

【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 0 7 D 205/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/10 (2006.01)

C 0 7 D 403/10 (2006.01)

C 0 7 D 403/14 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 405/04 (2006.01)

C 0 7 D 211/26 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/4178 (2006.01)

A 6 1 K 31/397 (2006.01)

A 6 1 K 31/451 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/4545 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/4525 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 31/4155 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/08 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 205/04

C 0 7 D 401/10 C S P

C 0 7 D 403/10

C 0 7 D 403/14

C 0 7 D 471/04 1 0 1

C 0 7 D 471/04 1 0 8 X

C 0 7 D 401/04

C 0 7 D 405/04

C 0 7 D 471/04 1 0 6 A

C 0 7 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

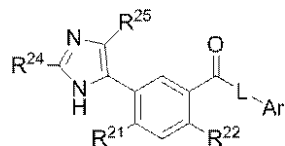
【補正の内容】

【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 9 0 1】

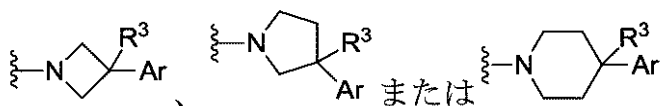


I I I

ここで、

L - A r は、

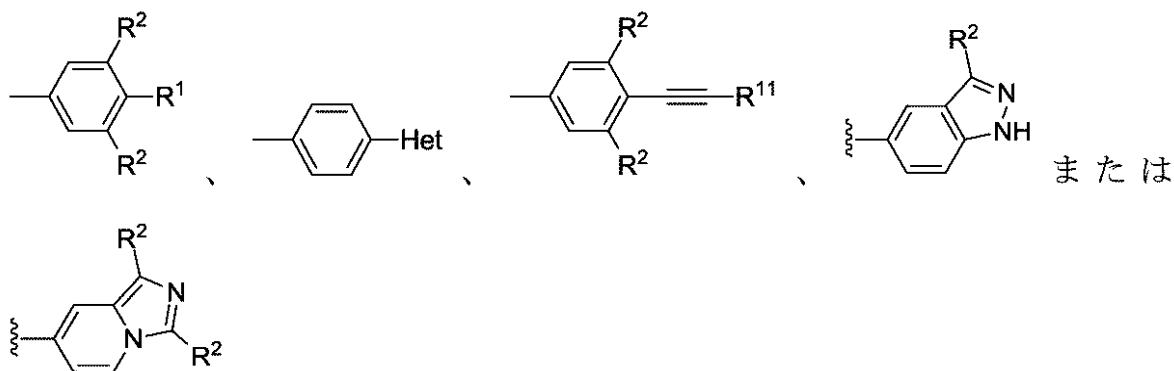
【化 9 0 2】



であり；

Ar は、

【化903】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R<sup>1</sup> は、H、-CN、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、-O-(C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)であり、ここで、R<sup>1</sup>がH、-CNまたはハロゲンではない場合、R<sup>1</sup>は1つ以上のハロゲンで置換されていてもよく；

各R<sup>2</sup>は、独立して水素、ハロゲンまたはC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルであり；

R<sup>3</sup>は、HまたはFであり；

R<sup>11</sup>は、Hまたは-CH<sub>3</sub>であり；

R<sup>21</sup>は、H、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R<sup>22</sup>は、H、ハロゲン、またはC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>アルキルであり；

R<sup>24</sup>は、H、-CN、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)-CN、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)-OH、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)-N(R<sup>241</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)<sub>t</sub>-O<sub>u</sub>-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル)、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)<sub>t</sub>-O<sub>u</sub>-(4～6員複素環)または-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>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R<sup>241</sup>は、独立してHまたはC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>アルキルであり；ならびに、

R<sup>25</sup>は、ハロゲン、-CN、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)-CN、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>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剂的に許容できる塩。

【請求項2】

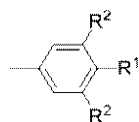
L-Arが

【化904】



である場合、Arは

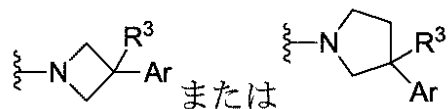
【化905】



ではない、請求項 1 に記載の化合物。

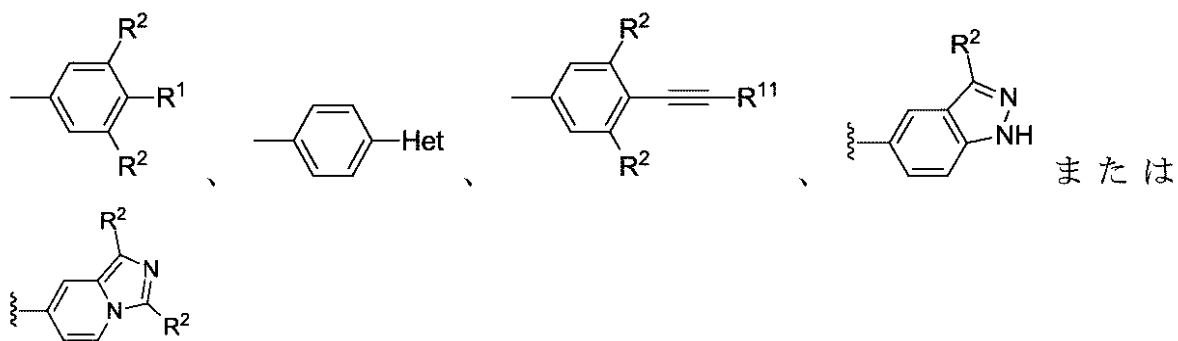
【請求項 3】

i) L - Ar が  
【化 906】



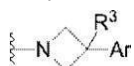
であり、Ar が

【化 907】



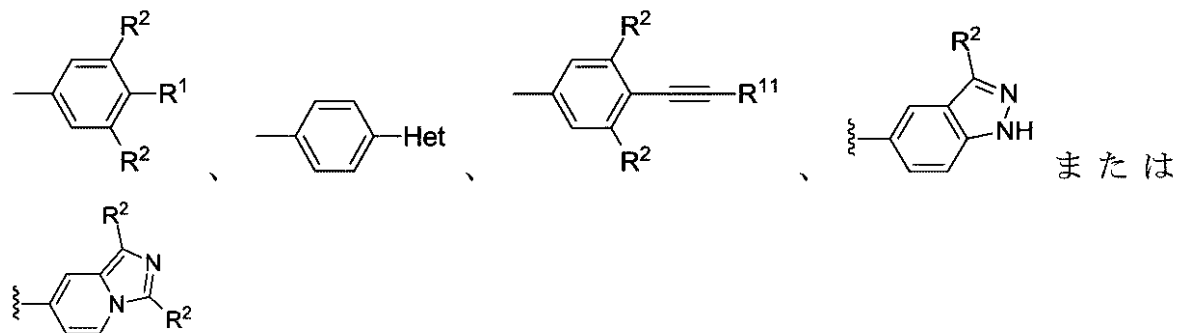
であるか、あるいは

L - Ar が  
【化 908】



であり、Ar が

【化 909】

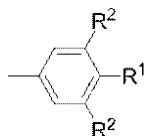


である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

Ar が

## 【化 9 1 0】



である、請求項 3 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

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 i i)  $R^1$  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】

$R^2$  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)  $R^{2,1}$  がハロゲン、 $C_1 - C_4$  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 i i)  $R^{2,1}$  が  $C_1 - C_4$  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 i i i)  $R^{2,1}$  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 i v)  $R^{2,1}$  が  $C_1 - C_2$  アルキルであるか、あるいは v)  $R^{2,1}$  が  $-CH_3$  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)  $R^{2,2}$  が H または  $C_1 - C_2$  アルキルであるか、あるいは i i)  $R^{2,2}$  が H または  $-CH_3$  であるか、あるいは i i i)  $R^{2,2}$  が  $-CH_3$  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)  $R^{2,4}$  が H、 $-CN$ 、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 - C_4$  アルキル、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{2,4,1})_2$ 、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 - C_6 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$  または  $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - O - (C_1 - C_4 \text{ アルキル})$  であるか、あるいは i i)  $R^{2,4}$  が H、 $C_1 - C_4$  アルキル、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{2,4,1})_2$ 、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 - C_6 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$  または  $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - O - (C_1 - C_4 \text{ アルキル})$  であるか、あるいは i i i)  $R^{2,4}$  が  $C_1 - C_4$  アルキルまたは  $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - O - (C_1 - C_4 \text{ アルキル})$  であるか、あるいは i v)  $R^{2,4}$  が  $-(C_1 - C_2 \text{ アルキル}) - O - (C_1 - C_2 \text{ アルキル})$  であるか、あるいは v)  $R^{2,4}$  が  $C_1 - C_2$  アルキルであるか、あるいは v i)  $R^{2,4}$  が  $C_3 - C_6$  シクロアルキルであるか、あるいは v i i)  $R^{2,4}$  が  $-CN$  または  $-(C_1 - C_2 \text{ アルキル}) - CN$  であるか、あるいは v i i i)  $R^{2,4}$  が  $-(C_1 - C_2 \text{ アルキル}) - CN$  であるか、あるいは i x)  $R^{2,4}$  がメチル、イソプロピル、シクロプロピル、 $-CN$  または  $-(C_1 - C_2 \text{ アルキル}) - CN$  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)  $R^{2,4}$  が  $-CH_2 - O - CH_3$  であるか、あるいは i i)  $R^{2,4}$  が  $-CH_3$  であるか、あるいは i i i)  $R^{2,4}$  が  $-CN$  であるか、あるいは i v)  $R^{2,4}$  が H、 $-CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2OCH_3$ 、 $-(CH_2)_2OH$ 、 $-(CH_2)_2OCH_3$  または  $-(CH_2)_2N(CH_3)_2$  である、請求項 9 に記載の化合物。

## 【請求項 11】

$R^{2,4}$  が  $C_1 - C_2$  アルキル、オキソ、 $-CN$ 、ハロゲン、アルカノイル、アルコシカルボニル、 $-OH$  および  $C_1 - C_2$  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  $R^{2,4}$  がメチル、 $-F$ 、メトキシ、 $-C(=O)CH_3$  および  $C(=O) - OCH_3$  から選択される 1 つ以上の置換基で置換される、請求項 9 に記載の化合物

。

## 【請求項 1 2】

i)  $R^{24}$  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 ii)  $R^{24}$  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)  $R^{25}$  がハロゲン、 $-CN$ 、 $C_1 - C_2$  アルキルまたはシクロプロピルであるか、あるいは ii)  $R^{25}$  がハロゲン、 $C_1 - C_2$  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)  $R^{25}$  が  $-CN$ 、 $-Cl$  または  $-CH_3$  であるか、あるいは ii)  $R^{25}$  が  $-Cl$  または  $R^{25}$  が  $-CH_3$  である、請求項 1 3 に記載の化合物。

## 【請求項 1 5】

i)  $R^{25}$  が  $-OH$ 、ハロゲン、 $C_1 - C_2$  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 ii)  $R^{25}$  が  $-F$ 、メチルおよび  $O - C(=O) - CH_3$  から選択される 1 つ以上の置換基で置換される、請求項 1 ~ 1 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

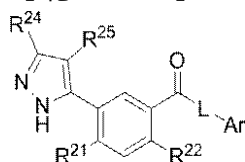
## 【請求項 1 6】

i)  $R^{25}$  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 ii)  $R^{25}$  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 II I b を有する化合物であり：

