

【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 07D 417/14	(2006.01)
C 07D 471/04	(2006.01)
C 07D 487/04	(2006.01)
C 07D 471/06	(2006.01)
C 07D 473/00	(2006.01)
C 07D 513/04	(2006.01)
C 07D 495/04	(2006.01)
A 61K 31/4725	(2006.01)
A 61K 31/5377	(2006.01)
A 61K 31/519	(2006.01)
A 61K 31/496	(2006.01)
A 61K 31/4745	(2006.01)
A 61K 31/52	(2006.01)
A 61K 31/506	(2006.01)
A 61P 35/00	(2006.01)
A 61P 35/02	(2006.01)
A 61P 7/02	(2006.01)
A 61P 7/00	(2006.01)
A 61P 9/10	(2006.01)

【F I】

C 07D 417/14	C S P
C 07D 471/04	1 0 4 Z
C 07D 487/04	1 4 3
C 07D 471/06	
C 07D 473/00	
C 07D 513/04	3 3 1
C 07D 495/04	1 0 5 Z
A 61K 31/4725	
A 61K 31/5377	
A 61K 31/519	
A 61K 31/496	
A 61K 31/4745	
A 61K 31/52	
A 61K 31/506	
A 61P 35/00	
A 61P 35/02	
A 61P 7/02	
A 61P 7/00	
A 61P 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

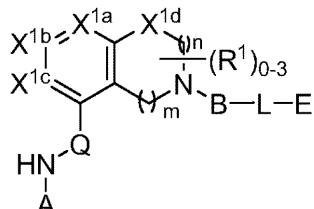
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

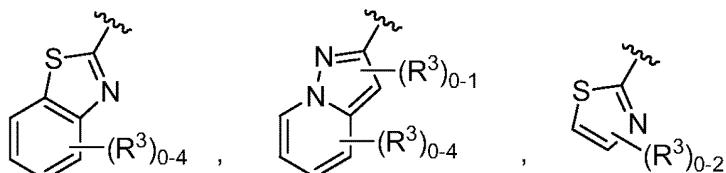
式Iの化合物



又はその薬学的に許容可能な塩で、上式中、

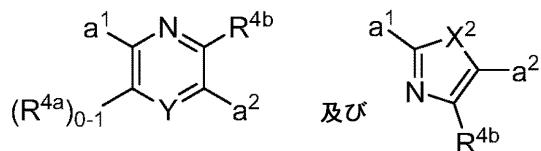
Qは、-C(O)-、-CH<sub>2</sub>-、-CH(R<sup>a</sup>)-及び-C(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>-からなる群から選択され、ここでR<sup>a</sup>はC<sub>1-4</sub>アルキル又はC<sub>1-4</sub>ハロアルキルであり；R<sup>1</sup>は、存在する場合、独立して、ハロゲン、=O、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>ヘテロアルキル、C<sub>2-6</sub>アルケニル、C<sub>2-6</sub>アルキニル及びC<sub>1-6</sub>ハロアルキルからなる群から選択され；X<sup>1a</sup>、X<sup>1b</sup>及びX<sup>1c</sup>は、それぞれ独立して、C(H)、C(R<sup>2</sup>)及びNからなる群から選択され、ここでX<sup>1a</sup>、X<sup>1b</sup>及びX<sup>1c</sup>の少なくとも一つはC(H)又はC(R<sup>2</sup>)であり；ここでR<sup>2</sup>は独立して、-OR<sup>b</sup>、-NR<sup>b</sup>R<sup>c</sup>、-SR<sup>b</sup>、-C(O)OR<sup>c</sup>、-C(O)NR<sup>b</sup>R<sup>c</sup>、-NR<sup>b</sup>C(O)R<sup>d</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>d</sup>、-S(O)R<sup>d</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>b</sup>R<sup>c</sup>、-R<sup>d</sup>、ハロゲン、-CN及び-NO<sub>2</sub>からなる群から選択され、ここでR<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>はそれぞれ独立して、水素、C<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>2-4</sub>アルケニル、C<sub>2-4</sub>アルキニル、C<sub>1-4</sub>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<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それぞれが結合する原子と共に、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；R<sup>d</sup>はC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>2-4</sub>アルケニル、C<sub>2-4</sub>アルキニル及びC<sub>1-4</sub>ハロアルキルからなる群から選択され；X<sup>1d</sup>は存在しないか又は-OR<sub>1</sub>、-NH-、-N(C<sub>1-4</sub>アルキル)-及び-N(C(O)C<sub>1-4</sub>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<sup>1d</sup>が存在するならば、下付文字nは2又は3であり；

Aは、

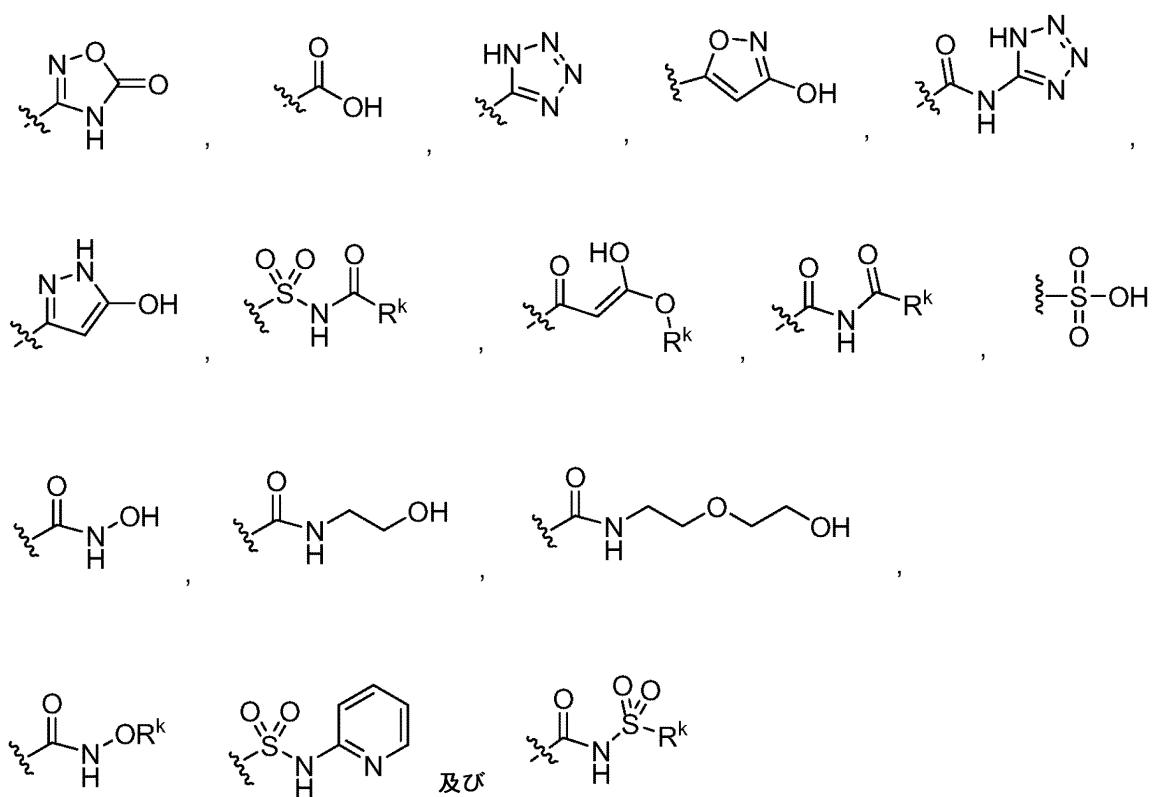


からなる群から選択されるメンバーであり、ここで、R<sup>3</sup>は、存在する場合、独立して-NR<sup>e</sup>R<sup>f</sup>、-OR<sup>e</sup>、-CN、-NO<sub>2</sub>、ハロゲン、-C(O)OR<sup>e</sup>、-C(O)NR<sup>e</sup>R<sup>f</sup>、-NR<sup>e</sup>C(O)R<sup>f</sup>、-NR<sup>e</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>g</sup>、-NR<sup>e</sup>S(O)R<sup>g</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>g</sup>、-S(O)R<sup>g</sup>及び-R<sup>g</sup>からなる群から選択され、ここでR<sup>e</sup>及びR<sup>f</sup>はそれぞれの場合において、それぞれ独立して、水素、C<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>2-4</sub>アルケニル、C<sub>2-4</sub>アルキニル、C<sub>1-4</sub>ハロアルキル及び-(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>フェニルからなる群から選択され、又はR<sup>e</sup>及びR<sup>f</sup>、又はR<sup>e</sup>及びR<sup>g</sup>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<sup>g</sup>はC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>2-4</sub>アルケニル、C<sub>2-4</sub>アルキニル及びC<sub>1-4</sub>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<sup>4a</sup>)であり；X<sup>2</sup>は-N(H)-、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)-、O又はSであり；R<sup>4a</sup>は、存在する場合、独立してC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>ハロアルキル、C<sub>2-4</sub>アルケニル、C<sub>2-4</sub>アルキニル、ハロゲン及び-CNからなる群から選択され；R<sup>4b</sup>は独立して-C(O)OR<sup>j</sup>、-C(O)NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-C(O)R<sup>i</sup>、-NR<sup>h</sup>C(O)R<sup>i</sup>、-NR<sup>h</sup>C(O)NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-OC(O)NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-NR<sup>h</sup>C(O)OR<sup>j</sup>、-C(=NOR<sup>h</sup>)NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-NR<sup>h</sup>C(=NCN)NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-NR<sup>h</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>j</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-N(R<sup>h</sup>)S(O)<sub>2</sub>R<sup>i</sup>、-NR<sup>h</sup>C(=NR<sup>i</sup>)NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-C(=S)NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-C(=N(R<sup>h</sup>))NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、及び-CNからなる群から選択され、ここでR<sup>h</sup>及びR<sup>i</sup>はそれぞれの場合において、それぞれ独立して水素、C<sub>1-6</sub>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>3-6</sub>シクロアルキル、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、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>j</sup>はC<sub>1-6</sub>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>1-6</sub>ハロアルキル、C<sub>3-7</sub>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>h</sup>及びR<sup>i</sup>、又はR<sup>h</sup>及びR<sup>j</sup>は、それら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<sup>4b</sup>は、



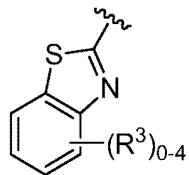
からなる群から選択され、ここで、 $R^k$  は  $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{3-7}$  シクロアルキル及び $C_{1-6}$  ハロアルキルから選択され； $a^1$  は式Iの窒素原子へのB基の結合部位を示し、 $a^2$  は式IのL基へのB基の結合部位を示し；Lは存在しないか又は $C_{6-10}$  アリーレン- $C_{1-6}$  ヘテロアルキレン、 $C_{5-9}$  ヘテロアリーレン- $C_{1-6}$  ヘテロアルキレン、 $C_{1-6}$  ヘテロアルキレン、 $C_{1-6}$  アルキレン、 $C_{1-6}$  ハロアルキレン、 $C_{2-6}$  アルケニレン、 $C_{2-6}$  アルキニレン、-NH-、-S-及び-O-からなる群から選択されるリンカーであり、ここでL基のアルキレン、アルケニレン、アルキニレン又はヘテロアルキレン部分はハロゲン、-R<sup>m</sup> 及び=Oからなる群から選択される0から4のR<sup>5a</sup>置換基で置換され、及びL基の芳香族部分はハロゲン、-OR<sup>n</sup>、-NRR<sup>o</sup>、-R<sup>n</sup>、-NO<sub>2</sub>、及びCNからなる群から選択される0から4のR<sup>5b</sup>置換基で置換されていてもよく；ここでR<sup>m</sup> は  $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{1-6}$  ヘテロアルキル、 $C_{3-6}$  ヘテロシクロアルキル- $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{3-7}$  ヘテロシクロアルキル- $C_{1-6}$  ヘテロシクロアルキル及び $C_{1-6}$  ハロアルキルからなる群から選択され、場合によっては同一又は異なるLの原子と結合する何れか2つのR<sup>5a</sup>置換基は組み合わされて、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く；ここでR<sup>n</sup> 及びR<sup>o</sup> は、それぞれの場合において、独立して水素、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル及び $C_{1-6}$  ハロアルキルからなる群から選択され、及び場合によってはR<sup>n</sup> 及びR<sup>o</sup> は、それぞれが結合する原子と共に、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；

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、 $C_{5-6}$  ヘテロアリール、 $C_{3-7}$  ヘテロシクロアルキル及び $C_{3-7}$  シクロアルキルからなる群から選択され、Eに縮合していくよいものは、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と縮合していくよい各環は、ハロゲン、-NRR<sup>p</sup>R<sup>q</sup>、-SR<sup>p</sup>、-OR<sup>p</sup>、-C(O)OR<sup>p</sup>、-C(O)NRR<sup>p</sup>R<sup>q</sup>、-C(O)R<sup>p</sup>、-NRR<sup>p</sup>C(O)R<sup>q</sup>、-OC(O)R<sup>r</sup>、-NRR<sup>p</sup>C(O)NRR<sup>p</sup>R<sup>q</sup>、-OC(O)NRR<sup>p</sup>R<sup>q</sup>、-NRR<sup>p</sup>C(O)OR<sup>r</sup>、-C

