

【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】令和1年6月6日(2019.6.6)

【公表番号】特表2018-520096(P2018-520096A)

【公表日】平成30年7月26日(2018.7.26)

【年通号数】公開・登録公報2018-028

【出願番号】特願2017-559303(P2017-559303)

【国際特許分類】

C 07 D 209/18 (2006.01)
A 61 K 45/00 (2006.01)
A 61 P 7/00 (2006.01)
A 61 P 3/02 (2006.01)
A 61 P 35/00 (2006.01)
A 61 P 25/00 (2006.01)
A 61 P 37/02 (2006.01)
A 61 P 19/02 (2006.01)
A 61 P 35/02 (2006.01)
A 61 P 31/22 (2006.01)
A 61 K 31/5377 (2006.01)
A 61 K 31/404 (2006.01)
A 61 K 31/439 (2006.01)
A 61 K 31/437 (2006.01)
A 61 K 31/541 (2006.01)
A 61 K 31/4375 (2006.01)
A 61 K 31/454 (2006.01)
A 61 K 31/4545 (2006.01)
A 61 K 31/496 (2006.01)
A 61 K 31/41 (2006.01)
A 61 K 31/422 (2006.01)
A 61 K 31/501 (2006.01)
A 61 K 31/405 (2006.01)
A 61 K 31/4725 (2006.01)
A 61 K 31/4439 (2006.01)
A 61 K 31/506 (2006.01)
A 61 K 31/428 (2006.01)
A 61 K 31/427 (2006.01)
A 61 K 31/438 (2006.01)
A 61 K 31/433 (2006.01)
A 61 K 31/4155 (2006.01)
A 61 K 31/517 (2006.01)
A 61 K 31/551 (2006.01)
A 61 K 31/416 (2006.01)
A 61 K 31/407 (2006.01)
C 07 D 405/12 (2006.01)
C 07 D 451/02 (2006.01)
C 07 D 471/04 (2006.01)
C 07 D 405/14 (2006.01)
C 07 D 401/14 (2006.01)
C 07 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 409/12 (2006.01)
 C 0 7 D 403/10 (2006.01)
 C 0 7 D 413/10 (2006.01)
 C 0 7 D 401/10 (2006.01)
 C 0 7 D 401/12 (2006.01)
 C 0 7 D 403/12 (2006.01)
 C 0 7 D 405/10 (2006.01)
 C 0 7 D 277/62 (2006.01)
 C 0 7 D 417/10 (2006.01)
 C 0 7 D 491/107 (2006.01)
 C 0 7 D 403/14 (2006.01)
 C 0 7 D 471/10 (2006.01)
 C 0 7 D 487/04 (2006.01)
 C 0 7 D 209/20 (2006.01)
 C 0 7 D 409/14 (2006.01)
 C 0 7 D 209/44 (2006.01)
 C 0 7 D 209/42 (2006.01)
 C 0 7 D 277/64 (2006.01)
 C 0 7 D 209/30 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 209/18
 A 6 1 K 45/00
 A 6 1 P 7/00
 A 6 1 P 3/02
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 31/22
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 K 31/404
 A 6 1 K 31/439
 A 6 1 K 31/437
 A 6 1 K 31/541
 A 6 1 K 31/4375
 A 6 1 K 31/454
 A 6 1 K 31/4545
 A 6 1 K 31/496
 A 6 1 K 31/41
 A 6 1 K 31/422
 A 6 1 K 31/501
 A 6 1 K 31/405
 A 6 1 K 31/4725
 A 6 1 K 31/4439
 A 6 1 K 31/506
 A 6 1 K 31/428
 A 6 1 K 31/427
 A 6 1 K 31/438
 A 6 1 K 31/433

A 6 1 K	31/4155
A 6 1 K	31/517
A 6 1 K	31/551
A 6 1 K	31/416
A 6 1 K	31/407
C 0 7 D	405/12
C 0 7 D	451/02
C 0 7 D	471/04 1 0 4 Z
C 0 7 D	471/04 1 1 4 Z
C 0 7 D	405/14
C 0 7 D	401/14
C 0 7 D	417/14
C 0 7 D	409/12
C 0 7 D	403/10
C 0 7 D	413/10
C 0 7 D	401/10
C 0 7 D	401/12
C 0 7 D	403/12
C 0 7 D	405/10
C 0 7 D	277/62
C 0 7 D	417/10
C 0 7 D	491/107
C 0 7 D	403/14
C 0 7 D	471/04 1 1 8 Z
C 0 7 D	471/10 1 0 1
C 0 7 D	487/04 1 3 7
C 0 7 D	209/20
C 0 7 D	409/14
C 0 7 D	209/44
C 0 7 D	209/42
C 0 7 D	277/64
C 0 7 D	209/30

【手続補正書】

【提出日】平成31年4月23日(2019.4.23)

【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

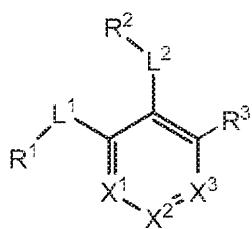
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

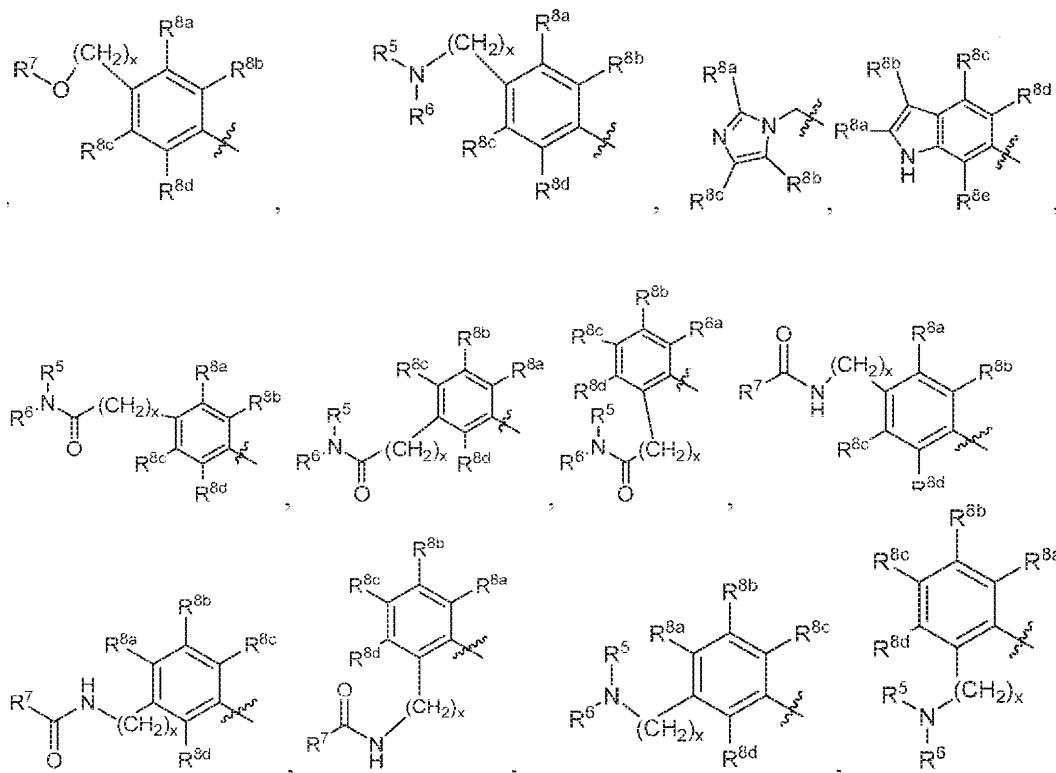
【請求項1】

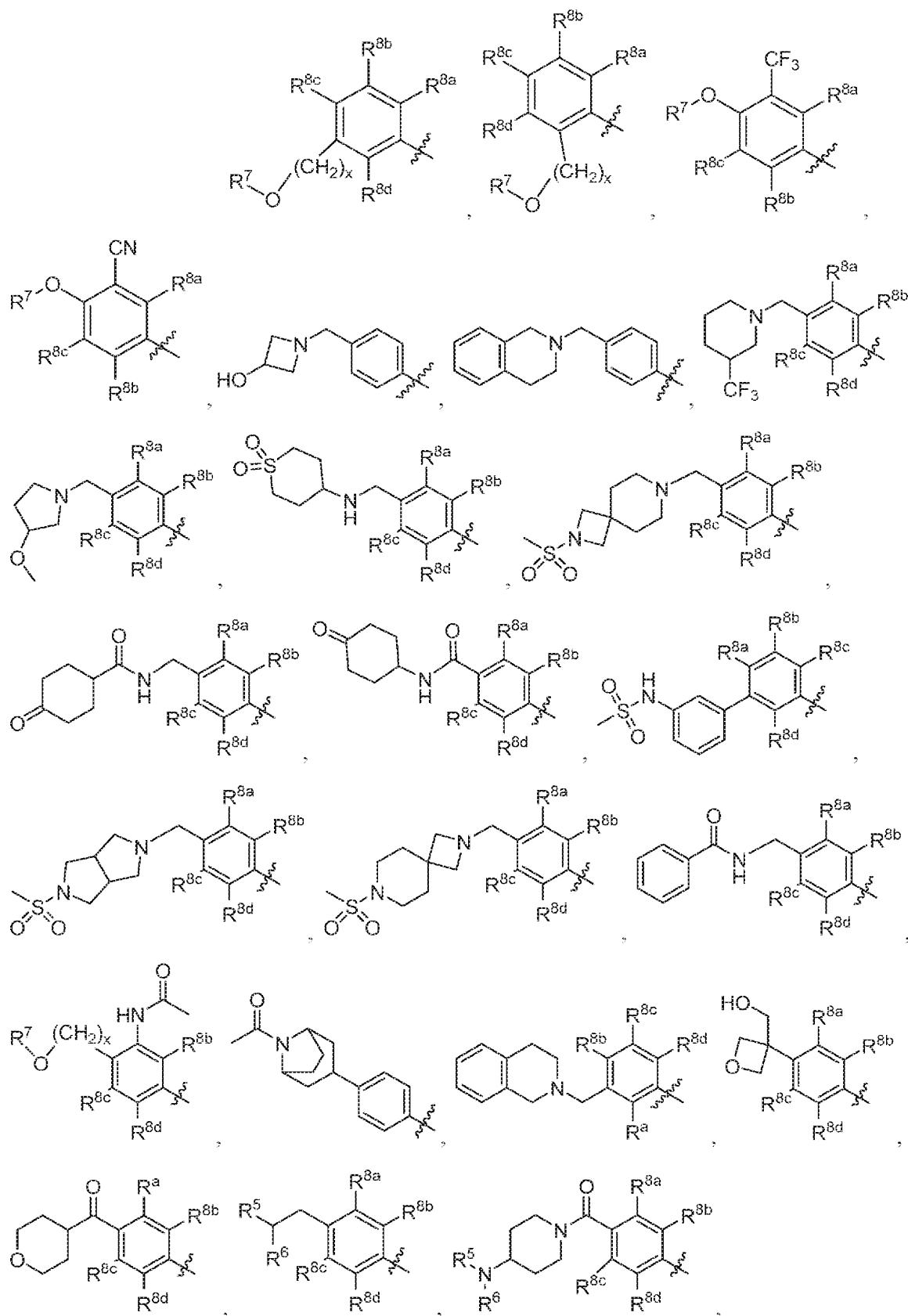
式(I)の化合物、またはそのエナンチオマー、ジアステレオマー、互変異性体、塩、および/もしくは溶媒和物

