

【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31年2月28日(2019.2.28)

【公表番号】特表2018-502141(P2018-502141A)

【公表日】平成30年1月25日(2018.1.25)

【年通号数】公開・登録公報2018-003

【出願番号】特願2017-537966(P2017-537966)

【国際特許分類】

C 0 7 D 215/233 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 239/91 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

A 6 1 K 31/47 (2006.01)

A 6 1 K 31/501 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 215/233

C 0 7 D 403/12 C S P

C 0 7 D 471/04 1 0 8 Z

C 0 7 D 471/04 1 0 7 Z

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 239/91

C 0 7 D 409/14

C 0 7 D 417/12

C 0 7 D 471/04 1 0 1

C 0 7 D 495/04 1 0 5 A

C 0 7 D 495/04 1 0 3

A 6 1 K 31/517

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/541

A 6 1 K 31/47

A 6 1 K 31/501

C 0 7 D 405/14

A 6 1 K 31/506

A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 K 45/00

【手続補正書】

【提出日】平成31年1月17日(2019.1.17)

【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

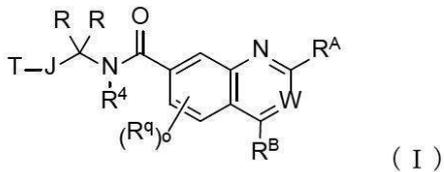
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

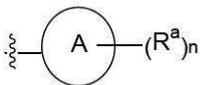
式I:

【化174】



の化合物、または式Iの薬学的に許容される塩であって、式中、
 R^A が、

【化175】



、または $Y R^C R^D R^E$ であり、

R^B が、 $X R^1 R^2 R^3$ であり、

W が、 N 、 CH 、または CR^q であり、

Y が、 C 、 O 、 S 、及び N から選択されるが、但し、(1) Y が N であるとき、 R^C 、 R^D 、及び R^E のうちの一つが不在であり、 R^C 、 R^D 、及び R^E のうち残りの二つが両方とも水素ではなく、かつ(2) Y が O または S であるとき、 R^C 、 R^D 、及び R^E のうち二つが不在であり、 R^C 、 R^D 、及び R^E のうち残りの一つが水素ではないことを条件とし、

R^C 、 R^D 、及び R^E が、各々独立して、水素；直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族（前記 C_{1-6} 脂肪族の一つまたは二つのメチレン単位が、任意にかつ独立して、 O 、 S 、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 、または $N(R^{2-5})$ で置き換えられる）； $(CH_2)_q$ - 6 ~ 10員アリアル； $(CH_2)_r$ - 3 ~ 10員環状脂肪族；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1 ~ 5個のヘテロ原子を有する $(CH_2)_x$ - 4 ~ 10員複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1 ~ 5個のヘテロ原子を有する $(CH_2)_b$ - 5 ~ 10員ヘテロアリアルから選択され、前記 C_{1-6} 脂肪族、アリアル、環状脂肪族、複素環、及びヘテロアリアルが任意に、1つ以上の R^e で置換され、

X が、ハロゲン、 C 、 O 、 S 、及び N から選択されるが、但し、(1) X が N であるとき

、 R^1 、 R^2 、及び R^3 のうちの一つが不在であり、(2) Xがハロゲンであるとき、 R^1 、 R^2 、及び R^3 が不在であり、かつ(3) XがOまたはSであるとき、 R^1 、 R^2 、及び R^3 のうちの一つが不在であり、 R^1 、 R^2 、及び R^3 のうちの一つが水素ではないことを条件とし、

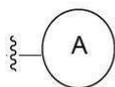
R^1 、 R^2 、及び R^3 が、各々独立して、水素；直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族（前記 C_{1-6} 脂肪族の一つまたは二つのメチレン単位が、任意にかつ独立して、O、S、S(O)、S(O)₂、またはN(R^{1-9})で置き換えられる）；(CH₂)_s-6~10員アリール；(CH₂)_t-3~10員環状脂肪族；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する(CH₂)_u-4~10員複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する(CH₂)_p-5~10員ヘテロアリールから選択され、前記 C_{1-6} 脂肪族、アリール、環状脂肪族、複素環、及びヘテロアリールが任意に、1つ以上の R^k で置換されるか、

あるいは、XがCまたはNであるとき、 R^1 、 R^2 、及び R^3 のうちのいずれか二つが、それらが結合する前記原子Xと一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する4~10員複素環、ならびに3~10員環状脂肪族から選択される環を形成し、前記環が任意に、1つ以上の R^b で置換されるか、

あるいは、XがCであるとき、 R^1 、 R^2 、及び R^3 が、それらが結合する前記原子Xと一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~4個のヘテロ原子を有する5~10員ヘテロアリール、ならびに6~10員アリールから選択される環を形成し、前記環が任意に、1つ以上の R^b で置換されるか、

あるいは、XがNであるとき、 R^1 、 R^2 、及び R^3 が、それらが結合する前記原子Xと一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する5~10員ヘテロアリール環を形成し、前記環が任意に、1つ以上の R^b で置換され、

【化176】



が、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される0~3個のヘテロ原子を有する3~7員飽和、部分不飽和、及び芳香族単環式環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される0~5個のヘテロ原子を有する8~10員飽和、部分不飽和、及び芳香族単環式環から選択される環であり、

R^a の各出現が、独立して、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族及び Z_1-R^8 から選択されるか、

あるいは、2つの R^a が、それらが結合する原子（複数可）と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する4~10員複素環、ならびに3~6員環状脂肪族から選択される環を形成し、前記環が任意に、1つ以上の R^p で置換され、

R^p の各出現が、独立して、CN、CH₃、CF₃、CH₂F、CF₂H、NH₂、NH（直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-3} 脂肪族）、N（直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-3} 脂肪族）₂、OH、ハロゲン、OCH₃、OCF₃、OCH₂F、OCF₂H、O（直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族）、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族から選択され、前記 C_{2-3} 脂肪族が任意に、1つ以上のFで置換され、

Z_1 の各出現が、独立して、直接結合、 C_{1-3} アルキレン鎖、O、N(R^{1-6})、S、S(O)、S(O)₂、C(O)、CO₂、C(O)NR¹⁻⁶、N(R^{1-6})C(O)、N(R^{1-6})CO₂、S(O)₂NR¹⁻⁶、N(R^{1-6})S(O)₂、OC(O)N(R^{1-6})、N(R^{1-6})C(O)NR¹⁻⁶、N(R^{1-6})S(O)₂N(R^{1-6})、及びOC(O)から選択され、前記アルキレン鎖が任意に、1つ以上の R^h で置換され、

R^hの各出現が、独立して、CN、CH₃、CF₃、CH₂F、CF₂H、OH、ハロゲン、OCH₃、OCF₃、OCH₂F、OCF₂H、O（直鎖もしくは分岐鎖C₂₋₃脂肪族）、及び直鎖もしくは分岐鎖C₂₋₃脂肪族から選択され、前記C₂₋₃脂肪族が任意に、1つ以上のFで置換され、

R^bの各出現が、独立して、直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₆脂肪族及びZ₂-R⁶から選択されるか、

あるいは、2つのR^bが、それらが結合する原子（複数可）と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される0~3個のヘテロ原子を有する3~7員飽和、部分不飽和、または芳香族単環式環を形成し、前記環が任意に、1つ以上のR^cで置換され、

R^cの各出現が、独立して、直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₆脂肪族、CF₃、CF₂H、CH₂F、ハロゲン、OR^{1 2}、(CH₂)_v-C(O)R⁹、及び(CH₂)_w-NR^{1 0}C(O)R^{1 1}から選択され、

Z₂の各出現が、独立して、直接結合、C₁₋₃アルキレン鎖、O、N(R^{1 7})、S、S(O)、S(O)₂、C(O)、CO₂、C(O)NR^{1 7}、N(R^{1 7})C(O)、N(R^{1 7})CO₂、S(O)₂NR^{1 7}、N(R^{1 7})S(O)₂、OC(O)N(R^{1 7})、N(R^{1 7})C(O)NR^{1 7}、N(R^{1 7})S(O)₂N(R^{1 7})、及びOC(O)から選択され、前記アルキレン鎖が任意に、1つ以上のRⁱで置換され、

Rⁱの各出現が、独立して、CN、CH₃、CF₃、CH₂F、CF₂H、ハロゲン、OH、OCH₃、OCF₃、OCH₂F、OCF₂H、O（直鎖もしくは分岐鎖C₂₋₃脂肪族）、及び直鎖もしくは分岐鎖C₂₋₃脂肪族から選択され、前記C₂₋₃脂肪族が任意に、1つ以上のFで置換され、

R^kの各出現が、独立して、直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₆脂肪族及びZ₃-R^{2 3}から選択され、

Z₃の各出現が、独立して、直接結合、C₁₋₃アルキレン鎖、O、N(R^{2 4})、S、S(O)、S(O)₂、C(O)、CO₂、C(O)NR^{2 4}、N(R^{2 4})C(O)、N(R^{2 4})CO₂、S(O)₂NR^{2 4}、N(R^{2 4})S(O)₂、OC(O)N(R^{2 4})、N(R^{2 4})C(O)NR^{2 4}、N(R^{2 4})S(O)₂N(R^{2 4})、及びOC(O)から選択され、前記アルキレン鎖が任意に、1つ以上のRⁿで置換され、

