

【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25年1月31日 (2013.1.31)

【公表番号】特表2012-510990(P2012-510990A)

【公表日】平成24年5月17日 (2012.5.17)

【年通号数】公開・登録公報2012-019

【出願番号】特願2011-539512(P2011-539512)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 487/04 1 5 0

C 0 7 D 487/04 C S P

A 6 1 K 31/55

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 37/00

A 6 1 P 29/00

C 0 7 D 519/00 3 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成24年12月4日 (2012.12.4)

【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

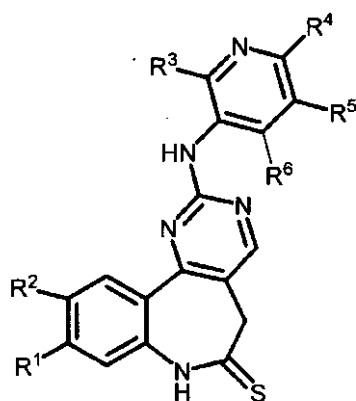
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 7 5】



(式中、

$R^1$  は、水素、 $-CN$ 、ハロゲン、任意選択的に置換された  $C_1 \sim 6$  脂肪族、または  $-YR^{1a}$  から選択され、

$Y$  は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、または  $-NR^{1a}$  であり、それぞれ存在する  $R^{1a}$  は、独立して、水素または任意選択的に置換された  $C_1 \sim 6$  脂肪族であり、

$R^2$  は、水素、ハロゲン、 $-ZR^{2a}$ 、または  $-OR^{2b}$  から選択され、

$Z$  は任意選択的に置換された  $C_1 \sim 6$  アルキレン鎖であり、 $R^{2a}$  は、 $-OR^{2b}$ 、 $-N(R^{2b})_2$ 、 $-SR^{2b}$ 、 $-C(O)N(R^{2b})_2$ 、 $-N(R^{2b})C(O)R^{2b}$ 、 $-SO_2N(R^{2b})_2$ 、 $-NR^{2b}SO_2R^{2b}$ 、 $-NR^{2b}C(O)N(R^{2b})_2$ 、または  $-NR^{2b}SO_2N(R^{2b})_2$  であり、それぞれ存在する  $R^{2b}$  は、独立して、水素または任意選択的に置換された  $C_1 \sim 6$  アルキルであるか、2つの存在する  $R^{2b}$  が、それらが結合する1つの窒素原子と共に、任意選択的に置換された3～7員ヘテロシクリル環を形成し、

$R^3$  は、水素、ハロゲン、任意選択的に置換された  $C_1 \sim 4$  アルキル、または任意選択的に置換された  $C_1 \sim 4$  アルコキシから選択され、

$R^4$  は、水素、任意選択的に置換された  $C_1 \sim 6$  脂肪族、任意選択的に置換された3～7員ヘテロシクリル環、 $-(CH_2)_xNR^{4a}R^{4b}$ 、 $-(CH_2)_xNR^{4a}C(O)R^{4b}$ 、 $-(CH_2)_xNR^{4a}S(O)_2R^{4b}$ 、 $-(CH_2)_xC(O)R^{4b}$ 、 $-(CH_2)_xC(O)NR^{4a}R^{4b}$ 、 $-(CH_2)_xS(O)_2NR^{4a}R^{4b}$ 、または  $-(CH_2)_xOR^{4b}$  から選択され、

それぞれ存在する  $x$  は、独立して、0～6であり、

$R^{4a}$  は水素または任意選択的に置換された  $C_1 \sim 6$  脂肪族であり、

$R^{4b}$  は、水素、任意選択的に置換された  $C_1 \sim 6$  脂肪族、任意選択的に置換された  $C_3 \sim 7$  -ヘテロシクリルまたは  $C_3 \sim 7$  カルボシクリル環であるか、 $W-R^{4c}$  であり、 $W$  は任意選択的に置換された  $C_2 \sim 6$  アルキレン鎖であり、 $R^{4c}$  は、任意選択的に置換された  $C_3 \sim 7$  -ヘテロシクリル環、 $-OR^{4d}$ 、 $-N(R^{4d})_2$ 、 $-SR^{4d}$ 、 $-C(O)N(R^{4d})_2$ 、 $-N(R^{4d})C(O)R^{4d}$ 、 $-SO_2N(R^{4d})_2$ 、 $-NR^{4d}SO_2R^{4d}$ 、 $-NR^{4d}C(O)N(R^{4d})_2$ 、または  $-NR^{4d}SO_2N(R^{4d})_2$  であり、それぞれ存在する  $R^{4d}$  は、独立して、水素または任意選択的に置換された  $C_1 \sim 6$  脂肪族であるか、2つの存在する  $R^{4d}$  が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された3～7員ヘテロシクリル環を形成するか、

$R^{4a}$  および  $R^{4b}$  が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された3～7員ヘテロシクリル環を形成し、

$R^5$  は、水素、任意選択的に置換された  $C_1 \sim 6$  脂肪族、任意選択的に置換された  $C_3 \sim 7$  -ヘテロシクリル環であるか、 $X-R^{5a}$  であり、 $X$  は任意選択的に置換された  $C_2 \sim 6$  アルキレン鎖または  $-NR^{5c}$  であり、

$X$  が任意選択的に置換された  $C_2 \sim 6$  アルキレン鎖である場合、 $R^{5a}$  は、 $-OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5b})_2$ 、 $-SR^{5b}$ 、 $-C(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-N(R^{5b})C(O)R^{5b}$ 、 $-SO_2N(R^{5b})_2$ 、 $-NR^{5b}SO_2R^{5b}$ 、 $-NR^{5b}C(O)N(R^{5b})_2$ 、または  $-NR^{5b}SO_2N(R^{5b})_2$  であり、

$X$  が  $-NR^{5c}$  である場合、 $R^{5a}$  は水素または任意選択的に置換された  $C_1 \sim 6$  脂肪族であるか、 $R^{5a}$  および  $R^{5c}$  が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された3～7員ヘテロシクリル環を形成し、

それぞれ存在する  $R^{5b}$  および  $R^{5c}$  は、独立して、水素または任意選択的に置換された  $C_1 \sim 6$  脂肪族であるか、2つの存在する  $R^{5b}$  または  $R^{5a}$  および  $R^{5c}$  が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された3～7員ヘテロシクリル環を形成するか、

$R^4$  および  $R^5$  が共に任意選択的に置換された5～7員の脂環式環またはヘテロシクリル環を形成し、

$R^6$  は、水素、ハロゲン、任意選択的に置換された  $C_1 \sim 4$  アルキル、または任意選択

的に置換された  $C_1 \sim 4$  アルコキシから選択される) の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2】

$R^2$ 、 $R^4$ 、および  $R^6$  はそれぞれ水素である、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 3】

$R^2$ 、 $R^5$ 、および  $R^6$  はそれぞれ水素である、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4】

$R^1$  は、任意選択的に置換された  $C_1 \sim 4$  脂肪族、ハロゲン、 $-CN$ 、または  $-OMe$  である、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5】

$R^1$  は、メチル、エチル、 $-CF_3$ 、 $Cl$ 、 $-CN$ 、 $-OMe$ 、またはシクロプロピルである、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6】

$R^2$  は水素または  $-Z-R^{2a}$  であり、 $Z$  は  $-(CH_2)_{2 \sim 4}$  であり、 $R^{2a}$  は  $N(R^{2b})_2$  であり、それぞれ存在する  $R^{2b}$  は水素または  $C_1 \sim 4$  アルキルから選択されるか、2つの存在する  $R^{2b}$  が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された  $C_3 \sim 7$  - ヘテロシクリル環を形成する、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 7】

$R^3$  はメチルまたは  $CF_3$  である、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 8】

$R^4$  はメチルまたは  $-NR^{4a}R^{4b}$  であり、 $R^{4a}$  および  $R^{4b}$  が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された 3 ~ 7 員ヘテロシクリル環を形成するか、 $R^{4a}$  は水素または  $C_1 \sim 4$  アルキルであり、 $R^{4b}$  は任意選択的に置換された  $C_3 \sim 7$  - ヘテロシクリル環であるか、 $W-R^{4c}$  であり、 $W$  は任意選択的に置換された  $C_2 \sim 6$  アルキレン鎖であり、 $R^{4c}$  は任意選択的に置換された  $C_3 \sim 7$  - ヘテロシクリル環である、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

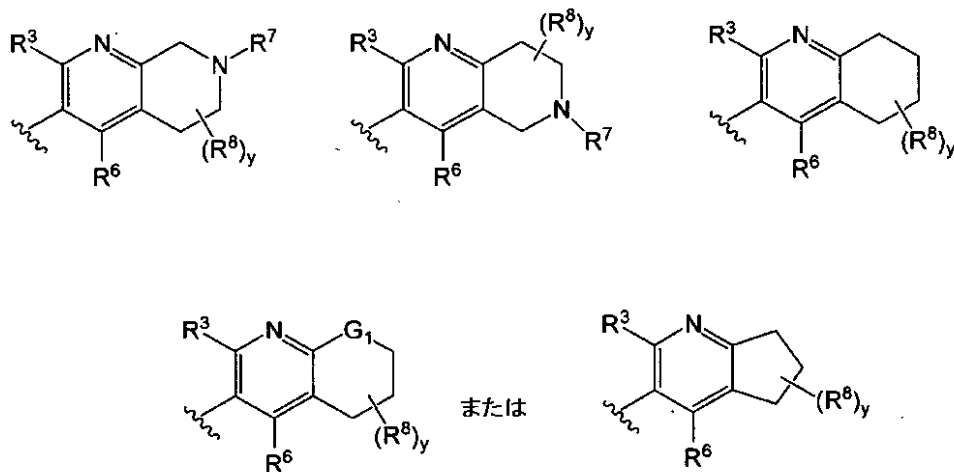
【請求項 9】

$R^5$  は任意選択的に置換された  $C_3 \sim 7$  - ヘテロシクリル環であるか、 $X-R^{5a}$  であり、 $X$  は任意選択的に置換された  $C_2 \sim 6$  アルキレン鎖であり、 $R^{5a}$  は  $-N(R^{5b})_2$  であり、それぞれ存在する  $R^{5b}$  は、独立して、水素または  $C_1 \sim 6$  アルキルであるか、2つの存在する  $R^{5b}$  が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された 3 ~ 7 員ヘテロシクリル環を形成する、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 10】

$R^4$  および  $R^5$  が共に以下：

## 【化 7 6】



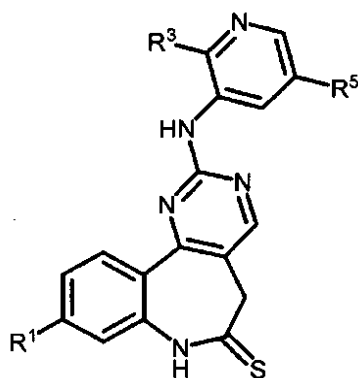
( 式中、

 $G_1$  は、 $-NH-$ 、 $-O-$ 、または  $-N(CH_3)-$  であり、 $R^7$  は、水素または任意選択的に置換された  $C_{1-6}$  脂肪族から選択され、 $R^8$  は、フルオロ、任意選択的に置換された  $C_{1-6}$  脂肪族、または  $-YR^{1a}$  から選択され、 $Y$  は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、または  $-NR^{1a}$  であり、それぞれ存在する  $R^{1a}$  は、独立して、水素または任意選択的に置換された  $C_{1-6}$  脂肪族であり、 $y$  は 0 ~ 4 である) から選択される環を形成する、請求項 1 に記載の化合物 またはその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 11】

式 I - A :

## 【化 7 7】



I-A

の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物 またはその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 12】

 $R^1$  は、任意選択的に置換された  $C_{1-4}$  脂肪族、ハロゲン、 $-CN$ 、または  $-OMe$  である、請求項 11 に記載の化合物 またはその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 13】

 $R^1$  は、メチル、エチル、 $-CF_3$ 、 $Cl$ 、 $-CN$ 、 $-OMe$ 、またはシクロプロピルである、請求項 11 に記載の化合物 またはその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 14】

 $R^3$  はメチルまたは  $CF_3$  である、請求項 11 に記載の化合物 またはその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 15】

 $R^5$  は任意選択的に置換された  $C_{3-7}$  - ヘテロシクリル環であるか、 $X-R^{5a}$  であり

、Xは任意選択的に置換された $C_2 \sim 6$ アルキレン鎖であり、 $R^{5a}$ は $-N(R^{5b})_2$ であり、それぞれ存在する $R^{5b}$ は、独立して、水素または $C_1 \sim 6$ アルキルであるか、2つの存在する $R^{5b}$ が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された3～7員ヘテロシクリル環を形成する、請求項11に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項16】

$R^5$ は、任意選択的に置換されたピロリジニル基、モルホリニル基、ピペリジニル基、またはピペラジニル基であるか、 $X-R^{5a}$ であり、Xは $C_2 \sim 4$ アルキレン鎖であり、 $R^{5a}$ は $-N(R^{5b})_2$ であり、それぞれ存在する $R^{5b}$ は、独立して、水素または $C_1 \sim 6$ アルキルであるか、2つの存在する $R^{5b}$ が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換されたピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基、またはモルホリニル基を形成する、請求項15に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項17】

前記ピロリジニル基、モルホリニル基、ピペリジニル基、またはピペラジニル基が1～4個の存在する $C_1 \sim 4$ アルキルまたは $C_1 \sim 4$ ハロアルキルに任意選択的に置換される、請求項16に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項18】

以下：

a)  $R^1$ は、メチル、エチル、プロピル、 $-CF_3$ 、Cl、 $-CN$ 、 $-OMe$ 、またはシクロプロピルであり、

b)  $R^3$ はメチルまたは $CF_3$ であり、

c)  $R^5$ は、任意選択的に置換されたピロリジニル基、モルホリニル基、ピペリジニル基、またはピペラジニル基であるか、 $X-R^{5a}$ であり、Xは $C_2 \sim 4$ アルキレン鎖であり、 $R^{5a}$ は $-N(R^{5b})_2$ であり、それぞれ存在する $R^{5b}$ は、独立して、水素または $C_1 \sim 6$ アルキルであるか、2つの存在する $R^{5b}$ が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換されたピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基、またはモルホリニル基を形成する、請求項11に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

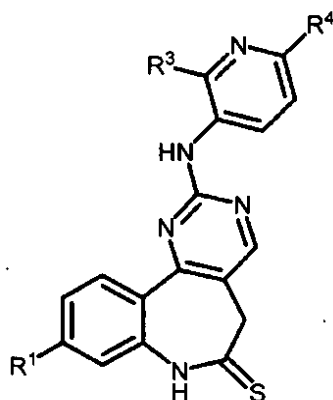
【請求項19】

$R^1$ はClまたは $CF_3$ であり、 $R^3$ はメチルである、請求項18に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項20】

式I-B：

【化78】



I-B.