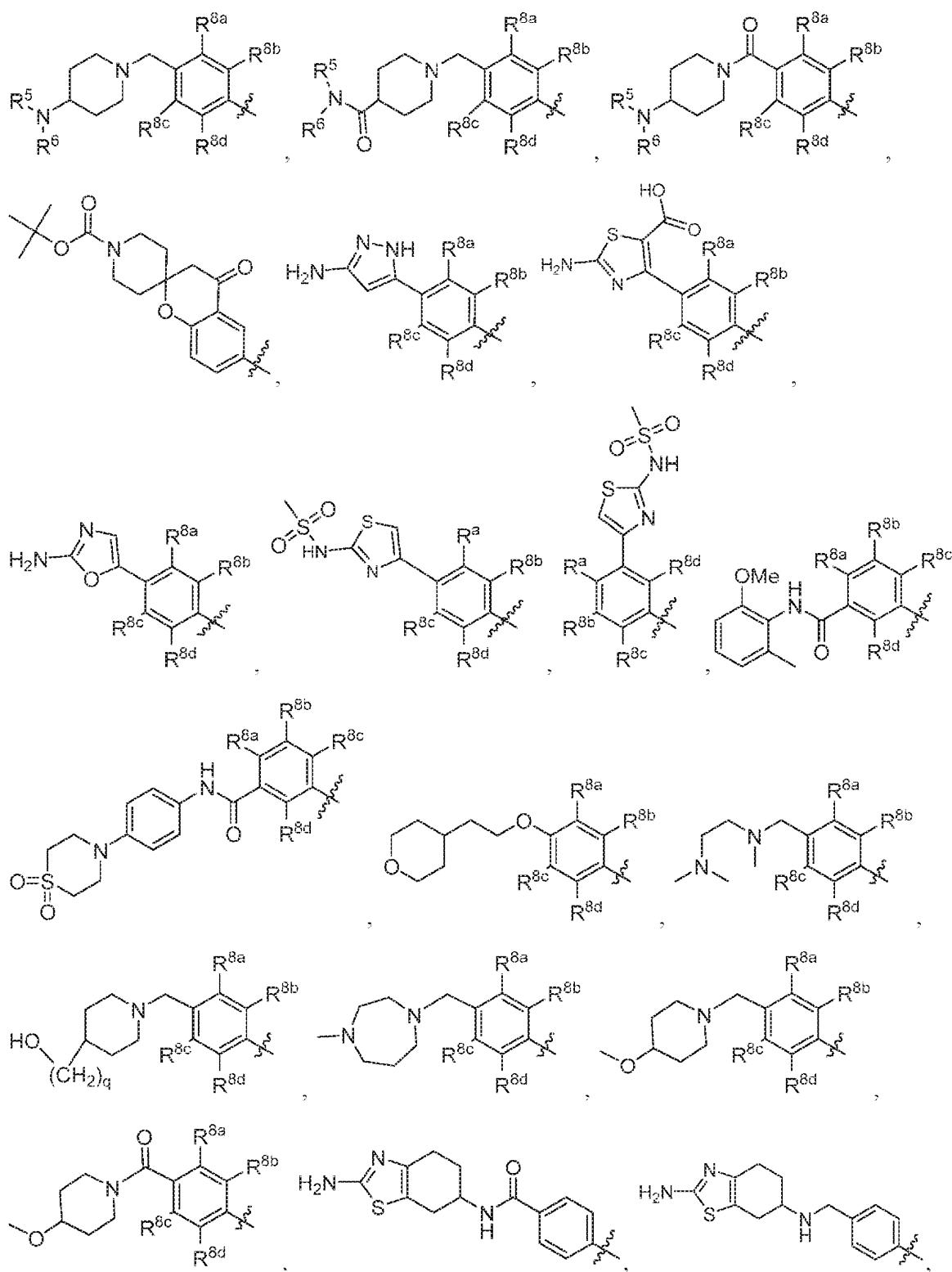


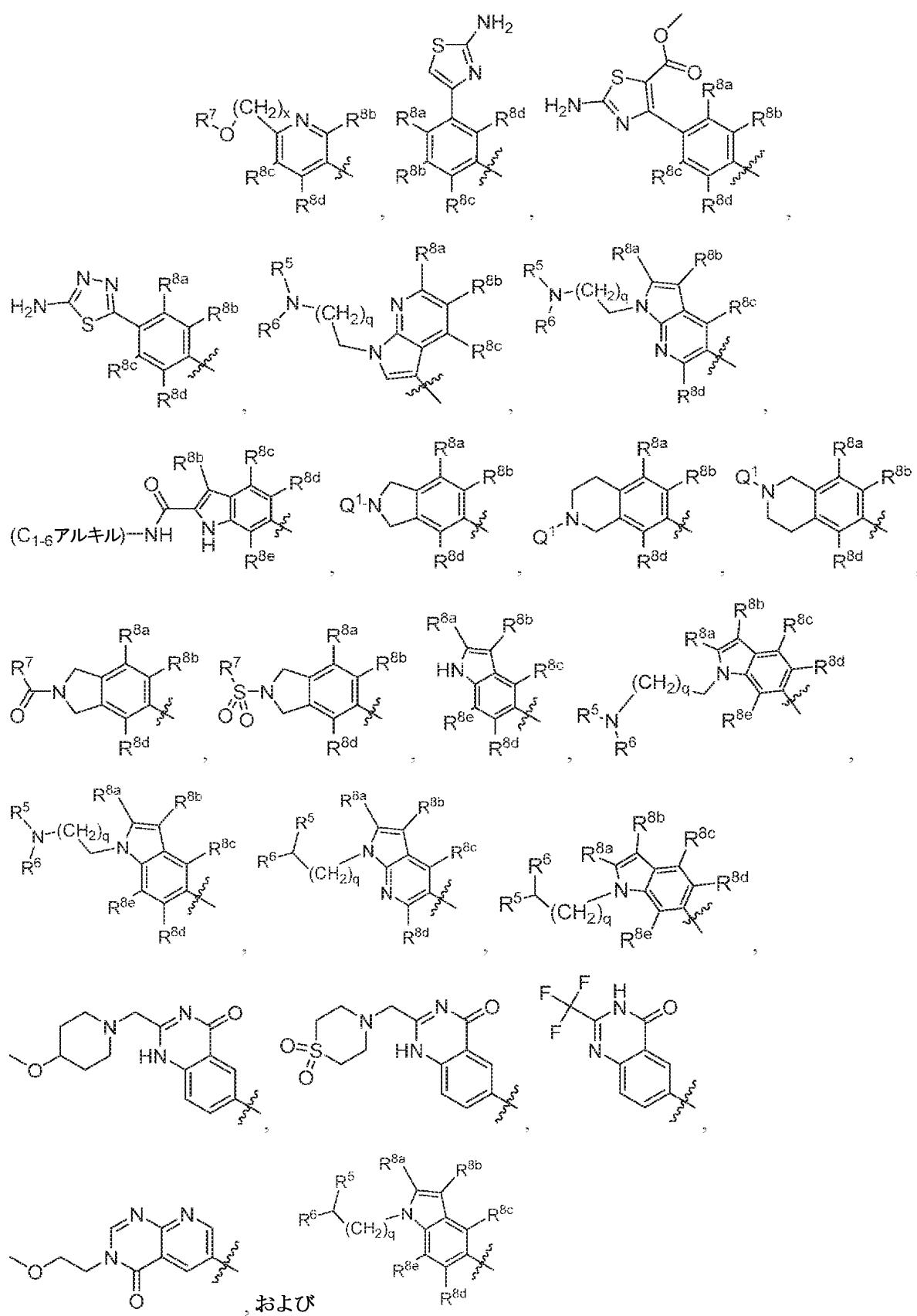
(I)

式中、

X¹はCR^{4a}およびNからなる群より選択され；X²はCR^{4b}およびNからなる群より選択され；X³はCR^{4c}およびNからなる群より選択され；R¹は

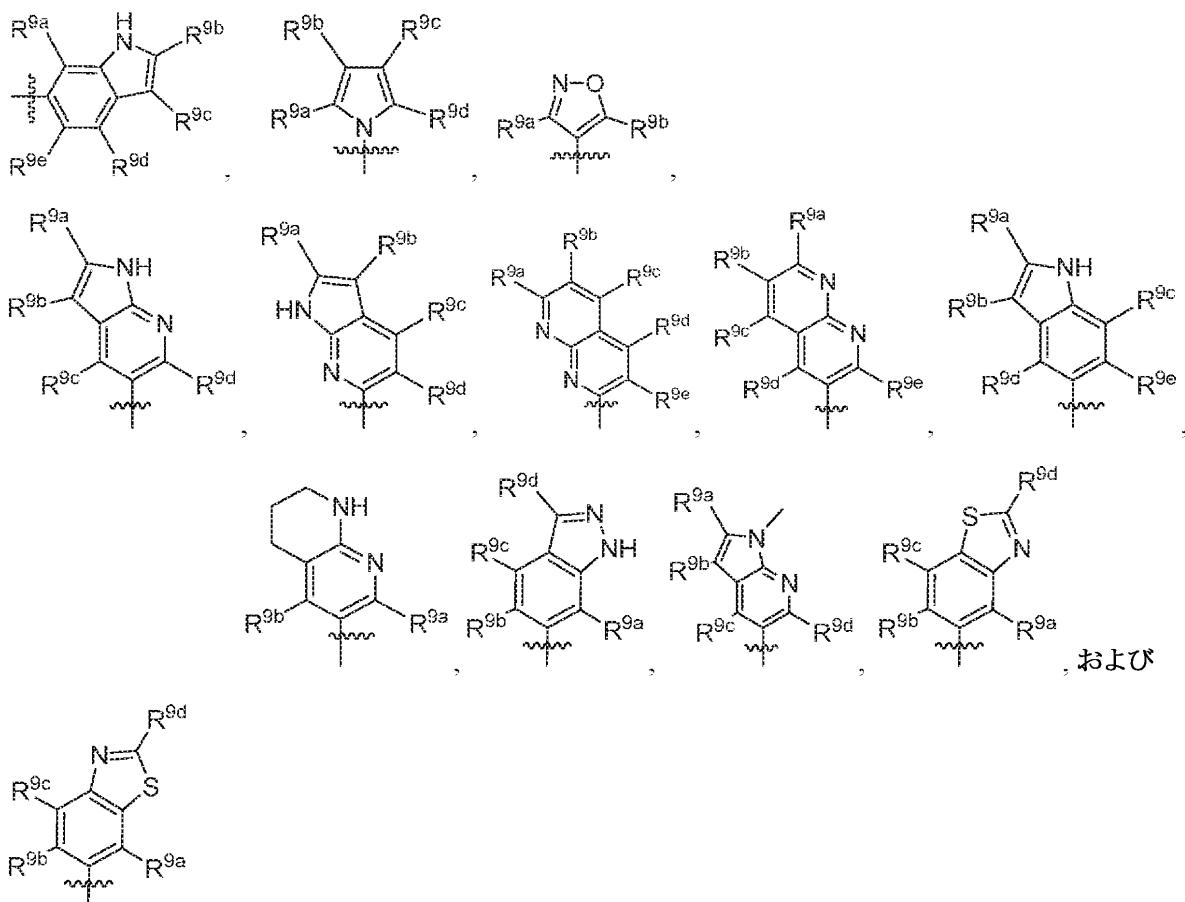






からなる群より選択され；

R^2 は



からなる群より選択され；

R³は-CO₂R^{4d}、-C(=O)NH-S(=O)₂NR⁵R⁶、-S(=O)₂NHC(=O)R⁷、-NHS(=O)₂R⁷、および1H-テトラゾール-5-イルからなる群より選択され；

R^{4a}、R^{4b}、およびR^{4c}はそれぞれ独立してH、F、Cl、Br、およびIからなる群より選択され；

R^{4d}はH、置換されていてもよいC₁～₆直鎖アルキル、および置換されていてもよいC₃～₆分岐アルキルからなる群より選択され；

R⁵は置換されていてもよいC₁～₆直鎖アルキル、および置換されていてもよいC₃～₆分岐アルキルからなる群より選択され；

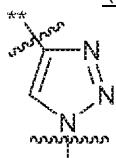
R⁶はH、置換されていてもよいC₁～₆直鎖アルキル、および置換されていてもよいC₃～₆分岐アルキルからなる群より選択されるか；あるいはR⁵およびR⁶はそれらが結合している原子と一緒にになって、酸素、硫黄、SO、SO₂、CF₂、NH、N(C₁～₆アルキル)、N(C₃～₇分岐アルキル)、N(C₃～₆シクロアルキル)、N(ヘテロアリール)、NCO(C₁～₆アルキル)、NCO(C₁～₆分岐アルキル)、NCO(C₃～₆シクロアルキル)、NCO₂(C₁～₆アルキル)、NCO₂(C₁～₆分岐アルキル)、NCO₂(C₃～₆シクロアルキル)、NCON(C₁～₆アルキル)₂、SO₂NH₂、NSO₂(C₁～₆アルキル)、NSO₂(C₃～₆分岐アルキル)、NSO₂(C₃～₆シクロアルキル)、およびNSO₂アリールからなる群より選択される単位を含有してもよい、3-、4-、5-、または6-員の環を形成し；

R⁷は置換されていてもよいC₁～₆直鎖アルキル、置換されていてもよいC₃～₆分岐アルキル、C₁～₆ハロアルキル、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよいピリジル、置換されていてもよいヘテロアリール、および-CH(R⁵)(R⁶)からなる群より選択され；

R^{8a}、R^{8b}、R^{8c}、R^{8d}、およびR^{8e}はそれぞれ独立してH、ハロゲン、ヒドロキシル、CN、置換されていてもよいC₁～₆直鎖アルキル、置換されていてもよいC₃～₆分岐アルキル、およびC₁～₆アルコキシからなる群より選択され；

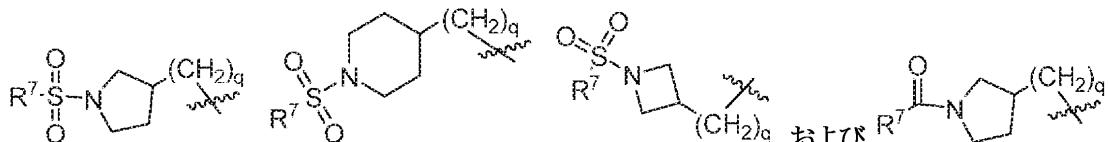
R^{9a}、R^{9b}、R^{9c}、R^{9d}、およびR^{9e}はそれぞれ独立してH、ハロゲン、置換されていてもよいC₁～₆直鎖アルキル、C₁～₆アルコキシ、および置換されていてもよいC₃～₆分岐アルキルからなる群より選択され；

