

【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 2 月 4 日 (2021.2.4)

【公表番号】特表 2020-504727 (P2020-504727A)

【公表日】令和 2 年 2 月 13 日 (2020.2.13)

【年通号数】公開・登録公報 2020-006

【出願番号】特願 2019-533349 (P2019-533349)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 31/4985 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/438 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

A 6 1 K 31/538 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 31/22 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z

C 0 7 D 471/04 C S P

C 0 7 D 487/04 1 4 2

C 0 7 D 471/04 1 0 6 A

A 6 1 K 31/437

A 6 1 K 31/4985

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 519/00 3 1 1

C 0 7 D 471/04 1 0 5 Z

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/438

C 0 7 D 519/00 3 0 1

A 6 1 K 31/541

A 6 1 K 31/538

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 25/04
 A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 31/22
 A 6 1 K 45/00
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】 令和2年12月17日 (2020.12.17)

【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

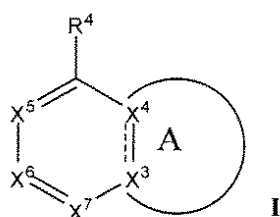
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I を有する化合物：

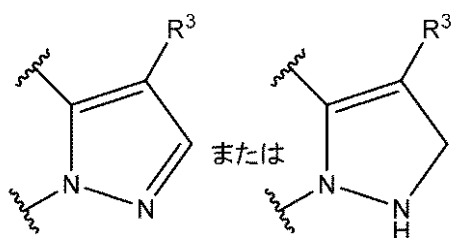
【化 1】



、
 またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、互変異性体、立体異性体、もしくは重水素化類似体であって、式中、

環 A は、X 3、X 4、ならびに X 3 および X 4 を連結する任意選択の二重結合と共に、
 環 A 4 または A 5：

【化 2】



A 4

A 5

であり；

X 5 は、C R 5 または N であり、

X 6 は、C H であり、

X 7 は、C H であり、

R 3 は、- B - L - T であり、

R 4 は、(a) ~ (f) :

(a) - X - ヘテロシクロアルキルであって、- X - ヘテロシクロアルキルの前記ヘテロシクロアルキル部分が、0 ~ 3 個の R 7 基および 0 ~ 1 個の R 8 基で置換されており、- X - ヘテロシクロアルキルの前記ヘテロシクロアルキル部分が、飽和もしくは不飽和である、- X - ヘテロシクロアルキル、

(b) - X - シクロアルキルであって、- X - シクロアルキルの前記シクロアルキル部分が、0 ~ 3 個の R 7 基および 0 ~ 1 個の R 8 基で置換されており、前記シクロアルキルが、飽和もしくは不飽和である、- X - シクロアルキル、

(c) アリールもしくはヘテロアリールであって、前記アリールもしくはヘテロアリールが、0 ~ 1 個の R 10 基および 0 ~ 1 個の R 11 基で置換されている、アリールもしくはヘテロアリール、

(d) R 12 で任意選択に置換されたアルキニル、

(e) 1 ~ 3 個の R 13 a で任意選択に置換されたアルコキシ、または

(f) - N (H) (R 15)、のうちの 1 つであり、

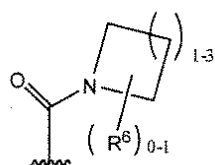
R 5 は、水素、ハロゲン、- C N、または 1 ~ 3 個のハロゲンで任意選択に置換されたメチルであり、

R 6 は、H、アルキル、- アルキレン - C N、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、またはアリールであり、

各 R 7 は、独立して、アルキル、ハロゲン、C N、ヒドロキシル、ハロアルキル、シアノアルキル、またはヘテロアリールで任意選択に置換されたヒドロキシアルキルであり、ただし、ハロゲンおよび C N がヘテロ原子に結合しておらず、

R 8 は、C N、アリール、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、- (C H 2) 0 ~ 3 - C (O) - N (H) - R 6、- C (O) R 6、- (C H 2) 0 ~ 3 C (O) O R 6、- (C H 2) 0 ~ 3 S (O) 2 R 6、または

【化 3】



、
あるいは R 7 および R 8 は、両方が飽和ヘテロシクロアルキルの同じ炭素原子に結合しているとき、ヘテロシクロアルキル、オキソヘテロシクロアルキル、またはジオキソヘテロシクロアルキルを形成するために結合し、前記ヘテロシクロアルキル、オキソヘテロシクロアルキル、またはジオキソヘテロシクロアルキルは、1 ~ 2 個のアルキル基で任意選択に置換されており、前記オキソヘテロシクロアルキルは、アリールまたはヘテロアリールに任意選択に縮合しており、

B は、結合、アリーレン、ヘテロアリーレン、またはヘテロシクロアルキレンであり、前記アリーレン、ヘテロアリーレン、またはヘテロシクロアルキレンは、各々 0 ~ 3 個の G 1 基および 0 ~ 1 個の G 2 基で置換されており、

L は、結合、- O -、- C (O) -、- N (H) -、- N (H) S (O) 2 -、- S (O) 2 - N (H) -、- S (O) 2 -、- S (O) 2 - C 1 ~ C 4 アルキレン、- N (H) C (O) - C 1 ~ C 4 アルキレン、- N (H) C (O) O - C 1 ~ C 4 アルキレン、C 1 ~ C 4 アルキレン - N (H) - C (O) -、- N (H) - (C H 2) 0 ~ 4 -、- C 1 ~ C 6 アルキレン、- O - C 1 ~ C 6 アルキレン、- O - C 1 ~ C 6 ハロアルキレン、-

O-C 1～C 6 アルキレン-O-、または-O-C 1～C 6 ヒドロキシアルキレンであり、

T は、ヘテロアリール、アリール、アルキル、シクロアルキル、またはヘテロシクロアルキルであり、前記ヘテロアリール、アルキル、シクロアルキル、またはヘテロシクロアルキルは、各々 0～3 個の G 3 基および 0～1 個の G 4 基で置換されており、

あるいは B-L は、エチニレンであり、T は、0～3 個の G 3 基で置換されたヘテロアリールであり、

各 G 1 は、独立して、ハロゲン、-C 1～C 4 アルキル、アルコキシ、-C 1～C 4 ハロアルキル、ヒドロキシル、または-C 1～C 4 ヒドロキシアルキルであり、

G 2 は、-C 0～C 4 アルキレン-S (O) 2-C 1～C 4 アルキル、-C 0～C 4 アルキレン-C (O)-NH 2、または-N (H) C (O)-C 1～C 4 アルキルであり、

各 G 3 は、独立して、ハロゲン、-C 1～C 6 アルキル、-C 1～C 6 アルコキシ、-C 1～C 6 ハロアルキル、ヒドロキシル、C 1～C 6 ヒドロキシアルキル、または-C 0～C 6 アルキレン-CN であり、

G 4 は、炭素原子に結合しているとき、ハロゲン、-C 1～C 6 アルキル、-C 1～C 6 アルコキシ、-C 1～C 6 ハロアルキル、ヒドロキシル、-C 1～C 6 ヒドロキシアルキル、-C 0～C 6 アルキレン-CN、-C 0～C 4 アルキレン-S (O) 2-C 1～C 6 アルキル、-C 0～C 4 アルキレン-N (H)-S (O) 2-C 1～C 4 アルキル、-C 0～C 4 アルキレン-C (O)-NH 2、-C 0～C 4 アルキレン-C (O)-N (H)-C 1～C 4 アルキル、-N (H)-C (O)-C 1～C 4 アルキル、-C 0～C 4 アルキレン-C (O)-N (C 1～C 4 アルキル) 2、-C 1～C 6 アルキレン-N-(C 1～C 4 アルキル) 2、-C 1～C 6 アルキレン-N (H)-(C 1～C 4 アルキル)、-C 1～C 6 アルキレン-NH 2、-C 0～C 4 アルキレン-ヘテロシクロアルキル、-C 0～C 4 アルキレン-C (O) O-C 1～C 6 アルキル、または CN、OH、-C 1～C 4 アルキル、-C (O) O-C 1～C 4 アルキル、-C (O) OH、もしくはハロゲンで任意選択に置換された-C 0～C 6 アルキレン-シクロアルキルであり、

あるいは G 4 は、窒素原子に結合しているとき、-C 1～C 6 アルキル、-C 1～C 6 アルキレン-C 1～C 6 アルコキシ、-C 1～C 6 ハロアルキル、-C 1～C 6 ヒドロキシアルキル、-C 1～C 6 アルキレン-CN、-C 1～C 4 アルキレン-S (O) 2-C 1～C 6 アルキル、-C 1～C 3 アルキル-N (H)-S (O) 2-C 1～C 4 アルキル、-C 1～C 4 アルキレン-C (O)-NH 2、-C 1～C 4 アルキレン-C (O)-N (H)-C 1～C 4 アルキル、-C 1～C 4 アルキレン-C (O)-N (C 1～C 4 アルキル) 2、-C 1～C 6 アルキレン-N-(C 1～C 4 アルキル) 2、-C 1～C 6 アルキレン-N (H)-(C 1～C 4 アルキル)、-C 1～C 6 アルキレン-NH 2、-C 0～C 4 アルキレン-ヘテロシクロアルキル、-C 0～C 4 アルキレン-C (O) O-C 1～C 6 アルキル、-C 0～C 4 アルキレン-C (O) OH、または CN、OH、C 1～C 4 アルキル、-C (O) O-C 1～C 4 アルキル、-C (O) OH、もしくはハロゲンで任意選択に置換された-C 1～C 6 アルキレン-シクロアルキルであり、

R 9 は、H、アルキル、ヒドロキシアルキル、またはハロアルキルであり、

R 10 は、-NHS (O) 2-アルキル、-S (O) 2-アルキル、-S (O) 2-ヘテロシクロアルキル、-S (O) 2-N (H) アルキル、-(CH 2) 0～2-C (O) NH-C 1～C 3 アルキル、-(CH 2) 0～3-O-アリール-R 9、-ヘテロアリール-R 9、-(CH 2) 0～3-O-ヘテロアリール-R 9、-C 1～C 4 アルキレン-ヘテロシクロアルキル、-C 1～C 4 アルキレン-O-ヘテロシクロアルキル、-O-C 1～C 4-アルキレン-O-C 0～C 4-アルキレン-ヘテロシクロアルキル、-(CH 2) 0～3-NHC (O) O-C 1～C 4 アルキレン-アリール、-C (O)-O-アルキル、-(CH 2) 0～3-NHC (O)-ヘテロアリール-R 9、-(CH 2) 0～3-NHC (O)-アリール-R 9、アルキル、アルケニル、アルキニル、または CN であり、

R 11 は、ハロゲン、シクロアルキル、シクロアルケニル、またはヘテロシクロアルキ

ルであり、

R 1 2 は、 $-C 1 \sim C 6$ アルキルアミノ、シクロアルキレン-W、ヘテロアルキレン-W、ヘテロアリール-W、 $-C 1 \sim C 6$ アルキレン- $C(O)NHR 6$ 、 $-C 1 \sim C 6$ アルキレン- $C(O)OR 6$ 、 $-C 1 \sim C 6$ ヒドロキシアルキル、 $-C 1 \sim C 6$ シアノアルキル、 $-Z 1$ -アルキレン- $Z 2$ 、 $-Z 1$ -ハロアルキレン- $Z 2$ 、または $-Z 1$ -ヒドロキシアルキレン- $Z 2$ であり、

各 R 1 3 a は、独立して、H、ハロゲン、ヒドロキシル、アルキル、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、CN、またはヘテロシクロアルキルであり、

R 1 5 は、H、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、シアノアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルキルで任意選択に置換されたヘテロアリール、またはヘテロシクロアルキルであり、

W は、H、ハロゲン、ヒドロキシル、アルキル、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、CN、またはヘテロシクロアルキルであり、

X は、結合、 $-O-$ 、または $-N(H)-$ であり、

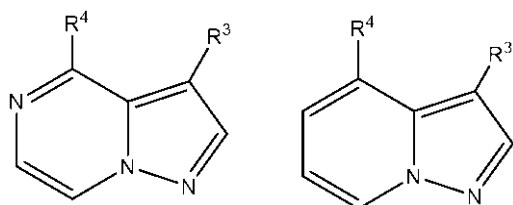
Z 1 は、不在、 $-C 1 \sim C 4$ アルキレン、または $-C 1 \sim C 4$ ハロアルキレンであり、

Z 2 は、ヒドロキシルで任意選択に置換された $-C 1 \sim C 4$ アルコキシル、 $-N(H)-S(O)_2-C 1 \sim C 4$ アルキル、 $-N(H)-C(O)-C 1 \sim C 4$ アルキル、 $-N(H)-C(O)-C 1 \sim C 4$ ハロアルキル、 $-C(O)-N(H)-C 1 \sim C 4$ アルキル、 $-C(O)-N(H)-C 1 \sim C 4$ ハロアルキル、またはフェニルである、化合物、またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、互変異性体、立体異性体、もしくは重水素化類似体。

【請求項 2】

式 I I (b) または I I (c) を有する、請求項 1 に記載の化合物、

【化 4】



I I (b)

I I (c)

またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物、互変異性体、立体異性体、もしくは重水素化類似体。

【請求項 3】

R 4 は、(a 1)、(a 2)、(b 1)、(b 2)、(c 1)、(d)、(e) または (f) :

(a 1) 0 ~ 3 個の R 7 基で置換された飽和 5 ~ 6 員ヘテロシクロアルキルであって、前記飽和ヘテロシクロアルキルが、1 個の R 8 基でさらに任意選択に置換されている、飽和 5 ~ 6 員ヘテロシクロアルキル、

(a 2) 0 ~ 3 個の R 7 基で置換されたヘテロシクロアルケニルであって、前記ヘテロシクロアルケニルが、1 個の R 8 基でさらに任意選択に置換されている、ヘテロシクロアルケニル、

(b 1) 0 ~ 3 個の R 7 基で置換された飽和 C 3 ~ C 6 シクロアルキルであって、前記飽和 C 3 ~ C 6 シクロアルキルが、1 個の R 8 基でさらに任意選択に置換されている、C 3 ~ C 6 シクロアルキル、

(b 2) 0 ~ 3 個の R 7 基で置換された C 5 ~ C 6 シクロアルケニルであって、前記シクロアルケニルが、1 個の R 8 基でさらに任意選択に置換されている、C 5 ~ C 6 シクロアルケニル、

(c 1) 1 個の R 1 0 基で置換されたアリールまたはヘテロアリールであって、前記アリールまたはヘテロアリールが、1 個の R 1 1 基でさらに任意選択に置換されている、

アリールまたはヘテロアリール、

(d) R 1 2 で置換された $-C 2 \sim C 3$ アルキニレン、

(e) 1 ～ 3 個の R 1 3 a で任意選択に置換された $-C 1 \sim C 6$ アルコキシ、または

(f) $-N(H)$ (R 1 5)、のうちの 1 つであり、

R 5 は、H、F、Br、Cl、または CH 3 であり、

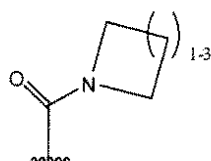
R 6 は、H、 $-C 1 \sim C 6$ アルキル、 $-C 1 \sim C 6$ アルキレン-CN、 $-C 3 \sim C 6$ シクロアルキル、4 ～ 6 員ヘテロシクロアルキル、5 ～ 6 員ヘテロアリール、またはフェニルであり、

各 R 7 は、独立して、 $-C 1 \sim C 6$ アルキル、ハロゲン、CN、ヒドロキシル、 $-C 1 \sim C 6$ ハロアルキル、 $-C 1 \sim C 6$ シアノアルキル、またはヘテロアリールで任意選択に置換された $-C 1 \sim C 6$ ヒドロシアルキルであり、ただし、ハロゲンおよび CN がヘテロ原子に結合しておらず、

R 8 は、CN、フェニル、5 ～ 6 員ヘテロシクロアルキルもしくはヘテロアリール、 $-(CH_2)_0 \sim 2 - C(O) - N(H) - R 6$ 、 $-C(O) R 6$ 、 $-(CH_2)_0 \sim 2 C(O) OR 6$ 、

$-(CH_2)_0 \sim 2 S(O)_2 R 6$ 、または

【化 5】



であり、

あるいは R 7 および R 8 は、両方が前記飽和ヘテロシクロアルキルの同じ炭素原子に結合しているとき、ヘテロシクロアルキル、オキソヘテロシクロアルキル、またはジオキソヘテロシクロアルキルを形成するために結合し、前記ヘテロシクロアルキル、オキソヘテロシクロアルキル、またはジオキソヘテロシクロアルキルは、1 ～ 2 個の $-C 1 \sim C 6$ アルキル基で任意選択に置換されており、前記オキソヘテロシクロアルキルは、フェニルまたは 5 ～ 6 員ヘテロアリールに任意選択に縮合しており、

R 1 0 は、 $-NHS(O)_2 - C 1 \sim C 5$ アルキル、 $-S(O)_2 - C 1 \sim C 5$ アルキル、 $-S(O)_2 - 5 \sim 6$ 員ヘテロシクロアルキル、 $-S(O)_2 - N(H) - C 1 \sim C 5$ アルキル、 $-(CH_2)_0 \sim 1 - O$ -フェニル、 $-(CH_2)_0 \sim 1 - O$ -(5 ～ 6 員)ヘテロアリール、 $-(CH_2)_0 \sim 1 - NHC(O)O - C 1 \sim C 2$ -アルキレン-フェニル、 $-(CH_2)_0 \sim 1 - NHC(O) - 5 \sim 6$ 員ヘテロアリール、 $-(CH_2)_0 \sim 1 - NHC(O) -$ フェニル、 $-C 1 \sim C 4$ アルキレン-(5 ～ 6 員)ヘテロシクロアルキル、 $-C 2 \sim C 4$ アルケニル、または CN であり、

R 1 1 は、H、 $C 3 \sim C 7$ シクロアルキル、 $C 5 \sim C 6$ シクロアルケニル、または 5 ～ 6 員ヘテロシクロアルキルであり、

R 1 2 は、4 ～ 6 員シクロアルキレン-R 1 3 a、 $-Z 1 - (CH_2)_1 \sim 2 - Z 2$ 、 $-Z 1 - (C 1 \sim C 2)$ ハロアルキレン-Z 2、または $-Z 1 - (C 1 \sim C 2)$ ヒドロキシアルキレン-Z 2 であり、

各 R 1 3 a は、ハロゲン、ヒドロキシル、 $-C 1 \sim C 3$ アルキル、 $-C 1 \sim C 3$ ヒドロキシアルキル、 $-C 1 \sim C 3$ ハロアルキル、または CN であり、

R 1 5 は、H、 $-C 1 \sim C 6$ アルキル、 $-C 1 \sim C 6$ ハロアルキル、 $-C 1 \sim C 6$ ヒドロキシアルキル、 $-C 1 \sim C 6$ シアノアルキル、またはヘテロアリール- $-C 1 \sim C 6$ アルキルであり、

Z 1 は、不在、 $-C 1 \sim C 3$ アルキレン、または $-C 1 \sim C 3$ ハロアルキレンであり、

Z 2 は、ヒドロキシルで任意選択に置換された $-C 1 \sim C 3$ アルコキシル、 $-N(H) - S(O)_2 - C 1 \sim C 3$ アルキル、 $-N(H) - C(O) - C 1 \sim C 3$ アルキル、 $-N$

(H) - C (O) - C 1 ~ C 3 ハロアルキル、- C (O) - N (H) - C 1 ~ C 3 アルキル、- C (O) - N (H) - C 1 ~ C 3 ハロアルキル、またはフェニルである、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R 4 は、(a 1)、(a 2)、(b 1)、(b 2)、(c)、(d)、(e) または (f) :

(a 1) 0 ~ 1 個の R 7 基で置換された飽和 5 ~ 6 員ヘテロシクロアルキルであって、前記飽和ヘテロシクロアルキルが、1 個の R 8 基でさらに任意選択に置換されている、飽和 5 ~ 6 員ヘテロシクロアルキル、

(a 2) 0 ~ 1 個の R 7 基で置換された 5 ~ 6 員 N 置換ヘテロシクロアルケニルであって、前記 6 員 N 置換ヘテロシクロアルケニルが、1 個の R 8 基でさらに任意選択に置換されている、不飽和 5 ~ 6 員 N 置換ヘテロシクロアルキル、

(b 1) 1 個の R 7 基で置換された飽和シクロヘキシルであって、前記飽和シクロヘキシルが、1 個の R 8 基でさらに任意選択に置換されている、シクロヘキシル、

(b 2) 1 個の R 7 基で置換されたシクロヘキセニルであって、前記シクロアルケニルが、1 個の R 8 基でさらに任意選択に置換されている、シクロヘキセニル、

(c) 1 個の R 10 基で任意選択に置換されたフェニル、ピリジル、もしくはピラゾリルであって、前記フェニル、ピリジル、もしくはピラゾリルが、1 個の R 11 基でさらに任意選択に置換されている、フェニル、ピリジル、もしくはピラゾリル、

(d) R 12 で置換されたエチニレン、

(e) 1 ~ 2 個の R 13 a で任意選択に置換された - C 1 ~ C 3 アルコキシ、または (f) - N (H) (R 15)、のうちの 1 つであり、

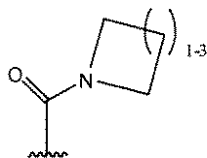
R 6 は、H、- C 1 ~ C 4 アルキル、- C 3 ~ C 4 シクロアルキル、4 ~ 6 員ヘテロシクロアルキル、5 ~ 6 員ヘテロアリール、またはフェニルであり、

各 R 7 は、独立して、- C 1 ~ C 4 アルキル、フルオロ、クロロ、ブロモ、CN、ヒドロキシル、- C 1 ~ C 4 ハロアルキル、- C 1 ~ C 4 シアノアルキル、またはヘテロアリールで任意選択に置換された - C 1 ~ C 4 ヒドロキシアルキルであり、ただし、フルオロ、クロロ、ブロモ、および CN がヘテロ原子に結合しておらず、

R 8 は、CN、フェニル、5 ~ 6 員ヘテロアリール、- C (O) - N (H) - R 6、- C (O) O R 6、

- (CH 2) 0 ~ 1 S (O) 2 R 6、または

【化 6】



であり、

あるいは R 7 および R 8 は、両方が前記飽和ヘテロシクロアルキルの同じ炭素原子に結合しているとき、ヘテロシクロアルキル、オキソヘテロシクロアルキル、またはジオキソヘテロシクロアルキルを形成するために結合し、前記ヘテロシクロアルキル、オキソヘテロシクロアルキル、またはジオキソヘテロシクロアルキルは、1 ~ 2 個の - C 1 ~ C 4 アルキル基で任意選択に置換されており、前記オキソヘテロシクロアルキルは、フェニルまたは 5 ~ 6 員ヘテロアリールに任意選択に縮合しており、

R 10 は、- NH S (O) 2 - C 1 ~ C 4 アルキル、- S (O) 2 - C 1 ~ C 4 アルキル、- S (O) 2 - 5 ~ 6 員ヘテロシクロアルキル、- S (O) 2 - N (H) - C 1 ~ C 4 アルキル、- (CH 2) 0 ~ 1 - O - フェニル、- (CH 2) 0 ~ 1 - O - (5 ~ 6 員) ヘテロアリール、- (CH 2) 0 ~ 1 - N H C (O) O - CH 2 - フェニル、- (CH

2) 0～1-NHC(O)-5～6員ヘテロアリール、-(CH₂)_{0～1}-NHC(O)-フェニル、-C_{1～4}アルキレン-(5～6員)ヘテロシクロアルキル、-C_{2～4}アルケニル、またはCNであり、

R₁₁は、ハロゲン、C_{3～6}シクロアルキル、C_{5～6}シクロアルケニル、または5～6員ヘテロシクロアルキルであり、

R₁₂は、4～6員シクロアルキレン-R_{13a}、-Z₁-(CH₂)_{1～2}-Z₂、-Z₁-(C_{1～2})ハロアルキレン-Z₂、または-Z₁-(C_{1～2})ヒドロキシアリレン-Z₂であり、

各R_{13a}は、F、C₁、ヒドロキシル、-C_{1～3}アルキル、-C_{1～3}ヒドロキシアリル、-C_{1～3}ハロアルキル、またはCNであり、

R₁₅は、H、-C_{1～4}アルキル、-C_{1～4}ハロアルキル、-C_{1～4}ヒドロキシアリル、-C_{1～4}シアノアルキル、ヘテロアリール-C_{1～4}アルキルであり、

Z₁は、不在、-C_{1～3}アルキレン、または-C_{1～3}フルオロアルキレンであり、

Z₂は、ヒドロキシルで任意選択に置換された-C_{1～3}アルコキシル、-N(H)S(O)₂-C_{1～3}アルキル、-N(H)-C(O)-C_{1～3}アルキル、-N(H)-C(O)-C_{1～3}ハロアルキル、-C(O)-N(H)-C_{1～3}アルキル、-C(O)-N(H)-C_{1～3}ハロアルキル、またはフェニルであり、

Bは、結合、フェニレン、5～6員ヘテロアリール、または4～6員ヘテロシクロアルキレンであり、前記フェニレン、5～6員ヘテロアリール、または4～6員ヘテロシクロアルキレンは、各々0～2個のG₁基および0～1個のG₂基で置換されており、

Lは、結合、-C(O)-、-N(H)-、-N(H)S(O)₂-、-S(O)₂-N(H)-、-S(O)₂-、-S(O)₂-C_{1～3}アルキレン、-N(H)C(O)-C_{1～3}アルキレン、-N(H)C(O)O-C_{1～3}アルキレン、C_{1～4}アルキレン-N(H)-C(O)-、-N(H)-(CH₂)_{0～3}-、-C_{1～5}アルキレン、-O-C_{1～5}アルキレン、-O-C_{1～5}ハロアルキレン、-O-C_{1～5}アルキレン-O-、または-O-C_{1～5}ヒドロキシアリレンであり、

Tは、5～10員ヘテロアリール、6～10員アリール、C_{1～6}アルキル、3～6員シクロアルキル、または4～6員ヘテロシクロアルキルであり、前記5～10員ヘテロアリール、-C_{1～6}アルキル、3～6員シクロアルキル、または4～6員ヘテロシクロアルキルは、各々0～3個のG₃基および0～1個のG₄基で置換されており、

あるいはB-Lは、エチニレンであり、Tは、0～3個のG₃基で置換された5～10員ヘテロアリールであり、

各G₁は、独立して、ハロゲン、-C_{1～3}アルキル、-C_{1～3}アルコキシ、-C_{1～3}ハロアルキル、ヒドロキシル、または-C_{1～3}ヒドロキシアリルであり、

G₂は、-C_{0～3}アルキレン-S(O)₂-C_{1～3}アルキル、-C_{0～3}アルキレン-C(O)-NH₂、または-N(H)C(O)-C_{1～3}アルキルであり、

