

【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18年10月19日(2006.10.19)

【公表番号】特表2005-538184(P2005-538184A)

【公表日】平成17年12月15日(2005.12.15)

【年通号数】公開・登録公報2005-049

【出願番号】特願2004-555293(P2004-555293)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4985 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 37/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 487/04 1 4 0

C 0 7 D 487/04 C S P

A 6 1 K 31/4985

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/02

A 6 1 P 31/14

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 37/00

A 6 1 P 37/04

A 6 1 P 43/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【誤訳訂正書】

【提出日】平成18年8月31日(2006.8.31)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

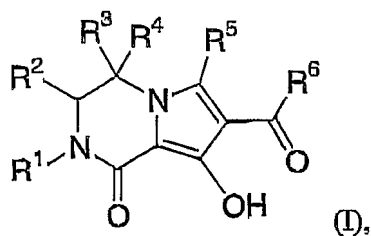
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



[式中、

R^1 は - H、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{3-6}$ シクロアルキル、または 1 個もしくは 2 個の置換基で置換された $-C_{1-6}$ アルキルであり、該置換基のそれぞれは、独立的に、

(1) C_{3-8} シクロアルキル、

(2) アリール、

(3) N、O および S から独立的に選択される 1 個から 4 個までのヘテロ原子を包含した 5 員もしくは 6 員の飽和もしくは一不飽和ヘテロ環式環、

(4) N、O および S から独立的に選択される 1 個から 4 個までのヘテロ原子を包含した 5 員もしくは 6 員のヘテロ芳香環、または

(5) 少なくとも 1 つの環が芳香環である、N、O および S から独立的に選択される 1 個から 4 個までのヘテロ原子を包含した 9 員もしくは 10 員の縮合二環式ヘテロ環、

であり；

ここで、

(A) 各シクロアルキルは、それぞれが独立的に八員、 $-C_{1-6}$ アルキルまたは $-O-C_{1-6}$ アルキルである 1 個から 3 個までの置換基で場合によって置換されており；

(B) 各アリールは、1 個から 5 個までの置換基で場合によって置換されており、該置換基のそれぞれは、独立的に、

(1) それぞれが独立的に $-OH$ 、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ 八員アルキル、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^a R^b)$ 、 $-C(=O)N(R^a R^b)$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-CO_2 R^c$ 、 $-S(O)_n R^c$ 、 $-SO_2 N(R^a R^b)$ 、 $-N(R^a)C(=O)R^b$ 、 $-N(R^a)CO_2 R^c$ 、 $-N(R^a)SO_2 R^c$ 、 $-N(R^a)SO_2 N(R^a R^b)$ 、 $-OC(=O)N(R^a R^b)$ または $-N(R^a)C(=O)N(R^a R^b)$ である 1 個から 3 個までの置換基で場合によって置換された $-C_{1-6}$ アルキル、

(2) それぞれが独立的に $-OH$ 、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ 八員アルキル、 $-S(O)_n R^c$ 、 $-C(=O)N(R^a R^b)$ 、 $-SO_2 N(R^a R^b)$ 、 $-N(R^a)C(=O)R^b$ 、 $-N(R^a)CO_2 R^c$ 、 $-N(R^a)SO_2 R^c$ 、 $-N(R^a)SO_2 N(R^a R^b)$ 、 $-OC(=O)N(R^a R^b)$ 、または $-N(R^a)C(=O)N(R^a R^b)$ である 1 個から 3 個までの置換基で場合によって置換された $-O-C_{1-6}$ アルキル、

(3) $-C_{1-6}$ 八員アルキル、

(4) $-O-C_{1-6}$ 八員アルキル、

(5) $-OH$ 、

(6) 八員、

(7) $-CN$ 、

(8) $-NO_2$ 、

(9) $-N(R^a R^b)$ 、

(10) $-C(=O)N(R^a R^b)$ 、

(11) $-C(=O)R^a$ 、

(12) $-CO_2 R^c$ 、

(13) $-SR^c$ 、

(14) $-S(=O)R^c$ 、

(15) $-SO_2 R^c$ 、

(16) $-N(R^a)SO_2 R^c$ 、

(17) $-SO_2 N(R^a R^b)$ 、

(18) $-N(R^a)C(=O)R^b$ 、または

(19) $-N(R^a)CO_2 R^c$

であり；

(C) 各飽和または一不飽和ヘテロ環式環は、

(i) それぞれが独立的に八員ゲン、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ 八員アルキル、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ 八員アルキルまたはオキソである 1 個から 5 個

