

【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22年6月17日(2010.6.17)

【公表番号】特表2009-534458(P2009-534458A)

【公表日】平成21年9月24日(2009.9.24)

【年通号数】公開・登録公報2009-038

【出願番号】特願2009-507166(P2009-507166)

【国際特許分類】

C 07 D 239/48 (2006.01)  
C 07 D 239/94 (2006.01)  
C 07 D 239/42 (2006.01)  
C 07 D 401/12 (2006.01)  
C 07 D 401/10 (2006.01)  
C 07 D 403/10 (2006.01)  
C 07 D 403/04 (2006.01)  
C 07 D 409/04 (2006.01)  
C 07 D 405/04 (2006.01)  
C 07 D 401/04 (2006.01)  
C 07 D 473/34 (2006.01)  
C 07 D 413/10 (2006.01)  
C 07 D 409/10 (2006.01)  
C 07 D 405/10 (2006.01)  
A 61 K 31/517 (2006.01)  
A 61 K 31/505 (2006.01)  
A 61 K 31/5377 (2006.01)  
A 61 K 31/506 (2006.01)  
A 61 K 31/52 (2006.01)  
A 61 P 43/00 (2006.01)  
A 61 P 35/00 (2006.01)  
A 61 P 17/00 (2006.01)  
A 61 P 17/06 (2006.01)  
A 61 P 17/12 (2006.01)  
A 61 P 9/00 (2006.01)  
A 61 P 29/00 (2006.01)  
A 61 P 9/04 (2006.01)  
A 61 P 27/02 (2006.01)  
A 61 P 19/08 (2006.01)  
A 61 P 9/10 (2006.01)  
A 61 P 9/08 (2006.01)  
A 61 P 35/02 (2006.01)  
A 61 P 3/04 (2006.01)  
A 61 P 19/02 (2006.01)  
A 61 P 19/06 (2006.01)  
A 61 P 25/28 (2006.01)  
A 61 P 1/04 (2006.01)  
A 61 P 31/06 (2006.01)  
A 61 P 21/00 (2006.01)  
A 61 P 31/04 (2006.01)  
A 61 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P	33/06	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	31/16	(2006.01)
A 6 1 P	7/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/18	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	29/02	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
C 1 2 N	9/99	(2006.01)
C 1 2 N	15/09	(2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 D	239/48	C S P
C 0 7 D	239/94	Z N A
C 0 7 D	239/42	Z
C 0 7 D	401/12	
C 0 7 D	401/10	
C 0 7 D	403/10	
C 0 7 D	403/04	
C 0 7 D	409/04	
C 0 7 D	405/04	
C 0 7 D	401/04	
C 0 7 D	473/34	3 2 1
C 0 7 D	413/10	
C 0 7 D	409/10	
C 0 7 D	405/10	
A 6 1 K	31/517	
A 6 1 K	31/505	
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	31/506	
A 6 1 K	31/52	
A 6 1 P	43/00	1 2 3
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	17/12	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	9/04	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	43/00	1 0 5
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	19/08	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	9/08	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	19/06	

A 6 1 P 25/28  
A 6 1 P 1/04  
A 6 1 P 31/06  
A 6 1 P 21/00  
A 6 1 P 31/04  
A 6 1 P 11/00  
A 6 1 P 33/06  
A 6 1 P 37/06  
A 6 1 P 31/16  
A 6 1 P 7/00  
A 6 1 P 31/18  
A 6 1 P 17/02  
A 6 1 P 29/02  
A 6 1 P 11/06  
A 6 1 P 13/12  
C 1 2 N 9/99  
C 1 2 N 15/00 A

## 【手続補正書】

【提出日】平成22年4月23日(2010.4.23)

## 【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

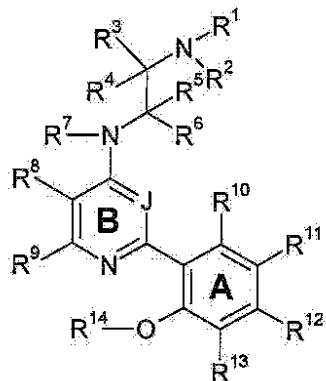
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

以下の式の化合物、ならびに医薬として許容し得るその塩、溶媒和物および水和物から選択される、化合物：

## 【化1】



(式中、

Jは、独立に、NまたはCHであり；そして

(1)R^8およびR^9の各々は、独立に、-Hまたは環B置換基であり；あるいは

(2)R^8およびR^9は、それらが結合した原子と一緒にになって、ちょうど5個の環原子またはちょうど6個の環原子を有する芳香族環Cを形成し、各環原子は、炭素環原子または窒素環原子であり、環Cは、ちょうど0個、ちょうど1個またはちょうど2個の窒素原子を有し、環Cは、環Bと縮合しており；そして

