

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成20年4月10日(2008.4.10)

【公表番号】特表2007-527902(P2007-527902A)

【公表日】平成19年10月4日(2007.10.4)

【年通号数】公開・登録公報2007-038

【出願番号】特願2007-502348(P2007-502348)

【国際特許分類】

|                |           |
|----------------|-----------|
| C 07 D 207/48  | (2006.01) |
| C 07 D 401/12  | (2006.01) |
| C 07 D 403/12  | (2006.01) |
| A 61 K 31/40   | (2006.01) |
| A 61 K 31/404  | (2006.01) |
| A 61 K 31/4439 | (2006.01) |
| A 61 P 1/04    | (2006.01) |
| A 61 P 9/04    | (2006.01) |
| A 61 P 9/10    | (2006.01) |
| A 61 P 9/14    | (2006.01) |
| A 61 P 11/00   | (2006.01) |
| A 61 P 11/02   | (2006.01) |
| A 61 P 11/06   | (2006.01) |
| A 61 P 13/08   | (2006.01) |
| A 61 P 15/00   | (2006.01) |
| A 61 P 17/00   | (2006.01) |
| A 61 P 17/06   | (2006.01) |
| A 61 P 19/02   | (2006.01) |
| A 61 P 19/06   | (2006.01) |
| A 61 P 25/00   | (2006.01) |
| A 61 P 25/16   | (2006.01) |
| A 61 P 25/28   | (2006.01) |
| A 61 P 29/00   | (2006.01) |
| A 61 P 31/18   | (2006.01) |
| A 61 P 35/00   | (2006.01) |
| A 61 P 35/02   | (2006.01) |
| A 61 P 35/04   | (2006.01) |
| A 61 P 37/04   | (2006.01) |
| A 61 P 43/00   | (2006.01) |

【F I】

|                |       |
|----------------|-------|
| C 07 D 207/48  | C S P |
| C 07 D 401/12  |       |
| C 07 D 403/12  |       |
| A 61 K 31/40   |       |
| A 61 K 31/404  |       |
| A 61 K 31/4439 |       |
| A 61 P 1/04    |       |
| A 61 P 9/04    |       |
| A 61 P 9/10    |       |
| A 61 P 9/14    |       |
| A 61 P 11/00   |       |

A 6 1 P 11/02  
 A 6 1 P 11/06  
 A 6 1 P 13/08  
 A 6 1 P 15/00  
 A 6 1 P 17/00  
 A 6 1 P 17/06  
 A 6 1 P 19/02  
 A 6 1 P 19/06  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 25/16  
 A 6 1 P 25/28  
 A 6 1 P 29/00 1 0 1  
 A 6 1 P 31/18  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 35/02  
 A 6 1 P 35/04  
 A 6 1 P 37/04  
 A 6 1 P 43/00 1 0 5  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

## 【手続補正書】

【提出日】平成20年2月15日(2008.2.15)

## 【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

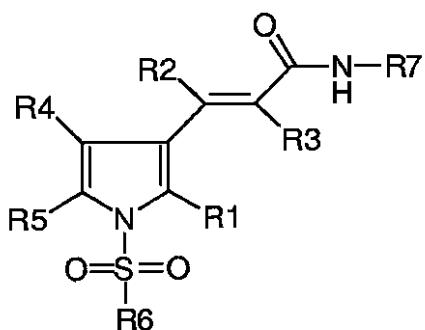
## 【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式 I

## 【化1】



(I)

[式中、

R 1 は、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキル、ハロゲン又はC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルコキシであり、  
 R 2 は、水素又はC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキルであり、  
 R 3 は、水素又はC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキルであり、  
 R 4 は、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキル、ハロゲン又はC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルコキシであり、  
 R 5 は、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキル、ハロゲン又はC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルコキシであり、  
 R 6 は、-T1-Q1であり、その際、

T 1 は、結合又は  $C_1 \sim C_4$  - アルキレンであり、

Q 1 は、A r 1、A a 1、H h 1 又は A h 1 であり、その際、

A r 1 は、フェニル又は、R 6 1 及び / 又は R 6 2 で置換されたフェニルであり、その際

、

R 6 1 は、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル又は - T 2 - N (R 6 1 1) R 6 1 2 であり、その際、

T 2 は、結合であり、かつ

R 6 1 1 は、水素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、ヒドロキシ -  $C_2 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ -  $C_2 \sim C_4$  - アルキル、フェニル -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル又は H a r 1 -  $C_1 \sim C_4$  - アルキルであり、その際、

H a r 1 は、R 6 1 1 1 及び / 又は R 6 1 1 2 によって置換されていてよく、かつ窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する単環式又は縮合二環式の 5 員ないし 10 員の不飽和の複素芳香環であり、その際、

R 6 1 1 1 は、ハロゲン又は  $C_1 \sim C_4$  - アルキルであり、

R 6 1 1 2 は、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルであり、かつ

R 6 1 2 は、水素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ -  $C_2 \sim C_4$  - アルキル又はヒドロキシ -  $C_2 \sim C_4$  - アルキルであるか、又は

