

【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28年8月18日(2016.8.18)

【公表番号】特表2015-522036(P2015-522036A)

【公表日】平成27年8月3日(2015.8.3)

【年通号数】公開・登録公報2015-049

【出願番号】特願2015-520627(P2015-520627)

【国際特許分類】

C 07 D 205/04	(2006.01)
C 07 D 401/10	(2006.01)
C 07 D 403/10	(2006.01)
C 07 D 403/14	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)
C 07 D 401/04	(2006.01)
C 07 D 405/04	(2006.01)
C 07 D 211/26	(2006.01)
C 07 D 487/04	(2006.01)
C 07 D 405/14	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
A 61 K 31/454	(2006.01)
A 61 K 31/4178	(2006.01)
A 61 K 31/397	(2006.01)
A 61 K 31/451	(2006.01)
A 61 K 31/55	(2006.01)
A 61 K 31/4545	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 K 31/4525	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
A 61 K 31/437	(2006.01)
A 61 K 31/4155	(2006.01)
A 61 P 31/12	(2006.01)
A 61 P 31/14	(2006.01)
A 61 P 1/16	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 15/08	(2006.01)
A 61 P 1/18	(2006.01)
A 61 P 1/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 205/04	
C 07 D 401/10	C S P
C 07 D 403/10	
C 07 D 403/14	
C 07 D 471/04	1 0 1
C 07 D 471/04	1 0 8 X
C 07 D 401/04	
C 07 D 405/04	
C 07 D 471/04	1 0 6 A
C 07 D 211/26	

C 0 7 D	487/04	1 5 0
C 0 7 D	471/04	1 0 7 K
C 0 7 D	405/14	
C 0 7 D	401/14	
A 6 1 K	31/454	
A 6 1 K	31/4178	
A 6 1 K	31/397	
A 6 1 K	31/451	
A 6 1 K	31/55	
A 6 1 K	31/4545	
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	31/4525	
A 6 1 K	31/496	
A 6 1 K	31/437	
A 6 1 K	31/4155	
A 6 1 P	31/12	
A 6 1 P	31/14	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	15/08	
A 6 1 P	1/18	
A 6 1 P	1/00	

【手続補正書】

【提出日】平成28年6月30日(2016.6.30)

【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

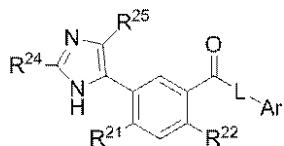
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

構造I I Iを有する化合物であり：

【化901】

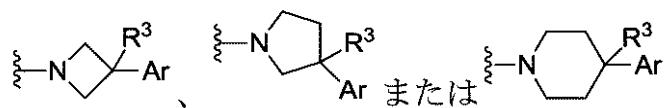


I I I

ここで、

L-Arは、

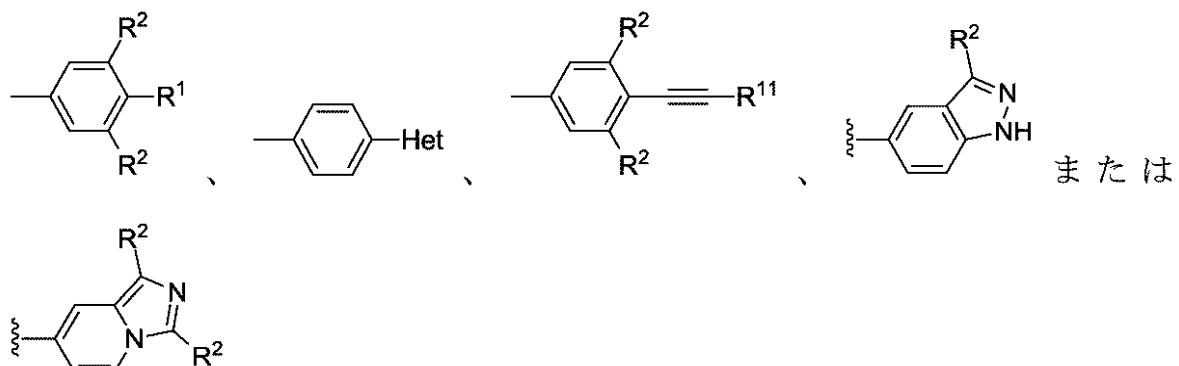
【化902】



であり；

A_rは、

【化903】



であり；

H_etは、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹は、H、-CN、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、-O-(C₃-C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁-C₄アルキル)であり、ここで、R¹がH、-CNまたはハロゲンではない場合、R¹は1つ以上のハロゲンで置換されてもよい；

各R²は、独立して水素、ハロゲンまたはC₁-C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-C₁H₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₃-C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲン、またはC₁-C₂アルキルであり；

R²⁴は、H、-CN、-(C₁-C₄アルキル)-CN、C₁-C₄アルキル、-(C₁-C₄アルキル)-OH、-(C₁-C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁-C₄アルキル)-O_u-(C₃-C₆シクロアルキル)、-(C₁-C₄アルキル)-O_u-(4～6員複素環)または-(C₁-C₄アルキル)-O-(C₁-C₄アルキル)であり、ここで：

tは、0または1であり；

uは、0または1であり；

ただし、uが1である時、tは1であり；および

各R²⁴¹は、独立してHまたはC₁-C₂アルキルであり；ならびに、

R²⁵は、ハロゲン、-CN、-(C₁-C₄アルキル)-CN、C₁-C₂アルキルまたはシクロプロピルである、前記化合物またはその薬剤的に許容できる塩。

【請求項2】

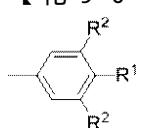
L-A_rが

【化904】



である場合、A_rは

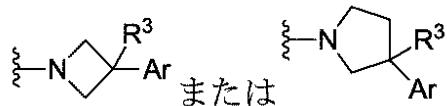
【化905】



ではない、請求項 1 に記載の化合物。

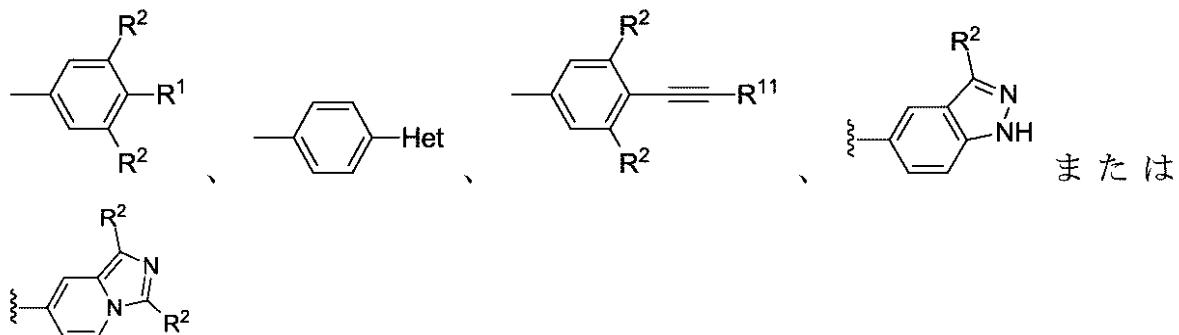
【請求項 3】

i) L - Ar が
【化 906】



であり、Ar が

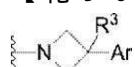
【化 907】



であるか、あるいは

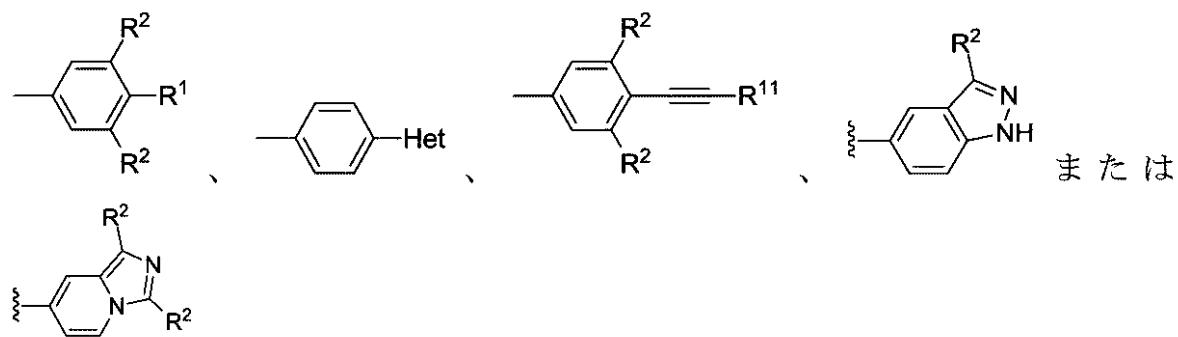
L - Ar が

【化 908】



であり、Ar が

【化 909】

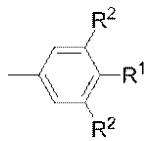


である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

Ar が

【化910】



である、請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

i) R¹がハロゲン、-CNまたはC₁-C₂ハロアルキルであるか、あるいはi i) R¹が-CNである、請求項1~4のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項6】

R²がHである、請求項1~5のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項7】

i) R²¹がハロゲン、C₁-C₄アルキルまたはC₃-C₅シクロアルキルであるか、あるいはi i) R²¹がC₁-C₄アルキルまたはC₃-C₅シクロアルキルであるか、あるいはi i i) R²¹がC₁-C₂アルキルまたはC₃-C₅シクロアルキルであるか、あるいはi v) R²¹がC₁-C₂アルキルであるか、あるいはv) R²¹が-CH₃である請求項1~6のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項8】

i) R²²がHまたはC₁-C₂アルキルであるか、あるいはi i) R²²がHまたは-CH₃であるか、あるいはi i i) R²²が-CH₃である、請求項1~7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項9】

i) R²⁴がH、-CN、-(C₁-C₄アルキル)-CN、C₁-C₄アルキル、-(C₁-C₄アルキル)-OH、-(C₁-C₄アルキル)-N(R²⁴)₂、-(C₁-C₄アルキル)_t-O_u-(C₃-C₆シクロアルキル)、-(C₁-C₄アルキ尔)_t-O_u-(4~6員複素環)または-(C₁-C₄アルキ尔)-O-(C₁-C₄アルキ尔)であるか、あるいはi i) R²⁴がH、C₁-C₄アルキル、-(C₁-C₄アルキル)-OH、-(C₁-C₄アルキル)-N(R²⁴)₂、-(C₁-C₄アルキル)_t-O_u-(C₃-C₆シクロアルキル)、-(C₁-C₄アルキル)_t-O_u-(4~6員複素環)または-(C₁-C₄アルキ尔)-O-(C₁-C₄アルキ尔)であるか、あるいはi i i) R²⁴がC₁-C₄アルキルまたは-(C₁-C₄アルキ尔)-O-(C₁-C₄アルキ尔)であるか、あるいはi v) R²⁴が-(C₁-C₂アルキ尔)-O-(C₁-C₂アルキ尔)であるか、あるいはv) R²⁴がC₁-C₂アルキルであるか、あるいはv i) R²⁴がC₃-C₆シクロアルキルであるか、あるいはv i i) R²⁴が-CNまたは-(C₁-C₂アルキ尔)-CNであるか、あるいはv i i i) R²⁴が-(C₁-C₂アルキ尔)-CNであるか、あるいはi x) R²⁴がメチル、イソブロピル、シクロプロピル、-CNまたは-(C₁-C₂アルキ尔)-CNである、請求項1~8のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項10】

i) R²⁴が-CH₂-O-CH₃であるか、あるいはi i) R²⁴が-CH₃であるか、あるいはi i i) R²⁴が-CNであるか、あるいはi v) R²⁴がH、-CH₃、-CH₂OH、-CH₂OCH₃、-(CH₂)₂OH、-(CH₂)₂OCH₃または-(CH₂)₂N(CH₃)₂である、請求項9に記載の化合物。

【請求項11】

R²⁴がC₁-C₂アルキル、オキソ、-CN、ハロゲン、アルカノイル、アルコキシカルボニル、-OHおよびC₁-C₂アルコキシから選択される1つ以上の置換基で置換されるか、あるいはR²⁴がメチル、-F、メトキシ、-C(=O)CH₃およびC(=O)-OCH₃から選択される1つ以上の置換基で置換される、請求項9に記載の化合物

。

【請求項 1 2】

i) R^{2~4} が同一または異なる 2 つの置換基で置換されるか、あるいは i i) R^{2~4} が同一または異なる 3 つの置換基で置換される、請求項 1 1 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

i) R^{2~5} がハロゲン、-C N、C₁-C₂ アルキルまたはシクロプロピルであるか、あるいは i i) R^{2~5} がハロゲン、C₁-C₂ アルキルまたはシクロプロピルである、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 4】

i) R^{2~5} が -C N、-C l または -C H₃ であるか、あるいは i i) R^{2~5} が -C l または R^{2~5} が -C H₃ である、請求項 1 3 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

i) R^{2~5} が -O H、ハロゲン、C₁-C₂ アルキルおよびアルキルカルボニルオキシから選択される 1 つ以上の置換基で置換されるか、あるいは i i) R^{2~5} が -F、メチルおよび O-C(=O)-C H₃ から選択される 1 つ以上の置換基で置換される、請求項 1 ~ 1 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

