

【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 07 D 237/14	(2006.01)
C 07 D 401/04	(2006.01)
C 07 D 403/04	(2006.01)
C 07 D 405/04	(2006.01)
C 07 D 405/14	(2006.01)
C 07 D 413/14	(2006.01)
C 07 D 413/12	(2006.01)
A 61 K 31/502	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
A 61 P 11/00	(2006.01)
A 61 P 7/02	(2006.01)
A 61 P 3/06	(2006.01)
A 61 P 3/00	(2006.01)
A 61 P 5/14	(2006.01)
A 61 P 5/18	(2006.01)
A 61 P 3/10	(2006.01)
A 61 P 19/08	(2006.01)
A 61 P 13/02	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 25/16	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 21/04	(2006.01)

【F I】

C 07 D 237/14	C S P
C 07 D 401/04	
C 07 D 403/04	
C 07 D 405/04	
C 07 D 405/14	
C 07 D 413/14	
C 07 D 413/12	
A 61 K 31/502	
A 61 K 31/506	
A 61 P 11/00	
A 61 P 7/02	
A 61 P 3/06	
A 61 P 3/00	
A 61 P 5/14	
A 61 P 5/18	
A 61 P 3/10	
A 61 P 19/08	
A 61 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

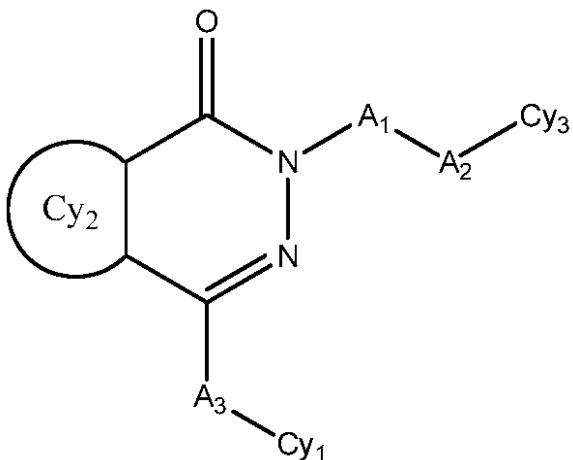
【補正の内容】

【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；

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；

Cy₁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；

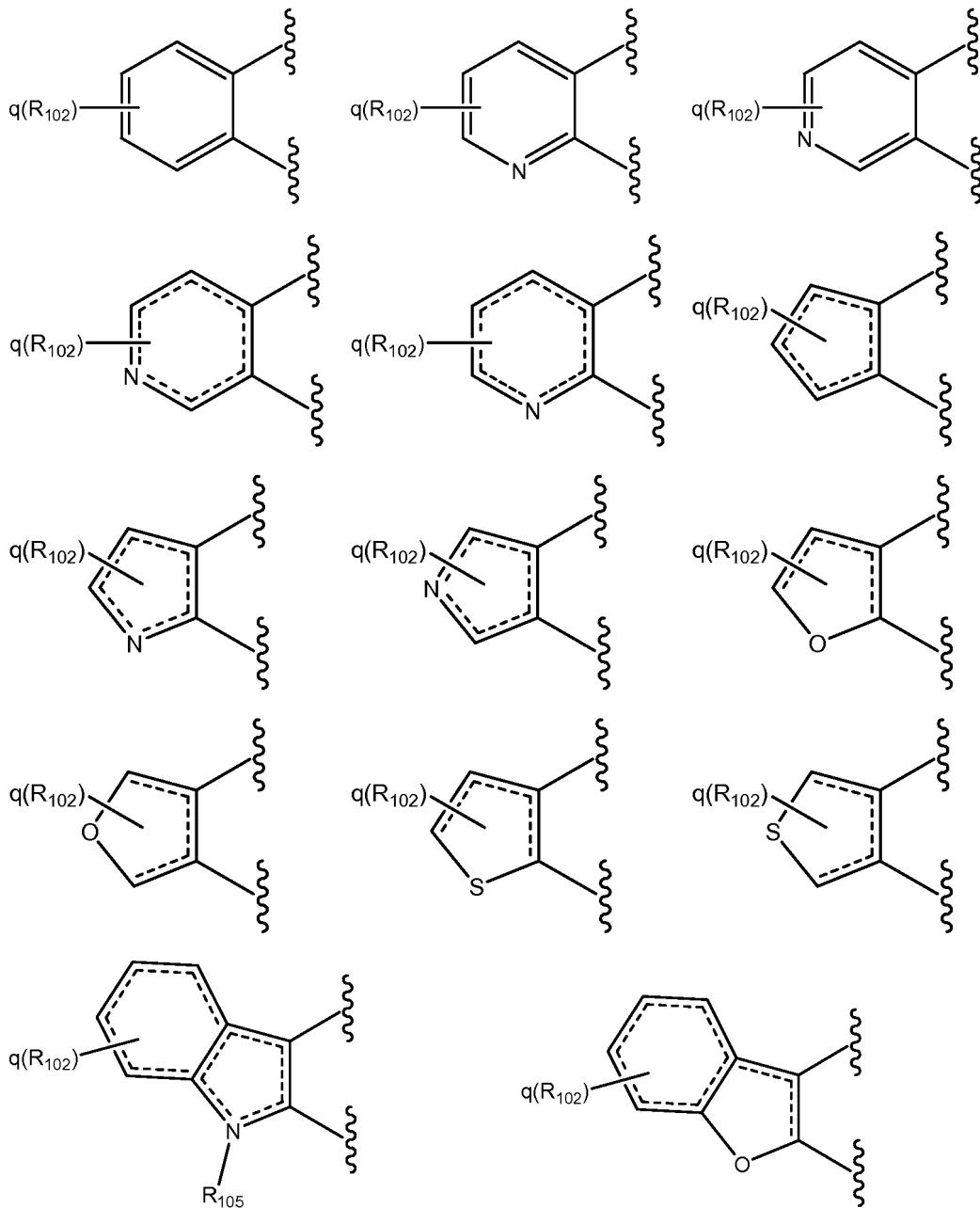
Cy₃は非存在であるか、1、2又は3環を有する、アリール基、置換されるアリール基、炭素環基、置換される炭素環基、ヘテロシクリル基、置換されるヘテロシクリル基、ヘテロアリール基又は置換されるヘテロアリール基である、

の化合物。

【請求項2】

Cy₂が、

【化2】



式中、qは0、1、2、3、4又は5であり；

各R₁₀₂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、-OR₁₀₀、-SR₁₀₀、-NR₁₀₀R₁₀₁、-C(O)R₁₀₀、-C(O)OR₁₀₀、-C(O)NR₁₀₀R₁₀₁、-N(R₁₀₀)C(O)R₁₀₁、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)R₁₀₀、-SR₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)R₁₀₁、-CF₃、-CN、-NO₂、-N₃であり；あるいは二つのR₁₀₂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；

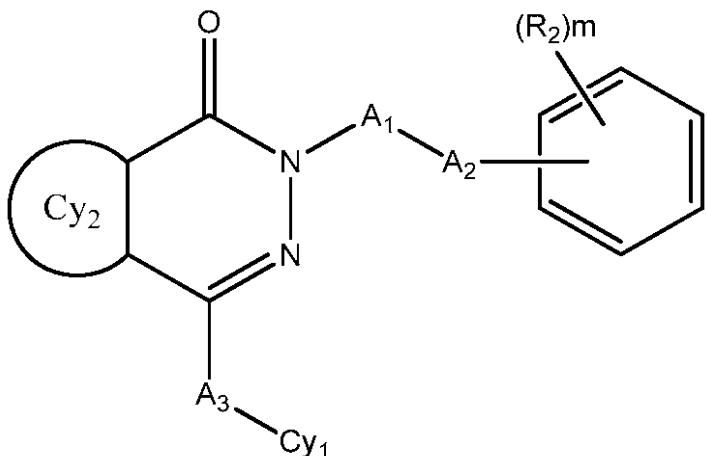
R_{105} は、水素、重水素、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリールである、

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；

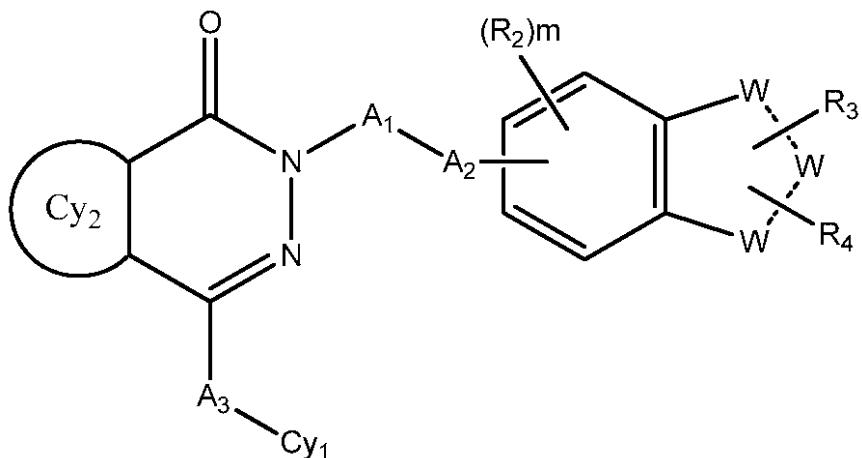
各 R_2 は、独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、シクロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール又は置換されるヘテロアリール、-OR₁₀₀、-SR₁₀₀、-NR₁₀₀R₁₀₁、-C(O)R₁₀₀、-C(O)OR₁₀₀、-C(O)NR₁₀₀R₁₀₁、-N(R₁₀₀)C(O)R₁₀₁、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)₂R₁₀₀、-SR₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)(R₁₀₁)、-CF₃、-CN、-NO₂、-N₃から選択され；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、CR₁₀₀、C(O)、N、NR₁₀₀、O、S、SO又はSO₂であり；

各R₃及びR₄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-OR₁₀₀、-SR₁₀₀、-NR₁₀₀R₁₀₁、-C(O)R₁₀₀、-C(O)OR₁₀₀、-C(O)NR₁₀₀R₁₀₁、-N(R₁₀₀)C(O)R₁₀₁、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)R₁₀₀、-SR₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)R₁₀₁、-CF₃、-CN、-NO₂、-N₃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】

A₁がC(R₁₀₀)(R₁₀₁)であり、A₂が-C(O)N(R₁₀₀)-である、請求項1～4いずれかに記載の化合物。

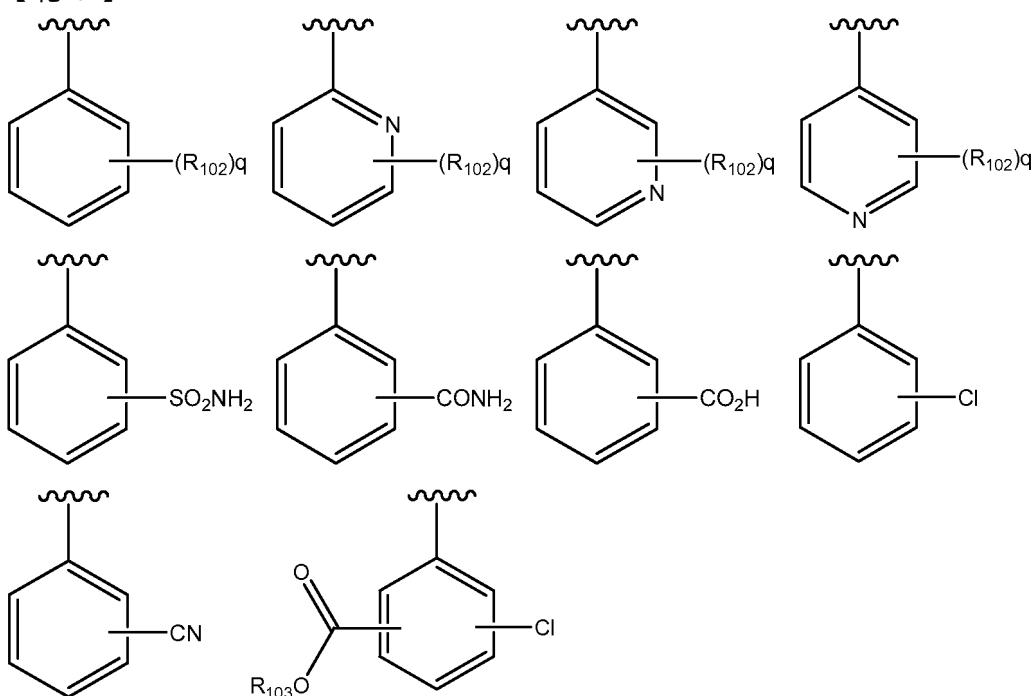
【請求項6】

A₃が非存在、-[C(R₁₀₀)(R₁₀₁)]n-、-C(O)-、-C(O)N(R₁₀₀)又は-C(O)N(R₁₀₀)(R₁₀₁)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R₁₀₂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、-OR₁₀₀、-SR₁₀₀、-NR₁₀₀R₁₀₁、-C(O)R₁₀₀、-C(O)OR₁₀₀、-C(O)NR₁₀₀R₁₀₁、-N(R₁₀₀)C(O)R₁₀₁、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)R₁₀₀、-SR₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)R₁₀₁、-CF₃、-CN、-NO₂、-N₃であり；あるいは二つのR₁₀₂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；

