

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成20年2月7日(2008.2.7)

【公表番号】特表2007-515489(P2007-515489A)

【公表日】平成19年6月14日(2007.6.14)

【年通号数】公開・登録公報2007-022

【出願番号】特願2006-547206(P2006-547206)

【国際特許分類】

C 0 7 D 275/02 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/425 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 39/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 33/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 1/02 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/22 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 37/04 (2006.01)

A 6 1 P 15/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/14 (2006.01)

A 6 1 P 17/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/08 (2006.01)
 A 6 1 P 9/12 (2006.01)
 A 6 1 P 31/16 (2006.01)
 A 6 1 P 19/06 (2006.01)
 A 6 1 P 11/02 (2006.01)
 A 6 1 P 17/14 (2006.01)
 A 6 1 P 7/06 (2006.01)
 A 6 1 P 7/04 (2006.01)
 A 6 1 P 15/08 (2006.01)
 A 6 1 P 3/10 (2006.01)
 A 6 1 P 15/00 (2006.01)
 A 6 1 P 5/14 (2006.01)
 A 6 1 P 13/10 (2006.01)
 A 6 1 P 21/04 (2006.01)
 A 6 1 P 37/02 (2006.01)
 A 6 1 P 35/04 (2006.01)
 A 6 1 P 31/10 (2006.01)
 A 6 1 P 5/24 (2006.01)
 A 6 1 P 29/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 275/02	C S P
C 0 7 D 417/12	
C 0 7 D 417/14	
A 6 1 K 31/425	
A 6 1 P 35/00	
A 6 1 P 9/00	
A 6 1 P 27/02	
A 6 1 P 43/00	1 1 1
A 6 1 P 29/00	
A 6 1 P 25/02	1 0 1
A 6 1 P 19/02	
A 6 1 P 17/06	
A 6 1 P 17/00	
A 6 1 P 37/08	
A 6 1 P 11/06	
A 6 1 P 1/04	
A 6 1 P 31/04	
A 6 1 P 39/02	
A 6 1 P 25/08	
A 6 1 P 9/10	
A 6 1 P 9/08	
A 6 1 P 13/12	
A 6 1 P 7/02	
A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 37/06	
A 6 1 P 33/06	
A 6 1 P 25/00	
A 6 1 P 19/10	
A 6 1 P 1/02	
A 6 1 P 31/12	

A 6 1 P 31/22
A 6 1 P 31/18
A 6 1 P 37/04
A 6 1 P 15/06
A 6 1 P 11/14
A 6 1 P 17/04
A 6 1 P 17/02
A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 1/18
A 6 1 P 1/16
A 6 1 P 21/00
A 6 1 P 11/08
A 6 1 P 9/12
A 6 1 P 31/16
A 6 1 P 19/06
A 6 1 P 11/02
A 6 1 P 17/14
A 6 1 P 7/06
A 6 1 P 7/04
A 6 1 P 25/02
A 6 1 P 15/08
A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 15/00
A 6 1 P 5/14
A 6 1 P 13/10
A 6 1 P 21/04
A 6 1 P 43/00
A 6 1 P 37/02
A 6 1 P 35/04
A 6 1 P 31/10
A 6 1 P 5/24
A 6 1 P 29/02

【手続補正書】

【提出日】平成19年12月14日(2007.12.14)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

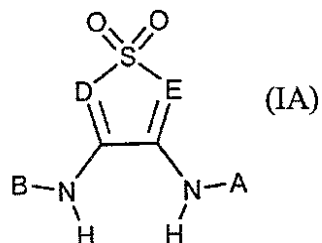
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下式の化合物：

【化 1】



およびその薬学的に受容可能な塩であって、ここで：

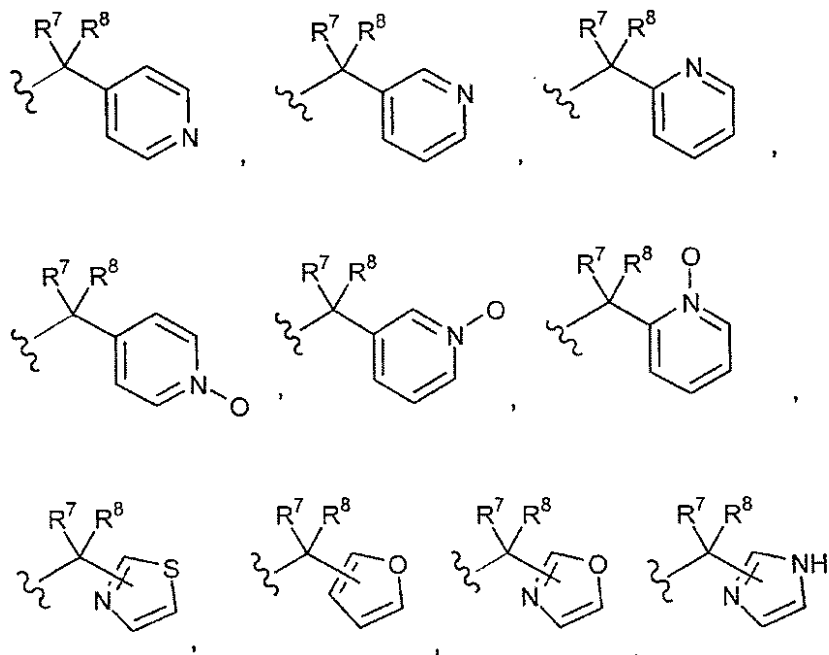
DおよびEは、N、およびC R^{5 0}からなる群より独立して選択され（ただし、DとEは同じではない）；

ここで、R^{5 0}は、H、-C(O)R^{1 3}、-C(O)OR^{1 3}、-C(O)NR^{1 3}R^{1 4}、-S(O)₂NR^{1 3}R^{1 4}、-CF₃、-CN、-NO₂、-NR^{1 3}R^{1 4}、R^{1 3}およびハロ（例えば、ClおよびBr）からなる群より選択され；

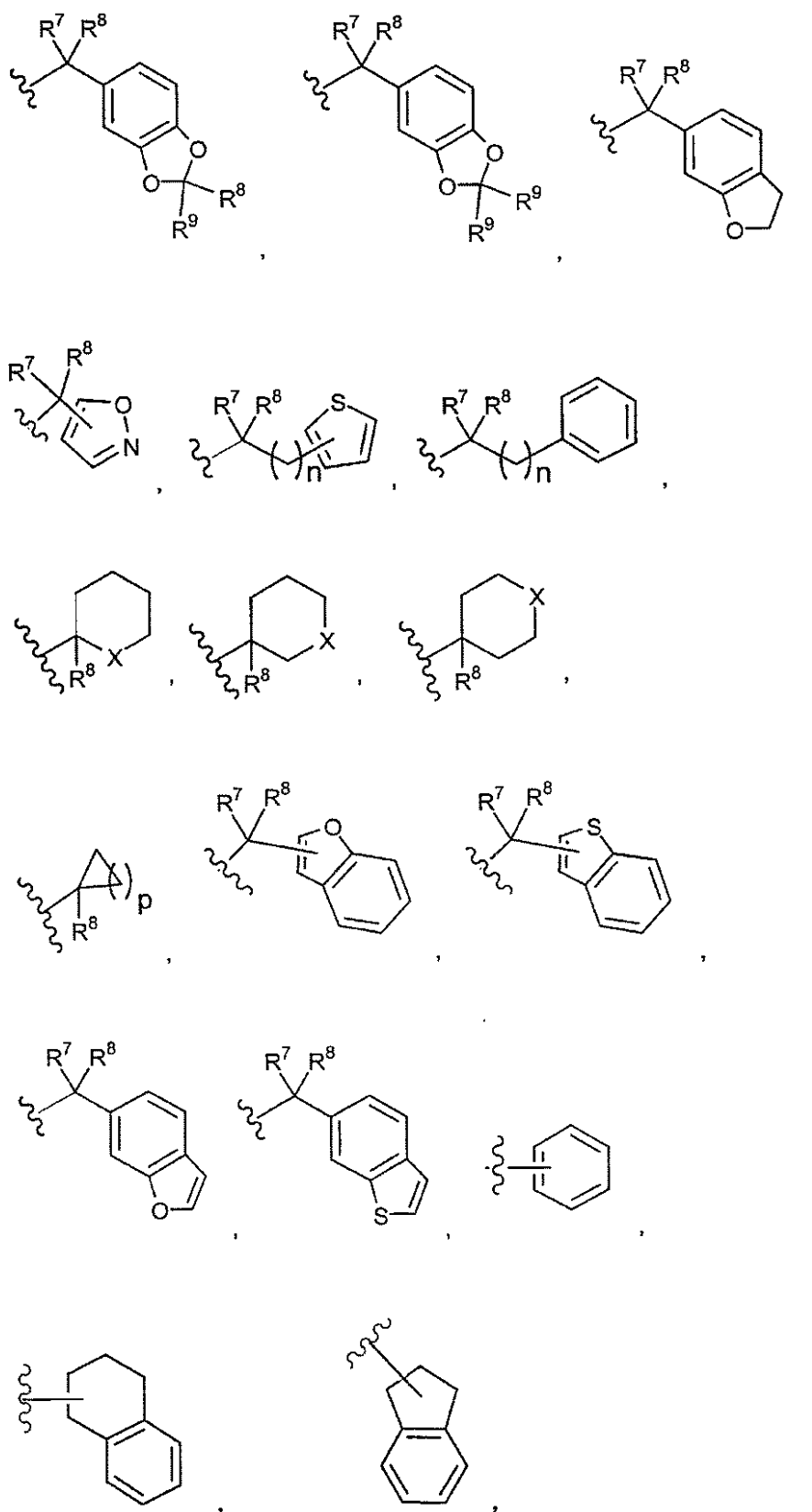
Aは、以下：

【化 2】

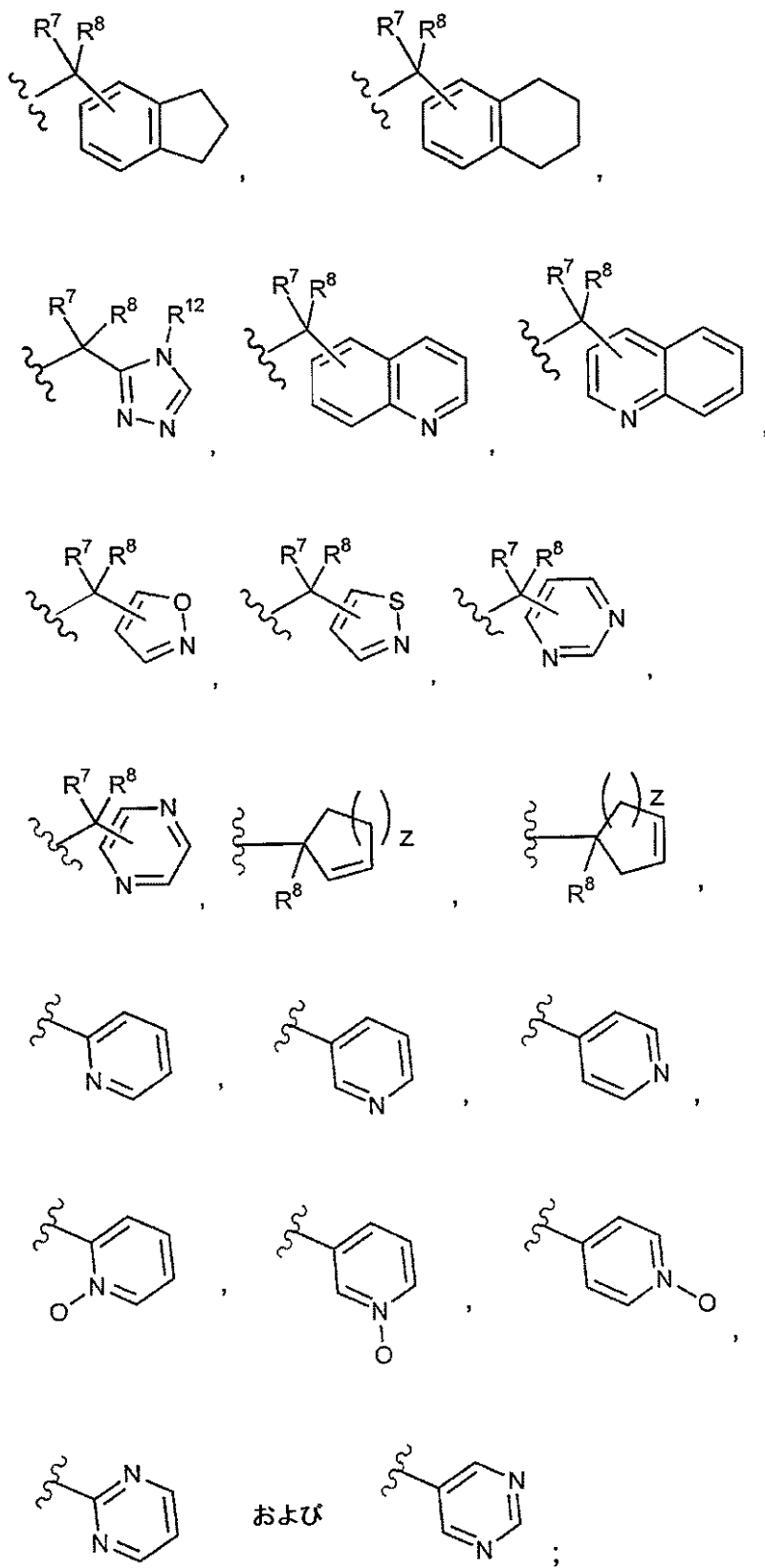
(1)