(1)R^10、R^11、R^12およびR^13の各々は、独立に、-Hまたは環A置換基であり；あるいは

(2)R^12およびR^13の各々は、独立に、-Hまたは環A置換基であり；R^10およびR^11は、それ

らが結合した原子と一緒にになって、ちょうど6個の環原子を有する芳香族環Dを形成し、各環原子は、炭素環原子であり、環Dは、環Aと縮合しており；あるいは

(3)R<sup>10</sup>およびR<sup>13</sup>の各々は、独立に、-Hまたは環A置換基であり；R<sup>11</sup>およびR<sup>12</sup>は、それらが結合した原子と一緒にになって、ちょうど6個の環原子を有する芳香族環Eを形成し、各環原子は、炭素環原子であり、環Eは、環Aと縮合しており；あるいは

(4)R<sup>10</sup>およびR<sup>11</sup>の各々は、独立に、-Hまたは環A置換基であり；R<sup>12</sup>およびR<sup>13</sup>は、それらが結合した原子と一緒にになって、ちょうど6個の環原子を有する芳香族環Fを形成し、各環原子は、炭素環原子であり、環Fは、環Aと縮合しており；そして

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>およびR<sup>7</sup>の各々は、独立に、-Hまたは基Gであり；さらに、

R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>の各々は、基Yであってもよく；

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>7</sup>の各々は、基Zであってもよく；

R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は、一緒にになって、基=Oを形成してもよく；

R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>は、一緒にになって、基=Oを形成してもよく；

R<sup>14</sup>は、独立に、-Hまたは基Wであり；

各環A置換基は、存在する場合には、独立に、1°炭素置換基(1° carbo-substituent)または1°ヘテロ置換基であり；

各環B置換基は、存在する場合には、独立に、1°炭素置換基または1°ヘテロ置換基であり；

基Wは、存在する場合には、独立に、1°炭素置換基であり；

各基Gは、存在する場合には、独立に、1°炭素置換基であり；

各基Yは、存在する場合には、独立に、1°ヘテロ置換基であり；

各基Zは、存在する場合には、独立に、(H-10)、(H-12)、(H-13)および(H-18)から選択される1°ヘテロ置換基であり；ここで、

各1°炭素置換基は、独立に、

(C-1)C<sub>1</sub>~<sub>7</sub>アルキル、

(C-2)C<sub>2</sub>~<sub>7</sub>アルケニル、

(C-3)C<sub>2</sub>~<sub>7</sub>アルキニル、

(C-4)C<sub>3</sub>~<sub>7</sub>シクロアルキル、

(C-5)C<sub>3</sub>~<sub>7</sub>シクロアルケニル、

(C-6)C<sub>3</sub>~<sub>14</sub>ヘテロシクリル、

(C-7)C<sub>6</sub>~<sub>14</sub>カルボアリール、

(C-8)C<sub>5</sub>~<sub>14</sub>ヘテロアリール、

(C-9)C<sub>6</sub>~<sub>14</sub>カルボアリール-C<sub>1</sub>~<sub>7</sub>アルキル、および

(C-10)C<sub>5</sub>~<sub>14</sub>ヘテロアリール-C<sub>1</sub>~<sub>7</sub>アルキル

から選択され、ここで、

各C<sub>1</sub>~<sub>7</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~<sub>7</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~<sub>7</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~<sub>7</sub>シクロアルキルおよびC<sub>3</sub>~<sub>7</sub>シクロアルケニルは、独立に、置換されていないか、または1°ヘテロ置換基から選択される1つもしくは複数の置換基で置換されており；

各C<sub>3</sub>~<sub>14</sub>ヘテロシクリル、C<sub>6</sub>~<sub>14</sub>カルボアリールおよびC<sub>5</sub>~<sub>14</sub>ヘテロアリールは、独立に、置換されていないか、または1°ヘテロ置換基および2°炭素置換基から選択される1つもしくは複数の置換基で置換されており；そして

各2°炭素置換基は、独立に、

各C<sub>1</sub>~<sub>7</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~<sub>7</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~<sub>7</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~<sub>7</sub>シクロアルキルおよびC<sub>3</sub>~<sub>7</sub>シクロアルケニルは、独立に、置換されていないか、または2°ヘテロ置換基から選択される1つもしくは複数の置換基で置換されており、

各C<sub>3</sub>~<sub>14</sub>ヘテロシクリル、C<sub>6</sub>~<sub>14</sub>カルボアリールおよびC<sub>5</sub>~<sub>14</sub>ヘテロアリールは、独立に、置換されていないか、または2°ヘテロ置換基および3°炭素置換基から選択される1つもしくは複数の置換基で置換されている