R 6 1 1 及び R 6 1 2 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、複素環 H e t 1 を形成し、その際、

H e t 1 は、モルホリノ、チオモルホリノ、S - オキソ - チオモルホリノ、S, S - ジオキソ - チオモルホリノ、ピペリジノ、ピロリジノ、ピペラジノ又は 4 N - (  $C_1 \sim C_4$  - アルキル ) - ピペラジノであるか、又は

T 2 は、 $C_1 \sim C_4$  - アルキレン又は、酸素によって中断された  $C_2 \sim C_4$  - アルキレンであり、かつ

R 6 1 1 は、水素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、ヒドロキシ -  $C_2 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ -  $C_2 \sim C_4$  - アルキル、フェニル -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル又は H a r 1 -  $C_1 \sim C_4$  - アルキルであり、その際、

H a r 1 は、R 6 1 1 1 及び / 又は R 6 1 1 2 によって置換されていてよく、かつ窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する単環式又は縮合二環式の 5 員ないし 10 員の不飽和の複素芳香環であり、その際、

R 6 1 1 1 は、ハロゲン又は  $C_1 \sim C_4$  - アルキルであり、

R 6 1 1 2 は、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルであり、かつ

R 6 1 2 は、水素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ -  $C_2 \sim C_4$  - アルキル又はヒドロキシ -  $C_2 \sim C_4$  - アルキルであるか、又は

R 6 1 1 及び R 6 1 2 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、複素環 H e t 1 を形成し、その際、

H e t 1 は、モルホリノ、チオモルホリノ、S - オキソ - チオモルホリノ、S, S - ジオキソ - チオモルホリノ、ピペリジノ、ピロリジノ、ピペラジノ、4 N - (  $C_1 \sim C_4$  - アルキル ) - ピペラジノ、イミダゾロ、ピロロ又はピラゾロであり、

R 6 2 は、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルカルボニルアミノ又は  $C_1 \sim C_4$  - アルキルスルホニルアミノであり、

A a 1 は、2 個のアリール基から構成されるビスアリール基であり、これらのアリール基は、フェニル及びナフチルからなる群から無関係に選択され、かつ単結合を介して共に結合されており、

H h 1 は、2 個のヘテロアリール基から構成されるビスヘテロアリール基であり、これらのヘテロアリール基は、窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を有する単環式の 5 員又は 6 員のヘテロアリール基からなる群から無関係に選択され、かつ単結合を介して共に結合されており、

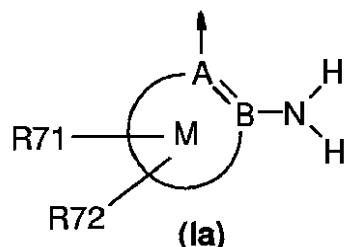
A h 1 は、ヘテロアリール基とアリール基とから構成されるヘテロアリール - アリール基又はアリール - ヘテロアリール基であり、ヘテロアリール基は、窒素、酸素及び硫黄から

なる群からそれぞれ選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を有する单環式の 5 員又は 6 員のヘテロアリール基からなる群から選択され、かつアリール基は、フェニル及びナフチルからなる群から選択され、その際、前記のヘテロアリール基とアリール基とは単結合を介して共に結合されており、

R 7 は、ヒドロキシル又は  $C_y c_1$  であり、その際、

$C_y c_1$  は、式 I a

【化 2】



で示される環系であり、その際、

A は、C (炭素) であり、

B は、C (炭素) であり、

R 7 1 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル又は  $C_1 \sim C_4$  - アルコキシであり、

R 7 2 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル又は  $C_1 \sim C_4$  - アルコキシであり、

M は、A 及び B を含んで、環 A r 2 又は環 H a r 2 であり、その際、

A r 2 は、ベンゼン環であり、

H a r 2 は、窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する单環式の 5 員又は 6 員の不飽和の複素芳香環である] で示される化合物及びこれらの化合物の塩。

【請求項 2】

式 I で示され、その式中、

R 1 は、水素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、ハロゲン又は  $C_1 \sim C_4$  - アルコキシであり、

R 2 は、水素又は  $C_1 \sim C_4$  - アルキルであり、

R 3 は、水素又は  $C_1 \sim C_4$  - アルキルであり、

R 4 は、水素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、ハロゲン又は  $C_1 \sim C_4$  - アルコキシであり、

R 5 は、水素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、ハロゲン又は  $C_1 \sim C_4$  - アルコキシであり、

R 6 は、- T 1 - Q 1 であり、その際、

T 1 は、結合又は  $C_1 \sim C_4$  - アルキレンであり、

Q 1 は、A r 1 、A a 1 、H h 1 又は A h 1 であり、その際、

A r 1 は、フェニル又は、R 6 1 及び / 又は R 6 2 で置換されたフェニルであり、その際、

、

R 6 1 は、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル又は - T 2 - N (R 6 1 1) R 6 1 2 であり、その際、