までの置換基で場合によって置換されており；また、

(i i) それぞれが独立的にアリール、またはN、OおよびSから独立的に選択される1個から4個までのヘテロ原子を包含した5員もしくは6員のヘテロ芳香環である1個または2個の置換基で場合によって置換されており；

(D) 各ヘテロ芳香環または各縮合二環式ヘテロ環は、

(i) それぞれが独立的にハロゲン、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ ハロアルキルまたはオキソである1個から7個までの置換基で場合によって置換されており；また、

(i i) それぞれが独立的にアリールまたは $-C_{1-6}$ アルキル-アリールである1個または2個の置換基で場合によって置換されており；

R^2 は $-H$ または $-C_{1-6}$ アルキル であり；

R^3 は $-H$ 、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ ハロアルキル、または ($-OH$ 、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^a R^b)$ 、 $-C(=O)N(R^a R^b)$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-CO_2 R^c$ 、 $-S(O)_n R^c$ 、 $-SO_2 N(R^a R^b)$ 、 $-N(R^a)C(=O)R^b$ 、 $-N(R^a)CO_2 R^c$ 、 $-N(R^a)SO_2 R^c$ 、 $-N(R^a)SO_2 N(R^a R^b)$ 、 $-OC(=O)N(R^a R^b)$ 、または $-N(R^a)C(=O)N(R^a R^b)$ のうちの1つで置換された) $-C_{1-6}$ アルキル であり；

R^4 は：

(1) $-H$ 、

(2) $-OH$ 、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^a R^b)$ 、 $-C(=O)N(R^a R^b)$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-CO_2 R^c$ 、 $-S(O)_n R^c$ 、 $-SO_2 N(R^a R^b)$ 、 $-N(R^a)C(=O)R^b$ 、 $-N(R^a)SO_2 R^c$ 、 $-N(R^a)SO_2 N(R^a R^b)$ 、 $-OC(=O)N(R^a R^b)$ 、 $-N(R^a)C(=O)N(R^a R^b)$ 、 $-O-C_{1-6}$ アルキル- $C(=O)N(R^a R^b)$ 、 $-S-C_{1-6}$ アルキル- $C(=O)N(R^a R^b)$ 、 $-N(R^a)-C_{1-6}$ アルキル- $C(=O)N(R^a R^b)$ または $-N(SO_2 R^c)-C_{1-6}$ アルキル- $C(=O)N(R^a R^b)$ の1つで場合によって置換された $-C_{1-6}$ アルキル、

(3) $-C_{1-6}$ ハロアルキル、

(4) $-C(=O)R^a$ 、

(5) $-CO_2 R^c$ 、

(6) $-C(=O)N(R^a R^b)$ 、

(7) $-SO_2 N(R^a R^b)$ 、

(8) $-C_{2-6}$ アルケニル、

(9) $-C_{2-6}$ アルケニル- $C(=O)-N(R^a)_2$ 、

(10) $-C_{2-5}$ アルキニル、

(11) $-C_{2-5}$ アルキニル- $CH_2 N(R^a)_2$ 、

(12) $-C_{2-5}$ アルキニル- $CH_2 OR^a$ 、

(13) $-C_{2-5}$ アルキニル- $CH_2 S(O)_n R^c$ 、または

(14) $-R^k$ 、

(15) R^k で置換された $-C_{1-6}$ アルキル、

(16) R^k で置換された $-C_{1-6}$ ハロアルキル、

(17) $-C_{1-6}$ アルキル- $O-R^k$ 、

(18) $-C_{1-6}$ アルキル- $O-C_{1-6}$ アルキル- R^k 、

(19) $-C_{1-6}$ アルキル- $S(O)_n-R^k$ 、

(20) $-C_{1-6}$ アルキル- $S(O)_n-C_{1-6}$ アルキル- R^k 、

(21) $-C_{1-6}$ アルキル- $N(R^a)-R^k$ 、

(22) $-C_{1-6}$ アルキル- $N(R^a)-C_{1-6}$ アルキル- R^k

(23) $-N(R^a)$ -部分および $-OR^k$ 部分の両方が $-C_{1-6}$ アルキル-部分の同じ炭素に結合されていないことを条件として、 $-C_{1-6}$ アルキル- $N(R^a)-C_{1-$