という点を除いて、1°炭素置換基について定義した通りであり；

各3°炭素置換基は、独立に、

各C<sub>1</sub>～<sub>7</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～<sub>7</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～<sub>7</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>～<sub>7</sub>シクロアルキルおよびC<sub>3</sub>～<sub>7</sub>シクロアルケニルは置換されておらず；

各C<sub>3</sub>～<sub>14</sub>ヘテロシクリル、C<sub>6</sub>～<sub>14</sub>カルボアリールおよびC<sub>5</sub>～<sub>14</sub>ヘテロアリールは置換されていない

という点を除いて、1°炭素置換基について定義した通りであり；

各1°ヘテロ置換基は、独立に、

(H-1)-F、-Cl、-Br、-I；

(H-2)-OH；

(H-3)-OR<sup>A1</sup>(R<sup>A1</sup>は、独立に、2°炭素置換基である)；

(H-4)-SH；

(H-5)-SR<sup>A2</sup>(R<sup>A2</sup>は、独立に、2°炭素置換基である)；

(H-6)-NH<sub>2</sub>、-NHR<sup>A3</sup>、-NR<sup>A4</sup>R<sup>A5</sup>(R<sup>A3</sup>、R<sup>A4</sup>およびR<sup>A5</sup>の各々は、独立に、2°炭素置換基であり；あるいはR<sup>A4</sup>およびR<sup>A5</sup>は、それらが結合した窒素原子と一緒にになって、3～7個の環原子を有する環を形成する)；

(H-7)-NHC(=O)R<sup>A6</sup>、-NR<sup>A7</sup>C(=O)R<sup>A6</sup>(R<sup>A6</sup>およびR<sup>A7</sup>の各々は、独立に、2°炭素置換基である)；

(H-8)-NHC(=O)OR<sup>A9</sup>、-NR<sup>A10</sup>C(=O)OR<sup>A9</sup>(R<sup>A9</sup>およびR<sup>A10</sup>の各々は、独立に、2°炭素置換基である)；

(H-9)-NHC(=O)NH<sub>2</sub>、-NR<sup>A10</sup>C(=O)NH<sub>2</sub>、-NHC(=O)NHR<sup>A11</sup>、-NR<sup>A10</sup>C(=O)NHR<sup>A11</sup>、-NHC(=O)NR<sup>A11</sup>R<sup>A12</sup>、-NR<sup>A10</sup>C(=O)NHR<sup>A11</sup>R<sup>A12</sup>(R<sup>A10</sup>、R<sup>A11</sup>およびR<sup>A12</sup>の各々は、独立に、2°炭素置換基であり；あるいはR<sup>A11</sup>およびR<sup>A12</sup>は、それらが結合した窒素原子と一緒にになって、3～7個の環原子を有する環を形成する)；

(H-10)-C(=O)R<sup>A13</sup>(R<sup>A13</sup>は、独立に、2°炭素置換基である)；

(H-11)-C(=O)OH；

(H-12)-C(=O)OR<sup>A14</sup>(R<sup>A14</sup>は、独立に、2°炭素置換基である)；

(H-13)-C(=O)NH<sub>2</sub>、-C(=O)NHR<sup>A15</sup>、-C(=O)NR<sup>A15</sup>R<sup>A16</sup>(R<sup>A15</sup>およびR<sup>A16</sup>の各々は、独立に、2°炭素置換基であり；あるいはR<sup>A15</sup>およびR<sup>A16</sup>は、それらが結合した窒素原子と一緒にになって、3～7個の環原子を有する環を形成する)；

(H-14)-OC(=O)R<sup>A17</sup>(R<sup>A17</sup>は、独立に、2°炭素置換基である)；

(H-15)-OC(=O)NH<sub>2</sub>、-OC(=O)NHR<sup>A18</sup>、-OC(=O)NR<sup>A18</sup>R<sup>A19</sup>(R<sup>A18</sup>およびR<sup>A19</sup>の各々は、独立に、2°炭素置換基であり；あるいは、R<sup>A18</sup>およびR<sup>A19</sup>は、それらが結合した窒素原子と一緒にになって、3～7個の環原子を有する環を形成する)；

(H-16)-S(=O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-S(=O)<sub>2</sub>NHR<sup>A20</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>A20</sup>R<sup>A21</sup>(R<sup>A20</sup>およびR<sup>A21</sup>の各々は、独立に、2°炭素置換基であり；あるいは、R<sup>A20</sup>およびR<sup>A21</sup>は、それらが結合した窒素原子と一緒にになって、3～7個の環原子を有する環を形成する)；

(H-17)-NHS(=O)<sub>2</sub>R<sup>A22</sup>、-NR<sup>A23</sup>S(=O)<sub>2</sub>R<sup>A22</sup>(R<sup>A22</sup>およびR<sup>A23</sup>の各々は、独立に、2°炭素置換基である)；