の構造を有する、請求項1に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項21】

$R^1$  は、任意選択的に置換された  $C_1 \sim 4$  脂肪族、ハロゲン、 $-CN$ 、または  $-OMe$  である、請求項 20 に記載の化合物 またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 22】

$R^1$  は、メチル、エチル、 $-CF_3$ 、 $Cl$ 、 $-CN$ 、 $-OMe$ 、またはシクロプロピルである、請求項 21 に記載の化合物 またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 23】

$R^3$  はメチルまたは  $CF_3$  である、請求項 20 に記載の化合物 またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 24】

$R^4$  は  $-NR^{4a}R^{4b}$  であり、 $R^{4a}$  および  $R^{4b}$  が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された 3 ~ 7 員ヘテロシクリル環を形成するか、 $R^{4a}$  は水素または  $C_1 \sim 4$  アルキルであり、 $R^{4b}$  は任意選択的に置換された  $C_3 \sim 7$  - ヘテロシクリル環であるか、 $W-R^{4c}$  であり、 $W$  は任意選択的に置換された  $C_2 \sim 4$  アルキレン鎖であり、 $R^{4c}$  は任意選択的に置換された  $C_3 \sim 7$  - ヘテロシクリル環または  $-N(R^{4d})_2$  であり、それぞれ存在する  $R^{4d}$  は、独立して、水素または  $C_1 \sim 6$  アルキルであるか、2 つの存在する  $R^{4d}$  が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された 3 ~ 7 員ヘテロシクリル環を形成する、請求項 20 に記載の化合物 またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 25】

$R^4$  は  $-NR^{4a}R^{4b}$  であり、 $R^{4a}$  および  $R^{4b}$  が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換されたピロリジニル環、ピペラジニル環、ピペリジニル環、またはモルホリニル環を形成するか、 $R^{4a}$  は水素または  $C_1 \sim 4$  アルキルであり、 $R^{4b}$  は、任意選択的に置換されたピロリジニル環、ピペラジニル環、ピペリジニル環、またはモルホリニル環であるか、 $W-R^{4c}$  であり、 $W$  は任意選択的に置換された  $C_2 \sim 4$  アルキレン鎖であり、 $R^{4c}$  は、任意選択的に置換されたピロリジニル環、ピペラジニル環、ピペリジニル環、またはモルホリニル環であるか、 $-N(R^{4d})_2$  であり、それぞれ存在する  $R^{4d}$  は、独立して、水素または  $C_1 \sim 6$  アルキルであるか、2 つの存在する  $R^{4d}$  が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換されたピロリジニル環、ピペラジニル環、ピペリジニル環、またはモルホリニル環を形成する、請求項 24 に記載の化合物 またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 26】

以下：

a)  $R^1$  は、メチル、エチル、プロピル、 $-CF_3$ 、 $Cl$ 、 $-CN$ 、 $-OMe$ 、またはシクロプロピルであり、

b)  $R^3$  はメチルまたは  $CF_3$  であり、

c)  $R^4$  は  $-NR^{4a}R^{4b}$  であり、 $R^{4a}$  および  $R^{4b}$  が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換されたピロリジニル環、ピペラジニル環、ピペリジニル環、またはモルホリニル環を形成するか、 $R^{4a}$  は水素または  $C_1 \sim 4$  アルキルであり、 $R^{4b}$  は、任意選択的に置換されたピロリジニル環、ピペラジニル環、ピペリジニル環、またはモルホリニル環であるか、 $W-R^{4c}$  であり、 $W$  は任意選択的に置換された  $C_2 \sim 4$  アルキレン鎖であり、 $R^{4c}$  は、任意選択的に置換されたピロリジニル環、ピペラジニル環、ピペリジニル環、またはモルホリニル環であるか、 $-N(R^{4d})_2$  であり、それぞれ存在する  $R^{4d}$  は、独立して、水素または  $C_1 \sim 6$  アルキルであるか、2 つの存在する  $R^{4d}$  が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換されたピロリジニル環、ピペラジニル環、ピペリジニル環、またはモルホリニル環を形成する、請求項 20 に記載の化合物 またはその薬学的に許容可能な塩。