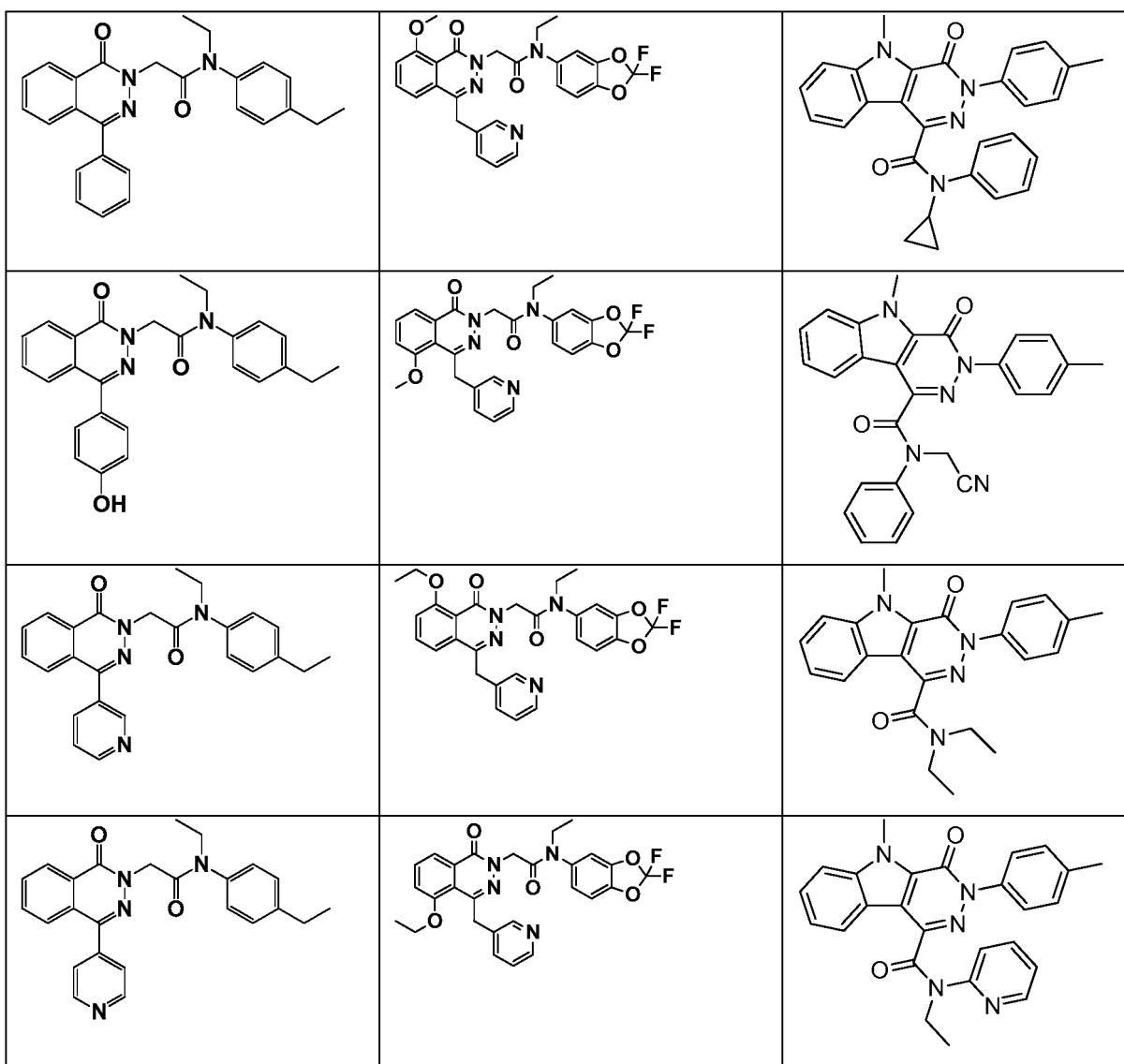
R₁₀₃は、水素、重水素、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリールである、