(H-18)-S(=O)<sub>2</sub>R<sup>A24</sup>(R<sup>A24</sup>は、独立に、2°炭素置換基である)；

(H-19)-S(=O)<sub>2</sub>OH；

(H-20)-S(=O)<sub>2</sub>OR<sup>A25</sup>、-OS(=O)<sub>2</sub>R<sup>A26</sup>(R<sup>A25</sup>およびR<sup>A26</sup>の各々は、独立に、2°炭素置換基である)；

(H-21)-NO<sub>2</sub>

から選択され；

各2°ヘテロ置換基は、独立に、各2°炭素置換基が3°炭素置換基である点を除いて、1°ヘテロ置換基について定義した通りであり；

但し、該化合物は、

(A1)2-{7-クロロ-4-[イソプロピル-(2-イソプロピルアミノ-エチル)-アミノ]-キナゾリン-2-イル}-フェノール；

(A2)2-{7-メチル-4-[イソプロピル-(2-イソプロピルアミノ-エチル)-アミノ]-キナゾリン-2-イル}-フェノール；

(A3)2-[6-フルオロ-4-[イソプロピル-(2-イソプロピルアミノ-エチル)-アミノ]-キナゾリン-2-イル]-フェノール；  
 (A4)2-{4-[(2-ジメチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-キナゾリン-2-イル}-フェノール(XX-110)；  
 (A5)2-{4-[ベンジル-(2-ジメチルアミノ-エチル)-アミノ]-キナゾリン-2-イル}-フェノール(XX-111)；  
 (A6)2-{4-[メチル-(2-メチルアミノ-エチル)-アミノ]-キナゾリン-2-イル}-フェノール(XX-113)；  
 (B1)2-[4-(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-キナゾリン-2-イル]-6-メトキシ-フェノール；  
 (B2)2-[4-(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-キナゾリン-2-イル]-フェノール；  
 (B3)2-{4-[2-(2-アミノ-エチルアミノ)-エチルアミノ]-キナゾリン-2-イル}-フェノール；  
 (B4)2-[4-(2-アミノ-エチルアミノ)-キナゾリン-2-イル]-フェノール(XX-100)；  
 (C1)2-{4-[2-(2-アミノ-エチルアミノ)-エチルアミノ]-6-メチル-ピリミジン-2-イル}-フェノール；  
 (C2)2-[4-(2-アミノ-エチルアミノ)-6-メチル-ピリミジン-2-イル]-フェノール；  
 (D1)N'-[2-(2,6-ジメトキシ-フェニル)-キノリン-4-イル]-N,N-ジメチル-エタン-1,2-ジアミン；または  
 (E1)N'-[2-(2,6-ジメトキシ-フェニル)-キノリン-4-イル]-N,N-ジメチル-エタン-1,2-ジアミンビス(ヒドロプロミド)  
 ではない)。

**【請求項2】**

Jが、独立に、Nである、請求項1に記載の化合物。

**【請求項3】**

Jが、独立に、CHである、請求項1に記載の化合物。

**【請求項4】**

R<sup>8</sup>およびR<sup>9</sup>の各々が、独立に、-Hまたは環B置換基である、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項5】**

各環B置換基が、存在する場合には、独立に、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-O-C<sub>1～7</sub>アルキル、-O-C<sub>1～7</sub>ハロアルキル、-S-C<sub>1～7</sub>アルキル、-NH<sub>2</sub>、-NH-C<sub>1～7</sub>アルキル、-N(C<sub>1～7</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-C(=O)OH、-C(=O)O-C<sub>1～7</sub>アルキル、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-OC(=O)-C<sub>1～7</sub>アルキル、-NO<sub>2</sub>、C<sub>1～7</sub>アルキル、-C<sub>1～7</sub>ハロアルキル、-CH<sub>2</sub>-Ph、-Ph、および-Ph-C<sub>1～7</sub>ハロアルキルから選択される、請求項4に記載の化合物。

**【請求項6】**

R<sup>8</sup>およびR<sup>9</sup>の各々が、独立に、-H、-F、-Cl、-Br、-I、C<sub>1～7</sub>アルキル、ピラゾールまたはフェニルから選択され；各ピラゾールおよびフェニルは、存在する場合には、例えば-F、-Cl、-Br、-I、-OH、C<sub>1～7</sub>アルキルおよび-O-C<sub>1～4</sub>アルキルから選択される1つまたは複数の置換基で場合により置換されている、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項7】**

R<sup>8</sup>が、独立に、-H、-F、-Cl、-Br、-I、C<sub>1～7</sub>アルキル、ピラゾールまたはフェニルから選択され；各ピラゾールおよびフェニルは、存在する場合には、例えば-F、-Cl、-Br、-I、-OH、C<sub>1～7</sub>アルキルおよび-O-C<sub>1～4</sub>アルキルから選択される1つまたは複数の置換基で場合により置換されており；

