

【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24年6月21日(2012.6.21)

【公表番号】特表2011-524355(P2011-524355A)

【公表日】平成23年9月1日(2011.9.1)

【年通号数】公開・登録公報2011-035

【出願番号】特願2011-513603(P2011-513603)

【国際特許分類】

C 0 7 C 311/29 (2006.01)
A 6 1 P 17/00 (2006.01)
A 6 1 P 13/10 (2006.01)
A 6 1 P 1/18 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 27/02 (2006.01)
A 6 1 P 15/00 (2006.01)
A 6 1 P 19/00 (2006.01)
A 6 1 P 1/04 (2006.01)
A 6 1 P 35/02 (2006.01)
A 6 1 P 5/00 (2006.01)
A 6 1 P 21/00 (2006.01)
A 6 1 P 13/02 (2006.01)
A 6 1 P 1/16 (2006.01)
A 6 1 P 1/02 (2006.01)
A 6 1 P 11/00 (2006.01)
A 6 1 P 13/12 (2006.01)
A 6 1 K 31/18 (2006.01)
C 0 7 D 213/81 (2006.01)
A 6 1 K 31/44 (2006.01)
A 6 1 K 31/275 (2006.01)
A 6 1 K 31/495 (2006.01)
C 0 7 D 241/44 (2006.01)
A 6 1 K 31/498 (2006.01)
C 0 7 D 213/68 (2006.01)
C 0 7 D 213/89 (2006.01)
C 0 7 D 213/36 (2006.01)
A 6 1 K 31/5375 (2006.01)
C 0 7 D 277/64 (2006.01)
A 6 1 K 31/428 (2006.01)
C 0 7 D 211/34 (2006.01)
A 6 1 K 31/451 (2006.01)
C 0 7 D 241/20 (2006.01)
A 6 1 K 31/497 (2006.01)
C 0 7 D 207/08 (2006.01)
A 6 1 K 31/40 (2006.01)
C 0 7 D 277/28 (2006.01)
A 6 1 K 31/426 (2006.01)
C 0 7 D 277/62 (2006.01)
C 0 7 D 243/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/5513 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4545 (2006.01)
 C 0 7 D 209/30 (2006.01)
 A 6 1 K 31/404 (2006.01)
 C 0 7 D 231/40 (2006.01)
 A 6 1 K 31/415 (2006.01)
 C 0 7 D 231/56 (2006.01)
 A 6 1 K 31/416 (2006.01)
 C 0 7 C 311/47 (2006.01)
 C 0 7 C 323/37 (2006.01)
 C 0 7 C 323/22 (2006.01)
 C 0 7 C 317/14 (2006.01)
 C 0 7 C 323/63 (2006.01)
 C 0 7 C 317/50 (2006.01)
 C 0 7 C 311/46 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 311/29 C S P
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 13/10
 A 6 1 P 1/18
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 15/00
 A 6 1 P 19/00
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 5/00
 A 6 1 P 21/00
 A 6 1 P 13/02
 A 6 1 P 1/16
 A 6 1 P 1/02
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 K 31/18
 C 0 7 D 213/81
 A 6 1 K 31/44
 A 6 1 K 31/275
 A 6 1 K 31/495
 C 0 7 D 241/44
 A 6 1 K 31/498
 C 0 7 D 213/68
 C 0 7 D 213/89
 C 0 7 D 213/36
 A 6 1 K 31/5375
 C 0 7 D 277/64
 A 6 1 K 31/428
 C 0 7 D 211/34
 A 6 1 K 31/451
 C 0 7 D 241/20

