

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成29年4月13日 (2017.4.13)

【公表番号】特表2016-513662(P2016-513662A)

【公表日】平成28年5月16日 (2016.5.16)

【年通号数】公開・登録公報2016-029

【出願番号】特願2016-502197(P2016-502197)

【国際特許分類】

C 0 7 D 237/14 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 405/04 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/502 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 5/14 (2006.01)

A 6 1 P 5/18 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 237/14 C S P

C 0 7 D 401/04

C 0 7 D 403/04

C 0 7 D 405/04

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 413/14

C 0 7 D 413/12

A 6 1 K 31/502

A 6 1 K 31/506

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 5/14

A 6 1 P 5/18

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 13/02

A 6 1 P 25/28  
 A 6 1 P 25/16  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 21/04

【手続補正書】

【提出日】平成29年3月9日(2017.3.9)

【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

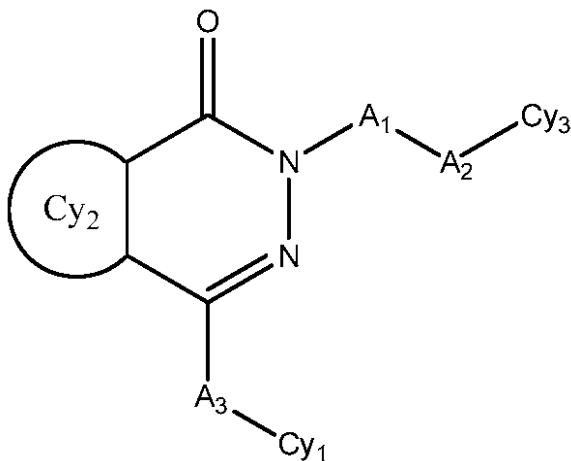
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I:

【化1】



式 I

式中、 $A_1$ は、 $-[C(R_{100})(R_{101})]n-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-C(O)N(R_{100})-$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})-$ 、 $-S(O)_2-$ 、炭素環(carbocycle)、置換される炭素環、複素環、置換される複素環、芳香族、置換される芳香族、ヘテロ芳香族又は置換されるヘテロ芳香族であり；

$n$ は、0、1、2、3、4、5、6又は7であり；

各 $R_{100}$ 及び $R_{101}$ は、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、ヘテロアルキル、置換されるヘテロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリールであり；あるいは $R_{100}$ 基及び $R_{101}$ 基の二つが、それらが結合する原子及び任意の介在原子(intervening atom)と一緒にあって、さらなる任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；

$A_2$ は、非存在、 $-[C(R_{100})(R_{101})]n-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-C(O)N(R_{100})-$ 、 $-C(O)N(R_{100})(R_{101})$ 、 $N(R_{100})(R_{101})$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ であり；

$A_3$ は、非存在、 $-[C(R_{100})(R_{101})]n-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-C(O)N(R_{100})-$ 、 $-C(O)N(R_{100})(R_{101})$ 、 $N(R_{100})(R_{101})$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ であり；

$Cy_2$ は、1、2又は3環を有する、アリール基、置換されるアリール基、炭素環基、置換される炭素環基、ヘテロシクリル基、置換されるヘテロシクリル基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基であり、該環は縮合環又は橋かけ環(bridged ring)であり得；

Cy<sub>1</sub>は、非存在であるか、1、2又は3環を有する、アリール基、置換されるアリール基、炭素環基、置換される炭素環基、ヘテロシクリル基、置換されるヘテロシクリル基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基であり；

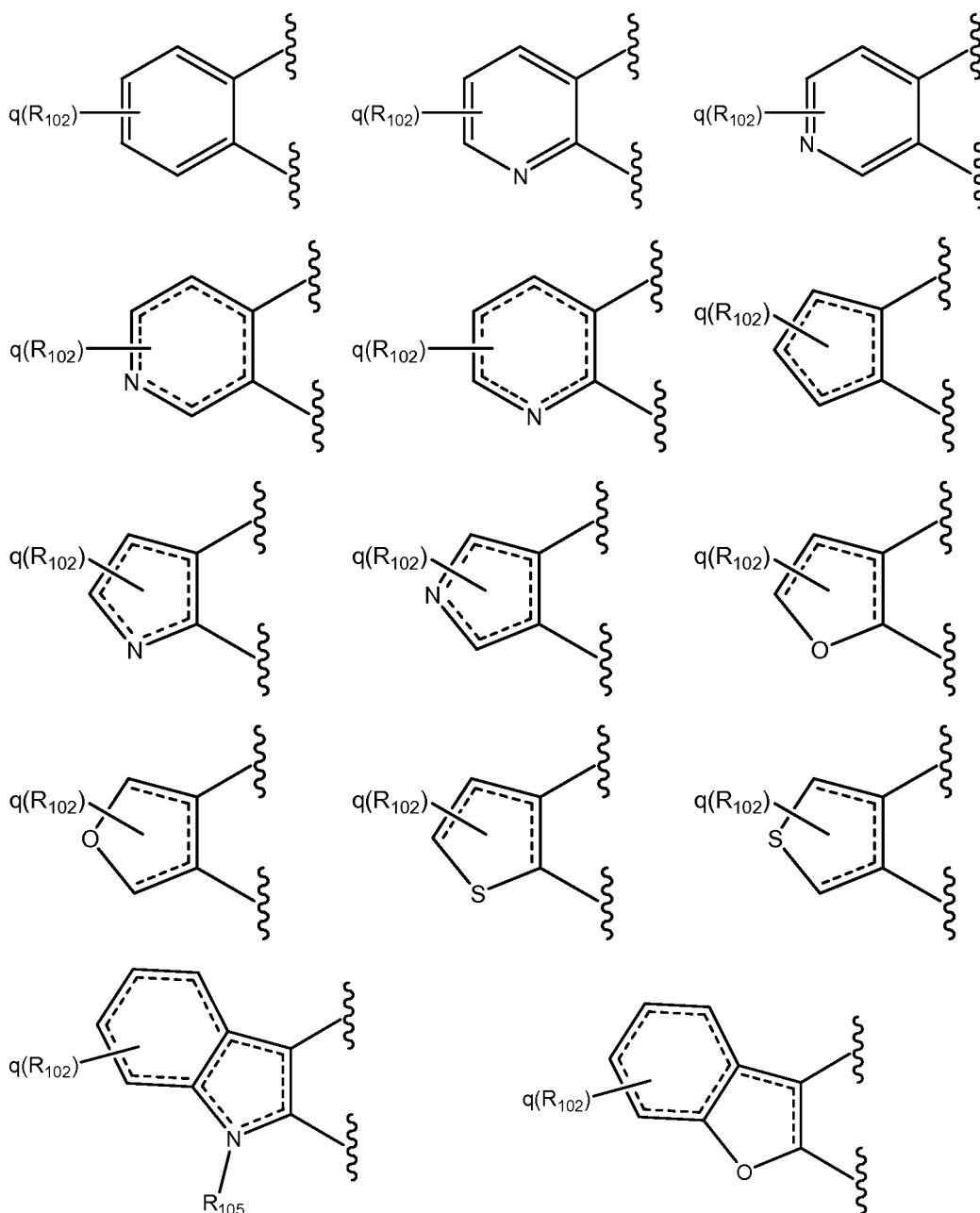
Cy<sub>3</sub>は非存在であるか、1、2又は3環を有する、アリール基、置換されるアリール基、炭素環基、置換される炭素環基、ヘテロシクリル基、置換されるヘテロシクリル基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基である、

の化合物。

【請求項 2】

Cy<sub>2</sub>が、  

【化 2】



式中、qは0、1、2、3、4又は5であり；

各R<sub>102</sub>は、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、炭素環、置換される炭素環、アリール、置換されるアリール、-OR<sub>100</sub>、-SR<sub>100</sub>、-NR<sub>100</sub>R<sub>101</sub>、-C(O)R<sub>100</sub>、-C(O)OR<sub>100</sub>、-C(O)NR<sub>100</sub>R<sub>101</sub>、-N(R<sub>100</sub>)C(O)R<sub>101</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R<sub>100</sub>、-S(O)R<sub>100</sub>、-SR<sub>100</sub>、-S(O)<sub>2</sub>N(R<sub>100</sub>)R<sub>101</sub>、-CF<sub>3</sub>、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>であり；あるいは二つのR<sub>102</sub>基が、

それらが結合する原子及び任意の介在原子と一緒になって、さらなる任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；

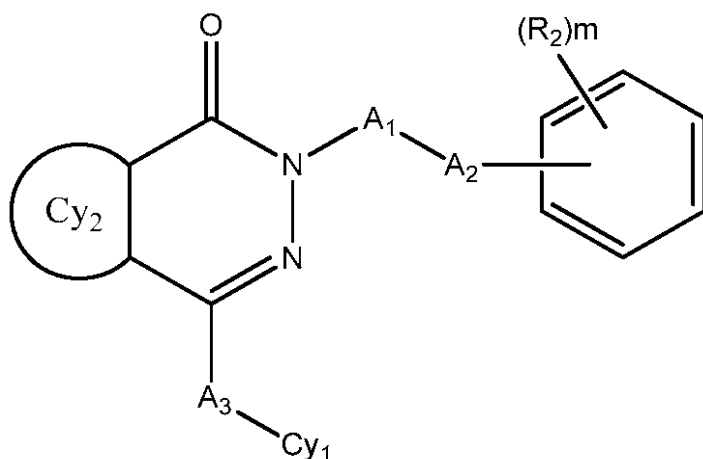
$R_{105}$ は、水素、重水素、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリールである、

から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

式：

【化3】



式中、 $m$ は0、1、2、3、4又は5であり；

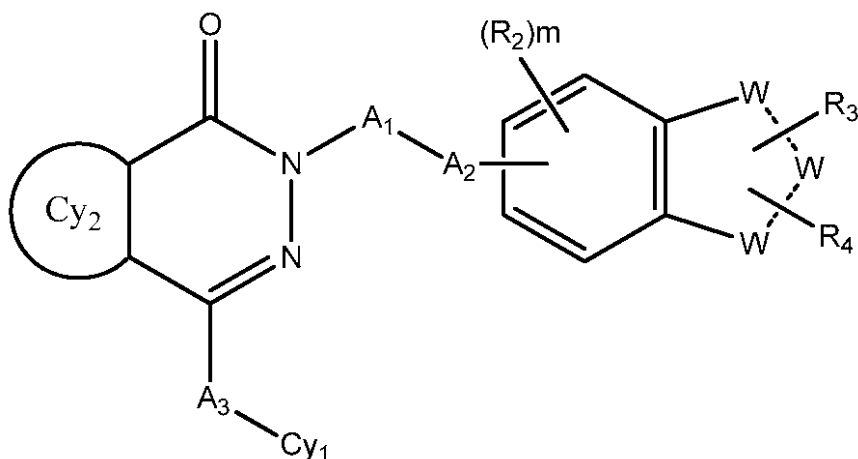
各 $R_2$ は、独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、シクロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール又は置換されるヘテロアリール、 $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}$ 、 $R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})(R_{101})$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；あるいは、二つの $R_2$ が、それらが結合する原子と一緒になって、任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；好ましくはシクロアルキル基、置換されるシクロアルキル基、複素環基、置換される複素環基、アリール基、置換されるアリール基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基を形成し得る、

を有する請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

式：

## 【化 4】



式中、

Wは、CH、 $CR_{100}$ 、 $C(O)$ 、N、 $NR_{100}$ 、O、S、SO又は $SO_2$ であり；

各 $R_3$ 及び $R_4$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；

## 【化 5】

-----

は単結合又は二重結合を表す、  
を有する請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

$A_1$ が $C(R_{100})(R_{101})$ であり、 $A_2$ が $-C(O)N(R_{100})-$ である、請求項 1 ~ 4 いずれかに記載の化合物。

