

【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25年2月14日 (2013.2.14)

【公表番号】特表2012-512891(P2012-512891A)

【公表日】平成24年6月7日 (2012.6.7)

【年通号数】公開・登録公報2012-022

【出願番号】特願2011-542439(P2011-542439)

【国際特許分類】

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 471/06 (2006.01)

C 0 7 D 473/00 (2006.01)

C 0 7 D 513/04 (2006.01)

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/4745 (2006.01)

A 6 1 K 31/52 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 417/14 C S P

C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z

C 0 7 D 487/04 1 4 3

C 0 7 D 471/06

C 0 7 D 473/00

C 0 7 D 513/04 3 3 1

C 0 7 D 495/04 1 0 5 Z

A 6 1 K 31/4725

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/4745

A 6 1 K 31/52

A 6 1 K 31/506

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 9/10

【手続補正書】

【提出日】平成24年12月17日(2012.12.17)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

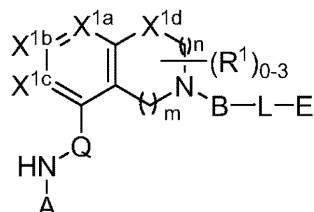
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物



又はその薬学的に許容可能な塩で、上式中、

Qは、 $-C(O)-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-CH(R^a)-$ 及び $-C(R^a)_2-$ からなる群から選択され、ここで $R^a$ は $C_{1-4}$ アルキル又は $C_{1-4}$ ハロアルキルであり；

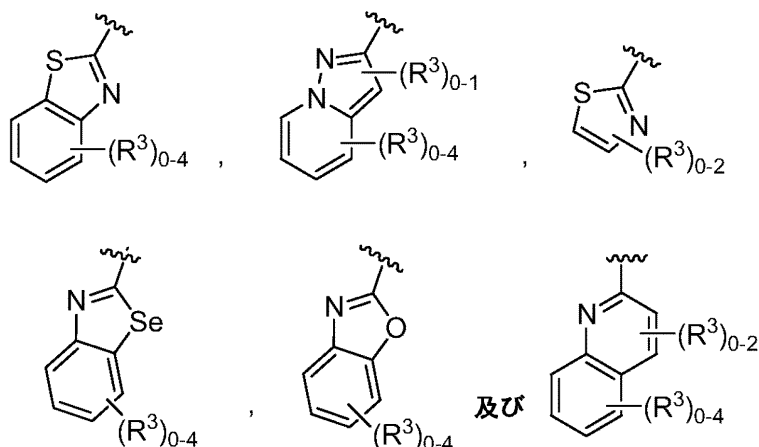
$R^1$ は、存在する場合、独立して、ハロゲン、 $=O$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ ヘテロアルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル及び $C_{1-6}$ ハロアルキルからなる群から選択され；

$X^{1a}$ 、 $X^{1b}$ 及び $X^{1c}$ は、それぞれ独立して、 $C(H)$ 、 $C(R^2)$ 及び $N$ からなる群から選択され、ここで $X^{1a}$ 、 $X^{1b}$ 及び $X^{1c}$ の少なくとも一つは $C(H)$ 又は $C(R^2)$ であり；ここで $R^2$ は独立して、 $-OR^b$ 、 $-NR^bR^c$ 、 $-SR^b$ 、 $-C(O)OR^c$ 、 $-C(O)NR^bR^c$ 、 $-NR^bC(O)R^d$ 、 $-S(O)_2R^d$ 、 $-S(O)R^d$ 、 $-S(O)_2NR^bR^c$ 、 $-R^d$ 、ハロゲン、 $-CN$ 及び $-NO_2$ からなる群から選択され、ここで $R^b$ 及び $R^c$ はそれぞれ独立して、水素、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{2-4}$ アルケニル、 $C_{2-4}$ アルキニル、 $C_{1-4}$ ハロアルキルからなる群から選択され、又は場合によっては $R^b$ 及び $R^c$ は、それぞれが結合する原子と共に、組み合わせられて環頂点として $N$ 、 $O$ 及び $S$ から選択される1から2のヘテロ原子を含む3員から7員の複素環を形成してもよく； $R^d$ は $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{2-4}$ アルケニル、 $C_{2-4}$ アルキニル及び $C_{1-4}$ ハロアルキルからなる群から選択され；

$X^{1d}$ は存在しないか又は $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-N(C_{1-4}アルキル)-$ 及び $-N(C(O)C_{1-4}アルキル)-$ からなる群から選択され；

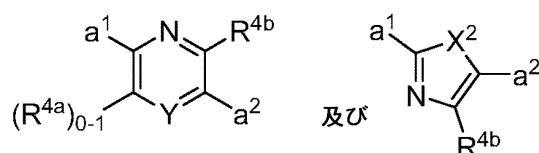
下付文字 $m$ は1から2の整数であり、下付文字 $n$ は1から3の整数であり；ここで $X^{1d}$ が存在するならば、下付文字 $n$ は2又は3であり；

Aは、

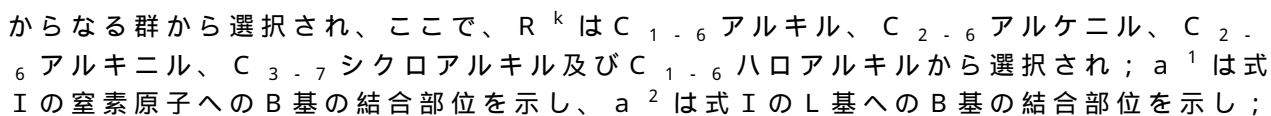


からなる群から選択されるメンバーであり、ここで、 $R^3$ は、存在する場合、独立して $-NR^eR^f$ 、 $-OR^e$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、ハロゲン、 $-C(O)OR^e$ 、 $-C(O)NR^eR^f$ 、 $-NR^eC(O)R^f$ 、 $-NR^eS(O)_2R^g$ 、 $-NR^eS(O)R^g$ 、 $-S(O)_2R^g$ 、 $-S(O)R^g$ 及び $-R^g$ からなる群から選択され、ここで $R^e$ 及び $R^f$ はそれぞれの場合において、それぞれ独立して、水素、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{2-4}$ アルケニル、 $C_{2-4}$ アルキニル、 $C_{1-4}$ ハロアルキル及び $-(CH_2)_{1-4}$ フェニルからなる群から選択され、又は $R^e$ 及び $R^f$ 、又は $R^e$ 及び $R^g$ は、それらがそれぞれ結合する原子と共に、場合によっては組み合わされて環頂点としてN、O及びSから選択される1から2のヘテロ原子を含む3員から7員の複素環を形成してもよく；及び $R^g$ は $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{2-4}$ アルケニル、 $C_{2-4}$ アルキニル及び $C_{1-4}$ ハロアルキルからなる群から選択され；

Bは、



からなる群から選択されるメンバーであり、ここで、YはN、 $C(H)$ 又は $C(R^{4a})$ であり； $X^2$ は $-N(H)-$ 、 $-N(C_{1-3}\text{アルキル})-$ 、O又はSであり； $R^{4a}$ は、存在する場合、独立して $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ ハロアルキル、 $C_{2-4}$ アルケニル、 $C_{2-4}$ アルキニル、ハロゲン及び $-CN$ からなる群から選択され； $R^{4b}$ は独立して $-C(O)OR^j$ 、 $-C(O)NR^hR^i$ 、 $-C(O)R^i$ 、 $-NR^hC(O)R^i$ 、 $-NR^hC(O)NR^hR^i$ 、 $-OC(O)NR^hR^i$ 、 $-NR^hC(O)OR^j$ 、 $-C(=NOR^h)NR^hR^i$ 、 $-NR^hC(=NCN)NR^hR^i$ 、 $-NR^hS(O)_2NR^hR^i$ 、 $-S(O)_2R^j$ 、 $-S(O)_2NR^hR^i$ 、 $-N(R^h)S(O)_2R^i$ 、 $-NR^hC(=NR^i)NR^hR^i$ 、 $-C(=S)NR^hR^i$ 、 $-C(=NR^h)NR^hR^i$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、及び $-CN$ からなる群から選択され、ここで $R^h$ 及び $R^i$ はそれぞれの場合において、それぞれ独立して水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、フェニル及び $-(CH_2)_{1-4}$ フェニルからなる群から選択され； $R^j$ は $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $C_{3-7}$ シクロアルキル、フェニル及び $-(CH_2)_{1-4}$ フェニルからなる群から選択され； $R^h$ 及び $R^i$ 、又は $R^h$ 及び $R^j$ は、それぞれが結合する原子と共に、場合によっては組み合わされて環頂点としてN、O及びSから選択される1から2のヘテロ原子を含む3員から7員の複素環を形成してもよく；又はその代わりに、 $R^{4b}$ は、

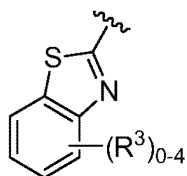


E は水素又はハロゲンであり；又はその代わりに E はフェニル、C<sub>5-6</sub> ヘテロアリール、C<sub>3-7</sub> ヘテロシクロアルキル及び C<sub>3-7</sub> シクロアルキルからなる群から選択され、E に縮合していてもよいものは、3 員から 7 員の炭素環、3 員から 7 員の複素環、ベンゼン環及び 5 員から 6 員の芳香族複素環からなる群から独立して選択される 1 又は 2 の環であり、ここで E 及び E と縮合していてもよい各環は、ハロゲン、-NR<sup>p</sup>R<sup>q</sup>、-SR<sup>p</sup>、-OR<sup>p</sup>、-C(O)OR<sup>p</sup>、-C(O)NR<sup>p</sup>R<sup>q</sup>、-C(O)R<sup>p</sup>、-NR<sup>p</sup>C(O)R<sup>q</sup>、-OC(O)R<sup>r</sup>、-NR<sup>p</sup>C(O)NR<sup>p</sup>R<sup>q</sup>、-OC(O)NR<sup>p</sup>R<sup>q</sup>、-NR<sup>p</sup>C(O)OR<sup>r</sup>、-C

(=NOR<sup>P</sup>)NR<sup>P</sup>R<sup>Q</sup>、-NR<sup>P</sup>C(=N-CN)NR<sup>P</sup>R<sup>Q</sup>、-NR<sup>P</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>P</sup>R<sup>Q</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>r</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>P</sup>R<sup>Q</sup>、-R<sup>r</sup>、-R<sup>s</sup>、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、=O、-CN、-Z<sup>1</sup>-NR<sup>P</sup>R<sup>Q</sup>、-Z<sup>1</sup>-SR<sup>P</sup>、-Z<sup>1</sup>-OR<sup>P</sup>、-Z<sup>1</sup>-C(O)OR<sup>P</sup>、-Z<sup>1</sup>-C(O)NR<sup>P</sup>R<sup>Q</sup>、-Z<sup>1</sup>-C(O)R<sup>P</sup>、-Z<sup>1</sup>-NR<sup>P</sup>C(O)R<sup>Q</sup>、-Z<sup>1</sup>-OC(O)R<sup>r</sup>、-Z<sup>1</sup>-NR<sup>P</sup>C(O)NR<sup>P</sup>R<sup>Q</sup>、-Z<sup>1</sup>-OC(O)NR<sup>P</sup>R<sup>Q</sup>、-Z<sup>1</sup>-NR<sup>P</sup>C(O)OR<sup>r</sup>、-Z<sup>1</sup>-C(=NOR<sup>P</sup>)NR<sup>P</sup>R<sup>Q</sup>、-Z<sup>1</sup>-NR<sup>P</sup>C(=N-CN)NR<sup>P</sup>R<sup>Q</sup>、-Z<sup>1</sup>-NR<sup>P</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>P</sup>R<sup>Q</sup>、-Z<sup>1</sup>-S(O)<sub>2</sub>R<sup>r</sup>、-Z<sup>1</sup>-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>P</sup>R<sup>Q</sup>、-Z<sup>1</sup>-NO<sub>2</sub>、-Z<sup>1</sup>-N<sub>3</sub>、-Z<sup>1</sup>-R<sup>s</sup>及び-Z<sup>1</sup>-CNからなる群から選択される0から5のR<sup>6</sup>置換基で独立して置換され；ここでZ<sup>1</sup>はC<sub>1-6</sub>アルキレン、C<sub>2-6</sub>アルケニレン、C<sub>2-6</sub>アルキニレン、C<sub>1-6</sub>ヘテロアルキレン、C<sub>3-7</sub>ヘテロシクロアルキル及びC<sub>3-7</sub>シクロアルキルからなる群から選択され；R<sup>P</sup>及びR<sup>Q</sup>はそれぞれ独立して水素、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、C<sub>2-6</sub>アルケニル、C<sub>2-6</sub>アルキニル、C<sub>3-7</sub>シクロアルキル、C<sub>3-7</sub>ヘテロシクロアルキル、フェニル及び-(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>-フェニルからなる群から選択され；R<sup>r</sup>はC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、C<sub>2-6</sub>アルケニル、C<sub>2-6</sub>アルキニル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキル、C<sub>3-10</sub>ヘテロシクロアルキル、フェニル及び-(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>-フェニルからなる群から選択され；場合によっては各R<sup>6</sup>中で、置換基R<sup>P</sup>及びR<sup>Q</sup>又はR<sup>P</sup>及びR<sup>r</sup>は、それぞれが結合する原子と共に、場合によっては組み合わされて、環頂点としてN、O及びSから選択される1から2のヘテロ原子を含んでいてもよい3員から7員の複素環を形成してもよく；R<sup>s</sup>はフェニル、C<sub>5-6</sub>ヘテロアリール、C<sub>3-7</sub>ヘテロシクロアルキル、C<sub>3-7</sub>シクロアルキルからなる群から選択され、場合によっては、5員から7員の炭素環、5員から7員の複素環、ベンゼン環及び5員から6員の芳香族複素環からなる群からそれぞれ独立して選択される1又は2の環がR<sup>s</sup>と縮合してよく、ここでR<sup>s</sup>及びR<sup>s</sup>と縮合していてもよい各環は、ハロゲン、-NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup>、-SR<sup>t</sup>、-OR<sup>t</sup>、-C(O)OR<sup>t</sup>、-C(O)NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup>、-C(O)R<sup>t</sup>、-NR<sup>t</sup>C(O)R<sup>v</sup>、-OC(O)R<sup>v</sup>、-NR<sup>t</sup>C(O)NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup>、-OC(O)NR<sup>t</sup>R<sup>r</sup>、-NR<sup>t</sup>C(O)OR<sup>v</sup>、-C(=NOR<sup>t</sup>)NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup>、-NR<sup>t</sup>C(=N-CN)NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup>、-NR<sup>t</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>v</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup>、-R<sup>v</sup>、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、=O、-CN、-Z<sup>2</sup>-NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup>、-Z<sup>2</sup>-SR<sup>t</sup>、-Z<sup>2</sup>-OR<sup>t</sup>、-Z<sup>2</sup>-C(O)OR<sup>t</sup>、-Z<sup>2</sup>-C(O)NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup>、-Z<sup>2</sup>-C(O)R<sup>v</sup>、-Z<sup>2</sup>-NR<sup>t</sup>C(O)R<sup>u</sup>、-Z<sup>2</sup>-OC(O)R<sup>v</sup>、-Z<sup>2</sup>-NR<sup>t</sup>C(O)NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup>、-Z<sup>2</sup>-OC(O)NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup>、-Z<sup>2</sup>-NR<sup>t</sup>C(O)OR<sup>v</sup>、-Z<sup>2</sup>-C(=NOR<sup>t</sup>)NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup>、-Z<sup>2</sup>-NR<sup>t</sup>C(=N-CN)NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup>、-Z<sup>2</sup>-NR<sup>t</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup>、-Z<sup>2</sup>-S(O)<sub>2</sub>R<sup>v</sup>、-Z<sup>2</sup>-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup>、-Z<sup>2</sup>-NO<sub>2</sub>、-Z<sup>2</sup>-N<sub>3</sub>及び-Z<sup>2</sup>-CNからなる群から選択される0から5のR<sup>7</sup>置換基でそれぞれ独立して置換され；ここでZ<sup>2</sup>はC<sub>1-6</sub>アルキレン、C<sub>2-6</sub>アルケニレン、C<sub>2-6</sub>アルキニレン、C<sub>1-6</sub>ヘテロアルキレンからなる群から選択され、R<sup>t</sup>及びR<sup>u</sup>は水素、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、C<sub>2-6</sub>アルケニル、C<sub>2-6</sub>アルキニル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>-フェニル、C<sub>3-7</sub>シクロアルキル及びC<sub>3-7</sub>ヘテロシクロアルキルからなる群からそれぞれ独立して選択され；R<sup>v</sup>はC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>ハロアルキル、C<sub>2-6</sub>アルケニル、C<sub>2-6</sub>アルキニル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>-フェニル、C<sub>3-7</sub>シクロアルキル及びC<sub>3-7</sub>ヘテロシクロアルキルから選択され；及び各R<sup>7</sup>置換基中で、R<sup>t</sup>及びR<sup>u</sup>又はR<sup>t</sup>及びR<sup>v</sup>は、それぞれが結合する原子と共に、場合によっては組み合わされて、環頂点としてN、O及びSから選択される1から2のヘテロ原子を持つ3員から7員の複素環を形成する、化合物。