A 6 1 K 31/497
 C 0 7 D 207/08
 A 6 1 K 31/40
 C 0 7 D 277/28
 A 6 1 K 31/426
 C 0 7 D 277/62
 C 0 7 D 243/14
 A 6 1 K 31/5513
 A 6 1 K 31/4545
 C 0 7 D 209/30
 A 6 1 K 31/404
 C 0 7 D 231/40
 A 6 1 K 31/415
 C 0 7 D 231/56
 A 6 1 K 31/416
 C 0 7 C 311/47
 C 0 7 C 323/37
 C 0 7 C 323/22
 C 0 7 C 317/14
 C 0 7 C 323/63
 C 0 7 C 317/50
 C 0 7 C 311/46

F

【手続補正書】

【提出日】平成24年4月26日(2012.4.26)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

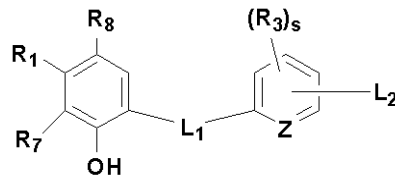
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物またはその塩：

【化1】



I

[式中、

L₁は、-SO₂N(R₂)-CH₂-であり；

L₂は、0～5個のR₆で置換されているC₃₋₁₀炭素環残基、0～5個のR₆で置換されているアール、0～5個のR₆で置換されているヘテロシクリル、-(CH₂)_n-N(R₄)-CO-(CH₂)₁-R₅、-(CH₂)_n-N(R₄)-CO-O-C₁₋₆アルキル、-CH₂-N(R₄)-SO₂-R₅、-CH₂-N(R₄)-CO-N(R₄)-R₅、-CO-N(R₄)-(CHR)_n-R₅、-CH₂-N(R₄)-CH₂-R₅、-O-R_{5a}、-CH₂-S-(CH₂)₁-R₅、-(CH₂)_n

- R_{5a} 、または $-CO-R_{5b}$ であり；

n は、0、1、2 または 3 であり；

l は、0、1、2 または 3 であり；

Z は、 CH 、 N または N -オキシドであり；

R は、それぞれ独立して、 H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキルおよび $-(CH_2)_r$ -アリーールから選択され；

R_1 は、水素、 F 、 Br 、 Cl 、 NO_2 、 CN 、 C_{1-6} アルキル、0~2 個の R_{1a} で置換されている $-(CHR)_r$ -アリーール、アルコキシ、0~2 個の R_{1a} で置換されているアリーールオキシ、または 0~2 個の R_{1a} で置換されているヘテロシクリルから選択され；

R_{1a} は、 H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 Cl 、 Br 、 F 、 NO_2 、 CN 、 $(CHR)_rOH$ 、 $(CHR)_rSH$ 、 $(CHR)_rOR_b$ 、 $(CHR)_rS(O)_pR_b$ 、 $(CHR)_rC(O)R_d$ 、 $(CHR)_rNR_aR_a$ 、 $(CHR)_rC(O)NR_aR_a$ 、 $(CHR)_rC(O)NR_aOR_b$ 、 $(CHR)_rNR_aC(O)R_d$ 、 $(CHR)_rNR_aC(O)OR_b$ 、 $(CHR)_rOC(O)NR_aR_a$ 、 $(CHR)_rC(O)OR_d$ 、 $(CHR)_rS(O)_pNR_aR_a$ 、 $(CHR)_rNR_aS(O)_pR_b$ 、または 0~5 個の R_e で置換されている $(CHR)_r-C_{3-6}$ 炭素環残基から選択され；

R_2 は、水素、 C_{1-9} アルキル、 C_{1-9} アルケニル、 C_{1-6} ハロアルキル、0~5 個の R_{2a} で置換されている $-(CH_2)_r$ -シクロアルキル、0~5 個の R_{2a} で置換されている $-(CH_2)_r$ アリーール、または 0~3 個の R_{2a} で置換されている $-(CH_2)_r$ -ヘテロシクロアルキルから選択され、