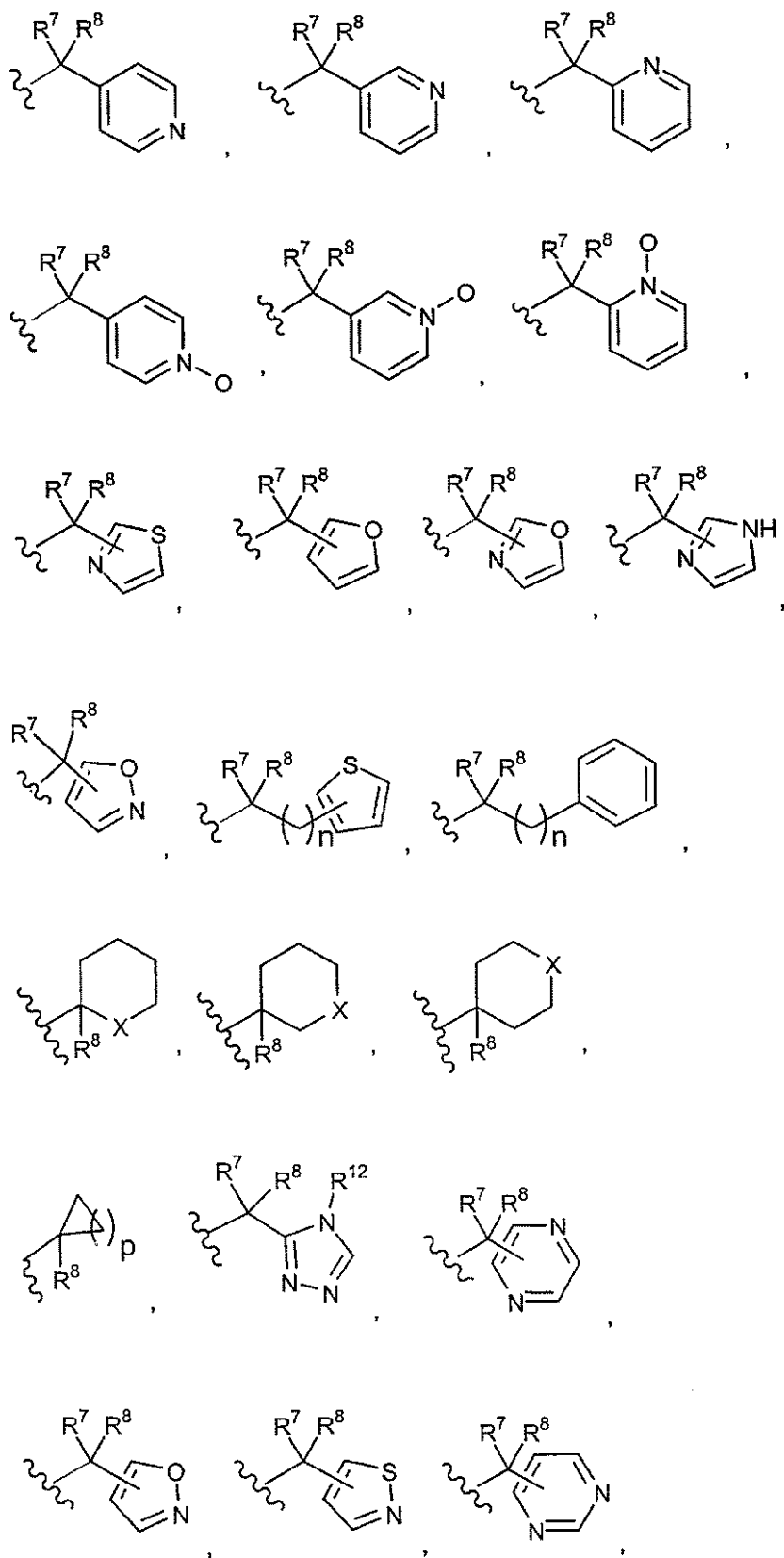
【化 3】



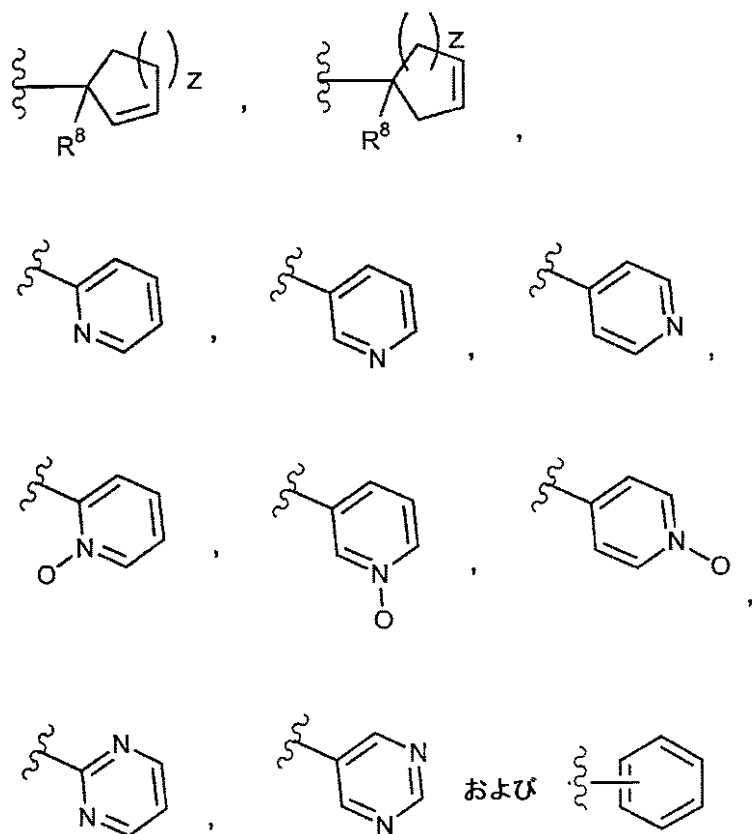
【化 4】



(2)



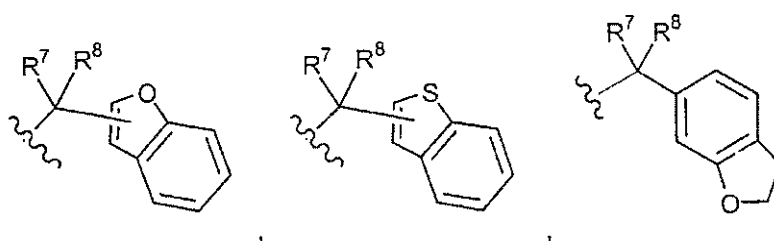
【化 6】



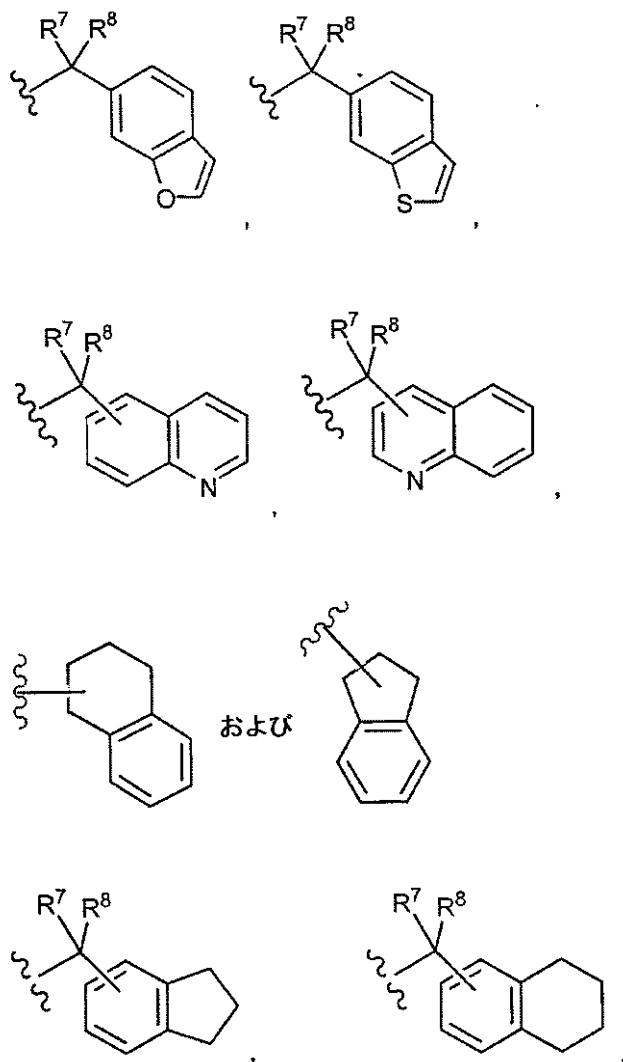
ここで該 A 基の上記環が、1 ~ 6 個の置換基で置換され、各々は、 R^9 基からなる群より独立して選択され：

【化 7】

(3)



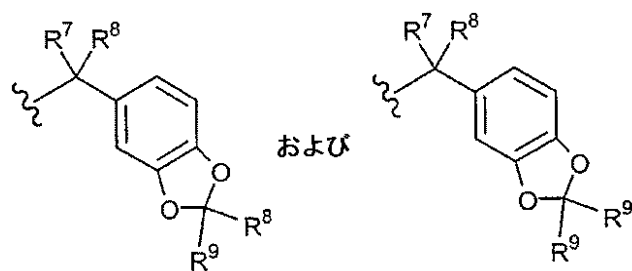
【化 8】



ここで該 A 基の上記環のうちの 1 個または両方が、1 ~ 6 個の置換基で置換され、各々は、 R^9 基からなる群より独立して選択され：

【化 9】

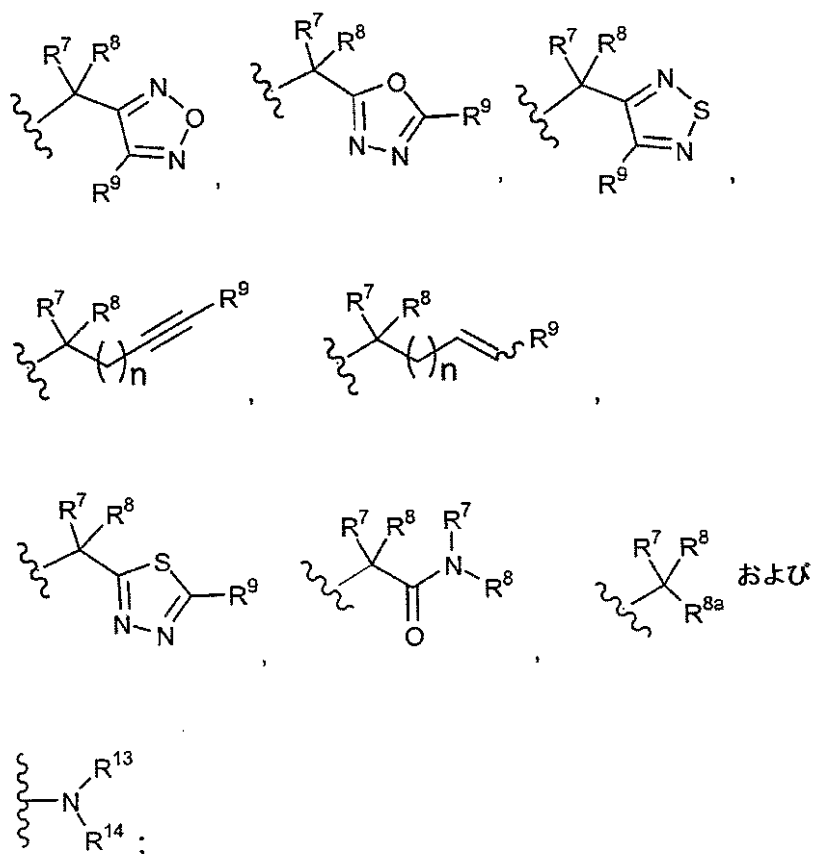
(4)



ここで該 A 基の上記フェニル環が、1 ~ 3 個の置換基で置換され、各々は、 R^9 基からなる群より独立して選択される：

【化 1 0】

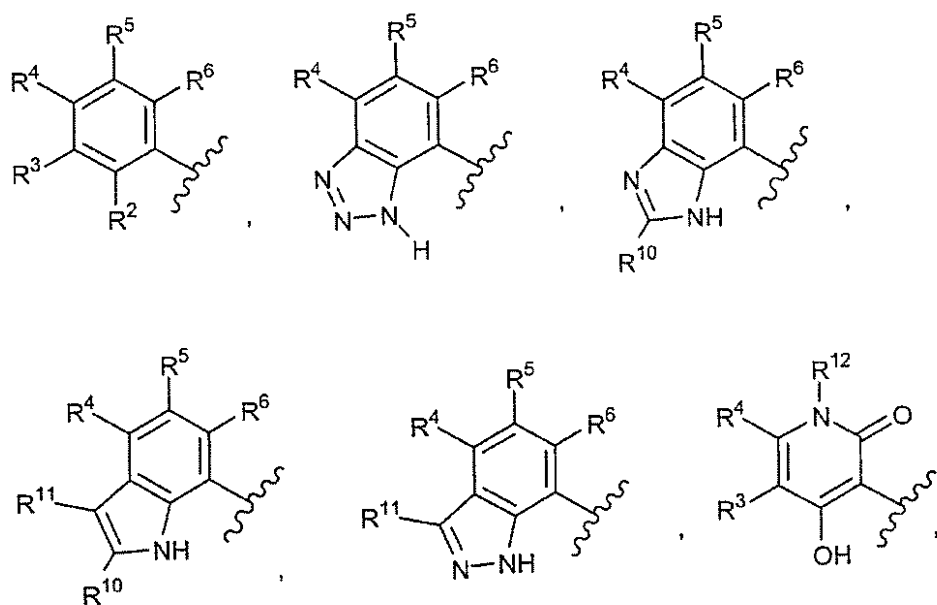
(5)