【請求項2】

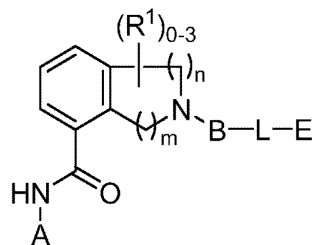
Aが、



である請求項 1 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 3】

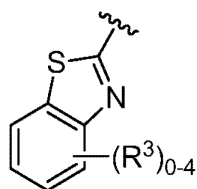
化合物が式



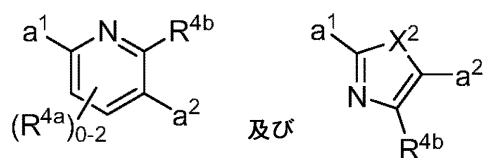
**I-a**

[ 上式中、 $R^1$  はハロゲン、 $C_1 - 6$  アルキル、 $C_1 - 6$  ヘテロアルキル又は=Oであり；

下付文字  $n$  は整数 2 又は 3 であり；及び下付文字  $m$  は 1 から 2 の整数であり、  
A は、

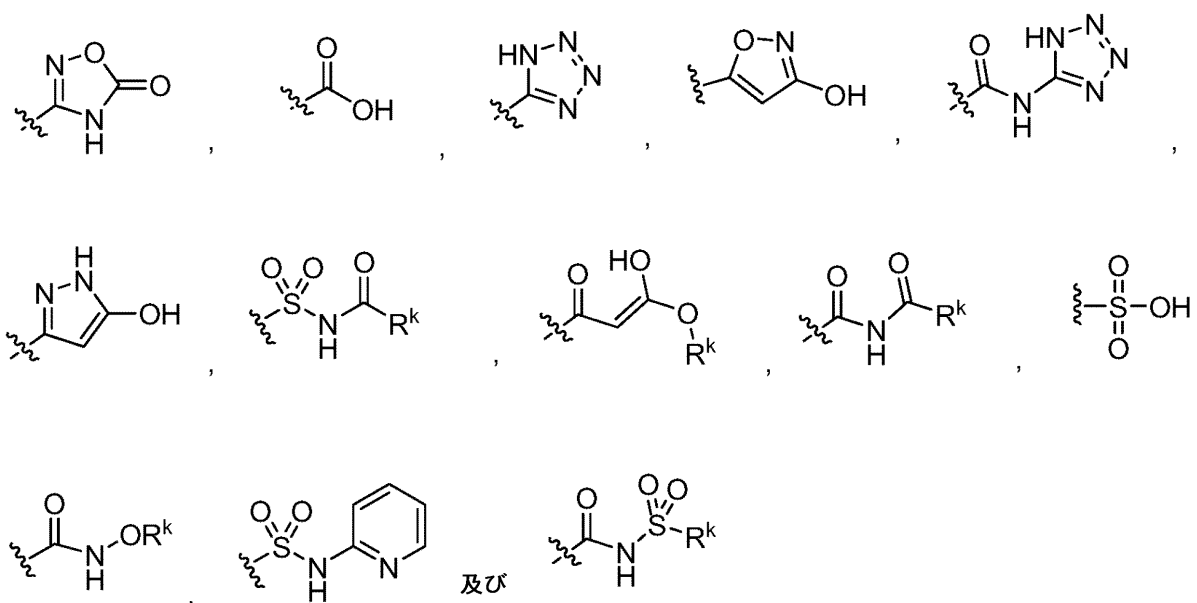


であり、B は、



からなる群から選択されるメンバーであり、

ここで、 $R^{4b}$  は、

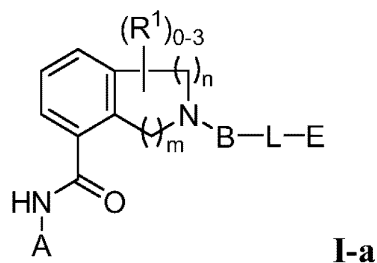


からなる群から選択される]

のものである請求項 1 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4】

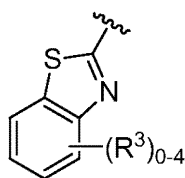
化合物が、式



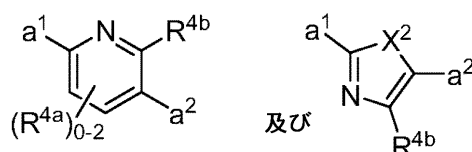
[ 上式中、 $R^1$  はハロゲン、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  ヘテロアルキル又は=O であり；

下付文字 n は 2 から 3 の整数であり；及び下付文字 m は 1 から 2 の整数であり；

A は、



であり、B は、



からなる群から選択されるメンバーであり、ここで、 $R^{4b}$  は  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^j$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^h\text{R}^i$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^i$ 、 $-\text{NR}^h\text{C}(\text{O})\text{R}^i$ 、 $-\text{NR}^h\text{C}(\text{O})\text{NR}^h\text{R}^i$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^h\text{R}^i$ 、 $-\text{NR}^h\text{C}(\text{O})\text{OR}^j$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^h)\text{NR}^h\text{R}^i$ 、 $-\text{NR}^h\text{C}(=\text{NCN})\text{NR}^h\text{R}^i$ 、 $-\text{NR}^h\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^h\text{R}^i$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^j$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^h\text{R}^i$ 、 $-\text{N}(\text{R}^h)\text{S}(\text{O})_2\text{R}^i$ 、 $-\text{NR}^h\text{C}(=\text{NR}^i)\text{NR}^h\text{R}^i$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{NR}^h\text{R}^i$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^h)\text{NR}^h\text{R}^i$ 、 $-\text{R}^j$ 、ハロゲン、 $-\text{NO}_2$ 、及び  $-\text{CN}$  からなる群から選択される]

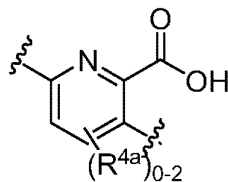
のものである請求項 1 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5】

下付文字 n が 2 であり、下付文字 m が 1 である請求項 3 又は 4 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6】

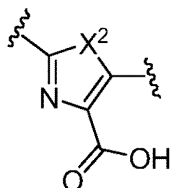
R<sup>1</sup> が存在せず；B が、



[ 上式中、R<sup>4a</sup> は、存在する場合ハロゲン及び C<sub>1</sub> - 4 アルキルから選択され；ここで下付文字 n は 2 であり、下付文字 m は 1 である ]  
である請求項 3 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 7】

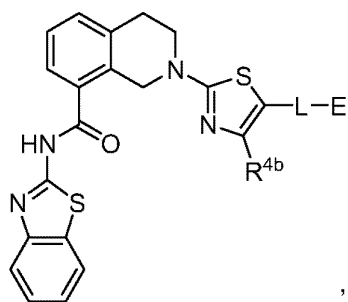
R<sup>1</sup> が存在せず；及び B が



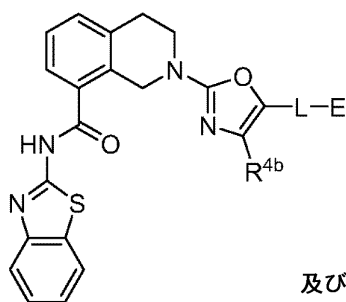
[ 上式中、下付文字 n は 2 であり、下付文字 m は 1 である ]  
である請求項 3 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 8】

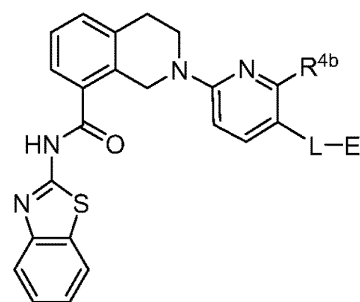
化合物が、



II-a



II-b



II-c

から選択される式のものである請求項 1、3 又は 4 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

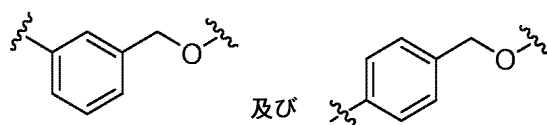
【請求項 9】

L が存在しないか又は置換されていてもよい C<sub>6</sub> - 10 アリーレン - C<sub>1</sub> - 6 ヘテロアルキレン及び C<sub>5</sub> - 9 ヘテロアリーレン - C<sub>1</sub> - 6 ヘテロアルキレンからなる群から選択される置換されていてもよい基である請求項 3 又は 4 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 10】

L が





からなる群から選択される請求項 9 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 1】

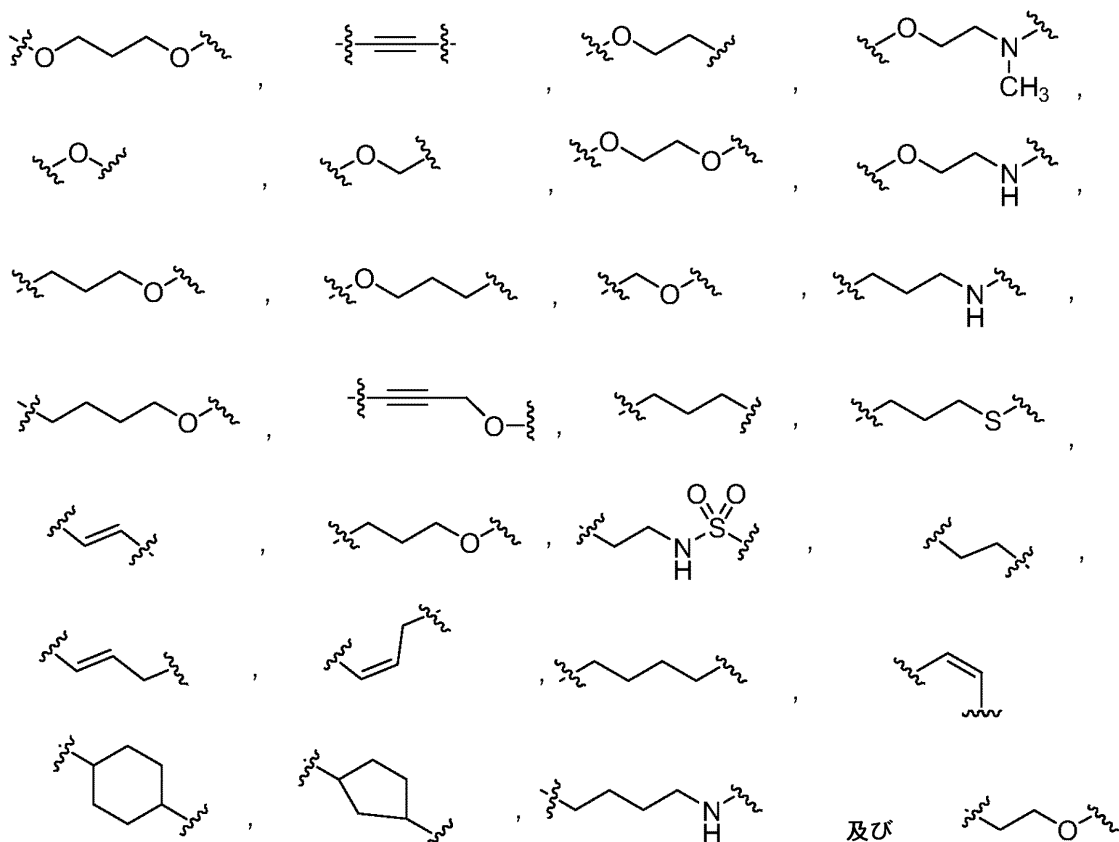
L が、置換されていてもよい C<sub>1</sub> - 6 ヘテロアルキレン、C<sub>1</sub> - 6 アルキレン、C<sub>2</sub> - 6 アルケニレン及び C<sub>2</sub> - 6 アルキニレンからなる群から選択される置換されていてもよい基である請求項 3 又は 4 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 2】