R<sup>9</sup>が、独立に、-HおよびC<sub>1～4</sub>アルキルから選択される、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項8】**

R<sup>8</sup>およびR<sup>9</sup>の各々が、独立に、Hである、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項9】**

$R^8$ および $R^9$ が、それらが結合した原子と一緒にになって、ちょうど6個の環原子を有する芳香族環Cを形成し、各環原子は、炭素環原子であり、環Cは、環Bと縮合しており、環Cが、独立に、置換されていないか、または1つもしくは複数の環C置換基で置換されており、各環C置換基は、存在する場合には、独立に、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-O-C<sub>1~7</sub>アルキル、-O-C<sub>1~7</sub>ハロアルキル、-S-C<sub>1~7</sub>アルキル、-NH<sub>2</sub>、-NH-C<sub>1~7</sub>アルキル、-N(C<sub>1~7</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-C(=O)OH、-C(=O)O-C<sub>1~7</sub>アルキル、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-OC(=O)-C<sub>1~7</sub>アルキル、-NO<sub>2</sub>、C<sub>1~7</sub>アルキル、-C<sub>1~7</sub>ハロアルキル、-CH<sub>2</sub>-Ph、-Ph、および-Ph-C<sub>1~7</sub>ハロアルキルから選択される、請求項1~3のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項10】

環Cが、置換されていない、請求項9に記載の化合物。

## 【請求項11】

$R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ および $R^{13}$ の各々が、独立に、-Hまたは環A置換基である、請求項1~10のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項12】

$R^{10}$ 、 $R^{12}$ および $R^{13}$ の各々が、独立に、-Hであり、 $R^{11}$ が、独立に、環A置換基である、請求項1~10のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項13】

各環A置換基が、存在する場合には、独立に、

-F、-Cl、-Br、-I、

-R<sup>D1</sup>、

-CF<sub>3</sub>、

-OH、

-L<sup>1</sup>-OH、

-OR<sup>D1</sup>、

-L<sup>1</sup>-OR<sup>D1</sup>、

-OCF<sub>3</sub>、

-SH、

-SR<sup>D1</sup>、

-SCF<sub>3</sub>、

-CN、

-NO<sub>2</sub>、

-NH<sub>2</sub>、-NHR<sup>D1</sup>、-NR<sup>D1</sup><sub>2</sub>、-NR<sup>N1</sup>R<sup>N2</sup>、

-L<sup>1</sup>-NH<sub>2</sub>、-L<sup>1</sup>-NHR<sup>D1</sup>、-L<sup>1</sup>-NR<sup>D1</sup><sub>2</sub>、-L<sup>1</sup>-NR<sup>N1</sup>R<sup>N2</sup>、

-C(=O)OH、

-C(=O)OR<sup>D1</sup>、

-C(=O)NH<sub>2</sub>、-C(=O)NHR<sup>D1</sup>、-C(=O)NR<sup>D1</sup><sub>2</sub>、-C(=O)NR<sup>N1</sup>R<sup>N2</sup>、

-NHC(=O)R<sup>D1</sup>、-NR<sup>D1</sup>C(=O)R<sup>D1</sup>、

-OC(=O)R<sup>D1</sup>、

-C(=O)R<sup>D</sup>、

-NHS(=O)<sub>2</sub>R<sup>D1</sup>、-NR<sup>D1</sup>S(=O)<sub>2</sub>R<sup>D1</sup>、

-S(=O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-S(=O)<sub>2</sub>NHR<sup>D1</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>D1</sup><sub>2</sub>、-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>N1</sup>R<sup>N2</sup>、

-S(=O)<sub>2</sub>R<sup>D1</sup>、

-OS(=O)<sub>2</sub>R<sup>D1</sup>、または

-S(=O)<sub>2</sub>OR<sup>D1</sup>であり、

さらに、2つの隣接する環A置換基は、存在する場合には、一緒にになって基-O-L<sup>2</sup>-O-を形成してもよく；ここで、

各-L<sup>1</sup>-は、独立に、飽和脂肪族C<sub>2~5</sub>アルキレンであり；

各-L<sup>2</sup>-は、独立に、飽和脂肪族C<sub>1~3</sub>アルキレンであり；

各基-NR<sup>N1</sup>R<sup>N2</sup>において、R<sup>N1</sup>およびR<sup>N2</sup>は、それらが結合した窒素原子と一緒にになって、ちょうど1個の環ヘテロ原子またはちょうど2個の環ヘテロ原子を有する5、6または7員の