$(=NOR^P)NR^P R^q$ 、 $-NR^P C(=N-CN)NR^P R^q$ 、 $-NR^P S(O)_2 NR^P R^q$ 、 $-S(O)_2 R^r$ 、 $-S(O)_2 NR^P R^q$ 、 $-R^r$ 、 $-R^s$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ 、 $=O$ 、 $-CN$ 、 $-Z^1-NR^P R^q$ 、 $-Z^1-SR^P$ 、 $-Z^1-OR^P$ 、 $-Z^1-C(O)OR^P$ 、 $-Z^1-C(O)NR^P R^q$ 、 $-Z^1-C(O)R^P$ 、 $-Z^1-NR^P C(O)R^q$ 、 $-Z^1-O C(O)R^r$ 、 $-Z^1-NR^P C(O)NR^P R^q$ 、 $-Z^1-O C(O)NR^P R^q$ 、 $-Z^1-NR^P C(O)OR^r$ 、 $-Z^1-C(=NOR^P)NR^P R^q$ 、 $-Z^1-NR^P C(=N-CN)NR^P R^q$ 、 $-Z^1-NR^P S(O)_2 NR^P R^q$ 、 $-Z^1-S(O)_2 R^r$ 、 $-Z^1-S(O)_2 NR^P R^q$ 、 $-Z^1-NO_2$ 、 $-Z^1-N_3$ 、 $-Z^1-R^s$ 及び $-Z^1-CN$ からなる群から選択される0から5の $R^6$ 置換基で独立して置換され；ここで $Z^1$ は $C_{1-6}$ アルキレン、 $C_{2-6}$ アルケニレン、 $C_{2-6}$ アルキニレン、 $C_{1-6}$ ヘテロアルキレン、 $C_{3-7}$ ヘテロシクロアルキル及び $C_{3-7}$ シクロアルキルからなる群から選択され； $R^P$ 及び $R^q$ はそれぞれ独立して水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{3-7}$ シクロアルキル、 $C_{3-7}$ ヘテロシクロアルキル、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； $R^r$ は $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{3-10}$ シクロアルキル、 $C_{3-10}$ ヘテロシクロアルキル、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；場合によっては各 $R^6$ 中で、置換基 $R^P$ 及び $R^q$ 又は $R^P$ 及び $R^r$ 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； $R^s$ はフェニル、 $C_{5-6}$ ヘテロアリール、 $C_{3-7}$ ヘテロシクロアルキル、 $C_{3-7}$ 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 $R^s$ と縮合してよく、ここで $R^s$ 及び $R^s$ と縮合していてもよい各環は、ハロゲン、 $-NR^t R^u$ 、 $-SR^t$ 、 $-OR^t$ 、 $-C(O)OR^t$ 、 $-C(O)NR^t R^u$ 、 $-C(O)R^t$ 、 $-NR^t C(O)R^v$ 、 $-OC(O)R^v$ 、 $-NR^t C(O)NR^t R^u$ 、 $-OC(O)NR^t R^r$ 、 $-NR^t C(O)OR^v$ 、 $-C(=NOR^t)NR^t R^u$ 、 $-NR^t C(=N-CN)NR^t R^u$ 、 $-NR^t S(O)_2 NR^t R^u$ 、 $-S(O)_2 R^v$ 、 $-S(O)_2 NR^t R^u$ 、 $-R^v$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ 、 $=O$ 、 $-CN$ 、 $-Z^2-NR^t R^u$ 、 $-Z^2-SR^t$ 、 $-Z^2-OR^t$ 、 $-Z^2-C(O)OR^t$ 、 $-Z^2-C(O)NR^t R^u$ 、 $-Z^2-C(O)R^v$ 、 $-Z^2-NR^t C(O)NR^t R^u$ 、 $-Z^2-OC(O)NR^t R^u$ 、 $-Z^2-NR^t C(O)OR^v$ 、 $-Z^2-C(=NOR^t)NR^t R^u$ 、 $-Z^2-NR^t C(=N-CN)NR^t R^u$ 、 $-Z^2-NR^t S(O)_2 NR^t R^u$ 、 $-Z^2-S(O)_2 R^v$ 、 $-Z^2-S(O)_2 NR^t R^u$ 、 $-Z^2-NO_2$ 、 $-Z^2-N_3$ 及び $-Z^2-CN$ からなる群から選択される0から5の $R^7$ 置換基でそれぞれ独立して置換され；ここで $Z^2$ は $C_{1-6}$ アルキレン、 $C_{2-6}$ アルケニレン、 $C_{2-6}$ アルキニレン、 $C_{1-6}$ ヘテロアルキレンからなる群から選択され、 $R^t$ 及び $R^u$ は水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $(CH_2)_{1-4}$ -フェニル、 $C_{3-7}$ シクロアルキル及び $C_{3-7}$ 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； $R^v$ は $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ ハロアルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $(CH_2)_{1-4}$ -フェニル、 $C_{3-7}$ シクロアルキル及び $C_{3-7}$ ヘテロシクロアルキルから選択され；及び各 $R^7$ 置換基中で、 $R^t$ 及び $R^u$ 又は $R^t$ 及び $R^v$ 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】

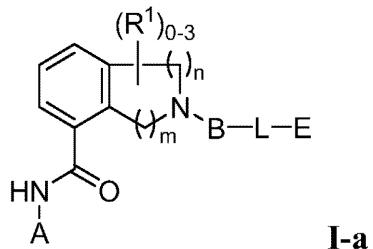
Aが、



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。

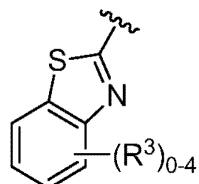
【請求項 3】

化合物が式

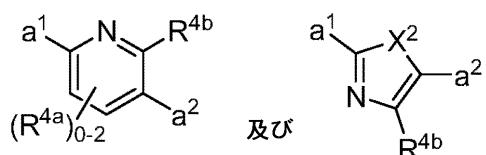


[ 上式中、  $R^1$  はハロゲン、  $C_{1-6}$  アルキル、  $C_{1-6}$  ヘテロアルキル又は=O であり；

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、

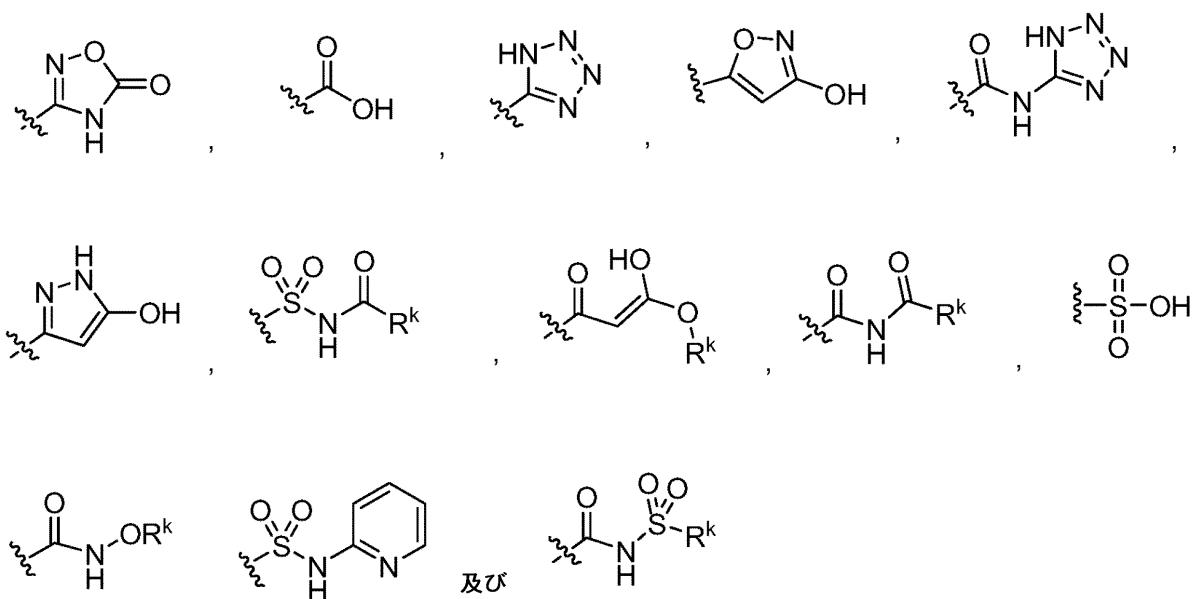


であり、  $B$  は、



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、

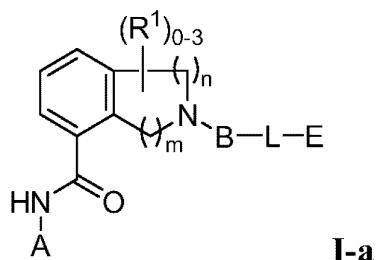


からなる群から選択される]

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。

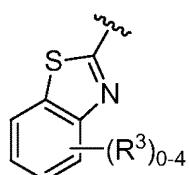
【請求項4】

化合物が、式

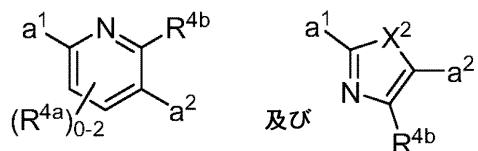


[上式中、R<sup>1</sup>はハロゲン、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>ヘテロアルキル又は=Oであり；

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<sup>4</sup><sup>b</sup>は-C(O)OR<sup>j</sup>、-C(O)NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-C(O)R<sup>i</sup>、-NR<sup>h</sup>C(O)R<sup>i</sup>、-NR<sup>h</sup>C(O)NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-OC(O)NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-NR<sup>h</sup>C(O)OR<sup>j</sup>、-C(=NOR<sup>h</sup>)NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-NR<sup>h</sup>C(=NCN)NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-NR<sup>h</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>j</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-N(R<sup>h</sup>)S(O)<sub>2</sub>R<sup>i</sup>、-NR<sup>h</sup>C(=NRI)NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-C(=S)NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-C(=NRI)NR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>、-R<sup>j</sup>、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、及び-CNからなる群から選択される]

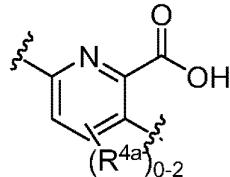
のものである請求項1記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【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、

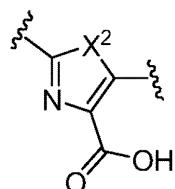


[上式中、R<sup>4a</sup>は、存在する場合ハロゲン及びC<sub>1-4</sub>アルキルから選択され；ここで下付文字nは2であり、下付文字mは1である]

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】

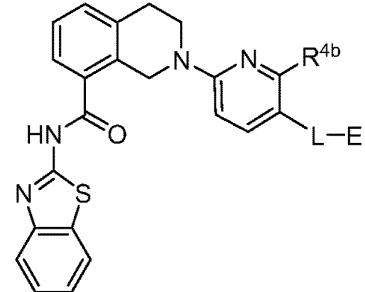
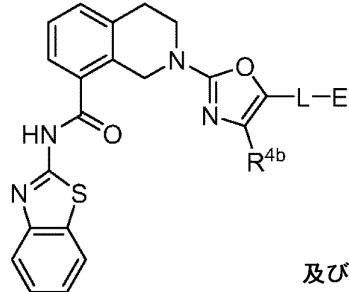
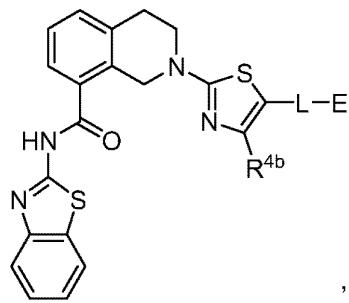
R<sup>1</sup>が存在せず；及びBが



[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

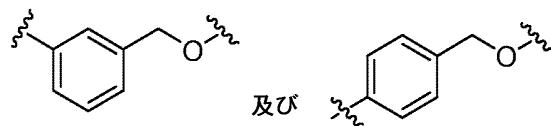
から選択される式のものである請求項1、3又は4記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【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>6-10</sub>アリーレン-C<sub>1-6</sub>ヘテロアルキレン及びC<sub>5-9</sub>ヘテロアリーレン-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】

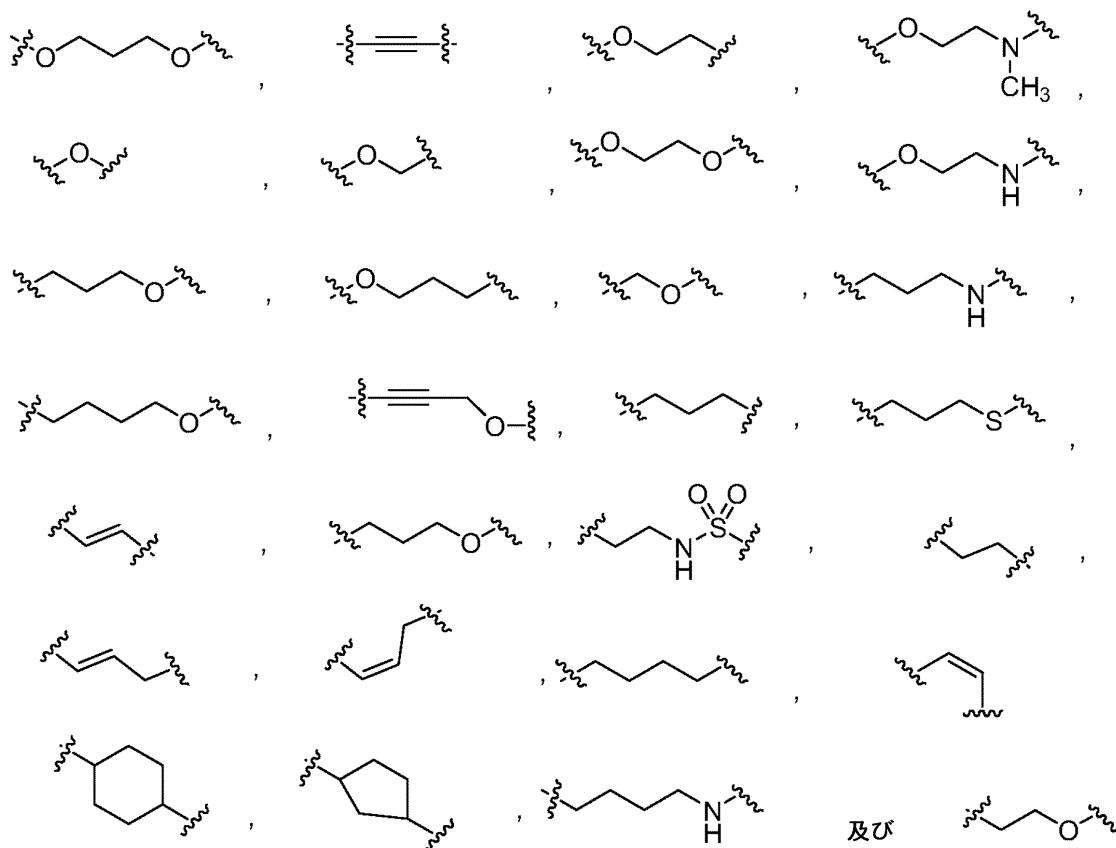
L が、置換されていてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ヘテロアルキレン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキレン、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニレン及び C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニレンからなる群から選択される置換されていてもよい基である請求項 3 又は 4 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 2】

L が置換されていてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキレンオキシ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルケニレンオキシ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキニレンオキシ及び C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> 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されて、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> ~ C<sub>6</sub> ヘテロアリール及び C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> 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<sup>6</sup>置換基が-NR<sup>p</sup>R<sup>q</sup>、-Z<sup>1</sup>-NR<sup>p</sup>R<sup>q</sup>、-R<sup>s</sup>、又は-Z<sup>1</sup>-R<sup>s</sup>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】