L が置換されていてもよい C<sub>1</sub> - 4 アルキレンオキシ、C<sub>2</sub> - 4 アルケニレンオキシ、C<sub>2</sub> - 4 アルキニレンオキシ及び C<sub>1</sub> - 4 アルキレンからなる群から選択され、ここで L が 0 から 4 の R<sup>m</sup> 基で置換され、ここで L の同一の又は異なった原子上に位置する何れか 2 つの R<sup>m</sup> 基は、場合によっては組み合わせられて、5 員から 7 員の炭素環又は環頂点として N、O 及び S から選択される 1 から 2 のヘテロ原子を含む 5 員から 7 員の複素環を形成してもよい請求項 1 1 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 3】

L が、



からなる群から選択される請求項 1 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 4】

E が水素である請求項 3 又は 4 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 5】

E が、フェニル、C<sub>5</sub> - 6 ヘテロアリール及び C<sub>3</sub> - 7 ヘテロシクロアルキルからなる群から選択され、場合によっては、5 員から 7 員の炭素環、5 員から 7 員の複素環、ベンゼン環及び 5 員から 6 員のヘテロ芳香環からなる群から独立して選択される環が E に縮合してもよく、ここで E 及びそこへ縮合してもよい環は共に、全体で 1 から 3 の R<sup>6</sup> 置換基

で置換され、ここで一つの  $R^6$  置換基が  $-NR^pR^q$ 、 $-Z^1-NR^pR^q$ 、 $-R^s$ 、又は  $-Z^1-R^s$  である請求項 3 又は 4 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 16】

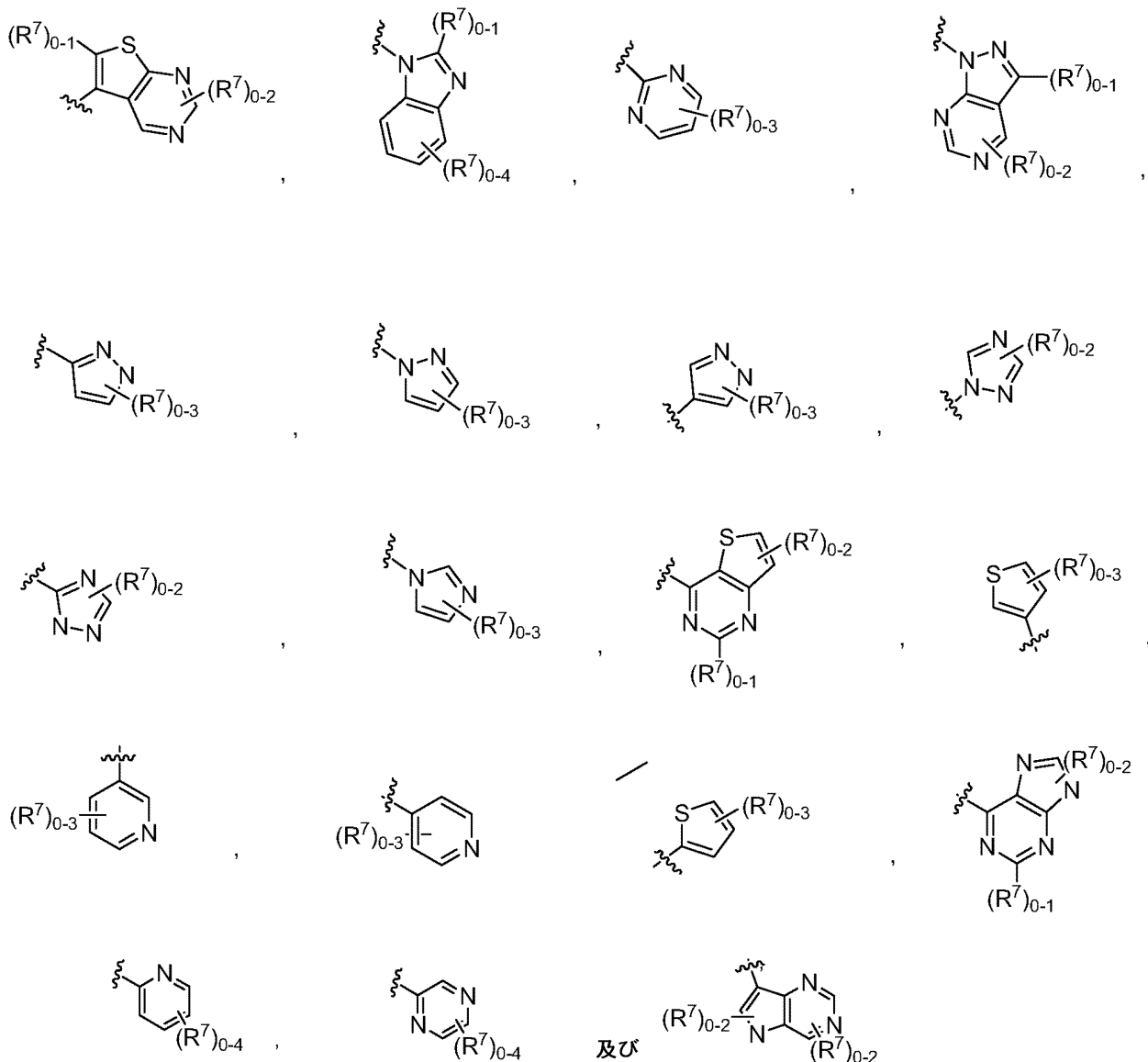
前記一つの  $R^6$  置換基が  $-NR^pR^q$  又は  $-Z^1-NR^pR^q$  である請求項 15 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 17】

1 又は 2 の  $R^6$  置換基がフッ素又は塩素からなる群から選択される請求項 16 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 18】

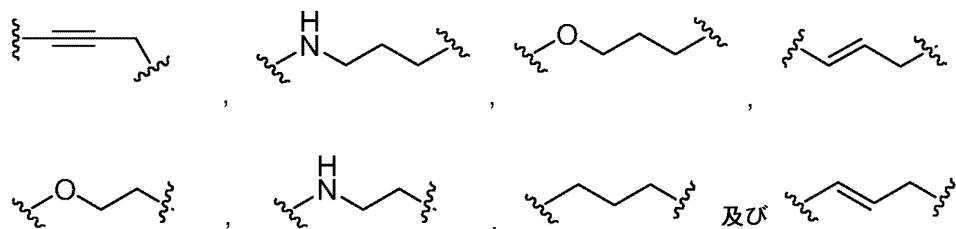
前記一つの  $R^6$  置換基が  $R^s$  又は  $-Z^1-R^s$  であり、ここで  $R^s$  が



からなる群から選択される式のものである請求項 15 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 19】

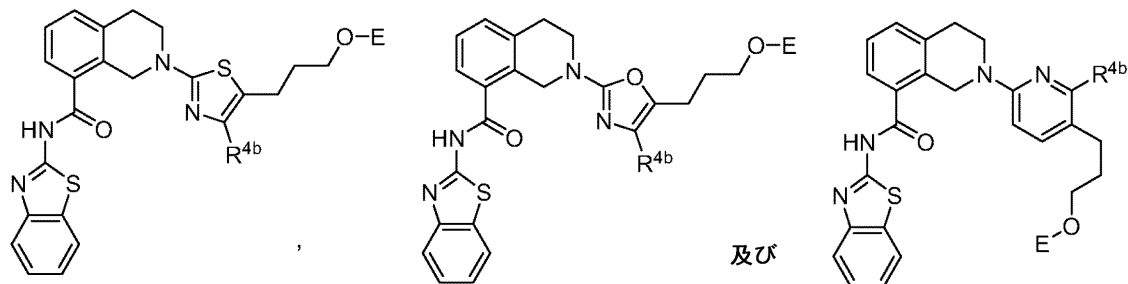
$Z^1$  が、



からなる群から選択される請求項 1 5 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 0】

化合物が、

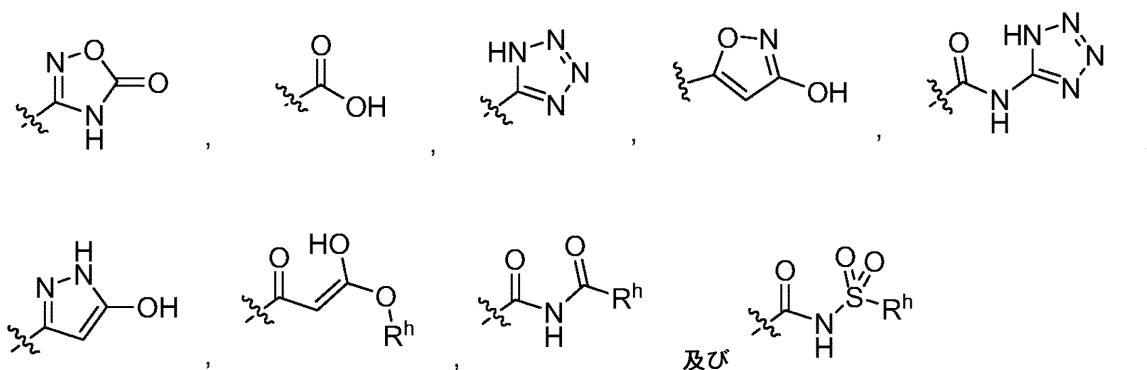


III-a

III-b

III-c

[ 上式中、 $R^{4b}$  は、



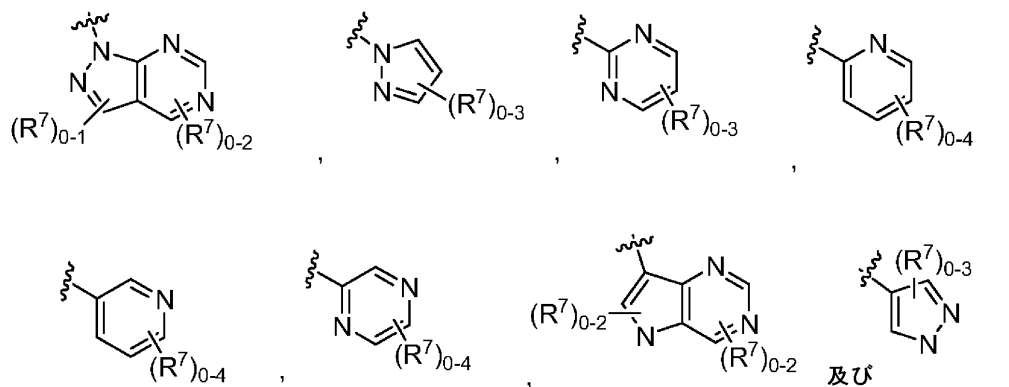
からなる群から選択され、E はフェニルであり、1 から 3 の  $R^6$  置換基で置換される ] からなる群から選択される式のものである請求項 5 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 1】

$R^{4b}$  が  $-C(O)OH$  である請求項 2 0 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 2】

E が -フェニルであり、ここで、該フェニル基は、



からなる群から選択される式のものである置換されていてもよい  $R^5$  基でメタ又はパラ位で置換されていてもよい請求項 3 又は 4 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 3】

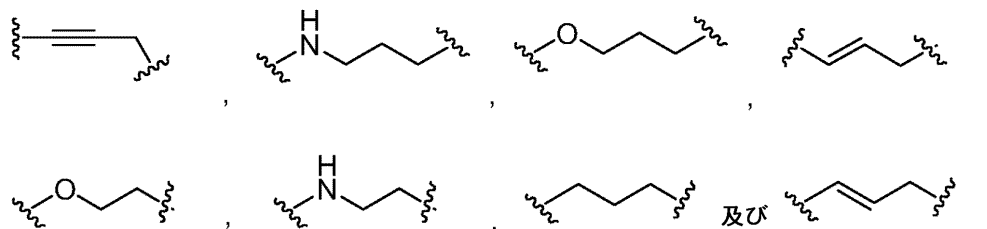
少なくとも一つの  $R^7$  が、存在する場合、 $-NR^tR^u$  及び  $-Z^2-NR^tR^u$  からなる群から選択される請求項 2 2 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 4】

$Z^2$  が  $C_{1-4}$  アルキレン、 $C_{2-4}$  アルケニレン、 $C_{2-4}$  アルキニレン及び  $C_{1-4}$  ヘテロアルキレンから選択される請求項 2 3 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 5】