非芳香族環を形成し、前記ちょうど2個の環ヘテロ原子の一方がNであり、前記ちょうど2個の環ヘテロ原子の他方が、独立に、NまたはOである；

各R<sup>E1</sup>は、独立に、

-R<sup>E1</sup>、 -R<sup>E2</sup>、 -R<sup>E3</sup>、 -R<sup>E4</sup>、 -R<sup>E5</sup>、 -R<sup>E6</sup>、 -R<sup>E7</sup>、 -R<sup>E8</sup>、  
-L<sup>3</sup>-R<sup>E4</sup>、 -L<sup>3</sup>-R<sup>E5</sup>、 -L<sup>3</sup>-R<sup>E6</sup>、 -L<sup>3</sup>-R<sup>E7</sup>または-L<sup>3</sup>-R<sup>E8</sup>であり；ここで、

各-R<sup>E1</sup>は、独立に、飽和脂肪族C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルであり；

各-R<sup>E2</sup>は、独立に、脂肪族C<sub>2</sub>～<sub>6</sub>アルケニルであり；

各-R<sup>E3</sup>は、独立に、脂肪族C<sub>2</sub>～<sub>6</sub>アルキニルであり；

各-R<sup>E4</sup>は、独立に、飽和C<sub>3</sub>～<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

各-R<sup>E5</sup>は、独立に、C<sub>3</sub>～<sub>6</sub>シクロアルケニルであり；

各-R<sup>E6</sup>は、独立に、非芳香族C<sub>3</sub>～<sub>7</sub>ヘテロシクリルであり；

各-R<sup>E7</sup>は、独立に、C<sub>6</sub>～<sub>14</sub>カルボアリールであり；

各-R<sup>E8</sup>は、独立に、C<sub>5</sub>～<sub>14</sub>ヘテロアリールであり；

各-L<sup>3</sup>-は、独立に、飽和脂肪族C<sub>1</sub>～<sub>3</sub>アルキレンであり；ここで、

各C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>～<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～<sub>6</sub>シクロアルケニル、非芳香族C<sub>3</sub>～<sub>7</sub>ヘテロシクリル、C<sub>6</sub>～<sub>14</sub>カルボアリール、C<sub>5</sub>～<sub>14</sub>ヘテロアリールおよびC<sub>1</sub>～<sub>3</sub>アルキレンは、

-F、 -Cl、 -Br、 -I、

-R<sup>F1</sup>、

-CF<sub>3</sub>、

-OH、

-OR<sup>F1</sup>、

-OCF<sub>3</sub>、

-SH、

-SR<sup>F1</sup>、

-SCF<sub>3</sub>、

-CN、

-NO<sub>2</sub>、

-NH<sub>2</sub>、 -NHR<sup>F1</sup>、 -NR<sup>F1</sup><sub>2</sub>、 -NR<sup>N3</sup>R<sup>N4</sup>、

-C(O)OH、

-C(=O)OR<sup>F1</sup>、

-C(=O)NH<sub>2</sub>、 -C(=O)NHR<sup>F1</sup>、 -C(=O)NR<sup>F1</sup><sub>2</sub>、 -C(=O)NR<sup>N3</sup>R<sup>N4</sup>、

-L<sup>4</sup>-OH、 -L<sup>4</sup>-OR<sup>F1</sup>、

-L<sup>4</sup>-NH<sub>2</sub>、 -L<sup>4</sup>-NHR<sup>F1</sup>、 -L<sup>4</sup>-NR<sup>F1</sup><sub>2</sub>または-L<sup>4</sup>-NR<sup>N3</sup>R<sup>N4</sup>

から選択される1つまたは複数の置換基で場合により置換されており；ここで、

各-R<sup>F1</sup>は、独立に、飽和脂肪族C<sub>1</sub>～<sub>4</sub>アルキルであり；

各-L<sup>4</sup>-は、独立に、飽和脂肪族C<sub>2</sub>～<sub>5</sub>アルキレンであり；

各基-NR<sup>N3</sup>R<sup>N4</sup>において、R<sup>N3</sup>およびR<sup>N4</sup>は、それらが結合した窒素原子と一緒にになって、ちょうど1個の環ヘテロ原子またはちょうど2個の環ヘテロ原子を有する5、6または7員の非芳香族環を形成し、前記ちょうど2個の環ヘテロ原子の一方がNであり、前記ちょうど2個の環ヘテロ原子の他方が、独立に、NまたはOである、