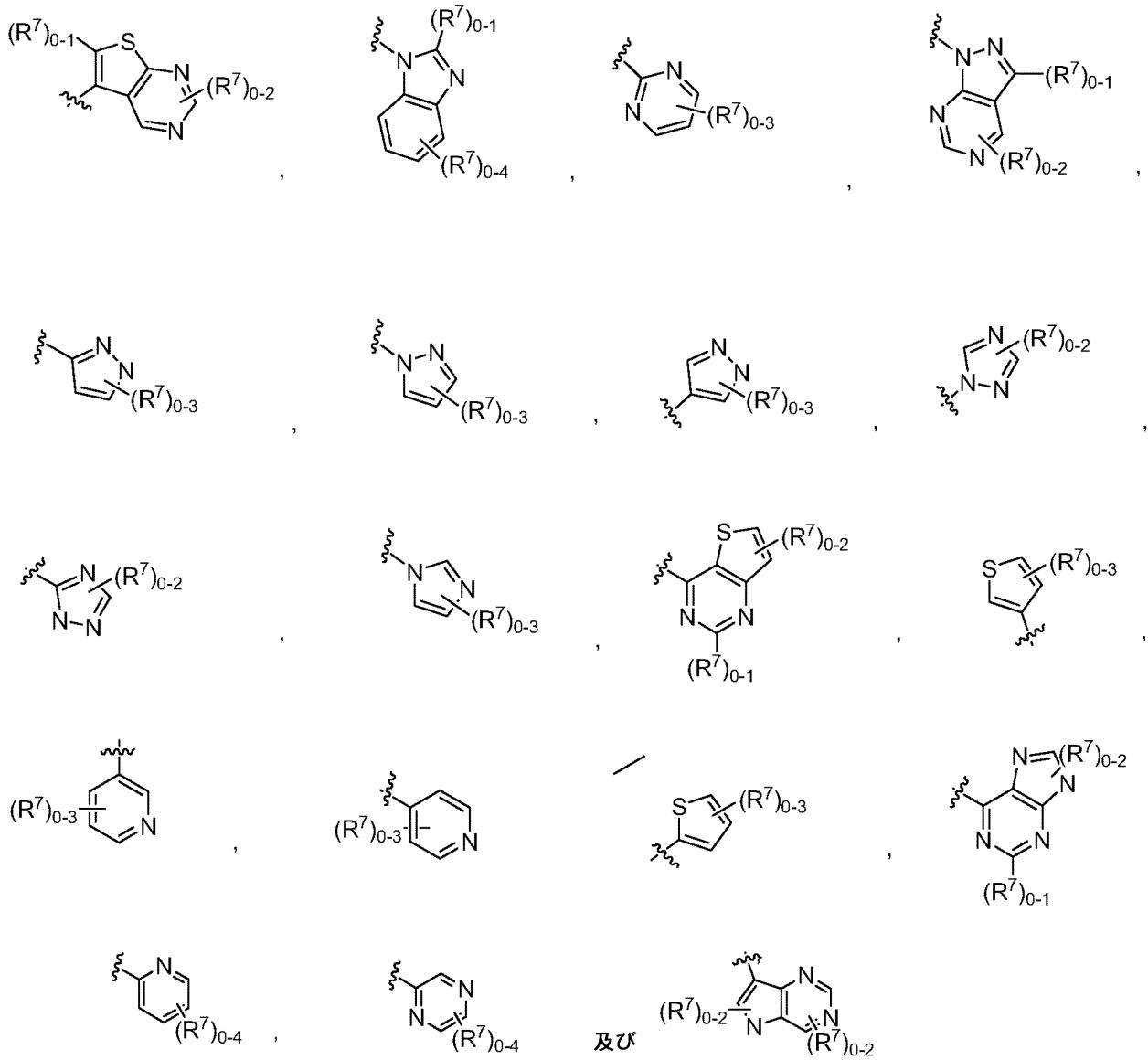
前記一つのR<sup>6</sup>置換基が-NR<sup>p</sup>R<sup>q</sup>又は-Z<sup>1</sup>-NR<sup>p</sup>R<sup>q</sup>である請求項15記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項17】

1又は2のR<sup>6</sup>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】

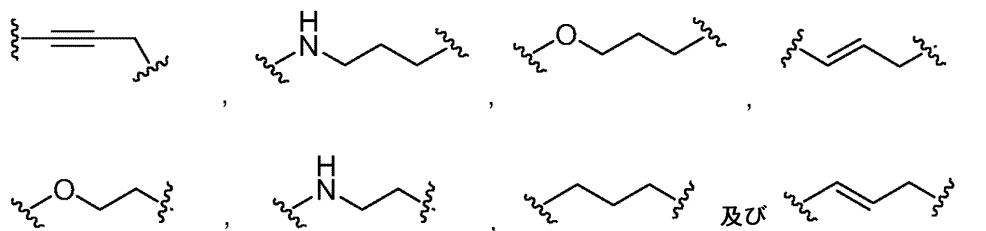
前記一つのR<sup>6</sup>置換基がR<sup>s</sup>又は-Z<sup>1</sup>-R<sup>s</sup>であり、ここでR<sup>s</sup>が



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】

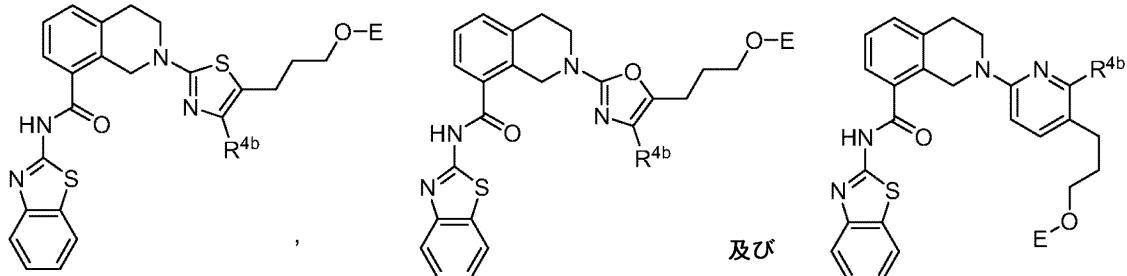
Z<sup>1</sup>が、



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、

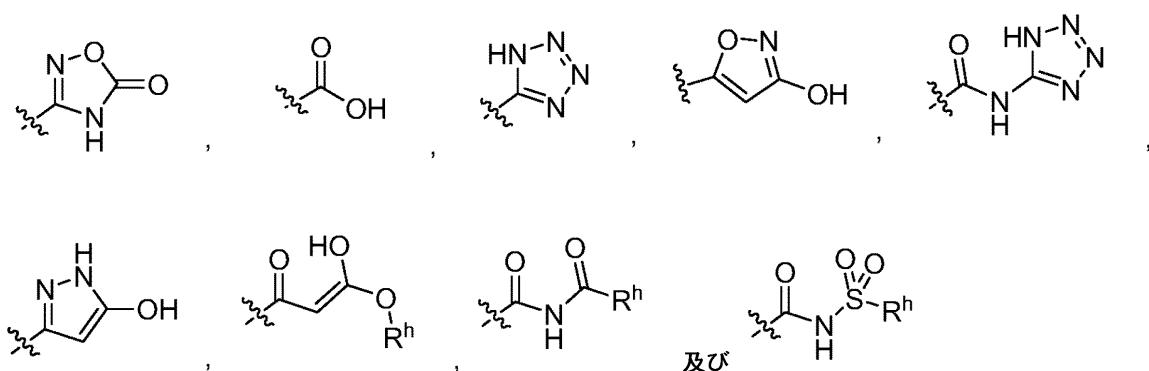


III-a

III-b

III-c

[ 上式中、  $R^{4b}$  は、



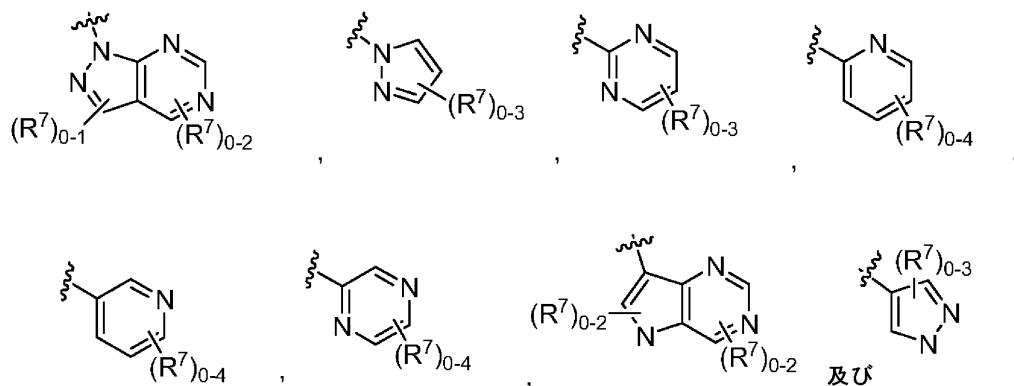
からなる群から選択され、  $E$  はフェニルであり、 1 から 3 の  $R^6$  置換基で置換される ] からなる群から選択される式のものである請求項 5 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【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<sup>s</sup>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23】

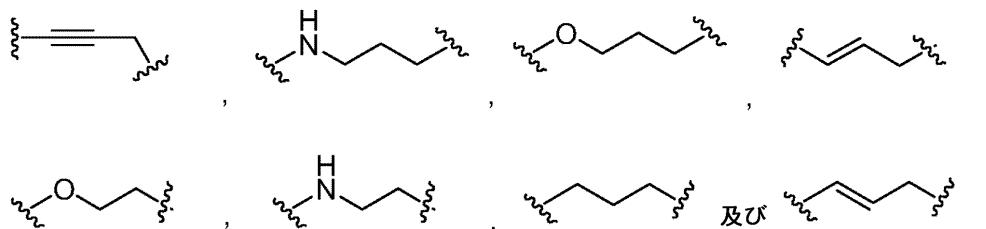
少なくとも一つのR<sup>7</sup>が、存在する場合、-N R<sup>t</sup> R<sup>u</sup>及び-Z<sup>2</sup>-N R<sup>t</sup> R<sup>u</sup>からなる群から選択される請求項22記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項24】

Z<sup>2</sup>がC<sub>1-4</sub>アルキレン、C<sub>2-4</sub>アルケニレン、C<sub>2-4</sub>アルキニレン及びC<sub>1-4</sub>ヘテロアルキレンから選択される請求項23記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項25】

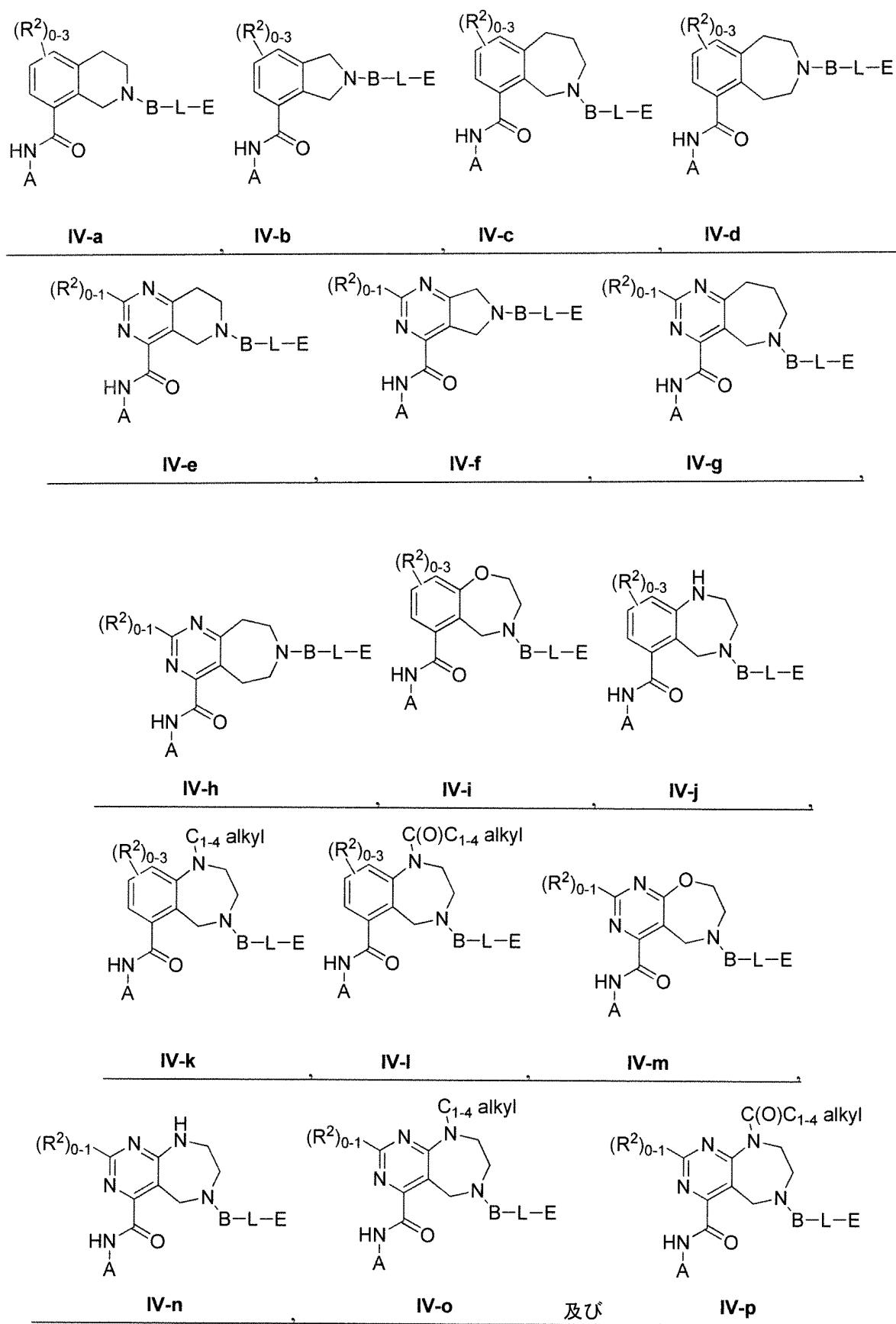
Z<sup>2</sup>が、



からなる群から選択される請求項24記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

【請求項26】

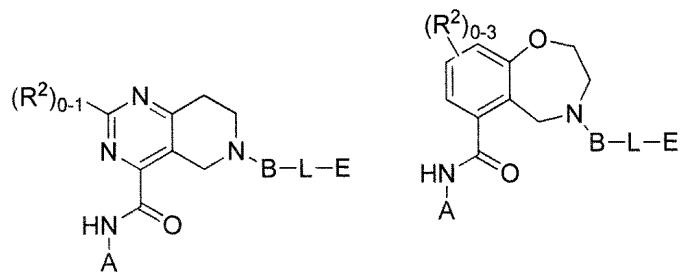
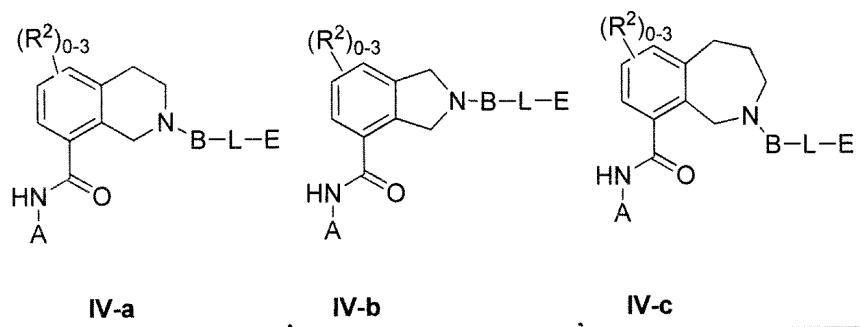
前記化合物が、