T 2 は、結合、 $C_1 \sim C_4$  - アルキレン又は、酸素によって中断された  $C_2 \sim C_4$  - アルキレンであり、

R 6 1 1 は、水素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、ヒドロキシ -  $C_2 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ -  $C_2 \sim C_4$  - アルキル、フェニル -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル又は H a r 1 -  $C_1 \sim C_4$  - アルキルであり、その際、

H a r 1 は、R 6 1 1 1 及び / 又は R 6 1 1 2 によって置換されていてよく、かつ窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する单環式又は縮合二環式の 5 員ないし 10 員の不飽和の複素芳香環であり、その際、

R 6 1 1 1 は、ハロゲン又は  $C_1 \sim C_4$  - アルキルであり、

R 6 1 1 2 は、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルであり、

R 6 1 2 は、水素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ -  $C_2 \sim C_4$  - アルキル又はヒドロキシ -  $C_2 \sim C_4$  - アルキルであり、

R 6 2 は、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルコキシ、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルコキシ-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキルカルボニルアミノ又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキルスルホニルアミノであり、

A a 1 は、2個のアリール基から構成されるビスアリール基であり、これらのアリール基は、フェニル及びナフチルからなる群から無関係に選択され、かつ単結合を介して共に結合されており、

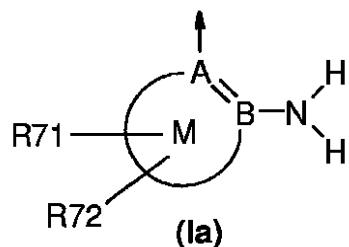
H h 1 は、2個のヘテロアリール基から構成されるビスヘテロアリール基であり、これらのヘテロアリール基は、窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される1又は2個のヘテロ原子を有する単環式の5員又は6員のヘテロアリール基からなる群から無関係に選択され、かつ単結合を介して共に結合されており、

A h 1 は、ヘテロアリール基とアリール基とから構成されるヘテロアリール-アリール基又はアリール-ヘテロアリール基であり、ヘテロアリール基は、窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される1又は2個のヘテロ原子を有する単環式の5員又は6員のヘテロアリール基からなる群から選択され、かつアリール基は、フェニル及びナフチルからなる群から選択され、その際、前記のヘテロアリール基とアリール基は、単結合を介して共に結合されており、

R 7 は、ヒドロキシル又はC<sub>y</sub>c 1 であり、その際、

C<sub>y</sub>c 1 は、式 I a

【化3】



で示される環系であり、その際、

A は、C(炭素)であり、

B は、C(炭素)であり、

R 7 1 は、水素、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルコキシであり、

R 7 2 は、水素、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルコキシであり、

M は、A及びBを含んで、環 A r 2 又は環 H a r 2 であり、その際、

A r 2 は、ベンゼン環であり、

H a r 2 は、窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される1～3個のヘテロ原子を有する単環式の5員又は6員の不飽和の複素芳香環である、請求項1記載の化合物及びこれらの化合物の塩。

【請求項3】

式 I で示され、その式中、

R 1 は、水素又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキルであり、

R 2 は、水素又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキルであり、

R 3 は、水素又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキルであり、

R 4 は、水素又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキルであり、

R 5 は、水素又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキルであり、

R 6 は、-T 1 -Q 1 であり、その際、

T 1 は、結合又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキレンであり、

Q 1 は、A r 1 、A a 1 、H h 1 又はA h 1 であり、その際、

A r 1 は、フェニル又は、R 6 1 で置換されたフェニルであり、その際、

R 6 1 は、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル又は-T 2 -N(R 6 1 1)R 6 1 2 であり、その際、

T 2 は、結合であり、

R 6 1 1 は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル、フェニル-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル又はH a r 1 - C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキルであり、その際、

H a r 1 は、

窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される1個、2個又は3個のヘテロ原子を有する単環式の5員の不飽和の複素芳香環、又は

1又は2個の窒素原子を有する単環式の6員の不飽和の複素芳香環、又は

窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される1個、2個又は3個のヘテロ原子を有する縮合二環式の9員の不飽和の複素芳香環、又は

窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される1又は2個のヘテロ原子を有する縮合二環式の10員の不飽和の複素芳香環

であり、かつ

R 6 1 2 は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル又はヒドロキシ-C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>-アルキルであるか、又は

R 6 1 1 及び R 6 1 2 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、複素環 H e t 1 を形成し、その際、

H e t 1 は、モルホリノであるか、又は

T 2 は、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキレンであり、

R 6 1 1 は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル、フェニル-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル又はH a r 1 - C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキルであり、その際、

H a r 1 は、

窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される1個、2個又は3個のヘテロ原子を有する単環式の5員の不飽和の複素芳香環、又は