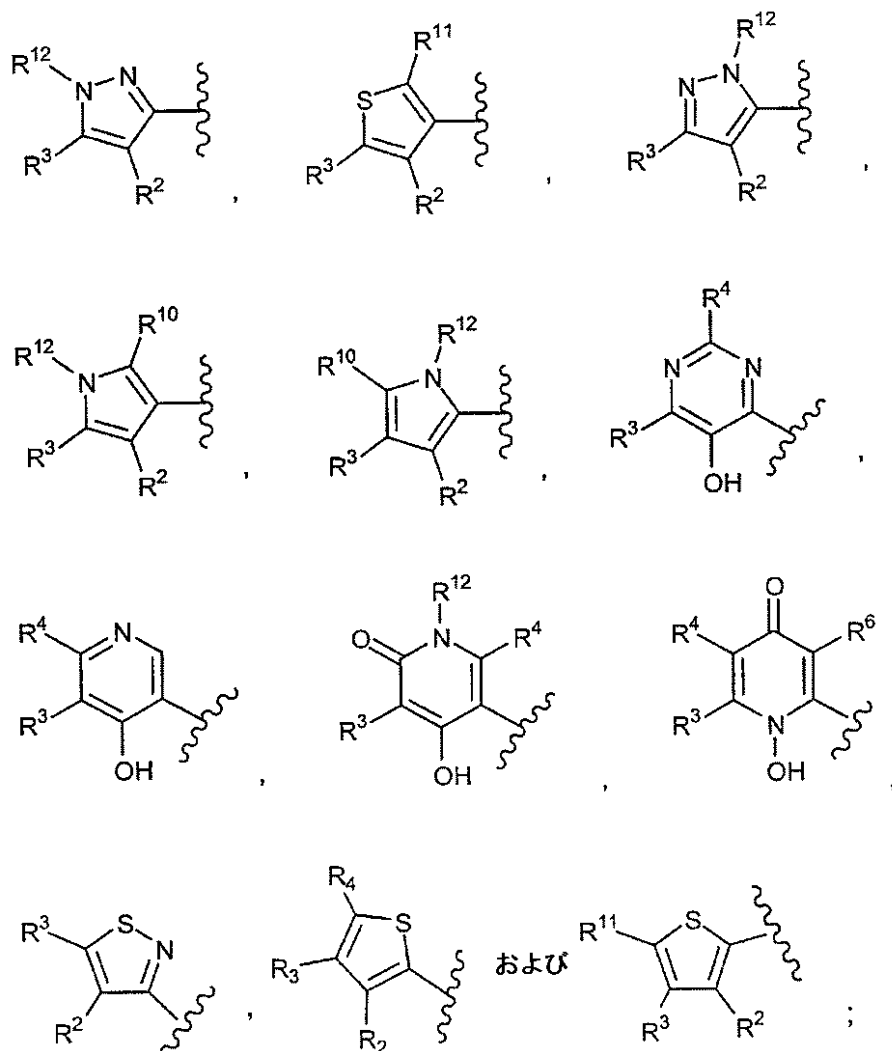
からなる群より選択され；

そしてBは、

【化 1 1】



【化 1 2】



からなる群より選択され、

n は、0 ~ 6 であり；

p は、1 ~ 5 であり；

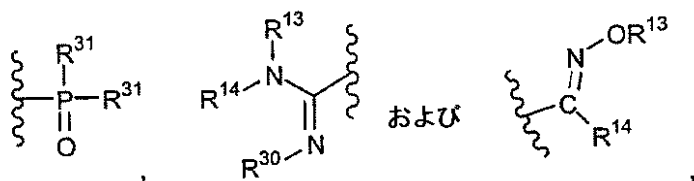
X は、O、 NR^{18} または S であり；

Z は、1 ~ 3 であり；

R^2 は、以下：水素、OH、 $-C(O)OH$ 、 $-SH$ 、 $-SO_2NR^{13}R^{14}$ 、 $-NH C(O)R^{13}$ 、 $-NH SO_2NR^{13}R^{14}$ 、 $-NH SO_2R^{13}$ 、 $-NR^{13}R^{14}$ 、 $-C(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-C(O)NHR^{13}$ 、 $-C(O)NR^{13}OH$ 、 $-S(O_2)OH$ 、 $-OC(O)R^{13}$ 、非置換複素環式酸性官能基および置換複素環式酸性官能基からなる群より選択され；ここで該置換複素環式酸性官能基に 1 ~ 6 個の置換基が存在し、各置換基は、 R^9 基からなる群より独立して選択され；

各 R^3 および R^4 は、水素、シアノ、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、1 ~ 4 個のアルキル基で置換されたシクロアルキル（各々のアルキル基は独立して選択される）、非置換シクロアルキル、1 ~ 4 個のアルキル基、 $-OH$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(O)R^{13}$ 、 $-C(O)OR^{13}$ 、 $-C(O)NHR^{17}$ 、 $-C(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-SO(t)NR^{13}R^{14}$ 、 $-SO(t)R^{13}$ 、 $-C(O)NR^{13}OR^{14}$ で置換されたシクロアルキル、非置換アリールもしくは置換アリール、非置換ヘテロアリールもしくは置換ヘテロアリール、

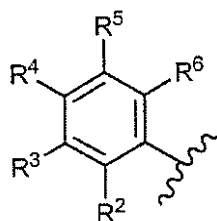
【化 1 3】



からなる群より独立して選択され、ここで、該置換アリール基に 1 ~ 6 個の置換基が存在し、各置換基は、 R^9 基からなる群より独立して選択され；ここで、該置換ヘテロアリール基に 1 ~ 6 個の置換基が存在し、各置換基は、 R^9 基からなる群より独立して選択されるか；または

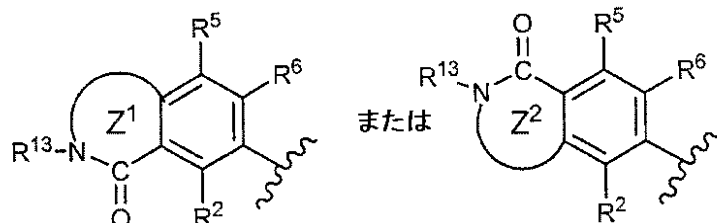
R^3 および R^4 は、それらが結合される炭素原子と一緒にあって、以下のフェニル B 置換基：

【化 1 4】



において、以下の式の縮合環：

【化 1 5】



を形成し、ここで、 Z^1 または Z^2 は、非置換もしくは置換の飽和複素環式環（好ましくは、4 ~ 7 員環の複素環式環）であり、該環 Z^1 または Z^2 は、必要に応じて、O、S および NR^{18} からなる群より選択される 1 個のさらなるヘテロ原子を含み；ここで、該環 Z^1 または Z^2 に 1 ~ 3 個の置換基が存在し、各置換基は、アルキル基、アリール基、ヒドロキシ基、ヒドロキシアルキル基、アルコキシ基、アルコキシアルキル基、アリールアルキル基、フルオロアルキル基、シクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基、ヘテロアリール基、ヘテロアリールアルキル基、アミノ基、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $-SO_tNR^{15}R^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-SO_2R^{15}$ （ただし、 R^{15} が H ではない）、 $-NHC(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $-NHC(O)OR^{15}$ 、ハロゲンおよびヘテロシクロアルケニル基からなる群より独立して選択され；

各 R^5 および R^6 は、同じであるかまたは異なり、そして水素、ハロゲン、アルキル基、アルコキシ基、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(O)R^{13}$ 、 $-C(O)OR^{13}$ 、 $-C(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-SO_tNR^{13}R^{14}$ 、 $-C(O)NR^{13}OR^{14}$ 、シアノ基、非置換アリール基もしくは置換アリール基、および非置換ヘテロアリール基もしくは置換ヘテロアリール基からなる群より独立して選択され；ここで、該置換アリール基に 1 ~ 6 個の置換基が存在し、各置換基が、 R^9 基からなる群より独立して選択され；ここで、該置換ヘテロアリール基に 1 ~ 6 個の置換基が存在し、各々の置換基は

、 R^9 基からなる群より独立して選択され；

各 R^7 および R^8 は、H、非置換アルキルもしくは置換アルキル、非置換アリールもしくは置換アリール、非置換ヘテロアリールもしくは置換ヘテロアリール、非置換アルキルアルキルもしくは置換アルキルアルキル、非置換ヘテロアリールアルキルもしくは置換ヘテロアリールアルキル、非置換シクロアルキルもしくは置換シクロアルキル、非置換シクロアルキルアルキルもしくは置換シクロアルキルアルキル、 $-CO_2R^{13}$ 、 $-CONR^{13}R^{14}$ 、アルキニル、アルケニル、およびシクロアルケニルからなる群より独立して選択され；ここで、該置換 R^7 基および R^8 基に 1 以上の置換基が存在し、各置換基が、以下：

- a) ハロゲン、
- b) $-CF_3$ 、
- c) $-COR^{13}$ 、
- d) $-OR^{13}$ 、
- e) $-NR^{13}R^{14}$ 、
- f) $-NO_2$ 、
- g) $-CN$ 、
- h) $-SO_2OR^{13}$ 、
- i) $-Si(\text{アルキル})_3$ 、ここで、各々のアルキルは、独立して選択される、
- j) $-Si(\text{アリール})_3$ 、ここで、各々のアリールは、独立して選択される、
- k) $-(R^{13})_2R^{14}Si$ 、ここで、各々の R^{13} は、独立して選択される、
- l) $-CO_2R^{13}$ 、
- m) $-C(O)NR^{13}R^{14}$ 、
- n) $-SO_2NR^{13}R^{14}$ 、
- o) $-SO_2R^{13}$ 、
- p) $-OC(O)R^{13}$ 、
- q) $-OC(O)NR^{13}R^{14}$ 、
- r) $-NR^{13}C(O)R^{14}$ 、および
- s) $-NR^{13}CO_2R^{14}$

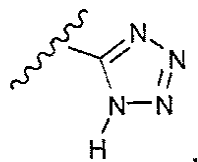
からなる群より独立して選択され（フルオロアルキルは、ハロゲンで置換されるアルキル基の非限定的な 1 例である）；

R^{8a} は、水素、アルキル、シクロアルキルおよびシクロアルキルアルキルからなる群より選択され；

各々の R^9 は、以下：

- a) $-R^{13}$ 、
- b) ハロゲン
- c) $-CF_3$ 、
- d) $-COR^{13}$ 、
- e) $-OR^{13}$ 、
- f) $-NR^{13}R^{14}$ 、
- g) $-NO_2$ 、
- h) $-CN$ 、
- i) $-SO_2R^{13}$ 、
- j) $-SO_2NR^{13}R^{14}$ 、
- k) $-NR^{13}COR^{14}$ 、
- l) $-CONR^{13}R^{14}$ 、
- m) $-NR^{13}CO_2R^{14}$ 、
- n) $-CO_2R^{13}$ 、

【化 16】



p) 1 以上の -OH 基で置換されたアルキル、

q) 1 以上の -NR¹³R¹⁴ 基で置換されたアルキル、および

r) -N(R¹³)SO₂R¹⁴

からなる群より独立して選択され；

各 R¹⁰ および R¹¹ は、R¹³、ハロゲン、-CF₃、-OCF₃、-NR¹³R¹⁴、-NR¹³C(O)NR¹³R¹⁴、-OH、-C(O)OR¹³、-SH、-SO₂R¹³、-NH₂、-NH₂NR¹³R¹⁴、-SO₂R¹³、-NHC(O)R¹³、-NH₂SO₂NR¹³R¹⁴、-NH₂SO₂R¹³、-C(O)NR¹³R¹⁴、-C(O)NR¹³OR¹⁴、-OC(O)R¹³ およびシアノからなる群より独立して選択され；

R¹² は、水素、-C(O)OR¹³、非置換アリール基もしくは置換アリール基、非置換ヘテロアリール基もしくは置換ヘテロアリール基、非置換アリールアルキル基もしくは置換アリールアルキル基、非置換シクロアルキル基もしくは置換シクロアルキル基、非置換アルキル基もしくは置換アルキル基、非置換シクロアルキルアルキル基もしくは置換シクロアルキルアルキル基、および非置換ヘテロアリールアルキル基もしくは置換ヘテロアリールアルキル基からなる群より選択され；ここで、該置換 R¹² 基に 1 ~ 6 個の置換基が存在し、各置換基は、R⁹ 基からなる群より独立して選択され；

各 R¹³ および R¹⁴ は、H、非置換アルキルもしくは置換アルキル、非置換シアノアルキルもしくは置換シアノアルキル、非置換アリールもしくは置換アリール、非置換ヘテロアリールもしくは置換ヘテロアリール、非置換アリールアルキルもしくは置換アリールアルキル、非置換ヘテロアリールアルキルもしくは置換ヘテロアリールアルキル、非置換シクロアルキルもしくは置換シクロアルキル、非置換シアノシクロアルキルもしくは置換シアノシクロアルキル、非置換シクロアルキルアルキルもしくは置換シクロアルキルアルキル、非置換複素環式もしくは置換複素環式、非置換フルオロアルキルもしくは置換フルオロアルキル、非置換ヘテロシクロアルキルアルキルもしくは置換ヘテロシクロアルキルアルキル（ここで、「ヘテロシクロアルキル」は、複素環式を意味する）からなる群より独立して選択され；ここで、該置換 R¹³ 基および R¹⁴ 基に 1 ~ 6 個の置換基が存在し、各置換基は、アルキル、-CF₃、-OH、アルコキシ、アリール、アリールアルキル、フルオロアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、-N(R⁴⁰)₂、-C(O)OR¹⁵、-C(O)NR¹⁵R¹⁶、-S(O)_tNR¹⁵R¹⁶、-C(O)R¹⁵、ハロゲン、-NHC(O)NR¹⁵R¹⁶ および -SO₂R¹⁵（ただし、R¹⁵ が H でない）からなる群（ただし、上記置換シアノアルキル基および上記シアノシクロアルキル基に関して、シアノ基が結合している炭素原子はまた、-OH、アルコキシ、-N(R⁴⁰)₂、ハロゲンおよび -NHC(O)NR¹⁵R¹⁶ からなる群より選択される置換基を、その炭素原子に結合しない）より独立して選択されるか；または