Rⁿの各出現が、独立して、CN、CH₃、CF₃、CF₂H、CH₂F、ハロゲン、OH、OCH₃、OCF₃、OCH₂F、OCF₂H、O（直鎖もしくは分岐鎖C₂₋₃脂肪族）、及び直鎖もしくは分岐鎖C₂₋₃脂肪族から選択され、前記C₂₋₃脂肪族が任意に、1つ以上のFで置換され、

R^eの各出現が、独立して、直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₆脂肪族及びZ₄-R^{2 2}から選択され、

Z₄の各出現が、独立して、直接結合、C₁₋₃アルキレン鎖、O、N(R^{2 0})、S、S(O)、S(O)₂、C(O)、CO₂、C(O)NR^{2 0}、N(R^{2 0})C(O)、N(R^{2 0})CO₂、S(O)₂NR^{2 0}、N(R^{2 0})S(O)₂、OC(O)N(R^{2 0})、N(R^{2 0})C(O)NR^{2 0}、N(R^{2 0})S(O)₂N(R^{2 0})、及びOC(O)から選択され、前記アルキレン鎖が任意に、1つ以上のR^tで置換され、

R^tの各出現が、独立して、CN、CH₃、CF₃、CF₂H、CH₂F、ハロゲン、OH、OCH₃、OCF₃、OCH₂F、OCF₂H、O（直鎖もしくは分岐鎖C₂₋₃脂肪族）、及び直鎖もしくは分岐鎖C₂₋₃脂肪族から選択され、前記C₂₋₃脂肪族が任意に、1つ以上のFで置換され、

Jが、直接結合；直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₆脂肪族から選択され、Jの1つまたは2つのメチレン単位が、任意にかつ独立して、O、S、またはN(R^{1 3})で置き換えられ、さらに前記C₁₋₆脂肪族が任意に、1つ以上のR^jで置換され、

R^jの各出現が、独立して、フッ素、CH₃、CF₃、CH₂F、CF₂H、OH、OCH₃、OCF₃、OCH₂F、OCF₂H、O（直鎖もしくは分岐鎖C₂₋₃脂肪族）、NH₂、NH（直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₃脂肪族）、N（直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₃脂肪族）₂、及び直鎖もしくは分岐鎖C₂₋₃脂肪族から選択され、前記C₂₋₃脂肪族

が任意に、1つ以上のFで置換されるか、

あるいは、2つのR^jが、それらが結合する原子(複数可)と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から選択される1個のヘテロ原子を有する3~6員複素環、ならびに3~6員環状脂肪族環から選択される環を形成し、前記環が任意に、1つ以上のR^mで置換され、Rの各出現が、独立して、水素、及び直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₃脂肪族から選択され、前記C₁₋₃脂肪族が任意に、1つ以上のFで置換されるか、

あるいは、R^jのうちの1つ及びRのうちの1つが、それらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から選択される1個のヘテロ原子を有する3~6員複素環、ならびに3~6員環状脂肪族から選択される環を形成し、前記環が任意に、1つ以上のR^mで置換され、

R⁴が、水素及び直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₆脂肪族から選択されるか、

あるいは、R及びR⁴のうちの1つが、それらが結合する前記原子と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する4~10員複素環を形成し、前記環が任意に、1つ以上のR^mで置換されるか、

あるいは、R^j及びR⁴のうちの1つが、それらが結合する前記原子と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する4~10員複素環を形成し、前記環が任意に、1つ以上のR^mで置換され、

R^mの各出現が、独立して、ハロゲン、CF₃、CF₂H、CH₂F、及び直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₆脂肪族から選択されるか、

あるいは、2つのR^mが、それらが結合する前記原子(複数可)と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~3個のヘテロ原子を有する3~7員飽和、部分不飽和、または芳香族単環式環を形成し、前記環が任意に、1つ以上のR^hで置換され、

R^hの各出現が、独立して、ハロゲン、CF₃、CF₂H、CH₂F、直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₆脂肪族、C(O)N(R¹⁻⁸)₂、OH、及びO(直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₆脂肪族)から選択され、

R⁵の各出現が、独立して、水素、CF₃、CF₂H、CH₂F、及び直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₆脂肪族から選択され、

R⁶の各出現が、独立して、CN、ハロゲン、OR⁷、N(R¹⁻⁹)₂、直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₆脂肪族、6~10員アリアル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する5~10員ヘテロアリアル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する4~10員複素環、ならびに3~10員環状脂肪族から選択され、前記アリアル、ヘテロアリアル、複素環、及び環状脂肪族が任意に、1つ以上のR^cで置換され、

R⁷の各出現が、独立して、水素、CF₃、CF₂H、CH₂F、直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₆脂肪族、及び6~10員アリアルから選択され、

R⁸の各出現が、独立して、CN、ハロゲン、OR⁵、N(R²⁻¹)₂、直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₆脂肪族、6~10員アリアル、3~10員環状脂肪族、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する5~10員ヘテロアリアル、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する4~10員複素環から選択され、前記アリアル、環状脂肪族、ヘテロアリアル、及び複素環が任意に、1つ以上のR^gで置換され、

R⁸の各出現が、独立して、CN、CH₃、CF₃、CF₂H、CH₂F、ハロゲン、OH、OCH₃、OCF₃、OCH₂F、OCF₂H、O(直鎖もしくは分岐鎖C₂₋₃脂肪族)、及び直鎖もしくは分岐鎖C₂₋₃脂肪族から選択され、前記C₂₋₃脂肪族が任意に、1つ以上のFで置換され、

R⁹の各出現が、独立して、OH、O(直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₆脂肪族)、N(R¹⁻⁵)₂、及び直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₆脂肪族から選択され、

R¹⁰の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₆脂肪族から選択され、

$R^{1\ 1}$ の各出現が、独立して、OH、 OC_{1-6} 脂肪族、 $N(R^{1\ 4})_2$ 、及び C_{1-6} 脂肪族から選択され、
 $R^{1\ 2}$ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、
 $R^{1\ 3}$ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、
 $R^{1\ 4}$ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、
 $R^{1\ 5}$ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、
 $R^{1\ 6}$ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、
 $R^{1\ 7}$ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、
 $R^{1\ 8}$ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、
 $R^{1\ 9}$ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-3} 脂肪族から選択され、
 $R^{2\ 0}$ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、
 $R^{2\ 1}$ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、
 $R^{2\ 2}$ の各出現が、独立して、CN、ハロゲン、 $OR^{2\ 8}$ 、 $N(R^{2\ 9})_2$ 、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族；6～10員アリール、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1～5個のヘテロ原子を有する5～10員ヘテロアリール、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1～5個のヘテロ原子を有する4～10員複素環、ならびに3～10員環状脂肪族から選択され、
 $R^{2\ 3}$ の各出現が、独立して、CN、ハロゲン、 $OR^{3\ 0}$ 、 $SR^{3\ 0}$ 、 $N(R^{2\ 6})_2$ 、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、
 $R^{2\ 4}$ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、
 $R^{2\ 5}$ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-3} 脂肪族から選択され、
 $R^{2\ 6}$ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-3} 脂肪族から選択され、
 $R^{2\ 7}$ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-3} 脂肪族から選択され、
 $R^{2\ 8}$ の各出現が、独立して、水素、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族、及び6～10員アリールから選択され、
 $R^{2\ 9}$ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-3} 脂肪族から選択され、
 $R^{3\ 0}$ の各出現が、独立して、水素、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族、及び6～10員アリールから選択され、
Tが、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1～5個のヘテロ原子を有する $(CH_2)_5-6$ ～10員アリールまたは $(CH_2)_2-5$ ～10員単環式もしくは二環式ヘテロアリールであり、前記アリールまたはヘテロアリールが任意に、1つ以上の R^d で置換され、
 R^d の各出現が、独立して、CN、ハロゲン、 $N(R^{2\ 7})_2$ 、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択されるか、
あるいは、2つの R^d が、それらが結合する原子（複数可）と一緒にあって、窒素、酸素

、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員複素環を形成し、

R^q の各出現が、独立して、 CN 、 CH_3 、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、ハロゲン、 OH 、 OCH_3 、 OCF_3 、 OCH_2F 、 OCF_2H 、 O (直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族)、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族から選択され、前記 C_{2-3} 脂肪族が任意に、1つ以上の F で置換され、

b が、0、1、2、または 3 であり、

n が、0、1、2、3、4、または 5 であり、

o が、0、1、2、または 3 であり、

p が、0、1、2、または 3 であり、

r が、0、1、2、または 3 であり、

s が、0、1、2、または 3 であり、

t が、0、1、2、または 3 であり、

q が、0、1、2、または 3 であり、

u が、0、1、2、または 3 であり、

x が、0、1、2、または 3 であり、

v が、0、1、2、または 3 であり、

w が、0、1、2、または 3 であり、

z が、0、1、2、または 3 であるが、

但し、 R^b が、四級アミンまたはメチルであり、 J が、直接結合であるとき、 T が、フェニルまたは 3 - ピリジンではないことをさらに条件とし、前記フェニル及び 3 - ピリジンが任意に、1つ以上の R^d で置換される、前記化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