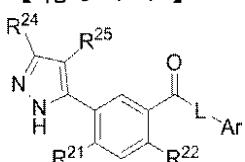
【請求項 1 6】

i) R^{2~5} が同一または異なる 2 つの置換基で置換されるか、あるいは i i) R^{2~5} が同一または異なる 3 つの置換基で置換される、請求項 1 5 に記載の化合物。

【請求項 1 7】

構造 I I I b を有する化合物であり：

【化 9 1 1】

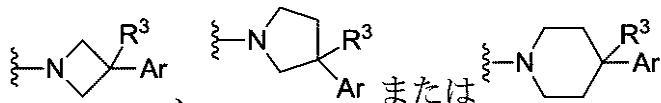


I I I b

ここで、

L-Ar は、

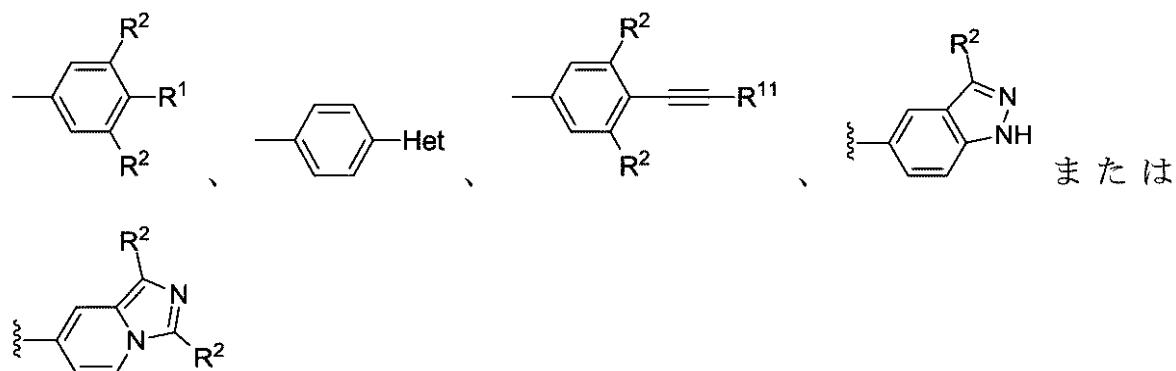
【化 9 1 2】



であり；

Ar は、

【化913】



であり；

Hetは、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹は、H、-CN、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、-O-(C₃-C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁-C₄アルキル)であり、ここで、R¹がH、-CNまたはハロゲンではない場合、R¹は1つ以上のハロゲンで置換されてもよく；

各R²は、独立して水素、ハロゲンまたはC₁-C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-C₁H₃であり；

R²⁴は、H、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₃-C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²⁵は、H、ハロゲンまたはC₁-C₂アルキルであり；ならびに

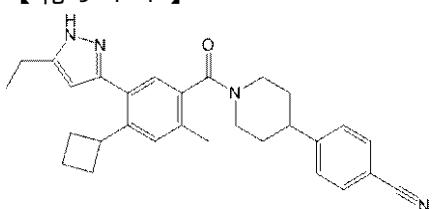
各R²⁴およびR²⁵は、独立してH、ハロゲン、-CN、-(C₁-C₄アルキル)、-CN、C₁-C₄アルキル、-(C₁-C₄アルキル)-OH、-(C₁-C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁-C₄アルキル)_t-O_u-(C₃-C₅シクロアルキル)、-(C₁-C₄アルキル)_t-O_u-(4～6員複素環)または-(C₁-C₄アルキル)_t-O-(C₁-C₄アルキル)であり、ここで：

各tは、独立して0または1であり；

各uは、独立して0または1であり；および

各R²⁴¹は、独立してHまたはC₁-C₂アルキルであり、ここで、前記化合物が：

【化914】



でない、前記化合物またはその薬剤的に許容できる塩。

【請求項18】

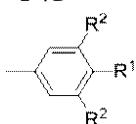
L-Arが

【化915】



である時、Arが

【化916】

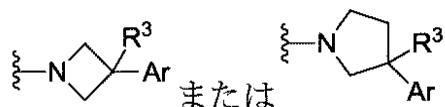


ではない、請求項17に記載の化合物。

【請求項19】

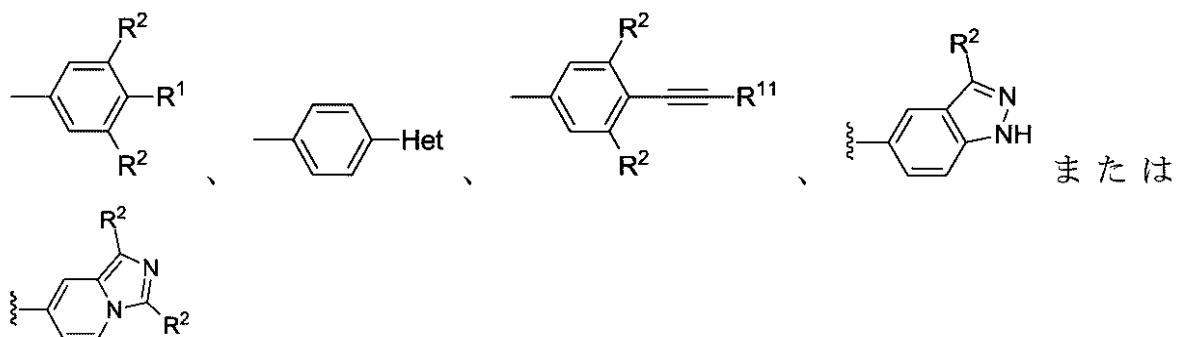
i) L-Arが

【化917】



であり、Arが

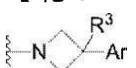
【化918】



であるか、あるいは

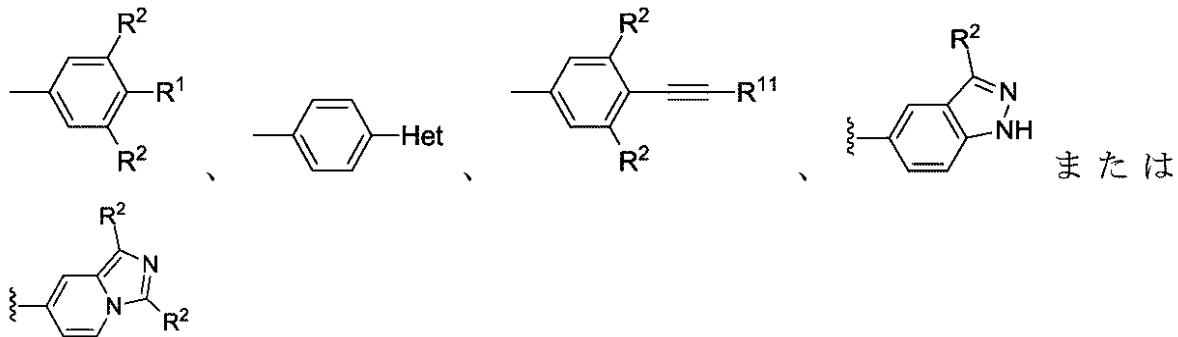
i i) L-Arが

【化919】



であり、Arが

【化920】

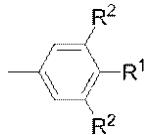


である、請求項1_7に記載の化合物。

【請求項20】

A r が

【化921】



である、請求項1_9に記載の化合物。

【請求項21】

i) R¹ がハロゲン、 - C N または C₁ - C₂ ハロアルキルであるか、あるいは i i) R¹ が - C N である、請求項1_7 ~ 2_0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項22】

R² が H である、請求項1_7 ~ 2_1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項23】

i) R^{2 1} がハロゲン、 C₁ - C₄ アルキル、 C₃ - C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であるか、あるいは i i) R^{2 1} が C₁ - C₄ アルキル、 C₃ - C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であるか、あるいは i i i) R^{2 1} が C₁ - C₂ アルキルまたは C₃ - C₅ シクロアルキルであるか、あるいは i v) R^{2 1} が C₁ - C₂ アルキルであるか、あるいは v) R^{2 1} が - C H₃ である、請求項1_7 ~ 2_2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項24】

i) R^{2 2} が H または C₁ - C₂ アルキルであるか、あるいは i i) R^{2 2} が H または - C H₃ であるか、あるいは i i i) R^{2 2} が - C H₃ である、請求項1_7 ~ 2_3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項25】

i) 各 R^{2 4} および R^{2 5} が独立して H、 - C N、 C₁ - C₄ アルキル、 - (C₁ - C₄ アルキル) - O H、 - (C₁ - C₄ アルキル) - N (R^{2 4 1})₂、 - (C₁ - C₄ アルキル) - O_u - (C₃ - C₅ シクロアルキル)、 - (C₁ - C₄ アルキル) - O_u - (4 ~ 6 員複素環) または - (C₁ - C₄ アルキル) - O - (C₁ - C₄ アルキル) であるか、あるいは i i) 各 R^{2 4} および R^{2 5} が独立して H、 C₁ - C₄ アルキル、 - (C₁ - C₄ アルキル) - O_u - (4 ~ 6 員複素環) または - (C₁ - C₄ アルキル) - O - (C₁ - C₄ アルキル) であるか、あるいは i i i) R^{2 4} が H、 C₁ - C₄ アルキル、 - (C₁ - C₄ アルキル) - O H、 - (C₁ - C₄ アルキル) - N (R^{2 4 1})₂、 - (C₁ - C₄ アルキル) - O_u - (C₃ - C₅ シクロアルキル)、 - (C₁ - C₄ アルキル) - O_u - (4 ~ 6 員複素環) または - (C₁ - C₄ アルキル) - O - (C₁ - C₄ アルキル) であるか、あるいは i v) R^{2 4} が - C N、 - C l、 C₁ - C₄ アルキルまたは - (C₁ - C₄ アルキル) - O - (C₁ - C₄ アルキル) であるか、あるいは v) R^{2 4} が C₁ - C₄ アルキルまたは - (C₁ - C₄ アルキル) - O - (C₁ - C₄ アルキル) であるか、あるいは v i) R^{2 4} が - (C₁ - C₂ アルキル) - O - (C₁ - C₂ アルキル) であるか、あるいは v i i) R^{2 4} が C₁ - C₄ アルキルである、請求項1_7 ~ 2_4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項26】

i) R^{2 4} が - C H₃ であるか、あるいは i i) R^{2 4} が水素である、請求項1_7 ~ 2_5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項27】

i) R^{2 4} がハロゲン、 C₃ - C₅ シクロアルキルおよび C₁ - C₂ アルコキシから選

択される 1 つ以上の置換基で置換されるか、あるいは i i) R^{2-4} が - F、シクロプロピルおよび OCH_3 から選択される 1 つ以上の置換基で置換される、請求項 17 ~ 25 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 28】

i) R^{2-4} が同一または異なる 2 つの置換基で置換されるか、あるいは i i) R^{2-4} が同一または異なる 3 つの置換基で置換される、請求項 27 に記載の化合物。

【請求項 29】

i) R^{2-5} がハロゲン、メチル、エチルまたはシクロプロピルであるか、あるいは i i) R^{2-5} が - CN、- Cl、 C_1-C_4 アルキル、- (C_1-C_4 アルキル) t - O - (C_3-C_5 シクロアルキル) または - (C_1-C_4 アルキル) t - O - (C_1-C_4 アルキル) であるか、あるいは i i i) R^{2-5} が - CN、- Cl、- CH_3 、- O - (C_3-C_5 シクロアルキル) または - O - (C_1-C_2 アルキル) であるか、あるいは i v) R^{2-5} が - CN、- Cl または C_1-C_4 アルキルである、請求項 17 ~ 28 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 30】

i) R^{2-5} が - CH_3 であるか、あるいは i i) R^{2-5} が - Cl である、請求項 17 ~ 29 のいずれか 1 項に記載の化合物。

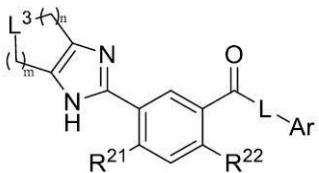
【請求項 31】

i) R^{2-5} が 1 つ以上のハロゲンで置換されるか、あるいは i i) R^{2-5} が 1 つ以上の - F で置換されるか、あるいは i i i) R^{2-5} が 2 つの置換基で置換されるか、あるいは i v) R^{2-5} が 3 つの置換基で置換される、請求項 17 ~ 29 のいずれか 1 項に記載の化合物。