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】

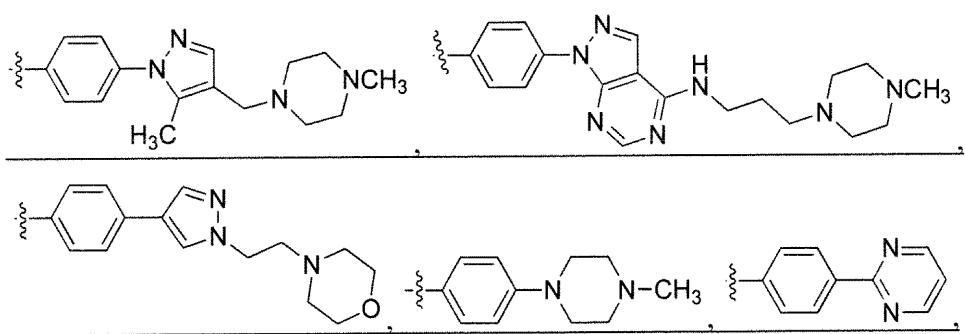
前記化合物が、

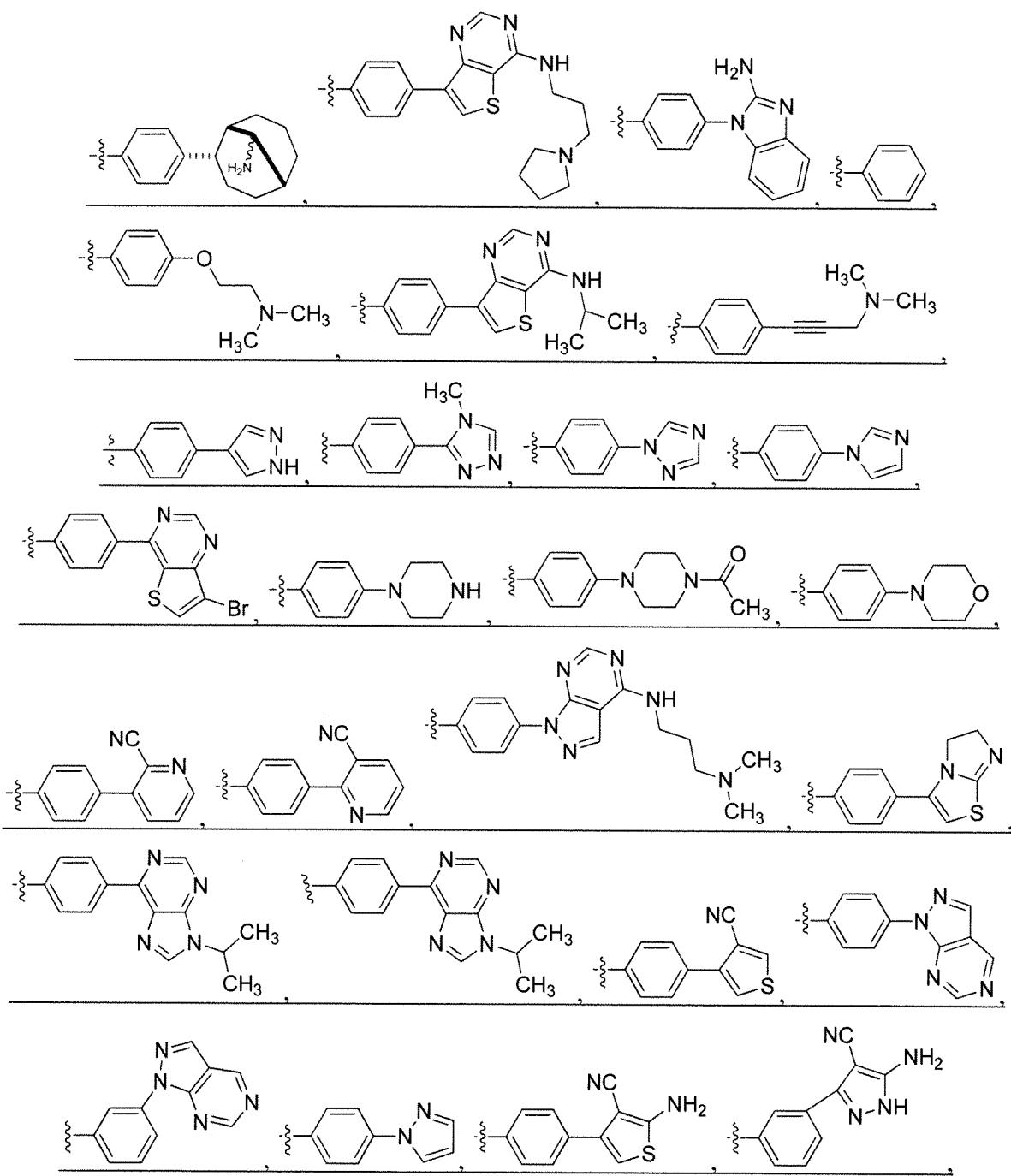


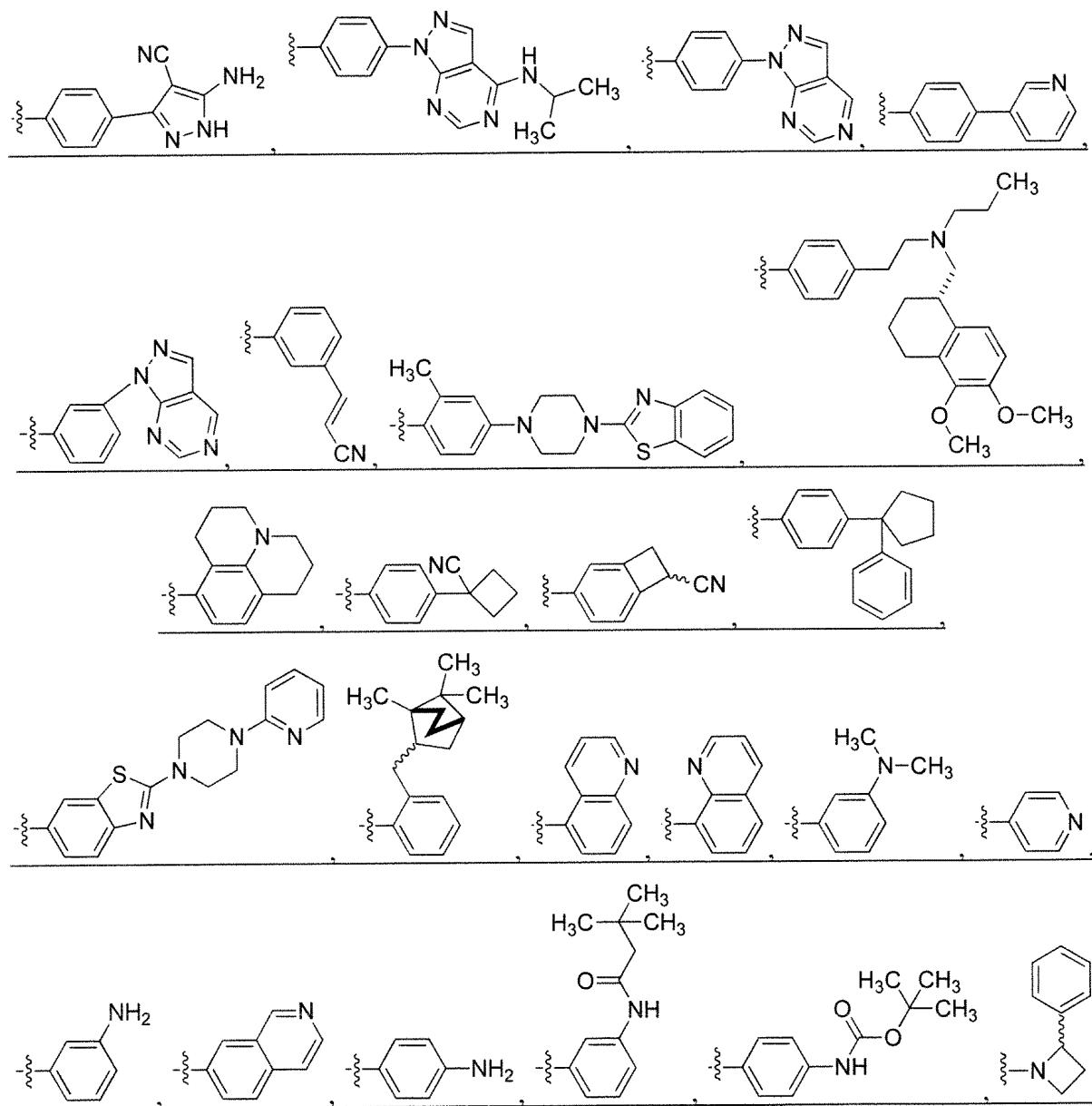
からなる群から選択される請求項 1 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

