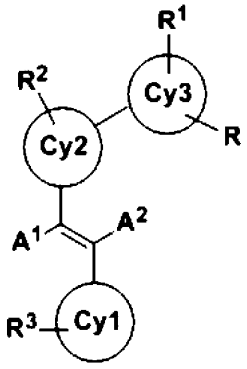
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和3年10月14日(2021.10.14)

【公表番号】特表2020-532551(P2020-532551A)
【公表日】令和2年11月12日(2020.11.12)
【年通号数】公開・登録公報2020-046
【出願番号】特願2020-512687(P2020-512687)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 401/14 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 13/12 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/16 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/10 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/506 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 405/14 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 471/04 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 401/14 ＣＳＰ
Ａ６１Ｐ 43/00 １１１
Ａ６１Ｐ 13/12
Ａ６１Ｐ 1/16
Ａ６１Ｐ 9/00
Ａ６１Ｐ 11/00
Ａ６１Ｐ 9/10
Ａ６１Ｐ 1/16 １０５
Ａ６１Ｐ 37/06
Ａ６１Ｐ 3/10
Ａ６１Ｋ 31/506
Ｃ０７Ｄ 405/14
Ｃ０７Ｄ 471/04 １０４Ｚ

【手続補正書】
【提出日】令和3年8月24日(2021.8.24)
【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】
下記の化学式（Ｉ）で表される化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【化１】



式中、

Ｃｙ１、Ｃｙ２、及びＣｙ３は、互いに独立して、アリールまたはヘテロアリールを表し、これらは、任意選択で、３～８員シクロアルキル、３～８員ヘテロシクロアルキル、６員アリール、または５～６員ヘテロアリールと縮合され；

R^1、R^2、及びR^3は、互いに独立して、水素、重水素、ハロ、－ＣＮ、－NO_2、または、任意選択で置換される、脂肪族、脂環式、ヘテロ脂肪族、複素環式、芳香族、ヘテロ芳香族、－OR^a、－NR^bR^c、－$S(=O)_wR^d$、－$O-S(=O)_wR^d$、－$S(=O)_wNR^eR^f$、－$C(=O)R^g$、－CO_2R^h、－$CONR^iR^j$、－$NR^kCONR^lR^m$、－$OCONR^nR^o$、若しくは－$NR^pCO_2R^q$から選択される、１個、２個、３個、または４個の互いに同一のまたは異なる置換基を表し；

Ｒは、任意選択で置換される、複素環式、芳香族、またはヘテロ芳香族であり；任意選択の置換基は、水素、重水素、ハロ、－ＣＮ、－NO_2、脂肪族、脂環式、ヘテロ脂肪族、複素環式、芳香族、ヘテロ芳香族、－OR^a、－NR^bR^c、－$S(=O)_wR^d$、－$O-S(=O)_wR^d$、－$S(=O)_wNR^eR^f$、－$C(=O)R^g$、－CO_2R^h、－$CONR^iR^j$、－$NR^kCONR^lR^m$、－$OCONR^nR^o$、または－$NR^kCO_2R^p$から選択され；

R^a、R^b、R^c、R^d、R^e、R^f、R^g、R^h、R^i、R^j、R^k、R^l、R^m、R^n、R^o、R^p、及びR^qは、互いに独立して、水素、重水素、ハロ、－ＣＮ、－NO_2、または、任意選択で置換される、脂肪族、脂環式、ヘテロ脂肪族、複素環式、芳香族、若しくはヘテロ芳香族から選択され；任意選択の置換基は、水素、重水素、ハロ、－ＣＮ、－NO_2、脂肪族、脂環式、ヘテロ脂肪族、複素環式、芳香族、ヘテロ芳香族、－OR^{aa}、－$NR^{bb}R^{cc}$、－$S(=O)_wR^{dd}$、－$S(=O)_wNR^{ee}R^{ff}$、－$C(=O)R^{gg}$、－CO_2R^{hh}、－$CONR^{ii}R^{jj}$、－$NR^{kk}CONR^{ll}R^{mm}$、－$OCONR^{nn}R^{oo}$、または－$NR^{kk}CO_2R^{pp}$から選択され；R^b及びR^c、R^e及びR^f、R^i及びR^j、R^l及びR^m、またはR^n及びR^oは、同一の窒素に結合した場合、任意選択で複素環を形成してもよく、任意選択で、環原子として、Ｏ、$S(O)_w$、またはＮから選択される１～５個の追加的な複素原子を含有してもよく、あるいは、任意選択で、１以上の水素、重水素、ハロ、－ＣＮ、－NO_2、脂肪族、脂環式、ヘテロ脂肪族、ヘテロ脂肪族、複素環式、芳香族、またはヘテロ芳香族で置換してもよく；