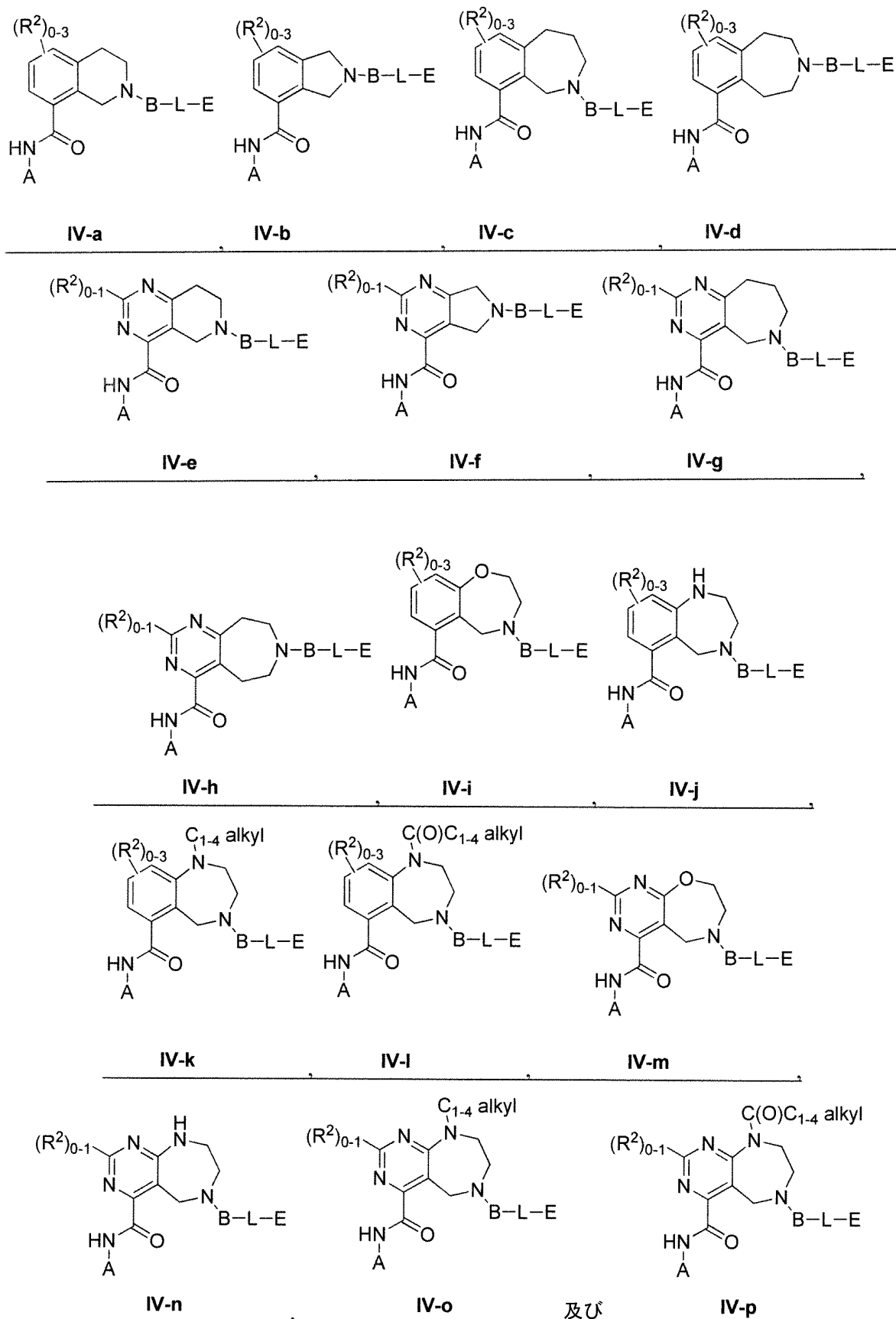
$Z^2$  が、



からなる群から選択される請求項 2 4 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 6】

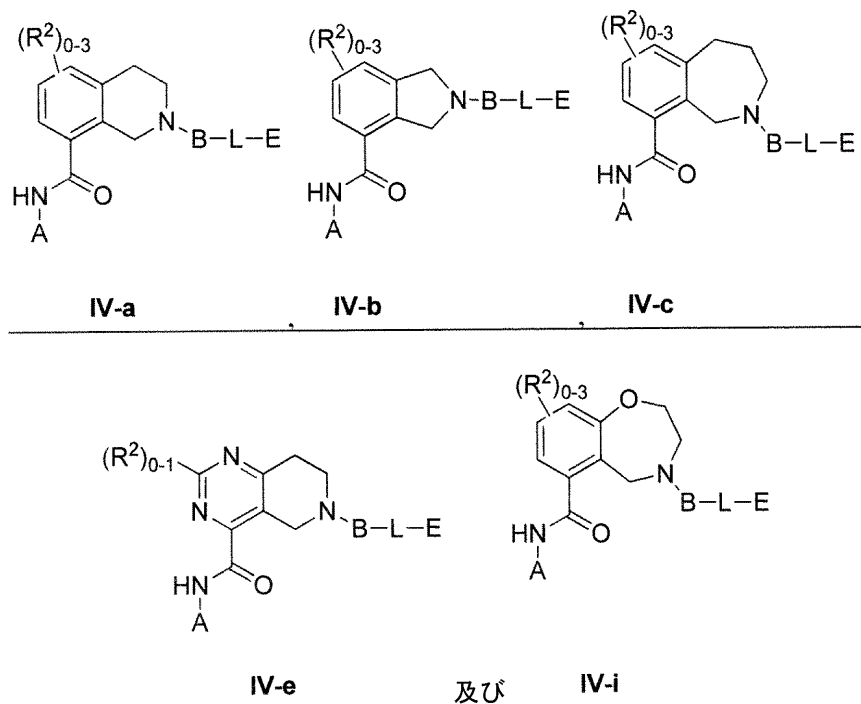
前記化合物が、



からなる群から選択される請求項 1 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 27】

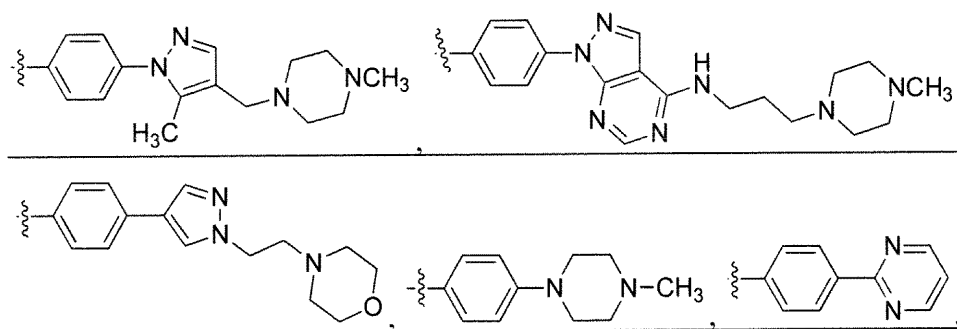
前記化合物が、

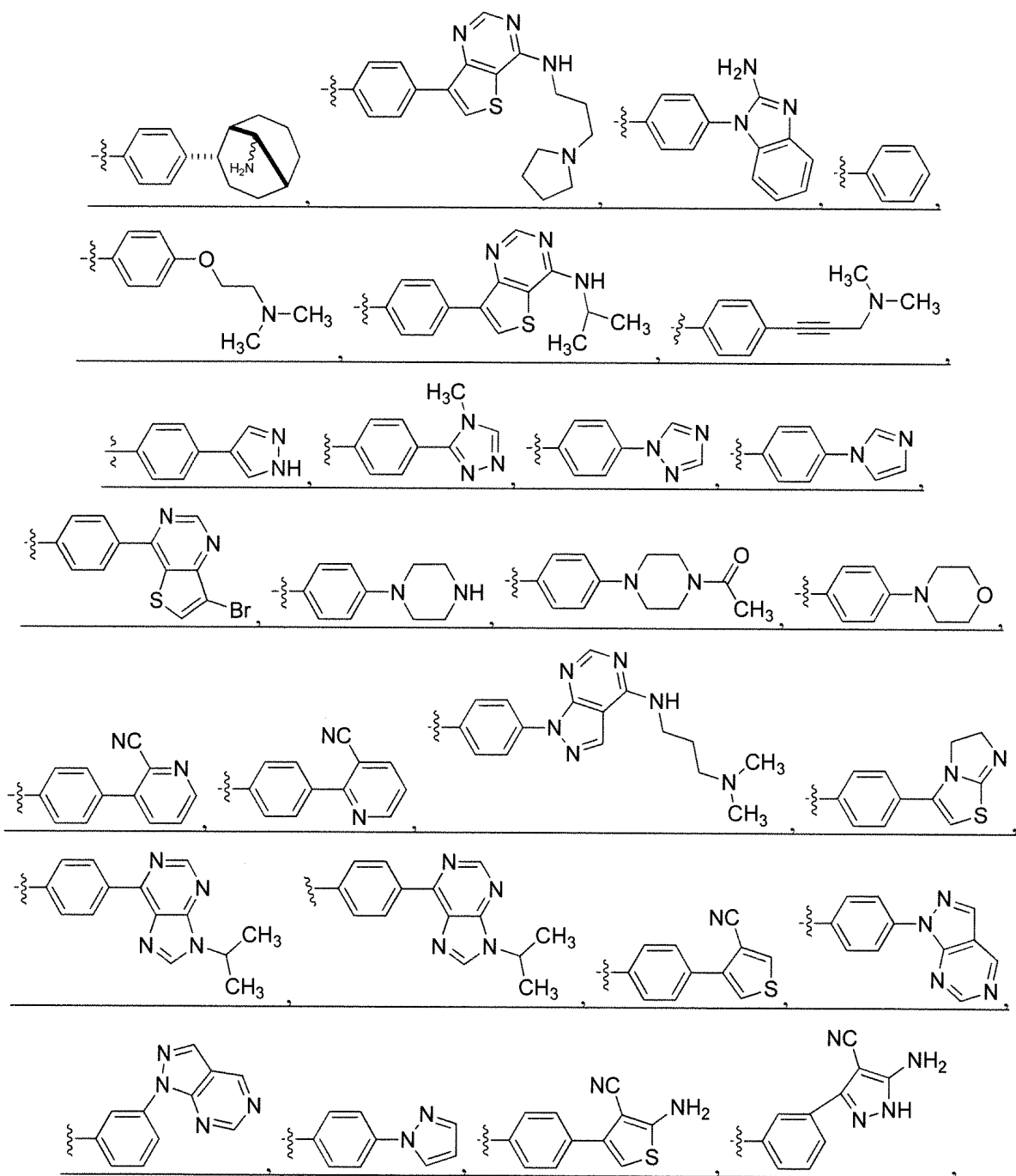


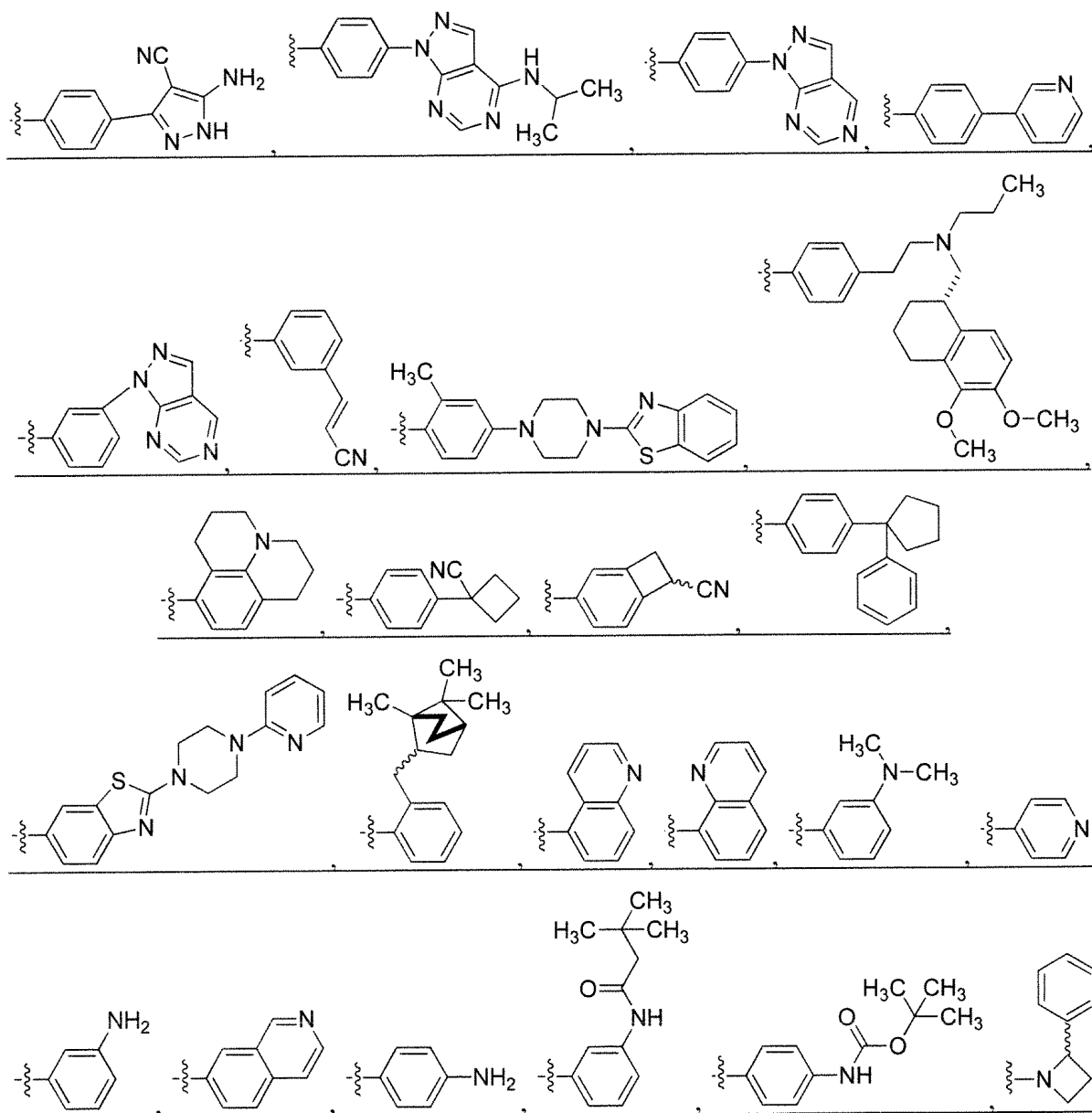
からなる群から選択される請求項 1 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 28】