-C(O)NR¹³R¹⁴ 基および -SO₂NR¹³R¹⁴ 基における R¹³ および R¹⁴ は、それらが結合される窒素と一緒に、非置換飽和複素環式環もしくは置換飽和複素環式環を形成し、該環は、必要に応じて、O、S および NR¹⁸ からなる群より選択される 1 個のさらなるヘテロ原子を含み；ここで、該置換環化 R¹³ 基および置換環化 R¹⁴ 基に 1 ~ 3 個の置換基が存在し、各置換基は、CN 基、アルキル基、シアノアルキル基、アリール基、ヒドロキシ基、ヒドロキシアルキル基、アルコキシ基、アルコキシアルキル基、アリールアルキル基、フルオロアルキル基、シクロアルキル基、シアノシクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基、ヘテロアリール基、ヘテロアリールアルキル基

、アミノ基、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $-SO_tNR^{15}R^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-SO_2R^{15}$ （ただし、 R^{15} がHでない）、 $-NHC(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $-NHC(O)OR^{15}$ 、ハロゲン、およびヘテロシクロアルケニル基からなる群（ただし、上記シアノ基が結合している炭素原子はまた、ヒドロキシ、アルコキシ、アミノ、ハロゲン、 $-NHC(O)NR^{15}R^{16}$ および $-NHC(O)OR^{15}$ からなる群より選択される置換基と該炭素原子は結合しない）より独立して選択され；

各 R^{15} および R^{16} は、H、アルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、およびヘテロアリールからなる群より独立して選択され；

R^{17} は、 $-SO_2$ アルキル、 $-SO_2$ アリール、 $-SO_2$ シクロアルキル、および $-SO_2$ ヘテロアリールからなる群より選択され；

R^{18} はH、アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-C(O)R^{19}$ 、 $-SO_2R^{19}$ 、および $-C(O)NR^{19}R^{20}$ からなる群より選択され；

各 R^{19} および R^{20} は、アルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群より独立して選択され；

R^{30} は、アルキル、シクロアルキル、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、または $-SO_2R^{15}$ （ただし、 R^{15} がHでない）からなる群より選択され；

各 R^{31} は、非置換アルキル、非置換アリールもしくは置換アリール、非置換ヘテロアリールもしくは置換ヘテロアリール、および非置換シクロアルキルもしくは置換シクロアルキルからなる群より独立して選択され；ここで、該置換 R^{31} 基に1～6個の置換基が存在し、各置換基は、アルキル、ハロゲンおよび $-CF_3$ からなる群より独立して選択され；

各 R^{40} は、H、アルキルおよびシクロアルキルからなる群より独立して選択され；そして

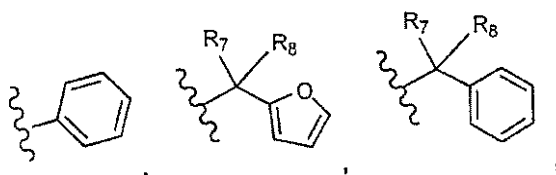
tは、0、1、または2である、
化合物。

【請求項2】

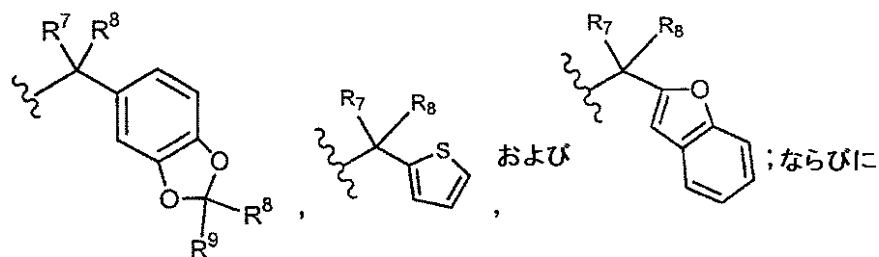
請求項1に記載の化合物であって、Aは、以下：

【化17】

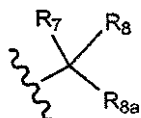
(1) 置換または非置換：



【化 1 8】



(2)

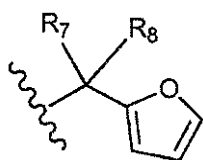


からなる群より選択される、化合物。

【請求項 3】

請求項 1 に記載の化合物であって、置換基 A は、以下：

【化 1 9】

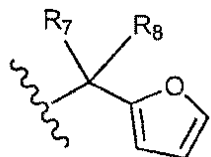


であり、ここで、該フラン環は、非置換であるか、または 1 個もしくは 2 個のアルキル基で置換されており、各アルキル基は、独立して選択され、 R^7 は、 $-CF_3$ 、アルキルおよびシクロアルキルからなる群より選択され、そして R^8 は H である、化合物。

【請求項 4】

請求項 1 に記載の化合物であって、置換基 A は、以下：

【化 2 0】

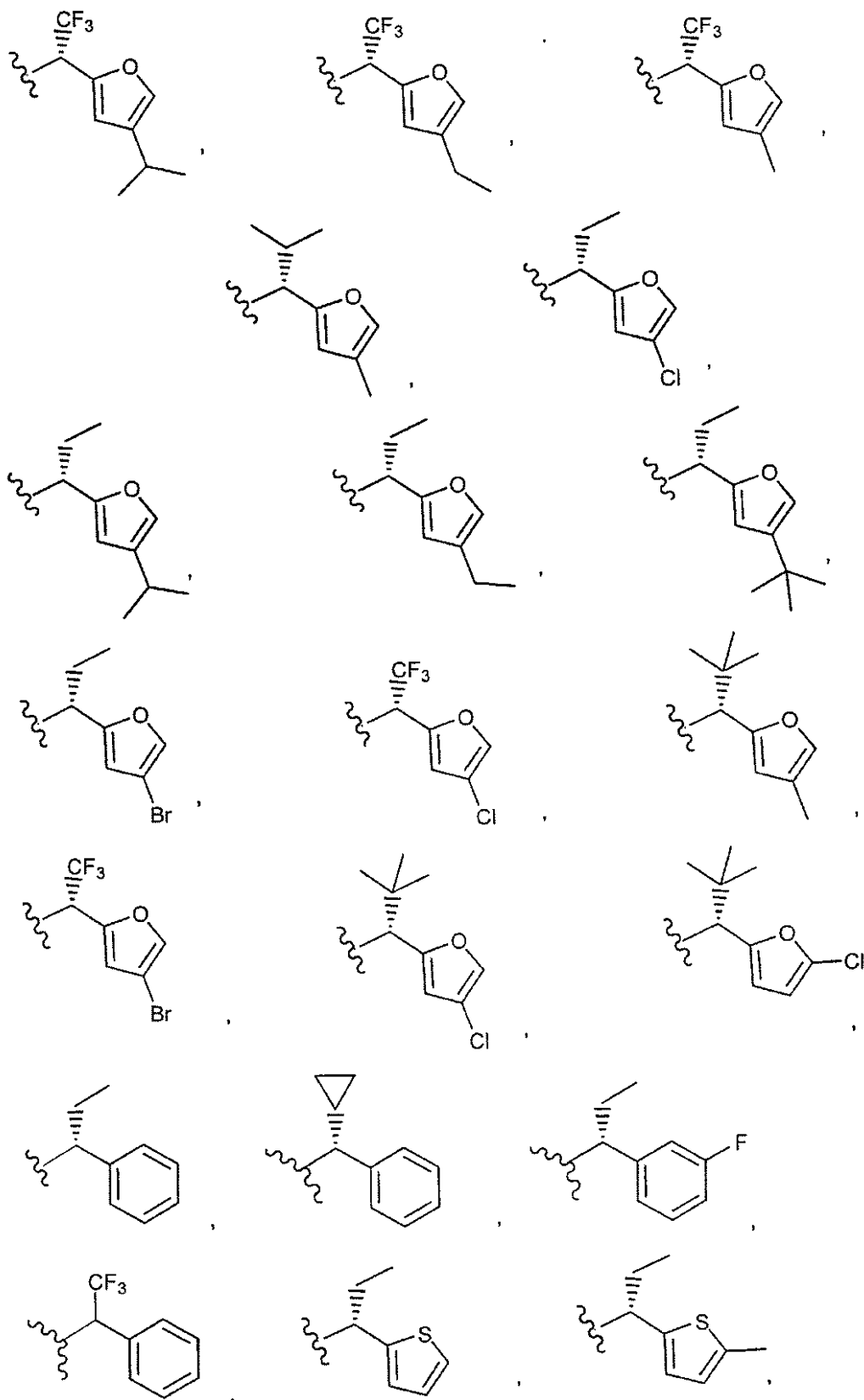


であり、ここで、該フラン環は、メチル、エチルおよびイソプロピルからなる群より独立して選択される 1 個もしくは 2 個のアルキル基で置換されており、 R^7 は、エチル、イソプロピル、および t -ブチルからなる群より選択され、そして R^8 は H である、化合物。

