

F または - C 1 ;

基 A - L - は独立して A - NH - C (= O) - NH - 、 A - C (= O) - NH - 、 または A - NH - C (= O) - ;

A は独立してフェニルまたはピラゾリル、

かつ、独立して非置換または以下から選択される一つ以上の基で置換される：

- (C = O) NH₂、 - (C = O) NMe₂、 - (C = O) NEt₂、 - (C = O) N (iPr)₂、 - (C = O) N (CH₂CH₂OH)₂、 - (C = O) - モルフォリノ、 - (C = O) NHPh、 - (C = O) NHCH₂Ph、 - F、 - C 1、 - Br、 - I、 - CN、 - OH、 - OMe、 - OEt、 - O (iPr)、 - O (tBu)、 - OPh、 - OCH₂Ph、 - OCF₃、 - OCH₂CF₃、 - OCF₂CF₂H、 - OCH₂CH₂O H、 - OCH₂CH₂OMe、 - OCH₂CH₂OEt、 - OCH₂CH₂NH₂、 - OCH₂CH₂NMe₂、 - OCH₂CH₂N (iPr)₂、 - OCH₂CH₂ - モルフォリノ、 - OCH₂CH₂ - ピペラジノ、 - OCH₂CH₂ - ピロリジノ、 - OPh - Me、 - OPh - OH、 - OPh - OMe、 - OPh - F、 - OPh - Cl、 - OPh - Br、 - OPh - I、 - NH₂、 - NHMe、 - NHEt、 - NH (iPr)、 - NMe₂、 - NEt₂、 - N (iPr)₂、 - N (CH₂CH₂OH)₂、 - NHPh、 - NHCH₂Ph、 ピペリジノ、 ピペラジノ、 モルフォリノ、 - NH (C = O) Me、 - NH (C = O) Et、 - NH (C = O) nPr、 - NH (C = O) Ph、 - NHCO (= O) CH₂Ph、 - NMe (C = O) Me、 - NMe (C = O) Et、 - NMe (C = O) Ph、 - NMeC (= O) CH₂Ph、 - SO₂Me、 - SO₂CF₃、 - SO₂Et、 - SO₂Ph、 - SO₂PhMe、 - SO₂CH₂Ph、 - SO₂NH₂、 - SO₂NHMe、 - SO₂NHET、 - SO₂NMe₂、 - SO₂NEt₂、 - SO₂ - モルフォリノ、 - SO₂NHPh、 - SO₂NHCH₂Ph、 - CH₂Ph、 - CH₂Ph - Me、 - CH₂Ph - OH、 - CH₂Ph - F、 - CH₂Ph - Cl、 - Ph、 - Ph - Me、 - Ph - OH、 - Ph - OMe、 - Ph - NH₂、 - Ph - F、 - Ph - Cl、 - Ph - Br、 - Ph - I、 ピリジル、 ピラジニル、 ピリミジニル、 ピリダジニル、 フラニル、 チオフェニル、 ピロリル、 イミダゾリル、 ピラゾリル、 オキサゾリル、 チアゾリル、 チアジアゾリル、 ピロリジニル、 イミダゾリジニル、 ピラゾリジニル、 ピペリジニル、 ピペラジニル、 アゼピニル、 テトラヒドロフラニル、 テトラヒドロピラニル、 モルフォリニル、 アゼチジニル、 - Me、 - Et、 - nPr、 - iPr、 - nBu、 - iBu、 - sBu、 - tBu、 - nPe、 - iPe、 - ter - Pe、 - neo - Pe、 - cPr、 - cHex、 - CH = CH₂、 - CH₂ - CH = CH₂、 - CF₃、 - CHF₂、 - CH₂F、 - CCl₃、 - CBr₃、 - CH₂CH₂F、 - CH₂CHF₂、 および - CH₂CF₃、 - CH₂OH、 - CH₂OMe、 - CH₂OEt、 - CH₂NH₂、 - CH₂NMe₂、 - CH₂CH₂O H、 - CH₂CH₂OMe、 - CH₂CH₂OEt、 - CH₂CH₂CH₂CH₂NH₂、 - CH₂CH₂NMe₂、 - CH₂CH₂ - モルフォリノ、 - CH₂CH₂ - ピペラジノ、 および = O。