式 I I もしくは I I I :

【化 177】



の請求項 1 に記載の化合物、または式 I I もしくは I I I の薬学的に許容される塩であって、式中、

R^{1A} 、 R^{2A} 、及び R^{3A} が、各々独立して、水素；直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族 (前記 C_{1-6} 脂肪族の 1つまたは 2つのメチレン単位が、任意にかつ独立して、 O 、 S 、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 、または $N(R^{19})$ で置き換えられる)； $(CH_2)_s - 6$ ~ 10 員アリアル； $(CH_2)_t - 3$ ~ 10 員環状脂肪族；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する $(CH_2)_u - 4$ ~ 10 員複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する $(CH_2)_p - 5$ ~ 10 員ヘテロアリアルから選択され、前記 C_{1-6} 脂肪族、アリアル、環状脂肪族、複素環、及びヘテロアリアルが任意に、1つ以上の R^k で置換されるが、

但し、式 I I I について、 R^{1A} が水素でないことを条件とし、かつ

但し、式 I I について、 R^{1A} 、 R^{2A} 、及び R^{3A} が、各々、水素であり、 J が、直接結合であるとき、前記 T が、フェニルまたは 3 - ピリジンではないことを条件とし、前記フェニル及び 3 - ピリジンが任意に、1つ以上の R^d で置換されるか、

あるいは、 R^{1A} 、 R^{2A} 、及び R^{3A} のいずれか 2つが、それらが結合する前記炭素原子と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子

を有する4～10員複素環、ならびに3～10員環状脂肪族から選択される環を形成し、前記環が任意に、1つ以上の R^b で置換されるか、

あるいは、 R^{1A} 、 R^{2A} 、及び R^{3A} が、それらが結合する前記炭素原子と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1～4個のヘテロ原子を有する5～10員ヘテロアリール、ならびに6～10員アリールから選択される環を形成し、前記環が任意に、1つ以上の R^b で置換され、

R^b の各出現が、独立して、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族及び Z_2-R^6 から選択されるか、

あるいは、2つの R^b が、それらが結合する原子(複数可)と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される0～3個のヘテロ原子を有する3～7員飽和、部分不飽和、または芳香族単環式環から選択される環を形成し、前記環が任意に、1つ以上の R^c で置換され、

R^c の各出現が、独立して、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、ハロゲン、 OR^{12} 、 $(CH_2)_v-C(O)R^9$ 、及び $(CH_2)_w-NR^{10}C(O)R^{11}$ から選択され、

Z_2 の各出現が、独立して、直接結合、 C_{1-3} アルキレン鎖、 O 、 $N(R^{17})$ 、 S 、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 、 $C(O)$ 、 CO_2 、 $C(O)NR^{17}$ 、 $N(R^{17})C(O)$ 、 $N(R^{17})CO_2$ 、 $S(O)_2NR^{17}$ 、 $N(R^{17})S(O)_2$ 、 $OC(O)N(R^{17})$ 、 $N(R^{17})C(O)NR^{17}$ 、 $N(R^{17})S(O)_2N(R^{17})$ 、及び O 、 $C(O)$ から選択され、前記アルキレン鎖が任意に、1つ以上の R^i で置換され、

R^i の各出現が、独立して、 CN 、 CH_3 、 CF_3 、 CH_2F 、 CF_2H 、ハロゲン、 O 、 H 、 OCH_3 、 OCF_3 、 OCH_2F 、 OCF_2H 、 O (直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族)、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族から選択され、前記 C_{2-3} 脂肪族が任意に、1つ以上の F で置換され、

R^k の各出現が、独立して、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族及び Z_3-R^{23} から選択され、

Z_3 の各出現が、独立して、直接結合、 C_{1-3} アルキレン鎖、 O 、 $N(R^{24})$ 、 S 、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 、 $C(O)$ 、 CO_2 、 $C(O)NR^{24}$ 、 $N(R^{24})C(O)$ 、 $N(R^{24})CO_2$ 、 $S(O)_2NR^{24}$ 、 $N(R^{24})S(O)_2$ 、 $OC(O)N(R^{24})$ 、 $N(R^{24})C(O)NR^{24}$ 、 $N(R^{24})S(O)_2N(R^{24})$ 、及び O 、 $C(O)$ から選択され、前記アルキレン鎖が任意に、1つ以上の R^n で置換され、

R^n の各出現が、独立して、 CN 、 CH_3 、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、ハロゲン、 O 、 H 、 OCH_3 、 OCF_3 、 OCH_2F 、 OCF_2H 、 O (直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族)、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族から選択され、前記 C_{2-3} 脂肪族が任意に、1つ以上の F で置換され、

R^6 の各出現が、独立して、 CN 、ハロゲン、 OR^7 、 $N(R^{19})_2$ 、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族、6～10員アリール、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1～5個のヘテロ原子を有する5～10員ヘテロアリール、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1～5個のヘテロ原子を有する4～10員複素環、ならびに3～10員環状脂肪族から選択され、前記アリール、ヘテロアリール、複素環、及び環状脂肪族が任意に、1つ以上の R^c で置換され、

R^7 の各出現が、独立して、水素、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族、及び6～10員アリールから選択され、

R^9 の各出現が、独立して、 OH 、 O (直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族)、 $N(R^{15})_2$ 、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、

R^{10} の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、

R^{11} の各出現が、独立して、 OH 、 OC_{1-6} 脂肪族、 $N(R^{14})_2$ 、及び C_{1-6} 脂肪族から選択され、

R^{12} の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され

、
 R^{14} の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、
 、
 R^{15} の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、
 、
 R^{17} の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、
 、
 R^{19} の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-3} 脂肪族から選択され、
 、
 R^{23} の各出現が、独立して、 CN 、ハロゲン、 OR^{30} 、 SR^{30} 、 $N(R^{26})_2$ 、
 及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、
 R^{24} の各出現が、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から独立して選択され、
 R^{26} の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-3} 脂肪族から選択され、
 、
 R^{30} の各出現が、独立して、水素、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、直鎖もしくは分岐鎖
 C_{1-6} 脂肪族、及び 6 ~ 10 員アリールから選択され、
 p が、0、1、2、または 3 であり、
 s が、0、1、2、または 3 であり、
 t が、0、1、2、または 3 であり、
 u が、0、1、2、または 3 であり、
 v が、0、1、2、または 3 であり、
 w が、0、1、2、または 3 である、前記化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 3】

R^{1A} 、 R^{2A} 、及び R^{3A} が、各々独立して、水素；直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族（前記 C_{1-6} 脂肪族の 1 つまたは 2 つのメチレン単位が、任意にかつ独立して、 O で置き換えられる）から選択されるが、但し、 R^{1A} 、 R^{2A} 、及び R^{3A} が、各々、水素であり、 J が、直接結合であるとき、前記 T が、フェニルまたは 3 - ピリジンではないことを条件とし、前記フェニル及び 3 - ピリジンが任意に、1 つ以上の R^d で置換される、請求項 2 に記載の式 I I の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

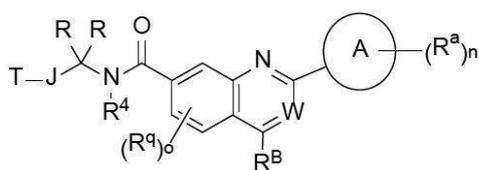
【請求項 4】

R^{1A} が、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族（ C_{1-6} 脂肪族の 1 つまたは 2 つのメチレン単位が、任意にかつ独立して、 O で置き換えられる）及び $(CH_2)_t - 3 \sim 7$ 員環状脂肪族から選択される、請求項 2 に記載の式 I I I の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 5】

式 V I :

【化 178】

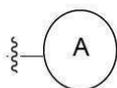


(VI)

の請求項 1 に記載の化合物、または式 V I の薬学的に許容される塩。

【請求項 6】

【化 1 7 9】



が、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 5 員または 6 員飽和、部分飽和、単環式環から選択される環である、請求項 5 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 7】

J が、直接結合、C₁ 脂肪族、及び C₂ 脂肪族から選択され、さらに前記脂肪族が任意に、1 つ以上の R^j で置換されるか、あるいは

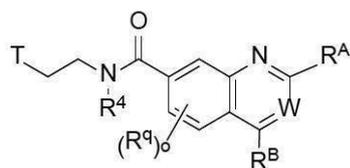
J が、C₁ 脂肪族及び C₂ 脂肪族から選択され、前記脂肪族が、1 つ以上の R^j で置換され、R^j のうちの 1 つ及び R のうちの 1 つが、それらが結合する前記原子と一緒にあって、3 ~ 6 員環状脂肪族環を形成するか、あるいは