各G₃は、独立して、ハロゲン、-C_{1～5}アルキル、-C_{1～5}アルコキシ、-C_{1～5}ハロアルキル、ヒドロキシル、-C_{1～5}ヒドロキシアリル、または-C_{0～5}アルキレン-CNであり、

G₄は、炭素原子に結合しているとき、ハロゲン、-C_{1～5}アルキル、-C_{1～5}アルコキシ、-C_{1～5}ハロアルキル、ヒドロキシル、-C_{1～5}ヒドロキシアリル、-C_{0～5}アルキレン-CN、-C_{0～3}アルキレン-S(O)₂-C_{1～3}アルキル、-C_{0～3}アルキレン-N(H)-S(O)₂-C_{1～4}アルキル、-C_{0～3}アルキレン-C(O)-NH₂、-C_{0～4}アルキレン-C(O)-N(H)-C_{1～2}アルキル、-C_{1～4}アルキレン-N-(C_{1～3}アルキル)₂、-C_{1～4}アルキレン-N(H)-(C_{1～3}アルキル)、-C_{1～4}アルキレン-

NH₂、-C₀~C₃アルキレン-ヘテロシクロアルキル、-C₀~C₃アルキレン-C(O)O-C₁~C₄アルキル、またはCN、OH、-C₁~C₃アルキル、-C(O)O-C₁~C₃アルキル、-C(O)OH、もしくはハロゲンで任意選択に置換された-C₀~C₃アルキレン-シクロアルキルであり、

あるいはG₄は、窒素原子に結合しているとき、-C₁~C₆アルキル、-C₁~C₆アルキレン-C₁~C₆アルコキシ、-C₁~C₆ハロアルキル、-C₁~C₆ヒドロキシアリル、-C₁~C₆アルキレン-CN、-C₁~C₃アルキレン-S(O)₂-C₁~C₃アルキル、-C₁~C₃アルキレン-N(H)-S(O)₂-C₁~C₃アルキル、-C₁~C₃アルキレン-C(O)-NH₂、-C₁~C₃アルキレン-C(O)-N(H)-C₁~C₃アルキル、またはCN、OH、C₁~C₃アルキル、-C(O)O-C₁~C₃アルキル、-C(O)OH、もしくはハロゲンで任意選択に置換された-C₁~C₅アルキレン-シクロアルキルである、請求項1~3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項5】

Bは、結合、フェニレン、5~6員ヘテロアリーレン、または4~6員ヘテロシクロアルキレンであり、前記フェニレン、5~6員ヘテロアリーレン、または4~6員ヘテロシクロアルキレンは、各々0~2個のG₁基および0~1個のG₂基で置換されており、

Lは、結合、-C(O)-、-N(H)-、-N(H)S(O)₂-、-S(O)₂-C₁~C₃アルキレン、-N(H)-C(O)-C₁~C₃アルキレン、-N(H)-C(O)O-C₁~C₃アルキレン、-N(H)-(CH₂)₀~3-、-C₁~C₄アルキレン、-O-C₁~C₄アルキレン、-O-C₁~C₄ハロアルキレン、-O-C₁~C₄アルキレン-O-、または-O-C₁~C₄ヒドロキシアリルであり、

Tは、5~10員ヘテロアリール、6~10員アリール、-C₁~C₄アルキル、3~6員シクロアルキル、または4~6員ヘテロシクロアルキルであり、前記5~10員ヘテロアリール、C₁~C₄アルキル、3~6員シクロアルキル、または4~6員ヘテロシクロアルキルは、各々0~2個のG₃基および0~1個のG₄基で置換されており、

各G₁は、独立して、ハロゲン、-C₁~C₂アルキル、C₁~C₂アルコキシ、-C₁~C₂フルオロアルキル、ヒドロキシル、または-C₁~C₂ヒドロキシアリルであり、

G₂は、-S(O)₂-C₁~C₂アルキル、-C₀~C₂アルキレン-C(O)-NH₂、または-N(H)-C(O)-C₁~C₂アルキルであり、

各G₃は、独立して、ハロゲン、-C₁~C₄アルキル、-C₁~C₄アルコキシ、-C₁~C₄フルオロアルキル、ヒドロキシル、-C₁~C₄ヒドロキシアリル、または-C₀~C₄アルキレン-CNであり、

G₄は、炭素原子に結合しているとき、ハロゲン、-C₁~C₄アルキル、-C₁~C₄アルコキシ、-C₀~C₄フルオロアルキル、ヒドロキシル、-C₁~C₄ヒドロキシアリル、-C₀~C₄アルキレン-CN-C₀~C₂アルキレン-S(O)₂-C₁~C₂アルキル、-N(H)-S(O)₂-C₁~C₃アルキル、-C₀~C₂アルキレン-C(O)-NH₂、-C₀~C₂アルキレン-C(O)-N(H)-CH₃、-C₁~C₃アルキレン-N-(C₁~C₂アルキル)₂、-C₁~C₃アルキレン-N(H)-(C₁~C₂アルキル)、-C₁~C₃アルキレン-NH₂、-C₀~C₃アルキレン-ピロリジニル、-C₀~C₃アルキレン-シクロプロピル、-C₀~C₂アルキレン-C(O)O-C₁~C₃アルキル、-C₀~C₂アルキレン-シクロプロピレン-OH、-C₀~C₂アルキレン-シクロプロピレン-C(O)O-C₁~C₃アルキル、-C₀~C₂アルキレン-シクロプロピレン-C(O)OH、または-C₀~C₂アルキレン-シクロプロピレン-CNであり、

あるいはG₄は、窒素原子に結合しているとき、-C₁~C₅アルキル、-C₁~C₅アルキレン-C₁~C₅アルコキシ、-C₁~C₅ハロアルキル、-C₁~C₅ヒドロキシアリル、-C₁~C₅アルキレン-CN、-C₁~C₂アルキレン-S(O)₂-C₁~C₂アルキル、-C₁~C₃アルキレン-C(O)-NH₂、-C₁~C₃アルキレ

ン-C(O)-N(H)C₁~C₂アルキル、-C₁~C₄アルキレン-シクロプロピル、または-C₁~C₄アルキレン-シクロプロピレン-CNである、請求項1~4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

BおよびLは、結合であり、Tは、9~10員二環式縮合アリールまたは9~10員二環式縮合ヘテロアリールであり、前記二環式縮合アリールまたは前記二環式縮合ヘテロアリールは、各々1~3個の置換基、各々独立して、C₁~C₂アルキル、ハロゲン、C₁~C₂ハロアルキル、ヒドロキシル、およびC₁~C₂ヒドロキシアルキルで任意選択に置換されている、請求項1~5のいずれか一項に記載の化合物。

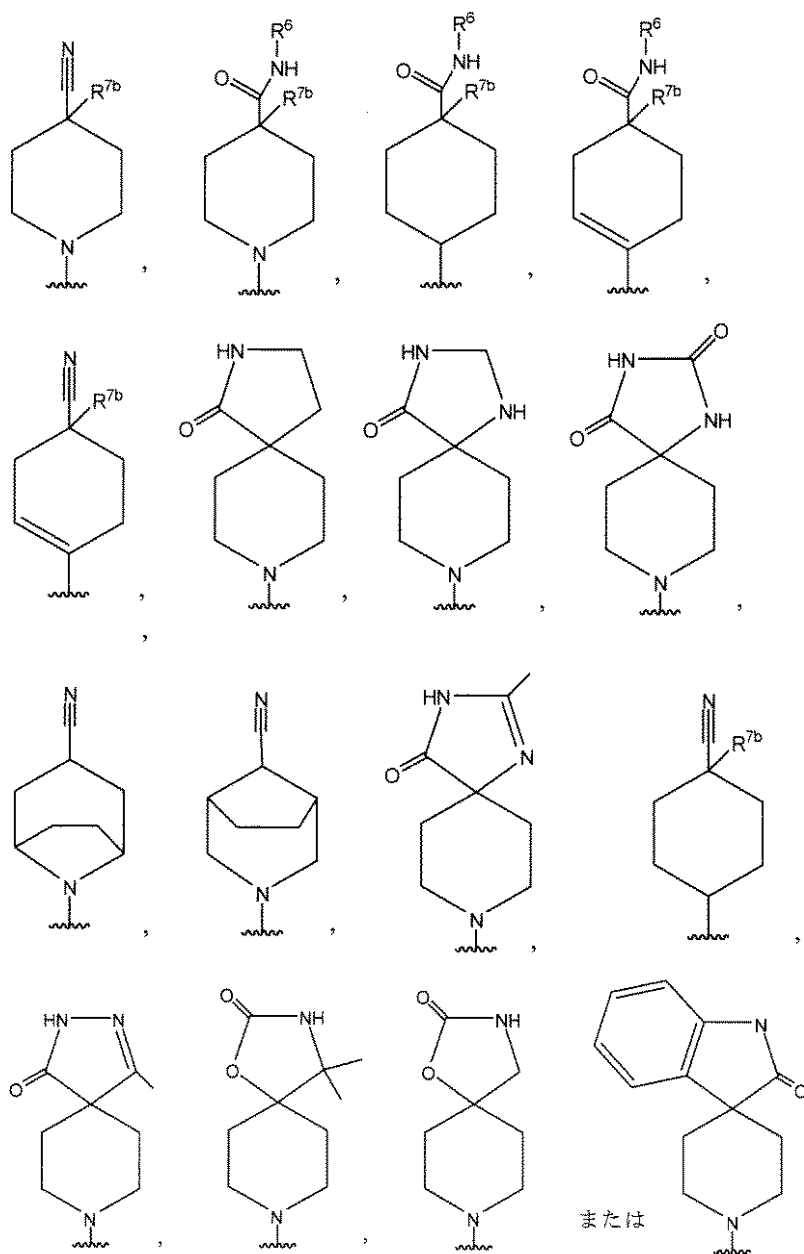
【請求項7】

BおよびLは、結合であり、Tは、各々1~2個の置換基、各々独立して、C₁~C₂アルキル、ハロゲン、C₁~C₂ハロアルキル、ヒドロキシル、およびC₁~C₂ヒドロキシアルキルで任意選択に置換された、ナフタレニル、イソキノリニル、キノリニル、イソインドリル、1H-インダゾリル、2H-インダゾリル、1H-ベンズイミダゾリル、1,3-ジヒドロ-2H-インデン-2-オン-5-イル、2,3-ジヒドロベンゾフラニル、2,3-ジヒドロベンゾ[d]チアゾリル、ベンゾチオフェニル、イミダゾ[1,2-a]ピリジニル、インドリン-2-オンである、請求項1~6のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項8】

R₄は、

【化 7】

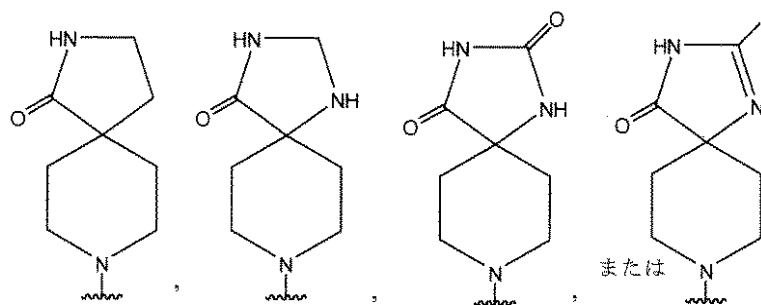


である、請求項 1～7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

R 4 は、

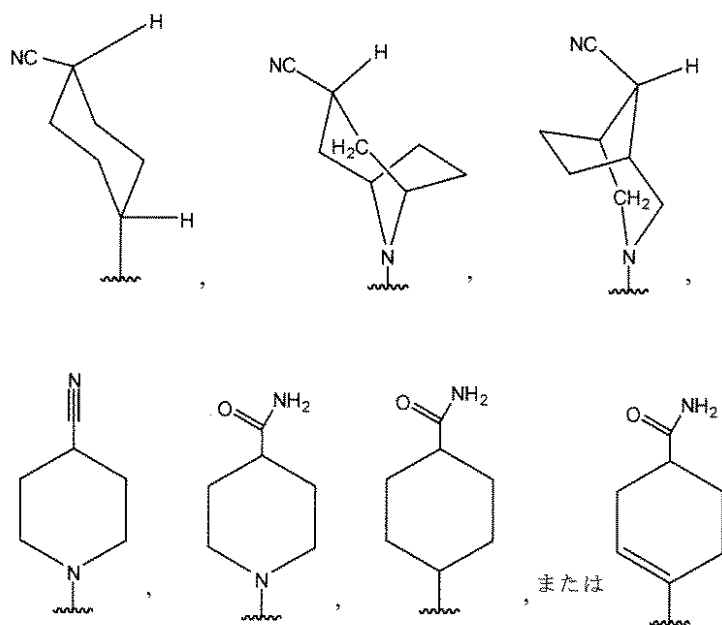
【化 8】



である、請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

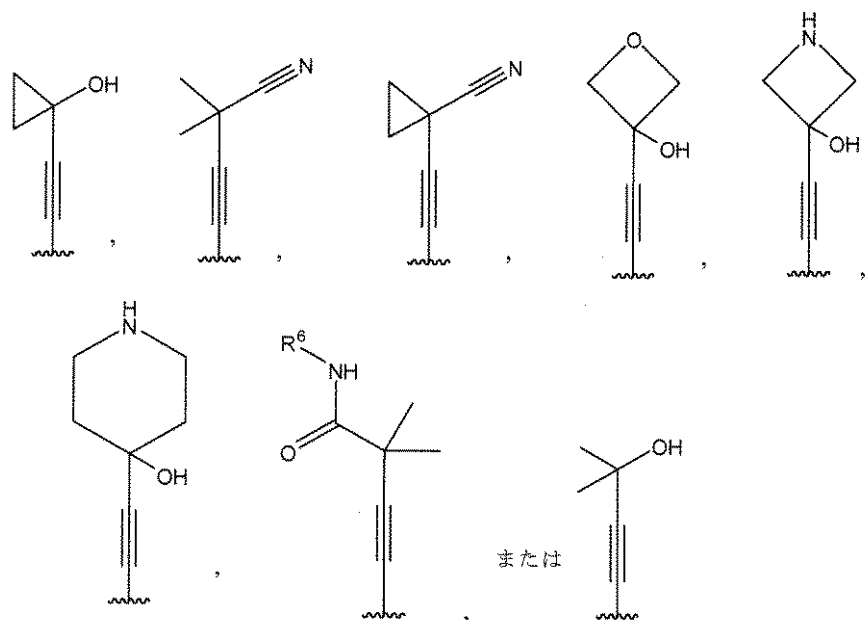
R 4 は、
【化 9】



である、請求項 1 ～ 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 1】

R 4 は、
【化 1 0】



である、請求項 1 ～ 2 のいずれか一項に記載の化合物。

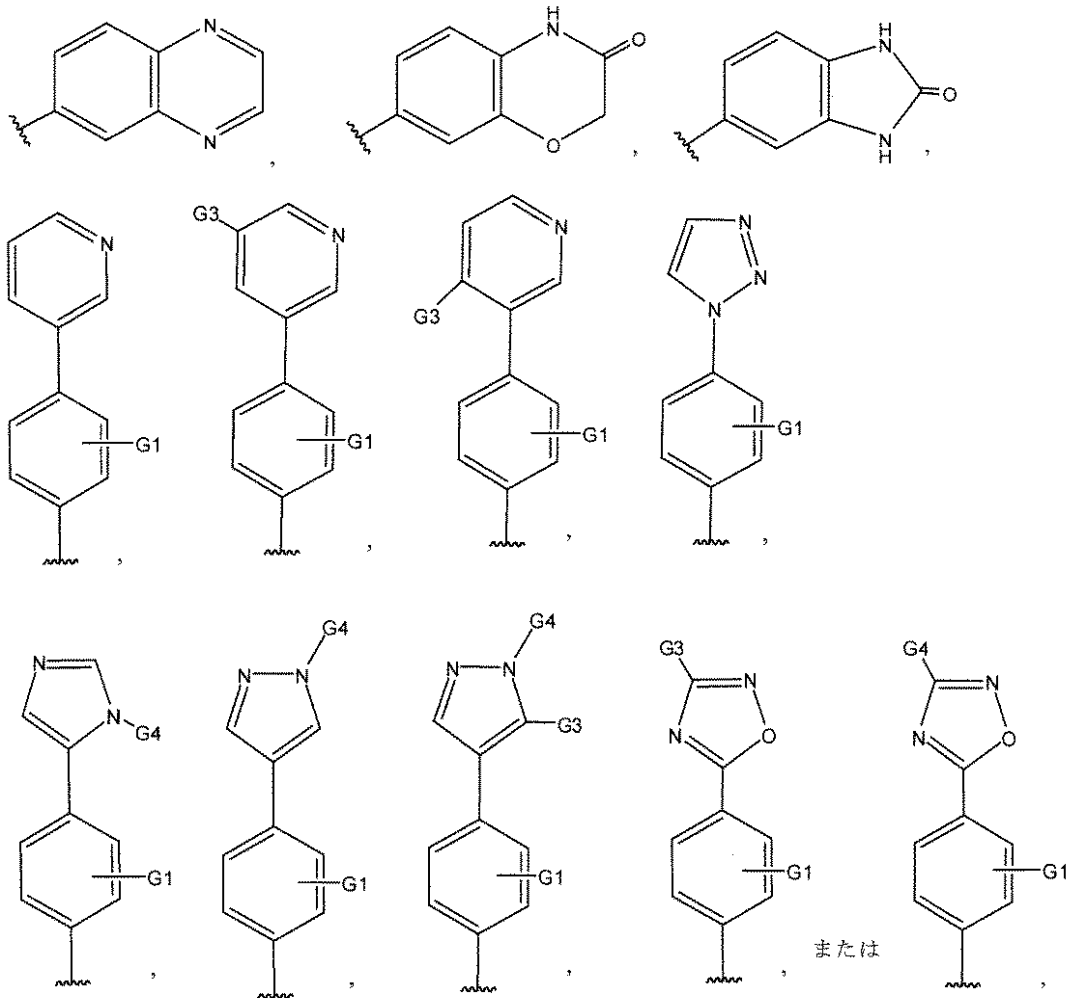
【請求項 1 2】

R 3 は、

Chemical structures 1-6 are shown below the text:

- Structure 1: A pyrazole ring substituted with G3 and G4, linked to a phenyl ring.
- Structure 2: A pyrazole ring substituted with G3 and G4, linked to a piperidine ring.
- Structure 3: An indazole ring system with a substituent.
- Structure 4: A phenyl ring substituted with G1, linked to a chain containing a repeating unit (CH₂)₀₋₄ and a ring containing X¹⁰ and X¹¹.
- Structure 5: A phenyl ring substituted with G1, linked to a chain containing a repeating unit (CH₂)₁₋₄ and a ring containing X⁹, X¹⁰, and X¹¹.
- Structure 6: A pyrazole ring substituted with G3, linked to a chain containing a repeating unit (CH₂)₀₋₄ and a ring containing X¹⁰ and X¹¹.

【化 1 4】



であり、式中、

G 1 は、H、CH 3、または F であり、

G 3 は、 $-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{F}$ 、 CHF_2 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CN}$ 、 $-(\text{CH}_2)_3-\text{CN}$ 、 $-(\text{CH}_2)_1\sim 2\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{CN}$ 、または $-(\text{CH}_2)_1\sim 2\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{OH}$ であり、

G 4 は、 $-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{F}$ 、 CHF_2 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-(\text{CH}_2)_1\sim 2\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{OH}$ 、 $-\text{C}_1\sim \text{C}_4$ アルキレン-シクロプロピル、 $-\text{C}_1\sim \text{C}_4$ アルキレン-シクロプロピレン-CN、 $-\text{C}_1\sim \text{C}_4$ アルキレン-シクロプロピレン-OH、 $-\text{C}_1\sim \text{C}_5$ アルキレン-CN、または $-(\text{CH}_2)_1\sim 3\text{N}(\text{CH}_3)_2$ であり、

各 R 1 6 は、H、ハロゲン、またはハロゲンで任意選択に置換された C 1 ~ C 4 アルキルであり、

X 9 は、結合または O であり、

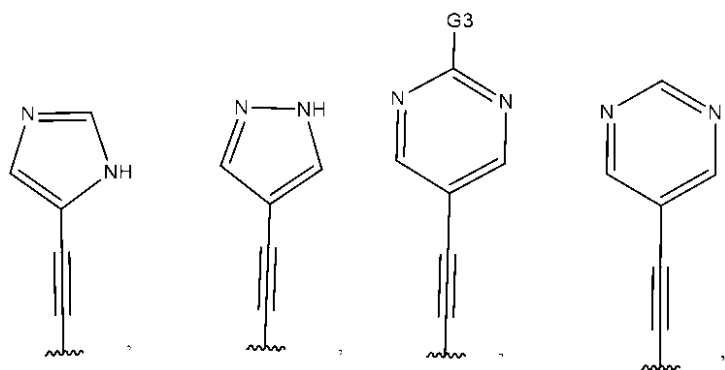
X 1 0 は、CH、 $-\text{C}(\text{CH}_3)-$ 、または N であり、

X 1 1 は、CH 2、NH、O、S、S(O)、または S(O) 2 である、請求項 1 ~ 4 または 8 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の化合物。

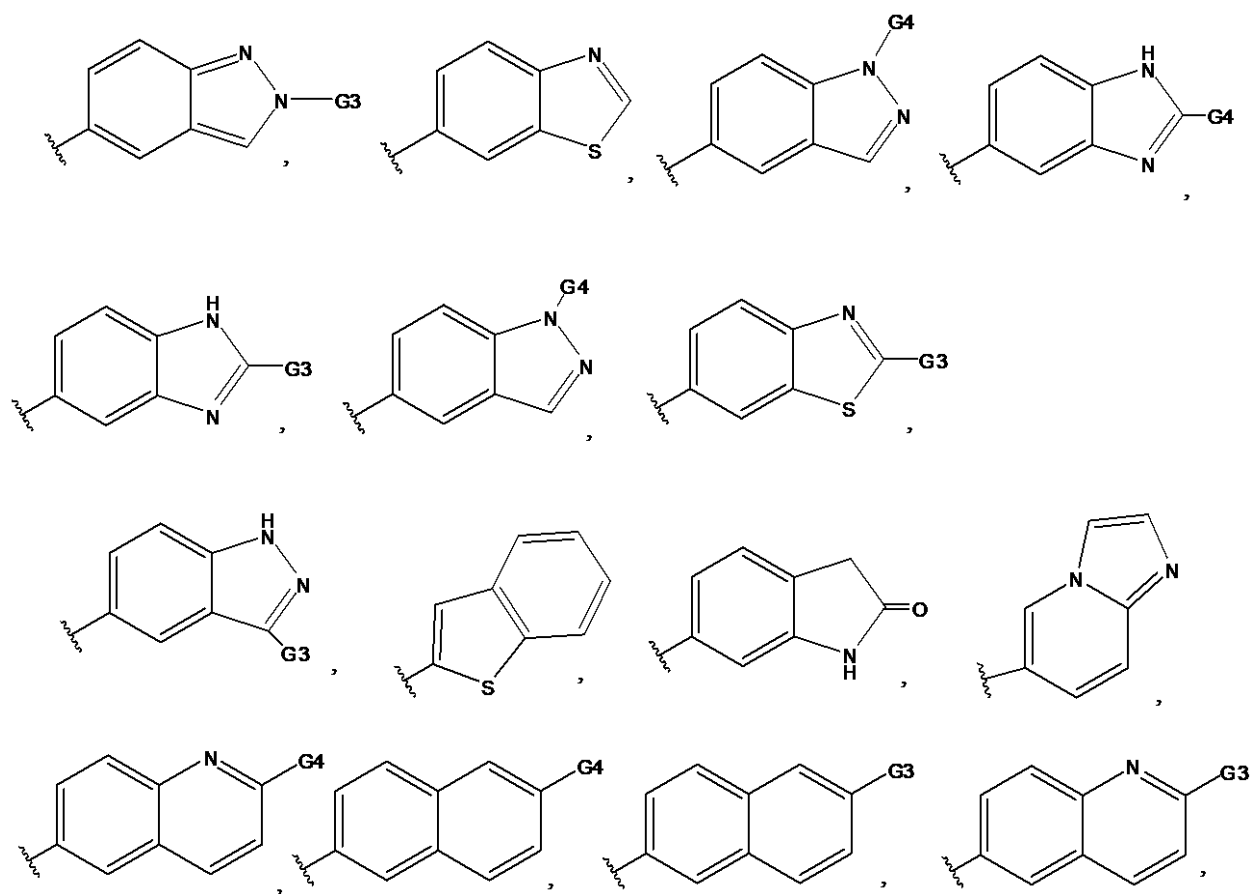
【請求項 1 3】

R 3 は、

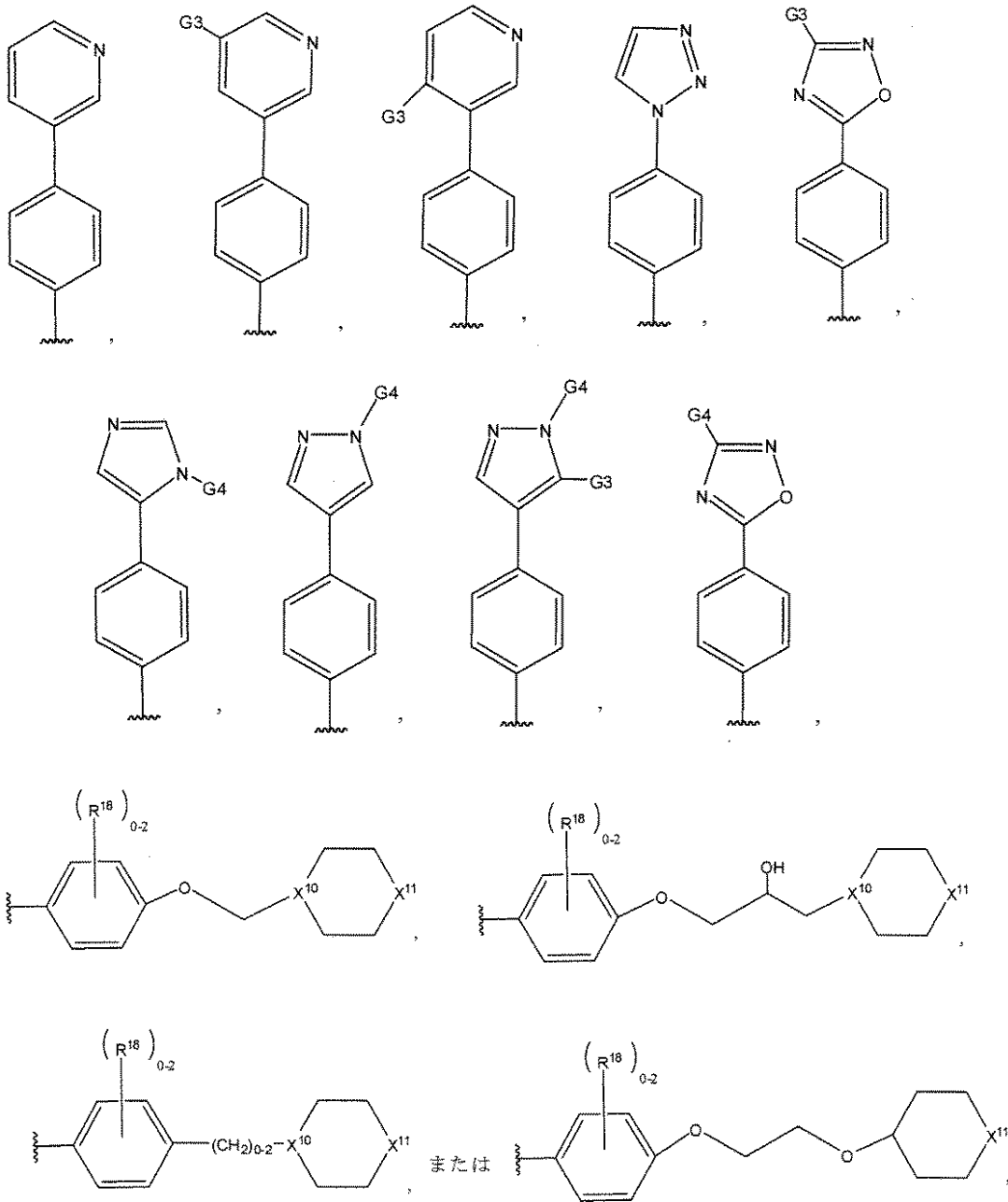
【化 1 5】



【化 1 6】



【化 17】



であり、式中、

X^{10} は、 CH 、 $-C(CH_3)-$ 、または N であり、

X^{11} は、 CH_2 、 NH 、 O 、 S 、 $S(O)$ 、または $S(O)_2$ であり、

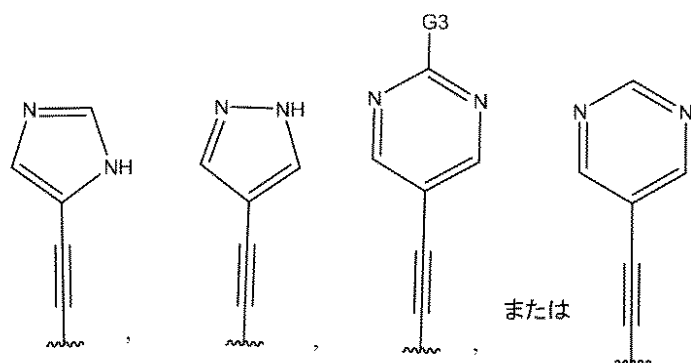
G^3 は、 $-CH_3$ 、 $-CH_2F$ 、 CHF_2 、 $-CF_3$ 、 $-CH_3$ 、 $-OCH_3$ 、 $-CH_2-CH_2F$ 、 $-(CH_2)_2-CN$ 、 $-(CH_2)_3-CN$ 、 $-(CH_2)_1\sim 2C(CH_3)_2-CN$ 、または $-(CH_2)_1\sim 2C(CH_3)_2-OH$ であり、