-₆ アルキル - OR^k、
 (24) - C₁₋₆ アルキル - C(=O) - R^k、
 (25) - C₁₋₆ アルキル - C(=O)N(R^a) - R^k、
 (26) - C₁₋₆ アルキル - N(R^a)C(=O) - R^k、
 (27) - C₁₋₆ アルキル - C(=O)N(R^a) - C₁₋₆ アルキル - R^k、または

(28) - C₁₋₆ アルキル - N(R^a) - C₀₋₆ アルキル - S(O)_n R^k
 であり；

ここで、R^k は、

(i) それぞれが独立的に - C₁₋₆ アルキル、 - C₁₋₆ アルキル - OH、 - C₁₋₆ アルキル - O - C₁₋₆ アルキル、 - C₁₋₆ アルキル - O - C₁₋₆ ハロアルキル、 - C₁₋₆ アルキル - N(R^aR^b)、 - C₁₋₆ アルキル - C(=O)N(R^aR^b)、 - C₁₋₆ アルキル - C(=O)R^a、 - C₁₋₆ アルキル - CO₂R^c、 - C₁₋₆ アルキル - S(O)_nR^k、 - O - C₁₋₆ アルキル、 - C₁₋₆ ハロアルキル、 - O - C₁₋₆ ハロアルキル、 - OH、ハロ、 - N(R^aR^b)、 - C(=O)N(R^aR^b)、 - C(=O)R^a、 - CO₂R^c、 - S(O)_nR^c または - SO₂N(R^aR^b) である 1 個から 5 個までの置換基で場合によって置換されたアリール；

(ii) 少なくとも 1 個の炭素原子と N、O および S から独立的に選択される 1 個から 4 個までのヘテロ原子を包含した 4 員から 7 員までの飽和または一不飽和ヘテロ環式環 {ここで、該ヘテロ環式環は、

(a) それぞれが独立的にハロゲン、 - C₁₋₆ アルキル、 - C₁₋₆ ハロアルキル、 - O - C₁₋₆ アルキル、 - O - C₁₋₆ ハロアルキルまたはオキソである 1 個から 5 個までの置換基で場合によって置換されており；また

(b) アリールまたは Het A；

[ここで、Het A は N、O および S から独立的に選択される 1 個から 4 個までのヘテロ原子を包含した 5 員または 6 員のヘテロ芳香環であり、該ヘテロ芳香環は場合によってベンゼン環と共に縮合されており、また、Het A は、それぞれが独立的に - C₁₋₆ アルキル、 - C₁₋₆ ハロアルキル、 - O - C₁₋₆ アルキル、 - O - C₁₋₆ ハロアルキルまたはオキソである 1 個から 4 個までの置換基で場合によって置換されている] で場合によって一置換されている}；または

(iii) N、O および S から独立的に選択される 1 個から 4 個までのヘテロ原子を包含した 5 員または 6 員のヘテロ芳香環 [ここで、該ヘテロ芳香環は、それぞれが独立的に - C₁₋₆ アルキル、 - C₁₋₆ ハロアルキル、 - O - C₁₋₆ アルキル、 - O - C₁₋₆ ハロアルキルまたはオキソである 1 個から 4 個までの置換基で場合によって置換されている]；

であり；

R⁵ は - H または - C₁₋₆ アルキルであり；

R⁶ は、

(1) - O - C₁₋₆ アルキル、

(2) - N(R^uR^v)、

(3) - O - C₁₋₆ ハロアルキル、

(4) - O - C₁₋₆ アルキル - アリール

(5) - O - C₁₋₆ アルキル - Het B、または

(6) - O - C₁₋₆ アルキル - Het C

[ここで

R^u は - H または - C₁₋₆ アルキルであり；

R^v は独立的に R¹ と同じ定義を有しており；

Het B は N、O および S から独立的に選択される 1 個から 4 個までのヘテロ原子を包含した 5 員もしくは 6 員の飽和環または一不飽和環であり、該環は、それぞれが独立的にハロゲン、 - C₁₋₆ アルキル、 - C₁₋₆ ハロアルキル、 - O - C₁₋₆ アルキル、 -