【請求項 2】

R^{N 1} が独立して - Me である、 請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^{N 1} が独立して - H である、 請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^{N 2} が独立して - Me である、 請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】

R^{N 2} が独立して - H である、 請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6】

R^{P 1} および R^{P 2} がそれぞれ独立して - H 以外であって、 R^{P 5} および R^{P 4} がそれぞれ独立して - H である、 請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7】

R^{P 1}、 R^{P 2}、 R^{P 5}、 および R^{P 4} がそれぞれ独立して - H である、 請求項 1 ~ 5

のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8】

基 A - L - が独立して A - N H - C (= O) - N H - である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9】

基 A - L - が独立して A - C (= O) - N H - である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 10】

基 A - L - が独立して A - N H - C (= O) - である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 11】

A が独立してフェニルであり、かつ独立して非置換または置換である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物。

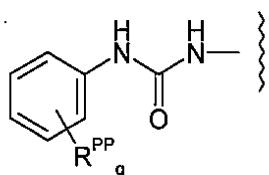
【請求項 12】

A が任意に置換されたフェニルであり、かつフェニル基上の置換基が独立して以下から選択される、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物： - F 、 - C l 、 - B r 、 - I 、 - O H 、 - O M e 、 - O E t 、 - O (i P r) 、 - O (t B u) 、 - O P h 、 - O C H ₂ P h 、 - O C F ₃ 、 - O C H ₂ C F ₃ 、 - O C H ₂ C H ₂ O H 、 - O C H ₂ C H ₂ O M e 、 - O C H ₂ C H ₂ O E t 、 - O C H ₂ C H ₂ N H ₂ 、 - O C H ₂ C H ₂ N M e ₂ 、 - N H ₂ 、 - N H M e 、 - N H E t 、 - N H (i P r) 、 - N M e ₂ 、 - N E t ₂ 、 - N (i P r) ₂ 、 - N (C H ₂ C H ₂ O H) ₂ 、 - N H P h 、 - N H C H ₂ P h 、 ピペリジノ、ピペラジノ、モルフォリノ、- P h 、 - P h - M e 、 - P h - O M e 、 - P h - F 、 - P h - C l 、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、フラニル、チオフェニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、アゼピニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、モルフォリニル、アゼチジニル、- M e 、 - E t 、 - n P r 、 - i P r 、 - n B u 、 - i B u 、 - s B u 、 - t B u 、 - n P e 、 - c P r 、 - c H e x 、 - C H = C H ₂ 、 - C H ₂ - C H = C H ₂ 、 - C F ₃ 、 - C H F ₂ 、 - C H ₂ F 、 - C H ₂ C H ₂ F 、 - C H ₂ C H F ₂ 、 および - C H ₂ C F ₃ 、 - C H ₂ O M e 、 - C H ₂ O E t 、 - C H ₂ N H ₂ 、 - C H ₂ N M e ₂ 、 - C H ₂ C H ₂ O H 、 - C H ₂ C H ₂ O M e 、 - C H ₂ C H ₂ O E t 、 - C H ₂ C H ₂ C H ₂ N H ₂ 、 および - C H ₂ C H ₂ N M e ₂ ；

【請求項 13】

A - L - が下記式である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物：

【化 2】



式中：

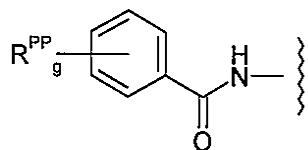
g は独立して 0 、 1 、 または 2 ； ならびに

R _P _P はそれぞれ独立して - F 、 - C l 、 - B r 、 - I 、 - O M e 、 - O C F ₃ 、 - M e 、 または - C F ₃ 。

【請求項 14】

A - L - が下記式である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物：

【化3】



式中：

g は独立して 0、1、または 2；ならびに

R^{PP} はそれぞれ独立して - F、- Cl、- Br、- I、- OMe、- OC₂H₅、- Me、または - CF₃。

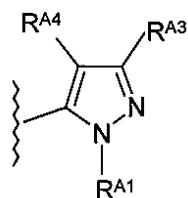
【請求項 15】

A が独立してピラゾリルであり、かつ独立して非置換または置換である、請求項 1～10 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 16】