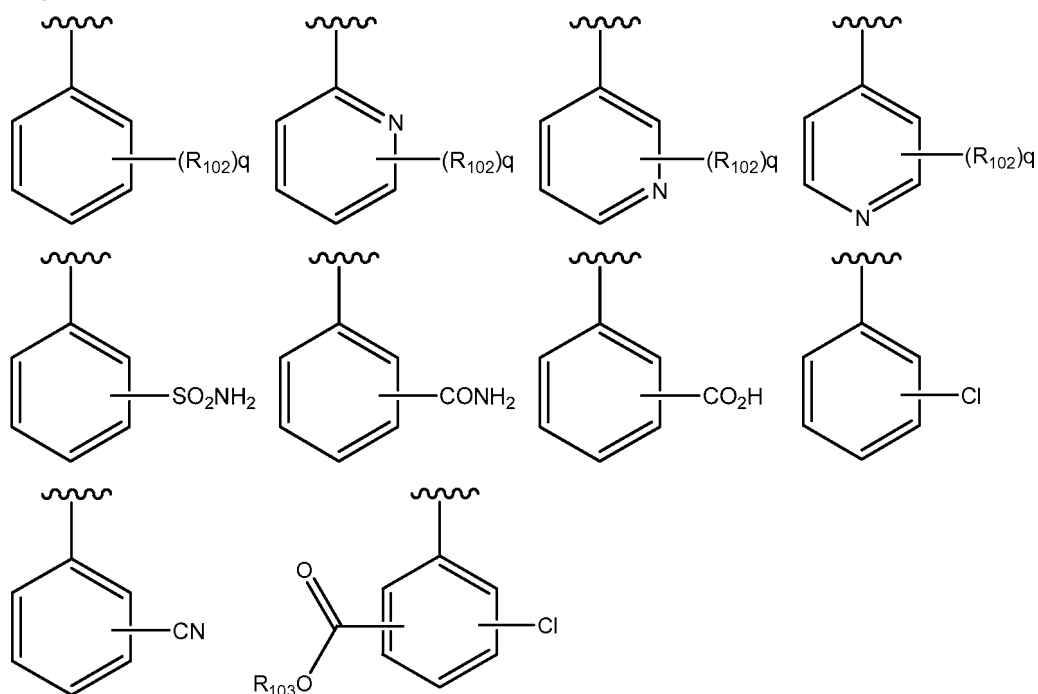
## 【請求項 6】

$A_3$ が非存在、 $-[C(R_{100})(R_{101})]n-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)N(R_{100})-$ 又は $-C(O)N(R_{100})(R_{101})$ である、請求項 1 ~ 5 いずれかに記載の化合物。

## 【請求項 7】

Cy1が

## 【化 6】



であり、及び $q$ は0、1、2、3、4又は5であり；

各 $R_{102}$ は、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、炭素環、置換される炭素環、アリール、置換されるアリール、 $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ であり；あるいは二つの $R_{102}$ 基が、それらが結合する原子及び任意の介在原子と一緒にあって、さらなる任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；

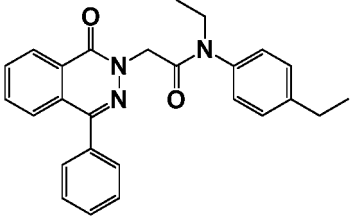
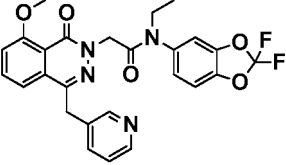
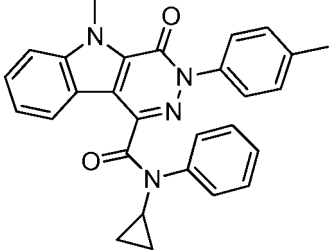
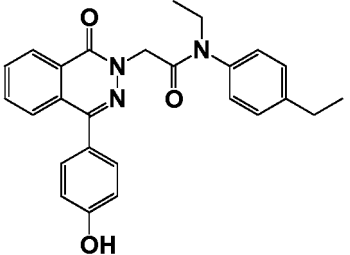
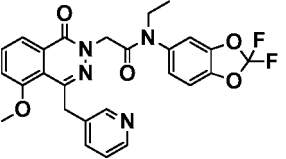
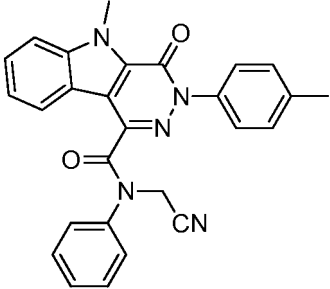
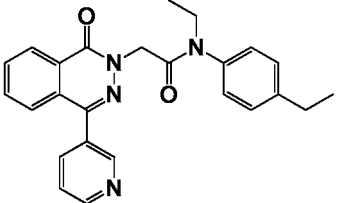
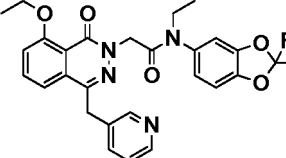
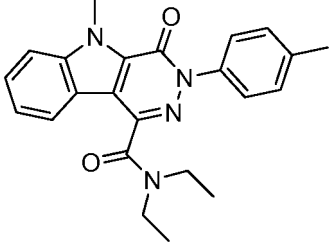
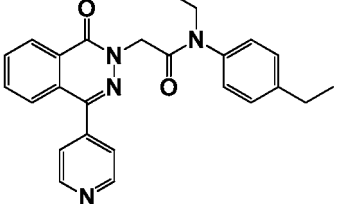
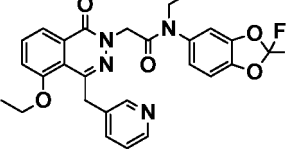
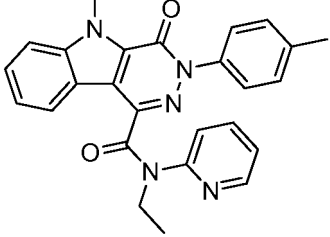
$R_{103}$ は、水素、重水素、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリールである、

請求項1～6のいずれかに記載の化合物。

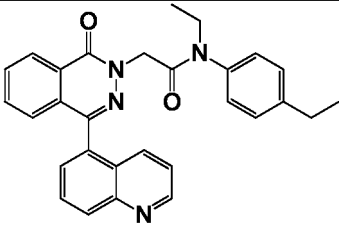
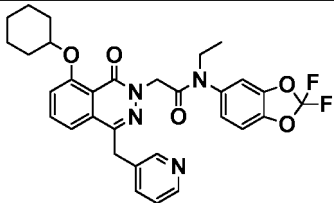
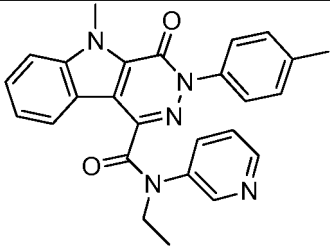
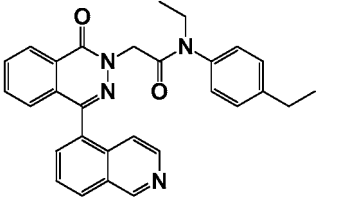
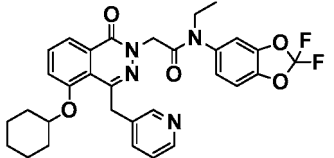
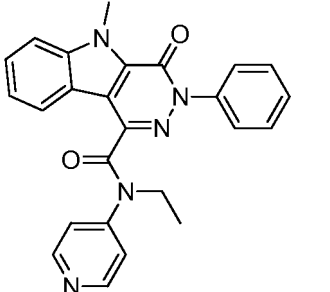
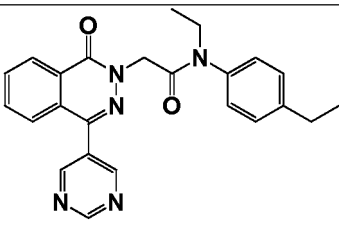
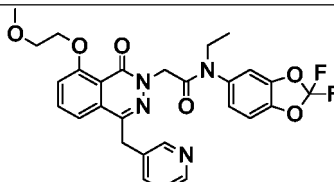
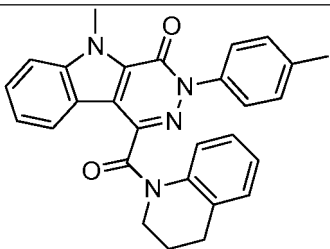
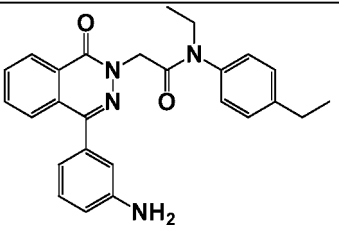
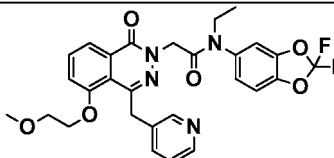
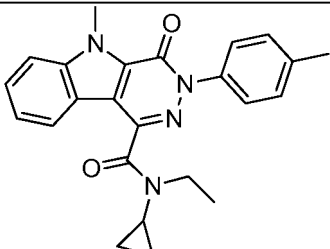
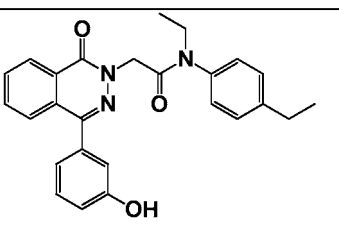
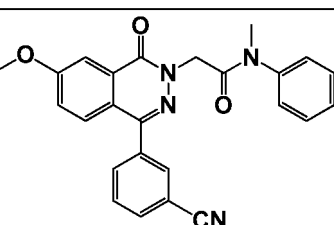
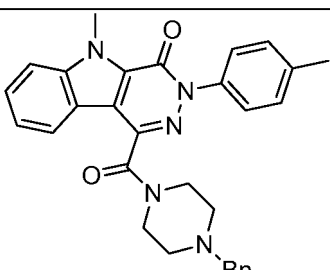
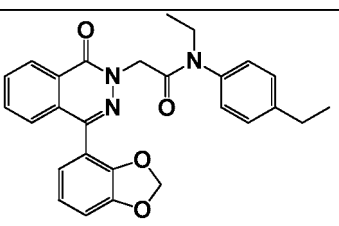
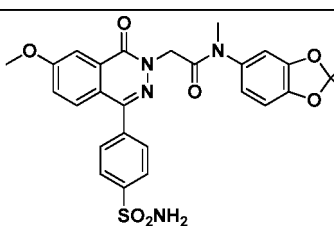
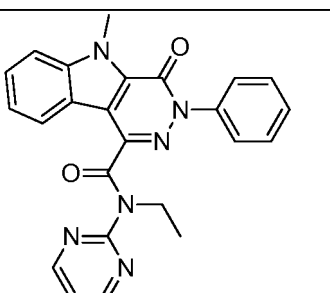
## 【請求項 8】

表A：

【表 1】

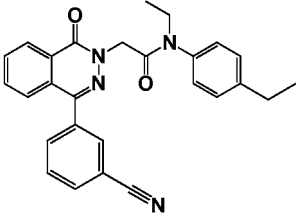
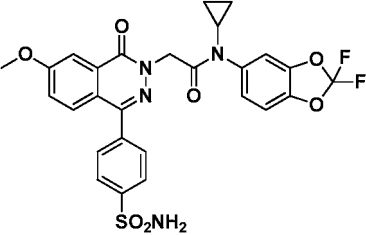
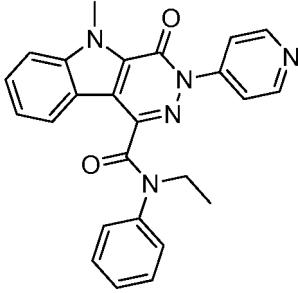
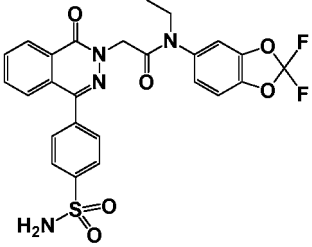
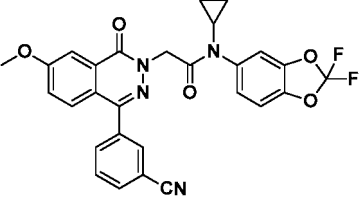
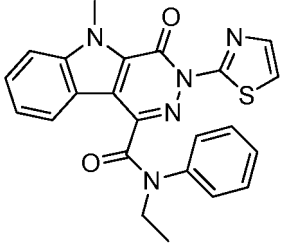
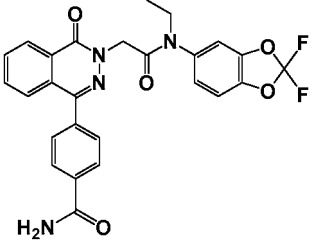
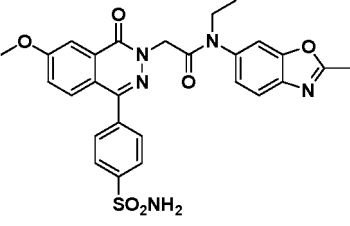
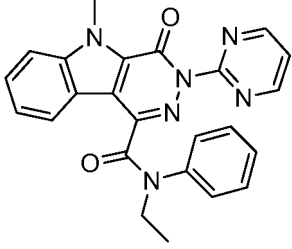
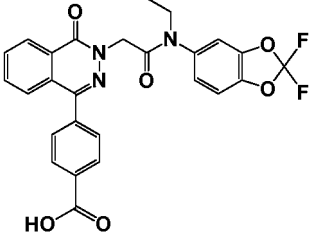
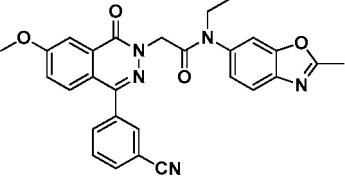
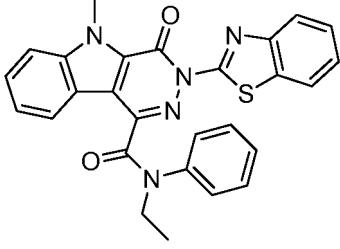
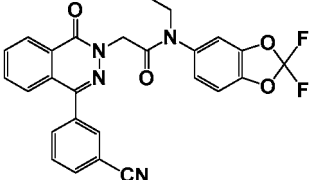
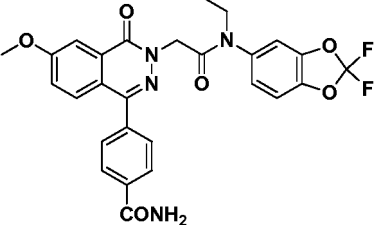
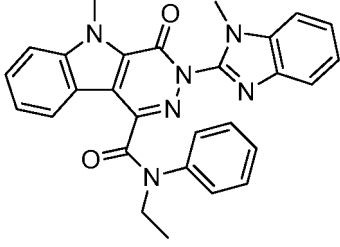
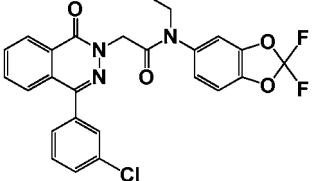
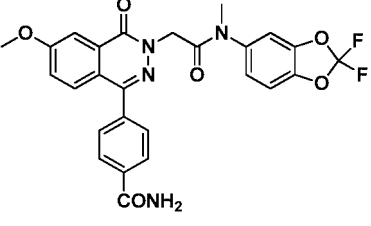
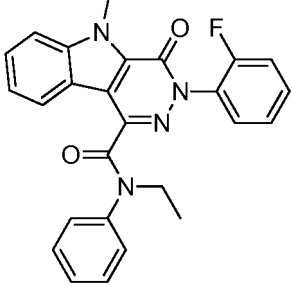
【表 2】