R^{aa}、R^{bb}、R^{cc}、R^{dd}、R^{ee}、R^{ff}、R^{gg}、R^{hh}、R^{ii}、R^{jj}、R^{kk}、R^{ll}、R^{mm}、R^{nn}、R^{oo}、及びR^{pp}は、互いに独立して、水素、重水素、ハロ、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＨ、－CH_2F、－CHF_2、－CF^3、－OCH_3、－OCH_2F、－$OCHF_2$、－OCF_3、－NH_2、－$NHCH_3$、－$N(CH_3)_2$、－CO_2H、－ＳＨ、－$S(O)_wCH_3$、脂肪族、脂環式、ヘテロ脂肪族、複素環式、芳香族、またはヘテロ芳香族から選択され；

ｗは、０、１、または２であり；

A^1及びA^2は、互いに独立して、水素、重水素、ハロ、－ＣＮ、－NO_2、または、任意選択で置換される、脂肪族、脂環式、ヘテロ脂肪族、複素環式、芳香族、若しくはヘテロ芳香族から選択され；任意選択の置換基は、水素、重水素、ハロ、－ＣＮ、－NO_2、－CH_2F、－CHF_2、－CF_3、－OCH_2F、－$OCHF_2$、－OCF_3、脂肪族、脂環式、ヘテロ脂肪族、複素環式、芳香族、またはヘテロ芳香族から選択される。

【請求項２】

請求項１に記載の化合物であって、

Ｃｙ１は、単環式、二環式、または三環式のヘテロアリールである、化合物。

【請求項３】

請求項２に記載の化合物であって、

Ｃｙ１は、ピリジニル、ピリドニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、トリアジニル、テトラジニル、キノリニル、キナゾリニル、キノキサリニル、シンノリニル、イソキノリニル、インドリル、アザ－インドリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、またはベンゾチアゾリルから選択される、化合物。

【請求項４】

請求項１に記載の化合物であって、

Ｃｙ２及びＣｙ３は、互いに独立して、単環式若しくは二環式の芳香族、または、単環式若しくは二環式のヘテロ芳香族を表す、化合物。

【請求項５】

請求項４に記載の化合物であって、

Ｃｙ２及びＣｙ３は、互いに独立して、フェニル、ナフチル、ピリジニル、ピリドニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、トリアジニル、テトラジニル、キノリニル、キナゾリニル、キノキサリニル、シンノリニル、インドリル、アザ－インドリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、またはベンゾチアゾリルから選択される、化合物。

【請求項６】

請求項１に記載の化合物であって、

Ｒは、複素環基である、化合物。

【請求項７】

請求項６に記載の化合物であって、

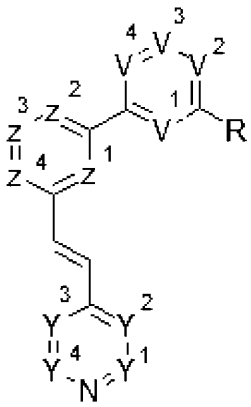
Ｒは、ピロリジニル、インドリニル、イソインドリニル、アザ－インドリニル、アザ－イソインドリニル、ジヒドロインダゾリル、テトラヒドロキノリニル、テトラヒドロイソキノリニル、アザ－テトラヒドロキノリニル、またはアザ－テトラヒドロイソキノリニルから選択される、化合物。