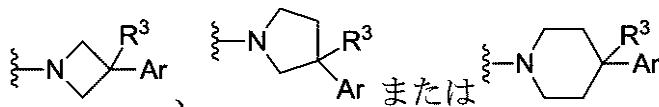
## 【化 9 1 1】

II I b

ここで、

$L - Ar$  は、

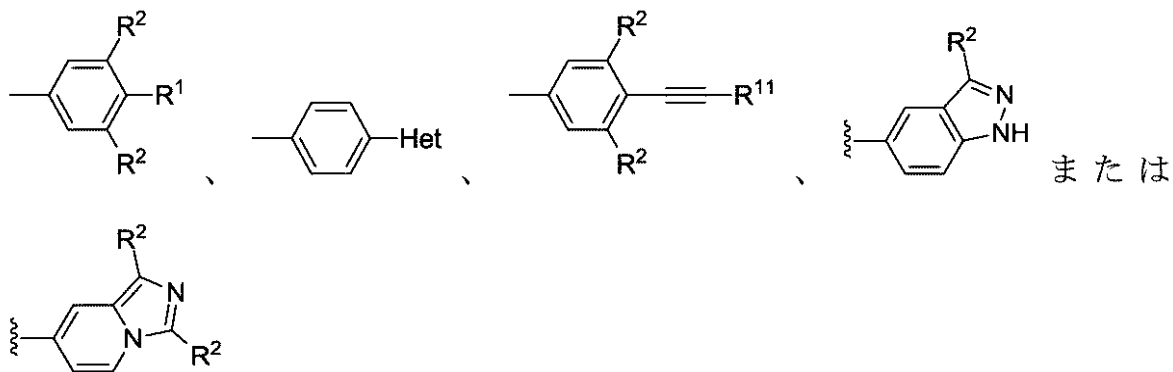
## 【化 9 1 2】



であり；

$Ar$  は、

## 【化 9 1 3】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R<sup>1</sup> は、H、- C N、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、- O - (C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub> シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) であり、ここで、R<sup>1</sup> が H、- C N またはハロゲンではない場合、R<sup>1</sup> は 1 つ以上のハロゲンで置換されていてもよく；

各 R<sup>2</sup> は、独立して水素、ハロゲンまたは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルであり；

R<sup>3</sup> は、H または F であり；

R<sup>11</sup> は、H または - C H<sub>3</sub> であり；

R<sup>21</sup> は、H、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub> シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R<sup>22</sup> は、H、ハロゲンまたは C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> アルキルであり；ならびに

各 R<sup>24</sup> および R<sup>25</sup> は、独立して H、ハロゲン、- C N、- (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) - C N、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、- (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) - O H、- (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) - N (R<sup>241</sup>)<sub>2</sub>、- (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)<sub>t</sub> - O<sub>u</sub> - (C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub> シクロアルキル)、- (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)<sub>t</sub> - O<sub>u</sub> - (4 ～ 6 員複素環) または - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)<sub>t</sub> - O - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) であり、ここで：

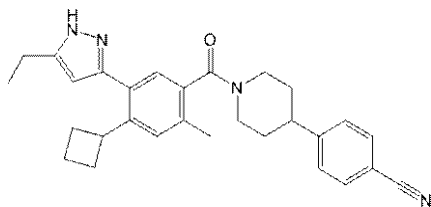
各 t は、独立して 0 または 1 であり；

各 u は、独立して 0 または 1 であり；および

各 R<sup>241</sup> は、独立して H または C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> アルキルであり、

ここで、前記化合物が：

## 【化 9 1 4】

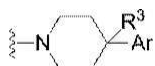


でない、前記化合物またはその薬剂的に許容できる塩。

## 【請求項 1 8】

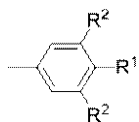
L - A r が

## 【化 9 1 5】



である時、Ar が

【化 9 1 6】

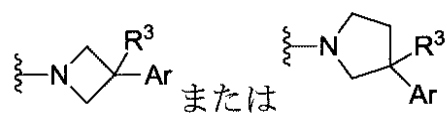


ではない、請求項 17 に記載の化合物。

【請求項 19】

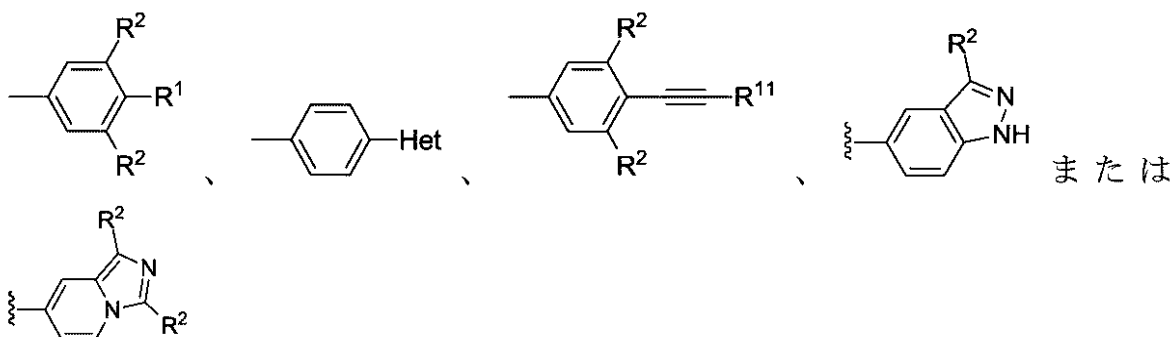
i) L - Ar が

【化 9 1 7】



であり、Ar が

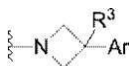
【化 9 1 8】



であるか、あるいは

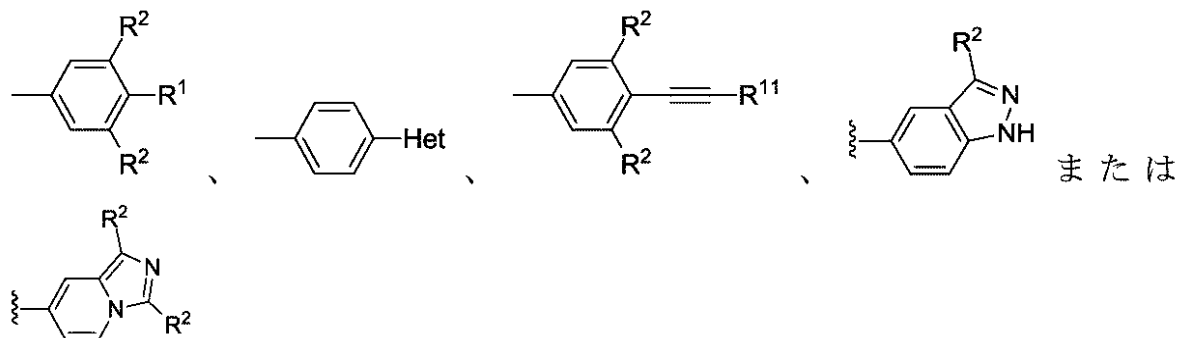
ii) L - Ar が

【化 9 1 9】



であり、Ar が

【化 9 2 0】



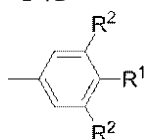


である、請求項 17 に記載の化合物。

【請求項 20】

Ar が

【化 921】



である、請求項 19 に記載の化合物。

【請求項 21】

i) R<sup>1</sup> がハロゲン、-CN または C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> ハロアルキルであるか、あるいは ii) R<sup>1</sup> が -CN である、請求項 17 ~ 20 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 22】

R<sup>2</sup> が H である、請求項 17 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 23】

i) R<sup>21</sup> がハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 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<sup>21</sup> が C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であるか、あるいは iii) R<sup>21</sup> が C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> アルキルまたは C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> シクロアルキルであるか、あるいは iv) R<sup>21</sup> が C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> アルキルであるか、あるいは v) R<sup>21</sup> が -CH<sub>3</sub> である、請求項 17 ~ 22 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 24】

i) R<sup>22</sup> が H または C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> アルキルであるか、あるいは ii) R<sup>22</sup> が H または -CH<sub>3</sub> であるか、あるいは iii) R<sup>22</sup> が -CH<sub>3</sub> である、請求項 17 ~ 23 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 25】

i) 各 R<sup>24</sup> および R<sup>25</sup> が独立して H、-CN、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル)-OH、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル)-N(R<sup>241</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル)<sub>t</sub>-O<sub>u</sub>-(C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> シクロアルキル)、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル)<sub>t</sub>-O<sub>u</sub>-(4 ~ 6 員複素環) または -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル)-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル) であるか、あるいは ii) 各 R<sup>24</sup> および R<sup>25</sup> が独立して H、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル)<sub>t</sub>-O<sub>u</sub>-(4 ~ 6 員複素環) または -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル)-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル) であるか、あるいは iii) R<sup>24</sup> が H、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル)-OH、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル)-N(R<sup>241</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル)<sub>t</sub>-O<sub>u</sub>-(C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> シクロアルキル)、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル)<sub>t</sub>-O<sub>u</sub>-(4 ~ 6 員複素環) または -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル)-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル) であるか、あるいは iv) R<sup>24</sup> が -CN、-Cl、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキルまたは -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル)-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル) であるか、あるいは v) R<sup>24</sup> が C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキルまたは -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル)-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル) であるか、あるいは vi) R<sup>24</sup> が -(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> アルキル)-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> アルキル) であるか、あるいは vii) R<sup>24</sup> が C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキルである、請求項 17 ~ 24 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 26】

i) R<sup>24</sup> が -CH<sub>3</sub> であるか、あるいは ii) R<sup>24</sup> が水素である、請求項 17 ~ 25 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 27】

i) R<sup>24</sup> がハロゲン、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> シクロアルキルおよび C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 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)  $R^{24}$  が - F、シクロプロピルおよび  $OC H_3$  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)  $R^{24}$  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)  $R^{24}$  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)  $R^{25}$  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)  $R^{25}$  が - CN、- Cl、 $C_1 - C_4$  アルキル、- ( $C_1 - C_4$  アルキル)<sub>t</sub> - O - ( $C_3 - C_5$  シクロアルキル) または - ( $C_1 - C_4$  アルキル)<sub>t</sub> - O - ( $C_1 - C_4$  アルキル) であるか、あるいは i i i)  $R^{25}$  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)  $R^{25}$  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)  $R^{25}$  が -  $CH_3$  であるか、あるいは i i)  $R^{25}$  が - Cl である、請求項 17 ~ 29 のいずれか 1 項に記載の化合物。

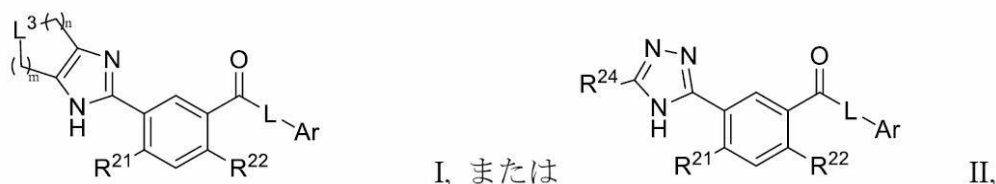
【請求項 31】

i)  $R^{25}$  が 1 つ以上のハロゲンで置換されるか、あるいは i i)  $R^{25}$  が 1 つ以上の - F で置換されるか、あるいは i i i)  $R^{25}$  が 2 つの置換基で置換されるか、あるいは i v)  $R^{25}$  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】



ここで：

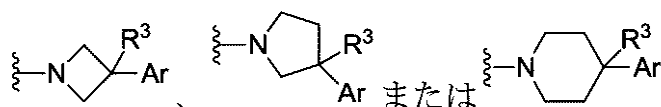
L<sup>3</sup> は、- CH<sub>2</sub> -、- CHR<sup>50</sup> -、- O -、- NR<sup>50</sup> -、- NC(O)R<sup>50</sup> -、または - NC(O)OR<sup>50</sup> - であり、ここで、R<sup>50</sup> は  $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_3 - C_5$  シクロアルキル、または 4 ~ 6 員複素環であり；

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、

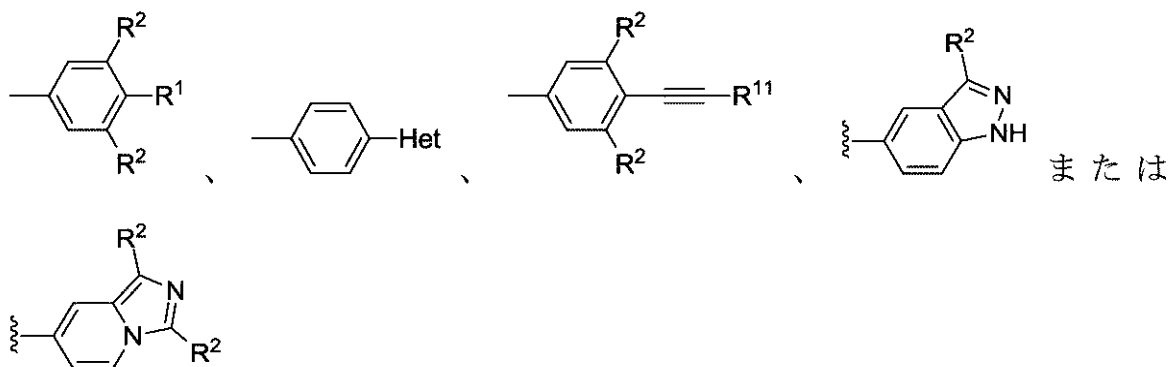
【化 923】



であり；

Ar は、

## 【化 9 2 4】



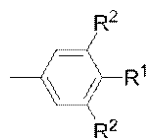
であり、ただし L - Ar が

## 【化 9 2 5】



である時、Ar は

## 【化 9 2 6】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R<sup>1</sup> は、H、-CN、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-O- (C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub> シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) であり、ここで、R<sup>1</sup> が H、-CN またはハロゲンでない場合、R<sup>1</sup> は 1 つ以上のハロゲンで置換されている；

