

【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31年2月14日 (2019.2.14)

【公表番号】特表2018-501288(P2018-501288A)

【公表日】平成30年1月18日 (2018.1.18)

【年通号数】公開・登録公報2018-002

【出願番号】特願2017-536302(P2017-536302)

【国際特許分類】

C 0 7 D 211/32 (2006.01)

C 0 7 D 405/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

C 0 7 D 401/10 (2006.01)

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

C 0 7 D 405/06 (2006.01)

C 0 7 D 413/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

A 6 1 K 31/4523 (2006.01)

A 6 1 K 31/4525 (2006.01)

A 6 1 K 31/4545 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/453 (2006.01)

A 6 1 K 31/4535 (2006.01)

A 6 1 K 31/495 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 241/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 211/32 C S P

C 0 7 D 405/04

C 0 7 D 401/06

C 0 7 D 401/10

C 0 7 D 403/06

C 0 7 D 405/06

C 0 7 D 413/06

A 6 1 K 31/445

A 6 1 K 31/4523

A 6 1 K 31/4525

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/453

A 6 1 K 31/4535

A 6 1 K 31/495

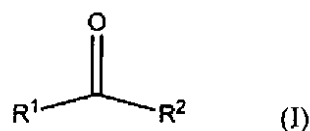
A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 43/00 1 0 5

【化 1 6 6】



b) C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₃ ~ 8 炭素環、3 ~ 8 員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、-NO₂、-N(R^b)₂、-CN、-C(O)-N(R^b)₂、-S(O)-N(R^b)₂、-S(O)₂-N(R^b)₂、-O-R^b、-S-R^b、-O-C(O)-R^b、-C(O)-R^b、-C(O)-OR^b、-S(O)-R^b、-S(O)₂-R^b、-N(R^b)-C(O)-R^b、-N(R^b)-S(O)-R^b、-N(R^b)-C(O)-N(R^b)₂、および-N(R^b)-S(O)₂-R^b からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で置換された炭素連結ピペラジン環であって；各々のC₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₃ ~ 8 炭素環、3 ~ 8 員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、-NO₂-N(R^b)₂、-CN、-C(O)-N(R^b)₂、-S(O)-N(R^b)₂、-S(O)₂-N(R^b)₂、-O-R^b、-S-R^b、-O-C(O)-

) $-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル (該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペラジン環；

であり、

各々の R^b は、水素、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、アリール、および $C_2 \sim 6$ アルキニルからなる群から独立して選択され、各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、アリール、および $C_2 \sim 6$ アルキニルは、ハロ、 $-N(R^c)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^c)_2$ 、 $-S(O)-N(R^c)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^c)_2$ 、 $-O-R^c$ 、 $-S-R^c$ 、 $-O-C(O)-R^c$ 、 $-C(O)-R^c$ 、 $-C(O)-OR^c$ 、 $-S(O)-R^c$ 、 $-S(O)_2-R^c$ 、 $-N(R^c)-C(O)-R^c$ 、 $-N(R^c)-S(O)-R^c$ 、 $-N(R^c)-C(O)-N(R^c)_2$ 、および $-N(R^c)-S(O)_2-R^c$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2つの R^b が、それらが結合する窒素とともに、ピロリジノ環、ピペリジノ環、またはピペラジノ環を形成し；

各々の R^c は、水素、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、および $C_2 \sim 6$ アルキニルからなる群から独立して選択され、各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、および $C_2 \sim 6$ アルキニルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、および $C_1 \sim 6$ アルコキシからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されるか；または、2つの R^c が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、および $C_1 \sim 3$ アルキル (該 $C_1 \sim 3$ アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

R^x は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、またはテトラヒドロピラニルであり、各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環は、ハロ、 $-CN$ 、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、および $C_3 \sim 8$ 炭素環 (該 $C_3 \sim 8$ 炭素環は、ハロおよび $C_1 \sim 3$ アルキルからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R^2 は5～10員ヘテロアリールまたは6～12員アリールであり、5～10員ヘテロアリール、および6～12員アリールは、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、および $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル (該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

各々の R^d は、水素、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、アリール、および

C₂ ~ 6 アルキニルからなる群から独立して選択され、各々の C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、アリール、および C₂ ~ 6 アルキニルは、ハロ、-N(R^e)₂、-CN、-C(O)-N(R^e)₂、-S(O)-N(R^e)₂、-S(O)₂-N(R^e)₂、-O-R^e、-S-R^e、-O-C(O)-R^e、-C(O)-R^e、-C(O)-O-R^e、-S(O)-R^e、-S(O)₂-R^e、-N(R^e)-C(O)-R^e、-N(R^c)-S(O)-R^e、-N(R^e)-C(O)-N(R^e)₂、および -N(R^e)-S(O)₂-R^e からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2 つの R^d が、それらが結合する窒素とともに、ピロリジノ環、ペリジノ環、またはピペラジノ環を形成し；

各々の R^e は、水素、C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、および C₂ ~ 6 アルキニルからなる群から独立して選択され、各々の C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、および C₂ ~ 6 アルキニルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、および C₁ ~ 6 アルコキシからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されるか；または、2 つの R^e が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、および C₁ ~ 3 アルキル（該 C₁ ~ 3 アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

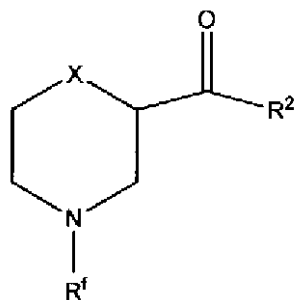
但し、R² が 6-メトキシ-2-ナフチルである場合、R¹ は、1-(シクロプロピルメチル)ピペリジン-3-イル、1-(シクロブチル)ピペリジン-3-イル、1-(シクロペンチル)ピペリジン-3-イル、1-(テトラヒドロピラニル)ピペリジン-3-イルのいずれでもないことを条件とし；

但し、R² が、フェニル、ナフチル、4-キノリル、5-キノリル、6-キノリル、7-キノリル、8-キノリル、2-メチル-6-キノリル、1, 5-ベンゾジオキセピン-7-イル、ベンゾ[b]チエン-7-イル、2, 3-ジヒドロ-1, 4-ベンゾジオキシン-6-イル、1H-1-(tert-ブトキシカルボニル)-4-ブromo-インドール-2-イル、1H-1-(tert-ブトキシカルボニル)-4-シアノ-インドール-2-イル、3, 4-ジヒドロキシフェニル、3-メトキシ-4-ヒドロキシフェニル、3, 4-ジメトキシフェニル、3-メトキシカルボニル-4-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル、または 2-ヒドロキシフェニルである場合、R¹ は任意選択的に置換されたピペリジン-2-イル (piperizine-2-yl) ではないことを条件とする) の化合物またはその塩。

【請求項 2】

式 (Ia)：

【化 167】



(Ia)

(式中、

X は C R^g R^h または N R^k であり；

各々の R^f は、H、C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₃ ~ 8 炭素環、3 ~ 8 員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、-NO₂、-N(R^b)₂、-CN、-C(O)-N(R^b)₂、-S(O)-N(R^b)₂、-S(O)

$_2 - N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択され；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

各々の R^g は、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択され；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

各々の R^h は、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、およびハロからなる群から独立して選択され、各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

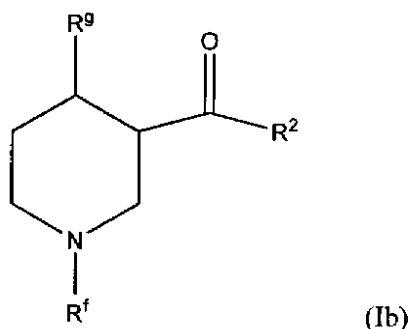
各々の R^k は、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールからなる群から独立して選択され、各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる

群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) の化合物である、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 3】

式 (I b) :

【化 1 6 8】

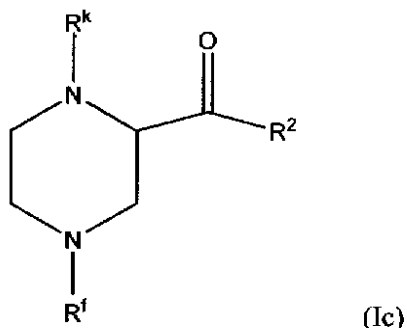


の化合物である、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 4】

式 (I c) :

【化 1 6 9】



の化合物である、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 5】

R^1 は、ピペリジン環窒素上で R^x 基で置換され、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3~8 員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的にさらに置換された炭素連結ピペリジン環であって；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3~8 員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル (該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペリジン環である、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

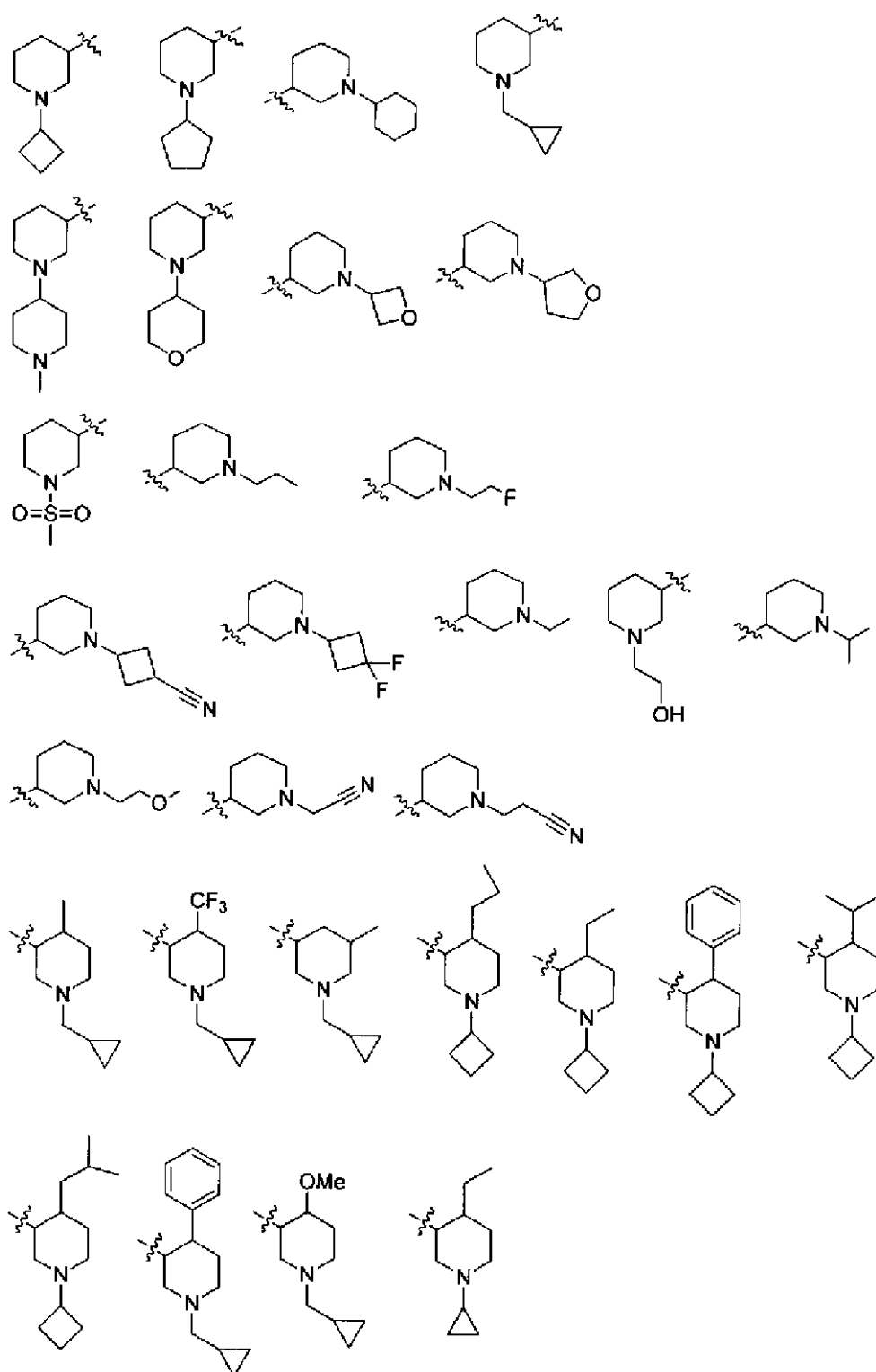
【請求項 6】

R^1 は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で置換された炭素連結ピペラジン環であって；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペラジン環である、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

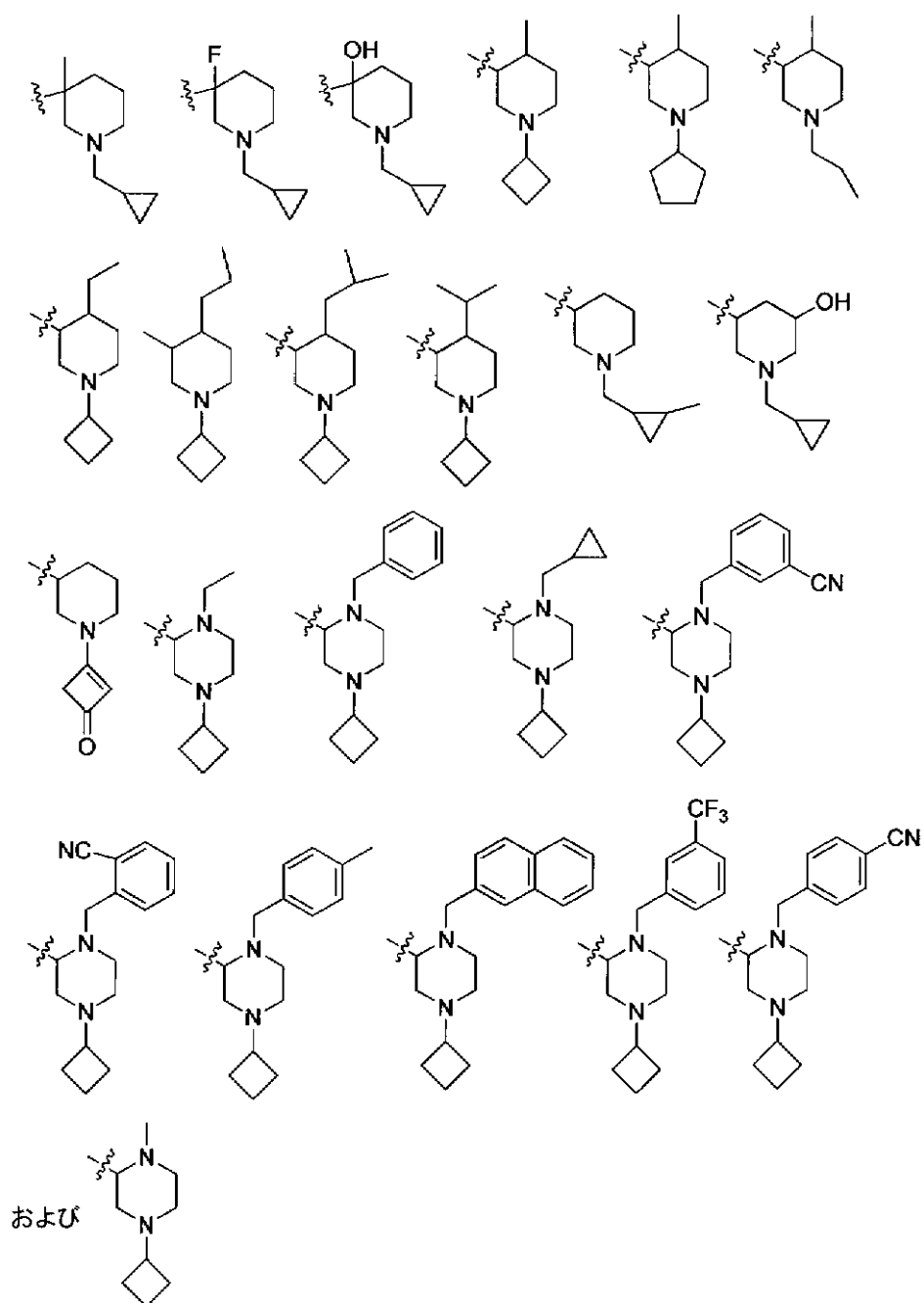
【請求項 7】

R^1 が、

【化 170】



【化 1 7 1】

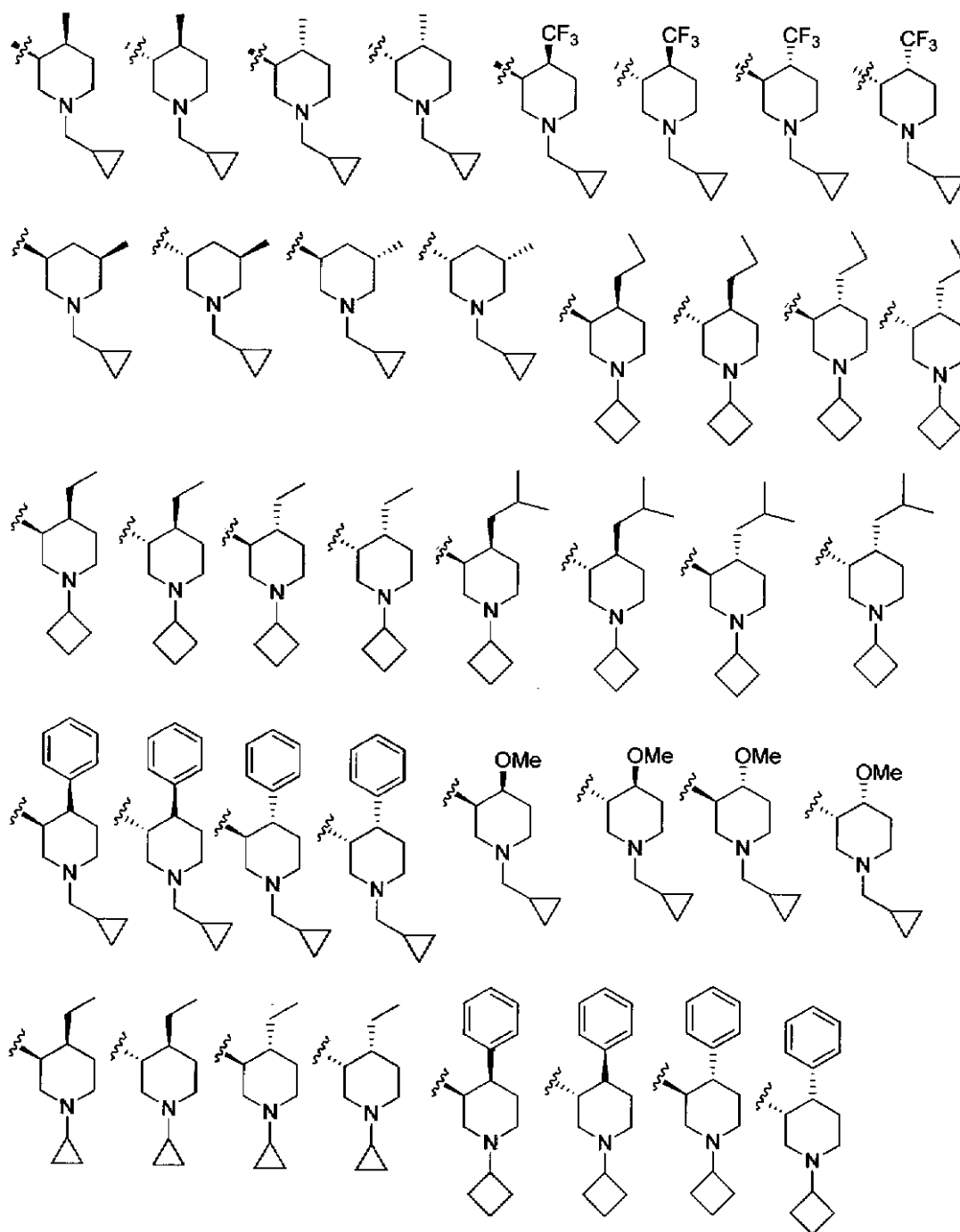


からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

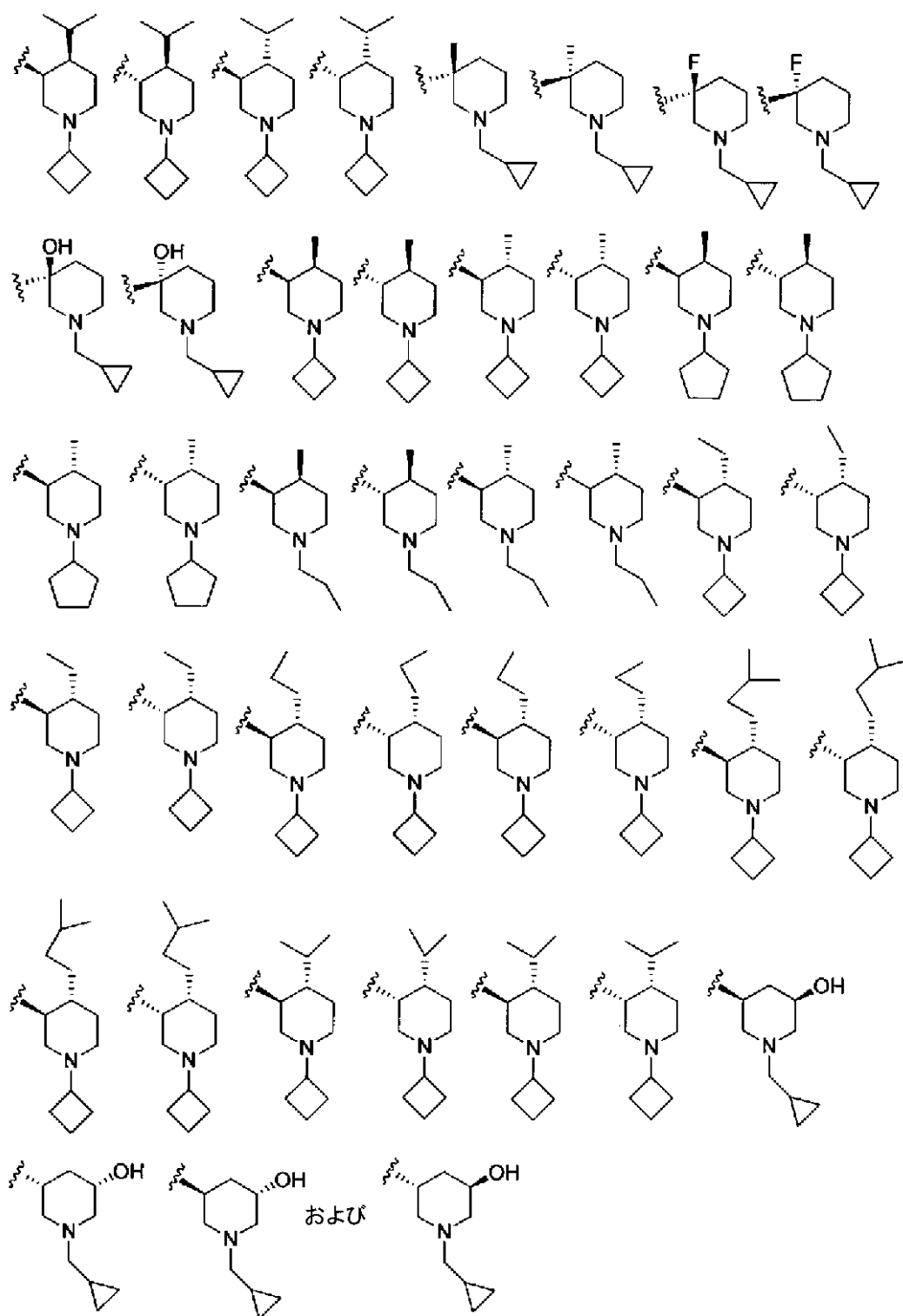
【請求項 8】

R¹ は、

【化 1 7 2】



【化 173】



からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 9】

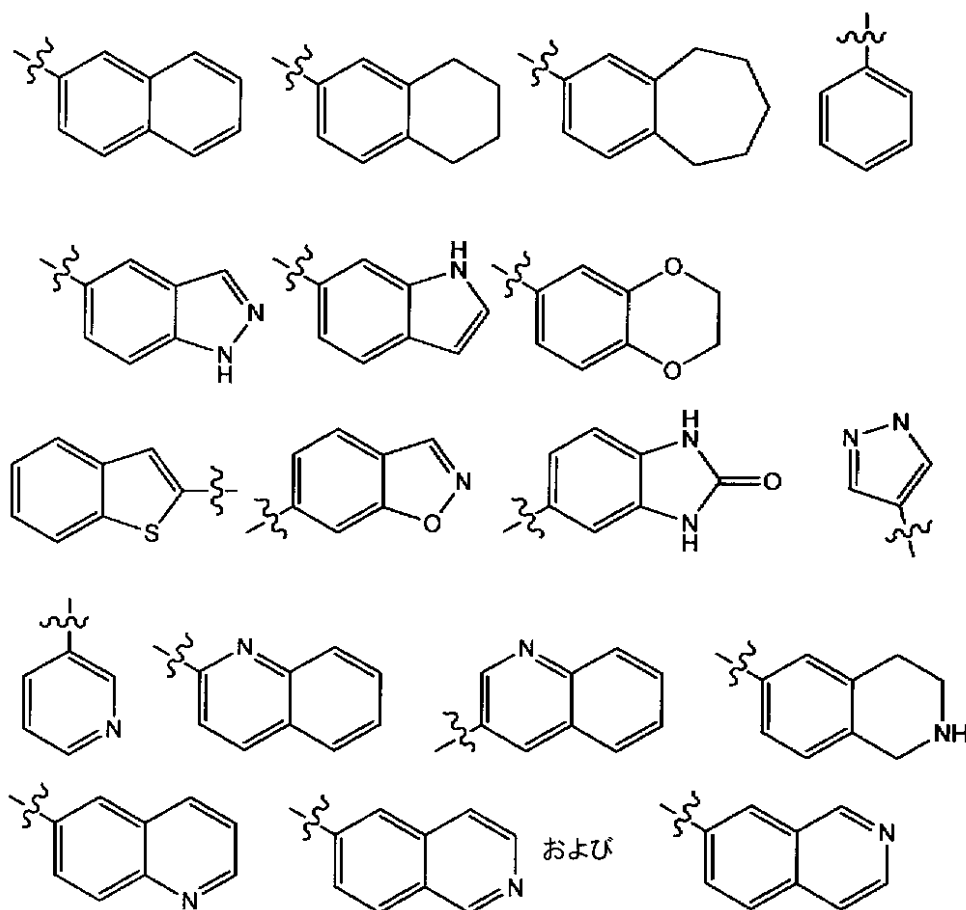
R^2 は、ナフチル、テトラリニル、フェニル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾ [7] アンヌレニル、1, 4-ベンゾジオキシニル、ベンゾイミダゾリル-2-オン、インドリル、インダゾリル、チオフェニル、ピリジル、キノリル、テトラヒドロキノリル、イソキノリル、テトラヒドロイソキノリル、およびピラゾリルからなる群から選択される環であり；環は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテ

ロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})_2$ 、 $-\text{O}-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{S}-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{\text{d}}$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})-\text{S}(\text{O})-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})_2$ 、および $-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^{\text{d}}$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim 6$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})_2$ 、 $-\text{O}-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{S}-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{\text{d}}$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})-\text{S}(\text{O})-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^{\text{d}}$ 、および $\text{C}_1 \sim 6$ アルキル（該 $\text{C}_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

【請求項10】

R^2 は、

【化174】



からなる群から選択される環であり；環は、 $\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim 6$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})_2$ 、 $-\text{O}-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{S}-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{\text{d}}$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})-\text{C}$

(O) - R^d、-N(R^d) - S(O) - R^d、-N(R^d) - C(O) - N(R^d)₂、および -N(R^d) - S(O)₂ - R^d からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、-NO₂ - N(R^d)₂、-CN、-C(O) - N(R^d)₂、-S(O) - N(R^d)₂、-S(O)₂ - N(R^d)₂、-O - R^d、-S - R^d、-O - C(O) - R^d、-C(O) - R^d、-C(O) - OR^d、-S(O) - R^d、-S(O)₂ - R^d、-N(R^d) - C(O) - R^d、-N(R^d) - S(O) - R^d、-N(R^d) - C(O) - N(R^d)₂、-N(R^d) - S(O)₂ - R^d、および C₁ ~ 6 アルキル（該 C₁ ~ 6 アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1~8のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

【請求項11】

R² は、ナフチル環であり、環は、C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、-NO₂、-N(R^d)₂、-CN、-C(O) - N(R^d)₂、-S(O) - N(R^d)₂、-S(O)₂ - N(R^d)₂、-O - R^d、-S - R^d、-O - C(O) - R^d、-C(O) - R^d、-C(O) - OR^d、-S(O) - R^d、-S(O)₂ - R^d、-N(R^d) - C(O) - R^d、-N(R^d) - S(O) - R^d、-N(R^d) - C(O) - N(R^d)₂、および -N(R^d) - S(O)₂ - R^d からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、-NO₂ - N(R^d)₂、-CN、-C(O) - N(R^d)₂、-S(O) - N(R^d)₂、-S(O)₂ - N(R^d)₂、-O - R^d、-S - R^d、-O - C(O) - R^d、-C(O) - R^d、-C(O) - OR^d、-S(O) - R^d、-S(O)₂ - R^d、-N(R^d) - C(O) - R^d、-N(R^d) - S(O) - R^d、-N(R^d) - C(O) - N(R^d)₂、-N(R^d) - S(O)₂ - R^d、および C₁ ~ 6 アルキル（該 C₁ ~ 6 アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1~8のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

【請求項12】

R² は、ナフチル環であり、環は、C₁ ~ 6 アルキル、炭素環、アリール、ハロ、-NO₂、-N(R^d)₂、-CN、-C(O) - N(R^d)₂、-S(O) - N(R^d)₂、-S(O)₂ - N(R^d)₂、-O - R^d、-S - R^d、-O - C(O) - R^d、-C(O) - R^d、-C(O) - OR^d、-S(O) - R^d、-S(O)₂ - R^d、-N(R^d) - C(O) - R^d、-N(R^d) - S(O) - R^d、-N(R^d) - C(O) - N(R^d)₂、および -N(R^d) - S(O)₂ - R^d からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、-NO₂ - N(R^d)₂、-CN、-C(O) - N(R^d)₂、-S(O) - N(R^d)₂、-S(O)₂ - N(R^d)₂、-O - R^d、-S - R^d、-O - C(O) - R^d、-C(O) - R^d、-C(O) - OR^d、-S(O) - R^d、-S(O)₂ - R^d、-N(R^d) - C(O) - R^d、-N(R^d) - S(O) - R^d、-N(R^d) - C(O) - N(R^d)₂、-N(R^d) - S(O)₂ - R^d、および C₁ ~ 6 アルキル（該 C₁ ~ 6 アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項11に記載の化合物またはその塩。

【請求項13】

R² は、フェニル環であり、環は、C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、-NO₂、-N(R^d)₂、-CN、-C(O) - N(R^d)₂、-S(O) - N(R^d)₂、-S(O)₂ - N(R^d)₂、-O - R^d、-S - R^d、-O - C(O) - R^d、-C(O) - R^d、-C(O) - OR^d、-S(O) - R^d、-S(O)₂ - R^d、-N(R^d) - C(O) - R^d、-N(R^d) - S(O) - R^d、-N(R^d) - C(O) - N(R^d)₂、-N(R^d) - S(O)₂ - R^d、および C₁ ~ 6 アルキル（該 C₁ ~ 6 アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項11に記載の化合物またはその塩。

【請求項 14】

【請求項 15】

R^2 は、キノリルまたはイソキノリル環であり、環は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、および $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項 1～8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

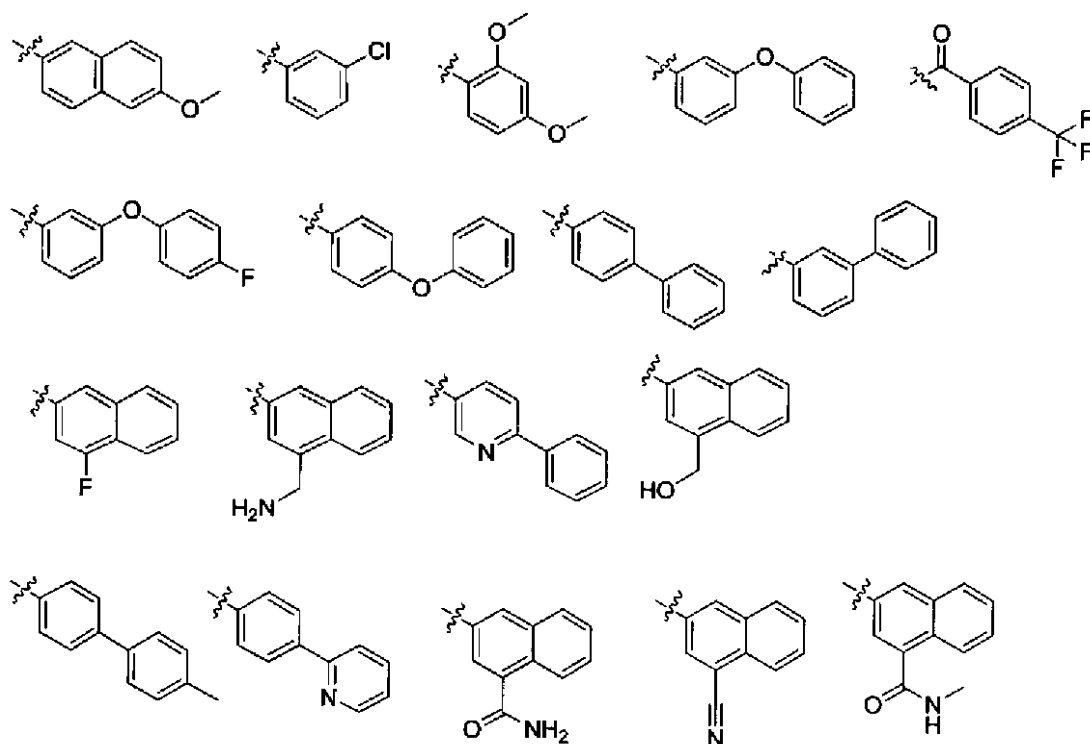
【請求項 16】

R^2 は、キノリルまたはイソキノリル環であり、環は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、炭素環、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、および $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項 15 に記載の化合物 またはその塩。

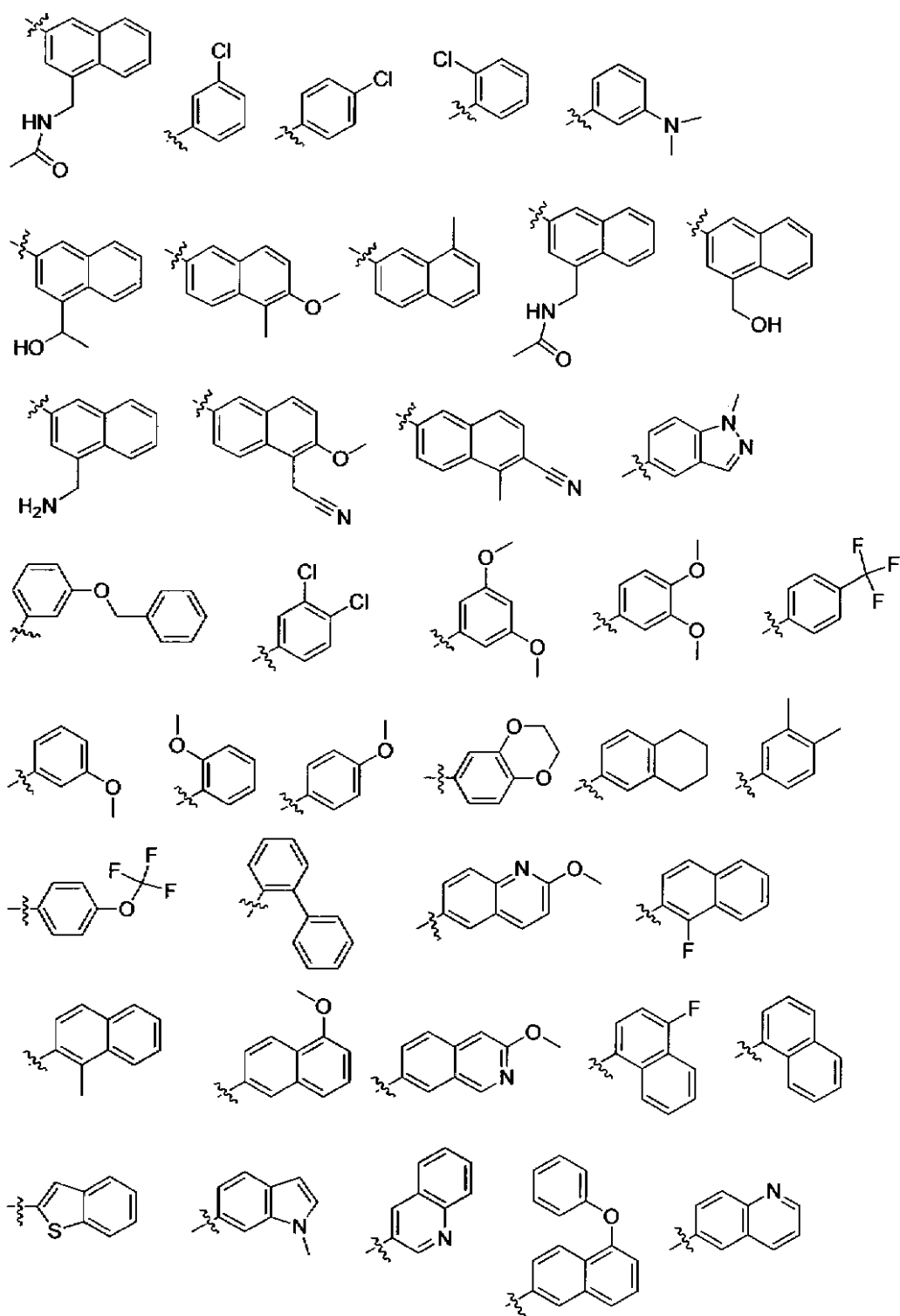
【請求項 17】

R^2 は、

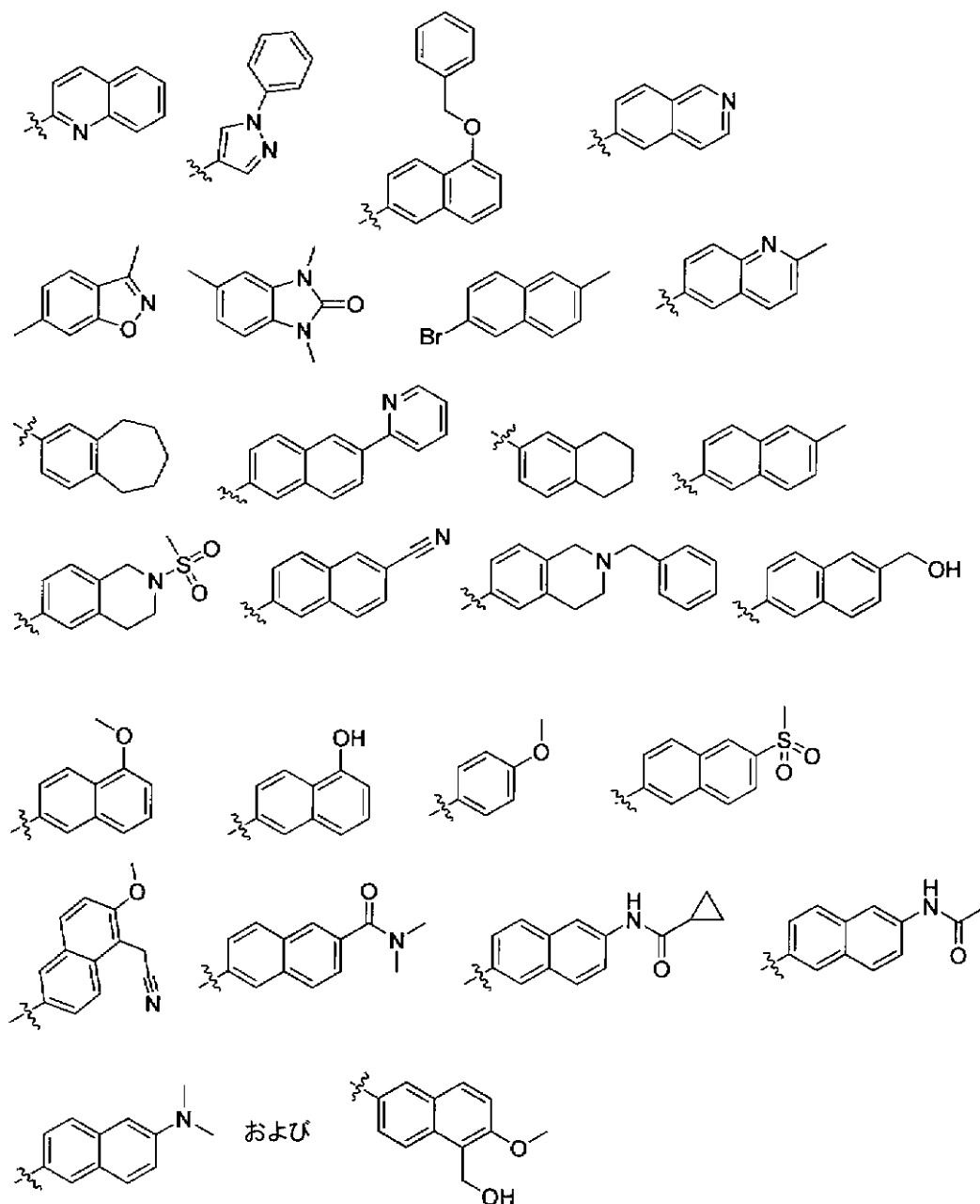
【化 175】



【化 1 7 6】



【化 177】



からなる群から選択される、請求項 1～8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

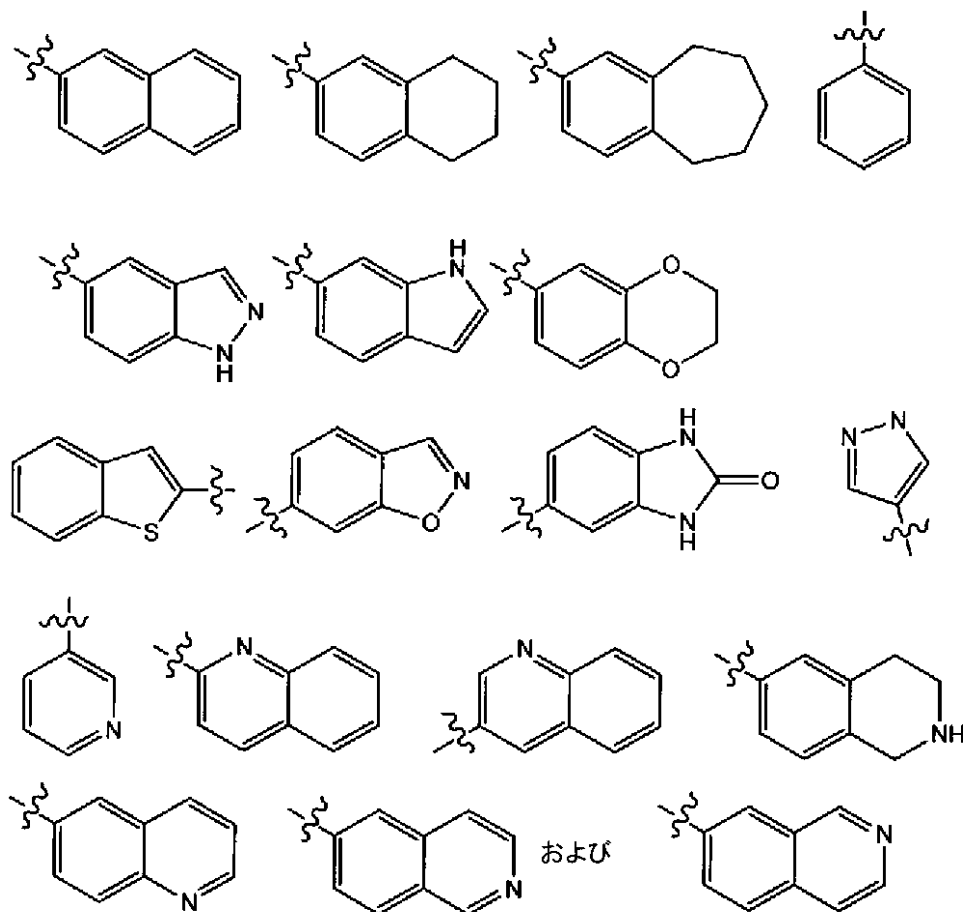
【請求項 18】

R^1 は、ピペリジン環窒素上で R^x 基で置換され、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8 員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{O}-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}-\text{R}^b$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^b$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{S}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、および $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^b$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的にさらに置換された炭素連結ピペリジン環であって；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8 員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{O}-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}-\text{R}^b$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-$