O - C_{1 - 6} ハロアルキルまたはオキソである 1 個から 5 個までの置換基で場合によって置換されており；

H e t C は N、O および S から独立的に選択される 1 個から 4 個までのヘテロ原子を包含した 5 員または 6 員のヘテロ芳香環であり、該ヘテロ芳香環は、それぞれが独立的に - C_{1 - 6} アルキル、- C_{1 - 6} ハロアルキル、- O - C_{1 - 6} アルキル、- O - C_{1 - 6} ハロアルキルまたはオキソである 1 個から 4 個までの置換基で場合によって置換されている]

であり；

各 R^a および R^b は独立的に - H または - C_{1 - 6} アルキルであり；

各 R^c は独立的に - C_{1 - 6} アルキルであり；

各 n は独立的に 0、1 または 2 に等しい整数である]

の化合物または該化合物の医薬適合性の塩。

【請求項 2】

R¹ が、アリアルで一置換された - C_{1 - 4} アルキル

[ここで、該アリアルは、それぞれが独立的に、

(1) - OH、- O - C_{1 - 4} アルキル、- O - C_{1 - 4} ハロアルキル、- CN、- N (R^a R^b)、- C (=O) N (R^a R^b)、- C (=O) R^a、- CO₂ R^c、- S (O)_n R^c、- SO₂ N (R^a R^b)、- N (R^a) C (=O) R^b、- N (R^a) CO₂ R^c、- N (R^a) SO₂ R^c、- N (R^a) SO₂ N (R^a R^b)、- OC (=O) N (R^a R^b) または - N (R^a) C (=O) N (R^a R^b) で場合によって一置換された - C_{1 - 4} アルキル、

(2) - OH、- O - C_{1 - 4} アルキル、- O - C_{1 - 4} ハロアルキル、- S (O)_n R^c、- N (R^a) - CO₂ R^c、- C (=O) N (R^a R^b)、- SO₂ N (R^a R^b)、- N (R^a) C (=O) R^b、- N (R^a) CO₂ R^c、- N (R^a) SO₂ R^c、- N (R^a) SO₂ N (R^a R^b)、- OC (=O) N (R^a R^b) または - N (R^a) C (=O) N (R^a R^b) で場合によって一置換された - O - C_{1 - 4} アルキル、

(3) - C_{1 - 4} ハロアルキル、

(4) - O - C_{1 - 4} ハロアルキル、

(5) - OH、

(6) ハロ、

(7) - CN、

(8) - NO₂、

(9) - N (R^a R^b)、

(10) - SR^c、

(11) - S (=O) R^c、

(12) - SO₂ R^c、

(13) - N (R^a) SO₂ R^c、

(14) - SO₂ N (R^a R^b)、

(15) - N (R^a) C (=O) R^b、または

(16) - N (R^a) CO₂ R^c

である 1 個から 4 個までの置換基で場合によって置換されている]

であり；

R⁶ が、

(1) - O - C_{1 - 6} アルキル、

(2) - N (R^u R^v)、

(3) - O - C_{1 - 6} ハロアルキル、

(4) - O - C_{1 - 6} アルキル - アリアル

(5) - O - C_{1 - 6} アルキル - H e t B、または

(6) - O - C_{1 - 6} アルキル - H e t C、

[ここで、

R^u は - H または - C_{1-6} アルキルであり；

R^v は - H、- C_{1-6} アルキルもしくは - C_{3-6} シクロアルキルであり、または独立的に上の R^1 と同じ定義を有しており；

He t B は N、O および S から独立的に選択される 1 個から 4 個までのヘテロ原子を包含した 5 員もしくは 6 員の飽和環または一不飽和環であり、ここで、該環は、それぞれが独立的にハロゲン、- C_{1-6} アルキル、- C_{1-6} ハロアルキル、- O - C_{1-6} アルキル、- O - C_{1-6} ハロアルキルまたはオキソである 1 個から 5 個までの置換基で場合によって置換されており；