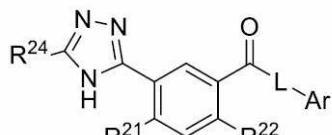
【請求項 32】

構造 I または II を有する化合物であり：

【化 922】



I, または



II,

ここで：

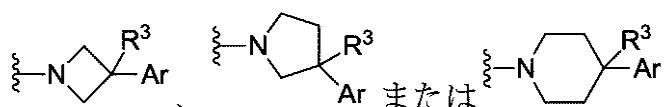
L^3 は、 - CH_2 - 、 - CHR^{5-0} - 、 - O - 、 - NR^{5-0} - 、 - $NC(O)R^{5-0}$ - または - $NC(O)OR^{5-0}$ - であり、ここで、 R^{5-0} は C_1-C_6 アルキル、 C_3-C_5 シクロアルキル、または 4 ~ 6 員複素環であり；

n は、 1、 2、 または 3 であり；

m は、 $n + m = 3$ という条件で 1 または 2 であり；

$L-Ar$ は、

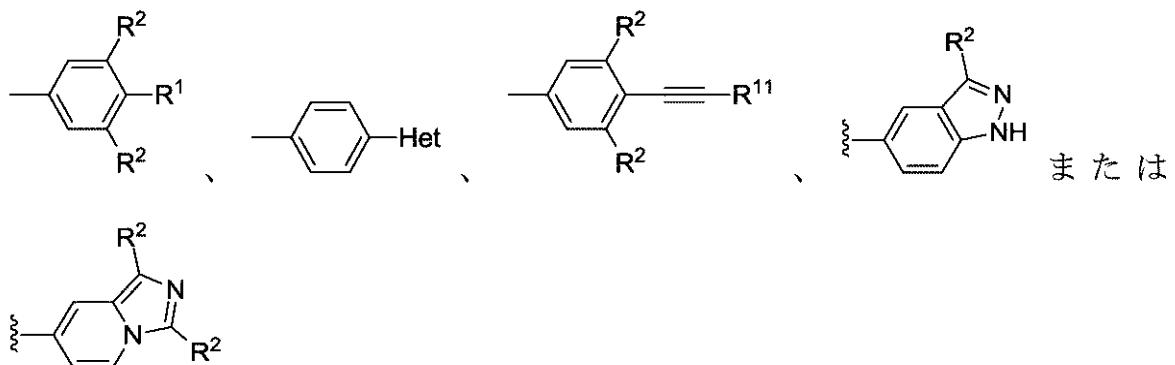
【化 923】



であり；

Ar は、

【化924】



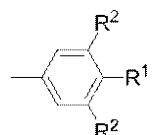
であり、ただし L - Ar が

【化925】



である時、Ar は

【化926】



ではなく；

Het は、5 ~ 6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ - C₄ アルキル、-O-(C₃ - C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ~ 6員複素環)または-O-(C₁ - C₄ アルキル)であり、ここで、R¹ がH、-CN またはハロゲンでない場合、R¹ は1つ以上のハロゲンで置換されていてもよく；

各R² は、独立して水素、ハロゲンまたはC₁ - C₄ アルキルであり；

R³ は、H またはF であり；

R¹¹ は、H または-C₁H₃ であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ - C₄ アルキル、C₃ - C₅ シクロアルキルまたは4 ~ 6員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲン、またはC₁ - C₂ アルキルであり；ならびに、

R²⁴ は、H、C₁ - C₄ アルキル、-(C₁ - C₄ アルキル)-OH、-(C₁ - C₄ アルキル)_t-N(R²⁴¹)₂、-(C₁ - C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ - C₅ シクロアルキル)、-(C₁ - C₄ アルキル)_t-O_t-(4 ~ 6員複素環)または-(C₁ - C₄ アルキル)_t-O-(C₁ - C₄ アルキル)であり、ここで：

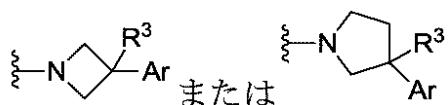
各t は、独立して0 または1 であり；および、

各R²⁴¹ は、独立してH またはC₁ - C₂ アルキルである、前記化合物またはその薬剤的に許容できる塩。

【請求項33】

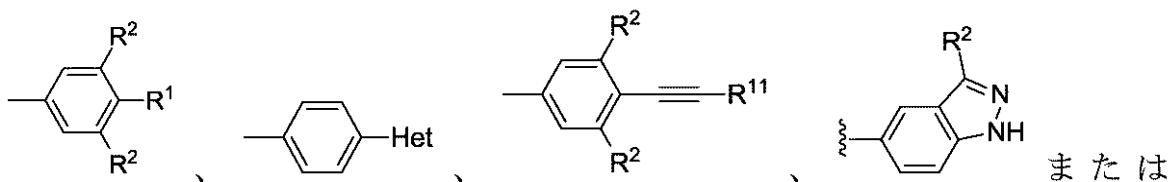
i) L - Ar が

【化927】

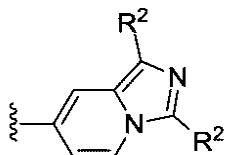


であり、Arが

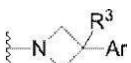
【化928-1】



【化928-2】

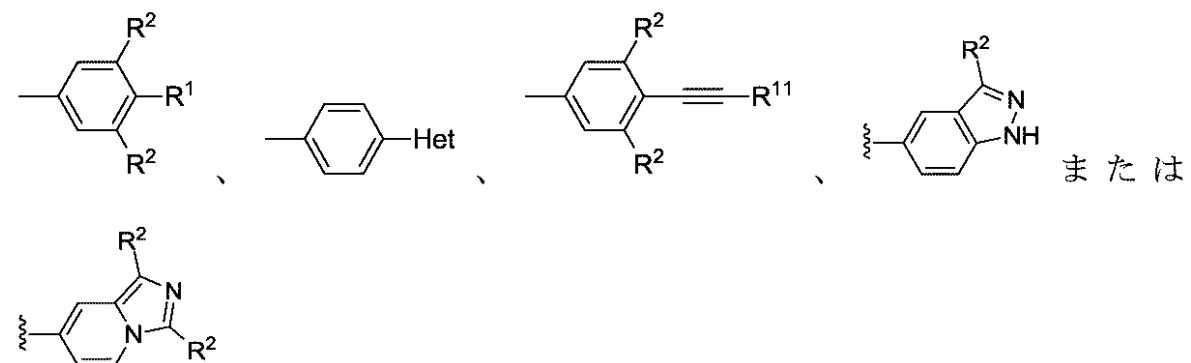


であるか、あるいは

i i) L - Ar が
【化929】

であり、Arが

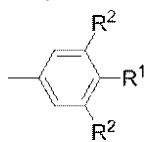
【化930】

である、請求項32に記載の化合物。

【請求項34】

Arが

【化931】



である、請求項3_3に記載の化合物。

【請求項35】

i) R¹ がハロゲン、 - C N または C₁ - C₂ ハロアルキルであるか、あるいはi i) R¹ が - C N または C₁ - C₂ ハロアルキルであるか、あるいはi i i) R¹ が - C N であるか、あるいはi v) R¹ が - C₁ である、請求項3_2 ~ 3_4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項36】

R² が H である、請求項3_2 ~ 3_5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項37】

i) R²¹ がハロゲン、C₁ - C₄ アルキル、C₃ - C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であるか、あるいはi i) R²¹ が H、C₁ - C₄ アルキル、C₃ - C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であるか、あるいはi i i) R²¹ が C₁ - C₂ アルキルまたは C₃ - C₅ シクロアルキルであるか、あるいはi v) R²¹ が C₃ - C₅ シクロアルキルであるか、あるいはv) R²¹ が C₁ - C₂ アルキルである、請求項3_2 ~ 3_6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項38】

i) R²² が H または C₁ - C₂ アルキルであるか、あるいはi i) R²² が H であるか、あるいはi i i) R²² が C₁ - C₂ アルキルであるか、あるいはi v) R²² が - C H₃ である、請求項3_2 ~ 3_7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項39】

i) R²⁴ が C₁ - C₄ アルキルまたは - (C₁ - C₄ アルキル)_t - O - (C₁ - C₄ アルキル) であるか、あるいはi i) R²⁴ が - (C₁ - C₂ アルキル)_t - O - (C₁ - C₂ アルキル) である、請求項3_2 ~ 3_8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項40】

L³ が - N (C H₃) - である、請求項3_2 ~ 3_9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

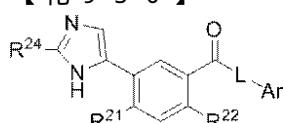
【請求項41】

i) n が 2 であり、m が 2 であるか、あるいはi i) n が 1 または 2 であるか、あるいはi i i) n が 1 であり、m が 2 である、請求項3_2 ~ 4_0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項42】

構造 I V を有する化合物であり：

【化950】

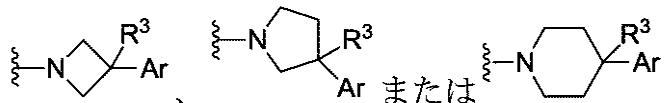


I V

ここで：

L - Ar は、

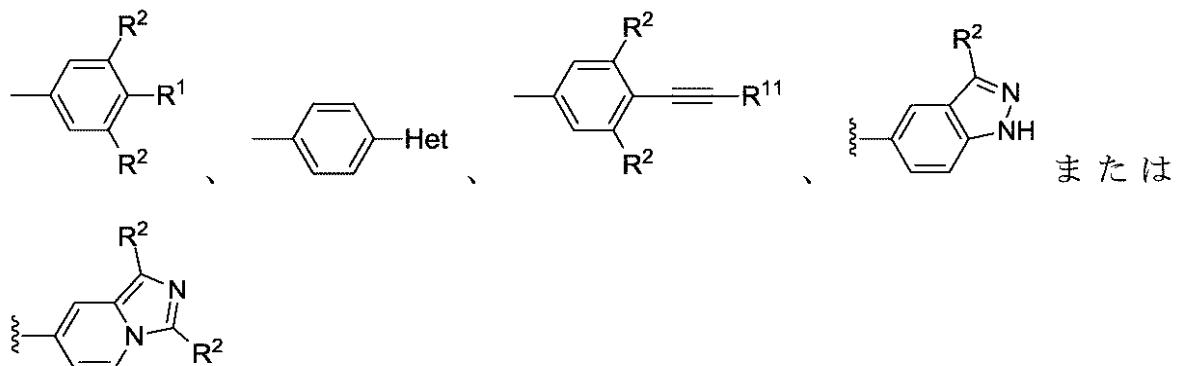
【化951】



であり；

Arは、

【化952】



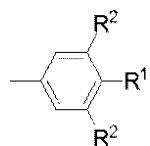
であり、ただしL-Arが

【化953】



である時、Arは

【化954】



ではなく；

Hetは、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹は、H、-CN、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、-O-(C₃-C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁-C₄アルキル)であり、ここでR¹がH、-CNまたはハロゲンではない場合、R¹は1つ以上のハロゲンで置換してもよい；

各R²は、独立して水素、ハロゲンまたはC₁-C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₃-C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁-C₂アルキルであり；ならびに

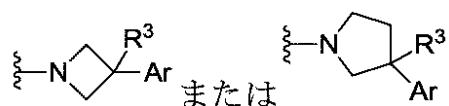
R²⁴は、H、C₁-C₄アルキル、-(C₁-C₄アルキル)-OH、-(C₁-C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁-C₄アルキル)_t-O_u-(C₃-C₅シクロアルキル)、-(C₁-C₄アルキル)_t-O_u-(4～6員複素環)または-(C₁-C₄アルキル)-O_u-(C₃-C₅シクロアルキル)、-(C₁-C₄アルキル)_t-O_u-(4～6員複素環)または-(C₁-C₄アルキル)-O_u-(C₃-C₅シクロアルキル)。

$C_1 - C_4$ アルキル) - O - ($C_1 - C_4$ アルキル)、ここで:
 t は、0 または 1 であり;
 u は、0 または 1 であり;
 ただし u が 1 である時、 t は 1 であり; および、
 R^{2-4} は、H または $C_1 - C_2$ アルキルである、前記化合物またはその薬剤的に許容できる塩。

【請求項 4 3】

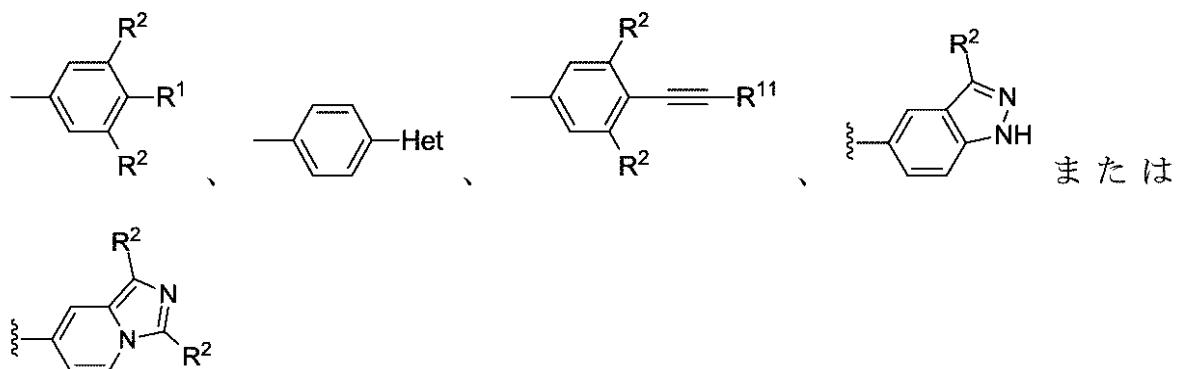
L - Ar が

【化 9 5 5】



であり、Ar が

【化 9 5 6】



である、請求項 4 2 に記載の化合物。

【請求項 4 4】

i) R^1 がハロゲン、-CN または $C_1 - C_2$ ハロアルキルであるか、あるいは ii)
 R^1 が -CN である、請求項 4 2 または 4 3 に記載の化合物。