【請求項８】

請求項１に記載の化合物であって、

下記の化学式（Ｉａ）で表される化合物。

【化２】



式中、

V^1、V^2、V^3、及びV^4は、互いに独立して、ＮまたはＣ－R^1であり、互いに隣接する炭素原子の２つのR^1基は、それらが結合している炭素と共に、任意選択で、３～７員の芳香族、ヘテロ芳香族、または複素環を形成してもよく、任意選択で、環原子として、Ｏ、Ｓ（Ｏ）$_w$、またはＮから選択される１～５個の追加的な複素原子を含有してもよく、あるいは、任意選択で、１以上の水素、重水素、ハロ、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＨ、－CH_2F、－CHF_2、－CF_3、－OCH_3、－OCH_2F、$OCHF_2$、－OCF_3、－NH_2、－$NHCH_3$、－$N(CH_3)_2$、－CO_2H、－ＳＨ、－Ｓ（Ｏ）$_w$$CH_3$、脂肪族、または複素環式で置換してもよく；

Z^1、Z^2、Z^3、及びZ^4は、互いに独立して、ＮまたはＣ－R^2であり、互いに隣接する炭素原子の２つのR^2基は、それらが結合している炭素と共に、任意選択で、３～７員の芳香族、ヘテロ芳香族、または複素環を形成してもよく、任意選択で、環原子として、Ｏ、Ｓ（Ｏ）$_w$、またはＮから選択される１～５個の付加的な複素原子を含有してもよく、あるいは、任意選択で、１以上の水素、重水素、ハロ、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＨ、－CH_2F、－CHF_2、－CF_3、－OCH_3、－OCH_2F、$OCHF_2$、－OCF_3、－NH_2、－$NHCH_3$、－$N(CH_3)_2$、－CO_2H、－ＳＨ、－Ｓ（Ｏ）$_w$$CH_3$、脂肪族、または複素環式で置換してもよく；

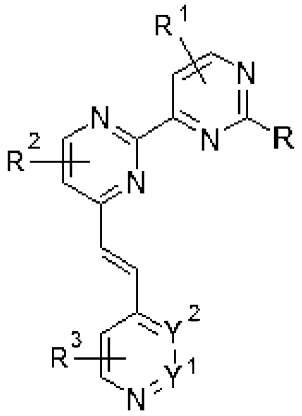
Y^1、Y^2、Y^3、及びY^4は、互いに独立して、ＮまたはＣ－R^3であり、互いに隣接する炭素原子の２つのR^3基は、それらが結合している炭素と共に、任意選択で、３～７員の芳香族、ヘテロ芳香族、または複素環を形成してもよく、複素環は、任意選択で、環原子として、Ｏ、Ｓ（Ｏ）$_w$、またはＮから選択される１～５個の付加的な複素原子を含有してもよく、任意選択の置換基は、１以上の水素、重水素、ハロ、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＨ、－CH_2F、－CHF_2、－CF_3、－OCH_3、－OCH_2F、$OCHF_2$、－OCF_3、－NH_2、－$NHCH_3$、－$N(CH_3)_2$、－CO_2H、－ＳＨ、－Ｓ（Ｏ）$_w$$CH_3$、脂肪族、または複素環式から選択される。

【請求項９】

請求項８に記載の化合物であって、

下記の化学式（Ｉｂ）で表される化合物。

【化３】



式中、

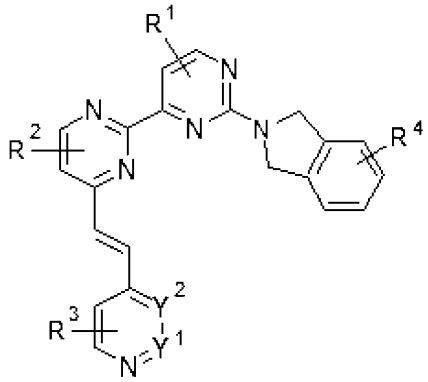
Y^1、及びY^2は、互いに独立して、ＮまたはＣ－R^3であり、２つのR^3基は、それらが結合している炭素と共に、任意選択で、３～７員の芳香族、ヘテロ芳香族、または複素環を形成してもよく、任意選択で、環原子として、Ｏ、Ｓ（Ｏ）$_w$、またはＮから選択される１～５個の付加的な複素原子を含有してもよく、あるいは、任意選択で、１以上の水素、重水素、ハロ、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＨ、－CH_2F、－CHF_2、－CF_3、－OCH_3、－OCH_2F、$OCHF_2$、－OCF_3、－NH_2、－$NHCH_3$、－$N(CH_3)_2$、－CO_2H、－ＳＨ、－Ｓ（Ｏ）$_w$$CH_3$、脂肪族、または複素環式で置換してもよい。