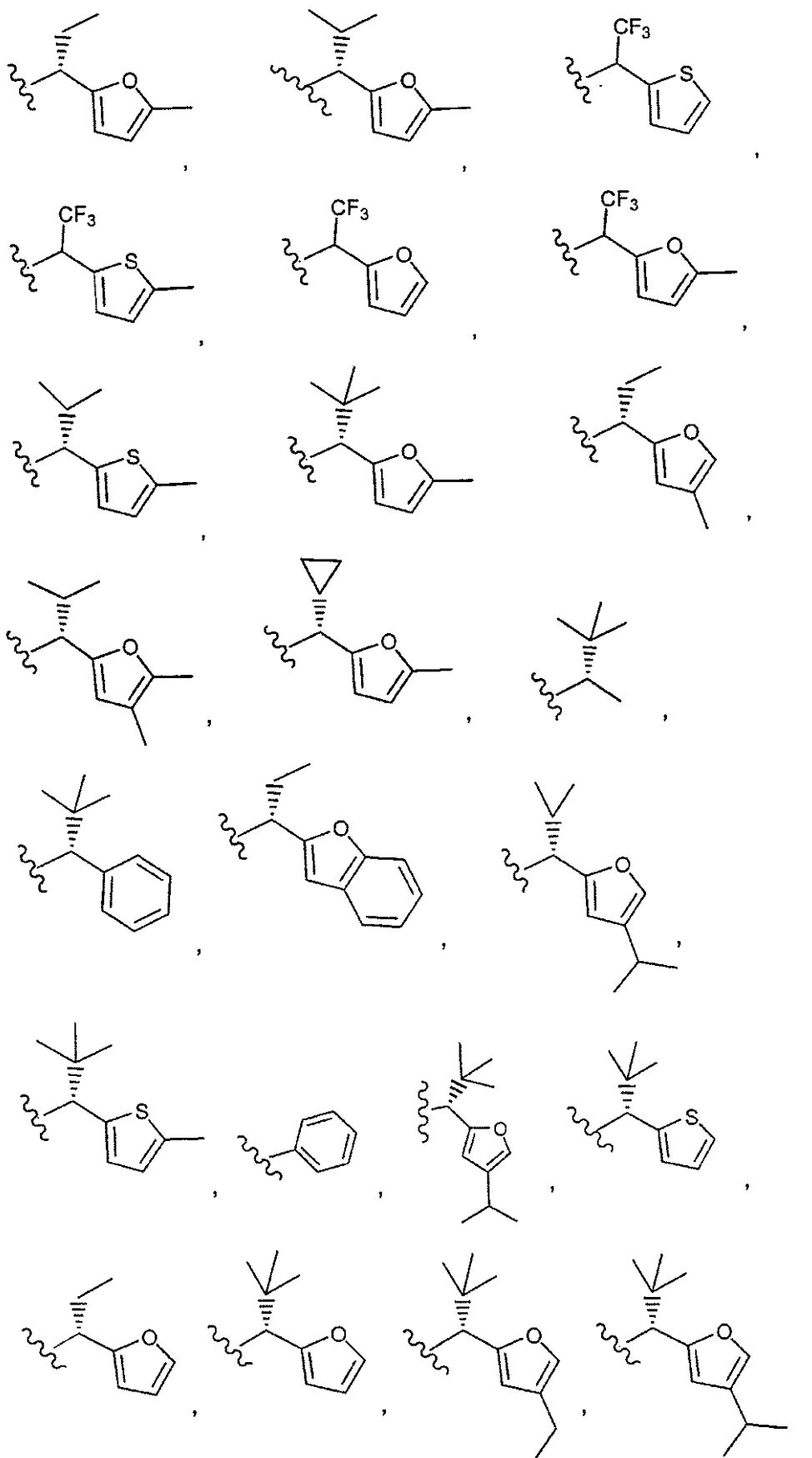
【請求項 5】

請求項 1 に記載の化合物であって、A は、以下：

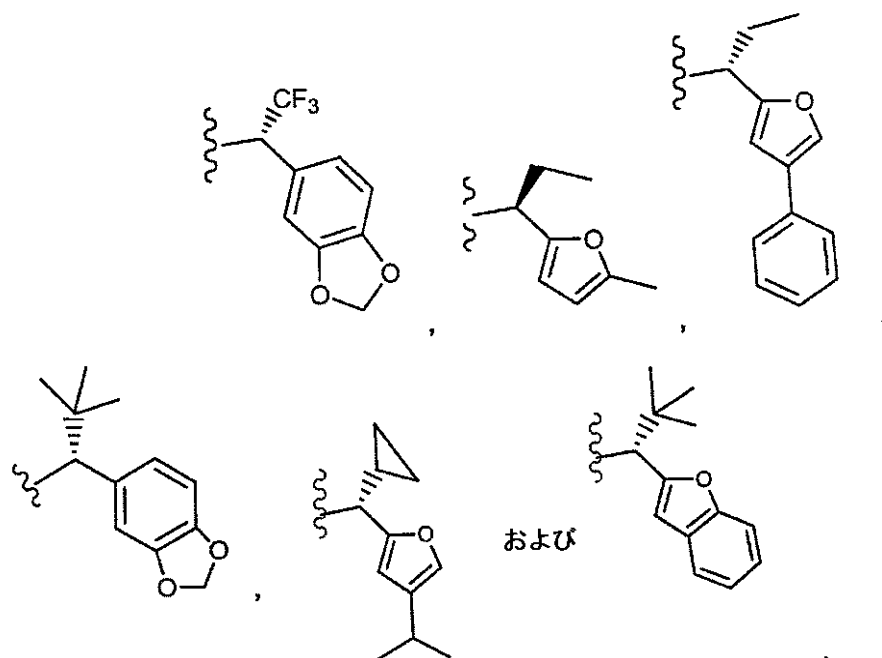
【化 2 1】



【化 2 2】



【化 2 3】

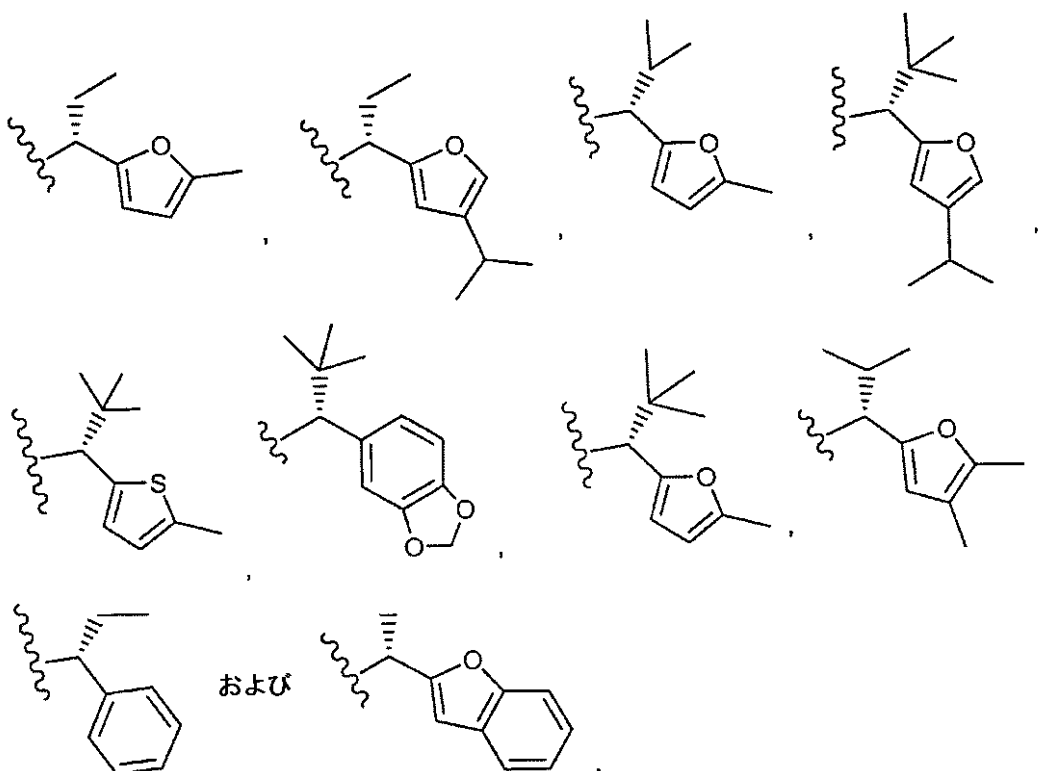


からなる群より選択される、化合物。

【請求項 6】

請求項 1 に記載の化合物であって、A は、以下：

【化 2 4】

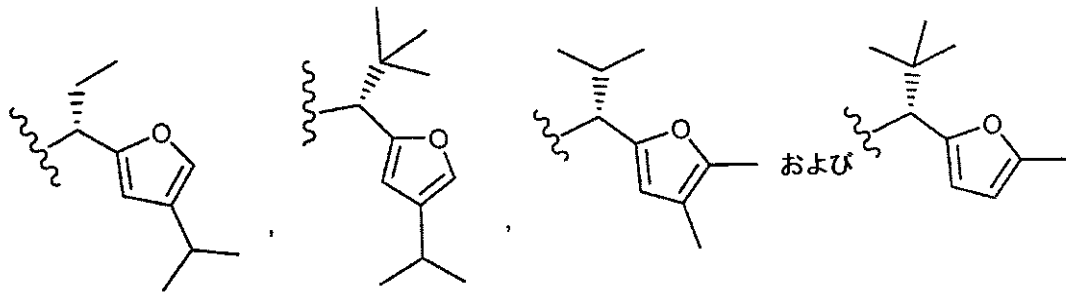


からなる群より選択される、化合物。

【請求項 7】

請求項 1 に記載の化合物であって、置換基 A は、以下：

【化 2 5】

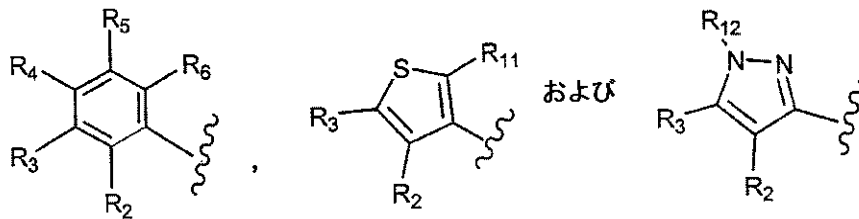


からなる群より選択される、化合物。

【請求項 8】

請求項 1 に記載の化合物であって、B は、以下：

【化 2 6】

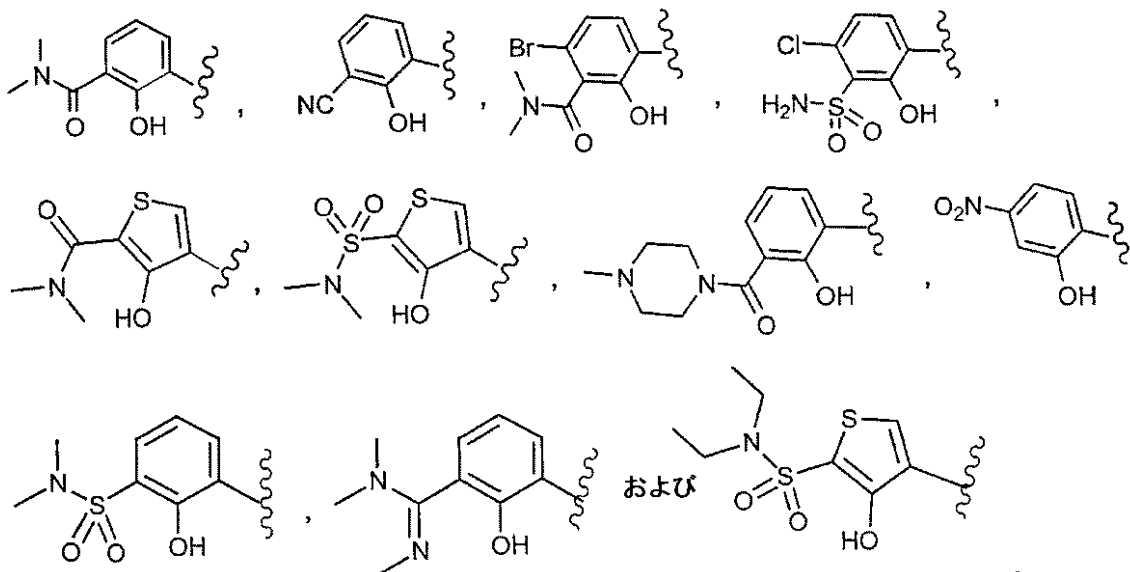


からなる群より選択される、化合物。

【請求項 9】

請求項 1 に記載の化合物であって、B は、以下：

【化 2 7】

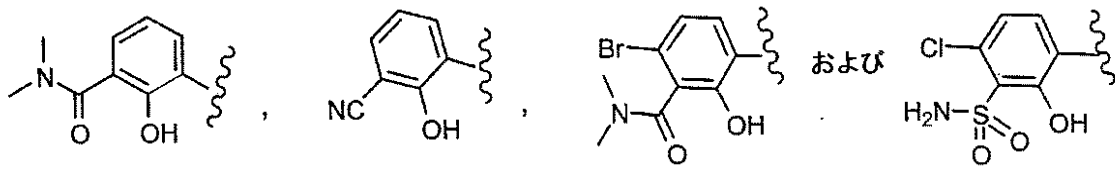


からなる群より選択される、化合物。

【請求項 10】

請求項 1 に記載の化合物であって、B は、以下：

【化 2 8】

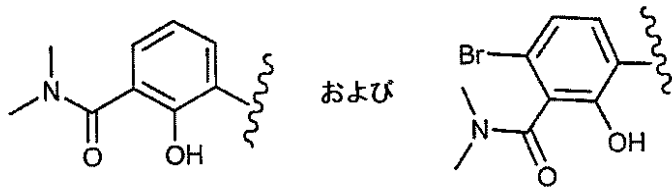


からなる群より選択される、化合物。

【請求項 1 1】

請求項 1 に記載の化合物であって、B は、以下：

【化 2 9】

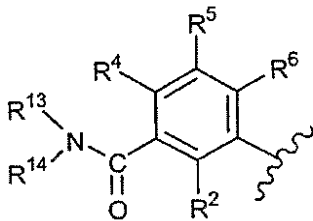


からなる群より選択される、化合物。

【請求項 1 2】

請求項 1 に記載の化合物であって、B は、以下：

【化 3 0】

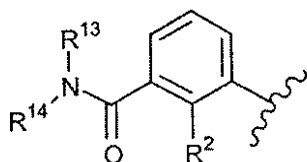


である、化合物。

【請求項 1 3】

請求項 1 に記載の化合物であって、B は、以下：

【化 3 1】

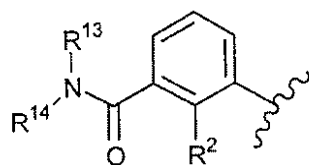


であり、ここで、 R^2 は -OH である、化合物。

【請求項 1 4】

請求項 1 に記載の化合物であって、B は、以下：

【化 3 2】

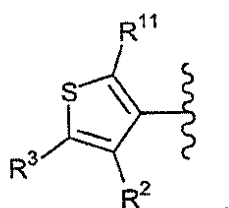


であり、ここで、 R^2 は、 $-OH$ であり、そして R^{13} および R^{14} は、 H およびアルキルからなる群より独立して選択される、化合物。

【請求項 15】

請求項 1 に記載の化合物であって、 B は、以下：

【化 3 3】



である、化合物。

【請求項 16】

R^{11} が、 H である、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 17】

R^2 が、 $-OH$ である、請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 18】

R^3 が、 $-C(O)NR^{13}R^{14}$ である、請求項 17 に記載の化合物。

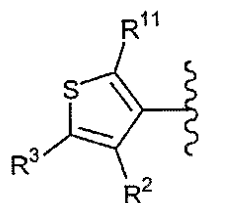
【請求項 19】

R^3 が、 $-S(O)_tNR^{13}R^{14}$ である、請求項 17 に記載の化合物。

【請求項 20】

請求項 1 に記載の化合物であって、 B は、以下：

【化 3 4】

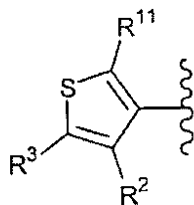


であり、ここで、 R^2 は、 $-OH$ であり、 R^3 は、 $-C(O)NR^{13}R^{14}$ であり、 R^{11} は、 H またはメチルであり、そして R^{13} および R^{14} は、 H 、アルキル、非置換シクロアルキル、置換シクロアルキル、非置換ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールからなる群より独立して選択される、化合物。

【請求項 21】

請求項 1 に記載の化合物であって、 B は、以下：

【化 3 5】

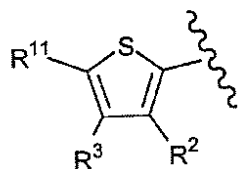


であり、ここで、R²は、-OHであり、R³は、-S(O)_tNR¹³R¹⁴であり、R¹¹は、Hまたはメチルであり、そしてR¹³およびR¹⁴は、H、アルキル、非置換シクロアルキルおよび置換シクロアルキルからなる群より独立して選択される、化合物。

【請求項 2 2】

請求項 1 に記載の化合物であって、B は、以下：

【化 3 6】



である、化合物。

【請求項 2 3】

R¹¹が、Hである、請求項 2 2 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

R²が、-OHである、請求項 2 3 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

R³が、-C(O)NR¹³R¹⁴である、請求項 2 4 に記載の化合物。

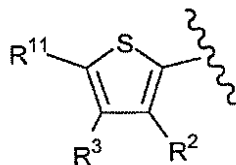
【請求項 2 6】

R³は、-S(O)_tNR¹³R¹⁴である、請求項 2 4 に記載の化合物。

【請求項 2 7】

請求項 1 に記載の化合物であって、B は、以下：

【化 3 7】

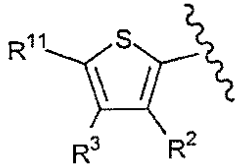


であり、ここで、R²は、-OHであり、R³は、-C(O)NR¹³R¹⁴であり、R¹¹は、Hであり、そしてR¹³およびR¹⁴は、H、アルキル、非置換ヘテロアリアルおよび置換ヘテロアリアルからなる群より独立して選択される、化合物。