【表 3】

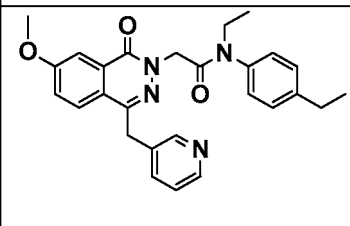
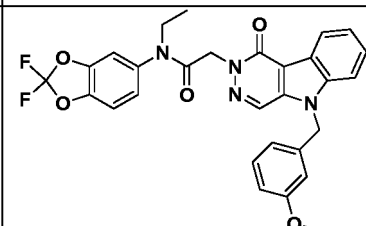
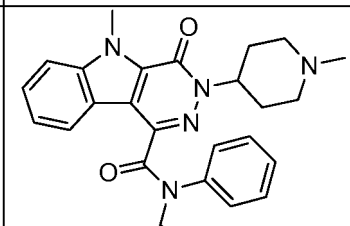
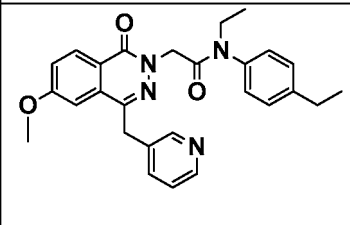
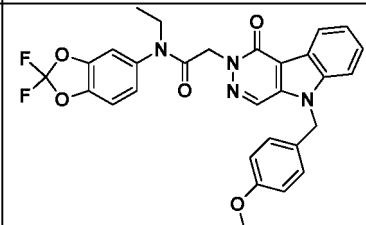
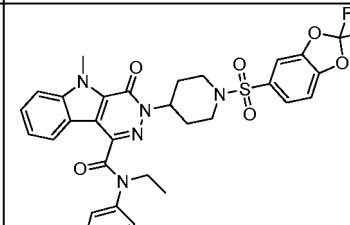
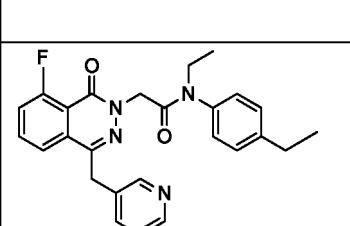
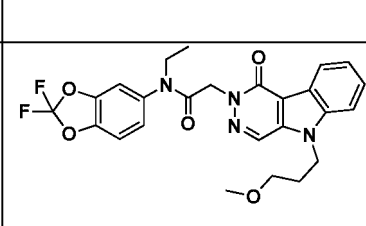
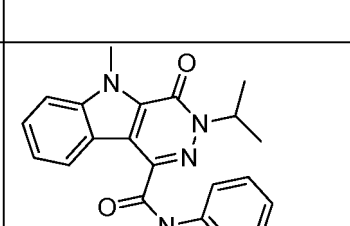
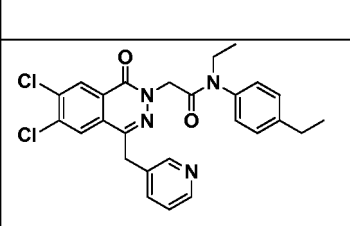
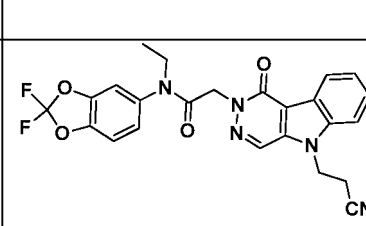
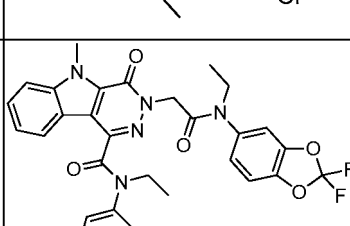
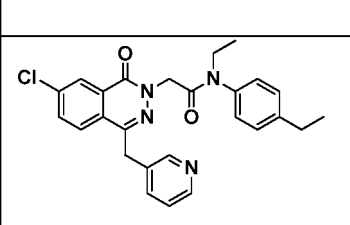
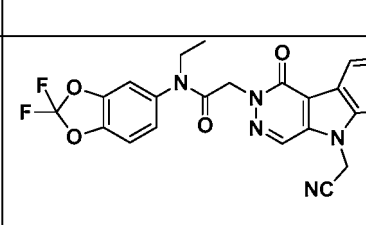
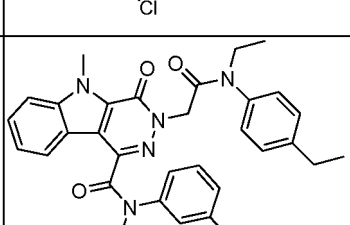
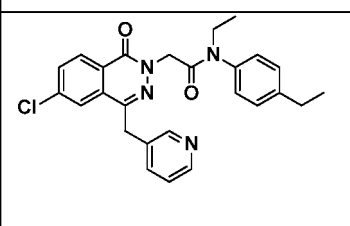
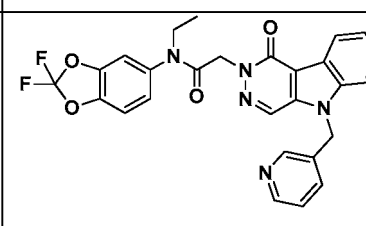
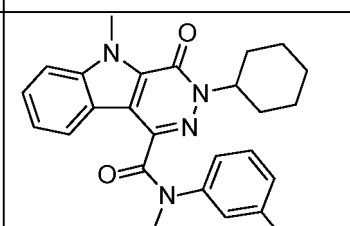

【表 4】

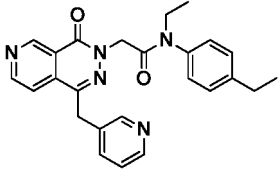
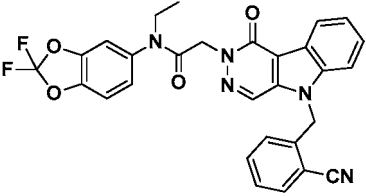
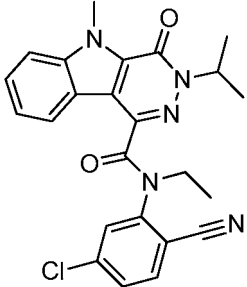
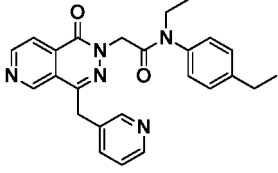
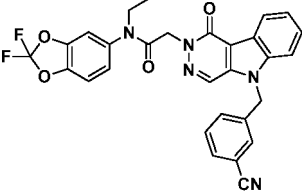
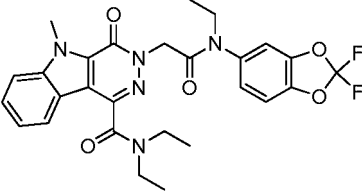
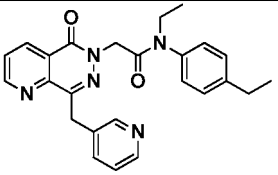
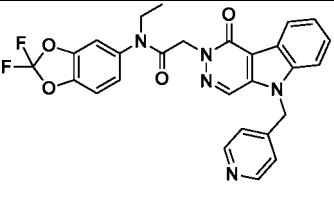
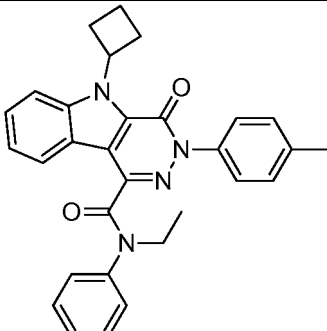
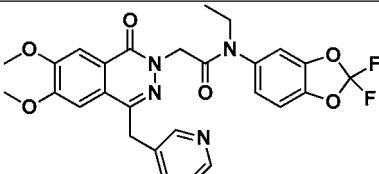
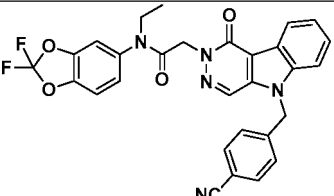
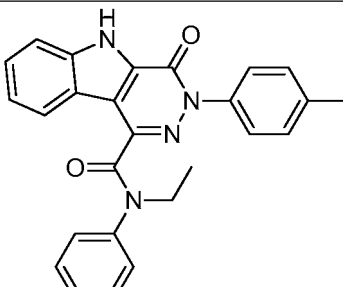
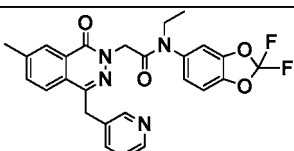
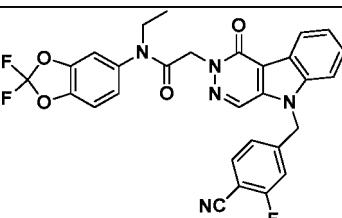
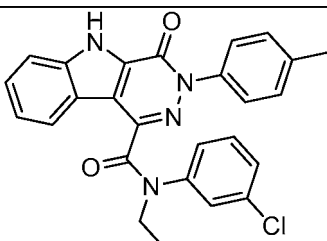
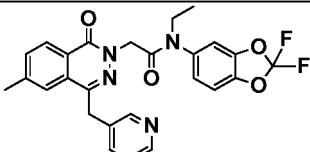
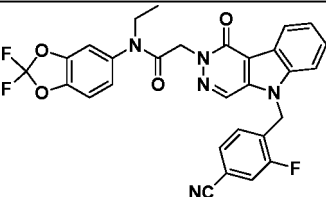
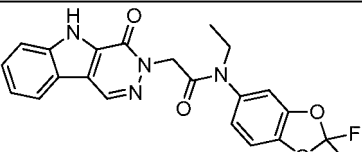
【表 5】