A が任意に置換されたピラゾリルであり、かつ次式で表される、請求項 1～10 のいずれか 1 項に記載の化合物：

【化4】



式中：

R^{A4} は H；

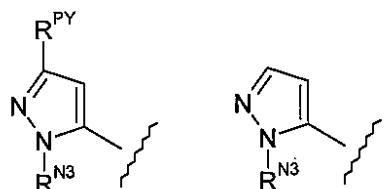
R^{A3} は - F、- Cl、- Br、- I、- Ph、- Me、- Et、- nPr、- iPr、- nBu、- iBu、- sBu、- tBu、- nPe、- cPr、- cHex、- CF₃、- CH₂F、- CH₂CH₂F、- CH₂CH₂F、および - CH₂CF₃ から独立して選択される；

R^{A1} は - Ph、- Ph-Me、- Ph-OH、- Ph-OMe、- Ph-NH₂、- Ph-F、- Ph-Cl、- Ph-Br、- Ph-I、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル；フラニル、チオフェニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、アゼピニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、モルフォリニル、アゼチジニル、- Me、- Et、- nPr、- iPr、- nBu、- iBu、- sBu、- tBu、- nPe、- cPr、- cHex；- CH=CH₂、- CH₂-CH=CH₂、- CF₃、- CH₂F、- CH₂CH₂F、- CH₂CH₂F、および - CH₂CF₃、- CH₂OMe、- CH₂OEt、- CH₂NH₂、- CH₂NMe₂、- CH₂CH₂OH、- CH₂CH₂OMe、- CH₂CH₂OEt、- CH₂CH₂CH₂NH₂、および - CH₂CH₂NMe₂ から独立して選択される。

【請求項 17】

A が次式で表される基から選択されるピラゾリル基である、請求項 1～10 のいずれか 1 項に記載の化合物：

【化5】



式中：

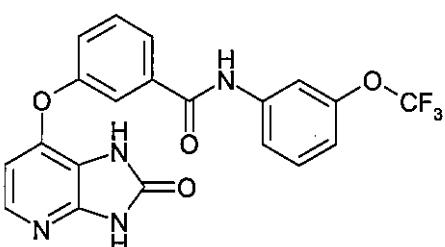
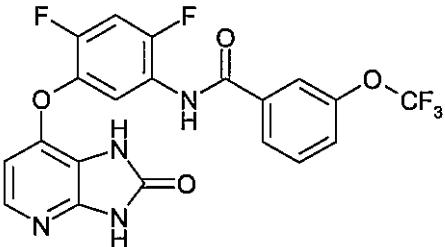
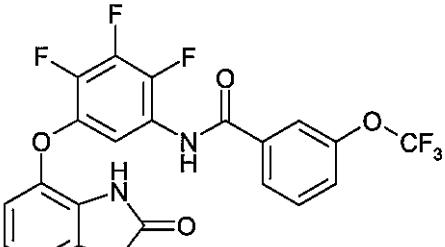
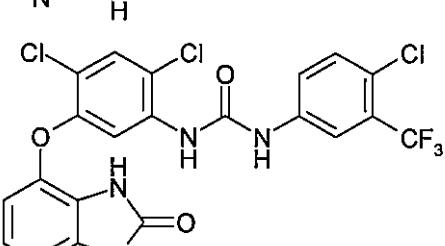
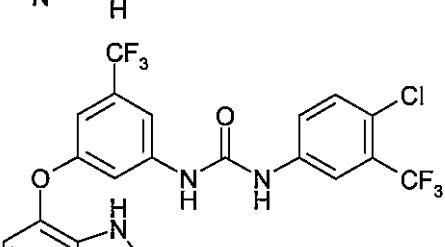
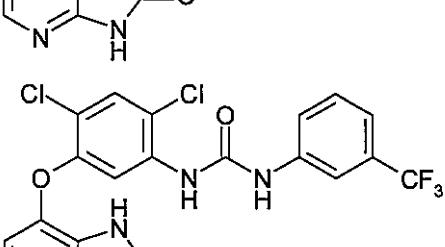
R^P Y は独立して飽和 C_{1-7} アルキル；ならびに