R^b 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペリジン環であり、かつ

R^2 は、

【化178】



からなる群から選択される環であり、この環は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、および $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項

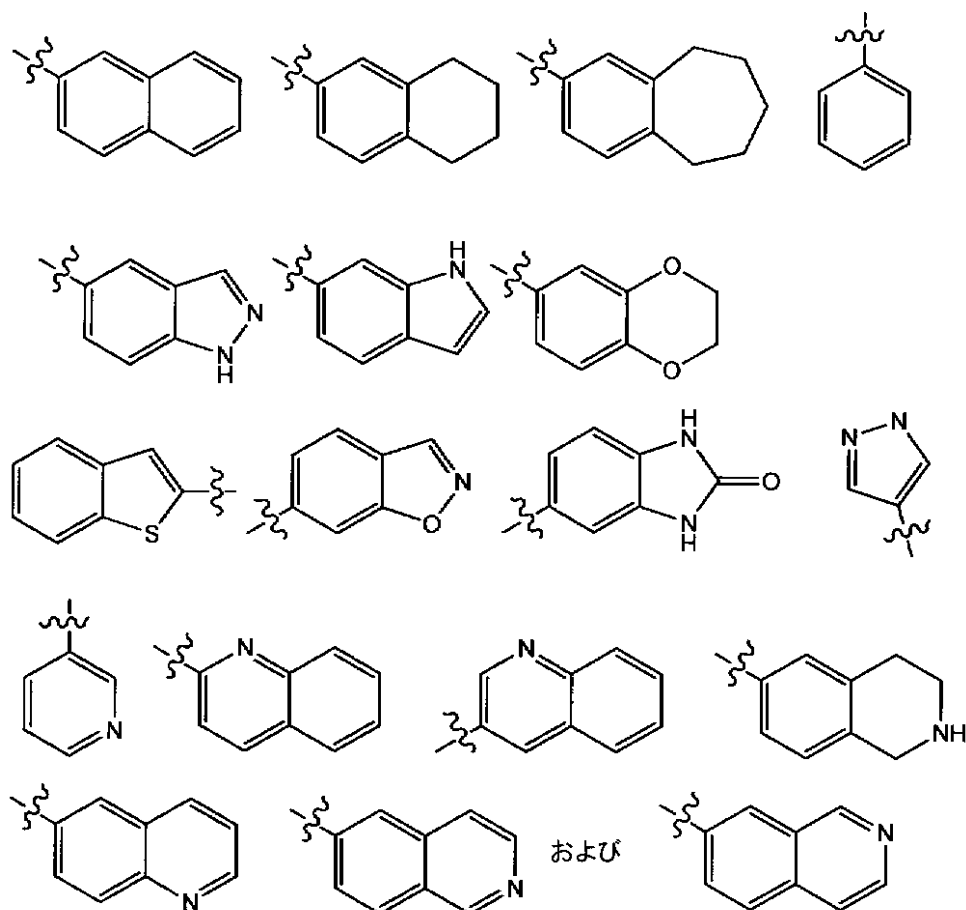
1に記載の化合物またはその塩。

【請求項19】

R^1 は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で置換された炭素連結ピペラジン環であって；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペラジン環であり；

R^2 は、

【化179】



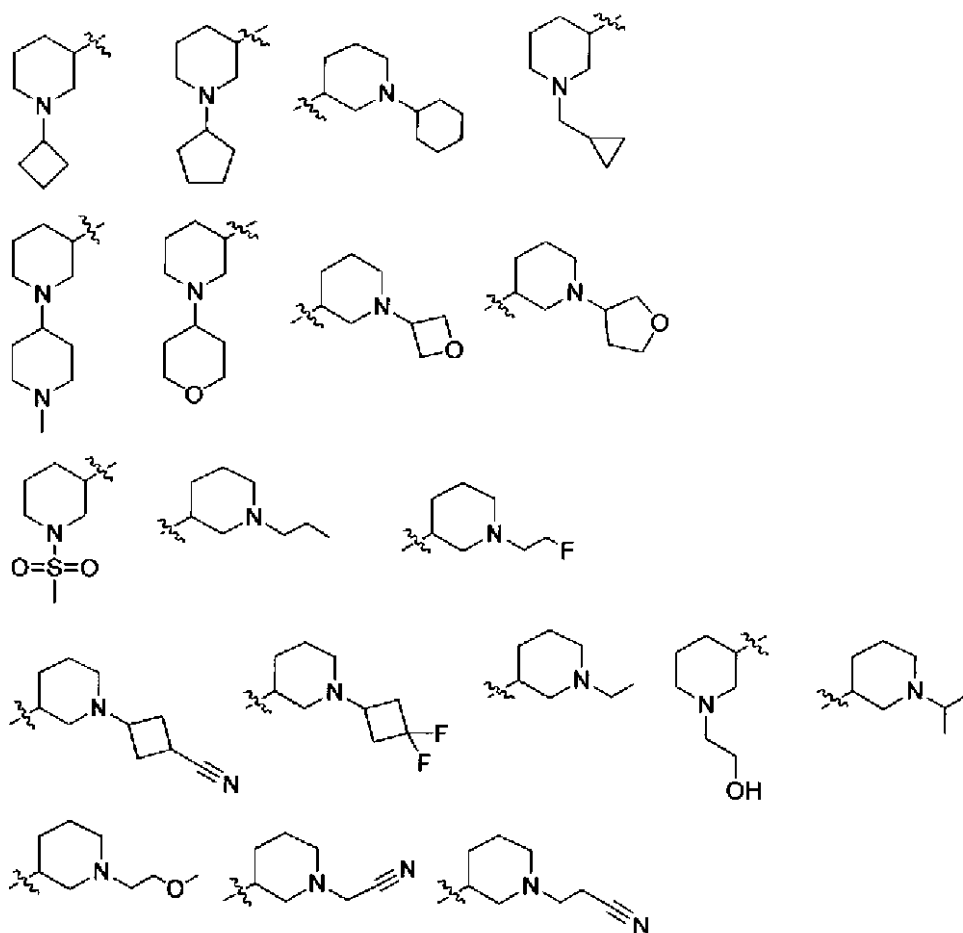
からなる群から選択される環であり；環は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペラジン環であり；

$\text{O})_2 - \text{N}(\text{R}^d)_2$ 、 $-\text{O}-\text{R}^d$ 、 $-\text{S}-\text{R}^d$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^d$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^d$ 、 $-\text{N}(\text{R}^d)-\text{C}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{N}(\text{R}^d)-\text{S}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{N}(\text{R}^d)-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、および $-\text{N}(\text{R}^d)-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^d$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim 6$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、 $-\text{O}-\text{R}^d$ 、 $-\text{S}-\text{R}^d$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^d$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^d$ 、 $-\text{N}(\text{R}^d)-\text{C}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{N}(\text{R}^d)-\text{S}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{N}(\text{R}^d)-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^d)-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^d$ 、および $\text{C}_1 \sim 6$ アルキル（該 $\text{C}_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1に記載の化合物またはその塩。

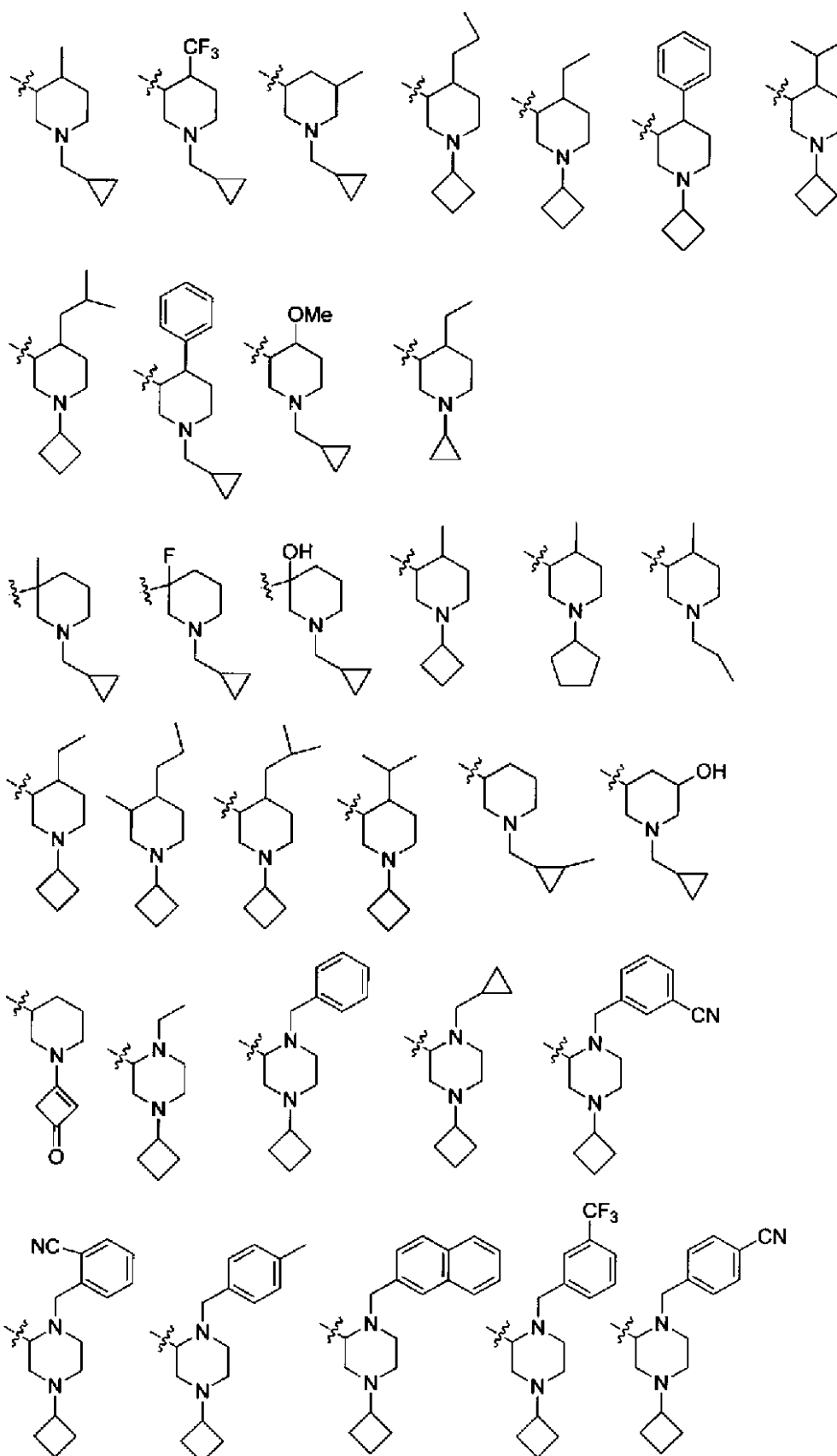
【請求項20】

R^1 は、

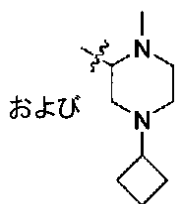
【化180】



【化 1 8 1】



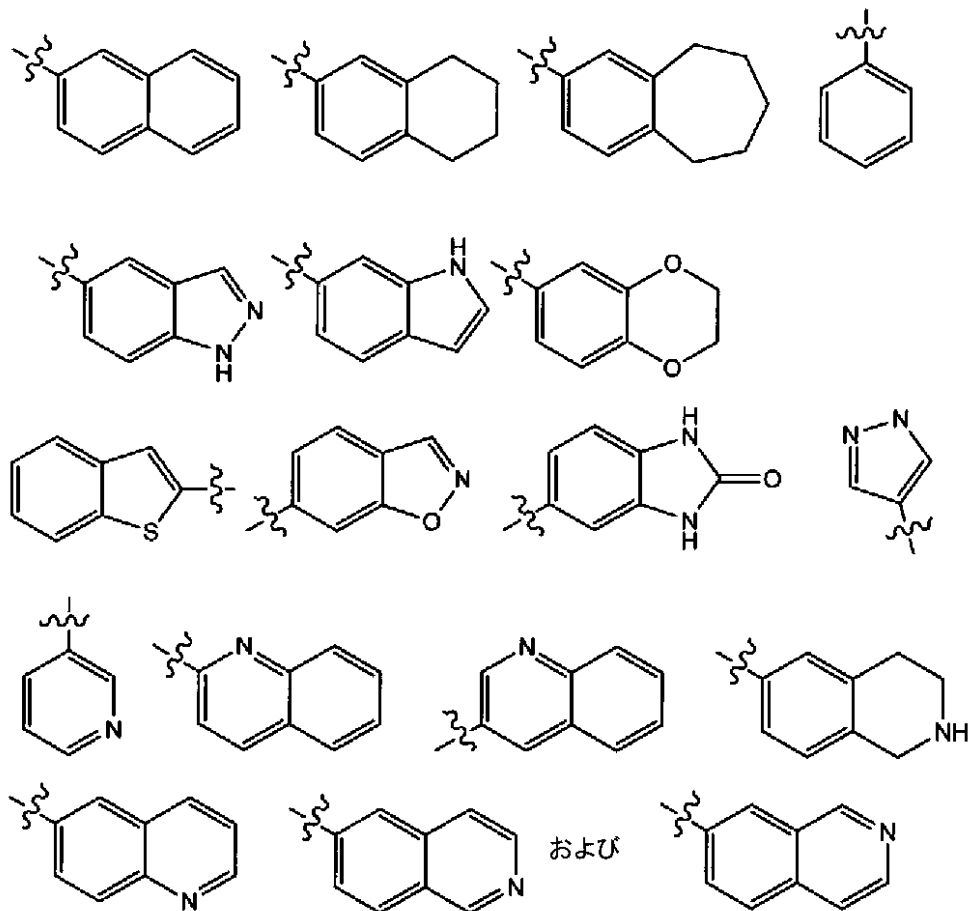
【化 1 8 2】



からなる群から選択され、

R^2 は、

【化 1 8 3】



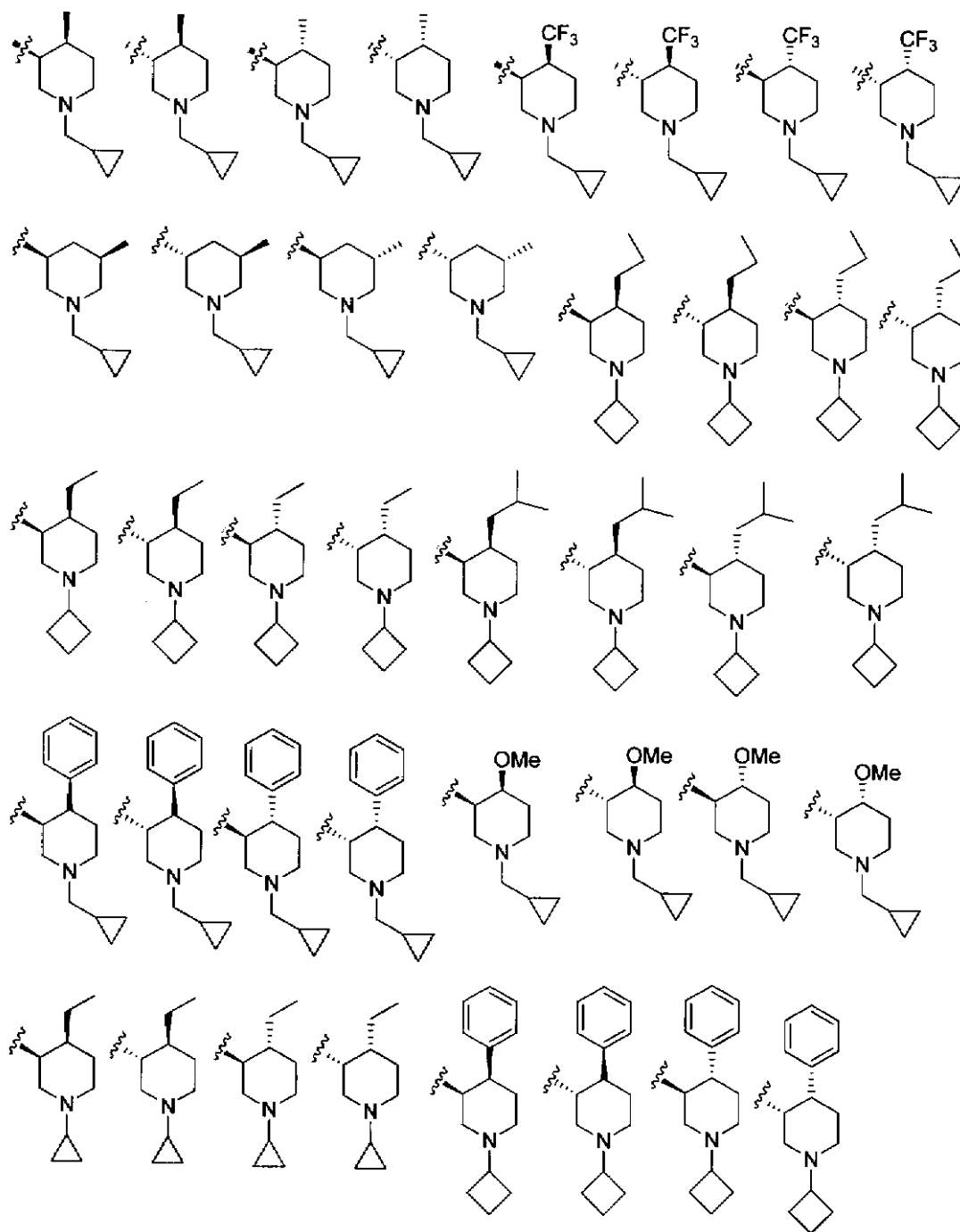
からなる群から選択される環であり；環は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、および $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキル

は、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1に記載の化合物またはその塩。

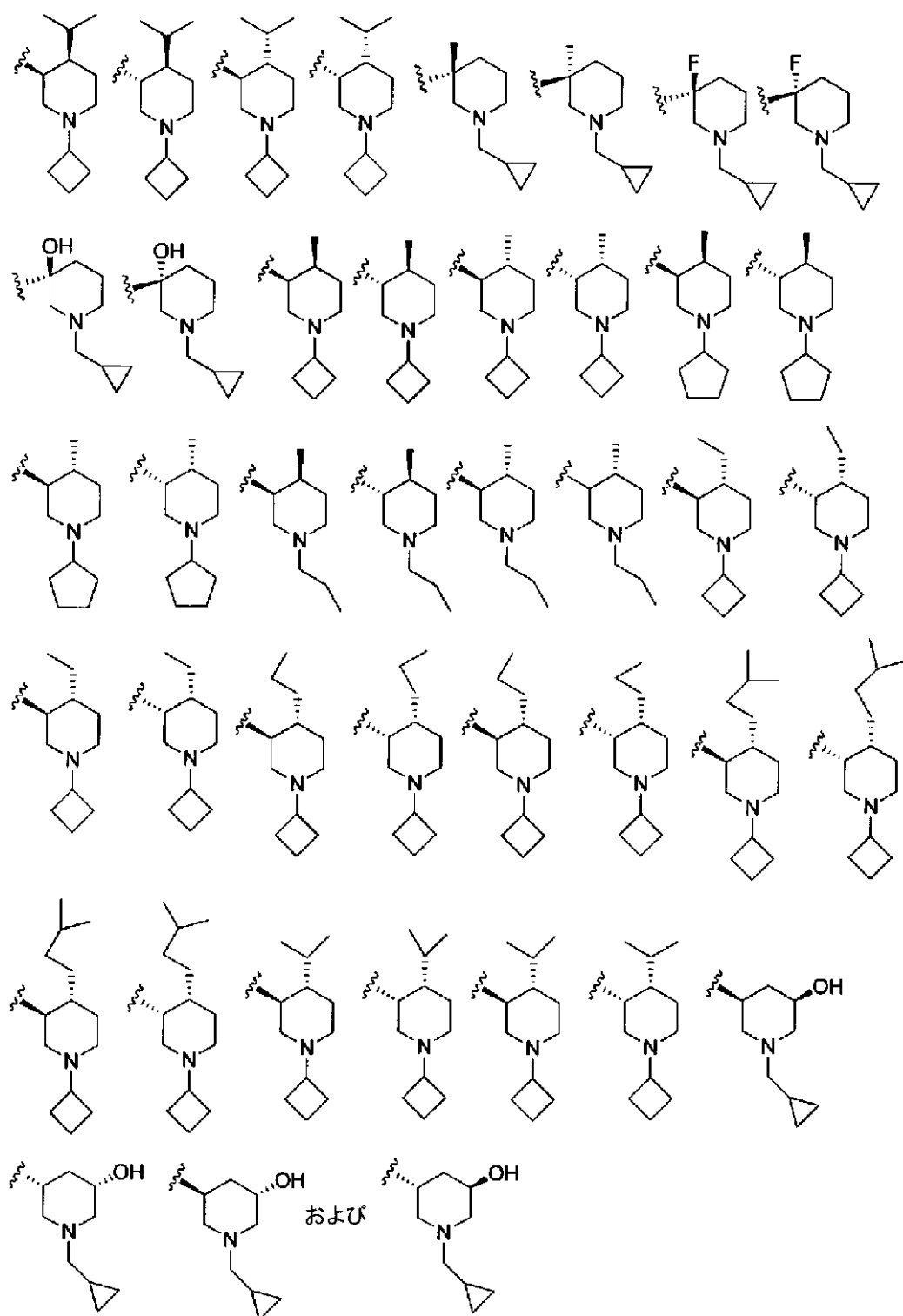
【請求項21】

R¹ は、

【化184】

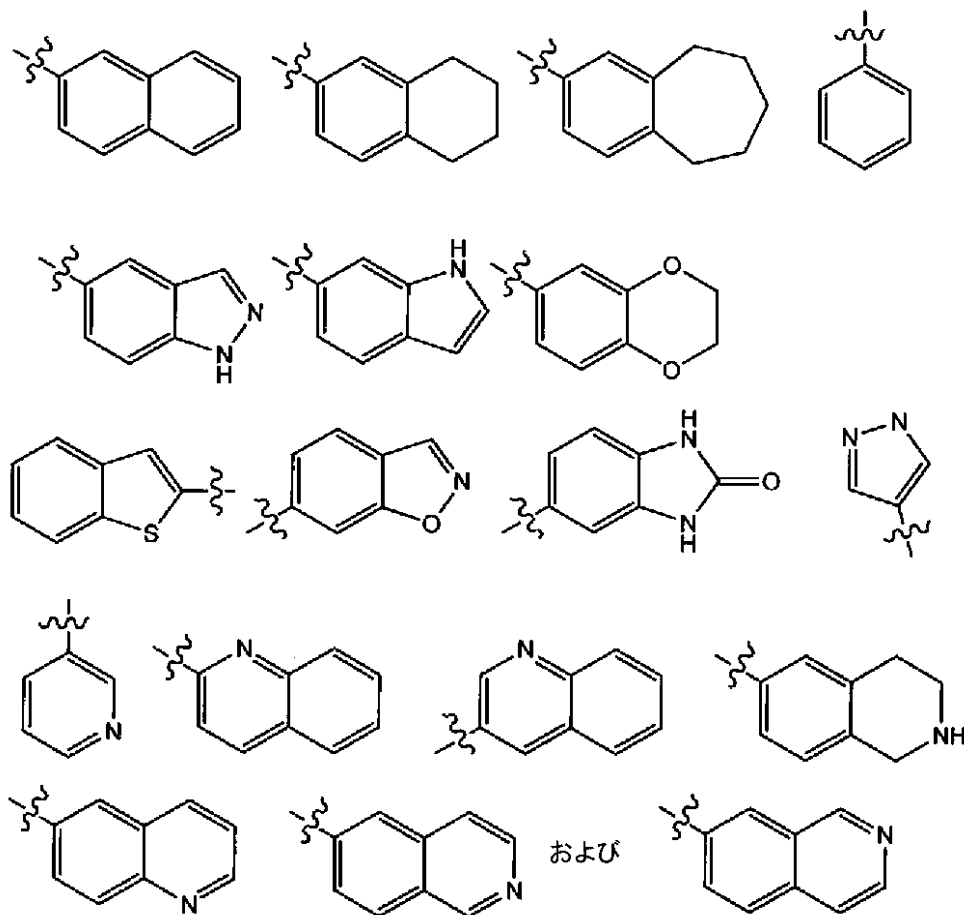


【化 1 8 5】



からなる群から選択され、
 R^2 は、

【化 1 8 6】



からなる群から選択される環であり；環は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、 $-\text{O}-\text{R}^d$ 、 $-\text{S}-\text{R}^d$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^d$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^d$ 、 $-\text{N}(\text{R}^d)-\text{C}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{N}(\text{R}^d)-\text{S}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{N}(\text{R}^d)-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、および $-\text{N}(\text{R}^d)-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^d$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、 $-\text{O}-\text{R}^d$ 、 $-\text{S}-\text{R}^d$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^d$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^d$ 、 $-\text{N}(\text{R}^d)-\text{C}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{N}(\text{R}^d)-\text{S}(\text{O})-\text{R}^d$ 、 $-\text{N}(\text{R}^d)-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^d)-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^d$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1に記載の化合物またはその塩。

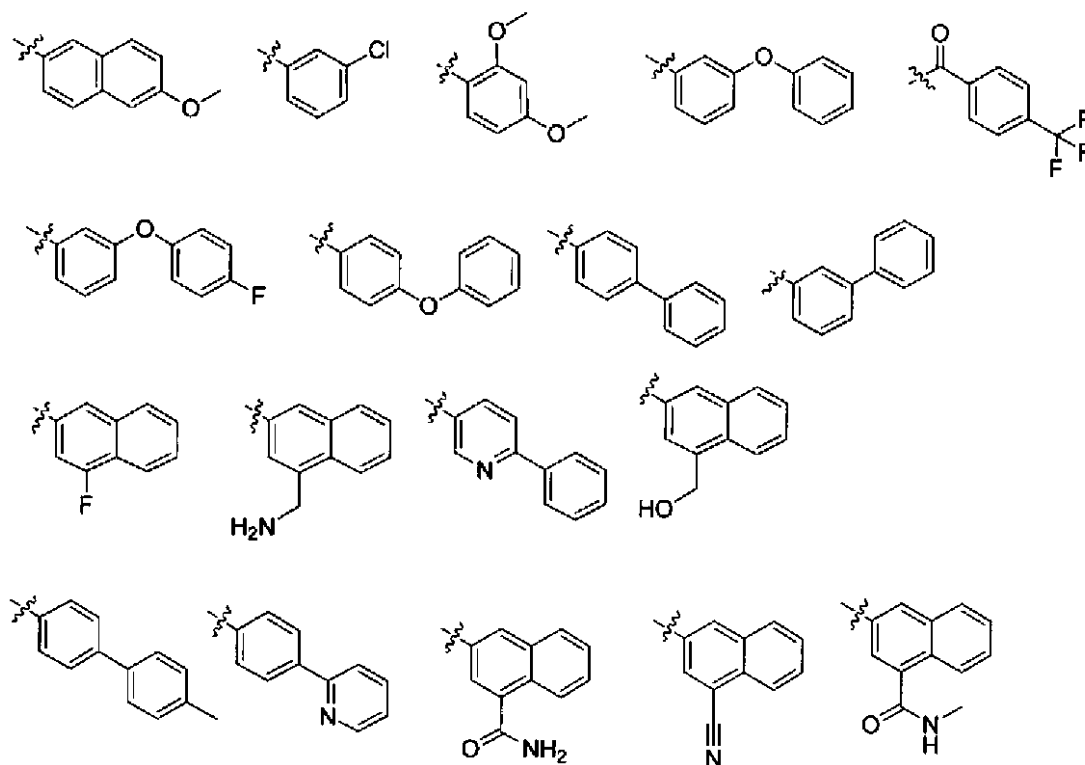
【請求項 2 2】

R^1 は、ピペリジン環窒素上で R^x 基で置換され、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{O}-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}-\text{R}^b$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^b$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2$

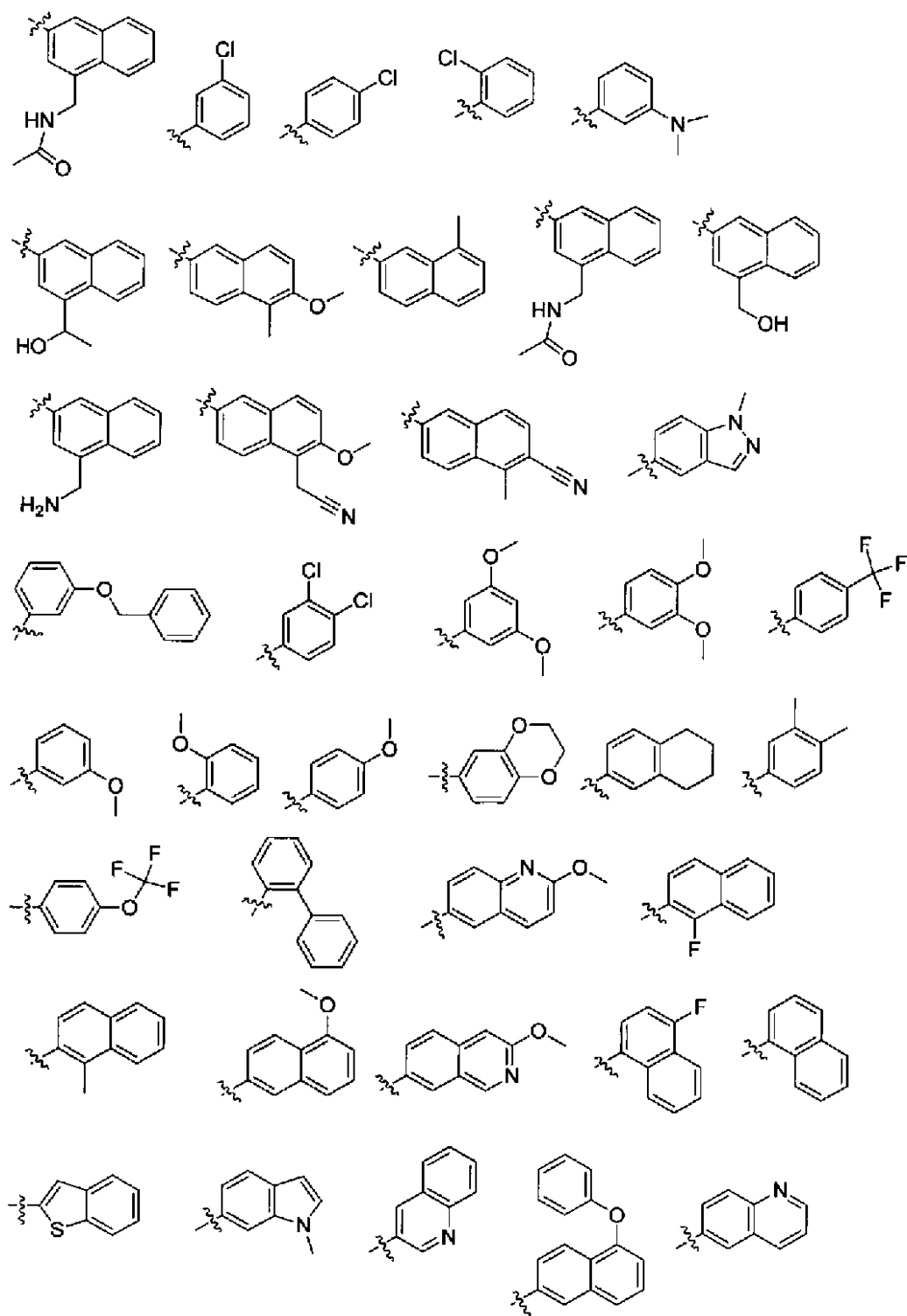
$-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的にさらに置換された炭素連結ピペリジン環であって；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペリジン環であり；

R^2 は、

【化187】



【化 1 8 8】



[illegible]

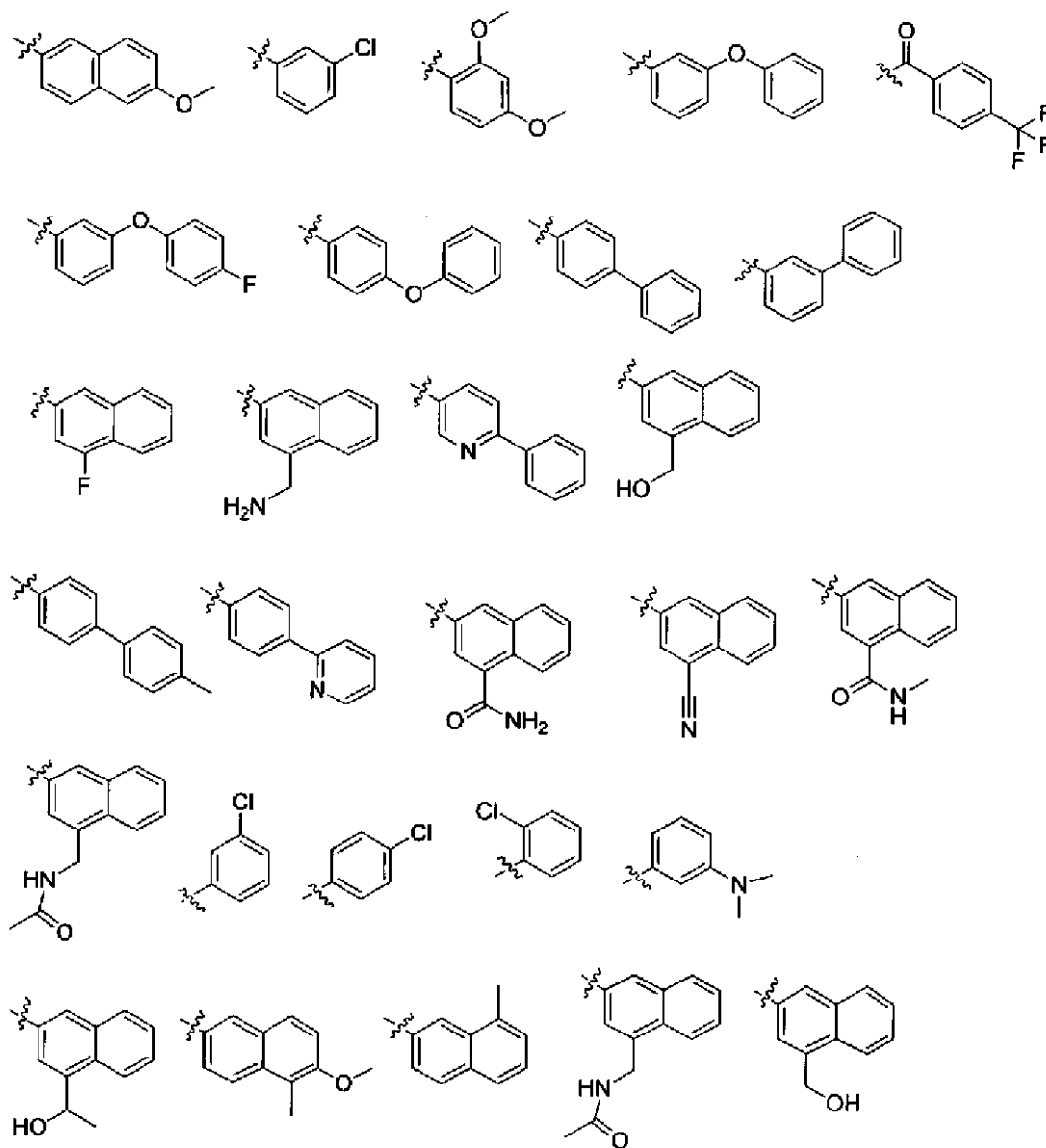
【請求項 23】

R¹ は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₂ ~ C₆ アルキニル、C₃ ~ C₈ 炭素環、3 ~ 8 員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、-NO₂、-N(R^b)₂、-CN、-C(O)-N(R^b)₂、-S(O)-N(R^b)₂、-S(O)₂-N(R^b)₂、-O-R^b、-S-R^b、-O-C(O)-R^b、-C(O)-R^b、-C(O)-OR^b、-S(O)-R^b、-S(O)₂-R^b、-N(R^b)-C(O)-R^b、-N(R^b)-S(O)-R^b、-N(R^b)-C(O)-N(R^b)₂、および-N(R^b)-S(O)₂-R^b からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で置換された炭素連結ピペラジン環であって；各々のC₁ ~ C₆ アルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₂ ~ C₆ アルキニル、C₃ ~ C₈ 炭素環、3 ~ 8 員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、-NO₂、-N(R^b)₂、-CN、-C(O)-N(R^b)₂、-S(O)-N(R^b)₂、-S(O)₂-N(R^b)₂、-O-R^b、-S-R^b、-O-C(

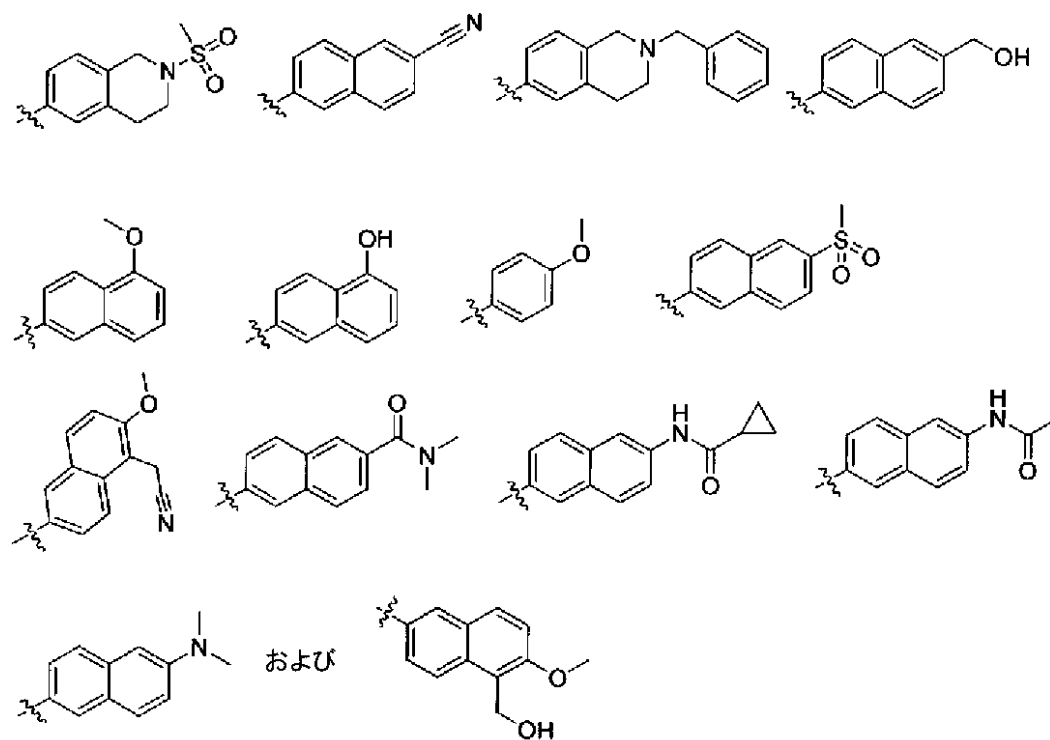
$O) - R^b$ 、 $-C(O) - R^b$ 、 $-C(O) - OR^b$ 、 $-S(O) - R^b$ 、 $-S(O)_2 - R^b$ 、 $-N(R^b) - C(O) - R^b$ 、 $-N(R^b) - S(O) - R^b$ 、 $-N(R^b) - C(O) - N(R^b)_2$ 、 $-N(R^b) - S(O)_2 - R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル
 (該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペラジン環であり；