各 R<sup>2</sup> は、独立して水素、ハロゲンまたは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルであり；

R<sup>3</sup> は、H または F であり；

R<sup>11</sup> は、H または -CH<sub>3</sub> であり；

R<sup>21</sup> は、H、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub> シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R<sup>22</sup> は、H、ハロゲン、または C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> アルキルであり；ならびに、

R<sup>24</sup> は、H、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、- (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) - OH、- (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)<sub>t</sub> - N (R<sup>241</sup>)<sub>2</sub>、- (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)<sub>t</sub> - O<sub>t</sub> - (C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub> シクロアルキル)、- (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)<sub>t</sub> - O<sub>t</sub> - (4 ～ 6 員複素環) または - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)<sub>t</sub> - O - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) であり、ここで：

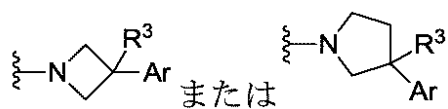
各 t は、独立して 0 または 1 であり；および、

各 R<sup>241</sup> は、独立して H または C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> アルキルである、前記化合物またはその薬剂的に許容できる塩。

## 【請求項 33】

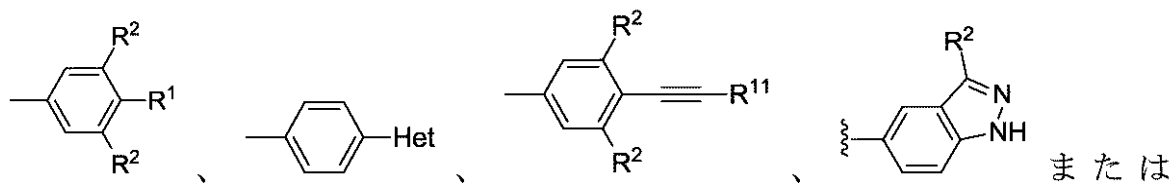
i) L - Ar が

【化 9 2 7】

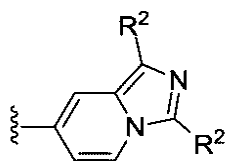


であり、Ar が

【化 9 2 8 - 1】



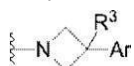
【化 9 2 8 - 2】



であるか、あるいは

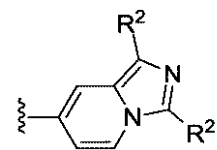
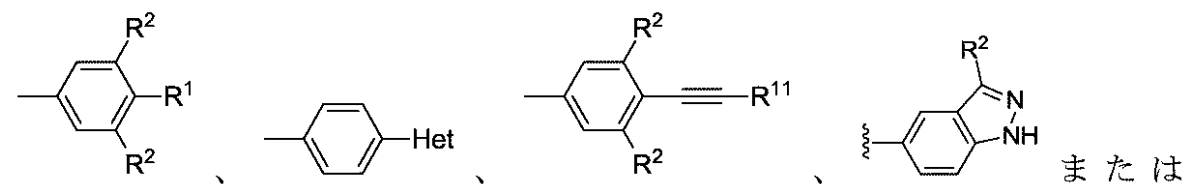
i i) L - Ar が

【化 9 2 9】



であり、Ar が

【化 9 3 0】

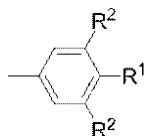


である、請求項 3 2 に記載の化合物。

【請求項 3 4】

Ar が

## 【化 9 3 1】



である、請求項 3 3 に記載の化合物。

## 【請求項 3 5】

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  $-CN$  または  $C_1 - C_2$  ハロアルキルであるか、あるいは iii)  $R^1$  が  $-CN$  であるか、あるいは iv)  $R^1$  が  $-Cl$  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 3 6】

$R^2$  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 3 7】

i)  $R^{21}$  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)  $R^{21}$  が H、 $C_1 - C_4$  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 iii)  $R^{21}$  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 iv)  $R^{21}$  が  $C_3 - C_5$  シクロアルキルであるか、あるいは v)  $R^{21}$  が  $C_1 - C_2$  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 3 8】

i)  $R^{22}$  が H または  $C_1 - C_2$  アルキルであるか、あるいは ii)  $R^{22}$  が H であるか、あるいは iii)  $R^{22}$  が  $C_1 - C_2$  アルキルであるか、あるいは iv)  $R^{22}$  が  $-CH_3$  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 3 9】

i)  $R^{24}$  が  $C_1 - C_4$  アルキルまたは  $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 - C_4 \text{ アルキル})$  であるか、あるいは ii)  $R^{24}$  が  $-(C_1 - C_2 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 - C_2 \text{ アルキル})$  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 4 0】

$L^3$  が  $-N(CH_3)-$  である、請求項 3 2 ~ 3 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

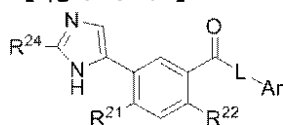
## 【請求項 4 1】

i)  $n$  が 2 であり、 $m$  が 2 であるか、あるいは ii)  $n$  が 1 または 2 であるか、あるいは iii)  $n$  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 4 2】

構造 IV を有する化合物であり：

## 【化 9 5 0】

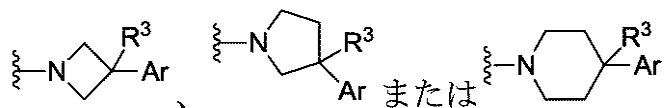


IV

ここで：

$L - Ar$  は、

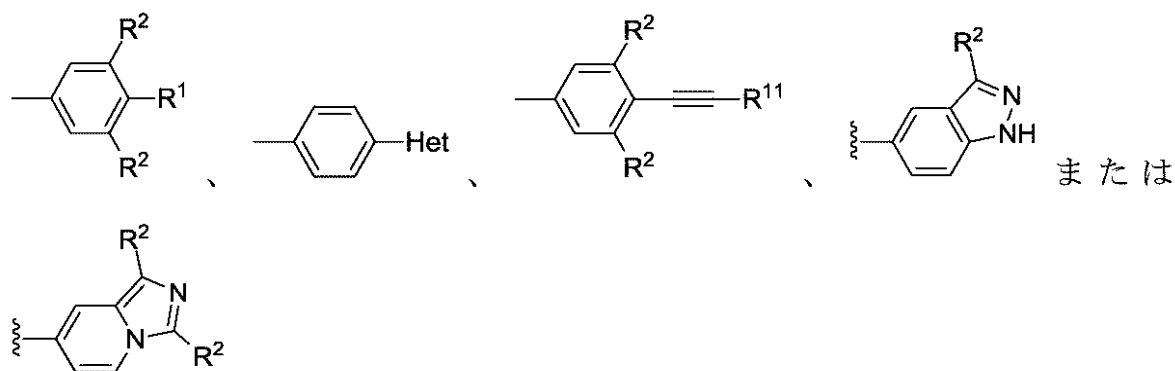
## 【化 9 5 1】



であり；

Ar は、

## 【化 9 5 2】



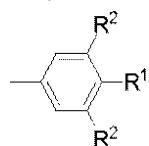
であり、ただし L - Ar が

## 【化 9 5 3】



である時、Ar は

## 【化 9 5 4】



ではなく；

Het は、5～6員ヘテロアリーールであり；

$R^1$  は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  アルキル、-O- ( $C_3 - C_5$  シクロアルキル)、-O- (4～6員複素環) または -O- ( $C_1 - C_4$  アルキル) であり、ここで  $R^1$  が H、-CN または ハロゲンではない場合、 $R^1$  は 1 つ以上のハロゲンで置換されている；

各  $R^2$  は、独立して水素、ハロゲンまたは  $C_1 - C_4$  アルキルであり；

$R^3$  は、H または F であり；

$R^{11}$  は、H または -CH<sub>3</sub> であり；

$R^{21}$  は、H、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員複素環であり；

$R^{22}$  は、H、ハロゲンまたは  $C_1 - C_2$  アルキルであり；ならびに

$R^{24}$  は、H、 $C_1 - C_4$  アルキル、- ( $C_1 - C_4$  アルキル) - OH、- ( $C_1 - C_4$  アルキル) - N ( $R^{241}$ )<sub>2</sub>、- ( $C_1 - C_4$  アルキル)<sub>t</sub> - O<sub>u</sub> - ( $C_3 - C_5$  シクロアルキル)、- ( $C_1 - C_4$  アルキル)<sub>t</sub> - O<sub>u</sub> - (4～6員複素環) または - (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；

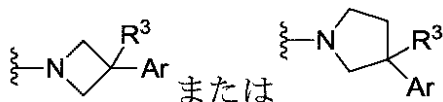
ただし u が 1 である時、t は 1 であり；および、

$R^{241}$  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剂的に許容できる塩。

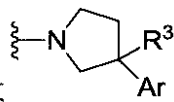
【請求項 43】

L - Ar が

【化 955】

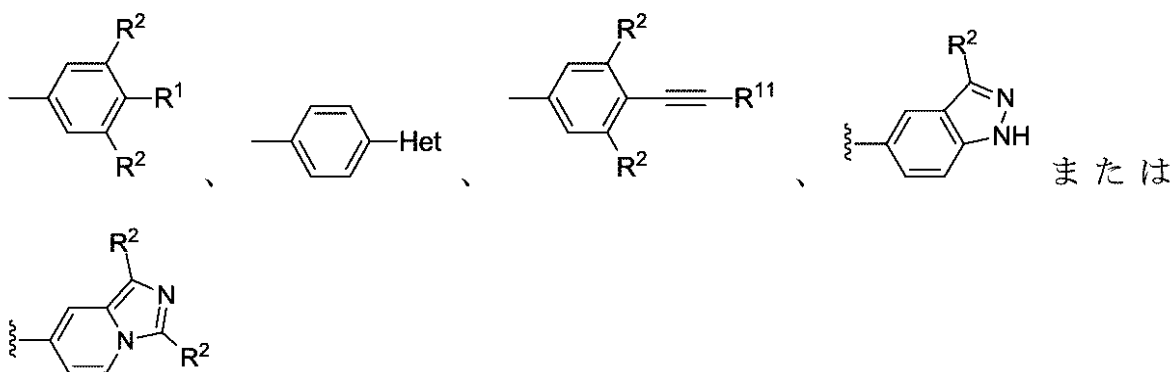


または



であり、Ar が

【化 956】



または

である、請求項 42 に記載の化合物。

【請求項 44】

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 42 または 43 に記載の化合物。

【請求項 45】

$R^2$  が H である、請求項 42 ~ 44 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 46】

i)  $R^{21}$  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)  $R^{21}$  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)  $R^{21}$  が  $C_1 - C_2$  アルキルであるか、あるいは iv)  $R^{21}$  が  $C_3 - C_5$  シクロアルキルである、請求項 42 ~ 45 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 47】

i)  $R^{22}$  が H または  $C_1 - C_2$  アルキルであるか、あるいは ii)  $R^{22}$  が H であるか、あるいは iii)  $R^{22}$  が  $C_1 - C_2$  アルキルであるか、あるいは iv)  $R^{22}$  が -CH<sub>3</sub> である、請求項 42 ~ 46 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 48】

i)  $R^{24}$  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)  $R^{24}$  が - ( $C_1 - C_2$  アルキル) - O - ( $C_1 - C_2$  アルキル) である、請求項 42 ~ 47 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 49】

請求項 1 ~ 4 8 のいずれかの化合物および薬剂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、膵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】