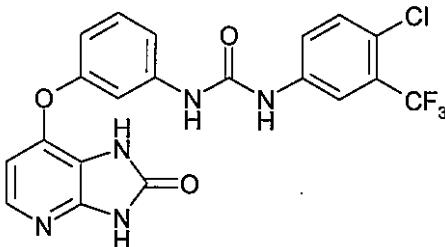
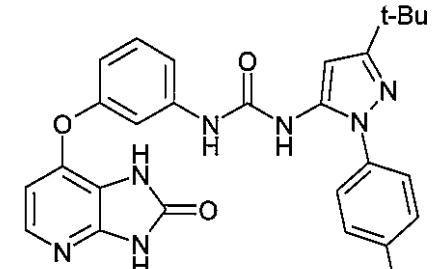
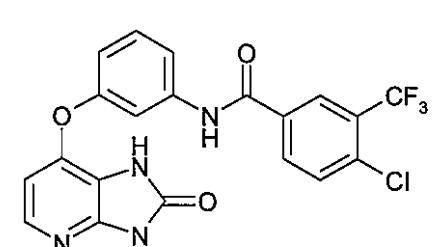
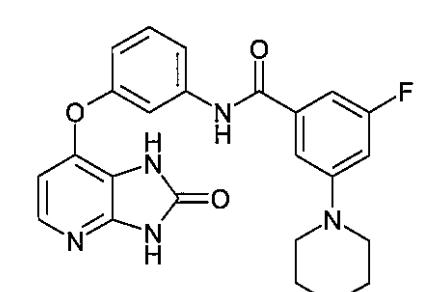
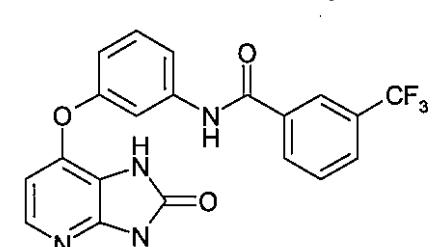
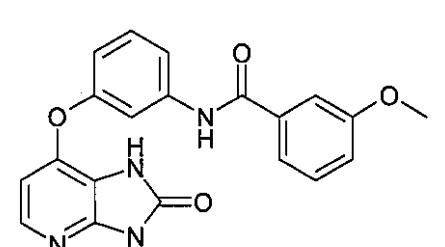
R^N 3 は独立してフェニルであり、かつ独立して非置換または - F、- Cl、- Br、- I、- OMe、- OC₂H₅、- Me、および - CF₃ から選択される一つ以上の置換基で置換される。

【請求項 1-8】

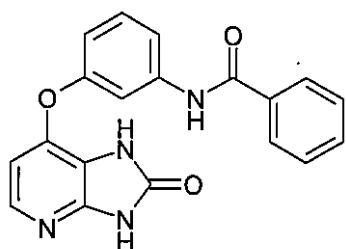
下記化合物、ならびにその製薬上許容される塩および溶媒和物から選択される、請求項 1 に記載の化合物：

【表 1】

1		CJS 3256
2		CJS 3440
3		CJS 3441
4		CJS 3513
5		CJS 3517
6		CJS 3518

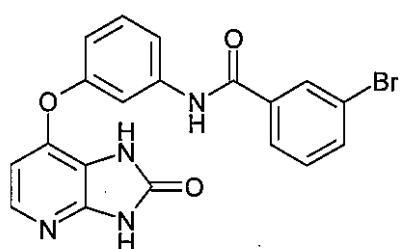
7		CJS 3678
8		CJS 3683
10		CJS 3685
11		CJS 3686
12		CJS 3687
13		CJS 3688

