

【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

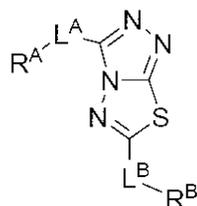
【訂正の内容】

【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：

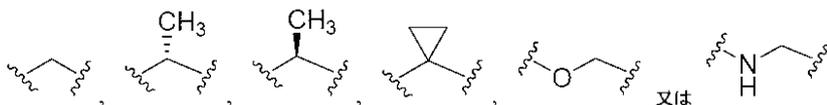
## 【化3】



(I-a)

式中、L<sup>A</sup>は次式

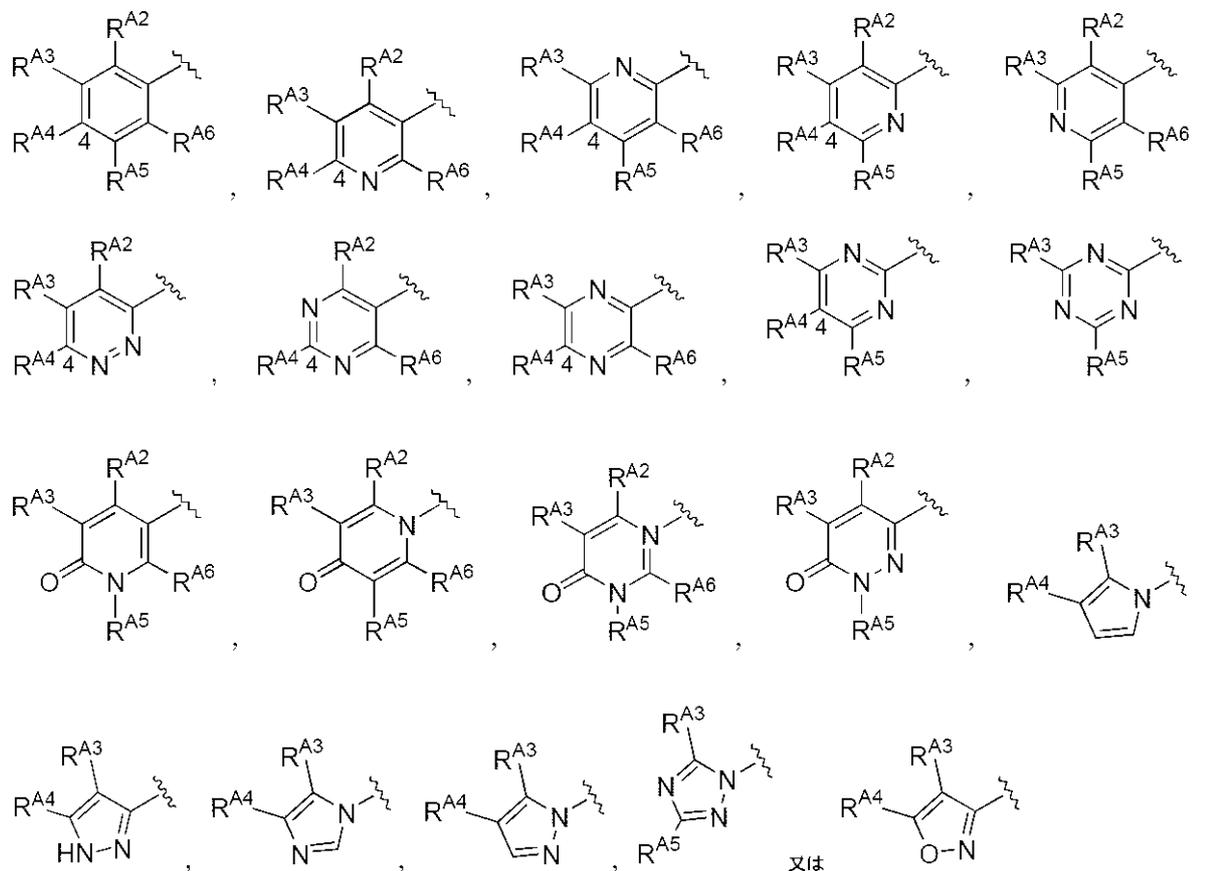
## 【化7】



から選ばれ；

R<sup>A</sup>は次式から選ばれ

## 【化2】



式中、R<sup>A2</sup>及びR<sup>A6</sup>のそれぞれは独立して、水素、ハロゲン、-CN、-C(O)OR<sup>+</sup>、-C(O)R<sup>+</sup>、-C(O)N(R<sup>+</sup>)<sub>2</sub>、-C(S)N(R<sup>+</sup>)<sub>2</sub>、-C(NH)N(R<sup>+</sup>)<sub>2</sub>、-OR<sup>+</sup>、-O(ハロ(C<sub>1-4</sub>脂肪族))、-OC(O)N(R<sup>+</sup>)<sub>2</sub>、-SR<sup>+</sup>、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>+</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>+</sup>)C(O)(R<sup>+</sup>)、-N(R<sup>+</sup>)C(O)N(R<sup>+</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>+</sup>)C(O)OR<sup>+</sup>、-N(R<sup>+</sup>)N(R<sup>+</sup>)C(O)R<sup>+</sup>、-N(R<sup>+</sup>)N(R<sup>+</sup>)C(O)N(R<sup>+</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>+</sup>)N(R<sup>+</sup>)C(O)OR<sup>+</sup>、-N(R<sup>+</sup>)S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>+</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>+</sup>)S(O)<sub>2</sub>R<sup>+</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>+</sup>、-S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>+</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)R<sup>+</sup>およびC<sub>1-4</sub>脂肪族から選ばれ、当該C<sub>1-4</sub>

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 $R^A$ 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 $R^A$ の独立した存在で適宜置換される6員アリアル、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アル環を形成し、前記ヘテロシクリル又はヘテロアリアル環は3個以下の $R^A$ 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 $R^A$ 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員アリアル環；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員ヘテロアリアル環；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、前記アリアル、ヘテロアリアル、又はヘテロシクリル環はそれぞれ適宜5以下の $R^A$ の独立した存在で置換され；

$R$ はハロゲン、 $-R^0$ 、 $-OR^0$ 、 $-SR^0$ 、 $-OC(O)(C_{1-8}$ 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 $-CH_2CH_2(Ph)$ 、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、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=NNHR^*$ 、 $=NN(R^*)_2$ 、 $=NNHC(O)R^*$ 、 $=NNHC(O)O(C_{1-8}$ 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、 $-R^0$ 、 $-OR^0$ 、 $-SR^0$ 、 $-OC(O)(C_{1-8}$ 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 $R^A$ 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

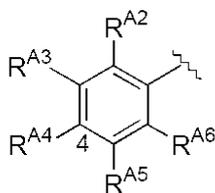
置換される  $C_{1-8}$  脂肪族であり；あるいは、同一の窒素上の 2 個の  $R^*$  は当該窒素と共に、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選ばれるヘテロ原子を 1 - 3 個有する 5 - 8 員ヘテロシクリル又はヘテロアリール環を形成し；

$R^0$  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  $R^0$  の脂肪族のそれぞれの置換基は、独立して、-  $NH_2$ 、-  $NH$  (  $C_{1-4}$  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 ) )、又はハロ (  $C_{1-4}$  脂肪族 ) であり；あるいは、同一の窒素上の 2 個の  $R^0$  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。