1又は2個の窒素原子を有する単環式の6員の不飽和の複素芳香環、又は

窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される1個、2個又は3個のヘテロ原子を有する縮合二環式の9員の不飽和の複素芳香環、又は

窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される1又は2個のヘテロ原子を有する縮合二環式の10員の不飽和の複素芳香環

であり、かつ

R 6 1 2 は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル又はヒドロキシ-C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>-アルキルであるか、又は

R 6 1 1 及び R 6 1 2 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、複素環 H e t 1 を形成し、その際、

H e t 1 は、モルホリノであり、

A a 1 は、ビフェニル基であり、

H h 1 は、ビピリジル基、ピラゾリル-ピリジニル基、イミダゾリル-ピリジニル基又はピリジニル-チオフェニル基であり、

A h 1 は、ピリジニル-フェニル基、ピラゾリル-フェニル基又はイミダゾリル-フェニル基であり、

R 7 は、ヒドロキシル又は2-アミノフェニルである、請求項1記載の化合物及びこれらの化合物の塩。

#### 【請求項4】

式Iで示され、その式中、

R 1 は、水素であり、

R 2 は、水素であり、

R 3 は、水素であり、

R 4 は、水素であり、

R 5 は、水素であり、

R 6 は、-T 1 - Q 1 、A a 1 、H h 1 又はA h 1 であり、その際、

T 1 は、結合又はC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>-アルキレンであり、

Q 1 は、A r 1 であり、その際、

A r 1 は、フェニル又は、R 6 1 で置換されたフェニルであり、その際、

R 6 1 は、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル又は-T 2 - N (R 6 1 1) R 6 1 2 であり、その際、

T 2 は、結合であり、

R 6 1 1 は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル、フェニル-C<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>-アルキル又はH a r 1 - C<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>-アルキルであり、その際、

H a r 1 は、ピリジニル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾキサゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル又はインドリルであり、かつ

R 6 1 2 は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル又はヒドロキシ-C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>-アルキルであるか、又は

R 6 1 1 及びR 6 1 2 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、複素環H e t 1 を形成し、その際、

H e t 1 は、モルホリノであるか、又は

T 2 は、C<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>-アルキレンであり、

R 6 1 1 は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル、フェニル-C<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>-アルキル又はH a r 1 - C<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>-アルキルであり、その際、

H a r 1 は、ピリジニル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾキサゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル又はインドリルであり、かつ

R 6 1 2 は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル又はヒドロキシ-C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>-アルキルであるか、又は

R 6 1 1 及びR 6 1 2 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、複素環H e t 1 を形成し、その際、

H e t 1 は、モルホリノであり、

A a 1 は、ビフェニル基であり、

H h 1 は、ビピリジル基、ピラゾリル-ピリジニル基、イミダゾリル-ピリジニル基又はピリジニル-チオフェニル基であり、

A h 1 は、ピリジニル-フェニル基、ピラゾリル-フェニル基又はイミダゾリル-フェニル基であり、

R 7 は、ヒドロキシル又は2-アミノフェニルである、請求項1記載の化合物及びこれらの化合物の塩。

### 【請求項5】

式Iで示され、その式中、

R 1 は、水素であり、

R 2 は、水素であり、

R 3 は、水素であり、

R 4 は、水素であり、

R 5 は、水素であり、

R 6 は、-T 1 - Q 1 、A a 1 、H h 1 、A h 1 又はベンジルであり、その際、

T 1 は、結合であり、

Q 1 は、A r 1 であり、その際、

A r 1 は、フェニル又はR 6 1 で置換されたフェニルであり、その際、

R 6 1 は、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル又は-T 2 - N (R 6 1 1) R 6 1 2 であり、その際、

T 2 は、結合であり、

R 6 1 1 は、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキルであり、かつ

R 6 1 2 は、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキルであるか、又は

T 2 は、C<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>-アルキレンであり、

R 6 1 1 は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル、フェニル-C<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>-アルキル又はH a r 1 - C<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>-アルキルであり、その際、

H a r 1 は、ピリジニル又はインドリルであり、かつ

R 6 1 2 は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>-アルキル又はヒドロキシ-C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>-アルキルであるか、又は

R 611 及び R 612 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、複素環 H e t 1 を形成し、その際、

H e t 1 は、モルホリノであり、

A a 1 は、1, 1 - ビフェン - 4 - イル又は1, 1 - ビフェン - 3 - イルであり、

H h 1 は、ピリジニル - チオフェニル基であり、

A h 1 は、3 - (ピリジニル) - フェニル基、3 - (ピラゾリル) - フェニル基、4 - (ピリジニル) - フェニル基又は4 - (ピラゾリル - フェニル基であり、