前記がんが膵癌である、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】

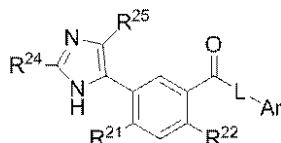
様々な態様において、本開示は、対象の脂肪酸合成酵素経路の調節不全を特徴とする状態を治療する方法を提供し、当該方法はそのような治療が必要な対象に構造 I、II、III、III b、III c、IV、V および VI のいずれか 1 つの化合物を有効な量で投与することを含む。様々な態様において、脂肪酸合成酵素経路の調節不全を特徴とする状態は、ウイルス感染またはがんである。様々な態様において、ウイルス感染は、構造 I、II、III、III b、III c、IV、V および VI のいずれか 1 つの化合物を 1 つ以上の追加の抗ウイルス治療と組み合わせて使用して、治療される。様々な態様において、がん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

【化 9 0 1】



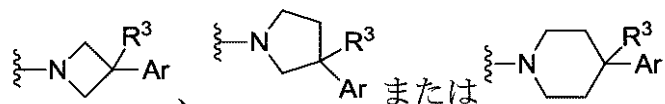
III

ここで、

L - Ar は、



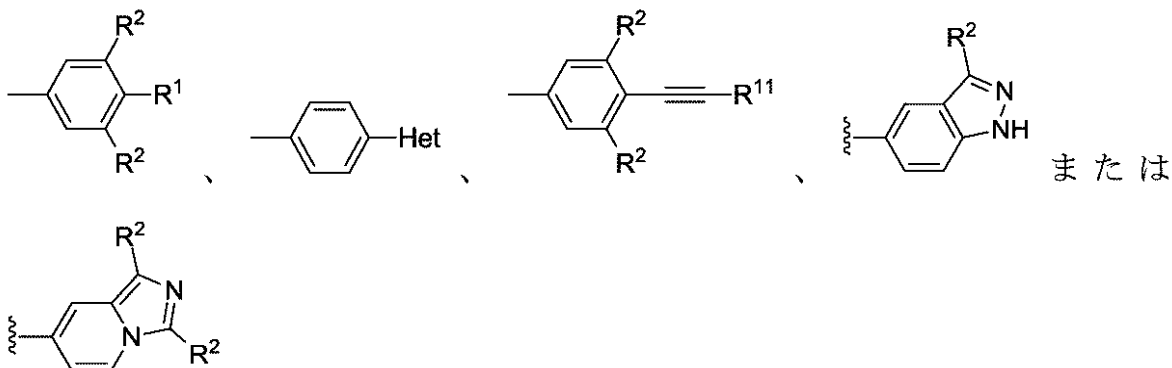
## 【化 9 0 2】



であり；

Ar は、

## 【化 9 0 3】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリアルであり；

R<sup>1</sup> は、H、-CN、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、-O-(C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)であり、ここで、R<sup>1</sup>がH、-CNまたはハロゲンではない場合、R<sup>1</sup>は1つ以上のハロゲンで置換されていてもよく；

各R<sup>2</sup>は、独立して水素、ハロゲンまたはC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルであり；

R<sup>3</sup>は、HまたはFであり；

R<sup>11</sup>は、Hまたは-CH<sub>3</sub>であり；

R<sup>21</sup>は、H、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R<sup>22</sup>は、H、ハロゲン、またはC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>アルキルであり；

R<sup>24</sup>は、H、-CN、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)-CN、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)-OH、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)-N(R<sup>241</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)<sub>t</sub>-O<sub>u</sub>-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル)、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)<sub>t</sub>-O<sub>u</sub>-(4～6員複素環)または-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>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R<sup>241</sup>は、独立してHまたはC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>アルキルであり；ならびに、

R<sup>25</sup>は、ハロゲン、-CN、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)-CN、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>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剂的に許容できる塩。

(項目2)

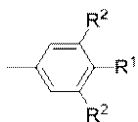
L-Arが

## 【化 9 0 4】



である場合、Ar は

【化 9 0 5】

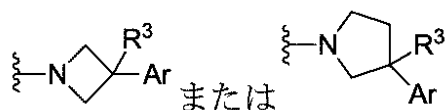


ではない、項目 1 に記載の化合物。

( 項目 3 )

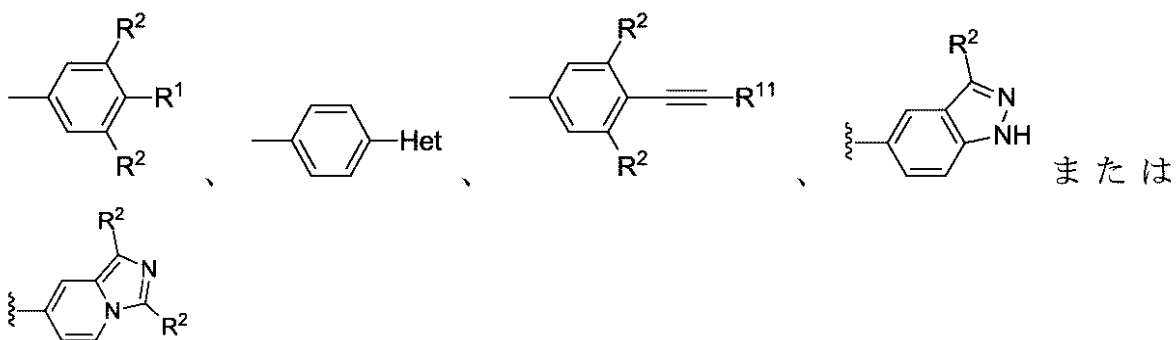
L - Ar が

【化 9 0 6】



であり、Ar が

【化 9 0 7】

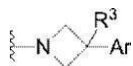


である、項目 1 に記載の化合物。

( 項目 4 )

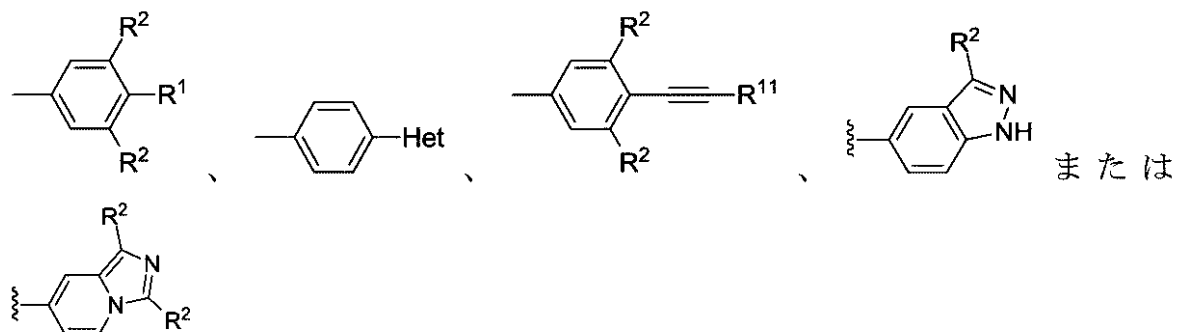
L - Ar が

【化 9 0 8】



であり、Ar が

【化 9 0 9】

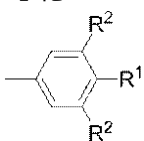


である、項目 3 に記載の化合物。

(項目 5)

Ar が

【化 9 1 0】



である、項目 4 に記載の化合物。

(項目 6)

R<sup>1</sup> がハロゲン、-CN または C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> 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)

R<sup>1</sup> が -CN である、項目 6 に記載の化合物。

(項目 8)

R<sup>2</sup> 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)

R<sup>2 1</sup> がハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルまたは C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub> 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)

R<sup>2 1</sup> が C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルまたは C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub> シクロアルキルである、項目 9 に記載の化合物。

(項目 11)

R<sup>2 1</sup> が C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> アルキルまたは C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub> シクロアルキルである、項目 10 に記載の化合物。

(項目 12)

R<sup>2 1</sup> が C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> アルキルである、項目 11 に記載の化合物。

(項目 13)

R<sup>2 1</sup> が -CH<sub>3</sub> である、項目 12 に記載の化合物。

(項目 14)

R<sup>2 2</sup> が H または C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> 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)

R<sup>2 2</sup> が H または -CH<sub>3</sub> である、項目 14 に記載の化合物。

(項目 16)

R<sup>2 2</sup> が -CH<sub>3</sub> である、項目 15 に記載の化合物。

(項目 17)

R<sup>2 4</sup> が H、-CN、-(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) - CN、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) - OH、-(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) - N(R<sup>2 4 1</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)<sub>t</sub> - O<sub>u</sub> - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル)、-(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)<sub>t</sub> - O<sub>u</sub> - (4 ~ 6 員複素環) または -(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) - O - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 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)

R<sup>2 4</sup> が H、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) - OH、-(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) - N(R<sup>2 4 1</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)<sub>t</sub> - O<sub>u</sub> - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル)、-(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)<sub>t</sub> - O<sub>u</sub> - (4 ~ 6 員複素環) または -(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) - O - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) である、項目 17 に記載の化合物。

( 項目 1 9 )

$R^{2,4}$  が  $C_1 - C_4$  アルキルまたは  $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - O - (C_1 - C_4 \text{ アルキル})$  である、項目 1 8 に記載の化合物。

( 項目 2 0 )

$R^{2,4}$  が  $-(C_1 - C_2 \text{ アルキル}) - O - (C_1 - C_2 \text{ アルキル})$  である、項目 1 9 に記載の化合物。

( 項目 2 1 )

$R^{2,4}$  が  $-CH_2 - O - CH_3$  である、項目 2 0 に記載の化合物。

( 項目 2 2 )

$R^{2,4}$  が  $C_1 - C_2$  アルキルである、項目 1 9 に記載の化合物。

( 項目 2 3 )

$R^{2,4}$  が  $-CH_3$  である、項目 2 2 に記載の化合物。

( 項目 2 4 )

$R^{2,4}$  が  $C_3 - C_6$  シクロアルキルである、項目 1 8 に記載の化合物。

( 項目 2 5 )

$R^{2,4}$  が  $-CN$  または  $-(C_1 - C_2 \text{ アルキル}) - CN$  である、項目 1 7 に記載の化合物。

( 項目 2 6 )

$R^{2,4}$  が  $-CN$  である、項目 2 5 に記載の化合物。

( 項目 2 7 )

$R^{2,4}$  が  $-(C_1 - C_2 \text{ アルキル}) - CN$  である、項目 2 5 に記載の化合物。

( 項目 2 8 )

$R^{2,4}$  が  $H$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2OCH_3$ 、 $-(CH_2)_2OH$ 、 $-(CH_2)_2OCH_3$  または  $-(CH_2)_2N(CH_3)_2$  である、項目 1 7 に記載の化合物。

( 項目 2 9 )

$R^{2,4}$  がメチル、イソプロピル、シクロプロピル、 $-CN$  または  $-(C_1 - C_2 \text{ アルキル}) - CN$  である、項目 1 7 に記載の化合物。

( 項目 3 0 )

$R^{2,4}$  が  $C_1 - C_2$  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  $C_1 - C_2$  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 ~ 2 0、2 2、2 4 ~ 2 5、2 7 および 2 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

( 項目 3 1 )

$R^{2,4}$  がメチル、 $-F$ 、メトキシ、 $-C(=O)CH_3$  および  $C(=O) - OCH_3$  から選択される 1 つ以上の置換基で置換される、項目 3 0 に記載の化合物。

( 項目 3 2 )

$R^{2,4}$  が同一または異なる 2 つの置換基で置換される、項目 3 0 または 3 1 に記載の化合物。

( 項目 3 3 )

$R^{2,4}$  が同一または異なる 3 つの置換基で置換される、項目 3 0 または 3 1 に記載の化合物。

( 項目 3 4 )

$R^{2,5}$  がハロゲン、 $-CN$ 、 $C_1 - C_2$  アルキルまたはシクロプロピルである、項目 1 ~ 3 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

( 項目 3 5 )

$R^{2,5}$  がハロゲン、 $C_1 - C_2$  アルキルまたはシクロプロピルである、項目 3 4 に記載の化合物。

( 項目 3 6 )

$R^{2,5}$  が  $-CN$ 、 $-Cl$  または  $-CH_3$  である、項目 3 4 に記載の化合物。

(項目 37)

 $R^{25}$  が -C1 である、項目 36 に記載の化合物。

(項目 38)

 $R^{25}$  が -CH<sub>3</sub> である、項目 36 に記載の化合物。

(項目 39)

 $R^{25}$  が -OH、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> 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)

 $R^{25}$  が -F、メチルおよび O-C(=O)-CH<sub>3</sub> 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)

 $R^{25}$  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。

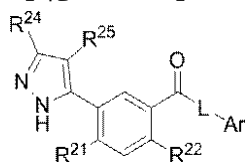
(項目 42)