【請求項 2】

$R^A$  は次式

【化 8】



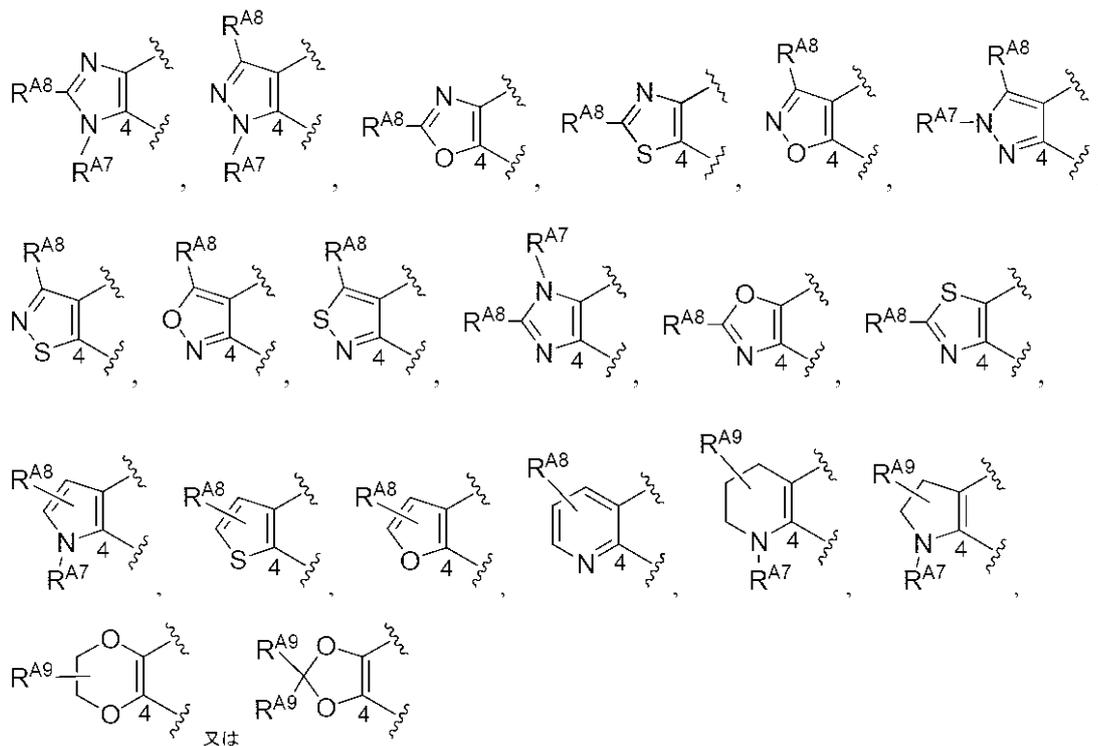
であり、

$R^{A4}$  は OH である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

$R^{A3}$ 、 $R^{A4}$  及びこれらが結合する炭素は次式

【化 9】



から選ばれるヘテロシクリル又はヘテロアリール環を形成し；

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

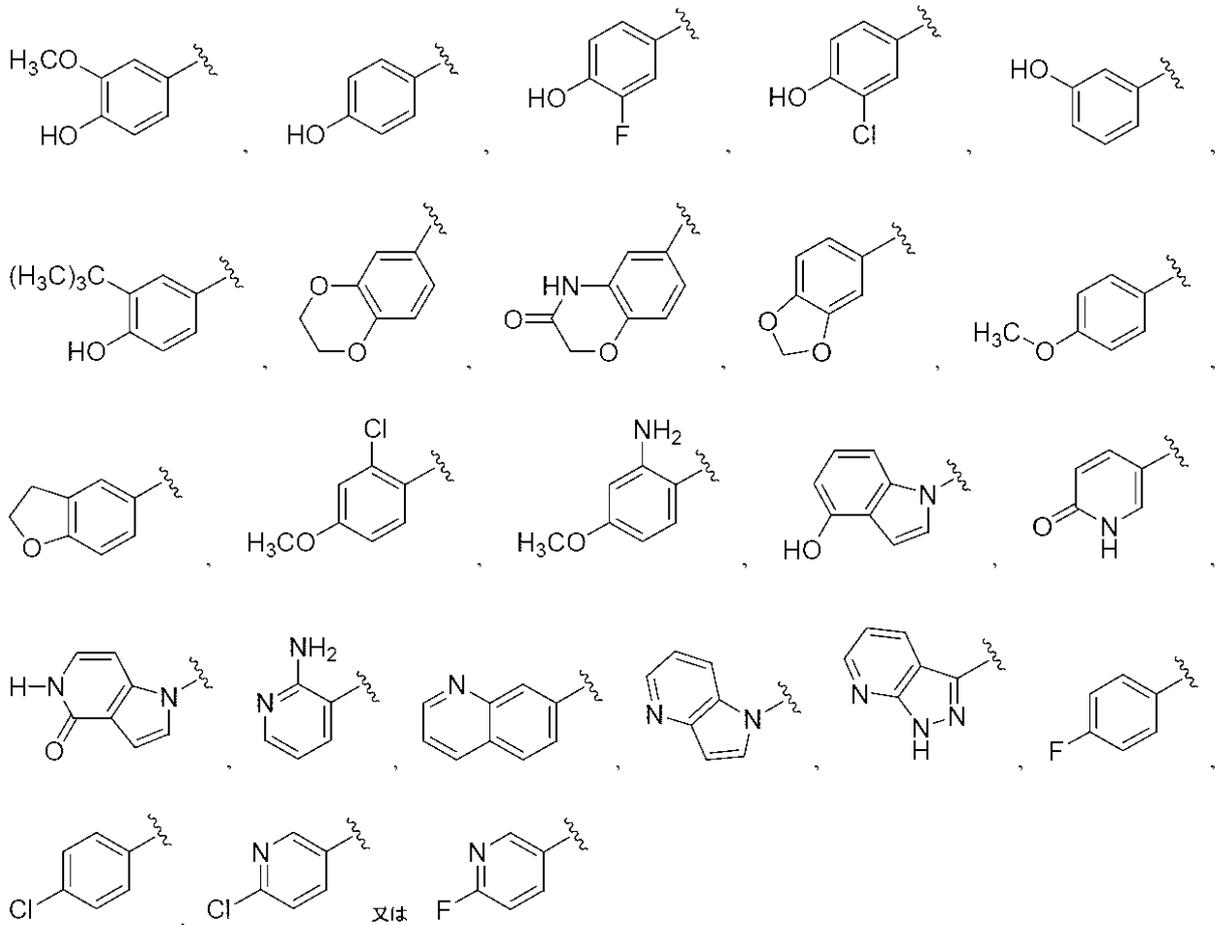
$R^{A9}$ のそれぞれは、水素であり；

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】

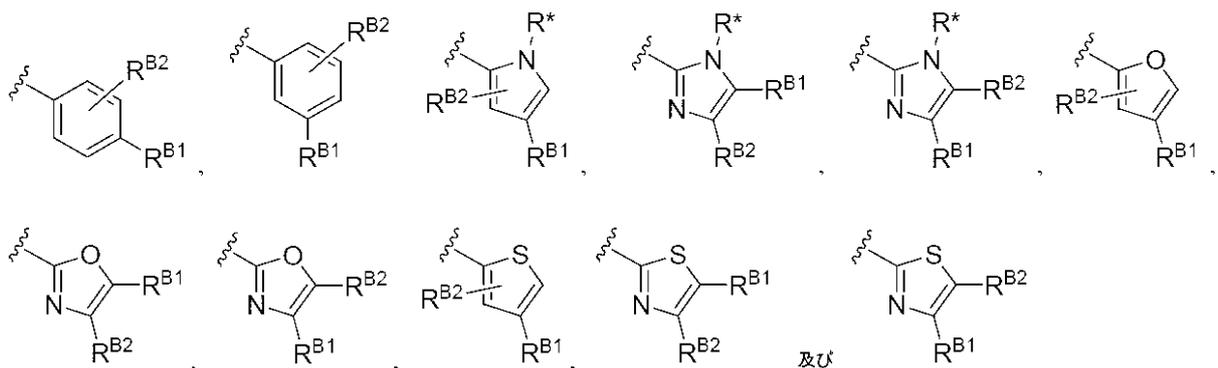


から選ばれる、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

$R^B$ は次式

【化12】



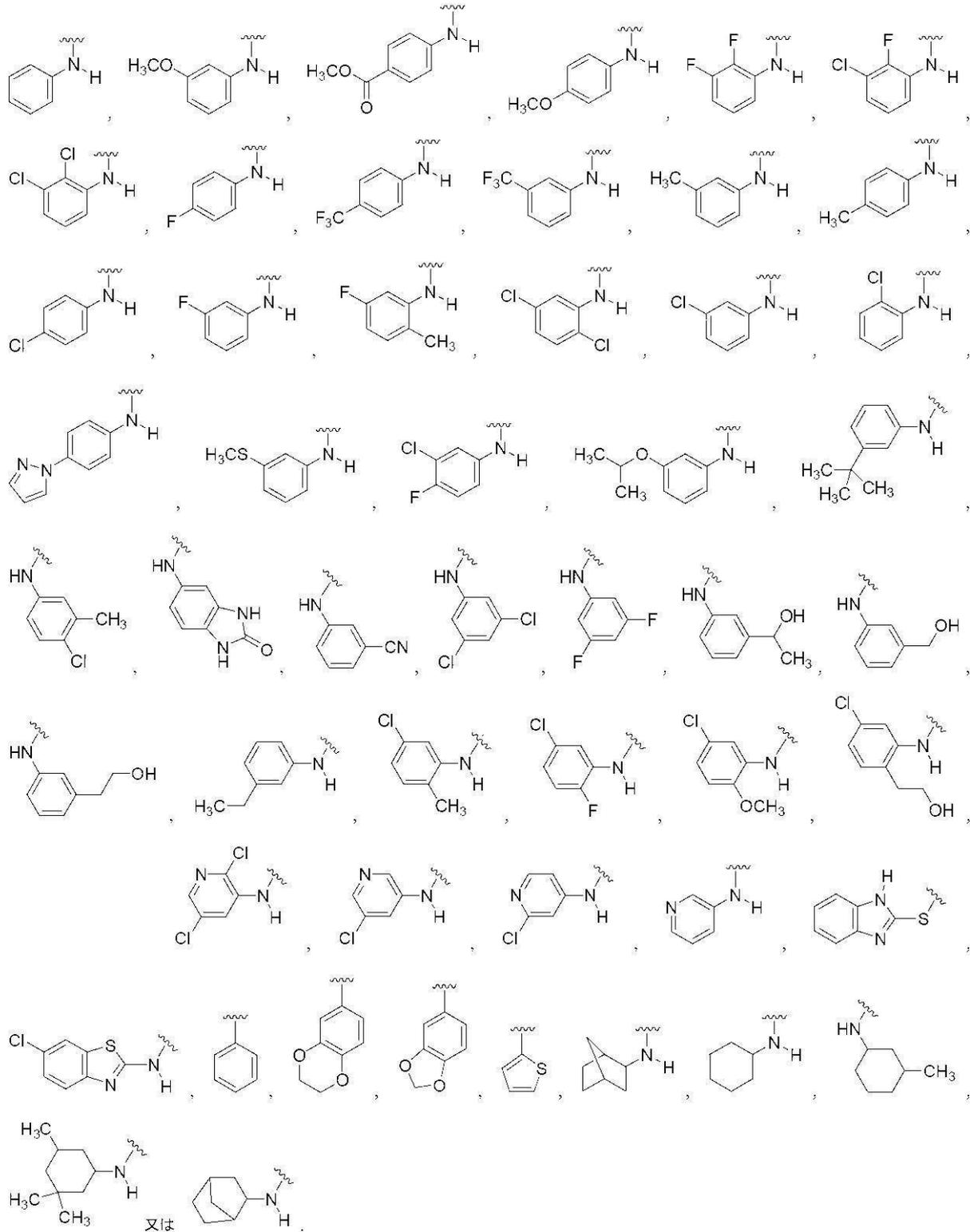
から選ばれ、

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

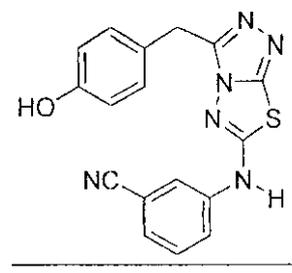
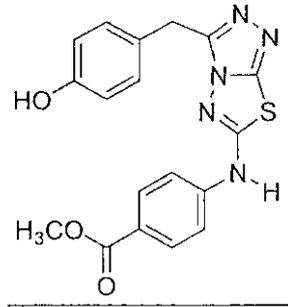
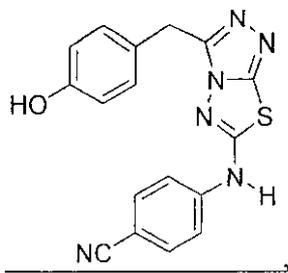
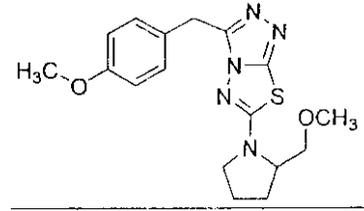
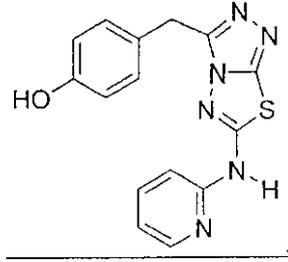