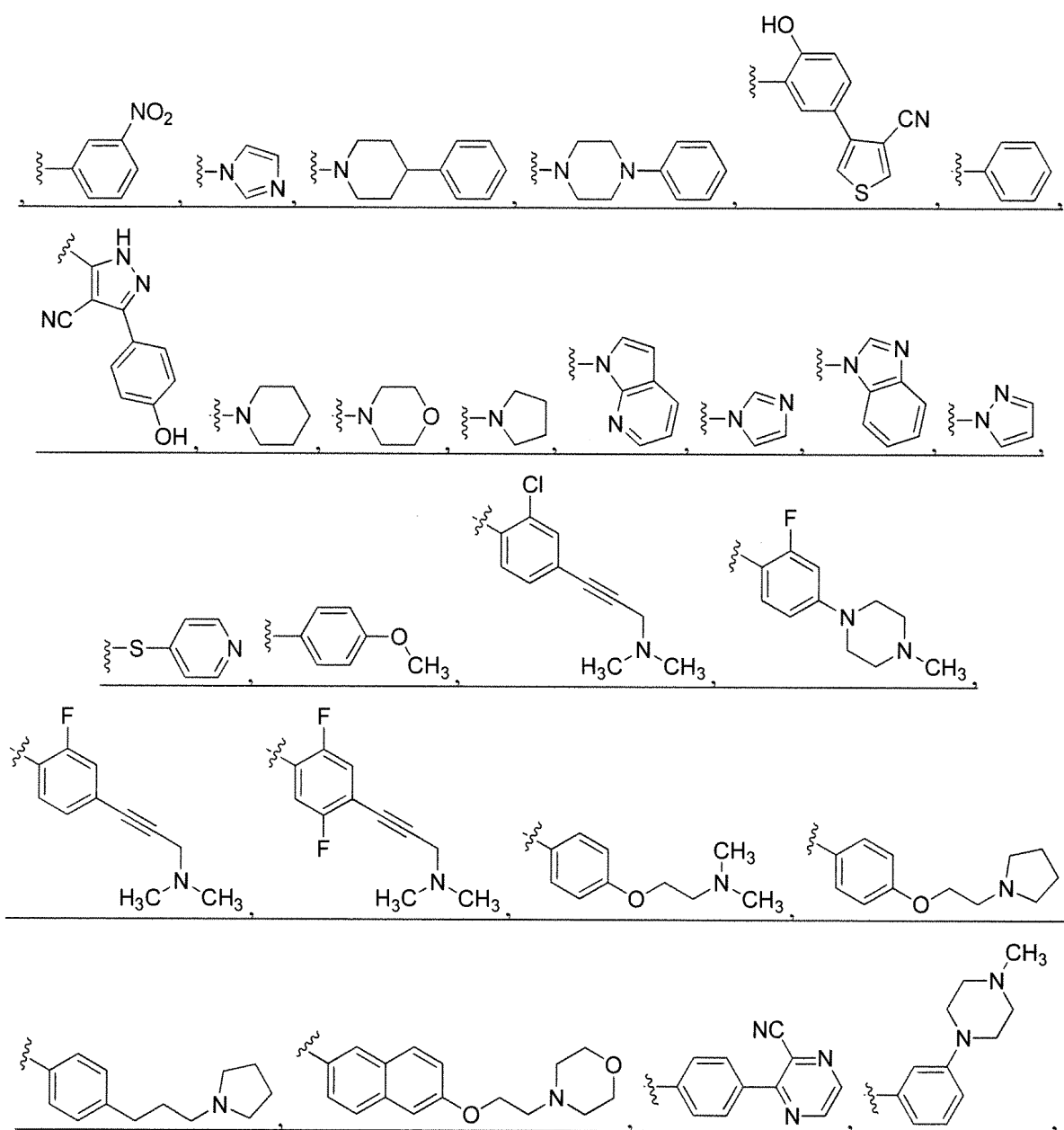
E が、





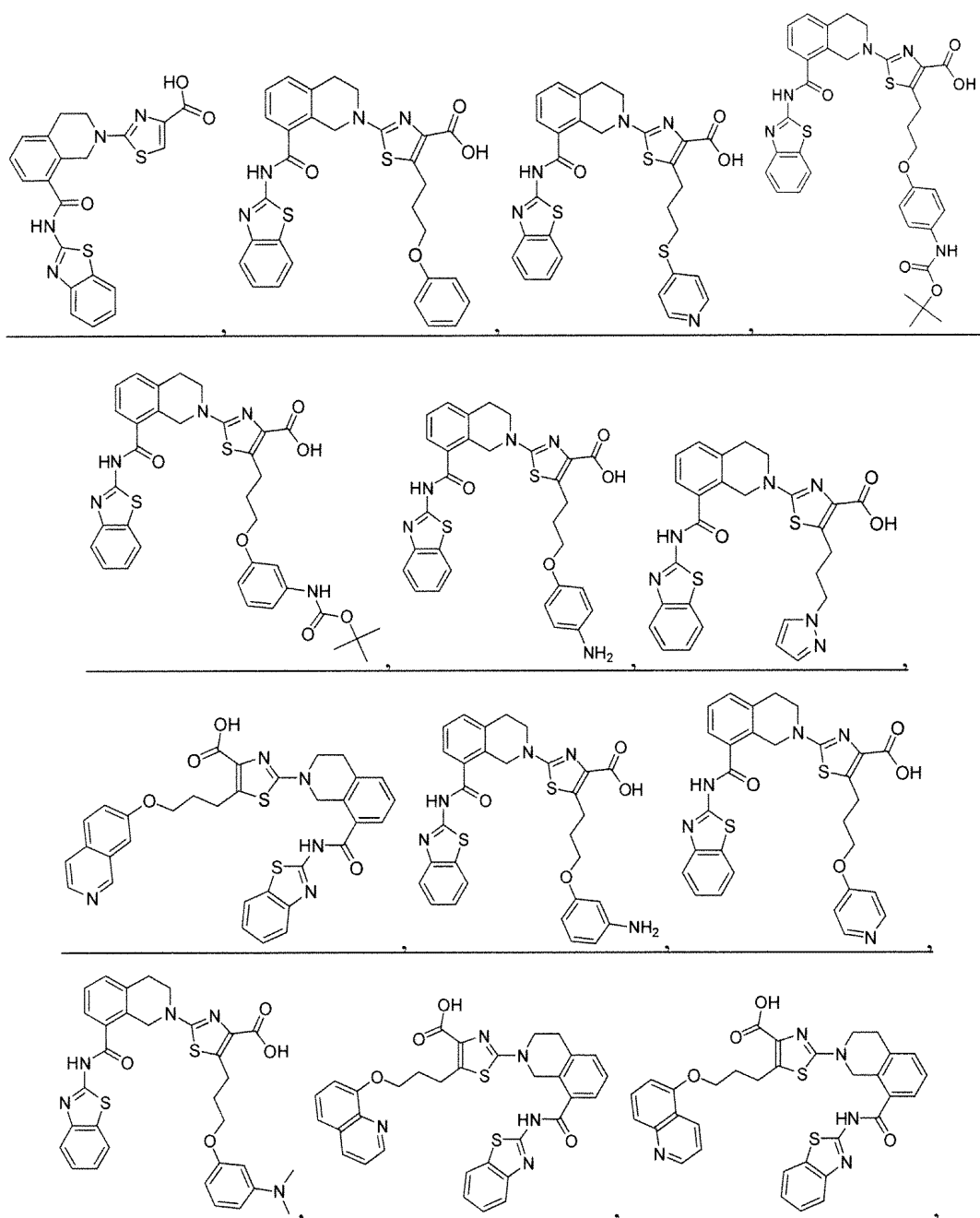


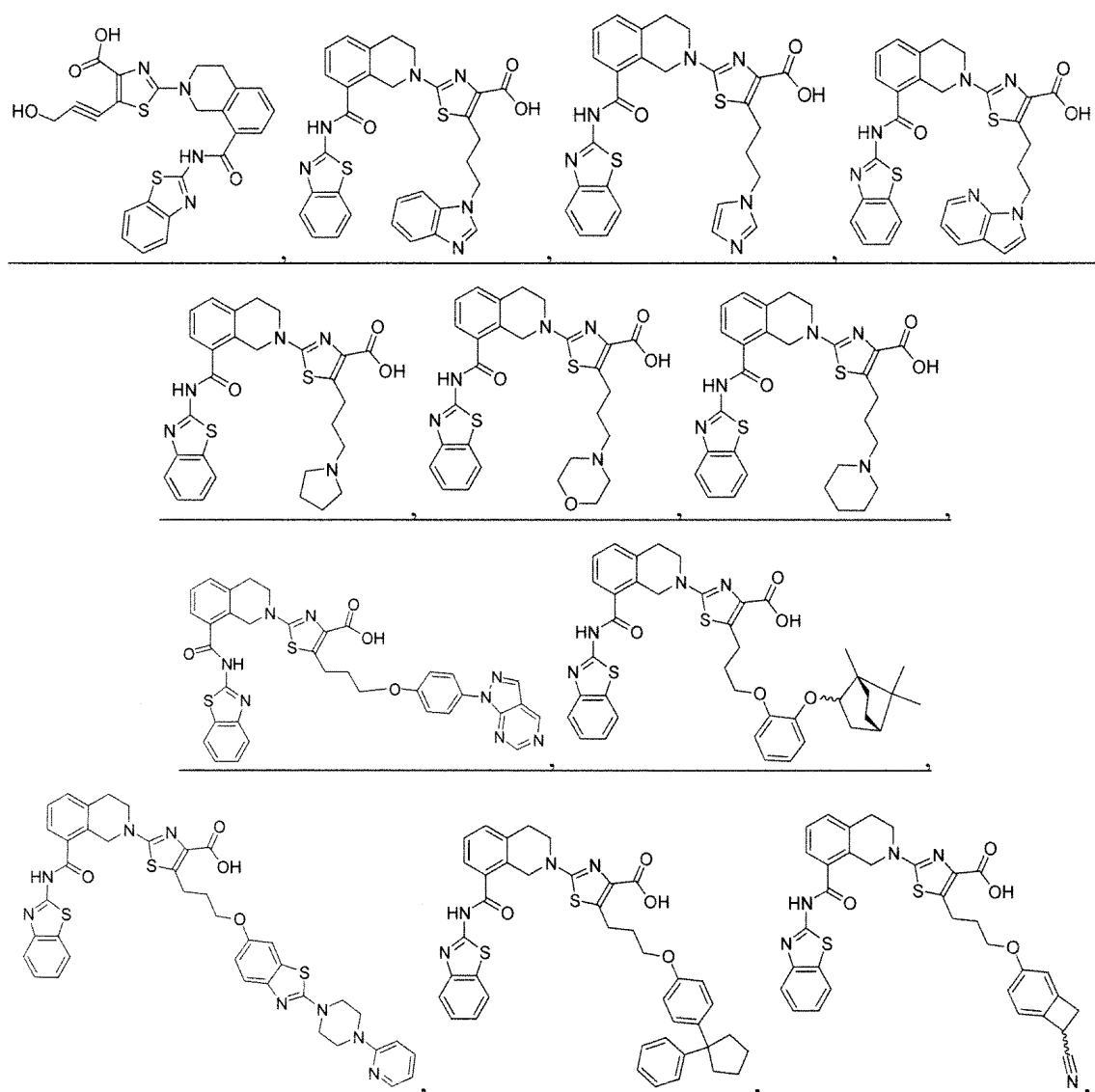


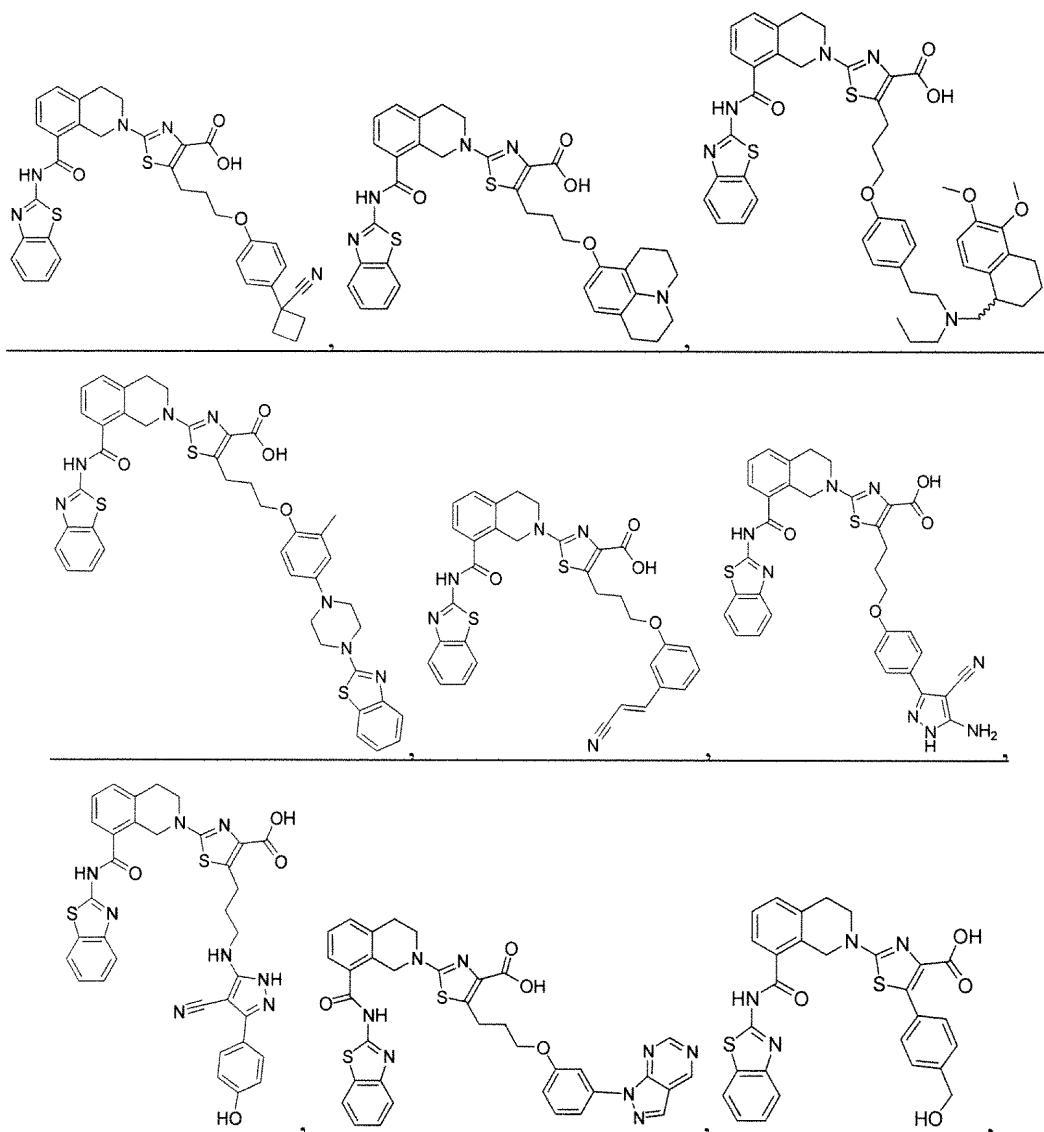


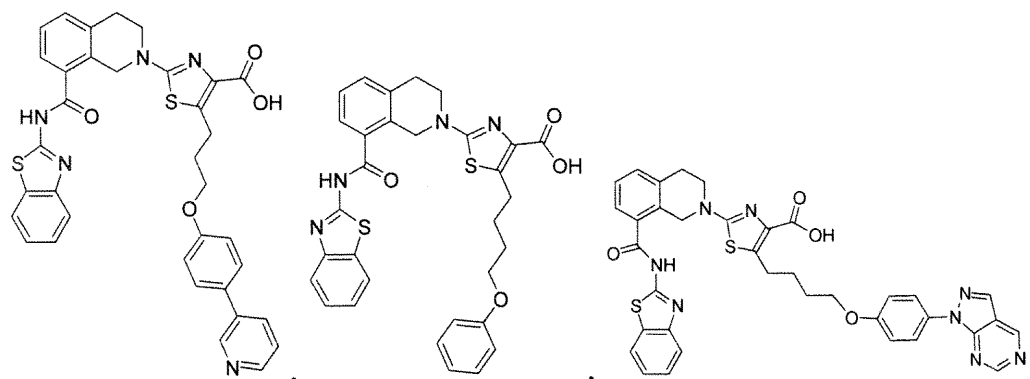