R 7 は、ヒドロキシル又は2 - アミノフェニルである、請求項1記載の化合物及びこれらの化合物の塩。

【請求項6】

式Iで示され、その式中、

R 1 は、水素であり、

R 2 は、水素であり、

R 3 は、水素であり、

R 4 は、水素であり、

R 5 は、水素であり、

R 6 は、- T 1 - Q 1、A a 1、H h 1、A h 1 又はベンジルであり、その際、

T 1 は、結合であり、

Q 1 は、A r 1 であり、その際、

A r 1 は、フェニル、3 - (R 61) - フェニル又は4 - (R 61) - フェニルであり、その際、

R 61 は、メチル又は - T 2 - N (R 611) R 612 であり、その際、

T 2 は、結合であり、

R 611 は、メチルであり、かつ

R 612 は、メチルであるか、又は

T 2 は、メチレンであり、

R 611 は、水素、メチル、イソブチル、ベンジル、H a r 1 - メチル又は2 - (H a r 1) - エチルであり、その際、

H a r 1 は、ピリジニル又はインドリルであり、かつ

R 612 は、水素、メチル又は2 - ヒドロキシ - エチルであるか、又は

R 611 及び R 612 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、複素環 H e t 1 を形成し、その際、

H e t 1 は、モルホリノであり、

A a 1 は、1, 1 - ビフェン - 4 - イル又は1, 1 - ビフェン - 3 - イルであり、

H h 1 は、ピリジニル - チオフェニル基であり、

A h 1 は、3 - (ピリジニル) - フェニル基、3 - (ピラゾリル) - フェニル基、4 - (ピリジニル) - フェニル基又は4 - (ピラゾリル - フェニル基であり、

R 7 は、ヒドロキシル又は2 - アミノフェニルである、請求項1記載の化合物及びこれらの化合物の塩。

【請求項7】

式Iで示され、その式中、

R 1 は、水素であり、

R 2 は、水素であり、

R 3 は、水素であり、

R 4 は、水素であり、

R 5 は、水素であり、

R 6 は、- T 1 - Q 1、A a 1、H h 1、A h 1 又はベンジルであり、その際、

T 1 は、結合であり、

Q 1 は、A r 1 であり、その際、

A r 1 は、フェニル、3 - (R 61) - フェニル又は4 - (R 61) - フェニルであり、

その際、

R 6 1 は、メチル又は - T 2 - N ( R 6 1 1 ) R 6 1 2 であり、その際、

T 2 は、結合であり、

R 6 1 1 は、メチルであり、かつ

R 6 1 2 は、メチルであるか、又は

T 2 は、メチレンであり、

R 6 1 1 は、水素、メチル、イソブチル、ベンジル、H a r 1 - メチル又は 2 - ( H a r 1 ) - エチルであり、その際、

H a r 1 は、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、インドール - 2 - イル、インドール - 3 - イル又はインドール - 5 - イルであり、かつ

R 6 1 2 は、水素、メチル又は 2 - ヒドロキシ - エチルであるか、又は

R 6 1 1 及び R 6 1 2 は、一緒にになって、これらが結合される窒素原子を含んで、複素環 H e t 1 を形成し、その際、

H e t 1 は、モルホリノであり、

A a 1 は、1 , 1 - ビフェン - 4 - イル又は 1 , 1 - ビフェン - 3 - イルであり、

H h 1 は、5 - ( ピリジン - 2 - イル ) - チオフェン - 2 - イルであり、

A h 1 は、3 - ( ピリジン - 3 - イル ) - フェニル、3 - ( ピリジン - 4 - イル ) - フェニル、3 - ( ピラゾール - 1 - イル ) - フェニル、3 - ( 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - フェニル、4 - ( ピリジン - 3 - イル ) - フェニル、4 - ( ピリジン - 4 - イル ) - フェニル、4 - ( ピラゾール - 1 - イル ) - フェニル又は 4 - ( 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - フェニルであり、

R 7 は、ヒドロキシル又は 2 - アミノフェニルである、請求項 1 記載の化合物及びこれらの化合物の塩。

#### 【請求項 8】

式 I で示され、その式中、

R 1 は、水素であり、

R 2 は、水素であり、

R 3 は、水素であり、

R 4 は、水素であり、

R 5 は、水素であり、

R 6 は、 - T 1 - Q 1 、A a 1 、H h 1 、A h 1 又はベンジルであり、その際、

T 1 は、結合であり、

Q 1 は、A r 1 であり、その際、

A r 1 は、フェニル、3 - ( R 6 1 ) - フェニル又は 4 - ( R 6 1 ) - フェニルであり、その際、

R 6 1 は、メチル又は - T 2 - N ( R 6 1 1 ) R 6 1 2 であり、その際、

T 2 は、結合であり、

R 6 1 1 は、メチルであり、かつ

R 6 1 2 は、メチルであるか、又は

T 2 は、メチレンであり、

R 6 1 1 は、水素、イソブチル、ベンジル、H a r 1 - メチル又は 2 - ( H a r 1 ) - エチルであり、その際、

H a r 1 は、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、インドール - 2 - イル、インドール - 3 - イル又はインドール - 5 - イルであり、かつ