R^2 は、

【化190】



【化 1 9 2】

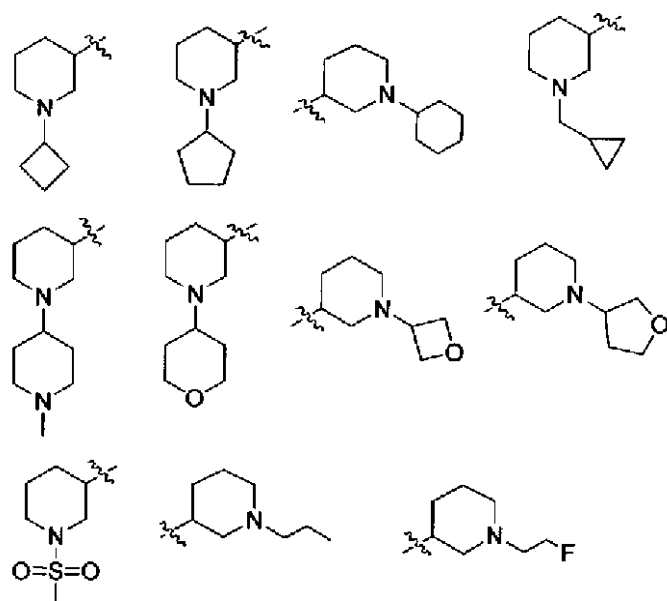


からなる群から選択される、
請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

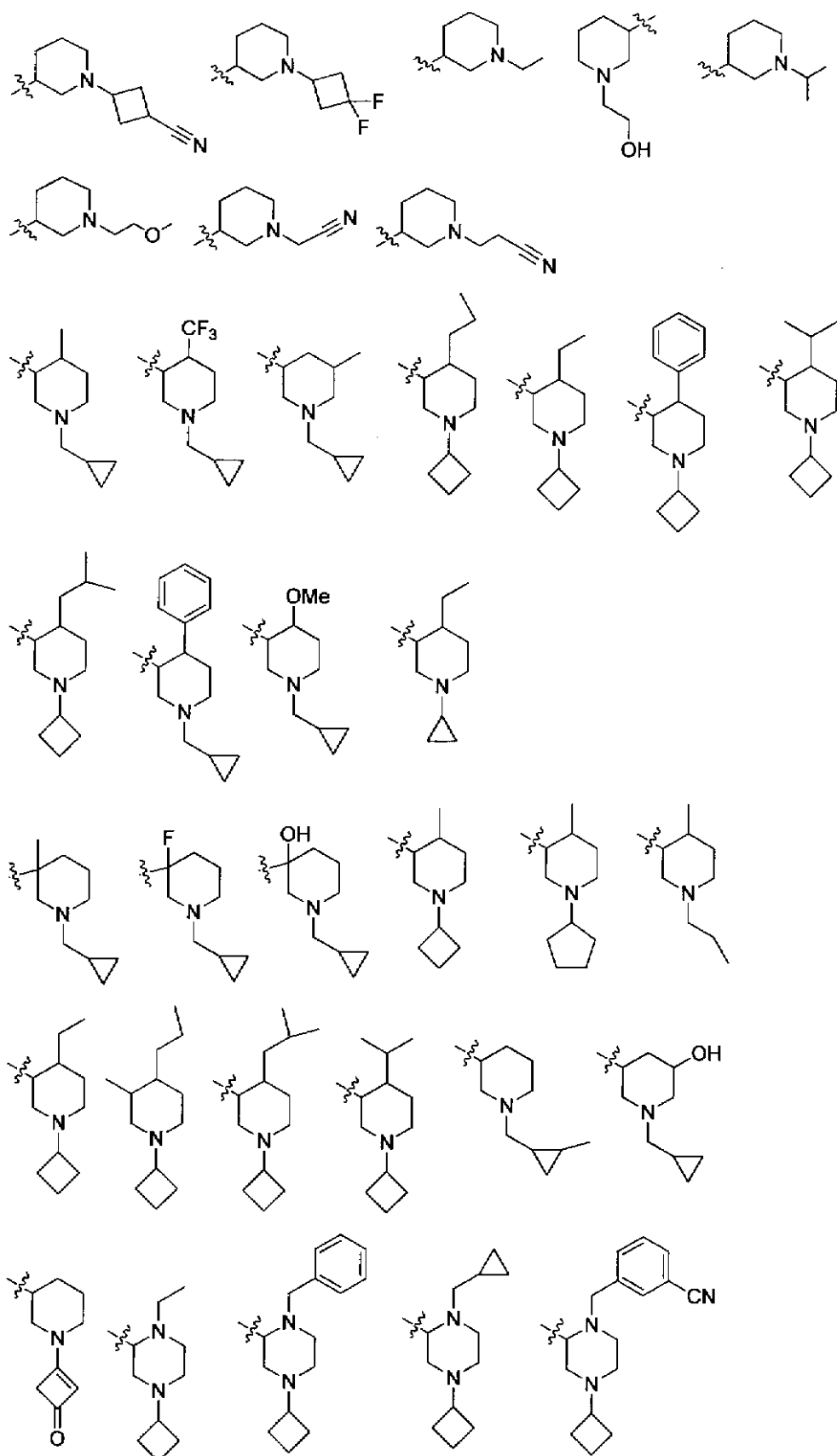
【請求項 2 4】

R¹ は、

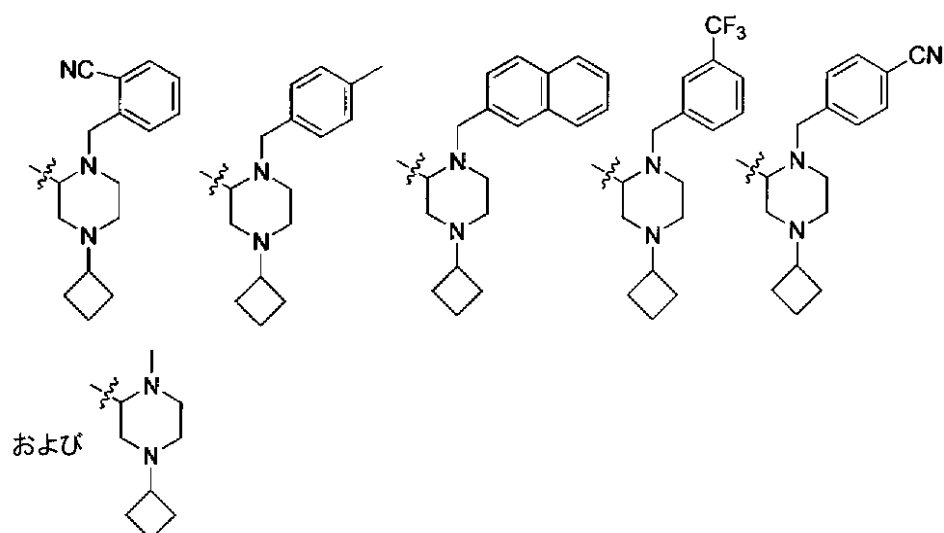
【化 1 9 3】



【化 1 9 4】



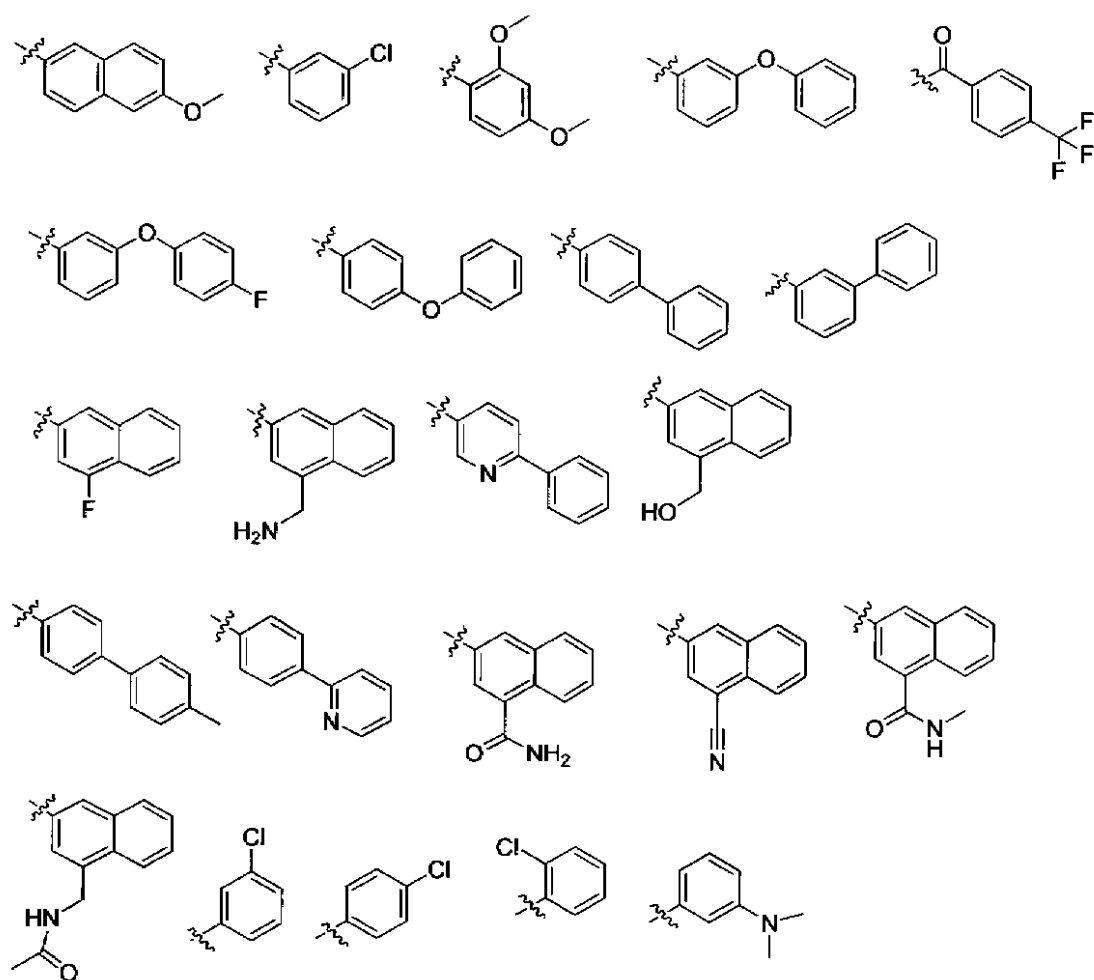
【化 1 9 5】



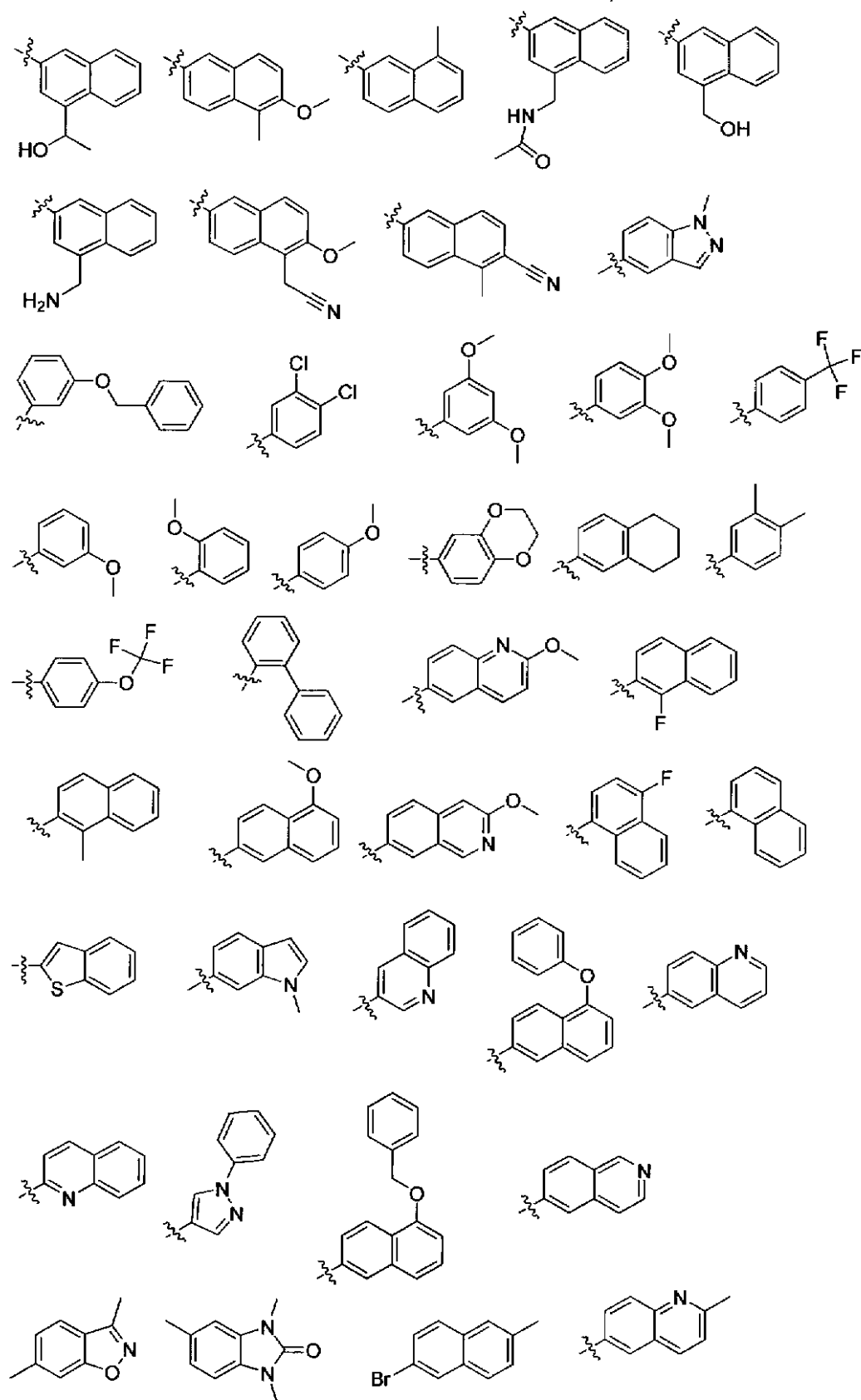
からなる群から選択され；

R^2 は、

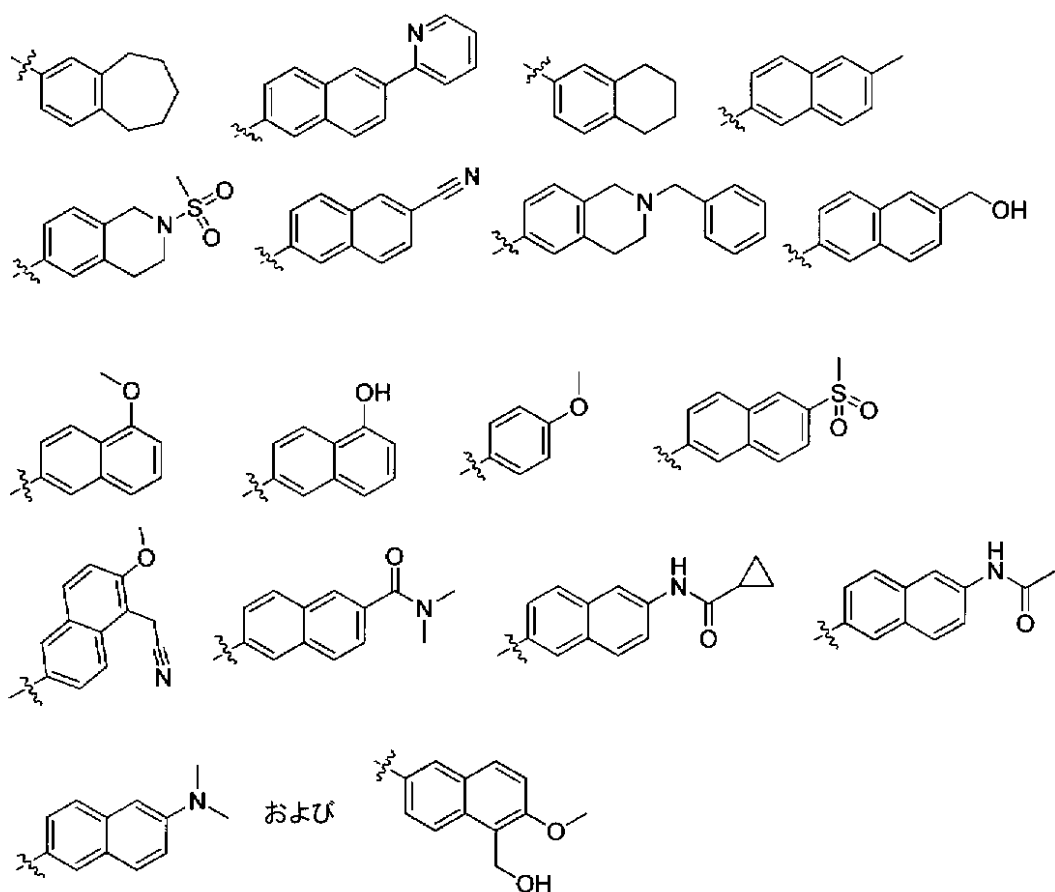
【化 1 9 6】



【化 1 9 7】



【化 1 9 8】

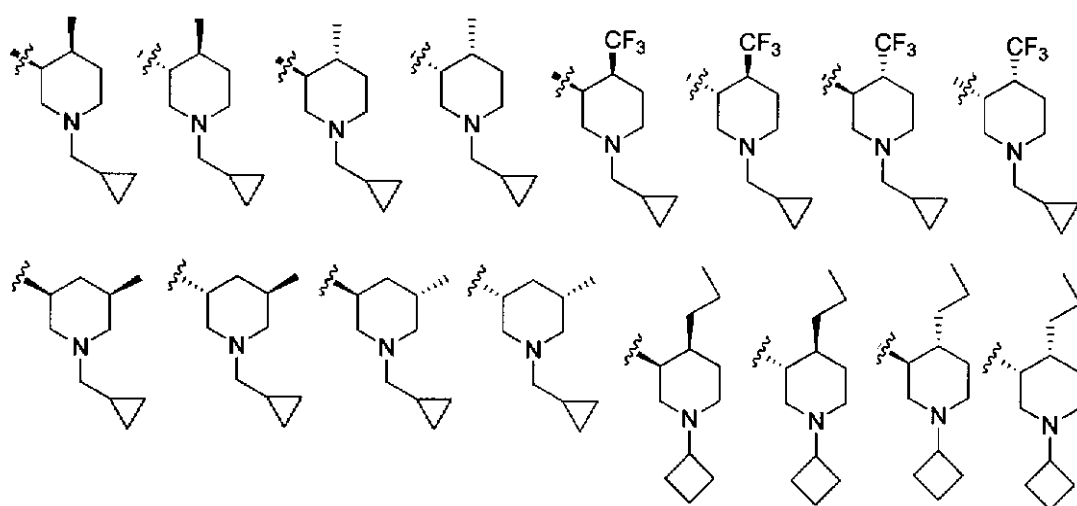


からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

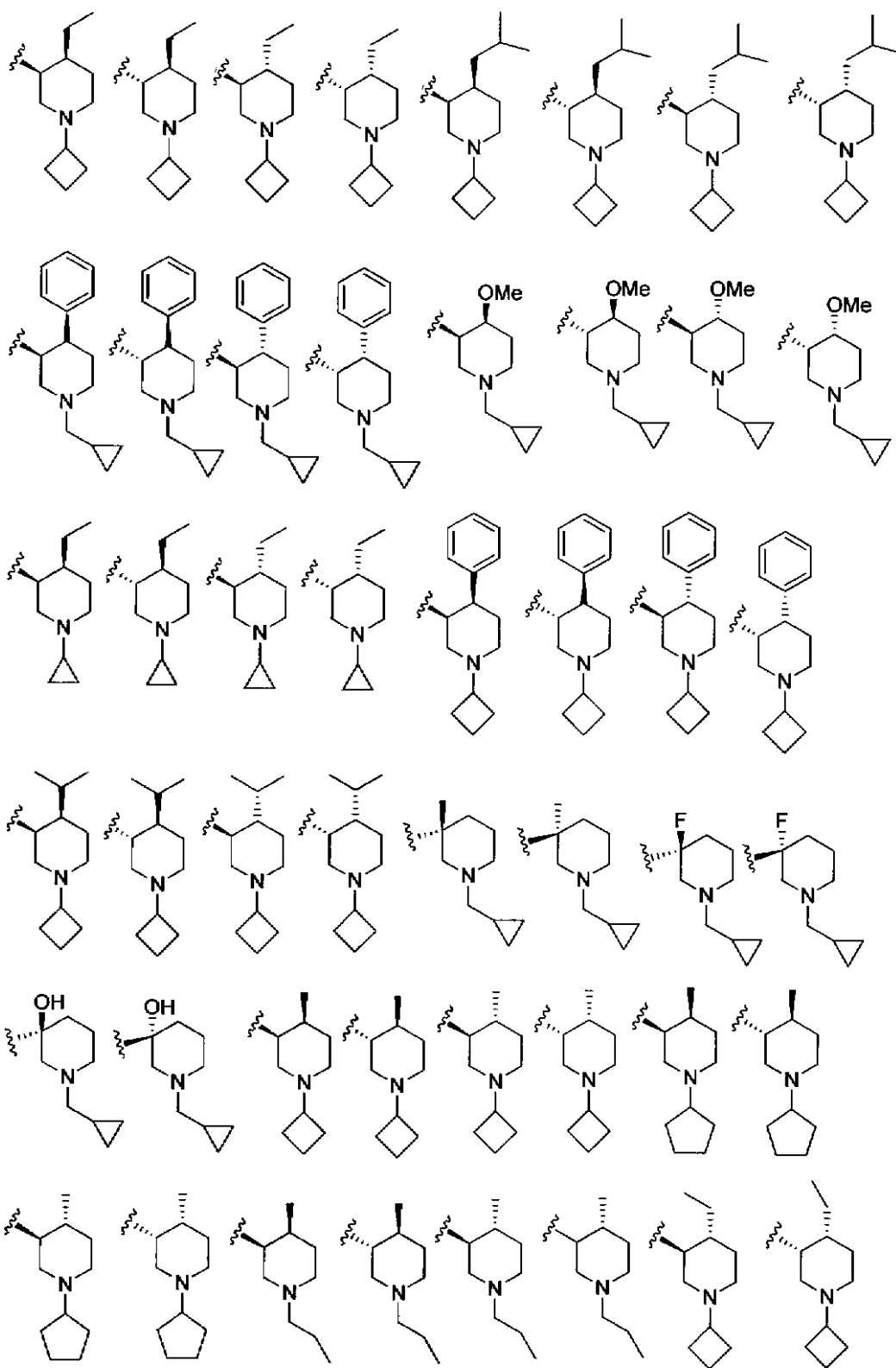
【請求項 2 5】

R¹ は、

【化 1 9 9】



【化 200】



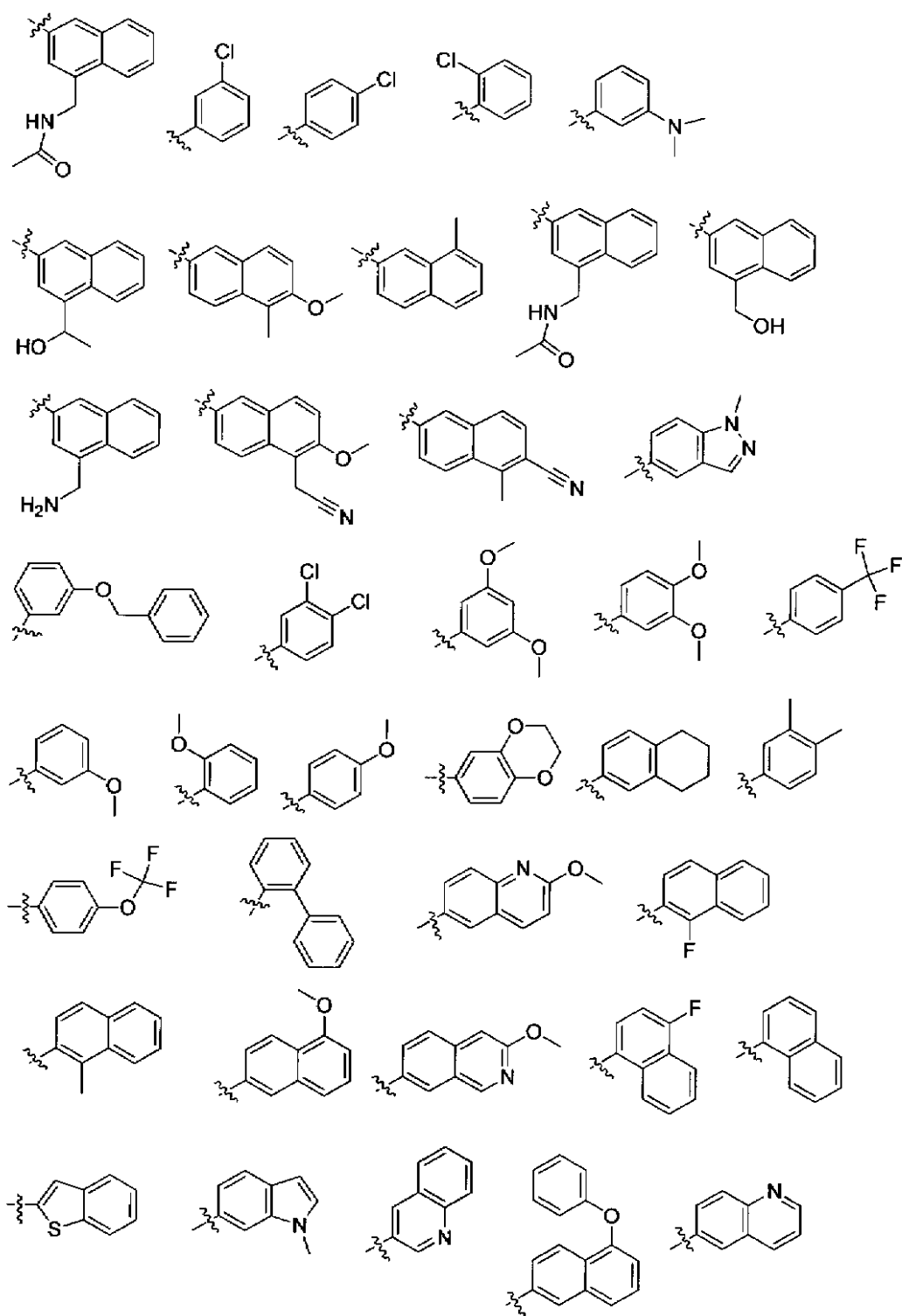
Chemical structures of various substituted piperidines, including cyclobutyl, hydroxy, and cyclopropyl derivatives.

R^2 は、

The image displays 15 chemical structures representing different substituents (R₁) that can be attached to the 2,6-difluoro-4-phenyl-1,3,5-triazine core. The structures are arranged in four rows:

- Row 1: 1-methoxy-2-naphthyl, 3-chlorophenyl, 3,5-dimethoxyphenyl, 4-phenoxyphenyl, and 4-(trifluoromethyl)benzoyl.
- Row 2: 4-fluorophenyl, 4-phenoxyphenyl, biphenyl-4-yl, and biphenyl-3-yl.
- Row 3: 2-fluoro-1-naphthyl, (2-aminoethyl)-1-naphthyl, 2-phenylpyridin-5-yl, and 2-(hydroxymethyl)-1-naphthyl.
- Row 4: 4-(4-methylphenyl)phenyl, 2-(4-phenylpyridin-2-yl)phenyl, 2-aminonaphthalen-1-yl, 2-cyano-1-naphthyl, and 2-(dimethylamino)-1-naphthyl.

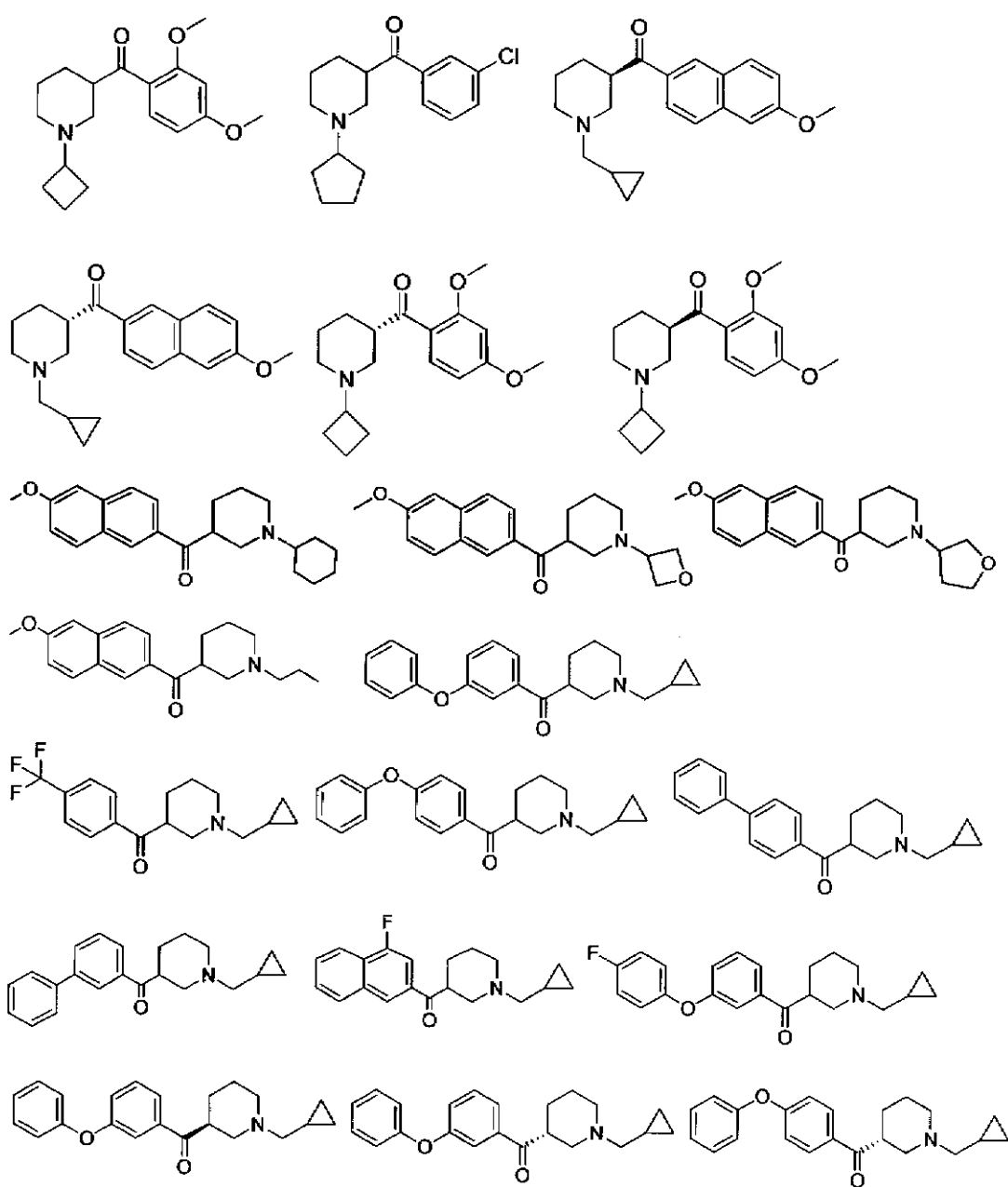
【化 2 0 3】



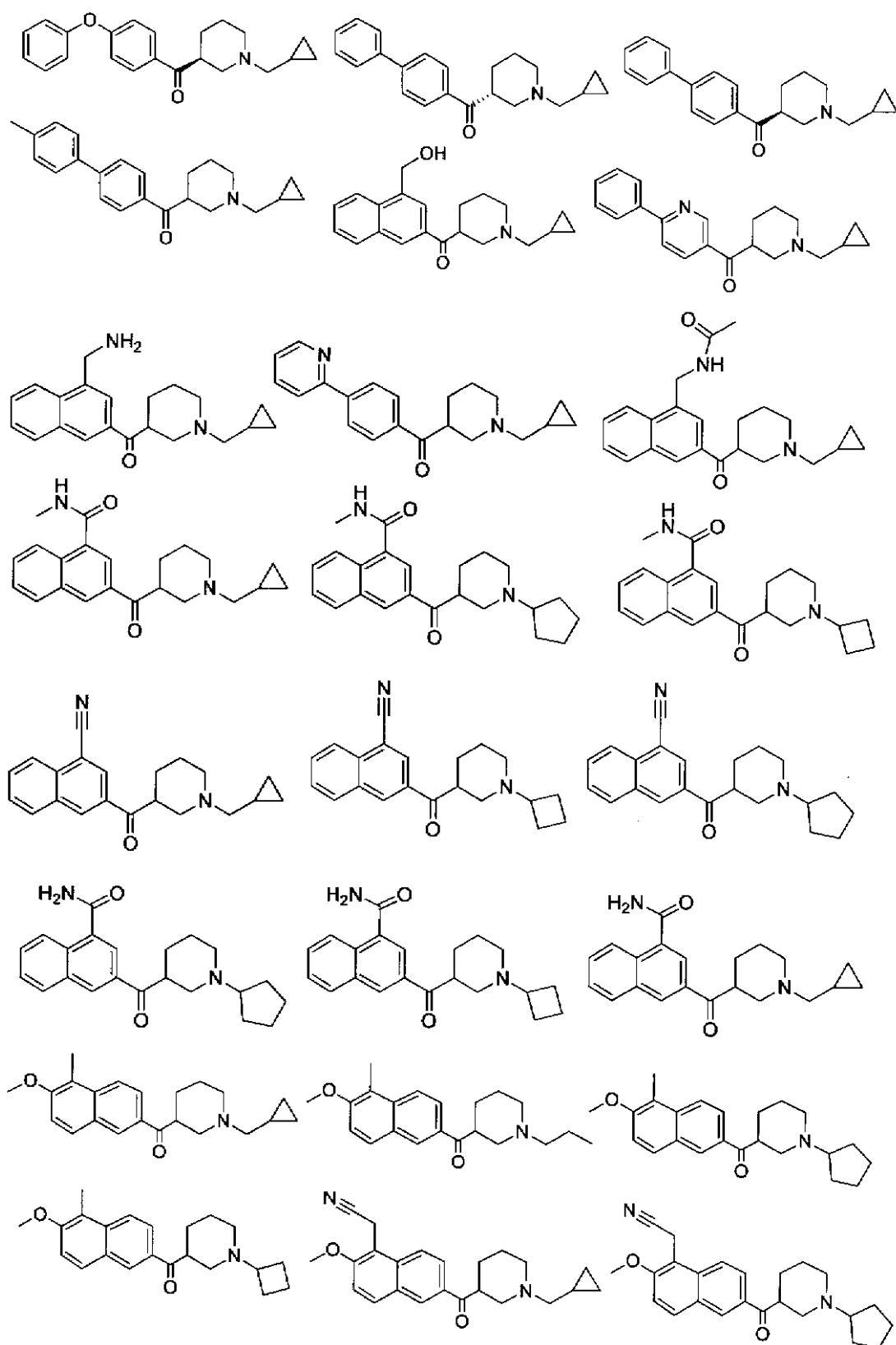
Chemical structures of various naphthalene derivatives, including quinoline, indole, and substituted naphthalenes, with wavy lines indicating attachment points.