【請求項 4 5】

 R^2 が H である、請求項 4 2 ~ 4 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 4 6】

i) R^{2-1} がハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_3 - C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であるか、あるいは ii) R^{2-1} が $C_1 - C_2$ アルキルまたは $C_3 - C_5$ シクロアルキルであるか、あるいは iii) R^{2-1} が $C_1 - C_2$ アルキルであるか、あるいは iv) R^{2-1} が $C_3 - C_5$ シクロアルキルである、請求項 4 2 ~ 4 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 4 7】

i) R^{2-2} が H または $C_1 - C_2$ アルキルであるか、あるいは ii) R^{2-2} が H であるか、あるいは iii) R^{2-2} が $C_1 - C_2$ アルキルであるか、あるいは iv) R^{2-2} が -CH₃ である、請求項 4 2 ~ 4 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 4 8】

i) R^{2-4} が $C_1 - C_4$ アルキルまたは - ($C_1 - C_4$ アルキル) - O - ($C_1 - C_4$ アルキル) であるか、あるいは ii) R^{2-4} が - ($C_1 - C_2$ アルキル) - O - ($C_1 - C_2$ アルキル) である、請求項 4 2 ~ 4 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 4 9】

請求項 1 ~ 4 8 のいずれかの化合物および薬剤的に許容できる担体、賦形剤または希釈剤を含む医薬組成物。

【請求項 5 0】

対象のウイルス感染を治療するための、請求項 1 ~ 4 8 のいずれかの化合物または請求項 4 9 の医薬組成物の治療上有効な量を含む、組成物。

【請求項 5 1】

前記ウイルス感染が C 型肝炎感染を含む、請求項 5 0 に記載の組成物。

【請求項 5 2】

対象の脂肪酸合成酵素経路の調節不全を特徴とする状態を治療するための、請求項 1 ~ 4 8 のいずれかの化合物または請求項 4 9 の医薬組成物の治療上有効な量を含む、組成物。

【請求項 5 3】

対象のがんを治療するための、請求項 1 ~ 4 8 のいずれかの化合物または請求項 4 9 の医薬組成物の治療上有効な量を含む、組成物。

【請求項 5 4】

前記がんが、乳癌、肺癌また大腸癌である、請求項 5 3 に記載の組成物。

【請求項 5 5】

前記がんが肺癌である、請求項 5 3 に記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 5 0

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 5 0】

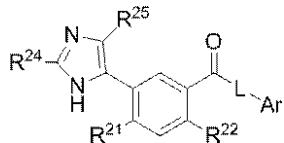
様々な態様において、本開示は、対象の脂肪酸合成酵素経路の調節不全を特徴とする状態を治療する方法を提供し、当該方法はそのような治療が必要な対象に構造 I、I I、I I I、I I I b、I I I c、I V、V およびVI のいずれか 1 つの化合物を有効な量で投与することを含む。様々な態様において、脂肪酸合成酵素経路の調節不全を特徴とする状態は、ウイルス感染またはがんである。様々な態様において、ウイルス感染は、構造 I、I I、I I I、I I I b、I I I c、I V、V およびVI のいずれか 1 つの化合物を 1 つ以上の追加の抗ウイルス治療と組み合わせて使用して、治療される。様々な態様において、がんは、構造 I、I I、I I I、I I I b、I I I c、I V、V およびVI のいずれか 1 つの化合物を 1 つ以上の追加のがん治療と組み合わせて使用して、治療される。様々な態様において、ウイルス感染は C 型肝炎である。様々な態様において、がんは乳癌である。様々な態様において、がんは肺癌である。様々な態様において、がんは大腸癌である。

本発明は、例えば、以下を提供する。

(項目 1)

構造 I I I を有する化合物であり：

【化 9 0 1】

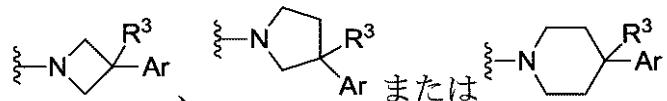


I I I

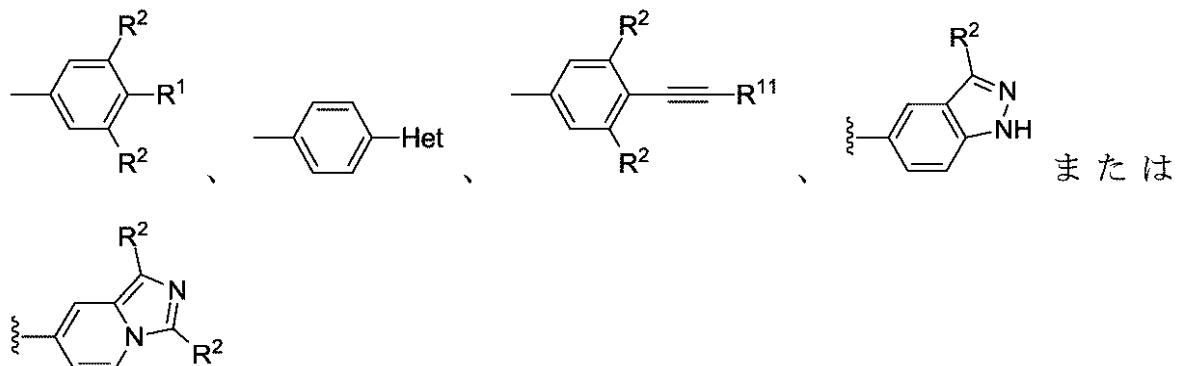
ここで、

L - Ar は、

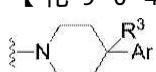
【化902】

であり；A r は、

【化903】

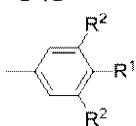
であり；H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、-O-(C₃-C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁-C₄アルキル)であり、ここで、R¹がH、-CNまたはハロゲンではない場合、R¹は1つ以上のハロゲンで置換されてもよく；各R²は、独立して水素、ハロゲンまたはC₁-C₄アルキルであり；R³ は、HまたはFであり；R¹¹ は、Hまたは-CH₃であり；R²¹ は、H、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₃-C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；R²² は、H、ハロゲン、またはC₁-C₂アルキルであり；R²⁴ は、H、-CN、-(C₁-C₄アルキル)-CN、C₁-C₄アルキル、-(C₁-C₄アルキル)-OH、-(C₁-C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁-C₄アルキル)-O_u-(C₃-C₆シクロアルキル)、-(C₁-C₄アルキル)-O_u-(4～6員複素環)または-(C₁-C₄アルキル)-O-(C₁-C₄アルキル)であり、ここで：t は、0または1であり；u は、0または1であり；ただし、uが1である時、tは1であり；および各R²⁴¹は、独立してHまたはC₁-C₂アルキルであり；ならびに、R²⁵ は、ハロゲン、-CN、-(C₁-C₄アルキル)-CN、C₁-C₂アルキルまたはシクロプロピルである、前記化合物またはその薬剤的に許容できる塩。(項目2)L-A r が

【化904】



である場合、Arは

【化905】

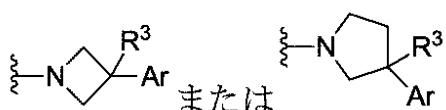


ではない、項目1に記載の化合物。

(項目3)

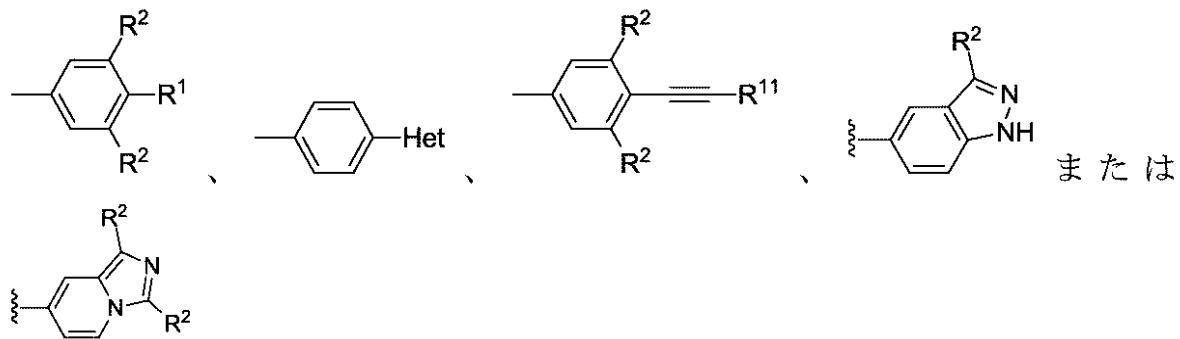
L-Arが

【化906】



であり、Arが

【化907】



である、項目1に記載の化合物。

(項目4)

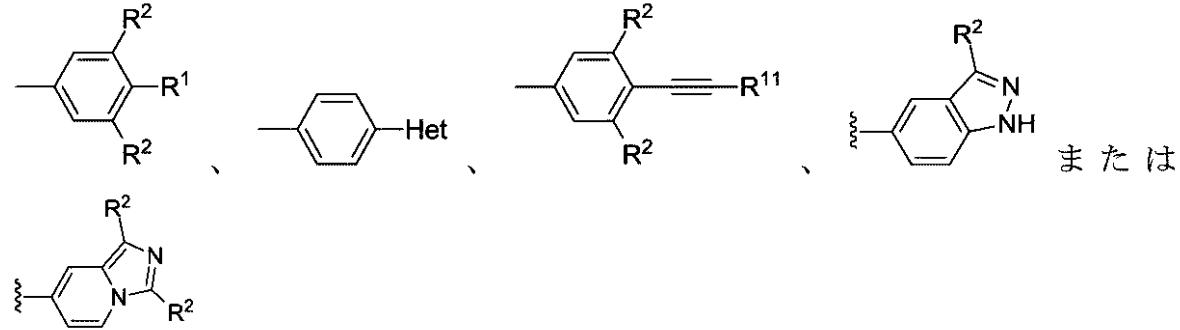
L-Arが

【化908】



であり、Arが

【化909】

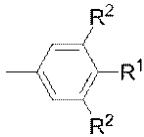


である、項目3に記載の化合物。

(項目5)

A r が

【化910】



である、項目4に記載の化合物。

(項目6)

R¹がハロゲン、-CNまたはC₁-C₂ハロアルキルである、項目1~5のいずれか1項に記載の化合物。

(項目7)

R¹が-CNである、項目6に記載の化合物。

(項目8)

R²がHである、項目1~7のいずれか1項に記載の化合物。

(項目9)

R²¹がハロゲン、C₁-C₄アルキルまたはC₃-C₅シクロアルキルである、項目1~8のいずれか1項に記載の化合物。

(項目10)

R²¹がC₁-C₄アルキルまたはC₃-C₅シクロアルキルである、項目9に記載の化合物。

(項目11)

R²¹がC₁-C₂アルキルまたはC₃-C₅シクロアルキルである、項目10に記載の化合物。

(項目12)

R²¹がC₁-C₂アルキルである、項目11に記載の化合物。

(項目13)

R²¹が-CH₃である、項目12に記載の化合物。

(項目14)

R²²がHまたはC₁-C₂アルキルである、項目1~13のいずれか1項に記載の化合物。

(項目15)

R²²がHまたは-CH₃である、項目14に記載の化合物。

(項目16)

R²²が-CH₃である、項目15に記載の化合物。

(項目17)

R²⁴がH、-CN、-(C₁-C₄アルキル)-CN、C₁-C₄アルキル、-(C₁-C₄アルキル)-OH、-(C₁-C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁-C₄アルキル)-O_u-(C₃-C₆シクロアルキル)、-(C₁-C₄アルキル)_t-O_u-(4~6員複素環)または-(C₁-C₄アルキル)-O-(C₁-C₄アルキル)である、項目1~16のいずれか1項に記載の化合物。

(項目18)

R²⁴がH、C₁-C₄アルキル、-(C₁-C₄アルキル)-OH、-(C₁-C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁-C₄アルキル)_t-O_u-(C₃-C₆シクロアルキル)、-(C₁-C₄アルキル)_t-O_u-(4~6員複素環)または-(C₁-C₄アルキル)-O-(C₁-C₄アルキル)である、項目17に記載の化合物。

(項目19)