【請求項 2 8】

請求項 1 に記載の化合物であって、B は、以下：

【化 3 8】

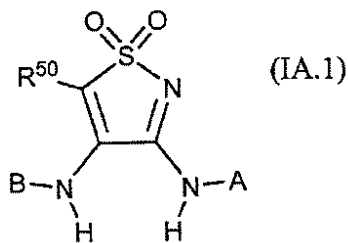


であり、ここで、R²は、-OHであり、R³は、-S(O)_tNR¹³R¹⁴であり、R¹¹は、Hであり、そしてR¹³およびR¹⁴は、Hおよびアルキルからなる群より独立して選択される、化合物。

【請求項 29】

請求項 1 に記載の化合物であって、式 I A の化合物が式 I A . 1 :

【化 3 9】

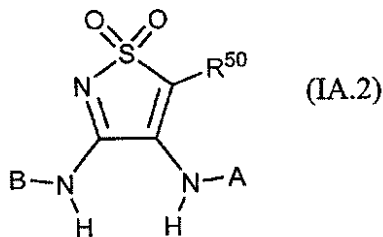


またはその薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物である、化合物。

【請求項 30】

請求項 1 に記載の化合物であって、式 I A の化合物が式 I A . 2 :

【化 4 0】



またはその薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物である、化合物。

【請求項 31】

R⁵⁰がHである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 32】

R⁵⁰が-C(O)R¹³である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 33】

R⁵⁰が-C(O)OR¹³である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 34】

R⁵⁰が-C(O)NR¹³R¹⁴である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 35】

R⁵⁰が-S(O)₂NR¹³R¹⁴である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 36】

R⁵⁰が-S(O)₂NR¹³R¹⁴である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 37】

R^{50} が $-CF_3$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 38】

R^{50} が $-CN$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 39】

R^{50} が $-NO_2$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 40】

R^{50} が $-NR^{13}R^{14}$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 41】

R^{50} が R^{13} である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 42】

R^{50} がハロである、請求項 1 に記載の化合物。

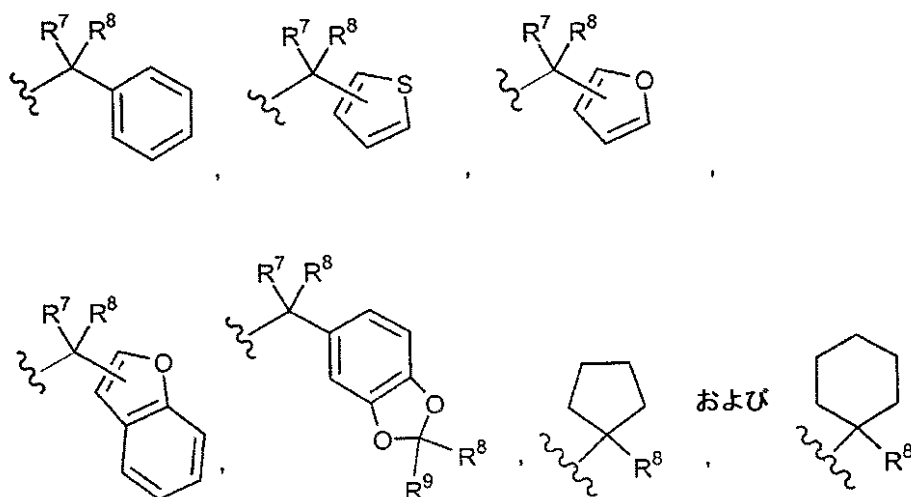
【請求項 43】

請求項 1 に記載の化合物であって、

(1) 式 I A における置換基 A は、以下の (a) および (b) からなる群より選択され：

【化 41】

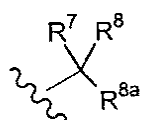
(a)



ここで、上記環は、置換されていないか、または上記環は、F、Cl、Br、アルキル、シクロアルキル、および $-CF_3$ からなる群より独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されており； R^7 は、H、 $-CF_3$ 、 $-CF_2CH_3$ 、メチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピルおよび *t*-ブチルからなる群より選択され；そして R^8 は、H であり；そして

【化 42】

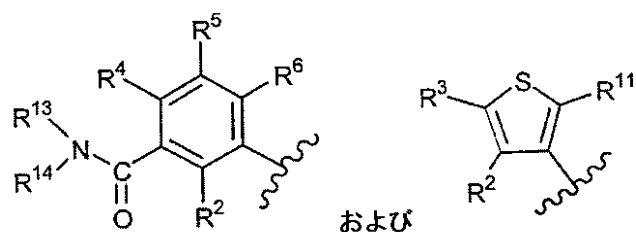
(b)



ここで、 R^7 は、H、 $-CF_3$ 、 $-CF_2CH_3$ 、メチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピルおよび *t*-ブチルからなる群より選択され； R^8 は、H であり；そして R^{8a} は、請求項 1 で定義される通りであって；

(2) 式 I A における置換基 B は、以下：

【化 4 3】



からなる群より選択され、ここで；

R^2 は、H、OH、 $-NHC(O)R^{13}$ 、および $-NH SO_2 R^{13}$ からなる群より選択され；

R^3 は、 $-C(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-SO_2NR^{13}R^{14}$ 、 $-NO_2$ 、シアノ、および $-SO_2R^{13}$ からなる群より選択され；

R^4 は、H、 $-NO_2$ 、シアノ、アルキル、ハロゲン、および $-CF_3$ からなる群より選択され；

R^5 は、H、 $-CF_3$ 、 $-NO_2$ 、ハロゲンおよびシアノからなる群より選択され；

R^6 は、H、アルキルおよび $-CF_3$ からなる群より選択され；

R^{11} は、H、ハロゲンおよびアルキルからなる群より選択され；そして

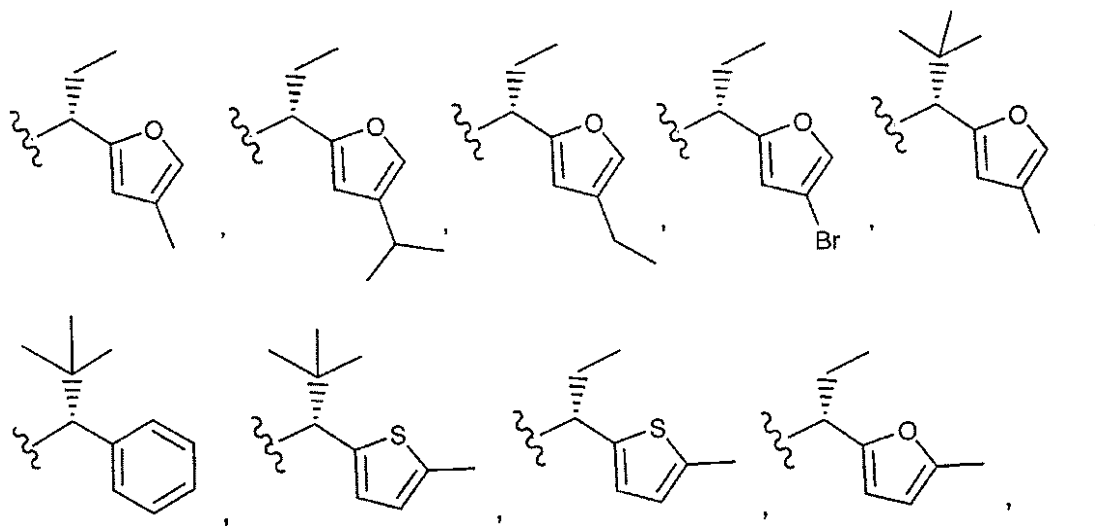
各 R^{13} および R^{14} は、H、非置換アルキルからなる群より独立して選択される、化合物。

【請求項 4 4】

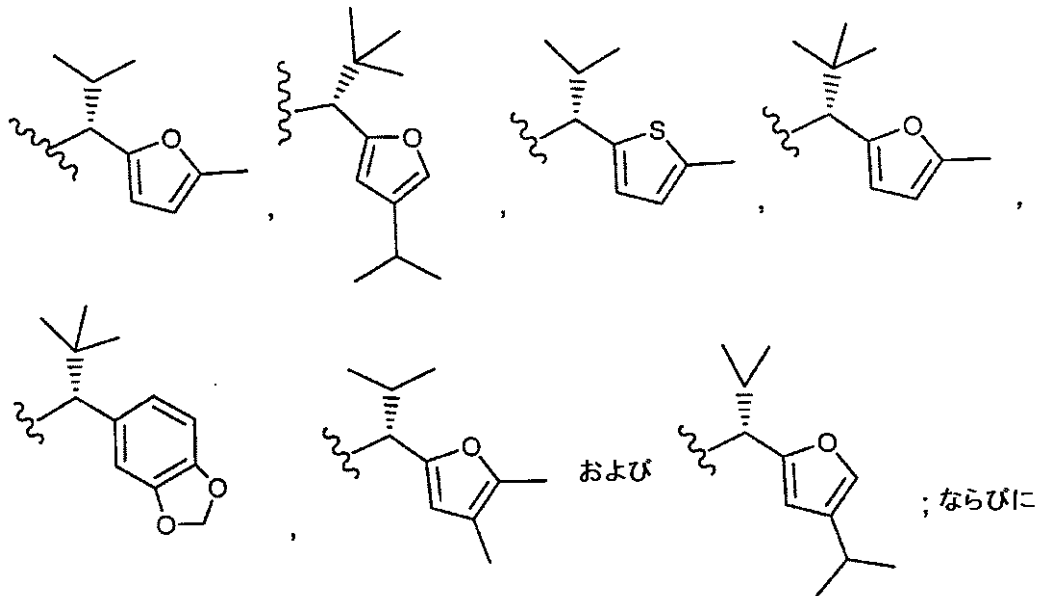
請求項 1 に記載の化合物であって、

(1) 式 I A における置換基 A は、以下：

【化 4 4】

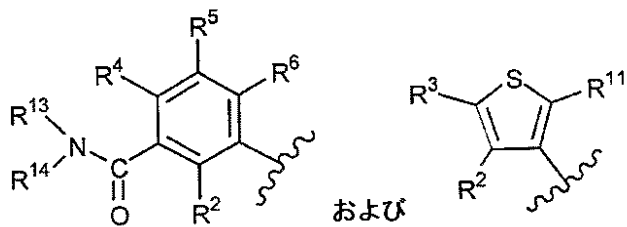


【化 4 5】



からなる群より選択され；そして
 (2) 式 I A における置換基 B は、以下：

【化 4 6】



からなる群より選択され、ここで、

R^2 は、 $-OH$ であり；

R^3 は、 $-SO_2NR^{13}R^{14}$ および $-CONR^{13}R^{14}$ からなる群より選択され；

R^4 は、 H 、 Br 、 $-CH_3$ 、エチルおよび $-CF_3$ からなる群より選択され；

R^5 は、 H およびシアノからなる群より選択され；

R^6 は、 H 、 $-CH_3$ および $-CF_3$ からなる群より選択され；

R^{11} は、 H であり；そして

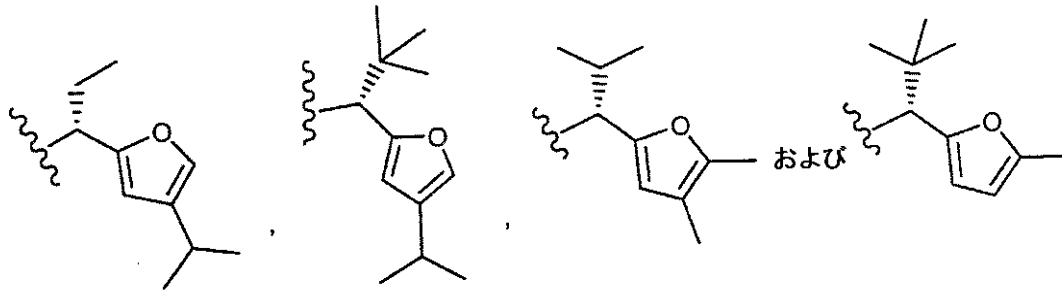
R^{13} および R^{14} は、独立して、 H およびメチルからなる群より選択される、化合物