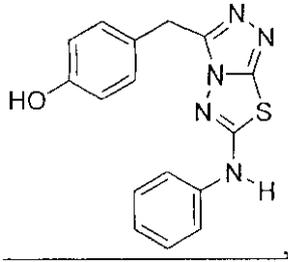
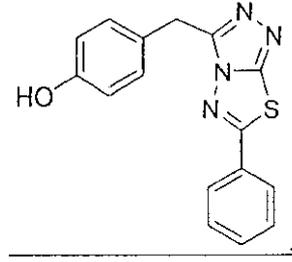
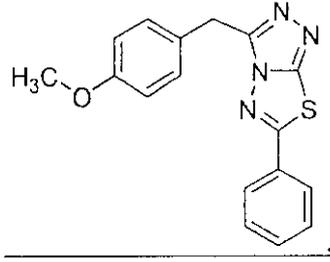
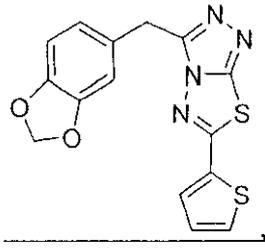
【化 13】



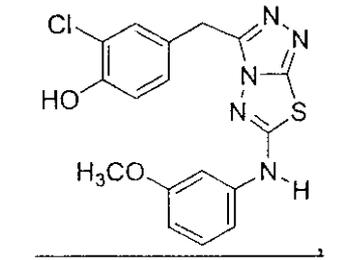
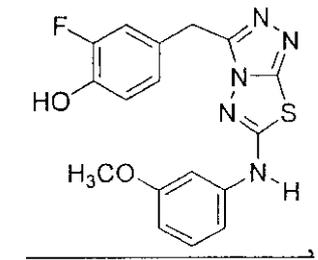
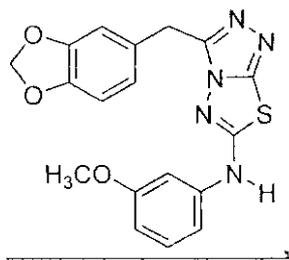
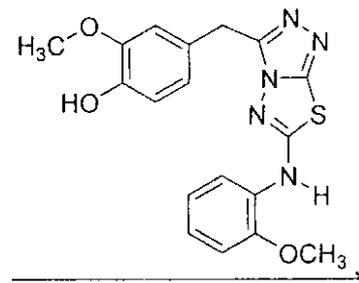
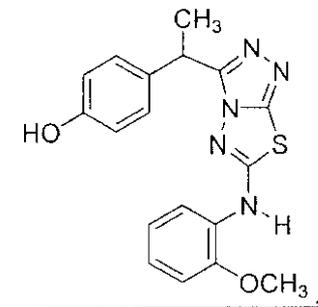
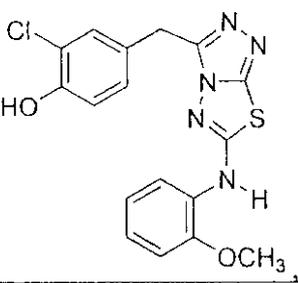
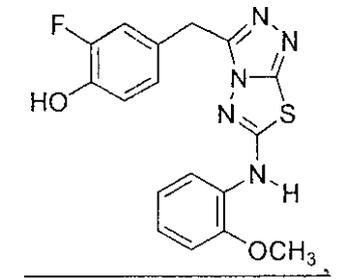
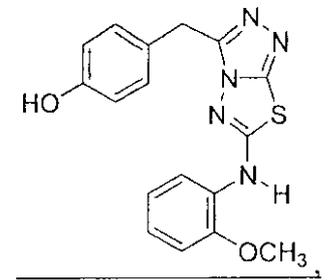
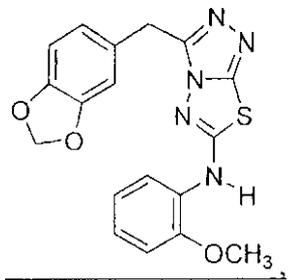
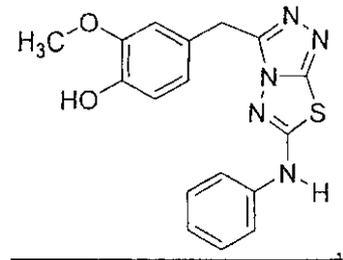
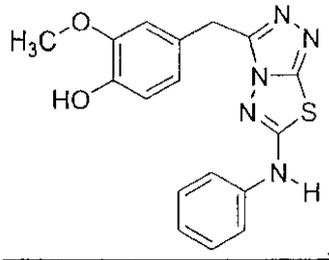
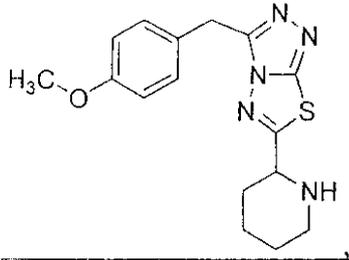
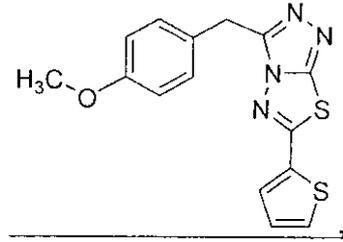
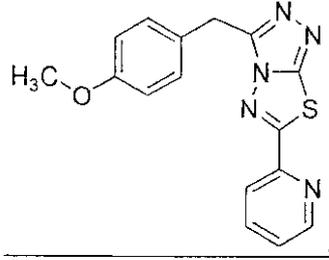
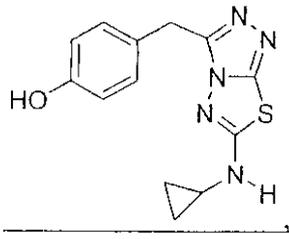
から選ばれる、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