L^1 は $-C=C-$ 、 $-CH=CH-$ および $-(CH_2)_n-$ からなる群より選択され；
 L^2 は $(CH_2)_m$ 、 NH 、および



からなる群より選択され、ここで「**」は R^2 に対する結合点を示し；

Q^1 は置換されていてもよいベンジル、 $-COR^7$ 、 $-SO_2R^7$



からなる群より選択され；

n は 0、1、2、または 3 であり；

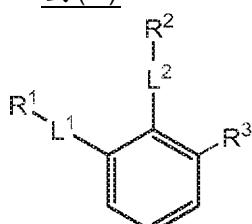
m は 0、1、2、または 3 であり；

q は 1、2、3、または 4 であり；および

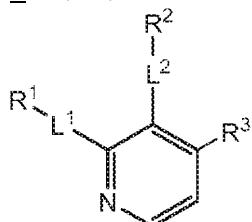
x は 1、2、または 3 である。

【請求項 2】

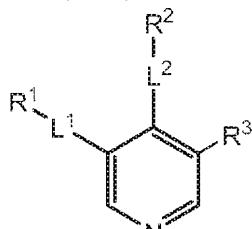
式(V)



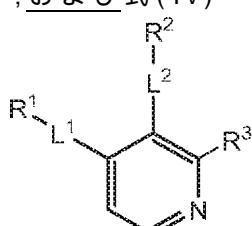
式(II)



式(III)



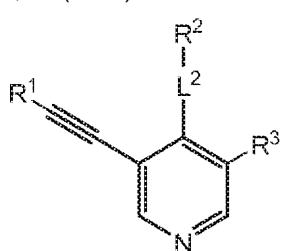
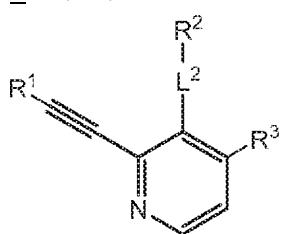
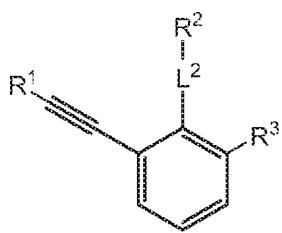
および式(IV)



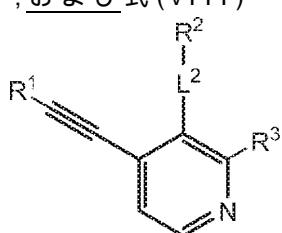
からなる群より選択される、少なくとも1つの式の化合物である、請求項1記載の化合物。

【請求項 3】

式(IX)



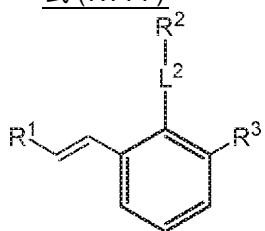
および式(VIII)



からなる群より選択される、少なくとも1つの式の化合物である、請求項2記載の化合物。

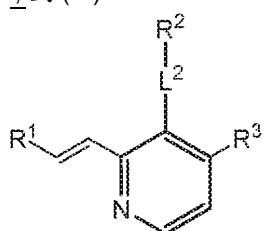
【請求項4】

式(XIII)



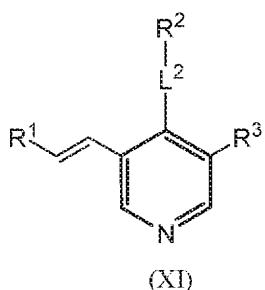
(XIII)

式(X)

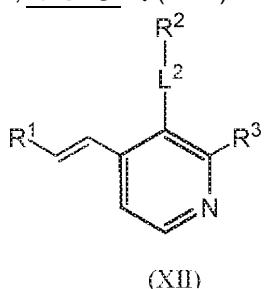


(X)

式(XI)



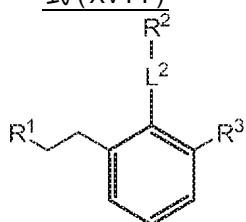
; および式(XII)



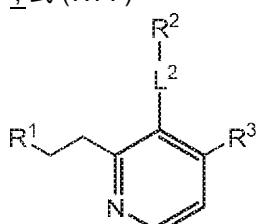
からなる群より選択される、少なくとも1つの式の化合物である、請求項2記載の化合物。

【請求項5】

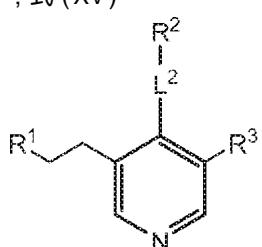
式(XVII)



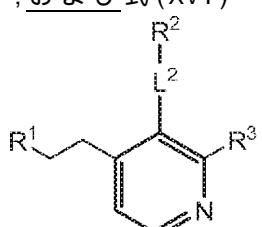
; 式(XIV)



; 式(XV)



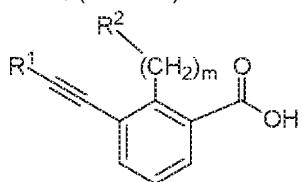
; および式(XVI)



からなる群より選択される、少なくとも1つの式の化合物である、請求項2記載の化合物。

【請求項6】

式(XVIII)



の化合物である、請求項1記載の化合物。

【請求項7】

R^1 が、4-{8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル}フェニル; 4-{[(2-カルボキシフェニル)ホルムアミド]メチル}フェニル; 4-{[(4-カルボキシフェニル)ホルムアミド]メチル}フェニル; 4-[(4,4-ジフルオロピペリジン-1-イル)メチル]フェニル; 4-({[2-(ジメチルアミノ)エチル](メチル)アミノ}メチル)フェニル; 1-[2-(ジメチルアミノ)エチル]-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-3-イル; 1-[3-(ジメチルアミノ)プロピル]-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-3-イル; 4-[(ジメチルアミノ)メチル]フェニル; 4-[(1,1-ジオキソ-1⁶-チアン-4-イル)オキシ]フェニル; 4-[(1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリン-4-イル)メチル]フェニル; 4-[(4-エチルピペラジン-1-イル)メチル]フェニル; 4-[(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル)メチル]フェニル; 4-[(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)メチル]フェニル; 4-(4-メトキシベンゼン-スルホンアミド)フェニル; 4-{[(2-メトキシエチル)(メチル)アミノ]メチル}フェニル; 4-[(4-メトキシピペリジン-1-イル)メチル]フェニル; 4-[(4-メチル-1,4-ジアゼパン-1-イル)メチル]フェニル; 4-[(4-メチルピペラジン-1-イル)メチル]フェニル; 2-メチル-4-オキソ-3,4-ジヒドロキナゾリン-7-イル; 4-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル; 1-[2-(モルホリン-4-イル)エチル]-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-3-イル; 1-[3-(モルホリン-4-イル)プロピル]-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イル; 1-[2-(ジメチルアミノ)エチル]-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イル; 4-(オキサン-4-イルメトキシ)フェニル; 4-(オキサン-4-イルオキシ)-3-(トリフルオロメチル)フェニル; 4-オキソ-3,4-ジヒドロキナゾリン-7-イル; および4-[(フェニルホルムアミド)メチル]フェニルからなる群より選択される少なくとも1つである、請求項1記載の化合物。

【請求項8】

R^2 が、1,3-ベンゾチアゾール-5-イル; 5-フルオロ-インドール-6-イル; 7-フルオロ-インドール-6-イル; インドール-6-イル; 2-メチル-1,3-ベンゾチアゾール-5-イル; 1-メチル-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-6-イル; 1,8-ナフチリジン-2-イル; 1,8-ナフチリジン-3-イル; および1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イルからなる群より選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項9】

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(2-モルホリン-4-イル-エチル)-1H-インドール-6-イルエチニル]-安息香酸;

3-[4-(8-アセチル-8-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-3-イル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸;

3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸;

3-[1-(3-ジメチルアミノ-プロピル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸;

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(3-モルホリン-4-イル-プロピル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イルエチニル]-安息香酸;

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(3-モルホリン-4-イル-プロピル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-3-イルエチニル]-安息香酸;

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(2-モルホリン-4-イル-エチル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イルエチニル]-安息香酸;

3-{2-[3-(3,3-ジメチル-2-オキソアゼチジン-1-イル)フェニル]エチニル}-2-(1H-ピロ

ール-1-イル)安息香酸；

3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-3-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(2-モルホリン-4-イル-エチル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-3-イルエチニル]-安息香酸；

3-[1-(3-ジメチルアミノ-プロピル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-3-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

3-{1-[2-(1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリン-4-イル)-エチル]-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イルエチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(2-モルホリン-4-イル-エチル)-1H-インドール-5-イルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(3-モルホリン-4-イル-プロピル)-1H-インドール-5-イルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(3-モルホリン-4-イル-プロピル)-1H-インドール-6-イルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-(5,6,7,8-テトラヒドロ-[1,8]ナフチリジン-3-イルエチニル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(テトラヒドロ-ピラン-4-イルメチル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(テトラヒドロ-ピラン-4-イルメチル)-1H-インドール-5-イルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(1-メタンスルホニル-ピペリジン-4-イルメチル)-1H-インドール-5-イルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(1-メタンスルホニル-ピペリジン-4-イルメチル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イルエチニル]-安息香酸；

3-{1-[2-(1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリン-4-イル)-エチル]-1H-インドール-5-イル-エチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

3-{1-[2-(1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリン-4-イル)-エチル]-1H-インドール-6-イルエチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

3-{1-[3-(1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリン-4-イル)-プロピル]-1H-インドール-5-イル-エチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

3-{1-[3-(1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリン-4-イル)-プロピル]-1H-インドール-6-イル-エチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

3-[4-(1,1-ジオキソ-ヘキサヒドロ-1⁶-チオピラン-4-イルオキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(テトラヒドロ-ピラン-4-イルオキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-(4-イソプロポキシメチル-フェニルエチニル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-(3-モルホリン-4-イルメチル-1H-インドール-6-イルエチニル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[3-(4-メタンスルホニル-ピペラジン-1-イルメチル)-1H-インドール-6-イルエチニル]-安息香酸；

3-[3-(1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリン-4-イルメチル)-1H-インドール-6-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-(2-モルホリン-4-イルメチル-1H-インドール-6-イルエチニル)-安息香酸；

3-[2-(1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリン-4-イルメチル)-1H-インドール-6-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