J が、C₂ 脂肪族であり、前記脂肪族が、2 つ以上の R^j で置換され、2 つの R^j が、それらが結合する前記原子（複数可）と一緒にあって、3 ~ 6 員環状脂肪族環を形成する、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

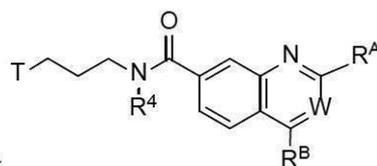
【請求項 8】

請求項 1 に記載の化合物、または式 X I V もしくは X V :

【化 1 8 0】



(X I V) もしくは



(X V)

または式 X I V もしくは X V の薬学的に許容される塩。

【請求項 9】

T が、(C H₂)_s - 6 ~ 10 員アリアルであり、前記アリアルが任意に、1 つ以上の R^d で置換される、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 10】

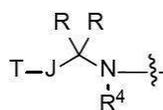
T が、窒素及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 9 員ヘテロアリアル環であり、前記環が任意に、1 つ以上の R^d で置換される、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 11】

T が、2 個の窒素ヘテロ原子を有する 5 員ヘテロアリアル環であり、前記環が任意に、1 つ以上の R^d で置換される、請求項 10 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

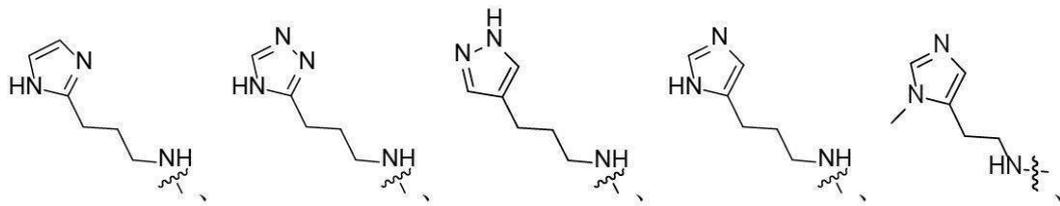
【請求項 12】

【化 1 8 1】

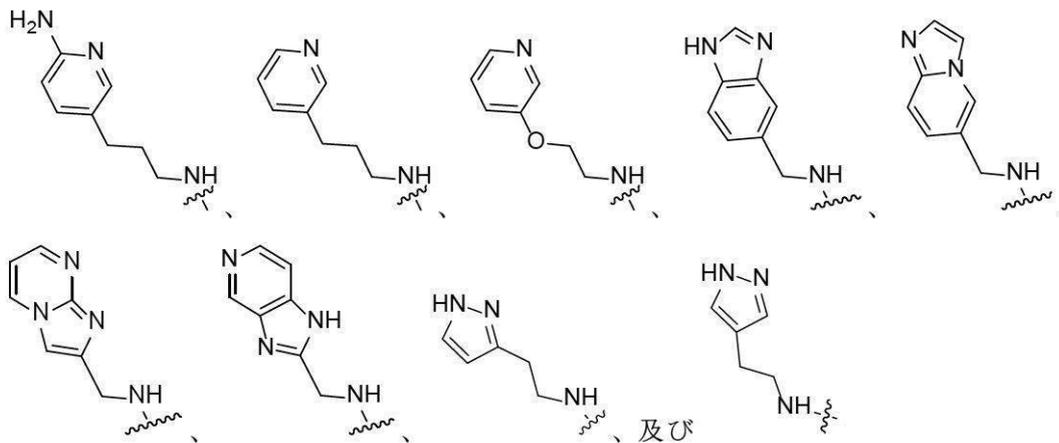


が、

【化 1 8 2】



【化 1 8 3】



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される塩。

【請求項 1 3】

表 1 の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 4】

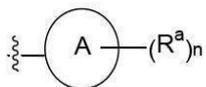
J が、直鎖 C₁₋₆ 脂肪族であり、J の 1 ~ 2 つのメチレン単位が、任意にかつ独立して、O、S、または N (R¹⁻³) で置き換えられ、

T が、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリアルであり、前記アリアル及びヘテロアリアルが任意に、1 つ以上の R^d で置換され、

R が、水素であり、

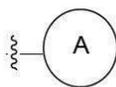
R^A が、

【化 1 8 4】



であり、

【化 1 8 5】



が、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 5 員または 6 員芳香族単環式環であり、

n が、0、1、2、または 3 であり、

R^a が、 $Z_1 - R^8$ であり、

Z_1 が、直接結合であり、

R^8 が、独立して、ハロゲン、 R^5 、及び OR^5 から選択され、

W が、 CH であり、

R^q が、水素であり、

R^{1A} が、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族であり、 C_{1-6} 脂肪族の 1 つまたは 2 つのメチレン単位が、任意にかつ独立して、 O 、 S 、または $N(R^{19})$ で置き換えられ、

前記 C_{1-6} 脂肪族が任意に、1 つ以上の R^k で置換され、

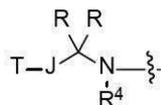
R^k の各出現が、独立して、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族及び $Z_3 - R^{23}$ から選択され、

Z_3 の各出現が、独立して、直接結合及び C_{1-3} アルキレン鎖から選択され、

R^{23} の各出現が、独立して、 CN 、ハロゲン、 OR^{30} 、 SR^{30} 、 $N(R^{26})_2$ 、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択される、請求項 2 に記載の式 I I I の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

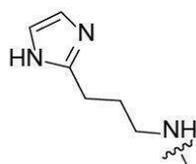
【請求項 1 5】

【化 1 8 6】



が、

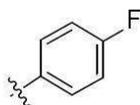
【化 1 8 7】



であり、

R^A が、

【化 1 8 8】



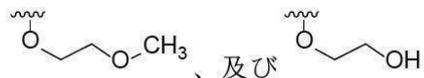
であり、

R^{1A} が、直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族であり、C₁₋₆ 脂肪族の 1 つまたは 2 つのメチレン単位が、任意にかつ独立して、O、S、または NH で置き換えられる、請求項 14 に記載の式 III の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 16】

OR^{1A} が、

【化 189】

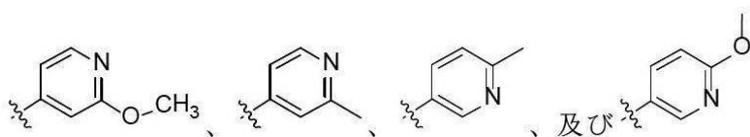


から選択される、請求項 15 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 17】

R^A が、

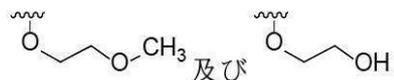
【化 190】



から選択され、

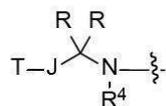
OR^{1A} が、

【化 191】



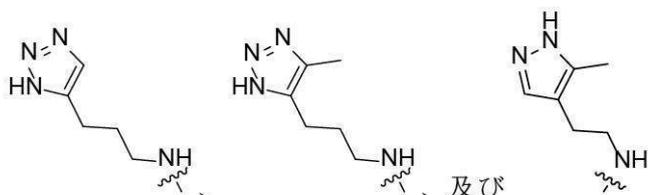
から選択され、

【化 192】



が、

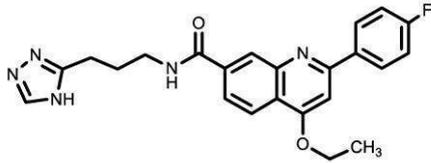
【化 193】



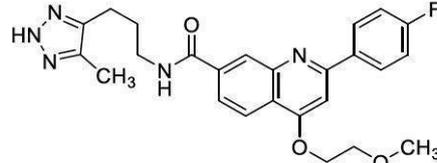
から選択される、請求項 14 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 18】

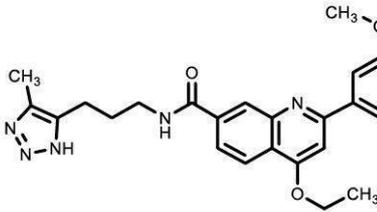
【化 194】



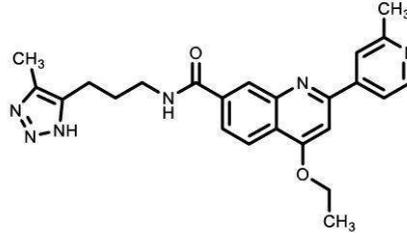
I-5、



I-66、

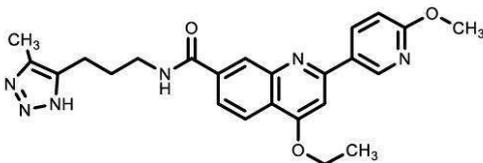


I-71、

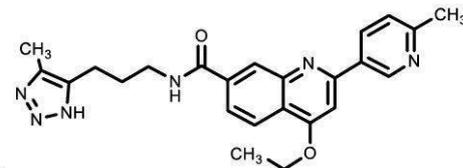


I-75、

【化 195】



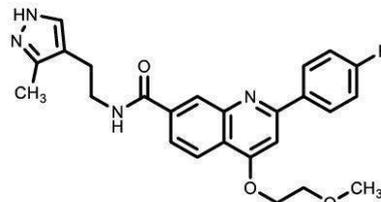
I-93、



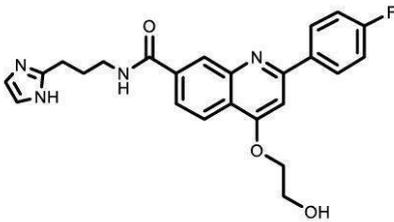
I-112、



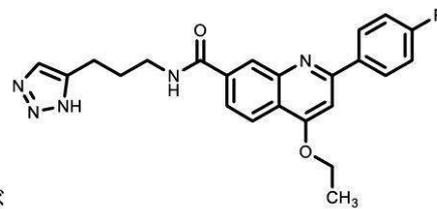
I-124、



I-126、



I-229、及び



I-115

から選択される、請求項 17 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 19】

請求項 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される担体とを含む、薬学的組成物。

【請求項 20】

別の治療剤をさらに含む、請求項 19 に記載の薬学的組成物。

【請求項 21】

請求項 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含む、対象における異常細胞成長を阻害するため、または過剰増殖性障害を治療もしくは予防するための組成物。

