar} であり；

L^B は、 R^B と L^B が結合する炭素との間の共有結合であるか、又はハロゲン、 C_{1-4} 脂肪族、ハロ (C_{1-4} 脂肪族)、 $-OR^{++}$ 、 $-O$ (ハロ (C_{1-4} 脂肪族))、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)OR^{++}$ 、 $-C(O)N(R^{++})_2$ 、又は $-N(R^{++})$

$_2$ から独立して選ばれる 5 基以下で適宜置換される飽和又は不飽和 C_{1-4} アルキレン鎖であり、前記アルキレン鎖の 2 以下の飽和炭素は、適宜、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)N(R^{++})-$ 、 $-C(O)N(R^{++})N(R^{++})-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-N(R^{++})-$ 、 $-N(R^{++})C(O)-$ 、 $-N(R^{++})C(O)O-$ 、 $-N(R^{++})S(O)_2-$ 、 $-N(R^{++})C(O)N(R^{++})-$ 、 $-N(R^{++})N(R^{++})-$ 、 $-O-$ 、 $-OC(O)-$ 、 $-OC(O)N(R^{++})-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、又は $-S(O)_2N(R^{++})-$ で入れ替わり；

R^B はハロゲン、 NH_2 、適宜 R で置換された C_{1-8} 脂肪族基；6 - 10 員アリール環；3 - 7 員炭素環式環、窒素、酸素及び硫黄から独立して選ばれる 1 - 4 ヘテロ原子を有する 5 - 10 員ヘテロアリール環；又は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選ばれる 1 - 4 ヘテロ原子を有する 3 - 10 員ヘテロシクリル環であり、前記アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリル環の各々は適宜、5 以下の R^A の独立した存在で置換され；

R^C はそれぞれ独立して、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 R^{++} 、又は $-O(C_{1-4}$ 脂肪族) であり；

R はハロゲン、 $-R^O$ 、 $-OR^O$ 、 $-SR^O$ 、 $-OC(O)(C_{1-8}$ 脂肪族)、適宜 R^O で置換された Ph、適宜 R^O で置換された $-O(Ph)$ 、適宜 R^O で置換された $-CH_2(Ph)$ 、適宜 R^O で置換された $-CH_2CH_2(Ph)$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N(R^O)_2$ 、 $-NR^OC(O)R^O$ 、 $-NR^OC(O)N(R^O)_2$ 、 $-NR^OC(O)OR^O$ 、 $-NR^ONR^OC(O)R^O$ 、 $-NR^ONR^OC(O)N(R^O)_2$ 、 $-NR^ONR^OC(O)OR^O$ 、 $-C(O)C(O)R^O$ 、 $-C(O)CH_2C(O)R^O$ 、 $-C(O)OR^O$ 、 $-C(O)R^O$ 、 $-C(O)N(R^O)_2$ 、 $-OC(O)N(R^O)_2$ 、 $-S(O)_2R^O$ 、 $-S(O)_2N(R^O)_2$ 、 $-S(O)R^O$ 、 $-NR^OS(O)_2N(R^O)_2$ 、 $-NR^OS(O)_2R^O$ 、 $-C(=S)N(R^O)_2$ 、 $-C(=NH)N(R^O)_2$ 、又は $-(CH_2)_yNHC(O)R^O$ であり、y は 1 から 4 であり；あるいは同一炭素原子上に共に存在する 2 個の R は、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=NNHR^*$ 、 $=NN(R^*)_2$ 、 $=NNHC(O)R^*$ 、 $=NNHC(O)O(C_{1-8}$ 脂肪族)、 $=NNHS(O)_2(C_{1-8}$ 脂肪族)、又は $=NR^*$ であり；

R^A はそれぞれ独立して、ハロゲン、 $-R^O$ 、 $-OR^O$ 、 $-SR^O$ 、 $-OC(O)(C_{1-8}$ 脂肪族)、適宜 5 個までの $-R^O$ で置換された Ph、適宜 5 個までの $-R^O$ で置換された $-CH_2(Ph)$ 、適宜 5 個までの $-R^O$ で置換された $-(CH_2)_y(Ph)$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N(R^O)_2$ 、 $-NR^OC(O)R^O$ 、 $-NR^OC(O)N(R^O)_2$ 、 $-NR^OC(O)OR^O$ 、 $-NR^ONR^OC(O)R^O$ 、 $-NR^ONR^OC(O)N(R^O)_2$ 、 $-NR^ONR^OC(O)OR^O$ 、 $-C(O)CH_2C(O)R^O$ 、 $-C(O)OR^O$ 、 $-C(O)R^O$ 、 $-C(O)N(R^O)_2$ 、 $-OC(O)N(R^O)_2$ 、 $-S(O)_2R^O$ 、 $-S(O)_2N(R^O)_2$ 、 $-S(O)R^O$ 、 $-NR^OS(O)_2N(R^O)_2$ 、 $-NR^OS(O)_2R^O$ 、 $-C(S)N(R^O)_2$ 、 $-C(NH)N(R^O)_2$ 、及び $-(CH_2)_yNHC(O)R^O$ から選ばれ、y は 1 から 4 であり；あるいは、2 個の隣接する R^A 基は一緒になって 1, 2 - メチレンジオキシ又は 1, 2 - エチレンジオキシであり；

R^{++} はそれぞれ独立して水素又は C_{1-4} 脂肪族であり；

R^* はそれぞれ独立して、水素又は適宜 5 個までの $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-4}$ 脂肪族)、 $-N(C_{1-4}$ 脂肪族) $_2$ 、ハロゲン、 C_{1-4} 脂肪族、 $-OH$ 、 $-O(C_{1-4}$ 脂肪族)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)O(C_{1-4}$ 脂肪族)、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(O)NH(C_{1-4}$ 脂肪族)、 $-C(O)N(C_{1-4}$ 脂肪族) $_2$ 、 $-O(ハロ(C_{1-4}$ 脂肪族))、もしくはハロ(C_{1-4} 脂肪族)の独立した存在で置換される C_{1-8} 脂肪族であり；あるいは、同一の窒素上の 2 個の R^* は当該窒素と共に、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選ばれるヘテロ原子を 1 - 3 個有する 5 - 8 員ヘテロシクリル又はヘテロアリール環を形成し；

R^O はそれぞれ独立に、水素、適宜置換された C_{1-6} 脂肪族、非置換 5 - 6 員ヘテロ

アリール又はヘテロシクリル環、 $-Ph$ 、又は $-O(Ph)$ であり、ここで前記適宜置換された R^O の脂肪族のそれぞれの置換基は、独立して、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-4}\text{脂肪族})$ 、 $-N(C_{1-4}\text{脂肪族})_2$ 、ハロゲン、 $C_{1-4}\text{脂肪族}$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_{1-4}\text{脂肪族})$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)O(C_{1-4}\text{脂肪族})$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(O)NH(C_{1-4}\text{脂肪族})$ 、 $-C(O)N(C_{1-4}\text{脂肪族})_2$ 、 $-O(\text{ハロ}(C_{1-4}\text{脂肪族}))$ 、又は $\text{ハロ}(C_{1-4}\text{脂肪族})$ であり；あるいは、同一の窒素上の2個の R^O は当該窒素と共に、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選ばれるヘテロ原子を1 - 3個有する5 - 8員ヘテロシクリル又はヘテロアリール環を形成し；
 ただし、 $L^A R^A$ が $-S-CH_2-$ ピリジルであるときに、 $L^B R^B$ は $-S-CH_2-$ ピリジルではない。