14



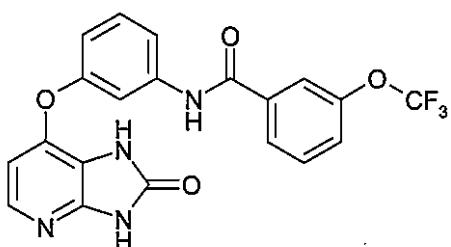
CJS 3689

15



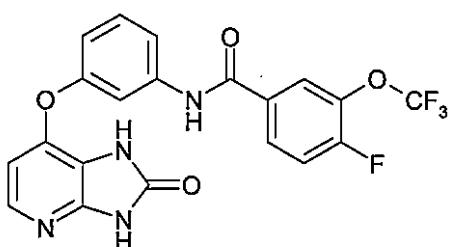
CJS 3690

20



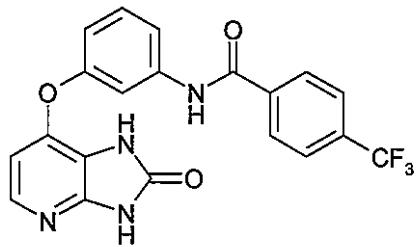
CJS 3695

21



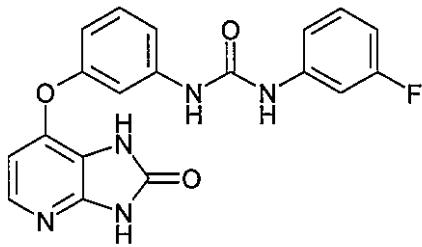
CJS 3696

22



CJS 3697

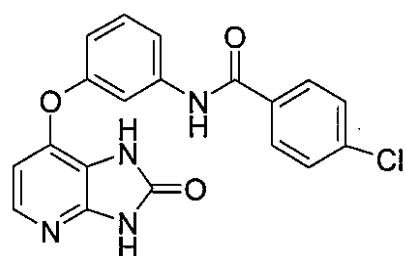
23



CJS 3717

24		CJS 3720
25		CJS 3721
27		CJS 3724
28		CJS 3725
29		CJS 3726
30		CJS 3727

33



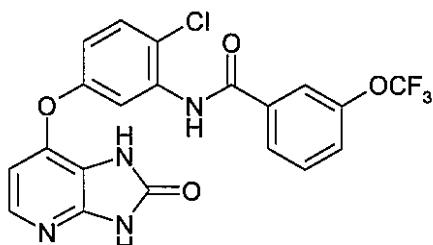
CJS 3730

【請求項 19】

下記化合物、ならびにその製薬上許容される塩および溶媒和物から選択される、請求項1に記載の化合物：

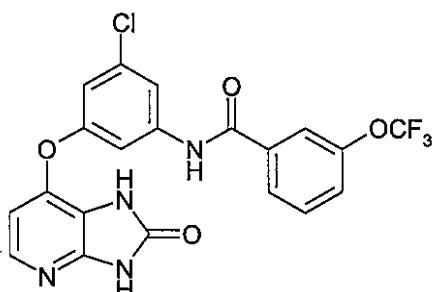
【表 2】

37



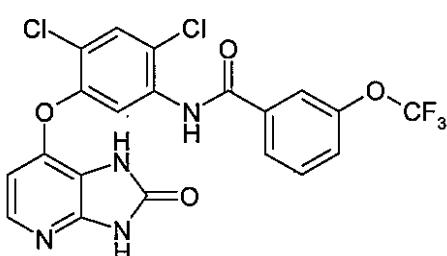
CJS 3442

38



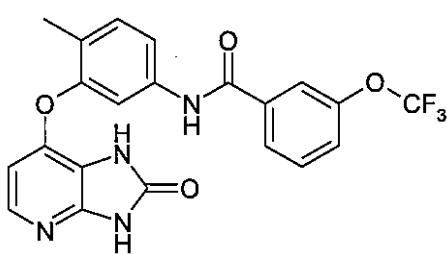