。

【請求項 4 5】

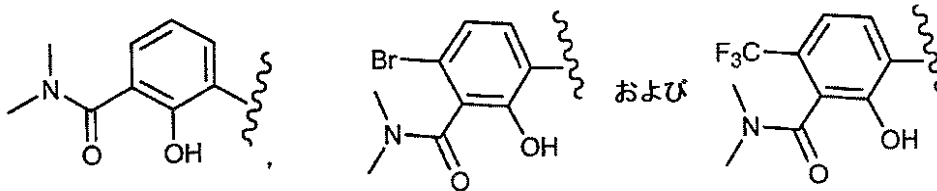
請求項 1 に記載の化合物であって、置換基 A は、以下：

【化 4 7】



からなる群より選択され、そして置換基 B は、以下：

【化 4 8】

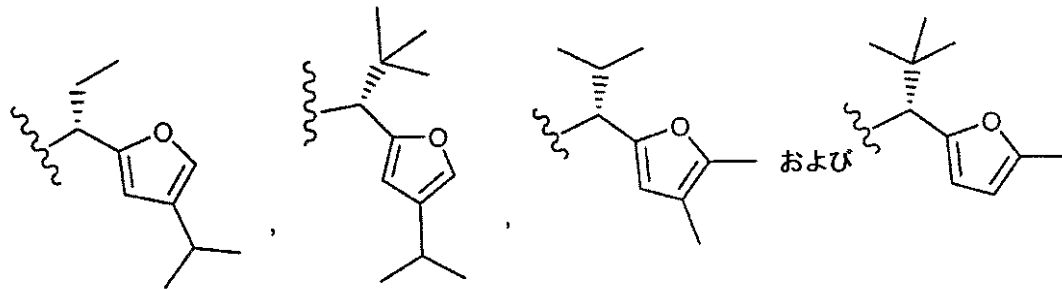


からなる群より選択される、化合物。

【請求項 4 6】

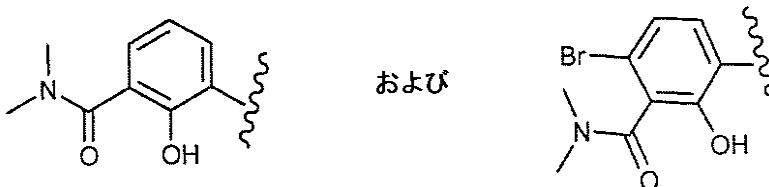
請求項 1 に記載の化合物であって、置換基 A は、以下：

【化 4 9】



からなる群より選択され、そして置換基 B は、以下：

【化 5 0】



からなる群より選択される、化合物。

【請求項 4 7】

請求項 1 ～ 4 6 のいずれか 1 項に記載の化合物の薬学的に受容可能な塩。

【請求項 4 8】

請求項 1 ～ 4 6 のいずれか 1 項に記載の化合物のナトリウム塩。

【請求項 4 9】

請求項 1 ~ 4 6 のいずれか 1 項に記載の化合物のカルシウム塩。

【請求項 5 0】

請求項 1 に記載の化合物であって、実施例 1 ~ 6、1 0 0 ~ 1 1 9、1 2 1 ~ 1 2 4、1 2 9 ~ 1 5 0、1 5 2 ~ 1 5 5、1 6 0 ~ 1 8 1、1 8 3 ~ 1 8 6、1 9 1 ~ 2 1 3、2 1 4 ~ 2 1 7 および 2 2 2 ~ 2 6 3 の最終化合物ならびにそれらの薬学的に受容可能な塩からなる群より選択される、化合物。

【請求項 5 1】

請求項 1 に記載の化合物であって、実施例 1、2、6、1 0 0、1 0 1、1 0 3、1 0 4、1 0 5、1 0 9、1 1 0、1 1 1、1 1 3、1 1 4、1 1 5、1 1 7、1 1 8、1 1 9、1 2 9、1 3 1、1 3 2、1 3 4、1 3 6、1 4 1、1 4 6、1 6 2、1 6 3、1 6 5、1 6 7、1 7 3、1 7 7、1 9 4、1 9 7、1 9 8、2 0 4、2 0 8、2 2 5、2 2 9、2 3 5、2 5 5、2 5 6 の最終化合物およびそれらの薬学的に受容可能な塩からなる群より選択される、化合物。

【請求項 5 2】

請求項 1 に記載の化合物であって、実施例 1、2、6、1 0 0、1 0 1、1 0 4、1 0 5、1 1 1、1 1 5、1 1 9、1 2 9、1 3 2、1 3 6、2 2 9、2 3 5、2 5 6 の最終化合物およびそれらの薬学的に受容可能な塩からなる群より選択される、化合物。

【請求項 5 3】

実施例 1、2、6、1 0 0、1 0 1、1 0 4、1 0 5、1 1 1、1 1 9、1 2 9、1 3 2、1 3 6、2 2 9、2 3 5、2 5 6 の最終化合物およびその薬学的に受容可能な塩からなる群より選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5 4】

請求項 1 ~ 5 3 のいずれか 1 項に記載の、単離されかつ純粋な形態の化合物。

【請求項 5 5】

請求項 1 ~ 5 4 のいずれか 1 項に記載の化合物の少なくとも 1 つまたはそれらの薬学的に受容可能な塩を、薬学的に受容可能なキャリアと組み合わせて含有する、薬学的組成物。

【請求項 5 6】

請求項 1 ~ 5 4 のいずれか 1 項に記載の化合物の少なくとも 1 つ、またはそれらの薬学的に受容可能な塩、ならびにケモカイン媒介性の疾患の処置のための少なくとも 1 種の他の薬剤、医薬品、抗体および / またはインヒビターを、薬学的に受容可能なキャリアと組み合わせて含有する、薬学的組成物。

【請求項 5 7】

ケモカイン媒介性の疾患を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 5 4 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 つの化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項 5 8】

癌を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 5 4 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 つの化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項 5 9】

癌を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 5 4 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 つの化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該組成物は、以下：(a) 微小管作用剤、(b) 抗腫瘍剤、(c) 抗血管新生剤、または (d) V E G F レセプターキナーゼインヒビター、(e) V E G F レセプターに対する抗体、(f) インターフェロン、および g) 放射線からなる群より選択される少なくとも 1 種の抗癌剤と共に用いるために適切である、組成物。

【請求項 6 0】

癌を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 5 4 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 つの化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該組成物は、ゲムシタビン、パクリタキセル、5 - フルオロウラシル、シクロホスファミド、テモゾロミド、およびビンクリスチンからなる群より選択される少なくとも 1 種の抗腫瘍剤と共に用いるために適

切である、組成物。

【請求項 6 1】

癌を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 5 4 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 つの化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該組成物は、微小管作用剤と同時かまたは連続的に用いるために適切である、組成物。

【請求項 6 2】

癌を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 5 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該組成物は：(1) 抗腫瘍剤、(2) 微小管作用剤、および(3) 抗血管新生剤、からなる群より選択される少なくとも 1 種の薬剤と同時かまたは連続的に用いるために適切である、組成物。

【請求項 6 3】

血管新生を阻害するための組成物であって、請求項 1 ~ 5 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項 6 4】

血管新生性眼疾患を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 5 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項 6 5】

疾患または状態を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 5 4 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 つの化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該疾患または状態は、疼痛、急性炎症、慢性炎症、慢性関節リウマチ、乾癬、アトピー性皮膚炎、喘息、C O P D、成人呼吸器系疾患、関節炎、炎症性腸疾患、クローン病、潰瘍性大腸炎、敗血症性ショック、内毒素性ショック、グラム陰性菌敗血症、トキシックショック症候群、発作、虚血再灌流傷害、腎性再灌流傷害、糸球体腎炎、血栓症、アルツハイマー病、対宿主性移植反応、同種移植片拒絶、マラリア、急性呼吸窮迫症候群、遅延型過敏性反応、アテローム性動脈硬化症、脳虚血、心虚血、変形性関節症、多発性硬化症、再狭窄、血管新生、骨粗鬆症、歯肉炎、呼吸器ウイルス、ヘルペスウイルス、肝炎ウイルス、H I V、カポジ肉腫関連ウイルス、髄膜炎、嚢胞性線維症、早期分娩、咳、掻痒症、多臓器不全、外傷、挫傷、捻挫、打撲傷、乾癬性関節炎、ヘルペス、脳炎、C N S 脈管炎、外傷性脳傷害、C N S 腫瘍、クモ膜下出血、術後外傷、間質性肺炎、過敏症、結晶誘発性関節炎、急性肺炎、慢性肺炎、急性アルコール性肝炎、壊死性腸炎、慢性静脈洞炎、血管新生性眼疾患、眼炎症、未熟児網膜症、糖尿病性網膜症、湿式優先の黄斑変性、角膜血管新生、多発性筋炎、脈管炎、座瘡、胃潰瘍、十二指腸潰瘍、セリアック病、食道炎、舌炎、気流閉塞、気道応答性亢進、気管支拡張症、細気管支炎、閉塞性細気管支炎、慢性気管支炎、肺性心、呼吸困難、気腫、高炭酸ガス症、過度膨張、低酸素血症、高酸素誘発性炎症、外科的肺容量減少、低酸素症、肺線維症、肺高血圧症、右心室肥大、連続携行式腹膜灌流(C A P D)に伴う腹膜炎、顆粒球エールリヒア症、サルコイドーシス、小気道疾患、呼吸還流不適合、ぜん鳴、感冒、痛風、アルコール性肝臓疾患、狼瘡、熱傷治療、歯周炎、癌、移植再灌流傷害、早期移植片拒絶、気道反応性亢進、アレルギー性接触皮膚炎、アレルギー性鼻炎、円形脱毛症、抗リン脂質症候群、再生不良性貧血、自己免疫性難聴、自己免疫性溶血性症候群、自己免疫性肝炎、自己免疫性ニューロパシー、自己免疫性卵巢不全、自己免疫性精巢炎、自己免疫性血小板減少症、水疱性類天疱瘡、慢性同種移植血管症、慢性炎症性脱髓性多発ニューロパシー、肝硬変、中心性肺炎、クリオグロブリン血症、皮膚筋炎、糖尿病、薬剤性自己免疫、後天性表皮水疱症、子宮内膜症、線維性疾患、胃炎、グッドパスチャー症候群、グレーブズ病、ギラン - バレ病、橋本甲状腺炎、肝炎関連自己免疫、H I V 関連自己免疫症候群および血液障害、下垂体炎、特発性血小板減少性紫斑病、間質性膀胱炎、若年性関節炎、ランゲルハンス細胞組織球増殖症、扁平苔癬、金属誘発性自己免疫、重篤筋無力症、脊髄形成異常症候群、心筋炎、筋炎、ニューロパシー、腎炎症候群、視神経炎、脾炎、発作性夜間血色素尿症、天疱瘡、多発性筋痛、感染後自己免疫、原発性胆汁性肝硬変、反応性関節炎、強直性脊椎炎、レーノー現象、ライター症候群、再灌流傷害、強膜炎、強皮症、自己免疫疾患の二次性血液症的発現、シリコン移植関連自己免疫疾患

、シェーグレン症候群、全身性エリテマトーデス、血小板減少症、横断脊髄炎、尿細管間質性腎炎、ブドウ膜炎、脈管炎症候群、および白斑からなる群より選択される、組成物。

【請求項 66】

ケモカイン媒介性の疾患を処置するための組成物であって、請求項 1 ～ 54 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該組成物は、ケモカイン媒介性の疾患の処置に有用な少なくとも 1 種の他の医薬と共に用いるために適切である、組成物。

【請求項 67】

ケモカイン媒介性の疾患を処置するための組成物であって、請求項 1 ～ 54 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該組成物は：

- (a) 疾患緩和抗リウマチ薬；
- (b) 非ステロイド性抗炎症薬；
- (c) COX - 2 選択的インヒビター；
- (d) COX - 1 インヒビター；
- (e) 免疫抑制剤；
- (f) ステロイド；
- (g) 生物学的応答改変物質；および

(h) ケモカイン媒介性の疾患の処置に有用な他の抗炎症剤または治療薬からなる群より選択される少なくとも 1 種の他の医薬と共に用いるために適切である、組成物。

【請求項 68】

肺疾患を処置するための組成物であって、請求項 1 ～ 54 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該組成物は：糖質コルチコイド、5 - リボキシゲナーゼインヒビター、- 2 アドレナリン作用性レセプターアゴニスト、ムスカリン性 M1 アンタゴニスト、ムスカリン性 M3 アンタゴニスト、ムスカリン性 M2 アゴニスト、NK3 アンタゴニスト、LTB4 アンタゴニスト、システイニルロイコトリエンアンタゴニスト、気管支拡張薬、PDE4 インヒビター、PDE インヒビター、エラスターゼインヒビター、MMP インヒビター、ホスホリパーゼ A2 インヒビター、ホスホリパーゼ D インヒビター、ヒスタミン H1 アンタゴニスト、ヒスタミン H3 アンタゴニスト、ドーパミンアゴニスト、アデノシン A2 アゴニスト、NK1 アンタゴニストおよび NK2 アンタゴニスト、GABA - b アゴニスト、ノシセプチンアゴニスト、去痰剤、粘液溶解剤、鬱血除去薬、抗酸化剤、抗 IL - 8 抗体、抗 IL - 5 抗体、抗 IgE 抗体、抗 TNF 抗体、IL - 10、接着分子インヒビター、および成長ホルモンからなる群より選択される少なくとも 1 種の化合物と共に用いるために適切である、組成物。

【請求項 69】

多発性硬化症を処置するための組成物であって、請求項 1 ～ 54 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該組成物は、酢酸グラチラマー、糖質コルチコイド、メトトレキサート、アゾチオプリン、ミトキサントロン、ケモカインインヒビター、および CB2 選択的薬剤からなる群より選択される少なくとも 1 種の化合物と共に用いるために適切である、組成物。

【請求項 70】

多発性硬化症を処置するための組成物であって、請求項 1 ～ 54 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該組成物は、メトトレキサート、シクロスポリン、レフルニミド、スルファサラジン、- メタゾン、- インターフェロン、酢酸グラチラマー、およびプレドニゾンからなる群より選択される少なくとも 1 種の化合物と共に用いるために適切である、組成物。

【請求項 71】

慢性関節リウマチを処置するための組成物であって、請求項 1 ～ 54 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項 72】

慢性関節リウマチを処置するための組成物であって、請求項 1 ～ 5 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該組成物は、COX-2 インヒビター、COX インヒビター、免疫抑制剤、ステロイド、PDE IV インヒビター、抗 TNF- α 化合物、MMP インヒビター、糖質コルチコイド、ケモカインインヒビター、CB2 選択的インヒビター、および慢性関節リウマチの処置に指示される他のクラスの化合物からなる群より選択される少なくとも 1 種の化合物と共に用いるために適切である、組成物。

【請求項 7 3】

発作および心再灌流傷害の処置するための組成物であって、請求項 1 ～ 5 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該組成物は、血栓溶解剤、抗血小板剤、アンタゴニスト、抗凝血薬、および慢性関節リウマチの処置に指示される他の化合物からなる群より選択される少なくとも 1 種の化合物と共に用いるために適切である、組成物。

【請求項 7 4】

発作および心再灌流傷害を処置するための組成物であって、請求項 1 ～ 5 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該組成物は、テネクテプラゼ、TPA、アルテプラゼ、アブシキシマブ、エフチイフバチド、およびヘパリンからなる群より選択される少なくとも 1 種の化合物と共に用いるために適切である、組成物。