G^4 は、 $-CH_3$ 、 $-CH_2F$ 、 CHF_2 、 $-CF_3$ 、 $-CH_2-CH_2F$ 、 $-CH_2-CH_3$ 、 $-CH_2-CHF_2$ 、 $-CH_2-CF_3$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2F$ 、 $-(CH_2)_2-CN$ 、 $-(CH_2)_3-CN$ 、 $-(CH_2)_1\sim 2C(CH_3)_2-CN$ 、 $-(CH_2)_1\sim 2C(CH_3)_2-OH$ 、 $-CH_2-CH_2OH$ 、 $-CH_2-S(O)_2-CH_3$ 、 $-CH_2-CH_2-S(O)_2-CH_3$ 、 $-CH_2-C(O)-NH_2$ 、 $-CH_2-CH_2-$ モルホリニル、 $-CH_2-CH_2-$ ピロリジニル、 $-CH_2-$ モルホリニル、 $-CH_2-$ ピロリジニル、 $-CH_2-CH_2-$ シクロブチル、 $-CH_2-$ シクロブチル、 $-C_1\sim C_3$ アルキレン-シクロプロピル、 $-C_1\sim C_3$ アルキレン-シクロプロ

R 1 8 は、HまたはFである、請求項 1 ～ 4 または 8 ～ 1 2 のいずれか一項に記載の化合物。

R 3 は、

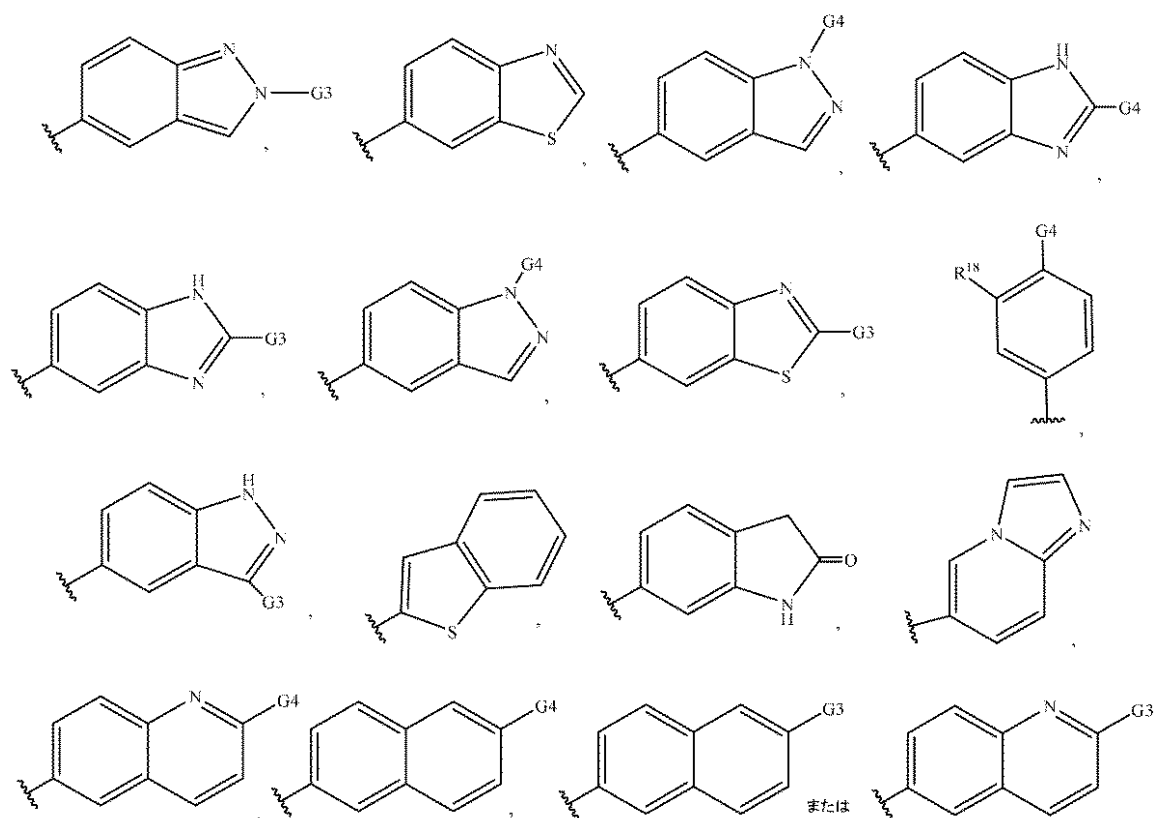
【化 1 8】



【請求項 15】

R 3 は、

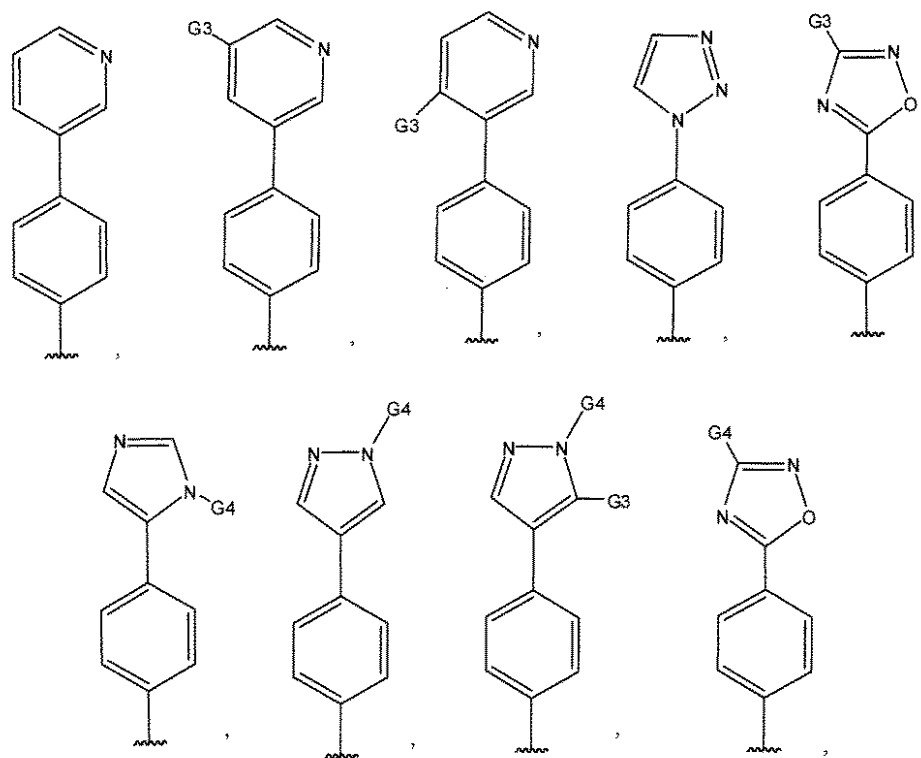
【化 1 9】



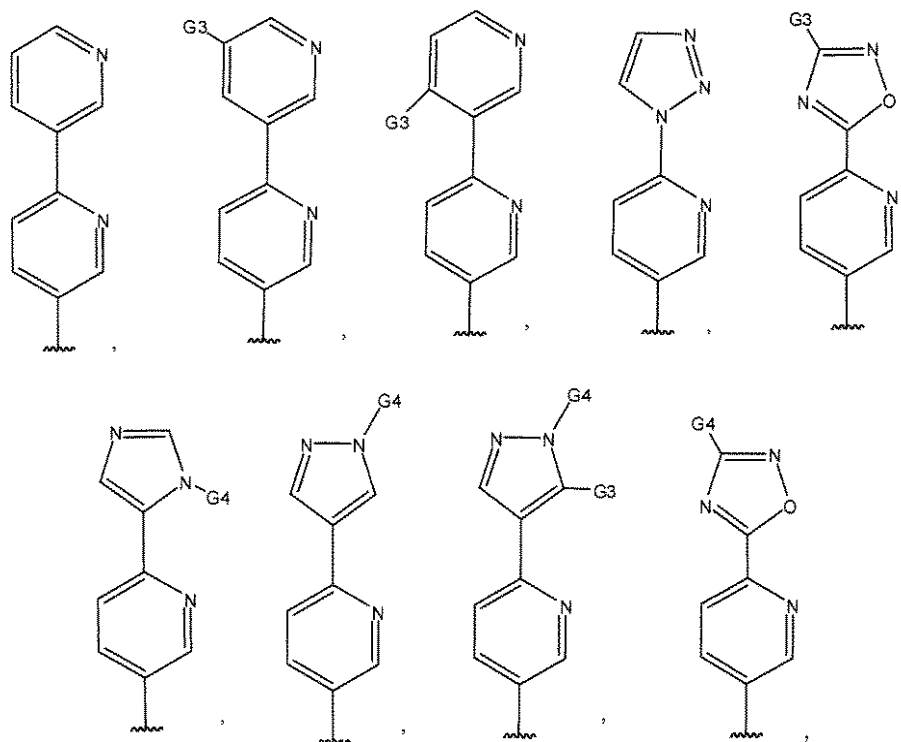
【請求項 16】

R 3 は、

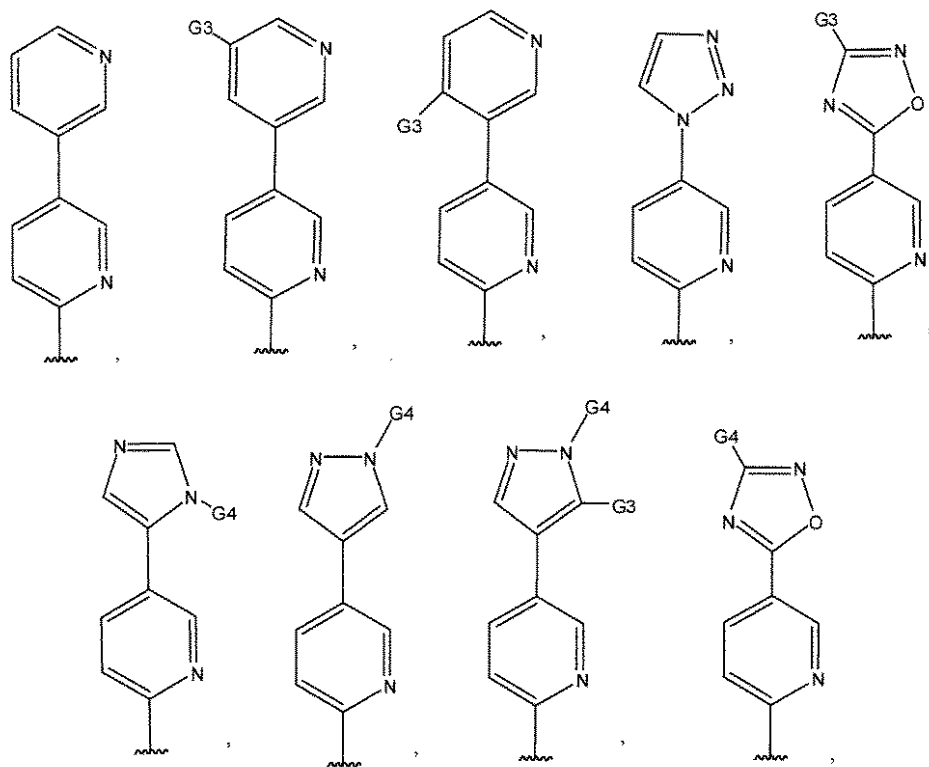
【化 2 0】



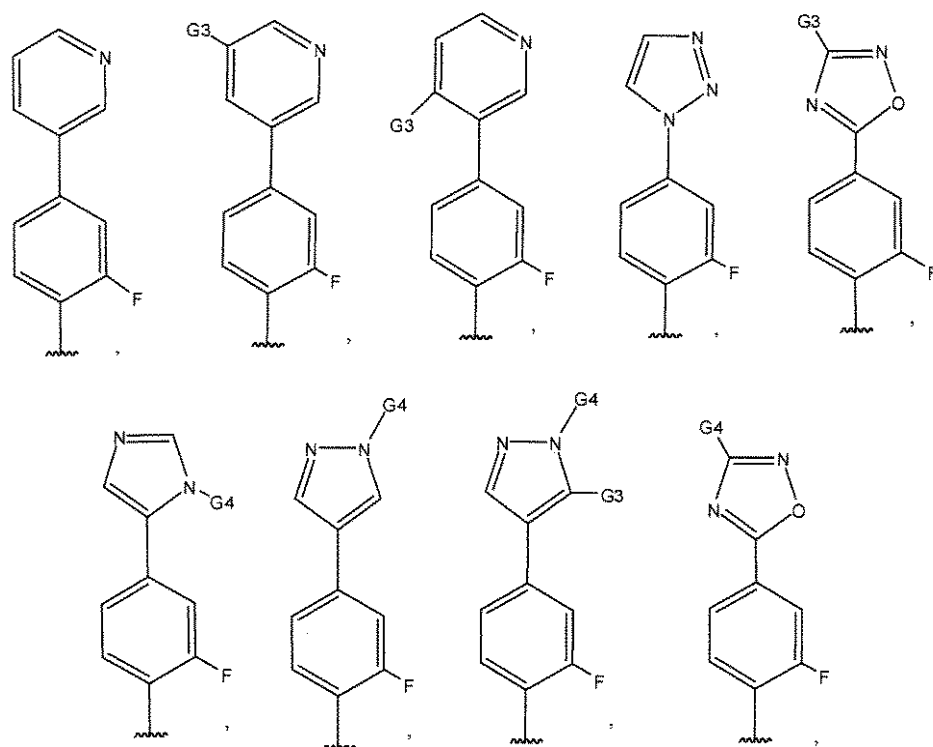
【化 2 1】



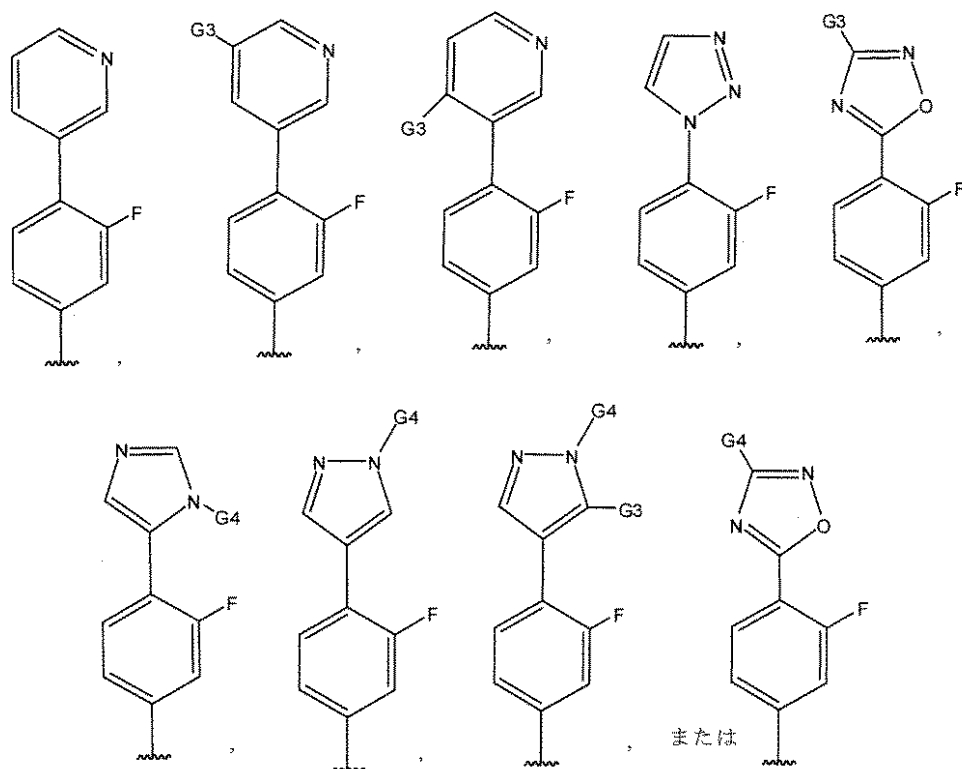
【化 2 2】



【化 2 3】



【化 2 4】

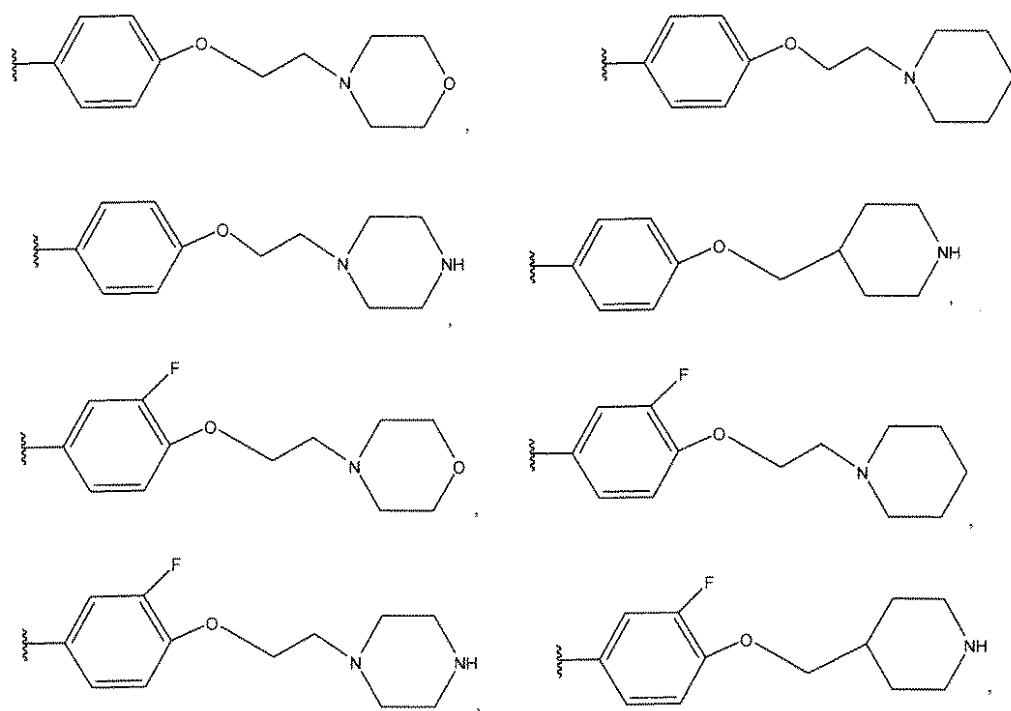


である、請求項 1 ～ 5 または 8 ～ 11 のいずれか一項に記載の化合物。

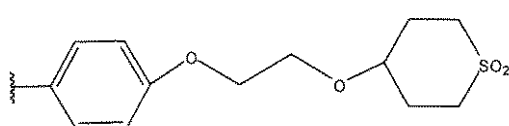
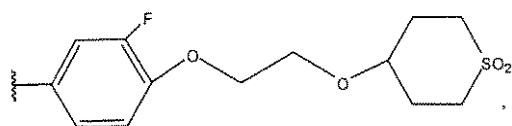
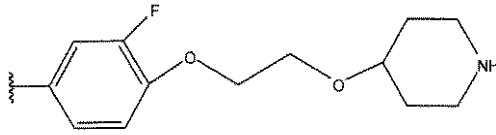
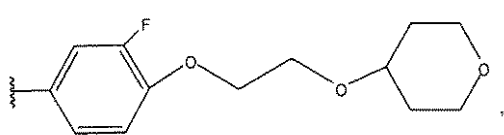
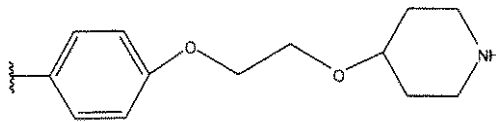
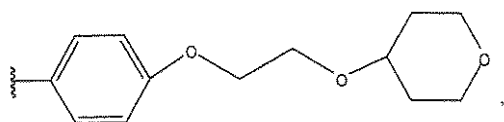
【請求項 17】

R 3 は、

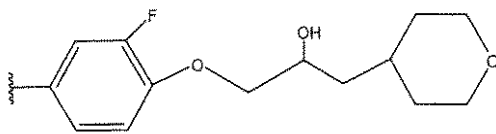
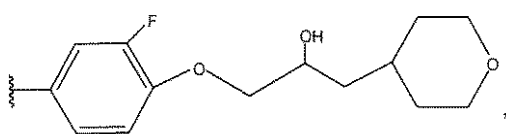
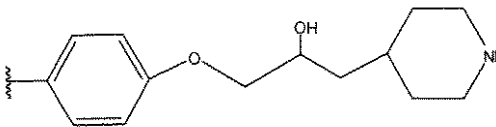
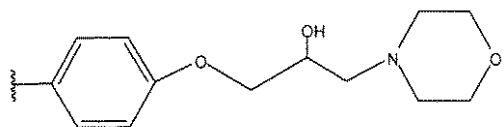
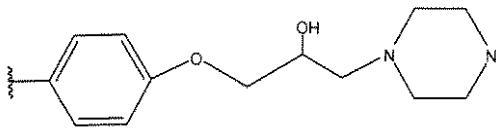
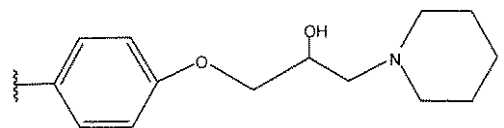
【化 2 5】



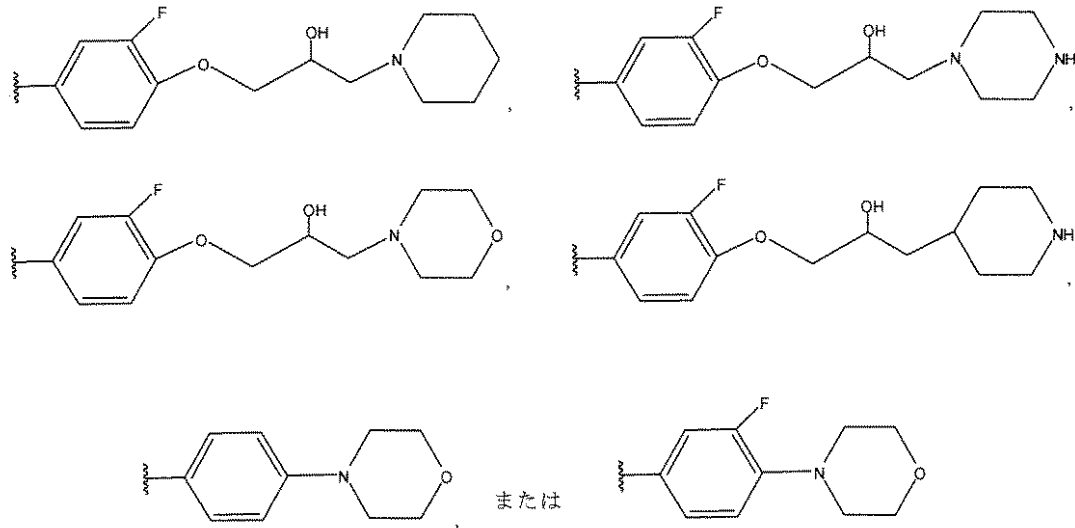
【化 2 6】



【化 2 7】



【化 2 8】



である、請求項 1 ～ 5 または 8 ～ 11 のいずれか一項に記載の化合物。

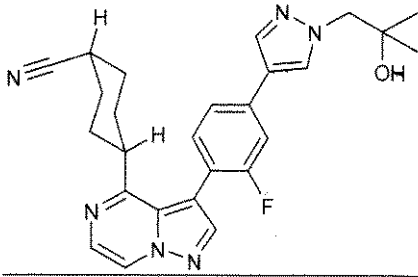
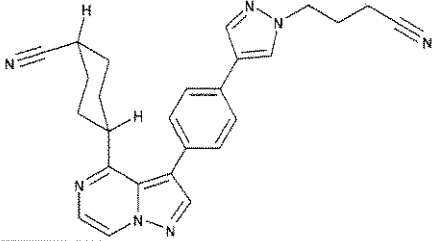
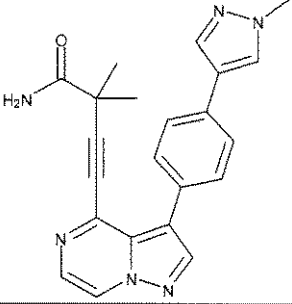
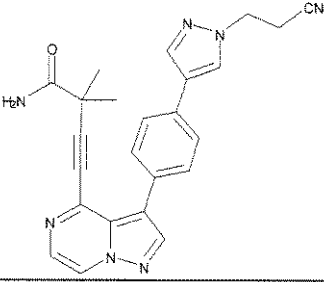
【請求項 18】