CJS 3443

39



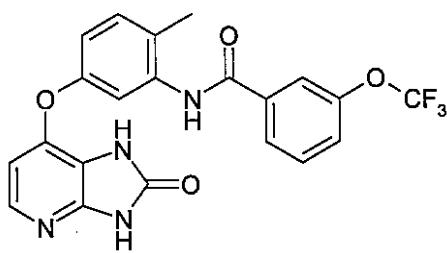
CJS 3521

41



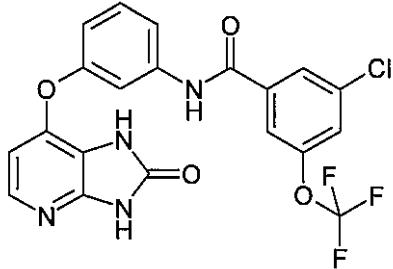
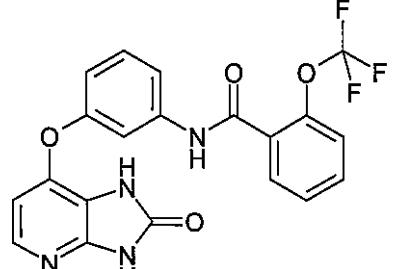
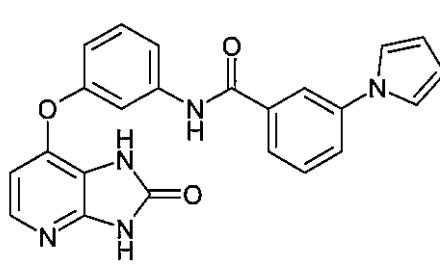
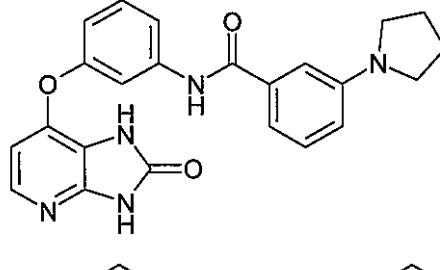
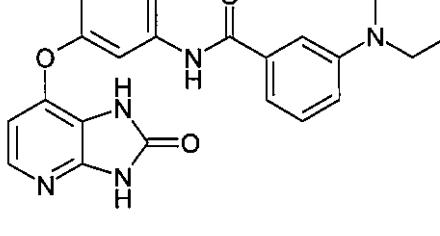
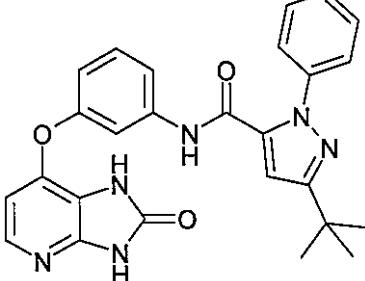
CJS 3523

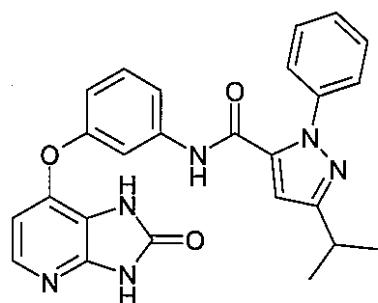
42



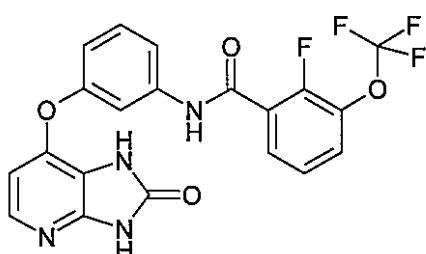
CJS 3524

44		CJS 3526
47		CJS 3741
48		CJS 3742
49		CJS 3743
50		CJS 3744

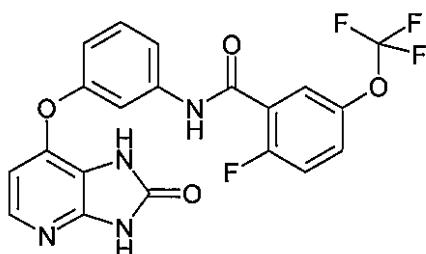
51		CJS 3745
55		CJS 3751
56		CJS 3752
57		CJS 3753
58		CJS 3754
60		CJS 3757