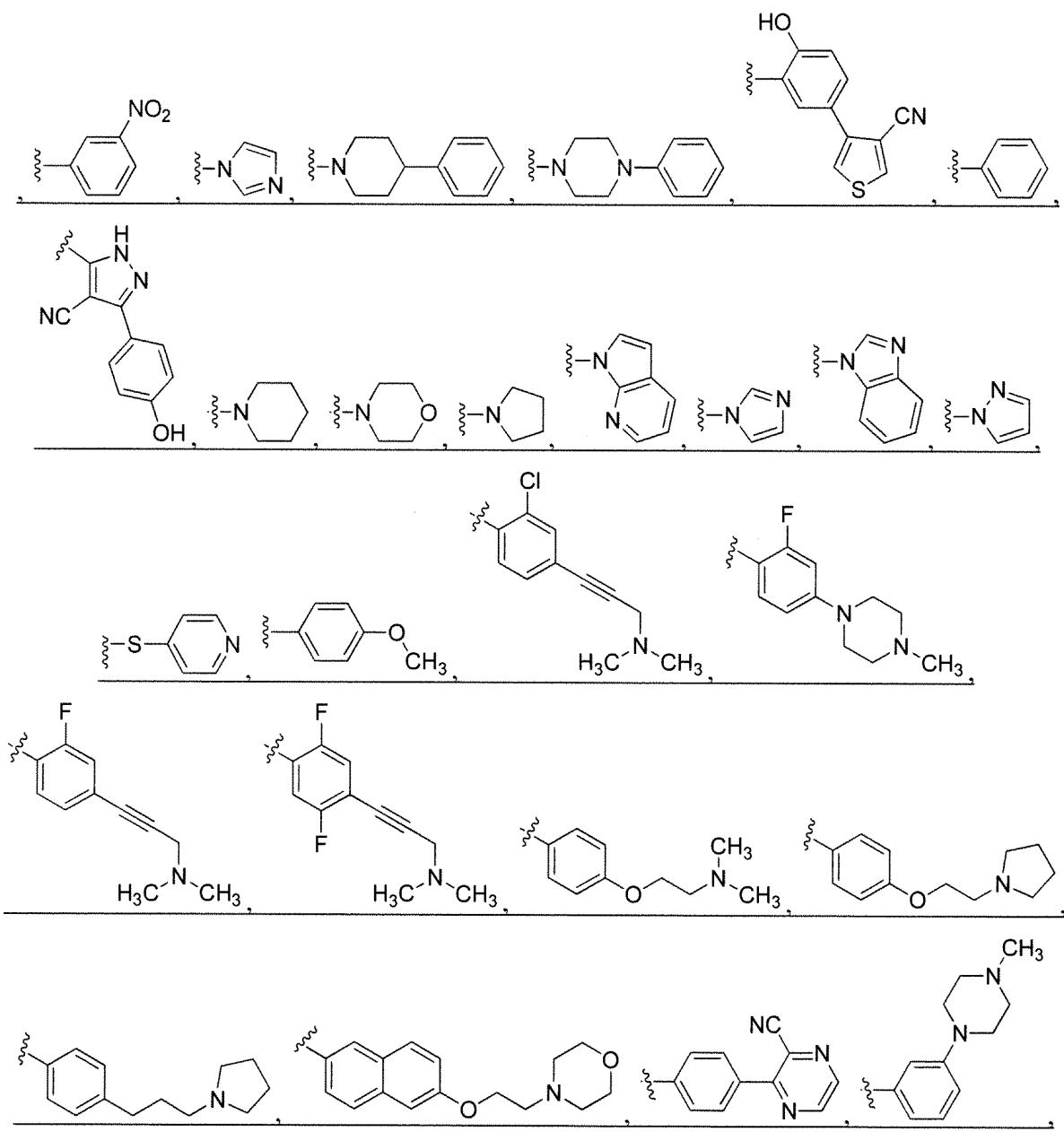
【請求項 2 8】

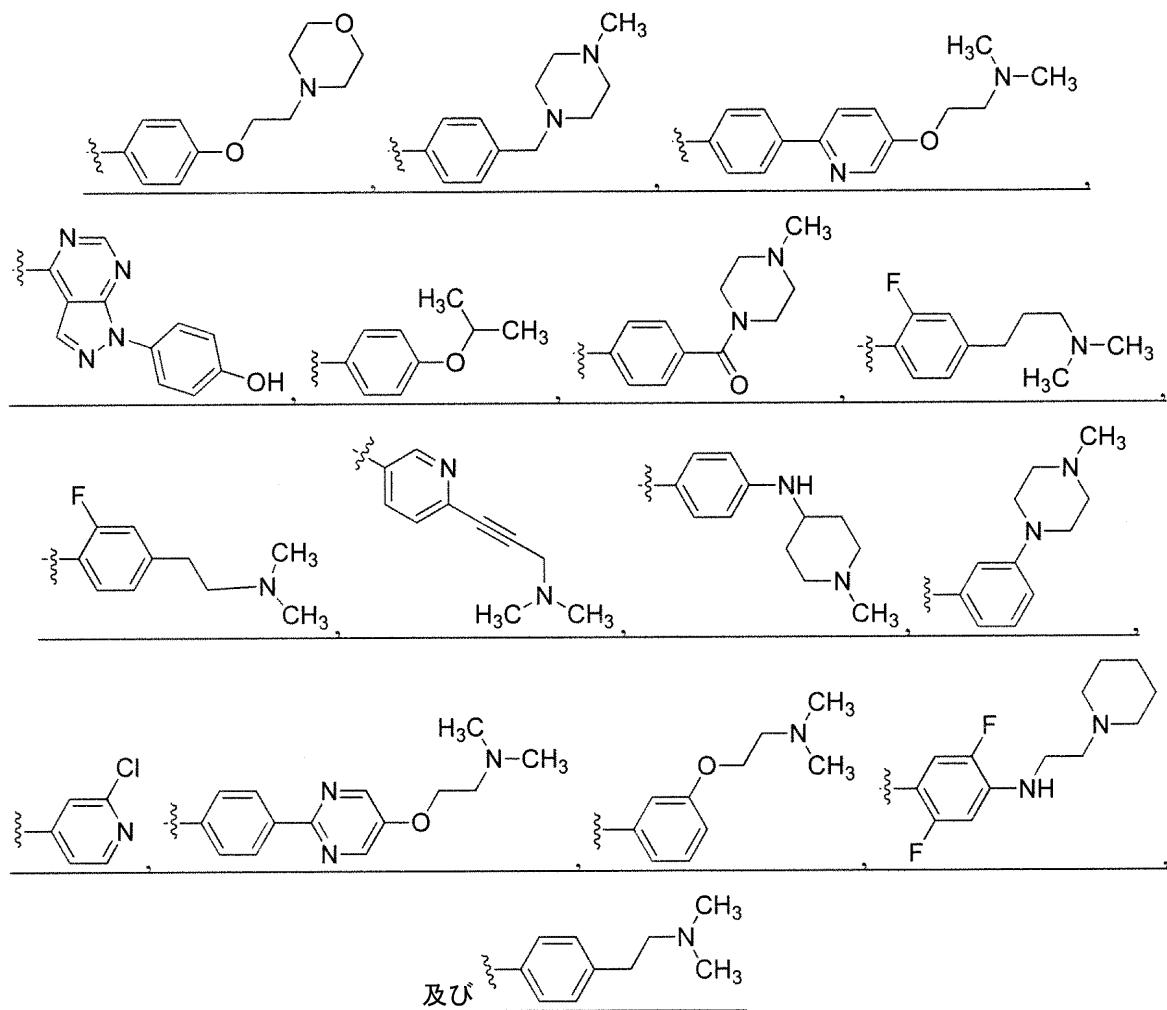
E が、







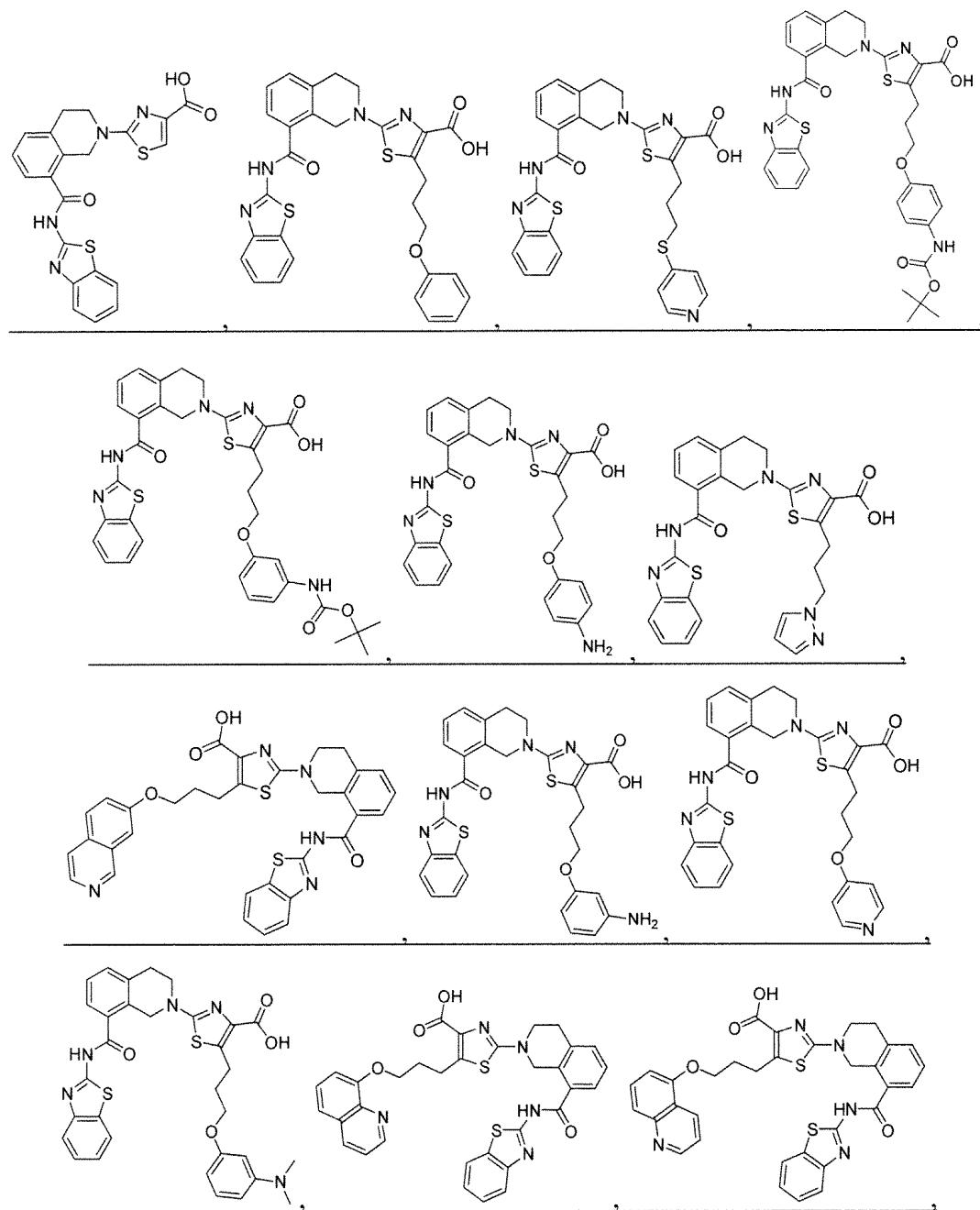


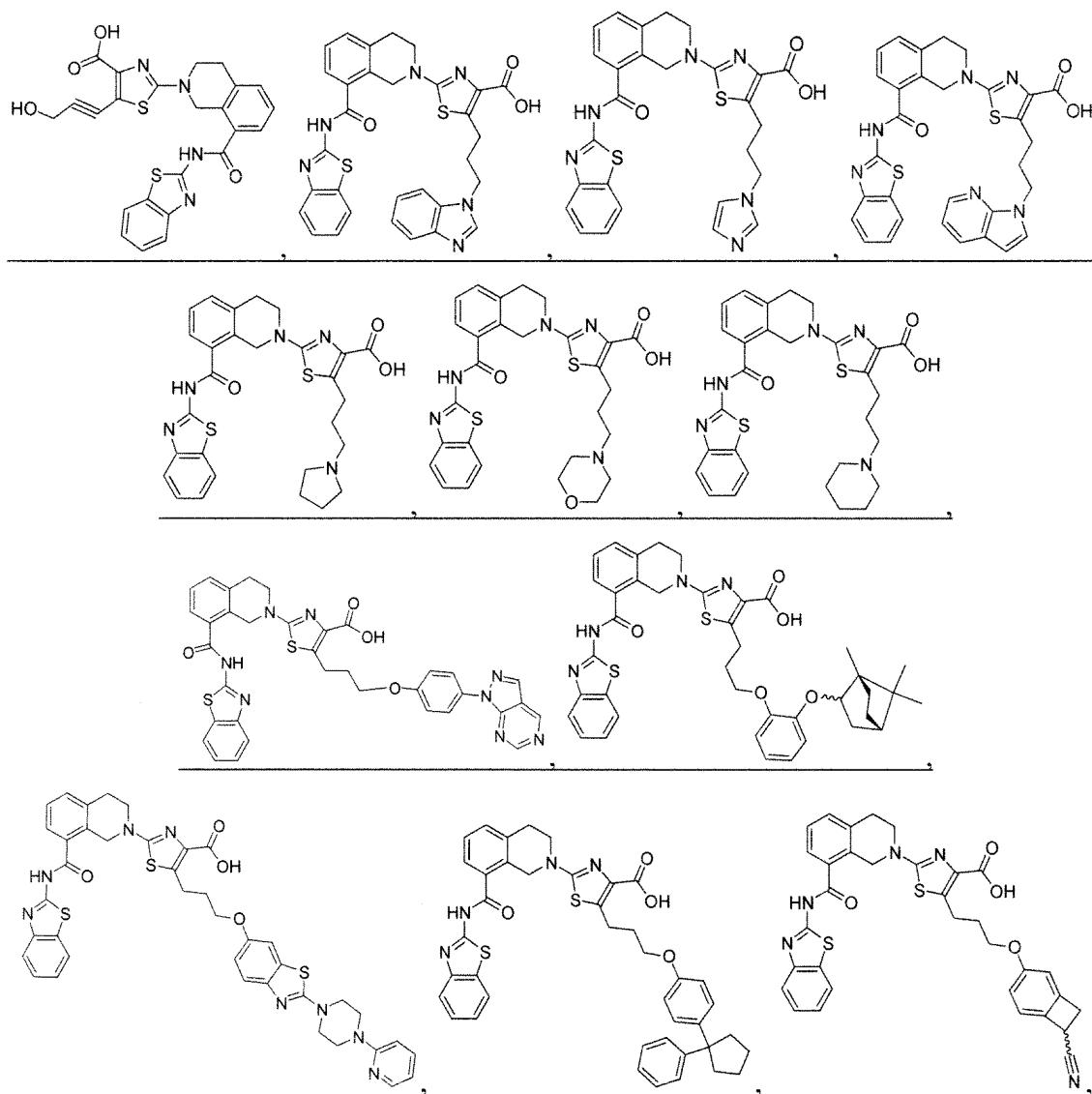


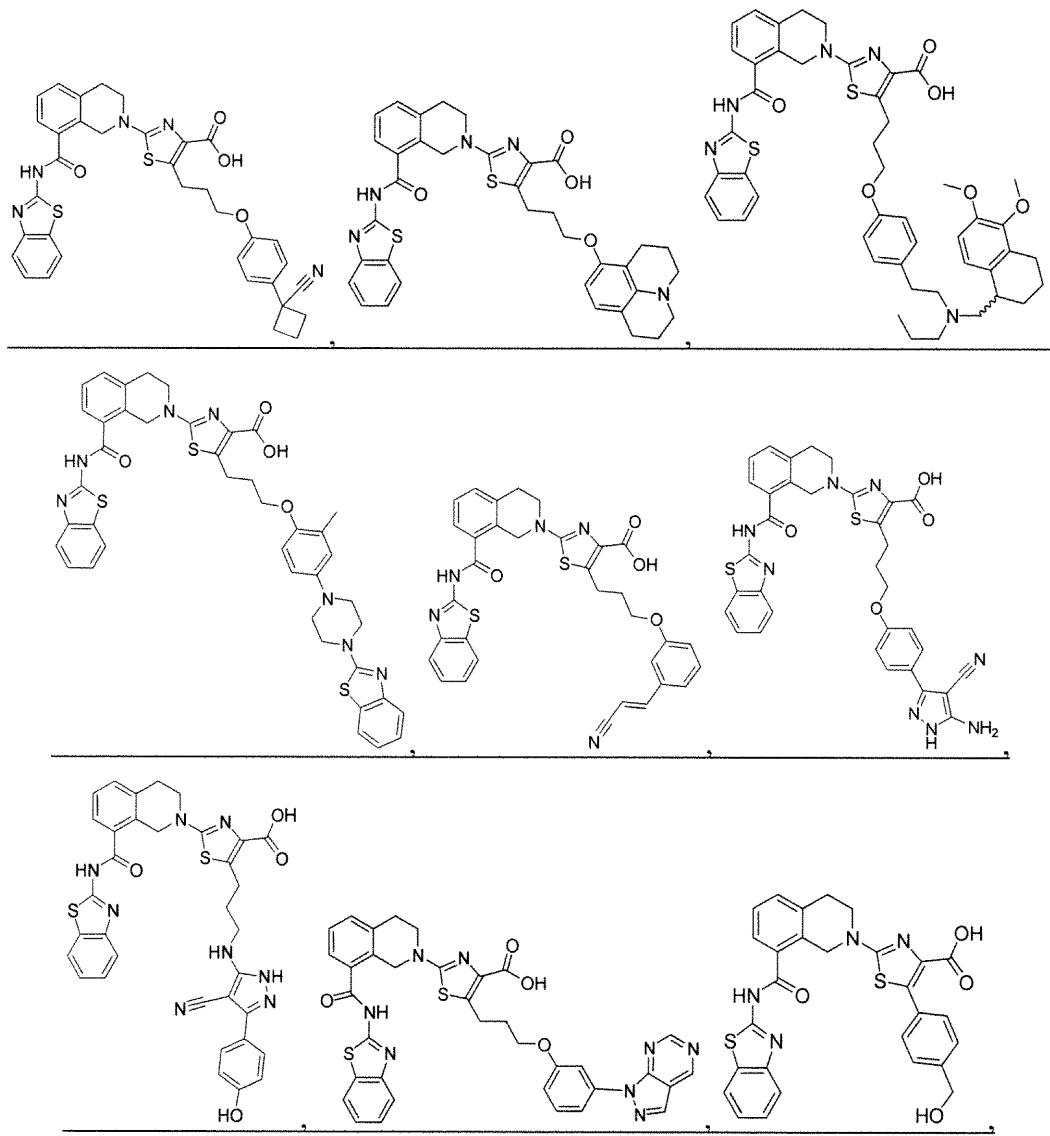
からなる群から選択される請求項1の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