【請求項 26】

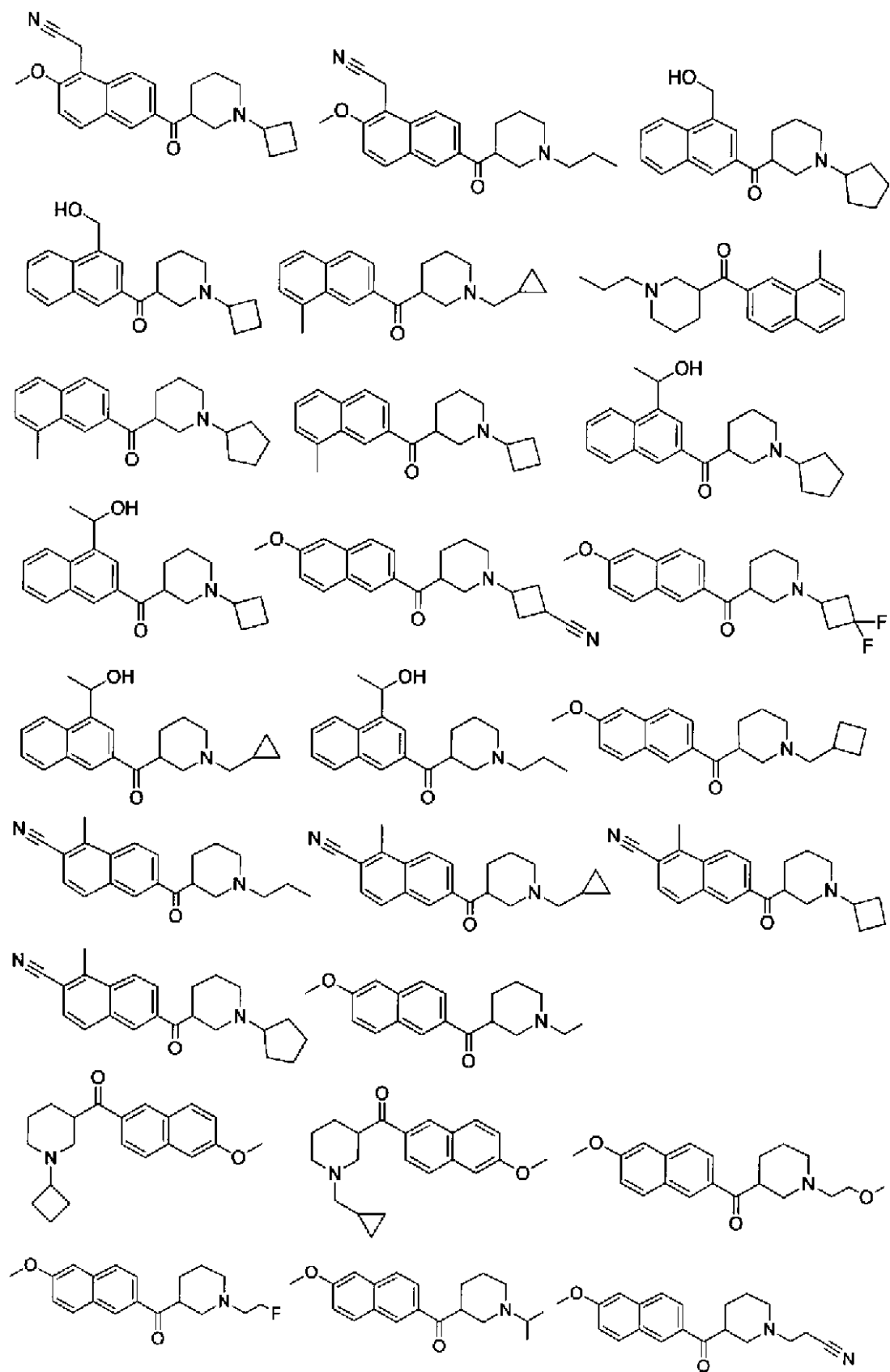
【化 2 0 5】



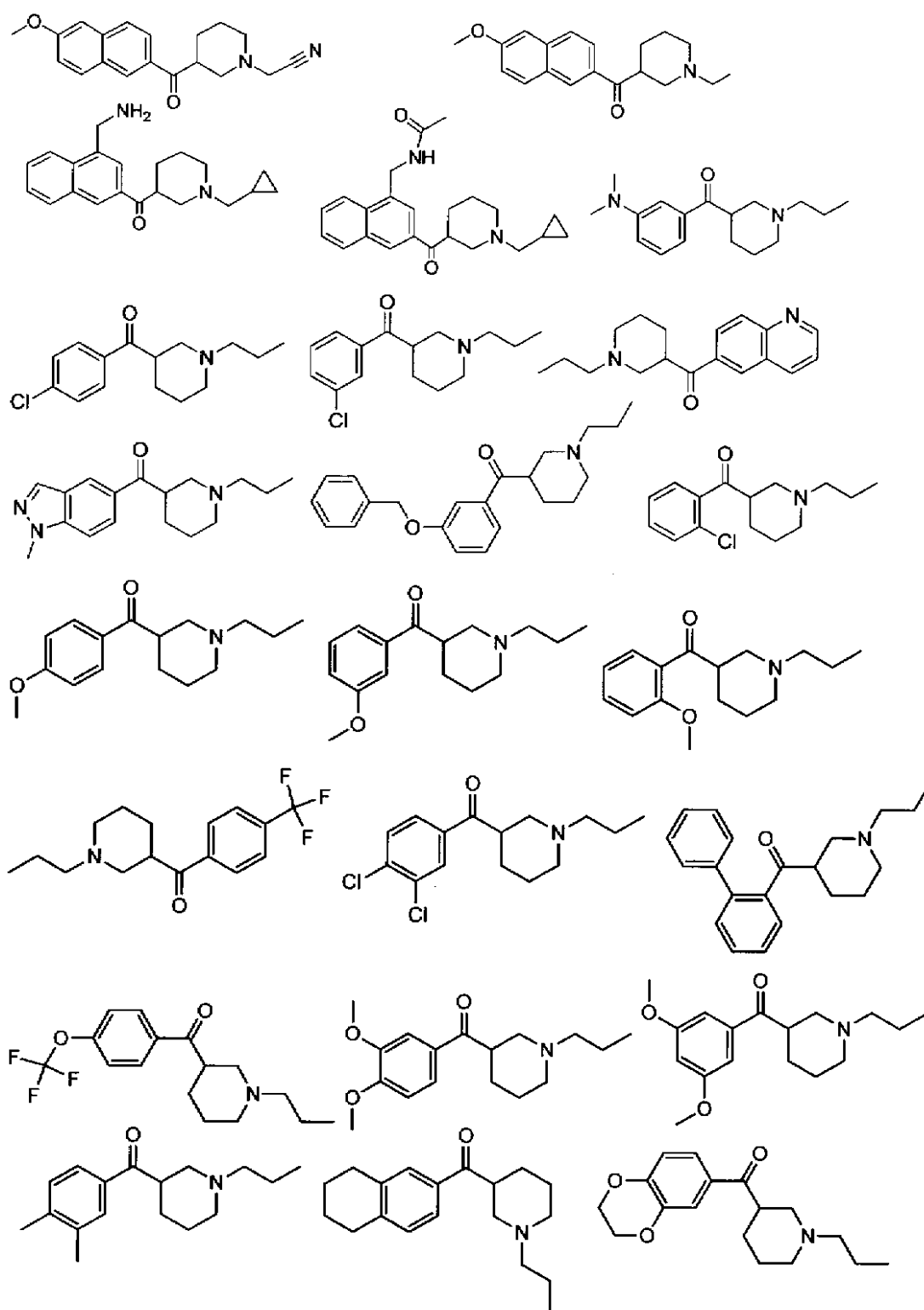
【化 206】



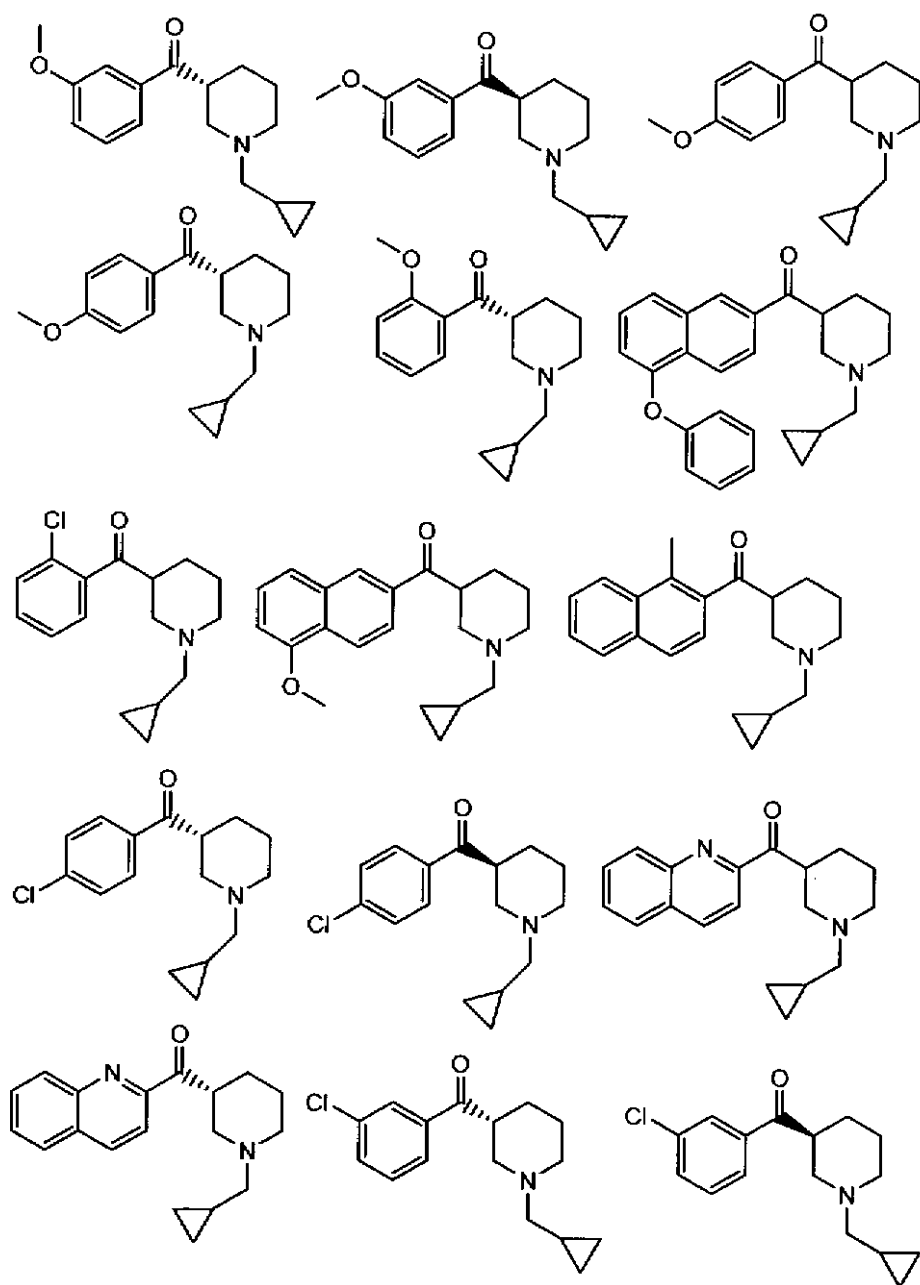
【化 2 0 7】



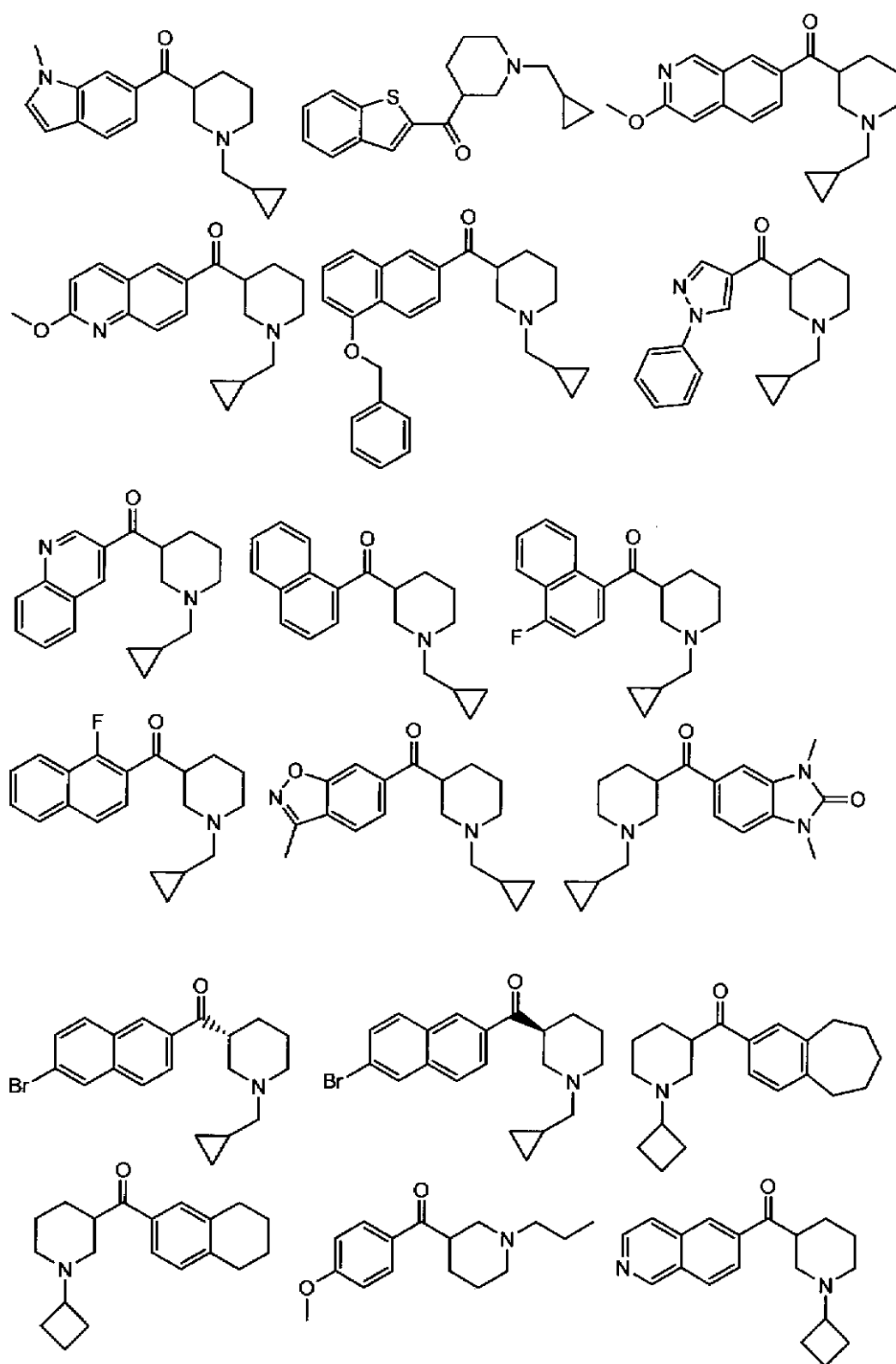
【化 208】



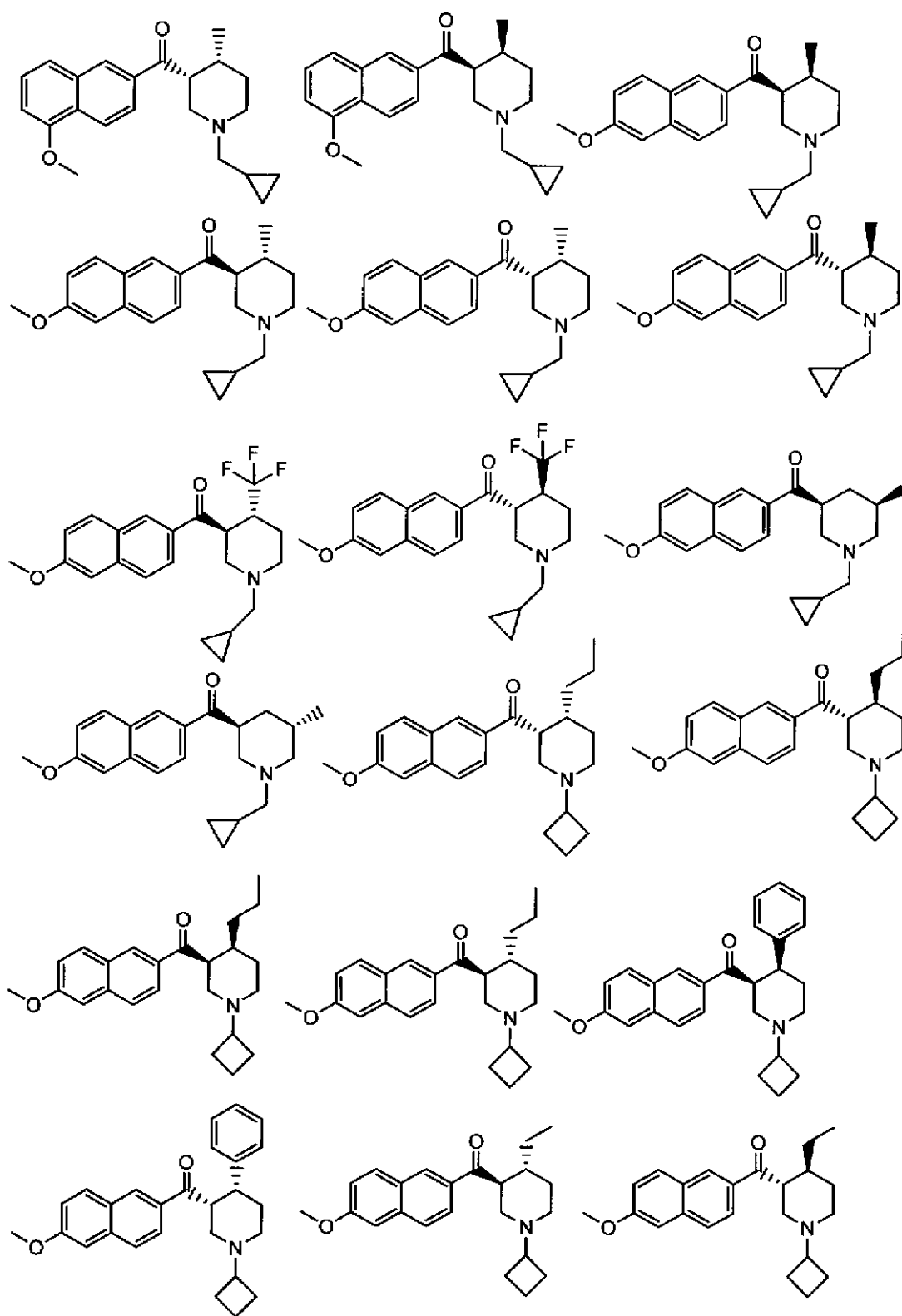
【化 2 0 9】



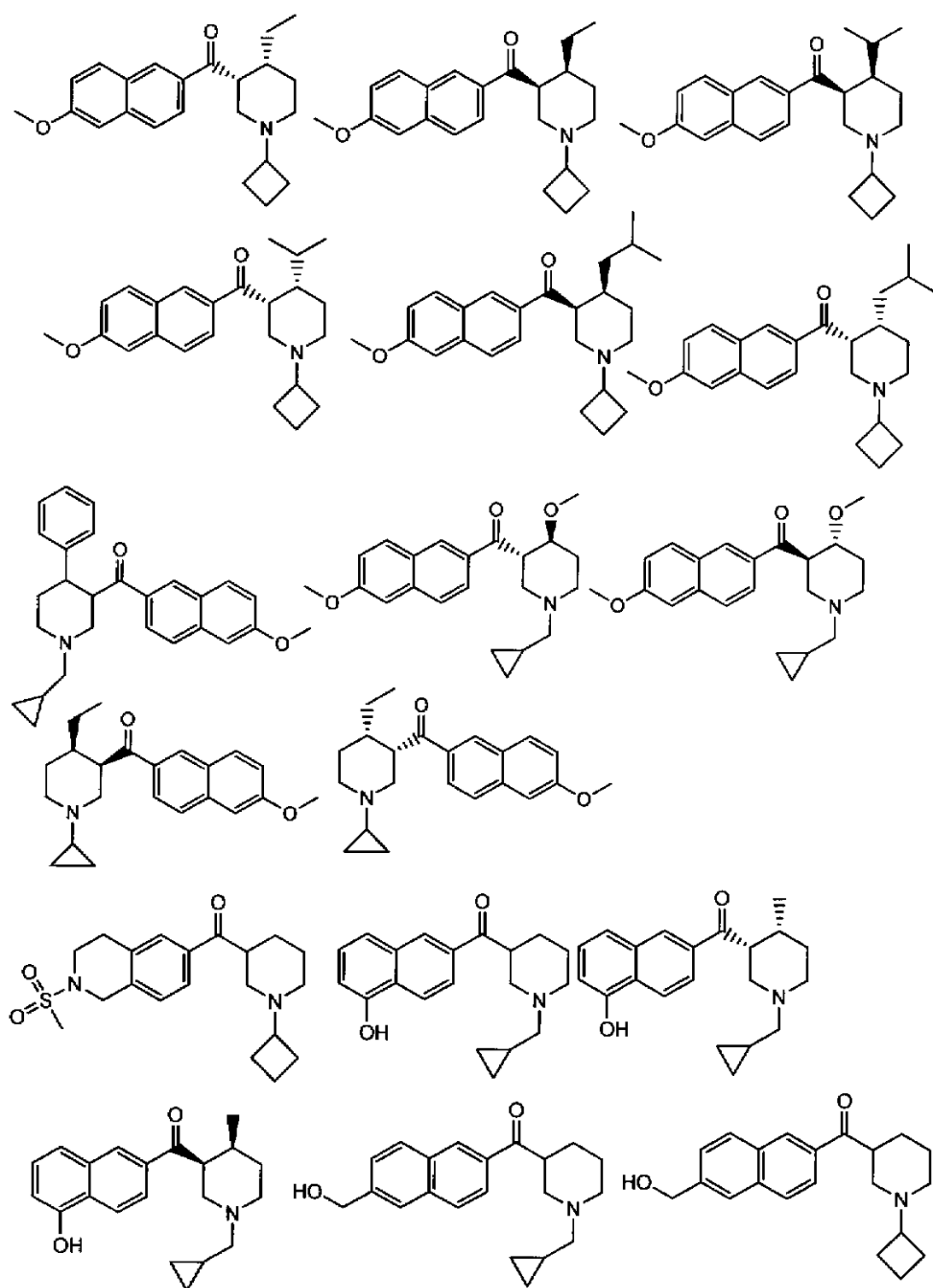
【化 2 1 0】



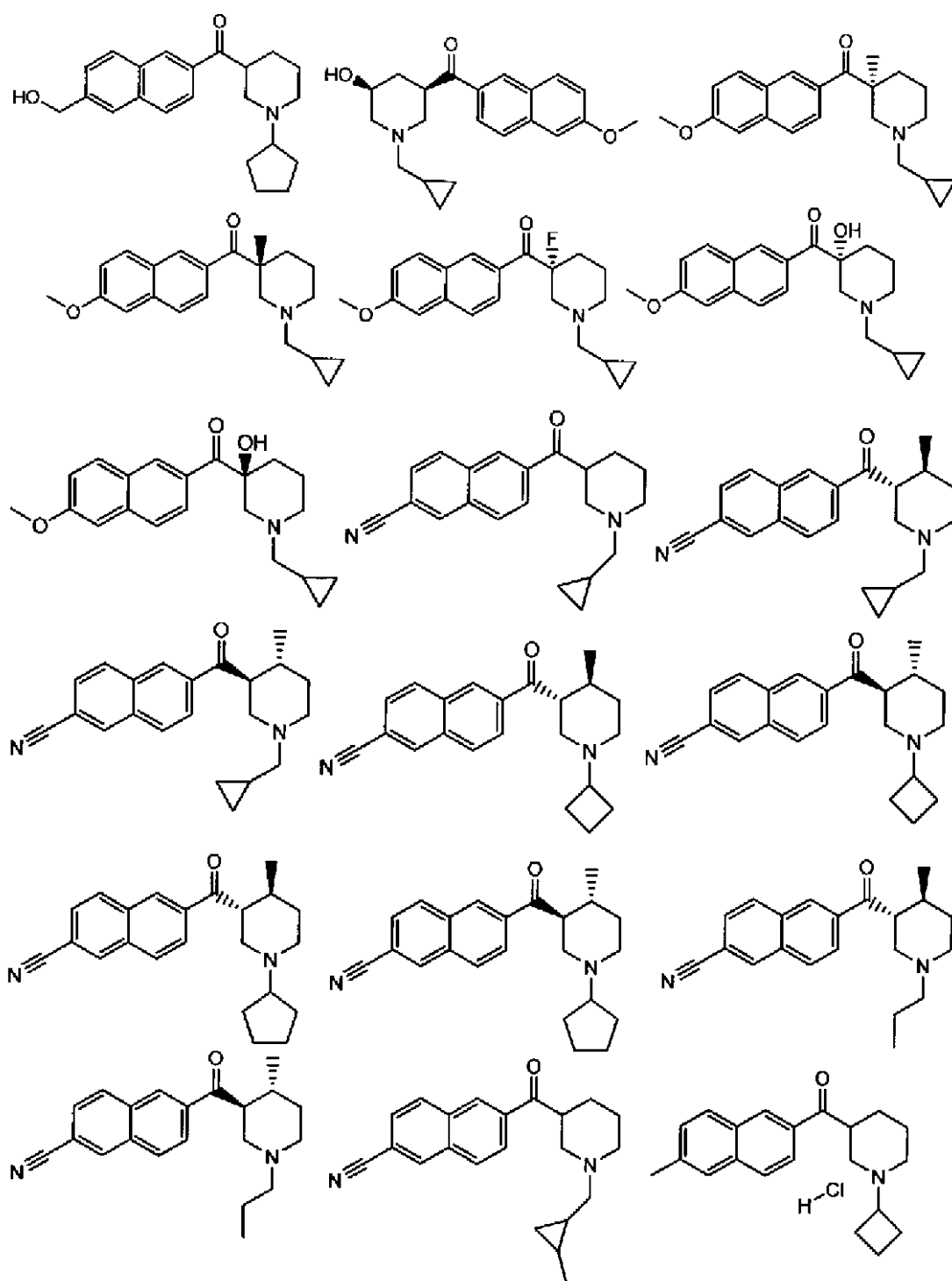
【化 2 1 1】



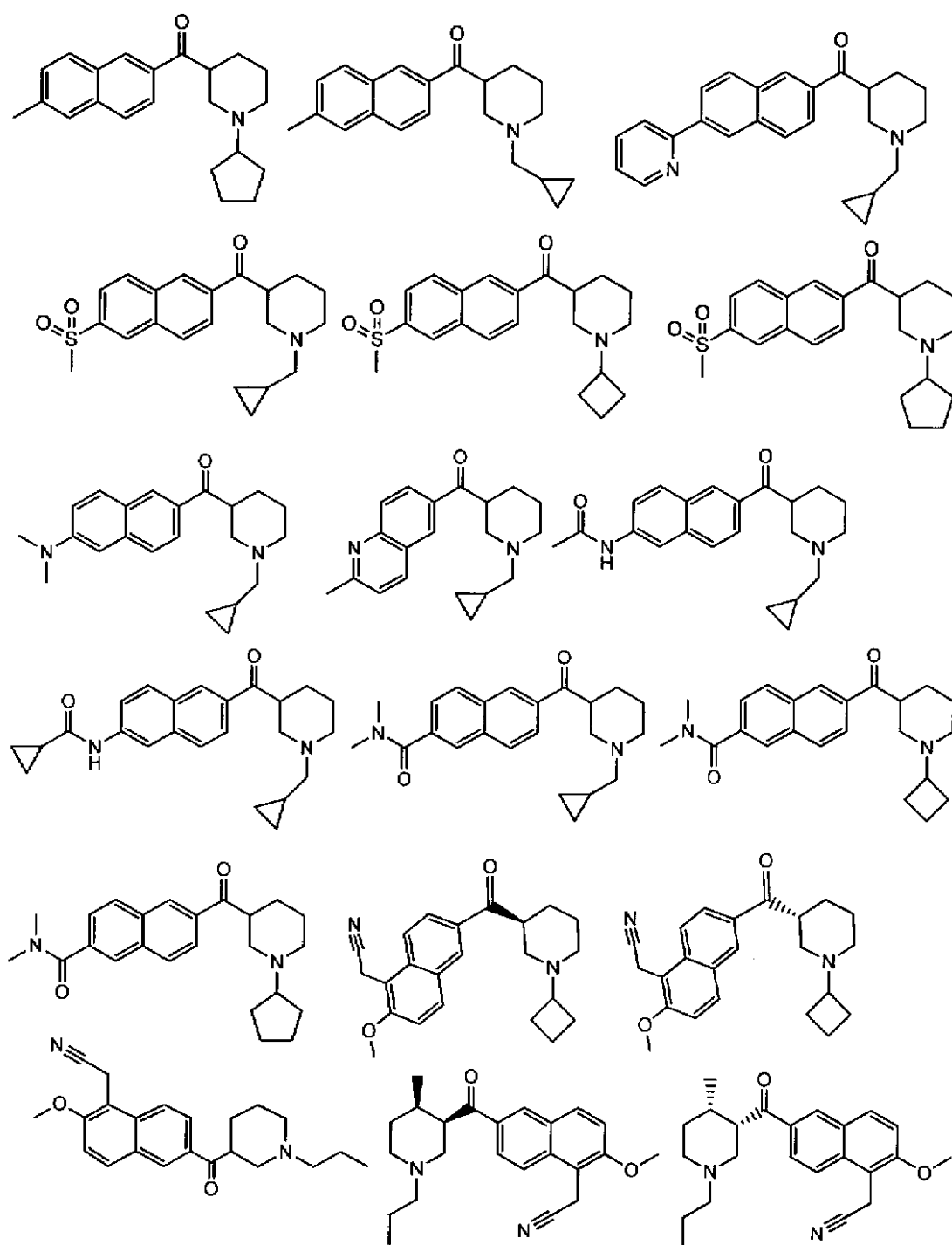
【化 2 1 2】



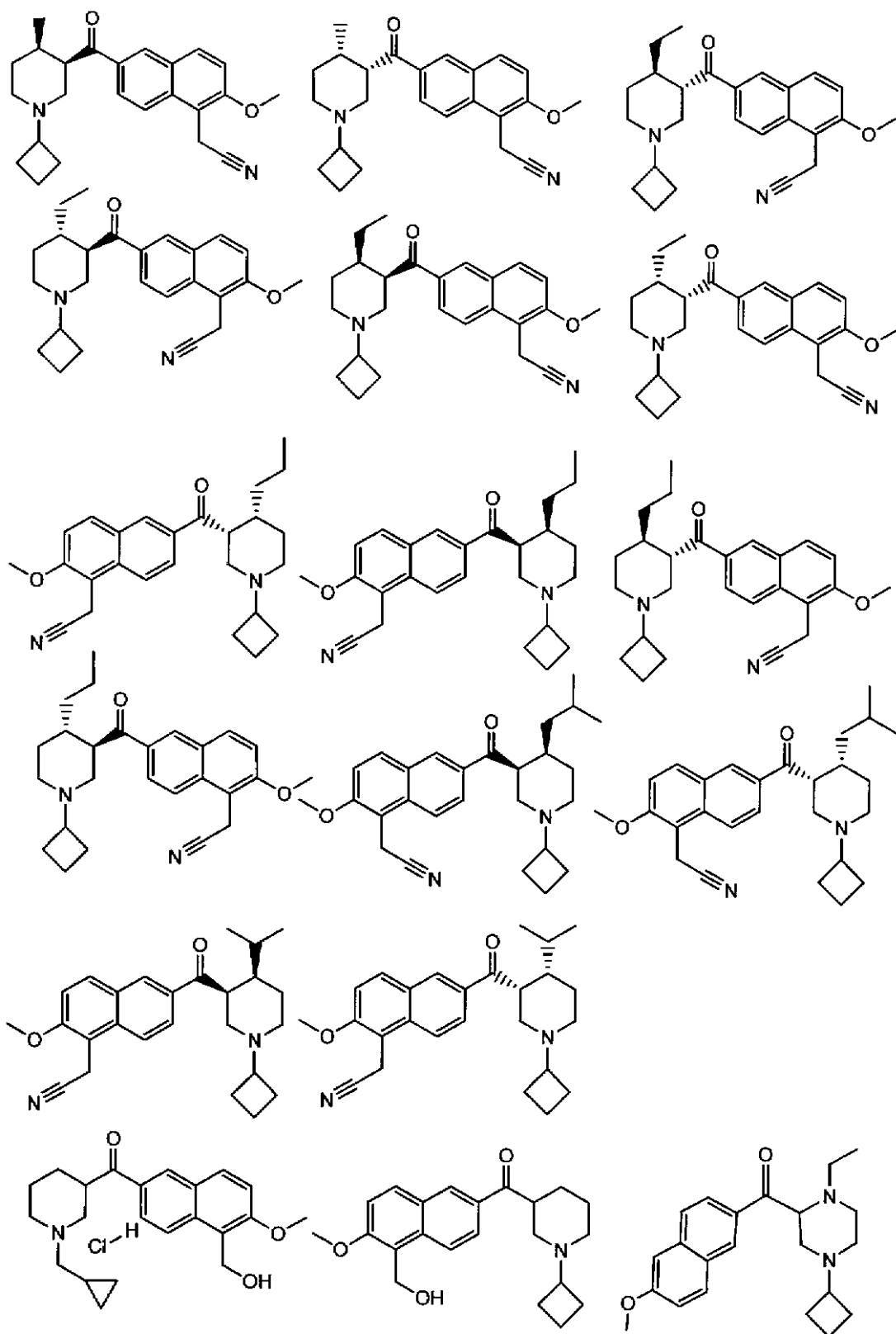
【化 2 1 3】



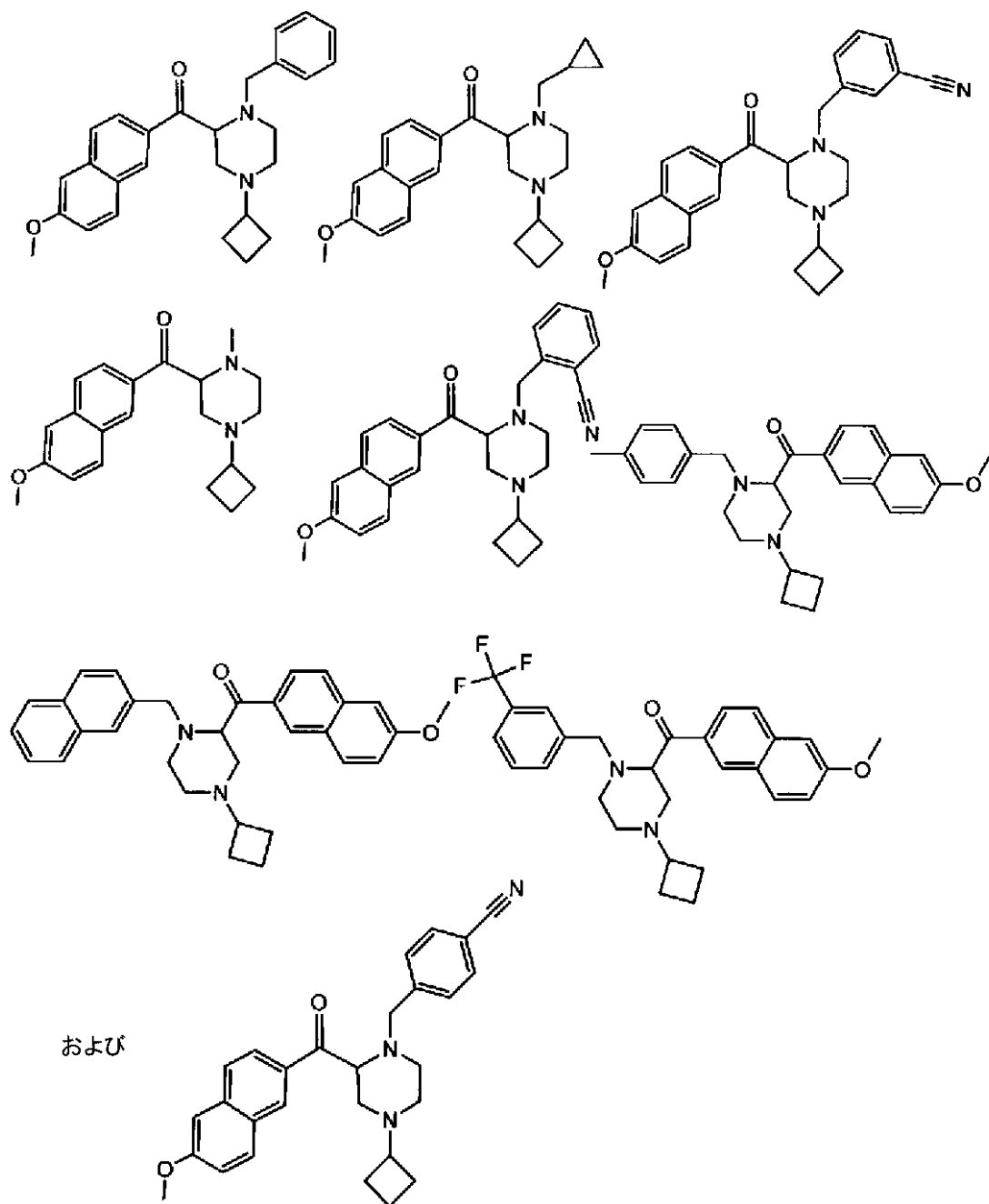
【化 2 1 4】



【化 2 1 5】



【化 2 1 6】



および

からなる群から選択される、化合物またはその塩。

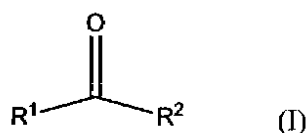
【請求項 27】

請求項 1～26 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩、および薬学的に許容され得るアジュバント、担体、またはビヒクルを含む組成物。

【請求項 28】

癌の処置を必要とする哺乳動物において癌を処置するための組成物であって、請求項 1～26 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその薬学的に許容され得る塩；または式 (I)：

【化 2 1 7】



(式中、

R¹ は、

c) ピペリジン環窒素上で R^x 基で置換され、C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₃ ~ 8 炭素環、3 ~ 8 員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、-NO₂、-N(R^b)₂、-CN、-C(O)-N(R^b)₂、-S(O)-N(R^b)₂、-S(O)₂-N(R^b)₂、-O-R^b、-S-R^b、-O-C(O)-R^b、-C(O)-R^b、-C(O)-OR^b、-S(O)-R^b、-S(O)₂-R^b、-N(R^b)-C(O)-R^b、-N(R^b)-S(O)-R^b、-N(R^b)-C(O)-N(R^b)₂、および -N(R^b)-S(O)₂-R^b からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的にさらに置換された炭素連結ピペリジン環であって；各々の C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₃ ~ 8 炭素環、3 ~ 8 員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、-NO₂、-N(R^b)₂、-CN、-C(O)-N(R^b)₂、-S(O)-N(R^b)₂、-S(O)₂-N(R^b)₂、-O-R^b、-S-R^b、-O-C(O)-R^b、-C(O)-R^b、-C(O)-OR^b、-S(O)-R^b、-S(O)₂-R^b、-N(R^b)-C(O)-R^b、-N(R^b)-S(O)-R^b、-N(R^b)-C(O)-N(R^b)₂、-N(R^b)-S(O)₂-R^b、および C₁ ~ 6 アルキル（該 C₁ ~ 6 アルキルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペリジン環；または

d) C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₃ ~ 8 炭素環、3 ~ 8 員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、-NO₂、-N(R^b)₂、-CN、-C(O)-N(R^b)₂、-S(O)-N(R^b)₂、-S(O)₂-N(R^b)₂、-O-R^b、-S-R^b、-O-C(O)-R^b、-C(O)-R^b、-C(O)-OR^b、-S(O)-R^b、-S(O)₂-R^b、-N(R^b)-C(O)-R^b、-N(R^b)-S(O)-R^b、-N(R^b)-C(O)-N(R^b)₂、および -N(R^b)-S(O)₂-R^b からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で置換された炭素連結ピペラジン環であって；各々の C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₃ ~ 8 炭素環、3 ~ 8 員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、-NO₂、-N(R^b)₂、-CN、-C(O)-N(R^b)₂、-S(O)-N(R^b)₂、-S(O)₂-N(R^b)₂、-O-R^b、-S-R^b、-O-C(O)-R^b、-C(O)-R^b、-C(O)-OR^b、-S(O)-R^b、-S(O)₂-R^b、-N(R^b)-C(O)-R^b、-N(R^b)-S(O)-R^b、-N(R^b)-C(O)-N(R^b)₂、-N(R^b)-S(O)₂-R^b、および C₁ ~ 6 アルキル（該 C₁ ~ 6 アルキルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペラジン環；

であり、

各々の R^b は、水素、C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、アリール、および C₂ ~ 6 アルキニルからなる群から独立して選択され、各々の C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、アリール、および C₂ ~ 6 アルキニルは、ハロ、-N(R^c)₂、-CN、-C(O)-N(R^c)₂、-S(O)-N(R^c)₂、-S(O)₂-N(R^c)₂、

—O—R^c、—S—R^c、—O—C(O)—R^c、—C(O)—R^c、—C(O)—OR^c、—S(O)—R^c、—S(O)₂—R^c、—N(R^c)—C(O)—R^c、—N(R^c)—S(O)—R^c、—N(R^c)—C(O)—N(R^c)₂、および—N(R^c)—S(O)₂—R^cからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2つのR^bが、それらが結合する窒素とともに、ピロリジノ環、ピペリジノ環、またはピペラジノ環を形成し；

各々のR^cは、水素、C₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、およびC₂～6アルキニルからなる群から独立して選択され、各々のC₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、およびC₂～6アルキニルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、およびC₁～6アルコキシからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されるか；または、2つのR^cが、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、およびC₁～3アルキル（該C₁～3アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

R^xは、C₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、C₂～6アルキニル、C₃～8炭素環、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、またはテトラヒドロピラニルであり、各々のC₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、C₂～6アルキニル、C₃～8炭素環は、ハロ、—CN、C₁～3アルコキシ、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、およびC₃～8炭素環（該C₃～8炭素環は、ハロおよびC₁～3アルキルからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R²は5～10員ヘテロアリールまたは6～12員アリールであり、5～10員ヘテロアリール、および6～12員アリールは、C₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、C₂～6アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、—NO₂、—N(R^d)₂、—CN、—C(O)—N(R^d)₂、—S(O)—N(R^d)₂、—S(O)₂—N(R^d)₂、—O—R^d、—S—R^d、—O—C(O)—R^d、—C(O)—R^d、—C(O)—OR^d、—S(O)—R^d、—S(O)₂—R^d、—N(R^d)—C(O)—R^d、—N(R^d)—S(O)—R^d、—N(R^d)—C(O)—N(R^d)₂、および—N(R^d)—S(O)₂—R^dからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々のC₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、C₂～6アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、—NO₂—N(R^d)₂、—CN、—C(O)—N(R^d)₂、—S(O)—N(R^d)₂、—S(O)₂—N(R^d)₂、—O—R^d、—S—R^d、—O—C(O)—R^d、—C(O)—R^d、—C(O)—OR^d、—S(O)—R^d、—S(O)₂—R^d、—N(R^d)—C(O)—R^d、—N(R^d)—S(O)—R^d、—N(R^d)—C(O)—N(R^d)₂、—N(R^d)—S(O)₂—R^d、およびC₁～6アルキル（該C₁～6アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

各々のR^dは、水素、C₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、アリール、およびC₂～6アルキニルからなる群から独立して選択され、各々のC₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、アリール、およびC₂～6アルキニルは、ハロ、—N(R^e)₂、—CN、—C(O)—N(R^e)₂、—S(O)—N(R^e)₂、—S(O)₂—N(R^e)₂、—O—R^e、—S—R^e、—O—C(O)—R^e、—C(O)—R^e、—C(O)—OR^e、—S(O)—R^e、—S(O)₂—R^e、—N(R^e)—C(O)—R^e、—N(R^c)—S(O)—R^e、—N(R^e)—C(O)—N(R^e)₂、および—N(R^e)—S(O)₂—R^eからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2つのR^dが、それらが結合する窒素とともに、ピロリジノ環、ピペリジノ環、またはピペラジノ環を形成し；

各々のR^eは、水素、C₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、およびC₂～6アルキニルからなる群から独立して選択され、各々のC₁～6アルキル、C₂～6アルケニル

ル、および $C_2 \sim 6$ アルキニルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、および $C_1 \sim 6$ アルコキシからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されるか；または、2つの R^e が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、および $C_1 \sim 3$ アルキル（該 $C_1 \sim 3$ アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成する）の化合物もしくはその薬学的に許容され得る塩を含む、組成物。

【請求項 29】

前記癌が癌幹細胞／前駆細胞を含む、請求項 28 に記載の組成物。

【請求項 30】

癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の分化の誘導を必要とする哺乳動物において癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の分化を誘導するための組成物であって、請求項 1～26 および請求項 28 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含む、組成物。

【請求項 31】

癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の活性の低下を必要とする哺乳動物において癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の活性を低下させるための組成物であって、請求項 1～26 および請求項 28 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含む、組成物。

【請求項 32】

癌幹細胞／前駆細胞の枯渇を必要とする哺乳動物において癌幹細胞／前駆細胞を枯渇させるための組成物であって、請求項 1～26 および請求項 28 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含む、組成物。

【請求項 33】

癌発生の減少を必要とする哺乳動物において癌発生を減少させるための組成物であって、請求項 1～26 および請求項 28 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含む、組成物。

【請求項 34】

前記癌が、肺癌、白血病、またはリンパ腫である、請求項 28～33 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 35】

医学療法における使用のための、請求項 1～26 および 28 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含む組成物。

【請求項 36】

癌の治療的処置または予防的処置のための、請求項 1～26 および 28 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含む組成物。

【請求項 37】

前記癌が癌幹細胞／前駆細胞を含む、請求項 36 に記載の組成物。

【請求項 38】

癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の分化を誘導するための、請求項 1～26 および 28 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含む組成物。

【請求項 39】

癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の活性を低下させるための、請求項 1～26 および 28 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含む組成物。

【請求項 40】

癌幹細胞／前駆細胞を枯渇させるための、請求項 1～26 および 28 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含む組成物。

【請求項 41】

癌発生を減少させるための、請求項 1～26 および 28 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含む組成物。

【請求項 4 2】

前記癌が、肺癌、白血病、またはリンパ腫である、請求項 3 6～4 1 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 4 3】

哺乳動物における癌を処置するための医薬を調製するための、請求項 1～2 6 および請求項 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

【請求項 4 4】

前記癌が癌幹細胞／前駆細胞を含む、請求項 4 3 に記載の使用。

【請求項 4 5】

哺乳動物における癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の分化を誘導するための医薬を調製するための、請求項 1～2 6 および請求項 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

【請求項 4 6】

哺乳動物における癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の活性を低下させるための医薬を調製するための、請求項 1～2 6 および請求項 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

【請求項 4 7】

哺乳動物における癌幹細胞／前駆細胞を枯渇させるための医薬を調製するための、請求項 1～2 6 および請求項 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

【請求項 4 8】

哺乳動物における癌発生を減少させるための医薬を調製するための、請求項 1～2 6 および請求項 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

【請求項 4 9】

前記癌が、肺癌、白血病、またはリンパ腫である、請求項 4 3～4 8 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 5 0】

癌の処置を必要とする個体において癌を処置するための組成物であって、K D M 2 インヒビターを含む、組成物。

【請求項 5 1】

前記癌が癌幹細胞／前駆細胞を含む、請求項 5 0 に記載の組成物。

【請求項 5 2】

前記 K D M 2 インヒビターが、前記個体において癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の分化を誘導し、癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の活性を低下させ、そして／または癌幹細胞／前駆細胞集団を枯渇させるのに有効である、請求項 5 0 または 5 1 に記載の組成物。

【請求項 5 3】

前記 K D M 2 インヒビターが、前記個体における癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の N o t c h シグナル伝達を低下させるのに有効である、請求項 5 0～5 2 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 5 4】

癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の分化の誘導を必要とする個体において癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の分化を誘導するための組成物であって、K D M 2 インヒビターを含む、組成物。

【請求項 5 5】

癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の活性の低下を必要とする個体において癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の活性を低下させるための組成物であって、K D M 2 インヒビターを含む、組成物。

【請求項 5 6】

癌幹細胞／前駆細胞集団の枯渇を必要とする個体において癌幹細胞／前駆細胞集団を枯

渴させるための組成物であって、KDM2インヒビターを含む、組成物。

【請求項57】

癌発生の減少を必要とする個体において癌発生を減少させるための組成物であって、KDM2インヒビターを含む、組成物。

【請求項58】

前記癌が、肺癌、白血病（例えば、AML、ALL、MLL）、またはリンパ腫である、請求項50～57のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項59】

前記インヒビターがKDM2Bインヒビターである、請求項50～58のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項60】

前記KDM2インヒビターが、KDM2に特異的に結合し、KDM2デメチラーゼ活性を阻害する、請求項50～59のいずれか1項に記載の組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0360

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0360】

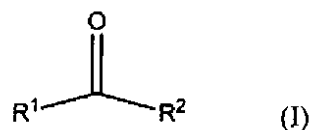
多数の実施形態を記載しているが、これらの実施例を、本明細書中に記載の化合物および方法を利用する他の実施形態を得るために変更することができる。したがって、本発明の範囲を、例で示した特定の実施形態ではなく添付の特許請求の範囲によって定義すべきである。