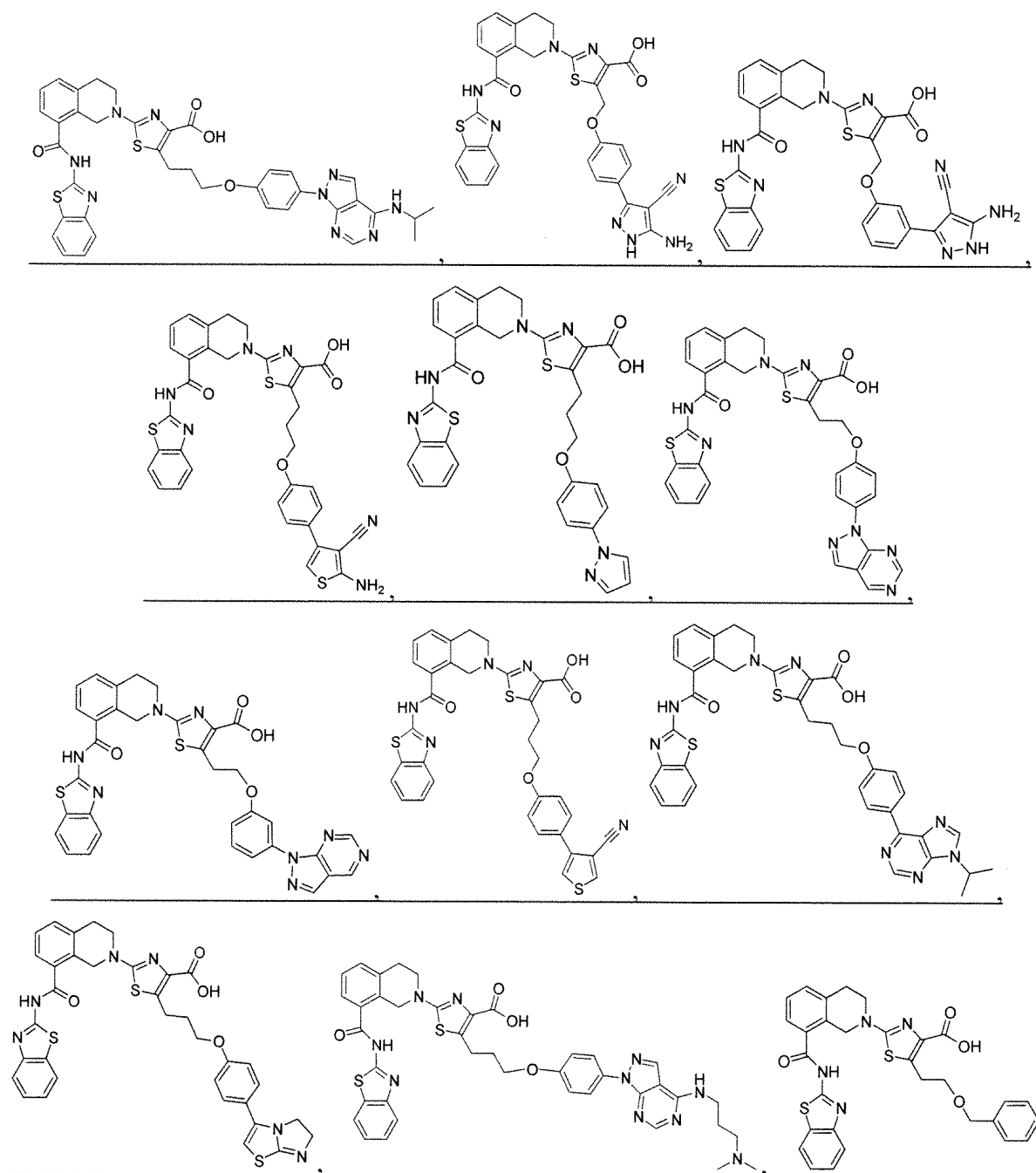
【請求項 29】  
前記化合物が

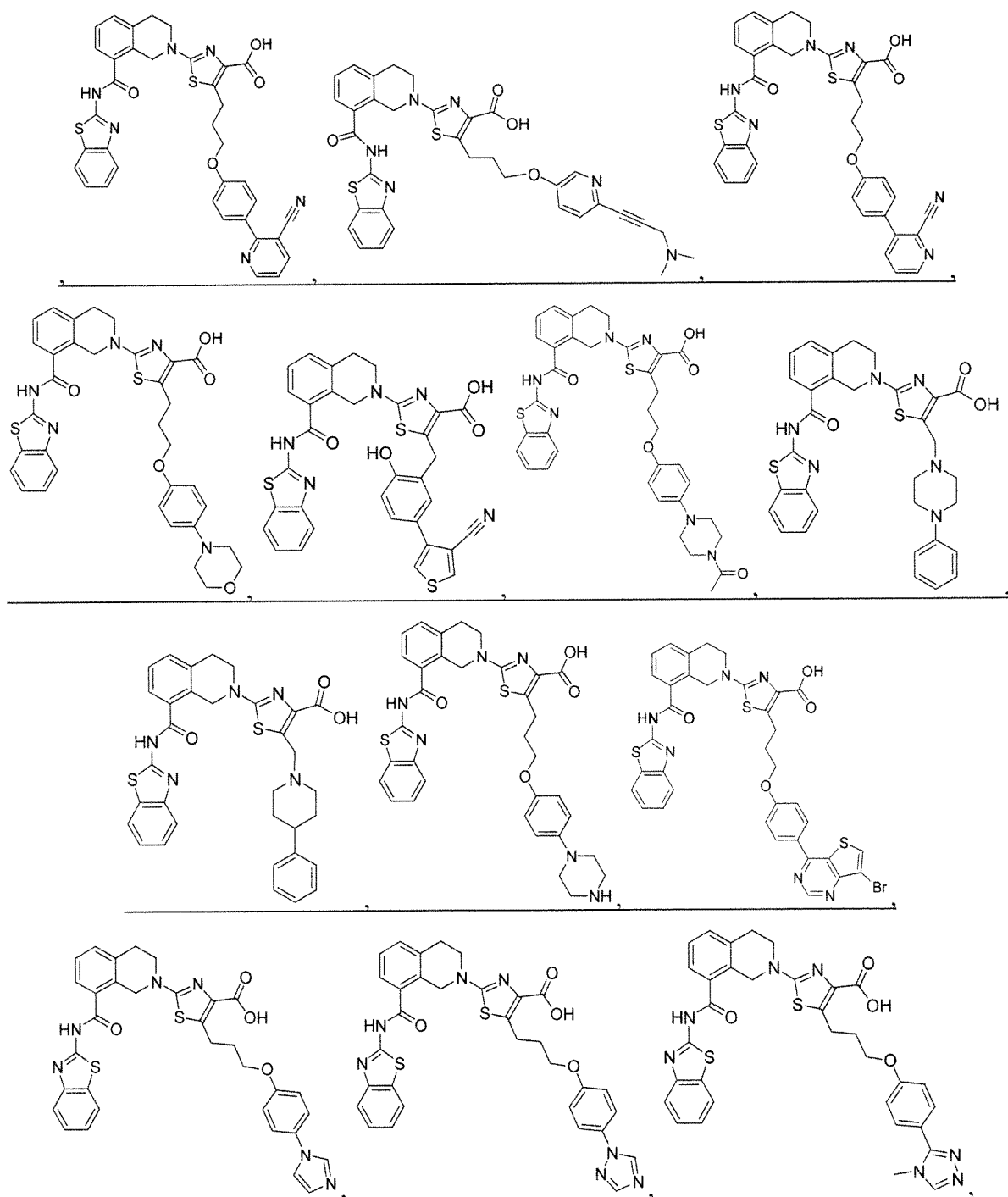




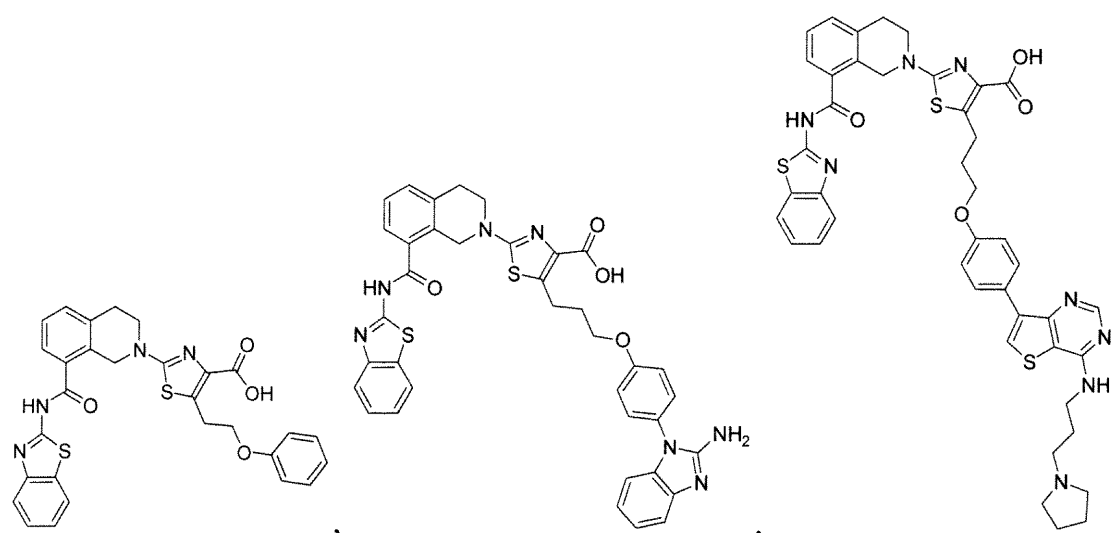
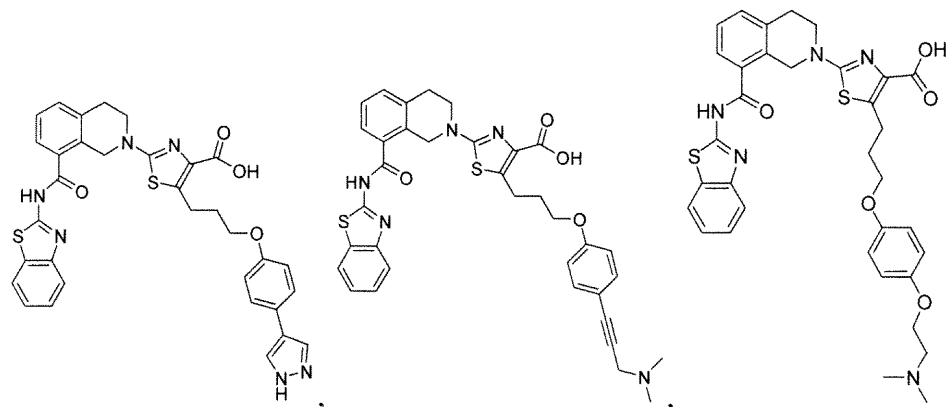
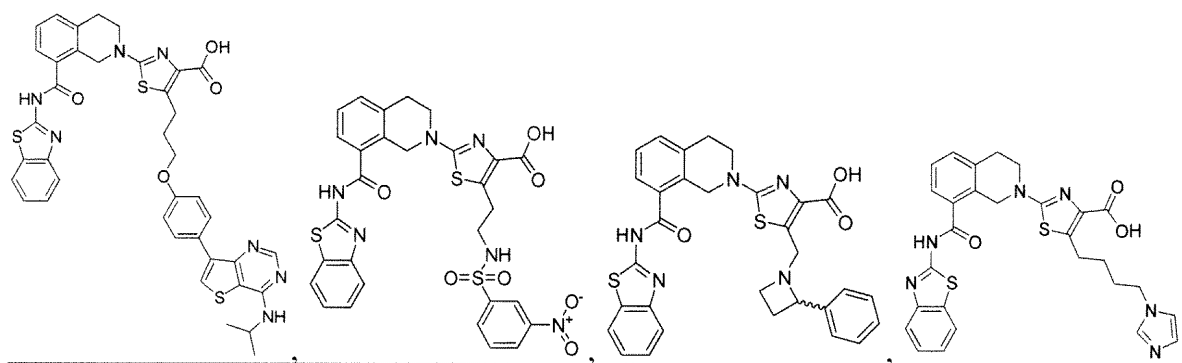