R²⁻⁴ が C₁ - C₄ アルキルまたは - (C₁ - C₄ アルキル) - O - (C₁ - C₄ アルキル) である、項目18に記載の化合物。

(項目20)

R²⁻⁴ が - (C₁ - C₂ アルキル) - O - (C₁ - C₂ アルキル) である、項目19に記載の化合物。

(項目21)

R²⁻⁴ が - CH₂ - O - CH₃ である、項目20に記載の化合物。

(項目22)

R²⁻⁴ が C₁ - C₂ アルキルである、項目19に記載の化合物。

(項目23)

R²⁻⁴ が - CH₃ である、項目22に記載の化合物。

(項目24)

R²⁻⁴ が C₃ - C₆ シクロアルキルである、項目18に記載の化合物。

(項目25)

R²⁻⁴ が - CN または - (C₁ - C₂ アルキル) - CN である、項目17に記載の化合物。

(項目26)

R²⁻⁴ が - CN である、項目25に記載の化合物。

(項目27)

R²⁻⁴ が - (C₁ - C₂ アルキル) - CN である、項目25に記載の化合物。

(項目28)

R²⁻⁴ が H、 - CH₃、 - CH₂OH、 - CH₂OCH₃、 - (CH₂)₂OH、 - (CH₂)₂OCH₃ または - (CH₂)₂N(CH₃)₂ である、項目17に記載の化合物。

(項目29)

R²⁻⁴ がメチル、イソプロピル、シクロプロピル、 - CN または - (C₁ - C₂ アルキル) - CN である、項目17に記載の化合物。

(項目30)

R²⁻⁴ が C₁ - C₂ アルキル、オキソ、 - CN、ハロゲン、アルカノイル、アルコキシカルボニル、 - OH および C₁ - C₂ アルコキシから選択される1つ以上の置換基で置換される、項目1~20、22、24~25、27および29のいずれか1項に記載の化合物。

(項目31)

R²⁻⁴ がメチル、 - F、メトキシ、 - C(=O)CH₃ および C(=O)-OCH₃ から選択される1つ以上の置換基で置換される、項目30に記載の化合物。

(項目32)

R²⁻⁴ が同一または異なる2つの置換基で置換される、項目30または31に記載の化合物。

(項目33)

R²⁻⁴ が同一または異なる3つの置換基で置換される、項目30または31に記載の化合物。

(項目34)

R²⁻⁵ がハロゲン、 - CN、 C₁ - C₂ アルキルまたはシクロプロピルである、項目1~33のいずれか1項に記載の化合物。

(項目35)

R²⁻⁵ がハロゲン、 C₁ - C₂ アルキルまたはシクロプロピルである、項目34に記載の化合物。

(項目36)

R²⁻⁵ が - CN、 - Cl または - CH₃ である、項目34に記載の化合物。

(項目37)

R²⁵が-C1である、項目36に記載の化合物。

(項目38)

R²⁵が-CH₃である、項目36に記載の化合物。

(項目39)

R²⁵が-OH、ハロゲン、C₁-C₂アルキルおよびアルキルカルボニルオキシから選択される1つ以上の置換基で置換される、項目1~35のいずれか1項に記載の化合物。

。

(項目40)

R²⁵が-F、メチルおよびO-C(=O)-CH₃から選択される1つ以上の置換基で置換される、項目39に記載の化合物。

(項目41)

R²⁵が同一または異なる2つの置換基で置換される、項目39または40に記載の化合物。

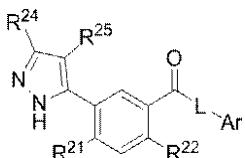
(項目42)

R²⁵が同一または異なる3つの置換基で置換される、項目39または40に記載の化合物。

(項目43)

構造IIIbを有する化合物であり：

【化911】

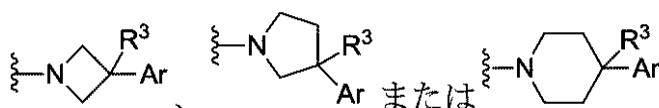


IIIb

ここで、

L-Arは、

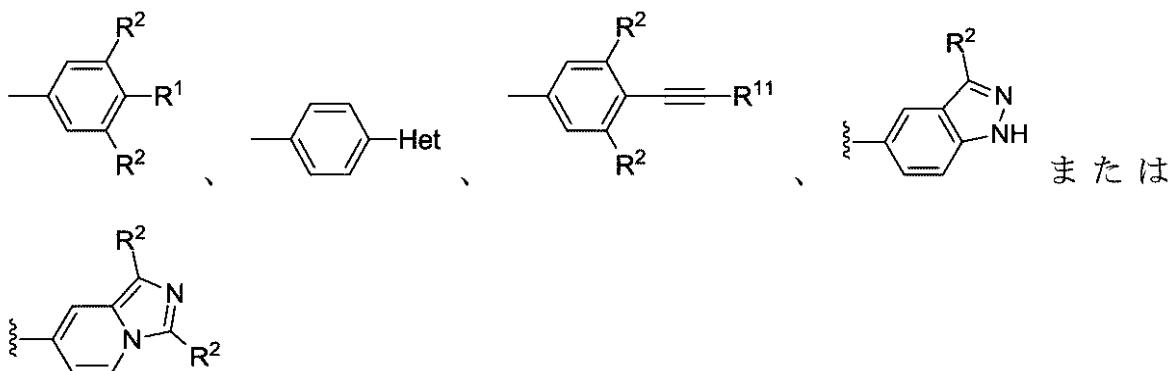
【化912】



であり；

Arは、

【化913】



であり；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、-O-(C₃-C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁-C₄アルキル)であり、ここで、R¹がH、-CNまたはハロゲンではない場合、R¹は1つ以上のハロゲンで置換されていてもよく；

各 R² は、独立して水素、ハロゲンまたはC₁-C₄アルキルであり；

R³ は、HまたはFであり；

R¹¹ は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₃-C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたはC₁-C₂アルキルであり；ならびに

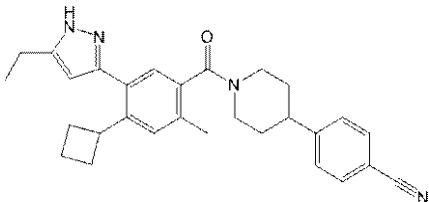
各 R²⁴ およびR²⁵ は、独立してH、ハロゲン、-CN、-(C₁-C₄アルキル)-CN、C₁-C₄アルキル、-(C₁-C₄アルキル)-OH、-(C₁-C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁-C₄アルキル)-t-O_u-(C₃-C₅シクロアルキル)、-(C₁-C₄アルキル)-t-O_u-(4～6員複素環)または-(C₁-C₄アルキル)-t-O-(C₁-C₄アルキル)であり、ここで：

各 t は、独立して0または1であり；

各 u は、独立して0または1であり；および

各 R²⁴¹ は、独立してHまたはC₁-C₂アルキルであり、ここで、前記化合物が：

【化914】

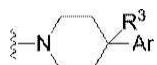


でない、前記化合物またはその薬剤的に許容できる塩。

(項目44)

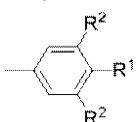
L-Ar が

【化915】



である時、Ar が

【化916】

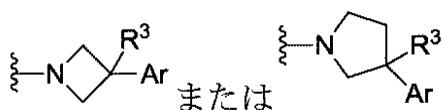


ではない、項目43に記載の化合物。

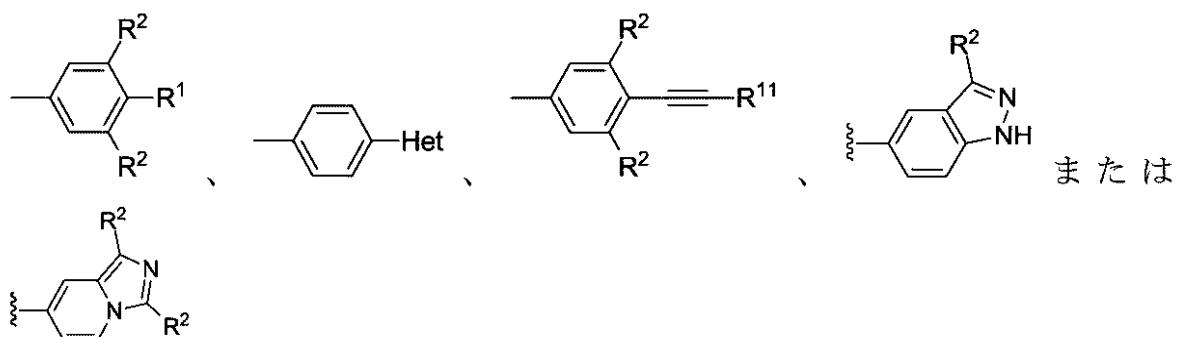
(項目45)

L-Ar が

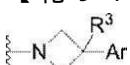
【化917】

であり、Arが

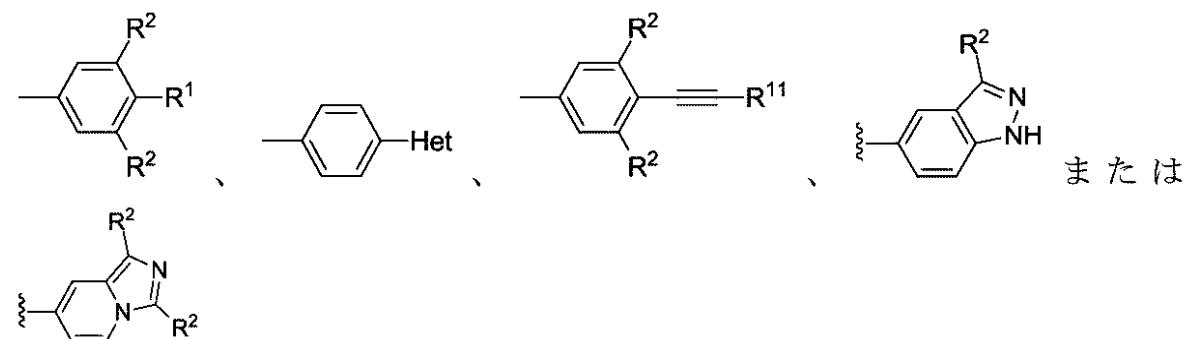
【化918】

である、項目43に記載の化合物。(項目46)L-Arが

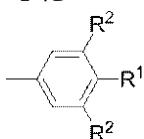
【化919】

であり、Arが

【化920】

である、項目45に記載の化合物。(項目47)Arが

【化921】



である、項目46に記載の化合物。

(項目48)

R¹がハロゲン、-CNまたはC₁-C₂ハロアルキルである、項目43~47のいずれか1項に記載の化合物。

(項目49)

R¹が-CNである、項目48に記載の化合物。

(項目50)

R²がHである、項目43~49のいずれか1項に記載の化合物。

(項目51)

R²がハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₃-C₅シクロアルキルまたは4~6員複素環である、項目43~50のいずれか1項に記載の化合物。

(項目52)

R²がC₁-C₄アルキル、C₃-C₅シクロアルキルまたは4~6員複素環である、項目51に記載の化合物。

(項目53)

R²がC₁-C₂アルキルまたはC₃-C₅シクロアルキルである、項目52に記載の化合物。

(項目54)

R²がC₁-C₂アルキルである、項目53に記載の化合物。

(項目55)

R²が-C₁H₃である、項目54に記載の化合物。

(項目56)

R²がHまたはC₁-C₂アルキルである、項目43~55のいずれか1項に記載の化合物。

(項目57)

R²がHまたは-C₁H₃である、項目56に記載の化合物。

(項目58)

R²が-C₁H₃である、項目57に記載の化合物。

(項目59)

各R²がR²およびR²が独立してH、-CN、C₁-C₄アルキル、-(C₁-C₄アルキル)-OH、-(C₁-C₄アルキル)-N(R²)₂、-(C₁-C₄アルキル)_t-O_u-(C₃-C₅シクロアルキル)、-(C₁-C₄アルキル)_t-O_u-(4~6員複素環)または-(C₁-C₄アルキル)-O-(C₁-C₄アルキル)である、項目43~58のいずれか1項に記載の化合物。

(項目60)

各R²がR²およびR²が独立してH、C₁-C₄アルキル、-(C₁-C₄アルキル)_t-O_u-(4~6員複素環)または-(C₁-C₄アルキル)-O-(C₁-C₄アルキル)である、項目59に記載の化合物。

(項目61)

R²がH、C₁-C₄アルキル、-(C₁-C₄アルキル)-OH、-(C₁-C₄アルキル)-N(R²)₂、-(C₁-C₄アルキル)_t-O_u-(C₃-C₅シクロアルキル)、-(C₁-C₄アルキル)_t-O_u-(4~6員複素環)または-(C₁-C₄アルキル)-O-(C₁-C₄アルキル)である、項目43~58のいずれか1項に記載の化合物。

(項目62)