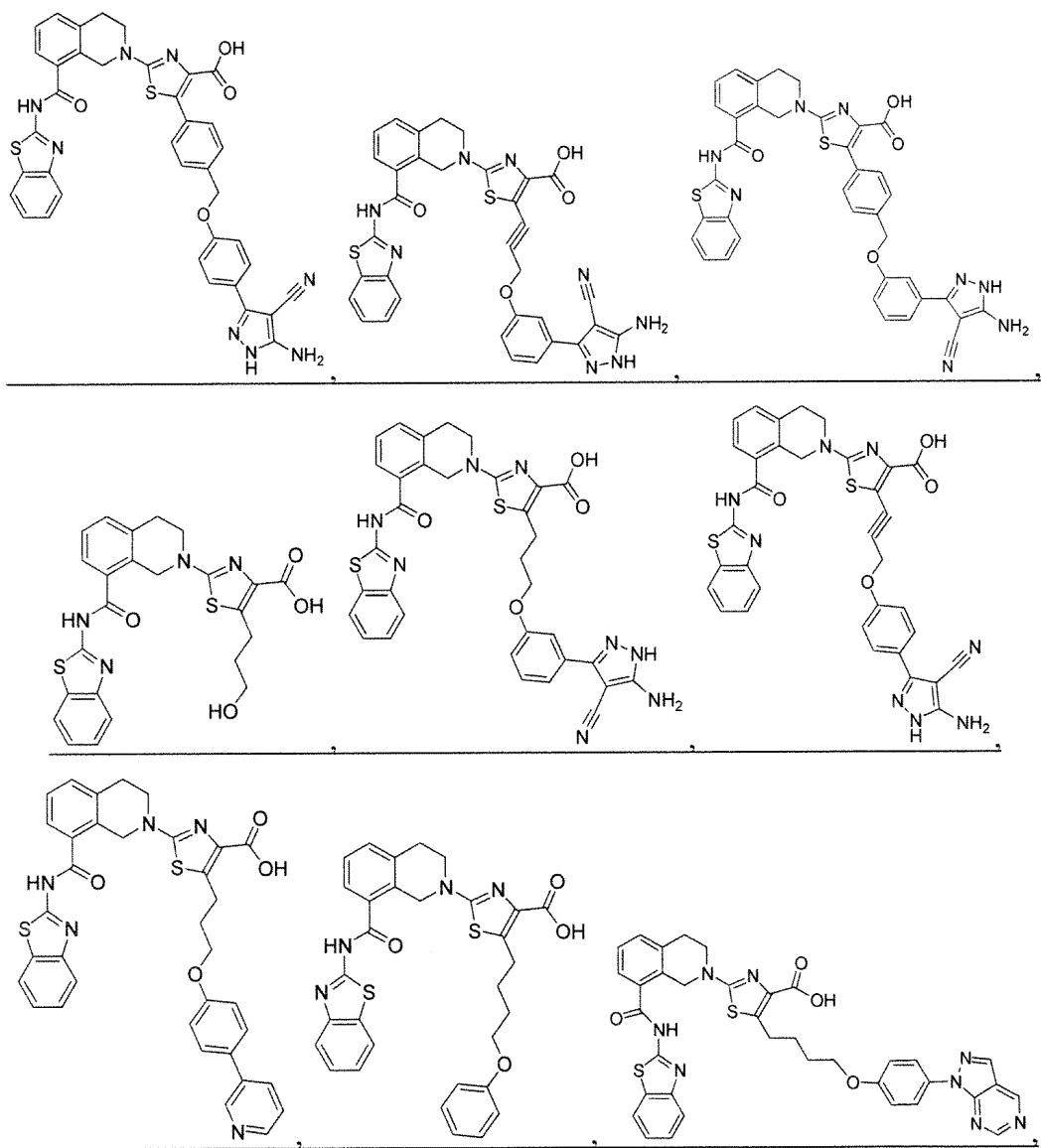
【請求項29】

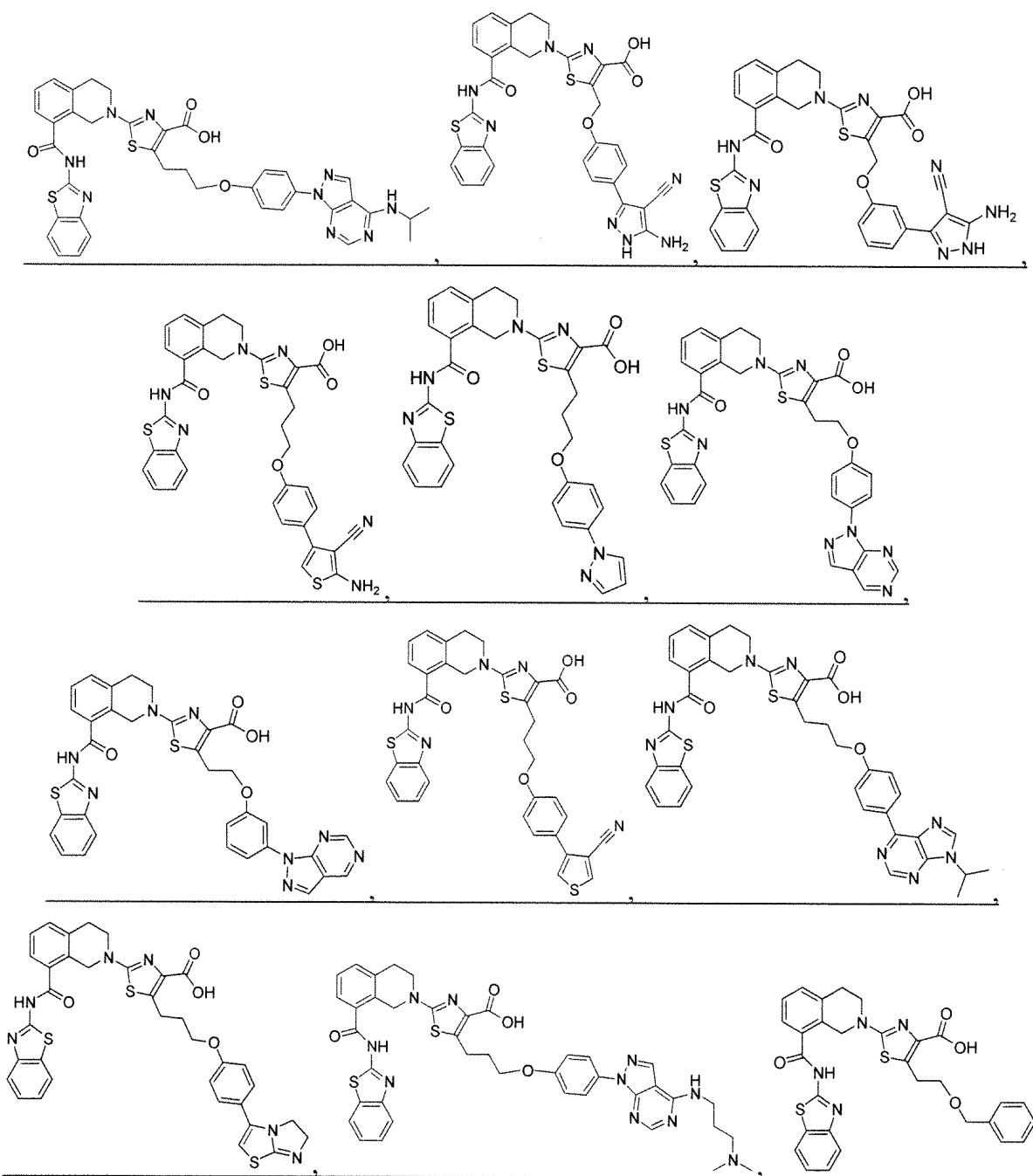
前記化合物が

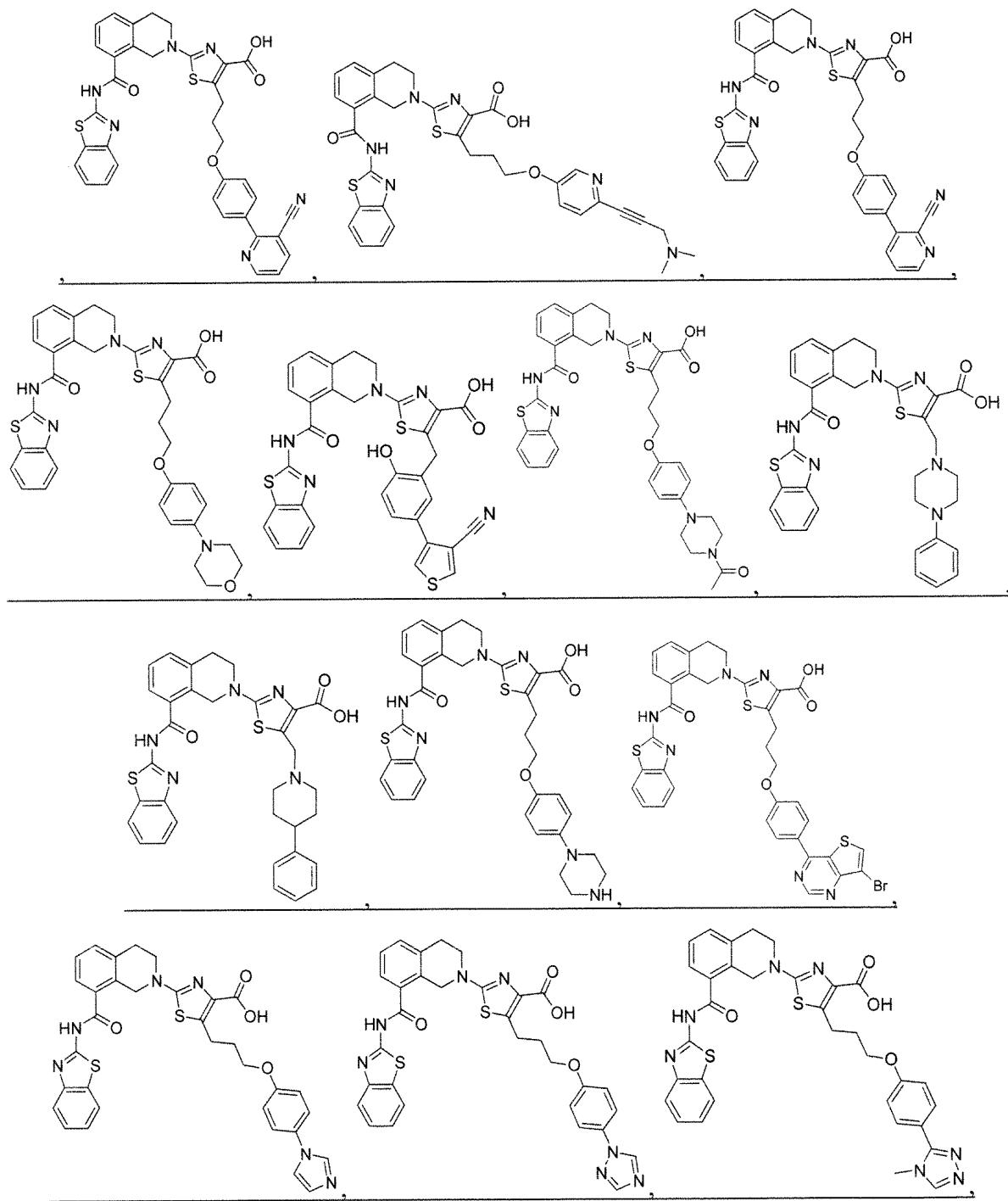


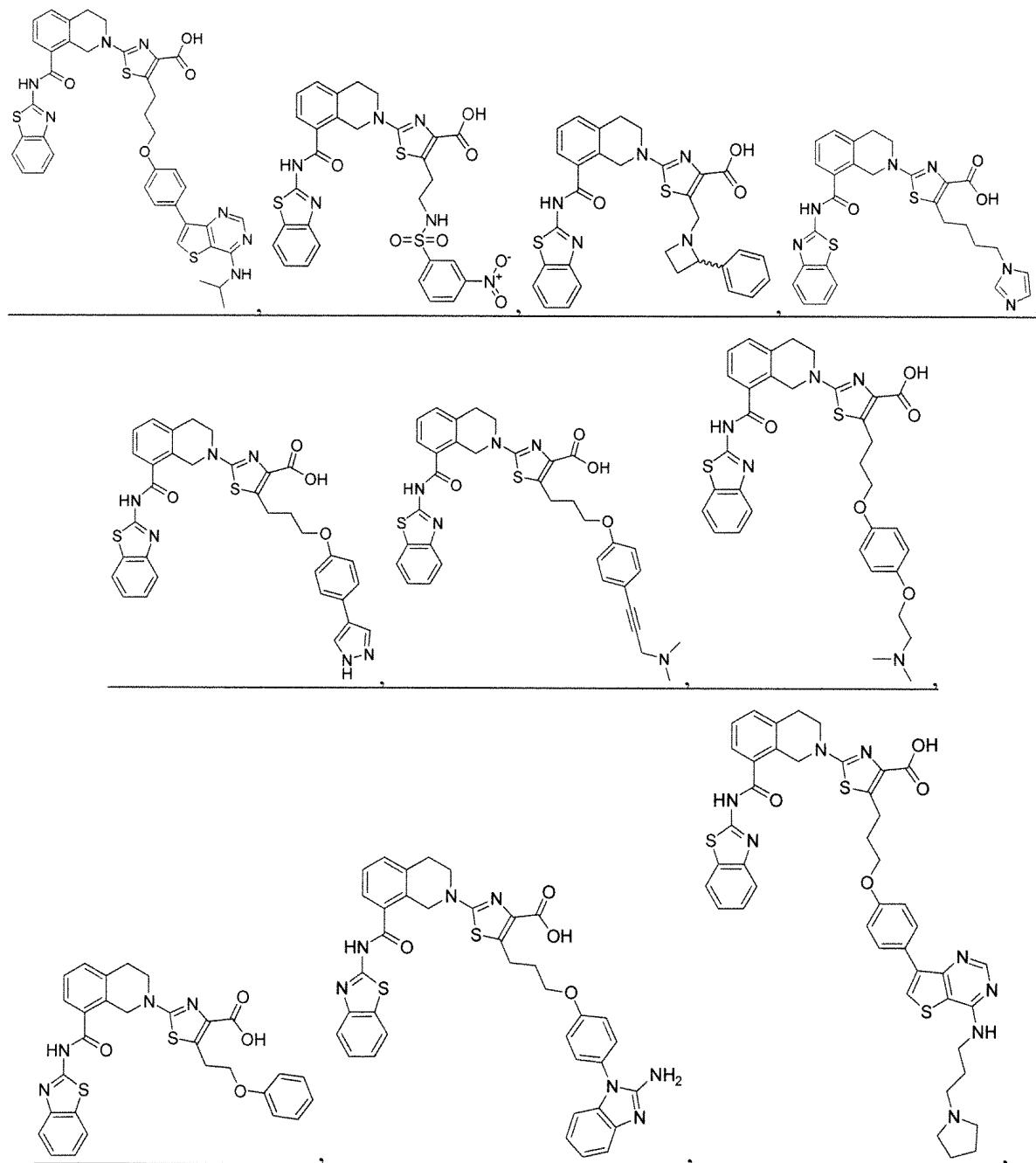


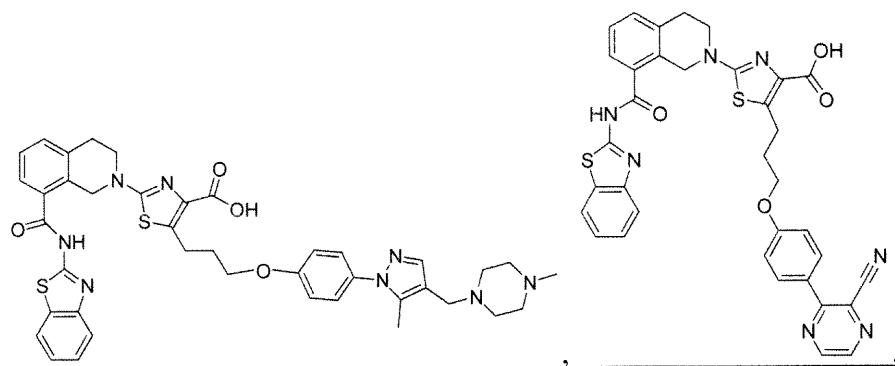
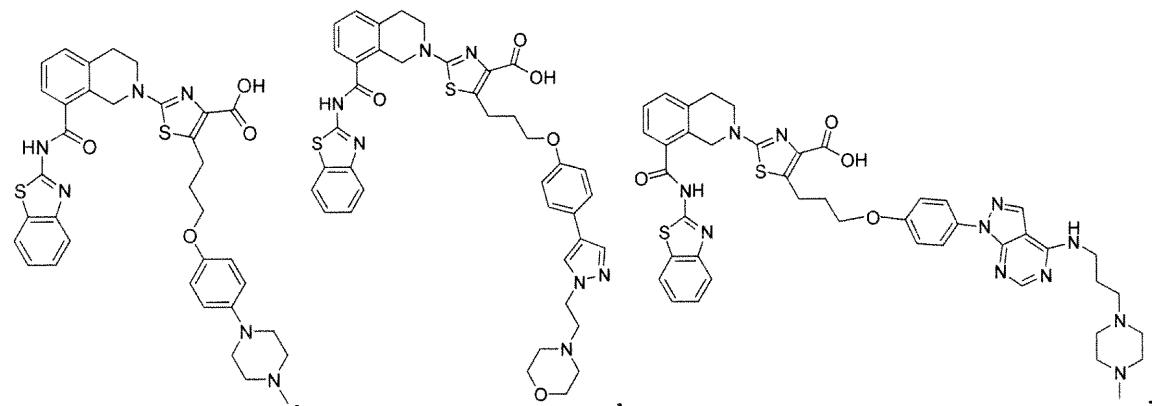
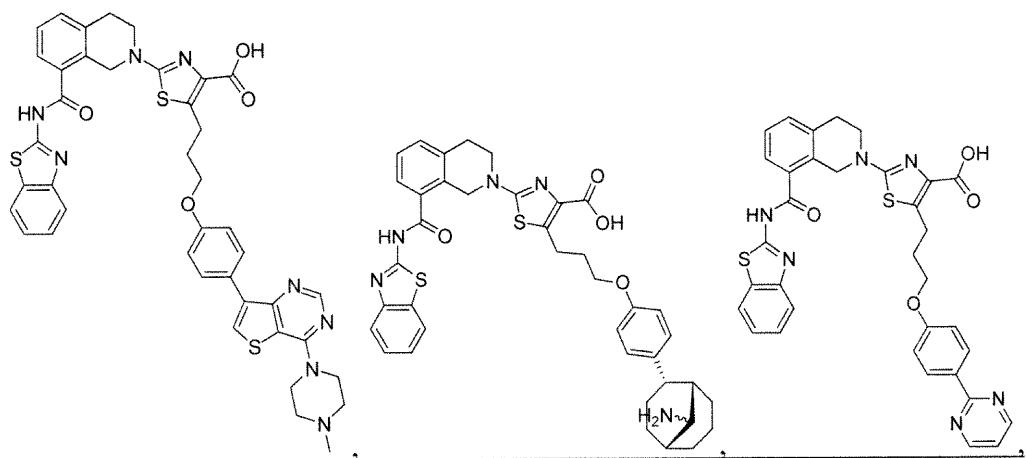