請求項1～6のいずれかに記載の化合物。

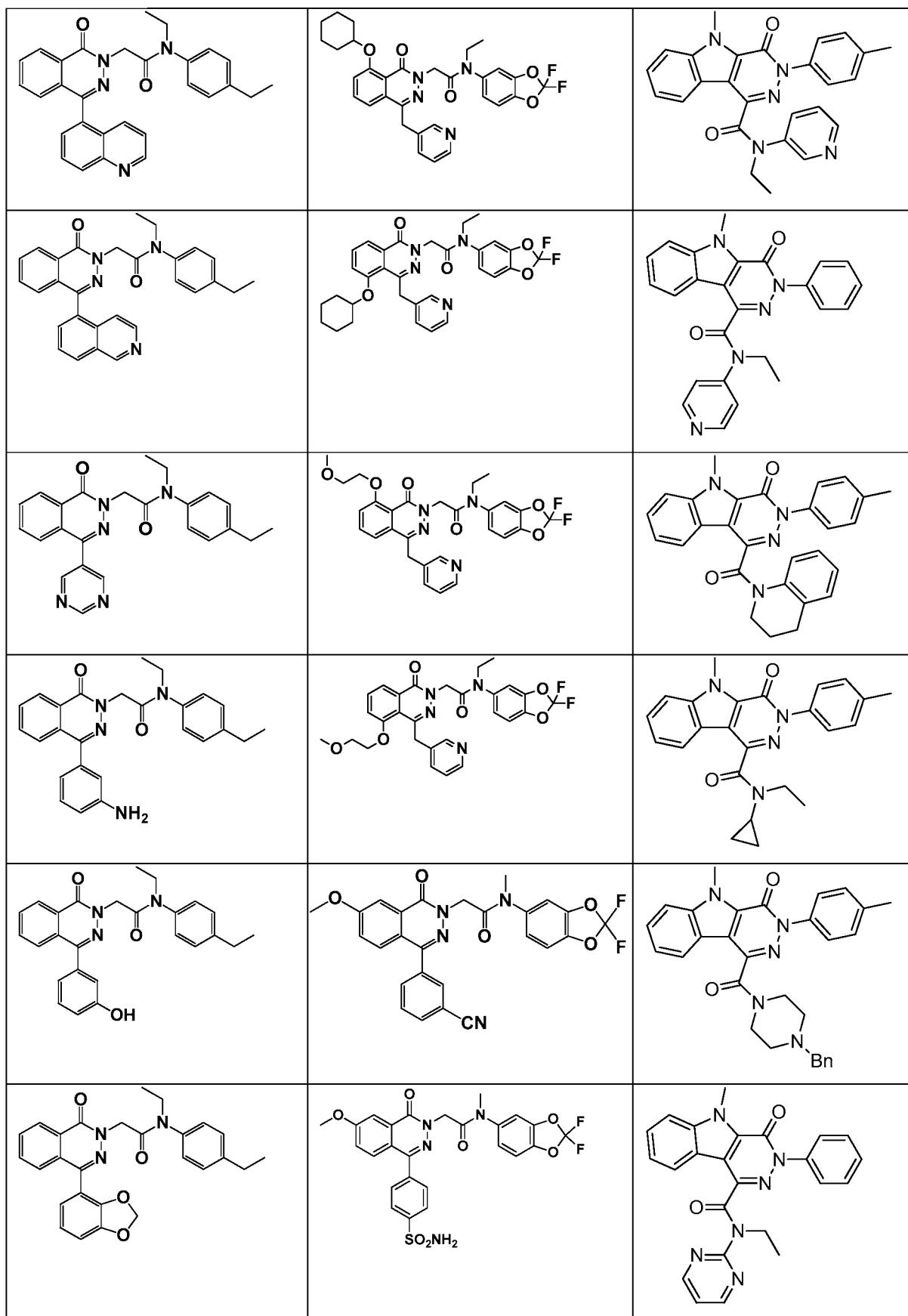
【請求項8】

表A：

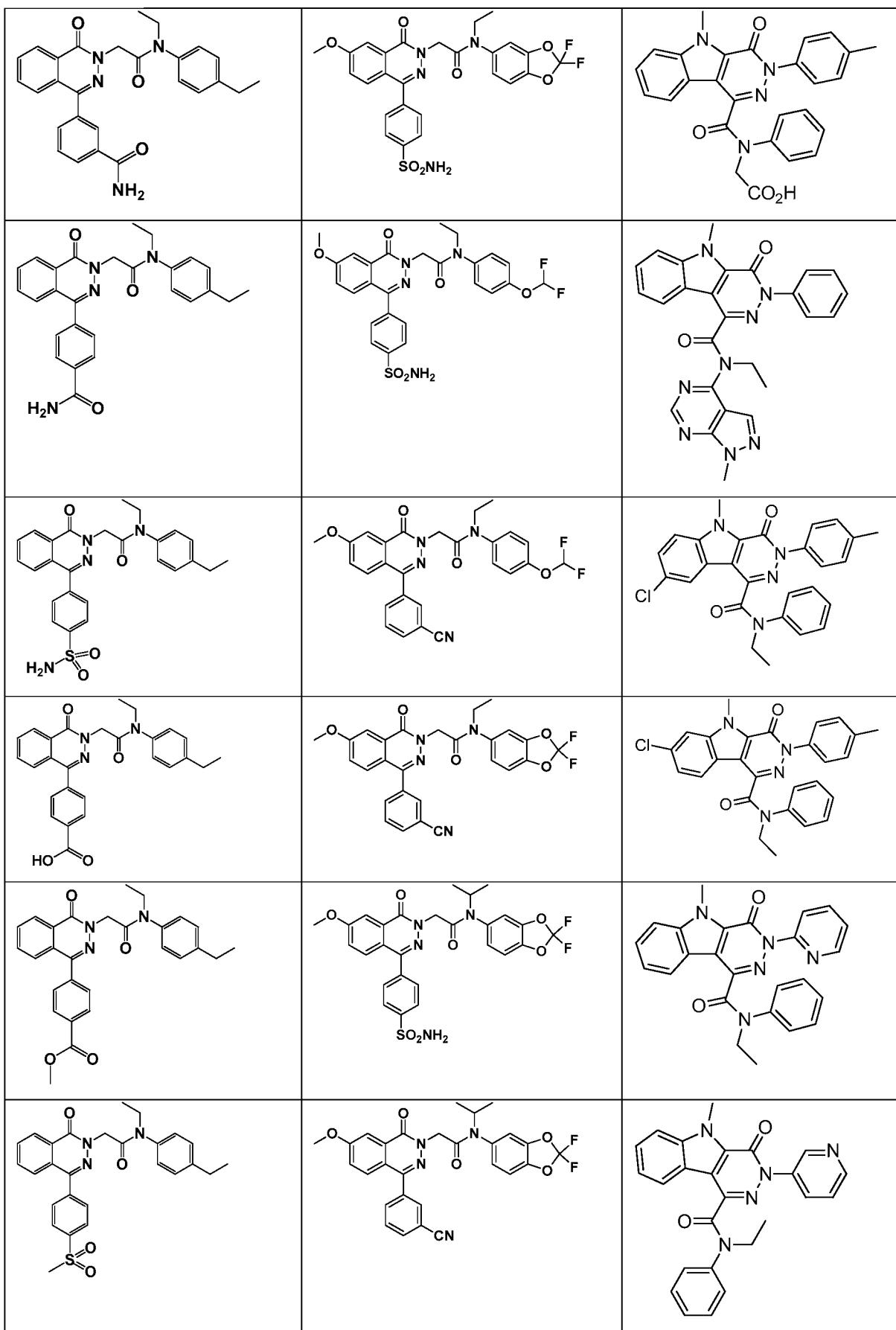
【表1】



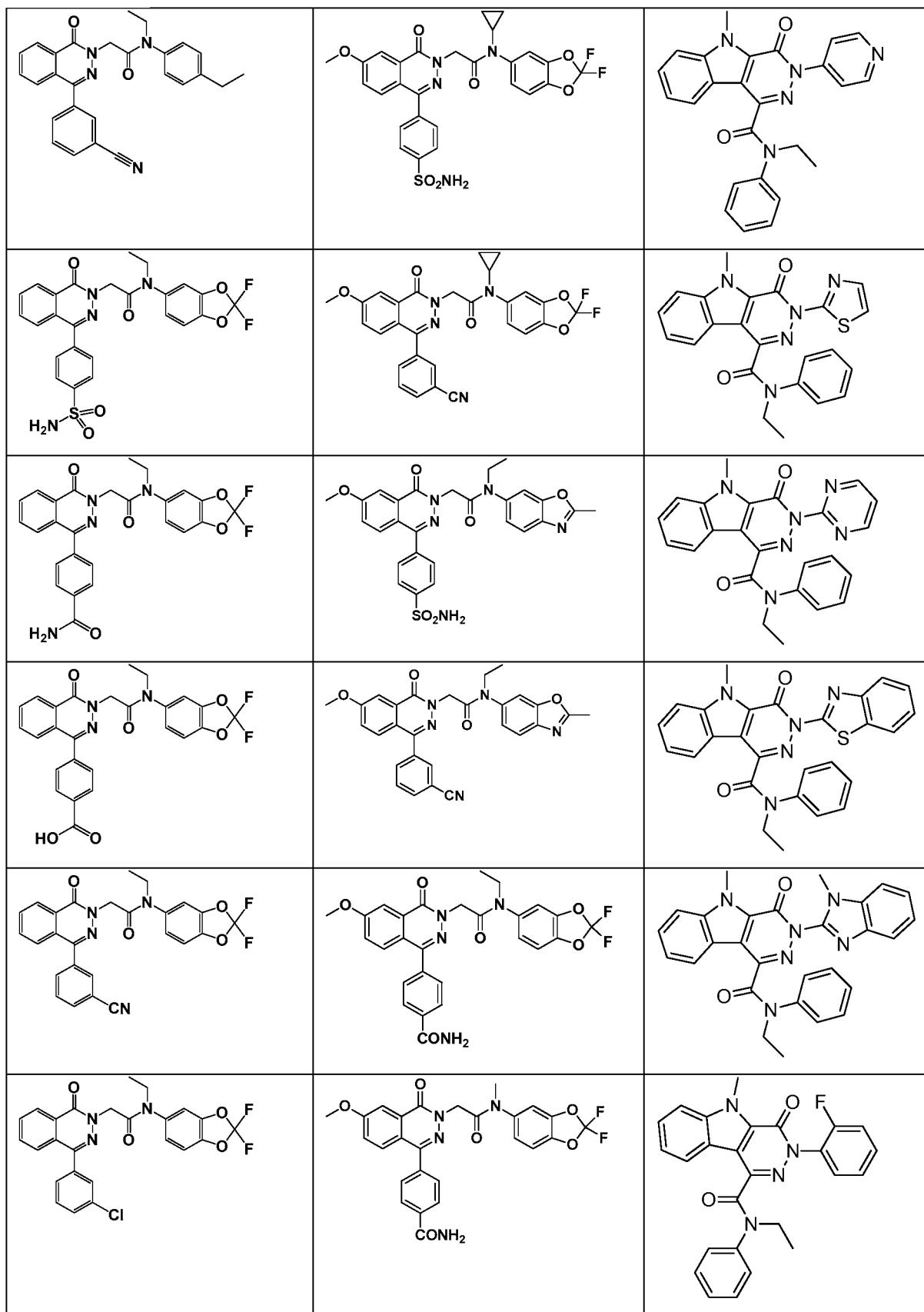
【表2】



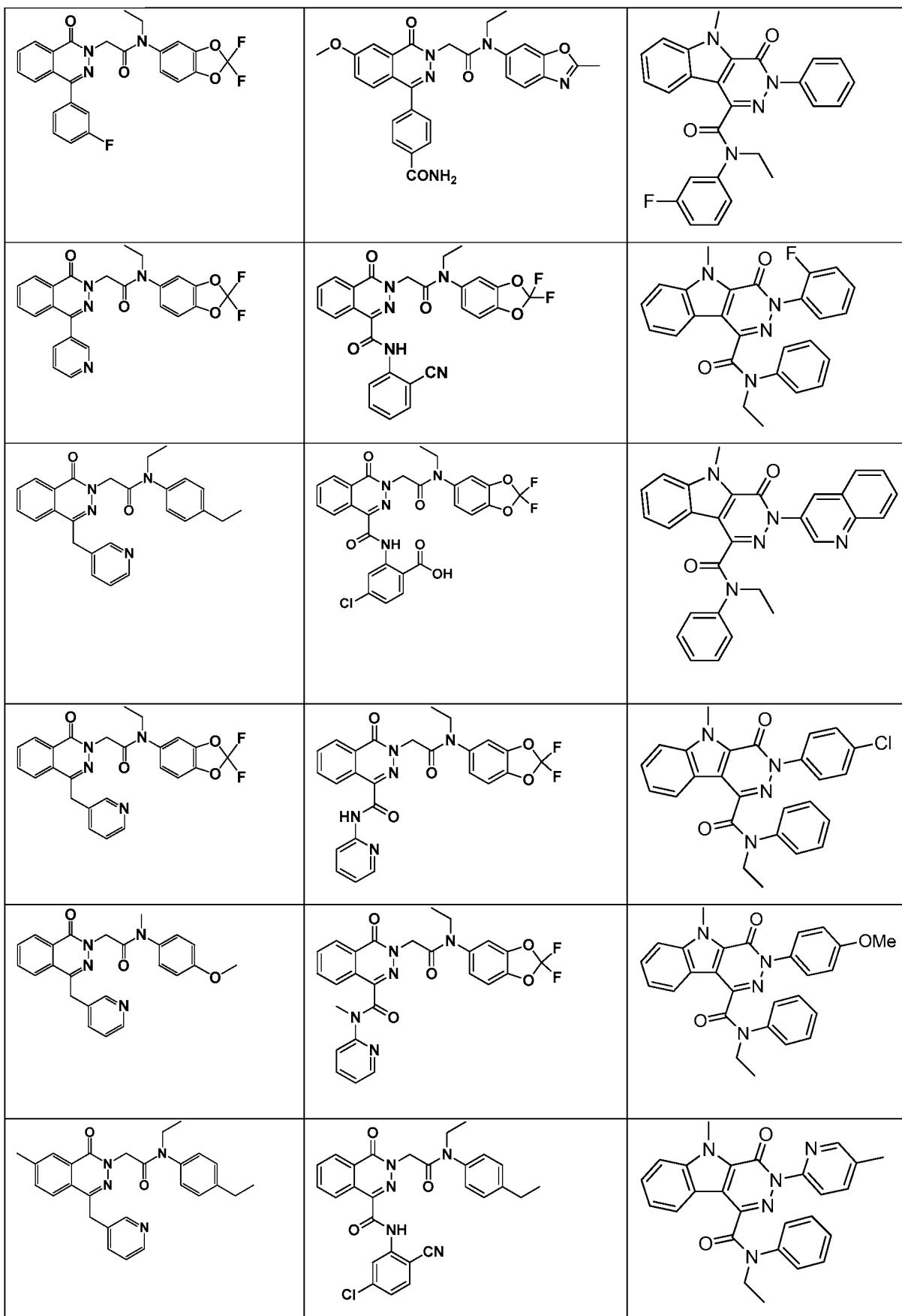
【表3】



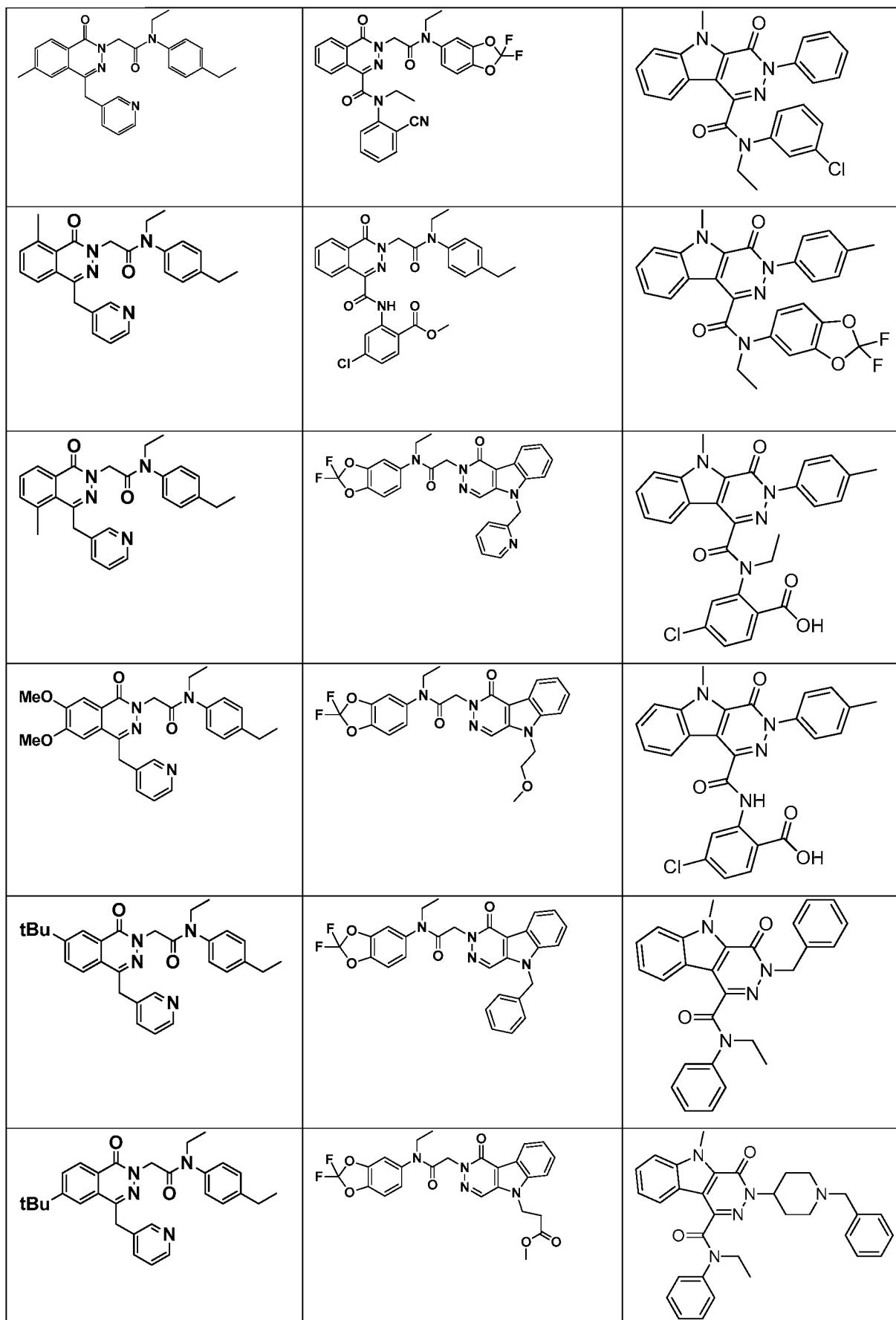
【表4】



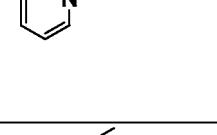
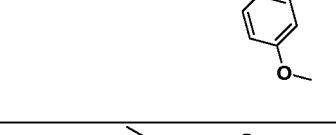
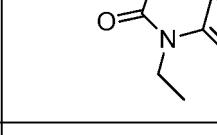
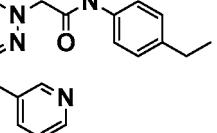
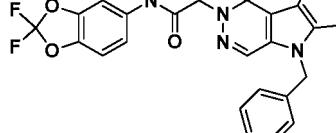
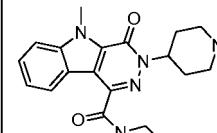
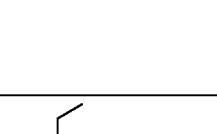
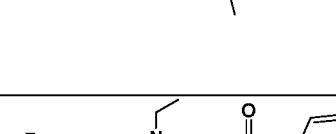
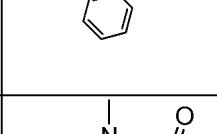
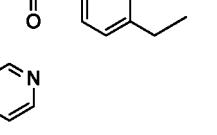
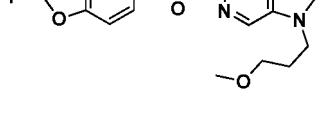
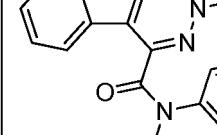
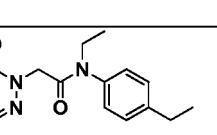
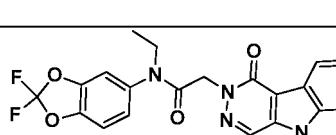
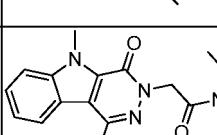
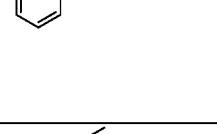
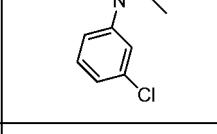
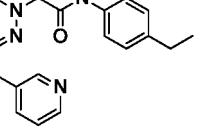
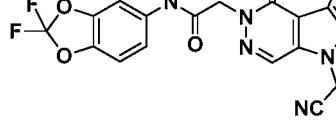
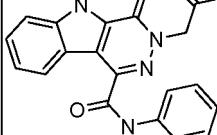
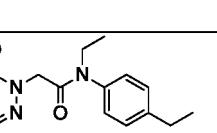
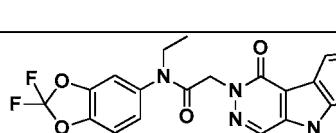
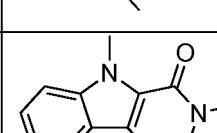
【表5】