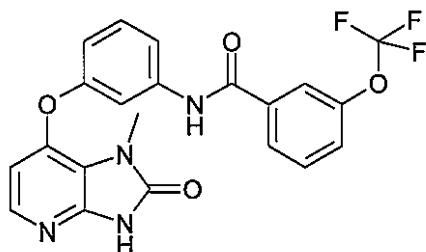
CJS 3758



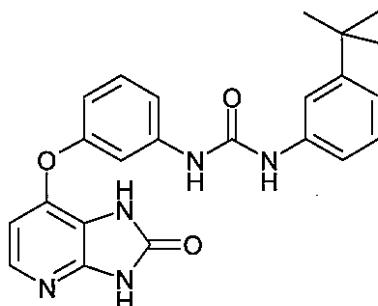
CJS 3759



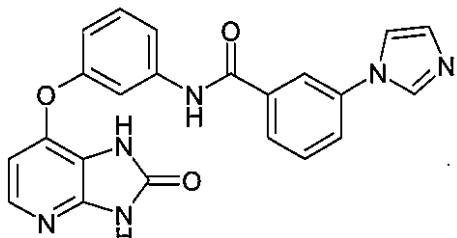
CJS 3760



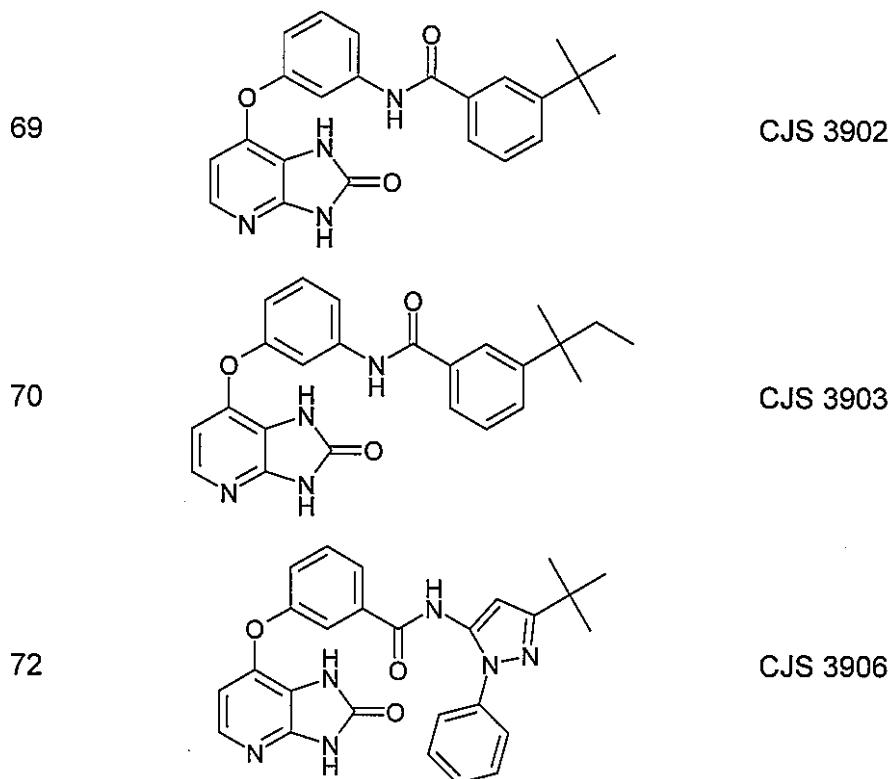
CJS 3768



CJS 3779



CJS 3900



【請求項 20】

請求項 1 ~ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物および医薬として許容される担体もしくは希釈剤を含む、医薬組成物。

【請求項 21】

請求項 1 ~ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物と、医薬として許容される担体もしくは希釈剤とを混合することを含む、医薬組成物の調製方法。

【請求項 22】

ヒトまたは動物体を治療による処置において使用するための、請求項 1 ~ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 23】

癌の治療による処置において使用するための、請求項 1 ~ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 24】

固体腫瘍癌の治療による処置において使用するための、請求項 1 ~ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 25】

黒色腫または悪性黒色腫の治療による処置において使用するための、請求項 1 ~ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 26】

結腸直腸癌の治療による処置において使用するための、請求項 1 ~ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 27】

癌の治療のための医薬の製造における、請求項 1 ~ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 28】

固体腫瘍癌の治療のための医薬の製造における、請求項 1 ~ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 29】

黒色腫または悪性黒色腫の治療のための医薬の製造における、請求項 1 ~ 19 のいずれ

か 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 30】

結腸直腸癌の治療のための医薬の製造における、請求項 1 ~ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。