請求項1～12のいずれか一項に記載の化合物。

#### 【請求項14】

各環A置換基が、存在する場合には、独立に、-F、 -Cl、 -Br、 -I、 -OH、 -O-C<sub>1</sub>～<sub>7</sub>アルキル、 -O-C<sub>1</sub>～<sub>7</sub>ハロアルキル、 -S-C<sub>1</sub>～<sub>7</sub>アルキル、 -NH<sub>2</sub>、 -NH-C<sub>1</sub>～<sub>7</sub>アルキル、 -N(C<sub>1</sub>～<sub>7</sub>アルキル)<sub>2</sub>、 -C(=O)OH、 -C(=O)O-C<sub>1</sub>～<sub>7</sub>アルキル、 -C(=O)NH<sub>2</sub>、 -OC(=O)-C<sub>1</sub>～<sub>7</sub>アルキル、 -NO<sub>2</sub>、 C<sub>1</sub>～<sub>7</sub>アルキル、 -C<sub>1</sub>～<sub>7</sub>ハロアルキル、 -CH<sub>2</sub>-Ph、 -Ph、 -Ph-C<sub>1</sub>～<sub>7</sub>ハロアルキルから選択される、請求項1～12のいずれか一項に記載の化合物。

#### 【請求項15】

R<sup>10</sup>、 R<sup>12</sup>およびR<sup>13</sup>の各々が、独立に、-Hであり、

$R^{11}$ が、独立に、-F、-Cl、-Br、-I、フェニル、ピラゾリルまたはピリジルであり；前記フェニル、ピラゾリルまたはピリジルは、-F、-Cl、-Br、-I、 $C_{1\sim 6}$ アルキル、-CF<sub>3</sub>、-OH、-O-C<sub>1\sim 6</sub>アルキルおよび-OCF<sub>3</sub>から独立に選択される1つまたは複数の置換基で場合により置換されている、請求項1～10のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項16】

$R^{10}$ 、 $R^{12}$ および $R^{13}$ の各々が、独立に、-Hであり、

$R^{11}$ が、独立に、ピラゾリルであり、前記ピラゾリルは、1つまたは複数の $C_{1\sim 6}$ アルキル基で場合により置換されている、請求項1～10のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項17】

基Wが、存在する場合には、独立に、-Me、-Et、-nPr、-iPr、-tBu、-Phおよび-CH<sub>2</sub>-Phから選択される、請求項1～16のいずれか一項に記載の化合物。

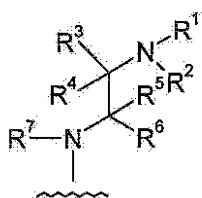
【請求項18】

$R^{14}$ が、独立に、-Hである、請求項1～17のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項19】

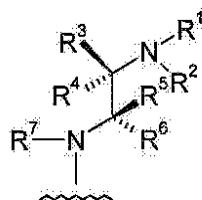
基：

【化2】



が、以下の基：

【化3】



である、請求項1～18のいずれか一項に記載の化合物。

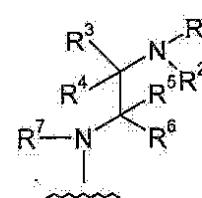
【請求項20】

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ および $R^7$ の各々が、独立に、-Hまたは基Gである、請求項1～19のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項21】