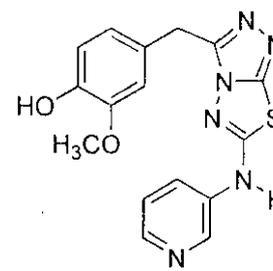
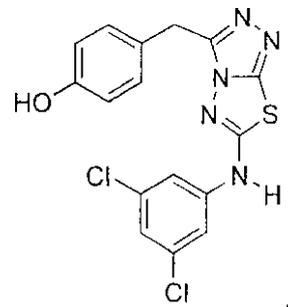
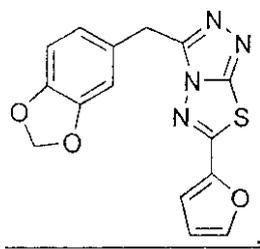
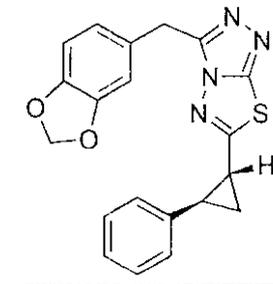
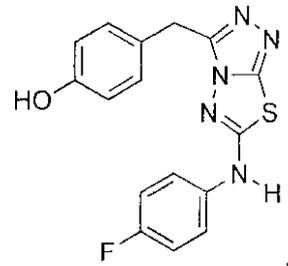
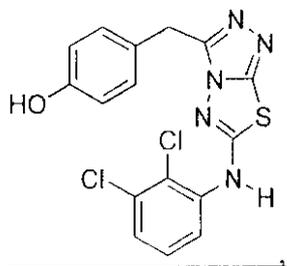
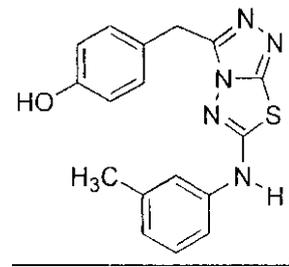
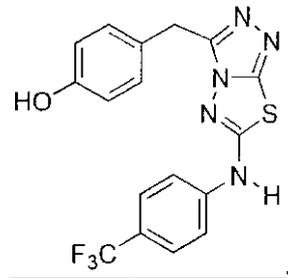
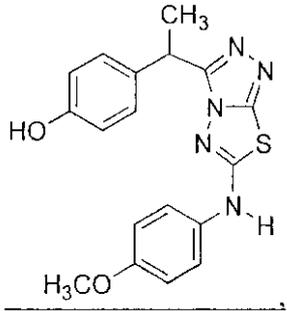
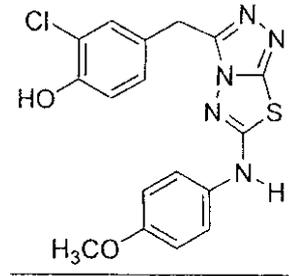
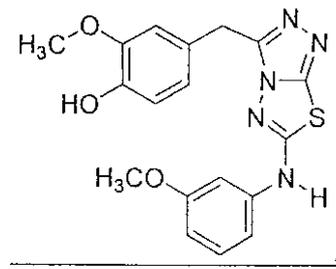
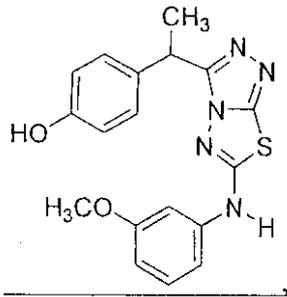
## 【化 1 4】



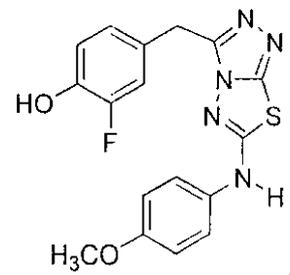
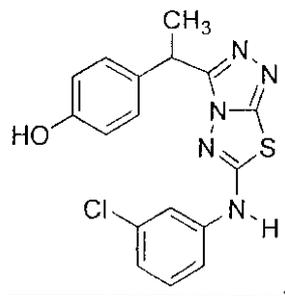
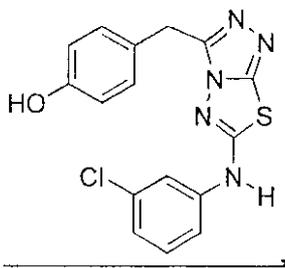
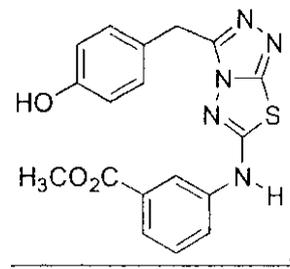
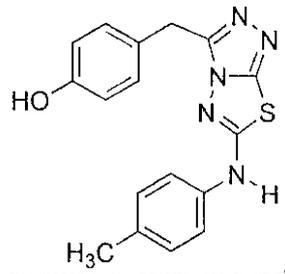
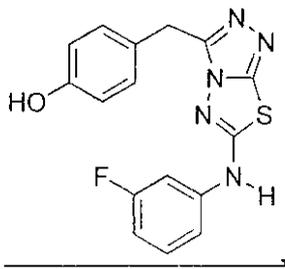
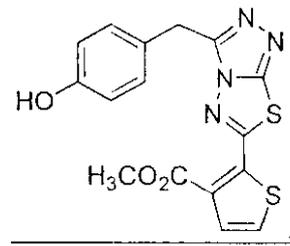
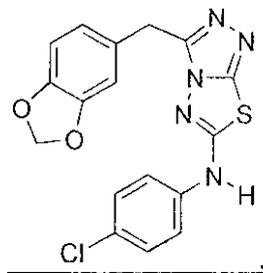
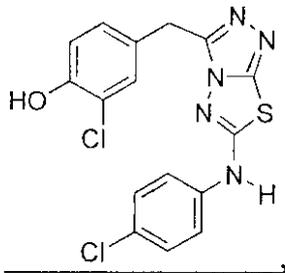
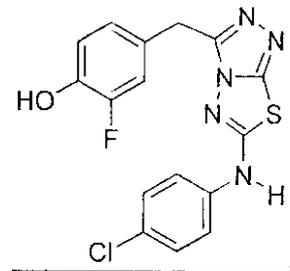
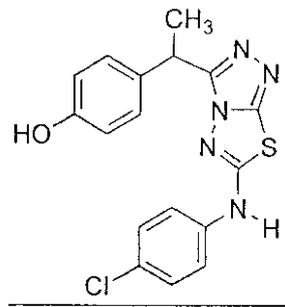
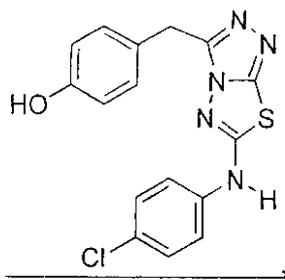
## 【化 15】



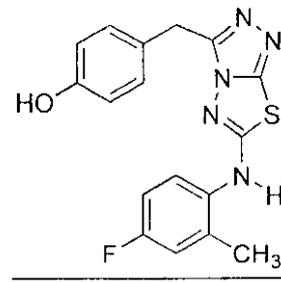
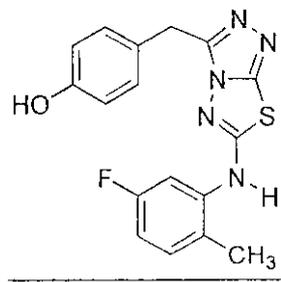
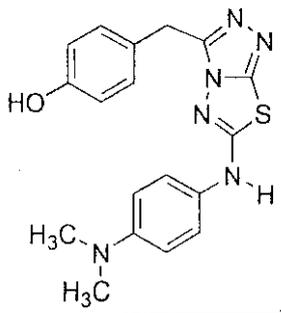
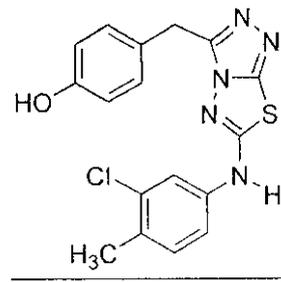
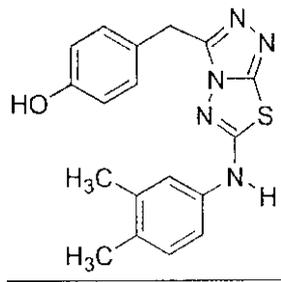
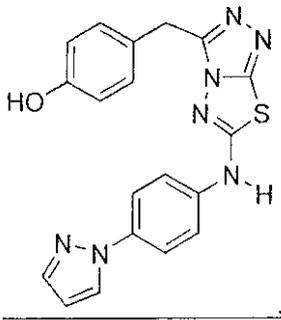
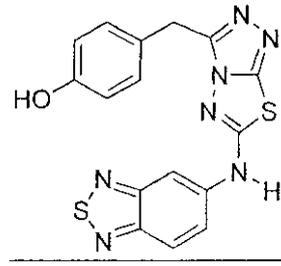
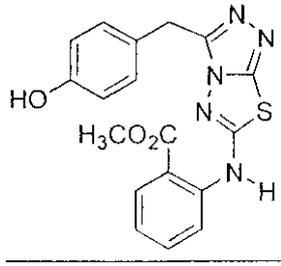
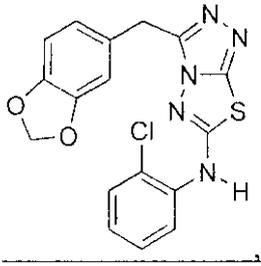
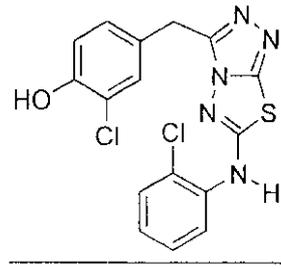
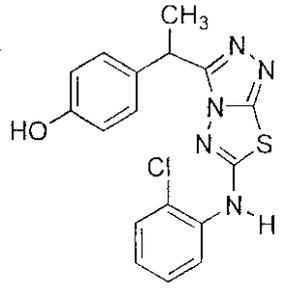
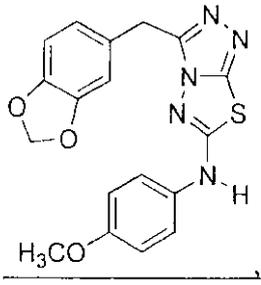
【化 1 6】