一実施形態において、例えば、以下の項目が提供される。

(項目1)

式(I)：

【化166】



(式中、

R¹は、

a) ピペリジン環窒素上でR^x基で置換され、C₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、C₂～6アルキニル、C₃～8炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、-NO₂、-N(R^b)₂、-CN、-C(O)-N(R^b)₂、-S(O)-N(R^b)₂、-S(O)₂-N(R^b)₂、-O-R^b、-S-R^b、-O-C(O)-R^b、-C(O)-R^b、-C(O)-OR^b、-S(O)-R^b、-S(O)₂-R^b、-N(R^b)-C(O)-R^b、-N(R^b)-S(O)-R^b、-N(R^b)-C(O)-N(R^b)₂、および-N(R^b)-S(O)₂-R^bからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的にさらに置換された炭素連結ピペリジン環であって；各々のC₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、C₂～6アルキニル、C₃～8炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、-NO₂-N(R^b)₂、-CN、-C(O)-N(R^b)₂、-S(O)-N(R^b)₂、-S(O)₂-N(R^b)₂、-O-R^b、-S-R^b、-O-C(O)-R^b、-C(O)-R^b、-C(O)-OR^b、-S(O)-R^b、-S(O)₂-R^b、-N(R^b)-C(O)-R^b、-N(R^b)-S(O)-R^b、-N(R^b)-C(O)-N(R^b)₂、

$-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペリジン環；または

b) $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で置換された炭素連結ピペラジン環であって；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペラジン環；であり、

各々の R^b は、水素、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、アリール、および $C_2 \sim 6$ アルキニルからなる群から独立して選択され、各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、アリール、および $C_2 \sim 6$ アルキニルは、ハロ、 $-N(R^c)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^c)_2$ 、 $-S(O)-N(R^c)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^c)_2$ 、 $-O-R^c$ 、 $-S-R^c$ 、 $-O-C(O)-R^c$ 、 $-C(O)-R^c$ 、 $-C(O)-OR^c$ 、 $-S(O)-R^c$ 、 $-S(O)_2-R^c$ 、 $-N(R^c)-C(O)-R^c$ 、 $-N(R^c)-S(O)-R^c$ 、 $-N(R^c)-C(O)-N(R^c)_2$ 、および $-N(R^c)-S(O)_2-R^c$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2つの R^b が、それらが結合する窒素とともに、ピロリジノ環、ピペリジノ環、またはピペラジノ環を形成し；

各々の R^c は、水素、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、および $C_2 \sim 6$ アルキニルからなる群から独立して選択され、各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、および $C_2 \sim 6$ アルキニルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、および $C_1 \sim 6$ アルコキシからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されるか；または、2つの R^c が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、および $C_1 \sim 3$ アルキル（該 $C_1 \sim 3$ アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

R^x は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、またはテトラヒドロピラニルであり、各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環は、ハロ、 $-CN$ 、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、および $C_3 \sim 8$ 炭素環（該 $C_3 \sim 8$ 炭素環は、ハロおよび $C_1 \sim 3$ アルキルからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R^2 は5～10員ヘテロアリールまたは6～12員アリールであり、5～10員ヘテロアリール、および6～12員アリールは、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、

$-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、および $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-N(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $C_{1\sim6}$ アルキル（該 $C_{1\sim6}$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

各々の R^d は、水素、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、アリール、および $C_{2\sim6}$ アルキニルからなる群から独立して選択され、各々の $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、アリール、および $C_{2\sim6}$ アルキニルは、ハロ、 $-N(R^e)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^e)_2$ 、 $-S(O)-N(R^e)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^e)_2$ 、 $-O-R^e$ 、 $-S-R^e$ 、 $-O-C(O)-R^e$ 、 $-C(O)-R^e$ 、 $-C(O)-OR^e$ 、 $-S(O)-R^e$ 、 $-S(O)_2-R^e$ 、 $-N(R^e)-C(O)-R^e$ 、 $-N(R^e)-S(O)-R^e$ 、 $-N(R^e)-C(O)-N(R^e)_2$ 、および $-N(R^e)-S(O)_2-R^e$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2つの R^d が、それらが結合する窒素とともに、ピロリジノ環、ピペリジノ環、またはピペラジノ環を形成し；

各々の R^e は、水素、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、および $C_{2\sim6}$ アルキニルからなる群から独立して選択され、各々の $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、および $C_{2\sim6}$ アルキニルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、および $C_{1\sim6}$ アルコキシからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されるか；または、2つの R^e が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、および $C_{1\sim3}$ アルキル（該 $C_{1\sim3}$ アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

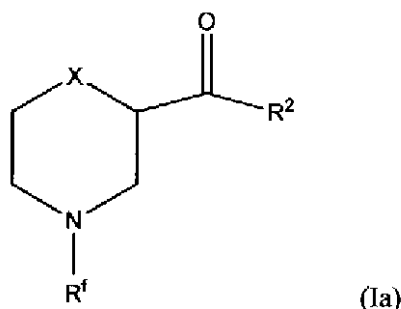
但し、 R^2 が6-メトキシ-2-ナフチルである場合、 R^1 は、1-(シクロプロピルメチル)ピペリジン-3-イル、1-(シクロブチル)ピペリジン-3-イル、1-(シクロペンチル)ピペリジン-3-イル、1-(テトラヒドロピラニル)ピペリジン-3-イルのいずれでもないことを条件とし；

但し、 R^2 が、フェニル、ナフチル、4-キノリル、5-キノリル、6-キノリル、7-キノリル、8-キノリル、2-メチル-6-キノリル、1, 5-ベンゾジオキセピン-7-イル、ベンゾ[b]チエン-7-イル、2, 3-ジヒドロ-1, 4-ベンゾジオキシン-6-イル、1H-1-(tert-ブトキシカルボニル)-4-プロモインドール-2-イル、1H-1-(tert-ブトキシカルボニル)-4-シアノインドール-2-イル、3, 4-ジヒドロキシフェニル、3-メトキシ-4-ヒドロキシフェニル、3, 4-ジメトキシフェニル、3-メトキシカルボニル-4-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル、または2-ヒドロキシフェニルである場合、 R^1 は任意選択的に置換されたピペリジン-2-イル(piperizine-2-yl)ではないことを条件とする)の化合物またはその塩。

(項目2)

式(Ia)：

【化 1 6 7】



(式中、

XはCR^gR^hまたはNR^kであり；

各々のR^fは、H、C₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、C₂～6アルキニル、C₃～8炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、-NO₂、-N(R^b)₂、-CN、-C(O)-N(R^b)₂、-S(O)-N(R^b)₂、-S(O)₂-N(R^b)₂、-O-R^b、-S-R^b、-O-C(O)-R^b、-C(O)-R^b、-C(O)-OR^b、-S(O)-R^b、-S(O)₂-R^b、-N(R^b)-C(O)-R^b、-N(R^b)-S(O)-R^b、-N(R^b)-C(O)-N(R^b)₂、および-N(R^b)-S(O)₂-R^bからなる群から独立して選択され；各々のC₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、C₂～6アルキニル、C₃～8炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、-NO₂、-N(R^b)₂、-CN、-C(O)-N(R^b)₂、-S(O)-N(R^b)₂、-S(O)₂-N(R^b)₂、-O-R^b、-S-R^b、-O-C(O)-R^b、-C(O)-R^b、-C(O)-OR^b、-S(O)-R^b、-S(O)₂-R^b、-N(R^b)-C(O)-R^b、-N(R^b)-S(O)-R^b、-N(R^b)-C(O)-N(R^b)₂、-N(R^b)-S(O)₂-R^b、およびC₁～6アルキル（該C₁～6アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

各々のR^gは、H、C₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、C₂～6アルキニル、C₃～8炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、-NO₂、-N(R^b)₂、-CN、-C(O)-N(R^b)₂、-S(O)-N(R^b)₂、-S(O)₂-N(R^b)₂、-O-R^b、-S-R^b、-O-C(O)-R^b、-C(O)-R^b、-C(O)-OR^b、-S(O)-R^b、-S(O)₂-R^b、-N(R^b)-C(O)-R^b、-N(R^b)-S(O)-R^b、-N(R^b)-C(O)-N(R^b)₂、-N(R^b)-S(O)₂-R^b、およびC₁～6アルキル（該C₁～6アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

各々のR^hは、H、C₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、C₂～6アルキニル、C₃～8炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、およびハロからなる群から独立して選択され、各々のC₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、C₂～6アルキニ

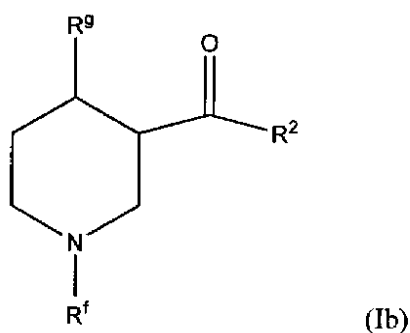
ル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{O}-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}-\text{R}^b$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^b$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{S}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

各々の R^k は、 H 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールからなる群から独立して選択され、各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{O}-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}-\text{R}^b$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^b$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{S}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）の化合物またはその塩である、項目1に記載の化合物。

（項目3）

式（I b）：

【化168】

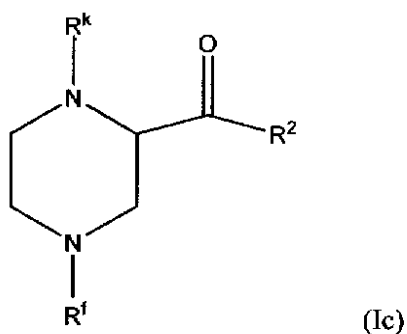


の化合物またはその塩である、項目1に記載の化合物。

（項目4）

式（I c）：

【化169】



の化合物またはその塩である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 5)

R^1 は、ピペリジン環窒素上で R^x 基で置換され、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8 員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的にさらに置換された炭素連結ピペリジン環であって；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8 員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペリジン環である、項目 1 に記載の化合物。

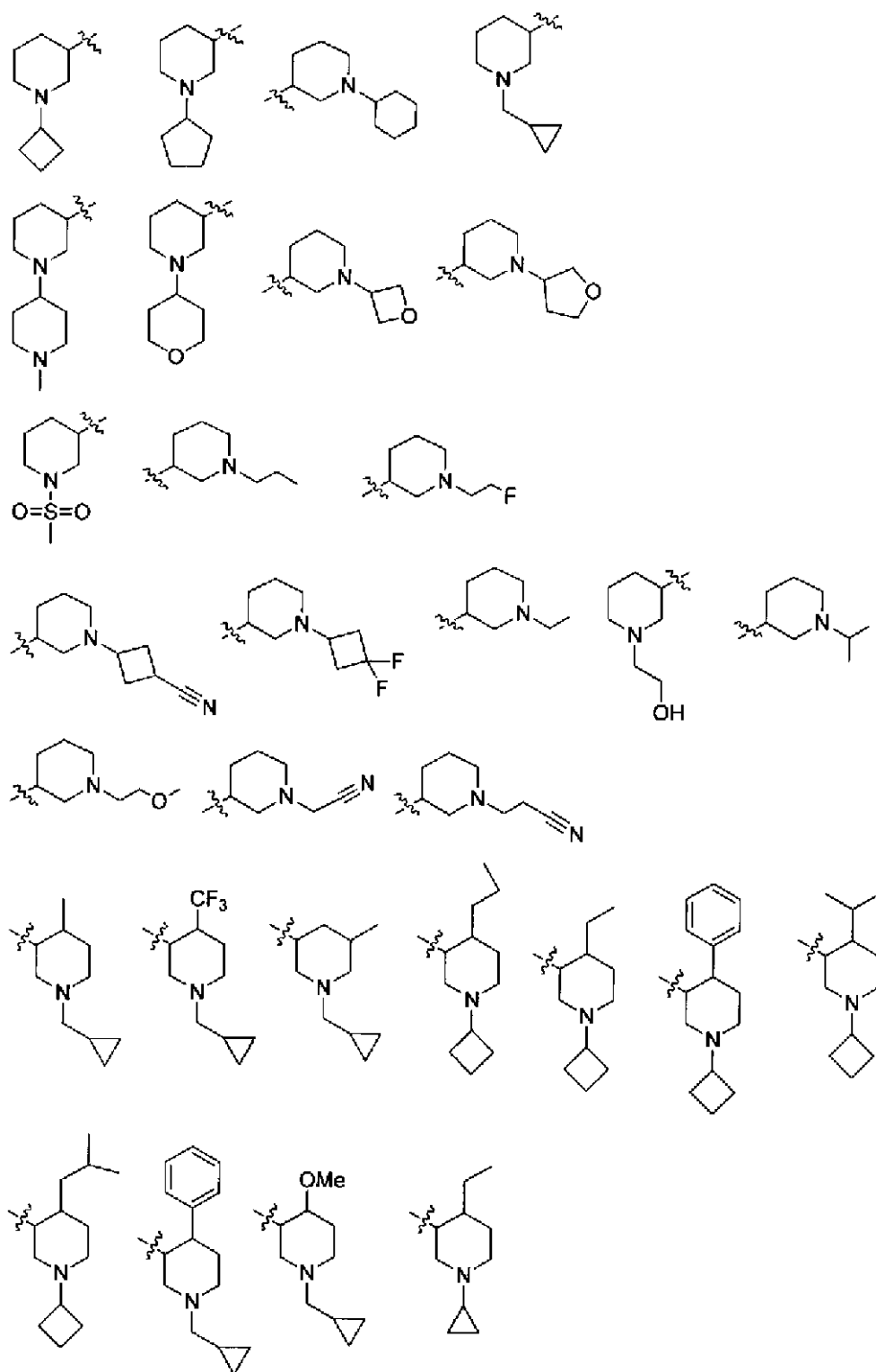
(項目 6)

R^1 は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8 員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で置換された炭素連結ピペラジン環であって；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8 員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペラジン環である、項目 1 に記載の化合物。

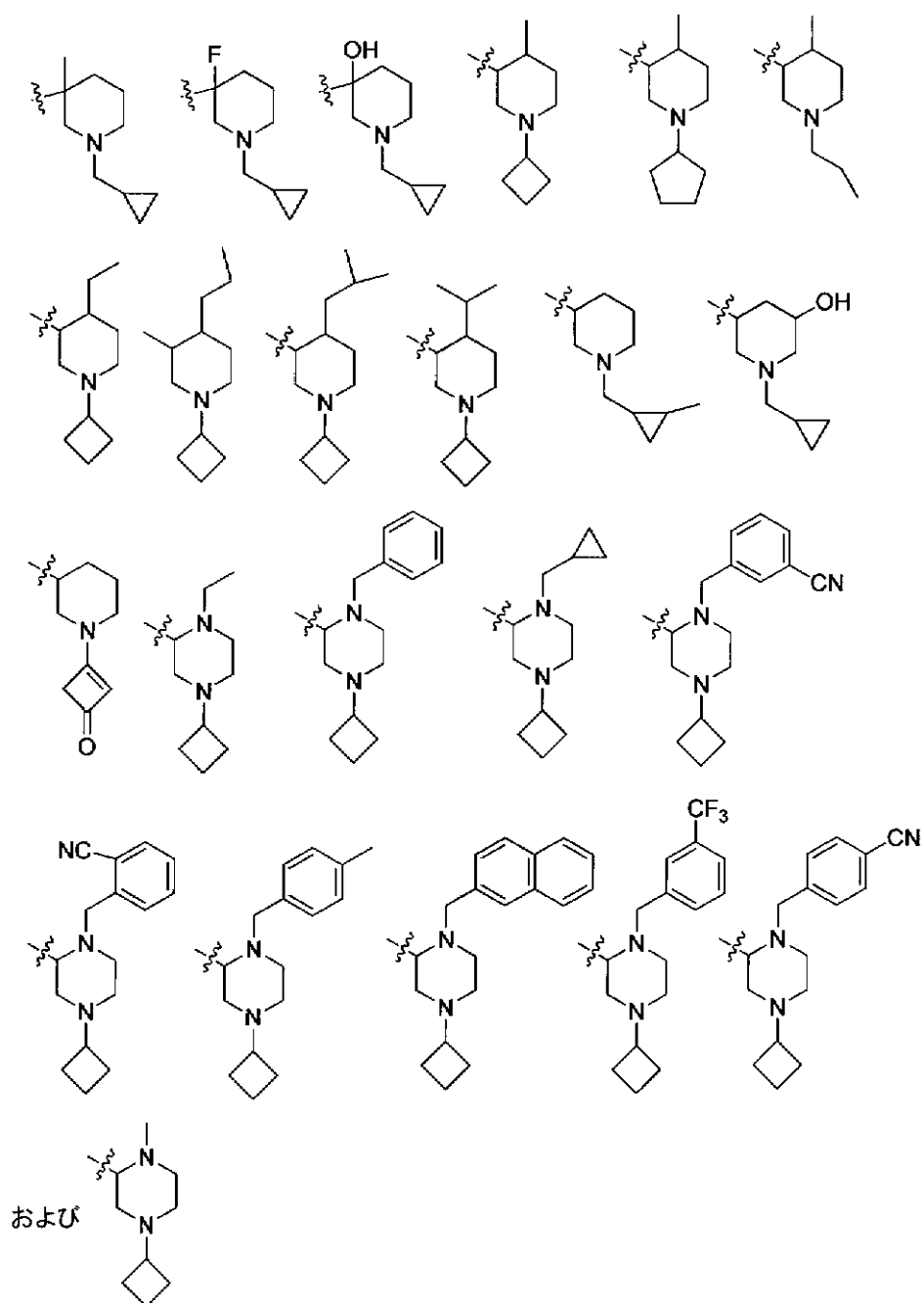
(項目 7)

R^1 が、

【化 170】



【化 1 7 1】

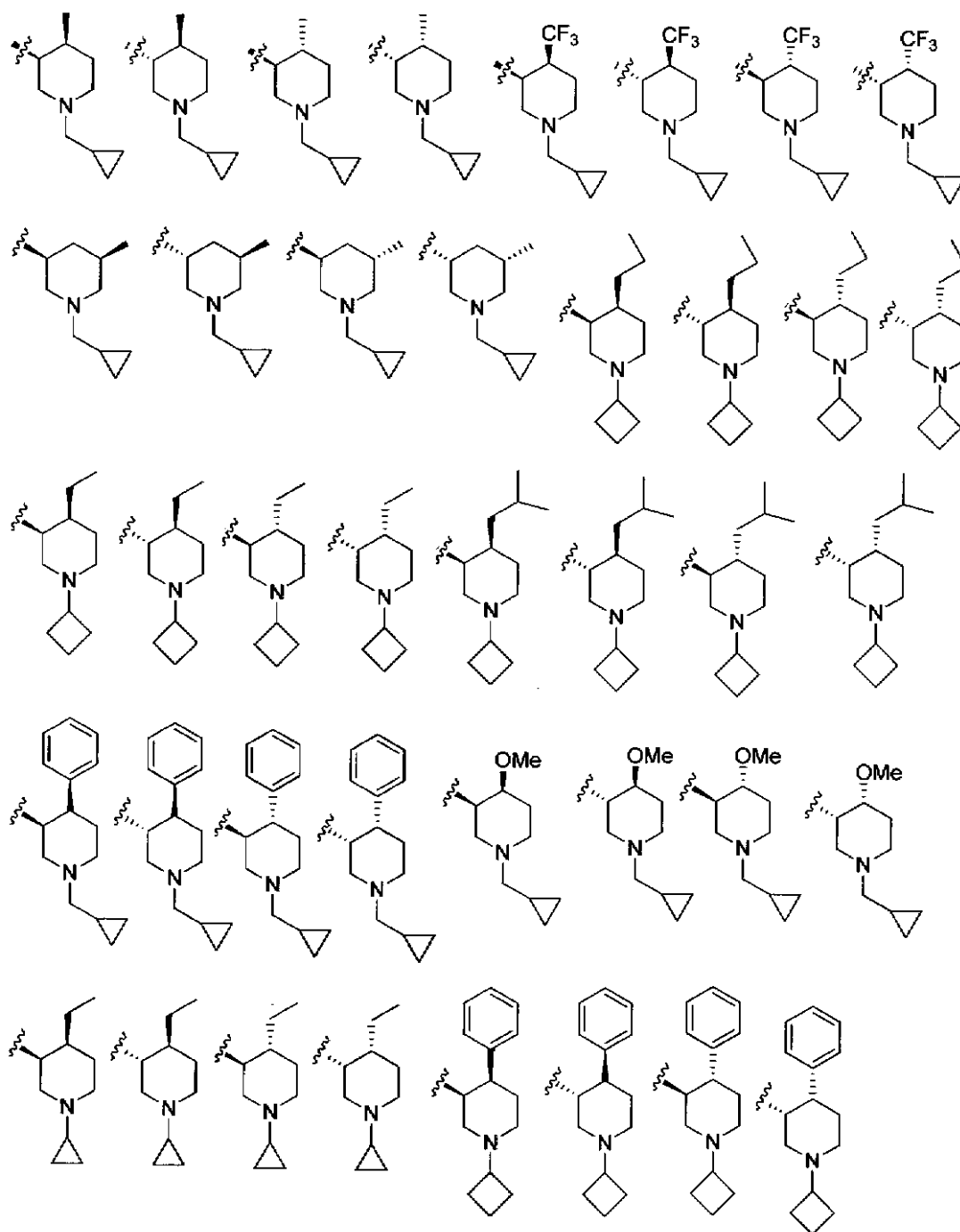


からなる群から選択される、項目 1 に記載の化合物。

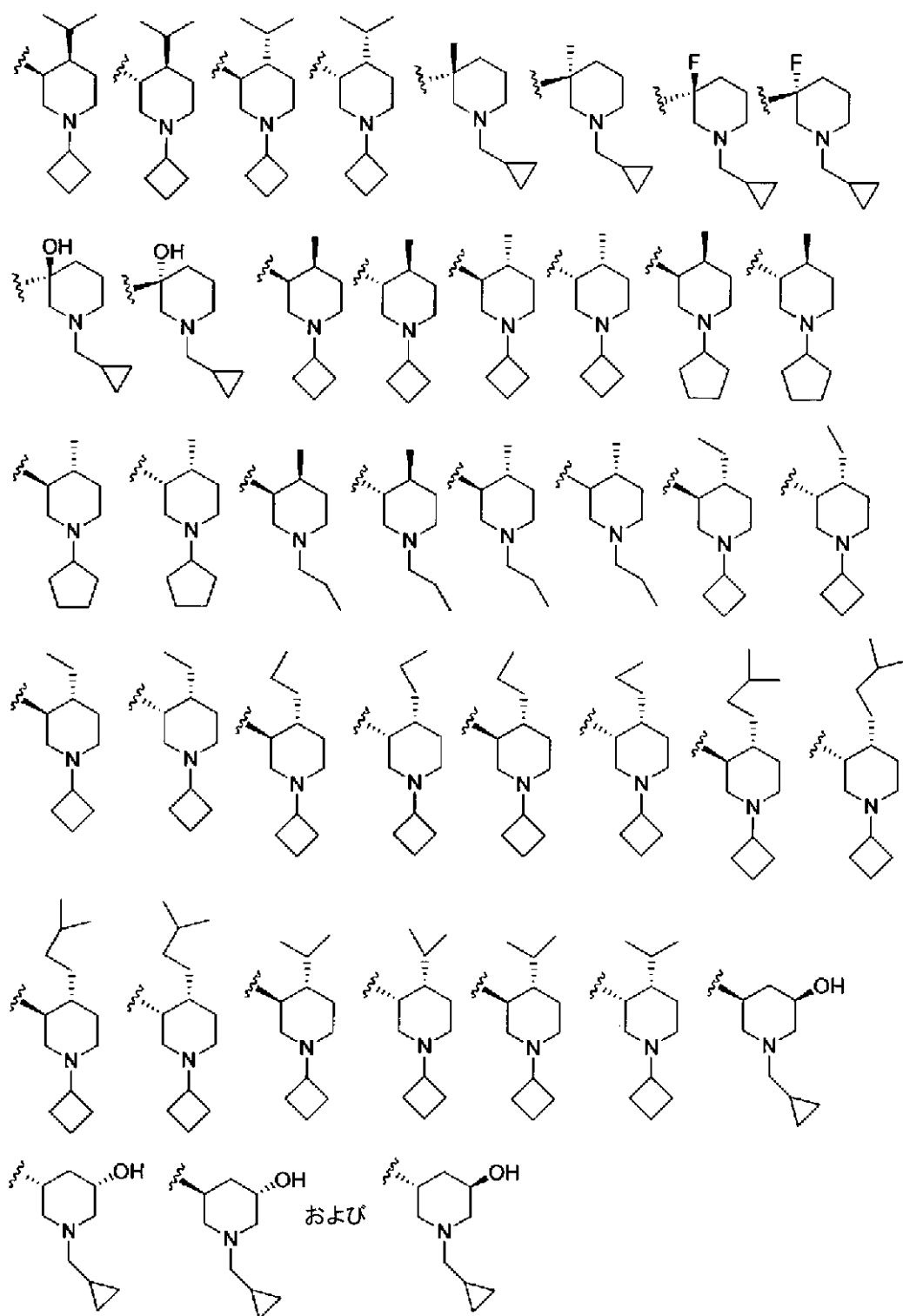
(項目 8)

R¹ は、

【化 1 7 2】



【化 1 7 3】



からなる群から選択される、項目 1 に記載の化合物。

(項目 9)

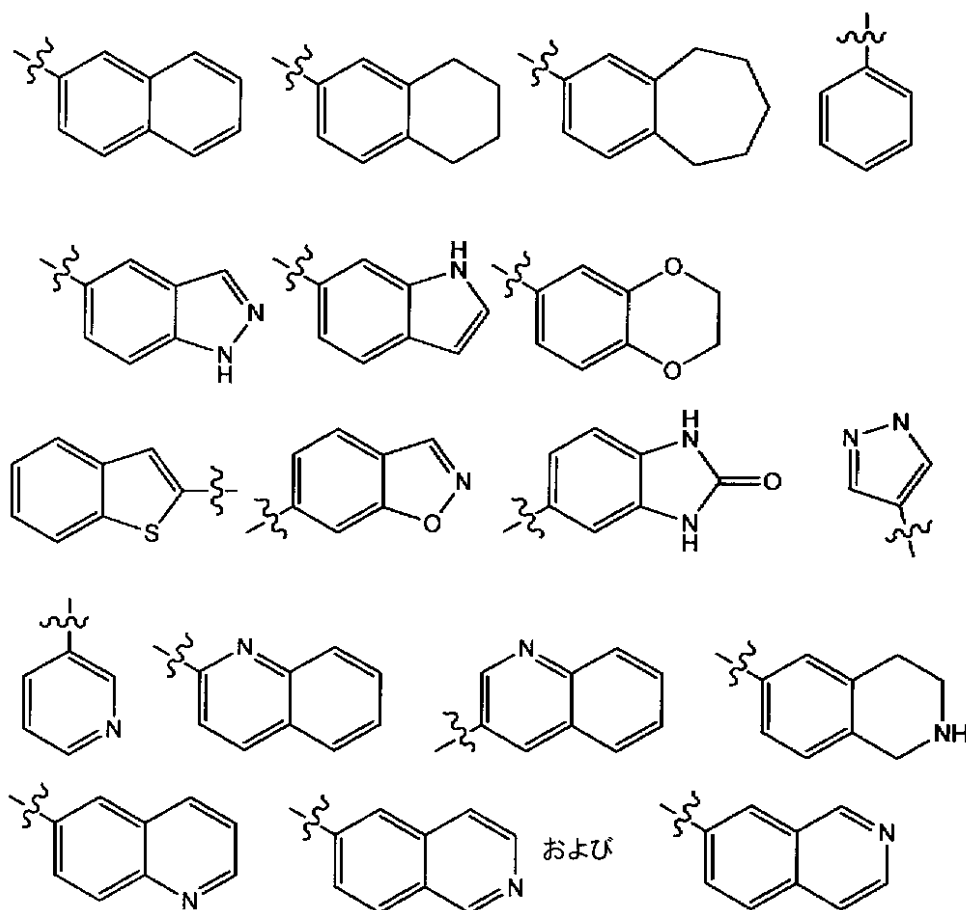
R^2 は、ナフチル、テトラリニル、フェニル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾ [7] アンヌレニル、1, 4-ベンゾジオキシニル、ベンゾイミダゾリル-2-オン、インドリル、インダゾリル、チオフェニル、ピリジル、キノリル、テトラヒドロキノリル、イソキノリル、テトラヒドロイソキノリル、およびピラゾリルからなる群から選択される環であ

り；環は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、および $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目 1～8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 10)

R^2 は、

【化 174】



からなる群から選択される環であり；環は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目 1～8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

R^d 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、および $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $C_{1\sim6}$ アルキル（該 $C_{1\sim6}$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目1～8のいずれか1項に記載の化合物。

(項目11)

R^2 は、ナフチル環であり、環は、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、および $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $C_{1\sim6}$ アルキル（該 $C_{1\sim6}$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目1～8のいずれか1項に記載の化合物。

(項目12)

R^2 は、ナフチル環であり、環は、 $C_{1\sim6}$ アルキル、炭素環、アリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $C_{1\sim6}$ アルキル（該 $C_{1\sim6}$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目11に記載の化合物。

(項目13)

R^2 は、フェニル環であり、環は、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$

(項目 14)

(項目 1 5)

R^2 は、キノリルまたはイソキノリル環であり、環は、 $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{2\sim 6}$ アルケニル、 $C_{2\sim 6}$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、および $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{2\sim 6}$ アルケニル、 $C_{2\sim 6}$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $C_{1\sim 6}$ アルキル（該 $C_{1\sim 6}$ アルキルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される。

、項目 1～8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

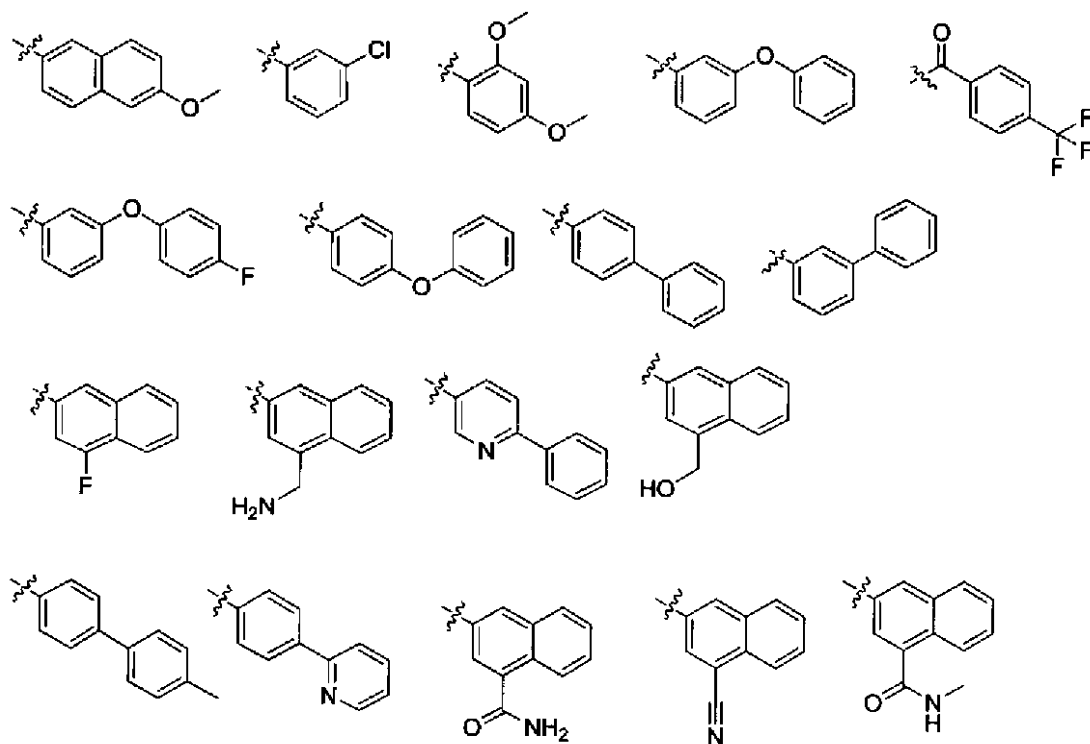
(項目 1 6)

R^2 は、キノリルまたはイソキノリル環であり、環は、 $C_{1\sim6}$ アルキル、炭素環、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、および $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $C_{1\sim6}$ アルキル（該 $C_{1\sim6}$ アルキルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目 1 5 に記載の化合物。

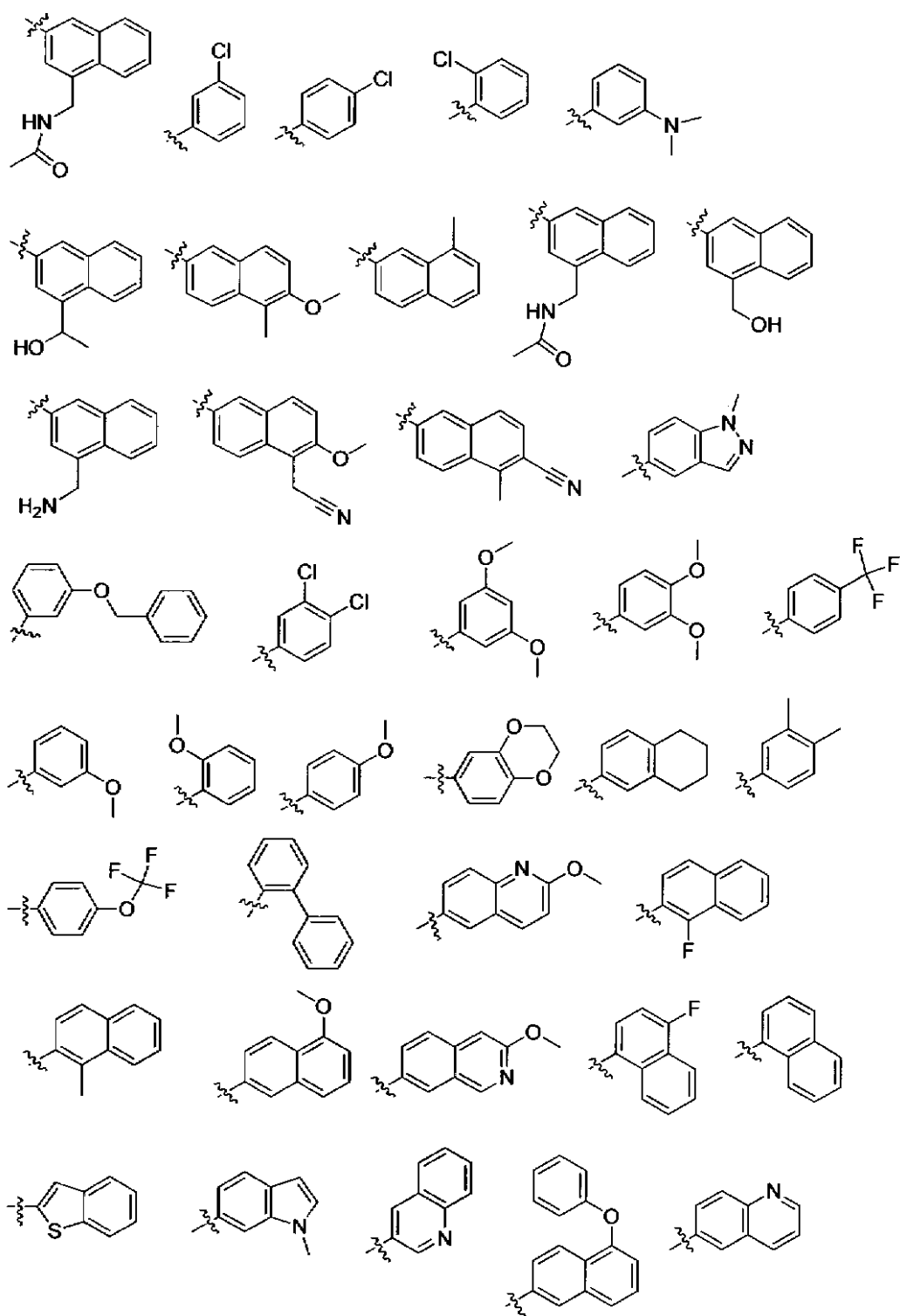
(項目 1 7)

R^2 は、

【化 1 7 5】



【化 1 7 6】



Chemical structures of various naphthalene derivatives, including quinoline, indole, and substituted naphthalenes, with wavy lines indicating attachment points.