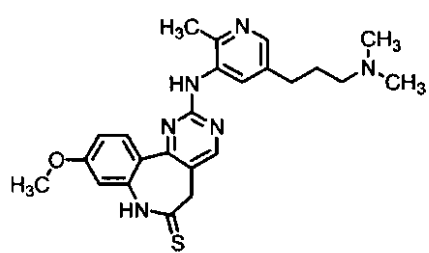
【請求項 27】

$R^1$  は  $Cl$  または  $CF_3$  であり、 $R^3$  はメチルである、請求項 26 に記載の化合物 またはその薬学的に許容可能な塩。

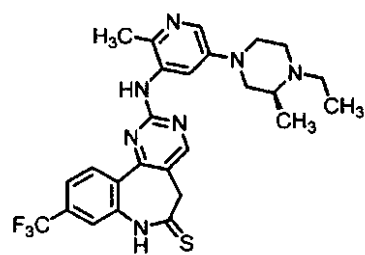
【請求項 28】

前記化合物が、以下：

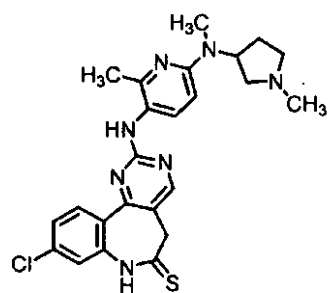
【化 7 9】



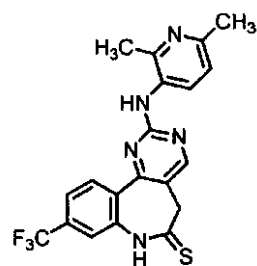
I-1



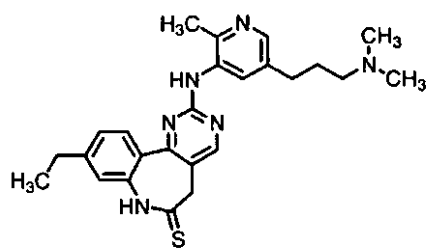
I-2



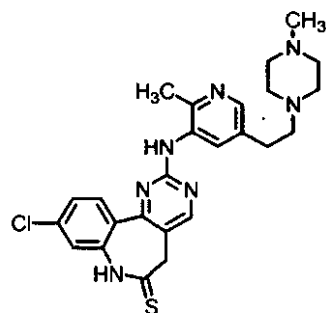
I-3



I-4

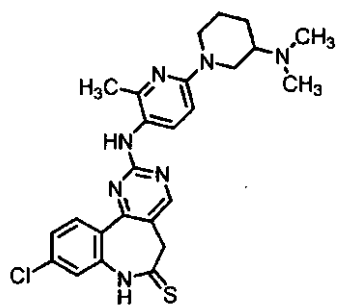


I-5

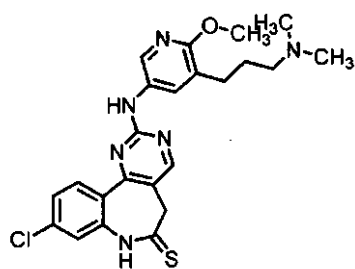


I-6

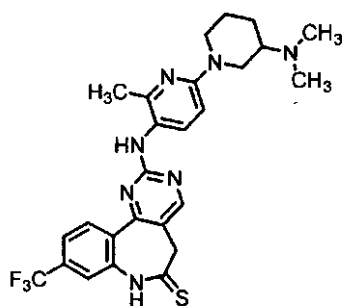
【化 8 0】



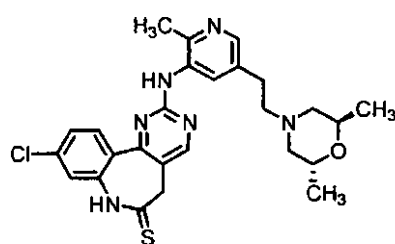
I-7



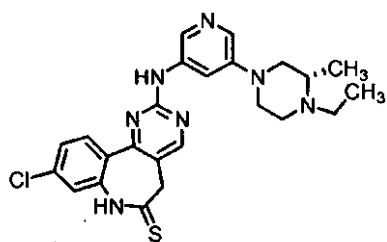
I-8



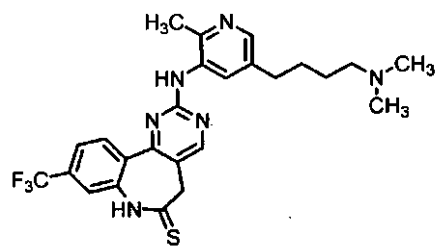
I-9



I-10



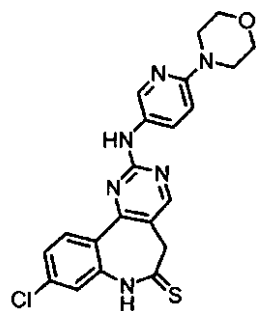
I-11



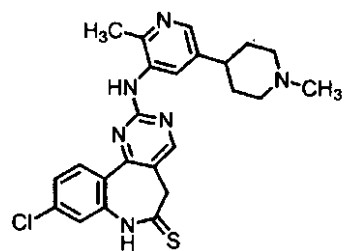
I-12



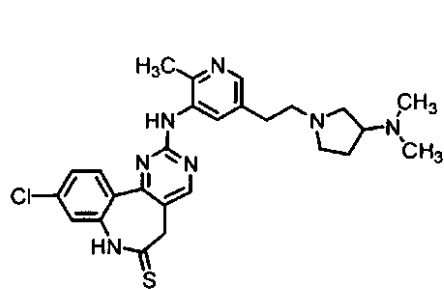
【化 8 1】



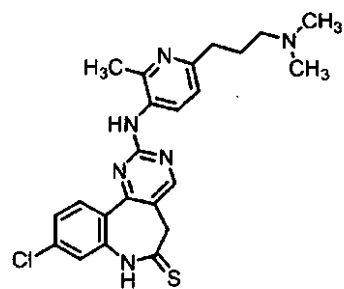
I-13



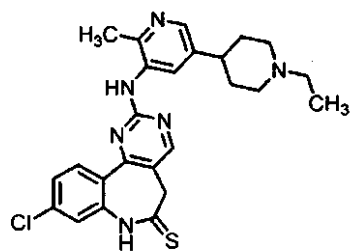
I-14



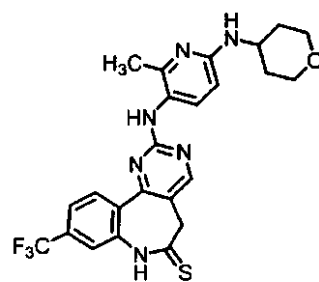
I-15



I-16

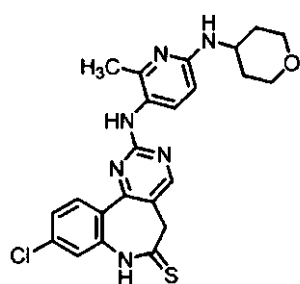


I-17

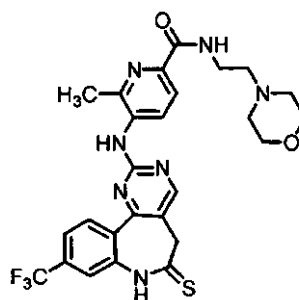


I-18

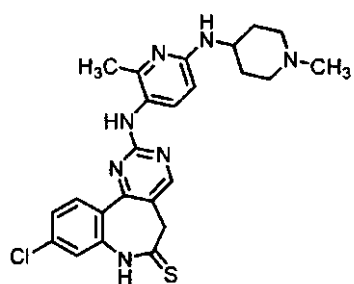
【化 8 2】



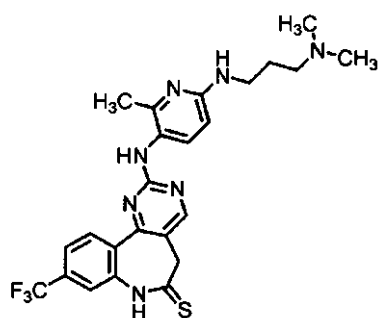
I-19



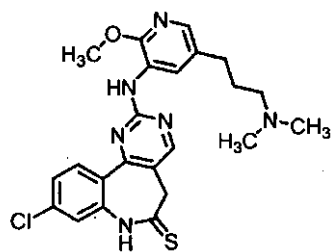
I-21



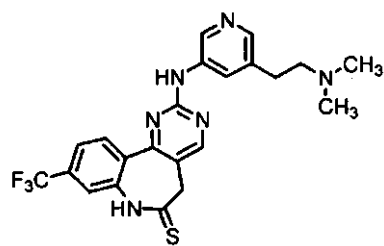
I-22



I-23

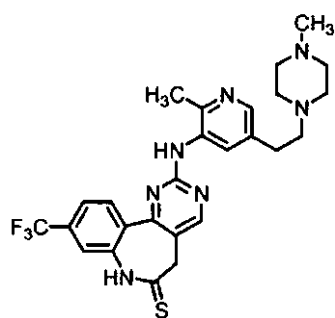


I-24

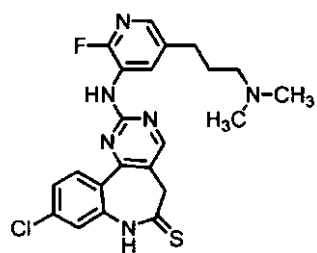


I-25

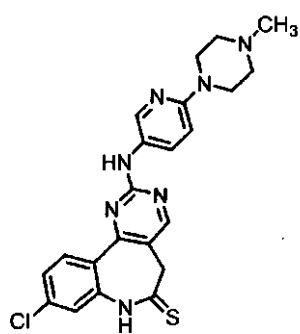
【化 8 3】



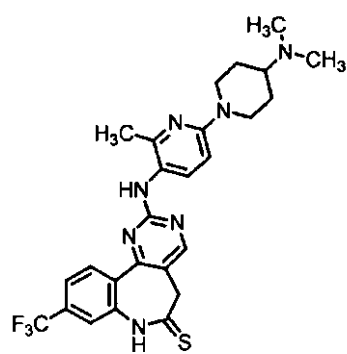
I-26



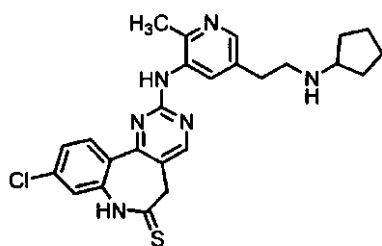
I-27



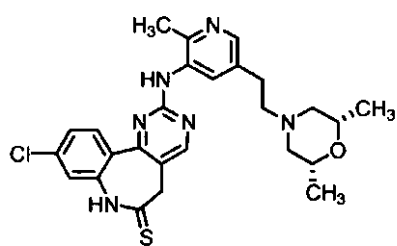
I-28



I-29

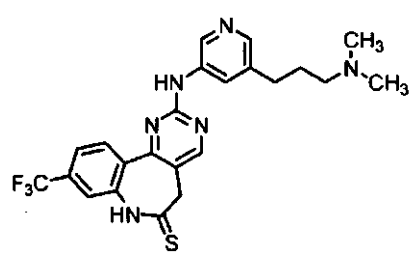


I-30

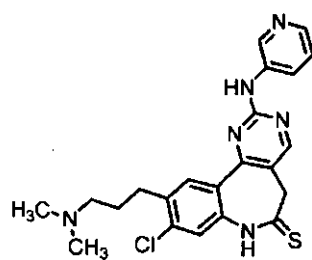


I-31

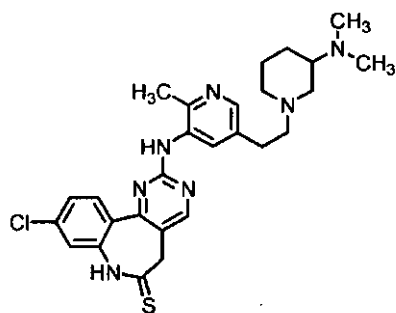
## 【化 8 4】



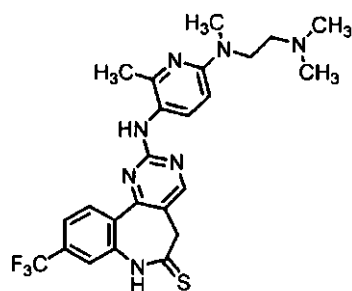
I-32



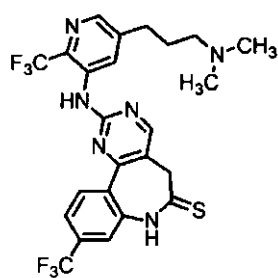
I-33



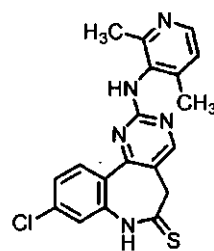
I-34



I-35

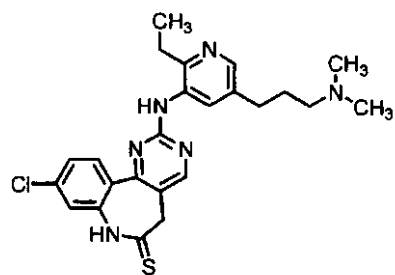


I-36

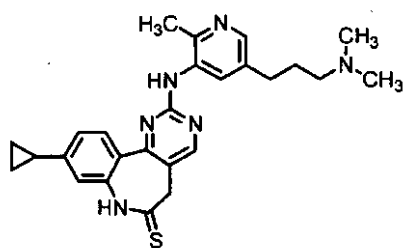


I-37

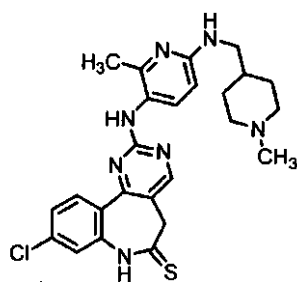
## 【化 8 5】



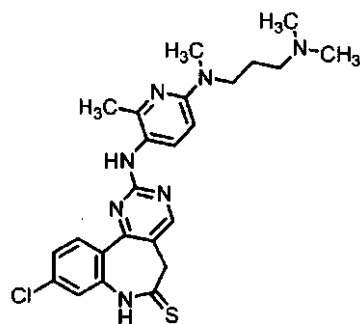
I-38



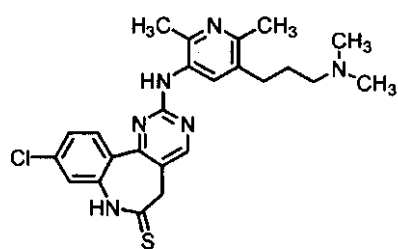
I-39



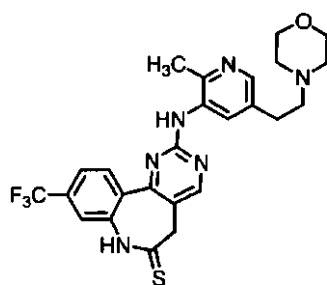
I-40



I-41

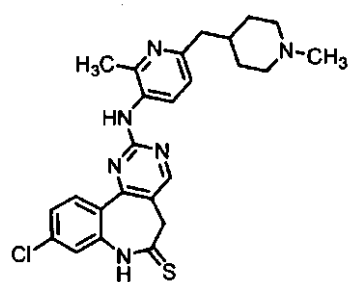


I-42

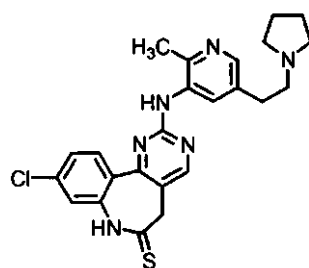


I-43

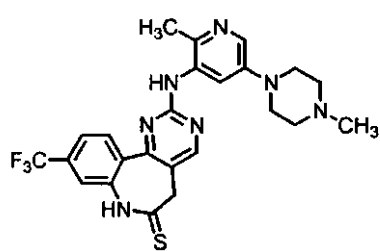
【化 8 6】



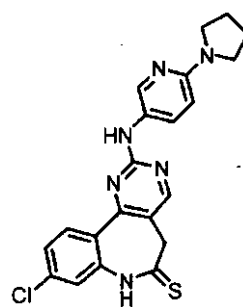
I-44



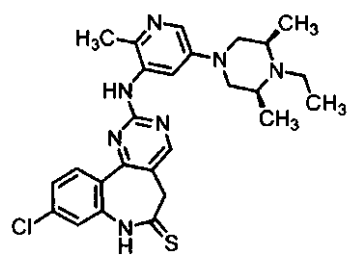
I-45



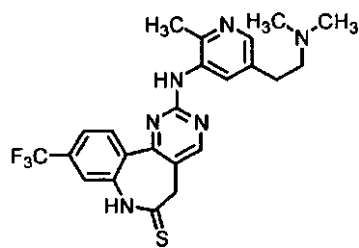
I-46



I-47

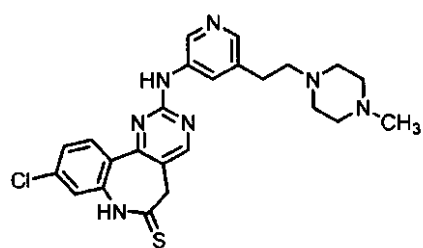


I-49

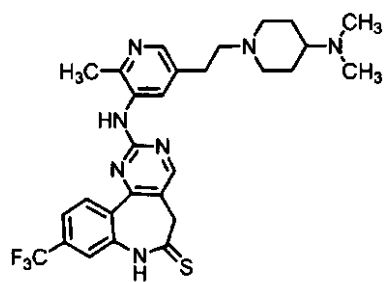


I-50

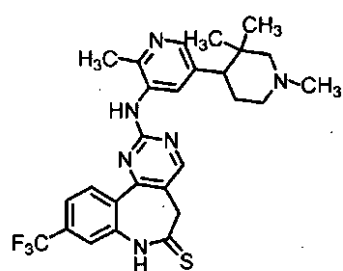
【化 8 7】



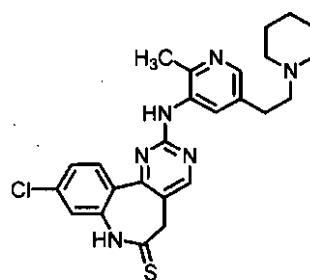
I-51



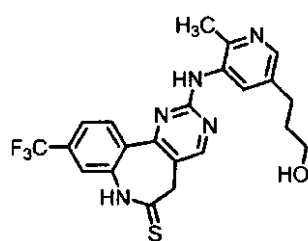
I-52



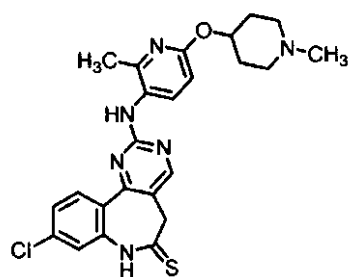
I-53



I-54

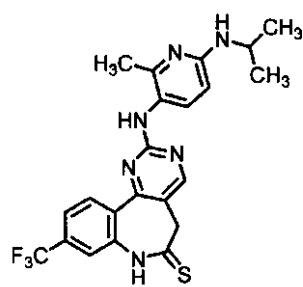


I-55

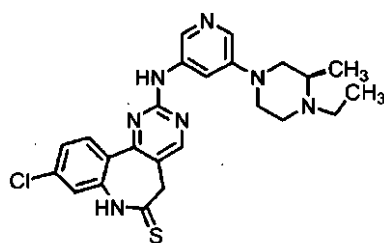


I-56

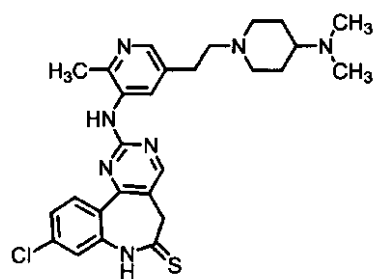
【化 8 8】



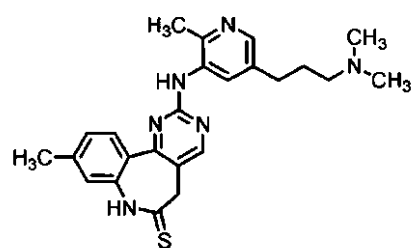
I-57



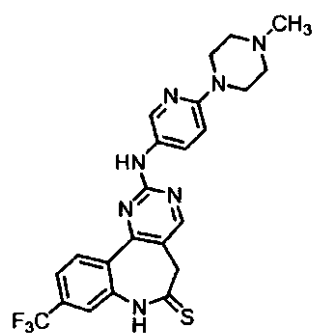
I-58



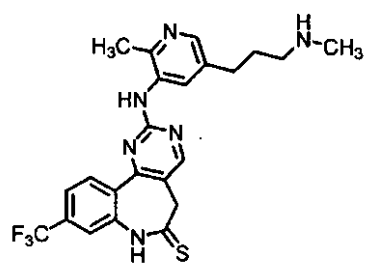
I-59



I-60



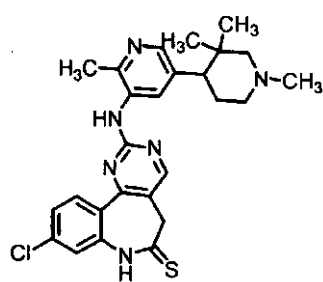
I-61



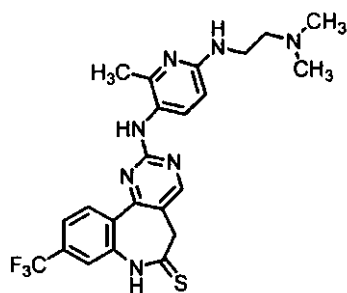
I-62



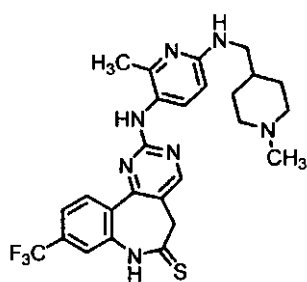
【化 8 9】



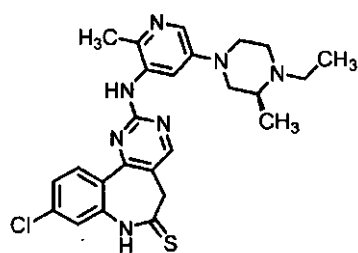
I-63



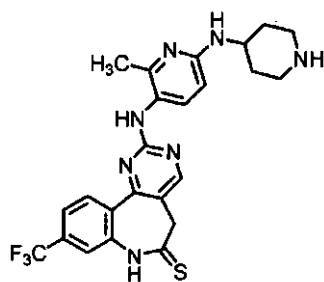
I-64



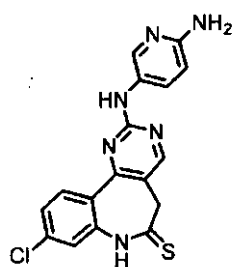
I-65



I-66

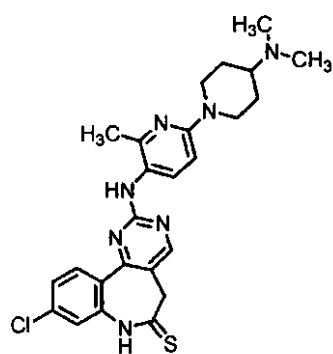


I-67

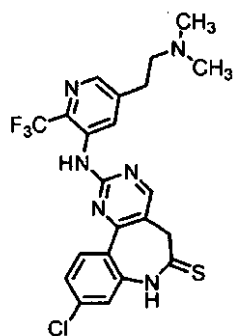


I-68

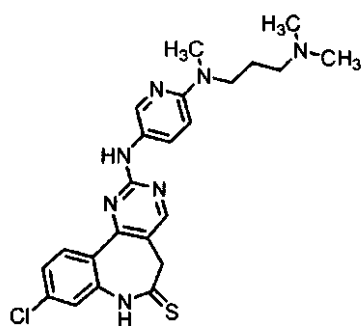
【化 9 0】