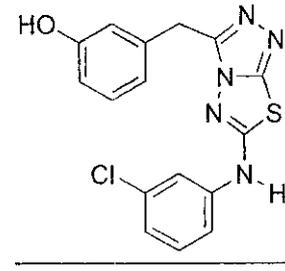
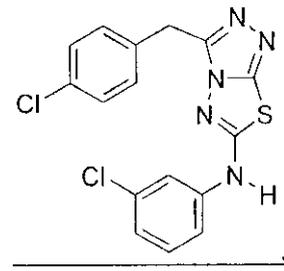
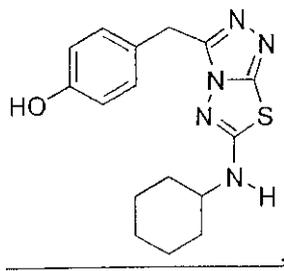
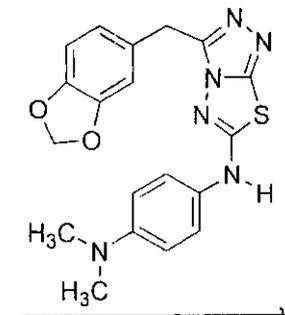
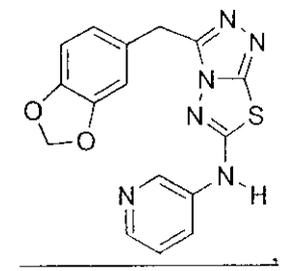
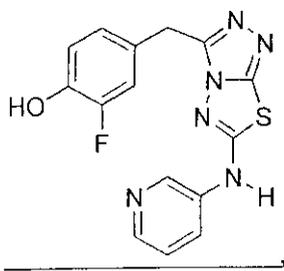
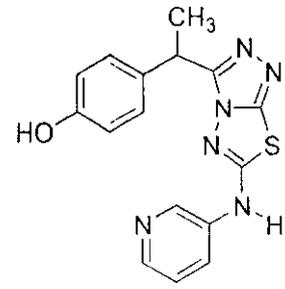
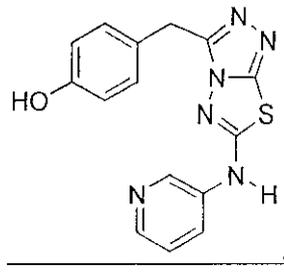
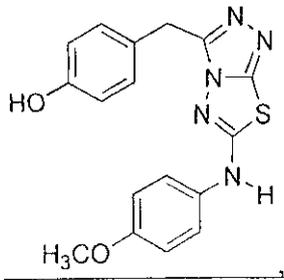
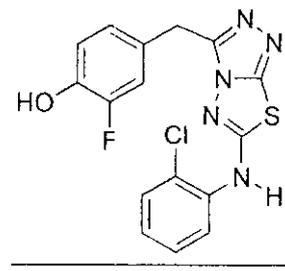
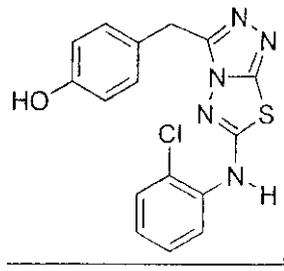
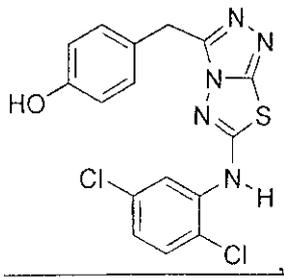
【化 17】



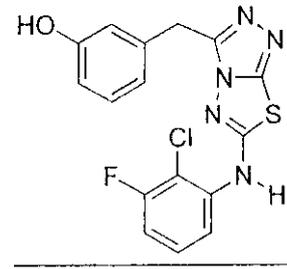
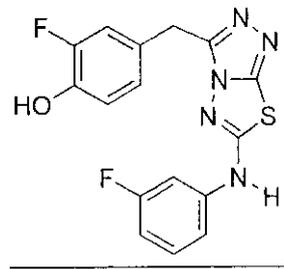
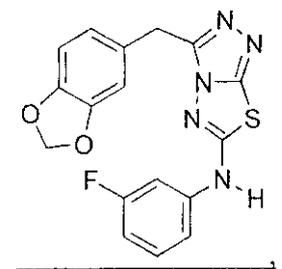
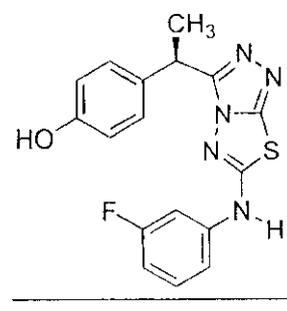
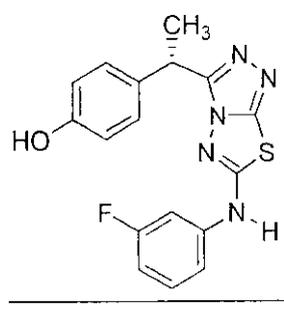
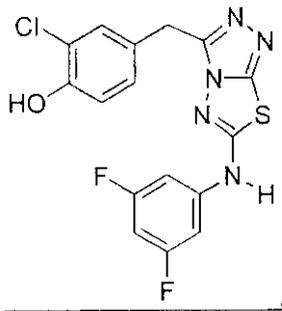
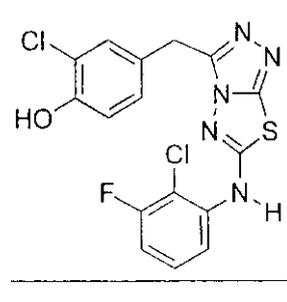
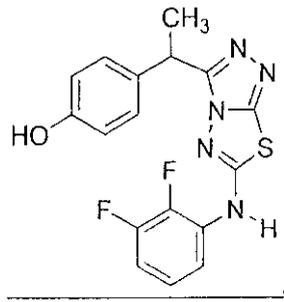
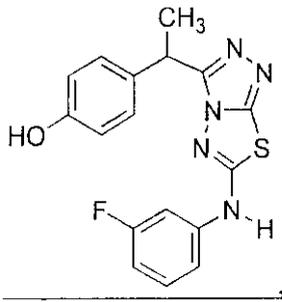
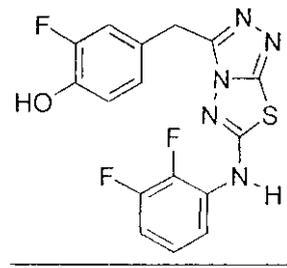
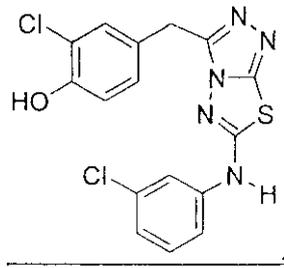
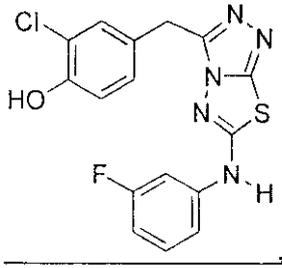
【化 18】