R²が-CN、-Cl、C₁-C₄アルキルまたは-(C₁-C₄アルキル)-O-(C₁-C₄アルキル)である、項目43~58のいずれか1項に記載の化合物。

(項目63)

R²がC₁-C₄アルキルまたは-(C₁-C₄アルキル)-O-(C₁-C₄アル

キル）である、項目62に記載の化合物。

(項目64)

R²⁻⁴が-(C₁-C₂アルキル)-O-(C₁-C₂アルキル)である、項目63に記載の化合物。

(項目65)

R²⁻⁴がC₁-C₄アルキルである、項目63に記載の化合物。

(項目66)

R²⁻⁴が-C_H₃である、項目65に記載の化合物。

(項目67)

R²⁻⁴が水素である、項目43~58のいずれか1項に記載の化合物。

(項目68)

R²⁻⁴がハロゲン、C₃-C₅シクロアルキルおよびC₁-C₂アルコキシから選択される1つ以上の置換基で置換される、項目43~65のいずれか1項に記載の化合物。

(項目69)

R²⁻⁴が-F、シクロプロピルおよびOCH₃から選択される1つ以上の置換基で置換される、項目68に記載の化合物。

(項目70)

R²⁻⁴が同一または異なる2つの置換基で置換される、項目68または69に記載の化合物。

(項目71)

R²⁻⁴が同一または異なる3つの置換基で置換される、項目68または69に記載の化合物。

(項目72)

R²⁻⁵がハロゲン、メチル、エチルまたはシクロプロピルである、項目43~58または項目61~71のいずれか1項に記載の化合物。

(項目73)

R²⁻⁵が-CN、-Cl、C₁-C₄アルキル、-(C₁-C₄アルキル)_t-O-(C₃-C₅シクロアルキル)または-(C₁-C₄アルキル)_t-O-(C₁-C₄アルキル)である、項目43~58または項目61~71のいずれか1項に記載の化合物。

(項目74)

R²⁻⁵が-CN、-Cl、-CH₃、-O-(C₃-C₅シクロアルキル)または-O-(C₁-C₂アルキル)である、項目73に記載の化合物。

(項目75)

R²⁻⁵が-CN、-ClまたはC₁-C₄アルキルである、項目73に記載の化合物。

(項目76)

R²⁻⁵が-CH₃である、項目75に記載の化合物。

(項目77)

R²⁻⁵が-Clである、項目75に記載の化合物。

(項目78)

R²⁻⁵が1つ以上のハロゲンで置換される、項目43~75のいずれか1項に記載の化合物。

(項目79)

R²⁻⁵が1つ以上の-Fで置換される、項目78に記載の化合物。

(項目80)

R²⁻⁵が2つの置換基で置換される、項目78または79に記載の化合物。

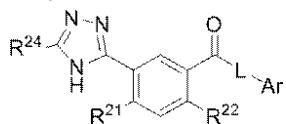
(項目81)

R²⁻⁵が3つの置換基で置換される、項目78または79に記載の化合物。

(項目82)

構造IIを有する化合物であり：

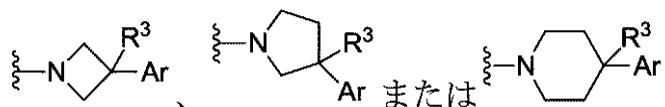
【化922】



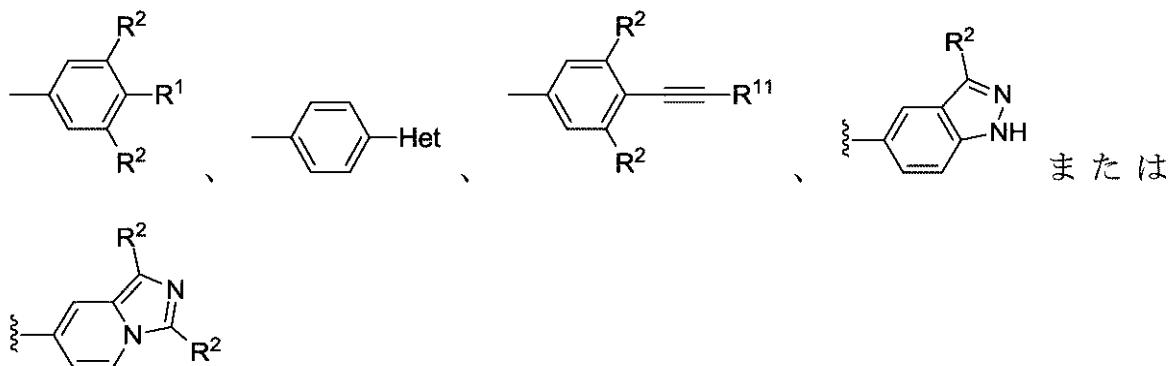
I I

ここで：L - Ar は、

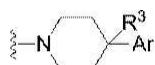
【化923】

であり；Ar は、

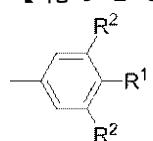
【化924】

であり、ただし L - Ar が

【化925】

である時、Ar は

【化926】

ではなく；Het は、5 ~ 6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、-O-(C₃-C₅シクロアルキル)、-O-(4~6員複素環)または-O-(C₁-C₄アルキル)であり、ここで、R¹ が H、-CN またはハロゲンでない場合、R¹ は 1 つ以上のハロゲンで置換されて

いてもよく；

各 R² は、独立して水素、ハロゲンまたは C₁ - C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R¹¹ は、H または -CH₃ であり；

R²⁴ は、H、ハロゲン、C₁ - C₄ アルキル、C₃ - C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲン、または C₁ - C₂ アルキルであり；ならびに、

R²⁴ は、H、C₁ - C₄ アルキル、- (C₁ - C₄ アルキル) - OH、- (C₁ - C₄ アルキル)_t - N (R²⁴¹)₂、- (C₁ - C₄ アルキル)_t - O_t - (C₃ - C₅ シクロアルキル)、- (C₁ - C₄ アルキル)_t - O_t - (4 ~ 6 員複素環) または - (C₁ - C₄ アルキル)_t - O - (C₁ - C₄ アルキル) であり、ここで：

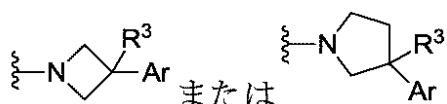
各 t は、独立して 0 または 1 であり；および、

各 R²⁴¹ は、独立して H または C₁ - C₂ アルキルである、前記化合物またはその薬剤的に許容できる塩。

(項目 83)

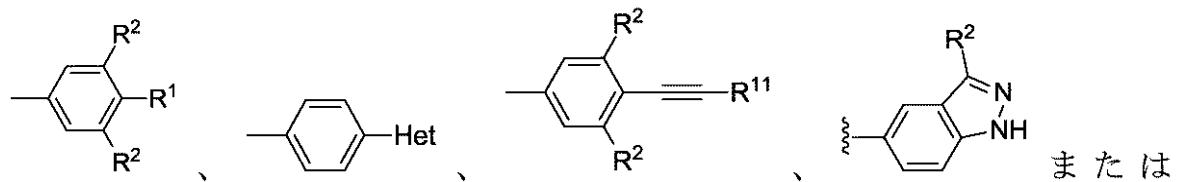
L-Ar が

【化927】

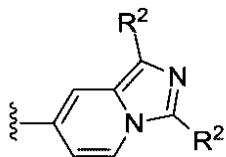


であり、Ar が

【化928-1】



【化928-2】

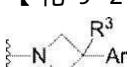


である、項目 82 に記載の化合物。

(項目 84)

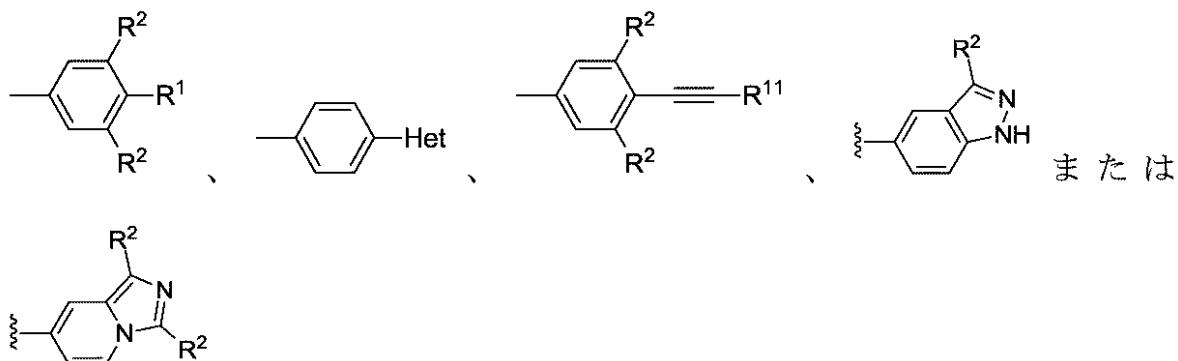
L-Ar が

【化929】



であり、Ar が

【化930】

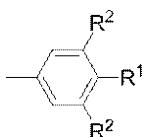


である、項目83に記載の化合物。

(項目85)

A r が

【化931】



である、項目84に記載の化合物。

(項目86)

R¹がハロゲン、-CNまたはC₁-C₂ハロアルキルである、項目82~85のいずれか1項に記載の化合物。

(項目87)

R¹が-CNである、項目86に記載の化合物。

(項目88)

R²がHである、項目82~87のいずれか1項に記載の化合物。

(項目89)

R²がHである、C₁-C₄アルキル、C₃-C₅シクロアルキルまたは4~6員複素環である、項目82~88のいずれか1項に記載の化合物。

(項目90)

R²がH、C₁-C₄アルキル、C₃-C₅シクロアルキルまたは4~6員複素環である、項目82~88のいずれか1項に記載の化合物。

(項目91)

R²がC₁-C₂アルキルまたはC₃-C₅シクロアルキルである、項目89または90に記載の化合物。

(項目92)

R²がC₁-C₂アルキルである、項目91に記載の化合物。

(項目93)

R²がC₃-C₅シクロアルキルである、項目91に記載の化合物。

(項目94)

R²がHまたはC₁-C₂アルキルである、項目82~93のいずれか1項に記載の化合物。

(項目95)

R²がHである、項目94に記載の化合物。

(項目96)

R²⁻² が C₁-C₂ アルキルである、項目 9-4 に記載の化合物。

(項目 9-7)

R²⁻² が -CH₃ である、項目 9-6 に記載の化合物。

(項目 9-8)

R²⁻⁴ が C₁-C₄ アルキルまたは - (C₁-C₄ アルキル) _t - O - (C₁-C₄ アルキル) である、項目 8-2 ~ 9-7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

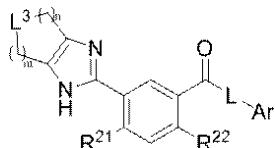
(項目 9-9)

R²⁻⁴ が - (C₁-C₂ アルキル) _t - O - (C₁-C₂ アルキル) である、項目 9-8 に記載の化合物。

(項目 100)

構造 I の化合物であり：

【化 9-3-2】



I

ここで：

L³ は、 -CH₂-、 -CHR⁵⁻⁰-、 -O-、 -NR⁵⁻⁰-、 -NC(O)R⁵⁻⁰-

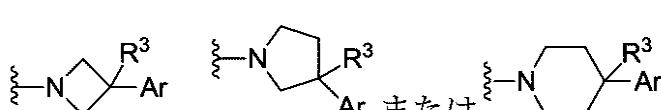
または -NC(O)OR⁵⁻⁰- であり、ここで、R⁵⁻⁰ は C₁-C₆ アルキル、 C₃-C₅ シクロアルキル、または 4~6 員複素環であり；

n は、1、2、または 3 であり；

m は、n + m = 3 という条件で 1 または 2 であり；

L-Ar は、

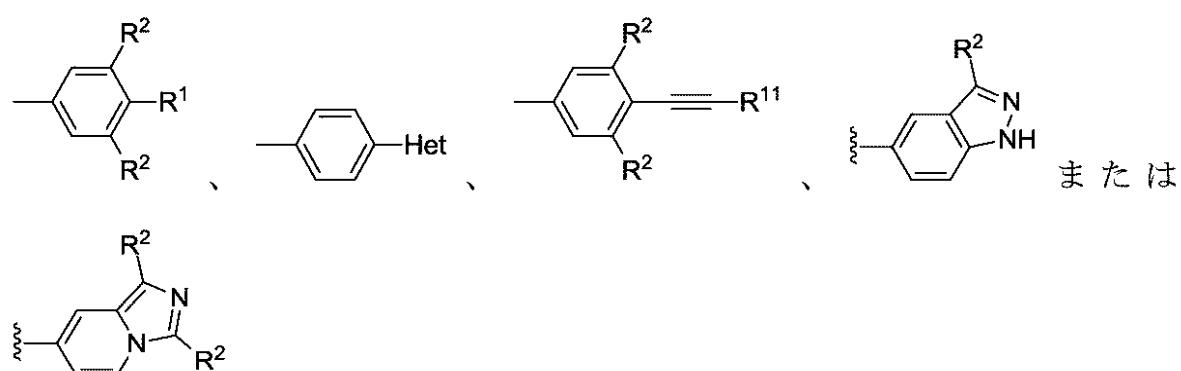
【化 9-3-3】



であり；

Ar は、

【化 9-3-4】



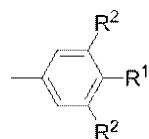
であり、ただし L-Ar が

【化935】



である時、Arは

【化936】



ではなく；

Hetは、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹は、H、-CN、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、-O-(C₃-C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁-C₄アルキル)であり、ここでR¹がH、-CNまたはハロゲンでない場合、R¹は1つ以上のハロゲンで置換してもよい；