【請求項１０】

請求項９に記載の化合物であって、

下記の化学式（Ｉｃ）で表される化合物。

【化４】



式中、

R^4は、水素、重水素、ハロ、－ＣＮ、－NO_2、脂肪族、脂環式、ヘテロ脂肪族、複素環式、芳香族、ヘテロ芳香族、－OR^a、－NR^bR^c、－Ｓ（＝Ｏ）$_w$$R^d$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_w$$R^d$、－Ｓ（＝Ｏ）$_w$$NR^eR^f$、－Ｃ（＝Ｏ）$R^g$、－$CO_2R^h$、－$CONR^iR^j$、－$NR^kCONR^lR^m$、－$OCONR^nR^o$、または－$NR^kCO_2R^p$から選択される、１個、２個、３個、または４個の互いに同一のまたは異なる置換基を表す。

【請求項１１】

請求項１に記載の化合物であって、

（Ｅ）－５－メトキシ－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン；

（Ｅ）－２－（４－（２－（１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ビニル）－［２、４′－ビ

ピリミジン］－２′－イル）－５－メトキシイソインドリン；
（Ｅ）－４－（２－（２′－（５－メトキシイソインドリン－２－イル）－［２、４′－ビピリミジン］－４－イル）ビニル）キノロン；
（Ｅ）－４－（２－（２′－（５－メトキシイソインドリン－２－イル）－［２、４′－ビピリミジン］－４－イル）ビニル）－１Ｈ－ピロロ［２、３－ｂ］ピリジン；
（Ｅ）－４－（２－（２′－（５－メトキシイソインドリン－２－イル）－［２、４′－ビピリミジン］－４－イル）ビニル）ピリミジン－２－アミン；
（Ｅ）－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン－５－オール；
（Ｅ）－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン－５－イルトリフルオロメタンスルホネート；
（Ｅ）－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン－５－カルボニトリル；
（Ｅ）－Ｎ、Ｎ－ジメチル－２－（（２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン－５－イル）オキシ）エタンアミン；
（Ｅ）－メチル－（（２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン－５－イル）オキシ）アセテート；
（Ｅ）－Ｎ－メチル－２－（（２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン－５－イル）オキシ）アセトアミド；
（Ｅ）－Ｎ－エチル－２－（（２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン－５－イル）オキシ）アセトアミド；
（Ｅ）－Ｎ－イソプロピル－２－（（２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン－５－イル）オキシ）アセトアミド；
（Ｅ）－５－フルオロ－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン；
（Ｅ）－５－クロロ－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン；
（Ｅ）－５－ブロモ－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン；
（Ｅ）－５－ヨード－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン；
（Ｅ）－５－エトキシ－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン；
（Ｅ）－５－イソプロポキシ－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン；
（Ｅ）－５－シクロプロポキシ－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン；
（Ｅ）－５－メチル－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン；
（Ｅ）－５－エチル－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン；
（Ｅ）－５－シクロプロピル－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン；
（Ｅ）－５－アミノ－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン；
（Ｅ）－５－メチルアミノ－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２