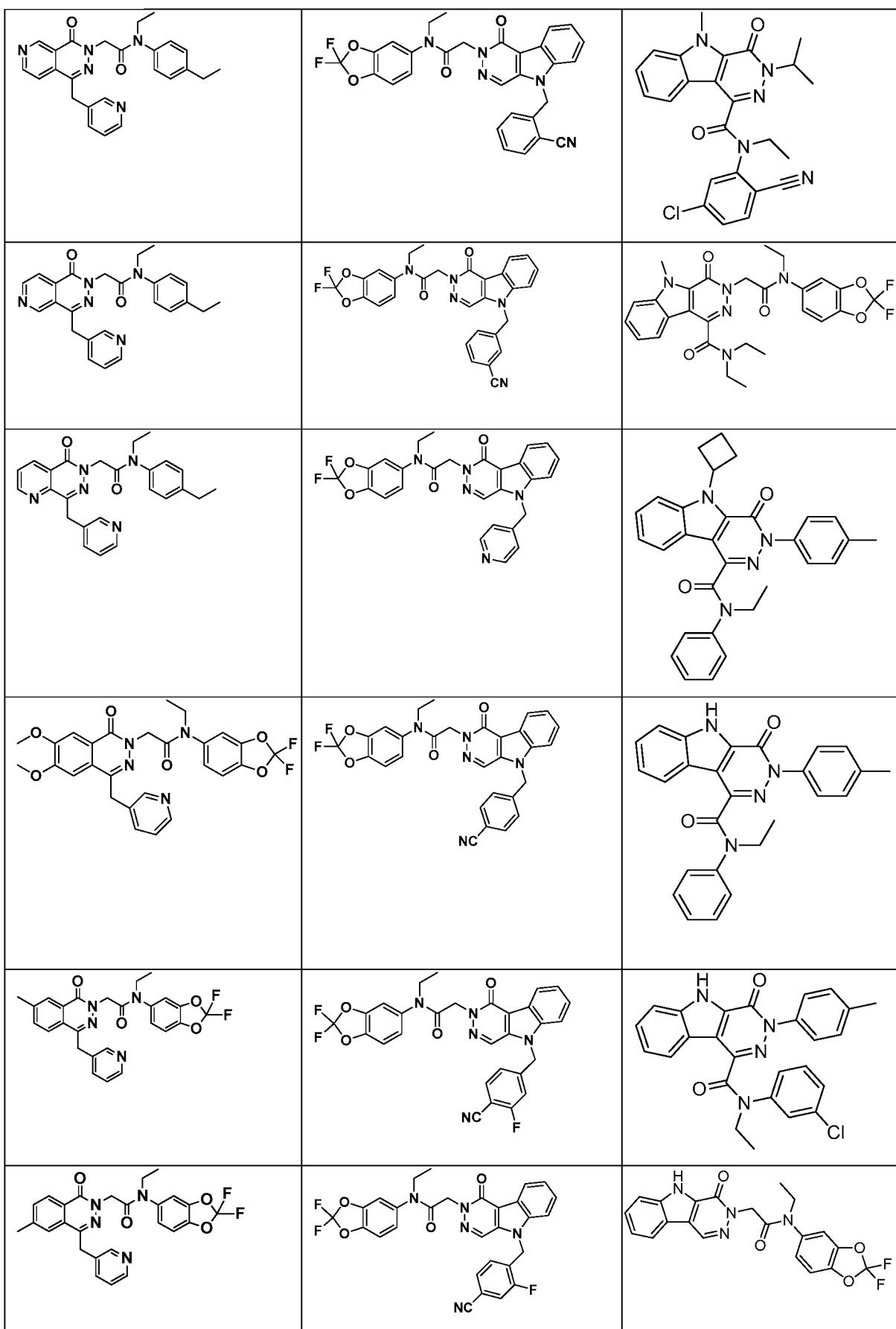
【表 6】



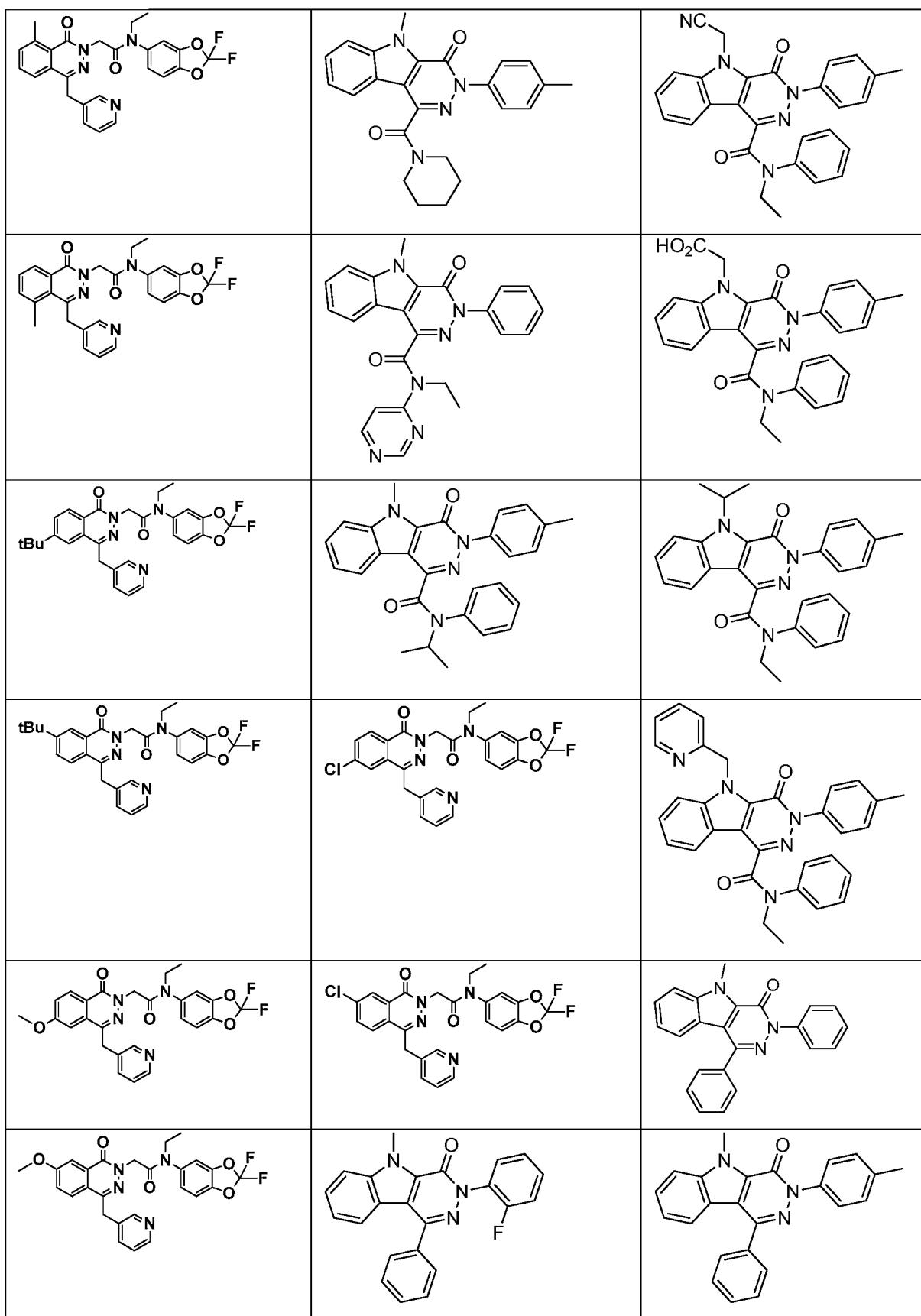
【表7】

【表8】



【表9】



【表10】

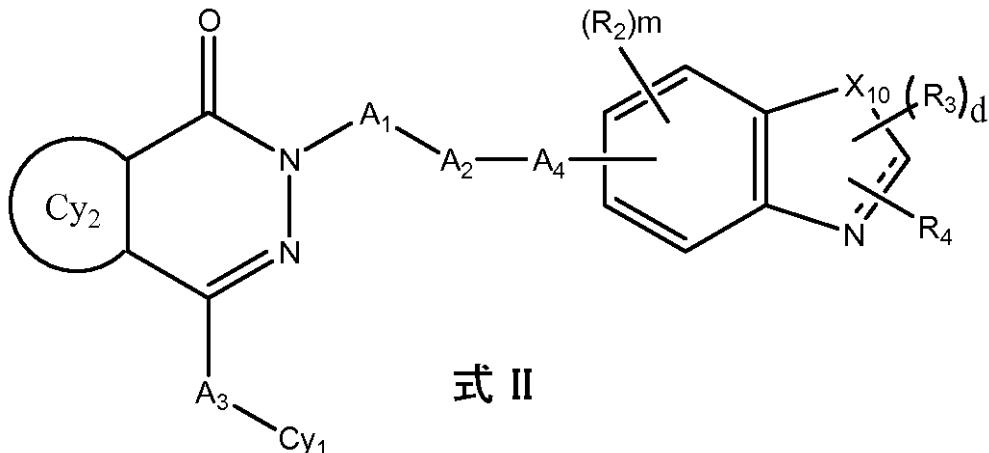


から選択される化合物。

【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；

X₁₀は、CH、CH₂、N、S又はOであり；

Cy₁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；

Cy₂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、Cy₂はC₅-C₇アリール又はヘテロアリールであり；好ましくは、Cy₂は、-OR₂₀₀、-SR₂₀₀、-C(O)R₂₀₀、-C(O)N(R₂₀₀)₂、-NC(O)R₂₀₀、-S(O)₂R₂₀₀で置換され、ここでR₂₀₀は水素、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル又はC₂-C₆アルキニルであり；

A₁は、非存在、-[C(R₁₀₀)(R₁₀₁)]n-、-C(O)-、-C(S)-、-S(O)-、-C(O)N(R₁₀₀)-、-S(O)₂N(R₁₀₀)-、-S(O)₂-、-[C(R₂₅)(R₂₆)]n-、-[C(R₂₅)(R₂₆)]n-C=C-[C(R₂₇)(R₂₈)]p、若しくは-[C(R₂₅)(R₂₆)]n-C-C-[C(R₂₇)(R₂₈)]p、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R₁₀₀及びR₁₀₁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、-OR₂₀₀、-SR₂₀₀、-C(O)R₂₀₀、-C(O)N(R₂₀₀)₂、-NC(O)R₂₀₀、-S(O)₂R₂₀₀であり、ここでR₂

R_{10} 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；

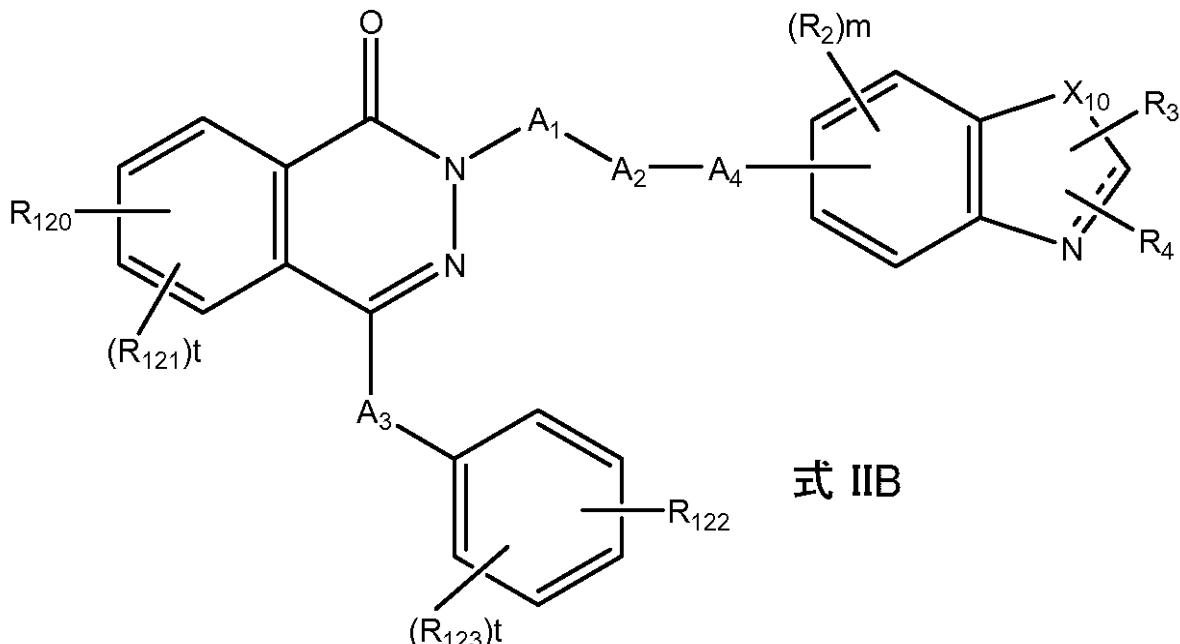
各 R_3 及び R_4 は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$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

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；

X₁₀はCH、CH₂、N、S又はOであり；

A₁は非存在、-[C(R₁₀₀)(R₁₀₁)]n-、-C(O)-、-C(S)-、-S(O)-、-C(O)N(R₁₀₀)-、-S(O)₂N(R₁₀₀)-、-S(O)₂-、-[C(R₂₅)(R₂₆)]n-、-[C(R₂₅)(R₂₆)]n-C=C-[C(R₂₇)(R₂₈)]p、若しくは-[C(R₂₅)(R₂₆)]n-C-C-[C(R₂₇)(R₂₈)]p、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R₁₀₀及びR₁₀₁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、-OR₂₀₀、-SR₂₀₀、-C(O)R₂₀₀、-C(O)N(R₂₀₀)₂、-NC(O)R₂₀₀、-S(O)₂R₂₀₀であって、ここでR₂₀₀は水素、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル又はC₂-C₆アルキニルであり；あるいはR₁₀₀基及びR₁₀₁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；

A₂は非存在又は-[C(R₁₀₀)(R₁₀₁)]n-、-C(O)-、-C(S)-、-S(O)-、-C(O)N(R₁₀₀)-、-C(O)N(R₁₀₀)(R₁₀₁)、N(R₁₀₀)(R₁₀₁)、-S(O)₂-、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)R₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)R₁₀₁、-[C(R₂₅)(R₂₆)]n-、-[C(R₂₅)(R₂₆)]n-C=C-[C(R₂₇)(R₂₈)]p若しくは-[C(R₂₅)(R₂₆)]n-C-C-[C(R₂₇)(R₂₈)]pであり；

A₃は非存在又は-[C(R₁₀₀)(R₁₀₁)]n-、-C(O)-、-C(S)-、-S(O)-、-C(O)N(R₁₀₀)-、-C(O)N(R₁₀₀)(R₁₀₁)、N(R₁₀₀)(R₁₀₁)、-S(O)₂-、S(O)₂R₁₀₀、S(O)R₁₀₀、S(O)₂N(R₁₀₀)(R₁₀₁)、-[C(R₂₅)(R₂₆)]n-、-[C(R₂₅)(R₂₆)]n-C=C-[C(R₂₇)(R₂₈)]p若しくは-[C(R₂₅)(R₂₆)]n-C-C-[C(R₂₇)(R₂₈)]pであり；

A₄は非存在又は-[C(R₂₅)(R₂₆)]n-、-[C(R₂₅)(R₂₆)]n-C=C-[C(R₂₇)(R₂₈)]p若しくは-[C(R₂₅)(R₂₆)]n-C-C-[C(R₂₇)(R₂₈)]pであり；

ここで各R₂₅、R₂₆、R₂₇及びR₂₈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R₂₅基、R₂₆基、R₂₇基及びR₂₈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；

pは0、1、2、3、4、5、6又は7であり；

R₂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-OR₁₀₀、-SR₁₀₀、-NR₁₀₀R₁₀₁、-C(O)R₁₀₀、-C(O)OR₁₀₀、-C(O)NR₁₀₀R₁₀₁、-N(R₁₀₀)C(O)R₁₀₁、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)R₁₀₀、-SR₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)R₁₀₁、-CF₃、-CN、-NO₂、-N₃から選択され；あるいは、二つのR₂が、それらが結合する原子と一緒にになって、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R₃及びR₄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-OR₁₀₀、-SR₁₀₀、-NR₁₀₀R₁₀₁、-C(O)R₁₀₀、-C(O)OR₁₀₀、-C(O)NR₁₀₀R₁₀₁、-N(R₁₀₀)C(O)R₁₀₁、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)R₁₀₀、-SR₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)R₁₀₁、-CF₃、-CN、-NO₂、及び-N₃から選択され；

R₁₂₀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-OR₁₀₀、-SR₁₀₀、-NR₁₀₀R₁₀₁、-C(O)R₁₀₀、-C(O)OR₁₀₀、-C(O)NR₁₀₀R₁₀₁、-N(R₁₀₀)C(O)R₁₀₁、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)R₁₀₀、-SR₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)R₁₀₁、-CF₃、-CN、-NO₂、-N₃から選択され；

各R₁₂₁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-OR₁₀₀、-SR₁₀₀、-NR₁₀₀R₁₀₁、-C(O)R₁₀₀、-C(O)OR₁₀₀、-C(O)NR₁₀₀R₁₀₁、-N(R₁₀₀)C(O)R₁₀₁、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)R₁₀₀、-SR₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)R₁₀₁、-CF₃、-CN、-NO₂、-N₃から選択され；

R₁₂₂は、ハロゲン又は-CNであり；

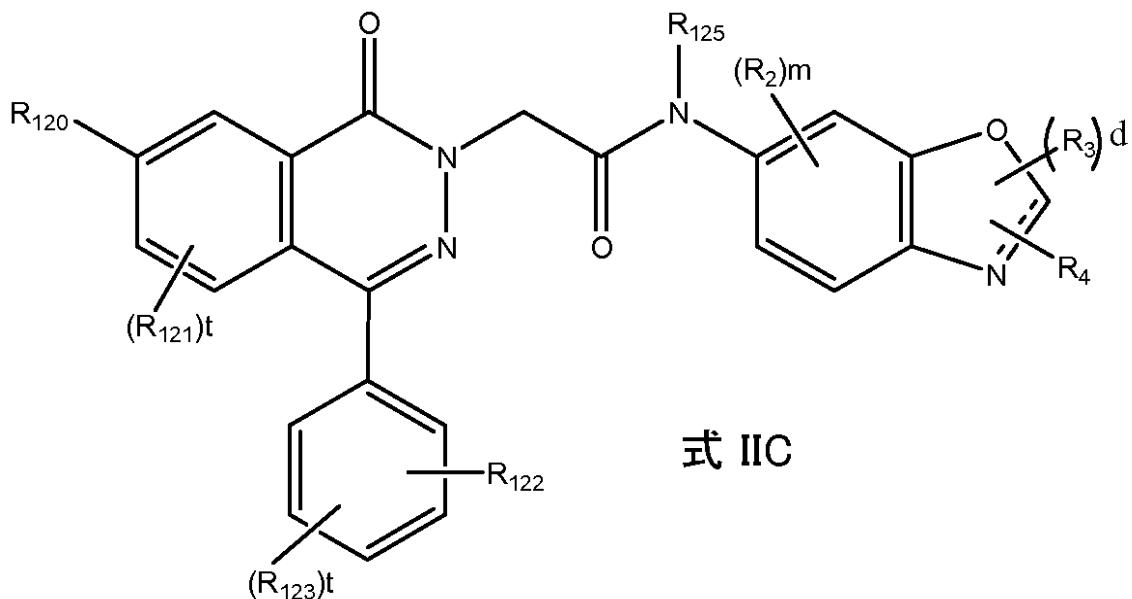
各R₁₂₃は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール、又は-OR₁₀₀、-SR₁₀₀、-NR₁₀₀R₁₀₁、-C(O)R₁₀₀、-C(O)OR₁₀₀、-C(O)NR₁₀₀R₁₀₁、-N(R₁₀₀)C(O)R₁₀₁、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)R₁₀₀、-SR₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)R₁₀₁、-CF₃、-CN、-NO₂、-N₃から選択される、