He t C は N、O および S から独立的に選択される 1 個から 4 個までのヘテロ原子を包含した 5 員または 6 員のヘテロ芳香環であり、ここで、該ヘテロ芳香環は、それぞれが独立的に - C_{1-6} アルキル、- C_{1-6} ハロアルキル、- O - C_{1-6} アルキル、- O - C_{1-6} ハロアルキルまたはオキソである 1 個から 4 個までの置換基で場合によって置換されている]

である、

請求項 1 に記載の化合物または該化合物の医薬適合性の塩。

【請求項 3】

R^2 が - H または - C_{1-4} アルキルであり；

R^3 が - H または - C_{1-4} アルキルであり；

R^4 が、

(1) - H、

(2) - OH、- O - C_{1-4} アルキル、- O - C_{1-4} ハロアルキル、- CN、- N ($R^a R^b$)、- C (=O) N ($R^a R^b$)、- C (=O) R^a 、- CO₂ R^c 、- S (O)_n R^c 、- SO₂ N ($R^a R^b$)、- N (R^a) - C (R^b) = O、- N (R^a) S O₂ R^b または - N (R^a) S O₂ N ($R^a R^b$) の 1 つで場合によって置換された - C_{1-4} アルキル、

(3) - C (=O) N ($R^a R^b$)、

(4) - R^k 、

(5) R^k で置換された - C_{1-4} アルキル、

(6) - C_{1-4} アルキル - O - R^k 、または

(7) - C_{1-4} アルキル - O - C_{1-4} アルキル - R^k

であり；

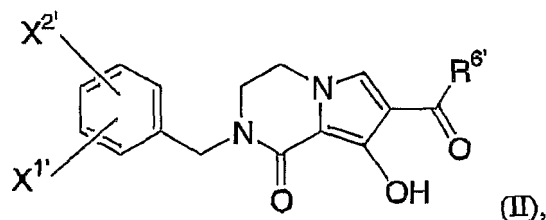
R^5 が - H である、

請求項 1 に記載の化合物または該化合物の医薬適合性の塩。

【請求項 4】

式 (II)：

【化 2】



[式中：

$X^{1'}$ および $X^{2'}$ は、それぞれ独立的に、

(1) - H、

(2) C_{1-4} アルキル、

(3) - O - C_{1-4} アルキル、

(4) C_{1-4} ハロアルキル、

(5) - O - C₁₋₄ ハロアルキル、または
(6) ハロ

であり；

R^{6'} は、

(1) - O - C₁₋₄ アルキル、または

(2) - N (R^u R^v)、

であり；

ここで、

R^u は - H または - C₁₋₄ アルキルであり；

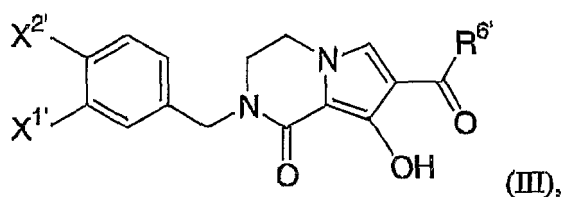
R^v は - C₁₋₄ アルキルまたはシクロプロピルである]

の化合物である請求項 1 に記載の化合物、または該化合物の医薬適合性の塩。

【請求項 5】

式 (III) :

【化 3】



[式中、X^{1'} および X^{2'} がそれぞれ独立的に - H、フルオロ、クロロまたはブromoであり；

R^{6'} が、

(1) メトキシ、

(2) エトキシ、

(3) - N (R^u R^v)

であり；

ここで、

R^u は - H であり；

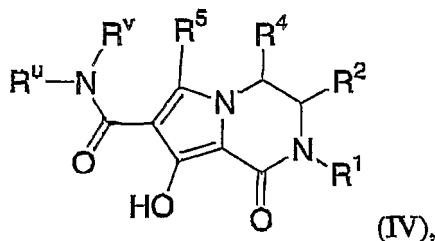
R^v は メチル、エチルまたはシクロプロピルである]