R 6 1 2 は、水素であるか、又は

T 2 は、メチレンであり、

R 6 1 1 は、メチル又は 2 - ( H a r 1 ) - エチルであり、その際、

H a r 1 は、インドール - 2 - イルであり、かつ

R 6 1 2 は、メチルであるか、又は

T 2 は、メチレンであり、

R 6 1 1 は、2 - ( H a r 1 ) - エチルであり、その際、

H a r 1 は、インドール - 2 - イルであり、かつ

R 6 1 2 は、2 - ヒドロキシ - エチルであるか、又は

T 2 は、メチレンであり、かつ

R 6 1 1 及び R 6 1 2 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、複素環 H e t 1 を形成し、その際、

H e t 1 は、モルホリノであり、

A a 1 は、1 , 1 - ビフェン - 4 - イル又は1 , 1 - ビフェン - 3 - イルであり、

H h 1 は、5 - ( ピリジン - 2 - イル ) - チオフェン - 2 - イルであり、

A h 1 は、3 - ( ピリジン - 3 - イル ) - フェニル、3 - ( ピリジン - 4 - イル ) - フェニル、3 - ( ピラゾール - 1 - イル ) - フェニル、3 - ( 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - フェニル、4 - ( ピリジン - 3 - イル ) - フェニル、4 - ( ピリジン - 4 - イル ) - フェニル、4 - ( ピラゾール - 1 - イル ) - フェニル又は4 - ( 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - フェニルであり、

R 7 は、ヒドロキシルである、請求項 1 記載の化合物及びこれらの化合物の塩。

【請求項 9】

式 I で示され、その式中、

R 1 は、水素であり、

R 2 は、水素であり、

R 3 は、水素であり、

R 4 は、水素であり、

R 5 は、水素であり、

R 6 は、- T 1 - Q 1 、A a 1 、H h 1 、A h 1 又はベンジルであり、その際、

T 1 は、結合であり、

Q 1 は、A r 1 であり、その際、

A r 1 は、フェニル、3 - ( R 6 1 ) - フェニル又は4 - ( R 6 1 ) - フェニルであり、その際、

R 6 1 は、メチル又は- T 2 - N ( R 6 1 1 ) R 6 1 2 であり、その際、

T 2 は、結合であり、

R 6 1 1 は、メチルであり、かつ

R 6 1 2 は、メチルであるか、又は

T 2 は、メチレンであり、

R 6 1 1 は、水素、イソブチル、ベンジル、H a r 1 - メチル又は2 - ( H a r 1 ) - エチルであり、その際、

H a r 1 は、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、インドール - 3 - イル又はインドール - 5 - イルであり、かつ

R 6 1 2 は、水素であるか、又は

T 2 は、メチレンであり、

R 6 1 1 は、メチル又は2 - ( H a r 1 ) - エチルであり、その際、

H a r 1 は、インドール - 2 - イルであり、かつ

R 6 1 2 は、メチルであるか、又は

T 2 は、メチレンであり、

R 6 1 1 は、2 - ( H a r 1 ) - エチルであり、その際、

H a r 1 は、インドール - 2 - イルであり、かつ

R 6 1 2 は、2 - ヒドロキシ - エチルであるか、又は

T 2 は、メチレンであり、かつ

R 6 1 1 及び R 6 1 2 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、複素環 H e t 1 を形成し、その際、

H e t 1 は、モルホリノであり、

A a 1 は、1 , 1 - ビフェン - 4 - イル又は1 , 1 - ビフェン - 3 - イルであり、

H h 1 は、 5 - ( ピリジン - 2 - イル ) - チオフェン - 2 - イルであり、  
 A h 1 は、 3 - ( ピリジン - 3 - イル ) - フェニル、 3 - ( ピリジン - 4 - イル ) - フェニル、 3 - ( ピラゾール - 1 - イル ) - フェニル、 3 - ( 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - フェニル、 4 - ( ピリジン - 3 - イル ) - フェニル、 4 - ( ピリジン - 4 - イル ) - フェニル、 4 - ( ピラゾール - 1 - イル ) - フェニル又は 4 - ( 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - フェニルであり、

R 7 は、 2 - アミノフェニルである、請求項 1 記載の化合物及びこれらの化合物の塩。

【請求項 1 0】

式 I で示され、その式中、

R 1 は、水素であり、

R 2 は、水素であり、

R 3 は、水素であり、

R 4 は、水素であり、

R 5 は、水素であり、

R 6 は、 - T 1 - Q 1 又はビフェニルであり、その際、

T 1 は、結合又は C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> - アルキレンであり、

Q 1 は、 A r 1 であり、その際、

A r 1 は、フェニル又は、R 6 1 で置換されたフェニルであり、その際、

R 6 1 は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキル又は - T 2 - N ( R 6 1 1 ) R 6 1 2 であり、その際、

T 2 は、結合又は C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> - アルキレンであり、

R 6 1 1 は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキル又は H a r 1 - C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> - アルキルであり、その際、