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 1 1】

式 IIC:

【化11】



式中、

【化12】

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；

R₂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、-OR₁₀₀、-SR₁₀₀、-NR₁₀₀R₁₀₁、-C(O)R₁₀₀、-C(O)OR₁₀₀、-C(O)NR₁₀₀R₁₀₁、-N(R₁₀₀)C(O)R₁₀₁、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)R₁₀₀、-SR₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)R₁₀₁、-CF₃、-CN、-NO₂、-N₃から選択され；あるいは、二つのR₂が、それらが結合する原子と一緒にになって、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R₃及びR₄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-OR₁₀₀、-SR₁₀₀、-NR₁₀₀R₁₀₁、-C(O)R₁₀₀、-C(O)OR₁₀₀、-C(O)NR₁₀₀R₁₀₁、-N(R₁₀₀)C(O)R₁₀₁、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)R₁₀₀、-SR₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)R₁₀₁、-CF₃、-CN、-NO₂、-N₃から選択され；

R₁₂₀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-OR₁₀₀、-SR₁₀₀、-NR₁₀₀R₁₀₁、-C(O)R₁₀₀、-C(O)OR₁₀₀、-C(O)NR₁₀₀R₁₀₁、-N(R₁₀₀)C(O)R₁₀₁、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)R₁₀₀、-SR₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)R₁₀₁、-CF₃、-CN、-NO₂、-N₃から選択され；

各R₁₂₁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-OR₁₀₀、-SR₁₀₀、-NR₁₀₀R₁₀₁、-C(O)R₁₀₀、-C(O)OR₁₀₀、-C(O)NR₁₀₀R₁₀₁、-N(R₁₀₀)C(O)R₁₀₁、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)R₁₀₀、-SR₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)R₁₀₁、-CF₃、-CN、-NO₂、-N₃から選択され；

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；

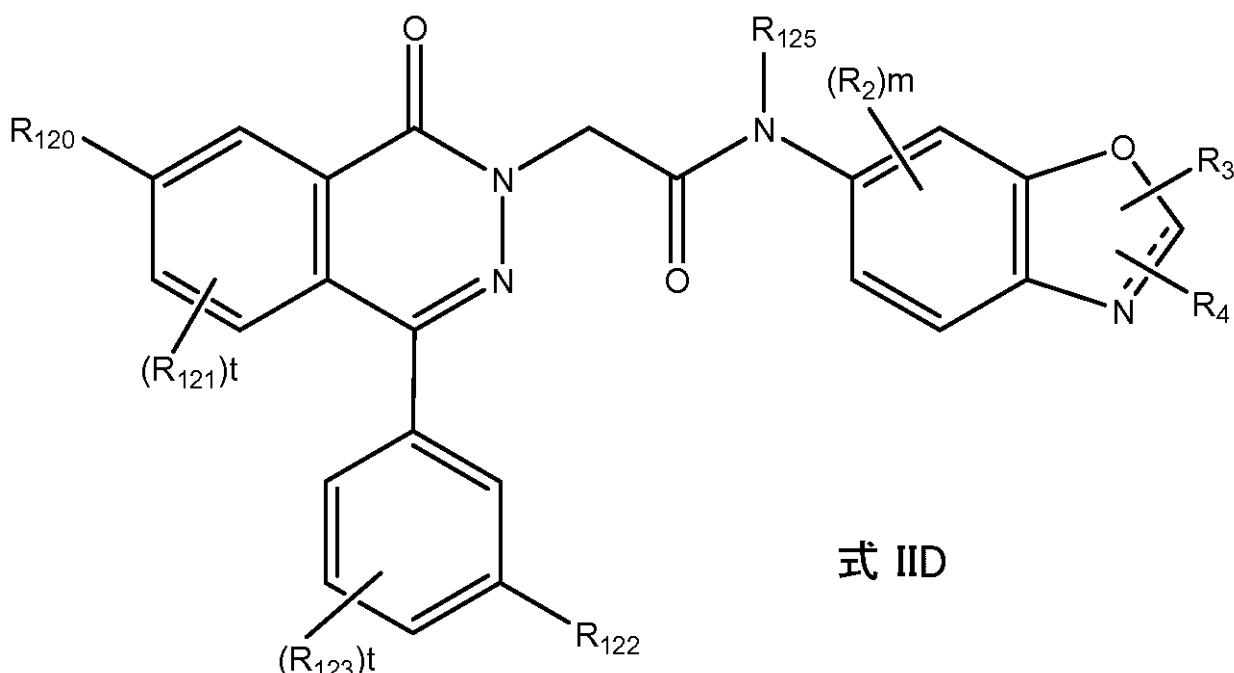
ここで各 R_{100} 及び R_{101} は水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、ヘテロアルキル、置換されるヘテロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリール、 $-OR_{200}$ 、 $-SR_{200}$ 、 $-C(O)R_{200}$ 、 $-C(O)N(R_{200})_2$ 、 $-NC(O)R_{200}$ 、 $-S(O)_2R_{200}$ であり、ここで R_{200} は、水素、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル又はC₂-C₆アルキニルであり；あるいは 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 1 2】

式 IID :

【化 1 3】



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、-OR₁₀₀、-SR₁₀₀、-NR₁₀₀R₁₀₁、-C(O)R₁₀₀、-C(O)OR₁₀₀、-C(O)NR₁₀₀R₁₀₁、-N(R₁₀₀)C(O)R₁₀₁、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)R₁₀₀、-SR₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)R₁₀₁、-CF₃、-CN、-NO₂、-N₃から選択され；あるいは、二つのR₂が、それらが結合する原子と一緒にになって、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R₃及びR₄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；

R₁₂₀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R₁₂₁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；

R₁₂₂は、ハロゲン、-CN、SO₂NH₂、CONH₂、CO₂H、-CH₃、OCH₃、-OR₁₀₀であり；

各R₁₂₃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、

R₁₂₅は、アルキル又は置換されるアルキルであり；

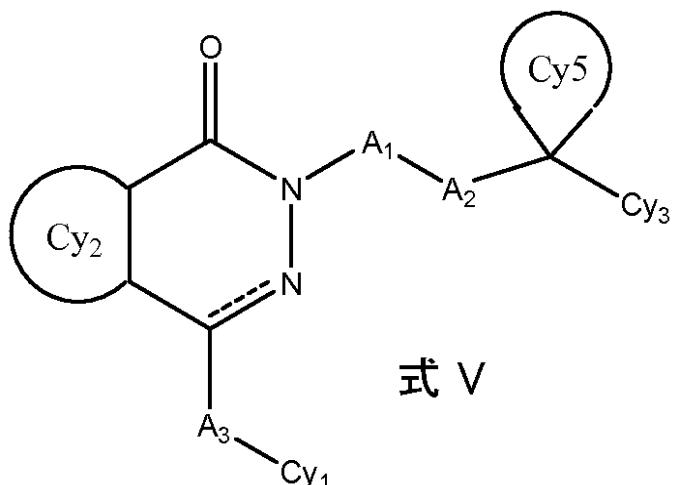
ここで各R₁₀₀及びR₁₀₁は、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、ヘテロアルキル、置換されるヘテロアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリール、 $-OR_{200}$ 、 $-SR_{200}$ 、 $-C(O)R_{200}$ 、 $-C(O)N(R_{200})_2$ 、 $NC(O)R_{200}$ 、 $-S(O)_2R_{200}$ であり、ここでR₂₀₀は水素、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル又はC₂-C₆アルキニルであり；あるいはR₁₀₀基及びR₁₀₁基の二つが、それらに結合した原子及び任意の介在原子と一緒にになって、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 1 3】

式V:

【化15】



式中、

【化16】

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；

Cy₁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；Cy₂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；A₁は、非存在、-[C(R₁₀₀)(R₁₀₁)]n-、-C(O)-、-C(S)-、-S(O)-、-C(O)N(R₁₀₀)-、-S(O)₂N(R₁₀₀)-、-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；ここでnは0、1、2、3、4、5、6又は7であり；好ましくは、Cy₂は、C₅-C₇アリール又はヘテロアリールであり；好ましくは、Cy₂は、-OR₂₀₀、-SR₂₀₀、-C(O)R₂₀₀、-C(O)N(R₂₀₀)₂、-NC(O)R₂₀₀、-S(O)₂R₂₀₀で置換され、ここでR₂₀₀は水素、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル又はC₂-C₆アルキニルであり；ここで各R₁₀₀及びR₁₀₁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、-OR₂₀₀、-SR₂₀₀、-C(O)R₂₀₀、-C(O)N(R₂₀₀)₂、-NC(O)R₂₀₀、-S(O)₂R₂₀₀であり、ここでR₂₀₀は、水素、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル又はC₂-C₆アルキニルであり；あるいはR₁₀₀基及びR₁₀₁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；Cy₃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；Cy₅は、スピロ結合したC₃-C₆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；A₂は、非存在又は-[C(R₁₀₀)(R₁₀₁)]n-、-C(O)-、-C(S)-、-S(O)-、-C(O)N(R₁₀₀)-、-C(O)N(R₁₀₀)(R₁₀₁)、N(R₁₀₀)(R₁₀₁)、-S(O)₂-、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)R₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)R₁₀₁であり；A₃は、非存在又は-[C(R₁₀₀)(R₁₀₁)]n-、-C(O)-、-C(S)-、-S(O)-、-C(O)N(R₁₀₀)-、-C(O)N(R₁₀₀)(R₁₀₁)、N(R₁₀₀)(R₁₀₁)、-S(O)₂-、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)R₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)R₁₀₁

)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；

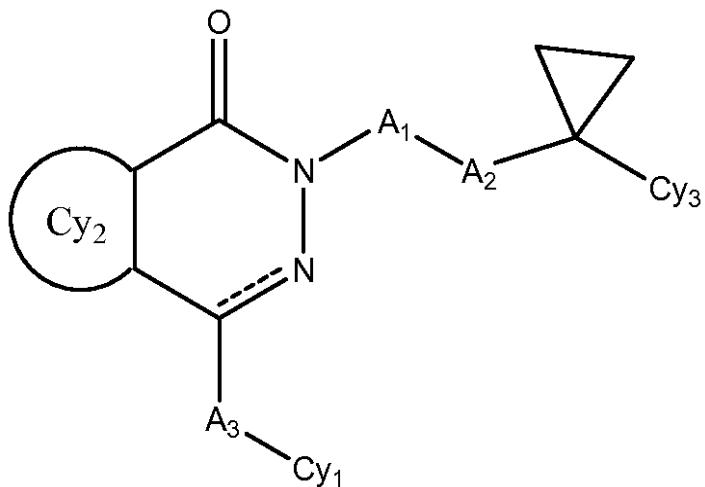
各 R_3 及び R_4 は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$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

【請求項 1 4】

式：

【化 1 7】

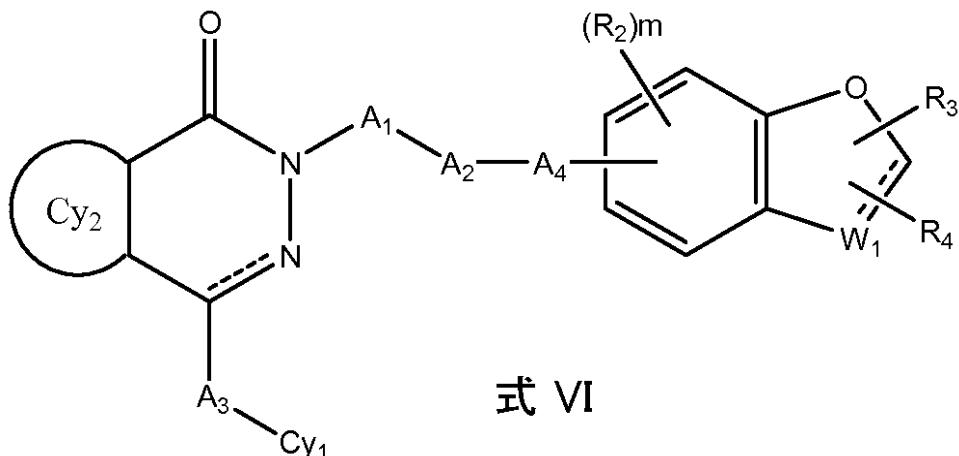


を有する、請求項13に記載の化合物又はその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 1 5】

式VI：

【化18】



式中、

【化19】

は単結合又は二重結合を表し；

W₁は、CH、CH₂、CR₁₀₀、C(O)、O、S、SO又はSO₂であり；

mは0、1、2、3又は4であり；

Cy₁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；Cy₂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；A₁は、非存在、-[C(R₁₀₀)(R₁₀₁)]_n-、-C(O)-、-C(S)-、-S(O)-、-C(O)N(R₁₀₀)-、-S(O)₂N(R₁₀₀)-、-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R₁₀₀及びR₁₀₁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、-OR₂₀₀、-SR₂₀₀、-C(O)R₂₀₀、-C(O)N(R₂₀₀)₂、-NC(O)R₂₀₀、-S(O)₂R₂₀₀であり、ここでR₂₀₀は、水素、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル又はC₂-C₆アルキニルであり；あるいはR₁₀₀基及びR₁₀₁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；A₂は、非存在又は-[C(R₁₀₀)(R₁₀₁)]_n-、-C(O)-、-C(S)-、-S(O)-、-C(O)N(R₁₀₀)-、-C(O)N(R₁₀₀)(R₁₀₁)、N(R₁₀₀)(R₁₀₁)、-S(O)₂-、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)R₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)(R₁₀₁)であり；A₃は、非存在又は-[C(R₁₀₀)(R₁₀₁)]_r-、-C(O)-、-C(S)-、-S(O)-、-C(O)N(R₁₀₀)-、-C(O)N(R₁₀₀)(R₁₀₁)、N(R₁₀₀)(R₁₀₁)、-S(O)₂-、S(O)₂R₁₀₀、S(O)R₁₀₀、S(O)₂N(R₁₀₀)(R₁₀₁)であり；A₄は、-[C(R₂₅)(R₂₆)]_r-、-[C(R₂₅)(R₂₆)]_r-C=C-[C(R₂₇)(R₂₈)]p又は-[C(R₂₅)(R₂₆)]_r-C-C-[C(R₂₇)(R₂₈)]pであり；ここで各R₂₅、R₂₆、R₂₇及びR₂₈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R₂₅基、R₂₆基、R₂₇基及びR₂₈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；