 $R^{25}$  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 III b を有する化合物であり：

【化 911】

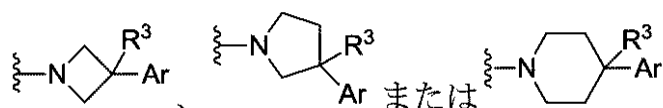


III b

ここで、

L-Ar は、

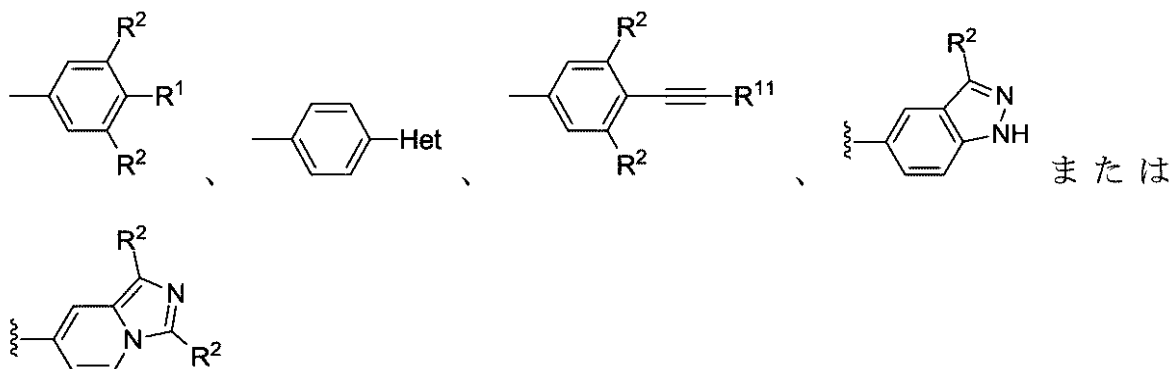
【化 912】



であり；

Ar は、

【化 913】



であり；

$\text{Het}$  は、5～6員ヘテロアリアルであり；

$\text{R}^1$  は、H、-CN、ハロゲン、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$  アルキル、-O-( $\text{C}_3 - \text{C}_5$  シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-( $\text{C}_1 - \text{C}_4$  アルキル)であり、ここで、 $\text{R}^1$  がH、-CNまたはハロゲンではない場合、 $\text{R}^1$  は1つ以上のハロゲンで置換されていてもよく；

各  $\text{R}^2$  は、独立して水素、ハロゲンまたは  $\text{C}_1 - \text{C}_4$  アルキルであり；

$\text{R}^3$  は、HまたはFであり；

$\text{R}^{11}$  は、Hまたは- $\text{CH}_3$ であり；

$\text{R}^{21}$  は、H、ハロゲン、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$  アルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_5$  シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

$\text{R}^{22}$  は、H、ハロゲンまたは  $\text{C}_1 - \text{C}_2$  アルキルであり；ならびに

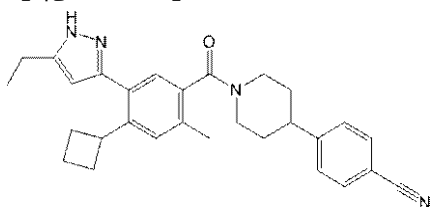
各  $\text{R}^{24}$  および  $\text{R}^{25}$  は、独立してH、ハロゲン、-CN、-( $\text{C}_1 - \text{C}_4$  アルキル)-CN、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$  アルキル、-( $\text{C}_1 - \text{C}_4$  アルキル)-OH、-( $\text{C}_1 - \text{C}_4$  アルキル)-N( $\text{R}^{241}$ )<sub>2</sub>、-( $\text{C}_1 - \text{C}_4$  アルキル)<sub>t</sub>-O<sub>u</sub>-( $\text{C}_3 - \text{C}_5$  シクロアルキル)、-( $\text{C}_1 - \text{C}_4$  アルキル)<sub>t</sub>-O<sub>u</sub>-(4～6員複素環)または-( $\text{C}_1 - \text{C}_4$  アルキル)<sub>t</sub>-O-( $\text{C}_1 - \text{C}_4$  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  $\text{R}^{241}$  は、独立してHまたは  $\text{C}_1 - \text{C}_2$  アルキルであり、  
ここで、前記化合物が：

【化914】

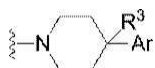


でない、前記化合物またはその薬剂的に許容できる塩。

(項目44)

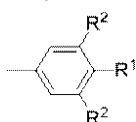
$\text{L-Ar}$  が

【化915】



である時、 $\text{Ar}$  が

【化916】

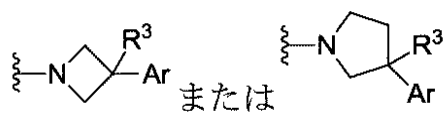


ではない、項目43に記載の化合物。

(項目45)

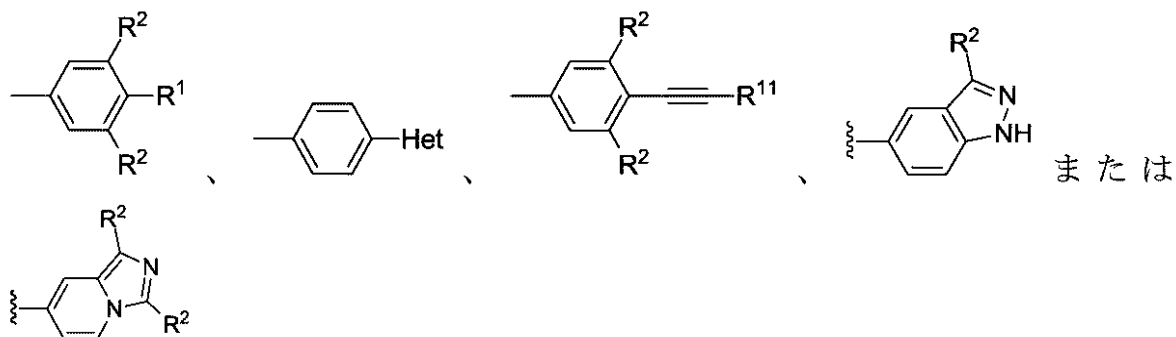
$\text{L-Ar}$  が

## 【化 9 1 7】



であり、Ar が

## 【化 9 1 8】

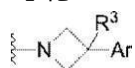


である、項目 4 3 に記載の化合物。

( 項目 4 6 )

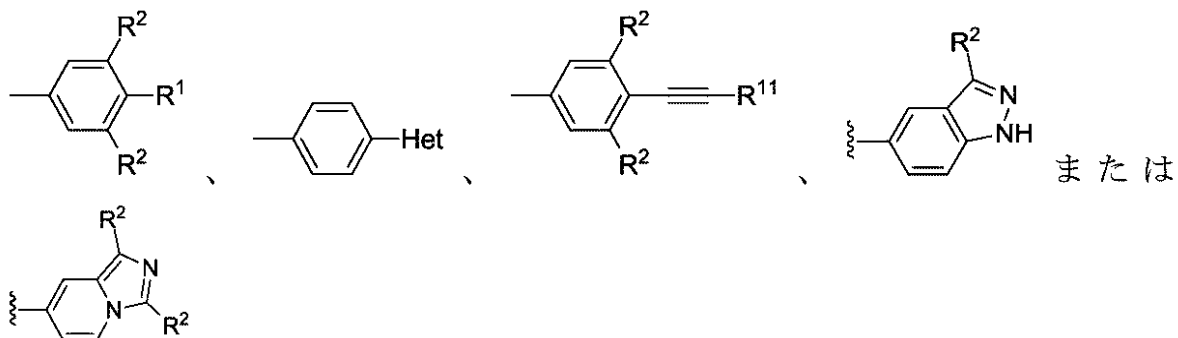
L - Ar が

## 【化 9 1 9】



であり、Ar が

## 【化 9 2 0】

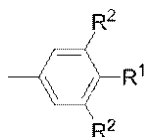


である、項目 4 5 に記載の化合物。

( 項目 4 7 )

Ar が

## 【化 9 2 1】



である、項目 4 6 に記載の化合物。

(項目 4 8)

$R^1$  がハロゲン、 $-CN$  または  $C_1 - C_2$  ハロアルキルである、項目 4 3 ~ 4 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 4 9)

$R^1$  が  $-CN$  である、項目 4 8 に記載の化合物。

(項目 5 0)

$R^2$  が H である、項目 4 3 ~ 4 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 5 1)

$R^{2,1}$  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、項目 4 3 ~ 5 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 5 2)

$R^{2,1}$  が  $C_1 - C_4$  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、項目 5 1 に記載の化合物。

(項目 5 3)

$R^{2,1}$  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、項目 5 2 に記載の化合物。

(項目 5 4)

$R^{2,1}$  が  $C_1 - C_2$  アルキルである、項目 5 3 に記載の化合物。

(項目 5 5)

$R^{2,1}$  が  $-CH_3$  である、項目 5 4 に記載の化合物。

(項目 5 6)

$R^{2,2}$  が H または  $C_1 - C_2$  アルキルである、項目 4 3 ~ 5 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 5 7)

$R^{2,2}$  が H または  $-CH_3$  である、項目 5 6 に記載の化合物。

(項目 5 8)

$R^{2,2}$  が  $-CH_3$  である、項目 5 7 に記載の化合物。

(項目 5 9)

各  $R^{2,4}$  および  $R^{2,5}$  が独立して H、 $-CN$ 、 $C_1 - C_4$  アルキル、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{2,4,1})_2$ 、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 - C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$  または  $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - O - (C_1 - C_4 \text{ アルキル})$  である、項目 4 3 ~ 5 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 6 0)

各  $R^{2,4}$  および  $R^{2,5}$  が独立して H、 $C_1 - C_4$  アルキル、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$  または  $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - O - (C_1 - C_4 \text{ アルキル})$  である、項目 5 9 に記載の化合物。

(項目 6 1)

$R^{2,4}$  が H、 $C_1 - C_4$  アルキル、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{2,4,1})_2$ 、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 - C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$  または  $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - O - (C_1 - C_4 \text{ アルキル})$  である、項目 4 3 ~ 5 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 6 2)

$R^{2,4}$  が  $-CN$ 、 $-Cl$ 、 $C_1 - C_4$  アルキルまたは  $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - O - (C_1 - C_4 \text{ アルキル})$  である、項目 4 3 ~ 5 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 6 3)

$R^{2,4}$  が  $C_1 - C_4$  アルキルまたは  $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - O - (C_1 - C_4 \text{ アルキル})$  である、項目 4 3 ~ 5 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。



キル)である、項目62に記載の化合物。

(項目64)

$R^{2,4}$ が $-(C_1-C_2 \text{ アルキル})-O-(C_1-C_2 \text{ アルキル})$ である、項目63に記載の化合物。

(項目65)

$R^{2,4}$ が $C_1-C_4$ アルキルである、項目63に記載の化合物。

(項目66)

$R^{2,4}$ が $-CH_3$ である、項目65に記載の化合物。

(項目67)

$R^{2,4}$ 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)

$R^{2,4}$ がハロゲン、 $C_3-C_5$ シクロアルキルおよび $C_1-C_2$ 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)

$R^{2,4}$ が $-F$ 、シクロプロピルおよび $OC_1H_3$ 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)

$R^{2,4}$ 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)

$R^{2,4}$ 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)

$R^{2,5}$ がハロゲン、メチル、エチルまたはシクロプロピルである、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)

$R^{2,5}$ が $-CN$ 、 $-Cl$ 、 $C_1-C_4$ アルキル、 $-(C_1-C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_3-C_5 \text{ シクロアルキル})$ または $-(C_1-C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1-C_4 \text{ アルキル})$ 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)

$R^{2,5}$ が $-CN$ 、 $-Cl$ 、 $-CH_3$ 、 $-O-(C_3-C_5 \text{ シクロアルキル})$ または $-O-(C_1-C_2 \text{ アルキル})$ である、項目73に記載の化合物。

(項目75)

$R^{2,5}$ が $-CN$ 、 $-Cl$ または $C_1-C_4$ アルキルである、項目73に記載の化合物。

(項目76)

$R^{2,5}$ が $-CH_3$ である、項目75に記載の化合物。

(項目77)

$R^{2,5}$ が $-Cl$ である、項目75に記載の化合物。

(項目78)

$R^{2,5}$ 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)

$R^{2,5}$ 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)