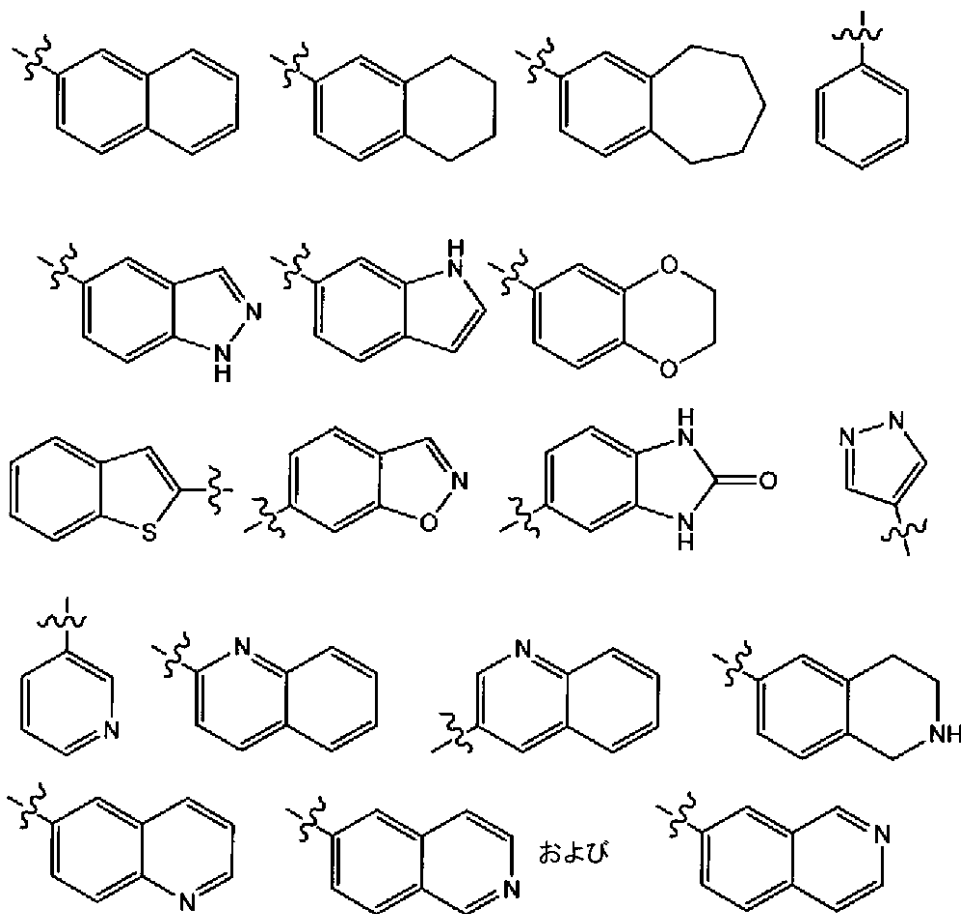
(項目 1 8)

R¹ は、ピペリジン環窒素上で R^x 基で置換され、C₁ ~₆ アルキル、C₂ ~₆ アルケニル、C₂ ~₆ アルキニル、C₃ ~₈ 炭素環、3 ~ 8 員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、-NO₂、-N(R^b)₂、-CN、-C(O)-N(R^b)₂、-S(O)-N(R^b)₂、-S(O)₂-N(R^b)₂、-O-R^b、-S-R^b、-O-C(O)-R^b、-C(O)-R^b、-C(O)-OR^b、-S(O)-R^b、-S(O)₂-R^b、-N(R^b)-C(O)-R^b、-N(R^b)-S(O)-R^b、-N(R^b)-C(O)-N(R^b)₂、および -N(R^b)-S(O)₂-R^b からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的にさらに置換された炭素連結ピペリジン環であって；各々の C₁ ~₆ アルキル、C₂ ~₆ アルケニル、C₂ ~₆ アルキニル、C₃ ~₈ 炭素環、3 ~ 8 員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、-NO₂、-N(R^b)₂、-CN、-C(O)-N(R^b)₂、-S(O)-N(R^b)₂、-S(O)

$O)_2 - N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル (該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペリジン環であり、かつ

R^2 は、

【化 178】



からなる群から選択される環であり、この環は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、および $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル (該 $C_1 \sim 6$ アル

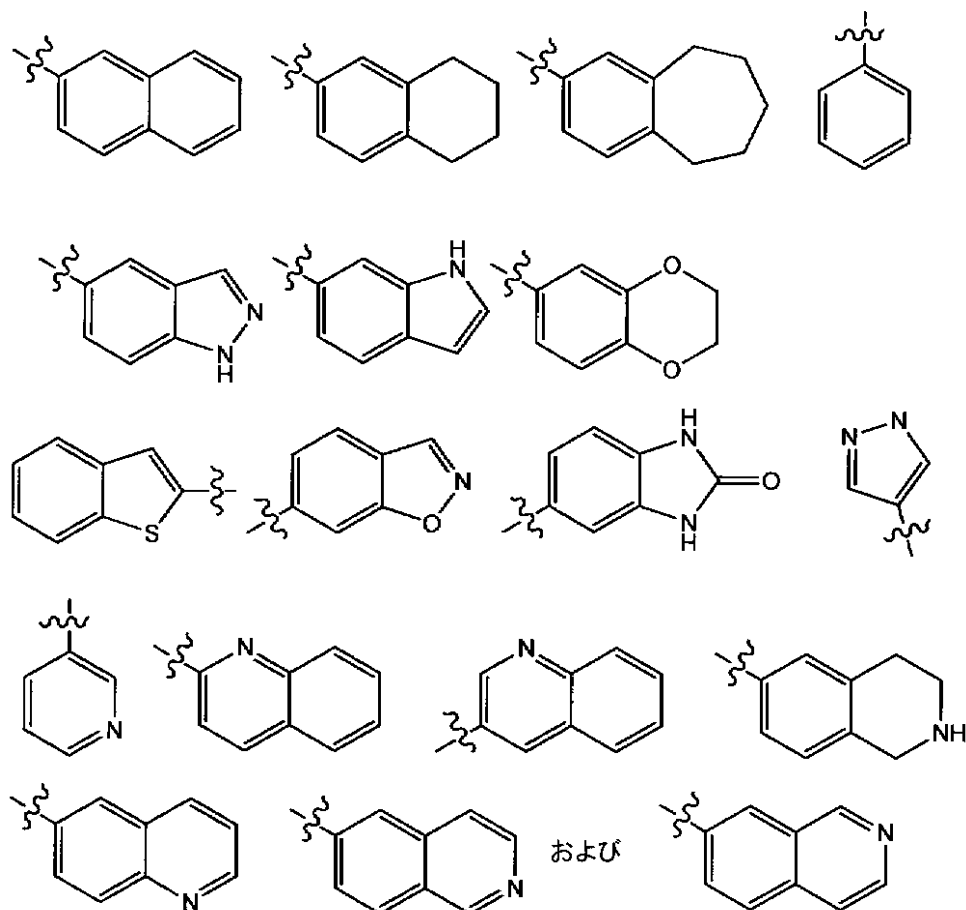
キルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目1に記載の化合物。

(項目19)

R^1 は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で置換された炭素連結ピペラジン環であって；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル (該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペラジン環であり；

R^2 は、

【化179】

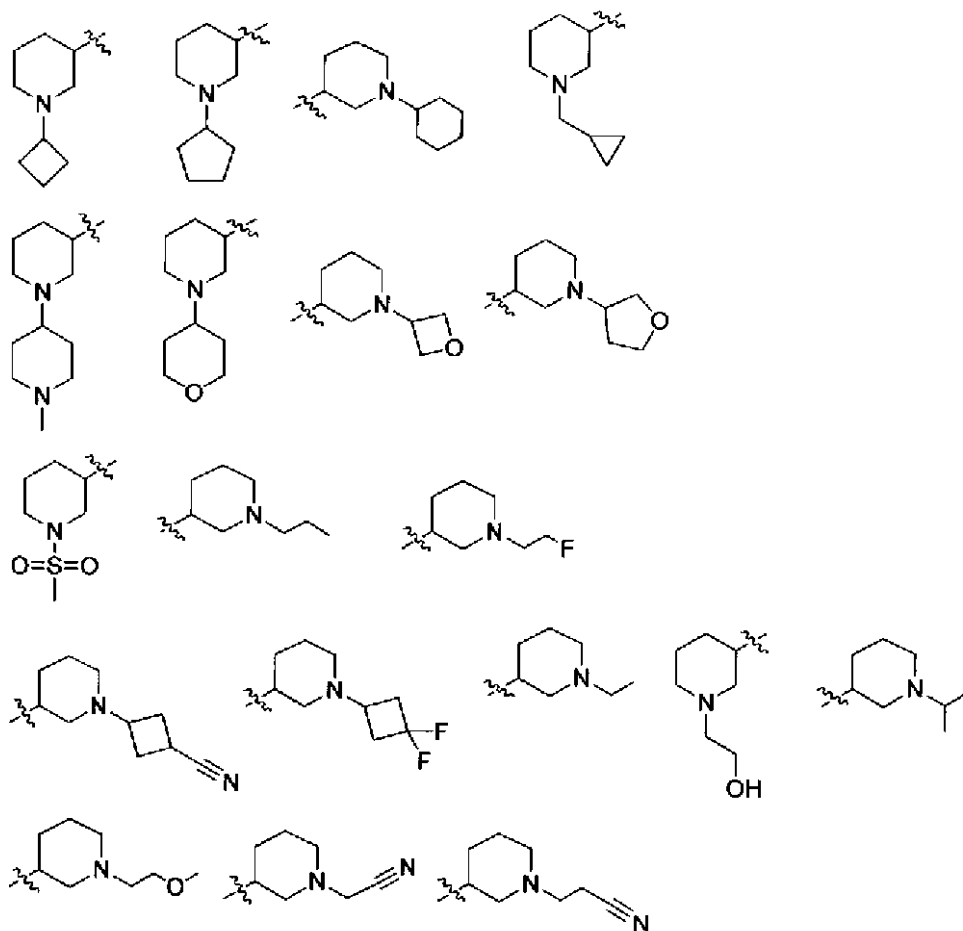


からなる群から選択される環であり；環は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、および $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目 1 に記載の化合物。

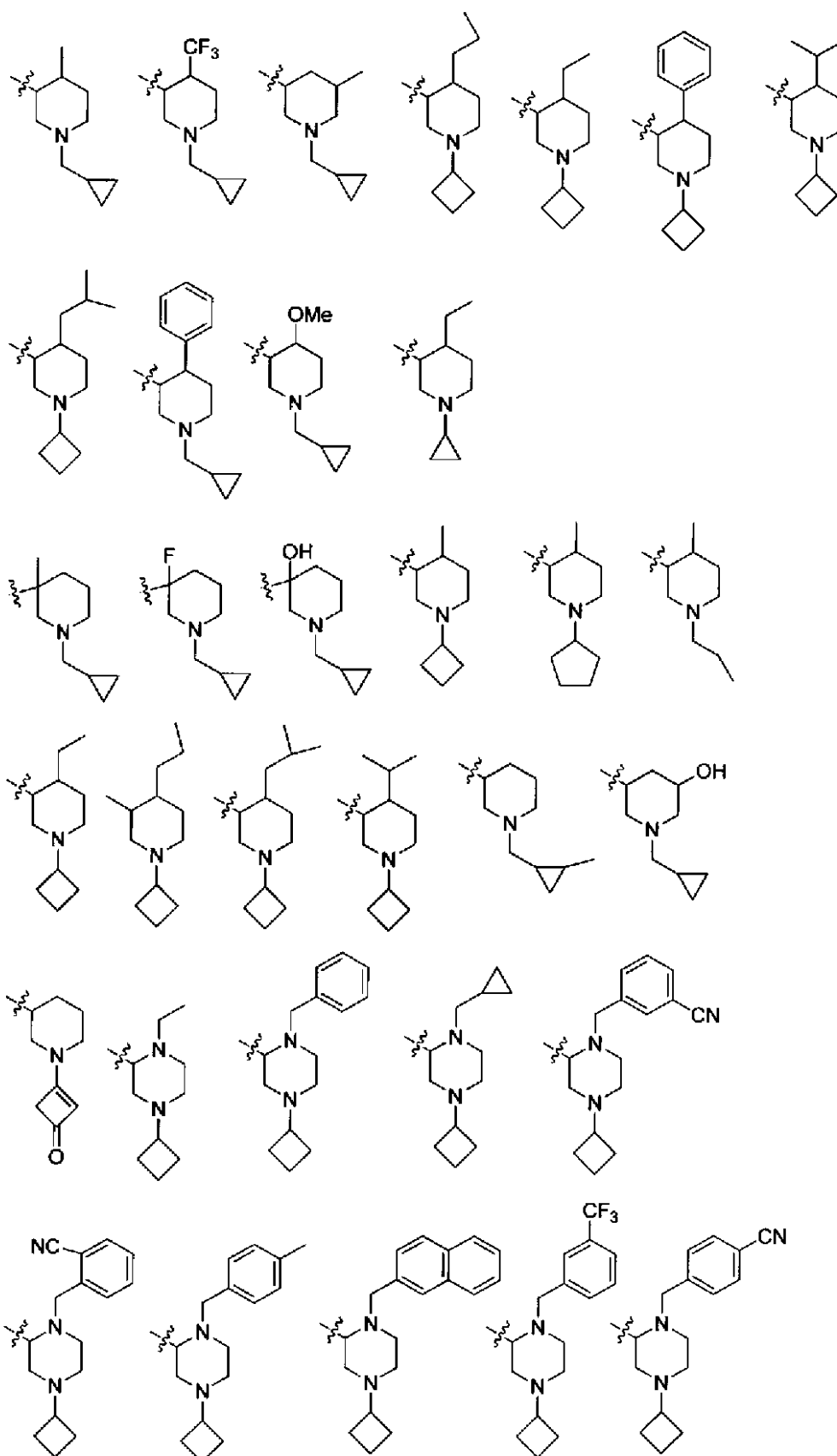
(項目 20)

R^1 は、

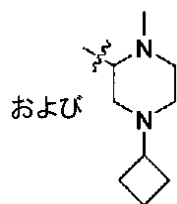
【化 180】



【化 1 8 1】



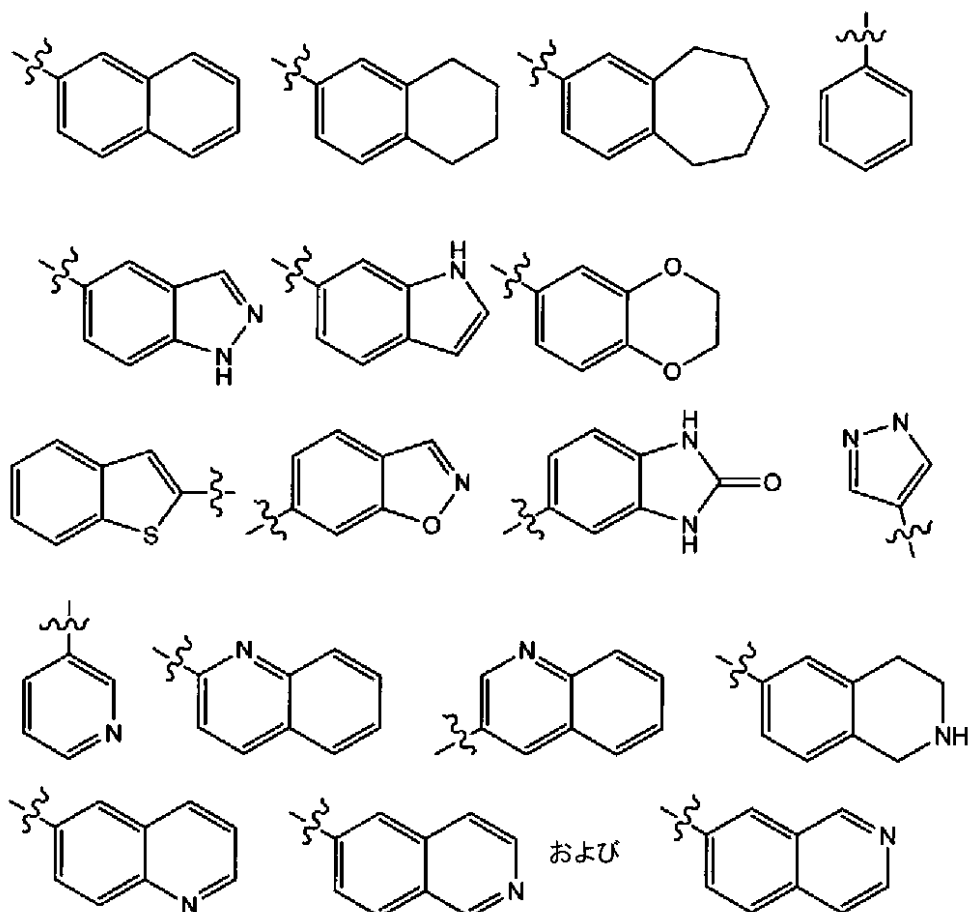
【化 1 8 2】



からなる群から選択され、

R^2 は、

【化 1 8 3】



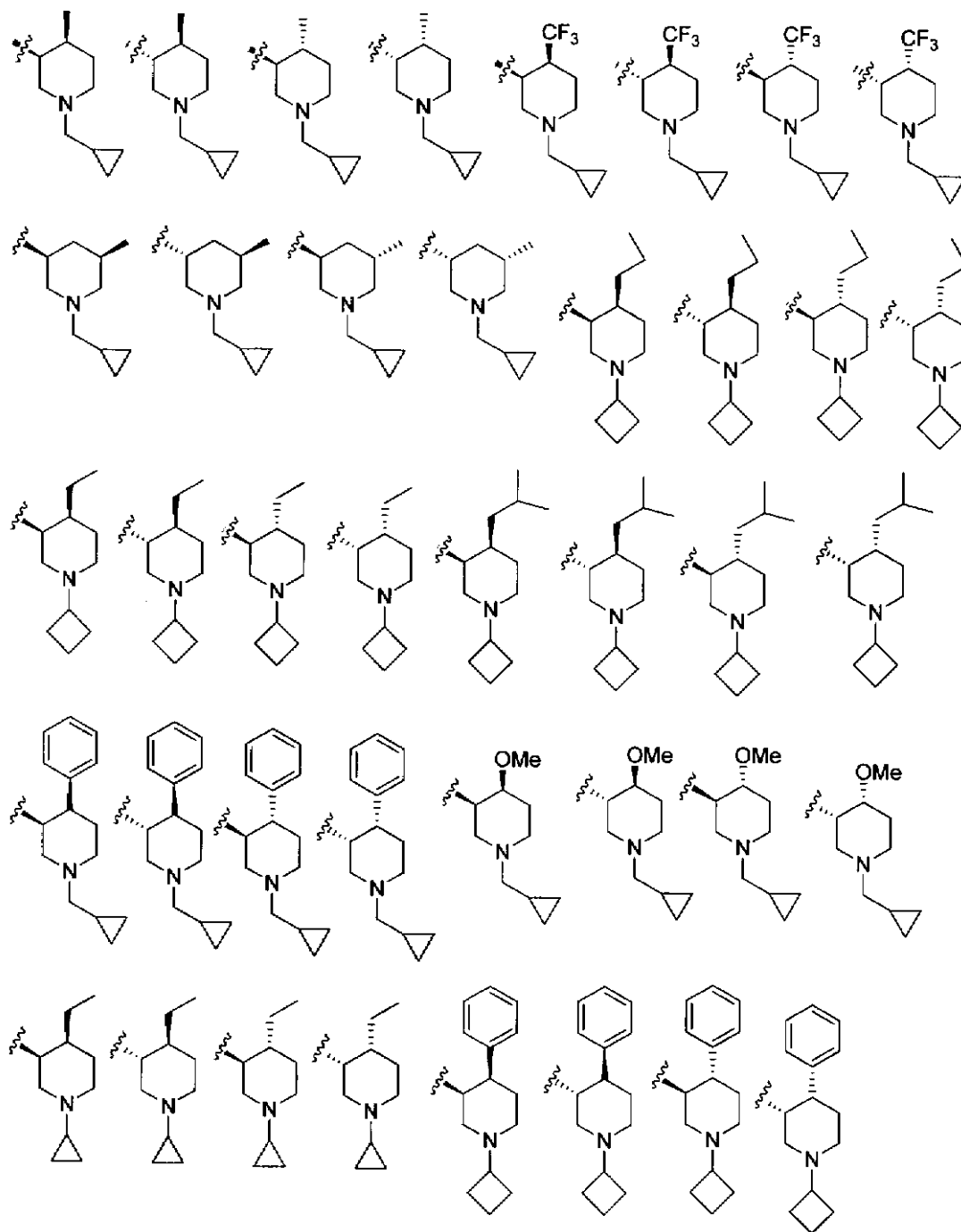
からなる群から選択される環であり；環は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、および $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)$

$-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})-\text{S}(\text{O})-\text{R}^{\text{d}}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{d}})-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^{\text{d}}$ 、および $\text{C}_{1\sim 6}$ アルキル（該 $\text{C}_{1\sim 6}$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目1に記載の化合物。

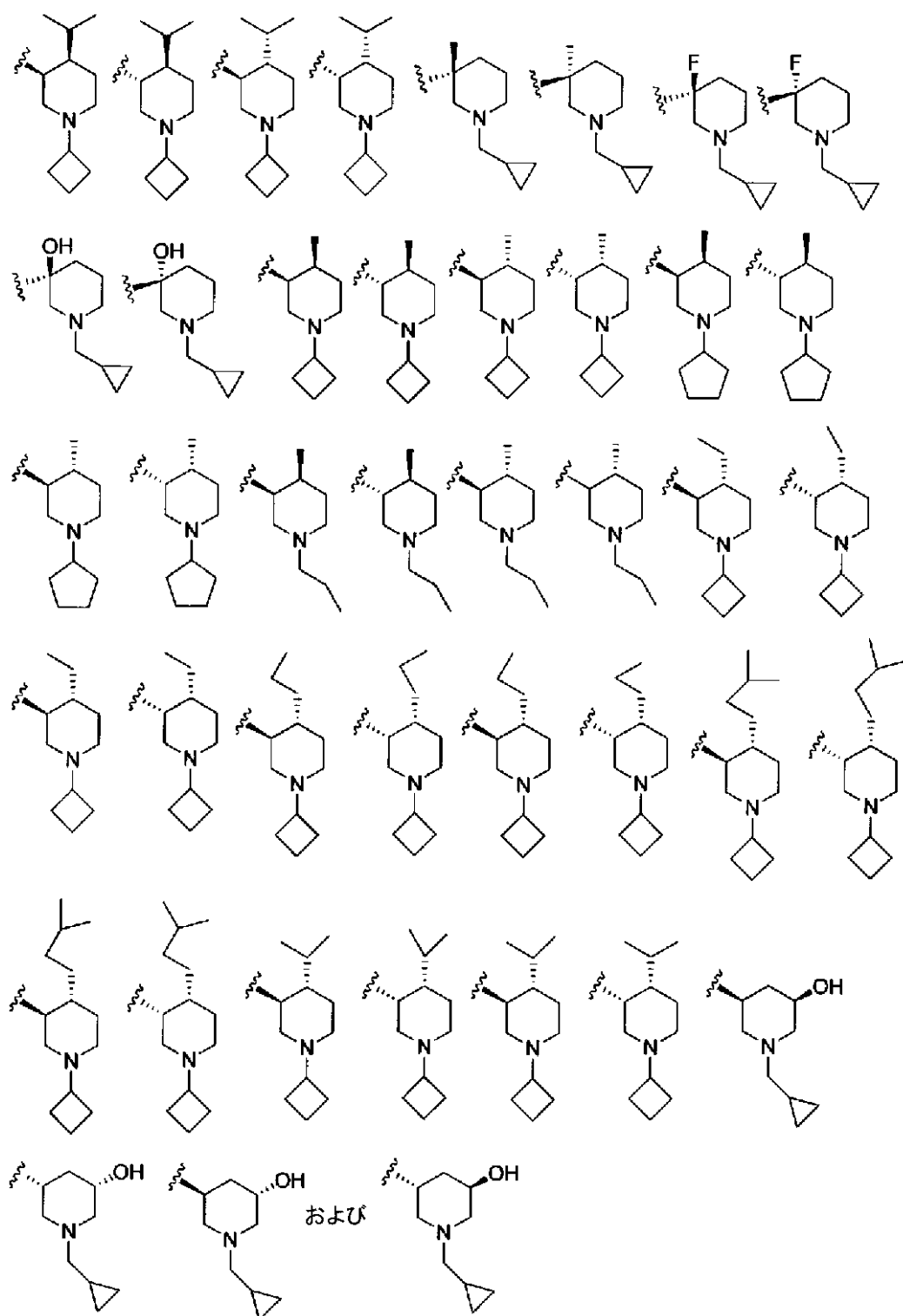
（項目21）

R^1 は、

【化184】

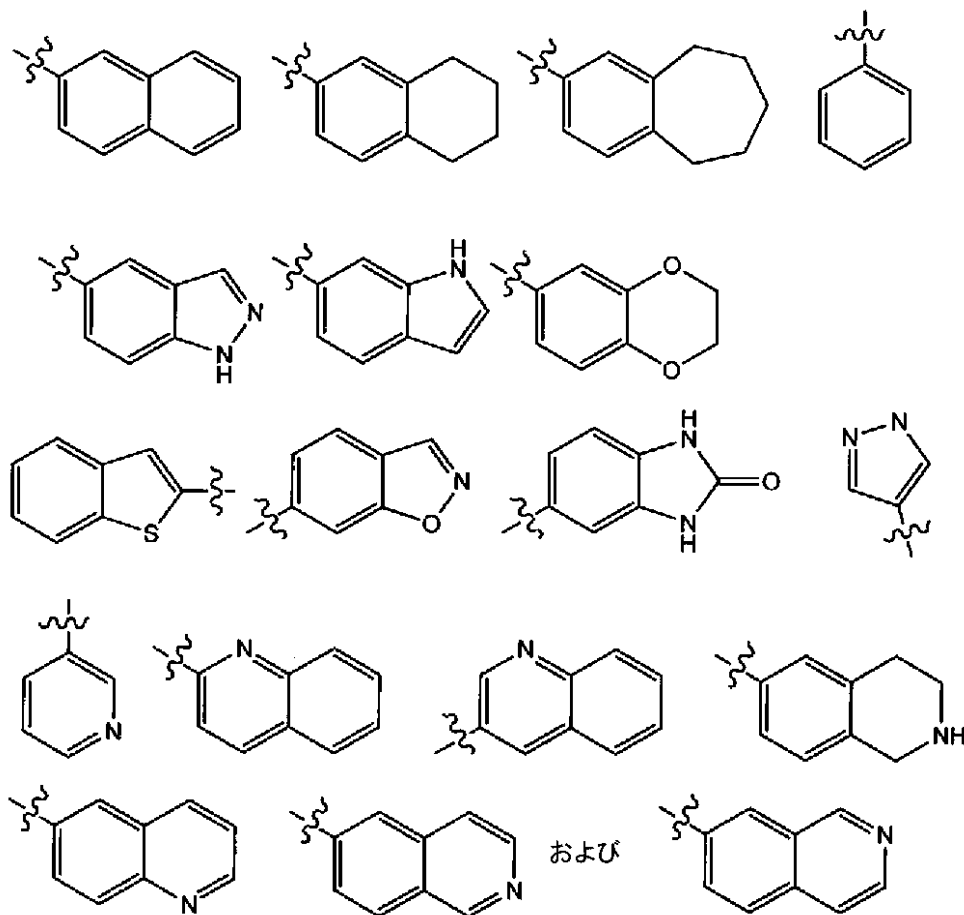


【化 1 8 5】



からなる群から選択され、
 R^2 は、

【化 1 8 6】



からなる群から選択される環であり；環は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、および $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目 1 に記載の化合物。

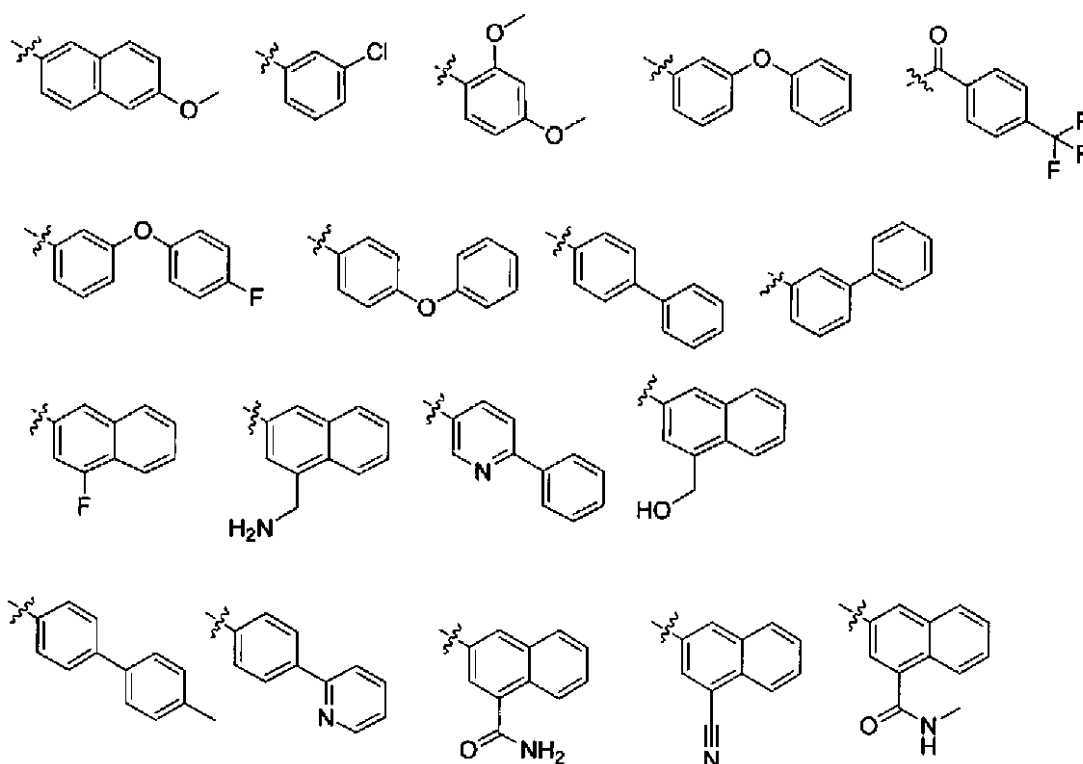
(項目 2 2)

R^1 は、ピペリジン環窒素上で R^x 基で置換され、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8 員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目 1 に記載の化合物。

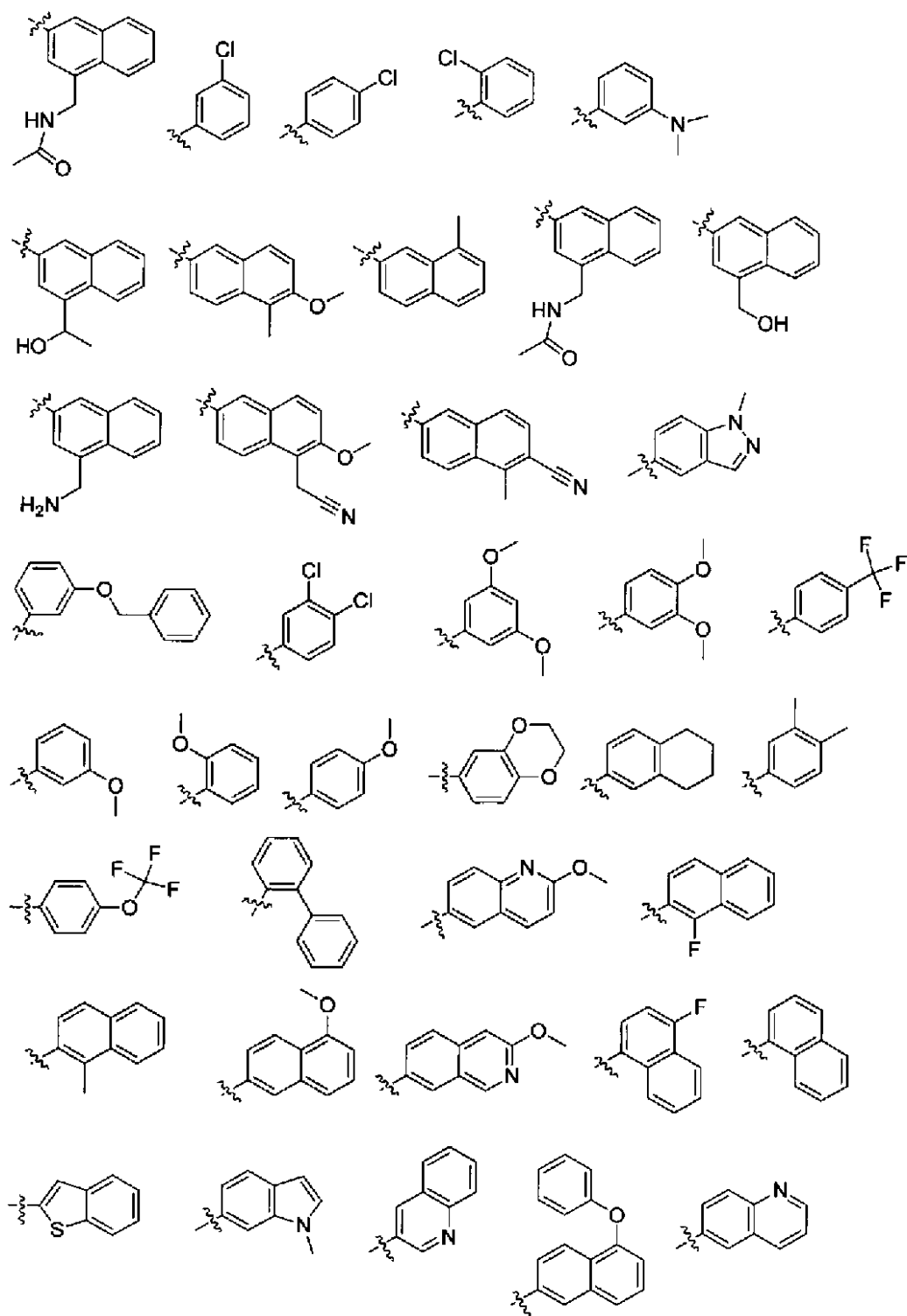
$O) - R^b$ 、 $-C(O) - R^b$ 、 $-C(O) - OR^b$ 、 $-S(O) - R^b$ 、 $-S(O)_2 - R^b$ 、 $-N(R^b) - C(O) - R^b$ 、 $-N(R^b) - S(O) - R^b$ 、 $-N(R^b) - C(O) - N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b) - S(O)_2 - R^b$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的にさらに置換された炭素連結ピペリジン環であって；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O) - N(R^b)_2$ 、 $-S(O) - N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2 - N(R^b)_2$ 、 $-O - R^b$ 、 $-S - R^b$ 、 $-O - C(O) - R^b$ 、 $-C(O) - R^b$ 、 $-C(O) - OR^b$ 、 $-S(O) - R^b$ 、 $-S(O)_2 - R^b$ 、 $-N(R^b) - C(O) - R^b$ 、 $-N(R^b) - S(O) - R^b$ 、 $-N(R^b) - C(O) - N(R^b)_2$ 、 $-N(R^b) - S(O)_2 - R^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペリジン環であり；

R^2 は、

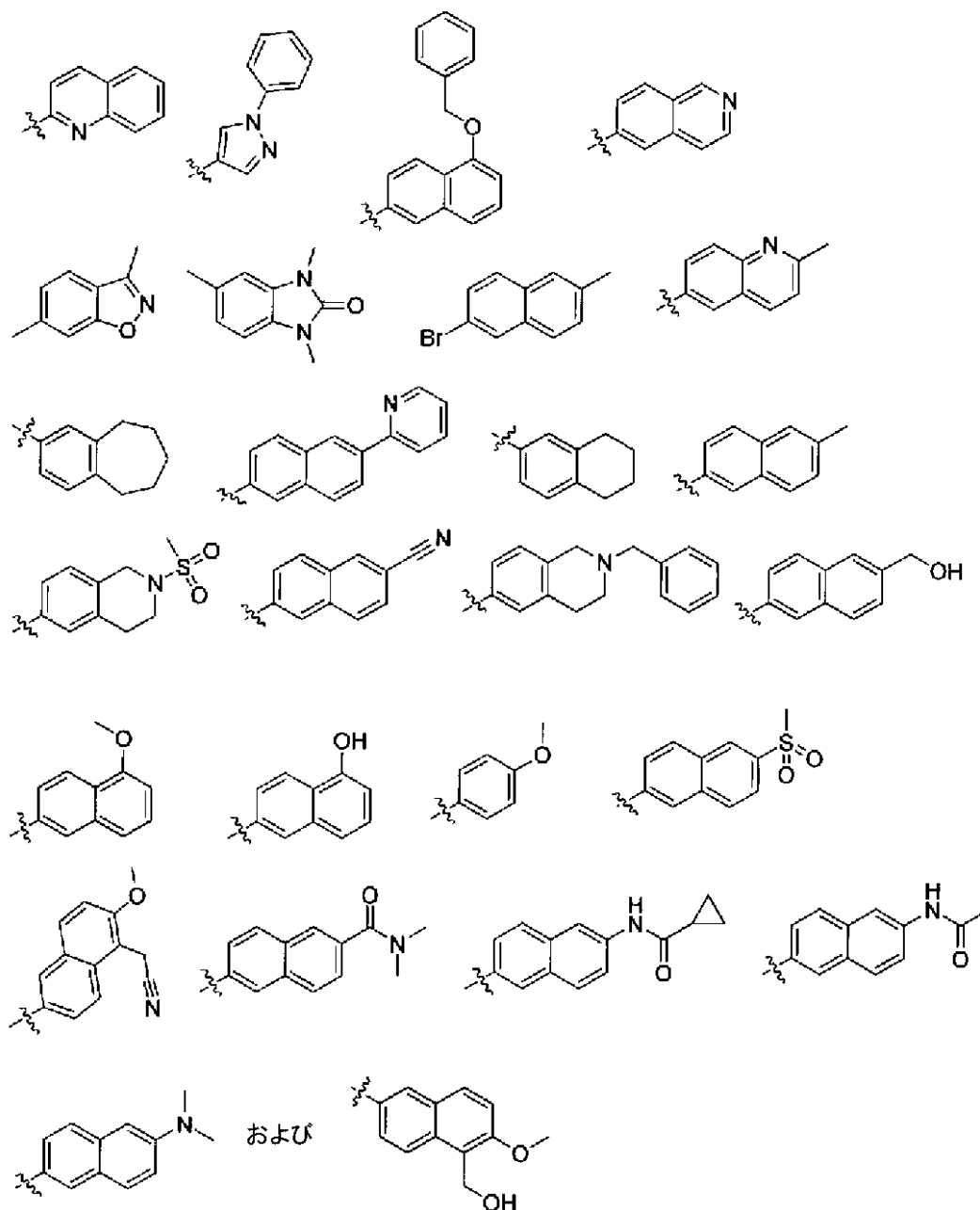
【化187】



【化 1 8 8】



【化 1 8 9】



からなる群から選択される、
項目 1 に記載の化合物。

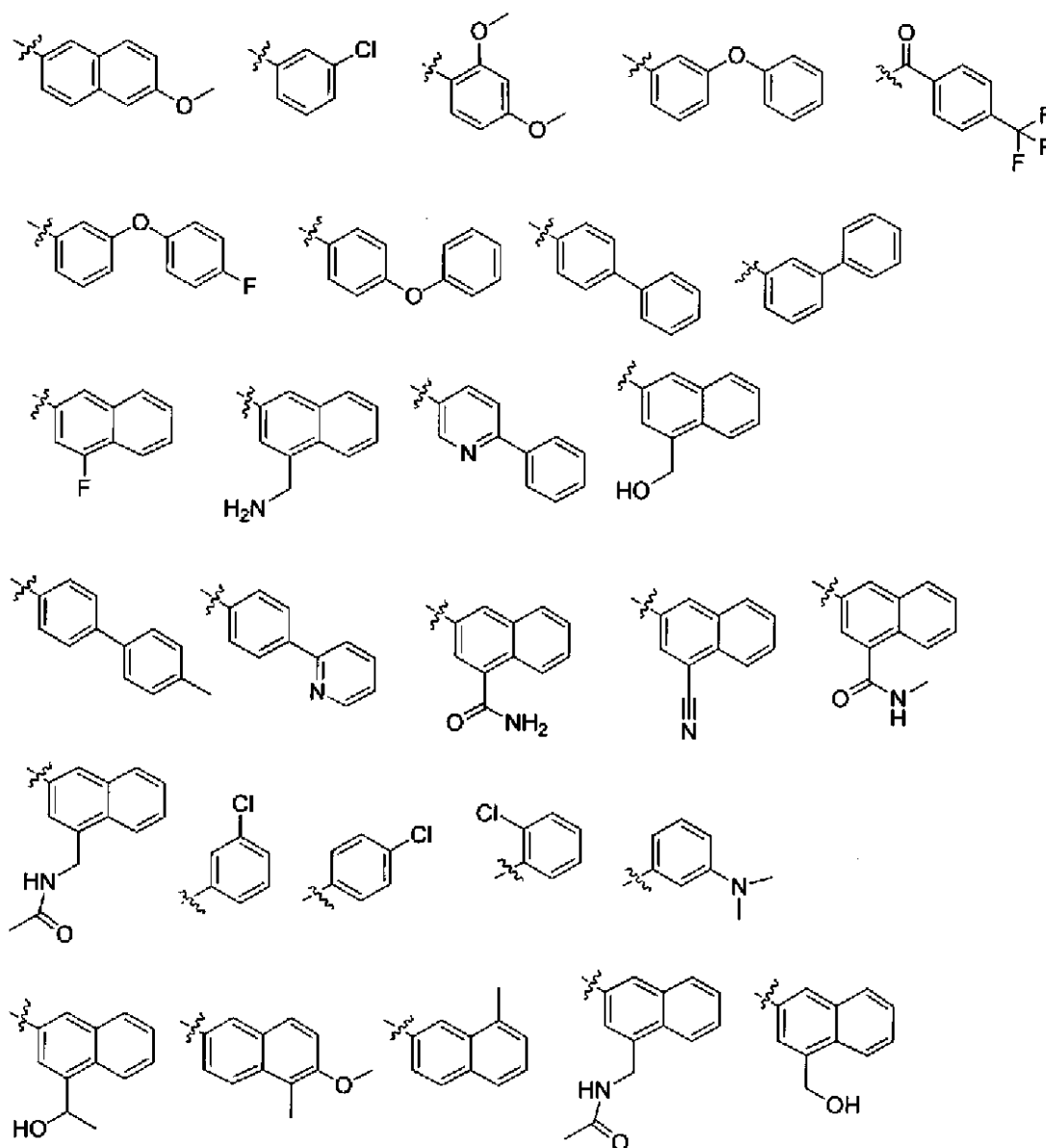
(項目 2 3)

R^1 は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で置換された炭素連結ピペラジン環であって；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)$

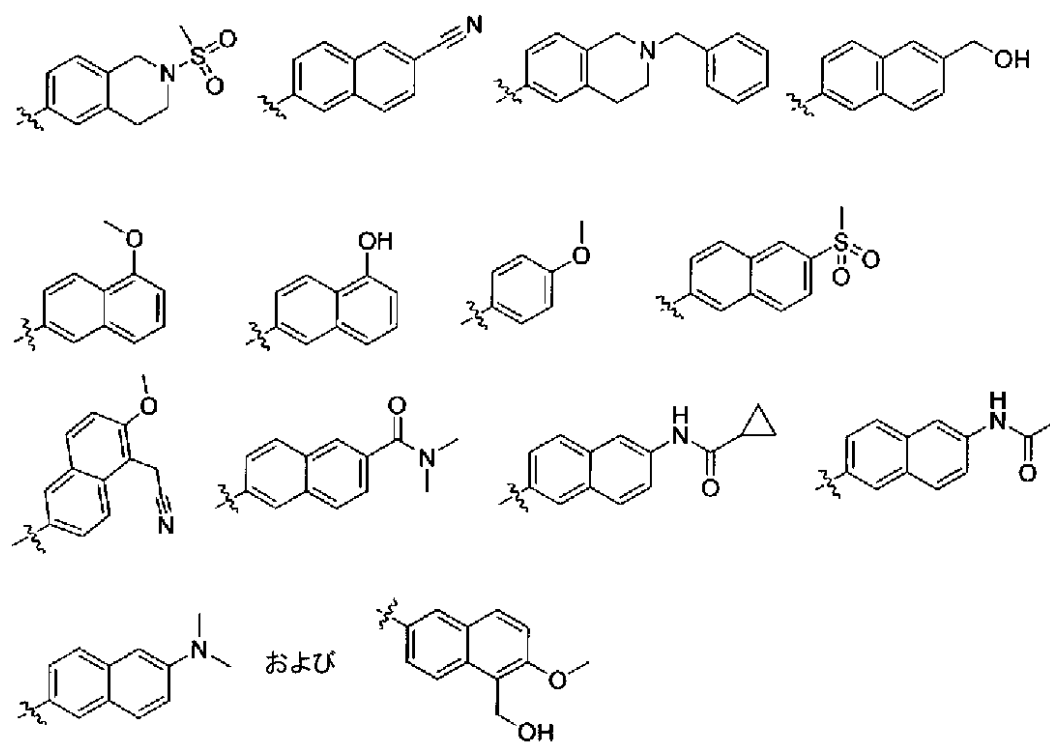
$\text{)} - \text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2 - \text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{O}-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}-\text{R}^b$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^b$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{S}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^b$ 、および $\text{C}_{1\sim 6}$ アルキル（該 $\text{C}_{1\sim 6}$ アルキルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペラジン環であり；