R_{2a} はそれぞれ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 $(CH_2)_rC_{3-6}$ シクロアルキル、 Cl 、 Br 、 F 、 NO_2 、 CN 、 $(CHR)_rOH$ 、 $(CHR)_rSH$ 、 $(CHR)_rOR_b$ 、 $(CHR)_rS(O)_pR_b$ 、 $(CHR)_rC(O)R_d$ 、 $(CHR)_rNR_aR_a$ 、 $(CHR)_rC(O)NR_aR_a$ 、 $(CHR)_rC(O)NR_aOR_b$ 、 $(CHR)_rNR_aC(O)R_d$ 、 $(CHR)_rNR_aC(O)OR_b$ 、 $(CHR)_rOC(O)NR_aR_a$ 、 $(CHR)_rC(O)OR_d$ 、 $(CHR)_rS(O)_pNR_aR_a$ 、 $(CHR)_rNR_aS(O)_pR_b$ 、または 0~5 個の R_e で置換されている $(CHR)_r-C_{3-10}$ 炭素環残基から選択され；

R_3 は、水素、 F 、 Br 、 Cl 、 C_{1-6} アルキル、 $(CHR)_r-C_{3-6}$ シクロアルキル、0~3 個の R_{3a} で置換されている $(CHR)_r$ -アリーール、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、0~3 個の R_{3a} で置換されている $-O-(CHR)_r$ -アリーール、または 0~2 個の R_{3a} で置換されているヘテロ環から選択され；

R_{3a} はそれぞれ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 $(CH_2)_rC_{3-6}$ シクロアルキル、 Cl 、 Br 、 F 、 NO_2 、 CN 、 $(CHR)_rOH$ 、 $(CHR)_rSH$ 、 $(CHR)_rOR_b$ 、 $(CHR)_rS(O)_pR_b$ 、 $(CHR)_rC(O)R_d$ 、 $(CHR)_rNR_aR_a$ 、 $(CHR)_rC(O)NR_aR_a$ 、 $(CHR)_rC(O)NR_aOR_b$ 、 $(CHR)_rNR_aC(O)R_d$ 、 $(CHR)_rNR_aC(O)OR_b$ 、 $(CHR)_rOC(O)NR_aR_a$ 、 $(CHR)_rC(O)OR_d$ 、 $(CHR)_rS(O)_pNR_aR_a$ 、 $(CHR)_rNR_aS(O)_pR_b$ 、または 0~5 個の R_e で置換されている $(CHR)_r-C_{3-6}$ 炭素環残基から選択され；

R_4 は、水素、0~3 個の R_e で置換されている C_{1-6} アルキル、 $(CHR)_r-C_{3-6}$ シクロアルキル、0~2 個の R_{4a} で置換されている $(CHR)_r$ -アリーール、または 0~2 個の R_{4a} で置換されている $(CHR)_r$ -ヘテロ環から選択され；

R_{4a} はそれぞれ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 $(CH_2)_rC_{3-6}$ シクロアルキル、 Cl 、 Br 、 F 、 NO_2 、 CN 、 $(CHR)_rOH$ 、 $(CHR)_rSH$ 、 $(CHR)_rOR_b$ 、 $(CHR)_rS(O)_pR_b$ 、 $(CHR)_r$

$C(O)R_d$ 、 $(CHR)_rNR_aR_a$ 、 $(CHR)_rC(O)NR_aR_a$ 、 $(CHR)_rC(O)NR_aOR_b$ 、 $(CHR)_rNR_aC(O)R_d$ 、 $(CHR)_rNR_aC(O)OR_b$ 、 $(CHR)_rOC(O)NR_aR_a$ 、 $(CHR)_rC(O)OR_d$ 、 $(CHR)_rS(O)_pNR_aR_a$ 、 $(CHR)_rNR_aS(O)_pR_b$ 、または0～5個の R_e で置換されている $(CHR)_r-C_{3-6}$ 炭素環残基から選択され；

R_5 は、0～3個の R_6 で置換されている C_{1-6} アルキル、0～5個の R_6 で置換されている C_{3-10} 炭素環残基、0～5個の R_6 で置換されているアリール、または0～5個の R_6 で置換されているヘテロシクリルから選択され；