【請求項 22】

請求項 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含む、対象における癌、炎症性状態、または T 細胞媒介性自己免疫疾患を治療もしくは予防するための組成物。

【請求項 23】

請求項 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含む

細胞中のニコチンアミドホスホリボシルトランスフェラーゼ (NAMPT) を阻害するための組成物。

【請求項 24】

請求項 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含む NAMPT 活性によって媒介される状態に罹患している対象を治療するための組成物。

【請求項 25】

請求項 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含む対象における状態の治療または予防用の組成物であって、前記状態が、NAMPT 活性によって媒介される、前記組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0413

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0413】

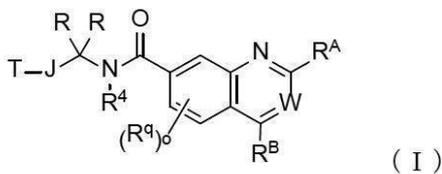
本発明のいくつかの実施形態を説明してきたが、基本的な例を修正して、本発明の化合物及び方法を利用する他の実施形態を提供することができることは明らかである。したがって、本発明の範囲が、一例として提示されている特定の実施形態ではなく、添付の特許請求の範囲によって定義されるべきであることが理解されるであろう。

特定の実施形態では、例えば以下の項目が提供される。

(項目 1)

式 I :

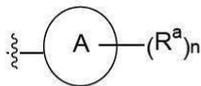
【化 174】



の化合物、または式 I の薬学的に許容される塩であって、式中、

R^A が、

【化 175】



、または Y R^C R^D R^E であり、

R^B が、X R¹ R² R³ であり、

W が、N、CH、または C R^q であり、

Y が、C、O、S、及び N から選択されるが、但し、(1) Y が N であるとき、R^C、R^D、及び R^E のうちの 1 つが不在であり、R^C、R^D、及び R^E のうちの残りの 2 つが両方とも水素ではなく、かつ (2) Y が O または S であるとき、R^C、R^D、及び R^E のうちの 2 つが不在であり、R^C、R^D、及び R^E のうちの残りの 1 つが水素ではないことを条件とし、

R^C、R^D、及び R^E が、各々独立して、水素；直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族 (前記 C₁₋₆ 脂肪族の 1 つまたは 2 つのメチレン単位が、任意にかつ独立して、O、S、S

(O)、S(O)₂、またはN(R²)₅で置き換えられる)；(CH₂)_q-6~10員アリール；(CH₂)_r-3~10員環状脂肪族；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する(CH₂)_x-4~10員複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する(CH₂)_b-5~10員ヘテロアリールから選択され、前記C₁₋₆脂肪族、アリール、環状脂肪族、複素環、及びヘテロアリールが任意に、1つ以上のR^eで置換され、

Xが、ハロゲン、C、O、S、及びNから選択されるが、但し、(1)XがNであるとき、R¹、R²、及びR³のうち1つが不在であり、(2)Xがハロゲンであるとき、R¹、R²、及びR³が不在であり、かつ(3)XがOまたはSであるとき、R¹、R²、及びR³のうち2つが不在であり、R¹、R²、及びR³のうち残りの1つが水素ではないことを条件とし、

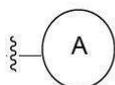
R¹、R²、及びR³が、各々独立して、水素；直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₆脂肪族(前記C₁₋₆脂肪族の1つまたは2つのメチレン単位が、任意にかつ独立して、O、S、S(O)、S(O)₂、またはN(R¹)₉で置き換えられる)；(CH₂)_s-6~10員アリール；(CH₂)_t-3~10員環状脂肪族；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する(CH₂)_u-4~10員複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する(CH₂)_p-5~10員ヘテロアリールから選択され、前記C₁₋₆脂肪族、アリール、環状脂肪族、複素環、及びヘテロアリールが任意に、1つ以上のR^kで置換されるか、

あるいは、XがCまたはNであるとき、R¹、R²、及びR³のうちいずれか2つが、それらが結合する前記原子Xと一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する4~10員複素環、ならびに3~10員環状脂肪族から選択される環を形成し、前記環が任意に、1つ以上のR^bで置換されるか、

あるいは、XがCであるとき、R¹、R²、及びR³が、それらが結合する前記原子Xと一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~4個のヘテロ原子を有する5~10員ヘテロアリール、ならびに6~10員アリールから選択される環を形成し、前記環が任意に、1つ以上のR^bで置換されるか、

あるいは、XがNであるとき、R¹、R²、及びR³が、それらが結合する前記原子Xと一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する5~10員ヘテロアリール環を形成し、前記環が任意に、1つ以上のR^bで置換され

【化176】



が、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される0~3個のヘテロ原子を有する3~7員飽和、部分不飽和、及び芳香族単環式環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される0~5個のヘテロ原子を有する8~10員飽和、部分不飽和、及び芳香族単環式環から選択される環であり、

R^aの各出現が、独立して、直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₆脂肪族及びZ₁-R⁸から選択されるか、

あるいは、2つのR^aが、それらが結合する原子(複数可)と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する4~10員複素環、ならびに3~6員環状脂肪族から選択される環を形成し、前記環が任意に、1つ以上のR^pで置換され、

R^pの各出現が、独立して、CN、CH₃、CF₃、CH₂F、CF₂H、NH₂、NH(直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₃脂肪族)、N(直鎖もしくは分岐鎖C₁₋₃脂肪族)₂、OH、ハロゲン、OCH₃、OCF₃、OCH₂F、OCF₂H、O(直鎖もしくは分岐

鎖 C_{2-3} 脂肪族)、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族から選択され、前記 C_{2-3} 脂肪族が任意に、1つ以上のFで置換され、
 Z_1 の各出現が、独立して、直接結合、 C_{1-3} アルキレン鎖、O、 $N(R^{16})$ 、S、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 、 $C(O)$ 、 CO_2 、 $C(O)NR^{16}$ 、 $N(R^{16})C(O)$ 、 $N(R^{16})CO_2$ 、 $S(O)_2NR^{16}$ 、 $N(R^{16})S(O)_2$ 、 $OC(O)N(R^{16})$ 、 $N(R^{16})C(O)NR^{16}$ 、 $N(R^{16})S(O)_2N(R^{16})$ 、及びO
 $C(O)$ から選択され、前記アルキレン鎖が任意に、1つ以上の R^h で置換され、
 R^h の各出現が、独立して、CN、 CH_3 、 CF_3 、 CH_2F 、 CF_2H 、OH、ハロゲン、 OCH_3 、 OCF_3 、 OCH_2F 、 OCF_2H 、O(直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族)、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族から選択され、前記 C_{2-3} 脂肪族が任意に、1つ以上のFで置換され、
 R^b の各出現が、独立して、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族及び $Z_2 - R^6$ から選択されるか、
あるいは、2つの R^b が、それらが結合する原子(複数可)と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される0~3個のヘテロ原子を有する3~7員飽和、部分不飽和、または芳香族単環式環を形成し、前記環が任意に、1つ以上の R^c で置換され、
 R^c の各出現が、独立して、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、ハロゲン、 OR^{12} 、 $(CH_2)_v - C(O)R^9$ 、及び $(CH_2)_w - NR^{10}C(O)R^{11}$ から選択され、
 Z_2 の各出現が、独立して、直接結合、 C_{1-3} アルキレン鎖、O、 $N(R^{17})$ 、S、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 、 $C(O)$ 、 CO_2 、 $C(O)NR^{17}$ 、 $N(R^{17})C(O)$ 、 $N(R^{17})CO_2$ 、 $S(O)_2NR^{17}$ 、 $N(R^{17})S(O)_2$ 、 $OC(O)N(R^{17})$ 、 $N(R^{17})C(O)NR^{17}$ 、 $N(R^{17})S(O)_2N(R^{17})$ 、及びO
 $C(O)$ から選択され、前記アルキレン鎖が任意に、1つ以上の R^i で置換され、
 R^i の各出現が、独立して、CN、 CH_3 、 CF_3 、 CH_2F 、 CF_2H 、ハロゲン、OH、 OCH_3 、 OCF_3 、 OCH_2F 、 OCF_2H 、O(直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族)、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族から選択され、前記 C_{2-3} 脂肪族が任意に、1つ以上のFで置換され、
 R^k の各出現が、独立して、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族及び $Z_3 - R^{23}$ から選択され、
 Z_3 の各出現が、独立して、直接結合、 C_{1-3} アルキレン鎖、O、 $N(R^{24})$ 、S、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 、 $C(O)$ 、 CO_2 、 $C(O)NR^{24}$ 、 $N(R^{24})C(O)$ 、 $N(R^{24})CO_2$ 、 $S(O)_2NR^{24}$ 、 $N(R^{24})S(O)_2$ 、 $OC(O)N(R^{24})$ 、 $N(R^{24})C(O)NR^{24}$ 、 $N(R^{24})S(O)_2N(R^{24})$ 、及びO
 $C(O)$ から選択され、前記アルキレン鎖が任意に、1つ以上の R^n で置換され、
 R^n の各出現が、独立して、CN、 CH_3 、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、ハロゲン、OH、 OCH_3 、 OCF_3 、 OCH_2F 、 OCF_2H 、O(直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族)、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族から選択され、前記 C_{2-3} 脂肪族が任意に、1つ以上のFで置換され、
 R^e の各出現が、独立して、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族及び $Z_4 - R^{22}$ から選択され、
 Z_4 の各出現が、独立して、直接結合、 C_{1-3} アルキレン鎖、O、 $N(R^{20})$ 、S、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 、 $C(O)$ 、 CO_2 、 $C(O)NR^{20}$ 、 $N(R^{20})C(O)$ 、 $N(R^{20})CO_2$ 、 $S(O)_2NR^{20}$ 、 $N(R^{20})S(O)_2$ 、 $OC(O)N(R^{20})$ 、 $N(R^{20})C(O)NR^{20}$ 、 $N(R^{20})S(O)_2N(R^{20})$ 、及びO
 $C(O)$ から選択され、前記アルキレン鎖が任意に、1つ以上の R^t で置換され、
 R^t の各出現が、独立して、CN、 CH_3 、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、ハロゲン、OH、 OCH_3 、 OCF_3 、 OCH_2F 、 OCF_2H 、O(直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族)、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族から選択され、前記 C_{2-3} 脂肪族が任意に、1つ以上のFで置換され、