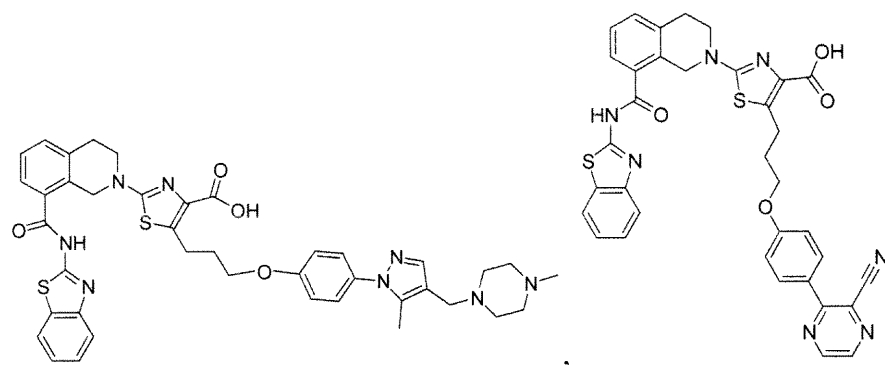
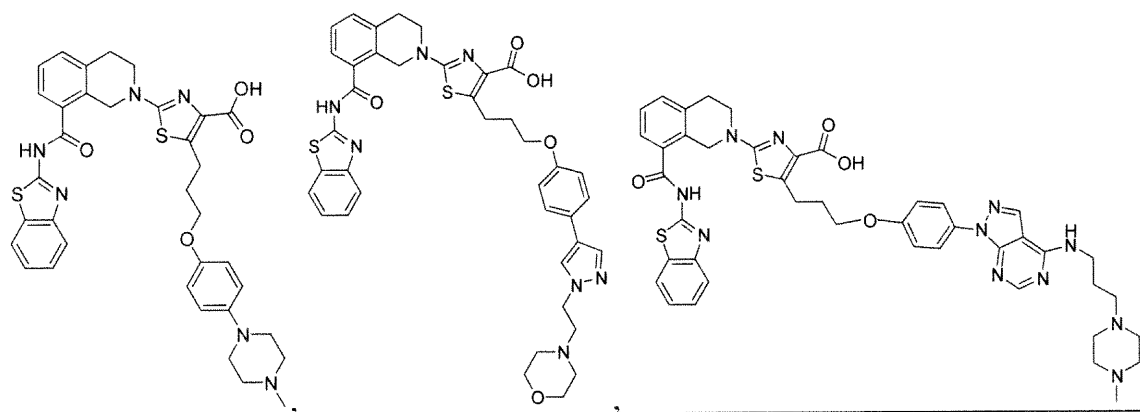
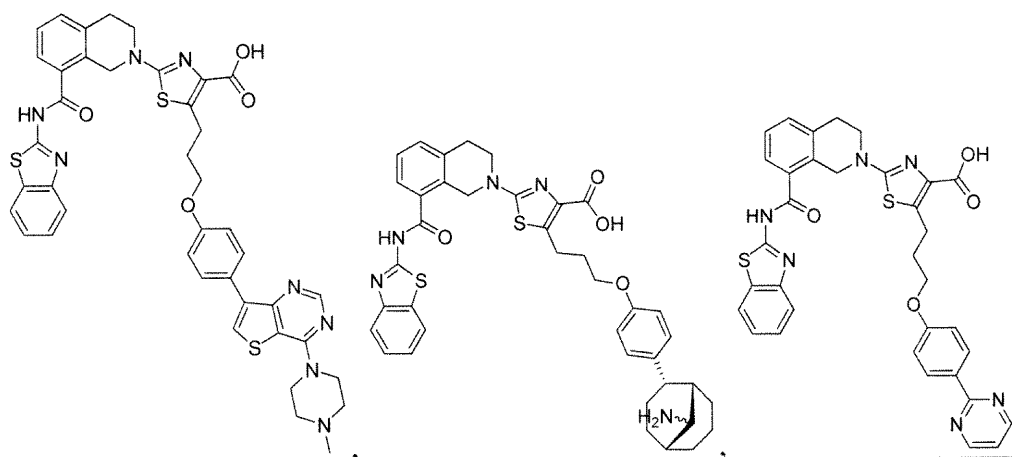