【表 6】


【表 7】

【表 8】

【表 9】


【表 10】

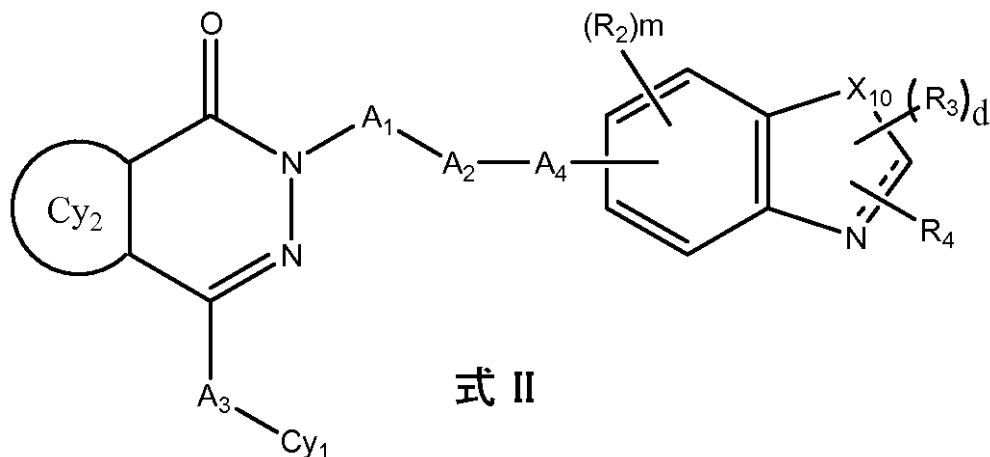
		
---	--	--

から選択される化合物。

【請求項 9】

式 II :

【化 7】



式中、

【化 8】



は単結合又は二重結合を表し；

mは0、1、2、3又は4であり；

dは0、1又は2であり；

X<sub>10</sub>は、  CH、CH<sub>2</sub>、N、S又は0であり；

Cy<sub>1</sub>は、  非存在であるか、1、2又は3環を有する、アリール基、置換されるアリール基、炭素環基、置換される炭素環基、ヘテロシクリル基、置換されるヘテロシクリル基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基であり；

Cy<sub>2</sub>は、1、2又は3環を有する、アリール基、置換されるアリール基、炭素環基、置換される炭素環基、ヘテロシクリル基、置換されるヘテロシクリル基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基であり；

好ましくは、Cy<sub>2</sub>はC<sub>5</sub>-C<sub>7</sub>アリール又はヘテロアリールであり；好ましくは、Cy<sub>2</sub>は、  -OR<sub>200</sub>、-SR<sub>200</sub>、-C(O)R<sub>200</sub>、-C(O)N(R<sub>200</sub>)<sub>2</sub>、-NC(O)R<sub>200</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R<sub>200</sub>で置換され、ここでR<sub>200</sub>は水素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル又はC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルであり；

A<sub>1</sub>は、  非存在、-[C(R<sub>100</sub>)(R<sub>101</sub>)]<sub>n</sub>-、-C(O)-、-C(S)-、-S(O)-、-C(O)N(R<sub>100</sub>)-、-S(O)<sub>2</sub>N(R<sub>100</sub>)-、-S(O)<sub>2</sub>-、-[C(R<sub>25</sub>)(R<sub>26</sub>)]<sub>n</sub>-、-[C(R<sub>25</sub>)(R<sub>26</sub>)]<sub>n</sub>-C=C-[C(R<sub>27</sub>)(R<sub>28</sub>)]<sub>p</sub>、若しくは-[C(R<sub>25</sub>)(R<sub>26</sub>)]<sub>n</sub>-C-C-[C(R<sub>27</sub>)(R<sub>28</sub>)]<sub>p</sub>、炭素環、置換される炭素環、複素環、置換される複素環、芳香族、置換される芳香族、ヘテロ芳香族又は置換されるヘテロ芳香族であり；  ここでnは0、1、2、3、4、5、6又は7であり；

各R<sub>100</sub>及びR<sub>101</sub>は、  水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、ヘテロアルキル、置換されるヘテロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリール、-OR<sub>200</sub>、-SR<sub>200</sub>、-C(O)R<sub>200</sub>、-C(O)N(R<sub>200</sub>)<sub>2</sub>、-NC(O)R<sub>200</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R<sub>200</sub>であり、  ここでR<sub>2</sub>



$R_{100}$ は、水素、 $C_1$ - $C_6$ アルキル、 $C_2$ - $C_6$ アルケニル又は $C_2$ - $C_6$ アルキニルであり；あるいは $R_{100}$ 基及び $R_{101}$ 基の二つが、それらが結合する原子及び任意の介在原子と一緒になって、さらなる任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；好ましくは、各 $R_{100}$ 及び $R_{101}$ は独立して、 $C_1$ - $C_8$ アルキル、 $C_2$ - $C_8$ アルケニル、 $C_2$ - $C_8$ アルキニル及び $C_3$ - $C_8$ シクロアルキルから選択され；

$A_2$ は、非存在又は  $-[C(R_{100})(R_{101})]n-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-C(O)N(R_{100})-$ 、 $-C(O)N(R_{100})(R_{101})$ 、 $N(R_{100})(R_{101})$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-[C(R_{25})(R_{26})]n-$ 、 $-[C(R_{25})(R_{26})]n-C=C-[C(R_{27})(R_{28})]p$ 若しくは  $-[C(R_{25})(R_{26})]n-C-C-[C(R_{27})(R_{28})]p$ であり；

$A_3$ は非存在又は  $-[C(R_{100})(R_{101})]n-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-C(O)N(R_{100})-$ 、 $-C(O)N(R_{100})(R_{101})$ 、 $N(R_{100})(R_{101})$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $S(O)_2R_{100}$ 、 $S(O)R_{100}$ 、 $S(O)_2N(R_{100})(R_{101})$ 、 $-[C(R_{25})(R_{26})]n-$ 、 $-[C(R_{25})(R_{26})]n-C=C-[C(R_{27})(R_{28})]p$ 若しくは  $-[C(R_{25})(R_{26})]n-C-C-[C(R_{27})(R_{28})]p$ であり；

$A_4$ は、非存在又は  $-[C(R_{25})(R_{26})]n-$ 、 $-[C(R_{25})(R_{26})]n-C=C-[C(R_{27})(R_{28})]p$ 若しくは  $-[C(R_{25})(R_{26})]n-C-C-[C(R_{27})(R_{28})]p$ であり；

ここで各 $R_{25}$ 、 $R_{26}$ 、 $R_{27}$ 及び $R_{28}$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、ヘテロアルキル、置換されるヘテロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリールから選択され；あるいは $R_{25}$ 基、 $R_{26}$ 基、 $R_{27}$ 基及び $R_{28}$ 基の二つが、それらが結合する原子及び任意の介在原子と一緒になって、さらなる任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；好ましくはシクロプロピル基を形成し得；

ここで $p$ は0、1、2、3、4、5、6又は7であり；

$R_2$ は、独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、シクロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール又は置換されるヘテロアリール、 $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；あるいは、二つの $R_2$ が、それらが結合する原子と一緒になって、任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；好ましくはシクロアルキル基、置換されるシクロアルキル基、複素環基、置換される複素環基、アリール基、置換されるアリール基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基を形成し得；

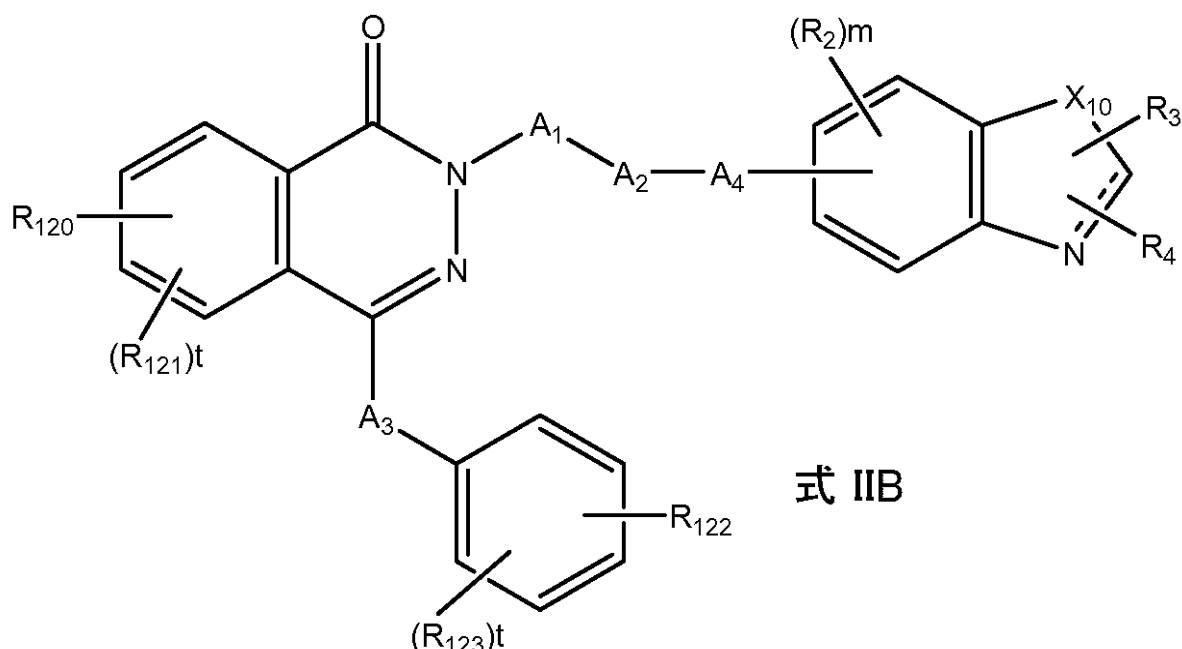
各 $R_3$ 及び $R_4$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択される、

の化合物又はその薬学的に許容され得る塩、エステル若しくはプロドラッグであって、好ましくは、式中、 $A_1$ は、 $-C(R_{100})(R_{101})-$ であり、 $A_2$ は、 $-C(O)N(R_{100})-$ である化合物又はその薬学的に許容され得る塩。

#### 【請求項 10】

式IIB：

## 【化 9】



式 IIB

式中、

## 【化 10】

=====

は単結合又は二重結合を表し；

mは0、1、2、3又は4であり；

tは0、1、2又は3であり；

X<sub>10</sub>はCH、CH<sub>2</sub>、N、S又はOであり；

A<sub>1</sub>は、非存在、-[C(R<sub>100</sub>)(R<sub>101</sub>)]<sub>n</sub>-、-C(O)-、-C(S)-、-S(O)-、-C(O)N(R<sub>100</sub>)-、-S(O)<sub>2</sub>N(R<sub>100</sub>)-、-S(O)<sub>2</sub>-、-[C(R<sub>25</sub>)(R<sub>26</sub>)]<sub>n</sub>-、-[C(R<sub>25</sub>)(R<sub>26</sub>)]<sub>n</sub>-C=C-[C(R<sub>27</sub>)(R<sub>28</sub>)]<sub>p</sub>、若しくは-[C(R<sub>25</sub>)(R<sub>26</sub>)]<sub>n</sub>-C-C-[C(R<sub>27</sub>)(R<sub>28</sub>)]<sub>p</sub>、炭素環、置換される炭素環、複素環、置換される複素環、芳香族、置換される芳香族、ヘテロ芳香族又は置換されるヘテロ芳香族であり；ここでnは0、1、2、3、4、5、6又は7であり；

ここで各R<sub>100</sub>及びR<sub>101</sub>は、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、ヘテロアルキル、置換されるヘテロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリール、-OR<sub>200</sub>、-SR<sub>200</sub>、-C(O)R<sub>200</sub>、-C(O)N(R<sub>200</sub>)<sub>2</sub>、-NC(O)R<sub>200</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R<sub>200</sub>であって、ここでR<sub>200</sub>は、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル又はC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルであり；あるいはR<sub>100</sub>基及びR<sub>101</sub>基の二つが、それらが結合する原子及び任意の介在原子と一緒にあって、さらなる任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；

A<sub>2</sub>は、非存在又は-[C(R<sub>100</sub>)(R<sub>101</sub>)]<sub>n</sub>-、-C(O)-、-C(S)-、-S(O)-、-C(O)N(R<sub>100</sub>)-、-C(O)N(R<sub>100</sub>)(R<sub>101</sub>)、N(R<sub>100</sub>)(R<sub>101</sub>)、-S(O)<sub>2</sub>-、-S(O)<sub>2</sub>R<sub>100</sub>、-S(O)R<sub>100</sub>、-S(O)<sub>2</sub>N(R<sub>100</sub>)(R<sub>101</sub>)、-[C(R<sub>25</sub>)(R<sub>26</sub>)]<sub>n</sub>-、-[C(R<sub>25</sub>)(R<sub>26</sub>)]<sub>n</sub>-C=C-[C(R<sub>27</sub>)(R<sub>28</sub>)]<sub>p</sub>若しくは-[C(R<sub>25</sub>)(R<sub>26</sub>)]<sub>n</sub>-C-C-[C(R<sub>27</sub>)(R<sub>28</sub>)]<sub>p</sub>であり；