の化合物である請求項 4 に記載の化合物、または該化合物の医薬適合性の塩。

【請求項 6】

式 (IV) :

【化 4】



[式中、

R^u は - H または - C₁₋₆ アルキルであり；

R^v は、それぞれが独立的に、

(1) C₃₋₈ シクロアルキル、

(2) アリール、

(3) N、O および S から独立的に選択される 1 個から 4 個までのヘテロ原子を包含した 5 員もしくは 6 員の飽和もしくは一不飽和ヘテロ環式環、

(4) N、OおよびSから独立的に選択される1個から4個までのヘテロ原子を包含した5員もしくは6員のヘテロ芳香環、または

(5) 少なくとも1つの環が芳香環であり、N、OおよびSから独立的に選択される1個から4個までのヘテロ原子を包含した9員もしくは10員の縮合二環式ヘテロ環、である1個または2個の置換基で置換された C_{1-6} アルキルであり；

ここで、

(A) 各シクロアルキルは、それぞれが独立的に八口、 $-C_{1-6}$ アルキルまたは $-O-C_{1-6}$ アルキルである1個から3個までの置換基で場合によって置換されており；

(B) 各アリールは、それぞれが独立的に、

(1) それぞれが独立的に $-OH$ 、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ 八口アルキル、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^a R^b)$ 、 $-C(=O)N(R^a R^b)$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-CO_2 R^c$ 、 $-S(O)_n R^c$ 、 $-SO_2 N(R^a R^b)$ 、 $-N(R^a)C(=O)R^b$ 、 $-N(R^a)CO_2 R^c$ 、 $-N(R^a)SO_2 R^c$ 、 $-N(R^a)SO_2 N(R^a R^b)$ 、 $-OC(=O)N(R^a R^b)$ または $-N(R^a)C(=O)N(R^a R^b)$ である1個から3個までの置換基で場合によって置換された $-C_{1-6}$ アルキル、

(2) それぞれが独立的に $-OH$ 、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ 八口アルキル、 $-S(O)_n R^c$ 、 $-C(=O)N(R^a R^b)$ 、 $-SO_2 N(R^a R^b)$ 、 $-N(R^a)C(=O)R^b$ 、 $-N(R^a)CO_2 R^c$ 、 $-N(R^a)SO_2 R^c$ 、 $-N(R^a)SO_2 N(R^a R^b)$ 、 $-OC(=O)N(R^a R^b)$ または $-N(R^a)C(=O)N(R^a R^b)$ である1個から3個までの置換基で場合によって置換された $-O-C_{1-6}$ アルキル、

(3) $-C_{1-6}$ 八口アルキル、

(4) $-O-C_{1-6}$ 八口アルキル、

(5) $-OH$ 、

(6) 八口、

(7) $-CN$ 、

(8) $-NO_2$ 、

(9) $-N(R^a R^b)$ 、

(10) $-C(=O)N(R^a R^b)$ 、

(11) $-C(=O)R^a$ 、

(12) $-CO_2 R^c$ 、

(13) $-SR^c$ 、

(14) $-S(=O)R^c$ 、

(15) $-SO_2 R^c$ 、

(16) $-N(R^a)SO_2 R^c$ 、

(17) $-SO_2 N(R^a R^b)$ 、

(18) $-N(R^a)C(=O)R^b$ 、または

(19) $-N(R^a)CO_2 R^c$

である1個から5個までの置換基で場合によって置換されており；

(C) 各飽和または一不飽和ヘテロ環式環は、

(i) それぞれが独立的に八口ゲン、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ 八口アルキル、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ 八口アルキルまたはオキソである1個から5個までの置換基で場合によって置換されており；また

(ii) それぞれが独立的にアリール、またはN、OおよびSから独立的に選択される1個から4個までのヘテロ原子を包含した5員もしくは6員のヘテロ芳香環である1個または2個の置換基で場合によって置換されており；

(D) 各ヘテロ芳香環または各縮合二環式ヘテロ環は、

(i) それぞれが独立的に八口ゲン、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ 八口アルキル、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ 八口アルキルまたはオキソである1個から7個までの置換基で場合によって置換されており；また