、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン；
（Ｅ）－５－ジメチルアミノ－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン；
（Ｅ）－５－ビニル－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン；
（Ｅ）－５－プロパルギル－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン；
Ｎ－メチル－２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－２－イル］ピリミジン－２－イル］イソインドリン－５－カルボキサミド；
Ｎ－エチル－２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－２－イル］ピリミジン－２－イル］イソインドリン－５－カルボキサミド；
Ｎ－イソプロピル－２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－２－イル］ピリミジン－２－イル］イソインドリン－５－カルボキサミド；
Ｎ－シクロプロピル－２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－２－イル］ピリミジン－２－イル］イソインドリン－５－カルボキサミド；
Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチル）－２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－２－イル］ピリミジン－２－イル］イソインドリン－５－カルボキサミド；
Ｎ′、Ｎ′－ジメチル－Ｎ－［２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－２－イル］ピリミジン－２－イル］イソインドリン－５－イル］エタン－１、２－ジアミン；
Ｎ′、Ｎ′－ジメチル－Ｎ－［２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－２－イル］ピリミジン－２－イル］イソインドリン－５－イル］エタン－１、２－ジアミン；
Ｎ、Ｎ、Ｎ′－トリメチル－Ｎ′－［２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－２－イル］ピリミジン－２－イル］イソインドリン－５－イル］エタン－１、２－ジアミン；
４－［２－［２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－２－イル］ピリミジン－２－イル］イソインドリン－５－イル］オキシエチル］モルホリン；
５－［２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エトキシ］－２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－２－イル］ピリミジン－２－イル］イソインドリン；
４－［２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－２－イル］ピリミジン－２－イル］イソインドリン－５－イル］モルホリン；
５－（４－メチルピペラジン－１－イル）－２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－２－イル］ピリミジン－２－イル］イソインドリン；
５－（１－メチルピラゾール－４－イル）－２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－２－イル］ピリミジン－２－イル］イソインドリン；
５－フェニル－２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－２－イル］ピリミジン－２－イル］イソインドリン；
４－［（Ｅ）－２－［２－［２－（５－メトキシイソインドリン－２－イル）ピリミジン－４－イル］ピリミジン－４－イル］ビニル］ピリジン－２－アミン；
４－［（Ｅ）－２－［２－［２－（５－フルオロイソインドリン－２－イル）ピリミジン－４－イル］ピリミジン－４－イル］ビニル］ピリジン－２－アミン；
４－［（Ｅ）－２－［２－［２－（５－クロロイソインドリン－２－イル）ピリミジン－４－イル］ピリミジン－４－イル］ビニル］ピリジン－２－アミン；
４－［（Ｅ）－２－［２－［２－（５－ブロモイソインドリン－２－イル）ピリミジン－４－イル］ピリミジン－４－イル］ビニル］ピリジン－２－アミン；
２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（２－アミノ－４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－

２－イル］ピリミジン－２－イル］イソインドリン－５－カルボニトリル；
４－［（Ｅ）－２－［２－［２－［５－（４－メチルピペラジン－１－イル）イソインドリン－２－イル］ピリミジン－４－イル］ピリミジン－４－イル］ビニル］ピリジン－２－アミン；
４－［（Ｅ）－２－［２－［２－（５－モルホリノイソインドリン－２－イル）ピリミジン－４－イル］ピリミジン－４－イル］ビニル］ピリジン－２－アミン；
２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（２－アミノ－４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－２－イル］ピリミジン－２－イル］－Ｎ－メチル－イソインドリン－５－カルボキサミド；
２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（２－アミノ－４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－２－イル］ピリミジン－２－イル］－Ｎ－エチルイソインドリン－５－カルボキサミド；
２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（２－アミノ－４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－２－イル］ピリミジン－２－イル］－Ｎ－イソプロピル－イソインドリン－５－カルボキサミド；
２－［４－［４－［（Ｅ）－２－（２－アミノ－４－ピリジル）ビニル］ピリミジン－２－イル］ピリミジン－２－イル］－Ｎ－メチル－イソインドリン－５－カルボキサミド；
４－［（Ｅ）－２－［２－［２－［５－［２－（ジメチルアミノ）エトキシ］イソインドリン－２－イル］ピリミジン－４－イル］ピリミジン－４－イル］ビニル］ピリジン－２－アミン；または、
４－［（Ｅ）－２－［２－［２－［５－（１－メチルピラゾール－４－イル）イソインドリン－２－イル］ピリミジン－４－イル］ピリミジン－４－イル］ビニル］ピリジン－２－アミン、
から選択される、化合物。
【請求項１２】
請求項１０に記載の化合物であって、
（Ｅ）－５－メトキシ－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン；
（Ｅ）－２－（４－（２－（１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）－５－メトキシイソインドリン；
（Ｅ）－４－（２－（２′－（５－メトキシイソインドリン－２－イル）－［２、４′－ビピリミジン］－４－イル）ビニル）キノロン；
（Ｅ）－４－（２－（２′－（５－メトキシイソインドリン－２－イル）－［２、４′－ビピリミジン］－４－イル）ビニル）－１Ｈ－ピロロ［２、３－ｂ］ピリジン；
（Ｅ）－４－（２－（２′－（５－メトキシイソインドリン－２－イル）－［２、４′－ビピリミジン］－４－イル）ビニル）ピリミジン－２－アミン；
（Ｅ）－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン－５－オール；
（Ｅ）－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン－５－イル－トリフルオロメタンスルホネート；
（Ｅ）－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン－５－カルボニトリル；
（Ｅ）－Ｎ、Ｎ－ジメチル－２－（（２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン－５－イル）オキシ）エタンアミン；
（Ｅ）－メチル－２－（（２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン－５－イル）オキシ）アセテート；
（Ｅ）－Ｎ－エチル－２－（（２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン－５－イル）オキシ）アセトアミド；