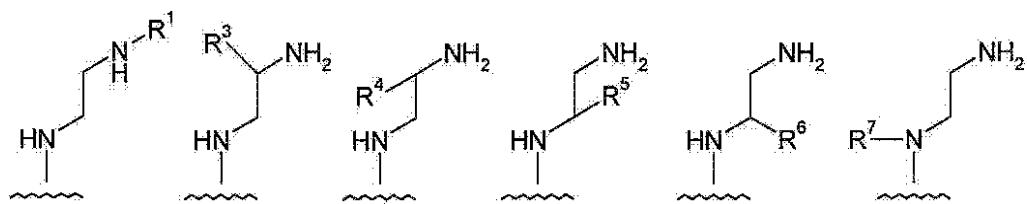
基：

【化4】



が、独立に、以下の基：

## 【化 5】

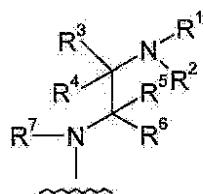


から選択される、請求項1～20のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 2 2】

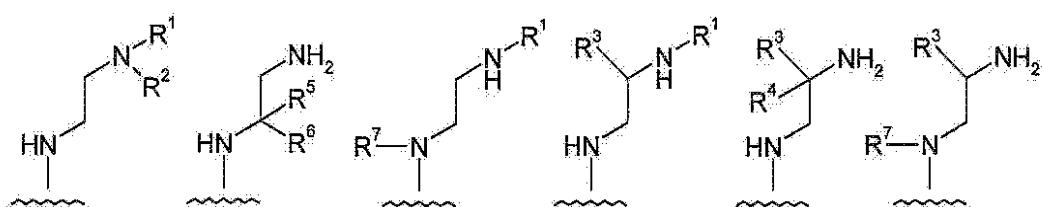
基：

## 【化 6】



が、独立に、以下の基：

## 【化 7】

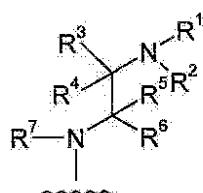


から選択される、請求項1～20のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 2 3】

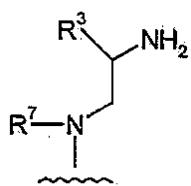
基：

## 【化 8】



が、以下の基：

## 【化 9】

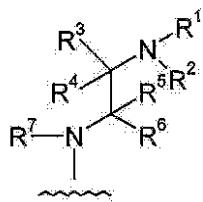


である、請求項1～20のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 2 4】

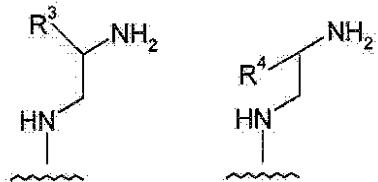
基：

## 【化10】



が、独立に、以下の基：

## 【化11】



から選択される、請求項1～20のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項25】

各基Gが、存在する場合には、独立に、C<sub>1</sub>～<sub>7</sub>アルキルであり、かつ、独立に、置換されていないか、または-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-OMe、-OCF<sub>3</sub>、-SMe、-NH<sub>2</sub>、-NHMe、-NMe<sub>2</sub>、-C(=O)OH、-C(=O)OMe、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-OC(=O)Me、-NO<sub>2</sub>、-Phおよび-Ph-CF<sub>3</sub>から選択される1つもしくは複数の置換基で置換されている、請求項1～24のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項26】

各基Gが、存在する場合には、独立に、C<sub>1</sub>～<sub>7</sub>アルキルであり、かつ置換されていない、請求項1～24のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項27】

各基Yが、存在する場合には、独立に、-C(=O)OH、-C(=O)OMe、-C(=O)OEt、-C(=O)OPh、-C(=O)OCH<sub>2</sub>Ph、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-C(=O)NHMe、-C(=O)NHEt、-C(=O)NMe<sub>2</sub>および-C(=O)NEt<sub>2</sub>から選択される、請求項1～26のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項28】

各基Zが、存在する場合には、独立に、-C(=O)Me、-C(=O)Et、-C(=O)OMe、-C(=O)OEt、-C(=O)OPh、-C(=O)OCH<sub>2</sub>Ph、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-C(=O)NHMe、-C(=O)NHEt、-C(=O)NMe<sub>2</sub>、-C(=O)NEt<sub>2</sub>、-S(=O)<sub>2</sub>Me、-S(=O)<sub>2</sub>Et、-S(=O)<sub>2</sub>Phおよび-S(=O)<sub>2</sub>Ph-Meから選択される、請求項1～27のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項29】

R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>の一方が、独立に、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>～<sub>6</sub>シクロアルキルであり；R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>の他方が、独立に、-Hであり；

R<sup>7</sup>が、独立に、-HまたはC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルであり；

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>の各々が、独立に、-Hである、請求項1～19のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項30】

R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>の一方が、独立に、C<sub>1</sub>～<sub>4</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>～<sub>4</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>の他方が、独立に、-Hであり；

R<sup>7</sup>が、独立に、-HまたはC<sub>1</sub>～<sub>4</sub>アルキルであり；

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>の各々が、独立に、-Hである、請求項1～19のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項31】

以下の化合物：化合物XX-001～XX-099、XX-101～XX-109、XX-112、XX114～XX-344およびYY-001～YY-003、ならびに医薬として許容し得るその塩、溶媒和物および水和物、から

選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項32】

請求項1～31のいずれか一項に記載の化合物および医薬として許容し得る担体または希釈剤を含む医薬組成物。

【請求項33】

請求項1～31のいずれか一項に記載の化合物と、医薬として許容し得る担体または希釈剤とを混合する工程を含む、医薬組成物の調製方法。

【請求項34】

治療法によりヒトまたは動物の体を処置する方法に使用するための、請求項1～31のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項35】

請求項1～31のいずれか一項に記載の化合物を含有する、増殖状態；癌；過剰増殖性皮膚疾患、乾癬、光線性角化症もしくは非黒色腫性皮膚癌；不適切な、過剰の、および/もしくは望ましくない血管形成を特徴とする疾患もしくは状態；炎症性疾患；または心臓リモデリング、心臓の筋細胞肥大、心臓の収縮障害、心臓のポンプ不全、病的心臓肥大および/もしくは心不全を伴う疾患もしくは障害に対する治療剤。

【請求項36】

増殖状態；癌；過剰増殖性皮膚疾患、乾癬、光線性角化症もしくは非黒色腫性皮膚癌；不適切な、過剰の、および/もしくは望ましくない血管形成を特徴とする疾患もしくは状態；炎症性疾患；または心臓リモデリング、心臓の筋細胞肥大、心臓の収縮障害、心臓のポンプ不全、病的心臓肥大および/もしくは心不全を伴う疾患もしくは障害の治療のための医薬の製造における、請求項1～31のいずれか一項に記載の化合物の使用。