J が、直接結合；直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、J の 1 つまたは 2 つのメチレン単位が、任意にかつ独立して、O、S、または $N(R^{13})$ で置き換えられ、さらに前記 C_{1-6} 脂肪族が任意に、1 つ以上の R^j で置換され、

R^j の各出現が、独立して、フッ素、 CH_3 、 CF_3 、 CH_2F 、 CF_2H 、OH、 OC 、 H_3 、 OCF_3 、 OCH_2F 、 OCF_2H 、O（直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族）、 NH_2 、NH（直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-3} 脂肪族）、N（直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-3} 脂肪族）₂、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族から選択され、前記 C_{2-3} 脂肪族が任意に、1 つ以上の F で置換されるか、

あるいは、2 つの R^j が、それらが結合する原子（複数可）と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から選択される 1 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 6 員複素環、ならびに 3 ~ 6 員環状脂肪族環から選択される環を形成し、前記環が任意に、1 つ以上の R^m で置換され、R の各出現が、独立して、水素、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-3} 脂肪族から選択され、前記 C_{1-3} 脂肪族が任意に、1 つ以上の F で置換されるか、

あるいは、 R^j のうちの 1 つ及び R のうちの 1 つが、それらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から選択される 1 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 6 員複素環、ならびに 3 ~ 6 員環状脂肪族から選択される環を形成し、前記環が任意に、1 つ以上の R^m で置換され、

R^4 が、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択されるか、

あるいは、R 及び R^4 のうちの 1 つが、それらが結合する前記原子と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員複素環を形成し、前記環が任意に、1 つ以上の R^m で置換されるか、

あるいは、 R^j 及び R^4 のうちの 1 つが、それらが結合する前記原子と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員複素環を形成し、前記環が任意に、1 つ以上の R^m で置換され、

R^m の各出現が、独立して、ハロゲン、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択されるか、

あるいは、2 つの R^m が、それらが結合する前記原子（複数可）と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 7 員飽和、部分不飽和、または芳香族単環式環を形成し、前記環が任意に、1 つ以上の R^h で置換され、

R^h の各出現が、独立して、ハロゲン、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族、 $C(O)N(R^{18})_2$ 、OH、及び O（直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族）から選択され、

R^5 の各出現が、独立して、水素、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択され、

R^6 の各出現が、独立して、CN、ハロゲン、 OR^7 、 $N(R^{19})_2$ 、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族、6 ~ 10 員アリアル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリアル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員複素環、ならびに 3 ~ 10 員環状脂肪族から選択され、前記アリアル、ヘテロアリアル、複素環、及び環状脂肪族が任意に、1 つ以上の R^c で置換され、

R^7 の各出現が、独立して、水素、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族、及び 6 ~ 10 員アリアルから選択され、

R^8 の各出現が、独立して、CN、ハロゲン、 OR^5 、 $N(R^{21})_2$ 、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族、6 ~ 10 員アリアル、3 ~ 10 員環状脂肪族、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリアル、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員複素環から選択され、前記アリアル、環状脂肪族、ヘテロアリアル、及び複素環が任意に、1 つ以上の R^g で置換され、

R^g の各出現が、独立して、CN、 CH_3 、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、ハロゲン、O

H、OCH₃、OCF₃、OCH₂F、OCF₂H、O（直鎖もしくは分岐鎖 C₂₋₃ 脂肪族）、及び直鎖もしくは分岐鎖 C₂₋₃ 脂肪族から選択され、前記 C₂₋₃ 脂肪族が任意に、1つ以上の F で置換され、

R⁹ の各出現が、独立して、OH、O（直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族）、N（R¹⁵）₂、及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族から選択され、

R¹⁰ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族から選択され、

R¹¹ の各出現が、独立して、OH、OC₁₋₆ 脂肪族、N（R¹⁴）₂、及び C₁₋₆ 脂肪族から選択され、

R¹² の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族から選択され、

R¹³ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族から選択され、

R¹⁴ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族から選択され、

R¹⁵ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族から選択され、

R¹⁶ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族から選択され、

R¹⁷ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族から選択され、

R¹⁸ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族から選択され、

R¹⁹ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₃ 脂肪族から選択され、

R²⁰ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族から選択され、

R²¹ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族から選択され、

R²² の各出現が、独立して、CN、ハロゲン、OR²⁸、N（R²⁹）₂、及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族；6～10員アリアル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1～5個のヘテロ原子を有する5～10員ヘテロアリアル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1～5個のヘテロ原子を有する4～10員複素環、ならびに3～10員環状脂肪族から選択され、

R²³ の各出現が、独立して、CN、ハロゲン、OR³⁰、SR³⁰、N（R²⁶）₂、及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族から選択され、

R²⁴ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族から選択され、

R²⁵ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₃ 脂肪族から選択され、

R²⁶ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₃ 脂肪族から選択され、

R²⁷ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₃ 脂肪族から選択され、

R²⁸ の各出現が、独立して、水素、CF₃、CF₂H、CH₂F、直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族、及び6～10員アリアルから選択され、

R²⁹ の各出現が、独立して、水素及び直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₃ 脂肪族から選択され、

R³⁰ の各出現が、独立して、水素、CF₃、CF₂H、CH₂F、直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族、及び6～10員アリアルから選択され、

T が、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する (C H₂)_s - 6 ~ 10 員アリールまたは (C H₂)_z - 5 ~ 10 員単環式もしくは二環式ヘテロアリールであり、前記アリールまたはヘテロアリールが任意に、1 つ以上の R^d で置換され、

R^d の各出現が、独立して、CN、ハロゲン、N(R^{2 7})₂、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1 - 6} 脂肪族から選択されるか、

あるいは、2 つの R^d が、それらが結合する原子 (複数可) と一緒になって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員複素環を形成し、

R^q の各出現が、独立して、CN、CH₃、CF₃、CF₂H、CH₂F、ハロゲン、OH、OCH₃、OCF₃、OCH₂F、OCF₂H、O (直鎖もしくは分岐鎖 C_{2 - 3} 脂肪族)、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{2 - 3} 脂肪族から選択され、前記 C_{2 - 3} 脂肪族が任意に、1 つ以上の F で置換され、

b が、0、1、2、または 3 であり、

n が、0、1、2、3、4、または 5 であり、

o が、0、1、2、または 3 であり、

p が、0、1、2、または 3 であり、

r が、0、1、2、または 3 であり、

s が、0、1、2、または 3 であり、

t が、0、1、2、または 3 であり、

q が、0、1、2、または 3 であり、

u が、0、1、2、または 3 であり、

x が、0、1、2、または 3 であり、

v が、0、1、2、または 3 であり、

w が、0、1、2、または 3 であり、

z が、0、1、2、または 3 であるが、

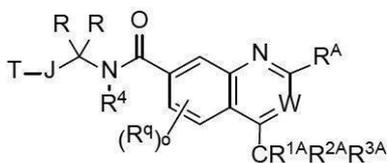
但し、R^B が、四級アミンまたはメチルであり、J が、直接結合であるとき、T が、フェニルまたは 3 - ピリジンではないことをさらに条件とし、前記フェニル及び 3 - ピリジンが任意に、1 つ以上の R^d で置換される、前記化合物、またはその薬学的に許容される塩