（Ｅ）－Ｎ－メチル－２－（（２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン－５－イル）オキシ）アセトアミド；
（Ｅ）－Ｎ－イソプロピル－２－（（２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン－５－イル）オキシ）アセトアミド；または、
（Ｅ）－５－フルオロ－２－（４－（２－（ピリジン－４－イル）ビニル）－［２、４′－ビピリミジン］－２′－イル）イソインドリン。
から選択される、化合物。
【請求項１３】
請求項１～１２のいずれかに記載の化合物であって、
当該化合物が、ＲＯＣＫ１、ＲＯＣＫ２、またはＲＯＣＫ１／２の阻害活性を有する、化合物。
【請求項１４】
請求項１～１２のいずれかに記載の化合物であって、
当該化合物が、ＲＯＣＫ２またはＲＯＣＫ１／２の阻害活性を有する、化合物。
【請求項１５】
請求項１～１２のいずれかに記載の化合物と、
薬学的に許容される担体、希釈剤、または賦形剤と、
を含有する医薬組成物。
【請求項１６】
請求項１５に記載の医薬組成物であって、
前記化合物が、ＲＯＣＫ１、ＲＯＣＫ２、またはＲＯＣＫ１／２の阻害活性を有する、医薬組成物。
【請求項１７】
請求項１６に記載の医薬組成物であって、
前記化合物が、抗線維化活性を有する、医薬組成物。
【請求項１８】
（ａ）患者または（ｂ）生体試料におけるＲＯＣＫ１、ＲＯＣＫ２、またはＲＯＣＫ１／２の活性を調節するための薬剤の調製における、請求項１５に記載の組成物または請求項１～１２のいずれかに記載の化合物の使用。
【請求項１９】
請求項１８に記載の組成物または化合物の使用であって、
前記薬剤が、ＲＯＣＫ１、ＲＯＣＫ２、またはＲＯＣＫ１／２が関与する状態、疾患、または障害を治療する、使用。
【請求項２０】
請求項１８または１９に記載の組成物または化合物の使用であって、
前記薬剤が、腎線維症、線維性肝疾患、肝虚血再灌流傷害、脳梗塞、虚血性心疾患、腎疾患、または肺線維症から選択される疾患または状態を治療するか、またはその重症度を軽減する、使用。
【請求項２１】
請求項２０に記載の組成物または化合物の使用であって、
前記薬剤が、Ｃ型肝炎、Ｂ型肝炎、デルタ肝炎、慢性アルコール依存症、非アルコール性脂肪性肝炎、肝外閉塞（胆管結石）、胆管症（原発性胆汁性肝硬変及び硬化性胆管炎）、自己免疫性肝疾患、または遺伝性代謝疾患（ウィルソン病、ヘモクロマトーシス、α１－抗トリプシン欠損症）に関連する肝線維症；損傷した及び／または虚血性の臓器、移植物または移植片；虚血再灌流障害；脳卒中；脳血管疾患；心筋虚血；アテローム性動脈硬化症；腎不全；または、腎線維症または特発性肺線維症、から選択される疾患または状態を治療するか、またはその重症度を軽減する、使用。
【請求項２２】

請求項２０に記載の組成物または化合物の使用であって、
前記薬剤が、治癒促進のための創傷；損傷した及び／または虚血性の臓器、移植物または移植片の血管新生；脳、心臓、肝臓、腎臓、または他の組織及び器官における虚血再灌流障害の改善；慢性心筋虚血または心筋梗塞の結果としての心筋灌流の正常化；血管閉塞後または虚血組織または器官への側副血管成長の発達または増大；線維性疾患；線維症及び肝硬変を含む肝疾患；肺線維症；放射線造影剤腎症；腎閉塞に続発する線維症；腎外傷及び移植；慢性糖尿病及び／または高血圧に続発する腎不全；及び／または、糖尿病、を治療する、使用。