【請求項 7 5】

乾癬を処置するための組成物であって、請求項 1 ～ 5 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該組成物は、免疫抑制剤、ステロイド、および抗 TNF- α 化合物からなる群より選択される少なくとも 1 種の化合物と共に用いるために適切である、組成物。

【請求項 7 6】

COPD を処置するための組成物であって、請求項 1 ～ 5 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項 7 7】

疼痛を処置するための組成物であって、請求項 1 ～ 5 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項 7 8】

請求項 7 7 に記載の組成物であって、前記疼痛が：異痛、強直性脊椎炎、虫垂炎、自己免疫障害、細菌感染、ベーチェット症候群、骨折、気管支炎、熱傷、滑液包炎、転移性癌を含む癌、カンジダ症、心臓血管系状態、カウザルギー、化学的傷害、分娩、慢性局所ニューロパシー、クローン病、結腸直腸癌、結合組織障害、結膜炎、COPD、頭蓋内圧下降、歯科処置、皮膚炎、糖尿病、糖尿病性ニューロパシー、知覚不全、月経困難、湿疹、気腫、熱、線維筋痛、胃潰瘍、胃炎、巨細胞性動脈炎、歯肉炎、痛風、痛風性関節炎、頭痛、腰椎穿刺から生じる頭痛、片頭痛を含む頭痛、単純ヘルペスウイルス感染、HIV、ホジキン病、痛覚過敏、過敏症、炎症性腸疾患、頭蓋内圧亢進、過敏性腸症候群、虚血、若年性関節炎、腎結石、腰部脊椎関節症、腰部状態、上背部状態、腰仙状態、腰部脊椎関節症、月経性痙攣、片頭痛、小傷害、多発性硬化症、重篤筋無力症、心筋炎、筋肉疲労、筋骨格状態、心筋虚血、腎炎症候群、神経根引き抜き損傷、神経炎、栄養障害、眼状態、角膜状態、光恐怖症、眼疾患、変形性関節症、耳手術、外耳炎、中耳炎、結節性動脈周囲炎、末梢ニューロパシー、幻肢痛、多発性筋炎、ヘルペス後神経痛、術後/外科的回復、開胸術後、乾癬性関節炎、肺線維症、肺水腫、神経根障害、反応性関節炎、反射性交感神経性ジストロフィー、網膜炎、網膜症、リウマチ熱、慢性関節リウマチ、サルコイドーシス、坐骨神経痛、強皮症、鎌状赤血球貧血、洞頭痛、静脈洞炎、脊髄傷害、脊椎関節症、捻挫、発作、外耳炎、腱炎、挫傷性頭痛、視床症候群、血栓症、甲状腺炎、トキシン、外傷性傷害、三叉神経痛、潰瘍性大腸炎、尿生殖器状態、ブドウ膜炎、膣炎、血管系疾患、脈管炎、ウイルス感染および/または創傷治癒と関連する、組成物。

【請求項 79】

疼痛を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 54 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該組成物は、NSAID、COXIB インヒビター、抗うつ薬および鎮痙薬からなる群より選択される少なくとも 1 つの医薬と共に用いるために適切である、組成物。

【請求項 80】

疼痛を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 54 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該組成物は、少なくとも 1 つの NSAID と共に用いるために適切である、組成物。

【請求項 81】

疼痛を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 54 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該組成物は、少なくとも 1 つの COXIB インヒビターと共に用いるために適切である、組成物。

【請求項 82】

疼痛を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 54 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該組成物は、少なくとも 1 つの抗うつ薬と共に用いるために適切である、組成物。

【請求項 83】

疼痛を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 54 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該組成物は、少なくとも 1 つの鎮痙薬と共に用いるために適切である、組成物。

【請求項 84】

請求項 80 に記載の組成物であって、ここで前記 NSAID が、ピロキシカム、ケトプロフェン、ナプロキセン、インドメタシン、およびイブプロフェンからなる群より選択される、組成物。

【請求項 85】

請求項 81 に記載の組成物であって、ここで前記 COXIB インヒビターが、ロフェコキシブおよびセレコキシブからなる群より選択される、組成物。

【請求項 86】

請求項 82 に記載の組成物であって、ここで前記抗うつ薬が、アミトリプチリンおよびノルトリプチリンからなる群より選択される、組成物。

【請求項 87】

請求項 83 に記載の組成物であって、ここで前記鎮痙薬が、ガバペンチン、カルバマゼピン、プレガバリンおよびラモトラジンからなる群より選択される、組成物。

【請求項 88】

急性疼痛を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 54 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項 89】

急性炎症性疼痛を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 54 のいずれか 1 項に記載の化合物およびその薬学的に受容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項 90】

慢性炎症性疼痛を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 54 のいずれか 1 項に記載の化合物およびその薬学的に受容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項 91】

ニューロパシー性疼痛を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 54 のいずれか 1 項に記載の化合物およびその薬学的に受容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項 92】

関節炎を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 54 のいずれか 1 項に記載の化合物およびその薬学的に受容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項 93】

変形性関節症を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 5 4 のいずれか 1 項に記載の化合物または薬学的に受容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項 9 4】

請求項 6 5 に記載の組成物であって、ここで

- (a) 前記同種移植片拒絶が、急性同種移植片拒絶および慢性同種移植片拒絶からなる群より選択され、
- (b) 前記早期移植片拒絶が、急性同種移植片拒絶であり、
- (c) 前記自己免疫難聴が、メニエール病であり
- (d) 前記心筋炎が、ウイルス性心筋炎であり、
- (e) 前記ニューロパシーが、I g A ニューロパシー、膜性ニューロパシーおよび特発性ニューロパシーからなる群より選択され、
- (f) 前記自己免疫疾患が、貧血であり、
- (g) 前記脈管炎症候群が、巨細胞性動脈炎、ベーチェット病およびヴェーゲナー肉芽腫症からなる群より選択され、ならびに
- (h) 前記疼痛が：急性疼痛、急性炎症性疼痛、慢性炎症性疼痛およびニューロパシー性疼痛からなる群より選択される、組成物。

【請求項 9 5】

C X C R 1 媒介性の疾患または状態ならびに / あるいは C X C R 2 媒介性の疾患または状態の処置を必要とする患者において、C X C R 1 媒介性の疾患または状態ならびに / あるいは C X C R 2 媒介性の疾患または状態を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 5 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該疾患または状態は：疼痛、急性炎症、慢性炎症、慢性関節リウマチ、乾癬、アトピー性皮膚炎、喘息、C O P D、成人呼吸器系疾患、関節炎、炎症性腸疾患、クローン病、潰瘍性大腸炎、敗血症性ショック、内毒素性ショック、グラム陰性菌敗血症、トキシックショック症候群、発作、虚血再灌流傷害、腎性再灌流傷害、糸球体腎炎、血栓症、アルツハイマー病、対宿主性移植反応、同種移植片拒絶、マラリア、急性呼吸窮迫症候群、遅延型過敏性反応、アテローム性動脈硬化症、脳虚血、心虚血、変形性関節症、多発性硬化症、再狭窄、血管新生、骨粗鬆症、歯肉炎、呼吸器ウイルス、ヘルペスウイルス、肝炎ウイルス、H I V、カポジ肉腫関連ウイルス、髄膜炎、嚢胞性線維症、早期分娩、咳、掻痒症、多臓器不全、外傷、挫傷、捻挫、打撲傷、乾癬性関節炎、ヘルペス、脳炎、C N S 脈管炎、外傷性脳傷害、C N S 腫瘍、クモ膜下出血、術後外傷、間質性肺炎、過敏症、結晶誘発性関節炎、急性膀胱炎、慢性膀胱炎、急性アルコール性肝炎、壊死性腸炎、慢性静脈洞炎、血管新生性眼疾患、眼炎症、未熟児網膜症、糖尿病性網膜症、湿式優先の黄斑変性、角膜血管新生、多発性筋炎、脈管炎、座瘡、胃潰瘍、十二指腸潰瘍、セリアック病、食道炎、舌炎、気流閉塞、気道応答性亢進、気管支拡張症、細気管支炎、閉塞性細気管支炎、慢性気管支炎、肺性心、呼吸困難、気腫、高炭酸ガス症、過度膨張、低酸素血症、高酸素誘発性炎症、低酸素症、外科的肺容量減少、肺線維症、肺高血圧症、右心室肥大、連続携行式腹膜灌流 (C A P D) に伴う腹膜炎、顆粒球エールリヒア症、サルコイドーシス、小気道疾患、呼吸還流不適合、ぜん鳴、感冒、痛風、アルコール性肝臓疾患、狼瘡、熱傷治療、歯周炎、癌、移植再灌流傷害、早期移植片拒絶からなる群より選択される、組成物。

【請求項 9 6】

C C R 7 媒介性の疾患、または状態の処置を必要とする患者において、C C R 7 媒介性の疾患、または状態を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 5 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、該疾患または状態は：疼痛、急性炎症、慢性炎症、急性同種移植片拒絶、急性呼吸窮迫症候群、成人呼吸器系疾患、気道反応性亢進、アレルギー性接触皮膚炎、アレルギー性鼻炎、円形脱毛症、アルツハイマー病、血管新生性眼疾患、抗リン脂質症候群、再生不良性貧血、喘息、アテローム性動脈硬化症、アトピー性皮膚炎、自己免疫性難聴、自己免疫性溶血性症候群、自己免疫性肝炎、自己免疫性ニューロパシー、自己免疫性卵巣不全、自己免疫性精巣炎、自己免疫性血小板減少症、細気管支炎、閉塞性細気管支炎症候群、水疱性類天疱瘡、熱傷治療、癌、脳虚血

、心虚血、慢性同種移植片拒絶、慢性同種移植脈管障害、慢性気管支炎、慢性炎症性脱髄性多発ニューロパシー、慢性静脈洞炎、肝硬変、CNS脈管炎、COPD、中心性肺炎、クローン病、クリオグロブリン血症、結晶誘発性関節炎、遅延型過敏症反応、皮膚筋炎、糖尿病、糖尿病性網膜症、薬物性自己免疫、呼吸困難、気腫、後天性表皮水疱症、子宮内膜症、線維性疾患、胃炎、糸球体腎炎、グッドパスチャー症候群、移植片対宿主疾患、グレーヴズ病、ギラン・バレー病、橋本甲状腺炎、肝炎関連自己免疫、HIV関連の自己免疫症候群および血液障害、高酸素症誘発性炎症、高炭酸ガス症、過度膨張、下垂体炎、低酸素症、特発性血小板紫斑病、炎症性腸疾患、間質性膀胱炎、間質性肺炎、若年性関節炎、ランゲルハンス細胞組織球増殖症、扁平苔癬、金属誘発性自己免疫、多発性硬化症、重篤筋無力症、骨髄異形成症候群、心筋炎（ウイルス性心筋炎を含む）、筋炎、ニューロパシー、腎炎症候群、眼炎症、視神経炎、変形性関節症、腓炎、発作性夜間血色素尿症、天疱瘡、多発性筋痛、多発性筋炎、感染後自己免疫、肺線維症、原発性胆汁性肝硬変、乾癬、掻痒症、慢性関節リウマチ、反応性関節炎、強直性脊椎炎、乾癬性関節炎、レーノー現象、ライター症候群、再灌流傷害、再狭窄、サルコイドーシス、強膜炎、強皮症、自己免疫疾患の二次性血液症的発現、シリコン移植関連自己免疫疾患、シェーグレン症候群、全身性エリテマトーデス、血小板減少症、血栓症、横断脊髄炎、尿細管間質性腎炎、潰瘍性大腸炎、ブドウ膜炎、脈管炎および脈管炎症候群ならびに白斑からなる群より選択される、組成物。

【請求項 97】

請求項 95 に記載の組成物であって、ここで：

- (a) 前記同種移植片拒絶が、急性同種移植片拒絶および慢性同種移植片拒絶からなる群より選択され、
- (b) 前記早期移植片拒絶が、急性同種移植片拒絶であり、
- (c) 前記自己免疫難聴が、メニエール病であり
- (d) 前記心筋炎が、ウイルス性心筋炎であり、
- (e) 前記ニューロパシーが、IgAニューロパシー、膜性ニューロパシーおよび特発性ニューロパシーからなる群より選択され、
- (f) 前記自己免疫疾患が、貧血であり、
- (g) 前記脈管炎症候群が、巨細胞性動脈炎、ベーチェット病およびヴェーゲナー肉芽腫症からなる群より選択され、そして
- (h) 前記疼痛が：急性疼痛、急性炎症性疼痛、慢性炎症性疼痛およびニューロパシー性疼痛からなる群より選択される、組成物。

【請求項 98】

請求項 96 に記載の組成物であって、ここで：

- (a) 前記同種移植片拒絶が、急性同種移植片拒絶および慢性同種移植片拒絶からなる群より選択され、
- (b) 前記早期移植片拒絶が、急性同種移植片拒絶であり、
- (c) 前記自己免疫難聴が、メニエール病であり
- (d) 前記心筋炎が、ウイルス性心筋炎であり、
- (e) 前記ニューロパシーが、IgAニューロパシー、膜性ニューロパシーおよび特発性ニューロパシーからなる群より選択され、
- (f) 前記自己免疫疾患が、貧血であり、
- (g) 前記脈管炎症候群が、巨細胞性動脈炎、ベーチェット病およびヴェーゲナー肉芽腫症からなる群より選択され、そして
- (h) 前記疼痛が：急性疼痛、急性炎症性疼痛、慢性炎症性疼痛およびニューロパシー性疼痛からなる群より選択される、組成物。

【請求項 99】

狭心症を処置するための組成物であって、請求項 1 ～ 54 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩を含有する、組成物。