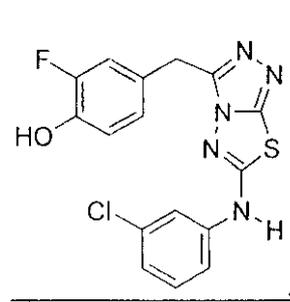
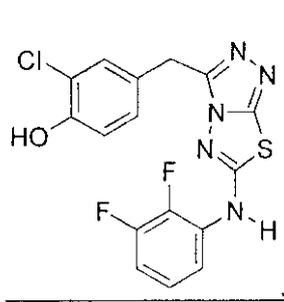
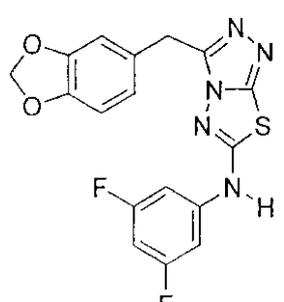
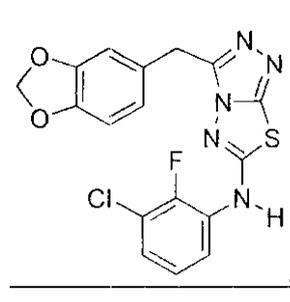
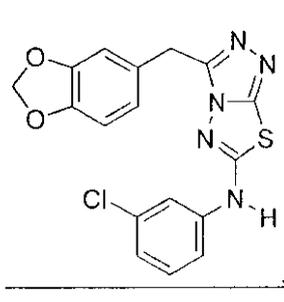
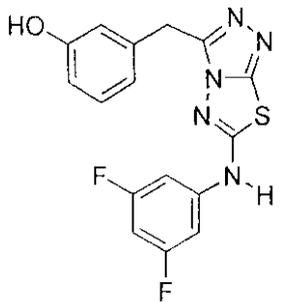
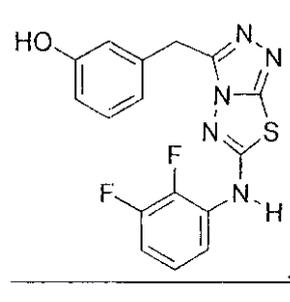
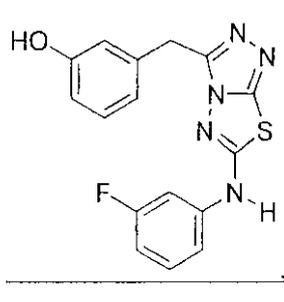
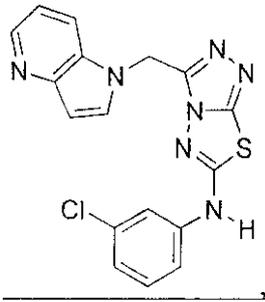
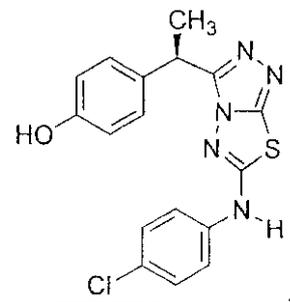
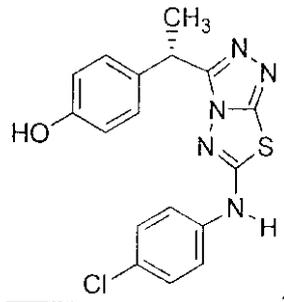
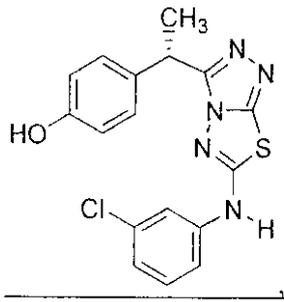
【化 19】



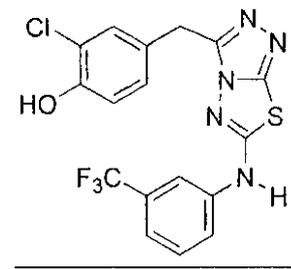
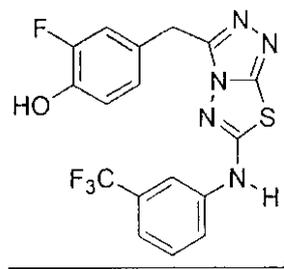
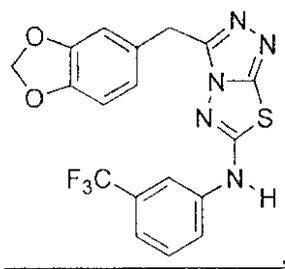
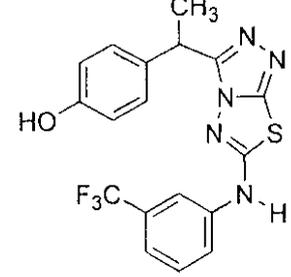
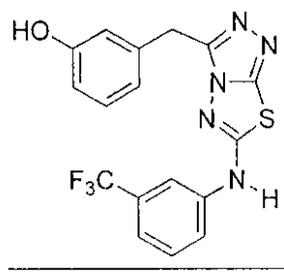
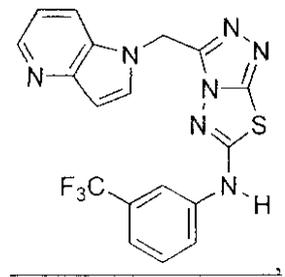
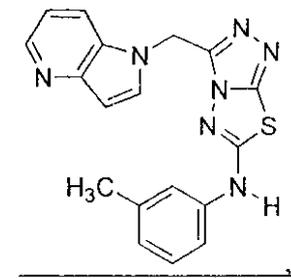
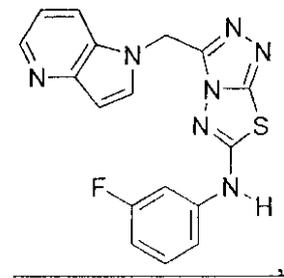
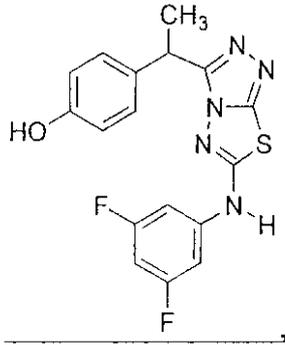
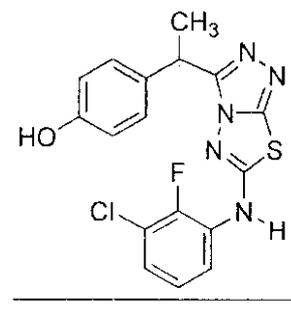
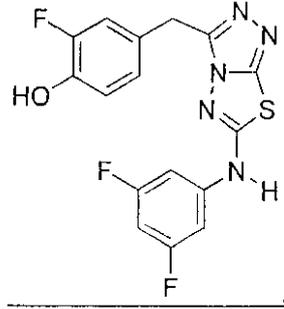
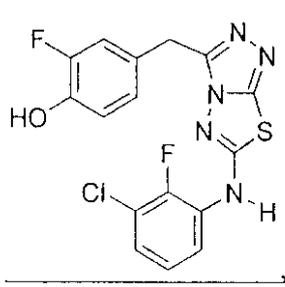
【化 2 0】