各R²は、独立して水素、ハロゲンまたはC₁-C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

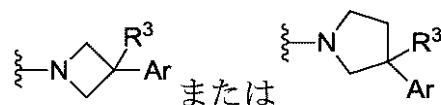
R²¹は、H、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₃-C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；ならびに、

R²²は、H、ハロゲン、またはC₁-C₂アルキルである、前記化合物またはその薬剤的に許容できる塩。

(項目101)

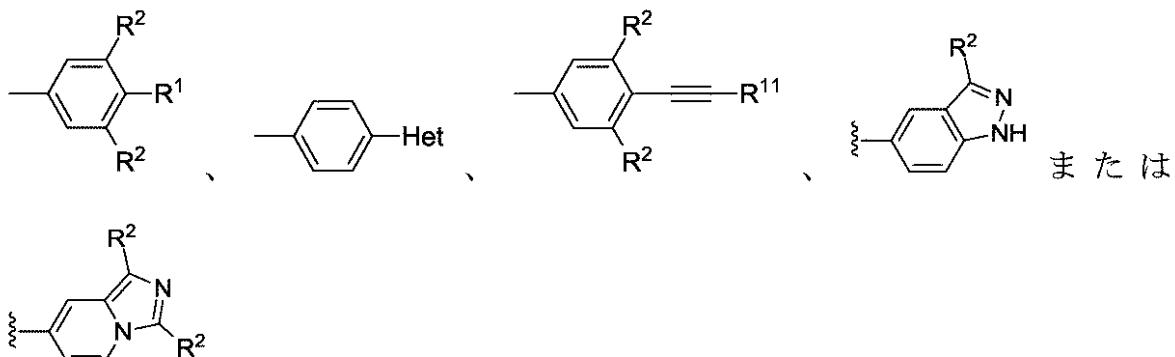
L-Arが

【化937】



であり、Arが

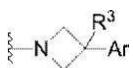
【化938】



である、項目100に記載の化合物。

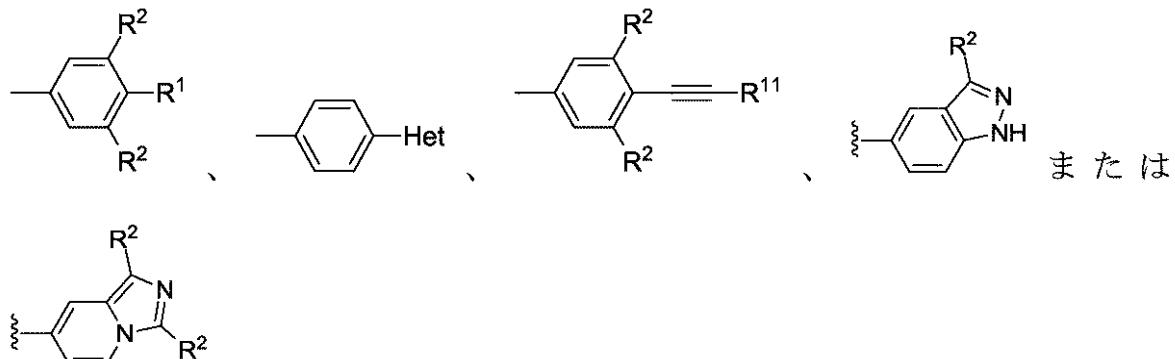
(項目102)

L - Ar が
【化939】



であり、Ar が

【化940】



である、項目101に記載の化合物。

(項目103)

R¹ が H、-CN、-C₁-C₄ アルキル、-O-(C₃-C₅ シクロアルキル)、-O-(4~6員複素環) または -O-(C₁-C₄ アルキル) であり、ここで、R¹ が H または -CN でない場合、R¹ は 1つ以上のハロゲンで置換されていてもよい、項目100~102のいずれか1項に記載の化合物。

(項目104)

R¹ がハロゲン、-CN または C₁-C₂ ハロアルキルである、項目100~102のいずれか1項に記載の化合物。

(項目105)

R¹ が -CN または C₁-C₂ ハロアルキルである、項目104に記載の化合物。

(項目106)

R¹ が -CN である、項目105に記載の化合物。

(項目107)

R¹ が -C1 である、項目104に記載の化合物。

(項目108)

R² が H である、項目100~107のいずれか1項に記載の化合物。

(項目109)

R² がハロゲン、C₁-C₄ アルキル、C₃-C₅ シクロアルキルまたは4~6員複素環である、項目100~108のいずれか1項に記載の化合物。

(項目110)

R² が C₁-C₂ アルキルまたは C₃-C₅ シクロアルキルである、項目109に記載の化合物。

(項目111)

R² が C₃-C₅ シクロアルキルである、項目110に記載の化合物。

(項目112)

R² が H または C₁-C₂ アルキルである、項目100~111のいずれか1項に記載の化合物。

(項目113)

R² が H である、項目112に記載の化合物。

(項目 1 1 4)

R² が C₁ - C₂ アルキルである、項目 1 1 2 に記載の化合物。

(項目 1 1 5)

R² が -C₁H₃ である、項目 1 1 4 に記載の化合物。

(項目 1 1 6)

L³ が -N(C₁H₃) - である、項目 1 0 0 ~ 1 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 1 7)

n が 2 であり、m が 2 である、項目 1 0 0 ~ 1 1 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 1 8)

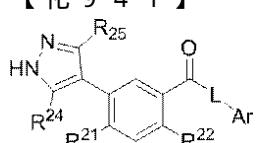
n が 1 または 2 である、項目 1 0 0 ~ 1 1 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 1 9)

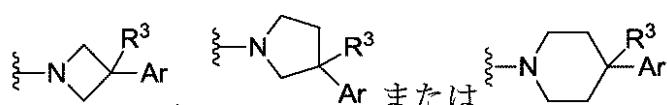
n が 1 であり、m が 2 である、項目 1 0 0 ~ 1 1 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 2 0)

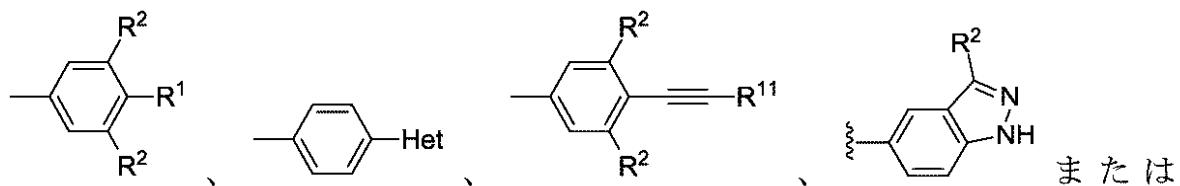
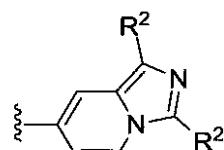
構造 I I I c を有する化合物であり：

【化 9 4 1】I I I cここで：

L - Ar は、

【化 9 4 2】であり；

Ar は、

【化 9 4 3 - 1】【化 9 4 3 - 2】であり；

Het は、5 ~ 6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、 H、 - C N、 ハロゲン、 C₁ - C₄ アルキル、 - O - (C₃ - C₅ シクロアルキル)、 - O - (4 ~ 6 員複素環) または - O - (C₁ - C₄ アルキル) であり、 ここで R¹ が H、 - C N またはハロゲンでない場合、 R¹ は 1 つ以上のハロゲンで置換されてもよく；

各 R² は、 独立して水素、 ハロゲンまたは C₁ - C₄ アルキルであり；

R³ は、 H または F であり；

R¹ は、 H または - CH₃ であり；

R² は、 H、 ハロゲン、 C₁ - C₄ アルキル、 C₃ - C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

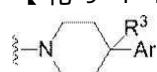
R² は、 H、 ハロゲンまたは C₁ - C₂ アルキルであり； ならびに、

各 R² および R² は、 独立して H、 - C₁ - C₄ アルキル、 またはハロゲンである、 前記化合物またはその薬剤的に許容できる塩。

(項目 121)

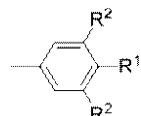
L - Ar が

【化 944】



であり、 Ar が

【化 945】

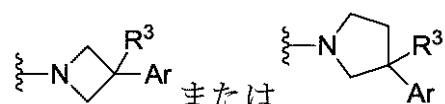


でない、 項目 120 に記載の化合物。

(項目 122)

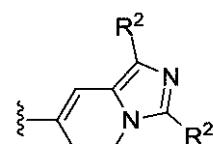
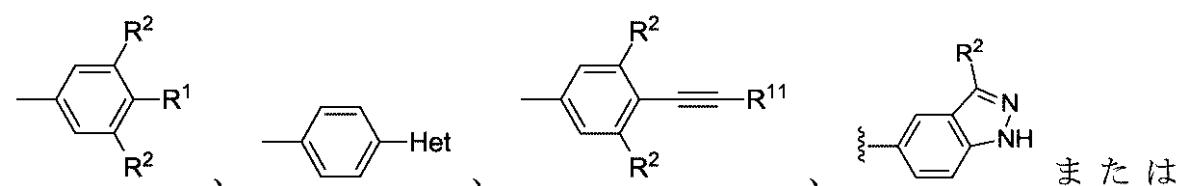
L - Ar が

【化 946】



であり、 Ar が

【化 947】



である、項目120に記載の化合物。

(項目123)

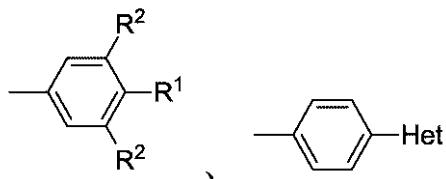
L-Arが

【化948】

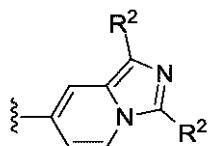


であり、Arが

【化949】



または



である、項目122に記載の化合物。

(項目124)

R¹がハロゲン、-CNまたはC₁-C₂ハロアルキルである、項目120~123のいずれか1項に記載の化合物。

(項目125)

R²¹がハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₃-C₅シクロアルキルまたは4~6員複素環である、項目120~124のいずれか1項に記載の化合物。

(項目126)

R²¹が-C₁H₃である、項目125に記載の化合物。

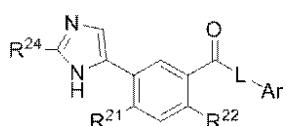
(項目127)

R²²がHである、項目120~126のいずれか1項に記載の化合物。

(項目128)

構造IVを有する化合物であり：

【化950】

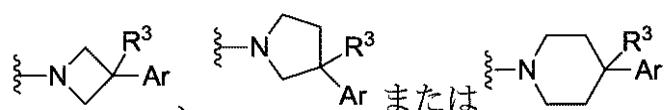


IV

ここで：

L-Arは、

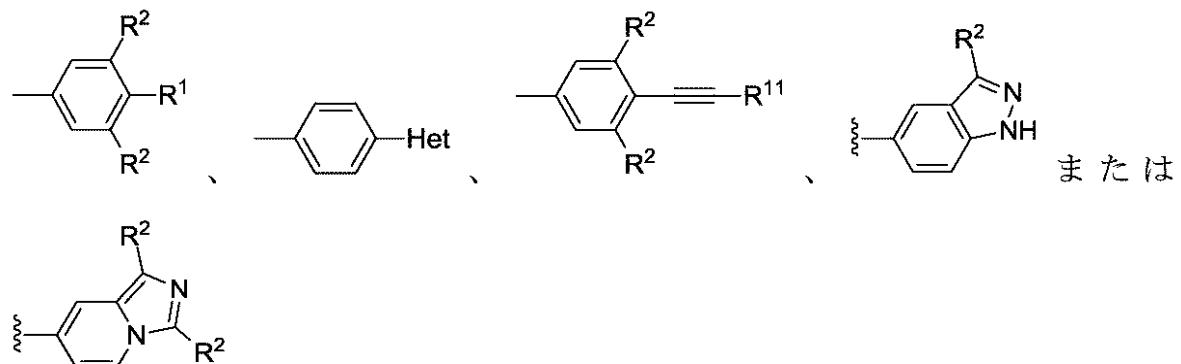
【化951】



であり；

A r は、

【化 9 5 2】



または

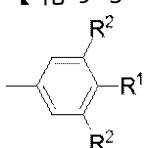
であり、ただし L - A r が

【化 9 5 3】



である時、A r は

【化 9 5 4】



ではなく；

H e t は、5 ~ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-C N、ハロゲン、C₁ - C₄ アルキル、-O-(C₃ - C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ~ 6 員複素環)または-O-(C₁ - C₄ アルキル)であり、ここでR¹がH、-C Nまたはハロゲンではない場合、R¹は1つ以上のハロゲンで置換してもよい；