R_{5a} は、0～5個の R_6 で置換されているアリールであり；

R_{5b} は、0～5個の R_6 で置換されているアリールまたは0～5個の R_6 で置換されているヘテロシクリルであり；

R_6 は、水素、H、F、Cl、Br、 OCF_3 、 CF_3 、CN、 NO_2 、=O、 N_3 、 $(CHR)_rOH$ 、 $(CHR)_rSH$ 、 $(CHR)_rOR_b$ 、 $(CHR)_rS(O)_pR_b$ 、 $(CHR)_rC(O)R_d$ 、 $(CHR)_rNR_aR_a$ 、 $(CHR)_rC(O)NR_aR_a$ 、 $(CHR)_rC(O)NR_aOR_b$ 、 $(CHR)_rNR_aC(O)R_d$ 、 $(CHR)_rNR_aC(O)OR_b$ 、 $(CHR)_rOC(O)NR_aR_a$ 、 $(CHR)_rNR_aC(O)NR_aR_a$ 、 $(CHR)_rC(O)OR_d$ 、 $(CHR)_rS(O)_pNR_aR_a$ 、 $(CHR)_rNR_aS(O)_pR_b$ 、 SO_2F または0～2個の R_e で置換されている C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、0～5個の R_e で置換されている $(CHR)_r-C_{3-6}$ 炭素環残基、または0～5個の R_e で置換されている $(CHR)_r$ -ヘテロシクリルから選択され；

R_a はそれぞれ独立して、H、0～2個の R_e で置換されている C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、0～2個の R_e で置換されている C_{3-6} アルケニル、0～2個の R_e で置換されている C_{3-6} アルキニル、0～5個の R_e で置換されている $(CH_2)_r-C_{3-10}$ 炭素環残基、または0～2個の R_e で置換されている $(CH_2)_r$ -ヘテロシクリルから選択され；

R_b はそれぞれ独立して、0～2個の R_e で置換されている C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、0～2個の R_e で置換されている C_{3-6} アルケニル、0～2個の R_e で置換されている C_{3-6} アルキニル、0～5個の R_e で置換されている $(CH_2)_r-C_{3-10}$ 炭素環残基、または0～2個の R_e で置換されている $(CH_2)_r$ -ヘテロシクリルから選択され；

R_d はそれぞれ独立して、H、0～2個の R_e で置換されている C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、0～2個の R_e で置換されている C_{3-6} アルケニル、0～2個の R_e で置換されている C_{3-6} アルキニル、0～5個の R_e で置換されている $(CH_2)_r-C_{3-10}$ 炭素環残基、または0～2個の R_e で置換されている $(CH_2)_r$ -ヘテロシクリルから選択され；

R_e はそれぞれ独立して、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 $(CH_2)_rC_{3-6}$ シクロアルキル、Cl、F、Br、CN、 NO_2 、 CO_2H 、 CO_2C_{1-5} アルキル、 $(CF_2)_rCF_3$ 、 $(CH_2)_rOC_{1-5}$ アルキル、OH、SH、 $(CH_2)_rSC_{1-5}$ アルキル、 $(CH_2)_rNR_fR_f$ 、または $(CH_2)_r$ フェニルから選択され；

R_f はそれぞれ独立して、H、 C_{1-5} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、またはフェニルから選択され；

R_7 は、F、Cl、 CF_3 、 $C(O)NR_aR_a$ 、または $C(O)OR_b$ から選択され；

R_8 は、水素、F、Cl、 CF_3 、 $C(O)NR_aR_a$ 、または $C(O)OR_b$ から選択され；

pはそれぞれ独立して、0、1または2から選択され；

rはそれぞれ独立して、0、1、2、3または4から選択され；

sは、0、1または2から選択される]。

【請求項2】

R_1 が、水素、F、Br、Cl、 C_{1-6} アルキル、または0～2個の R_{1a} で置換されている $(CH_2)_r$ - フェニルから選択され；

R_2 が、水素、 C_{1-9} アルキル、 C_{1-9} アルケニル、0～5個の R_{2a} で置換されている $(CH_2)_r$ - シクロヘキシル、0～5個の R_{2a} で置換されている $(CH_2)_r$ - フェニル、または0～1個の R_{2a} で置換されているインドリニルから選択され；