H a r 1 は、ベンゾイミダゾリル又はインドリルであり、

R 6 1 2 は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキルであり、

R 7 は、ヒドロキシル又は 2 - アミノフェニルである、請求項 1 記載の化合物及びこれらの化合物の塩。

【請求項 1 1】

式 I で示され、その式中、

R 1 は、水素であり、

R 2 は、水素であり、

R 3 は、水素であり、

R 4 は、水素であり、

R 5 は、水素であり、

R 6 は、 - T 1 - Q 1 、ビフェニル又はベンジルであり、その際、

T 1 は、結合であり、

Q 1 は、 A r 1 であり、その際、

A r 1 は、R 6 1 で置換されたフェニルであり、その際、

R 6 1 は、メチル、ジメチルアミノ又は - T 2 - N ( R 6 1 1 ) R 6 1 2 であり、その際

、

T 2 は、メチレンであり、

R 6 1 1 は、メチル又は 2 - ( インドール - 2 - イル ) エチルであり、

R 6 1 2 は、メチルであり、

R 7 は、ヒドロキシル又は 2 - アミノフェニルである、請求項 1 記載の化合物及びこれらの化合物の塩。

【請求項 1 2】

式 I で示され、以下の

1 . ( E ) - N - ヒドロキシ - 3 - [ 1 - ( トルエン - 4 - スルホニル ) - 1 - H - ピロール - 3 - イル ] - アクリルアミド

2 . N - ヒドロキシ - 3 - ( 1 - フェニルメタンスルホニル - 1 H - ピロール - 3 - イル ) - アクリルアミド

3 . ( E ) - 3 - [ 1 - ( ビフェニル - 4 - スルホニル ) - 1 H - ピロール - 3 - イ

ル] - N - ヒドロキシ - アクリルアミド

4 . ( E ) - 3 - [ 1 - ( 4 - ジメチルアミノ - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - ピロ

ール - 3 - イル ] - N - ヒドロキシ - アクリルアミド

5 . ( E ) - N - ( 2 - アミノ - フェニル ) - 3 - [ 1 - ( トルエン - 4 - スルホニル ) - 1 H - ピロール - 3 - イル ] - アクリルアミド

6 . ( E ) - N - ( 2 - アミノ - フェニル ) - 3 - ( 1 - フェニルメタンスルホニル - 1 H - ピロール - 3 - イル ] - アクリルアミド

7 . ( E ) - N - ( 2 - アミノ - フェニル ) - 3 - [ 1 - ( ビフェニル - 4 - スルホニル ) - 1 H - ピロール - 3 - イル ] - アクリルアミド

8 . ( E ) - N - ( 2 - アミノ - フェニル ) - 3 - [ 1 - ( 4 - ジメチルアミノ - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - ピロール - 3 - イル ] - アクリルアミド

9 . ( E ) - N - ヒドロキシ - 3 - ( 1 - [ 4 - ( ( 2 - ( 1 H - インドール - 2 - イル ) - エチル ) - メチル - アミノ ) - メチル ) - ベンゼンスルホニル ] - 1 H - ピロ

ール - 3 - イル ] - アクリルアミド

10 . ( E ) - 3 - [ 1 - ( 4 - ジメチルアミノメチル - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - ピロール - 3 - イル ] - N - ヒドロキシ - アクリルアミド

11 . ( E ) - N - ヒドロキシ - 3 - [ 1 - ( 4 - { [ ( ピリジン - 3 - イルメチル ) - アミノ ] - メチル } - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - ピロール - 3 - イル ] - アクリ

ルアミド

12 . ( E ) - N - ヒドロキシ - 3 - [ 1 - ( 4 - { [ ( 1 H - インドール - 3 - イルメチル ) - アミノ ] - メチル } - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - ピロール - 3 - イル ] - アクリルアミド

13 . ( E ) - 3 - { 1 - [ 4 - ( ベンジルアミノ - メチル ) - ベンゼンスルホニル ] - 1 H - ピロール - 3 - イル } - N - ヒドロキシ - アクリルアミド

14 . ( E ) - N - ヒドロキシ - 3 - { 1 - [ 4 - ( イソブチルアミノ - メチル ) - ベンゼンスルホニル ] - 1 H - ピロール - 3 - イル } - アクリルアミド

15 . ( E ) - N - ヒドロキシ - 3 - [ 1 - ( 4 - { [ ( 1 H - インドール - 5 - イルメチル ) - アミノ ] - メチル } - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - ピロール - 3 - イル ] - アクリルアミド

16 . ( E ) - N - ヒドロキシ - 3 - [ 1 - ( 4 - { [ ( ピリジン - 4 - イルメチル ) - アミノ ] - メチル } - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - ピロール - 3 - イル ] - アクリ

ルアミド

17 . ( E ) - 3 - [ 1 - ( 4 - アミノメチル - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - ピロ