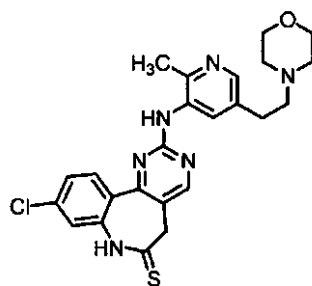
I-69



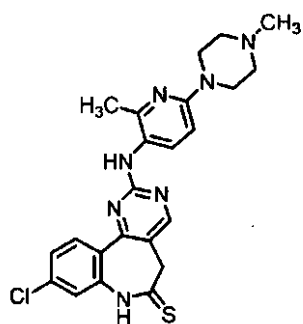
I-70



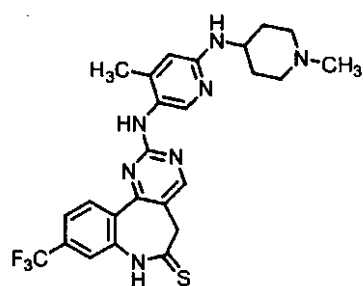
I-71



I-72

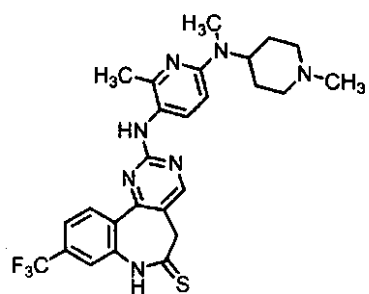


I-73

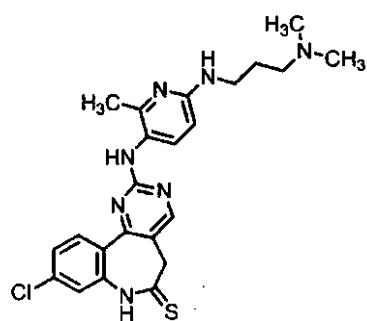


I-74

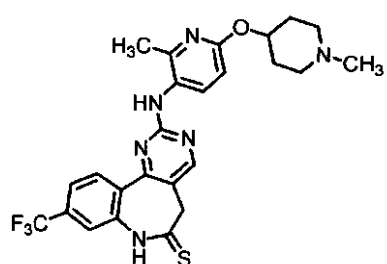
【化 9 1】



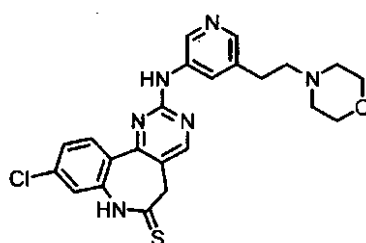
I-75



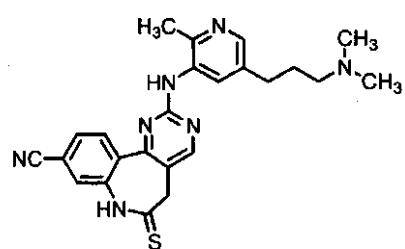
I-76



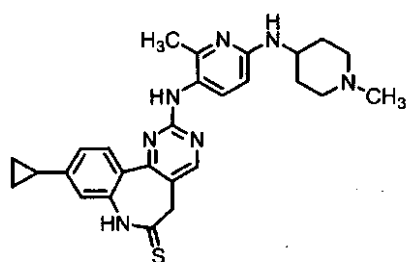
I-77



I-78

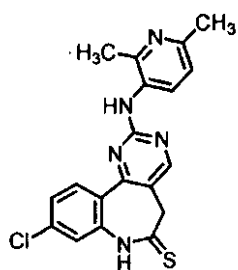


I-79

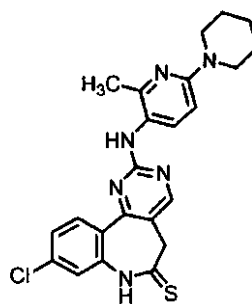


I-80

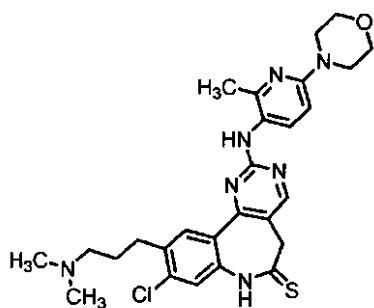
【化 9 2】



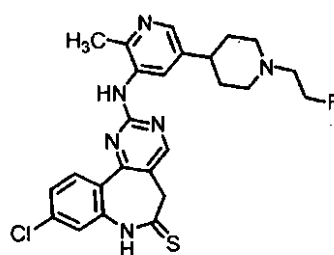
I-81



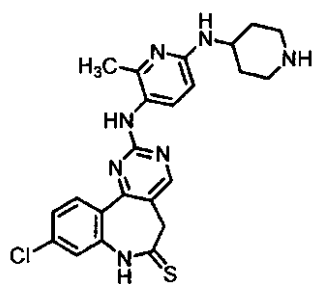
I-82



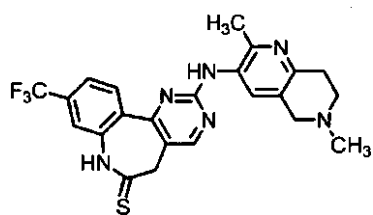
I-83



I-84

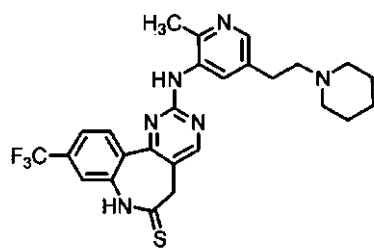


I-85

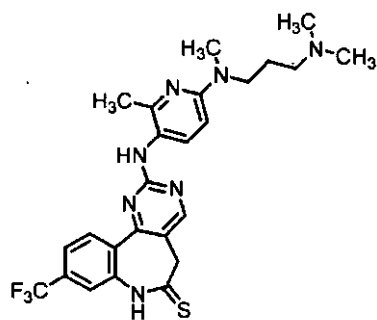


I-86

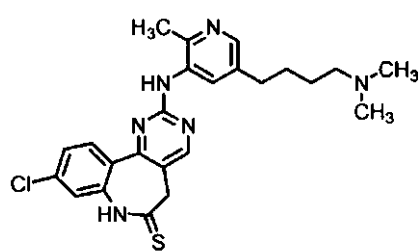
【化 9 3】



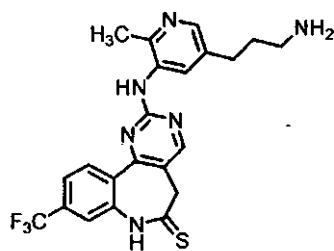
I-87



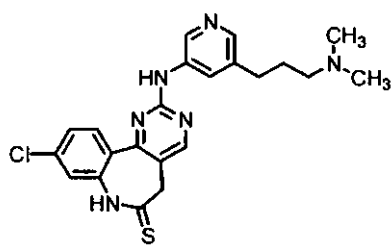
I-88



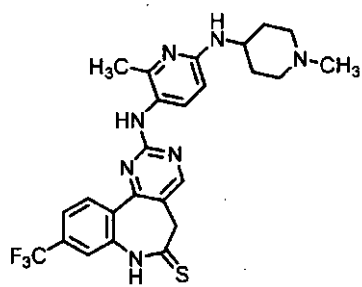
I-89



I-90

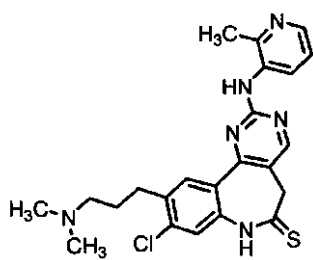


I-91

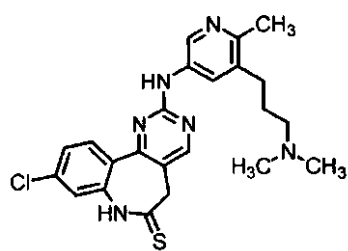


I-92

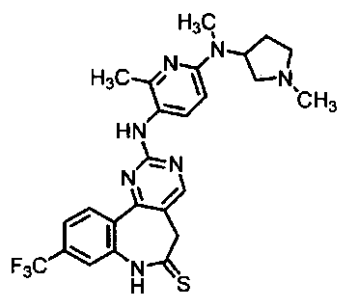
【化 9 4】



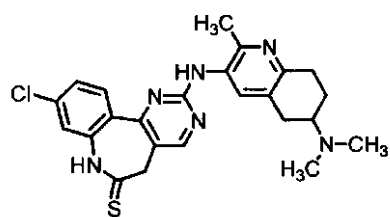
I-93



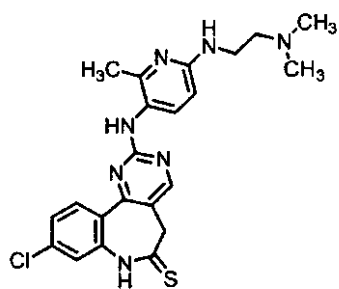
I-94



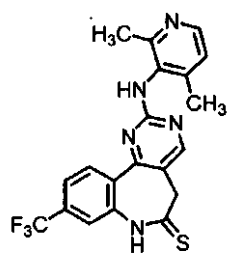
I-95



I-96

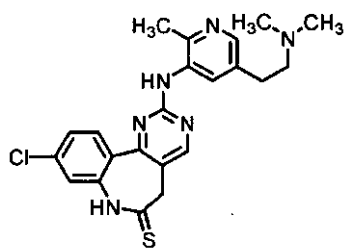


I-97

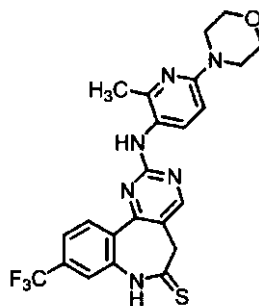


I-98

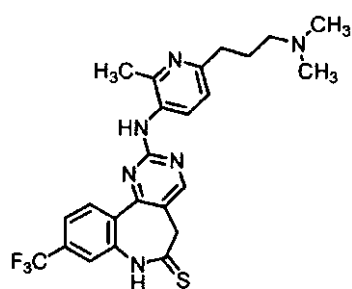
【化 9 5】



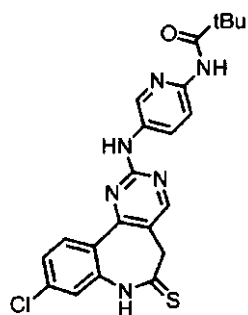
I-99



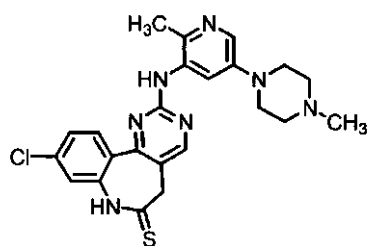
I-100



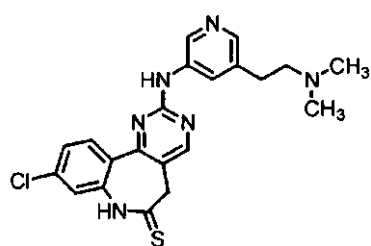
I-101



I-102

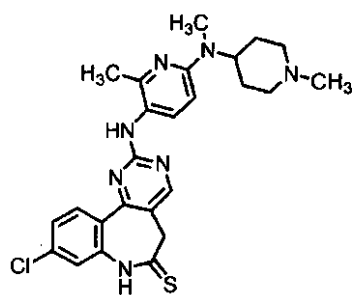


I-103

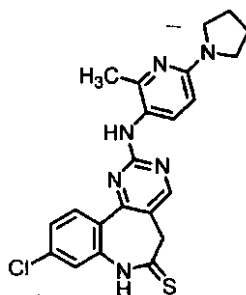


I-104

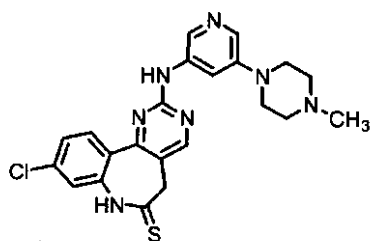
【化 9 6】



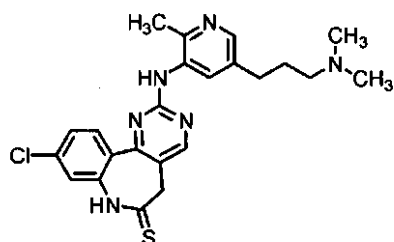
I-105



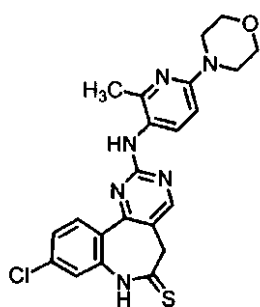
I-106



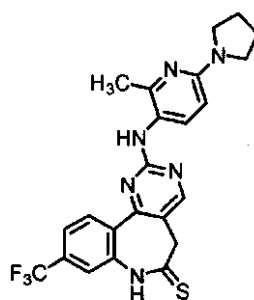
I-107



I-108



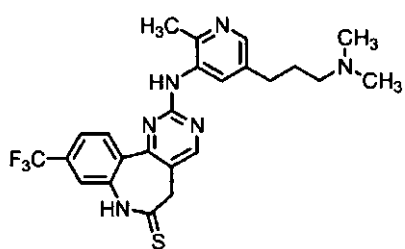
I-109



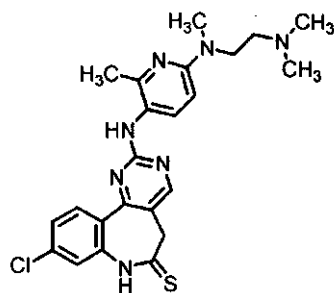
I-110



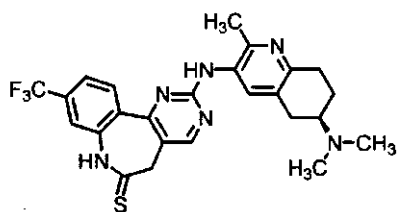
【化 9 7】



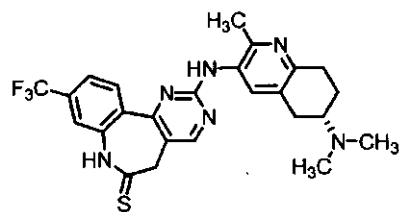
I-111



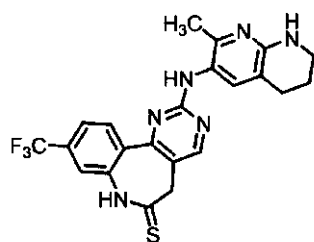
I-112



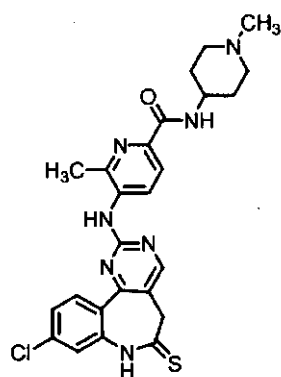
I-113



I-114

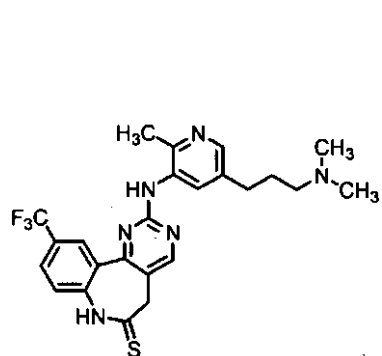


I-115

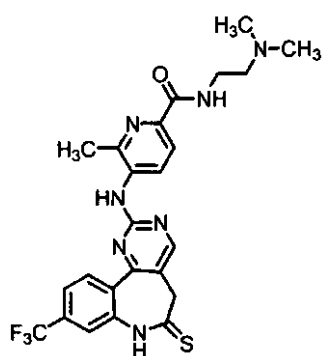


I-116

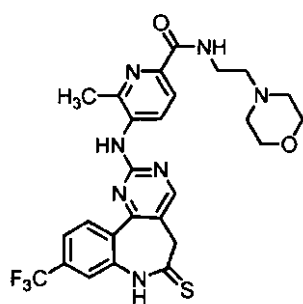
【化 9 8】



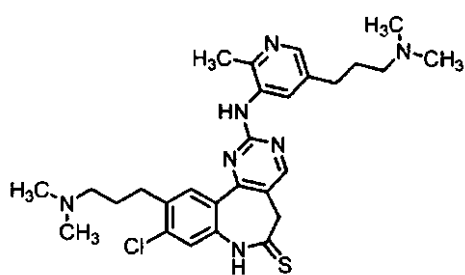
I-117



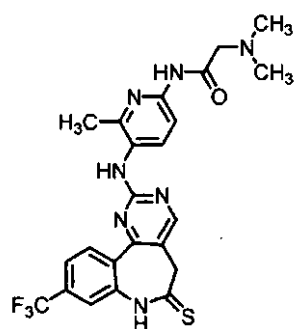
I-118



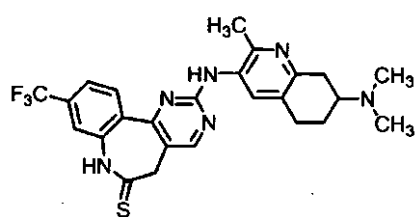
I-119



I-120

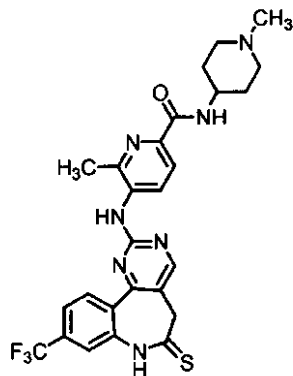


I-121



I-122

【化 9 9】



I-123

から選択される、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 9】

請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩および薬学的に許容可能なキャリアを含む組成物。

【請求項 3 0】

請求項 1 に記載の化合物もしくはその薬学的に許容可能な塩または請求項 2 9 に記載の組成物を含む、患者における P L K 活性を阻害するための組成物。

【請求項 3 1】

請求項 1 に記載の化合物もしくはその薬学的に許容可能な塩または請求項 2 9 に記載の組成物を含む、患者における増殖性障害、神経変性障害、自己免疫障害、炎症性障害、または免疫学的に媒介される障害を処置するための組成物。

【請求項 3 2】

請求項 1 に記載の化合物もしくはその薬学的に許容可能な塩または請求項 2 9 に記載の組成物を含む、患者における癌を処置するための組成物。

【請求項 3 3】

前記癌が、黒色腫、骨髄腫、白血病、リンパ腫、神経芽細胞腫、または結腸、乳房、胃、卵巣、子宮頸部、肺、中枢神経系 ( C N S )、直腸、前立腺、膀胱、もしくは脾臓から選択される癌である、請求項 3 2 に記載の組成物。

【請求項 3 4】

請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩での P L K の阻害によって癌細胞の有糸分裂が妨げられる、請求項 3 2 に記載の組成物。

【請求項 3 5】

化学療法薬および放射線療法からなる群から選択される細胞毒性薬と併せて投与されることを特徴とする、請求項 3 2 に記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 0 6

【補正方法】変更

【補正の内容】

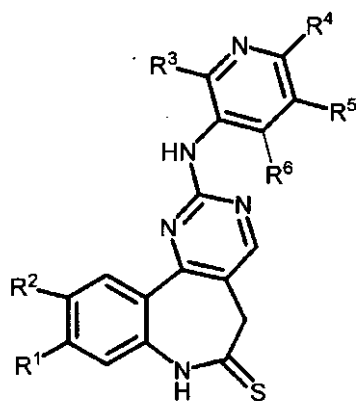
【0 0 0 6】

例えば、本発明は以下の項目を提供する。

(項目 1)