R_{2a} がそれぞれ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 $(CH_2)_r C_{3-6}$ シクロアルキル、Cl、Br、F、 NO_2 、CN、 $(CHR)_r OH$ 、 $(CHR)_r OR_b$ 、 $(CHR)_r S(O)_p R_b$ 、または0～5個の R_e で置換されている $(CHR)_r - C_{3-6}$ 炭素環残基から選択される、

請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R_3 が、水素、F、Br、Cl、0～3個の R_{3a} で置換されている $(CH_2)_r$ - フェニル、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、または0～3個の R_{3a} で置換されている $-O(CH_2)_r$ - フェニルから選択され；

R_{3a} がそれぞれ、 C_{1-6} アルキル、 $(CH_2)_r C_{3-6}$ シクロアルキル、 CF_3 、Cl、Br、F、 NO_2 、またはCNから選択され；

R_4 が、水素、0～1個の R_e で置換されている C_{1-6} アルキル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、0～2個の R_{4e} で置換されている $(CH_2)_r$ - フェニル、または0～2個の R_{4a} で置換されている $(CHR)_r$ - ヘテロ環から選択され；

R_{4a} がそれぞれ、 C_{1-6} アルキル、 $(CH_2)_r C_{3-6}$ シクロアルキル、Cl、Br、F、 NO_2 、CN、 $(CH_2)_r S(O)_p R_b$ 、 $(CHR)_r C(O)R_d$ 、または0～5個の R_e で置換されている $(CHR)_r - C_{3-6}$ 炭素環残基から選択される、

、

請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

R_1 が、水素であり；

R_2 が、水素、 C_{1-9} アルキル、0～5個の R_{2a} で置換されている $(CH_2)_r$ - シクロヘキシル、0～2個の R_{2a} で置換されている $(CH_2)_r$ - フェニル、またはインドリニルから選択され；

R_{2a} がそれぞれ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-2} ハロアルキル、Cl、Br、F、 NO_2 、CN、 $(CH_2)_r OH$ 、 $(CH_2)_r OR_b$ 、 $(CH_2)_r S(O)_p R_b$ 、または0～2個の R_e で置換されている $(CHR)_r - C_{3-6}$ 炭素環残基から選択される、請求項1から3のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項5】

R_3 が、水素、F、Br、Cl、0～1個の R_{3a} で置換されている $(CH_2)_r$ - フェニル、または0～1個の R_{3a} で置換されている $-O(CH_2)_r$ - フェニルから選択され；

R_4 が、水素、 C_{1-6} アルキル、または0～2個の R_{4e} で置換されている $(CH_2)_r$ - フェニルから選択され；

R_{4a} がそれぞれ、 C_{1-6} アルキル、Cl、Br、F、 NO_2 、CN、 $(CH_2)_r S(O)_p R_b$ 、 $(CHR)_r C(O)R_d$ 、または0～5個の R_e で置換されている $(CHR)_r - C_{3-6}$ 炭素環残基から選択される、

請求項1から4のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項6】

R_5 が、0～3個の R_6 で置換されている C_{1-6} アルキル、0～3個の R_6 で置換されているシクロプロピル、0～3個の R_6 で置換されているアリール（ここで、前記アリールは、フェニルまたはナフチルから選択される）、または0～3個の R_6 で置換されているヘテロシクリル（ここで、前記ヘテロシクリルは、ピロリジニル、ピペリジニル、モ