(i i) それぞれが独立的にアリールまたは - C₁₋₆ アルキル - アリールである 1 個または 2 個の置換基で場合によって置換されており ;

R¹ は - H または - C₁₋₆ アルキルである]

の化合物である請求項 1 に記載の化合物、または該化合物の医薬適合性の塩。

【請求項 7】

R^u が - H であり ;

R⁵ が - H であり ;

R⁴ が :

(1) - H、

(2) - OH、 - N (R^a R^b) または - C (= O) N (R^a R^b) のうちの 1 つで場合によって置換された - C₁₋₄ アルキル、

(3) - C (= O) N (R^a R^b)、

(4) - (CH₂)₁₋₃ - R^k、

(5) - (CH₂)₁₋₃ - O - R^k、または

(6) - (CH₂)₁₋₃ - O - (CH₂)₁₋₃ R^k であり ;

R² が - H であり ;

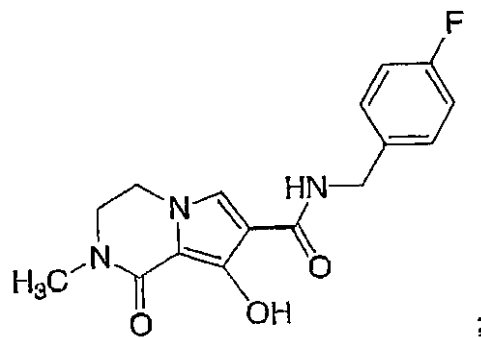
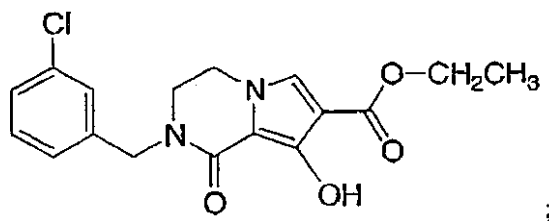
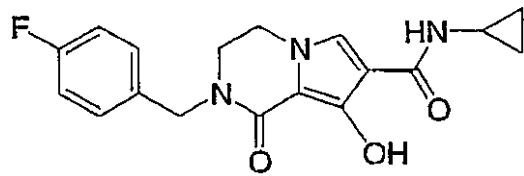
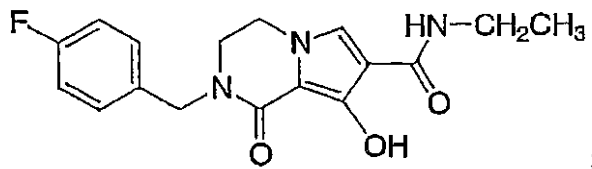
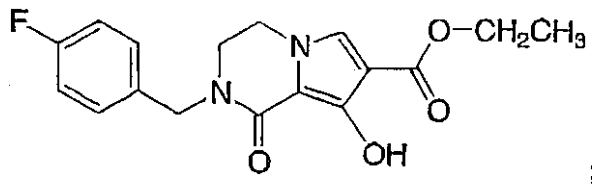
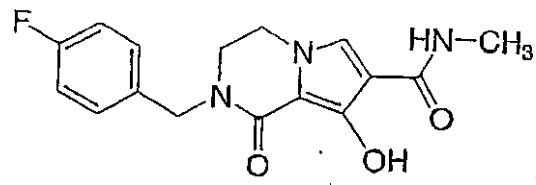
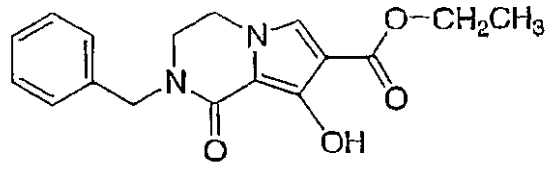
R¹ が - C₁₋₄ アルキルである、