式 I :

【化 7 5】



(式中、

$R^1$  は、水素、 $-CN$ 、ハロゲン、任意選択的に置換された  $C_{1-6}$  脂肪族、または  $-YR^{1a}$  から選択され、

$Y$  は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、または  $-NR^{1a}$  であり、それぞれ存在する  $R^{1a}$  は、独立して、水素または任意選択的に置換された  $C_{1-6}$  脂肪族であり、

$R^2$  は、水素、ハロゲン、 $-ZR^{2a}$ 、または  $-OR^{2b}$  から選択され、

$Z$  は任意選択的に置換された  $C_{1-6}$  アルキレン鎖であり、 $R^{2a}$  は、 $-OR^{2b}$ 、 $-N(R^{2b})_2$ 、 $-SR^{2b}$ 、 $-C(O)N(R^{2b})_2$ 、 $-N(R^{2b})C(O)R^{2b}$ 、 $-SO_2N(R^{2b})_2$ 、 $-NR^{2b}SO_2R^{2b}$ 、 $-NR^{2b}C(O)N(R^{2b})_2$ 、または  $-NR^{2b}SO_2N(R^{2b})_2$  であり、それぞれ存在する  $R^{2b}$  は、独立して、水素または任意選択的に置換された  $C_{1-6}$  アルキルであるか、2つの存在する  $R^{2b}$  が、それらが結合する1つの窒素原子と共に、任意選択的に置換された3～7員ヘテロシクリル環を形成し、

$R^3$  は、水素、ハロゲン、任意選択的に置換された  $C_{1-4}$  アルキル、または任意選択的に置換された  $C_{1-4}$  アルコキシから選択され、

$R^4$  は、水素、任意選択的に置換された  $C_{1-6}$  脂肪族、任意選択的に置換された3～7員ヘテロシクリル環、 $-(CH_2)_xNR^{4a}R^{4b}$ 、 $-(CH_2)_xNR^{4a}C(O)R^{4b}$ 、 $-(CH_2)_xNR^{4a}S(O)_2R^{4b}$ 、 $-(CH_2)_xC(O)R^{4b}$ 、 $-(CH_2)_xC(O)NR^{4a}R^{4b}$ 、 $-(CH_2)_xS(O)_2NR^{4a}R^{4b}$ 、または  $-(CH_2)_xOR^{4b}$  から選択され、

それぞれ存在する  $x$  は、独立して、0～6であり、

$R^{4a}$  は水素または任意選択的に置換された  $C_{1-6}$  脂肪族であり、

$R^{4b}$  は、水素、任意選択的に置換された  $C_{1-6}$  脂肪族、任意選択的に置換された  $C_{3-7}$  -ヘテロシクリルまたは  $C_{3-7}$  カルボシクリル環であるか、 $W-R^{4c}$  であり、 $W$  は任意選択的に置換された  $C_{2-6}$  アルキレン鎖であり、 $R^{4c}$  は、任意選択的に置換された  $C_{3-7}$  -ヘテロシクリル環、 $-OR^{4d}$ 、 $-N(R^{4d})_2$ 、 $-SR^{4d}$ 、 $-C(O)N(R^{4d})_2$ 、 $-N(R^{4d})C(O)R^{4d}$ 、 $-SO_2N(R^{4d})_2$ 、 $-NR^{4d}SO_2R^{4d}$ 、 $-NR^{4d}C(O)N(R^{4d})_2$ 、または  $-NR^{4d}SO_2N(R^{4d})_2$  であり、それぞれ存在する  $R^{4d}$  は、独立して、水素または任意選択的に置換された  $C_{1-6}$  脂肪族であるか、2つの存在する  $R^{4d}$  が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された3～7員ヘテロシクリル環を形成するか、

$R^{4a}$  および  $R^{4b}$  が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された3～7員ヘテロシクリル環を形成し、

$R^5$  は、水素、任意選択的に置換された  $C_{1-6}$  脂肪族、任意選択的に置換された  $C_{3-7}$  -ヘテロシクリル環であるか、 $X-R^{5a}$  であり、 $X$  は任意選択的に置換された  $C_{2-6}$  アルキレン鎖または  $-NR^{5c}$  であり、

$X$  が任意選択的に置換された  $C_{2-6}$  アルキレン鎖である場合、 $R^{5a}$  は、 $-OR^5$

$\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{5b})_2$ 、 $-\text{SR}^{5b}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{5b})_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{5b})\text{C}(\text{O})\text{R}^{5b}$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{5b})_2$ 、 $-\text{NR}^{5b}\text{SO}_2\text{R}^{5b}$ 、 $-\text{NR}^{5b}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{5b})_2$ 、または $-\text{NR}^{5b}\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{5b})_2$ であり、

Xが $-\text{NR}^{5c}$ である場合、 $\text{R}^{5a}$ は水素または任意選択的に置換された $\text{C}_{1-6}$ 脂肪族であるか、 $\text{R}^{5a}$ および $\text{R}^{5c}$ が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された3～7員ヘテロシクリル環を形成し、

それぞれ存在する $\text{R}^{5b}$ および $\text{R}^{5c}$ は、独立して、水素または任意選択的に置換された $\text{C}_{1-6}$ 脂肪族であるか、2つの存在する $\text{R}^{5b}$ または $\text{R}^{5a}$ および $\text{R}^{5c}$ が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された3～7員ヘテロシクリル環を形成するか、

$\text{R}^4$ および $\text{R}^5$ が共に任意選択的に置換された5～7員の脂環式環またはヘテロシクリル環を形成し、

$\text{R}^6$ は、水素、ハロゲン、任意選択的に置換された $\text{C}_{1-4}$ アルキル、または任意選択的に置換された $\text{C}_{1-4}$ アルコキシから選択される)の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

(項目2)

$\text{R}^2$ 、 $\text{R}^4$ 、および $\text{R}^6$ はそれぞれ水素である、項目1に記載の化合物。

(項目3)

$\text{R}^2$ 、 $\text{R}^5$ 、および $\text{R}^6$ はそれぞれ水素である、項目1に記載の化合物。

(項目4)

$\text{R}^1$ は、任意選択的に置換された $\text{C}_{1-4}$ 脂肪族、ハロゲン、 $-\text{CN}$ 、または $-\text{OMe}$ である、項目1に記載の化合物。

(項目5)

$\text{R}^1$ は、メチル、エチル、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{Cl}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OMe}$ 、またはシクロプロピルである、項目1に記載の化合物。

(項目6)

$\text{R}^2$ は水素または $-\text{Z}-\text{R}^{2a}$ であり、Zは $-(\text{CH}_2)_{2-4}$ であり、 $\text{R}^{2a}$ は $\text{N}(\text{R}^{2b})_2$ であり、それぞれ存在する $\text{R}^{2b}$ は水素または $\text{C}_{1-4}$ アルキルから選択されるか、2つの存在する $\text{R}^{2b}$ が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された $\text{C}_{3-7}$ -ヘテロシクリル環を形成する、項目1に記載の化合物。

(項目7)

$\text{R}^3$ はメチルまたは $\text{CF}_3$ である、項目1に記載の化合物。

(項目8)

$\text{R}^4$ はメチルまたは $-\text{NR}^{4a}\text{R}^{4b}$ であり、 $\text{R}^{4a}$ および $\text{R}^{4b}$ が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された3～7員ヘテロシクリル環を形成するか、 $\text{R}^{4a}$ は水素または $\text{C}_{1-4}$ アルキルであり、 $\text{R}^{4b}$ は任意選択的に置換された $\text{C}_{3-7}$ -ヘテロシクリル環であるか、 $\text{W}-\text{R}^{4c}$ であり、Wは任意選択的に置換された $\text{C}_{2-6}$ アルキレン鎖であり、 $\text{R}^{4c}$ は任意選択的に置換された $\text{C}_{3-7}$ -ヘテロシクリル環である、項目1に記載の化合物。

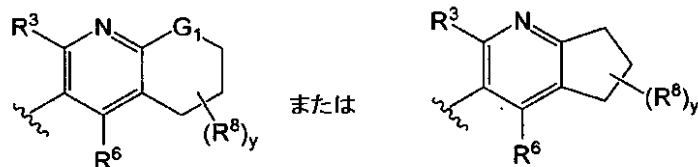
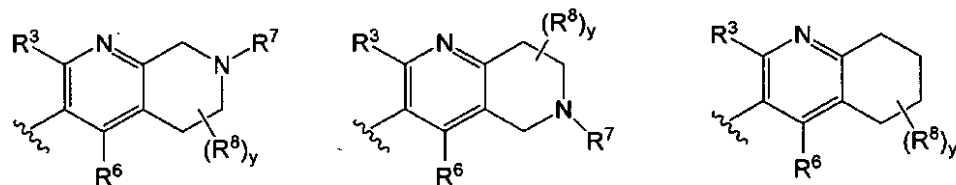
(項目9)

$\text{R}^5$ は任意選択的に置換された $\text{C}_{3-7}$ -ヘテロシクリル環であるか、 $\text{X}-\text{R}^{5a}$ であり、Xは任意選択的に置換された $\text{C}_{2-6}$ アルキレン鎖であり、 $\text{R}^{5a}$ は $-\text{N}(\text{R}^{5b})_2$ であり、それぞれ存在する $\text{R}^{5b}$ は、独立して、水素または $\text{C}_{1-6}$ アルキルであるか、2つの存在する $\text{R}^{5b}$ が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された3～7員ヘテロシクリル環を形成する、項目1に記載の化合物。

(項目10)

$\text{R}^4$ および $\text{R}^5$ が共に以下：

## 【化 7 6】



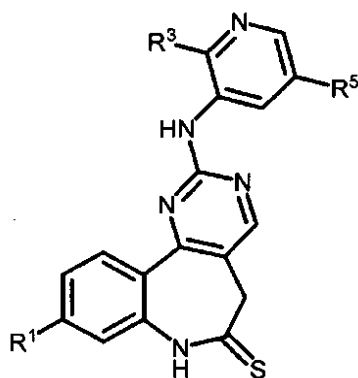
( 式中、

 $G_1$  は、 $-NH-$ 、 $-O-$ 、または  $-N(CH_3)-$  であり、 $R^7$  は、水素または任意選択的に置換された  $C_{1-6}$  脂肪族から選択され、 $R^8$  は、フルオロ、任意選択的に置換された  $C_{1-6}$  脂肪族、または  $-YR^{1a}$  から選択され、 $Y$  は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、または  $-NR^{1a}$  であり、それぞれ存在する  $R^{1a}$  は、独立して、水素または任意選択的に置換された  $C_{1-6}$  脂肪族であり、 $y$  は  $0 \sim 4$  である) から選択される環を形成する、項目 1 に記載の化合物。

( 項目 1 1 )

式 I - A :

## 【化 7 7】



I-A

の構造を有する、項目 1 に記載の化合物。

( 項目 1 2 )

 $R^1$  は、任意選択的に置換された  $C_{1-4}$  脂肪族、ハロゲン、 $-CN$ 、または  $-OMe$  である、項目 1 1 に記載の化合物。

( 項目 1 3 )

 $R^1$  は、メチル、エチル、 $-CF_3$ 、 $Cl$ 、 $-CN$ 、 $-OMe$ 、またはシクロプロピルである、項目 1 1 に記載の化合物。

( 項目 1 4 )

 $R^3$  はメチルまたは  $CF_3$  である、項目 1 1 に記載の化合物。

( 項目 1 5 )

 $R^5$  は任意選択的に置換された  $C_{3-7}$  - ヘテロシクリル環であるか、 $X-R^{5a}$  であり

、Xは任意選択的に置換されたC<sub>2</sub>～<sub>6</sub>アルキレン鎖であり、R<sup>5a</sup>は-N(R<sup>5b</sup>)<sub>2</sub>であり、それぞれ存在するR<sup>5b</sup>は、独立して、水素またはC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルであるか、2つの存在するR<sup>5b</sup>が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された3～7員ヘテロシクリル環を形成する、項目11に記載の化合物。

(項目16)

R<sup>5</sup>は、任意選択的に置換されたピロリジニル基、モルホリニル基、ピペリジニル基、またはピペラジニル基であるか、X-R<sup>5a</sup>であり、XはC<sub>2</sub>～<sub>4</sub>アルキレン鎖であり、R<sup>5a</sup>は-N(R<sup>5b</sup>)<sub>2</sub>であり、それぞれ存在するR<sup>5b</sup>は、独立して、水素またはC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルであるか、2つの存在するR<sup>5b</sup>が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換されたピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基、またはモルホリニル基を形成する、項目15に記載の化合物。

(項目17)

前記ピロリジニル基、モルホリニル基、ピペリジニル基、またはピペラジニル基が1～4個の存在するC<sub>1</sub>～<sub>4</sub>アルキルまたはC<sub>1</sub>～<sub>4</sub>ハロアルキルに任意選択的に置換される、項目16に記載の化合物。

(項目18)

以下：

a) R<sup>1</sup>は、メチル、エチル、プロピル、-CF<sub>3</sub>、Cl、-CN、-OMe、またはシクロプロピルであり、

b) R<sup>3</sup>はメチルまたはCF<sub>3</sub>であり、

c) R<sup>5</sup>は、任意選択的に置換されたピロリジニル基、モルホリニル基、ピペリジニル基、またはピペラジニル基であるか、X-R<sup>5a</sup>であり、XはC<sub>2</sub>～<sub>4</sub>アルキレン鎖であり、R<sup>5a</sup>は-N(R<sup>5b</sup>)<sub>2</sub>であり、それぞれ存在するR<sup>5b</sup>は、独立して、水素またはC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルであるか、2つの存在するR<sup>5b</sup>が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換されたピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基、またはモルホリニル基を形成する、項目11に記載の化合物。

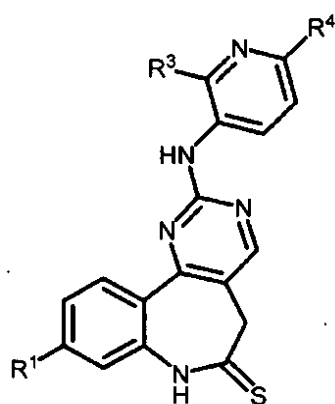
(項目19)

R<sup>1</sup>はClまたはCF<sub>3</sub>であり、R<sup>3</sup>はメチルである、項目18に記載の化合物。

(項目20)

式I-B：

【化78】



I-B.