$R^{2,5}$ 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。

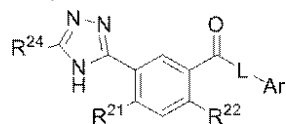
(項目81)

$R^{2,5}$ 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 9 2 2】

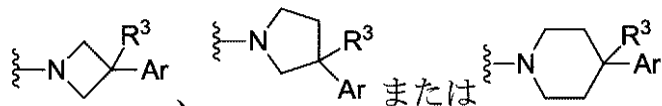


I I

ここで：

L - A r は、

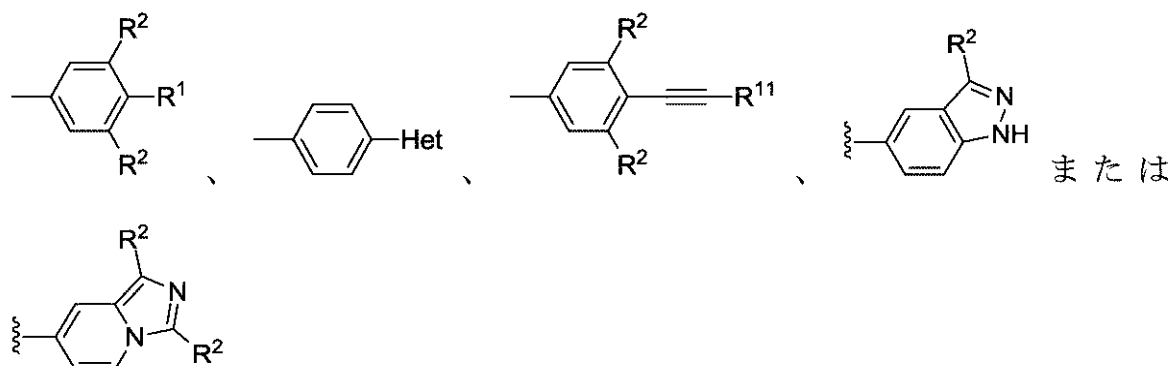
## 【化 9 2 3】



であり；

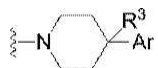
A r は、

## 【化 9 2 4】



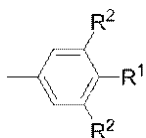
であり、ただし L - A r が

## 【化 9 2 5】



である時、A r は

## 【化 9 2 6】



ではなく；

H e t は、5 ~ 6 員ヘテロアリールであり；

R<sup>1</sup> は、H、- C N、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、- O - (C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub> シクロアルキル)、- O - (4 ~ 6 員複素環) または - O - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) であり、ここで、R<sup>1</sup> が H、- C N または ハロゲン でない場合、R<sup>1</sup> は 1 つ以上のハロゲンで置換されて

いてもよく；

各  $R^2$  は、独立して水素、ハロゲンまたは  $C_1 - C_4$  アルキルであり；

$R^3$  は、H または F であり；

$R^{11}$  は、H または  $-CH_3$  であり；

$R^{21}$  は、H、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 員複素環であり；

$R^{22}$  は、H、ハロゲン、または  $C_1 - C_2$  アルキルであり；ならびに、

$R^{24}$  は、H、 $C_1 - C_4$  アルキル、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル})_t - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル})_t - O_t - (C_3 - C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル})_t - O_t - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$  または  $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 - C_4 \text{ アルキル})$  であり、ここで：

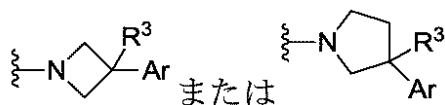
各  $t$  は、独立して 0 または 1 であり；および、

各  $R^{241}$  は、独立して 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剂的に許容できる塩。

(項目 83)

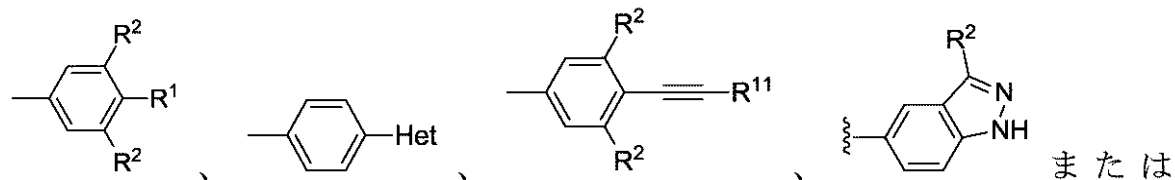
$L - Ar$  が

【化 927】



であり、 $Ar$  が

【化 928 - 1】



【化 928 - 2】

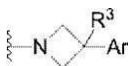


である、項目 82 に記載の化合物。

(項目 84)

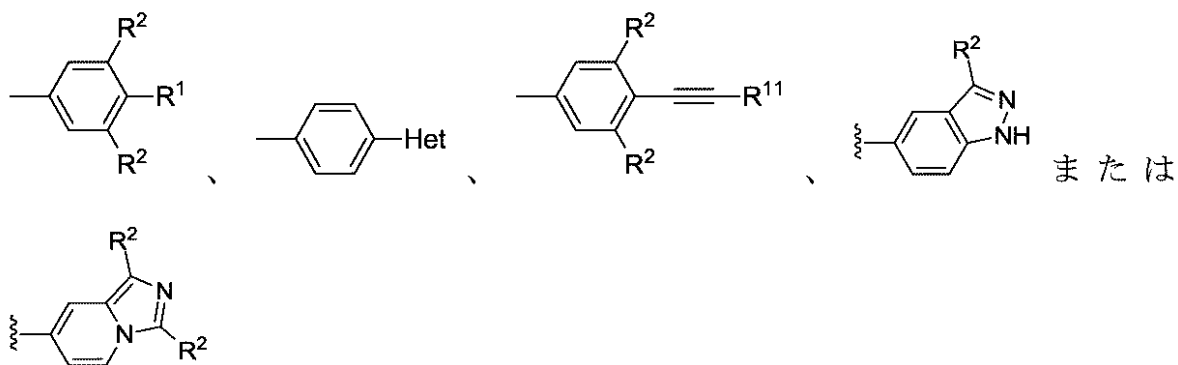
$L - Ar$  が

【化 929】



であり、 $Ar$  が

## 【化 9 3 0】

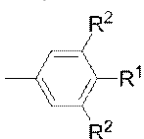


である、項目 8 3 に記載の化合物。

( 項目 8 5 )

Ar が

## 【化 9 3 1】



である、項目 8 4 に記載の化合物。

( 項目 8 6 )

R<sup>1</sup> がハロゲン、-CN または C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> ハロアルキルである、項目 8 2 ~ 8 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

( 項目 8 7 )

R<sup>1</sup> が -CN である、項目 8 6 に記載の化合物。

( 項目 8 8 )

R<sup>2</sup> が H である、項目 8 2 ~ 8 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

( 項目 8 9 )

R<sup>2 1</sup> がハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環である、項目 8 2 ~ 8 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

( 項目 9 0 )

R<sup>2 1</sup> が H、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環である、項目 8 2 ~ 8 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

( 項目 9 1 )

R<sup>2 1</sup> が C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> アルキルまたは C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> シクロアルキルである、項目 8 9 または 9 0 に記載の化合物。

( 項目 9 2 )

R<sup>2 1</sup> が C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> アルキルである、項目 9 1 に記載の化合物。

( 項目 9 3 )

R<sup>2 1</sup> が C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> シクロアルキルである、項目 9 1 に記載の化合物。

( 項目 9 4 )

R<sup>2 2</sup> が H または C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> アルキルである、項目 8 2 ~ 9 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

( 項目 9 5 )

R<sup>2 2</sup> が H である、項目 9 4 に記載の化合物。

( 項目 9 6 )

$R^{22}$  が  $C_1 - C_2$  アルキルである、項目 94 に記載の化合物。

(項目 97)

$R^{22}$  が  $-CH_3$  である、項目 96 に記載の化合物。

(項目 98)

$R^{24}$  が  $C_1 - C_4$  アルキルまたは  $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 - C_4 \text{ アルキル})$  である、項目 82 ~ 97 のいずれか 1 項に記載の化合物。

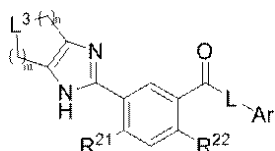
(項目 99)

$R^{24}$  が  $-(C_1 - C_2 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 - C_2 \text{ アルキル})$  である、項目 98 に記載の化合物。

(項目 100)

構造 I の化合物であり：

【化 932】



I

ここで：

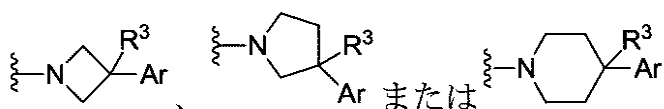
$L^3$  は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ 、  
または  $-NC(O)OR^{50}-$  であり、ここで、 $R^{50}$  は  $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_3 - C_5$  シクロアルキル、または 4 ~ 6 員複素環であり；

$n$  は、1、2、または 3 であり；

$m$  は、 $n + m \geq 3$  という条件で 1 または 2 であり；

$L - Ar$  は、

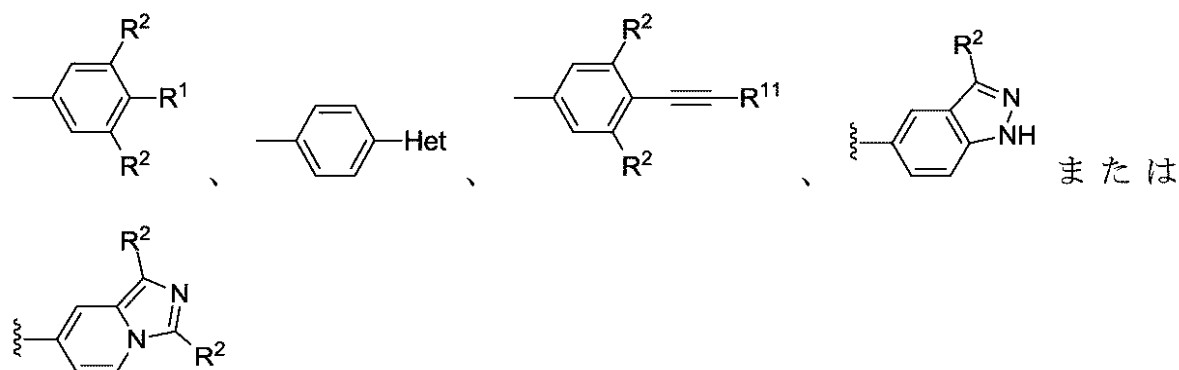
【化 933】



であり；

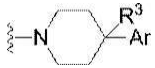
$Ar$  は、

【化 934】



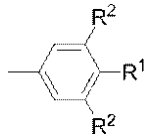
であり、ただし  $L - Ar$  が

## 【化 9 3 5】



である時、Ar は

## 【化 9 3 6】



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；

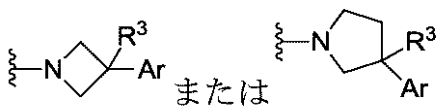
R²¹ は、H、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₃-C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；ならびに、

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剂的に許容できる塩。

(項目101)