A<sub>3</sub>は、非存在又は-[C(R<sub>100</sub>)(R<sub>101</sub>)]<sub>n</sub>-、-C(O)-、-C(S)-、-S(O)-、-C(O)N(R<sub>100</sub>)-、-C(O)N(R<sub>100</sub>)(R<sub>101</sub>)、N(R<sub>100</sub>)(R<sub>101</sub>)、-S(O)<sub>2</sub>-、S(O)<sub>2</sub>R<sub>100</sub>、S(O)R<sub>100</sub>、S(O)<sub>2</sub>N(R<sub>100</sub>)(R<sub>101</sub>)、-[C(R<sub>25</sub>)(R<sub>26</sub>)]<sub>n</sub>-、-[C(R<sub>25</sub>)(R<sub>26</sub>)]<sub>n</sub>-C=C-[C(R<sub>27</sub>)(R<sub>28</sub>)]<sub>p</sub>若しくは-[C(R<sub>25</sub>)(R<sub>26</sub>)]<sub>n</sub>-C-C-[C(R<sub>27</sub>)(R<sub>28</sub>)]<sub>p</sub>であり；

A<sub>4</sub>は、非存在又は-[C(R<sub>25</sub>)(R<sub>26</sub>)]<sub>n</sub>-、-[C(R<sub>25</sub>)(R<sub>26</sub>)]<sub>n</sub>-C=C-[C(R<sub>27</sub>)(R<sub>28</sub>)]<sub>p</sub>若しくは-[C(R<sub>25</sub>)(R<sub>26</sub>)]<sub>n</sub>-C-C-[C(R<sub>27</sub>)(R<sub>28</sub>)]<sub>p</sub>であり；

ここで各R<sub>25</sub>、R<sub>26</sub>、R<sub>27</sub>及びR<sub>28</sub>は、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアル

キル、ヘテロアルキル、置換されるヘテロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリールであり；あるいは $R_{25}$ 基、 $R_{26}$ 基、 $R_{27}$ 基及び $R_{28}$ 基の二つが、それらが結合する原子及び任意の介在原子と一緒に、さらなる任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；好ましくはシクロプロピル基を形成し得；

$p$ は0、1、2、3、4、5、6又は7であり；

$R_2$ は、独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、シクロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール又は置換されるヘテロアリール、 $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；あるいは、二つの $R_2$ が、それらが結合する原子と一緒に、任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；好ましくはシクロアルキル基、置換されるシクロアルキル基、複素環基、置換される複素環基、アリール基、置換されるアリール基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基を形成し得；

各 $R_3$ 及び $R_4$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、及び $-N_3$ から選択され；

$R_{120}$ は、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール、又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；

各 $R_{121}$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール、又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；

$R_{122}$ は、ハロゲン又は $-CN$ であり；

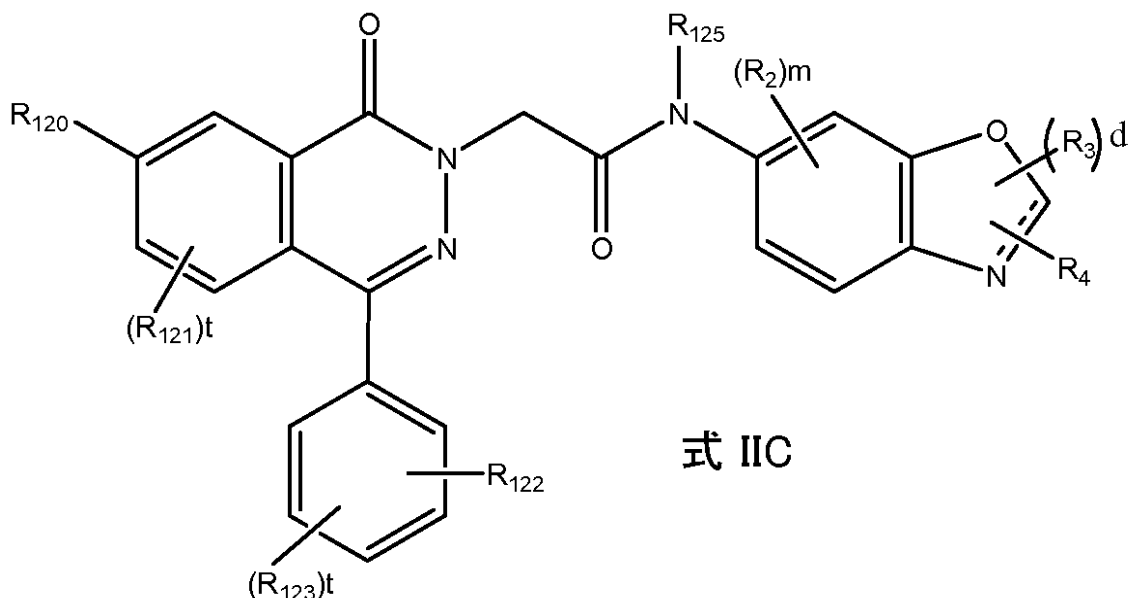
各 $R_{123}$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール、又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択される、

を有する化合物又はその薬学的に許容され得る塩、エステル若しくはプロドラッグ。

【請求項 11】

式IIC:

【化 1 1】



式 IIC

式中、

【化 1 2】

=====

は単結合又は二重結合を表し；

mは0、1、2、3又は4であり；

tは0、1、2又は3であり；

$R_2$ は、独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、シクロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール又は置換されるヘテロアリール、 $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；あるいは、二つの $R_2$ が、それらが結合する原子と一緒に、任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得、好ましくはシクロアルキル基、置換されるシクロアルキル基、複素環基、置換される複素環基、アリール基、置換されるアリール基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基を形成し得；

各 $R_3$ 及び $R_4$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；

$R_{120}$ は、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール、又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；

各 $R_{121}$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘ

テロアリール、置換されるヘテロアリール、又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；

$R_{122}$ は、ハロゲン又は $-CN$ であり；

各 $R_{123}$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール、又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；

$R_{125}$ は、アルキル又は置換されるアルキルであり；

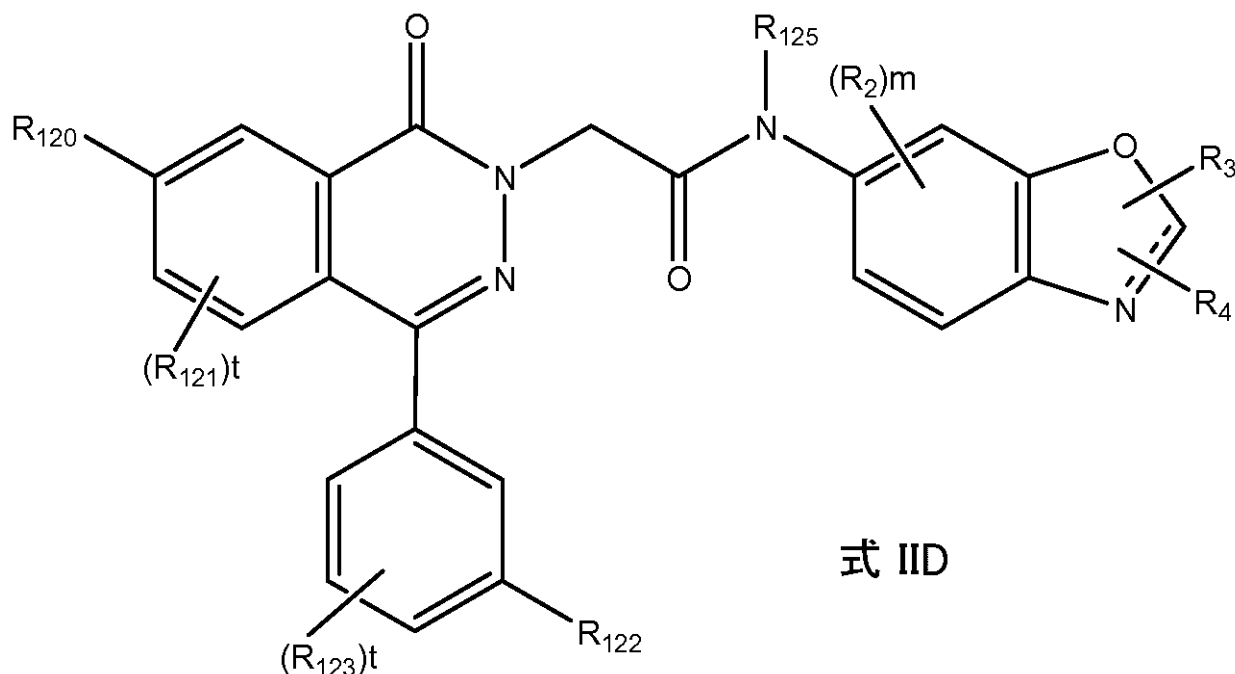
ここで各 $R_{100}$ 及び $R_{101}$ は水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、ヘテロアルキル、置換されるヘテロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリール、 $-OR_{200}$ 、 $-SR_{200}$ 、 $-C(O)R_{200}$ 、 $-C(O)N(R_{200})_2$ 、 $-NC(O)R_{200}$ 、 $-S(O)_2R_{200}$ であり、ここで $R_{200}$ は、水素、 $C_1$ - $C_6$ アルキル、 $C_2$ - $C_6$ アルケニル又は $C_2$ - $C_6$ アルキニルであり；あるいは $R_{100}$ 基及び $R_{101}$ 基の二つが、それらが結合する原子及び任意の介在原子と一緒にあって、さらなる任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得る、

を有する化合物又はその薬学的に許容され得る塩、エステル若しくはプロドラッグ。

【請求項 12】

式 IID：

【化 1 3】



式 IID

式中、

【化 1 4】



は単結合又は二重結合を表し；

$m$ は0、1、2、3又は4であり；

$t$ は0、1、2又は3であり；

$R_2$ は、独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、シクロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテ

ロシクリル、ヘテロアリール又は置換されるヘテロアリール、 $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；あるいは、二つの $R_2$ が、それらが結合する原子と一緒にあって、任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得、好ましくはシクロアルキル基、置換されるシクロアルキル基、複素環基、置換される複素環基、アリール基、置換されるアリール基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基を形成し得；

各 $R_3$ 及び $R_4$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；

$R_{120}$ は、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール、又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；

各 $R_{121}$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール、又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；

$R_{122}$ は、ハロゲン、 $-CN$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $CONH_2$ 、 $CO_2H$ 、 $-CH_3$ 、 $OCH_3$ 、 $-OR_{100}$ であり；

各 $R_{123}$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール、又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；及び、

$R_{125}$ は、アルキル又は置換されるアルキルであり；

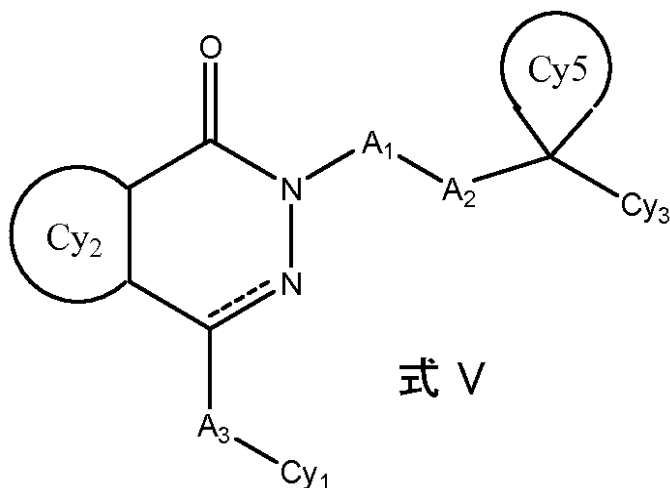
ここで各 $R_{100}$ 及び $R_{101}$ は、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、ヘテロアルキル、置換されるヘテロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリール、 $-OR_{200}$ 、 $-SR_{200}$ 、 $-C(O)R_{200}$ 、 $-C(O)N(R_{200})_2$ 、 $NC(O)R_{200}$ 、 $-S(O)_2R_{200}$ であり、ここで $R_{200}$ は水素、 $C_1$ - $C_6$ アルキル、 $C_2$ - $C_6$ アルケニル又は $C_2$ - $C_6$ アルキニルであり；あるいは $R_{100}$ 基及び $R_{101}$ 基の二つが、それらに結合した原子及び任意の介在原子と一緒にあって、さらに任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得る、

を有する化合物又はその薬学的に許容され得る塩、エステル若しくはプロドラッグ。

【請求項 13】

式V:

## 【化 1 5】



式中、

## 【化 1 6】

=====

は単結合又は二重結合を表し；

mは0、1、2、3又は4であり；

Cy<sub>1</sub>は、非存在であるか、1、2又は3環を有する、アリール基、置換されるアリール基、炭素環基、置換される炭素環基、ヘテロシクリル基、置換されるヘテロシクリル基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基であり；