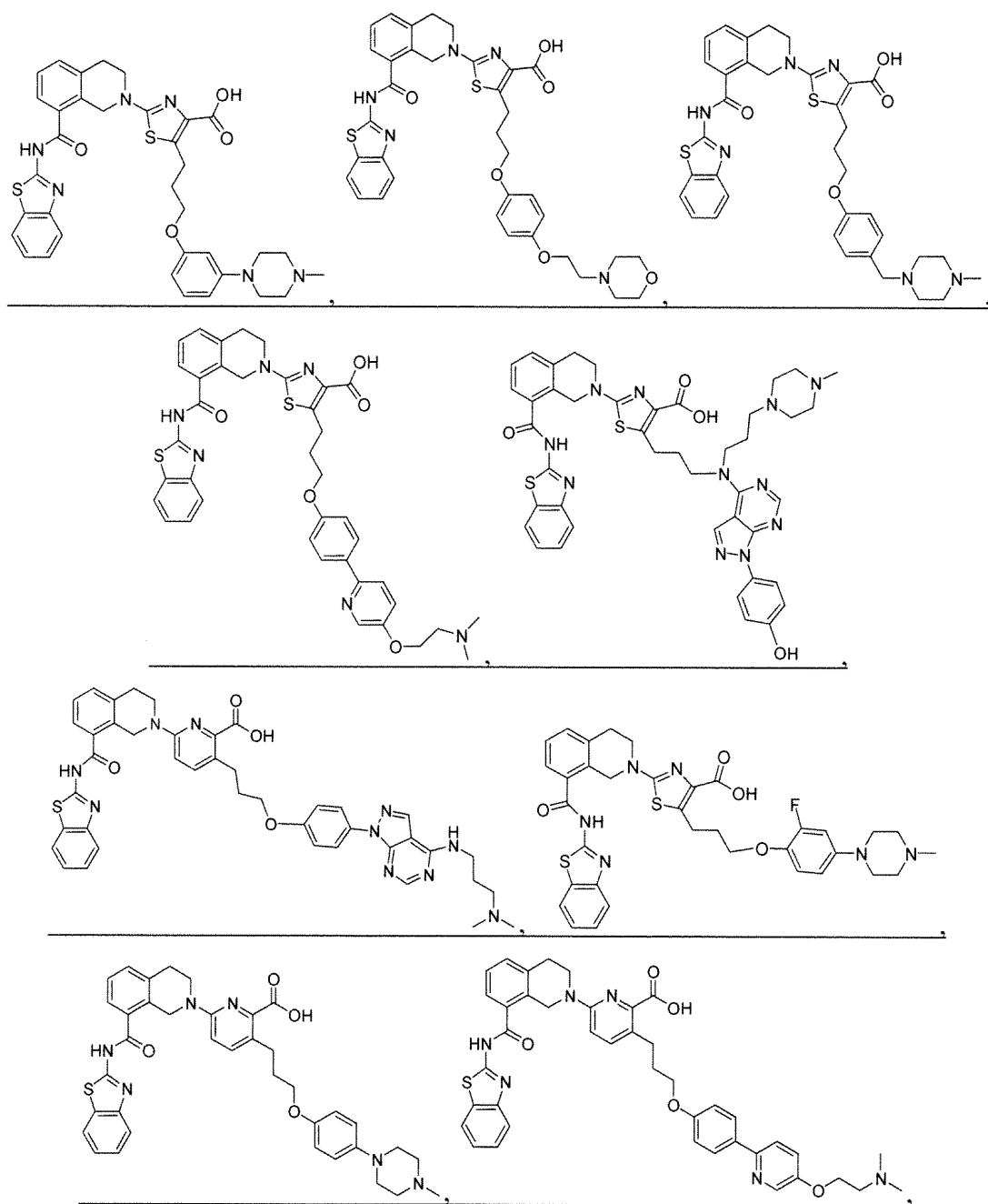


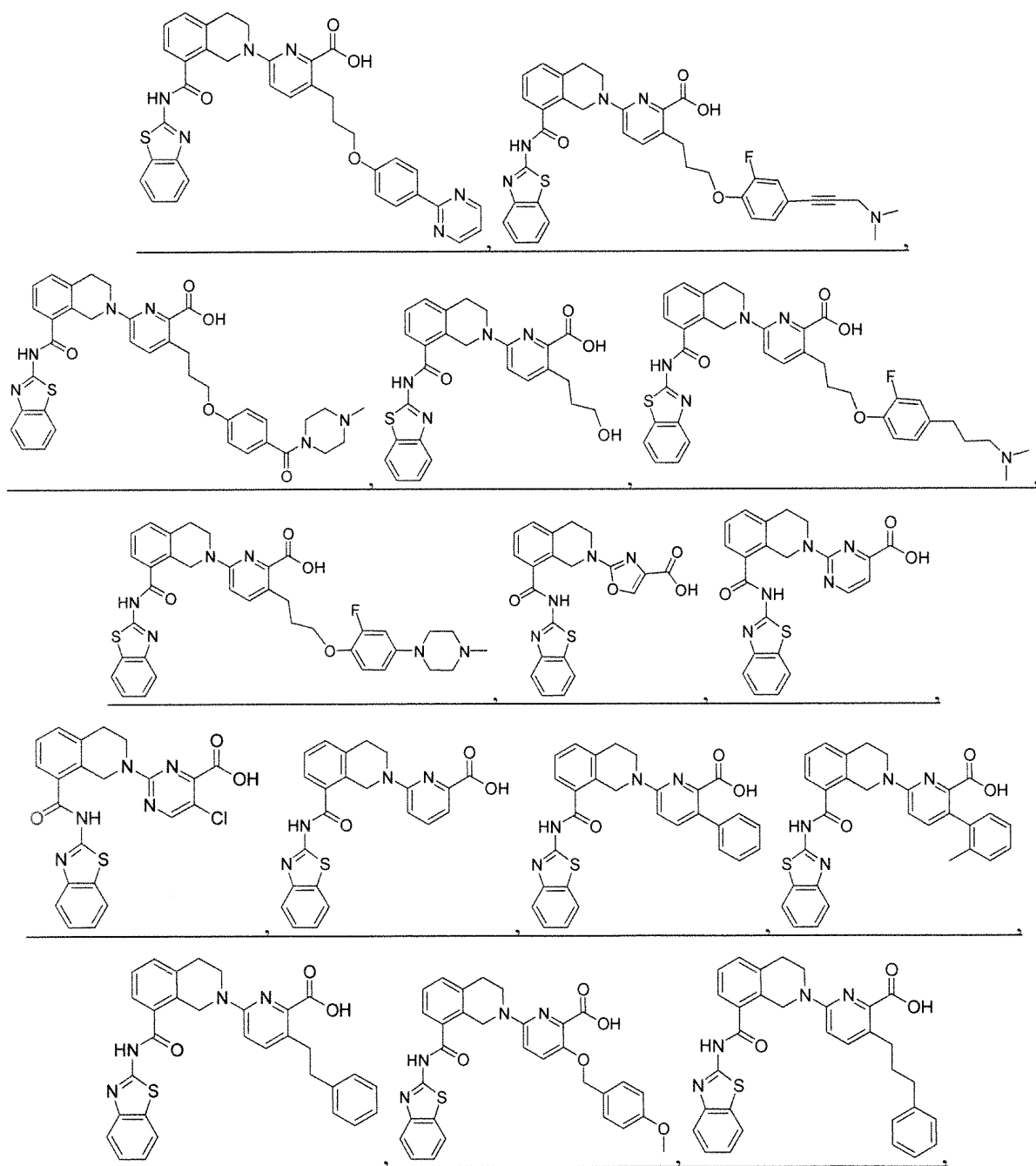


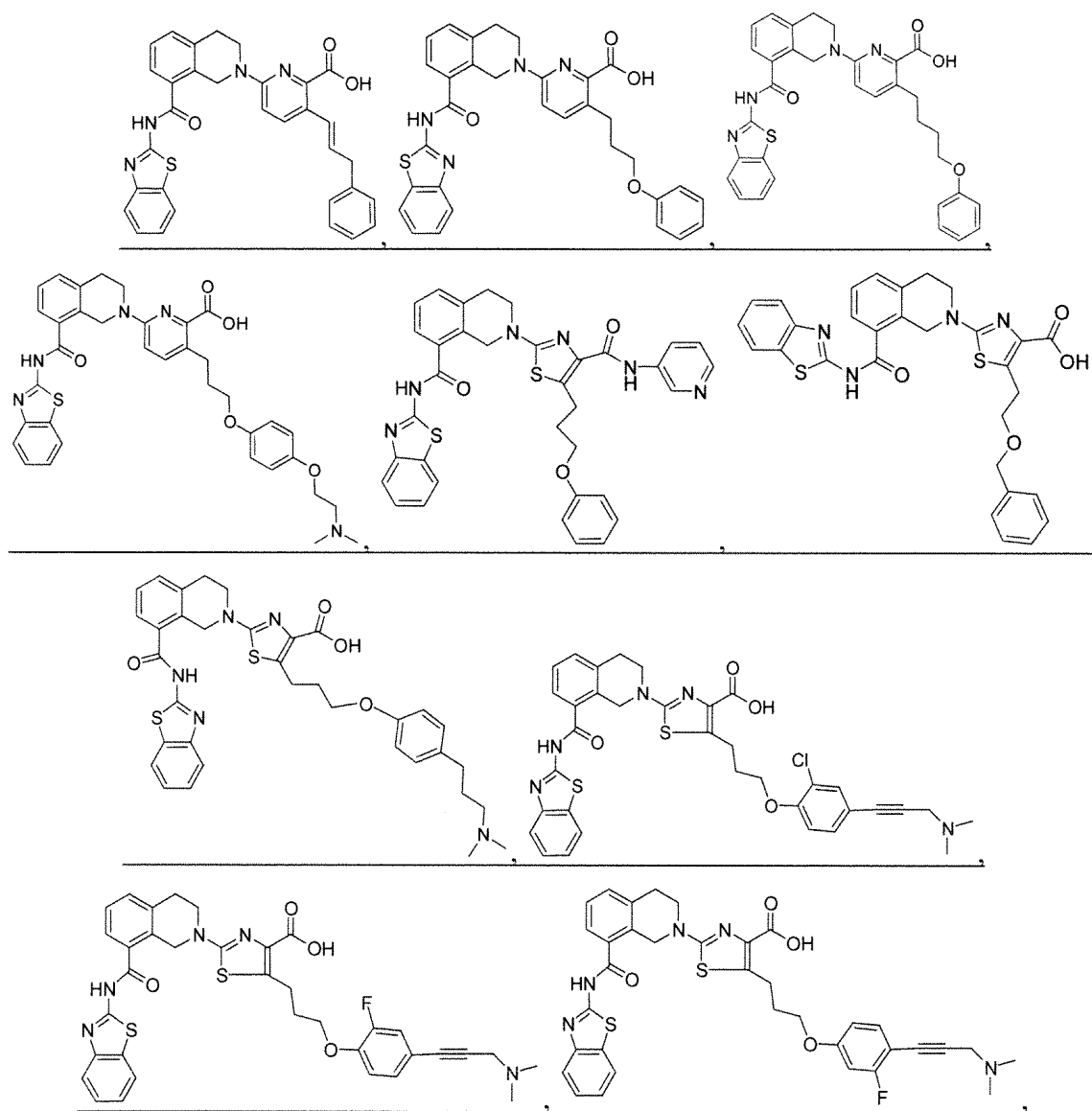


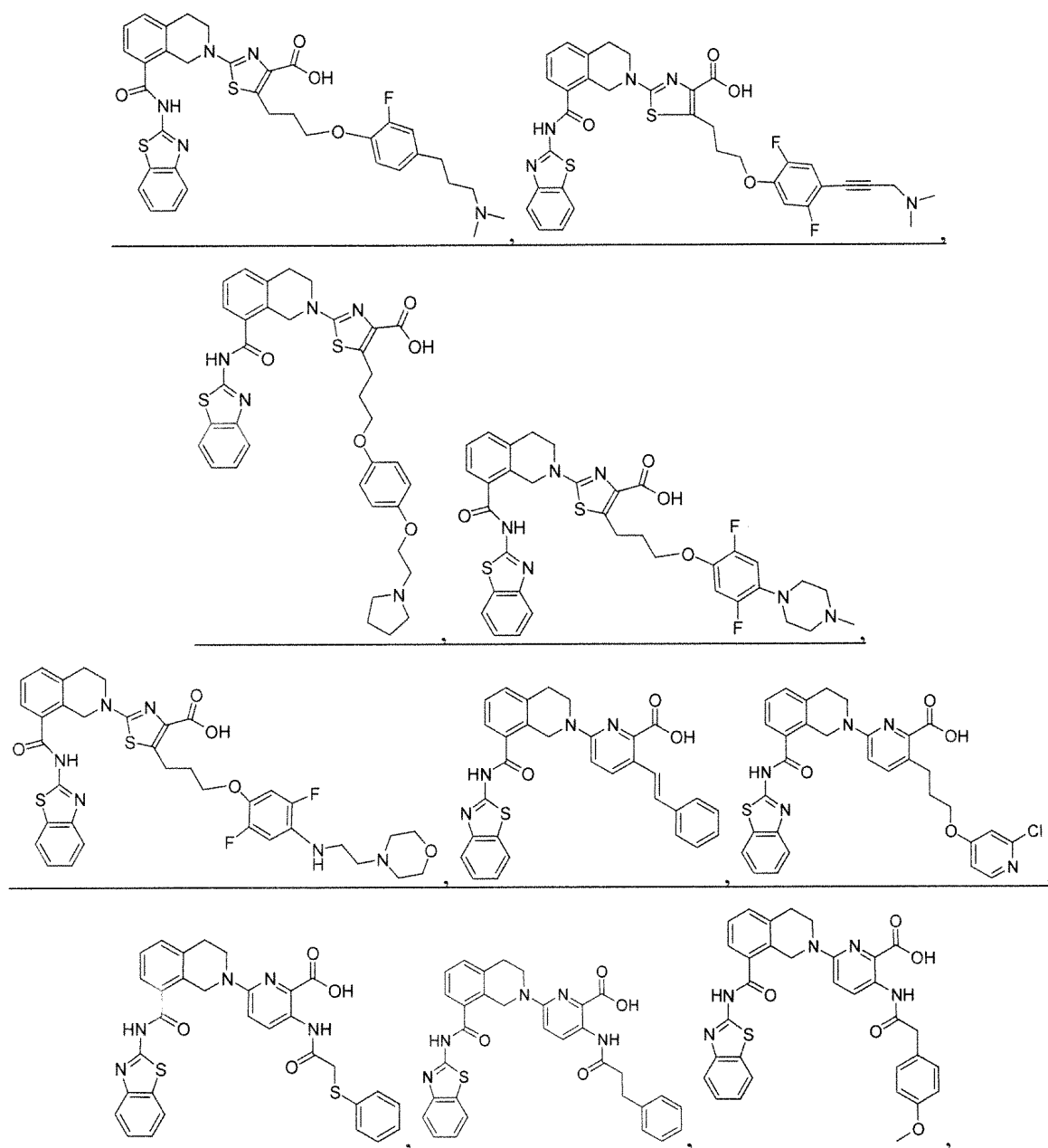


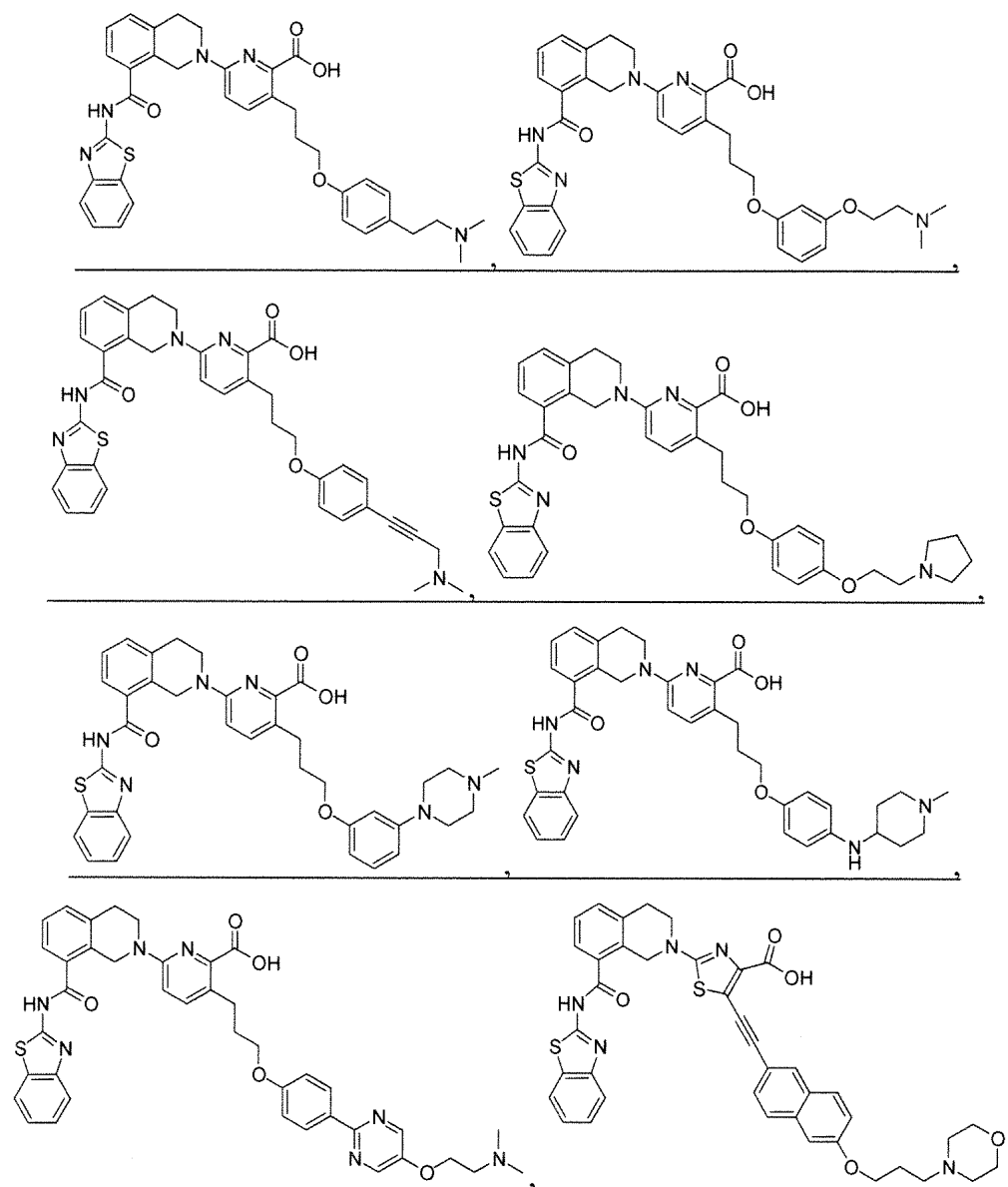


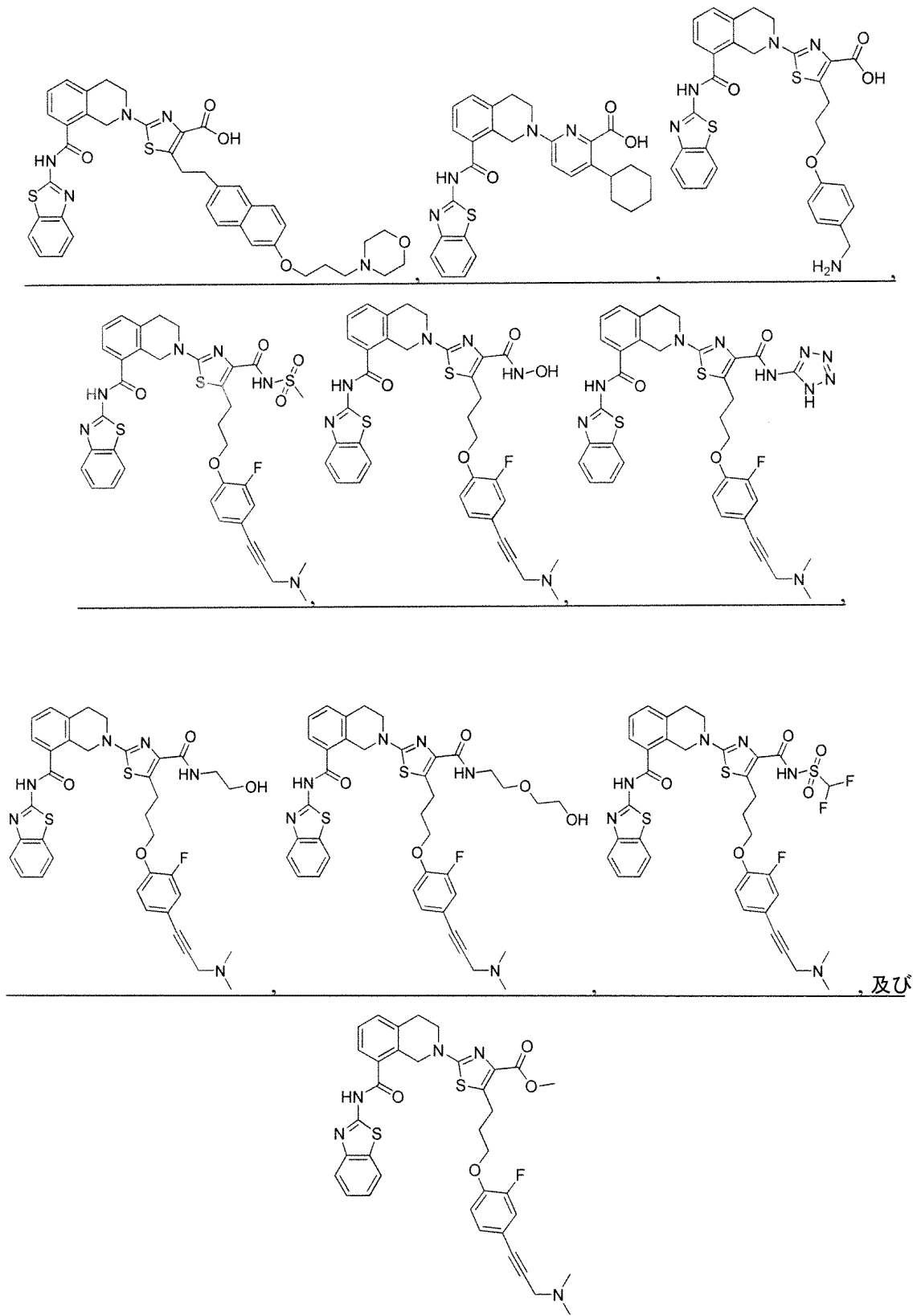












からなる群から選択される請求項 1 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 30】

請求項 1 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩と少なくとも一の薬学的に許容可能な希釈剤、担体又は賦形剤を含有する薬学的組成物。

【請求項 31】

請求項 1 記載の化合物、又はその薬学的に許容可能な塩を含む、小細胞肺癌を治療する



ための医薬。

【請求項 3 2】

請求項 1 記載の化合物、又はその薬学的に許容可能な塩を含む、患者における血小板の過剰、又は所望されない活性化によって引き起こされ、増悪し又はその結果生じる疾患又は症状を治療するための医薬。

【請求項 3 3】

請求項 1 記載の化合物、又はその薬学的に許容可能な塩を含む、患者の循環血小板数を減少させるための医薬。

【請求項 3 4】

前記疾患又は症状が、本態性血小板血症、真性多血症、再狭窄、手術前後の抗血小板療法及び器具関連血栓からなる群から選択される請求項 3 2 の医薬。

【請求項 3 5】

疾患又は症状の治療のための請求項 1 記載の化合物、又はその薬学的に許容可能な塩を含む医薬。

【請求項 3 6】

前記疾患又は症状が、本態性血小板血症、真性多血症、再狭窄、手術前後の抗血小板療法及び器具関連血栓からなる群から選択される請求項 3 5 記載の医薬。