ルホリニル、ピリジニル、ピリジニルN - オキシド、ピペラジニル、チアゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾジアゼピノニル、インドリルまたはキノキサリン - ジオニルから選択される) から選択され;

R_{5a} が、0 ~ 3 個の R_6 で置換されているフェニルまたは0 ~ 3 個の R_6 で置換されているナフチルであり;

R_{5b} が、0 ~ 3 個の R_6 で置換されているフェニルまたは0 ~ 3 個の R_6 で置換されているヘテロシクリル(ここで、前記ヘテロシクリルは、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニルまたはピロリジニルから選択される) である、
請求項1から5のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項7】

R_6 が、水素、F、Cl、Br、OCF₃、CF₃、CN、NO₂、=O、N₃、(CHR)_rOH、(CH₂)_rOR_b、(CH₂)_rS(O)_pR_b、(CH₂)_rC(O)R_d、(CH₂)_rNR_aR_a、(CH₂)_rC(O)NR_aR_a、(CH₂)_rNR_aC(O)R_d、(CH₂)_rNR_aC(O)OR_b、(CH₂)_rOC(O)NR_aR_a、(CH₂)_rNR_aC(O)NR_aR_a、(CH₂)_rC(O)OR_d、(CH₂)_rS(O)_pNR_aR_a、(CH₂)_rNR_aS(O)_pR_b、SO₂F、あるいは0 ~ 2 個の R_e で置換されているC₁ ~ 6 アルキル、0 ~ 5 個の R_e で置換されている(CHR)_r-C₃ ~ 6 炭素環残基(ここで、前記炭素環残基は、フェニルまたはシクロヘキシルから選択される)、または0 ~ 5 個の R_e で置換されている(CHR)_r-ヘテロシクリル(ここで、前記ヘテロシクリルは、ピペリジニル、ピラジニルまたはピリジニル(pyridinyl)から選択される)から選択される、
請求項1から6のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項8】

R_6 が、水素、F、Cl、Br、OCF₃、CF₃、CN、NO₂、=O、N₃、(CHR)_rOH、(CH₂)_rOR_b、S(O)_pR_b、NR_aR_a、NR_aC(O)NR_aR_a、C(O)OR_d、S(O)_pNR_aR_a、SO₂F、あるいは0 ~ 2 個の R_e で置換されているC₁ ~ 6 アルキル(ここで、アルキルは、メチル、エチル、プロピル、i-プロピルまたはt-ブチルから選択される)、0 ~ 5 個の R_e で置換されている(CHR)_r-C₃ ~ 6 炭素環残基(ここで、前記炭素環残基は、フェニルまたはシクロヘキシルから選択される)、または0 ~ 5 個の R_e で置換されている(CHR)_r-ヘテロシクリル(ここで、前記ヘテロシクリルは、ピペリジニル、ピラジニルまたはピリジニルから選択される)から選択される、
請求項1から7のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項9】

R_7 が、Cl、CF₃、C(O)NR_aR_a、またはC(O)OR_bから選択され;

R_8 が、水素、Cl、CF₃、C(O)NR_aR_a、またはC(O)OR_bから選択され;

R_a がそれぞれ独立して、H、0 ~ 2 個の R_e で置換されているC₁ ~ 6 アルキル、C₁ ~ 6 ハロアルキル、0 ~ 3 個の R_e で置換されている(CH₂)_r-C₃ ~ 6 炭素環残基(ここで、前記炭素環残基は、フェニルまたはシクロヘキシルから選択される)、(CH₂)_r-インドリル、または(CH₂)_r-ピラゾリルから選択され;

R_b がそれぞれ独立して、0 ~ 2 個の R_e で置換されているC₁ ~ 6 アルキル、CF₃、または0 ~ 3 個の R_e で置換されている(CH₂)_r-C₃ ~ 6 炭素環残基(ここで、前記炭素環残基はフェニルまたはシクロヘキシルから選択される)から選択され;