3-[1-(4-エトキシ-2-メチル-ブチル)-6-フルオロ-1H-インドール-5-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[7-フルオロ-1-(テトラヒドロ-ピラン-4-イルメチル)-1H-インドール-6-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[1-(1,1-ジオキソ-ヘキサヒドロ-1⁶-チオピラン-4-イルメチル)-7-フルオロ-1H-インドール-6-イルエチニル]-2-(1H-インドール-1)-安息香酸；
3-[1-(1,1-ジオキソ-ヘキサヒドロ-1⁶-チオピラン-4-イルメチル)-6-フルオロ-1H-インドール-5-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-(7-フルオロ-3-モルホリン-4-イルメチル-1H-インドール-6-イルエチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-(6-フルオロ-3-モルホリン-4-イルメチル-1H-インドール-5-イルエチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-((4-(2H-テトラゾール-5-イル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
3-((3-(2H-テトラゾール-5-イル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((4-(オキサゾール-5-イル)フェニル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((4-(6-オキソ-1,6-ジヒドロピリダジン-3-イル)フェニル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((3-メトキシ-4-(モルホリノメチル)フェニル)エチニル)安息香酸；
3-((3-ヒドロキシ-4-(モルホリン-4-カルボニル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[(3-メトキシ-4-(4-モルホリン-4-イル-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニル)エチニル]-安息香酸；
3-((4-((4,4-ジフルオロピペリジン-1-イル)メチル)-3-メトキシフェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
3-((4-((ジメチルカルバモイル)ピペリジン-1-イル)メチル)-3-メトキシフェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
3-((3-ヒドロキシ-4-(4-モルホリノピペリジン-1-カルボニル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
3-((4-(4,4-ジフルオロピペリジン-1-イルカルボニル)-3-ヒドロキシフェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((4-((1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イル)メチル)フェニル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((4-((1-(トリフルオロメチル)スルホニル)ピペリジン-4-イル)メチル)フェニル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((4-((1-(イソプロピルスルホニル)ピペリジン-4-イル)メチル)フェニル)エチニル)安息香酸；
3-((4-((1-アセチルピペリジン-4-イル)メチル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
3-((2-アセチルイソインドリン-5-イル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-(イソプロピルスルホニル)イソインドリン-5-イル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-(1-(メチルスルホニル)ピロリジン-3-イル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-((1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イル)メチル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-6-イル)エチニル)安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-(1-(メチルスルホニル)アゼチジン-3-イル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-6-イル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-((1-(メチルスルホニル)ピロリジン-3-イル)メチル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-6-イル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-((1-(メチルスルホニル)ピロリジン-3-イル)メチル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)エチニル)安息香酸；
3-((2-((1-アセチルピロリジン-3-イル)メチル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-((1-(メチルスルホニル)アゼチジン-3-イル)メチル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-6-イル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-((1-(メチルスルホニル)アゼチジン-3-イル)メチル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-(3-(メチルスルホンアミド)ベンジル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-6-イル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-(3-(メチルスルホンアミド)ベンジル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-(1-(メチルスルホニル)ピロリジン-3-イル)イソインドリン-5-イル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-(1-(メチルスルホニル)アゼチジン-3-イル)イソインドリン-5-イル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-((1-(メチルスルホニル)ピロリジン-3-イル)メチル)イソインドリン-5-イル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-((1-(メチルスルホニル)アゼチジン-3-イル)メチル)イソインドリン-5-イル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-((1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イル)メチル)イソインドリン-5-イル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-(メチルスルホニル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-(イソプロピルスルホニル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-プロピオニル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-(メチルスルホニル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-6-イル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-(イソプロピルスルホニル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-6-イル)エチニル)安息香酸；
3-((2-アセチル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-6-イル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-プロピオニル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-6-イル)エチニル)安息香酸；
3-[4-(4-シアノ-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(3-シアノ-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(3-カルバモイル-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-トリフルオロメチル-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(3-トリフルオロメチル-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-メトキシ-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-[4-(4-カルバモイル-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(3-メトキシ-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-(4-フェノキシメチル-フェニルエチニル)-安息香酸；
3-[4-(2-フルオロ-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(ピリジン-3-イルオキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-[4-(3-クロロ-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(3,4-ジクロロ-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(2-トリフルオロメチル-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-[4-(2-シアノ-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-メタンスルホニル-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(ピリミジン-5-イルオキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(2-メタンスルホニル-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(3-メタンスルホニル-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-{2-[3-(3-メタンスルホニアミドフェニル)フェニル]エチニル}安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-{2-[2-(プロピルカルバモイル)-1H-インドール-6-イル]エチニル}安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-{2-[3-(1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-2-イルメチル)フェニル]エチニル}安息香酸；
3-[2-(3-{[4-(エトキシカルボニル)ピペラジン-1-イル]メチル}フェニル)エチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
3-(2-{4-[3-(ヒドロキシメチル)オキセタン-3-イル]フェニル}エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
3-{2-[3-(5-アミノ-1H-ピラゾール-3-イル)フェニル]エチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-{2-[3-(1,3-オキサゾール-5-イル)フェニル]エチニル}安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-{2-[4-(オキサン-4-カルボニル)フェニル]エチニル}安息香酸；
3-(2-(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-(2-(4-(2-アミノチアゾール-4-イル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-(スピロ[2H-1-ベンゾピラン-2,1'-4-ピペリジン-1-イル-t-ブチルカルボキシラート]-4(3H)-オン)エチニル)安息香酸；
3-(2-(3-(2-アミノチアゾール-4-イル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)

- 安息香酸；

3-(2-(4-(5-(メトキシカルボニル)-2-アミノチアゾール-4-イル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-(2-(4-(5-アミノ-1,3,4-チアジアゾール-2-イル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-(2-(4-(3-アミノ-1H-ピラゾール-5-イル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-アミノ-4-{4-[3-カルボキシ-2-(1H-インドール-6-イル)-フェニルエチニル]-フェニル}-チアゾール-5-カルボン酸；
3-(2-(4-(2-アミノオキサゾール-5-イル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(2-メタンスルホニルアミノ-チアゾール-4-イル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[3-(2-メタンスルホニルアミノ-チアゾール-4-イル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-(2-(1,4-ジヒドロ-2-((4-メトキシペリジン-1-イル)メチル)-4-オキソキナゾリン-6-イル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
3-(2-(1,4-ジヒドロ-2-((4-チオモルホリニル-1,1ジオキシド-1-イル)メチル)-4-オキソキナゾリン-6-イル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
3-(2-(2-(トリフルオロメチル)-3,4-ジヒドロ-4-オキソキナゾリン-6-イル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
3-(2-(3,4-ジヒドロ-3-(2-メトキシエチル)-4-オキソピリド[2,3-d]ピリミジン-6-イル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[3-(2-メトキシ-6-メチル-フェニルカルバモイル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-{3-[4-(1,1-ジオキソ-1-チオモルホリン-4-イル)-フェニルカルバモイル]-フェニルエチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-{4-[2-(テトラヒドロ-ピラン-4-イル)-エトキシ]-フェニルエチニル}-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-(4-モルホリン-4-イルメチル-フェニルエチニル)-安息香酸；
3-[4-(4-エチル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-[4-(1,1-ジオキソ-チオモルホリン-4-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-(4-{[(2-ジメチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-フェニルエチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-{4-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペリジン-1-イルメチル]-フェニルエチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-メチル-[1,4]ジアゼパン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-[4-(3-ヒドロキシ-アゼチジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエ

チニル]-安息香酸；

3-[4-ジメチルアミノメチル-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-{[(2-メトキシ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-[4-(4,4-ジフルオロ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(3,3-ジフルオロ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-メタンスルホニル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(3-トリフルオロメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-イソプロピル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-[4-(4-シクロヘキシル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(4-シクロプロパンカルボニル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-(4-ピペラジン-1-イルメチル-フェニルエチニル)-安息香酸；
3-[4-(4-ベンゼンスルホニル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-{4-[(1,1-ジオキソ-ヘキサヒドロ-1-チオピラン-4-イルアミノ)-メチル]-フェニルエチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(4-シクロペンチル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(4-ジメチルカルバモイル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(2,3,5,6-テトラヒドロ-[1,2']ビピラジニル-4-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-チアゾール-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-{4-[(2-アミノ-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾチアゾール-6-イルアミノ)-メチル]-フェニルエチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-ピロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-安息香酸；
3-[4-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-ピロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-5-イル)-3-[4-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-5-イル)-3-[4-(4-メタンスルホニル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-[4-(4-メタンスルホニル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-ピロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-安息香酸；
3-[4-(4,4-ジフルオロ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-5-イル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-5-イル)-3-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

3-[4-(4-エタンスルホニル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

3-[2-フルオロ-4-(テトラヒドロ-ピラン-4-イルオキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

3-[4-(1,1-ジオキソ-ヘキサヒドロ-1-チオピラン-4-イルオキシメチル)-2-フルオロ-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(2-メタンスルホニル-2,7-ジアザ-スピロ[3.5]ノナ-7-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(5-メタンスルホニル-ヘキサヒドロ-ピロロ[3,4-c]ピロール-2-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

3-[4-(4-シクロプロパンスルホニル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-(プロパン-2-スルホニル)-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(7-メタンスルホニル-2,7-ジアザ-スピロ[3.5]ノナ-2-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

N-(N,N-ジメチルスルファモイル)-2-(1H-インドール-6-イル)-3-((4-(((テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)オキシ)メチル)フェニル)エチニル)ベンズアミド；

2-(1H-インドール-6-イル)-N-(メチルスルホニル)-3-((4-(((テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)オキシ)メチル)フェニル)エチニル)ベンズアミド；

6-[2-[4-(テトラヒドロ-ピラン-4-イルオキシメチル)-フェニルエチニル]-6-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル]-1H-インドール；

3-[4-(ベンゾイルアミノ-メチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-(4-{[(4-オキソ-シクロヘキサンカルボニル)-アミノ]-メチル}-フェニルエチニル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-オキソ-シクロヘキシカルバモイル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

3-[4-(2-アミノ-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾチアゾール-6-イルカルバモイル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イルカルボニル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イルカルボニル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インダゾール-6-イル)-3-[4-(4-メタンスルホニル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸； および

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-スルファモイル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸

からなる群より選択される、少なくとも1つである、請求項1記載の化合物。

【請求項10】

請求項1~9のいずれか一項記載の少なくとも1つの化合物と、少なくとも1つの薬学的に許容される担体とを含む、薬学的組成物。

【請求項11】

少なくとも1つの追加の抗ウイルス剤および/または抗がん剤をさらに含む、請求項10記載の薬学的組成物。

【請求項12】

請求項1~9のいずれか一項記載の少なくとも1つの化合物の治療的有効量を含む、対象におけるEBNA1活性によって引き起こされる疾患または障害を処置および/または予防する

ための薬学的組成物であって、該疾患または障害が、伝染性単核球症、慢性疲労症候群、多発性硬化症、全身性エリテマトーデス、および関節リウマチからなる群より選択される少なくとも1つである、薬学的組成物。

【請求項13】

請求項1~9のいずれか一項記載の少なくとも1つの化合物の治療的有効量を含む、対象におけるEBNA1活性によって引き起こされる疾患または障害を処置および/または予防するための薬学的組成物であって、該疾患または障害が、未分化大細胞リンパ腫、血管免疫芽球性T細胞リンパ腫、肝脾T細胞リンパ腫、B細胞リンパ腫、バーキットリンパ腫、細網内皮症、細網症、小膠細胞腫、びまん性大細胞型B細胞リンパ腫、節外性T/NK細胞リンパ腫/血管中心性リンパ腫、濾胞性リンパ腫、免疫芽球性リンパ腫、粘膜関連リンパ組織リンパ腫、B細胞慢性リンパ球性白血病、マントル細胞リンパ腫、縦隔大細胞型B細胞リンパ腫、リンパ形質細胞性リンパ腫、節性辺縁帯B細胞リンパ腫、脾性辺縁帯リンパ腫、血管内大細胞型B細胞リンパ腫、原発性滲出性リンパ腫、リンパ腫様肉芽腫症、血管免疫芽細胞性リンパ節症、平滑筋肉腫、X連鎖リンパ増殖性疾患、ホジキンリンパ腫、および乳がんからなる群より選択される少なくとも1つのがんである、薬学的組成物。

【請求項14】

請求項1~9のいずれか一項記載の少なくとも1つの化合物の治療的有効量を含む、対象におけるエプスタイン・バーウイルス(EBV)感染、および/またはEBV感染に関連する疾患もしくは障害を処置および/または予防するための薬学的組成物。

【請求項15】

請求項1~9のいずれか一項記載の少なくとも1つの化合物の治療的有効量を含む、対象における溶解EBVウイルス感染および/または潜伏EBVウイルス感染を処置および/または予防するための薬学的組成物。

【請求項16】

請求項1~9のいずれか一項記載の少なくとも1つの化合物の治療的有効量を含む、対象におけるEBNA1活性によって引き起こされる疾患または障害を処置および/または予防するための薬学的組成物であって、該疾患または障害が上咽頭癌である、薬学的組成物。

【請求項17】

請求項1~9のいずれか一項記載の少なくとも1つの化合物の治療的有効量を含む、対象におけるEBNA1活性によって引き起こされる疾患または障害を処置および/または予防するための薬学的組成物であって、該疾患または障害が胃癌である、薬学的組成物。

【請求項18】

請求項1~9のいずれか一項記載の少なくとも1つの化合物の治療的有効量を含む、対象におけるEBNA1活性によって引き起こされる疾患または障害を処置および/または予防するための薬学的組成物であって、該疾患または障害が非ホジキンリンパ腫である、薬学的組成物。

【請求項19】

請求項1~9のいずれか一項記載の少なくとも1つの化合物の治療的有効量を含む、対象におけるEBNA1活性によって引き起こされる疾患または障害を処置および/または予防するための薬学的組成物であって、該疾患または障害が移植後リンパ増殖性障害である、薬学的組成物。

【請求項20】

経口、鼻、吸入、局所、口腔、直腸、胸膜、腹膜、腔、筋肉内、皮下、経皮、硬膜外、気管内、耳、眼内、髄腔内、および静脈内経路からなる群より選択される少なくとも1つの経路によって対象に投与されるように用いられる、請求項12~19のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項21】

少なくとも1つの薬学的に許容される担体をさらに含む、請求項12~20のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0023

【補正方法】変更

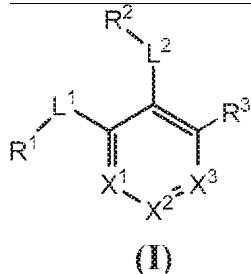
【補正の内容】

【0023】

ある態様において、化合物は、経口、鼻、吸入、局所、口腔、直腸、胸膜、腹膜、膿、筋肉内、皮下、経皮、硬膜外、気管内、耳、眼内、髄腔内、および静脈内経路からなる群より選択される少なくとも1つの経路によって対象に投与される。別の態様において、化合物は、少なくとも1つの薬学的に許容される担体をさらに含む薬学的組成物の一部として投与される。