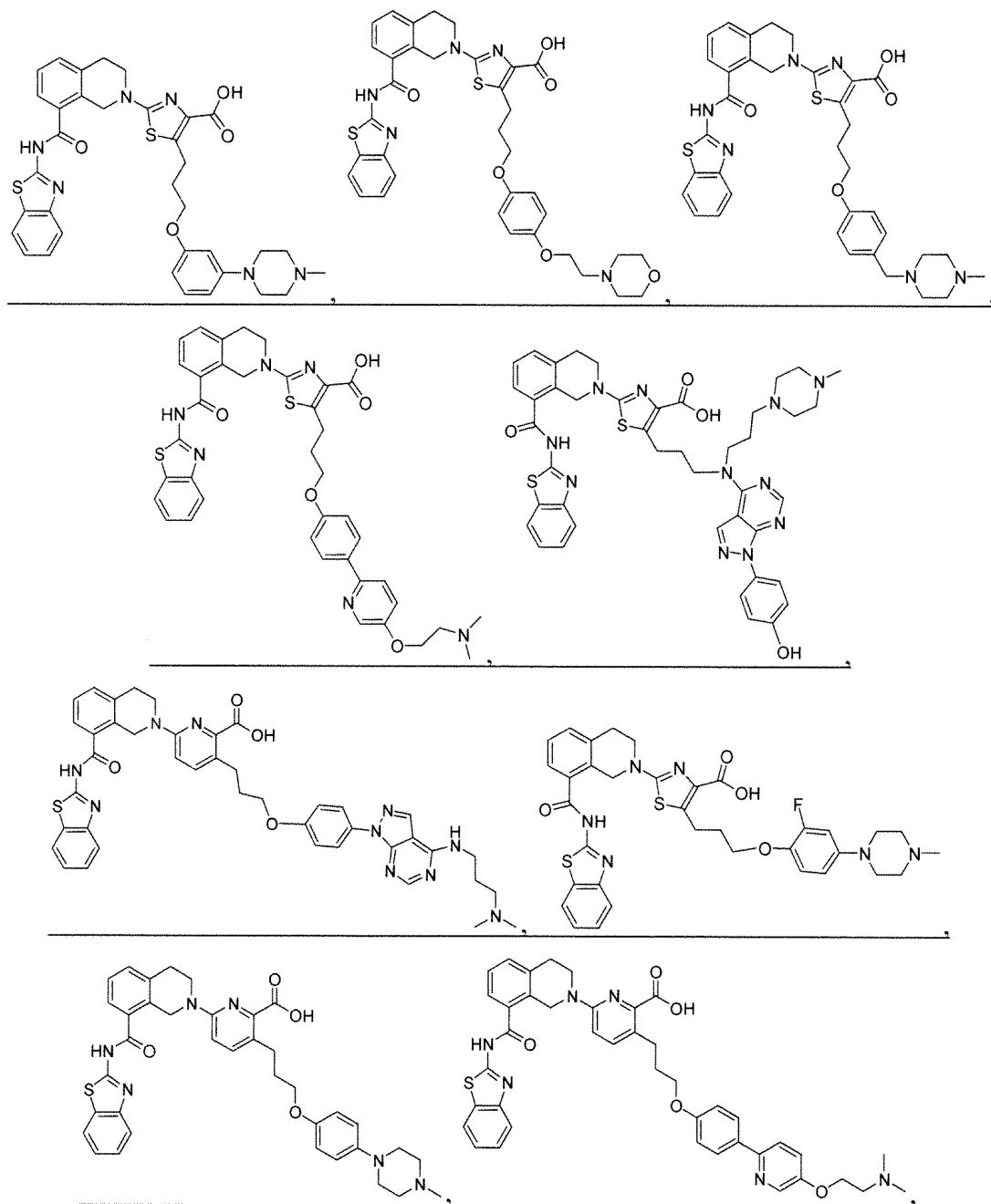


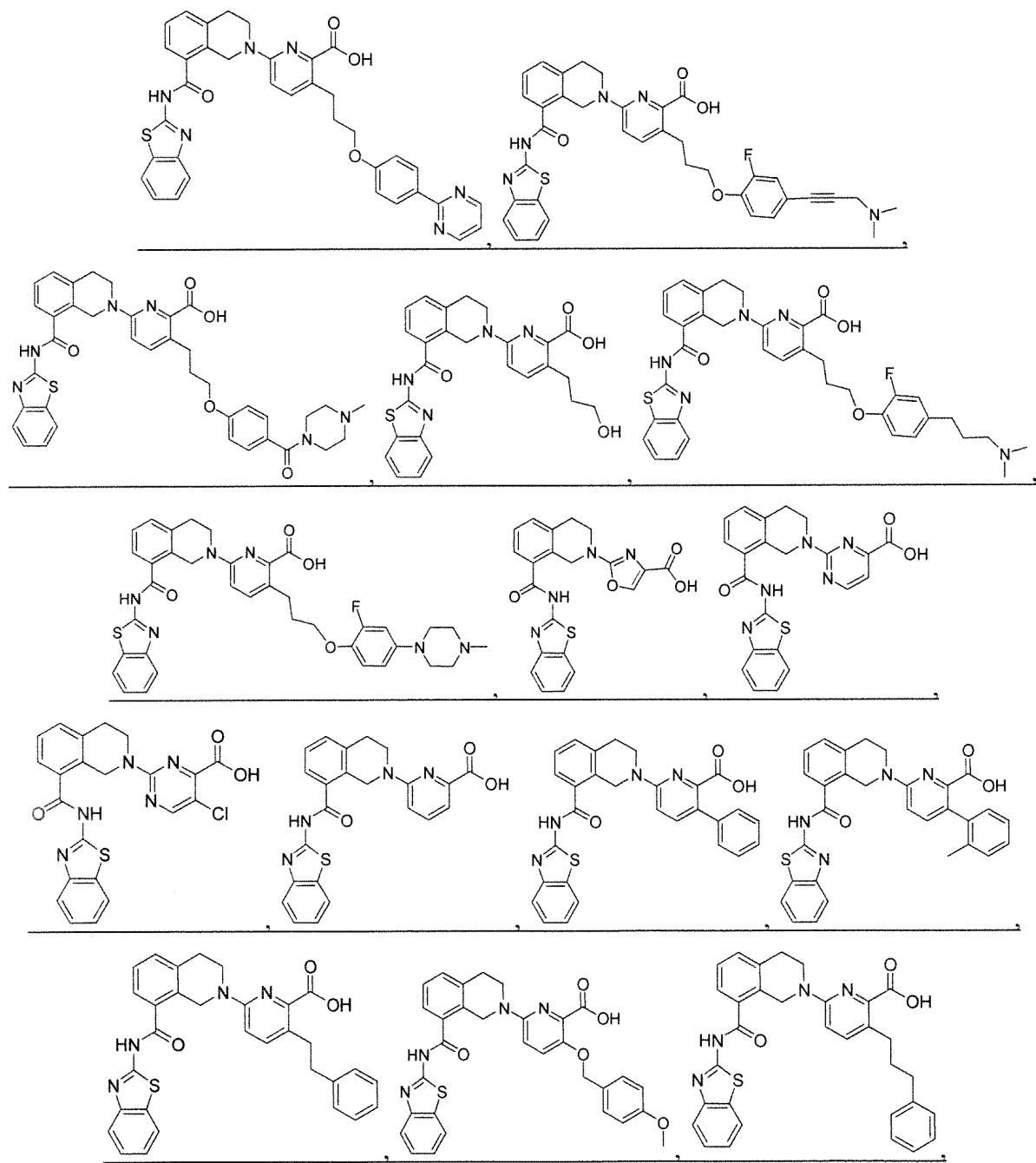


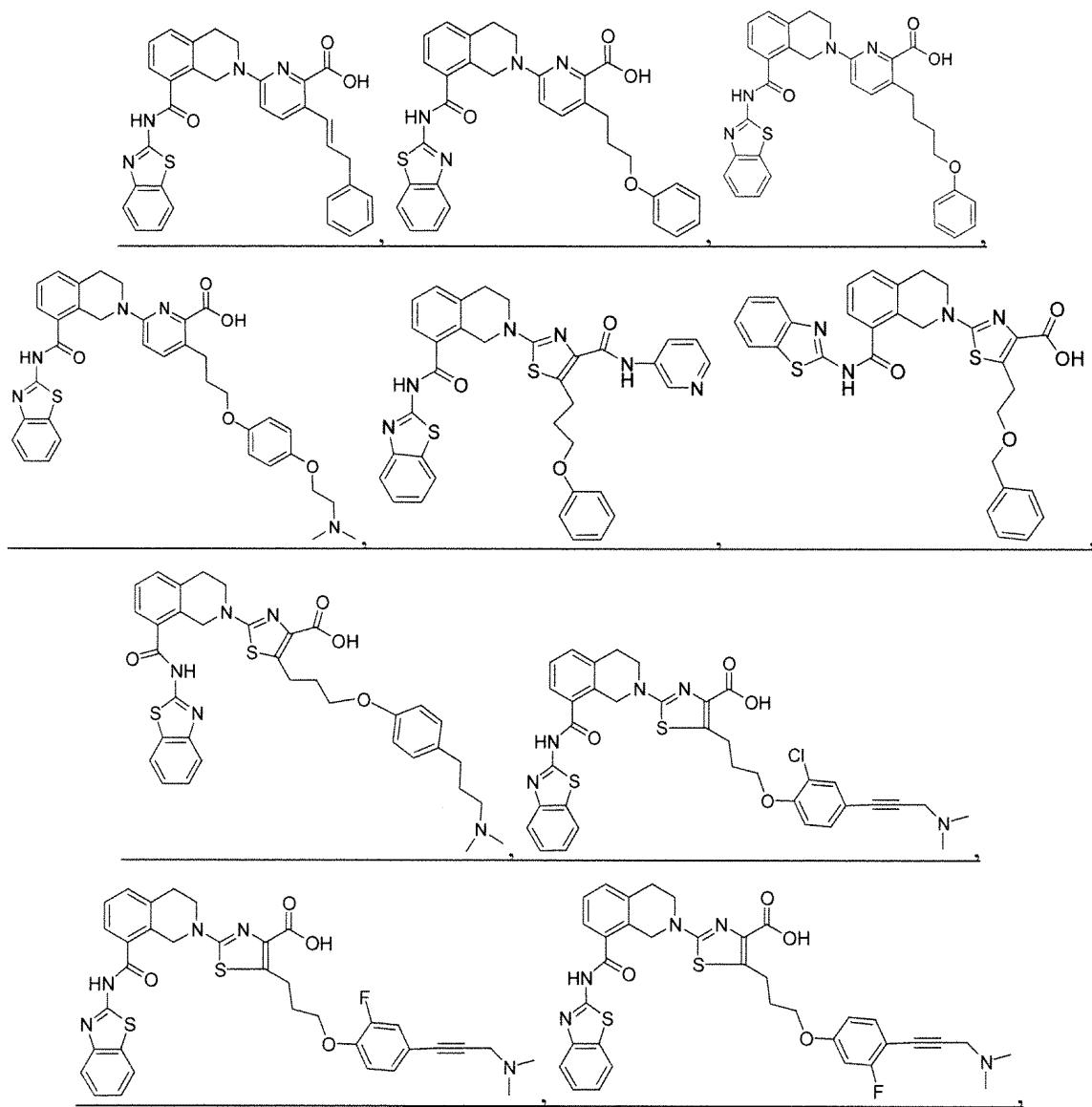


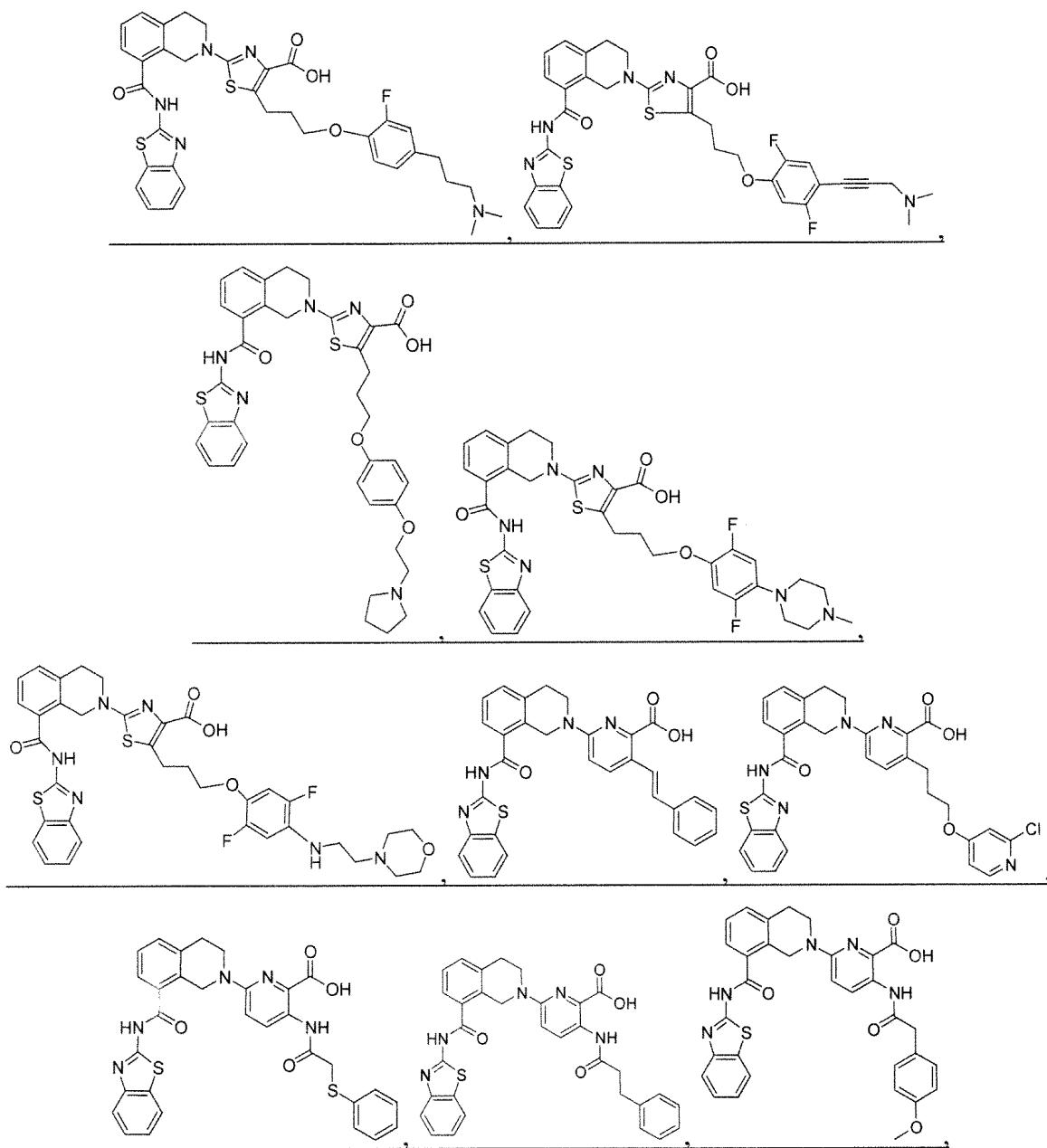


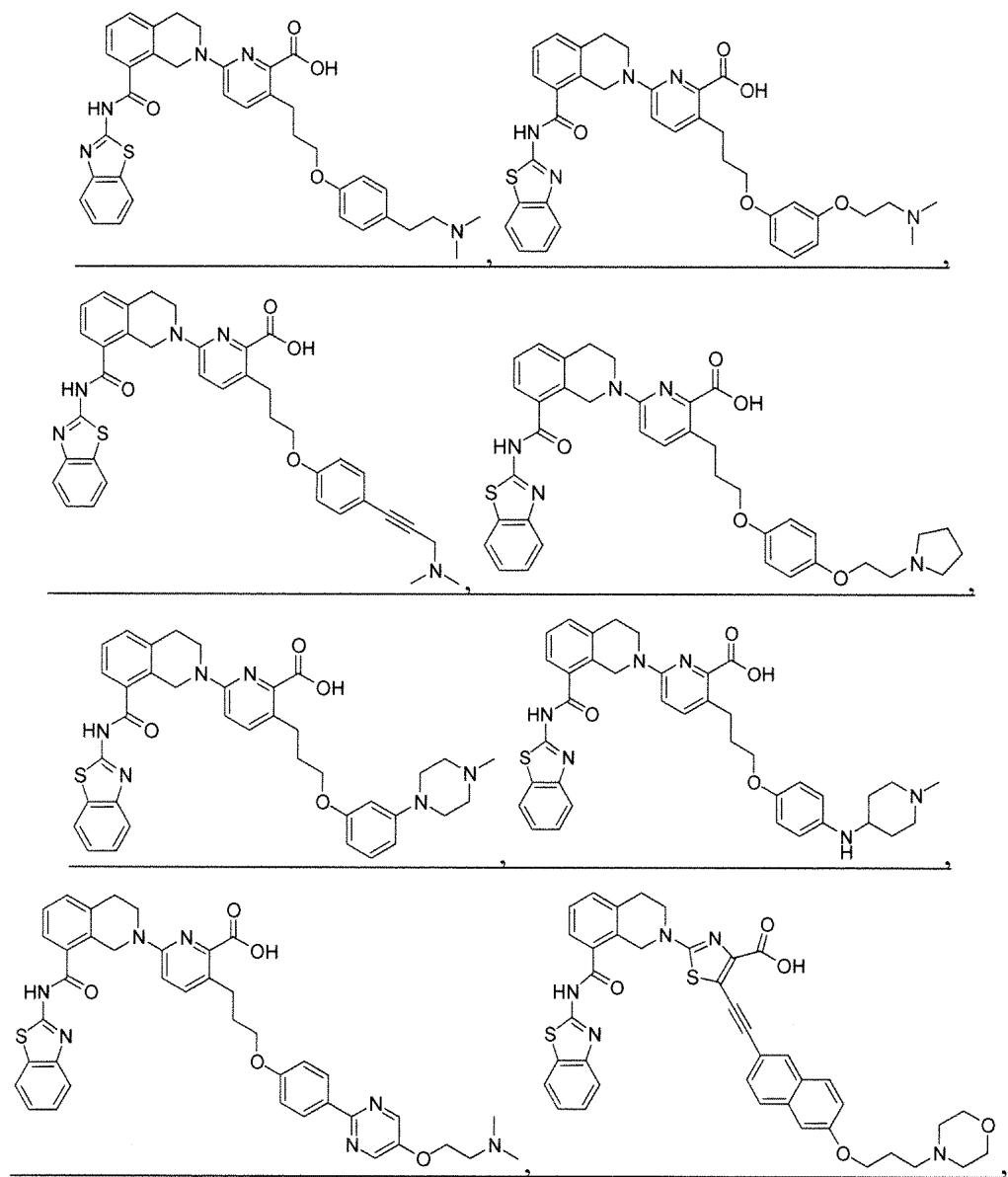


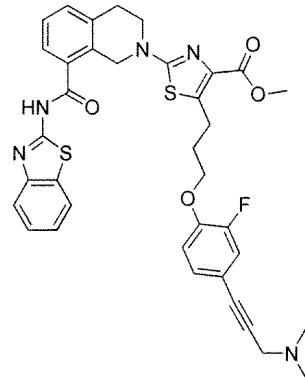