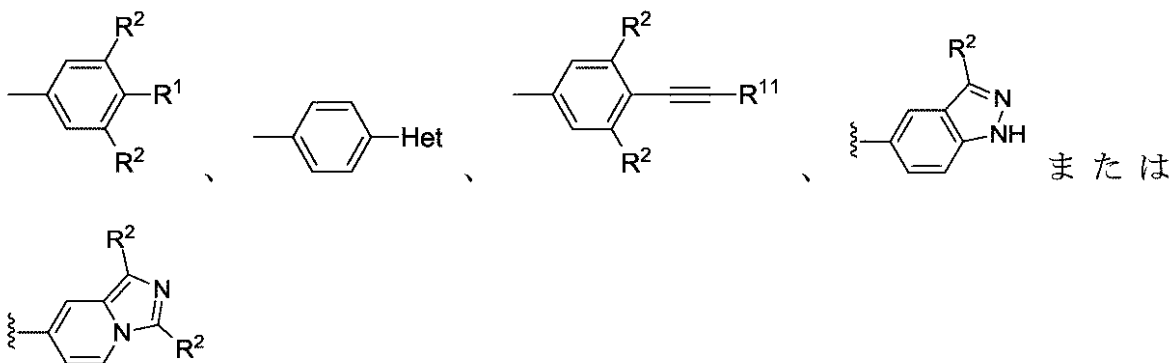
L-Ar が

## 【化 9 3 7】



であり、Ar が

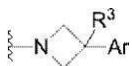
## 【化 9 3 8】



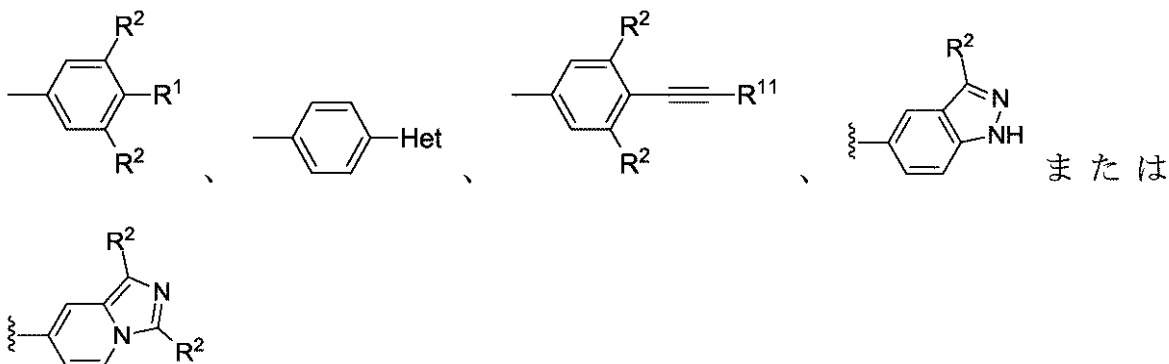
である、項目100に記載の化合物。

(項目102)

L - Ar が  
【化 9 3 9】



であり、Ar が  
【化 9 4 0】



である、項目 1 0 1 に記載の化合物。

(項目 1 0 3)

R<sup>1</sup> が H、-CN、-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル、-O-(C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> シクロアルキル)、-O-(4~6 員複素環) または -O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル) であり、ここで、R<sup>1</sup> が H または -CN でない場合、R<sup>1</sup> は 1 つ以上のハロゲンで置換されていてもよい、項目 1 0 0 ~ 1 0 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 0 4)

R<sup>1</sup> がハロゲン、-CN または C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> ハロアルキルである、項目 1 0 0 ~ 1 0 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 0 5)

R<sup>1</sup> が -CN または C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> ハロアルキルである、項目 1 0 4 に記載の化合物。

(項目 1 0 6)

R<sup>1</sup> が -CN である、項目 1 0 5 に記載の化合物。

(項目 1 0 7)

R<sup>1</sup> が -Cl である、項目 1 0 4 に記載の化合物。

(項目 1 0 8)

R<sup>2</sup> が H である、項目 1 0 0 ~ 1 0 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 0 9)

R<sup>2 1</sup> がハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> シクロアルキルまたは 4~6 員複素環である、項目 1 0 0 ~ 1 0 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 1 0)

R<sup>2 1</sup> が C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> アルキルまたは C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> シクロアルキルである、項目 1 0 9 に記載の化合物。

(項目 1 1 1)

R<sup>2 1</sup> が C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> シクロアルキルである、項目 1 1 0 に記載の化合物。

(項目 1 1 2)

R<sup>2 2</sup> が H または C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> アルキルである、項目 1 0 0 ~ 1 1 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 1 3)

R<sup>2 2</sup> が H である、項目 1 1 2 に記載の化合物。

(項目 1 1 4)

$R^{22}$  が  $C_1 - C_2$  アルキルである、項目 1 1 2 に記載の化合物。

(項目 1 1 5)

$R^{22}$  が  $-CH_3$  である、項目 1 1 4 に記載の化合物。

(項目 1 1 6)

$L^3$  が  $-N(CH_3)-$  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。

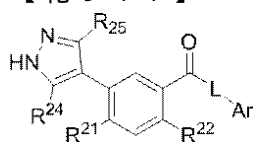
(項目 1 1 9)

$n$  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】

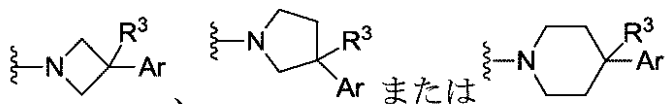


I I I c

ここで；

$L - Ar$  は、

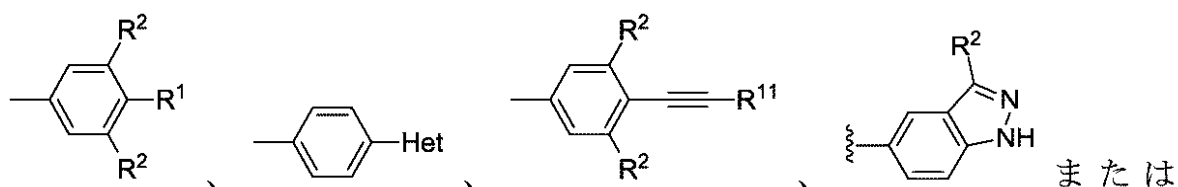
【化 9 4 2】



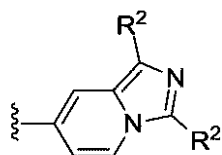
であり；

$Ar$  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；



$R^1$  は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  アルキル、-O-( $C_3 - C_5$  シクロアルキル)、-O-(4~6員複素環)または-O-( $C_1 - C_4$  アルキル)であり、ここで  $R^1$  がH、-CNまたはハロゲンでない場合、 $R^1$  は1つ以上のハロゲンで置換されていてもよく；

各  $R^2$  は、独立して水素、ハロゲンまたは  $C_1 - C_4$  アルキルであり；

$R^3$  は、HまたはFであり；

$R^{11}$  は、Hまたは-CH<sub>3</sub>であり；

$R^{21}$  は、H、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員複素環であり；

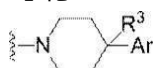
$R^{22}$  は、H、ハロゲンまたは  $C_1 - C_2$  アルキルであり；ならびに、

各  $R^{24}$  および  $R^{25}$  は、独立してH、- $C_1 - C_4$  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剂的に許容できる塩。

(項目121)

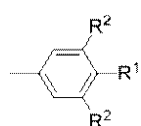
L-Arが

【化944】



であり、Arが

【化945】

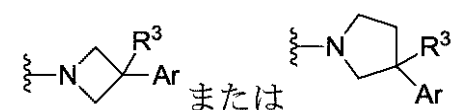


でない、項目120に記載の化合物。

(項目122)

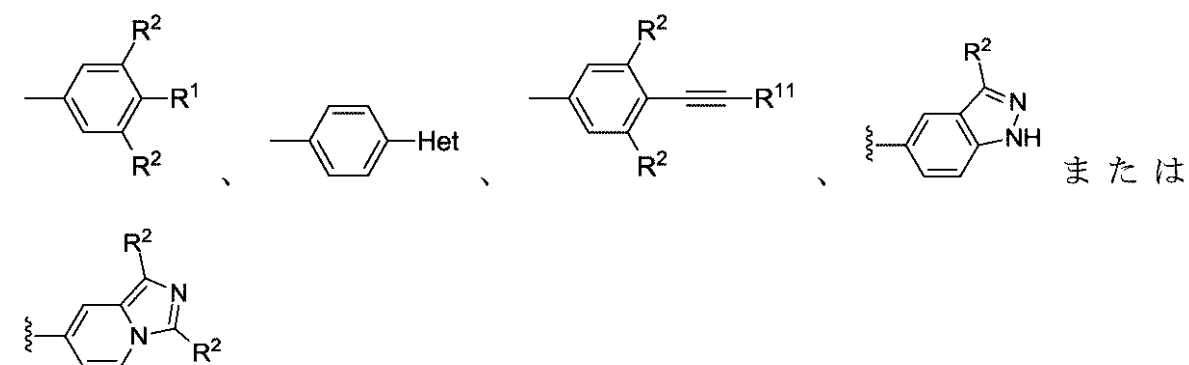
L-Arが

【化946】



であり、Arが

【化947】

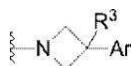


である、項目 1 2 0 に記載の化合物。

( 項目 1 2 3 )

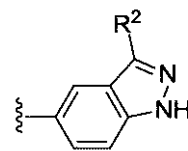
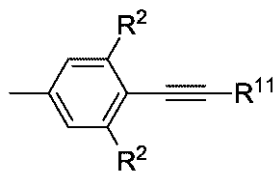
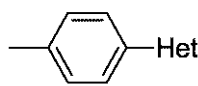
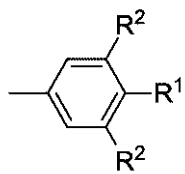
$L - Ar$  が

【化 9 4 8】

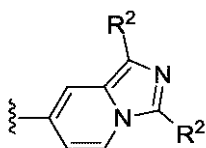


であり、 $Ar$  が

【化 9 4 9】



または



である、項目 1 2 2 に記載の化合物。

( 項目 1 2 4 )

$R^1$  がハロゲン、 $-CN$  または  $C_1 - C_2$  ハロアルキルである、項目 1 2 0 ~ 1 2 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

( 項目 1 2 5 )

$R^{2,1}$  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、項目 1 2 0 ~ 1 2 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

( 項目 1 2 6 )

$R^{2,1}$  が  $-CH_3$  である、項目 1 2 5 に記載の化合物。

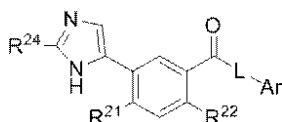
( 項目 1 2 7 )

$R^{2,2}$  が  $H$  である、項目 1 2 0 ~ 1 2 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

( 項目 1 2 8 )

構造 I V を有する化合物であり：

【化 9 5 0】

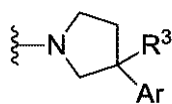
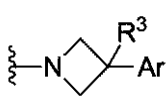


I V

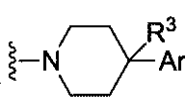
ここで：

$L - Ar$  は、

【化 9 5 1】



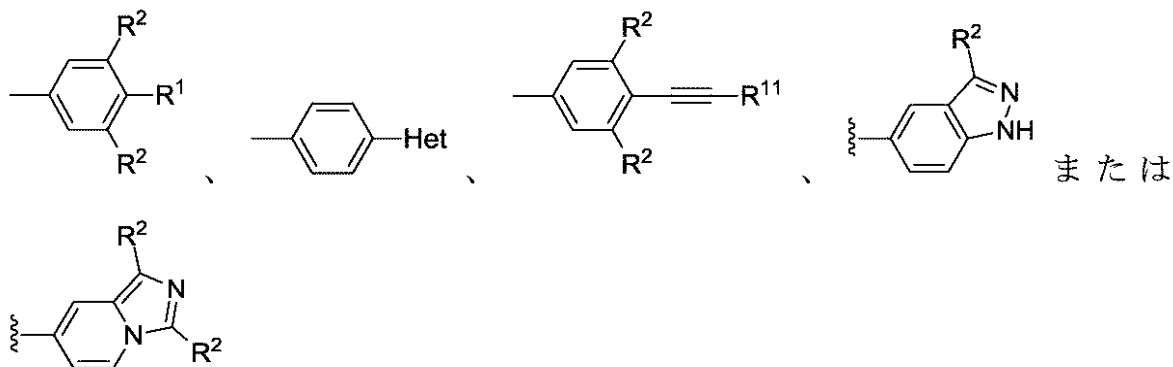
または



であり；

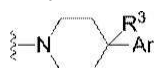
Ar は、

【化 9 5 2】



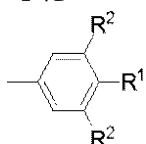
であり、ただし L - Ar が

【化 9 5 3】



である時、Ar は

【化 9 5 4】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R<sup>1</sup> は、H、-CN、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-O- (C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub> シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) であり、ここで R<sup>1</sup> が H、-CN または ハロゲンではない場合、R<sup>1</sup> は 1 つ以上のハロゲンで置換されている；

各 R<sup>2</sup> は、独立して水素、ハロゲンまたは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルであり；

R<sup>3</sup> は、H または F であり；

R<sup>11</sup> は、H または -CH<sub>3</sub> であり；

R<sup>21</sup> は、H、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub> シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R<sup>22</sup> は、H、ハロゲンまたは C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> アルキルであり；ならびに