[本発明1001]

式(I)の化合物、またはそのエナンチオマー、ジアステレオマー、互変異性体、塩、および/もしくは溶媒和物



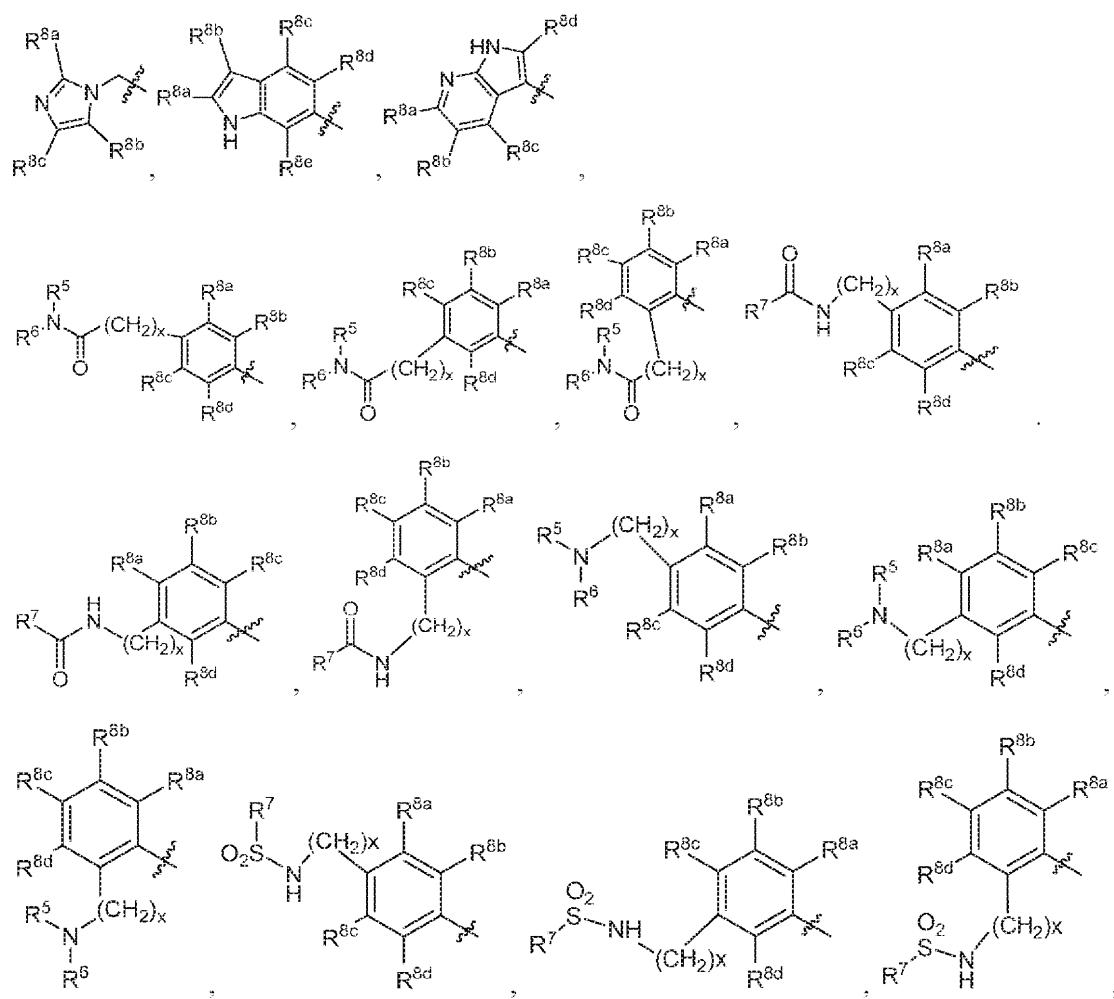
式中、

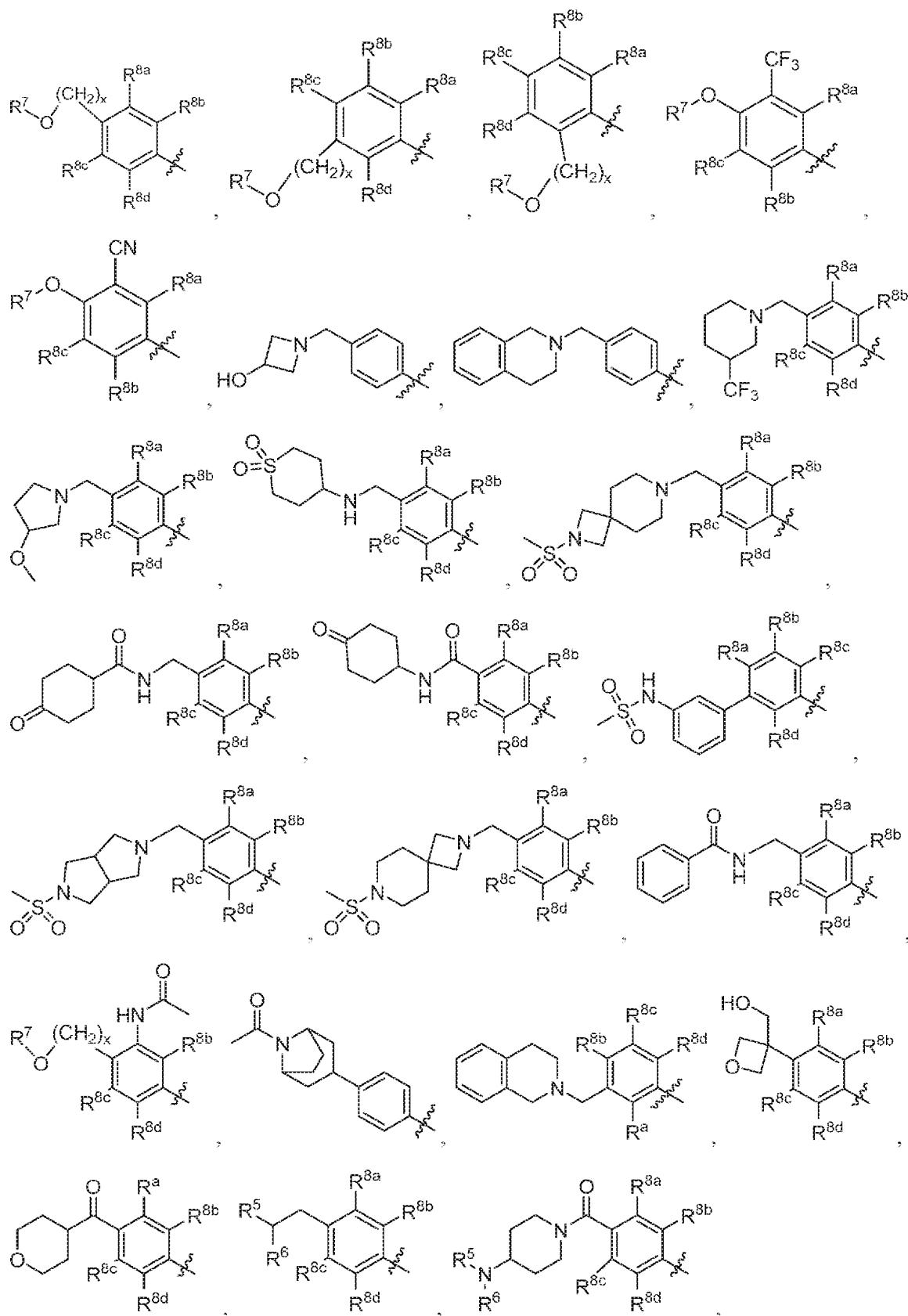
X¹はCR^{4a}およびNからなる群より選択され；

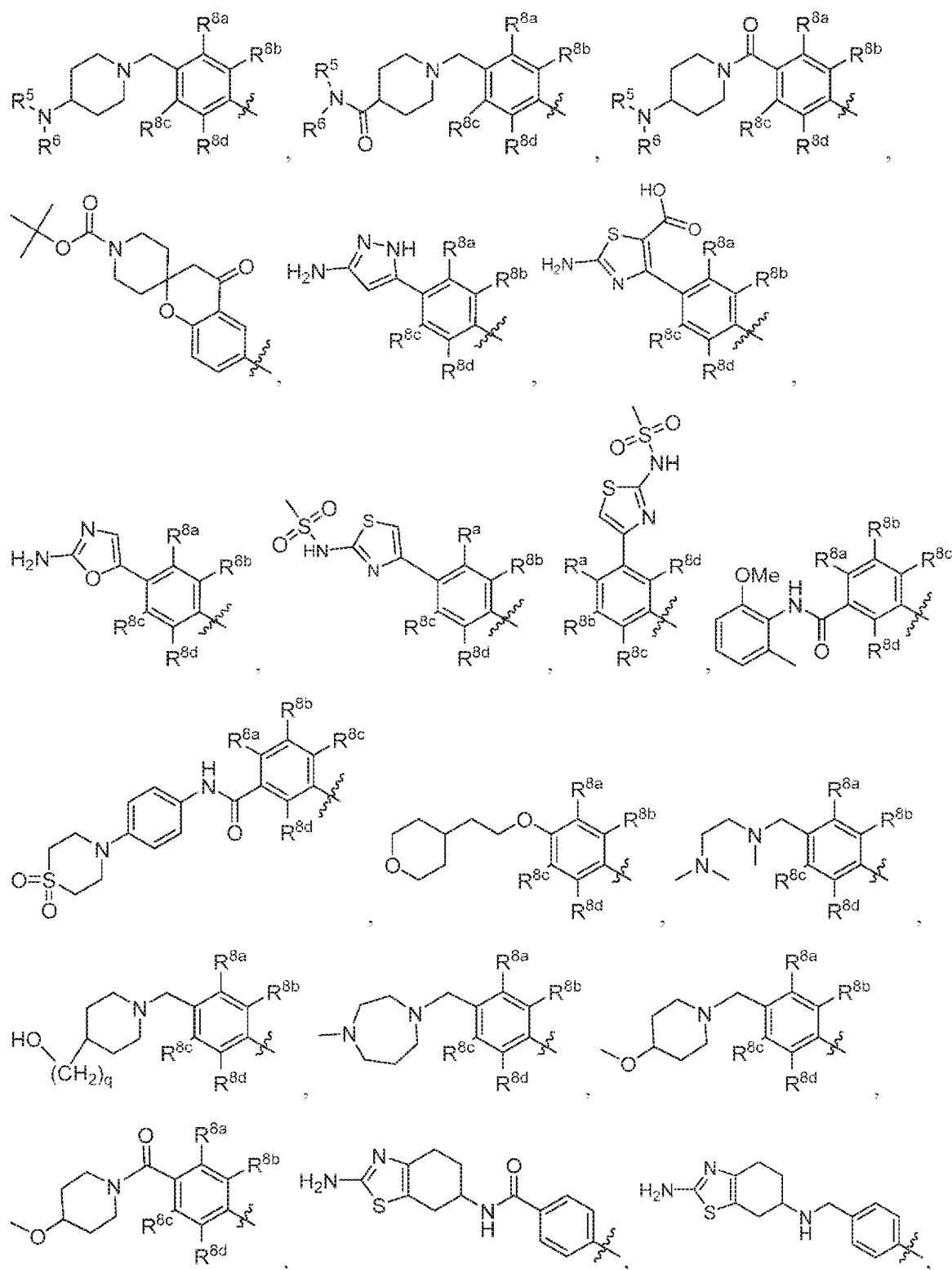
X²はCR^{4b}およびNからなる群より選択され；

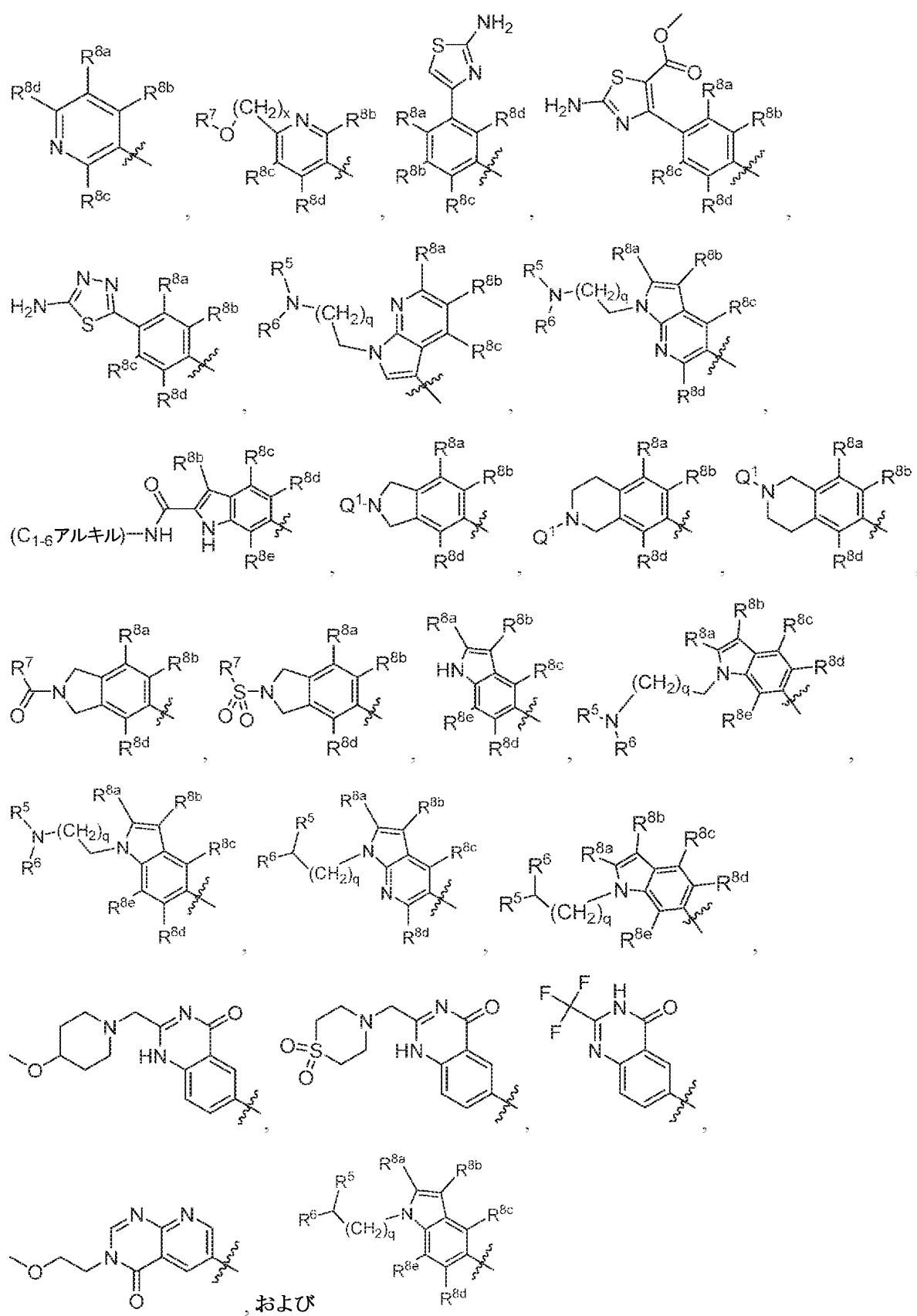
X³はCR^{4c}およびNからなる群より選択され；

R¹は



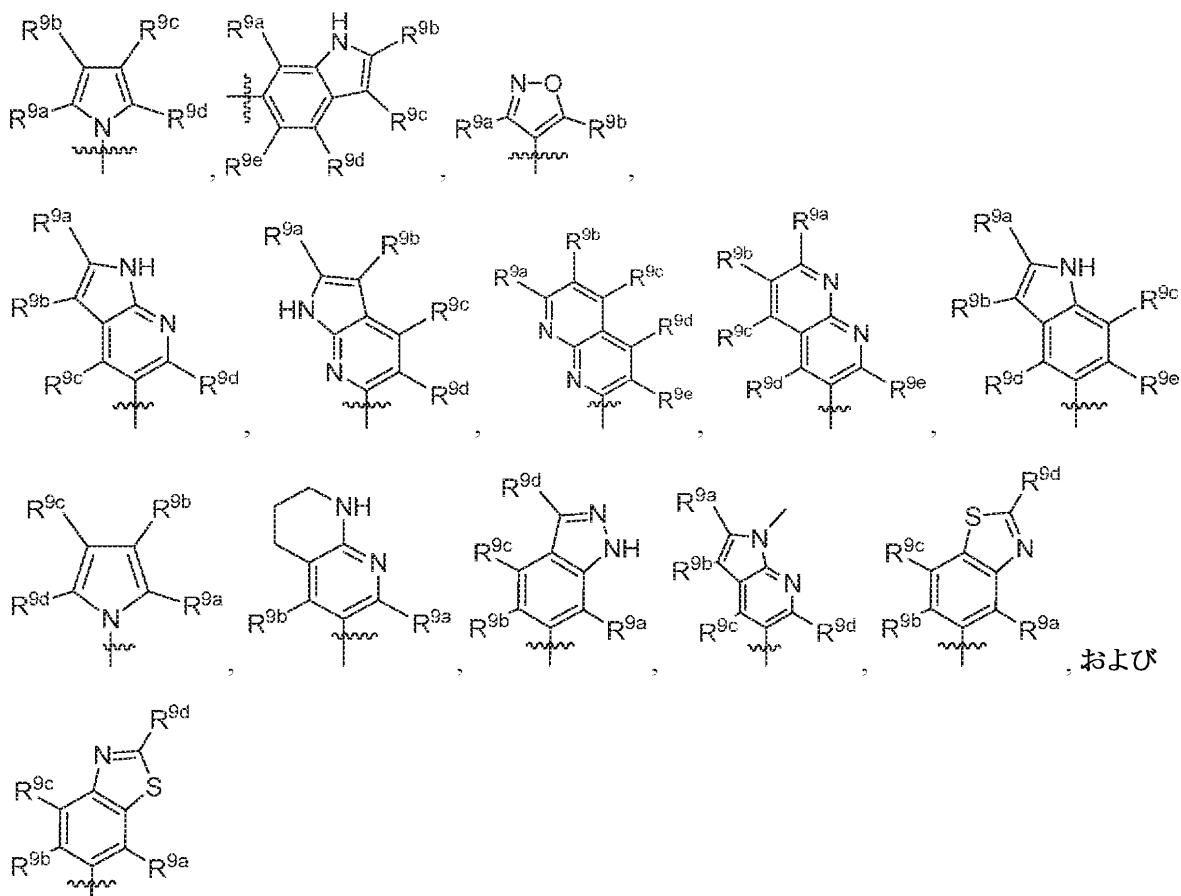






からなる群より選択され；

R² は



からなる群より選択され；

R³は-CO₂R^{4d}、-C(=O)NH-S(=O)₂NR⁵R⁶、-S(=O)₂NHC(=O)R⁷、-NHS(=O)₂R⁷、および1H-テトラゾール-5-イルからなる群より選択され；

R^{4a}、R^{4b}、およびR^{4c}はそれぞれ独立してF、Cl、Br、I、およびHからなる群より選択され；

R^{4d}はH、置換されていてもよいC_{1～6}直鎖アルキル、および置換されていてもよいC_{3～6}分岐アルキルからなる群より選択され；

R⁵はH、置換されていてもよいC_{1～6}直鎖アルキル、および置換されていてもよいC_{3～6}分岐アルキルからなる群より選択され；

R⁶はH、置換されていてもよいC_{1～6}直鎖アルキル、および置換されていてもよいC_{3～6}分岐アルキルからなる群より選択されるか；あるいはR⁵およびR⁶はそれらが結合している原子と一緒にになって、酸素、硫黄、SO、SO₂、CF₂、NH、N(C_{1～6}アルキル)、N(C_{3～7}分岐アルキル)、N(C_{3～6}シクロアルキル)、N(ヘテロアリール)、NCO(C_{1～6}アルキル)、NCO(C_{1～6}分岐アルキル)、NCO(C_{3～6}シクロアルキル)、NCO₂(C_{1～6}アルキル)、NCO₂(C_{1～6}分岐アルキル)、NCO₂(C_{3～6}シクロアルキル)、NCON(C_{1～6}アルキル)₂、SO₂NH₂、NSO₂(C_{1～6}アルキル)、NSO₂(C_{3～6}分岐アルキル)、NSO₂(C_{3～6}シクロアルキル)、およびNSO₂アリールからなる群より選択される単位を含有してもよい、3-、4-、5-、または6-員の環を形成し；

R⁷はH、置換されていてもよいC_{1～6}直鎖アルキル、置換されていてもよいC_{3～6}分岐アルキル、C_{1～6}ハロアルキル、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよいピリジル、置換されていてもよいヘテロアリール、および-CH(R⁵)(R⁶)からなる群より選択され；