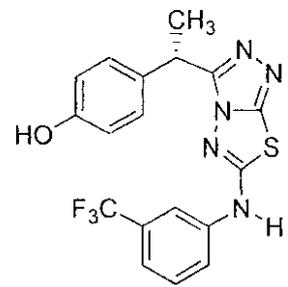
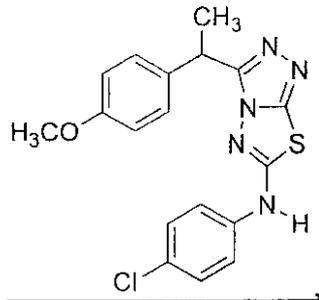
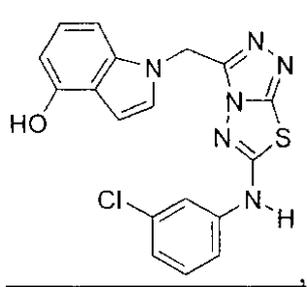
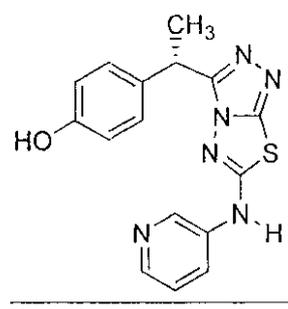
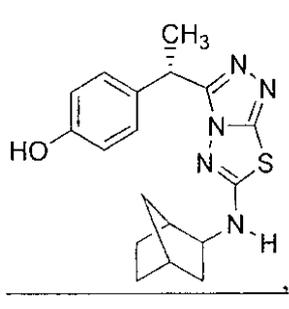
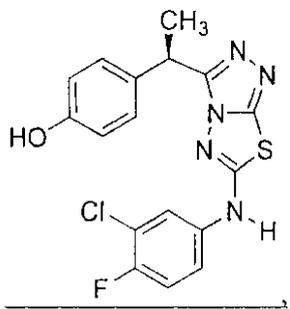
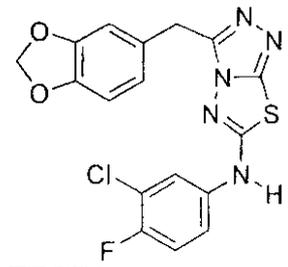
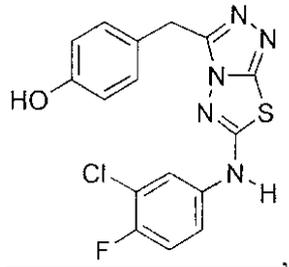
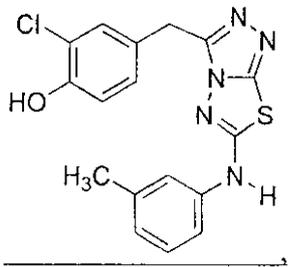
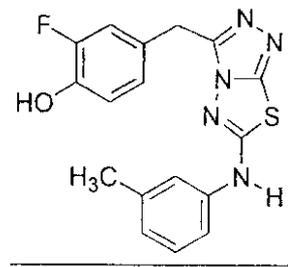
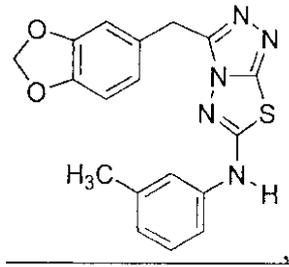
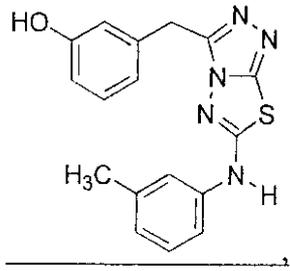
【化 2 1】



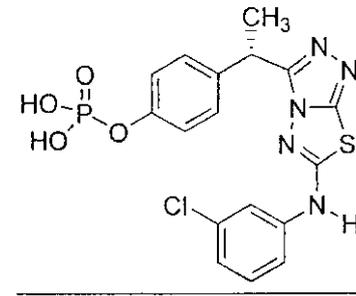
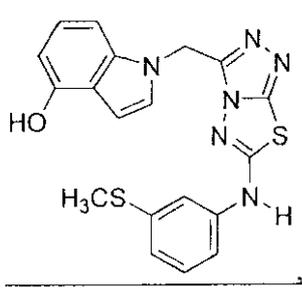
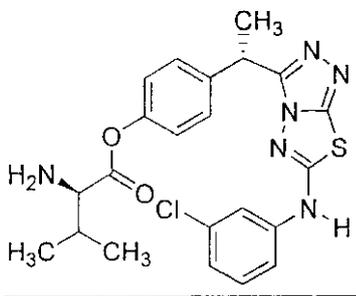
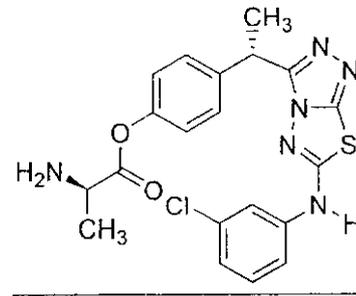
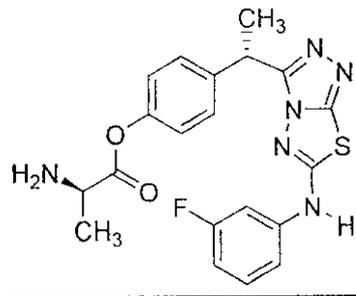
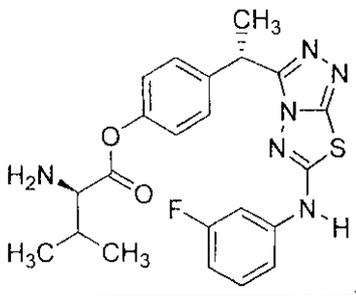
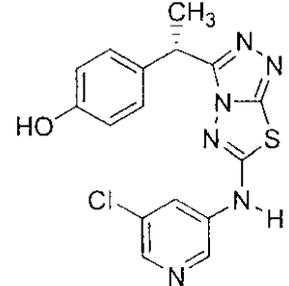
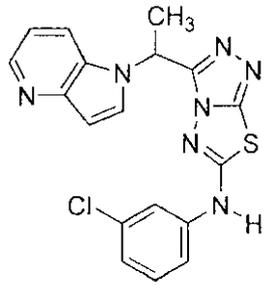
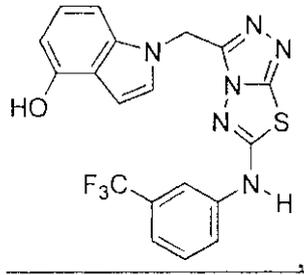
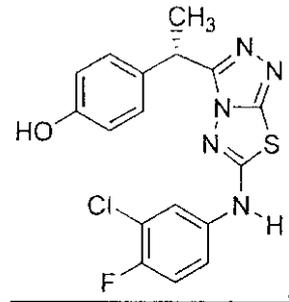
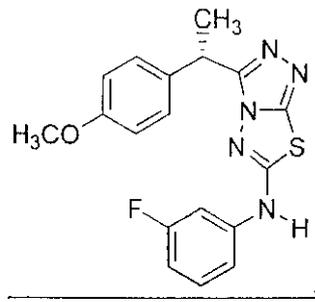
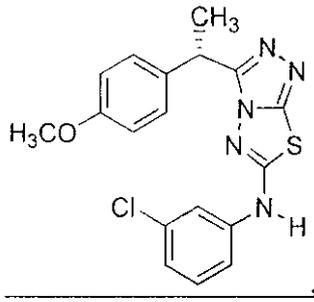
【化 2 2】