Cy<sub>2</sub>は、1、2又は3環を有する、アリール基、置換されるアリール基、炭素環基、置換される炭素環基、ヘテロシクリル基、置換されるヘテロシクリル基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基であり；

A<sub>1</sub>は、非存在、-[C(R<sub>100</sub>)(R<sub>101</sub>)]<sub>n</sub>-、-C(O)-、-C(S)-、-S(O)-、-C(O)N(R<sub>100</sub>)-、-S(O)<sub>2</sub>N(R<sub>100</sub>)-、-S(O)<sub>2</sub>-、炭素環、置換される炭素環、複素環、置換される複素環、芳香族、置換される芳香族、ヘテロ芳香族又は置換されるヘテロ芳香族であり；ここでnは0、1、2、3、4、5、6又は7であり；好ましくは、Cy<sub>2</sub>は、C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub>アリール又はヘテロアリールであり；好ましくは、Cy<sub>2</sub>は、-OR<sub>200</sub>、-SR<sub>200</sub>、-C(O)R<sub>200</sub>、-C(O)N(R<sub>200</sub>)<sub>2</sub>、-NC(O)R<sub>200</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R<sub>200</sub>で置換され、ここでR<sub>200</sub>は水素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル又はC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルであり；

ここで各R<sub>100</sub>及びR<sub>101</sub>は、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、ヘテロアルキル、置換されるヘテロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリール、-OR<sub>200</sub>、-SR<sub>200</sub>、-C(O)R<sub>200</sub>、-C(O)N(R<sub>200</sub>)<sub>2</sub>、-NC(O)R<sub>200</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R<sub>200</sub>であり、ここでR<sub>200</sub>は、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル又はC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルであり；あるいはR<sub>100</sub>基及びR<sub>101</sub>基の二つが、それらが結合する原子及び任意の介在原子と一緒にあって、さらなる任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；

Cy<sub>3</sub>は、非存在であるか、1、2又は3環を有する、アリール基、置換されるアリール基、炭素環基、置換される炭素環基、ヘテロシクリル基、置換されるヘテロシクリル基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基であり；

Cy<sub>5</sub>は、スピロ結合したC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>炭素環、好ましくはシクロプロピル又はシクロブチルであり；

A<sub>2</sub>は、非存在又は-[C(R<sub>100</sub>)(R<sub>101</sub>)]<sub>n</sub>-、-C(O)-、-C(S)-、-S(O)-、-C(O)N(R<sub>100</sub>)-、-C(O)N(R<sub>100</sub>)(R<sub>101</sub>)、N(R<sub>100</sub>)(R<sub>101</sub>)、-S(O)<sub>2</sub>-、-S(O)<sub>2</sub>R<sub>100</sub>、-S(O)R<sub>100</sub>、-S(O)<sub>2</sub>N(R<sub>100</sub>)R<sub>101</sub>であり；

A<sub>3</sub>は、非存在又は-[C(R<sub>100</sub>)(R<sub>101</sub>)]<sub>n</sub>-、-C(O)-、-C(S)-、-S(O)-、-C(O)N(R<sub>100</sub>)-、-C(O)N(R<sub>100</sub>)(R<sub>101</sub>)、N(R<sub>100</sub>)(R<sub>101</sub>)、-S(O)<sub>2</sub>-、-S(O)<sub>2</sub>R<sub>100</sub>、-S(O)R<sub>100</sub>、-S(O)<sub>2</sub>N(R<sub>100</sub>)(R<sub>101</sub>)

)であり；

$R_2$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、シクロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール又は置換されるヘテロアリール、 $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；あるいは、二つの $R_2$ が、それらが結合する原子と一緒に、任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；好ましくはシクロアルキル基、置換されるシクロアルキル基、複素環基、置換される複素環基、アリール基、置換されるアリール基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基を形成し得；

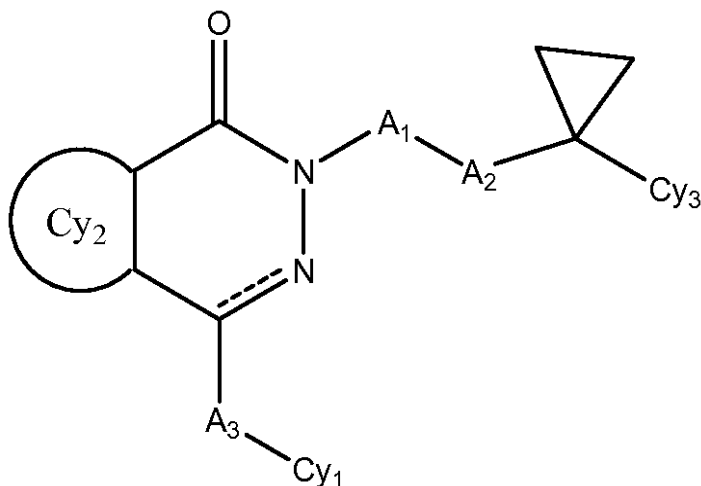
各 $R_3$ 及び $R_4$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択される、

の化合物又はその薬学的に許容され得る塩、エステル若しくはプロドラッグ。

【請求項 1 4】

式：

【化 1 7】



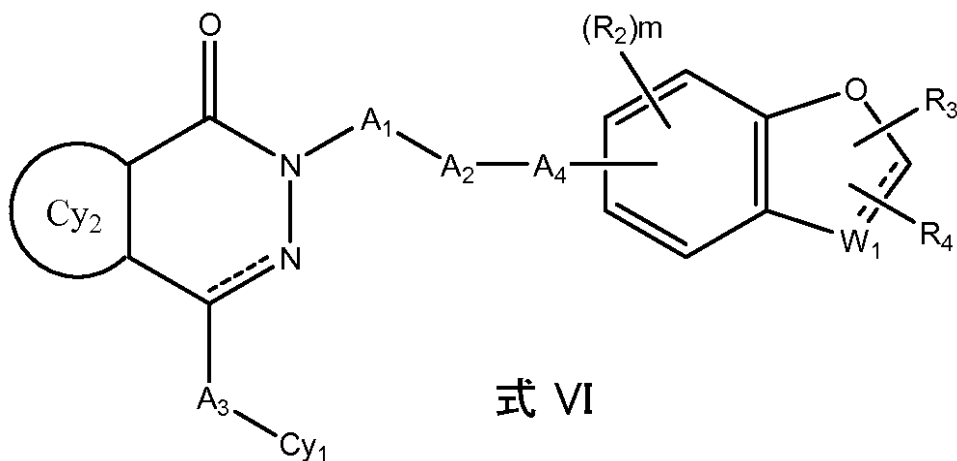
を有する、請求項 1 3 に記載の化合物又はその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 1 5】

式VI：



【化 1 8】



式 VI

式中、

【化 1 9】

=====

は単結合又は二重結合を表し；

 $W_1$  は、 $\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2$ 、 $\text{CR}_{100}$ 、 $\text{C(O)}$ 、 $\text{O}$ 、 $\text{S}$ 、 $\text{SO}$ 又は $\text{SO}_2$ であり； $m$ は0、1、2、3又は4であり；

$\text{Cy}_1$ は、非存在であるか、1、2又は3環を有する、アリール基、置換されるアリール基、炭素環基、置換される炭素環基、ヘテロシクリル基、置換されるヘテロシクリル基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基であり；

$\text{Cy}_2$ は、1、2又は3環を有する、アリール基、置換されるアリール基、炭素環基、置換される炭素環基、ヘテロシクリル基、置換されるヘテロシクリル基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基であり；

$A_1$ は、非存在、 $-\text{[C(R}_{100}\text{)(R}_{101}\text{)]}_n-$ 、 $-\text{C(O)}-$ 、 $-\text{C(S)}-$ 、 $-\text{S(O)}-$ 、 $-\text{C(O)N(R}_{100}\text{)}-$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{N(R}_{100}\text{)}-$ 、 $-\text{S(O)}_2-$ 、炭素環、置換される炭素環、複素環、置換される複素環、芳香族、置換される芳香族、ヘテロ芳香族又は置換されるヘテロ芳香族であり； $n$ は0、1、2、3、4、5、6又は7であり；

ここで各 $\text{R}_{100}$ 及び $\text{R}_{101}$ は、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、ヘテロアルキル、置換されるヘテロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリール、 $-\text{OR}_{200}$ 、 $-\text{SR}_{200}$ 、 $-\text{C(O)R}_{200}$ 、 $-\text{C(O)N(R}_{200}\text{)}_2$ 、 $-\text{NC(O)R}_{200}$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{R}_{200}$ であり、ここで $\text{R}_{200}$ は、水素、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ アルケニル又は $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ アルキニルであり；あるいは $\text{R}_{100}$ 基及び $\text{R}_{101}$ 基の二つが、それらが結合する原子及び任意の介在原子と一緒になる任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；

$A_2$ は、非存在又は $-\text{[C(R}_{100}\text{)(R}_{101}\text{)]}_n-$ 、 $-\text{C(O)}-$ 、 $-\text{C(S)}-$ 、 $-\text{S(O)}-$ 、 $-\text{C(O)N(R}_{100}\text{)}-$ 、 $-\text{C(O)N(R}_{100}\text{)(R}_{101}\text{)}$ 、 $\text{N(R}_{100}\text{)(R}_{101}\text{)}$ 、 $-\text{S(O)}_2-$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{R}_{100}$ 、 $-\text{S(O)R}_{100}$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{N(R}_{100}\text{)(R}_{101}\text{)}$ であり；

$A_3$ は、非存在又は $-\text{[C(R}_{100}\text{)(R}_{101}\text{)]}_r-$ 、 $-\text{C(O)}-$ 、 $-\text{C(S)}-$ 、 $-\text{S(O)}-$ 、 $-\text{C(O)N(R}_{100}\text{)}-$ 、 $-\text{C(O)N(R}_{100}\text{)(R}_{101}\text{)}$ 、 $\text{N(R}_{100}\text{)(R}_{101}\text{)}$ 、 $-\text{S(O)}_2-$ 、 $\text{S(O)}_2\text{R}_{100}$ 、 $\text{S(O)R}_{100}$ 、 $\text{S(O)}_2\text{N(R}_{100}\text{)(R}_{101}\text{)}$ であり；

$A_4$ は、 $-\text{[C(R}_{25}\text{)(R}_{26}\text{)]}_r-$ 、 $-\text{[C(R}_{25}\text{)(R}_{26}\text{)]}_r\text{-C=C-[C(R}_{27}\text{)(R}_{28}\text{)]}_p$ 又は $-\text{[C(R}_{25}\text{)(R}_{26}\text{)]}_r\text{-C-C-[C(R}_{27}\text{)(R}_{28}\text{)]}_p$ であり；

ここで各 $\text{R}_{25}$ 、 $\text{R}_{26}$ 、 $\text{R}_{27}$ 及び $\text{R}_{28}$ は、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、ヘテロアルキル、置換されるヘテロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリールであり；あるいは $\text{R}_{25}$ 基、 $\text{R}_{26}$ 基、 $\text{R}_{27}$ 基及び $\text{R}_{28}$ 基の二つが、それらが結合す

る原子及び任意の介在原子と一緒にあって、さらなる任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；好ましくはシクロプロピル基を形成し得；

pは0、1、2、3、4、5、6又は7であり；

rは1、2、3、4、5、6又は7であり；

$R_2$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、シクロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール又は置換されるヘテロアリール、 $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；あるいは、二つの $R_2$ が、それらが結合する原子と一緒にあって、任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；好ましくはシクロアルキル基、置換されるシクロアルキル基、複素環基、置換される複素環基、アリール基、置換されるアリール基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基を形成し得；