R^{8a}、R^{8b}、R^{8c}、R^{8d}、およびR^{8e}はそれぞれ独立してH、ハロゲン、ヒドロキシリ、CN、置換されていてもよいC_{1～6}直鎖アルキル、置換されていてもよいC_{3～6}分岐アルキル、およびC_{1～6}アルコキシからなる群より選択され；

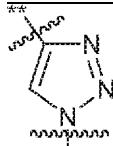
R^{9a}、R^{9b}、R^{9c}、R^{9d}、およびR^{9e}はそれぞれ独立してH、ハロゲン、置換されていてもよいC_{1～6}直鎖アルキル、C_{1～6}アルコキシ、および置換されていてもよいC_{3～6}分岐アルキ

ルからなる群より選択され；

R^{10a}およびR^{10b}はそれぞれ独立してH、置換されていてもよいC₁～₆直鎖アルキル、および置換されていてもよいC₁～₆分岐アルキルからなる群より選択され；

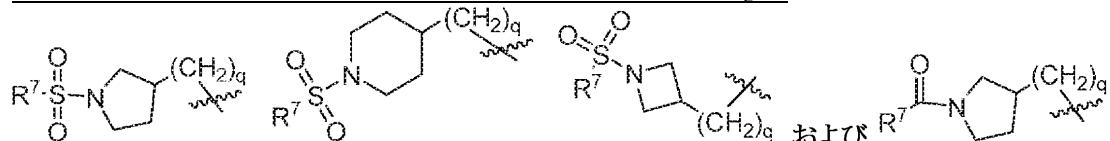
L¹は-C-C-、-CH=CH-および-(CH₂)_n-からなる群より選択され；

L²はNH、(CH₂)_m、および



からなる群より選択され、ここで「**」はR²に対する結合点を示し；

Q¹は置換されていてもよいベンジル、-COR⁷、-SO₂R⁷



からなる群より選択され；

nは0、1、2、または3であり；

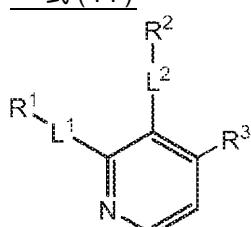
mは0、1、2、または3であり；

qは1、2、3、または4であり；および

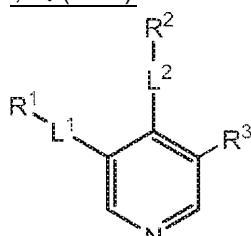
xは0、1、2、または3である。

[本発明1002]

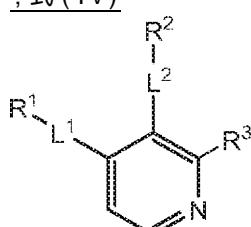
式(I)



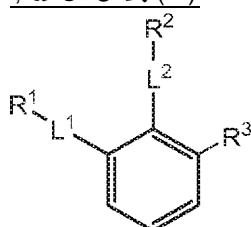
;式(II)



;式(IV)



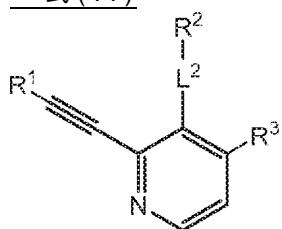
;および式(V)



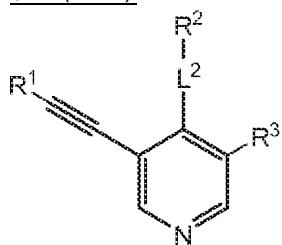
からなる群より選択される、少なくとも1つの式の化合物である、本発明1001の化合物。

[本発明1003]

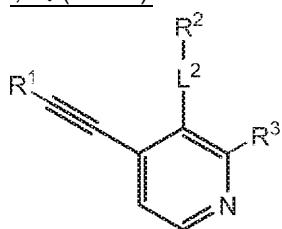
式(VI)



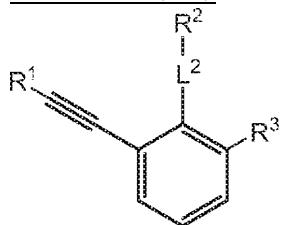
;式(VII)



;式(VIII)



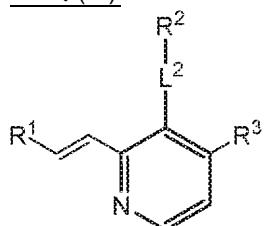
;および式(IX)



からなる群より選択される、少なくとも1つの式の化合物である、本発明1002の化合物。

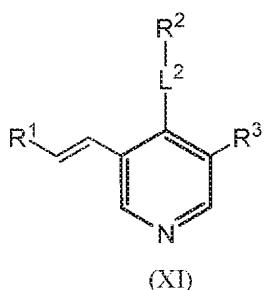
[本発明1004]

式(X)

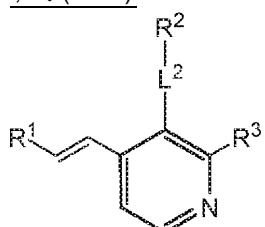


(X)