。

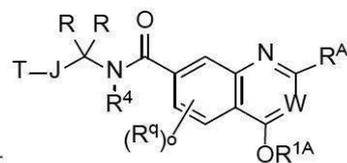
(項目 2)

式 I I もしくは I I I :

【化 1 7 7】



(I I) もしくは



(I I I)

の項目 1 に記載の化合物、または式 I I もしくは I I I の薬学的に許容される塩であって、式中、

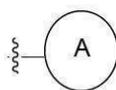
R^{1 A}、R^{2 A}、及び R^{3 A} が、各々独立して、水素；直鎖もしくは分岐鎖 C_{1 - 6} 脂肪族 (前記 C_{1 - 6} 脂肪族の 1 つまたは 2 つのメチレン単位が、任意にかつ独立して、O、S、S(O)、S(O)₂、または N(R^{1 9}) で置き換えられる)；(C H₂)_s - 6 ~ 10 員アリール；(C H₂)_t - 3 ~ 10 員環状脂肪族；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する (C H₂)_u - 4 ~ 10 員複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する (C H₂)_p - 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択され、前記 C_{1 - 6} 脂肪族、アリール、環状

脂肪族、複素環、及びヘテロアリアルが任意に、1つ以上の R^k で置換されるが、
 但し、式IIIについて、 R^{1A} が水素でないことを条件とし、かつ
 但し、式IIについて、 R^{1A} 、 R^{2A} 、及び R^{3A} が、各々、水素であり、Jが、直接結合であるとき、前記Tが、フェニルまたは3-ピリジンではないことを条件とし、前記フェニル及び3-ピリジンが任意に、1つ以上の R^d で置換されるか、
 あるいは、 R^{1A} 、 R^{2A} 、及び R^{3A} のいずれか2つが、それらが結合する前記炭素原子と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する4~10員複素環、ならびに3~10員環状脂肪族から選択される環を形成し、前記環が任意に、1つ以上の R^b で置換されるか、
 あるいは、 R^{1A} 、 R^{2A} 、及び R^{3A} が、それらが結合する前記炭素原子と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~4個のヘテロ原子を有する5~10員ヘテロアリアル、ならびに6~10員アリアルから選択される環を形成し、前記環が任意に、1つ以上の R^b で置換され、
 R^b の各出現が、独立して、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族及び Z_2-R^6 から選択されるか、
 あるいは、2つの R^b が、それらが結合する原子(複数可)と一緒にあって、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される0~3個のヘテロ原子を有する3~7員飽和、部分不飽和、または芳香族単環式環から選択される環を形成し、前記環が任意に、1つ以上の R^c で置換され、
 R^c の各出現が、独立して、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、ハロゲン、 OR^{12} 、 $(CH_2)_v-C(O)R^9$ 、及び $(CH_2)_w-NR^{10}C(O)R^{11}$ から選択され、
 Z_2 の各出現が、独立して、直接結合、 C_{1-3} アルキレン鎖、O、 $N(R^{17})$ 、S、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 、 $C(O)$ 、 CO_2 、 $C(O)NR^{17}$ 、 $N(R^{17})C(O)$ 、 $N(R^{17})CO_2$ 、 $S(O)_2NR^{17}$ 、 $N(R^{17})S(O)_2$ 、 $OC(O)N(R^{17})$ 、 $N(R^{17})C(O)NR^{17}$ 、 $N(R^{17})S(O)_2N(R^{17})$ 、及びO $C(O)$ から選択され、前記アルキレン鎖が任意に、1つ以上の R^i で置換され、
 R^i の各出現が、独立して、CN、 CH_3 、 CF_3 、 CH_2F 、 CF_2H 、ハロゲン、OH、 OCH_3 、 OCF_3 、 OCH_2F 、 OCF_2H 、O(直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族)、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族から選択され、前記 C_{2-3} 脂肪族が任意に、1つ以上のFで置換され、
 R^k の各出現が、独立して、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族及び Z_3-R^{23} から選択され、
 Z_3 の各出現が、独立して、直接結合、 C_{1-3} アルキレン鎖、O、 $N(R^{24})$ 、S、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 、 $C(O)$ 、 CO_2 、 $C(O)NR^{24}$ 、 $N(R^{24})C(O)$ 、 $N(R^{24})CO_2$ 、 $S(O)_2NR^{24}$ 、 $N(R^{24})S(O)_2$ 、 $OC(O)N(R^{24})$ 、 $N(R^{24})C(O)NR^{24}$ 、 $N(R^{24})S(O)_2N(R^{24})$ 、及びO $C(O)$ から選択され、前記アルキレン鎖が任意に、1つ以上の R^n で置換され、
 R^n の各出現が、独立して、CN、 CH_3 、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、ハロゲン、OH、 OCH_3 、 OCF_3 、 OCH_2F 、 OCF_2H 、O(直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族)、及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{2-3} 脂肪族から選択され、前記 C_{2-3} 脂肪族が任意に、1つ以上のFで置換され、
 R^6 の各出現が、独立して、CN、ハロゲン、 OR^7 、 $N(R^{19})_2$ 、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族、6~10員アリアル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する5~10員ヘテロアリアル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1~5個のヘテロ原子を有する4~10員複素環、ならびに3~10員環状脂肪族から選択され、前記アリアル、ヘテロアリアル、複素環、及び環状脂肪族が任意に、1つ以上の R^c で置換され、
 R^7 の各出現が、独立して、水素、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族、及び6~10員アリアルから選択され、

の項目 1 に記載の化合物、または式 V I の薬学的に許容される塩。

(項目 6)

【化 1 7 9】



が、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 5 員または 6 員飽和、部分飽和、単環式環から選択される環である、項目 5 に記載の化合物。

(項目 7)

J が、直接結合、C₁ 脂肪族、及び C₂ 脂肪族から選択され、さらに前記脂肪族が任意に、1 つ以上の R^j で置換されるか、あるいは

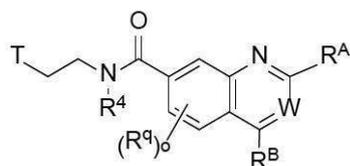
J が、C₁ 脂肪族及び C₂ 脂肪族から選択され、前記脂肪族が、1 つ以上の R^j で置換され、R^j のうちの 1 つ及び R のうちの 1 つが、それらが結合する前記原子と一緒にあって、3 ~ 6 員環状脂肪族環を形成するか、あるいは

J が、C₂ 脂肪族であり、前記脂肪族が、2 つ以上の R^j で置換され、2 つの R^j が、それらが結合する前記原子 (複数可)と一緒にあって、3 ~ 6 員環状脂肪族環を形成する、項目 1 に記載の化合物。

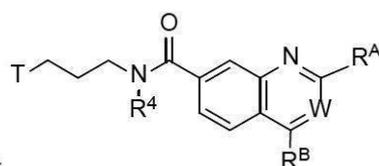
(項目 8)

項目 1 に記載の化合物、または式 X I V もしくは X V :

【化 1 8 0】



(XIV) もしくは



(XV)

または式 X I V もしくは X V の薬学的に許容される塩。

(項目 9)

T が、(CH₂)_s - 6 ~ 10 員アリアルであり、前記アリアルが任意に、1 つ以上の R^d で置換される、項目 1 に記載の化合物。

(項目 10)

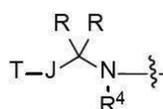
T が、窒素及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 9 員ヘテロアリアル環であり、前記環が任意に、1 つ以上の R^d で置換される、項目 1 に記載の化合物。

(項目 11)

T が、2 個の窒素ヘテロ原子を有する 5 員ヘテロアリアル環であり、前記環が任意に、1 つ以上の R^d で置換される、項目 10 に記載の化合物。

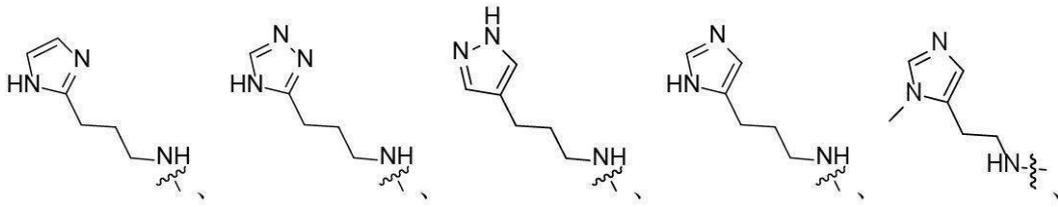
(項目 12)