の構造を有する、項目1に記載の化合物。

(項目21)

R<sup>1</sup>は、任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>～<sub>4</sub>脂肪族、ハロゲン、-CN、または-OMeである、項目20に記載の化合物。

( 項目 2 2 )

$R^1$  は、メチル、エチル、 $-CF_3$ 、 $Cl$ 、 $-CN$ 、 $-OMe$ 、またはシクロプロピルである、項目 2 1 に記載の化合物。

( 項目 2 3 )

$R^3$  はメチルまたは $CF_3$ である、項目 2 0 に記載の化合物。

( 項目 2 4 )

$R^4$  は $-NR^{4a}R^{4b}$ であり、 $R^{4a}$ および $R^{4b}$ が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された 3 ~ 7 員ヘテロシクリル環を形成するか、 $R^{4a}$ は水素または $C_{1-4}$ アルキルであり、 $R^{4b}$ は任意選択的に置換された $C_{3-7}$ -ヘテロシクリル環であるか、 $W-R^{4c}$ であり、 $W$ は任意選択的に置換された $C_{2-4}$ アルキレン鎖であり、 $R^{4c}$ は任意選択的に置換された $C_{3-7}$ -ヘテロシクリル環または $-N(R^{4d})_2$ であり、それぞれ存在する $R^{4d}$ は、独立して、水素または $C_{1-6}$ アルキルであるか、2つの存在する $R^{4d}$ が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換された 3 ~ 7 員ヘテロシクリル環を形成する、項目 2 0 に記載の化合物。

( 項目 2 5 )

$R^4$  は $-NR^{4a}R^{4b}$ であり、 $R^{4a}$ および $R^{4b}$ が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換されたピロリジニル環、ピペラジニル環、ピペリジニル環、またはモルホリニル環を形成するか、 $R^{4a}$ は水素または $C_{1-4}$ アルキルであり、 $R^{4b}$ は、任意選択的に置換されたピロリジニル環、ピペラジニル環、ピペリジニル環、またはモルホリニル環であるか、 $W-R^{4c}$ であり、 $W$ は任意選択的に置換された $C_{2-4}$ アルキレン鎖であり、 $R^{4c}$ は、任意選択的に置換されたピロリジニル環、ピペラジニル環、ピペリジニル環、またはモルホリニル環であるか、 $-N(R^{4d})_2$ であり、それぞれ存在する $R^{4d}$ は、独立して、水素または $C_{1-6}$ アルキルであるか、2つの存在する $R^{4d}$ が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換されたピロリジニル環、ピペラジニル環、ピペリジニル環、またはモルホリニル環を形成する、項目 2 4 に記載の化合物。

( 項目 2 6 )

以下：

a)  $R^1$  は、メチル、エチル、プロピル、 $-CF_3$ 、 $Cl$ 、 $-CN$ 、 $-OMe$ 、またはシクロプロピルであり、

b)  $R^3$  はメチルまたは $CF_3$ であり、

c)  $R^4$  は $-NR^{4a}R^{4b}$ であり、 $R^{4a}$ および $R^{4b}$ が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換されたピロリジニル環、ピペラジニル環、ピペリジニル環、またはモルホリニル環を形成するか、 $R^{4a}$ は水素または $C_{1-4}$ アルキルであり、 $R^{4b}$ は、任意選択的に置換されたピロリジニル環、ピペラジニル環、ピペリジニル環、またはモルホリニル環であるか、 $W-R^{4c}$ であり、 $W$ は任意選択的に置換された $C_{2-4}$ アルキレン鎖であり、 $R^{4c}$ は、任意選択的に置換されたピロリジニル環、ピペラジニル環、ピペリジニル環、またはモルホリニル環であるか、 $-N(R^{4d})_2$ であり、それぞれ存在する $R^{4d}$ は、独立して、水素または $C_{1-6}$ アルキルであるか、2つの存在する $R^{4d}$ が、それらが結合する窒素原子と共に、任意選択的に置換されたピロリジニル環、ピペラジニル環、ピペリジニル環、またはモルホリニル環を形成する、項目 2 0 に記載の化合物。

( 項目 2 7 )

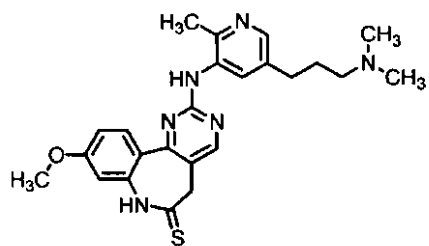
$R^1$  は $Cl$ または $CF_3$ であり、 $R^3$  はメチルである、項目 2 6 に記載の化合物。

( 項目 2 8 )