R^2 は、

【化 190】



【化 1 9 2】

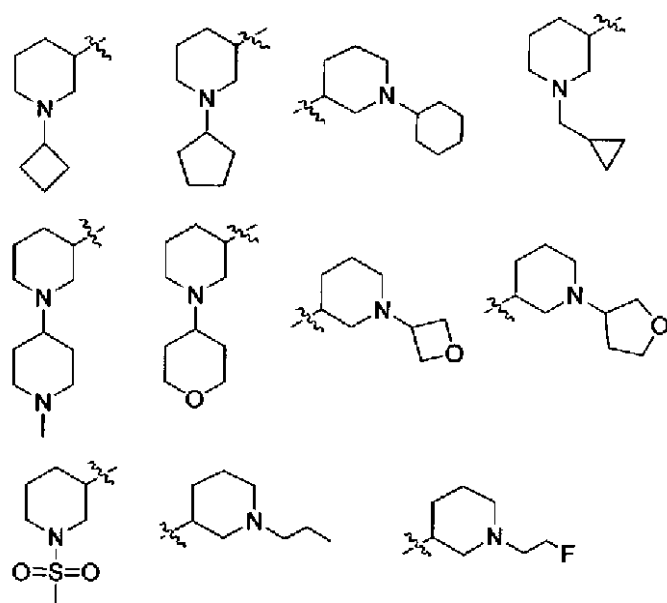


からなる群から選択される、
項目 1 に記載の化合物。

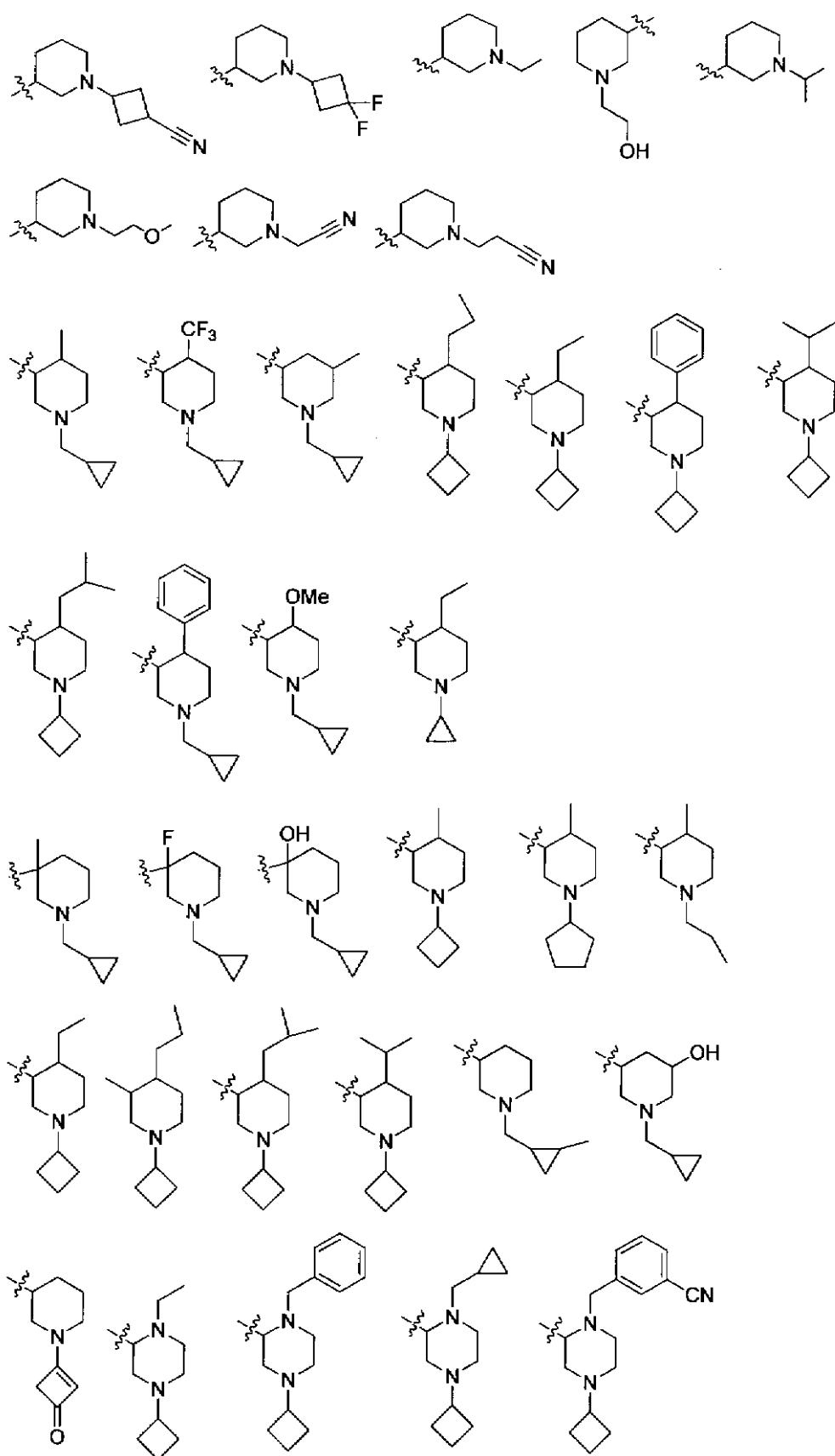
(項目 2 4)

R¹ は、

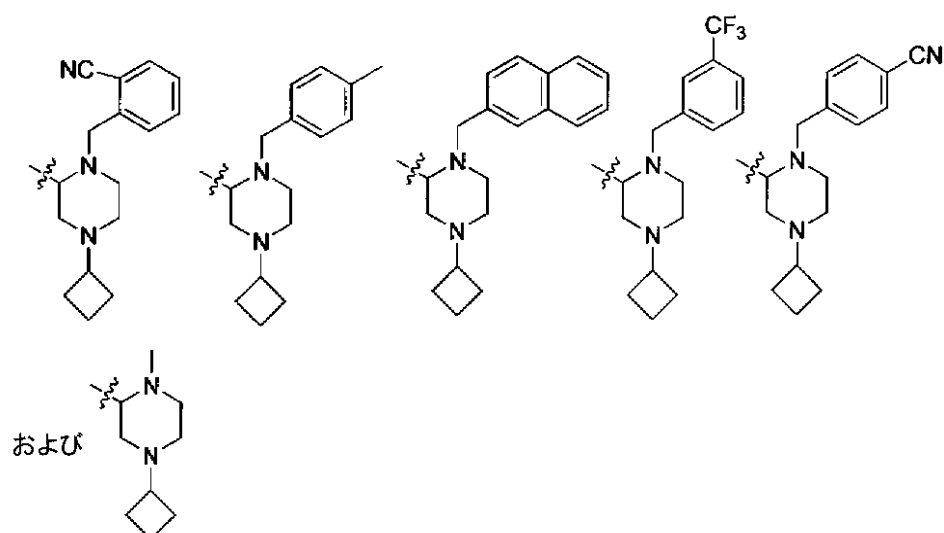
【化 1 9 3】



【化 1 9 4】



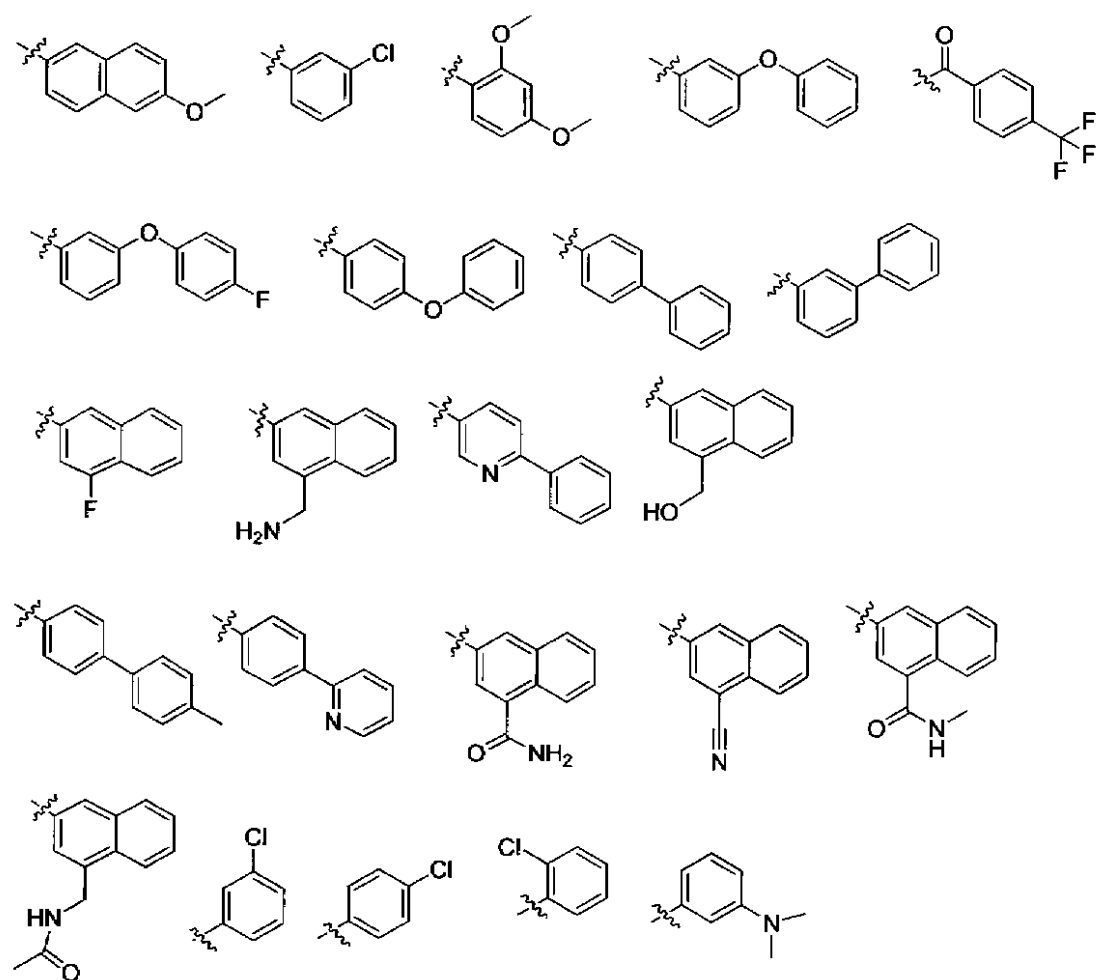
【化 1 9 5】



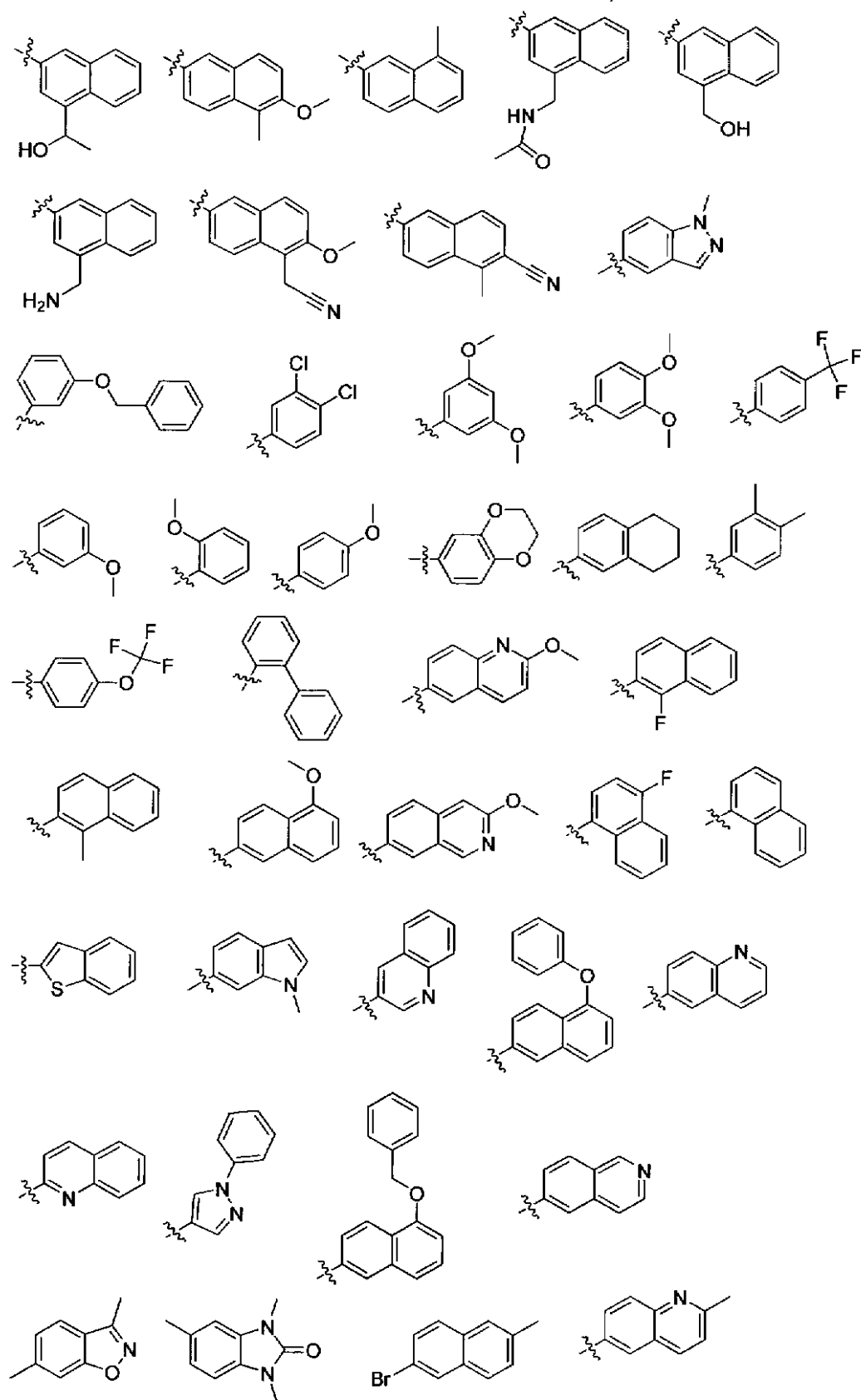
からなる群から選択され；

R^2 は、

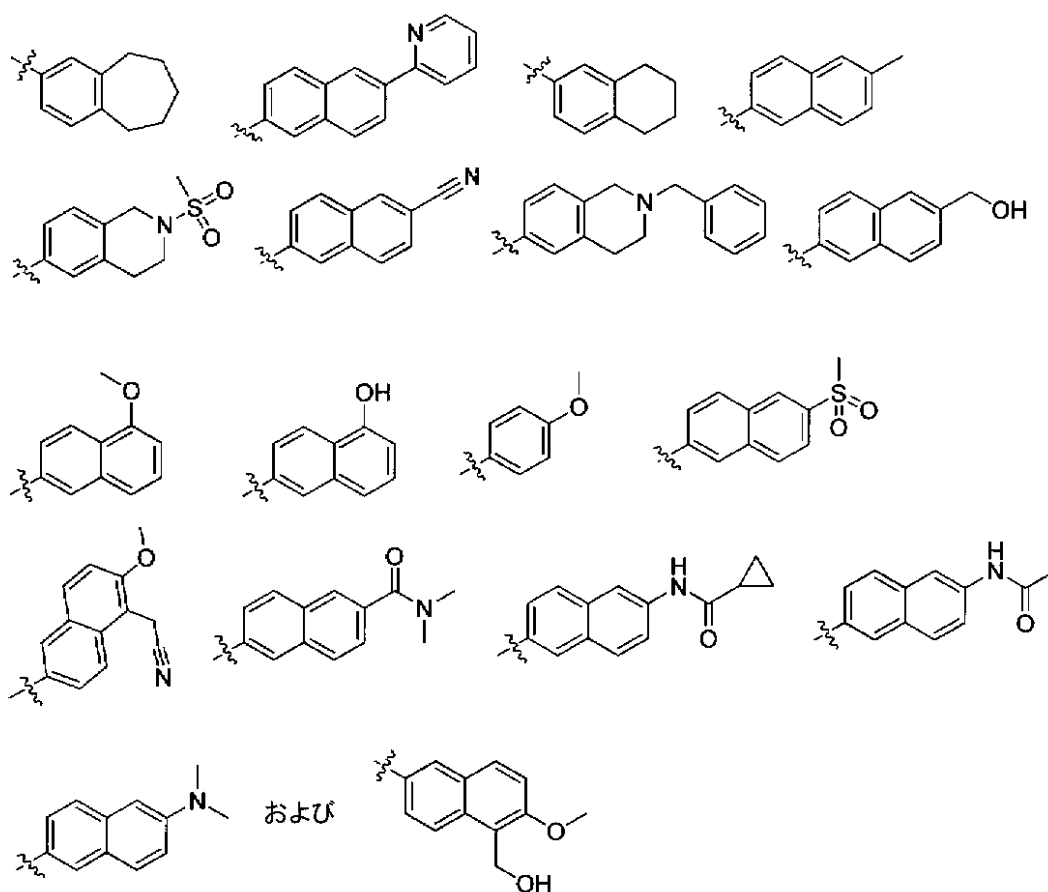
【化 1 9 6】



【化 1 9 7】



【化 1 9 8】

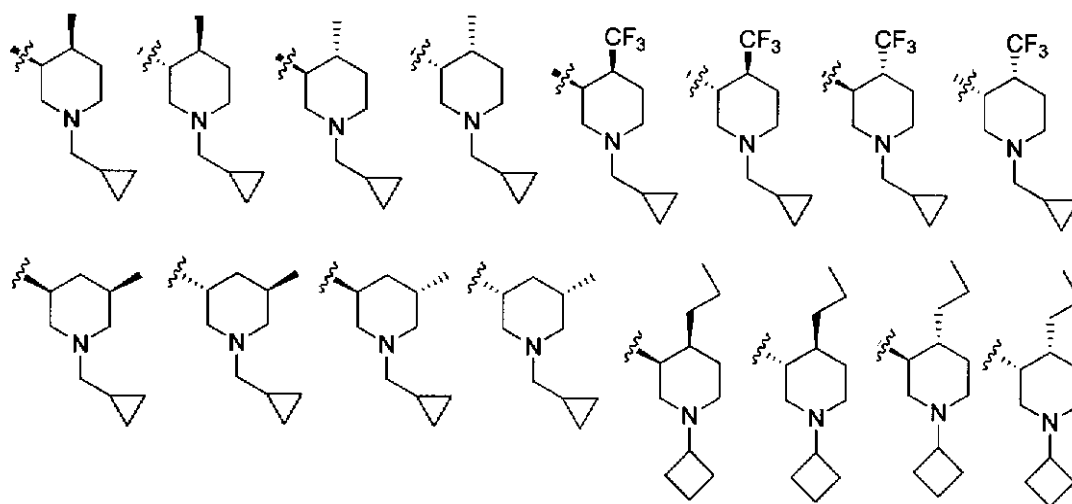


からなる群から選択される、項目 1 に記載の化合物。

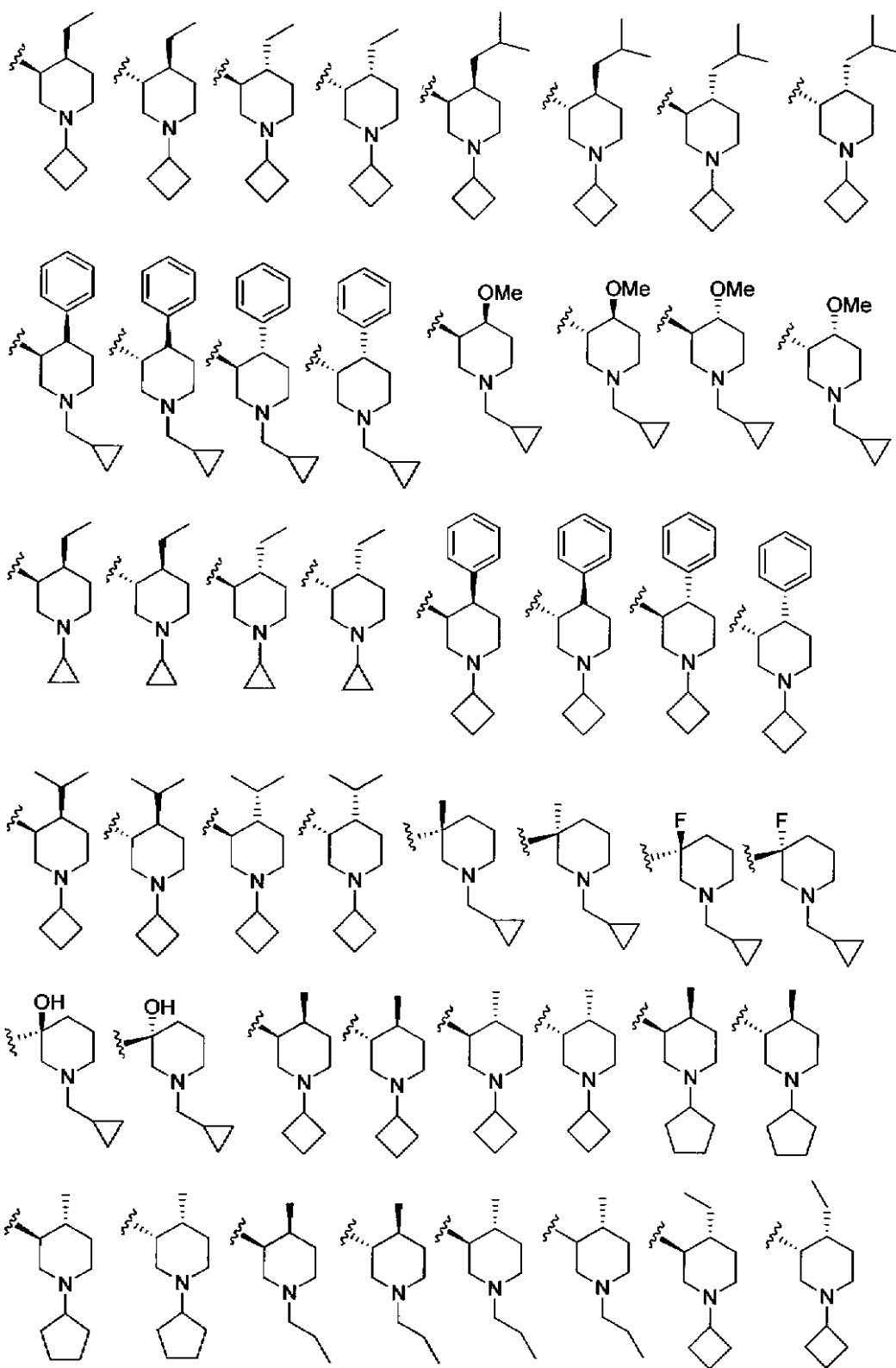
(項目 2 5)

R¹ は、

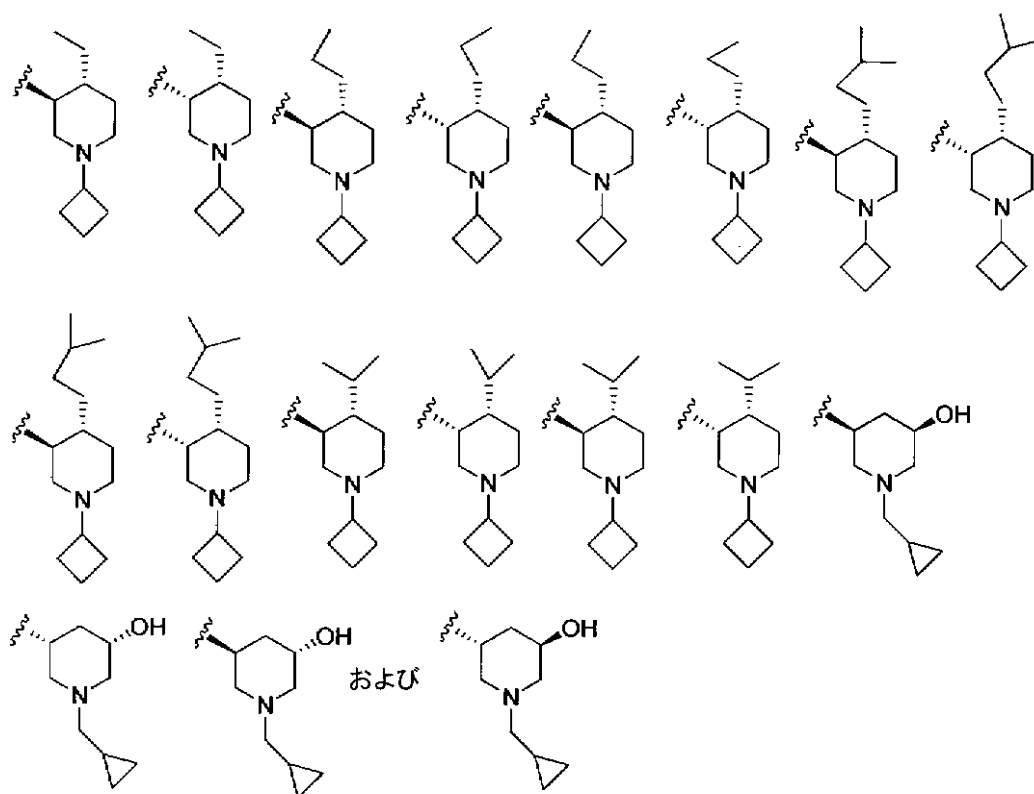
【化 1 9 9】



【化 200】



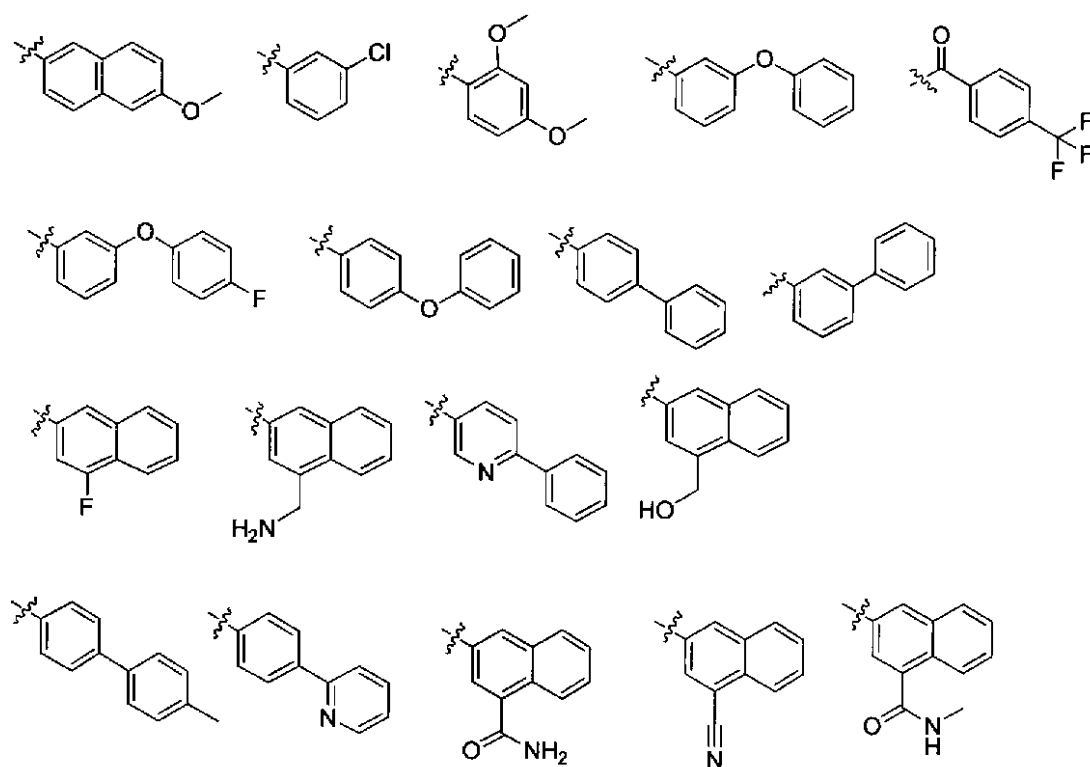
【化 2 0 1】



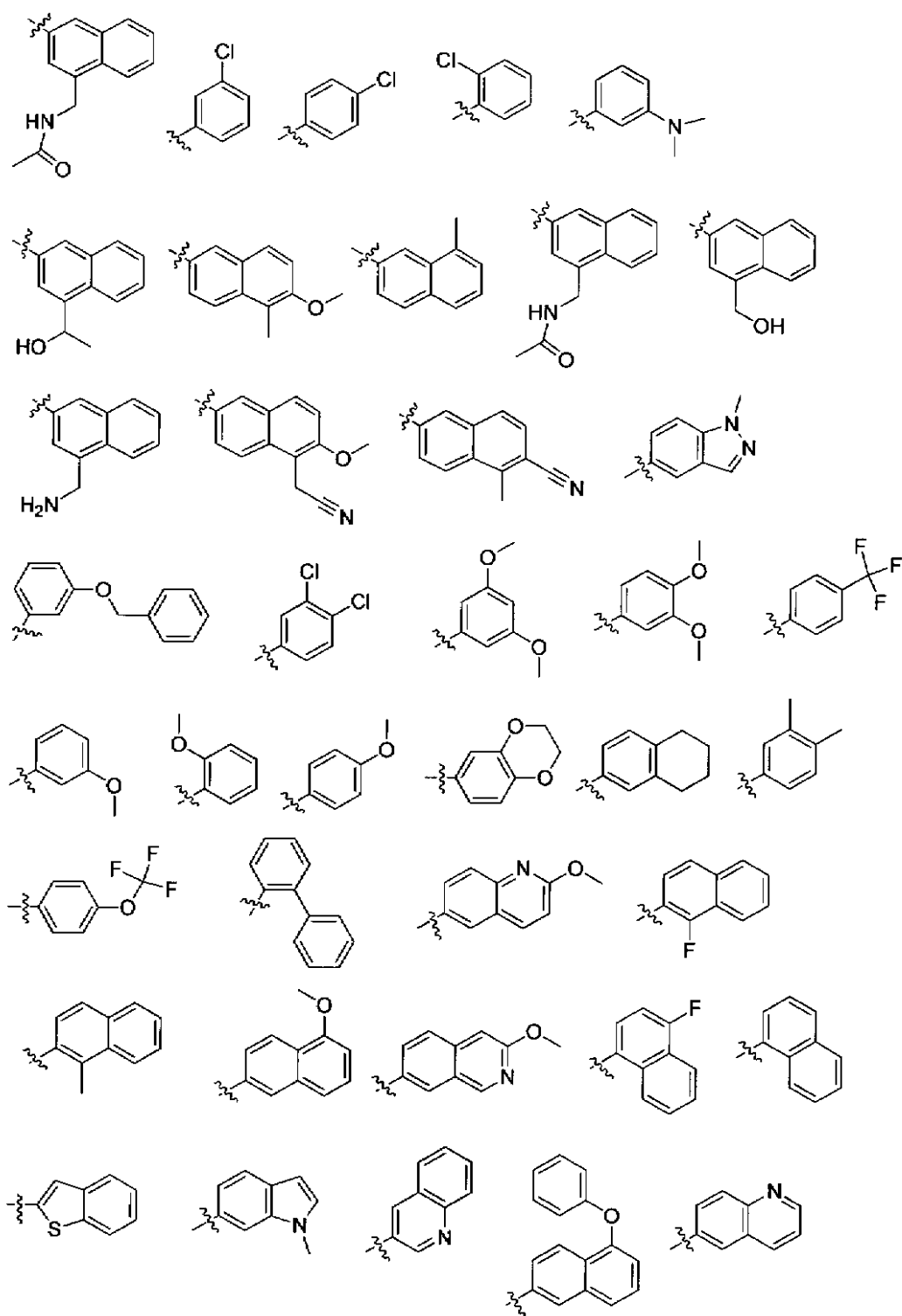
からなる群から選択され；

R^2 は、

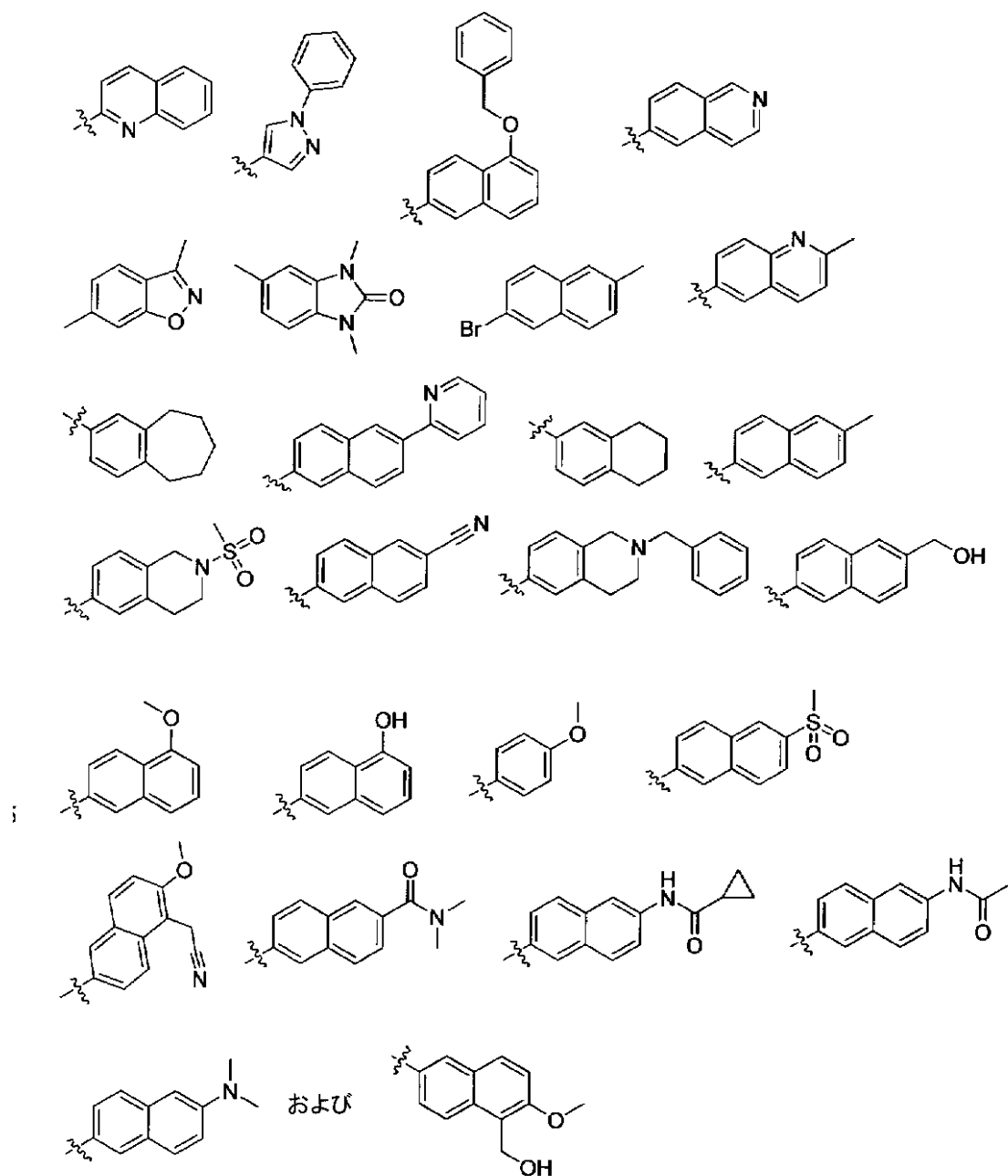
【化 2 0 2】



【化 2 0 3】

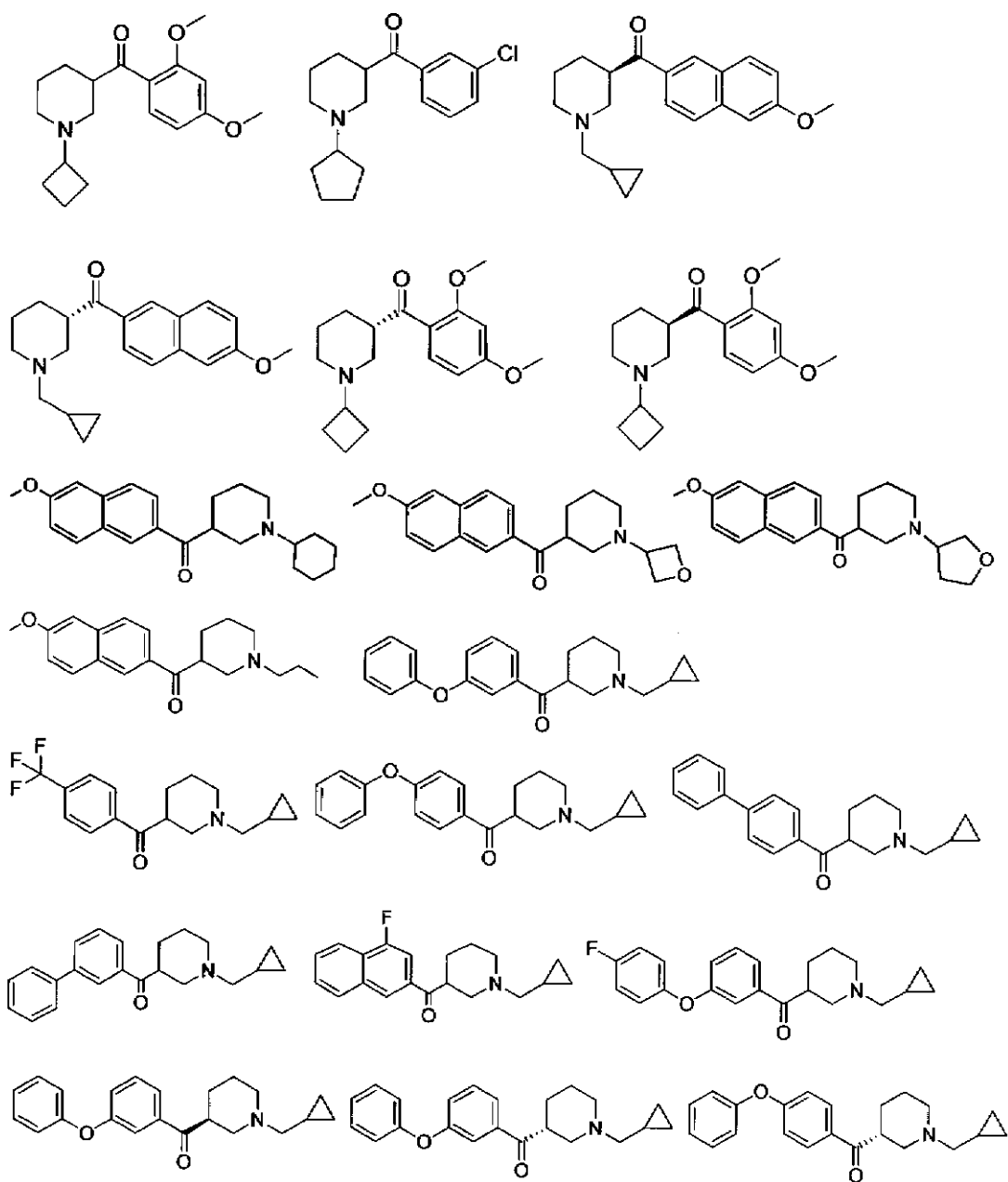


【化 2 0 4】

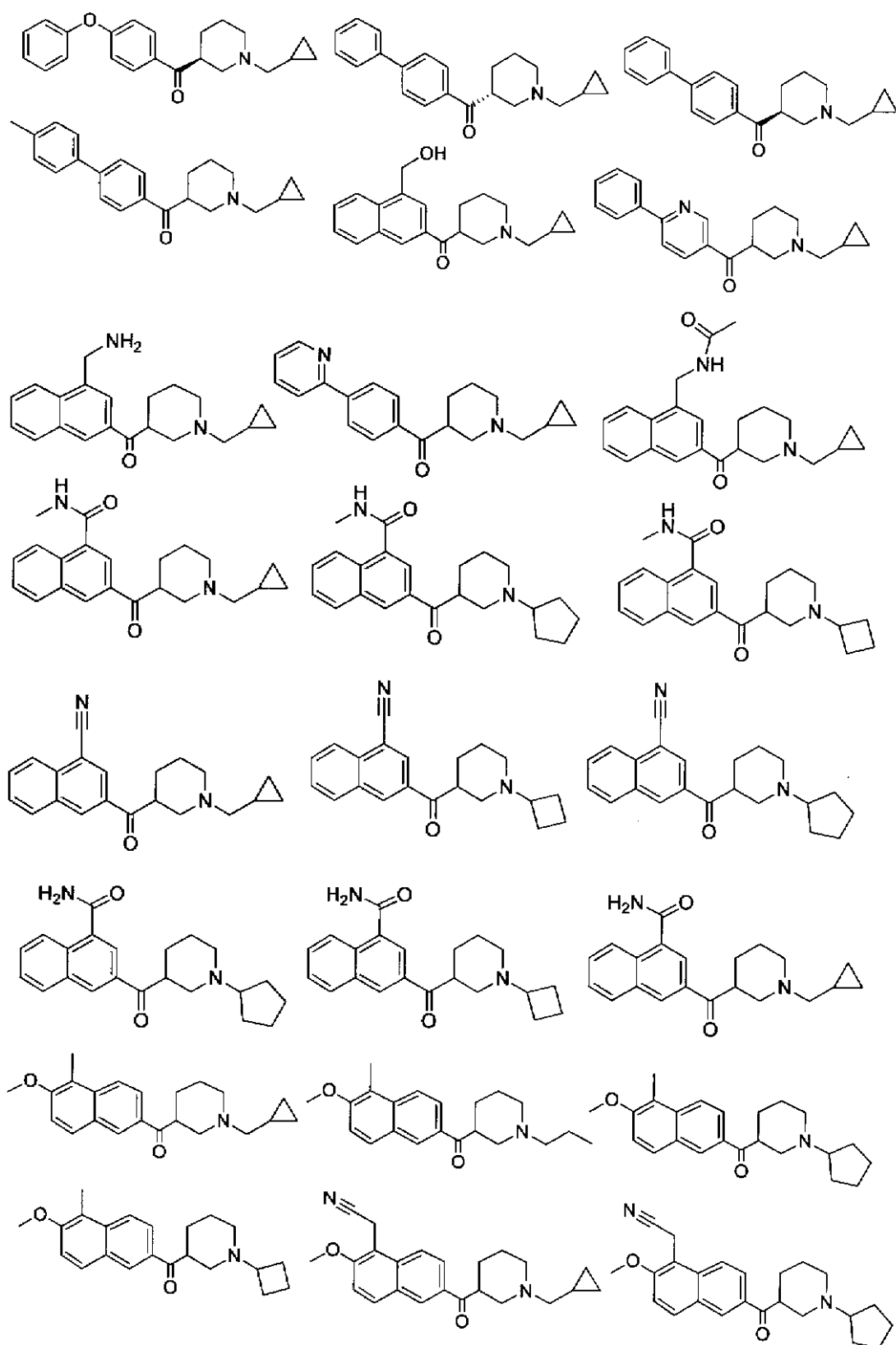


からなる群から選択される、項目 1 に記載の化合物。
 (項目 2 6)