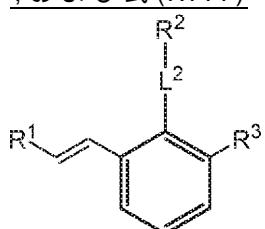
;式(XI)



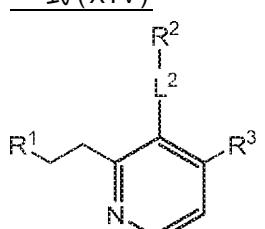
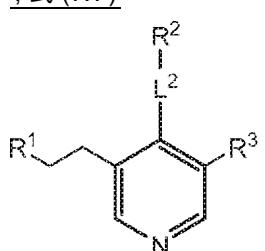
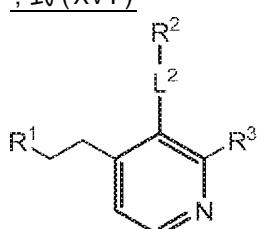
(XI)

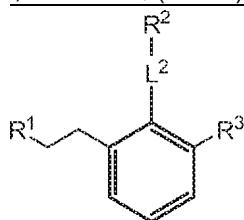
;式(XII)

(XII)

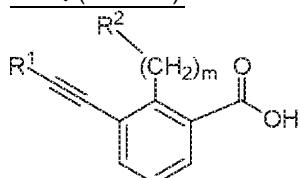
;および式(XIII)

(XIII)

からなる群より選択される、少なくとも1つの式の化合物である、本発明1002の化合物。[本発明1005]式(XIV);式(XV);式(XVI)

;および式(XVII)

からなる群より選択される、少なくとも1つの式の化合物である、本発明1002の化合物。

[本発明1006]式(XVIII)

の化合物である、本発明1001の化合物。

[本発明1007]

R¹が、4-アセトアミドフェニル;4-(アミノメチル)フェニル;4-アミノフェニル;4-{8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル}フェニル;3-カルバモイル-5-メトキシフェニル;4-{[(2-カルボキシフェニル)ホルムアミド]メチル}フェニル;4-{[(4-カルボキシフェニル)ホルムアミド]メチル}フェニル;4-(3-クロロ-4-フルオロベンゼンスルホンアミド)フェニル;2,4-ジフルオロフェニル;4-[(4,4-ジフルオロピペリジン-1-イル)メチル]フェニル;4-{[2-(ジメチルアミノ)エチル]カルバモイル}フェニル;4-({[2-(ジメチルアミノ)エチル](メチル)アミノ}メチル)フェニル;1-[2-(ジメチルアミノ)エチル]-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-3-イル;1-[3-(ジメチルアミノ)プロピル]-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-3-イル;4-[(ジメチルアミノ)メチル]フェニル;4-[(1,1-ジオキソ-1⁶-チアン-4-イル)オキシ]フェニル;4-[(1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリン-4-イル)メチル]フェニル;4-[(4-エチルピペラジン-1-イル)メチル]フェニル;4-フルオロ-3-(オキサン-4-イルオキシ)フェニル;4-フルオロフェニル;4-{[(2-フルオロフェニル)ホルムアミド]メチル}フェニル;4-[(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル)メチル]フェニル;4-{[4-(2-ヒドロキシエチル)ピペリジン-1-イル]メチル}フェニル;4-[(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)メチル]フェニル;4-メタンスルホンアミドフェニル;3-(3-メタンスルホンアミドフェニル)フェニル;4-(4-メトキシベンゼンスルホンアミド)フェニル;4-{[(2-メトキシエチル)(メチル)アミノ]メチル}フェニル;4-[(2-メトキシエチル)(メチル)カルバモイル]フェニル;4-メトキシフェニル;4-[(4-メトキシピペリジン-1-イル)メチル]フェニル;4-[(4-メチル-1,4-ジアゼパン-1-イル)メチル]フェニル;4-[(4-メチルピペラジン-1-イル)メチル]フェニル;2-メチル-4-オキソ-3,4-ジヒドロキナゾリン-7-イル;3-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル;4-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル;1-[2-(モルホリン-4-イル)エチル]-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-3-イル;1-[3-(モルホリン-4-イル)プロピル]-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-3-イル;1-[2-(モルホリン-4-イル)エチル]-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル;1-[2-(ジメチルアミノ)エチル]-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル;1,8-ナフチリジン-2-イル;4-(オキサン-4-イルメトキシ)フェニル;4-[2-(オキサン-4-イル)エトキシ]フェニル;4-(オキサン-4-イルオキシ)フェニル;4-(オキサン-4-イルオキシ)-3-(トリフルオロメチル)フェニル;4-オキソ-3,4-ジヒドロキナゾリン-7-イル;フェニル4-[(フェニルホルムアミド)メチル]フェニル;4-(ピペラジン-1-カルボニル)フェニル;4-(ピリジン-3-アミド)フェニル;2-(5,6,7,8-テトラヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-イル;および4-(チオフェン-2-スルホンアミド)フェニルからなる群より選択される少なくとも1つである、本発明1001の化合物。

[本発明1008]

R²が、1,3-ベンゾチアゾール-5-イル;5-フルオロ-インドール-6-イル;7-フルオロ-インドール-6-イル;インドール-6-イル;2-メチル-1,3-ベンゾチアゾール-5-イル;1-メチル-1H

-ピロ口[2,3-b]ピリジン-6-イル;1,8-ナフチリジン-2-イル;1,8-ナフチリジン-3-イル;および1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イルからなる群より選択される、本発明1001の化合物。

[本発明1009]

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(2-モルホリン-4-イル-エチル)-1H-インドール-6-イルエチニル]-安息香酸;
3-[3-アセチルアミノ-4-(テトラヒドロ-ピラン-4-イルオキシ)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸;
3-[4-(8-アセチル-8-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-3-イル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸;
3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸;
3-[1-(3-ジメチルアミノ-プロピル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸;
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(3-モルホリン-4-イル-プロピル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イルエチニル]-安息香酸;
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(3-モルホリン-4-イル-プロピル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-3-イルエチニル]-安息香酸;
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(2-モルホリン-4-イル-エチル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イルエチニル]-安息香酸;
3-{2-[3-(3,3-ジメチル-2-オキソアゼチジン-1-イル)フェニル]エチニル}-2-(1H-ピロール-1-イル)安息香酸;
3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-3-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸;
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(2-モルホリン-4-イル-エチル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-3-イルエチニル]-安息香酸;
3-[1-(3-ジメチルアミノ-プロピル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-3-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸;
3-{1-[2-(1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリン-4-イル)-エチル]-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イルエチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸;
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(2-モルホリン-4-イル-エチル)-1H-インドール-5-イルエチニル]-安息香酸;
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(3-モルホリン-4-イル-プロピル)-1H-インドール-5-イルエチニル]-安息香酸;
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(3-モルホリン-4-イル-プロピル)-1H-インドール-6-イルエチニル]-安息香酸;
2-(1H-インドール-6-イル)-3-(5,6,7,8-テトラヒドロ-[1,8]ナフチリジン-3-イルエチニル)-安息香酸;
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(テトラヒドロ-ピラン-4-イルメチル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イルエチニル]-安息香酸;
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(テトラヒドロ-ピラン-4-イルメチル)-1H-インドール-5-イルエチニル]-安息香酸;
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(1-メタンスルホニル-ピペリジン-4-イルメチル)-1H-インドール-5-イルエチニル]-安息香酸;
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[1-(1-メタンスルホニル-ピペリジン-4-イルメチル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イルエチニル]-安息香酸;
3-[1-(1,1-ジオキソ-ヘキサヒドロ-1⁶-チオピラン-4-イルメチル)-1H-ピロ口[2,3-b]ピリジン-5-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸;
3-{1-[2-(1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリン-4-イル)-エチル]-1H-インドール-5-イルエチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸;

3-[1-[2-(1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリン-4-イル)-エチル]-1H-インドール-6-イルエチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[1-[3-(1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリン-4-イル)-プロピル]-1H-インドール-5-イル-エチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[1-[3-(1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリン-4-イル)-プロピル]-1H-インドール-6-イル-エチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(1,1-ジオキソ-ヘキサヒドロ-1⁶-チオピラン-4-イルオキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(テトラヒドロ-ピラン-4-イルオキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-(4-イソプロポキシメチル-フェニルエチニル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(1-オキソ-ヘキサヒドロ-1⁴-チオピラン-4-イルオキシ)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-(3-モルホリン-4-イルメチル-1H-インドール-6-イルエチニル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[3-(4-メタンスルホニル-ピペラジン-1-イルメチル)-1H-インドール-6-イルエチニル]-安息香酸；
3-[3-(1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリン-4-イルメチル)-1H-インドール-6-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-(2-モルホリン-4-イルメチル-1H-インドール-6-イルエチニル)-安息香酸；
3-[2-(1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリン-4-イルメチル)-1H-インドール-6-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[1-(4-エトキシ-2-メチル-ブチル)-6-フルオロ-1H-インドール-5-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[7-フルオロ-1-(テトラヒドロ-ピラン-4-イルメチル)-1H-インドール-6-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[1-(1,1-ジオキソ-ヘキサヒドロ-1⁶-チオピラン-4-イルメチル)-7-フルオロ-1H-インドール-6-イルエチニル]-2-(1H-インドール-1)-安息香酸；
3-[1-(1,1-ジオキソ-ヘキサヒドロ-1⁶-チオピラン-4-イルメチル)-6-フルオロ-1H-インドール-5-イルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-(7-フルオロ-3-モルホリン-4-イルメチル-1H-インドール-6-イルエチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-(6-フルオロ-3-モルホリン-4-イルメチル-1H-インドール-5-イルエチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-((4-(2H-テトラゾール-5-イル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
3-((3-(2H-テトラゾール-5-イル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((4-(オキサゾール-5-イル)フェニル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((4-(6-オキソ-1,6-ジヒドロピリダジン-3-イル)フェニル)エチニル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-((3-メトキシ-4-(モルホリノメチル)フェニル)エチニル)エチニル)安息香酸；
3-((3-ヒドロキシ-4-(モルホリン-4-カルボニル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[3-メトキシ-4-(4-モルホリン-4-イル-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-((4-((4,4-ジフルオロピペリジン-1-イル)メチル)-3-メトキシフェニル)エチニル)-2

- (1H- インドール-6-イル) 安息香酸;

3-((4-((4-(ジメチルカルバモイル)ピペリジン-1-イル)メチル)-3-メトキシフェニル)エチニル)-2-(1H- インドール-6-イル) 安息香酸;

3-((3-ヒドロキシ-4-(4-モルホリノピペリジン-1-カルボニル)フェニル)エチニル)-2-(1H- インドール-6-イル) 安息香酸;

3-((4-(4,4-ジフルオロピペリジン-1-カルボニル)-3-ヒドロキシフェニル)エチニル)-2-(1H- インドール-6-イル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((4-((1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イル)メチル)フェニル)エチニル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((4-((1-((トリフルオロメチル)スルホニル)ピペリジン-4-イル)メチル)フェニル)エチニル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((4-((1-(イソプロピルスルホニル)ピペリジン-4-イル)メチル)フェニル)エチニル) 安息香酸;

3-((4-((1-アセチルピペリジン-4-イル)メチル)フェニル)エチニル)-2-(1H- インドール-6-イル) 安息香酸;

3-((2-アセチルイソインドリン-5-イル)エチニル)-2-(1H- インドール-6-イル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((2-(イソプロピルスルホニル)イソインドリン-5-イル)エチニル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((2-(1-(メチルスルホニル)ピロリジン-3-イル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)エチニル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((2-((1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イル)メチル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-6-イル)エチニル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((2-(1-(メチルスルホニル)アゼチジン-3-イル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-6-イル)エチニル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((2-((1-(メチルスルホニル)ピロリジン-3-イル)メチル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-6-イル)エチニル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((2-((1-(メチルスルホニル)ピロリジン-3-イル)メチル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)エチニル) 安息香酸;

3-((2-((1-アセチルピロリジン-3-イル)メチル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)エチニル)-2-(1H- インドール-6-イル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((2-((1-(メチルスルホニル)アゼチジン-3-イル)メチル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-6-イル)エチニル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((2-((1-(メチルスルホニル)アゼチジン-3-イル)メチル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)エチニル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((2-(3-(メチルスルホンアミド)ベンジル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-6-イル)エチニル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((2-(3-(メチルスルホンアミド)ベンジル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)エチニル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((2-(1-(メチルスルホニル)ピロリジン-3-イル)イソインドリン-5-イル)エチニル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((2-(1-(メチルスルホニル)アゼチジン-3-イル)イソインドリン-5-イル)エチニル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((2-((1-(メチルスルホニル)ピロリジン-3-イル)メチル)イソインドリン-5-イル)エチニル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((2-((1-(メチルスルホニル)アゼチジン-3-イル)メチル)イソインドリン-5-イル)エチニル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((2-((1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イル)メチル)イソインドリン-5-イル)エチニル) 安息香酸;