G 4 は、 $-CH_3$ 、 $-CH_2F$ 、 CHF_2 、 $-CF_3$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2F$ 、 $-(CH_2)_2-CN$ 、 $-(CH_2)_3-CN$ 、 $-(CH_2)C(CH_3)_2-CN$ 、 $-CH_2-C(CH_3)_2-OH$ 、 $-C_1 \sim C_3$ アルキレン-シクロプロピル、 $-CH_2$ -シクロプロピレン- $-OH$ 、または $-CH_2$ -シクロプロピレン- $-CN$ である、請求項 1 ～ 17 のいずれか一項に記載の化合物。

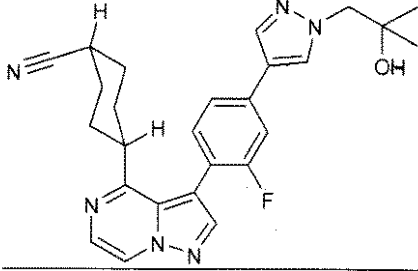
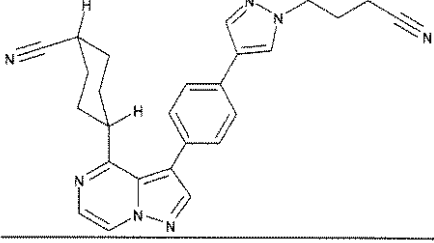
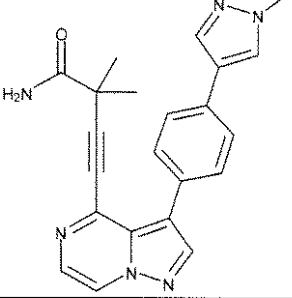
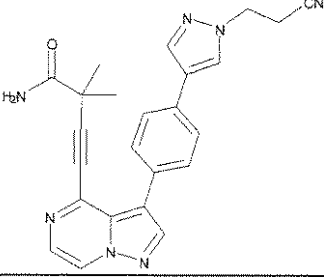
【請求項 19】

化合物が、

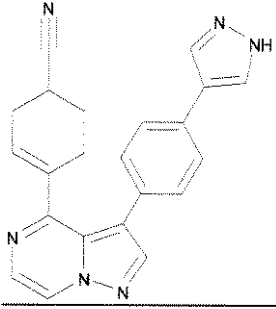
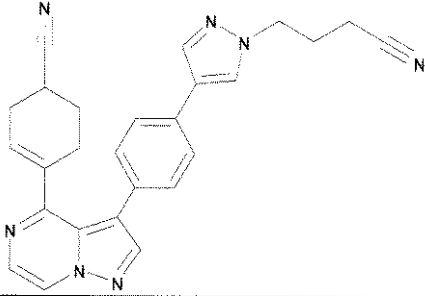
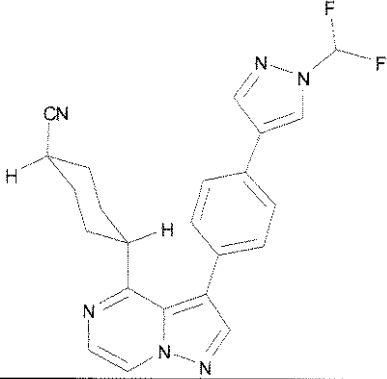
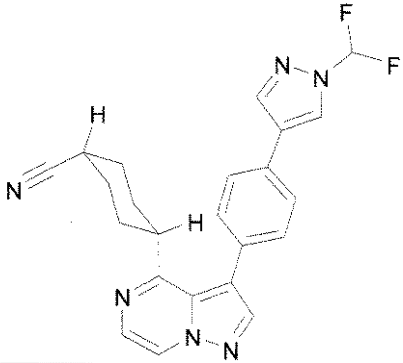
【表 1】

<u>P-0001</u>	
<u>P-0002</u>	
<u>P-0003</u>	
<u>P-0004</u>	

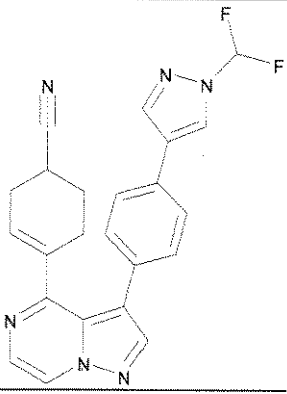
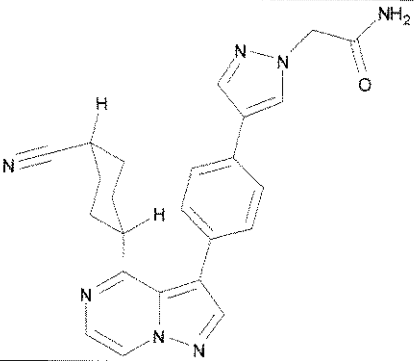
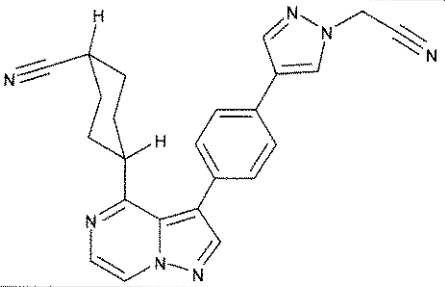
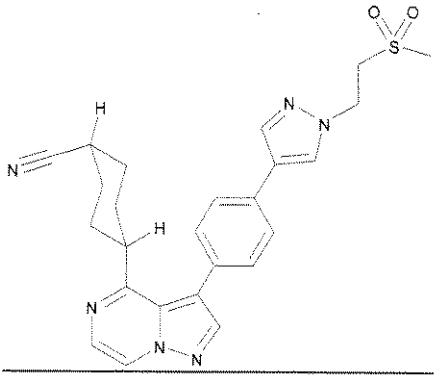
【表 2】

<u>P-0001</u>	
<u>P-0002</u>	
<u>P-0003</u>	
<u>P-0004</u>	

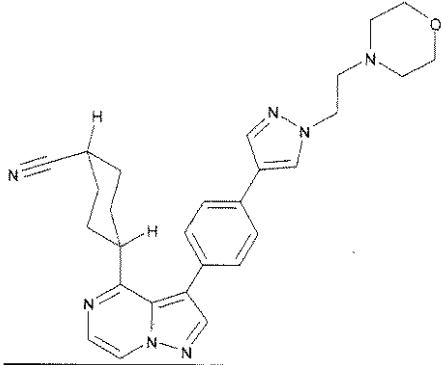
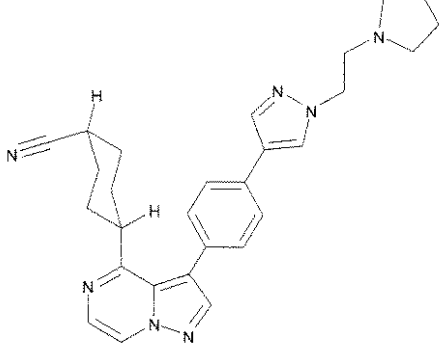
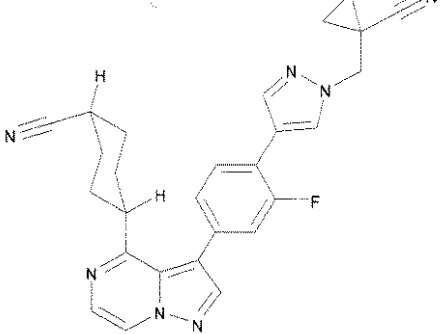
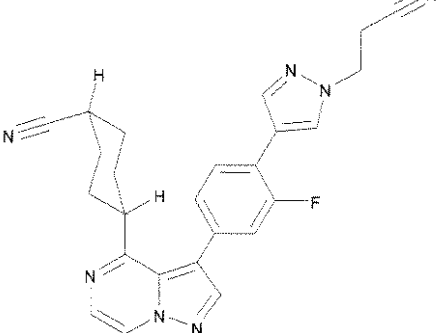
【表 3】

<u>P-0008</u>	
<u>P-0009</u>	
<u>P-0010</u>	
<u>P-0011</u>	

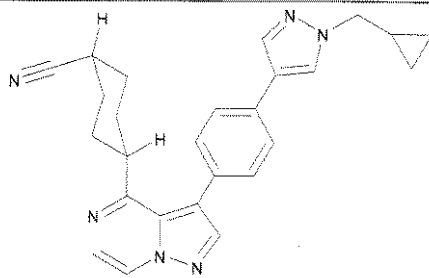
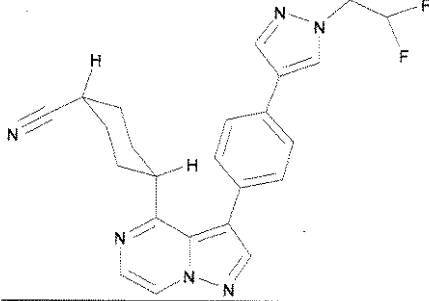
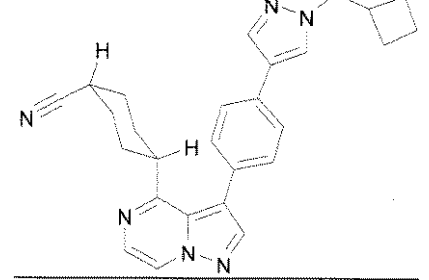
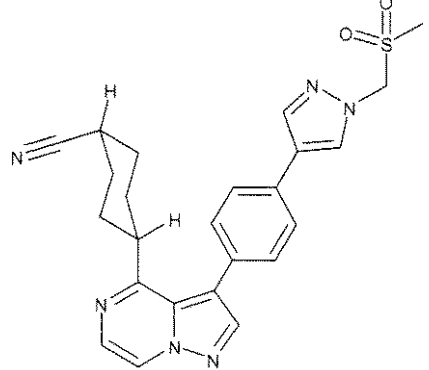
【表 4】

<u>P-0012</u>	
<u>P-0013</u>	
<u>P-0014</u>	
<u>P-0015</u>	

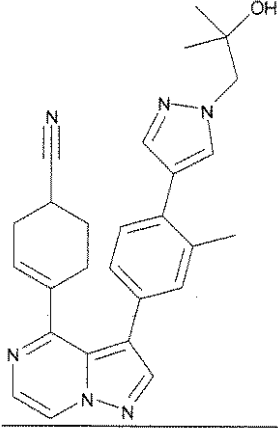
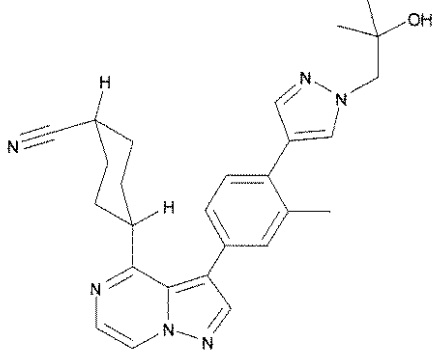
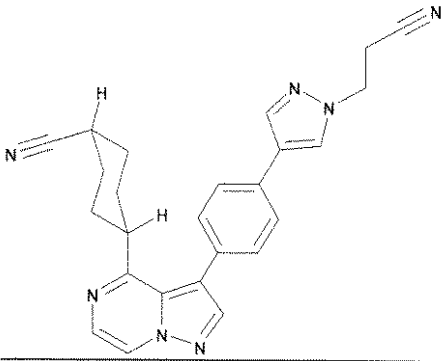
【表 5】

<u>P-0016</u>	
<u>P-0017</u>	
<u>P-0018</u>	
<u>P-0019</u>	

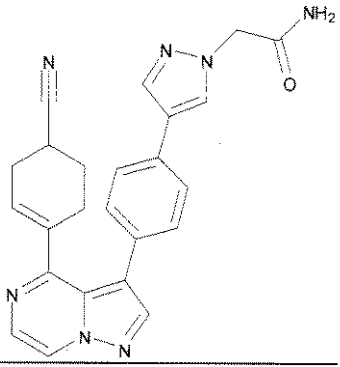
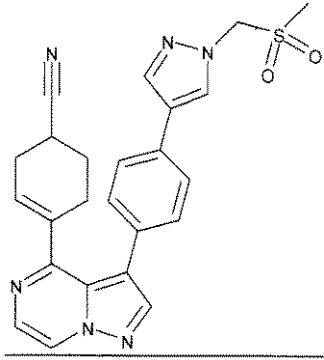
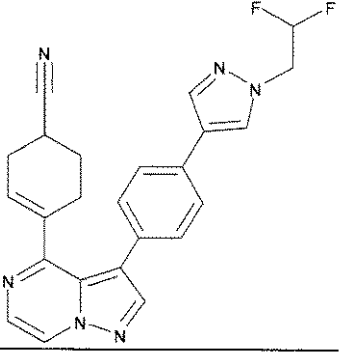
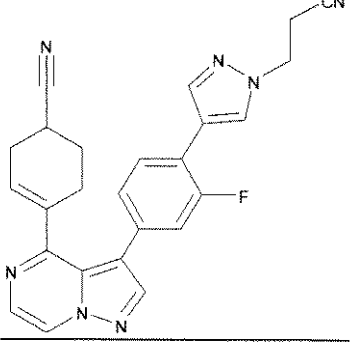
【表 6】

<u>P-0020</u>	
<u>P-0021</u>	
<u>P-0022</u>	
<u>P-0023</u>	

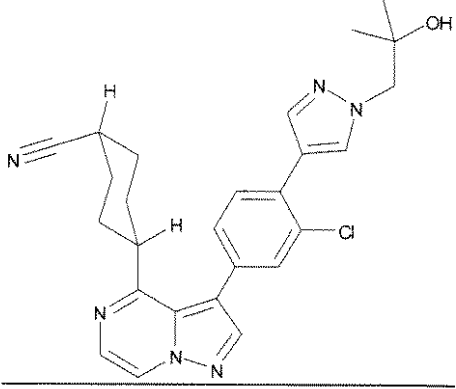
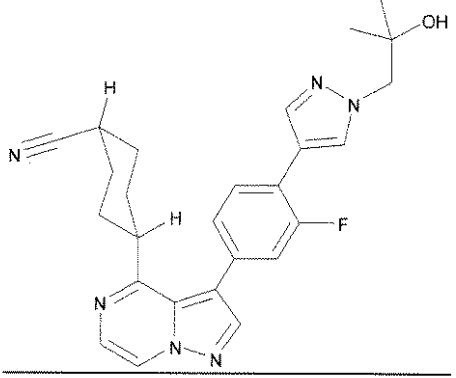
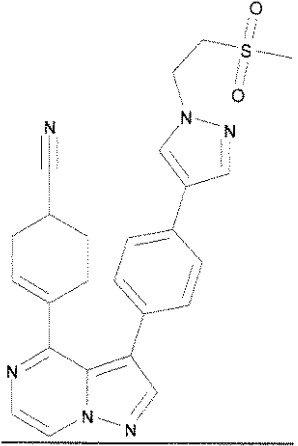
【表 7】

<u>P-0024</u>	 Chemical structure of P-0024: A triazole-fused pyrimidine system. The triazole ring is substituted with a 4-cyano-4-cyanoethylphenyl group and a 4-cyano-4-cyanoethylphenyl group. The pyrimidine ring is substituted with a 4-cyano-4-cyanoethylphenyl group.
<u>P-0025</u>	 Chemical structure of P-0025: A triazole-fused pyrimidine system. The triazole ring is substituted with a 4-cyano-4-cyanoethylphenyl group and a 4-cyano-4-cyanoethylphenyl group. The pyrimidine ring is substituted with a 4-cyano-4-cyanoethylphenyl group.
<u>P-0026</u>	 Chemical structure of P-0026: A triazole-fused pyrimidine system. The triazole ring is substituted with a 4-cyano-4-cyanoethylphenyl group and a 4-cyano-4-cyanoethylphenyl group. The pyrimidine ring is substituted with a 4-cyano-4-cyanoethylphenyl group.

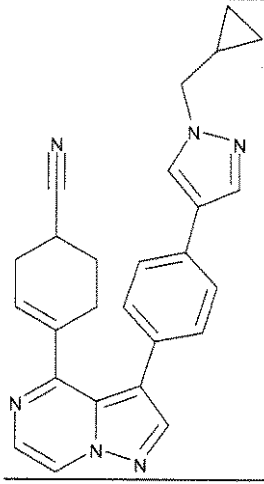
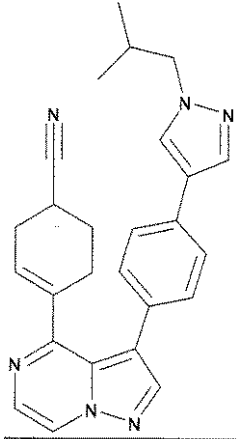
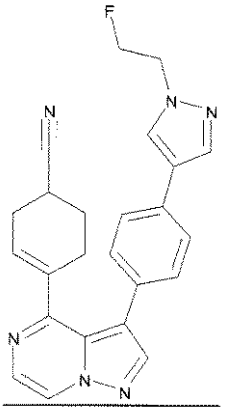
【表 8】

<u>P-0027</u>	
<u>P-0028</u>	
<u>P-0029</u>	
<u>P-0030</u>	

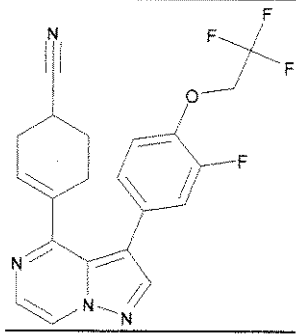
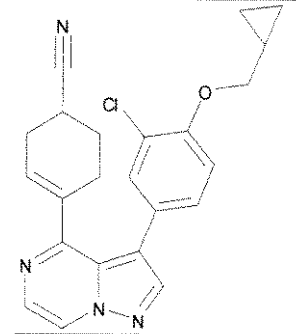
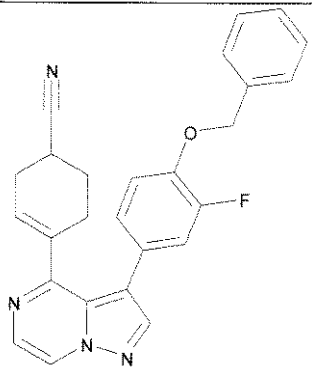
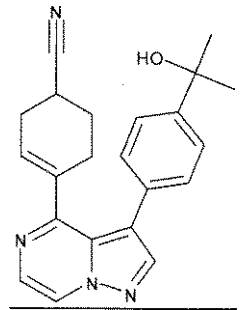
【表 9】

<u>P-0031</u>	 Chemical structure of P-0031: A bicyclic pyrazolo[1,5-a]pyrimidine core. The pyrimidine ring is substituted with a cyclohexyl group at position 6, which has a cyano group (-CN) at position 1. The pyrazole ring is substituted with a 4-chlorophenyl group at position 3 and a 1-(2-hydroxypropan-2-yl)-1H-imidazol-2-yl group at position 4.
<u>P-0032</u>	 Chemical structure of P-0032: A bicyclic pyrazolo[1,5-a]pyrimidine core. The pyrimidine ring is substituted with a cyclohexyl group at position 6, which has a cyano group (-CN) at position 1. The pyrazole ring is substituted with a 4-fluorophenyl group at position 3 and a 1-(2-hydroxypropan-2-yl)-1H-imidazol-2-yl group at position 4.
<u>P-0033</u>	 Chemical structure of P-0033: A bicyclic pyrazolo[1,5-a]pyrimidine core. The pyrimidine ring is substituted with a 4-cyanophenyl group at position 6 and a 4-(methylsulfonyl)phenyl group at position 3. The pyrazole ring is substituted with a 4-phenylphenyl group at position 3.

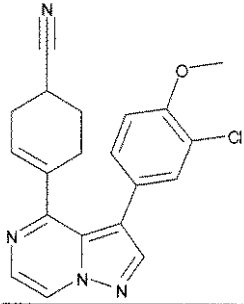
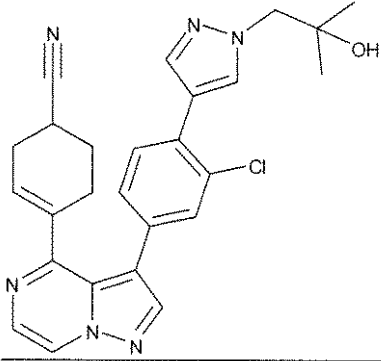
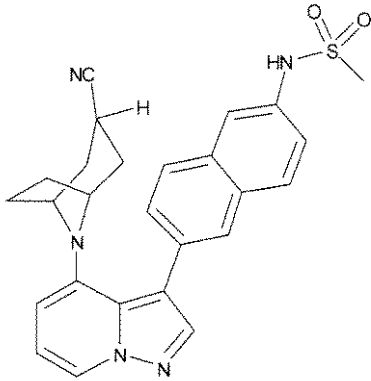
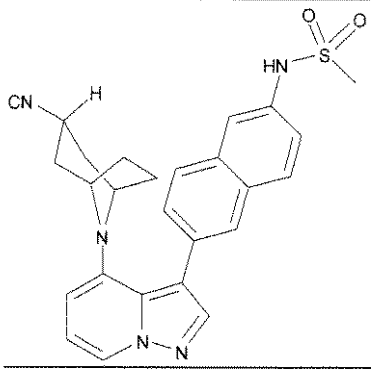
【表 10】

<u>P-0034</u>	
<u>P-0035</u>	
<u>P-0036</u>	

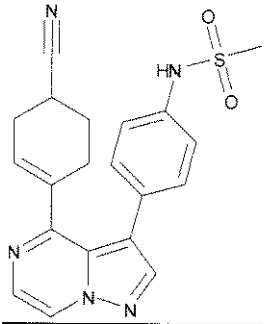
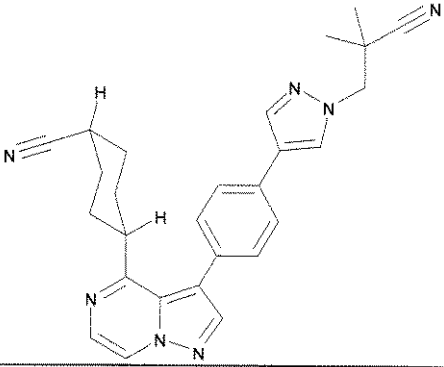
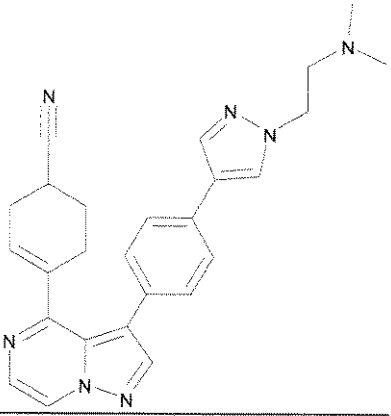
【表 1 1】

<u>P-0037</u>	
<u>P-0038</u>	
<u>P-0039</u>	
<u>P-0040</u>	

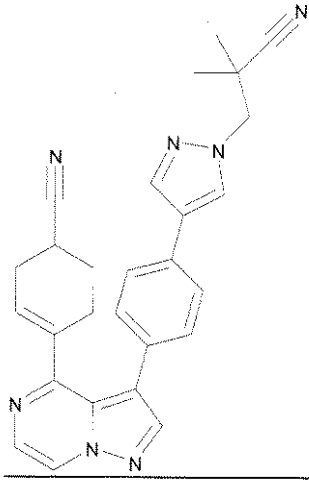
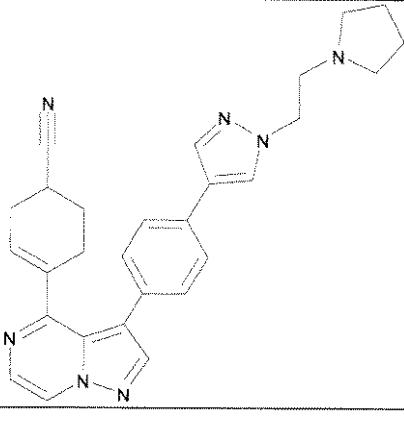
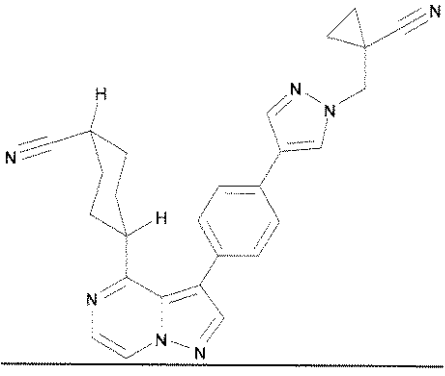
【表 1 2】

<u>P-0041</u>	
<u>P-0042</u>	
<u>P-0043</u>	
<u>P-0044</u>	

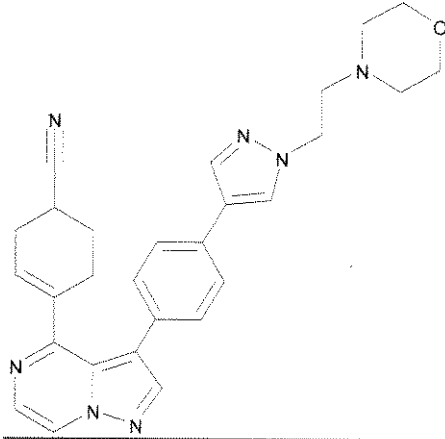
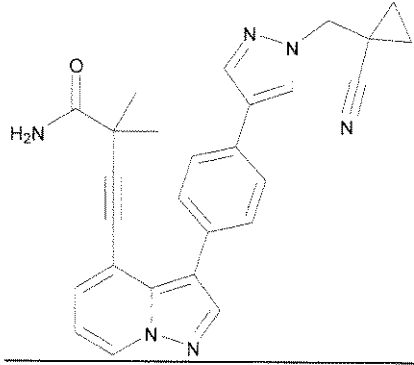
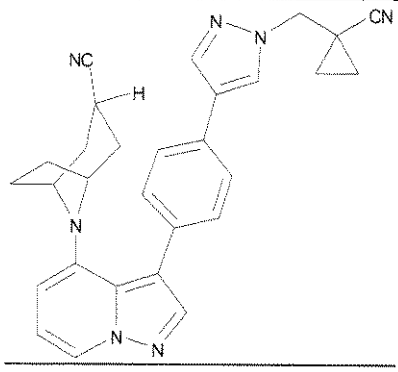
【表 1 3】