各R²は、独立して水素、ハロゲンまたはC₁ - C₄ アルキルであり；

R³ は、HまたはFであり；

R¹ は、Hまたは-C H₃ であり；

R² は、H、ハロゲン、C₁ - C₄ アルキル、C₃ - C₅ シクロアルキルまたは4 ~ 6 員複素環であり；

R² は、H、ハロゲンまたはC₁ - C₂ アルキルであり；ならびに

R² は、H、C₁ - C₄ アルキル、-(C₁ - C₄ アルキル)-O H、-(C₁ - C₄ アルキル)-N(R² 1)、-(C₁ - C₄ アルキル)-O_u-(C₃ - C₅ シクロアルキル)、-(C₁ - C₄ アルキル)-O_u-(4 ~ 6 員複素環)または-(C₁ - C₄ アルキル)-O-(C₁ - C₄ アルキル)、ここで：

t は、0または1であり；

u は、0または1であり；

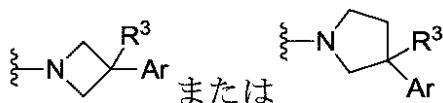
ただし u が 1 である時、t は 1 であり；および、

R² は、HまたはC₁ - C₂ アルキルである、前記化合物またはその薬剤的に許容できる塩。

(項目 129)

L-Arが

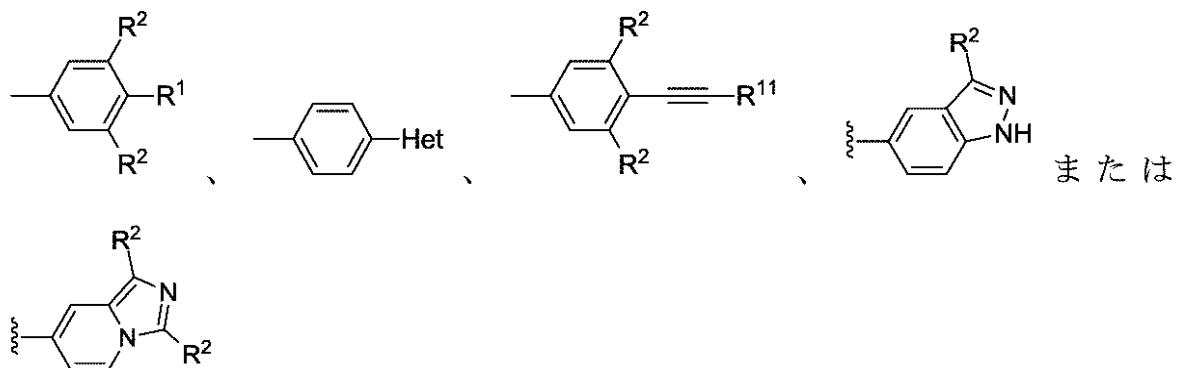
【化955】



または

であり、Arが

【化956】



または

である、項目128に記載の化合物。

(項目130)

R¹がハロゲン、-CNまたはC₁-C₂ハロアルキルである、項目128または129に記載の化合物。

(項目131)

R¹が-CNである、項目130に記載の化合物。

(項目132)

R²がHである、項目128~131のいずれか1項に記載の化合物。

(項目133)

R²¹がハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₃-C₅シクロアルキルまたは4~6員複素環である、項目128~132のいずれか1項に記載の化合物。

(項目134)

R²¹がC₁-C₂アルキルまたはC₃-C₅シクロアルキルである、項目133に記載の化合物。

(項目135)

R²¹がC₁-C₂アルキルである、項目134に記載の化合物。

(項目136)

R²¹がC₃-C₅シクロアルキルである、項目134に記載の化合物。

(項目137)

R²²がHまたはC₁-C₂アルキルである、項目128~136のいずれか1項に記載の化合物。

(項目138)

R²²がHである、項目137に記載の化合物。

(項目139)

R²²がC₁-C₂アルキルである、項目137に記載の化合物。

(項目140)

R²²が-C₁H₃である、項目139に記載の化合物。

(項目141)

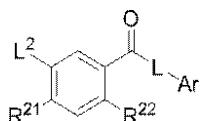
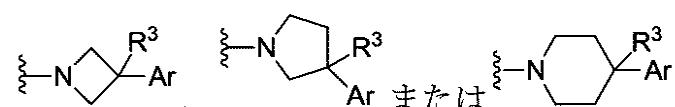
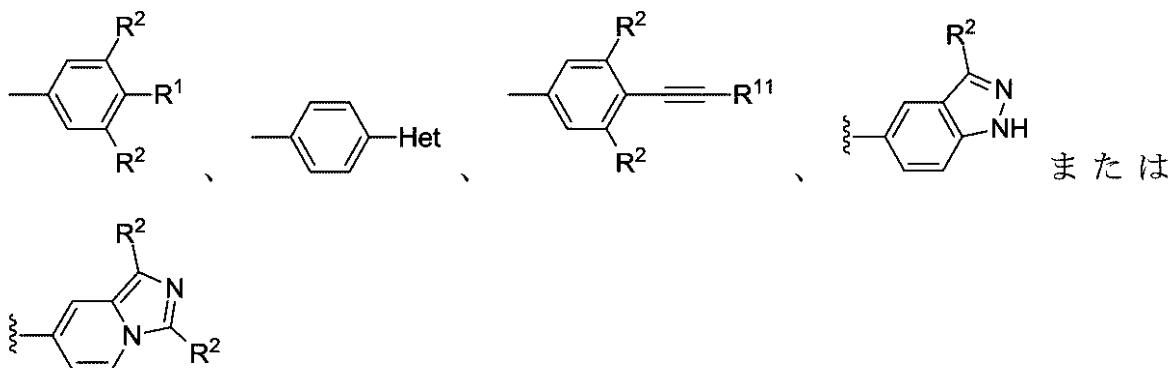
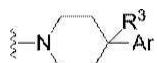
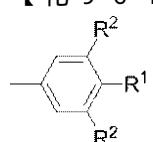
R^{2~4} が C₁ - C₄ アルキルまたは - (C₁ - C₄ アルキル) - O - (C₁ - C₄ アルキル) である、項目128~140のいずれか1項に記載の化合物。

(項目142)

R^{2~4} が - (C₁ - C₂ アルキル) - O - (C₁ - C₂ アルキル) である、項目141に記載の化合物。

(項目143)

構造Vを有する化合物であり：

【化957】Vここで：L - Ar は、【化958】であり；Ar は、【化959】であり、ただし L - Ar が【化960】である時、Ar は【化961】

でなく；

L²は、-NHR³R⁵または-C(O)NHR³R⁵1であり、ここで、R³R⁵1はC₁-C₆アルキル、C₃-C₅シクロアルキル、4~6員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Hetは、5~6員ヘテロアリールであり；

R¹は、H、-CN、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、-O-(C₃-C₅シクロアルキル)、-O-(4~6員複素環)、-O-(C₁-C₄アルキル)であり、ここで、R¹がH、-CNまたはハロゲンでない場合、R¹は1つ以上のハロゲンで置換されていてもよく；

各R²は、独立して水素、ハロゲンまたはC₁-C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹1は、Hまたは-CH₃であり；

R²1は、H、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₃-C₅シクロアルキルまたは4~6員複素環であり；

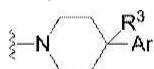
R²2は、H、ハロゲン、またはC₁-C₂アルキルであり；ならびに、

R³5は、-C(O)R³R⁵1、-C(O)NHR³R⁵1、C(O)OR³R⁵1またはS(O)₂R³R⁵1であり、ここで、R³R⁵1はC₁-C₆アルキル、C₃-C₅シクロアルキル、4~6員複素環、アリールまたはヘテロアリールである、前記化合物またはその薬剤的に許容できる塩。

(項目144)

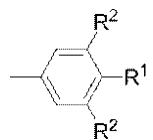
L-Arが

【化962】



である時、Arは

【化963】



ではない、項目143に記載の化合物。

(項目145)

L²が-NHR³R⁵である、項目143または144に記載の化合物。

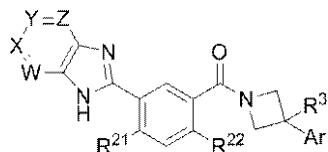
(項目146)

L²が-C(O)NHR³R⁵1である、項目143または144に記載の化合物。

(項目147)

構造V Iを有する化合物であり：

【化964】

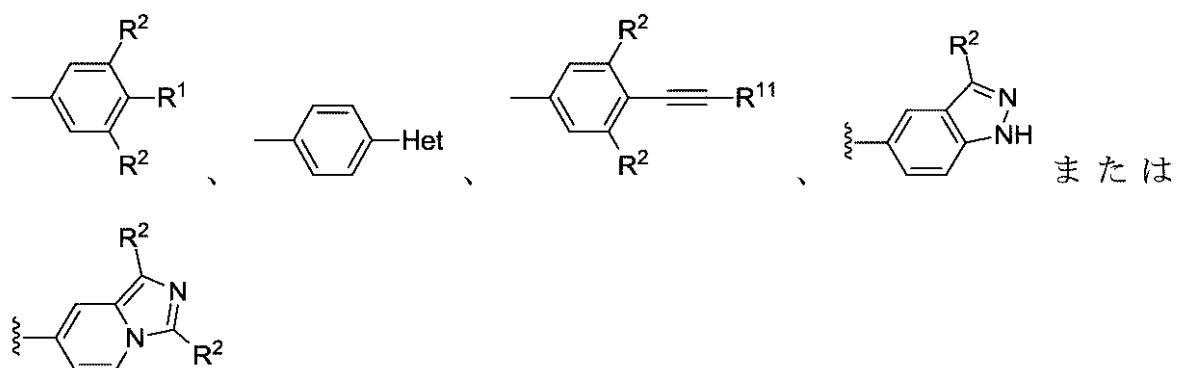


V Iここで：

各W、X、YおよびZは、独立して-N-または-CR²₆-であり、ただしW、X、YおよびZのうち2つより多くが-N-であることはなく；

各R²₆は、独立してH、C₁-C₄アルキル、-O-(C₁-C₄アルキル)、-N(R²₇)₂、-S(O)₂-(C₁-C₄アルキル)、または-C(O)-(C₁-C₄アルキル)であり；

各R²₇は、独立してHまたはC₁-C₄アルキルであり、または、双方のR²₇はC₁-C₄アルキルであり、それらが結合するNと結合して一緒に3~6員環を形成し、ここで、前記環は前記環の1員として1つの酸素原子を含んでいてもよく；

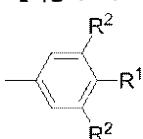
A r は、【化965】であり；H e tは、5~6員ヘテロアリールであり；

R¹は、H、-CN、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、-O-(C₃-C₅シクロアルキル)、-O-(4~6員複素環)、-O-(C₁-C₄アルキル)であり、ここでR¹がH、-CNまたはハロゲンでない場合、R¹は1つ以上のハロゲンで置換されていてもよく；

各R²は、独立して水素、ハロゲンまたはC₁-C₄アルキルであり；R³は、HまたはFであり；R¹₁は、Hまたは-C₁H₃であり；

R²₁は、H、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₃-C₅シクロアルキルまたは4~6員複素環であり；ならびに

R²₂は、H、ハロゲンまたはC₁-C₂アルキルである、前記化合物またはその薬剤的に許容できる塩。

(項目148)A r が【化966】である、項目147に記載の化合物。(項目149)

Yが-CR²₆-であり、ここでR²₆は-N(R²₇)₂である、項目147または148に記載の化合物。

(項目150)

Xが-N-である、項目147～149のいずれか1項に記載の化合物。

(項目151)

項目1～150のいずれかの化合物および薬剤的に許容できる担体、賦形剤または希釈剤を含む医薬組成物。

(項目152)

対象のウイルス感染を治療する方法であり、項目1～150のいずれかの化合物または項目151の医薬組成物の治療上有効な量を前記対象に投与することを含む、前記方法。

(項目153)

前記ウイルス感染がC型肝炎感染を含む、項目152に記載の方法。

(項目154)

対象の脂肪酸合成酵素経路の調節不全を特徴とする状態を、項目1～150のいずれかの化合物または項目151の医薬組成物の治療上有効な量を前記対象に投与することで治療する方法。

(項目155)

対象のがんを治療する方法であり、項目1～150のいずれかの化合物または項目151の医薬組成物の治療上有効な量を前記対象に投与することを含む、前記方法。

(項目156)

前記がんが、乳癌、膵癌また大腸癌である、項目155に記載の方法。

(項目157)

前記がんが膵癌である、項目155に記載の方法。