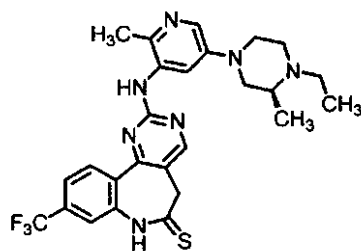
前記化合物が、以下：



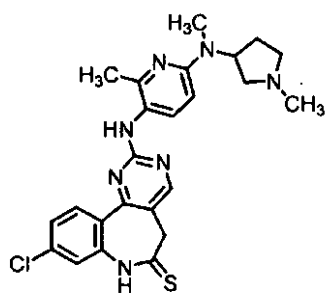
## 【化 7 9】



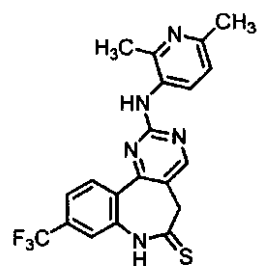
I-1



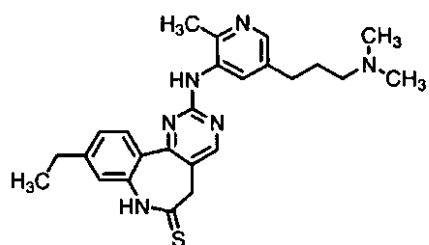
I-2



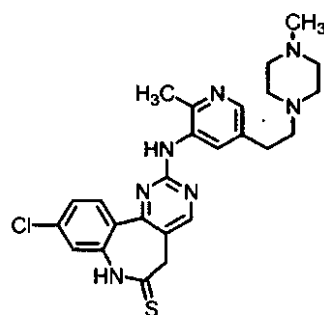
I-3



I-4

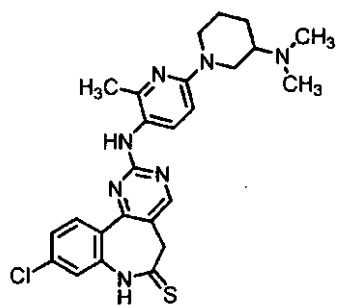


I-5

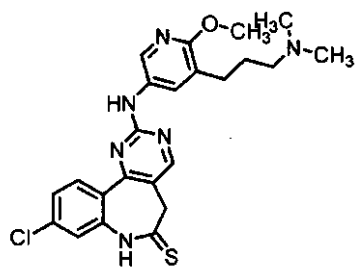


I-6

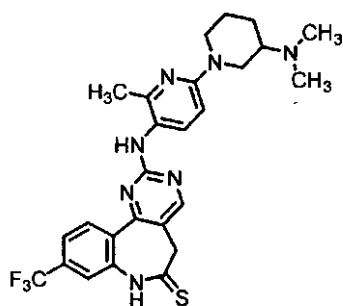
【化 8 0】



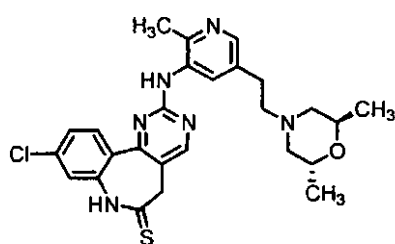
I-7



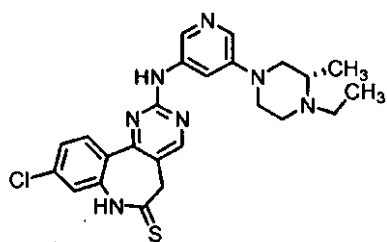
I-8



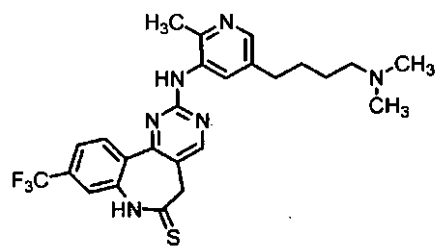
I-9



I-10

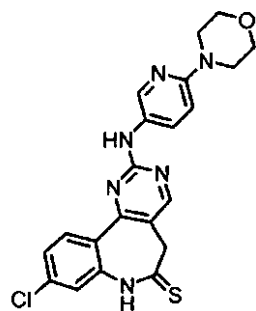


I-11

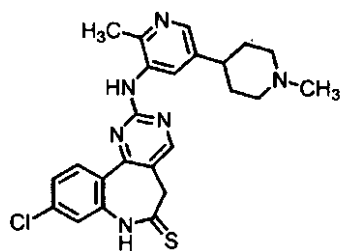


I-12

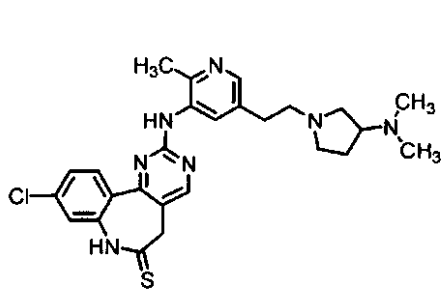
【化 8 1】



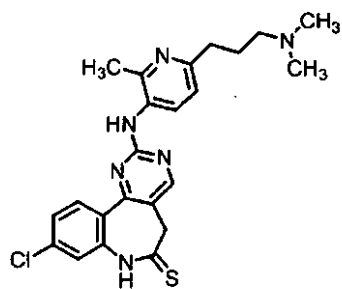
I-13



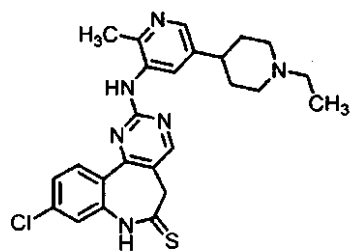
I-14



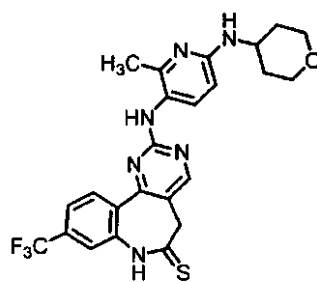
I-15



I-16

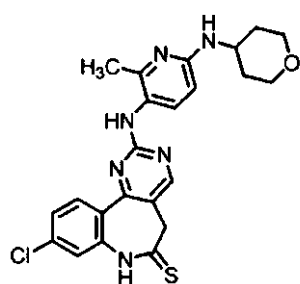


I-17

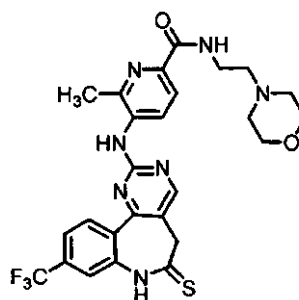


I-18

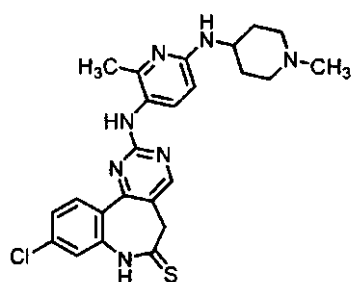
【化 8 2】



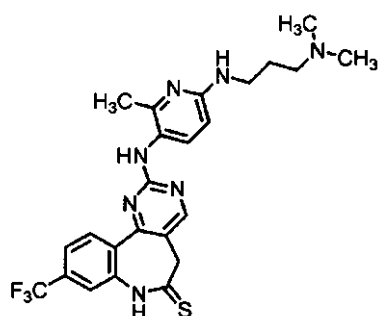
I-19



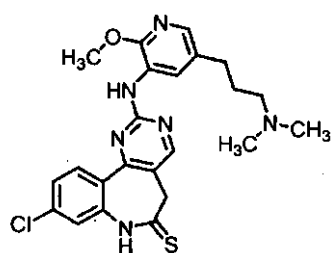
I-21



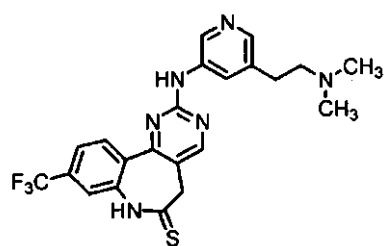
I-22



I-23

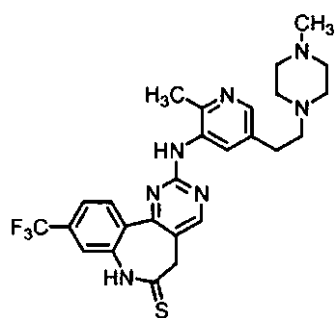


I-24

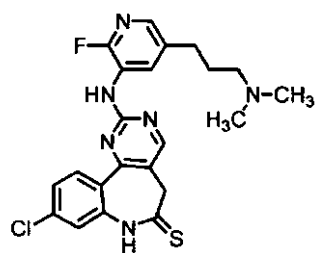


I-25

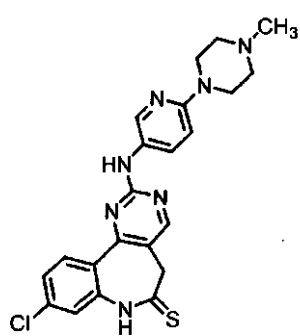
【化 8 3】



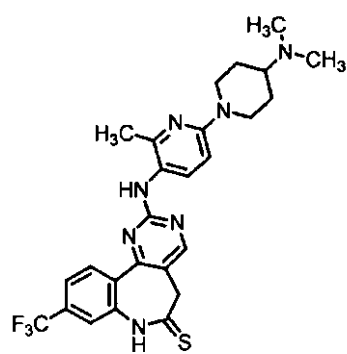
I-26



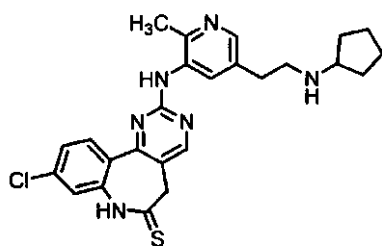
I-27



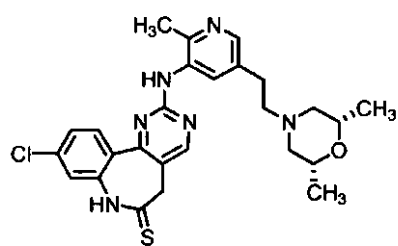
I-28



I-29

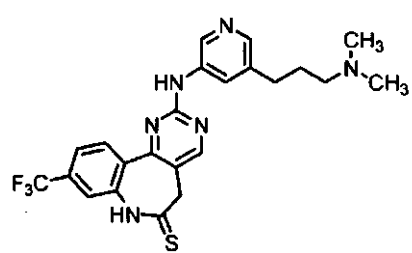


I-30

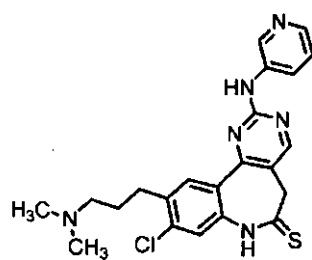


I-31

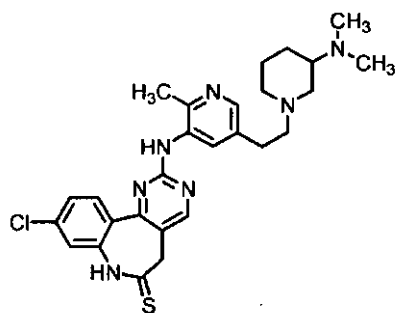
【化 8 4】



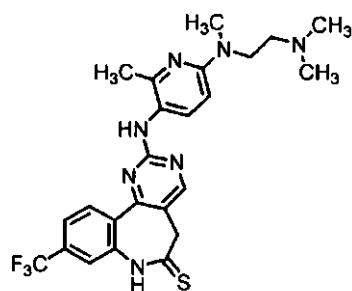
I-32



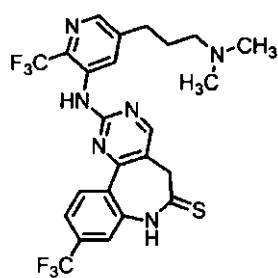
I-33



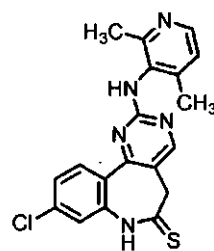
I-34



I-35

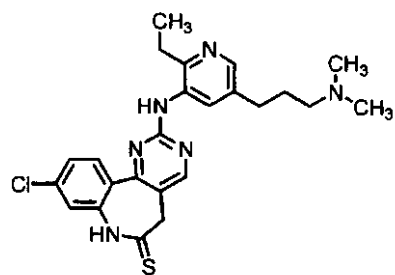


I-36

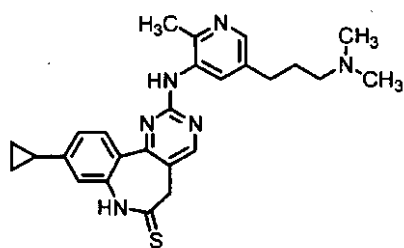


I-37

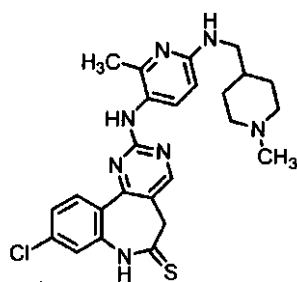
【化 8 5】



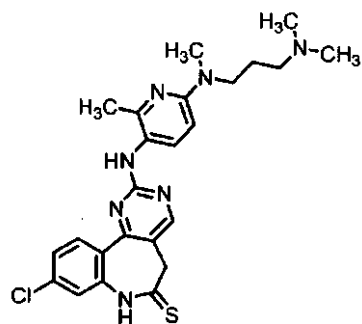
I-38



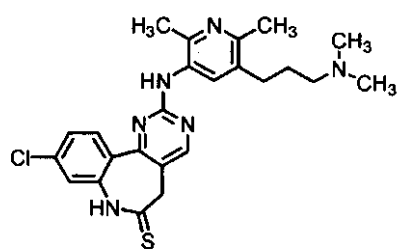
I-39



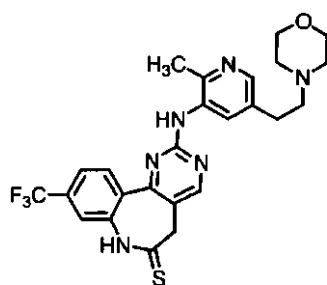
I-40



I-41

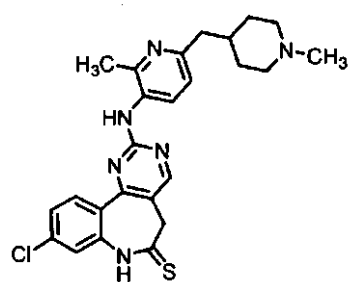


I-42

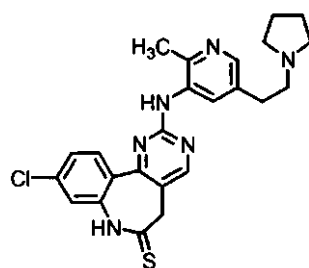


I-43

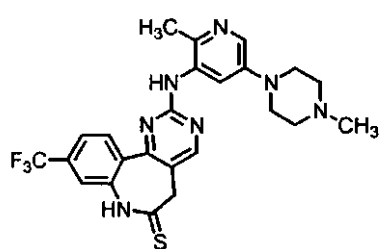
【化 8 6】



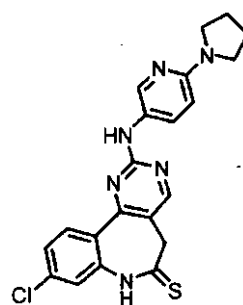
I-44



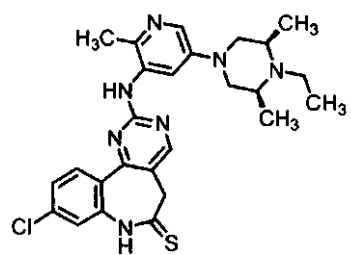
I-45



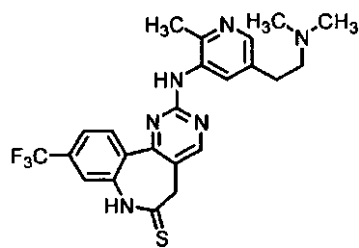
I-46



I-47



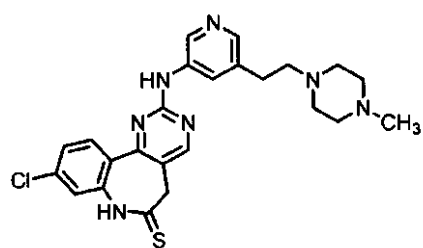
I-49



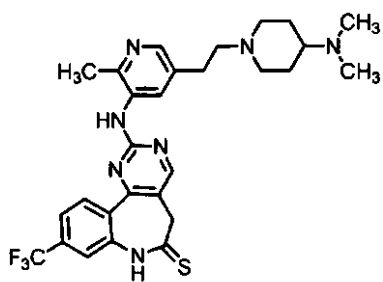
I-50



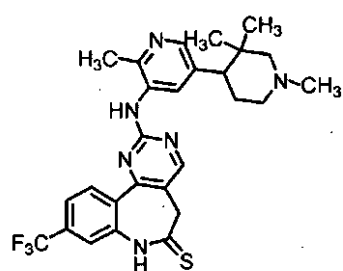
【化 8 7】



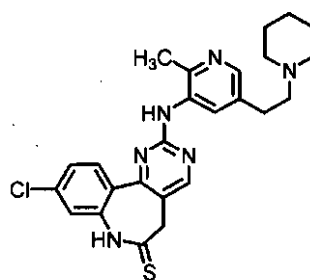
I-51



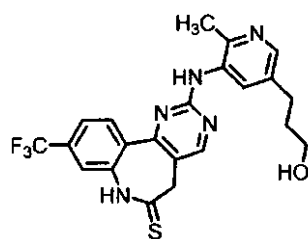
I-52



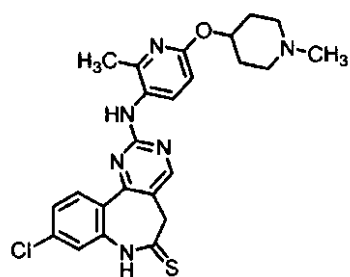
I-53



I-54

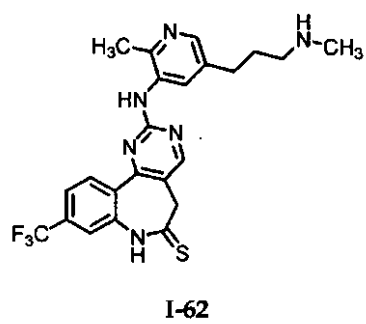
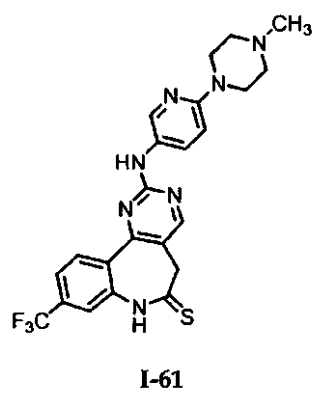
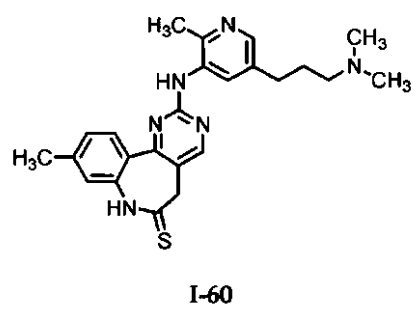
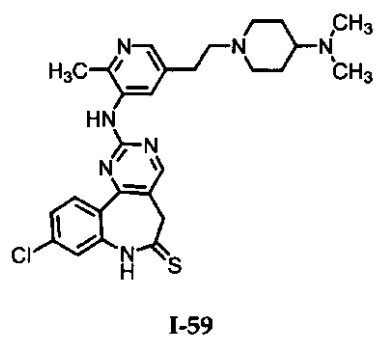
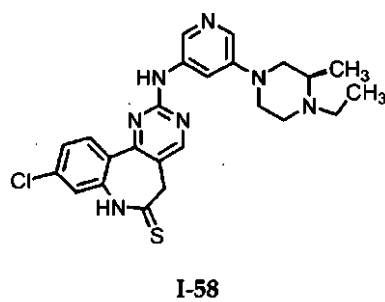
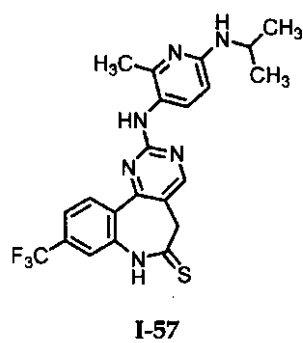