【化 1 8 1】

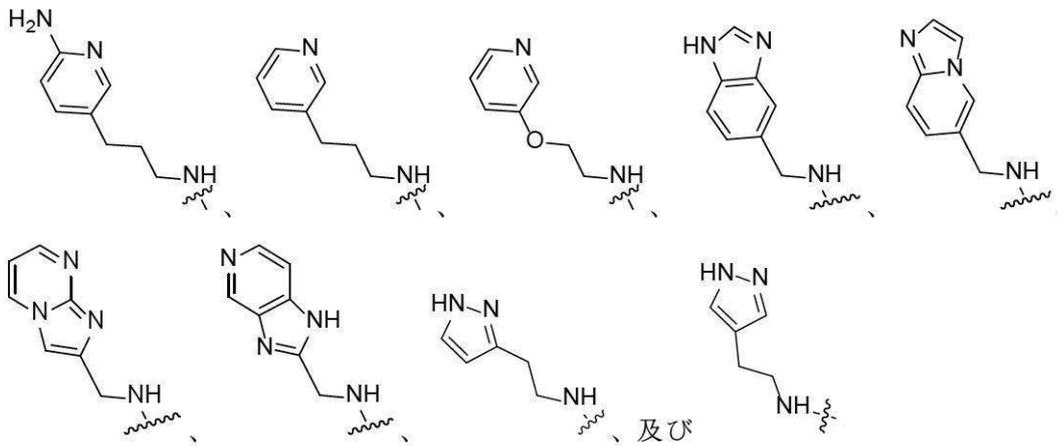


が、

【化 1 8 2】



【化 1 8 3】



から選択される、項目 1 に記載の化合物。

(項目 1 3)

表 1 の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

(項目 1 4)

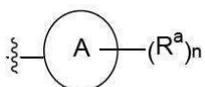
J が、直鎖 C₁₋₆ 脂肪族であり、J の 1 ~ 2 つのメチレン単位が、任意にかつ独立して、O、S、または N (R^{1 3}) で置き換えられ、

T が、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリアルであり、前記アリアル及びヘテロアリアルが任意に、1 つ以上の R^d で置換され、

R が、水素であり、

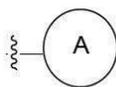
R^A が、

【化 1 8 4】



であり、

【化 1 8 5】



が、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 5 員または 6 員芳香族単環式環であり、

n が、0、1、2、または 3 であり、

R^a が、 $Z_1 - R^8$ であり、

Z_1 が、直接結合であり、

R^8 が、独立して、ハロゲン、 R^5 、及び OR^5 から選択され、

W が、 CH であり、

R^q が、水素であり、

R^{1A} が、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族であり、 C_{1-6} 脂肪族の 1 つまたは 2 つのメチレン単位が、任意にかつ独立して、 O 、 S 、または $N(R^{19})$ で置き換えられ、

前記 C_{1-6} 脂肪族が任意に、1 つ以上の R^k で置換され、

R^k の各出現が、独立して、直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族及び $Z_3 - R^{23}$ から選択され、

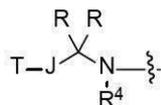
Z_3 の各出現が、独立して、直接結合及び C_{1-3} アルキレン鎖から選択され、

R^{23} の各出現が、独立して、 CN 、ハロゲン、 OR^{30} 、 SR^{30} 、 $N(R^{26})_2$ 、

及び直鎖もしくは分岐鎖 C_{1-6} 脂肪族から選択される、項目 2 に記載の式 III の化合物。

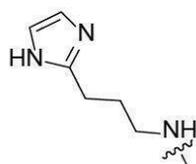
(項目 1 5)

【化 1 8 6】



が、

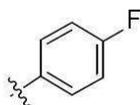
【化 1 8 7】



であり、

R^A が、

【化 1 8 8】

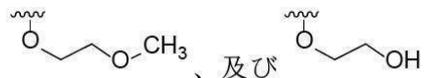


であり、

R^{1A} が、直鎖もしくは分岐鎖 C₁₋₆ 脂肪族であり、C₁₋₆ 脂肪族の 1 つまたは 2 つのメチレン単位が、任意にかつ独立して、O、S、または NH で置き換えられる、項目 14 に記載の式 I I I の化合物。

(項目 16)

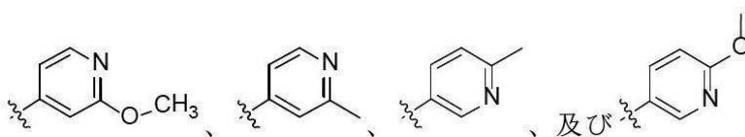
R^{1A} が、
【化 189】



から選択される、項目 15 に記載の化合物。

(項目 17)

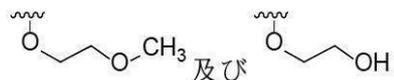
R^A が、
【化 190】



から選択され、

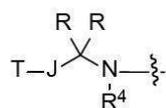
O R^{1A} が、

【化 191】



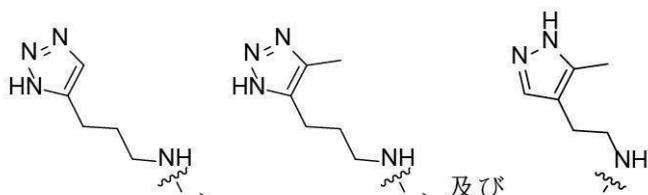
から選択され、

【化 192】



が、

【化 193】



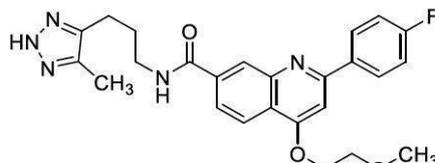
から選択される、項目 14 に記載の化合物。

(項目 18)

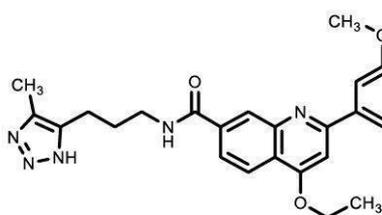
【化194】



I-5、



I-66、

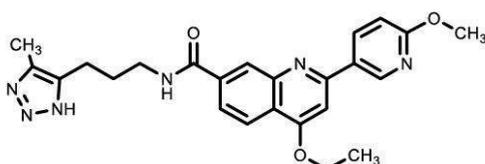


I-71、

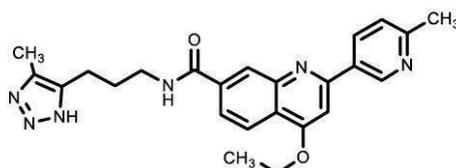


I-75、

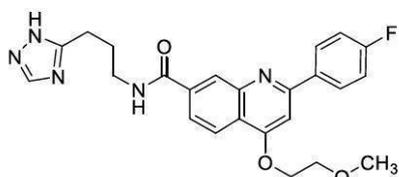
【化195】



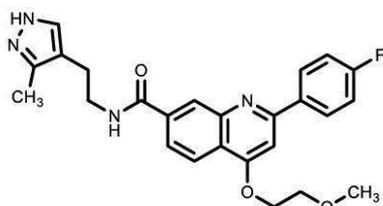
I-93、



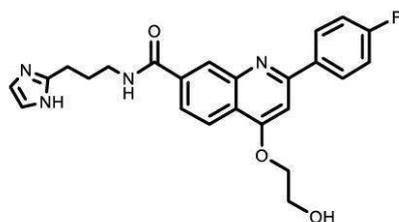
I-112、



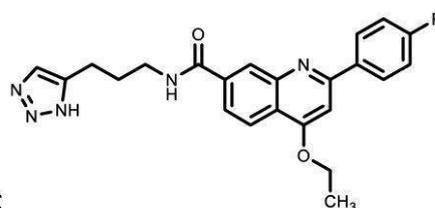
I-124、



I-126、



I-229、及び



I-115

から選択される、項目17に記載の化合物。

(項目19)

項目1～18のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される担体とを含む、薬学的組成物。

(項目20)

別の治療剤をさらに含む、項目19に記載の薬学的組成物。

(項目21)

対象における異常細胞成長を阻害する方法、または過剰増殖性障害を治療もしくは予防する方法であって、前記対象に、有効量の項目1～18のいずれか1項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を投与することを含む、前記方法。

(項目22)

対象における癌、炎症性状態、またはT細胞媒介性自己免疫疾患を治療もしくは予防する方法であって、前記対象に、有効量の項目1～18のいずれか1項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を投与することを含む、前記方法。

(項目23)

細胞中のニコチンアミドホスホリボシルトランスフェラーゼ(NAMPT)を阻害する

方法であって、前記細胞を、ある量の項目 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩と接触させることを含む、前記方法。

(項目 24)

N A M P T 活性によって媒介される疾患に罹患している対象を治療する方法であって、かかる治療を必要とする前記対象に、有効量の項目 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を投与することを含む、前記方法。

(項目 25)

対象における疾患の治療または予防用の薬剤の製造のための、項目 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩の使用であって、前記状態が、N A M P T 活性によって媒介される、前記使用。