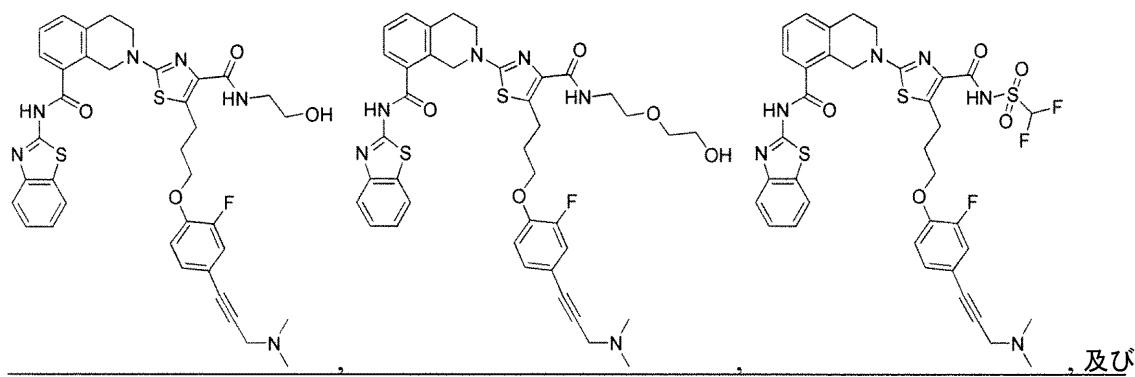
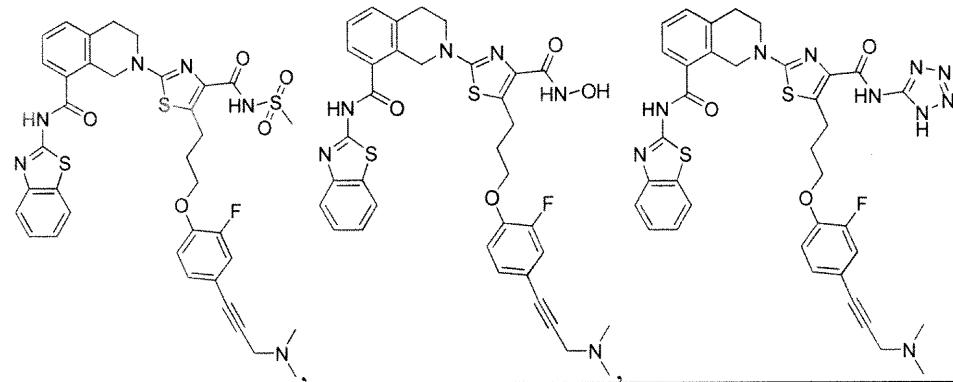
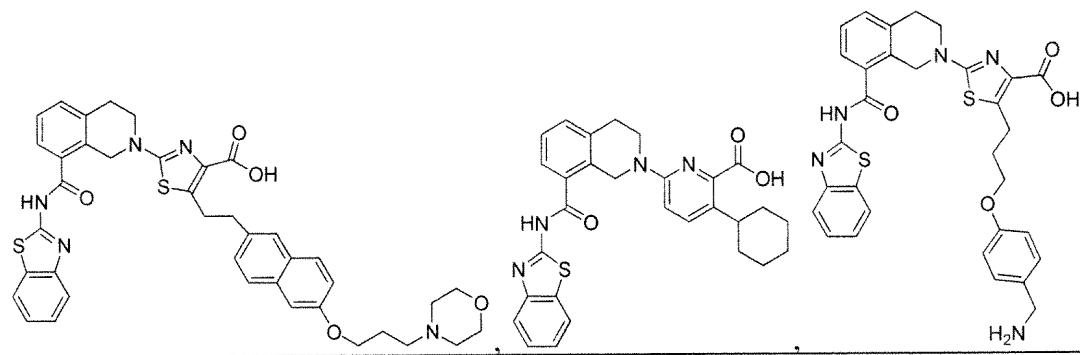












からなる群から選択される請求項 1 記載の化合物又は薬学的に許容可能な塩。

### 【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 3 1】

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。