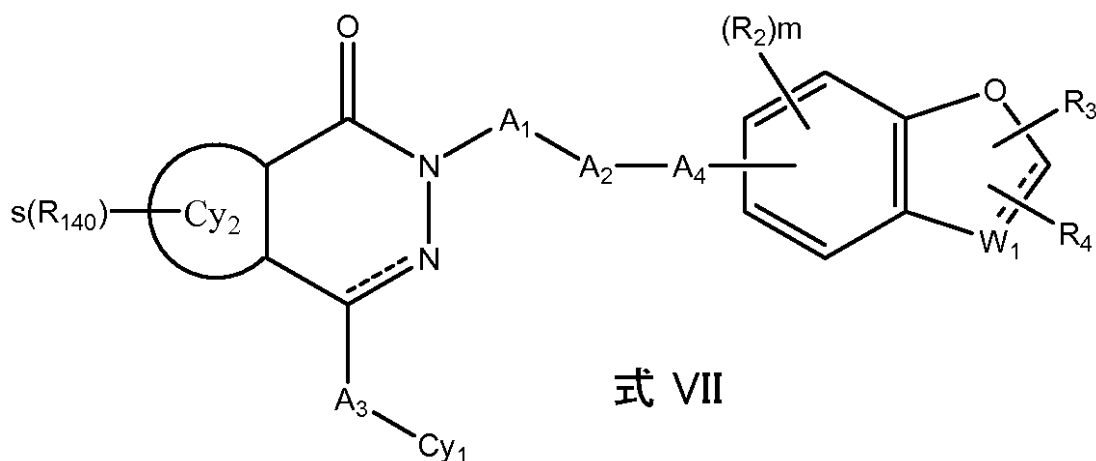
各 $R_3$ 及び $R_4$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択される、

を有する化合物又はその薬学的に許容され得る塩、エステル若しくはプロドラッグ。

【請求項16】

式VII:

【化20】



式 VII

式中、

【化21】



は単結合又は二重結合を表し；

$W_1$ は $-CH$ 、 $-CH_2$ 、 $-CR_{100}$ 、 $-C(O)$ 、 $-O$ 、 $-S$ 、 $-SO$ 又は $-SO_2$ であり；

mは0、1、2、3又は4であり；

sは1、2、3又は4であり；

$Cy_1$ は、非存在であるか、1、2又は3環を有する、アリール基、置換されるアリール基、炭素環基、置換される炭素環基、ヘテロシクリル基、置換されるヘテロシクリル基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基であり；

$Cy_2$ は、1、2又は3環を有する、アリール基、置換されるアリール基、炭素環基、置換される炭素環基、ヘテロシクリル基、置換されるヘテロシクリル基、ヘテロアリール基又は置

換されるヘテロアリール基であり；

$A_1$ は、非存在、 $-[C(R_{100})(R_{101})]_n-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-C(O)N(R_{100})-$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})-$ 、 $-S(O)_2-$ 、炭素環、置換される炭素環、複素環、置換される複素環、芳香族、置換される芳香族、ヘテロ芳香族又は置換されるヘテロ芳香族であり； $n$ は0、1、2、3、4、5、6又は7であり；

ここで各 $R_{100}$ 及び $R_{101}$ は水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、ヘテロアルキル、置換されるヘテロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリール、 $-OR_{200}$ 、 $-SR_{200}$ 、 $-C(O)R_{200}$ 、 $-C(O)N(R_{200})_2$ 、 $-NC(O)R_{200}$ 、 $-S(O)_2R_{200}$ であり、ここで $R_{200}$ は水素、 $C_1$ - $C_6$ アルキル、 $C_2$ - $C_6$ アルケニル又は $C_2$ - $C_6$ アルキニルであり；あるいは $R_{100}$ 基及び $R_{101}$ 基の二つが、それらが結合する原子及び任意の介在原子と一緒にあって、さらなる任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；

$A_2$ は、非存在又は $-[C(R_{100})(R_{101})]_n-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-C(O)N(R_{100})-$ 、 $-C(O)N(R_{100})(R_{101})$ 、 $N(R_{100})(R_{101})$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})(R_{101})$ であり；

$A_3$ は、非存在又は $-[C(R_{100})(R_{101})]r-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-C(O)N(R_{100})-$ 、 $-C(O)N(R_{100})(R_{101})$ 、 $N(R_{100})(R_{101})$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $S(O)_2R_{100}$ 、 $S(O)R_{100}$ 、 $S(O)_2N(R_{100})(R_{101})$ であり；

$A_4$ は、非存在、 $-[C(R_{25})(R_{26})]r-$ 、 $-[C(R_{25})(R_{26})]r-C=C-[C(R_{27})(R_{28})]p$ 又は $-[C(R_{25})(R_{26})]r-C-C-[C(R_{27})(R_{28})]p$ であり；

ここで各 $R_{25}$ 、 $R_{26}$ 、 $R_{27}$ 及び $R_{28}$ は、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、ヘテロアルキル、置換されるヘテロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリールであり；あるいは $R_{25}$ 基、 $R_{26}$ 基、 $R_{27}$ 基及び $R_{28}$ 基の二つが、それらが結合する原子及び任意の介在原子と一緒にあって、さらに任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；好ましくはシクロプロピル基を形成し得；

$p$ は0、1、2、3、4、5、6又は7であり；

$r$ は1、2、3、4、5、6又は7であり；

$R_2$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、シクロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール又は置換されるヘテロアリール、 $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；あるいは、二つの $R_2$ が、それらが結合する原子と一緒にあって、任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；好ましくはシクロアルキル基、置換されるシクロアルキル基、複素環基、置換される複素環基、アリール基、置換されるアリール基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基を形成し得；

各 $R_3$ 及び $R_4$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；

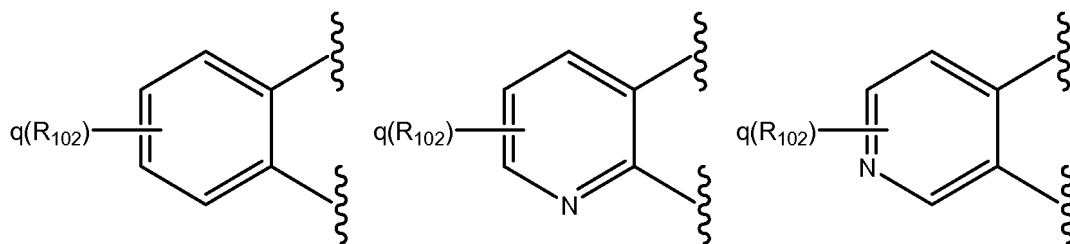
各 $R_{140}$ は独立して、ハロゲン、 $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)R_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択される、

を有する化合物又はその薬学的に許容され得る塩、エステル若しくはプロドラッグ。

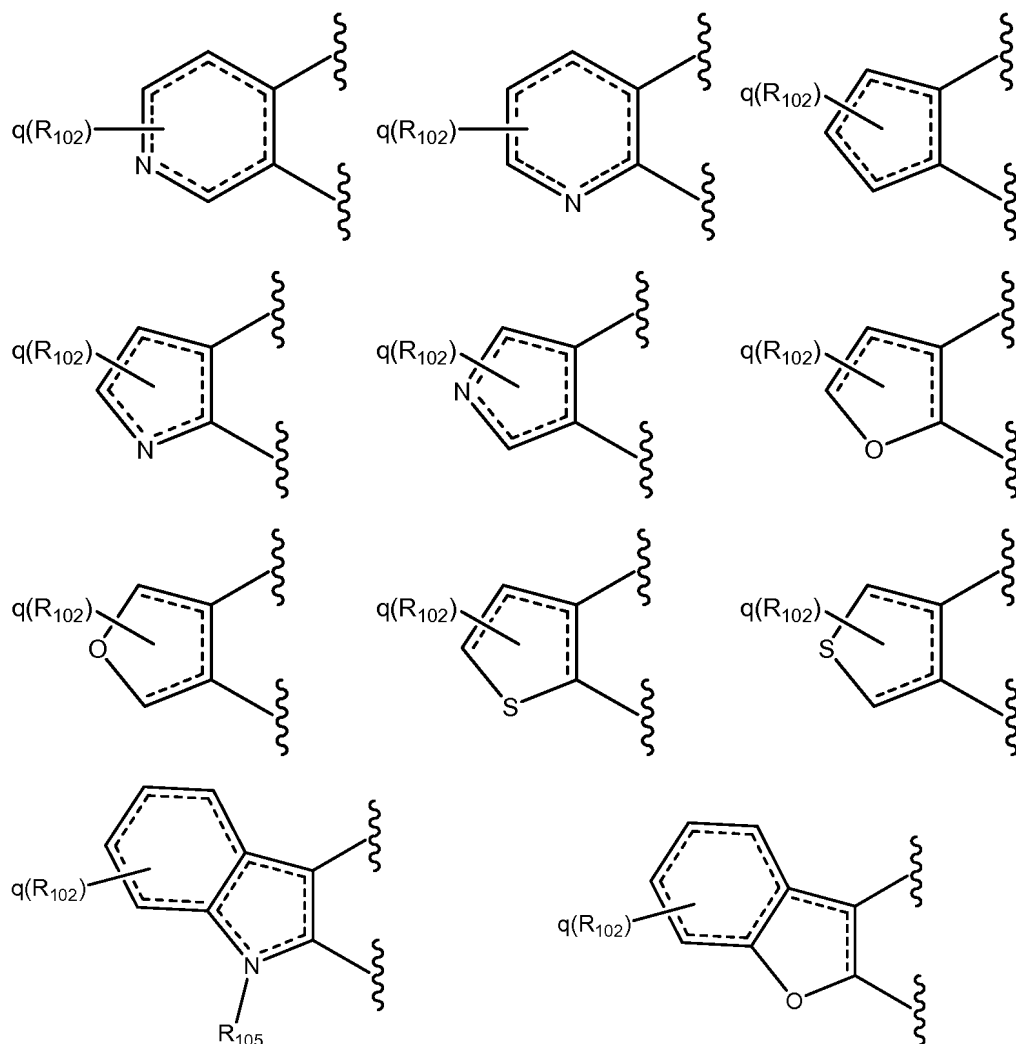
【請求項17】

Cy2が、

## 【化 2 2】



## 【化 2 3】



式中、 $q$ は0、1、2、3、4又は5であり；

各 $R_{102}$ は、独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、炭素環、置換される炭素環、アリール、置換されるアリール、 $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ であり；あるいは二つの $R_{102}$ 基が、それらが結合する原子及び任意の介在原子と一緒にあって、さらなる任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；

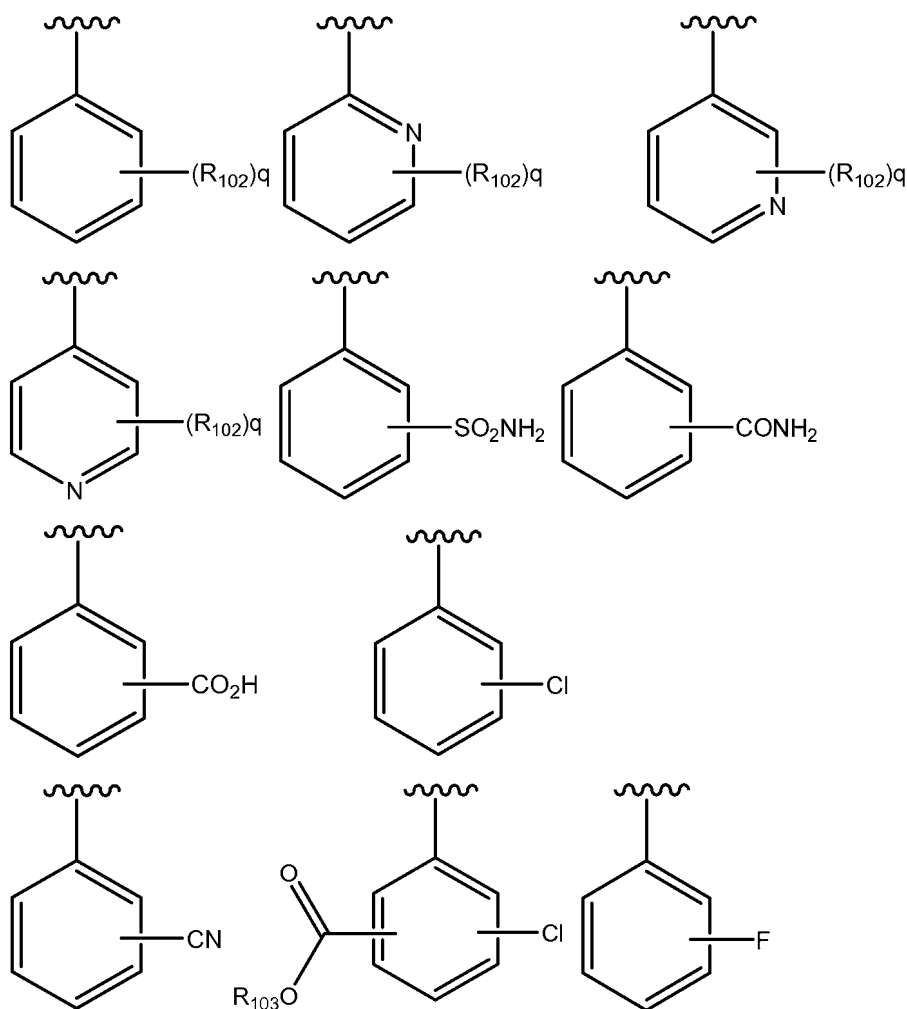
$R_{105}$ は、水素、重水素、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリールである、