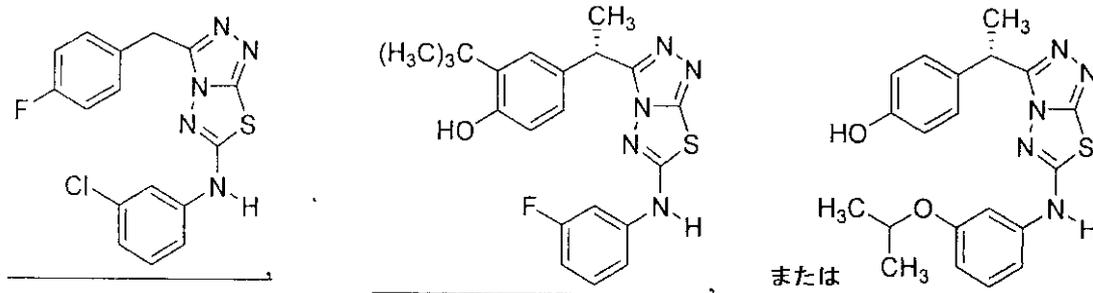
【化 2 3】



## 【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

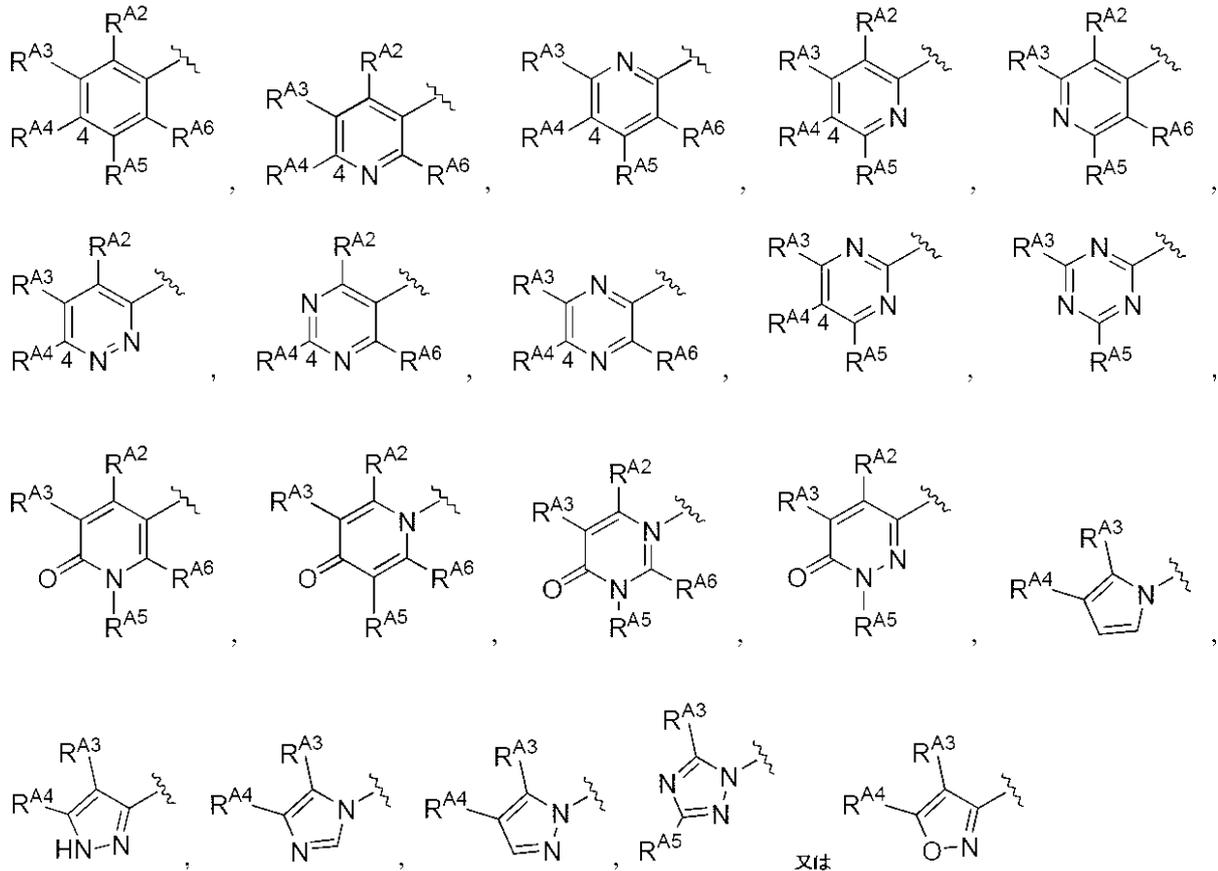
【訂正対象項目名】0 0 3 8

【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  $R^A$  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  $R^A$  の独立した存在で適宜置換される 6 員アリアル環、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アル環を形成し、前記ヘテロシクリル又はヘテロアリアル環は 3 個以下の  $R^A$  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  $R^A$  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<sub>1</sub> - 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<sup>++</sup>)-、-C(O)N(R<sup>++</sup>)N(R<sup>++</sup>)-、-C(O)O-、-N(R<sup>++</sup>)-、-N(R<sup>++</sup>)C(O)-、-N(R<sup>++</sup>)C(O)O-、-N(R<sup>++</sup>)S(O)<sub>2</sub>-、-N(R<sup>++</sup>)C(O)N(R<sup>++</sup>)-、-N(R<sup>++</sup>)N(R<sup>++</sup>)-、-O-、-OC(O)-、-OC(O)N(R<sup>++</sup>)-、-S-、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、又は -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>++</sup>)- で入れ替わり；

R<sup>B</sup> はハロゲン、NH<sub>2</sub>、適宜 R で置換された C<sub>1</sub> - 8 脂肪族基；6 - 10 員アリアル環；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 員ヘテロアリアル環；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、前記アリアル、ヘテロアリアル、又はヘテロシクリル環の各々は適宜、5 以下の R<sup>A</sup> の独立した存在で置換され；

R<sup>C</sup> はそれぞれ独立して、-CN、-NO<sub>2</sub>、R<sup>++</sup>、又は -O(C<sub>1</sub> - 4 脂肪族) であり；

R はハロゲン、-R<sup>0</sup>、-OR<sup>0</sup>、-SR<sup>0</sup>、-OC(O)(C<sub>1</sub> - 8 脂肪族)、適宜 R<sup>0</sup> で置換された Ph、適宜 R<sup>0</sup> で置換された -O(Ph)、適宜 R<sup>0</sup> で置換された -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(Ph)、適宜 R<sup>0</sup> で置換された -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(Ph)、-NO<sub>2</sub>、-CN、-N(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>0</sup>C(O)R<sup>0</sup>、-NR<sup>0</sup>C(O)N(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>0</sup>C(O)OR<sup>0</sup>、-NR<sup>0</sup>NR<sup>0</sup>C(O)R<sup>0</sup>、-NR<sup>0</sup>NR<sup>0</sup>C(O)N(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>0</sup>NR<sup>0</sup>C(O)OR<sup>0</sup>、-C(O)C(O)R<sup>0</sup>、-C(O)CH<sub>2</sub>C(O)R<sup>0</sup>、-C(O)OR<sup>0</sup>、-C(O)R<sup>0</sup>、-C(O)N(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>、-OC(O)N(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>0</sup>、-S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)R<sup>0</sup>、-NR<sup>0</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>0</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>0</sup>、-C(=S)N(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>、-C(=NH)-N(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>、又は -(CH<sub>2</sub>)<sub>y</sub>NHC(O)R<sup>0</sup> 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<sup>\*</sup>、=NN(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、=NNHC(O)R<sup>\*</sup>、=NNHC(O)O(C<sub>1</sub> - 8 脂肪族)、=NNHS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1</sub> - 8 脂肪族)、又は =NR<sup>\*</sup> であり；

R<sup>A</sup> はそれぞれ独立して、ハロゲン、-R<sup>0</sup>、-OR<sup>0</sup>、-SR<sup>0</sup>、-OC(O)(C<sub>1</sub> - 8 脂肪族)、適宜 5 個までの -R<sup>0</sup> で置換された Ph、適宜 5 個までの -R<sup>0</sup> で置換された -CH<sub>2</sub>(Ph)、適宜 5 個までの -R<sup>0</sup> で置換された -(CH<sub>2</sub>)<sub>y</sub>(Ph)、-NO<sub>2</sub>、-CN、-N(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>0</sup>C(O)R<sup>0</sup>、-NR<sup>0</sup>C(O)N(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>0</sup>C(O)OR<sup>0</sup>、-NR<sup>0</sup>NR<sup>0</sup>C(O)R<sup>0</sup>、-NR<sup>0</sup>NR<sup>0</sup>C(O)N(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>0</sup>NR<sup>0</sup>C(O)OR<sup>0</sup>、-C(O)CH<sub>2</sub>C(O)R<sup>0</sup>、-C(O)OR<sup>0</sup>、-C(O)R<sup>0</sup>、-C(O)N(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>、-OC(O)N(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>0</sup>、-S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)R<sup>0</sup>、-NR<sup>0</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>0</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>0</sup>、-C(S)N(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>、-C(NH)N(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>、及び -(CH<sub>2</sub>)<sub>y</sub>NHC(O)R<sup>0</sup> 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<sup>A</sup> 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<sup>++</sup> はそれぞれ独立して水素又は C<sub>1</sub> - 4 脂肪族であり；

R<sup>\*</sup> はそれぞれ独立して、水素又は適宜 5 個までの -NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub> - 4 脂肪族)、-N(C<sub>1</sub> - 4 脂肪族)<sub>2</sub>、ハロゲン、C<sub>1</sub> - 4 脂肪族、-OH、-O(C<sub>1</sub> - 4 脂肪族)、-NO<sub>2</sub>、-CN、-C(O)OH、-C(O)O(C<sub>1</sub> - 4 脂肪族)、-C(O)NH<sub>2</sub>、-C(O)NH(C<sub>1</sub> - 4 脂肪族)、-C(O)N(C<sub>1</sub> - 4 脂肪族)<sub>2</sub>、-O(ハロ(C<sub>1</sub> - 4 脂肪族))、もしくはハロ(C<sub>1</sub> - 4 脂肪族)の独立した存在で置換される C<sub>1</sub> - 8 脂肪族であり；あるいは、同一の窒素上の 2 個の R<sup>\*</sup> 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アル環を形成し；

R<sup>0</sup> はそれぞれ独立に、水素、適宜置換された C<sub>1</sub> - 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<sup>0</sup>の脂肪族のそれぞれの置換基は、独立して、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1-4</sub>脂肪族)、-N(C<sub>1-4</sub>脂肪族)<sub>2</sub>、ハロゲン、C<sub>1-4</sub>脂肪族、-OH、-O(C<sub>1-4</sub>脂肪族)、-NO<sub>2</sub>、-CN、-C(O)OH、-C(O)O(C<sub>1-4</sub>脂肪族)、-C(O)NH<sub>2</sub>、-C(O)NH(C<sub>1-4</sub>脂肪族)、-C(O)N(C<sub>1-4</sub>脂肪族)<sub>2</sub>、-O(ハロ(C<sub>1-4</sub>脂肪族))、又はハロ(C<sub>1-4</sub>脂肪族)であり；あるいは、同一の窒素上の2個のR<sup>0</sup>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<sup>A</sup>R<sup>A</sup>が-S-CH<sub>2</sub>-ピリジルであるときに、L<sup>B</sup>R<sup>B</sup>は-S-CH<sub>2</sub>-ピリジルではない。