ール - 3 - イル ] - N - ヒドロキシ - アクリルアミド

18 . ( E ) - N - ヒドロキシ - 3 - [ 1 - ( 4 - ピリジン - 4 - イル - ベンゼンス

ルホニル ) - 1 H - ピロール - 3 - イル ] - アクリルアミド

19 . ( E ) - N - ヒドロキシ - 3 - { 1 - [ 4 - ( 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - ベンゼンスルホニル ] - 1 H - ピロール - 3 - イル } - アクリルアミド

20 . ( E ) - N - ( 2 - アミノ - フェニル ) - 3 - [ 1 - ( 4 - ピリジン - 4 - イル - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - ピロール - 3 - イル ] - アクリルアミド

21 . ( E ) - N - ( 2 - アミノ - フェニル ) - 3 - [ 1 - ( 4 - ピリジン - 3 - イル - ベンゼンスルホニル ) - 1 H - ピロール - 3 - イル ] - アクリルアミド

22 . ( E ) - N - ( 2 - アミノ - フェニル ) - 3 - { 1 - [ 4 - ( 1 H - ピラゾ

ール - 4 - イル ) - ベンゼンスルホニル ] - 1 H - ピロール - 3 - イル } - アクリルアミド

23 . ( E ) - 3 - [ 1 - ( ビフェニル - 3 - スルホニル ) - 1 H - ピロール - 3 -

イル ] - N - ヒドロキシ - アクリルアミド

24 . ( E ) - N - ヒドロキシ - 3 - [ 1 - ( 5 - ピリジン - 2 - イル - チオフェン

- 2 - スルホニル ) - 1 H - ピロール - 3 - イル ] - アクリルアミド

25 . ( E ) - N - ヒドロキシ - 3 - [ 1 - ( 4 - ピラゾール - 1 - イル - ベンゼン

スルホニル ) - 1 H - ピロール - 3 - イル ] - アクリルアミド

26. (E) - N - (2-アミノ-フェニル) - 3 - [1 - (5-ピリジン-2-イル-チオフェン-2-スルホニル) - 1H - ピロール-3-イル] - アクリルアミド  
27. (E) - N - ヒドロキシ-3 - [1 - (4-モルホリン-4-イルメチル-ベンゼンスルホニル) - 1H - ピロール-3-イル] - アクリルアミド  
28. (E) - N - ヒドロキシ-3 - {1 - [4 - ({(2-ヒドロキシ-エチル) - [2 - (1H - インドール-2-イル) - エチル] - アミノ} - メチル) - ベンゼンスルホニル] - 1H - ピロール-3-イル} - アクリルアミド  
29. (E) - N - ヒドロキシ-3 - [1 - (3-ピリジン-4-イル-ベンゼンスルホニル) - 1H - ピロール-3-イル] - アクリルアミド  
30. (E) - N - (2-アミノ-フェニル) - 3 - [1 - (3-ピリジン-4-イル-ベンゼンスルホニル) - 1H - ピロール-3-イル] - アクリルアミド  
31. (E) - N - (2-アミノ-フェニル) - 3 - [1 - (3-ピリジン-3-イル-ベンゼンスルホニル) - 1H - ピロール-3-イル] - アクリルアミド  
32. (E) - N - ヒドロキシ-3 - {1 - [3 - (1H - ピラゾール-4-イル) - ベンゼンスルホニル] - 1H - ピロール-3-イル} - アクリルアミド、及び  
33. (E) - N - (2-アミノ-フェニル) - 3 - {1 - [3 - (1H - ピラゾール-4-イル) - ベンゼンスルホニル] - 1H - ピロール-3-イル} - アクリルアミドから選択される請求項1記載の化合物又はそれらの塩。

#### 【請求項13】

請求項1記載の1種以上の式Iの化合物と一緒に慣用の医薬品賦形剤及び/又はビヒクルを含有する良性新生物及び/又は悪性新生物、例えば癌を治療するための医薬組成物。

#### 【請求項14】

請求項1記載の1種以上の式Iの化合物と一緒に慣用の医薬品賦形剤及び/又はビヒクルを含有する非悪性の疾病、例えば関節症及び骨病理学的症状、全身性エリテマトーデス、リウマチ様関節炎、平滑筋細胞増殖、例えば血管増殖性疾患、アテローム性動脈硬化症及び再狭窄又は炎症症状を治療するための医薬組成物。

#### 【請求項15】

請求項1記載の式Iの化合物を、ヒストンデアセチラーゼ活性の阻害に反応性又は感受性の疾病の治療用の医薬組成物の製造のために用いる使用。

#### 【請求項16】

請求項1記載の式Iの化合物を、良性新生物及び/又は悪性新生物、例えば癌の治療用の医薬組成物の製造のために用いる使用。

#### 【請求項17】

請求項1記載の式Iの化合物を、悪性新生物とは異なる疾病、例えば関節症及び骨病理学的症状、全身性エリテマトーデス、リウマチ様関節炎、平滑筋細胞増殖、例えば血管増殖性疾患、アテローム性動脈硬化症及び再狭窄又は炎症症状の治療用の医薬組成物の製造のために用いる使用。