R_d がそれぞれ独立して、H、0 ~ 2 個の R_e で置換されているC₁ ~ 6 アルキル、CF₃、または0 ~ 3 個の R_e で置換されている(CH₂)_r-C₃ ~ 6 炭素環残基(ここで、前記炭素環残基はフェニルまたはシクロヘキシルから選択される)から選択され;

R_e がそれぞれ独立して、C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、(CH₂)_rC₃ ~ 6 シクロアルキル、Cl、F、Br、CN、NO₂、CO₂H、CO₂C₁ ~ 5 アルキル、(CF₂)_rCF₃、(CH₂)_rOC₁ ~ 5 アルキル、OH

、 SH 、 $(\text{CH}_2)_r\text{SC}_{1\sim 5}$ アルキル、 $(\text{CH}_2)_r\text{NR}_f\text{R}_f$ 、または $(\text{CH}_2)_r$ フェニルから選択される、
請求項1から8のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項10】

R_2 が、 $\text{C}_{1\sim 9}$ アルキル、0～5個の R_{2a} で置換されている $(\text{CH}_2)_r$ -シクロヘキシル、0～2個の R_{2a} で置換されている $(\text{CH}_2)_r$ -フェニル、またはインドリニルから選択される、請求項1から9のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項11】

請求項1から10のいずれか1つに記載の化合物もしくは薬学的に許容されるその塩、および薬学的に許容される担体を含む、癌を治療するための医薬組成物。

【請求項12】

該癌が、中皮腫、膀胱癌、膵臓癌、皮膚癌、頭頸部の癌、皮膚もしくは眼内黒色腫、卵巣癌、乳癌、子宮癌、ファロピウス管の癌、子宮内膜の癌、子宮頸部の癌、膣の癌、外陰部の癌、骨癌、卵巣癌、子宮頸癌、結腸癌、直腸癌、肛門領域の癌、胃癌、胃腸（胃、結腸直腸および十二指腸）の癌、慢性リンパ性白血病、食道癌、小腸の癌、内分泌系の癌、甲状腺の癌、副甲状腺の癌、副腎の癌、軟部組織の肉腫、尿道の癌、陰茎の癌、精巣癌、肝細胞癌（肝臓および胆管）、原発性もしくは続発性中枢神経系腫瘍、原発性もしくは続発性脳腫瘍、ホジキン病、慢性もしくは急性白血病、慢性骨髄性白血病、リンパ球性リンパ腫、リンパ芽球性白血病、濾胞性リンパ腫、T細胞もしくはB細胞由来のリンパ系悪性疾患、黒色腫、多発性骨髄腫、口腔癌、小細胞肺癌、腎臓および尿管の癌、腎細胞癌、腎盂の癌、中枢神経系の新生物、原発性中枢神経系リンパ腫、非ホジキンリンパ腫、脊髄軸腫瘍、脳幹神経膠腫、下垂体腺腫、副腎皮質癌、胆嚢癌、脾臓の癌、胆管癌、線維肉腫、神経芽細胞腫、網膜芽細胞腫、またはこれらの組合せから選択される、請求項11に記載の医薬組成物。