<u>P-0045</u>	
<u>P-0046</u>	
<u>P-0047</u>	

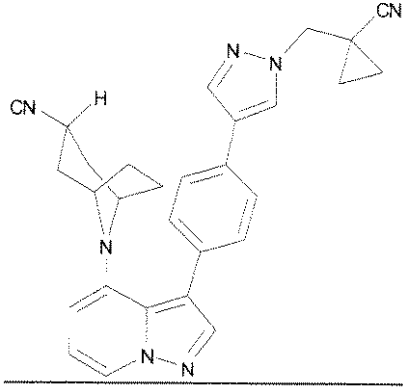
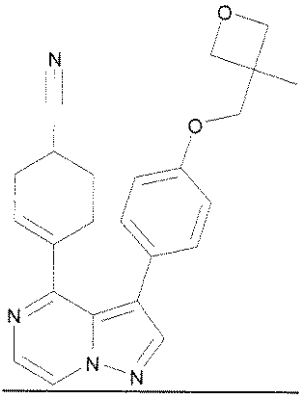
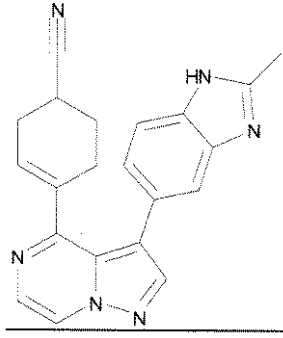
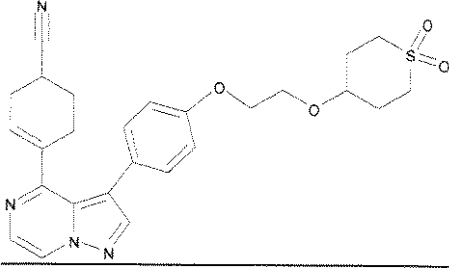
【表 1 4】

P-0048	
P-0049	
P-0050	

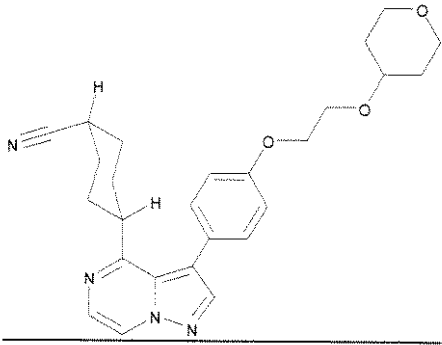
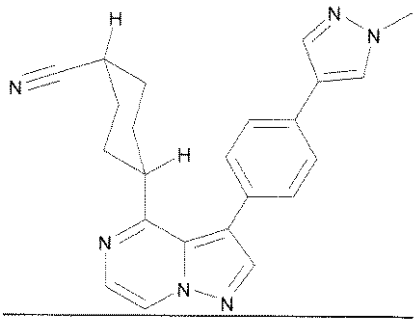
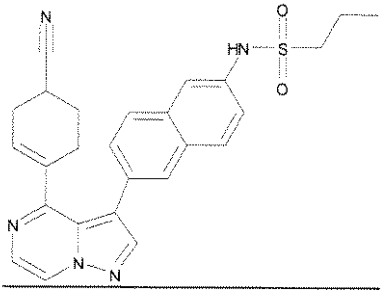
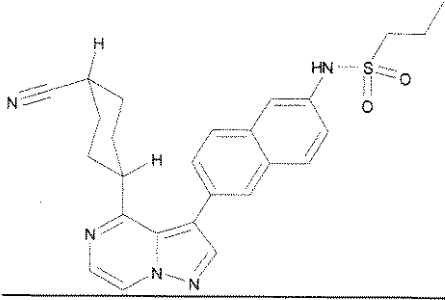
【表 1 5】

<u>P-0051</u>	
<u>P-0052</u>	
<u>P-0053</u>	

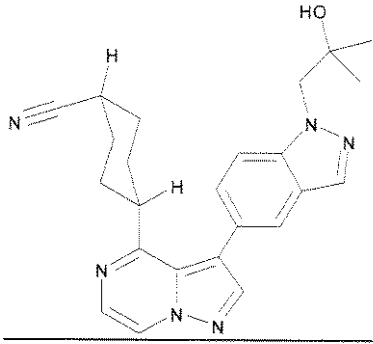
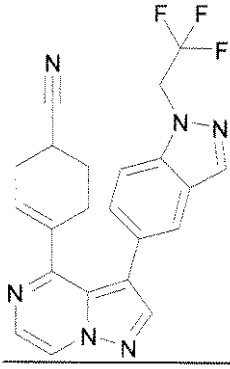
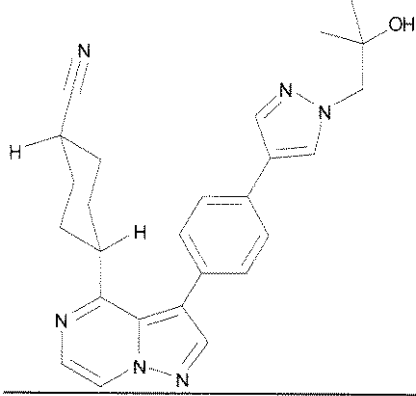
【表 1 6】

<u>P-0054</u>	
<u>P-0055</u>	
<u>P-0056</u>	
<u>P-0057</u>	

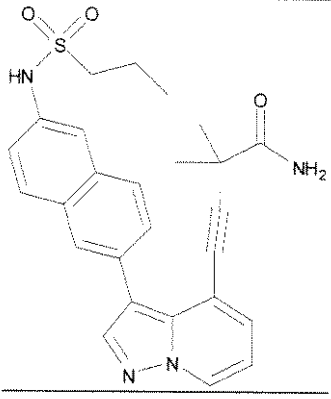
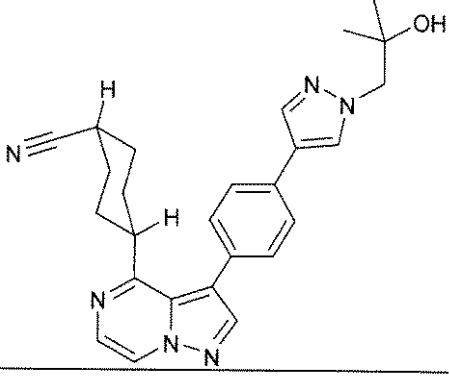
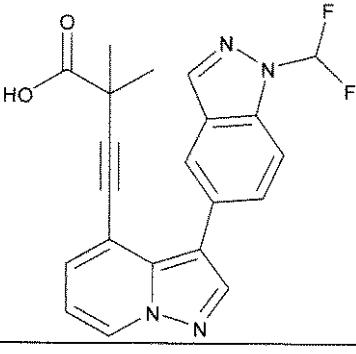
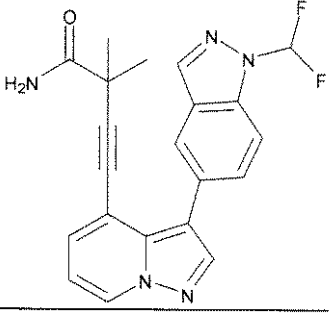
【表 1 7】

<u>P-0058</u>	
<u>P-0059</u>	
<u>P-0060</u>	
<u>P-0061</u>	

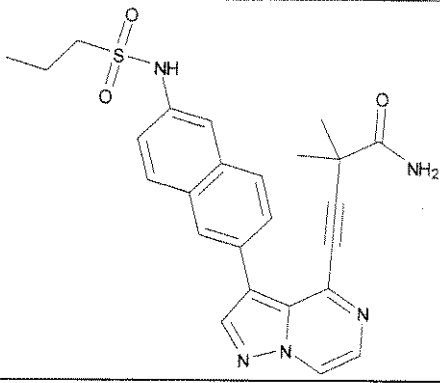
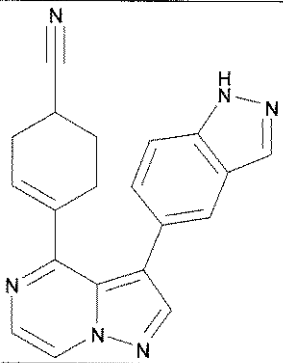
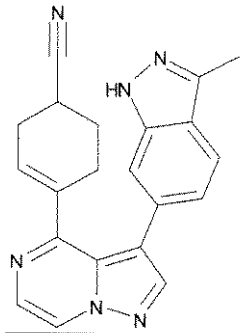
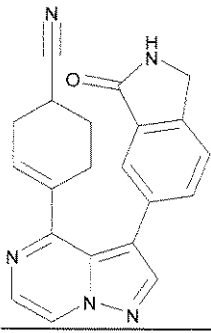
【表 1 8】

<u>P-0062</u>	 Chemical structure of P-0062: A 1,2,4-triazole ring is substituted at the 5-position with a 4-cyano-4,5,6,7-tetrahydrophthalazine-2-yl group and at the 3-position with a 1-(4-(1,2,4-triazol-5-yl)phenyl)ethyl group. The triazole ring also has a 2-hydroxy-2-methylpropyl substituent at the 1-position.
<u>P-0063</u>	 Chemical structure of P-0063: A 1,2,4-triazole ring is substituted at the 5-position with a 4-cyano-4,5,6,7-tetrahydrophthalazine-2-yl group and at the 3-position with a 1-(4-(1,2,4-triazol-5-yl)phenyl)ethyl group. The triazole ring also has a 2,2,2-trifluoroethyl substituent at the 1-position.
<u>P-0064</u>	 Chemical structure of P-0064: A 1,2,4-triazole ring is substituted at the 5-position with a 4-cyano-4,5,6,7-tetrahydrophthalazine-2-yl group and at the 3-position with a 1-(4-(1,2,4-triazol-5-yl)phenyl)ethyl group. The triazole ring also has a 2-hydroxy-2-methylpropyl substituent at the 1-position.

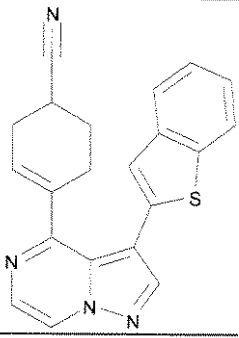
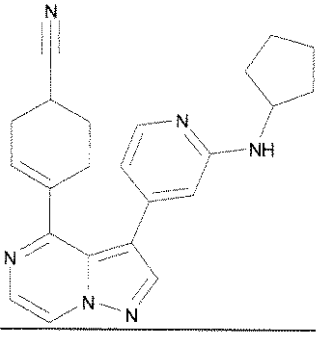
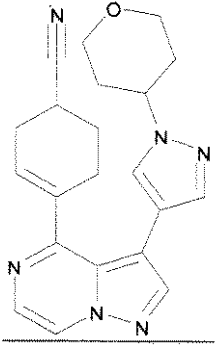
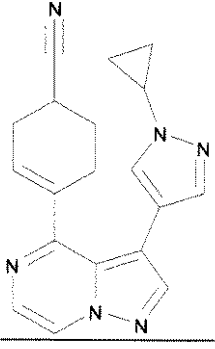
【表 19】

<u>P-0065</u>	
<u>P-0066</u>	
<u>P-0067</u>	
<u>P-0068</u>	

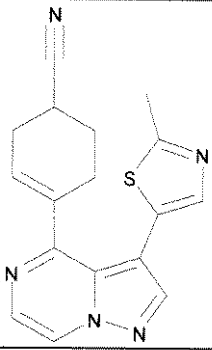
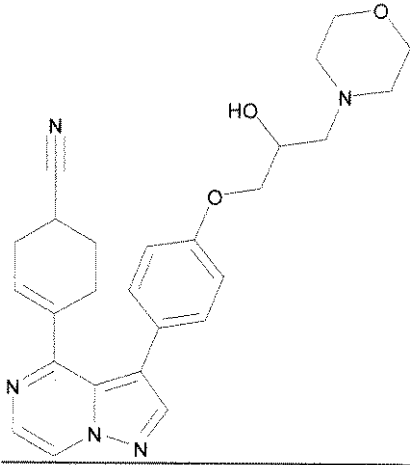
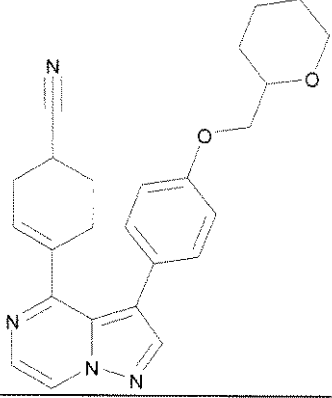
【表 2 0】

<u>P-0069</u>	
<u>P-0070</u>	
<u>P-0071</u>	
<u>P-0072</u>	

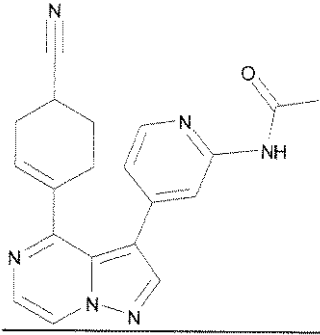
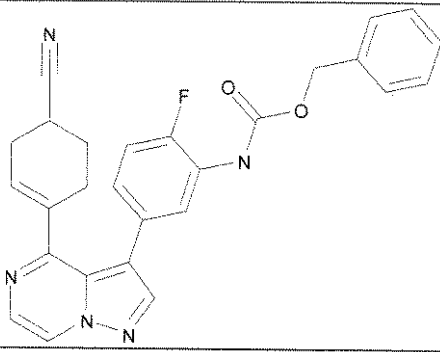
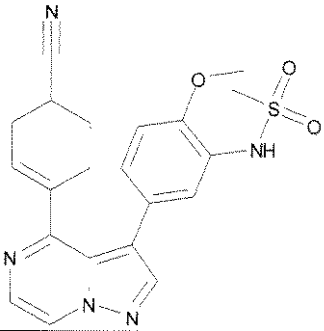
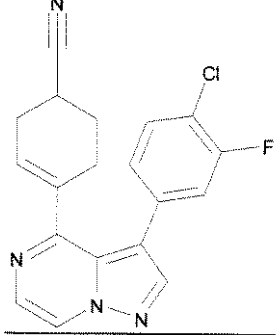
【表 2 1】

<u>P-0073</u>	
<u>P-0074</u>	
<u>P-0075</u>	
<u>P-0076</u>	

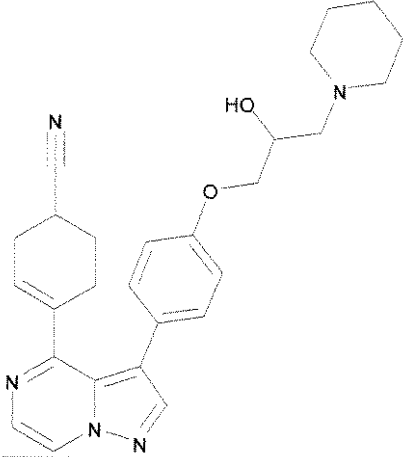
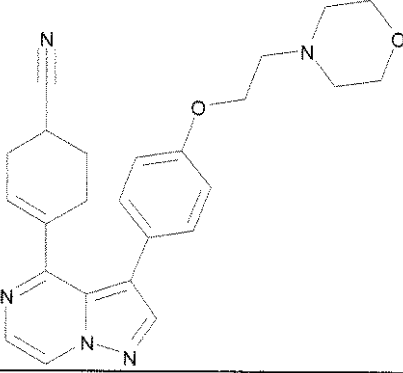
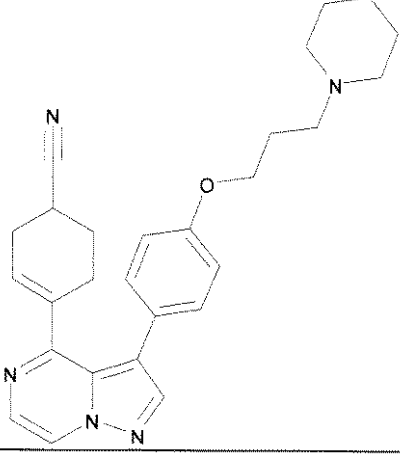
【表 2 2】

<u>P-0077</u>	
<u>P-0078</u>	
<u>P-0079</u>	

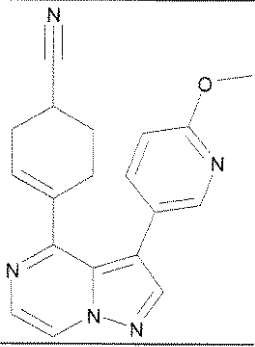
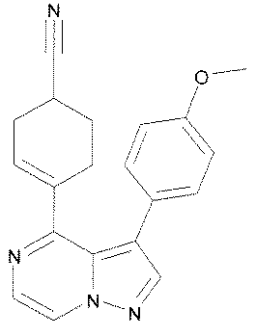
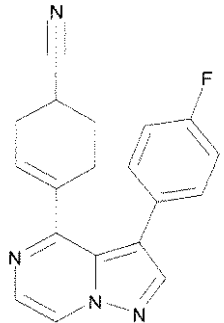
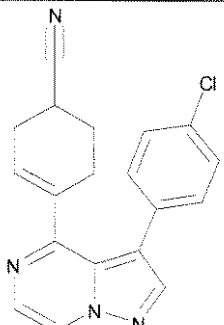
【表 2 3】

<u>P-0080</u>	
<u>P-0081</u>	
<u>P-0082</u>	
<u>P-0083</u>	

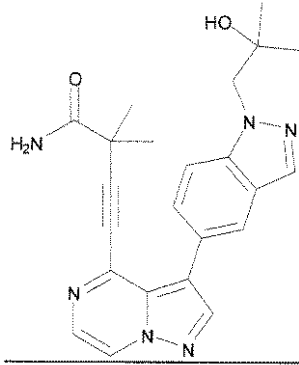
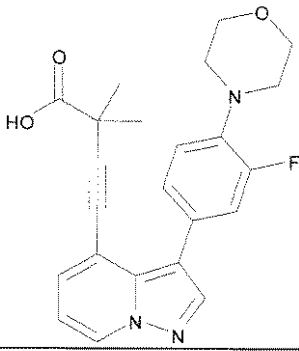
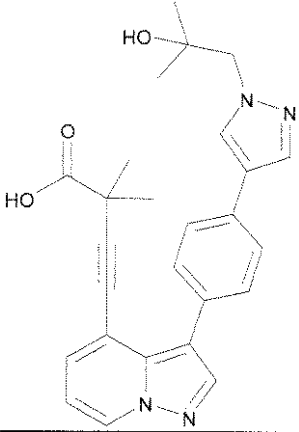
【表 2 4】

<u>P-0084</u>	
<u>P-0085</u>	
<u>P-0086</u>	

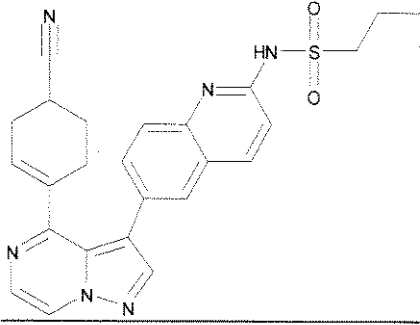
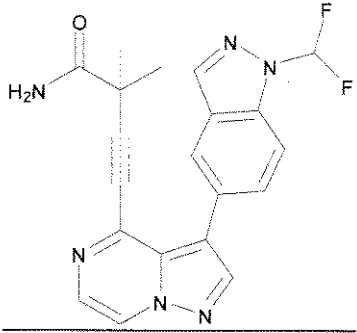
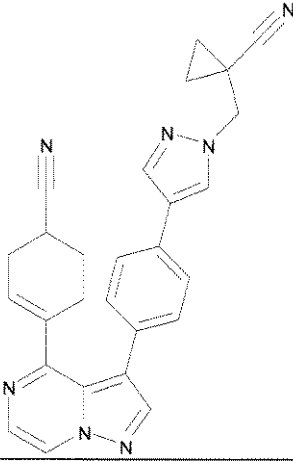
【表 2 5】

<u>P-0087</u>	
<u>P-0088</u>	
<u>P-0089</u>	
<u>P-0090</u>	

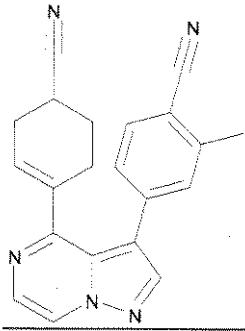
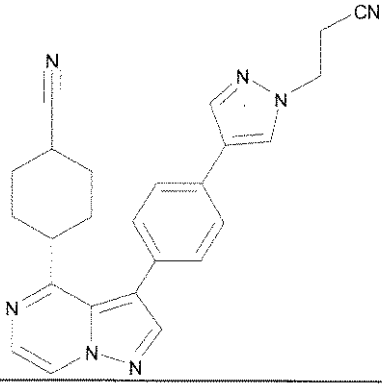
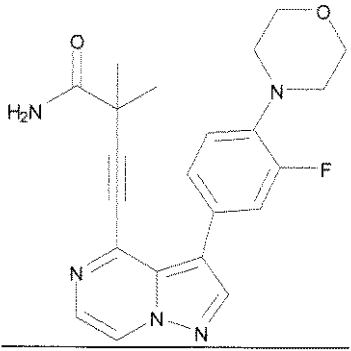
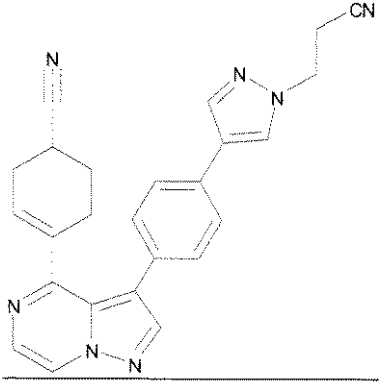
【表 2 6】

<u>P-0091</u>	 Chemical structure of P-0091: A quinazoline core substituted at the 4-position with a 2-((2-aminopropanoyl)amino)phenyl group and at the 7-position with a 2-((2-hydroxypropanoyl)amino)phenyl group.
<u>P-0092</u>	 Chemical structure of P-0092: A quinazoline core substituted at the 4-position with a 2-((2-carboxypropanoyl)amino)phenyl group and at the 7-position with a 2-((2-(4-fluorophenyl)-2-morpholinyl)amino)phenyl group.
<u>P-0093</u>	 Chemical structure of P-0093: A quinazoline core substituted at the 4-position with a 2-((2-carboxypropanoyl)amino)phenyl group and at the 7-position with a 2-((2-((2-hydroxypropanoyl)amino)phenyl)amino)phenyl group.

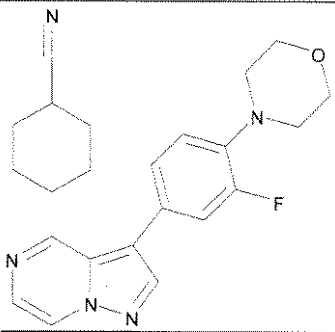
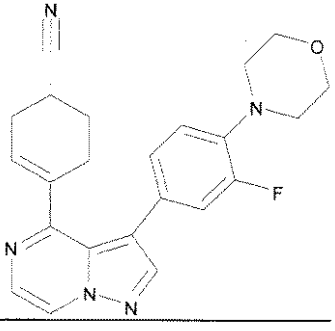
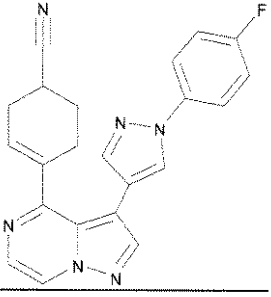
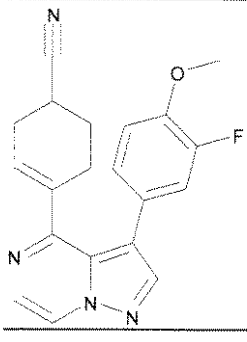
【表 2 7】

<u>P-0094</u>	
<u>P-0095</u>	
<u>P-0096</u>	

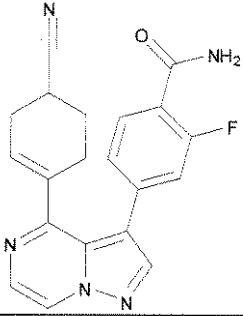
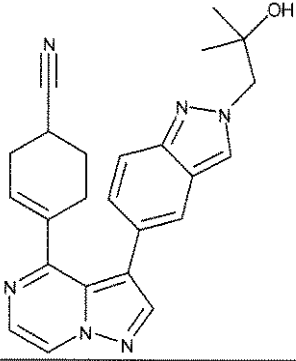
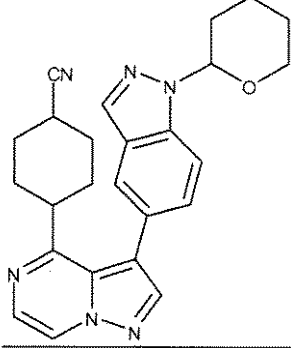
【表 2 8】

<u>P-0097</u>	
<u>P-0098</u>	
<u>P-0099</u>	
<u>P-0100</u>	

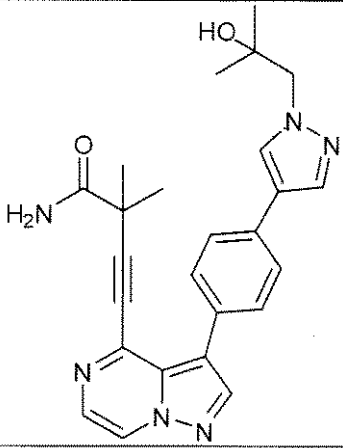
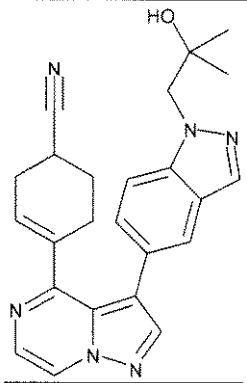
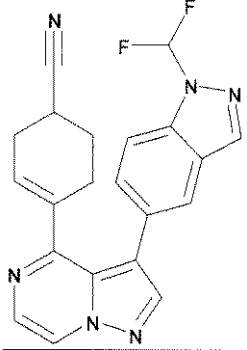
【表 2 9】

<u>P-0101</u>	
<u>P-0102</u>	
<u>P-0103</u>	
<u>P-0104</u>	

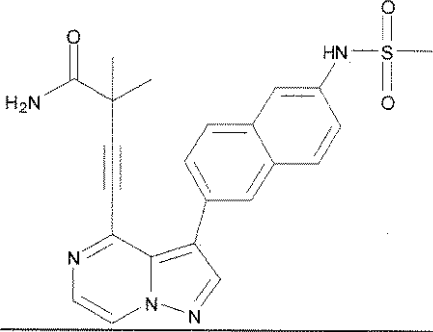
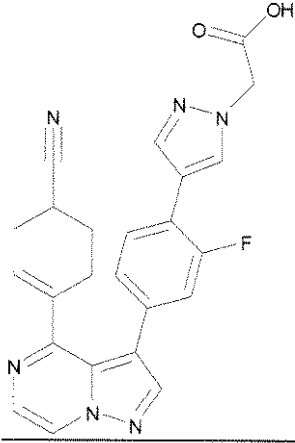
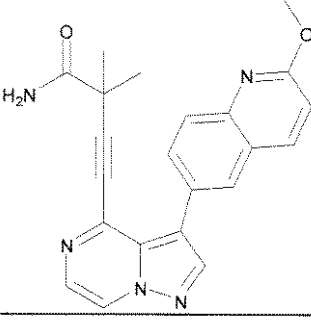
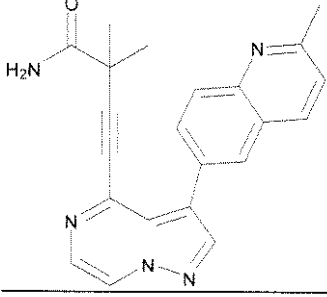
【表 3 0】

<u>P-0105</u>	
<u>P-0106</u>	
<u>P-0109</u>	

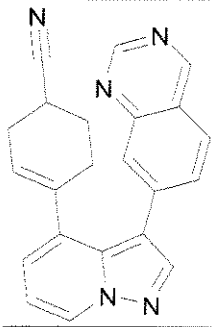
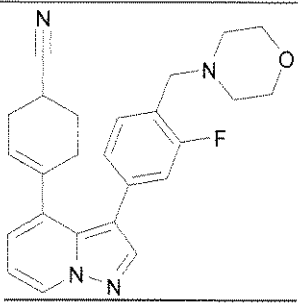
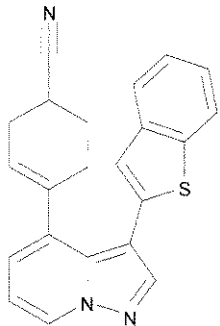
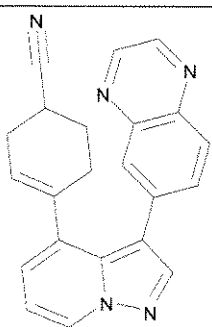
【表 3 1】

<u>P-0110</u>	 Chemical structure of P-0110: A triazole-fused pyrimidine system. The pyrimidine ring is substituted with a 4-(4-(2-((2-aminopropan-2-ylideneamino)oxy)phenyl)phenyl)phenyl group and a 2-((2-hydroxypropan-2-ylideneamino)oxy)phenyl group.
<u>P-0111</u>	 Chemical structure of P-0111: A triazole-fused pyrimidine system. The pyrimidine ring is substituted with a 4-(4-(2-((2-cyanoethylideneamino)oxy)phenyl)phenyl)phenyl group and a 2-((2-hydroxypropan-2-ylideneamino)oxy)phenyl group.
<u>P-0114</u>	 Chemical structure of P-0114: A triazole-fused pyrimidine system. The pyrimidine ring is substituted with a 4-(4-(2-((2-cyanoethylideneamino)oxy)phenyl)phenyl)phenyl group and a 2-((2-(difluoromethylideneamino)oxy)phenyl)phenyl group.