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；

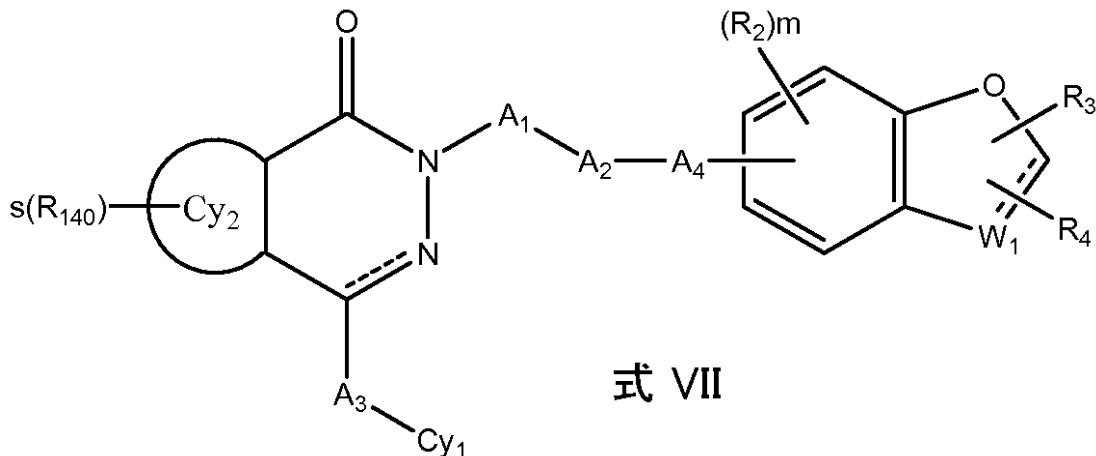
各 R_3 及び R_4 は独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール、置換されるアリール、ヘテロシクリル、置換されるヘテロシクリル、ヘテロアリール、置換されるヘテロアリール又は $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$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

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 1 6】

式VII:

【化 2 0】



式中、

【化 2 1】

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；

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、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になって、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；

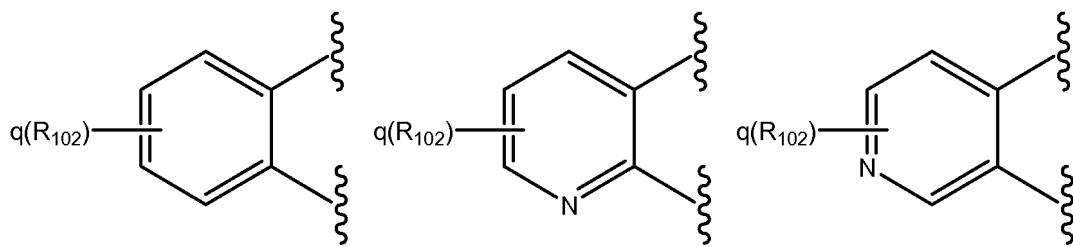
各 R_{140} は独立して、ハロゲン、 $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)R_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ から選択される、

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。

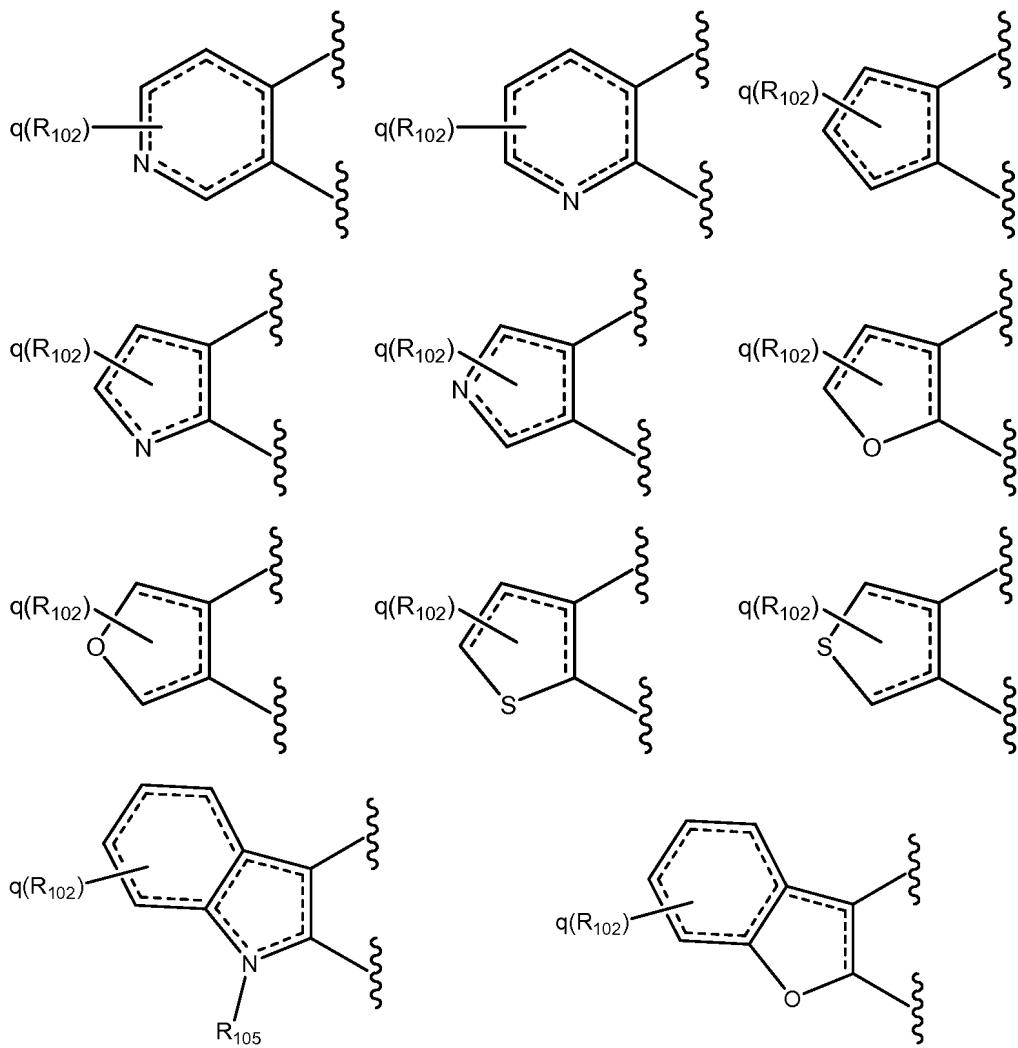
【請求項 1 7】

Cy2が、

【化22】



【化23】



式中、 q は0、1、2、3、4又は5であり；

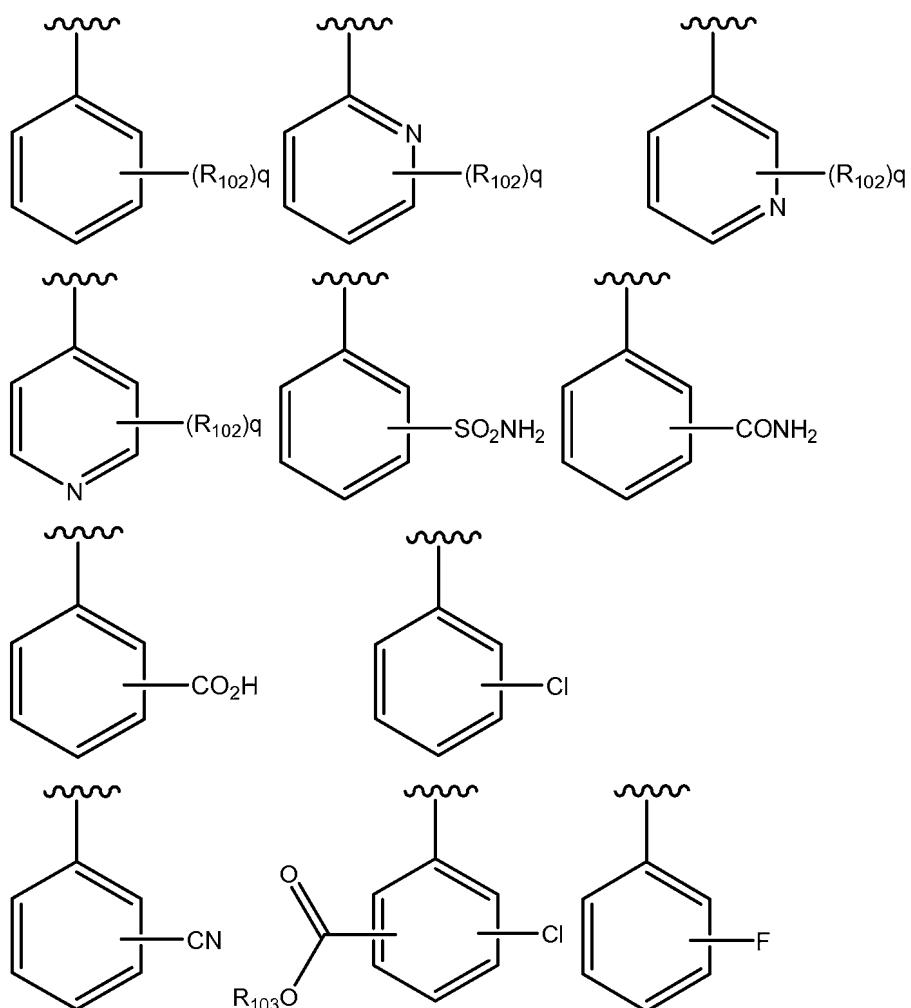
各 R_{102} は、独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、炭素環、置換される炭素環、アリール、置換されるアリール、 $-OR_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-NR_{100}R_{101}$ 、 $-C(O)R_{100}$ 、 $-C(O)OR_{100}$ 、 $-C(O)NR_{100}R_{101}$ 、 $-N(R_{100})C(O)R_{101}$ 、 $-S(O)_2R_{100}$ 、 $-S(O)R_{100}$ 、 $-SR_{100}$ 、 $-S(O)_2N(R_{100})R_{101}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ 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13～15のいずれかに記載の化合物。

【請求項 1 8】

Cy1が、
【化 2 4】



式中、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；及び

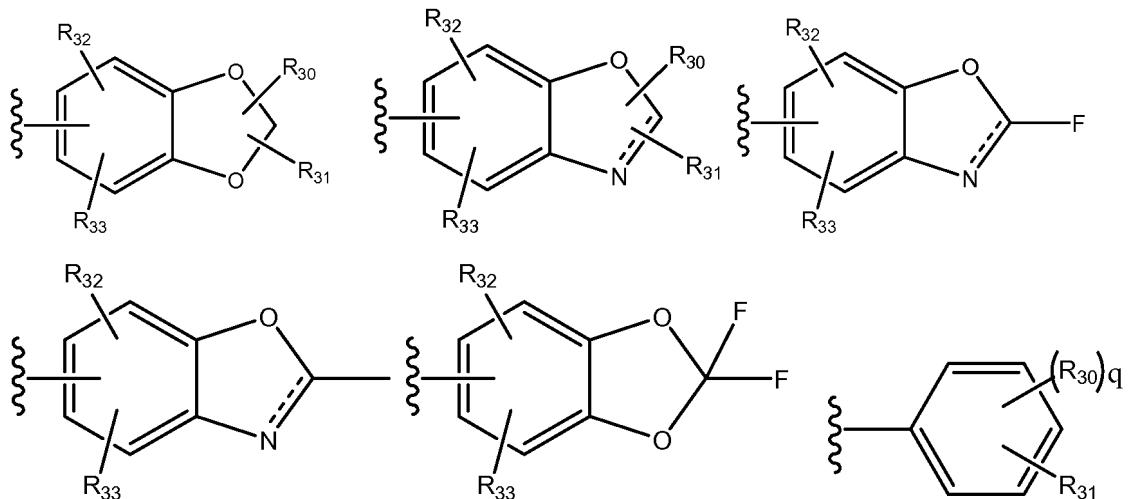
R_{103} は、水素、重水素、アルキル、置換されるアルキル、アルケニル、置換されるアルケニル、アルキニル、置換されるアルキニル、脂肪族、置換される脂肪族、アリール又は置換されるアリールである、

から選択される、請求項13～17のいずれかに記載の化合物。

【請求項 1 9】

Cy3が、

【化25】



式中、

各R₃₀、R₃₁、R₃₂及びR₃₃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、-O₁₀₀、-SR₁₀₀、-NR₁₀₀R₁₀₁、-C(O)R₁₀₀、-C(O)OR₁₀₀、-C(O)NR₁₀₀R₁₀₁、-N(R₁₀₀)C(O)R₁₀₁、-S(O)₂R₁₀₀、-S(O)R₁₀₀、-SR₁₀₀、-S(O)₂N(R₁₀₀)R₁₀₁、-CF₃、-CN、-NO₂、-N₃から選択され；あるいはR₃₀基、R₃₁基、R₃₂基及びR₃₃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員環を形成しえ得；