I-55

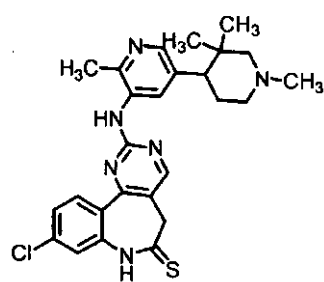


I-56

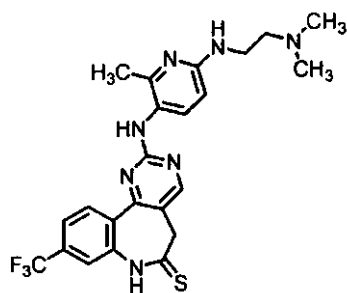
【化 8 8】



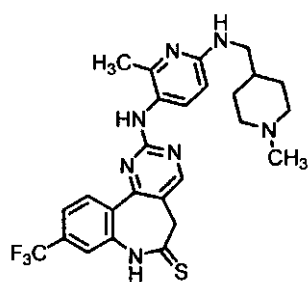
【化 8 9】



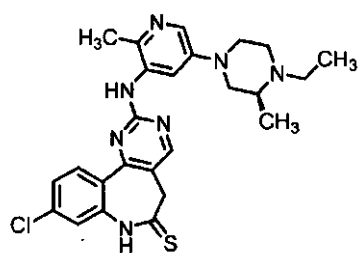
I-63



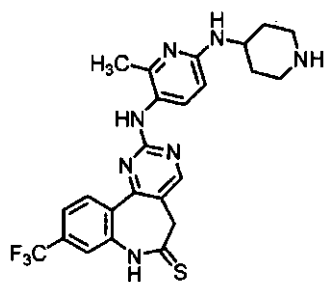
I-64



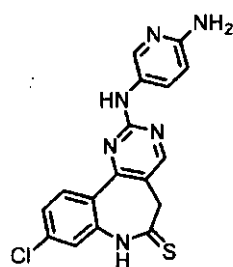
I-65



I-66

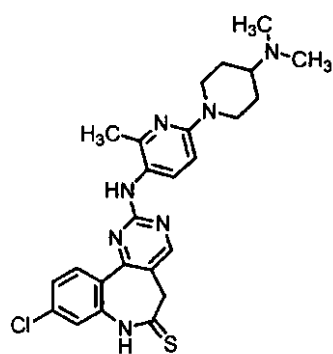


I-67

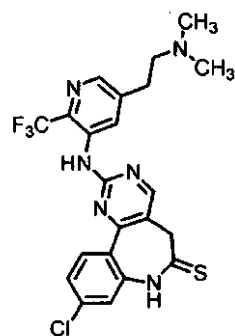


I-68

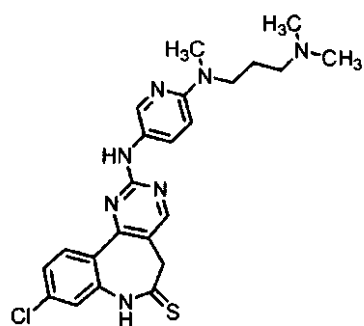
【化 9 0】



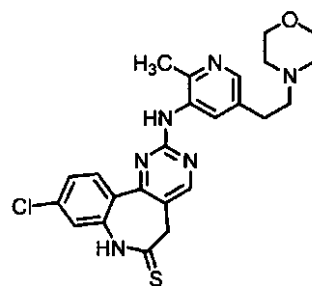
I-69



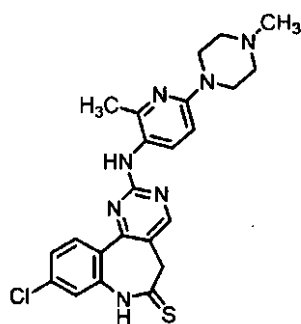
I-70



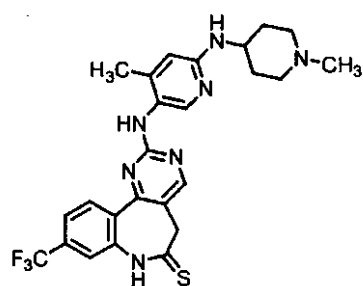
I-71



I-72

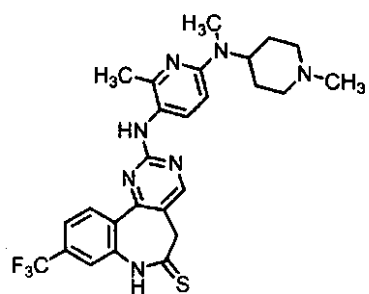


I-73

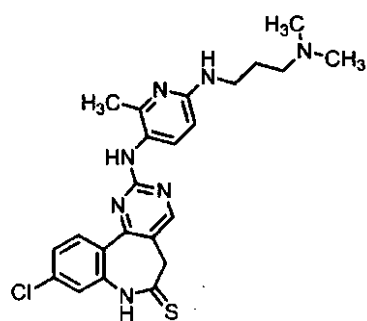


I-74

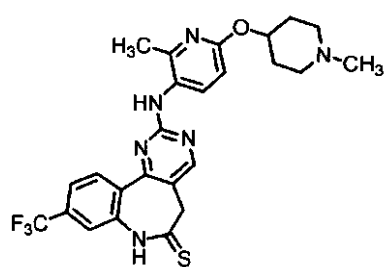
【化 9 1】



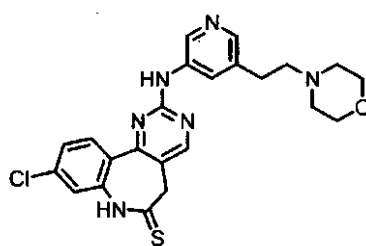
I-75



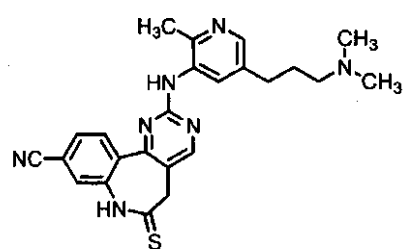
I-76



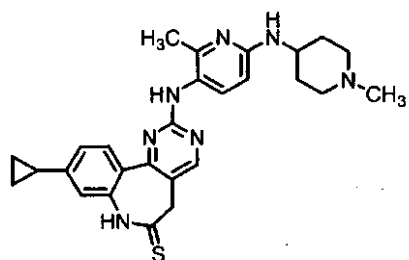
I-77



I-78

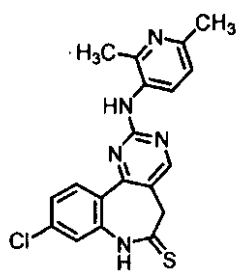


I-79

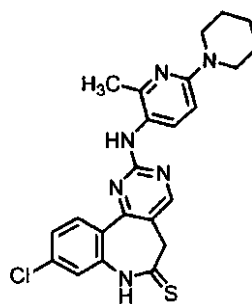


I-80

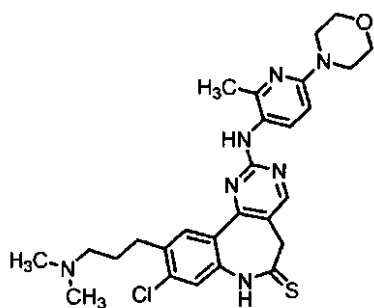
【化 9 2】



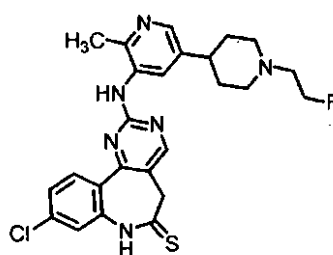
I-81



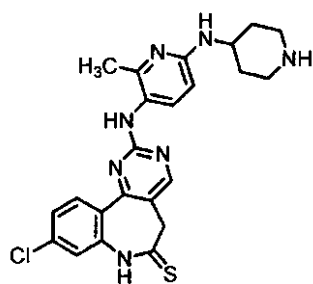
I-82



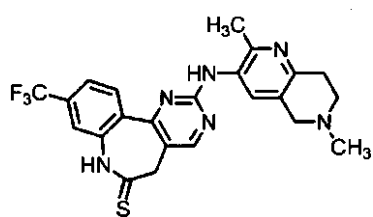
I-83



I-84

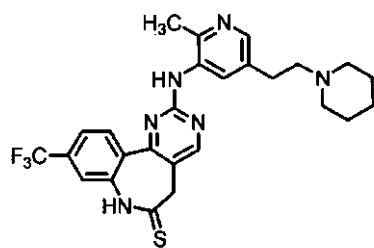


I-85

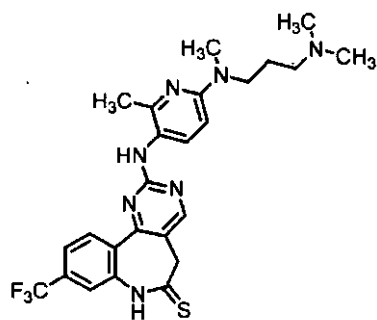


I-86

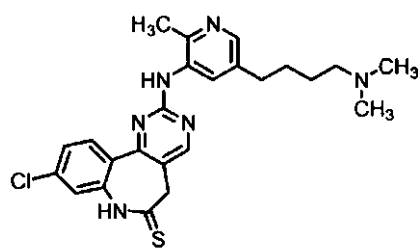
【化 9 3】



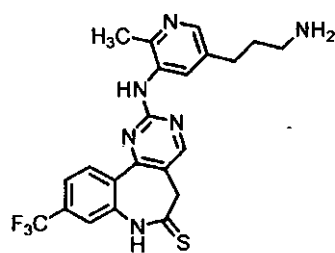
I-87



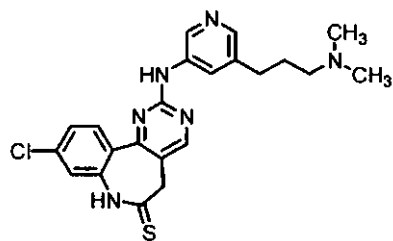
I-88



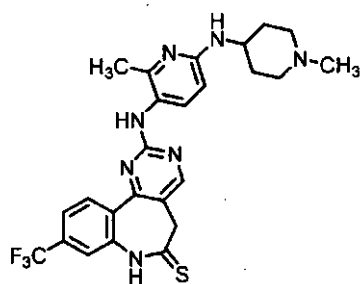
I-89



I-90

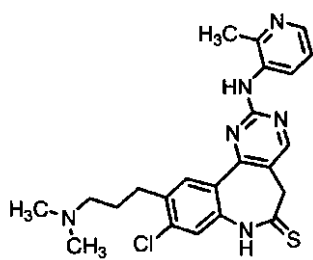


I-91

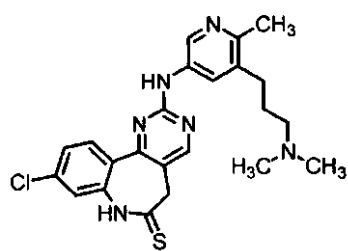


I-92

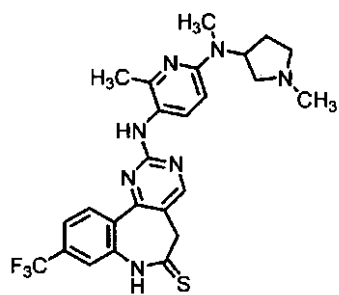
## 【化 9 4】



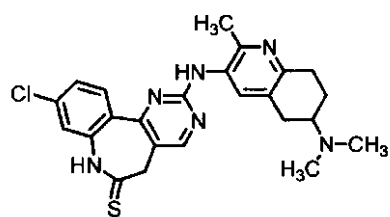
I-93



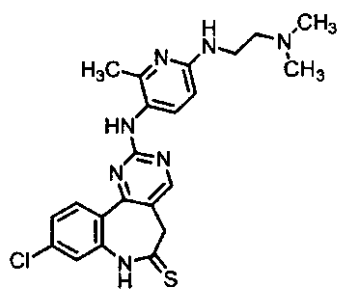
I-94



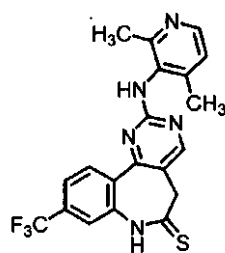
I-95



I-96



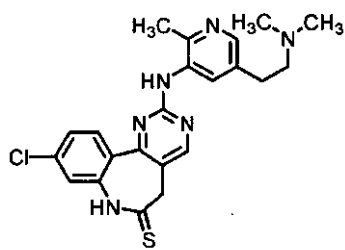
I-97



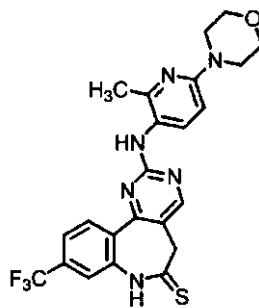
I-98



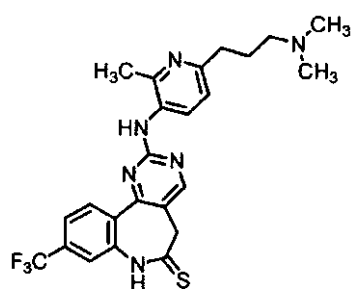
【化 9 5】



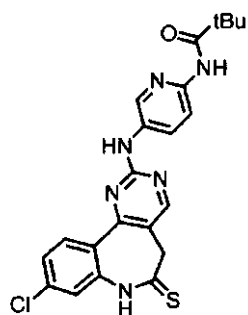
I-99



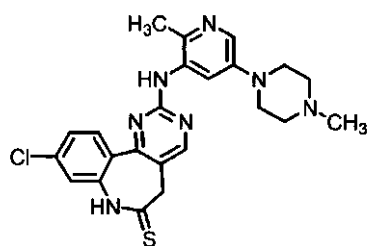
I-100



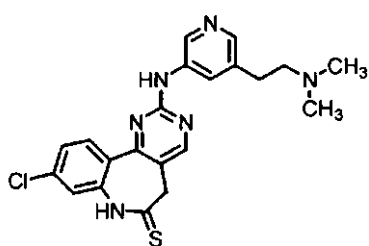
I-101



I-102

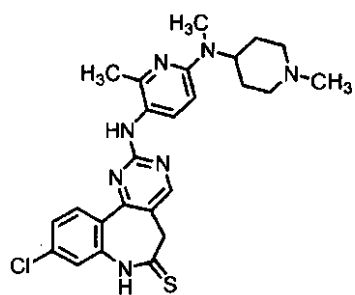


I-103

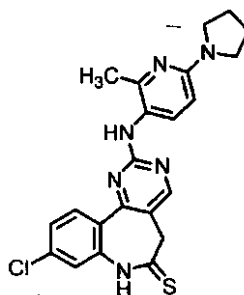


I-104

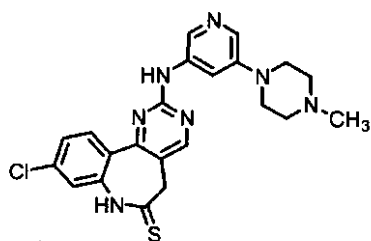
【化 9 6】



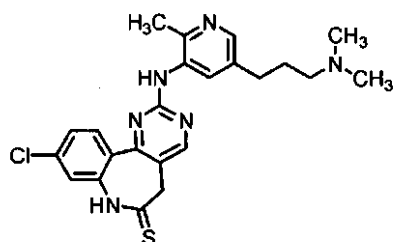
I-105



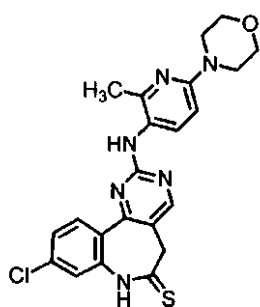
I-106



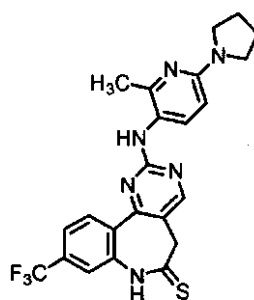
I-107



I-108

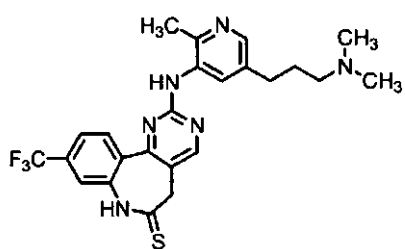


I-109

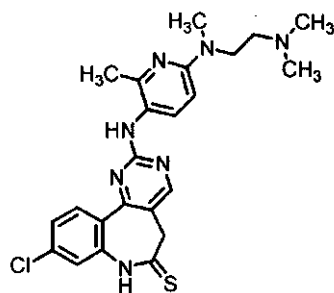


I-110

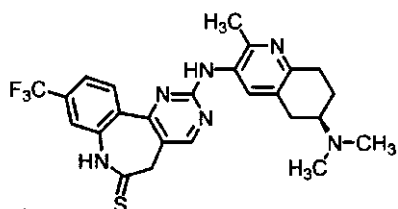
【化 9 7】



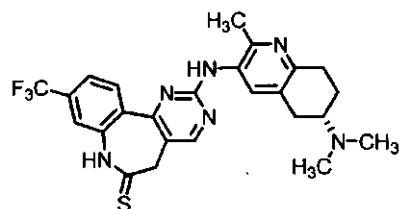
I-111



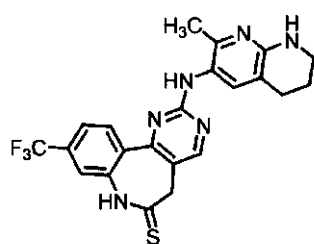
I-112



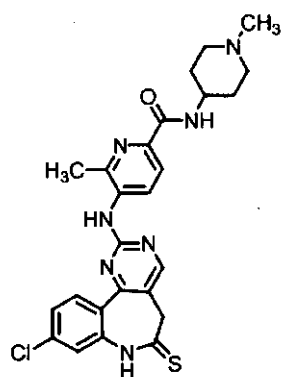
I-113



I-114

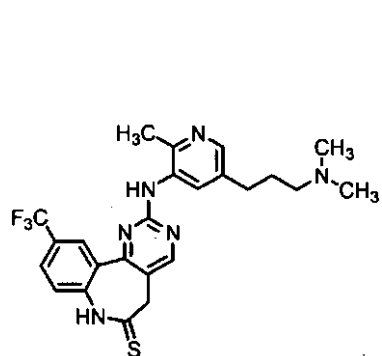


I-115

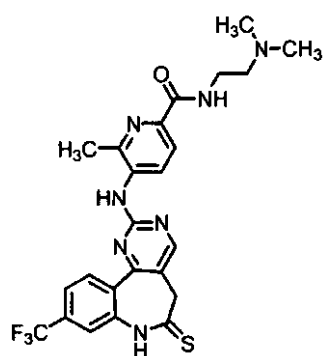


I-116

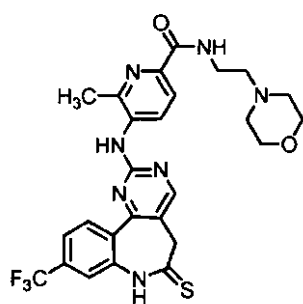
【化 9 8】



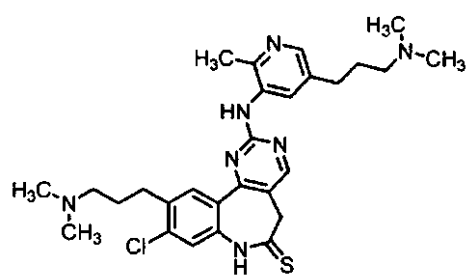
I-117



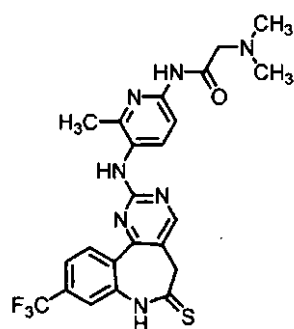
I-118



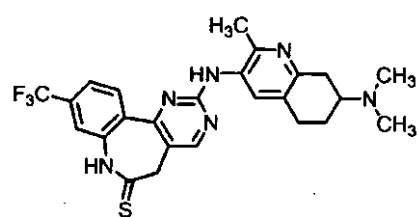
I-119



I-120

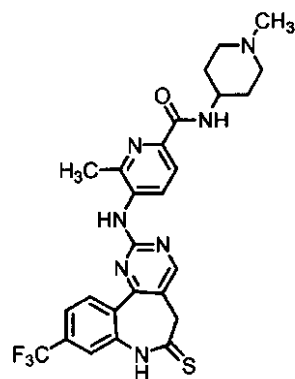


I-121



I-122

## 【化 9 9】



I-123

から選択される、項目 1 に記載の化合物。

(項目 2 9)

項目 1 に記載の化合物および薬学的に許容可能なキャリアを含む組成物。

(項目 3 0)

患者において P L K 活性を阻害するのに有効な量の項目 1 に記載の化合物を含む組成物または項目 2 9 に記載の組成物を投与することを含む、患者における P L K 活性を阻害するための方法。

(項目 3 1)

項目 1 に記載の化合物または項目 2 9 に記載の組成物を患者に投与する工程を含む、患者における増殖性障害、神経変性障害、自己免疫障害、炎症性障害、または免疫学的に媒介される障害を処置するための方法。

(項目 3 2)

項目 1 に記載の化合物または項目 2 9 に記載の組成物を患者に投与する工程を含む、患者における癌の処置方法。

(項目 3 3)

前記癌が、黒色腫、骨髄腫、白血病、リンパ腫、神経芽細胞腫、または結腸、乳房、胃、卵巣、子宮頸部、肺、中枢神経系 (C N S)、直腸、前立腺、膀胱、もしくは膵臓から選択される癌である、項目 3 2 に記載の方法。

(項目 3 4)

前記方法が、項目 1 に記載の化合物での P L K の阻害によって癌細胞の有糸分裂を妨げる工程を含む、項目 3 2 に記載の方法。

(項目 3 5)

化学療法薬および放射線療法からなる群から選択される細胞毒性薬を前記患者に投与する工程をさらに含む、項目 3 2 に記載の方法。

発明の詳細な説明

1. 本発明の化合物の一般的説明：

本発明は、P L K のインヒビターであり、したがって、増殖性障害、炎症性障害、または心血管障害の処置に有用である化合物を提供する。本発明の化合物は、式 I：