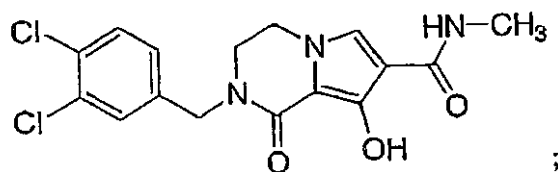
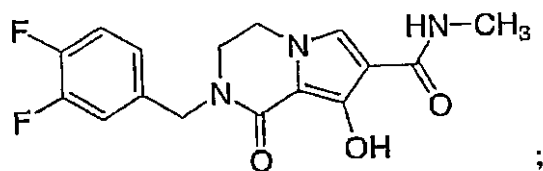
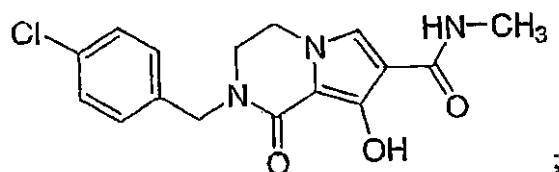
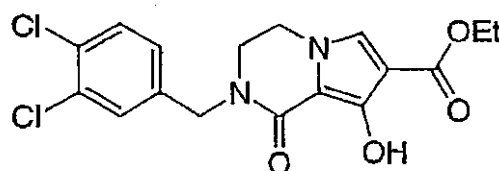
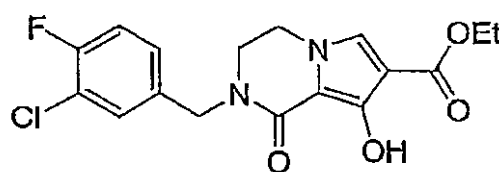
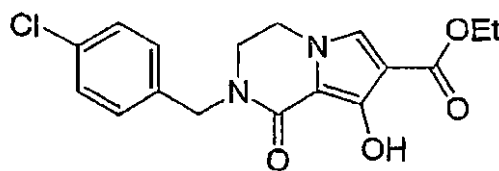
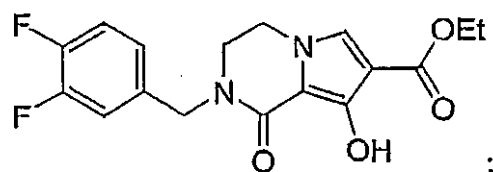
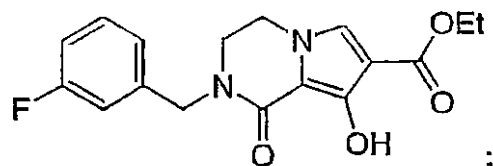
請求項 6 に記載の化合物または該化合物の医薬適合性の塩。

【請求項 8】

以下の :

【化 5】





からなるグループから選択される化合物である請求項 1 に記載の化合物、および該化合物の医薬適合性の塩。

【請求項 9】

治療学的に有効量の請求項 1 ~ 8 のいずれかに記載の化合物または該化合物の医薬適合

性の塩と医薬適合性の担体とを含む医薬組成物。

【請求項 10】

請求項 1 ~ 8 のいずれかに記載の化合物または該化合物の医薬適合性の塩の、H I V イ
ンテグラーゼの阻害のための、H I V による感染の予防もしくは治療のための、または A
I D S の予防、治療もしくは発現の遅延のための医薬組成物の調製における使用。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

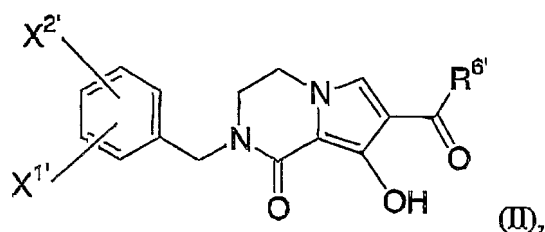
【訂正対象項目名】0035

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0035】

【化 10】



[式中 :

$X^{1'}$ および $X^{2'}$ は、それぞれ独立的に、

(1) - H、

(2) C_{1-4} アルキル、

(3) - O - C_{1-4} アルキル、

(4) C_{1-4} ハロアルキル、

(5) - O - C_{1-4} ハロアルキル、

(6) ハロ

であり；

$R^{6'}$ は、

(1) - OH、

(2) - O - C_{1-4} アルキル、

(3) - N (R^u R^v)、

であり；

ここで、

R^u は - H または - C_{1-4} アルキルであり；

R^v は - C_{1-4} アルキルまたはシクロプロピルである]

の化合物またはこれらの化合物の医薬適合性の塩を含む。