2-(1H- インドール-6-イル)-3-((2-(メチルスルホニル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノ

リン-7-イル)エチニル)安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-(イソプロピルスルホニル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)エチニル)安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-プロピオニル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)エチニル)安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-(メチルスルホニル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-6-イル)エチニル)安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-(イソプロピルスルホニル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-6-イル)エチニル)安息香酸；

3-((2-アセチル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-6-イル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-((2-プロピオニル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-6-イル)エチニル)安息香酸；

3-[4-(4-シアノ-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

3-[4-(3-シアノ-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

3-[4-(3-カルバモイル-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-トリフルオロメチル-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(3-トリフルオロメチル-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-メトキシ-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

3-[4-(4-カルバモイル-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(3-メトキシ-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-(4-フェノキシメチル-フェニルエチニル)-安息香酸；

3-[4-(2-フルオロ-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(ピリジン-3-イルオキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

3-[4-(3-クロロ-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

3-[4-(3,4-ジクロロ-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(2-トリフルオロメチル-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

3-[4-(2-シアノ-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-メタンスルホニル-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(ピリミジン-5-イルオキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(2-メタンスルホニル-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(3-メタンスルホニル-フェノキシメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-{2-[3-(3-メタンスルホンアミドフェニル)フェニル]エチニル}安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-{2-[6-(オキサン-4-イルオキシ)ピリジン-3-イル]エチニル}安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-{2-[2-(プロピルカルバモイル)-1H-インドール-6-イル]エチニル}安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-{2-[3-(1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-2-イルメチル)フェニル]エチニル}安息香酸；
3-{2-[3-シアノ-4-(オキサン-4-イルオキシ)フェニル]エチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
3-[2-(3-{[4-(エトキシカルボニル)ピペラジン-1-イル]メチル}フェニル)エチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
3-(2-{4-[3-(ヒドロキシメチル)オキセタン-3-イル]フェニル}エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
3-{2-[3-(5-アミノ-1H-ピラゾール-3-イル)フェニル]エチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-{2-[3-(1,3-オキサゾール-5-イル)フェニル]エチニル}安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-{2-[4-(オキサン-4-カルボニル)フェニル]エチニル}安息香酸；
2-(7-フルオロ-1H-インドール-6-イル)-3-フェニルエチニル-安息香酸；
2-ベンゾチアゾール-6-イル-3-フェニルエチニル-安息香酸；
2-ベンゾチアゾール-5-イル-3-フェニルエチニル-安息香酸；
2-(2-メチル-ベンゾチアゾール-5-イル)-3-フェニルエチニル-安息香酸；
2-(5-フルオロ-1H-インドール-6-イル)-3-フェニルエチニル-安息香酸；
2-(6-フルオロ-1H-インドール-5-イル)-3-フェニルエチニル-安息香酸；
2-[1,8]ナフチリジン-3-イル-3-フェニルエチニル-安息香酸；
2-(1-メチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-6-イル)-3-フェニルエチニル-安息香酸；
2-[1,8]ナフチリジン-2-イル-3-フェニルエチニル-安息香酸；
3-フェニルエチニル-2-(1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-6-イル)-安息香酸；
2-(4-メトキシ-1H-インドール-6-イル)-3-(2-フェニルエチニル)-安息香酸；
3-(2-(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-(2-(4-(2-アミノチアゾール-4-イル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-(3-スルファモイル-フェニルエチニル)-安息香酸；
3-(4-アミノ-3-スルファモイル-フェニルエチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-(スピロ[2H-1-ベンゾピラン-2,1'-4-ピペリジン-1-t-ブチルカルボキシラート]-4(3H)-オン)エチニル)安息香酸；
3-(2-(3-(2-アミノチアゾール-4-イル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-(2-(4-(5-(メトキシカルボニル)-2-アミノチアゾール-4-イル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-(2-(4-(5-アミノ-1,3,4-チアジアゾール-2-イル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-(2-(4-(3-アミノ-1H-ピラゾール-5-イル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-アミノ-4-{4-[3-カルボキシ-2-(1H-インドール-6-イル)-フェニルエチニル]-フェニル}-チアゾール-5-カルボン酸；

3-(2-(4-(2-アミノオキサゾール-5-イル)フェニル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(2-メタンスルホニルアミノ-チアゾール-4-イル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[3-(2-メタンスルホニルアミノ-チアゾール-4-イル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-(2-(1,4-ジヒドロ-2-((4-メトキシペリジン-1-イル)メチル)-4-オキソキナゾリン-6-イル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
3-(2-(1,4-ジヒドロ-2-((4-チオモルホリン-1,1ジオキシド-1-イル)メチル)-4-オキソキナゾリン-6-イル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
3-(2-(2-(トリフルオロメチル)-3,4-ジヒドロ-4-オキソキナゾリン-6-イル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
3-(2-(3,4-ジヒドロ-3-(2-メトキシエチル)-4-オキソピリド[2,3-d]ピリミジン-6-イル)エチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[3-(2-メトキシ-6-メチル-フェニルカルバモイル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-{3-[4-(1,1-ジオキソ-1-チオモルホリン-4-イル)-フェニルカルバモイル]-フェニルエチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-フェニルエチニル-2-(1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-安息香酸；
3-(4-フルオロ-フェニルエチニル)-2-(1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-安息香酸；
3-(4-メトキシ-フェニルエチニル)-2-(1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-安息香酸；
2-(1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-3-[4-(テトラヒドロ-ピラン-4-イルオキシ)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-{4-[2-(テトラヒドロ-ピラン-4-イル)-エトキシ]-フェニルエチニル}-安息香酸；
3-[4-(1,1-ジオキソ-ヘキサヒドロ-1-チオピラン-4-イルオキシ)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-(4-モルホリン-4-イルメチル-フェニルエチニル)-安息香酸；
3-[4-(4-エチル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-[4-(1,1-ジオキソ-チオモルホリン-4-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-(4-{[(2-ジメチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-フェニルエチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-{4-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペリジン-1-イルメチル]-フェニルエチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-メチル-[1,4]ジアゼパン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-[4-(3-ヒドロキシ-アゼチジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-(4-ジメチルアミノメチル-フェニルエチニル)-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-{[(2-メトキシ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-[4-(4,4-ジフルオロ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(3,3-ジフルオロ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-メタンスルホニル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(3-トリフルオロメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-イソプロピル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-[4-(4-シクロヘキシル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(4-シクロプロパンカルボニル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-(4-ピペラジン-1-イルメチル-フェニルエチニル)-安息香酸；
3-[4-(4-ベンゼンスルホニル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-{4-[(1,1-ジオキソ-ヘキサヒドロ-1-チオピラン-4-イルアミノ)-メチル]-フェニルエチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(4-シクロペンチル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(4-ジメチルカルバモイル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(2,3,5,6-テトラヒドロ-[1,2']ビピラジニル-4-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-チアゾール-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-{4-[(2-アミノ-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾチアゾール-6-イルアミノ)-メチル]-フェニルエチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-{4-[(2-アミノ-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾチアゾール-6-イルアミノ)-メチル]-フェニルエチニル}-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-安息香酸；
3-[4-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-5-イル)-3-[4-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-5-イル)-3-[4-(4-メタンスルホニル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-[4-(4-メタンスルホニル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-安息香酸；
3-[4-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-5-イル)-安息香酸；

2-(1H-インドール-5-イル)-3-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-[4-(4-エタンスルホニル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(1,1-ジオキソ-ヘキサヒドロ-1-チオピラン-4-イルオキシ)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-5-イル)-安息香酸；
3-[4-(1,1-ジオキソ-ヘキサヒドロ-チオピラン-4-イルオキシ)-フェニルエチニル]-2-(1H-インダゾール-6-イル)-安息香酸；
3-[2-フルオロ-4-(テトラヒドロ-ピラン-4-イルオキシメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(1,1-ジオキソ-ヘキサヒドロ-1-チオピラン-4-イルオキシメチル)-2-フルオロ-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(2-メタンスルホニル-2,7-ジアザ-スピロ[3.5]ノナ-7-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(5-メタンスルホニル-ヘキサヒドロ-ピロロ[3,4-c]ピロール-2-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-[4-(4-シクロプロパンスルホニル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(プロパン-2-スルホニル)-ピペラジン-1-イルメチル]-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(7-メタンスルホニル-2,7-ジアザ-スピロ[3.5]ノナ-2-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-5-イル)-3-[4-(テトラヒドロ-ピラン-4-イルオキシ)-フェニルエチニル]-安息香酸；
N-(N,N-ジメチルスルファモイル)-2-(1H-インドール-6-イル)-3-((4-(((テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)オキシ)メチル)フェニル)ベンズアミド；
2-(1H-インドール-6-イル)-N-(メチルスルホニル)-3-((4-(((テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)オキシ)メチル)フェニル)ベンズアミド；
6-[2-[4-(テトラヒドロ-ピラン-4-イルオキシメチル)-フェニルエチニル]-6-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル]-1H-インドール；
3-[4-(ベンゾイルアミノ-メチル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-(4-{[(4-オキソ-シクロヘキサンカルボニル)-アミノ]-メチル}-フェニルエチニル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-オキソ-シクロヘキシカルバモイル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
3-[4-(2-アミノ-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾチアゾール-6-イルカルバモイル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
3-[4-(2-アミノ-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾチアゾール-6-イルカルバモイル)-フェニルエチニル]-2-(1H-インドール-6-イル)-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-カルボニル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-メトキシ-ピペリジン-1-カルボニル)-フェニルエチニル]-安息香酸；
2-(1H-インダゾール-6-イル)-3-[4-(4-メタンスルホニル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸； および
2-(1H-インドール-6-イル)-3-[4-(4-スルファモイル-ピペラジン-1-イルメチル)-フェニルエチニル]-安息香酸
からなる群より選択される、少なくとも1つである、本発明1001の化合物。
[本発明1010]

本発明1001～1009のいずれかの少なくとも1つの化合物と、少なくとも1つの薬学的に許容される担体とを含む、薬学的組成物。

[本発明1011]

少なくとも1つの追加の抗ウイルス剤および/または抗がん剤をさらに含む、本発明1010の薬学的組成物。

[本発明1012]

本発明1001～1009のいずれかの少なくとも1つの化合物の治療的有効量を対象に投与する段階を含む、対象におけるEBNA1活性によって引き起こされる疾患または障害を処置および/または予防する方法。

[本発明1013]

疾患または障害が、がん、伝染性単核球症、慢性疲労症候群、多発性硬化症、全身性エリテマトーデス、および関節リウマチからなる群より選択される少なくとも1つである、本発明1012の方法。

[本発明1014]

がんが、上咽頭癌、胃癌、非ホジキンリンパ腫、未分化大細胞リンパ腫、血管免疫芽球性T細胞リンパ腫、肝脾T細胞リンパ腫、B細胞リンパ腫、バーキットリンパ腫、細網内皮症、細網症、小膠細胞腫、びまん性大細胞型B細胞リンパ腫、節外性T/NK細胞リンパ腫/血管中心性リンパ腫、濾胞性リンパ腫、免疫芽球性リンパ腫、粘膜関連リンパ組織リンパ腫、B細胞慢性リンパ球性白血病、マントル細胞リンパ腫、縦隔大細胞型B細胞リンパ腫、リンパ形質細胞性リンパ腫、節性辺縁帯B細胞リンパ腫、脾性辺縁帯リンパ腫、血管内大細胞型B細胞リンパ腫、原発性滲出性リンパ腫、リンパ腫様肉芽腫症、血管免疫芽細胞性リンパ節症、平滑筋肉腫、X連鎖リンパ増殖性疾患、移植後リンパ増殖性障害、ホジキンリンパ腫、および乳がんからなる群より選択される少なくとも1つである、本発明1013の方法。

[本発明1015]

本発明1001～1009のいずれかの少なくとも1つの化合物の治療的有効量を対象に投与する段階を含む、対象におけるエプスタイン・バーウィルス(EBV)感染、および/またはEBV感染に関連する疾患もしくは障害を処置および/または予防する方法。

[本発明1016]

本発明1001～1009のいずれかの少なくとも1つの化合物の治療的有効量を対象に投与する段階を含む、対象における溶解EBVウイルス感染および/または潜伏EBVウイルス感染を処置および/または予防する方法。

[本発明1017]

化合物が、経口、鼻、吸入、局所、口腔、直腸、胸膜、腹膜、腔、筋肉内、皮下、経皮、硬膜外、気管内、耳、眼内、髄腔内、および静脈内経路からなる群より選択される少なくとも1つの経路によって対象に投与される、本発明1012～1016のいずれかの方法。

[本発明1018]

化合物が、少なくとも1つの薬学的に許容される担体をさらに含む薬学的組成物の一部として投与される、本発明1012～1017のいずれかの方法。