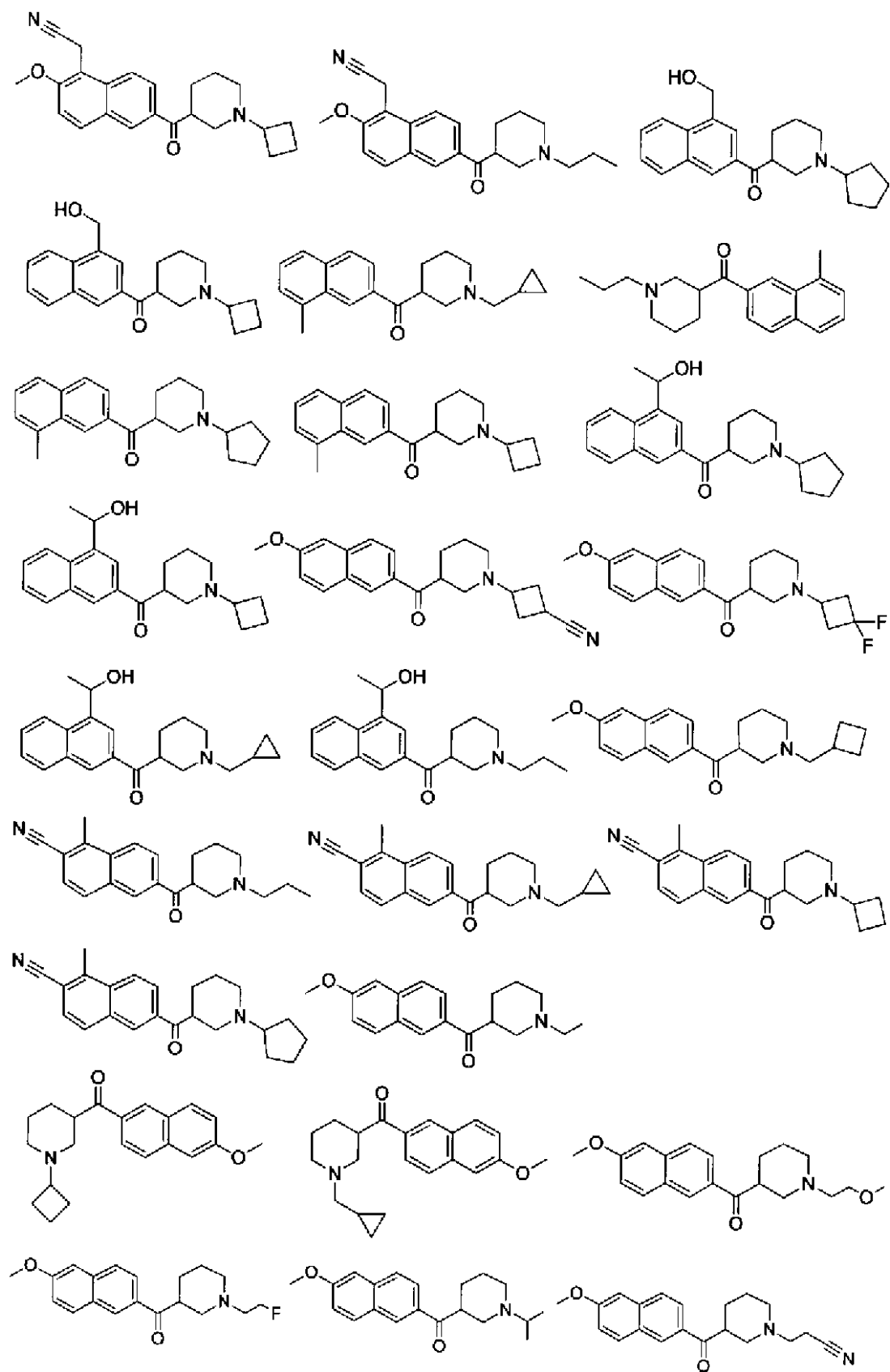
【化 2 0 5】



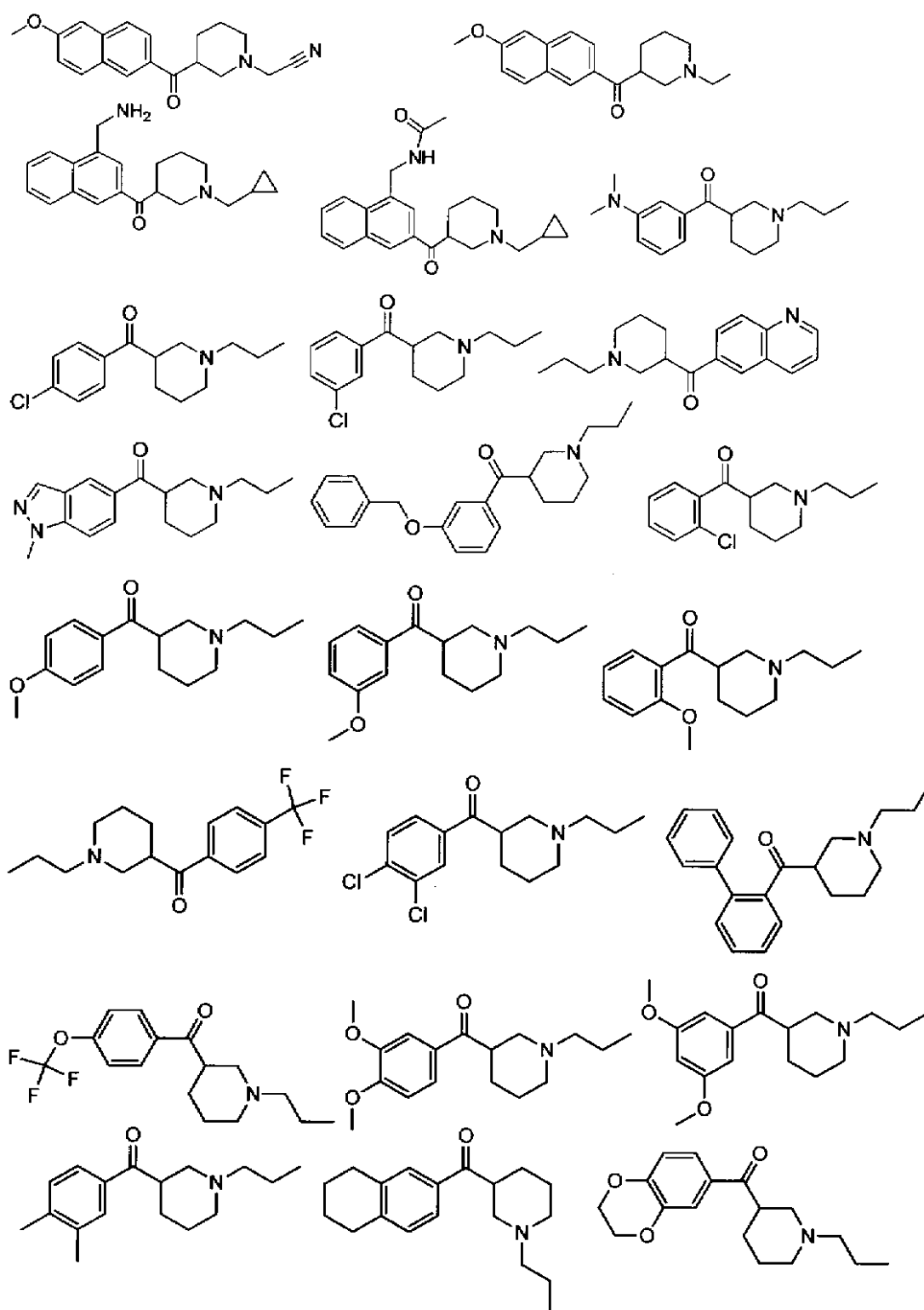
【化 206】



【化 2 0 7】

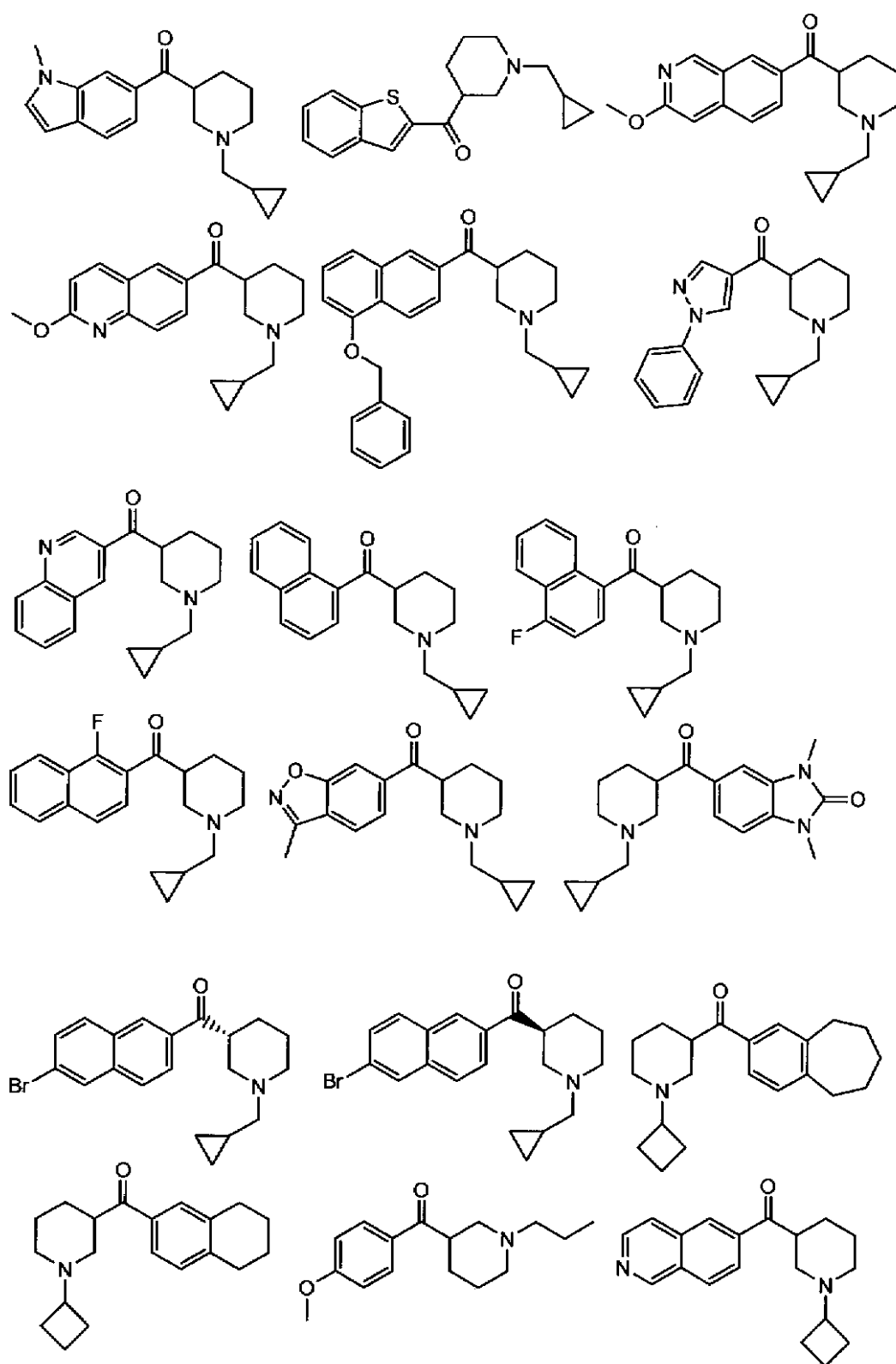


【化 208】

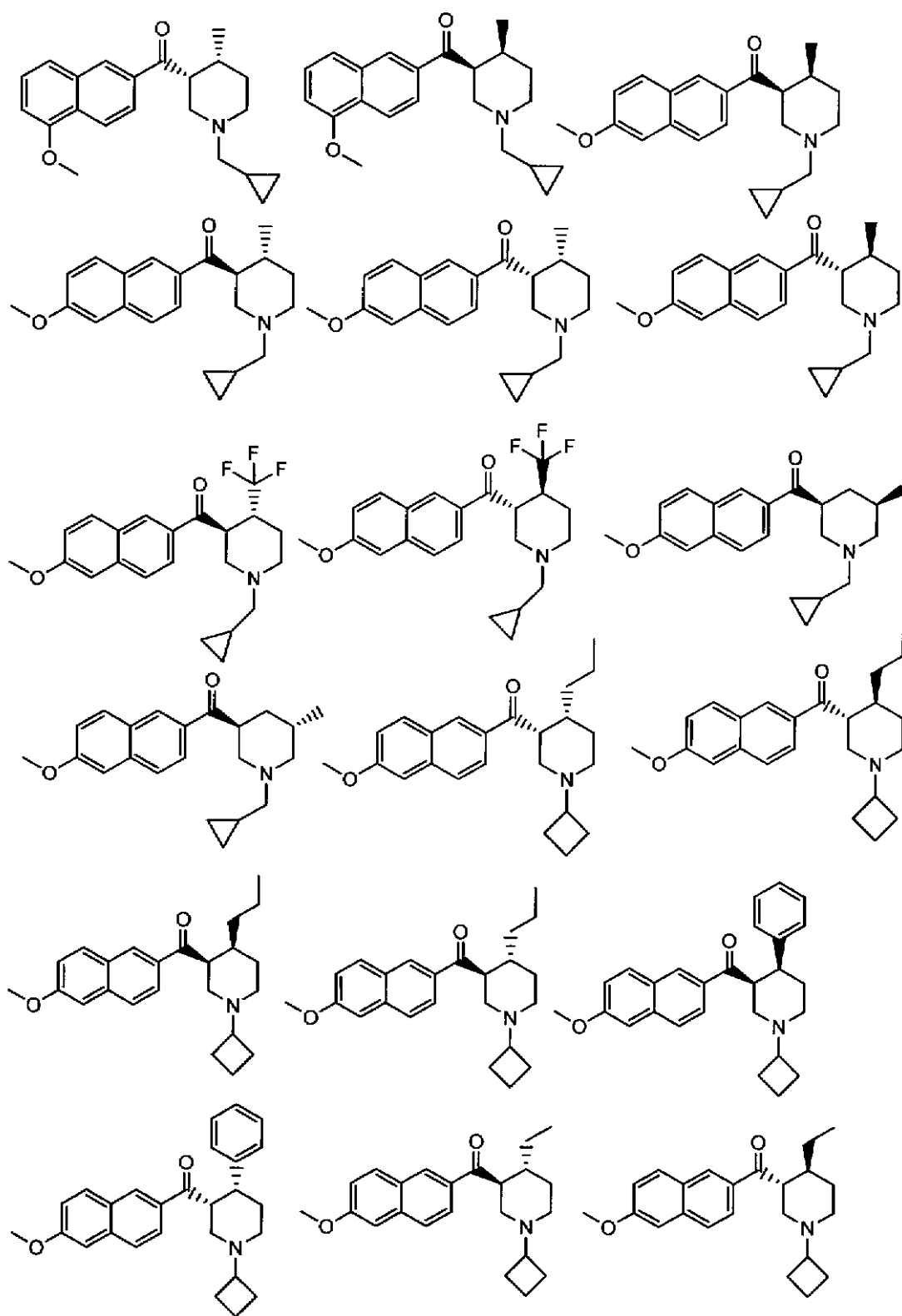


Chemical structures of 12 compounds, including various substituted piperidines and quinolines, with stereochemical indicators.

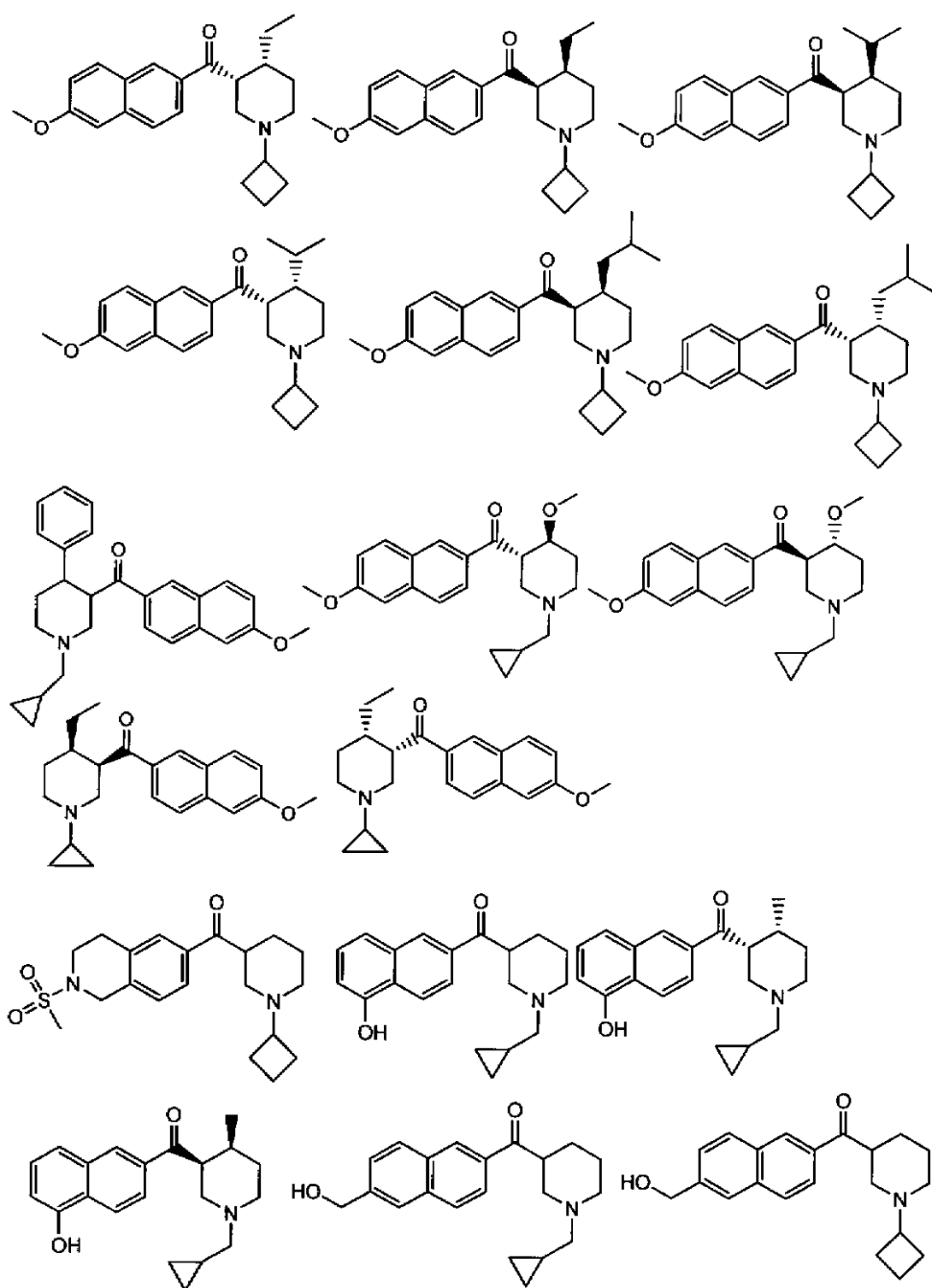
【化 2 1 0】



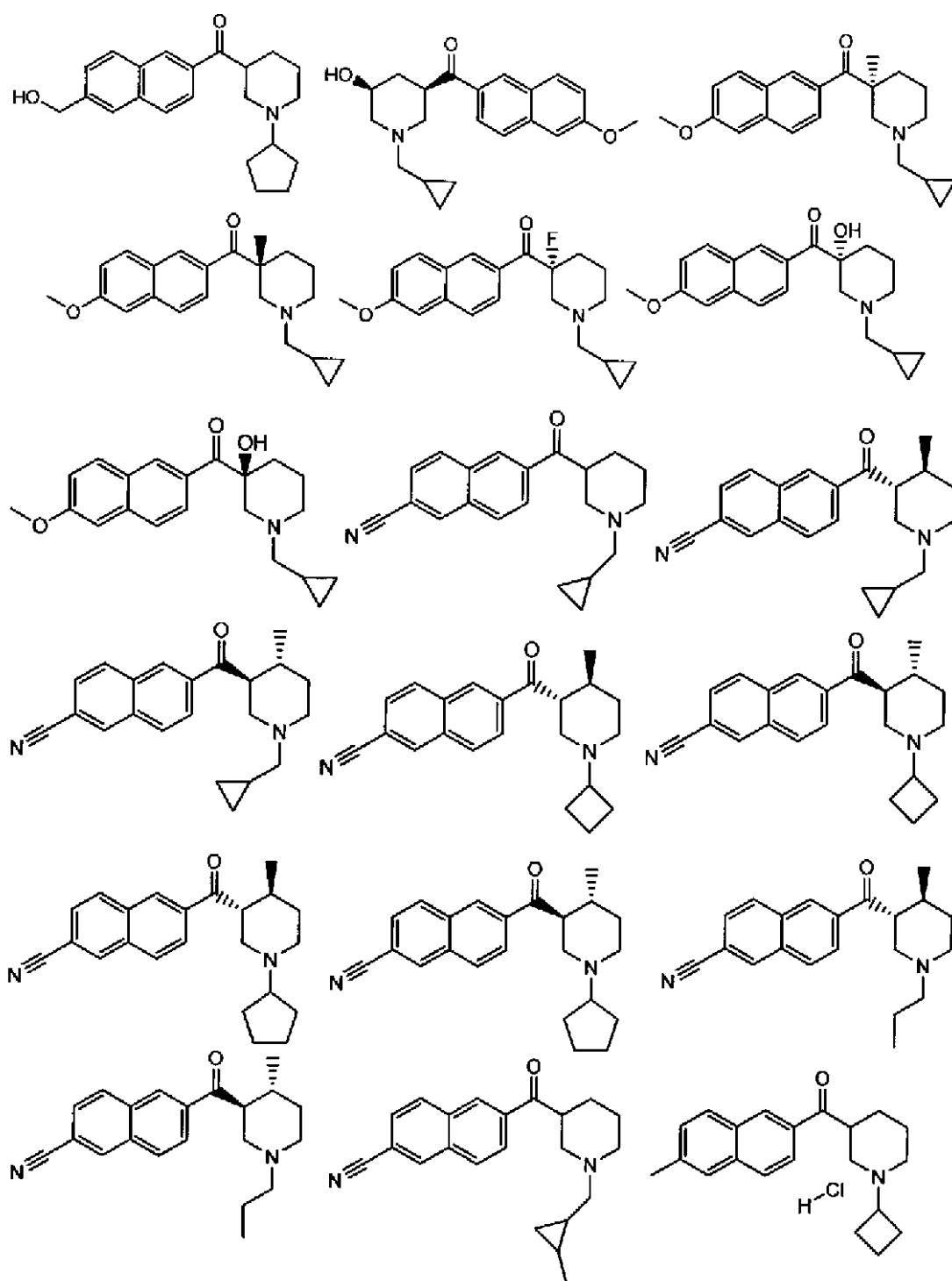
【化 2 1 1】



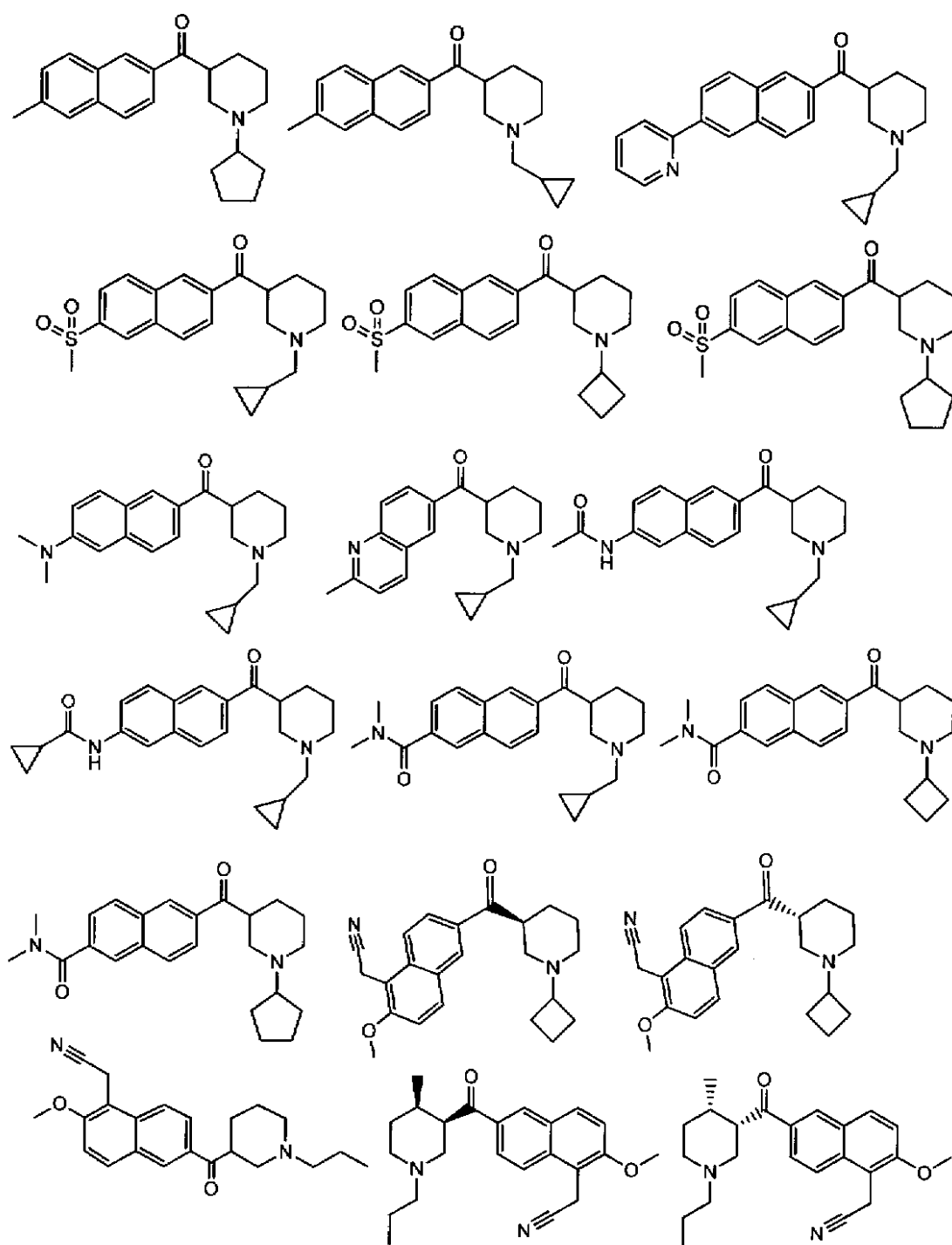
【化 2 1 2】



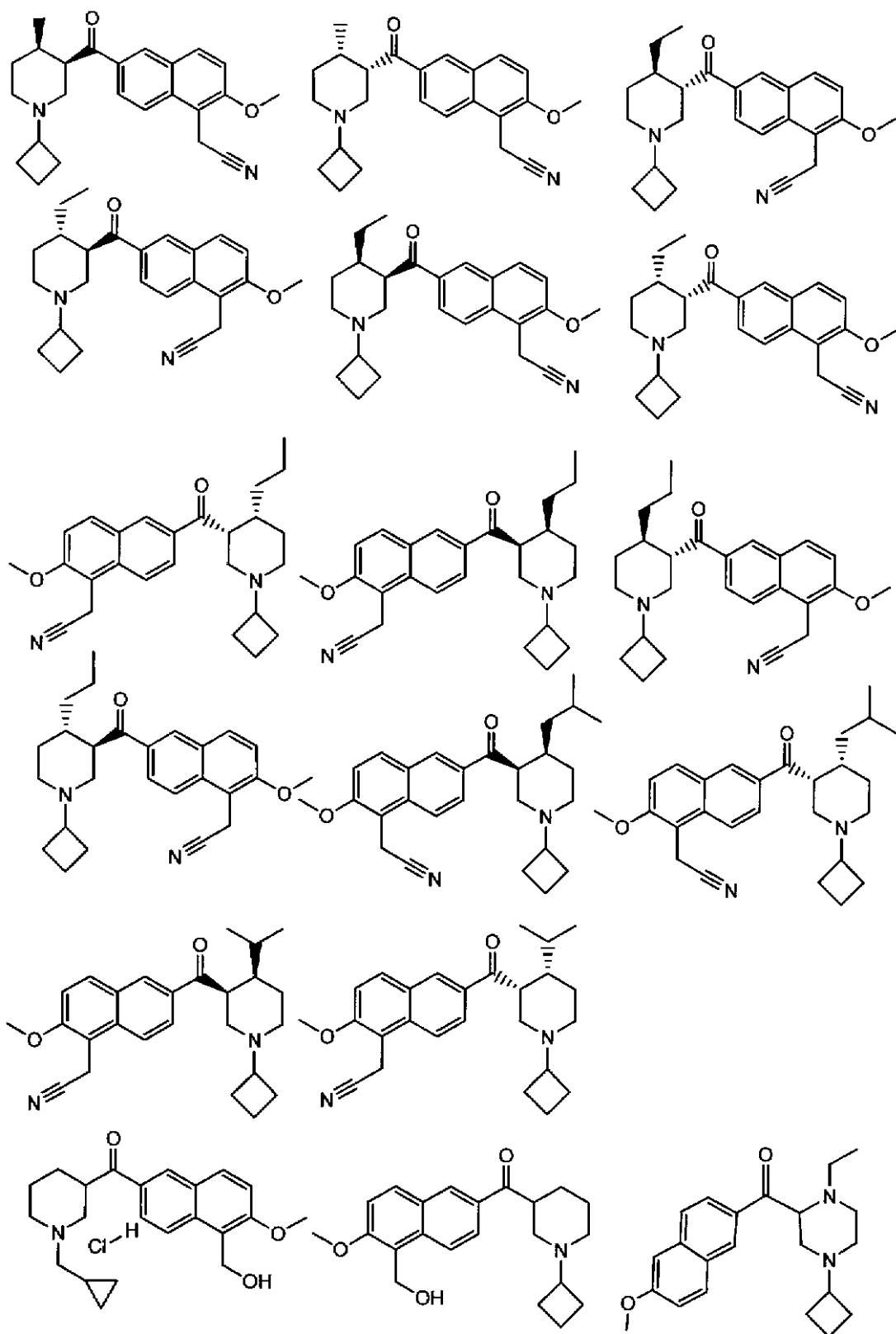
【化 2 1 3】



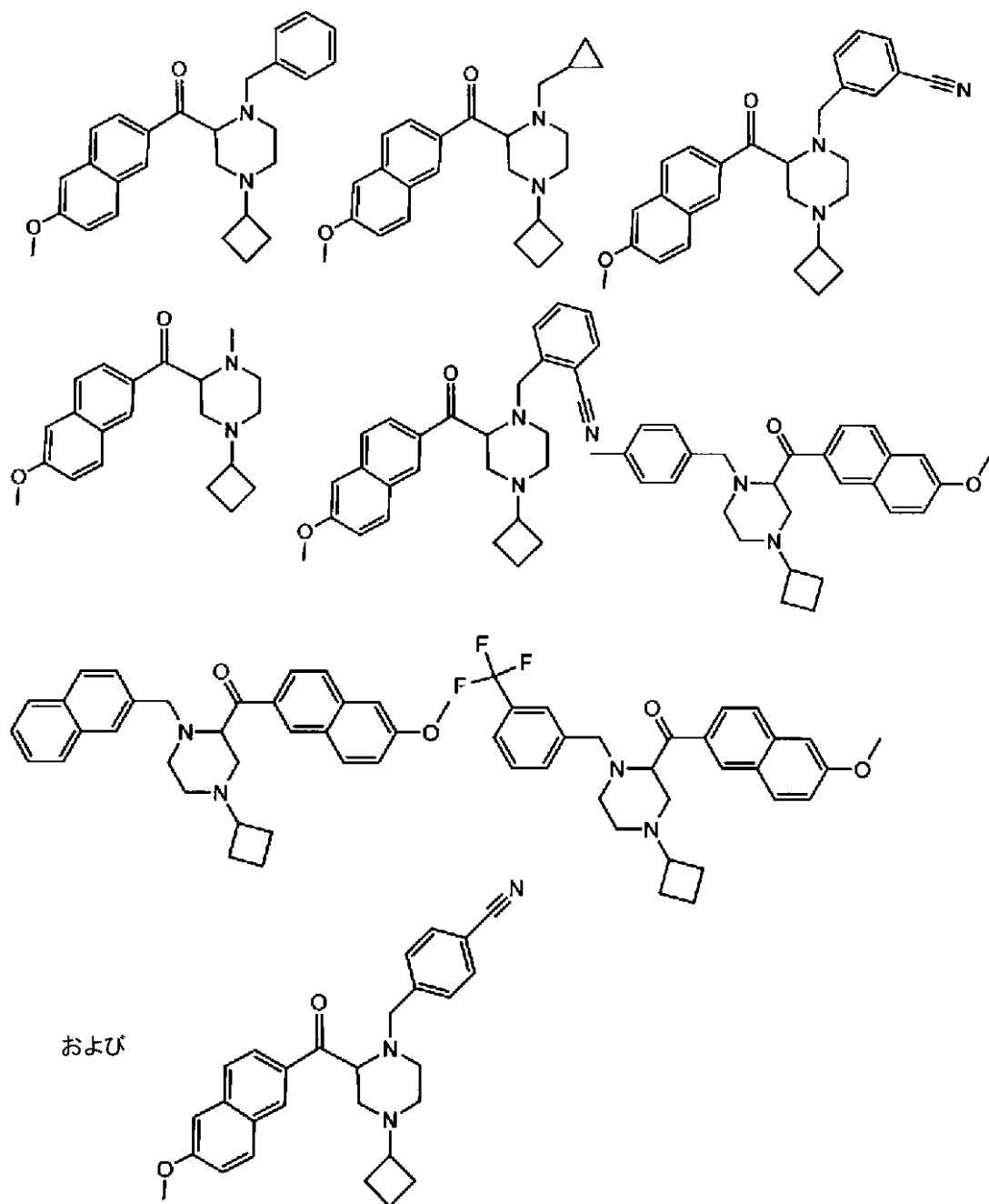
【化 2 1 4】



【化 2 1 5】



【化 2 1 6】



ならびにその塩

からなる群から選択される、化合物。

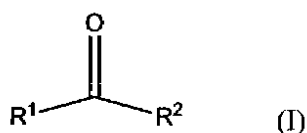
(項目 2 7)

項目 1 ～ 2 6 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩、および薬学的に許容され得るアジュバント、担体、またはビヒクルを含む組成物。

(項目 2 8)

癌の処置を必要とする哺乳動物において癌を処置する方法であって、有効量の項目 1 ～ 2 6 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその薬学的に許容され得る塩；または式 (I)：

【化 2 1 7】



(式中、

 R^1 は、

c) ピペリジン環窒素上で R^x 基で置換され、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{O}-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}-\text{R}^b$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^b$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{S}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、および $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^b$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的にさらに置換された炭素連結ピペリジン環であって；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{O}-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}-\text{R}^b$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^b$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{S}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペリジン環；または

d) $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{O}-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}-\text{R}^b$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^b$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{S}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、および $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^b$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で置換された炭素連結ピペラジン環であって；各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 8$ 炭素環、3～8員ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{O}-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}-\text{R}^b$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^b$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{C}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{S}(\text{O})-\text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^b)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^b)-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^b$ 、および $C_1 \sim 6$ アルキル（該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、炭素連結ピペラジン環；

であり、

各々の R^b は、水素、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、アリール、および $C_2 \sim 6$ アルキニルからなる群から独立して選択され、各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、アリール、および $C_2 \sim 6$ アルキニルは、ハロ、 $-\text{N}(\text{R}^c)_2$ 、 $-\text{CN}$ 、

$-C(O)-N(R^c)_2$ 、 $-S(O)-N(R^c)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^c)_2$ 、 $-O-R^c$ 、 $-S-R^c$ 、 $-O-C(O)-R^c$ 、 $-C(O)-R^c$ 、 $-C(O)-OR^c$ 、 $-S(O)-R^c$ 、 $-S(O)_2-R^c$ 、 $-N(R^c)-C(O)-R^c$ 、 $-N(R^c)-S(O)-R^c$ 、 $-N(R^c)-C(O)-N(R^c)_2$ 、および $-N(R^c)-S(O)_2-R^c$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2つの R^b が、それらが結合する窒素とともに、ピロリジノ環、ピペリジノ環、またはピペラジノ環を形成し；

各々の R^c は、水素、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、および $C_{2\sim6}$ アルキニルからなる群から独立して選択され、各々の $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、および $C_{2\sim6}$ アルキニルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、および $C_{1\sim6}$ アルコキシからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されるか；または、2つの R^c が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、および $C_{1\sim3}$ アルキル（該 $C_{1\sim3}$ アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

R^x は、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、 $C_{3\sim8}$ 炭素環、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、またはテトラヒドロピラニルであり、各々の $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、 $C_{3\sim8}$ 炭素環は、ハロ、 $-CN$ 、 $C_{1\sim3}$ アルコキシ、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、および $C_{3\sim8}$ 炭素環（該 $C_{3\sim8}$ 炭素環は、ハロおよび $C_{1\sim3}$ アルキルからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R^2 は5～10員ヘテロアリールまたは6～12員アリールであり、5～10員ヘテロアリール、および6～12員アリールは、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、ヘテロアリール、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、および $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；各々の $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^d)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)-N(R^d)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^d)_2$ 、 $-O-R^d$ 、 $-S-R^d$ 、 $-O-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-R^d$ 、 $-C(O)-OR^d$ 、 $-S(O)-R^d$ 、 $-S(O)_2-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-S(O)-R^d$ 、 $-N(R^d)-C(O)-N(R^d)_2$ 、 $-N(R^d)-S(O)_2-R^d$ 、および $C_{1\sim6}$ アルキル（該 $C_{1\sim6}$ アルキルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

各々の R^d は、水素、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、アリール、および $C_{2\sim6}$ アルキニルからなる群から独立して選択され、各々の $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、アリール、および $C_{2\sim6}$ アルキニルは、ハロ、 $-N(R^e)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^e)_2$ 、 $-S(O)-N(R^e)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^e)_2$ 、 $-O-R^e$ 、 $-S-R^e$ 、 $-O-C(O)-R^e$ 、 $-C(O)-R^e$ 、 $-C(O)-OR^e$ 、 $-S(O)-R^e$ 、 $-S(O)_2-R^e$ 、 $-N(R^e)-C(O)-R^e$ 、 $-N(R^e)-S(O)-R^e$ 、 $-N(R^e)-C(O)-N(R^e)_2$ 、および $-N(R^e)-S(O)_2-R^e$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2つの R^d が、それらが結合する窒素とともに、ピロリジノ環、ピペリジノ環、またはピペラジノ環を形成し；

各々の R^e は、水素、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、および $C_{2\sim6}$ ア

ルキニルからなる群から独立して選択され、各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、および $C_2 \sim 6$ アルキニルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、および $C_1 \sim 6$ アルコキシからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されるか；または、2 つの R^e が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、および $C_1 \sim 3$ アルキル（該 $C_1 \sim 3$ アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成する）の化合物もしくはその薬学的に許容され得る塩を前記哺乳動物に投与することを含む、方法。

（項目 2 9）

前記癌が癌幹細胞／前駆細胞を含む、項目 2 8 に記載の方法。

（項目 3 0）

癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の分化の誘導を必要とする哺乳動物において癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の分化を誘導する方法であって、有効量の項目 1 ～ 2 6 および項目 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を前記哺乳動物に投与することを含む、方法。

（項目 3 1）

癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の活性の低下を必要とする哺乳動物において癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の活性を低下させる方法であって、有効量の項目 1 ～ 2 6 および項目 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を前記哺乳動物に投与することを含む、方法。

（項目 3 2）

癌幹細胞／前駆細胞の枯渇を必要とする哺乳動物において癌幹細胞／前駆細胞を枯渇させる方法であって、有効量の項目 1 ～ 2 6 および項目 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を前記哺乳動物に投与することを含む、方法。

（項目 3 3）

癌発生の減少を必要とする哺乳動物において癌発生を減少させる方法であって、有効量の項目 1 ～ 2 6 および項目 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を前記哺乳動物に投与することを含む、方法。

（項目 3 4）

前記癌が、肺癌、白血病、またはリンパ腫である、項目 2 8 ～ 3 3 のいずれか 1 項に記載の方法。

（項目 3 5）

医学療法における使用のための、項目 1 ～ 2 6 および 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

（項目 3 6）

癌の治療的処置または予防的処置のための、項目 1 ～ 2 6 および 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

（項目 3 7）

前記癌が癌幹細胞／前駆細胞を含む、項目 3 6 に記載の化合物。

（項目 3 8）

癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の分化を誘導するための、項目 1 ～ 2 6 および 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

（項目 3 9）

癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の活性を低下させるための、項目 1 ～ 2 6 および 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

（項目 4 0）

癌幹細胞／前駆細胞を枯渇させるための、項目 1 ～ 2 6 および 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

（項目 4 1）

癌発生を減少させるための、項目 1 ～ 2 6 および 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物ま

たはその薬学的に許容され得る塩。

(項目 4 2)

前記癌が、肺癌、白血病、またはリンパ腫である、項目 3 6～4 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 4 3)

哺乳動物における癌を処置するための医薬を調製するための、項目 1～2 6 および項目 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

(項目 4 4)

前記癌が癌幹細胞／前駆細胞を含む、項目 4 3 に記載の使用。

(項目 4 5)

哺乳動物における癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の分化を誘導するための医薬を調製するための、項目 1～2 6 および項目 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

(項目 4 6)

哺乳動物における癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の活性を低下させるための医薬を調製するための、項目 1～2 6 および項目 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

(項目 4 7)

哺乳動物における癌幹細胞／前駆細胞を枯渇させるための医薬を調製するための、項目 1～2 6 および項目 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

(項目 4 8)

哺乳動物における癌発生を減少させるための医薬を調製するための、項目 1～2 6 および項目 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

(項目 4 9)

前記癌が、肺癌、白血病、またはリンパ腫である、項目 4 3～4 8 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 5 0)

癌の処置を必要とする個体において癌を処置する方法であって、有効量の K D M 2 インヒビターを前記個体に投与することを含む、方法。

(項目 5 1)

前記癌が癌幹細胞／前駆細胞を含む、項目 5 0 に記載の方法。

(項目 5 2)

前記 K D M 2 インヒビターが、前記個体において癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の分化を誘導し、癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の活性を低下させ、そして／または癌幹細胞／前駆細胞集団を枯渇させるのに有効である、項目 5 0 または 5 1 に記載の方法。

(項目 5 3)

前記 K D M 2 インヒビターが、前記個体における癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の N o t c h シグナル伝達を低下させるのに有効である、項目 5 0～5 2 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 5 4)

癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の分化の誘導を必要とする個体において癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の分化を誘導する方法であって、有効量の K D M 2 インヒビターを前記個体に投与することを含む、方法。

(項目 5 5)

癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の活性の低下を必要とする個体において癌幹細胞／前駆細胞（複数可）の活性を低下させる方法であって、有効量の K D M 2 インヒビターを前記個体に投与することを含む、方法。

(項目 5 6)

癌幹細胞／前駆細胞集団の枯渇を必要とする個体において癌幹細胞／前駆細胞集団を枯

喝させる方法であって、有効量の K D M 2 インヒビターを前記個体に投与することを含む、方法。

(項目 5 7)

癌発生の減少を必要とする個体において癌発生を減少させる方法であって、有効量の K D M 2 インヒビターを前記個体に投与することを含む、方法。

(項目 5 8)

前記癌が、肺癌、白血病（例えば、A M L、A L L、M L L）、またはリンパ腫である、項目 5 0 ～ 5 7 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 5 9)

前記インヒビターが K D M 2 B インヒビターである、項目 5 0 ～ 5 8 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 6 0)

前記 K D M 2 インヒビターが、K D M 2 に特異的に結合し、K D M 2 デメチラーゼ活性を阻害する、項目 5 0 ～ 5 9 のいずれか 1 項に記載の方法。