【請求項13】

治療有効量の請求項1から10のいずれか1つに記載の化合物もしくは薬学的に許容されるその塩、および1種以上の抗癌剤もしくは細胞傷害性薬物を組み合わせて含有する、癌を治療するための剤であって、該抗癌剤もしくは細胞傷害性薬物を請求項1から10のいずれか1つに記載の化合物もしくは薬学的に許容されるその塩と同時に、連続的に、もしくは別々に投与することを特徴とし、ここで、該抗癌剤は17-エチニルエストラジオール、ジエチルスチルベストロール、テストステロン、プレドニゾン、フルオキシメステロン、プロピオン酸ドロモスタノロン、テストラクトン、酢酸メゲストロール、メチルプレドニゾン、メチルテストステロン、プレドニゾン、トリアムシノロン、クロロトリアニセン、ヒドロキシプロゲステロン、アミノグルテチミド、エストラムスチン、酢酸メドロキシプロゲステロン、ロイプロリド、フルタミド、トレミフェン、ゾラデックス；マトリックスメタロプロテイナーゼ阻害剤；VEGF阻害剤；パタラニブ、BAY-43-9006、SU11248、CP-547632およびCEP-7055；HER₁およびHER₂阻害剤；EGFR阻害剤；Eg5阻害剤；panHer阻害剤；Src阻害剤；Gleevec（登録商標）；Casodex（登録商標）、タモキシフェン；MEK-1キナーゼ阻害剤、MAPKキナーゼ阻害剤、PI3キナーゼ阻害剤；PDGF阻害剤；充実性腫瘍への血流を遮断することによって、癌細胞から栄養を剥奪して癌細胞を休止状態にする抗血管新生剤および抗血管剤；アンドロゲン依存性の癌を非増殖性にする去勢薬；非受容体型および受容体型チロシンキナーゼの阻害剤；インテグリンシグナル伝達阻害剤；微小管活性化剤；CDK阻害剤、抗増殖性の細胞周期阻害剤、エピドフィロトキシン、エトポシド、VM-26；抗悪性腫瘍性酵素；プロカルバジン；ミトキサントロン；白金配位錯体；生物学的応答調節剤；増殖阻害剤；抗ホルモン治療薬；ロイコボリン；テガフル；代謝拮抗剤；グルタミンアンタゴニスト；リボヌクレオチド還元酵素阻害剤；mTOR阻害剤；および造血成長因子からなる群から選択され、該細胞傷害性薬物はシクロホスファミド、ドキシソルピシン、ダウノルピシン、ミトキサントロン、メルファラン、ヘキサメチルメラミン、チオテパ、シタラビン、イダトレキサート、トリメトレキサ

ート、ダカルバジン、L-アスパラギナーゼ、ピカルタミド、ロイプロリド、ピリドベンゾインドール誘導体、インターフェロンおよびインターロイキンからなる群から選択される、該剤。

【請求項14】

該癌が、中皮腫、膀胱癌、膵臓癌、皮膚癌、頭頸部の癌、皮膚もしくは眼内黒色腫、卵巣癌、乳癌、子宮癌、ファロピウス管の癌、子宮内膜の癌、子宮頸部の癌、膣の癌、外陰部の癌、骨癌、卵巣癌、子宮頸癌、結腸癌、直腸癌、肛門領域の癌、胃癌、胃腸（胃、結腸直腸および十二指腸）の癌、慢性リンパ性白血病、食道癌、小腸の癌、内分泌系の癌、甲状腺の癌、副甲状腺の癌、副腎の癌、軟部組織の肉腫、尿道の癌、陰茎の癌、精巣癌、肝細胞癌（肝臓および胆管）、原発性もしくは続発性中枢神経系腫瘍、原発性もしくは続発性脳腫瘍、ホジキン病、慢性もしくは急性白血病、慢性骨髄性白血病、リンパ球性リンパ腫、リンパ芽球性白血病、濾胞性リンパ腫、T細胞もしくはB細胞由来のリンパ系悪性疾患、黒色腫、多発性骨髄腫、口腔癌、小細胞肺癌、腎臓および尿管の癌、腎細胞癌、腎盂の癌、中枢神経系の新生物、原発性中枢神経系リンパ腫、非ホジキンリンパ腫、脊髄軸腫瘍、脳幹神経膠腫、下垂体腺腫、副腎皮質癌、胆嚢癌、脾臓の癌、胆管癌、線維肉腫、神経芽細胞腫、網膜芽細胞腫、またはこれらの組合せから選択される、請求項13に記載の剤。

【請求項15】

癌を治療するための医薬品の製造における、請求項1から10のいずれか1つに記載の化合物の使用。