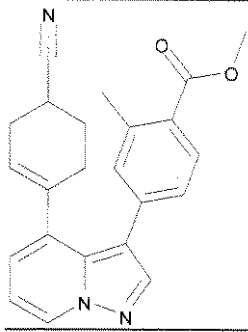
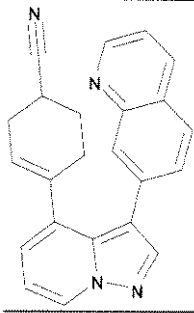
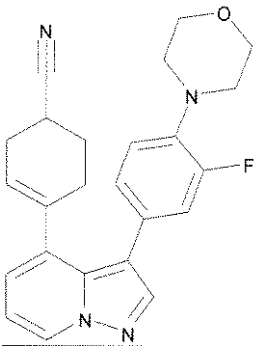
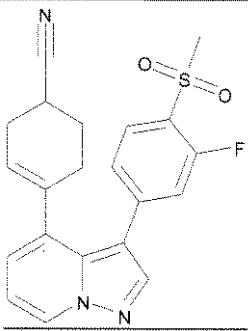
【表 3 2】

<u>P-0115</u>	
<u>P-0116</u>	
<u>P-0117</u>	
<u>P-0118</u>	

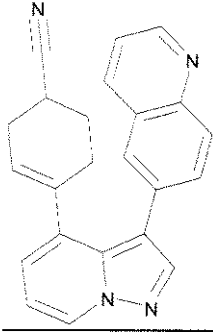
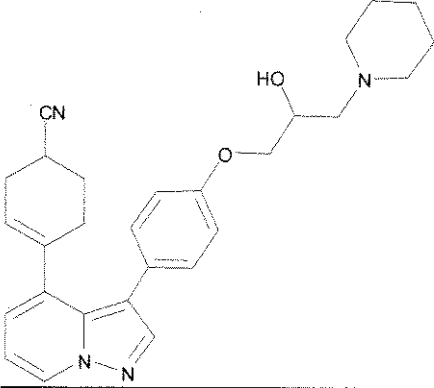
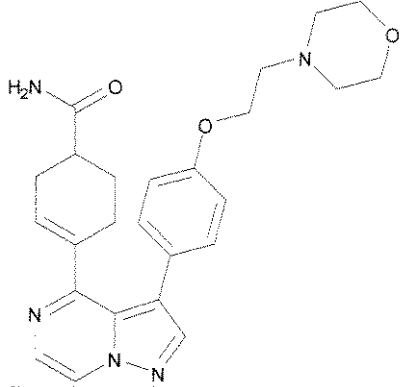
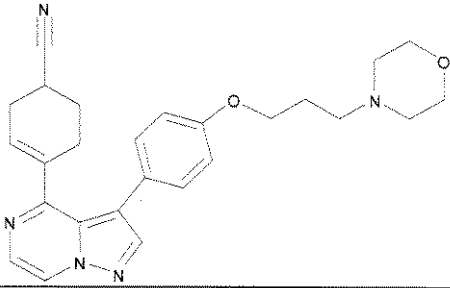
【表 3 3】

<u>P-0119</u>	
<u>P-0120</u>	
<u>P-0121</u>	
<u>P-0122</u>	

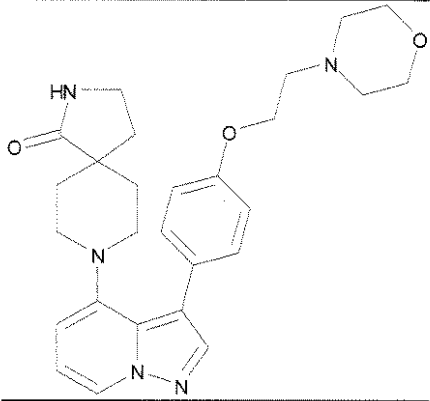
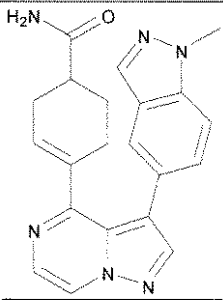
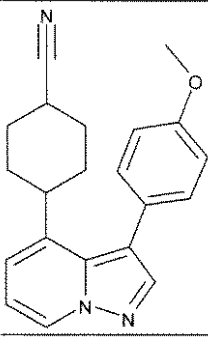
【表 3 4】

<u>P-0123</u>	
<u>P-0124</u>	
<u>P-0125</u>	
<u>P-0126</u>	

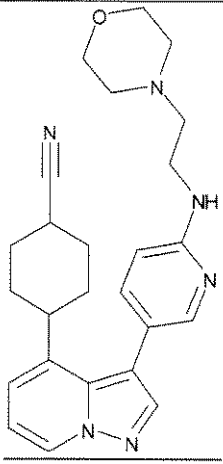
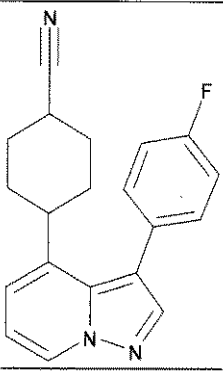
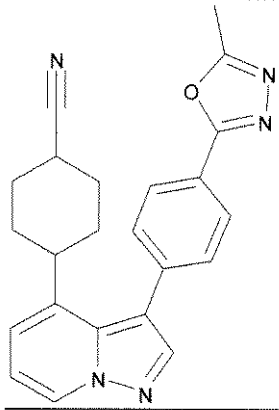
【表 3 5】

<u>P-0127</u>	
<u>P-0128</u>	
<u>P-0129</u>	
<u>P-0130</u>	

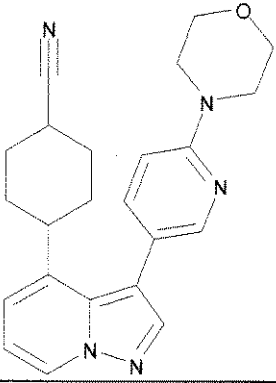
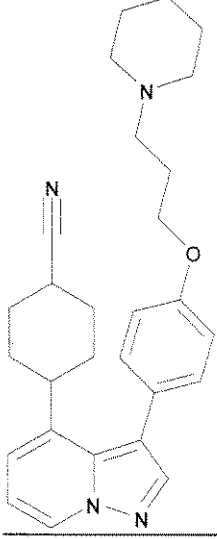
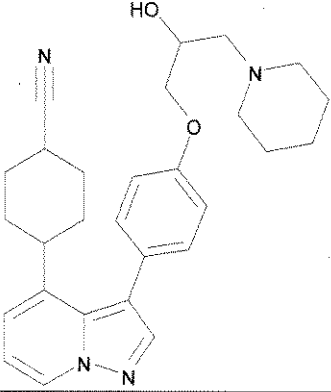
【表 3 6】

<u>P-0135</u>	 Chemical structure of P-0135: A 1,2,3-triazole core substituted at the 4-position with a 1-(4-(2-morpholinoethoxy)phenyl)-4-oxo-1,2,3,6-tetrahydropyridine group.
<u>P-0136</u>	 Chemical structure of P-0136: A 1,2,3-triazole core substituted at the 4-position with a 1-(4-(aminocarbonyl)cyclohexyl)-1H-1,2,3-triazole group.
<u>P-0137</u>	 Chemical structure of P-0137: A 1,2,3-triazole core substituted at the 4-position with a 1-(4-(cyano)cyclohexyl)-4-methoxyphenyl group.

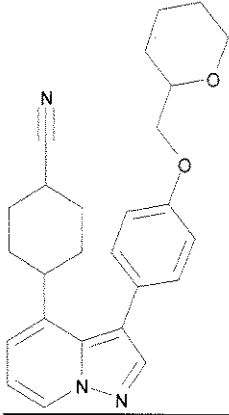
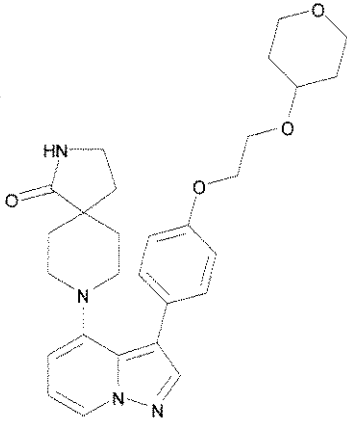
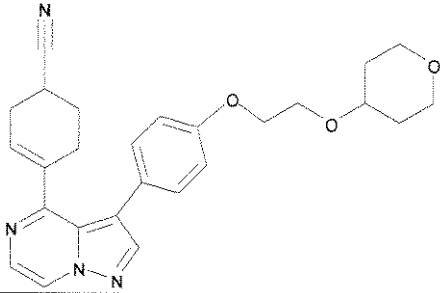
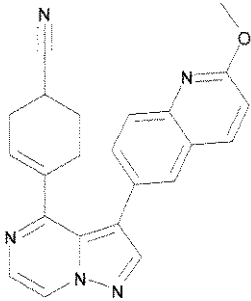
【表 3 7】

<u>P-0138</u>	
<u>P-0139</u>	
<u>P-0140</u>	

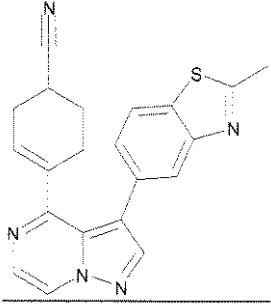
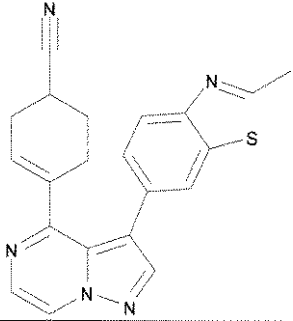
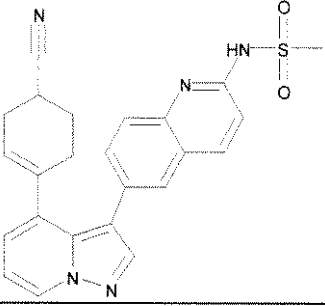
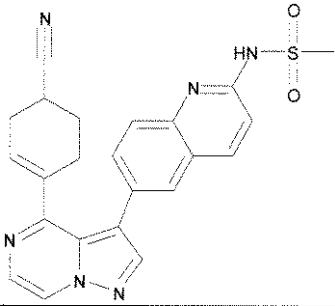
【表 3 8】

<u>P-0141</u>	
<u>P-0142</u>	
<u>P-0143</u>	

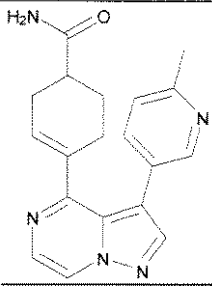
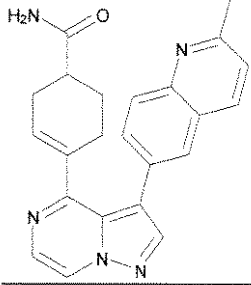
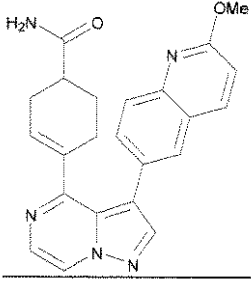
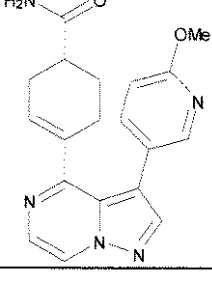
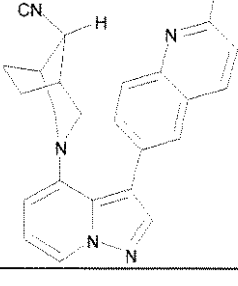
【表 3 9】

<u>P-0144</u>	
<u>P-0145</u>	
<u>P-0146</u>	
<u>P-0147</u>	

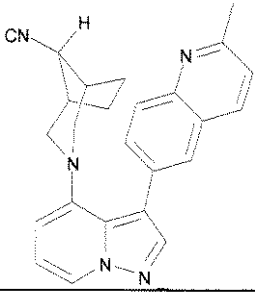
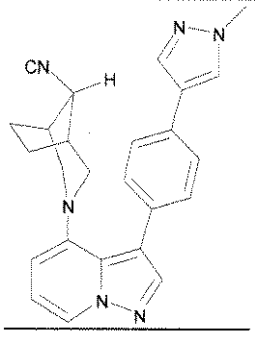
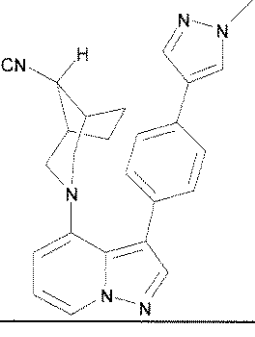
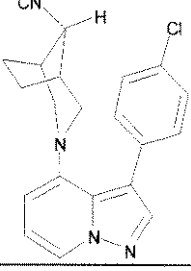
【表 4 0】

<u>P-0148</u>	
<u>P-0149</u>	
<u>P-0150</u>	
<u>P-0151</u>	

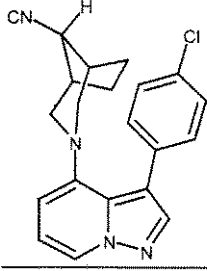
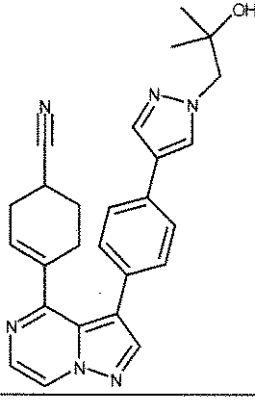
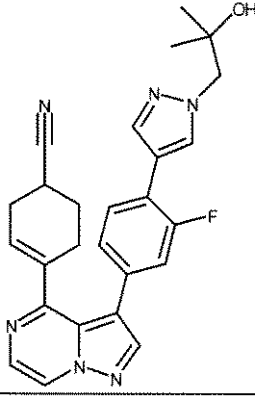
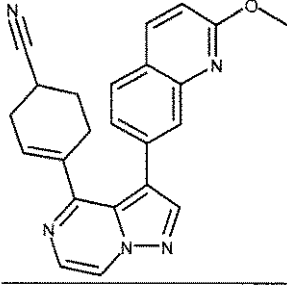
【表 4 1】

<u>P-0152</u>	
<u>P-0153</u>	
<u>P-0154</u>	
<u>P-0155</u>	
<u>P-0156</u>	

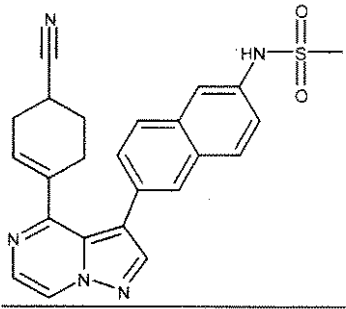
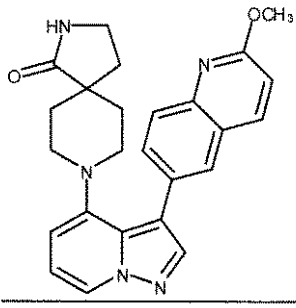
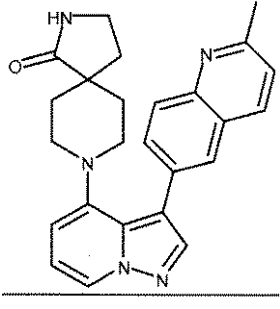
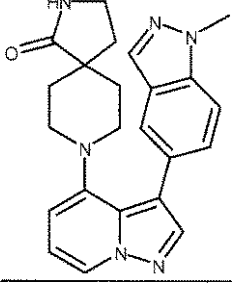
【表 4 2】

<u>P-0157</u>	
<u>P-0158</u>	
<u>P-0159</u>	
<u>P-0160</u>	

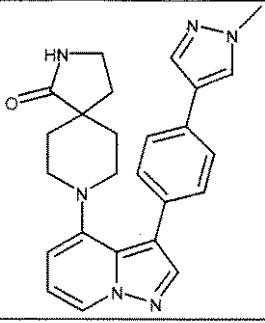
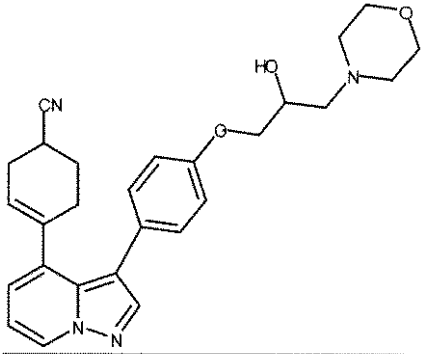
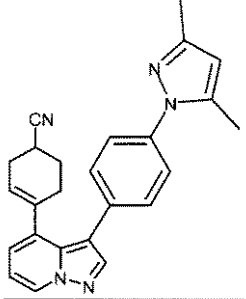
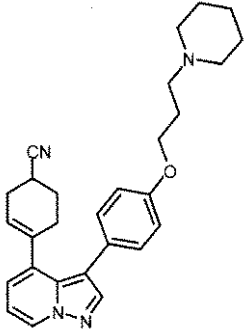
【表 4 3】

<u>P-0161</u>	
<u>P-0162</u>	
<u>P-0163</u>	
<u>P-0165</u>	

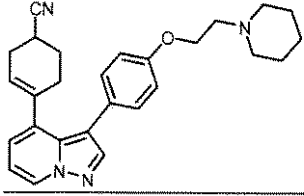
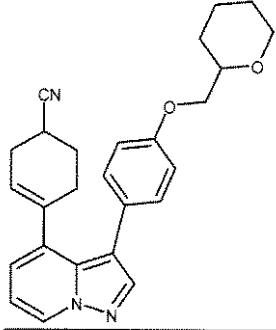
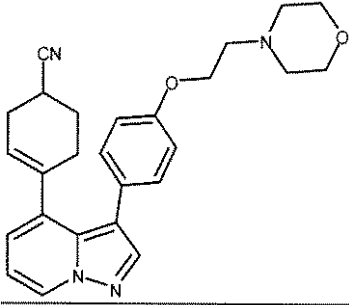
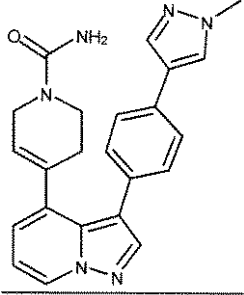
【表 4 4】

<u>P-0166</u>	 Chemical structure of P-0166: A 1,2,3-triazole ring is substituted at the 4-position with a 4-cyano-4-cyanoethylidene group and at the 5-position with a 4-(methylsulfonylamino)phenyl group.
<u>P-0167</u>	 Chemical structure of P-0167: A 1,2,3-triazole ring is substituted at the 4-position with a 4-methoxyphenyl group and at the 5-position with a 4-(2-oxo-2,3-dihydro-1H-pyridin-1-yl)phenyl group.
<u>P-0168</u>	 Chemical structure of P-0168: A 1,2,3-triazole ring is substituted at the 4-position with a 4-methylphenyl group and at the 5-position with a 4-(2-oxo-2,3-dihydro-1H-pyridin-1-yl)phenyl group.
<u>P-0169</u>	 Chemical structure of P-0169: A 1,2,3-triazole ring is substituted at the 4-position with a 4-methyl-1,2,3,4-tetrahydropyridin-2-yl group and at the 5-position with a 4-(2-oxo-2,3-dihydro-1H-pyridin-1-yl)phenyl group.

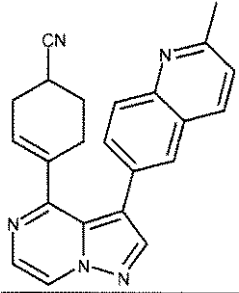
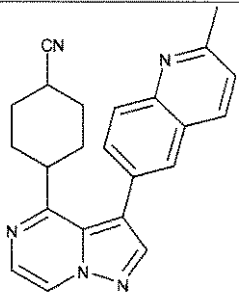
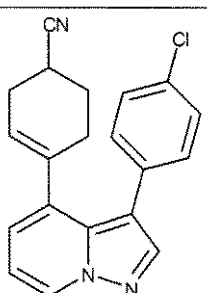
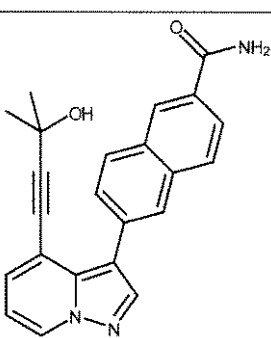
【表 4 5】

<u>P-0170</u>	
<u>P-0178</u>	
<u>P-0179</u>	
<u>P-0180</u>	

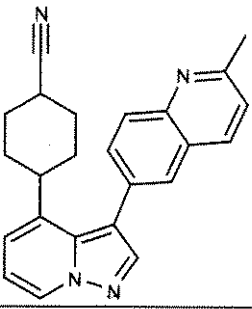
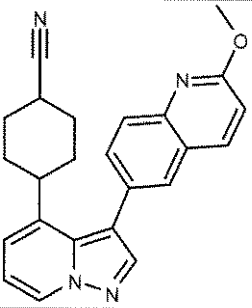
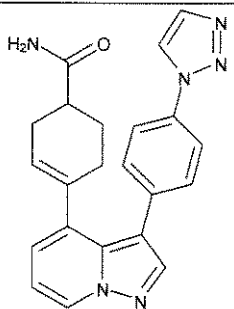
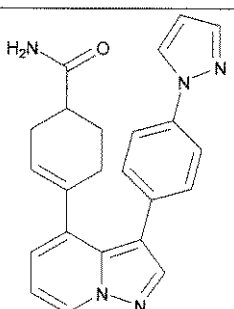
【表 4 6】

<u>P-0181</u>	
<u>P-0182</u>	
<u>P-0183</u>	
<u>P-0185</u>	

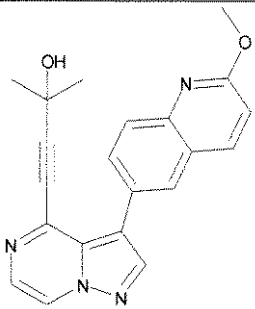
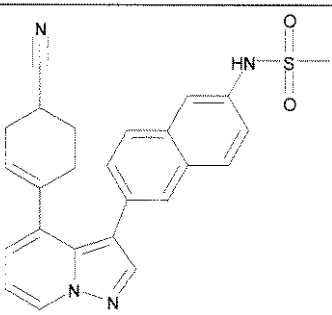
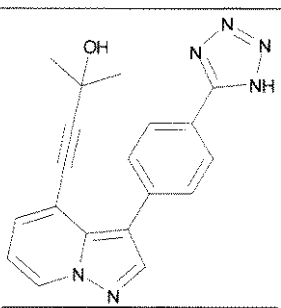
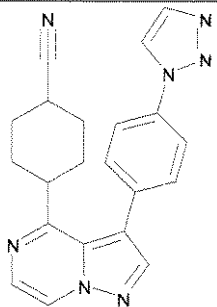
【表 4 7】

<u>P-0186</u>	
<u>P-0187</u>	
<u>P-0188</u>	
<u>P-0191</u>	

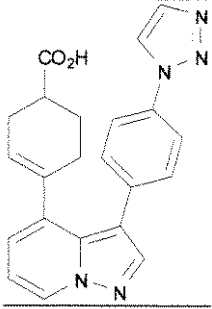
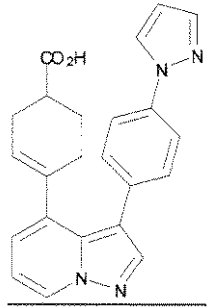
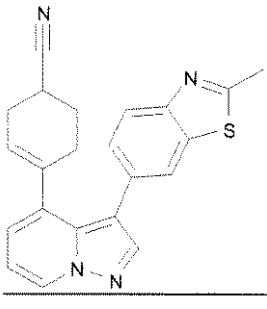
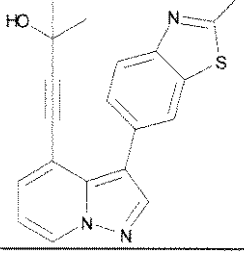
【表 4 8】