R<sup>241</sup> は、H、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、- (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) - OH、- (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) - N (R<sup>241</sup>)<sub>2</sub>、- (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)<sub>t</sub> - O<sub>u</sub> - (C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub> シクロアルキル)、- (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)<sub>t</sub> - O<sub>u</sub> - (4 ～ 6 員複素環) または - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) - O - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 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；

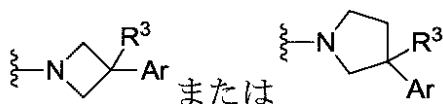
ただし u が 1 である時、t は 1 であり；および、

R<sup>241</sup> は、H または C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> アルキルである、前記化合物またはその薬剂的に許容できる塩。

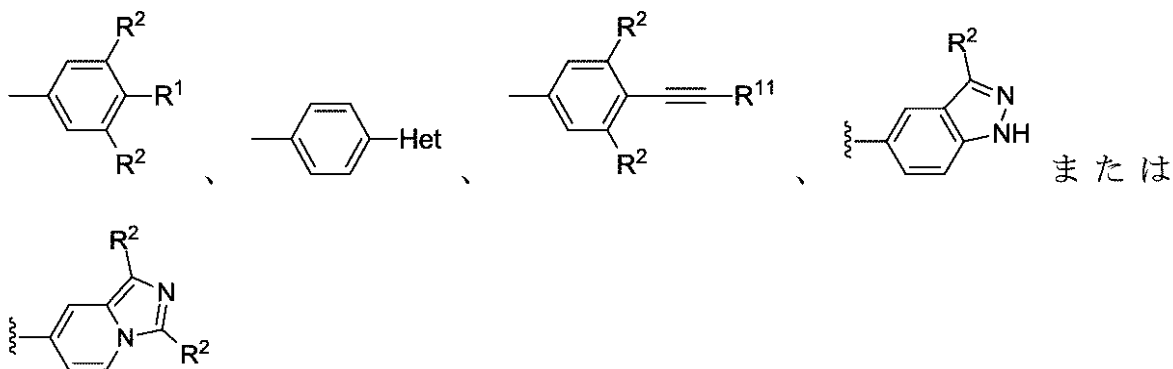
(項目 1 2 9)

 $L - Ar$  が

【化 9 5 5】

であり、 $Ar$  が

【化 9 5 6】



である、項目 1 2 8 に記載の化合物。

(項目 1 3 0)

$R^1$  がハロゲン、 $-CN$  または  $C_1 - C_2$  ハロアルキルである、項目 1 2 8 または 1 2 9 に記載の化合物。

(項目 1 3 1)

$R^1$  が  $-CN$  である、項目 1 3 0 に記載の化合物。

(項目 1 3 2)

$R^2$  が  $H$  である、項目 1 2 8 ~ 1 3 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 3 3)

$R^{2,1}$  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、項目 1 2 8 ~ 1 3 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 3 4)

$R^{2,1}$  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、項目 1 3 3 に記載の化合物。

(項目 1 3 5)

$R^{2,1}$  が  $C_1 - C_2$  アルキルである、項目 1 3 4 に記載の化合物。

(項目 1 3 6)

$R^{2,1}$  が  $C_3 - C_5$  シクロアルキルである、項目 1 3 4 に記載の化合物。

(項目 1 3 7)

$R^{2,2}$  が  $H$  または  $C_1 - C_2$  アルキルである、項目 1 2 8 ~ 1 3 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 3 8)

$R^{2,2}$  が  $H$  である、項目 1 3 7 に記載の化合物。

(項目 1 3 9)

$R^{2,2}$  が  $C_1 - C_2$  アルキルである、項目 1 3 7 に記載の化合物。

(項目 1 4 0)

$R^{2,2}$  が  $-CH_3$  である、項目 1 3 9 に記載の化合物。

(項目 1 4 1)

$R^{2,4}$  が  $C_1 - C_4$  アルキルまたは  $-(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) - O - (C_1 - C_4 \text{ アルキル})$  である、項目 1 2 8 ~ 1 4 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

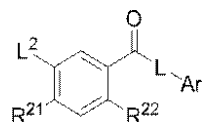
(項目 1 4 2)

$R^{2,4}$  が  $-(C_1 - C_2 \text{ アルキル}) - O - (C_1 - C_2 \text{ アルキル})$  である、項目 1 4 1 に記載の化合物。

(項目 1 4 3)

構造 V を有する化合物であり：

【化 9 5 7】

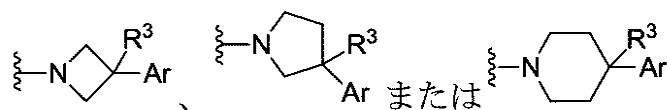


V

ここで：

$L - Ar$  は、

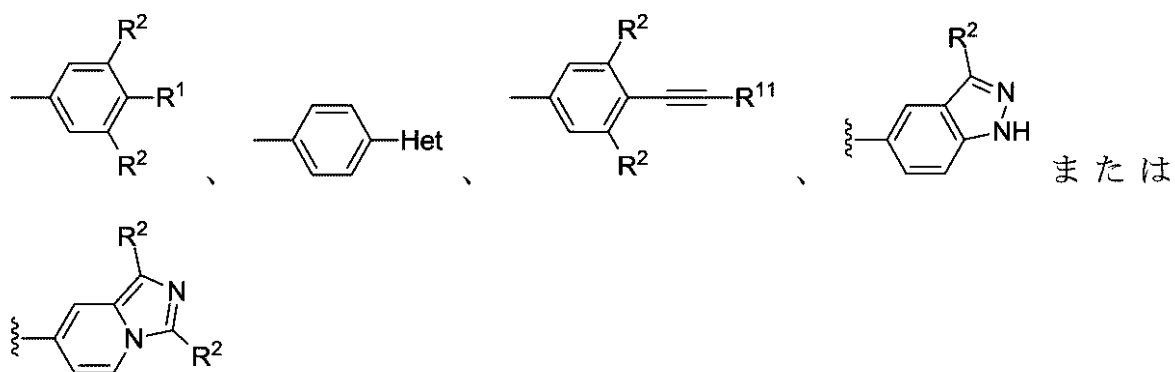
【化 9 5 8】



であり；

$Ar$  は、

【化 9 5 9】



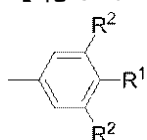
であり、ただし  $L - Ar$  が

【化 9 6 0】



である時、 $Ar$  は

【化 9 6 1】



でなく；

$L^2$  は、 $-NHR^{35}$  または  $-C(O)NHR^{351}$  であり、ここで、 $R^{351}$  は  $C_1$  -  $C_6$  アルキル、 $C_3$  -  $C_5$  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；

$R^1$  は、H、 $-CN$ 、ハロゲン、 $C_1$  -  $C_4$  アルキル、 $-O-(C_3-C_5)$  シクロアルキル)、 $-O-(4\sim6)$  員複素環)、 $-O-(C_1-C_4)$  アルキル)であり、ここで、 $R^1$  が H、 $-CN$  またはハロゲンでない場合、 $R^1$  は1つ以上のハロゲンで置換されているもよく；

各  $R^2$  は、独立して水素、ハロゲンまたは  $C_1$  -  $C_4$  アルキルであり；

$R^3$  は、HまたはFであり；

$R^{11}$  は、Hまたは  $-CH_3$  であり；

$R^{21}$  は、H、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員複素環であり；

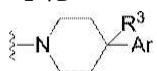
$R^{22}$  は、H、ハロゲン、または  $C_1$  -  $C_2$  アルキルであり；ならびに、

$R^{35}$  は、 $-C(O)R^{351}$ 、 $-C(O)NHR^{351}$ 、 $C(O)OR^{351}$  または  $S(O)_2R^{351}$  であり、ここで、 $R^{351}$  は  $C_1$  -  $C_6$  アルキル、 $C_3$  -  $C_5$  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剂的に許容できる塩。

(項目144)

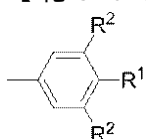
$L-Ar$  が

【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)

$L^2$  が  $-NHR^{35}$  である、項目143または144に記載の化合物。

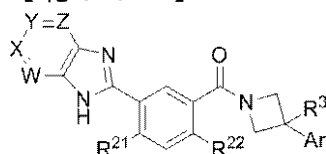
(項目146)

$L^2$  が  $-C(O)NHR^{351}$  である、項目143または144に記載の化合物。

(項目147)

構造VIを有する化合物であり；

【化964】



## V I

ここで：

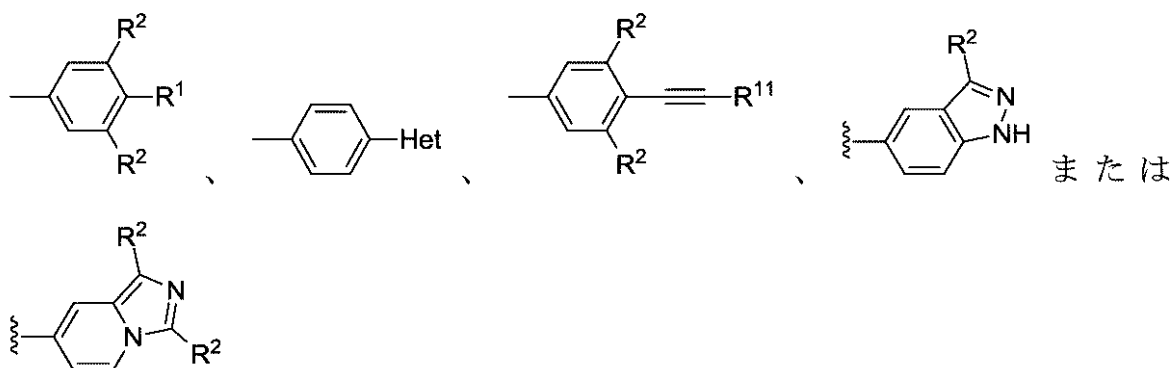
各 W、X、Y および Z は、独立して - N - または - C R<sup>2 6</sup> - であり、ただし W、X、Y および Z のうち 2 つより多くが - N - であることはなく；

各 R<sup>2 6</sup> は、独立して H、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、- O - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)、- N (R<sup>2 7</sup>)<sub>2</sub>、- S (O)<sub>2</sub> - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)、または - C (O) - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) であり；

各 R<sup>2 7</sup> は、独立して H または C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルであり、または、双方の R<sup>2 7</sup> は C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 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；

Ar は、

【化 9 6 5】



であり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリールであり；

R<sup>1</sup> は、H、- CN、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、- O - (C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub> シクロアルキル)、- O - (4 ~ 6 員複素環)、- O - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) であり、ここで R<sup>1</sup> が H、- CN または ハロゲン でない場合、R<sup>1</sup> は 1 つ以上のハロゲンで置換されていてもよく；

各 R<sup>2</sup> は、独立して水素、ハロゲンまたは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルであり；

R<sup>3</sup> は、H または F であり；

R<sup>1 1</sup> は、H または - CH<sub>3</sub> であり；

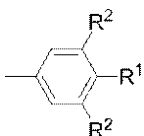
R<sup>2 1</sup> は、H、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub> シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；ならびに

R<sup>2 2</sup> は、H、ハロゲンまたは C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> 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 1 4 8)

Ar が

【化 9 6 6】



である、項目 1 4 7 に記載の化合物。

(項目 1 4 9)

Y が - C R<sup>2 6</sup> - であり、ここで R<sup>2 6</sup> は - N (R<sup>2 7</sup>)<sub>2</sub> である、項目 1 4 7 または 1 4 8 に記載の化合物。

( 項目 1 5 0 )

X が - N - である、項目 1 4 7 ~ 1 4 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

( 項目 1 5 1 )

項目 1 ~ 1 5 0 のいずれかの化合物および薬剂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 1 5 2 )

対象のウイルス感染を治療する方法であり、項目 1 ~ 1 5 0 のいずれかの化合物または項目 1 5 1 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 1 5 3 )

前記ウイルス感染が C 型肝炎感染を含む、項目 1 5 2 に記載の方法。

( 項目 1 5 4 )

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 ~ 1 5 0 のいずれかの化合物または項目 1 5 1 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 1 5 5 )

対象のがんを治療する方法であり、項目 1 ~ 1 5 0 のいずれかの化合物または項目 1 5 1 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 1 5 6 )

前記がんが、乳癌、膵癌また大腸癌である、項目 1 5 5 に記載の方法。

( 項目 1 5 7 )

前記がんが膵癌である、項目 1 5 5 に記載の方法。