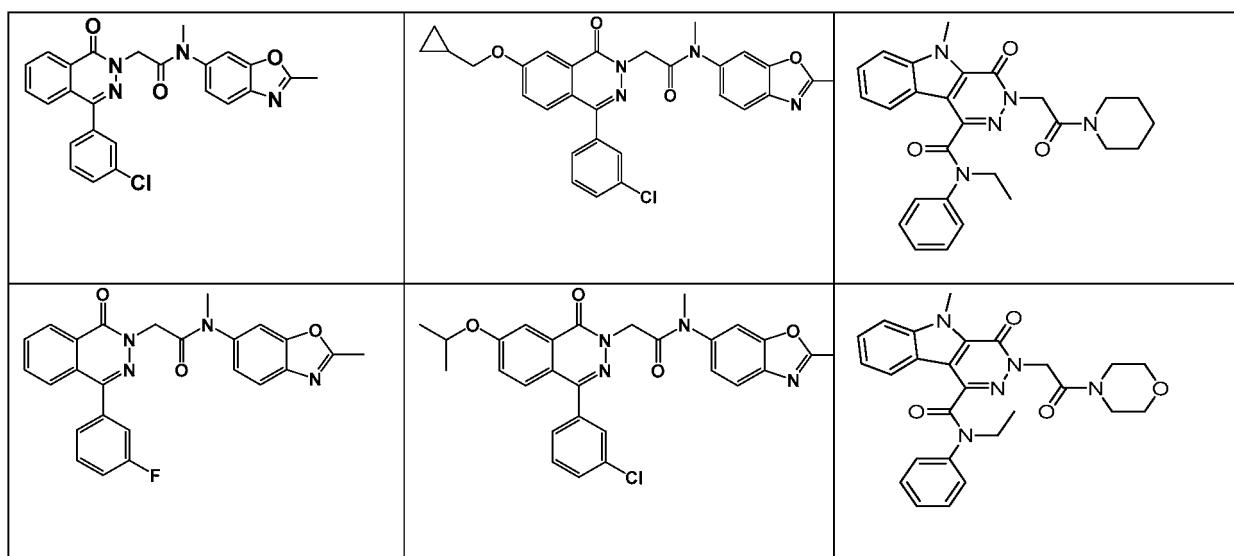
qは0、1、2、3、4又は5である、

から選択される、請求項13又は14に記載の化合物。

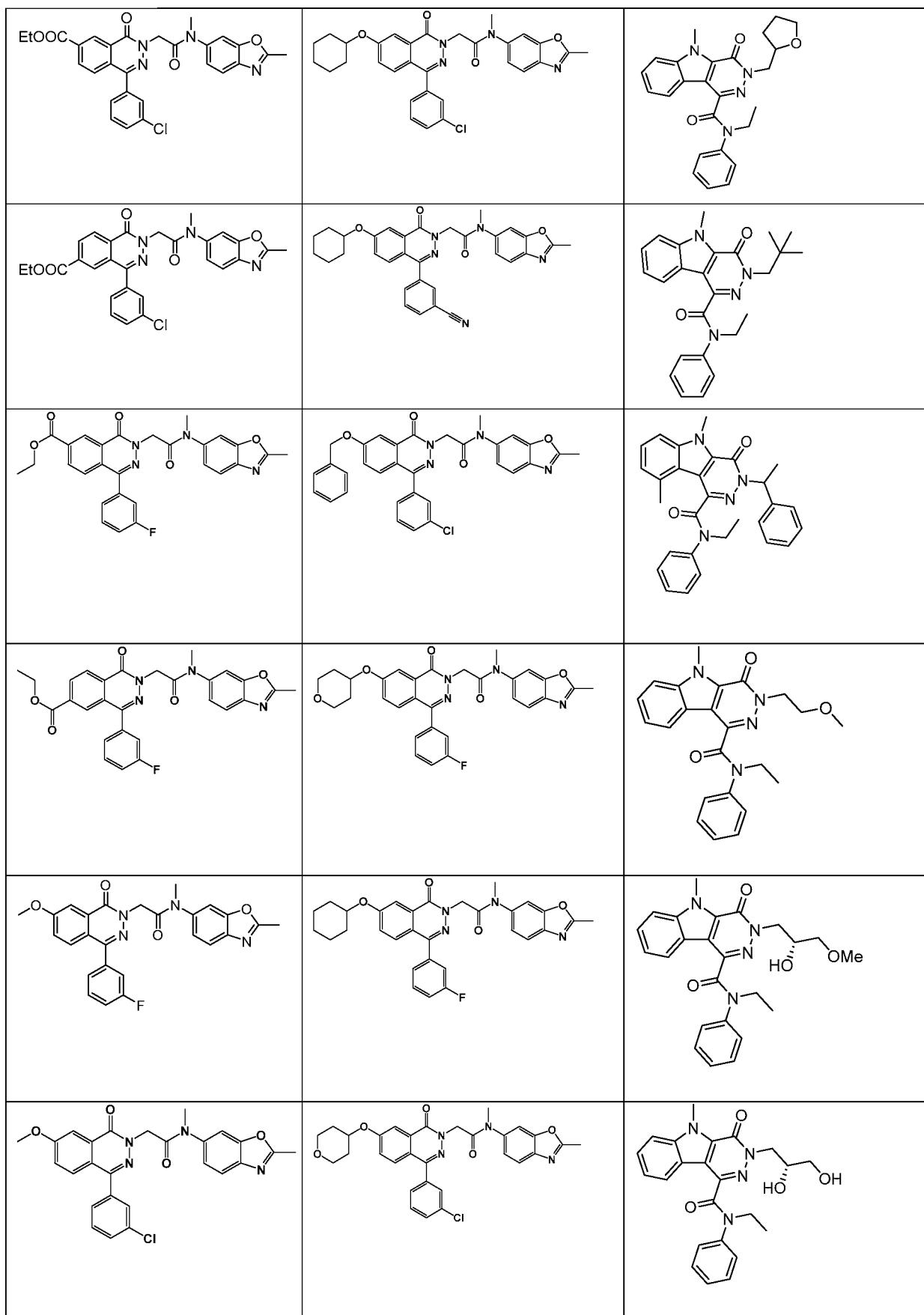
【請求項20】

表A2：

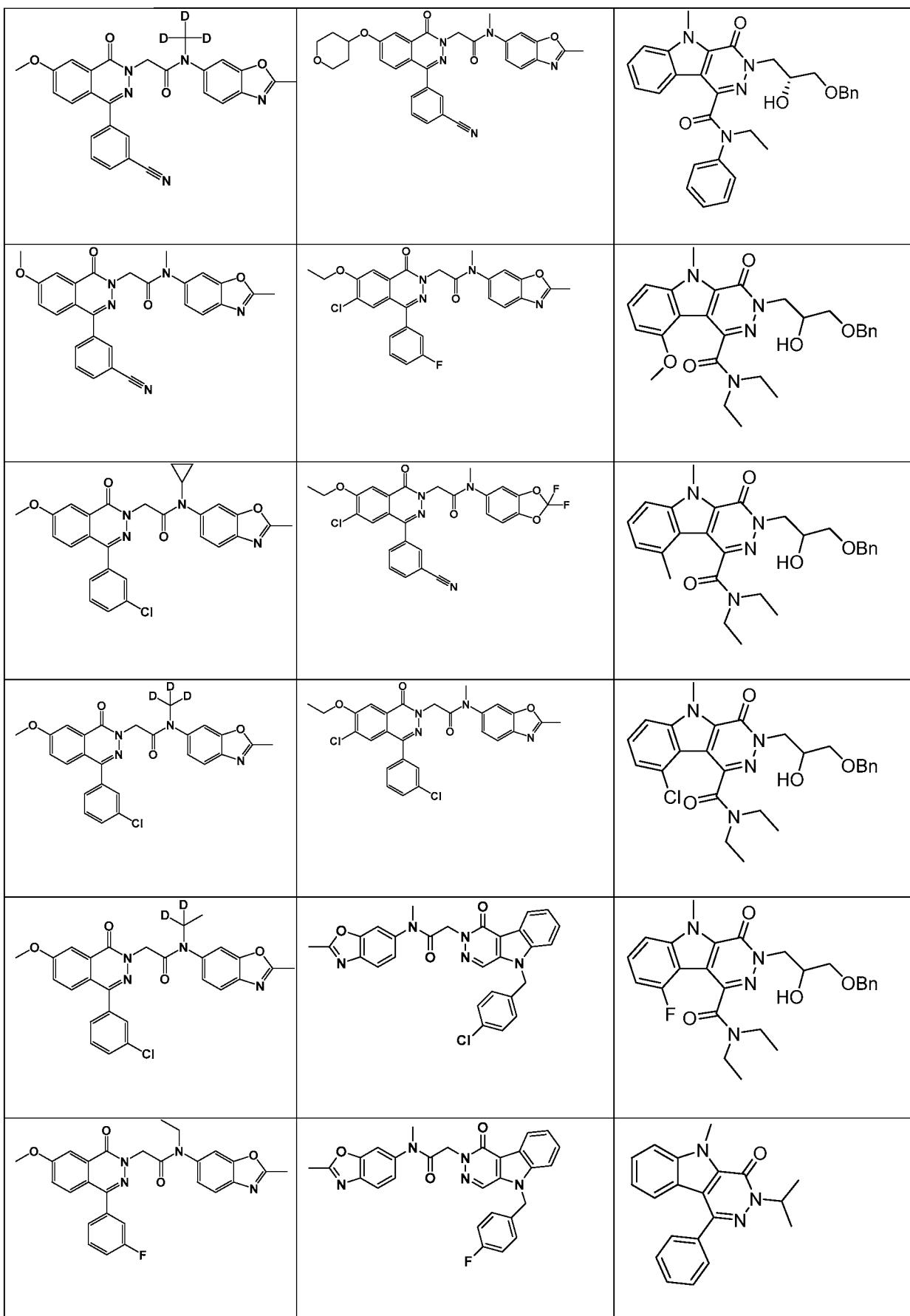
【表11】



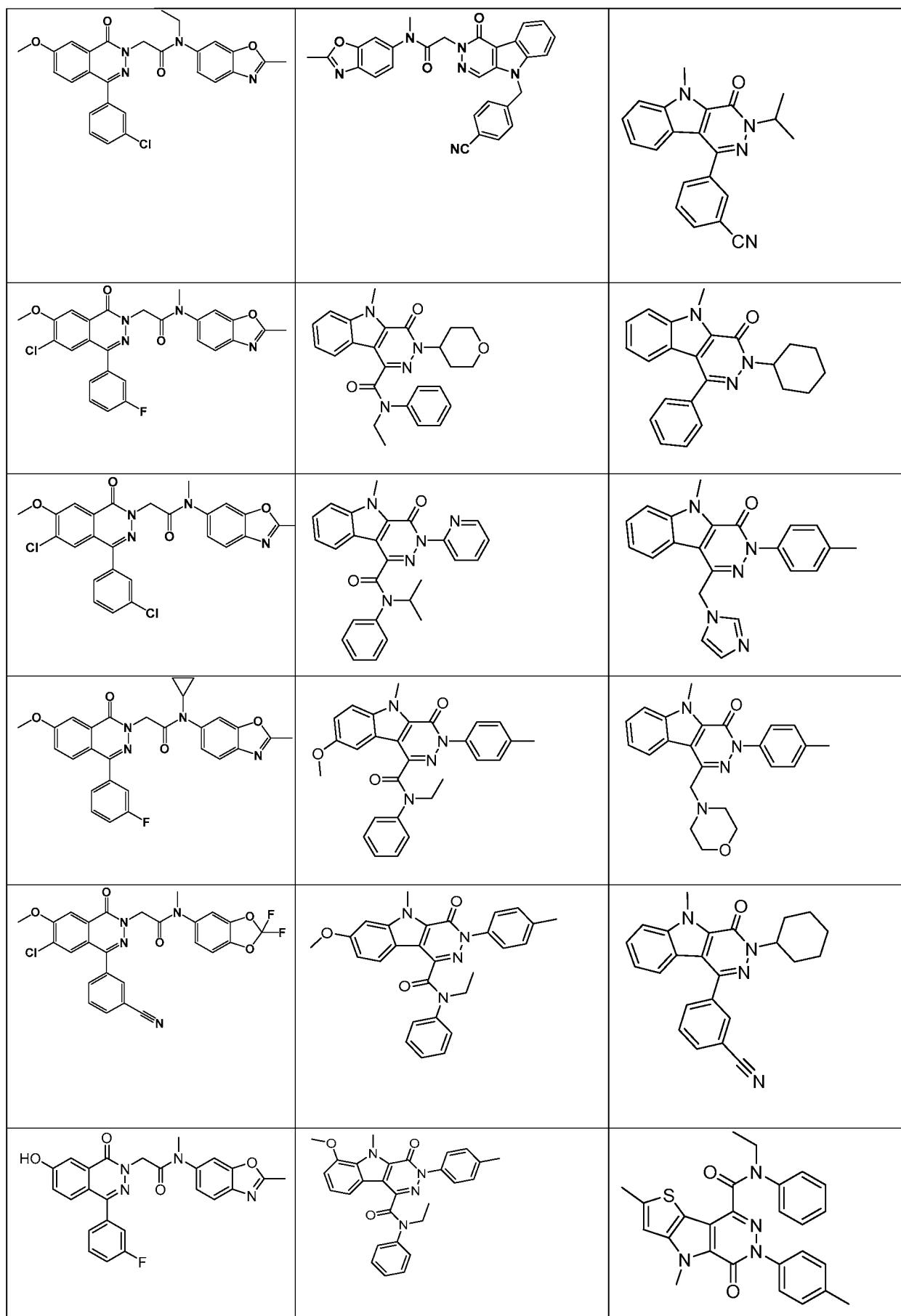
【表 1 2】



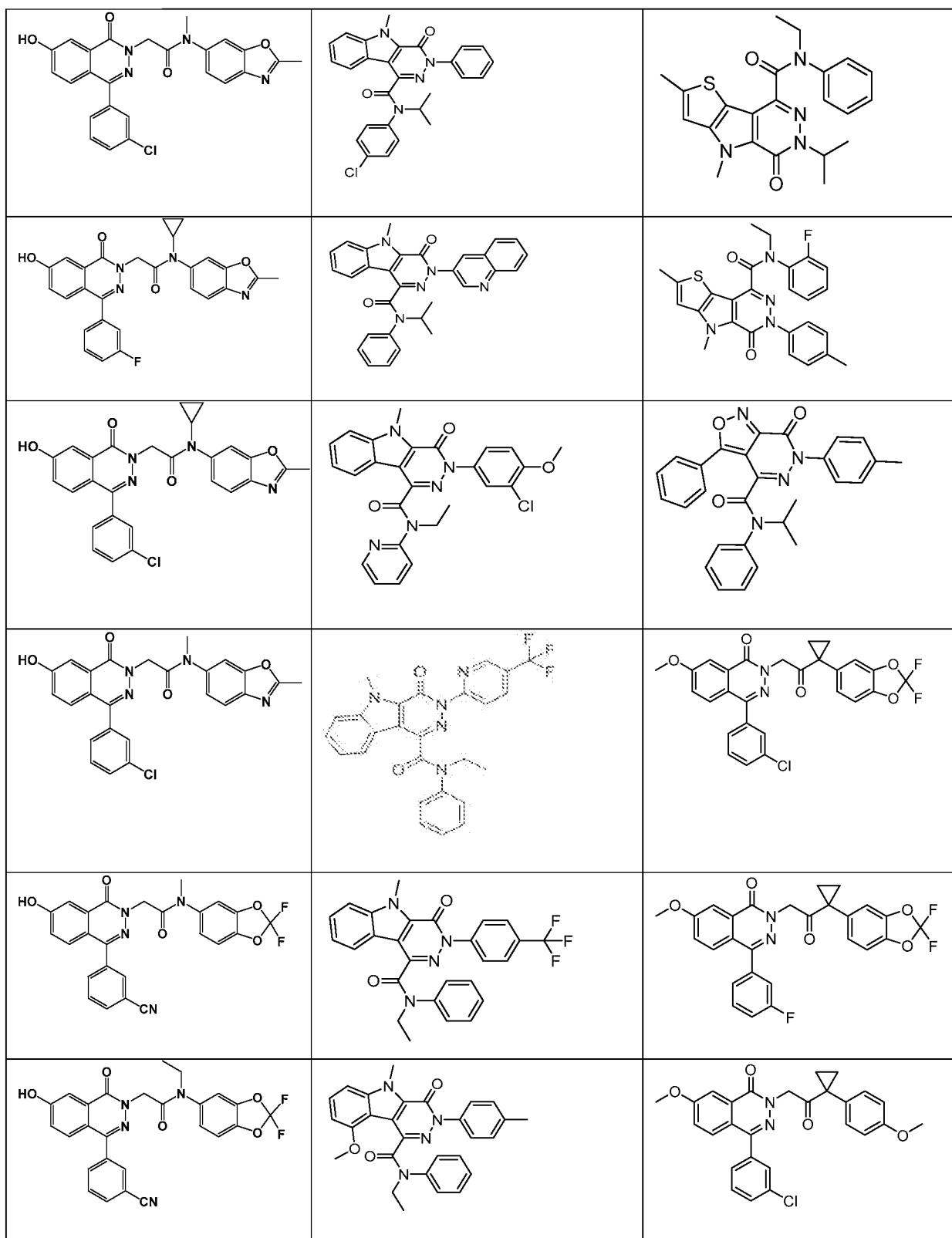
【表13】



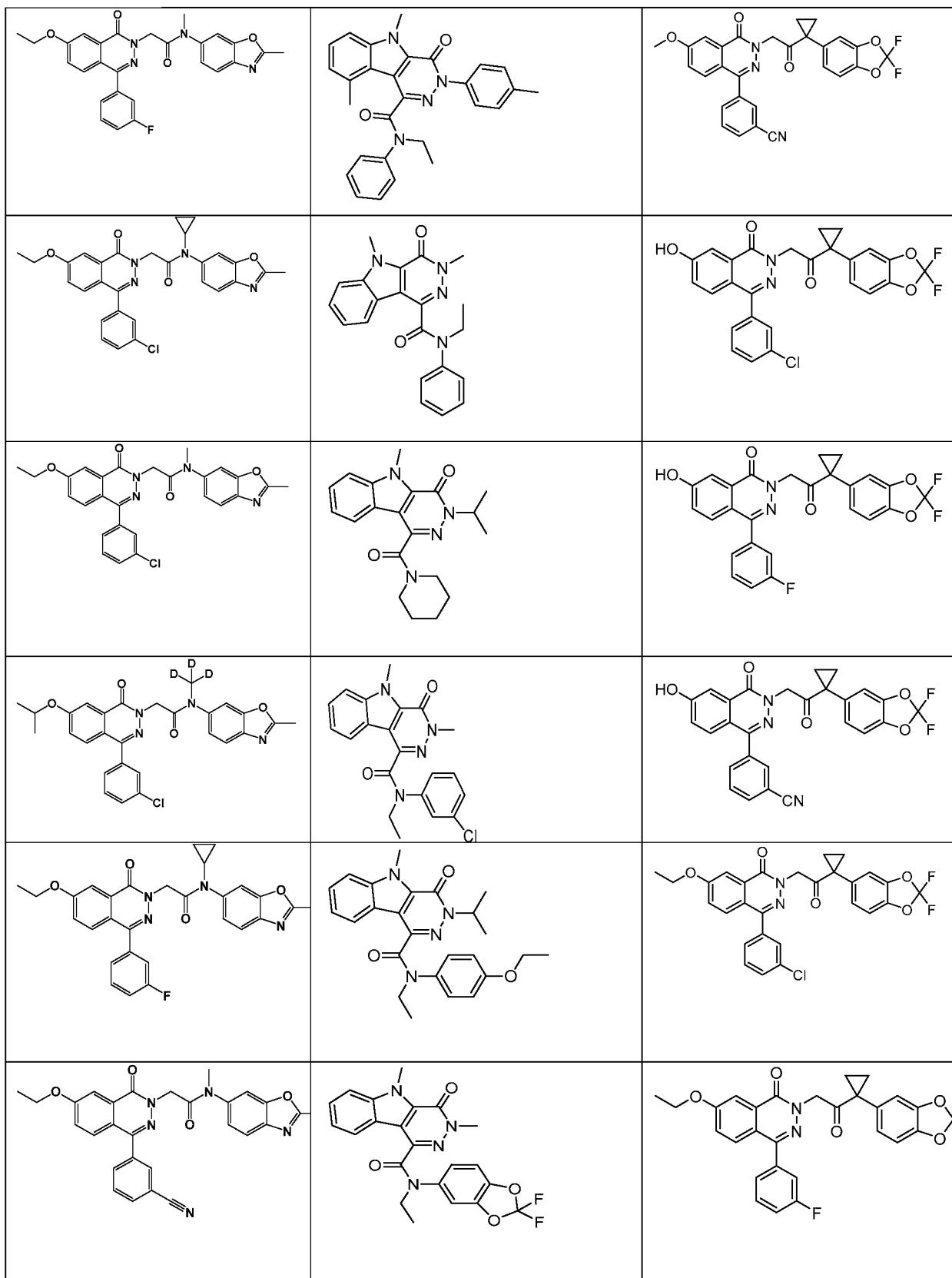
【表 14】



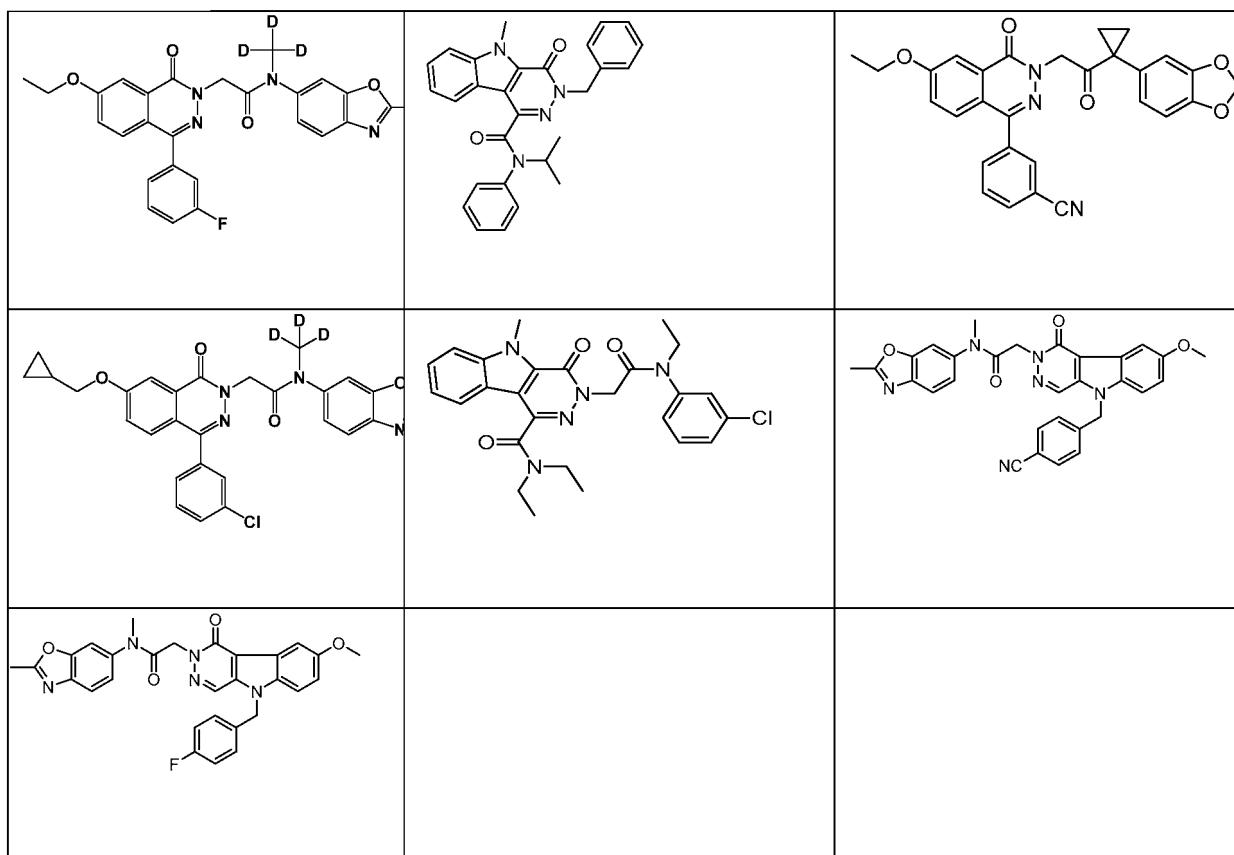
【表 15】



【表 1 6】



【表17】



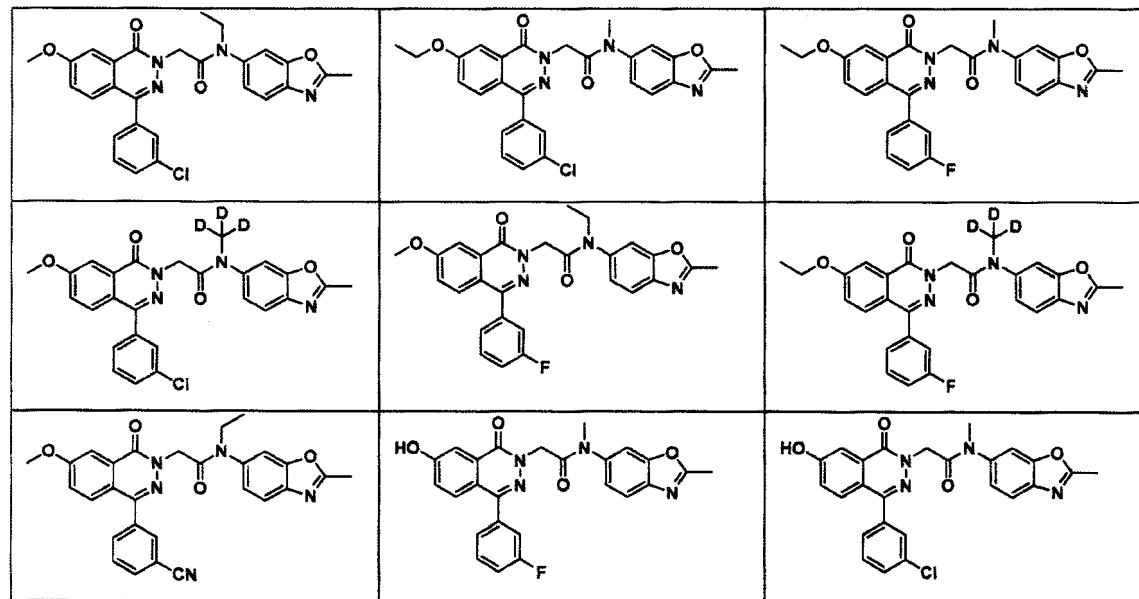
から選択される化合物又はその薬学的に許容され得る塩。

【請求項21】