<u>P-0194</u>	
<u>P-0195</u>	
<u>P-0196</u>	
<u>P-0197</u>	

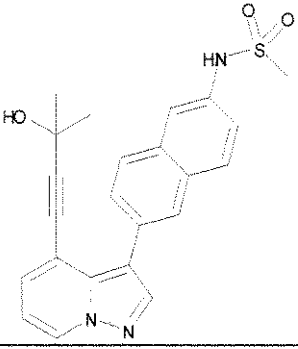
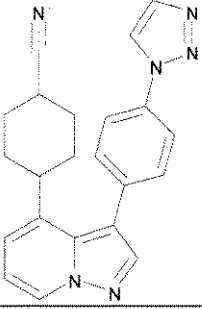
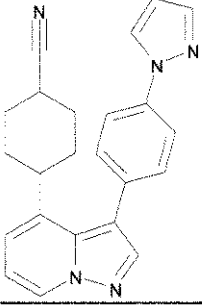
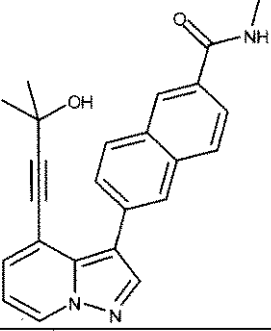
【表 4 9】

<u>P-0198</u>	
<u>P-0199</u>	
<u>P-0210</u>	
<u>P-0211</u>	

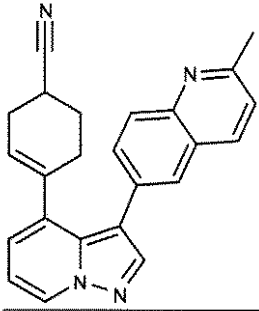
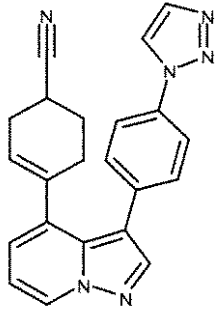
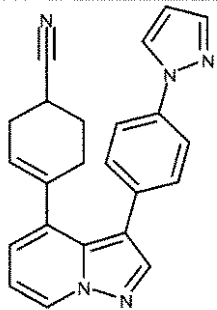
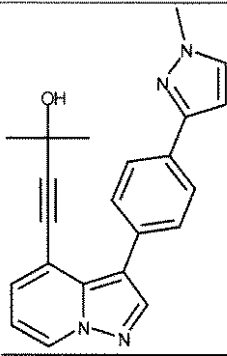
【表 5 0】

<u>P-0212</u>	
<u>P-0213</u>	
<u>P-0214</u>	
<u>P-0215</u>	

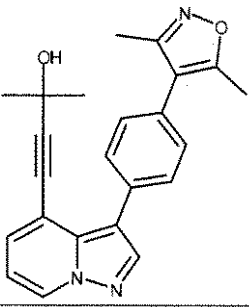
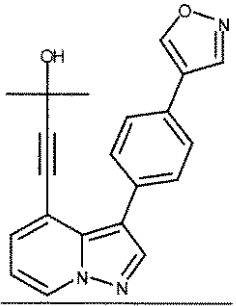
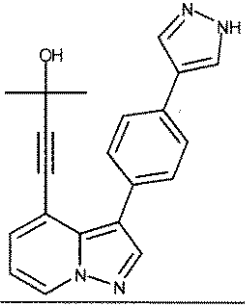
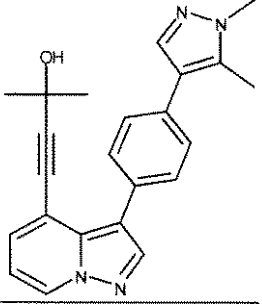
【表 5 1】

<u>P-0216</u>	
<u>P-0217</u>	
<u>P-0218</u>	
<u>P-0222</u>	

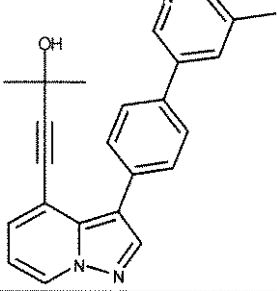
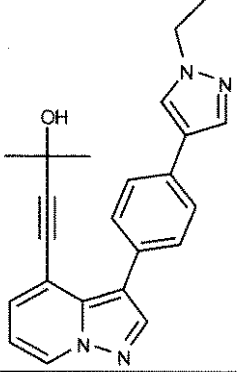
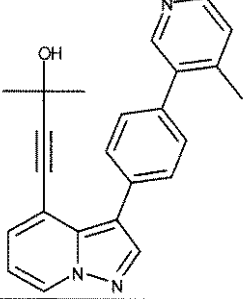
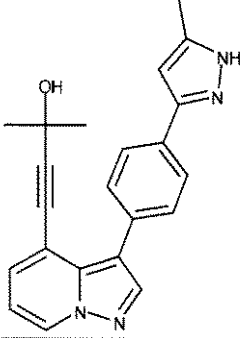
【表 5 2】

<u>P-0223</u>	
<u>P-0224</u>	
<u>P-0225</u>	
<u>P-0226</u>	

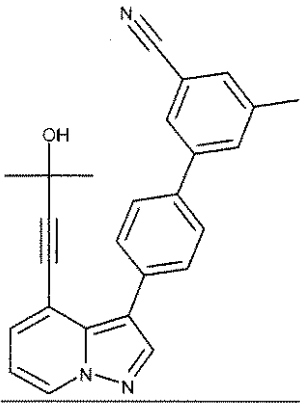
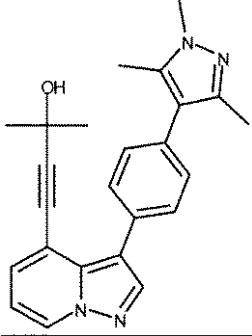
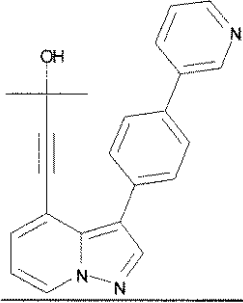
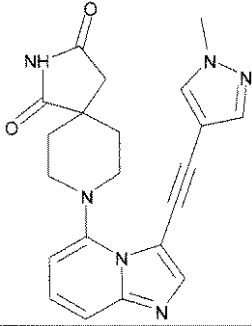
【表 5 3】

<u>P-0227</u>	
<u>P-0228</u>	
<u>P-0229</u>	
<u>P-0230</u>	

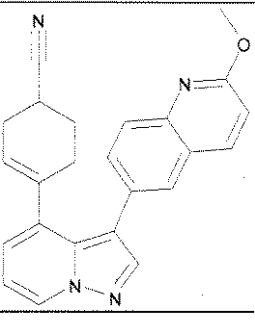
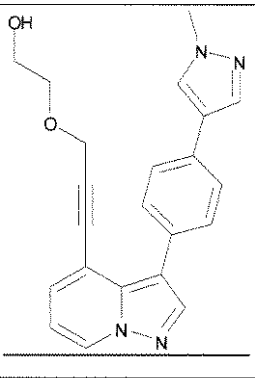
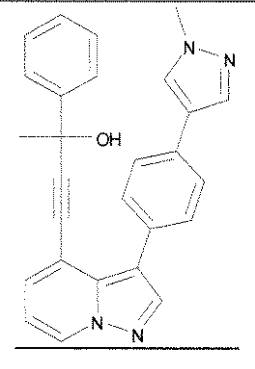
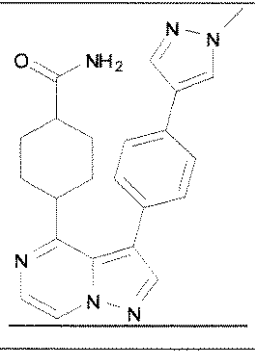
【表 5 4】

<u>P-0231</u>	
<u>P-0232</u>	
<u>P-0233</u>	
<u>P-0234</u>	

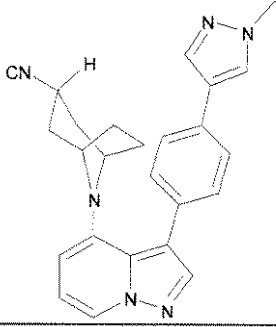
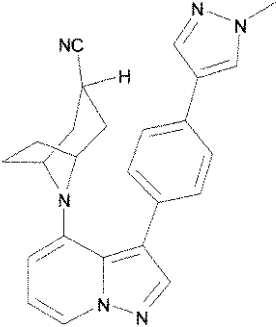
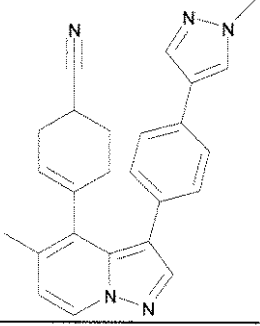
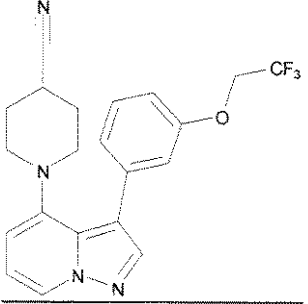
【表 5 5】

<u>P-0235</u>	
<u>P-0236</u>	
<u>P-0237</u>	
<u>P-0238</u>	

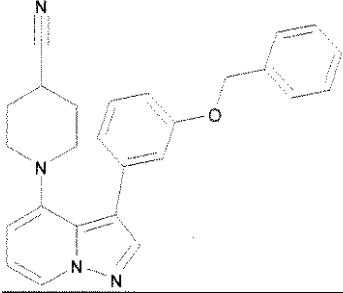
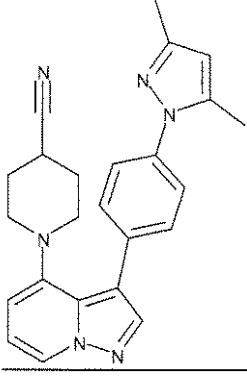
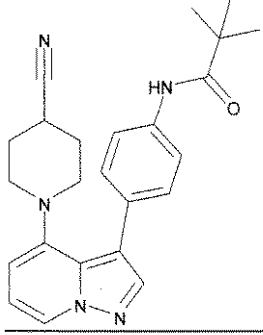
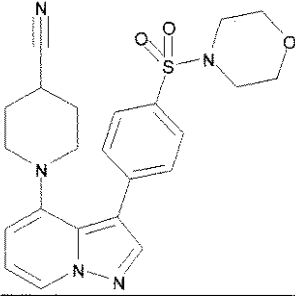
【表 5 6】

<u>P-0242</u>	
<u>P-0245</u>	
<u>P-0246</u>	
<u>P-0247</u>	

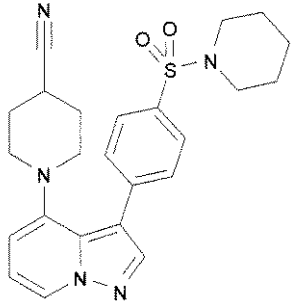
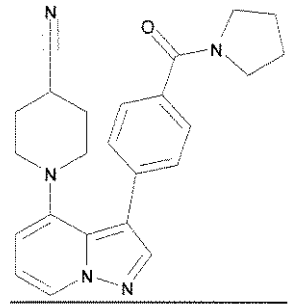
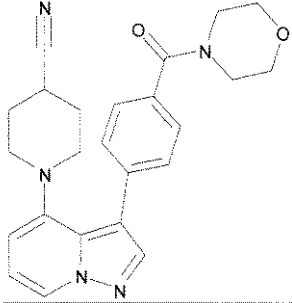
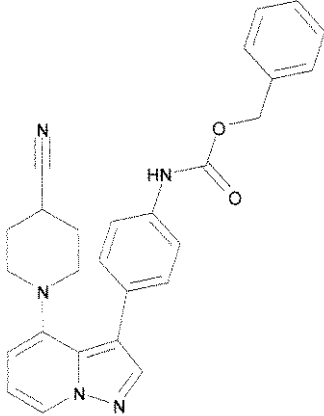
【表 5 7】

<u>P-0248</u>	
<u>P-0249</u>	
<u>P-0250</u>	
<u>P-0251</u>	

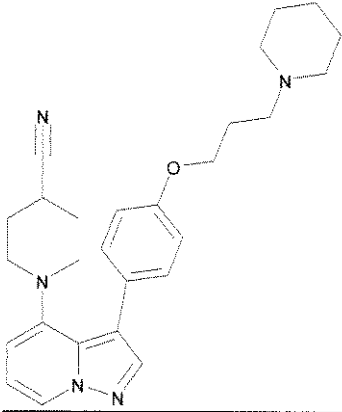
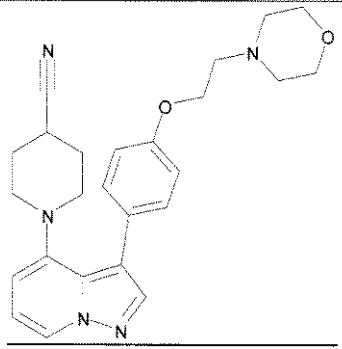
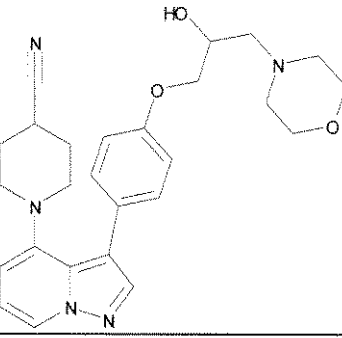
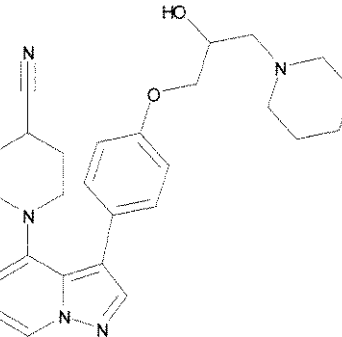
【表 5 8】

<u>P-0252</u>	
<u>P-0253</u>	
<u>P-0254</u>	
<u>P-0255</u>	

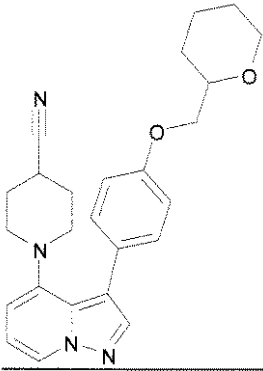
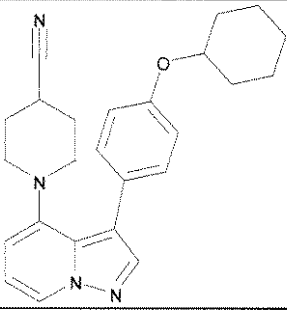
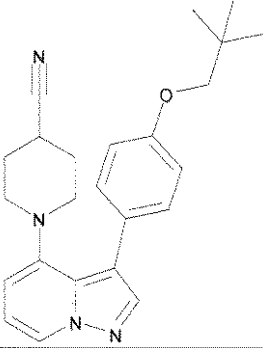
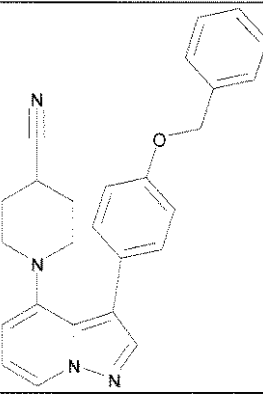
【表 5 9】

<u>P-0256</u>	
<u>P-0257</u>	
<u>P-0258</u>	
<u>P-0259</u>	

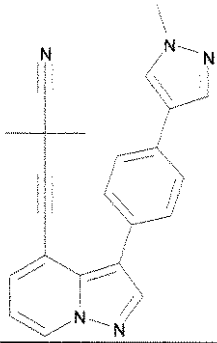
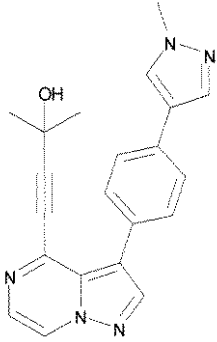
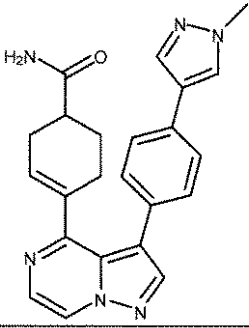
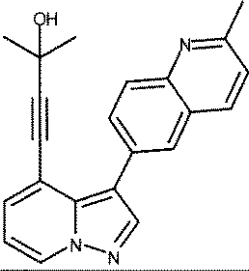
【表 6 0】

<u>P-0260</u>	
<u>P-0261</u>	
<u>P-0262</u>	
<u>P-0263</u>	

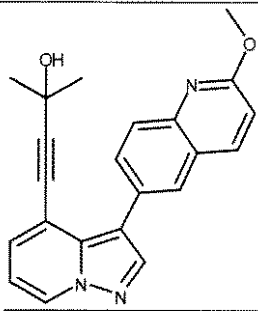
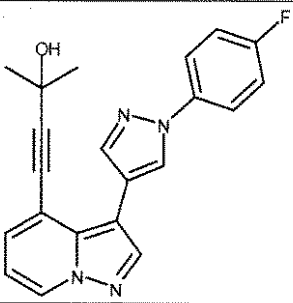
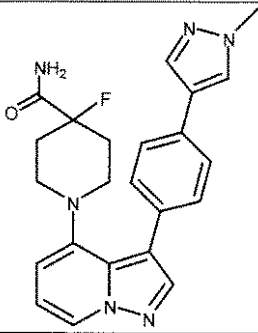
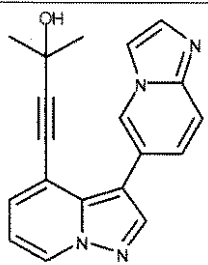
【表 6 1】

<u>P-0264</u>	
<u>P-0265</u>	
<u>P-0266</u>	
<u>P-0267</u>	

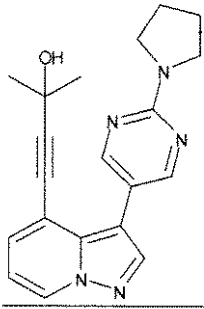
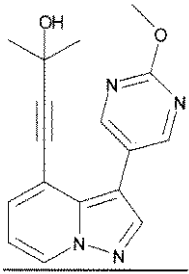
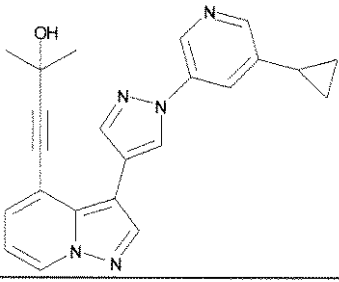
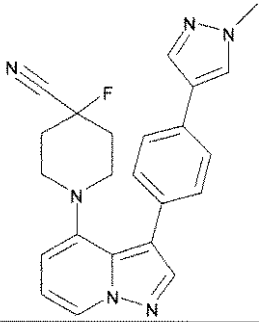
【表 6 2】

<u>P-0273</u>	
<u>P-0274</u>	
<u>P-0280</u>	
<u>P-0281</u>	

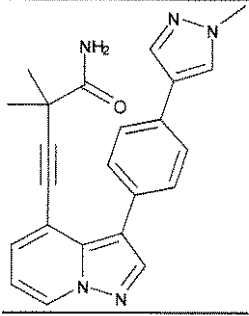
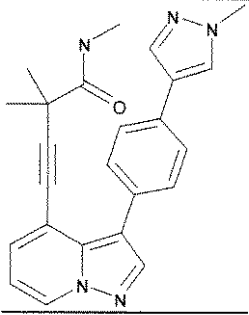
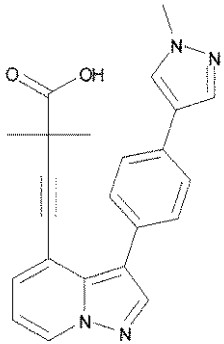
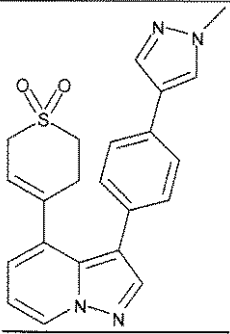
【表 6 3】

<u>P-0282</u>	
<u>P-0283</u>	
<u>P-0285</u>	
<u>P-0286</u>	

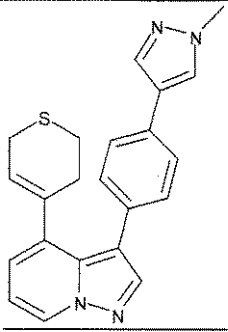
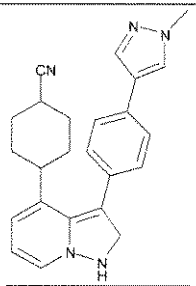
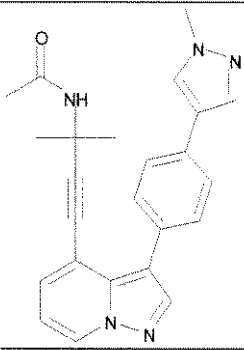
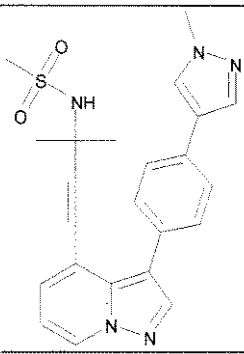
【表 6 4】

<u>P-0287</u>	
<u>P-0288</u>	
<u>P-0289</u>	
<u>P-0293</u>	

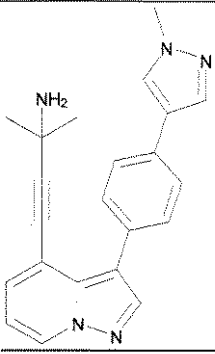
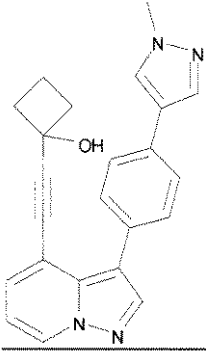
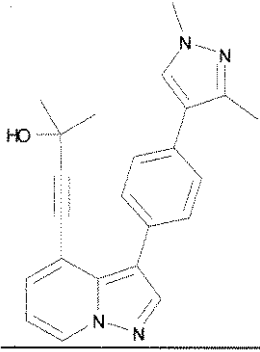
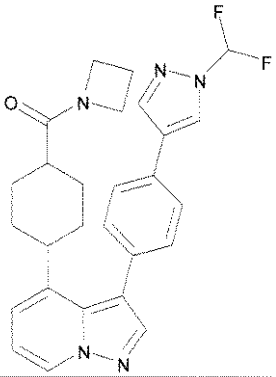
【表 6 5】

<u>P-0295</u>	
<u>P-0296</u>	
<u>P-0297</u>	
<u>P-0300</u>	

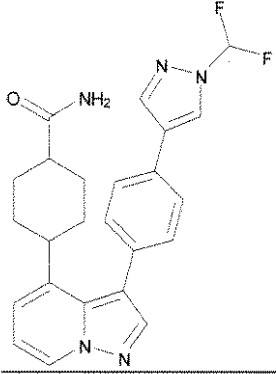
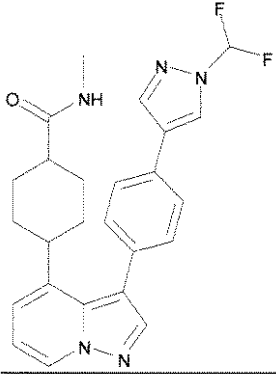
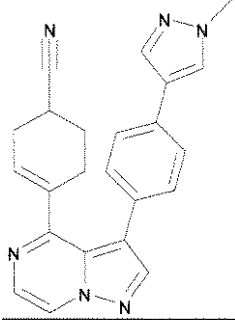
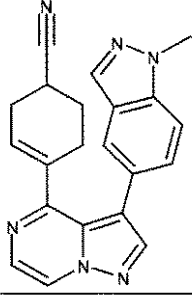
【表 6 6】

<u>P-0301</u>	
<u>P-0302</u>	
<u>P-0307</u>	
<u>P-0308</u>	

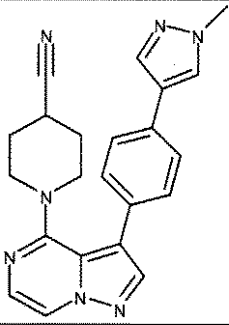
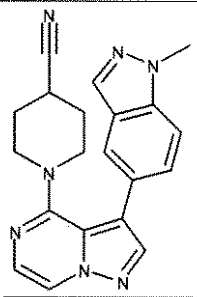
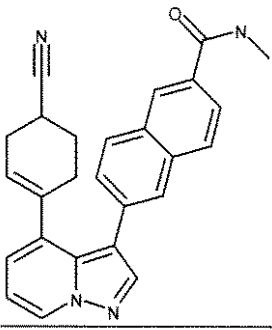
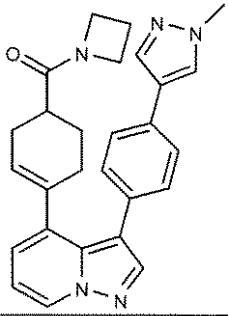
【表 6 7】

<u>P-0309</u>	
<u>P-0310</u>	
<u>P-0311</u>	
<u>P-0315</u>	

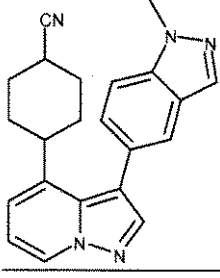
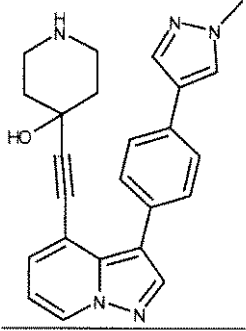
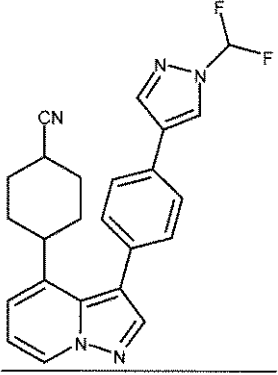
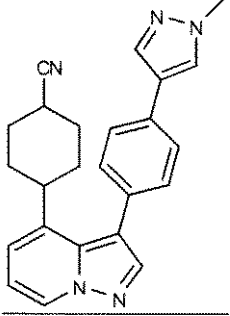
【表 6 8】