から選択される、請求項13～15のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 18】

Cy1が、      

## 【化 2 4】



式中、qは0、1、2、3、4又は5であり；

各R<sub>102</sub>は、      水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、炭素環、置換される炭素環、アリール、置換されるアリール、-OR<sub>100</sub>、-SR<sub>100</sub>、-NR<sub>100</sub>R<sub>101</sub>、-C(O)R<sub>100</sub>、-C(O)OR<sub>100</sub>、-C(O)NR<sub>100</sub>R<sub>101</sub>、-N(R<sub>100</sub>)C(O)R<sub>101</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R<sub>100</sub>、-S(O)R<sub>100</sub>、-SR<sub>100</sub>、-S(O)<sub>2</sub>N(R<sub>100</sub>)R<sub>101</sub>、-CF<sub>3</sub>、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>であり；あるいは二つのR<sub>102</sub>基が、それらが結合する原子及び任意の介在原子と一緒に、さらなる任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；及び

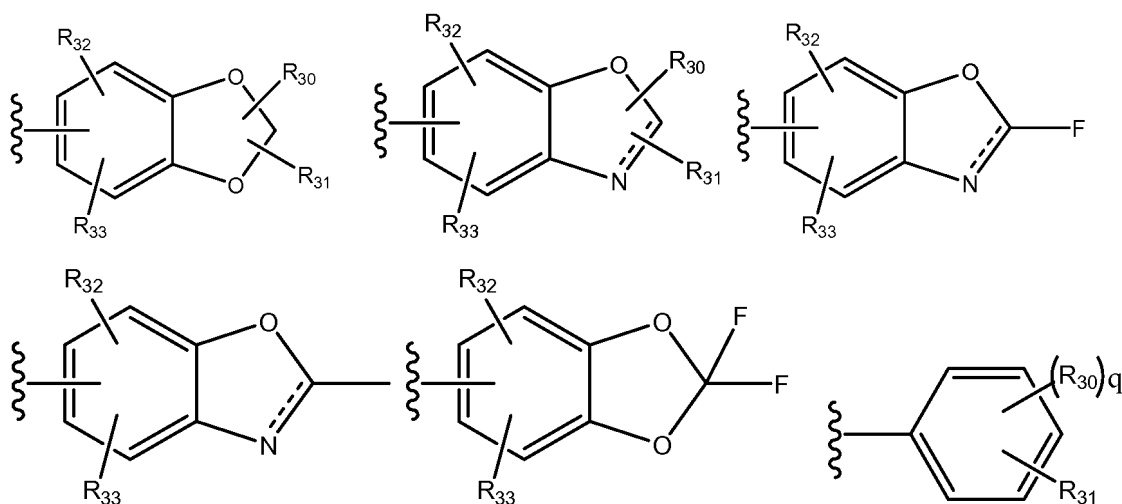
R<sub>103</sub>は、      水素、重水素、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリールである、

から選択される、請求項 1 3 ~ 1 7 のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 19】

Cy3が、

## 【化 2 5】



式中、

各 $R_{30}$ 、 $R_{31}$ 、 $R_{32}$ 及び $R_{33}$ は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、炭素環、置換される炭素環、アリール、置換されるアリール、 $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択され；あるいは $R_{30}$ 基、 $R_{31}$ 基、 $R_{32}$ 基及び $R_{33}$ 基の二つが、それらが結合する原子及び任意の介在原子と一緒に、さらなる任意に置換される3、4、5、6又は7員環を形成し得；

$q$ は0、1、2、3、4又は5である、

から選択される、請求項13又は14に記載の化合物。

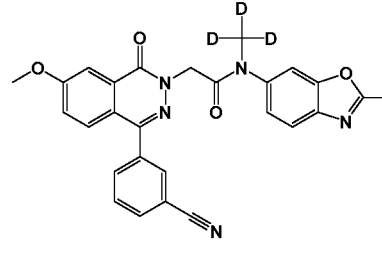
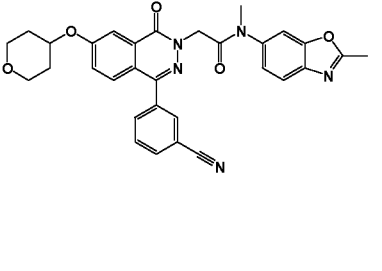
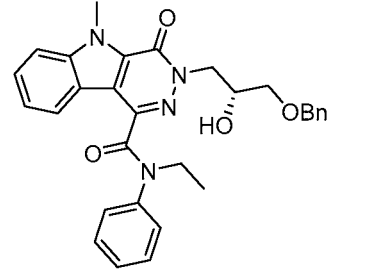
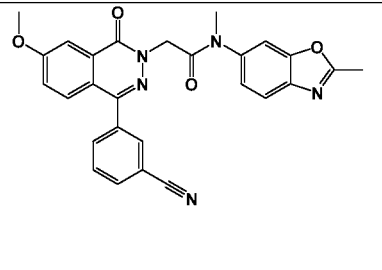
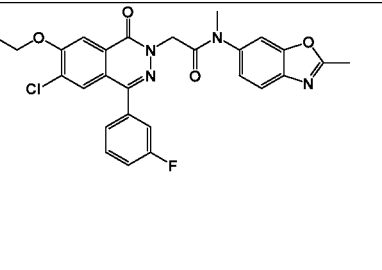
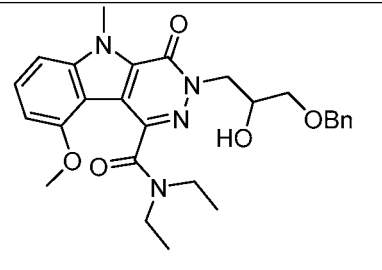
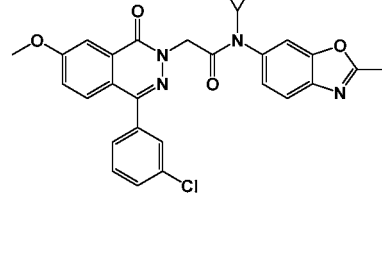
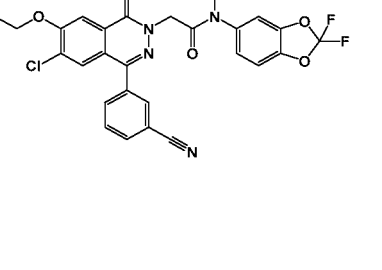
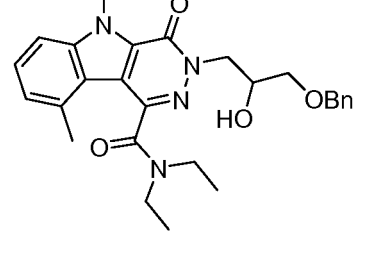
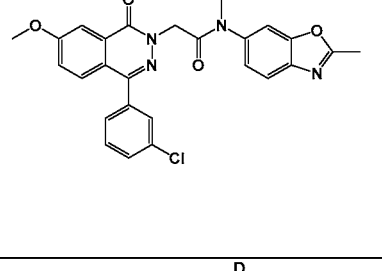
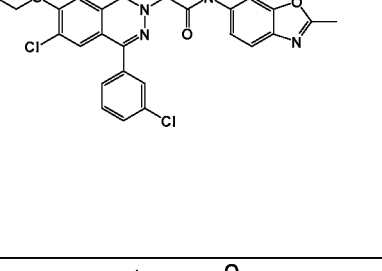
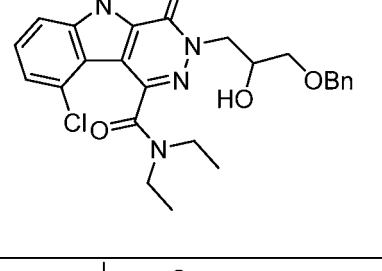
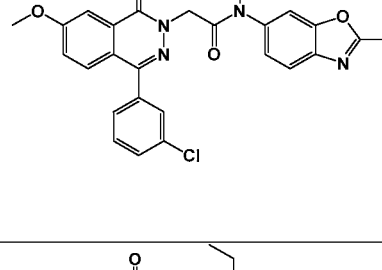
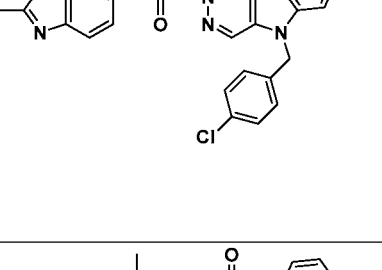
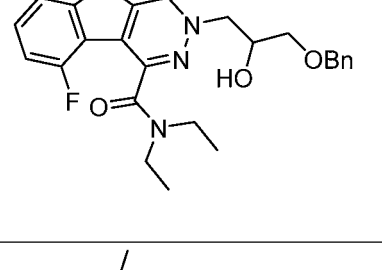
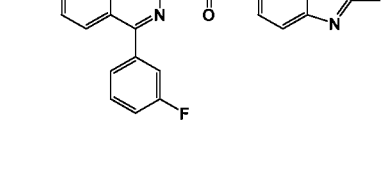
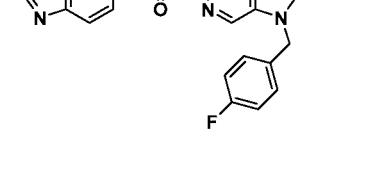
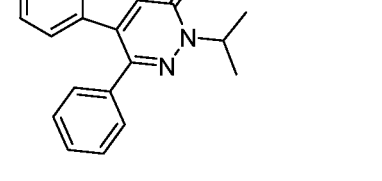
## 【請求項 20】

表A2：

## 【表 1 1】


【表 1 2】


【表 13】



【表 1 4】


【表 15】


【表 16】


【表 17】


から選択される化合物又はその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 21】

表A3：

【表 18】

表A3


【表 19】


から選択される化合物又はその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 22】

請求項 1 ~ 21 のいずれかに記載の化合物及び薬学的に許容有れ得る担体又は賦形剤を含有する医薬組成物。

【請求項 23】

囊胞性線維症膜貫通コンダクタンス制御因子(CFTR)が媒介する疾患又は障害を治療するための、請求項 22 に記載の医薬組成物。

【請求項 24】

前記疾患又は障害が、囊胞性線維症、遺伝性肺気腫、遺伝性ヘモクロマトーシス、凝固-線維素溶解欠損症(coagulation-fibrinolysis deficiencies)、1型遺伝性血管浮腫、家族性高コレステロール血症などの脂質処理欠損症(lipid processing deficiencies)、1型乳糜血症(type 1 chylomicronemia)、無-リポ蛋白血症、1細胞病/偽性フルーナーなどのリソソーム蓄積症、ムコ多糖症、サンドホフ/テイ-サックス、クリグラー-ナジャーII型、多発性内分泌腺症/高インスリン血症(hyperinsulemia)、真性糖尿病、ラロン型小人症、ミエロペルオキシダーゼ欠損症、原発性(primary)副甲状腺機能低下症、メラノーマ、グリカノーシス(glycanosis)CDG 1型、先天性甲状腺機能亢進症、骨形成不全症、遺伝性低フィブリノゲン血症、ACT欠損症、尿崩症(DI)、下垂体性(neurophyseal)DI、腎性尿崩症(neprogenic DI)、シャルコーマリートゥース症候群、ペリツェウスメルツバッハー病(perlizaesus-merzbacher disease)、アルツハイマー病などの神経変性疾患、パーキンソン病、筋萎縮性側索硬化症、進行性核上性麻痺、ピック病、ハンチントン病などのいくつかのポリグルタミン神経障害(polyglutamine neurological disorder)、脊髄小脳失調症I型(Spinocerebellar ataxia type I)、脊髄球性筋萎縮症、歯状核赤核淡蒼球ルイ体(Dentororubal pallidoluysian)、及び筋強直性ジストロフィー(Myotonic dystrophy)、並びに遺伝性クロイツフェルト-ヤコブ病などの海綿状脳障害、ファブリー病、シュトロイスラー-シャインカー病、分泌性下痢、多発性囊胞腎疾患、慢性閉塞性肺疾患(COPD)、ドライアイ疾患、又はシェーグレン症候群から選択される、請求項 23 に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

囊胞性線維症又はその症状を治療するための、請求項 22 に記載の医薬組成物。

【請求項 26】

請求項 1 ~ 21 のいずれかに記載の化合物並びにゲンタマイシン、アタルレン(Ataluren)、アイバカフトール(カリデコ(Kalydeco))及びVX-809から選択される化合物又はそれらの組み合わせを含有する組成物。