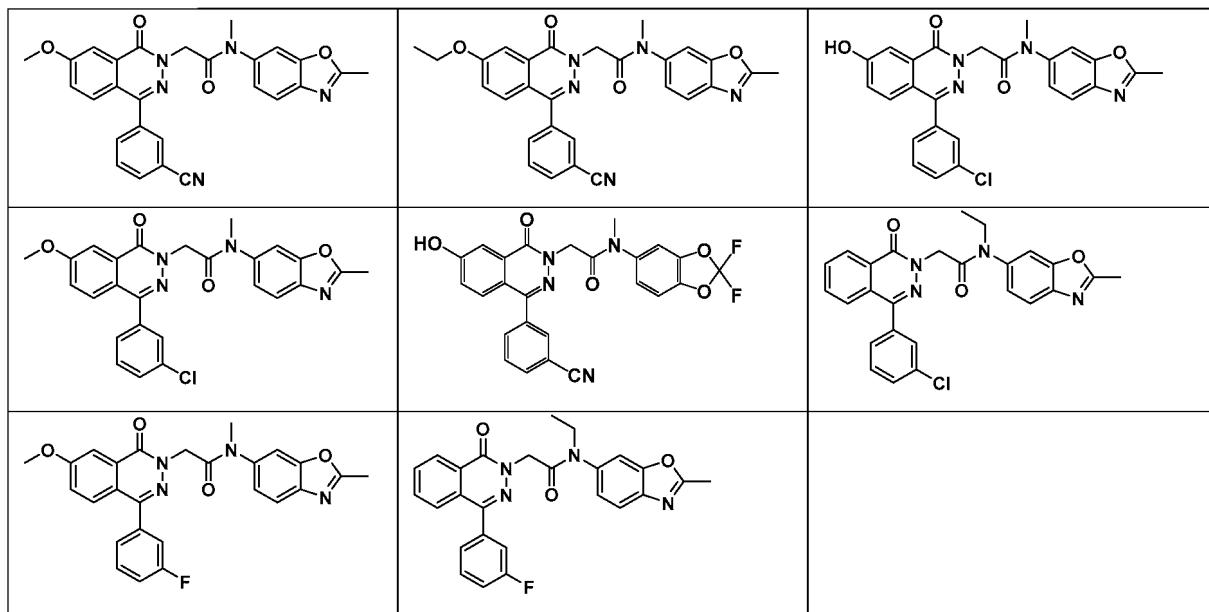
表A3：

【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 2 3】

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)、I型乳糜血症(type 1 chylomicronemia)、無-Lリボ蛋白血症、I細胞病/偽性フルラーなどのリソソーム蓄積症、ムコ多糖症、サンドホフ/ティ-サックス、クリグラー-ナジャール型、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ウース症候群、ペリツェウスマルツバッハーパー病(perlizaeus-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(Dentorubral pallidoluysian)、及び筋強直性ジストロフィー(Myotic 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。