<u>P-0316</u>	
<u>P-0317</u>	
<u>P-0323</u>	
<u>P-0324</u>	

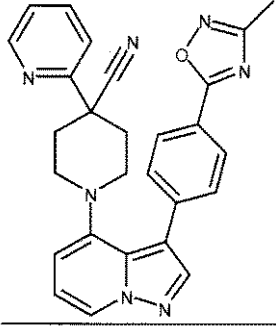
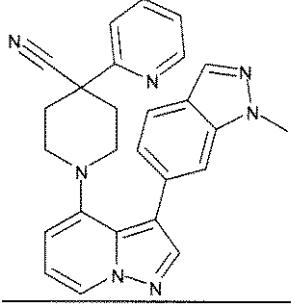
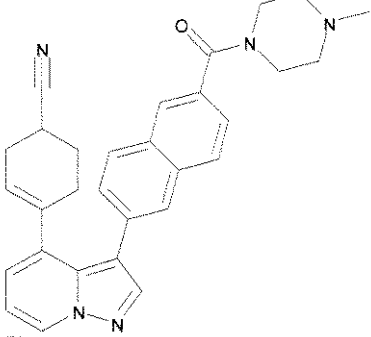
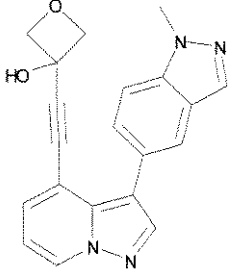
【表 6 9】

<u>P-0325</u>	
<u>P-0326</u>	
<u>P-0330</u>	
<u>P-0333</u>	

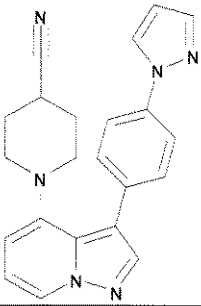
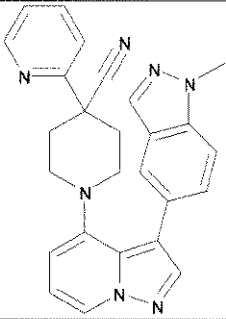
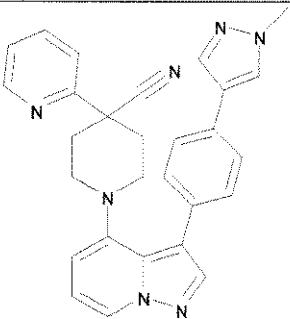
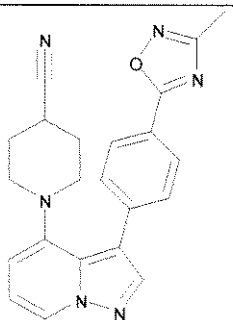
【表 7 0】

<u>P-0337</u>	
<u>P-0338</u>	
<u>P-0346</u>	
<u>P-0347</u>	

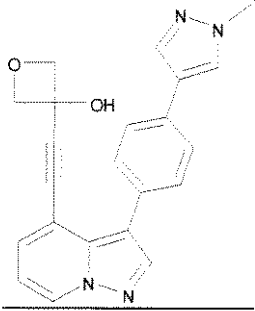
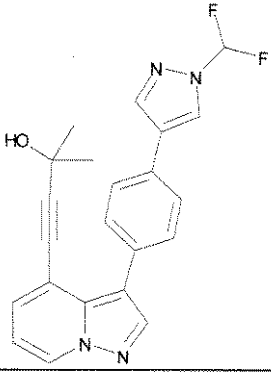
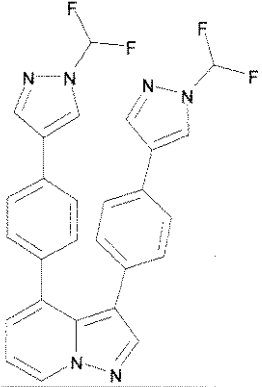
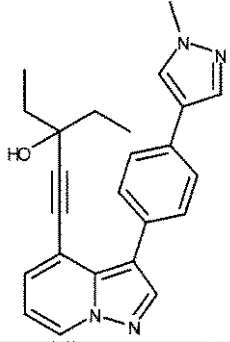
【表 7 1】

<u>P-0351</u>	
<u>P-0352</u>	
<u>P-0356</u>	
<u>P-0362</u>	

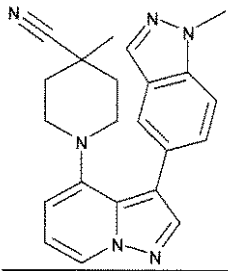
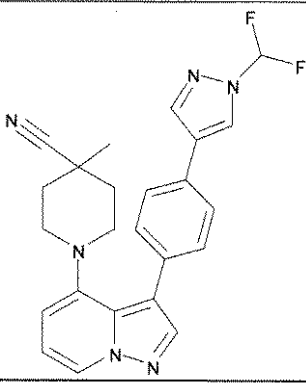
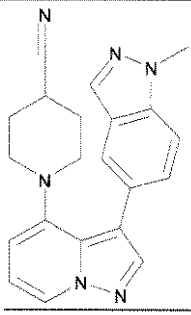
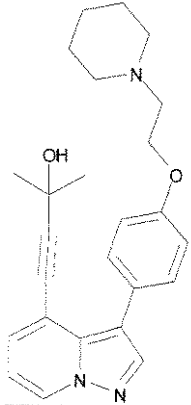
【表 7 2】

<u>P-0363</u>	
<u>P-0364</u>	
<u>P-0365</u>	
<u>P-0366</u>	

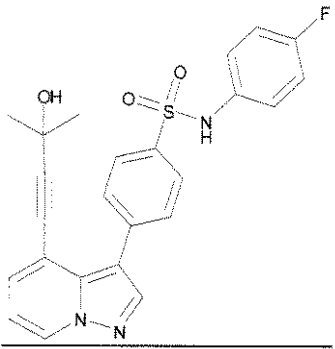
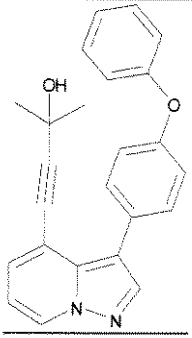
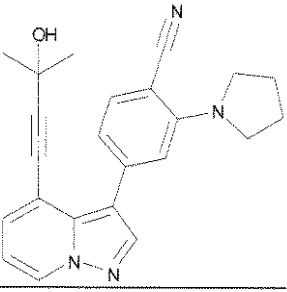
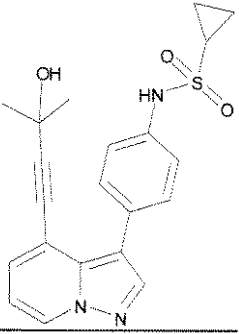
【表 7 3】

<u>P-0368</u>	
<u>P-0370</u>	
<u>P-0371</u>	
<u>P-0373</u>	

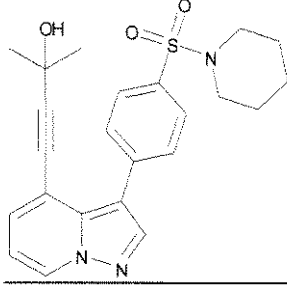
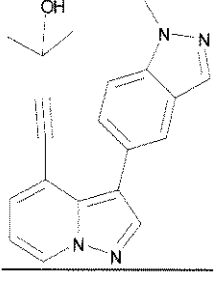
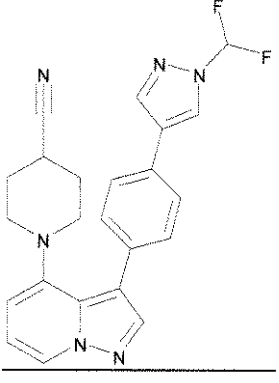
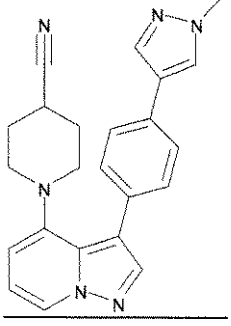
【表 7 4】

<u>P-0403</u>	
<u>P-0404</u>	
<u>P-0405</u>	
<u>P-0406</u>	

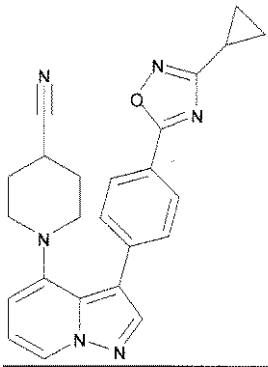
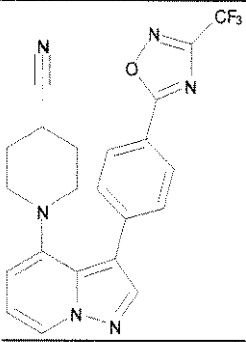
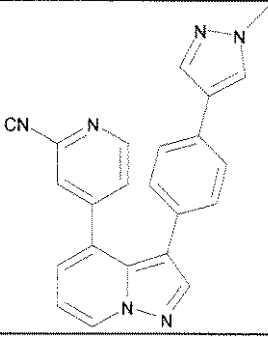
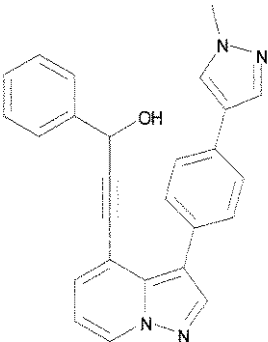
【表 7 5】

<u>P-0407</u>	
<u>P-0410</u>	
<u>P-0411</u>	
<u>P-0412</u>	

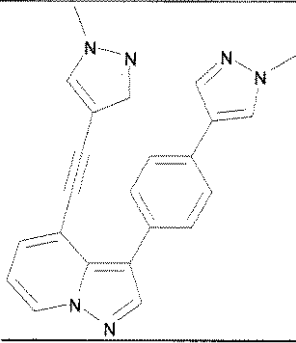
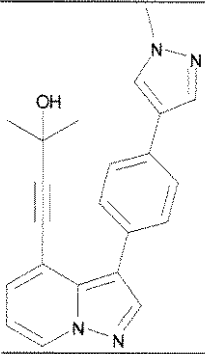
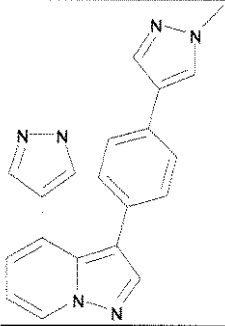
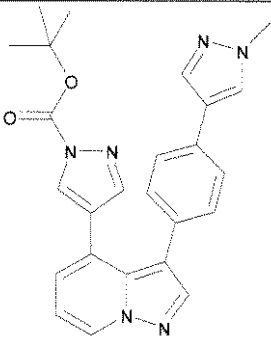
【表 7 6】

<u>P-0413</u>	
<u>P-0414</u>	
<u>P-0415</u>	
<u>P-0422</u>	

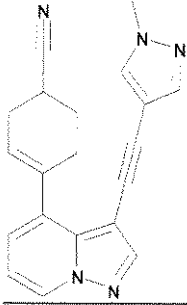
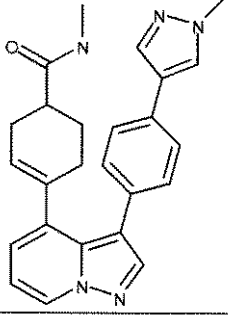
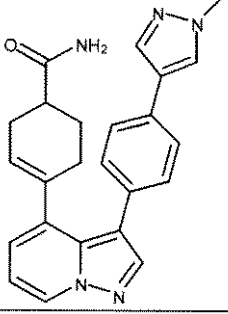
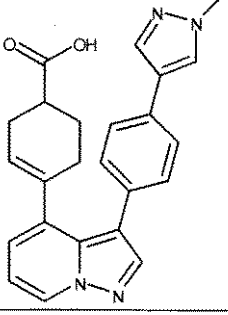
【表 7 7】

<u>P-0423</u>	
<u>P-0424</u>	
<u>P-0425</u>	
<u>P-0426</u>	

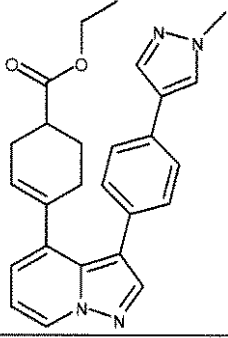
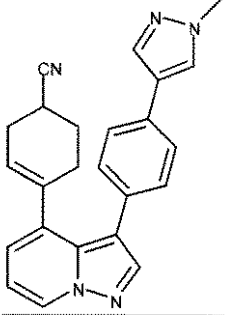
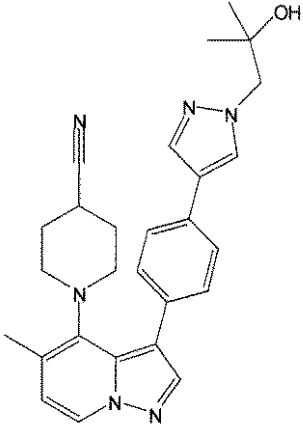
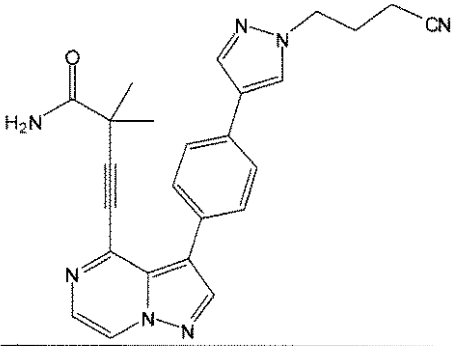
【表 7 8】

P-0428	
P-0429	
P-0430	
P-0431	

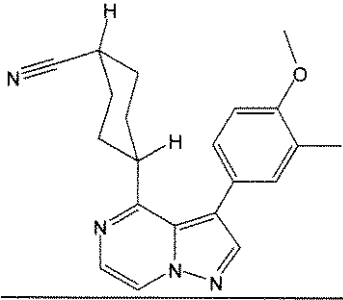
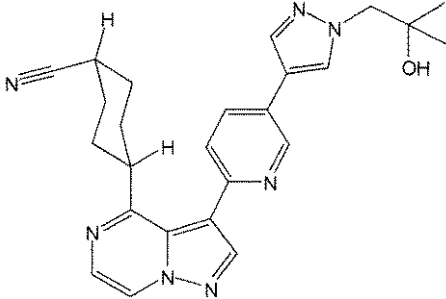
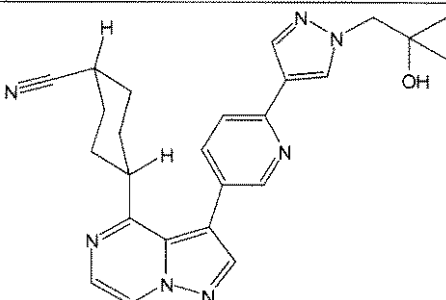
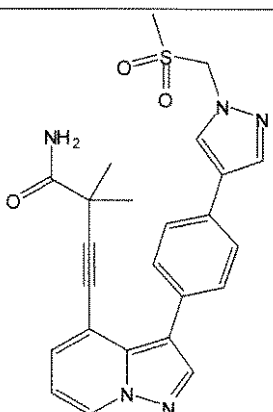
【表 7 9】

<u>P-0433</u>	
<u>P-0442</u>	
<u>P-0443</u>	
<u>P-0444</u>	

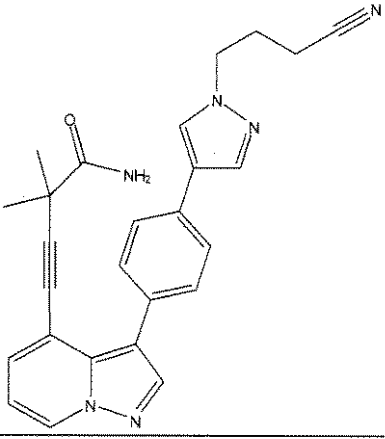
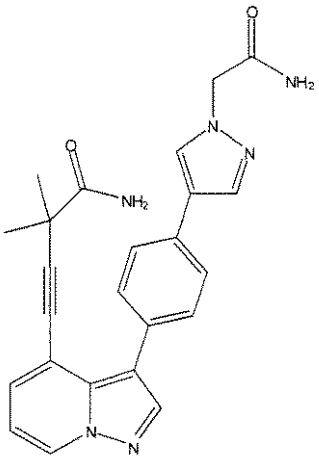
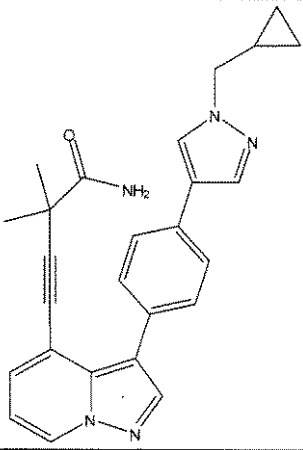
【表 8 0】

<u>P-0446</u>	
<u>P-0452</u>	
<u>P-0455</u>	
<u>P-0456</u>	

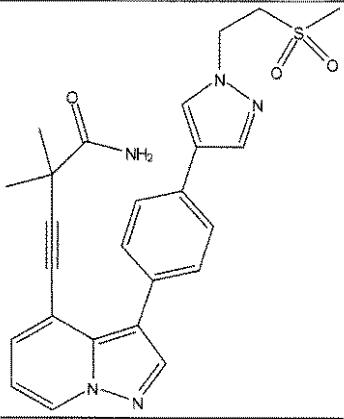
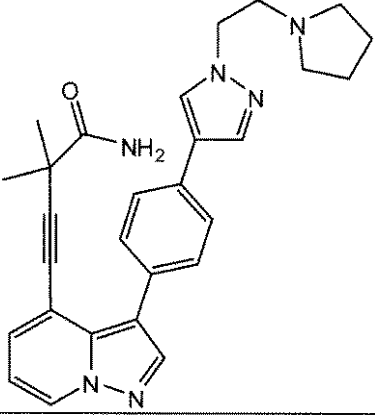
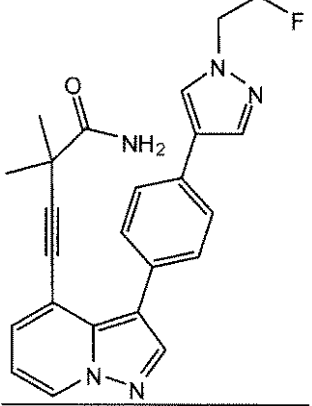
【表 8 1】

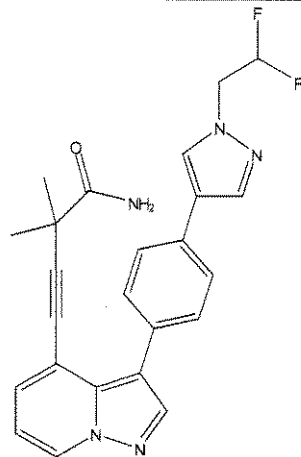
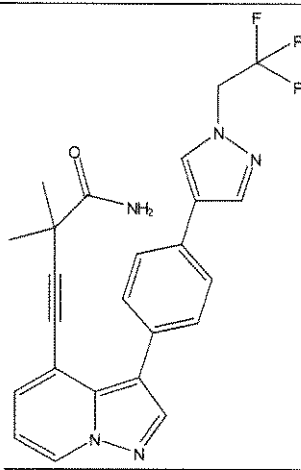
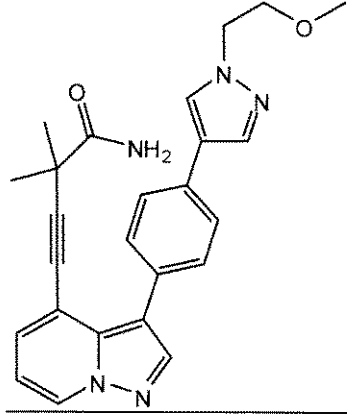
<u>P-0457</u>	
<u>P-0458</u>	
<u>P-0459</u>	
<u>P-0460</u>	

【表 8 2】

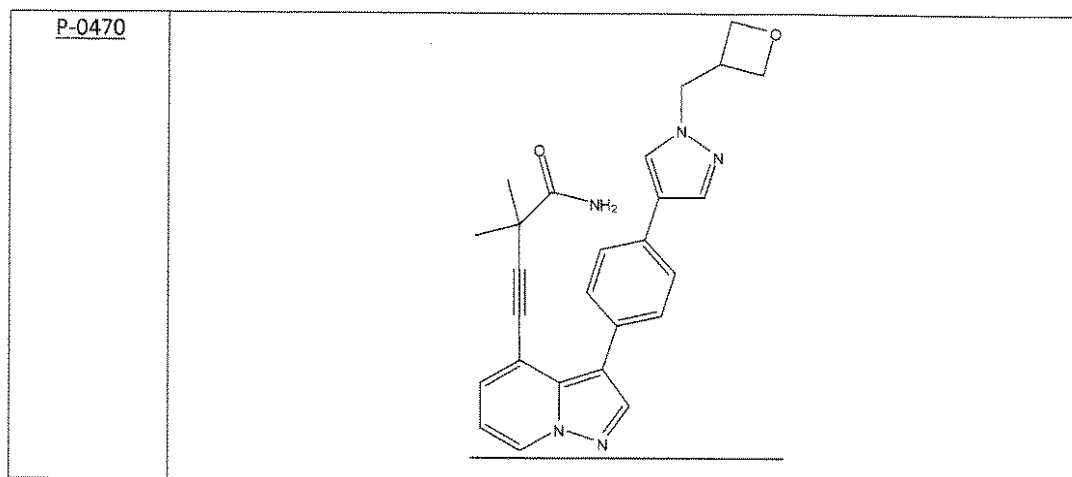
<u>P-0461</u>	 Chemical structure of P-0461: A 1,2,3,4-tetrahydroquinazolin-4-yl group is connected via a phenyl ring to a 1H-imidazole ring. The imidazole ring is substituted with a 3-oxo-3-(dimethylamino)propyl group and a 3-cyanopropyl group.
<u>P-0462</u>	 Chemical structure of P-0462: A 1,2,3,4-tetrahydroquinazolin-4-yl group is connected via a phenyl ring to a 1H-imidazole ring. The imidazole ring is substituted with a 3-oxo-3-(dimethylamino)propyl group and a 3-aminopropyl group.
<u>P-0463</u>	 Chemical structure of P-0463: A 1,2,3,4-tetrahydroquinazolin-4-yl group is connected via a phenyl ring to a 1H-imidazole ring. The imidazole ring is substituted with a 3-oxo-3-(dimethylamino)propyl group and a cyclopropylmethyl group.

【表 8 3】

<u>P-0464</u>	 Chemical structure of P-0464: A complex molecule featuring a 1,2,3-triazole ring system fused to a benzene ring. The triazole ring is substituted with a 4-((4-((4-aminobut-1-yn-1-yl)amino)phenyl)phenyl)methyl group. The triazole ring is also substituted with a 4-((4-((4-aminobut-1-yn-1-yl)amino)phenyl)phenyl)methyl group.
<u>P-0465</u>	 Chemical structure of P-0465: A complex molecule featuring a 1,2,3-triazole ring system fused to a benzene ring. The triazole ring is substituted with a 4-((4-((4-aminobut-1-yn-1-yl)amino)phenyl)phenyl)methyl group. The triazole ring is also substituted with a 4-((4-((4-aminobut-1-yn-1-yl)amino)phenyl)phenyl)methyl group.
<u>P-0466</u>	 Chemical structure of P-0466: A complex molecule featuring a 1,2,3-triazole ring system fused to a benzene ring. The triazole ring is substituted with a 4-((4-((4-aminobut-1-yn-1-yl)amino)phenyl)phenyl)methyl group. The triazole ring is also substituted with a 4-((4-((4-aminobut-1-yn-1-yl)amino)phenyl)phenyl)methyl group.

<u>P-0467</u>	
<u>P-0468</u>	
<u>P-0469</u>	

【表 8 5】



から選択される、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 20】

請求項 1～19 のいずれか一項に記載の化合物と、薬学的に許容される担体とを含む、医薬組成物。

【請求項 21】

第 2 の医薬剤をさらに含む、請求項 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

前記第 2 の医薬剤が、i) アルキル化剤、ii) 抗生物質、iii) 代謝拮抗剤、iv) 抗体療法剤、v) ホルモンもしくはホルモン拮抗剤、vi) タキサン、vii) レチノイド、viii) アルカロイド、ix) 抗血管新生剤、x) トポイソメラーゼ阻害剤、xi) キナーゼ阻害剤、xii) 標的シグナル伝達、xiii) 生物学的応答調節剤、xiv) 化学療法剤、xv) Hsp90 阻害剤、xvi) ファルネシルトランスフェラーゼ阻害剤、xvii) アロマトラーゼ阻害剤、xviii) IDO 阻害剤、xix) ヒストンアセチルトランスフェラーゼ (HAT) 阻害剤、xx) ヒストンデアセチラーゼ (HDAC) 阻害剤、xxi) サーチュイン (SIRT) 阻害剤、xxii) BET 阻害剤、または xxiii) 抗血管新生剤である、請求項 21 に記載の医薬組成物。

【請求項 23】

CDK8 によって媒介される疾患または状態を有する対象の治療における使用のための、前記対象に有効量の請求項 1～19 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、重水素化類似体、互変異性体、もしくは立体異性体、または請求項 20～22 のいずれか一項に記載の医薬組成物であって、ここで、前記疾患または状態が、異常にまたはそうでなければ CDK8 を発現する、または前述のいずれかの突然変異もしくは転座を活性化する、化合物または医薬組成物。

【請求項 24】

脳癌、肺癌、結腸癌、類表皮癌、扁平上皮癌、膀胱癌、胃癌、膵臓癌、乳癌、頭部癌、頸部癌、腎臓癌 (renal cancer)、腎臓癌 (kidney cancer)、肝臓癌、卵巣癌、前立腺癌、結腸直腸癌、子宮癌、直腸癌、食道癌、精巣癌、甲状腺癌、黒色腫、ブドウ膜黒色腫、急性骨髄性、白血病、急性骨髄性白血病、多発性骨髄腫、慢性骨髄性白血病、骨髄性細胞白血病、神経膠腫、カポジ肉腫、ヒト喉頭扁平上皮癌、炎症、アルツハイマー病、パーキンソン病、認知症、アミロイドーシス、アテローム性動脈硬化症、脳卒中／虚血、疼痛、外傷性脳損傷、腎臓病、炎症病理、2 型糖尿病、またはウイルス感染の治療における使用のための、請求項 1～19 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、重水素化類似体、互変異性体、もしくは立体異性体、または請求項 20～22 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

前記疾患または状態が、結腸直腸癌、胃癌、膵臓癌、黒色腫、乳癌、卵巣癌、肺癌、肺癌転移、乳癌転移、または白血病である、請求項 23 に記載の使用のための化合物または組成物。

【請求項 26】

前記ウイルス感染が、HSV、HCMV、HPV、またはHIVである、請求項 24 に記載の使用のための化合物または組成物。

【請求項 27】

前記疾患または状態が、FLT3-ITD急性骨髄性白血病である、請求項 24 に記載の使用のための化合物または組成物。

【請求項 28】

1 つ以上のFLT3 阻害剤をさらに含む、FLT3-ITD急性骨髄性白血病の治療における使用のための、請求項 20～22 のいずれか一項に記載の医薬組成物。