

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2008-507546

(P2008-507546A)

(43) 公表日 平成20年3月13日(2008.3.13)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C07D 487/04 (2006.01)	C07D 487/04 144	4C050
A61K 31/53 (2006.01)	C07D 487/04 CSP	4C086
A61P 43/00 (2006.01)	A61K 31/53	
A61P 35/00 (2006.01)	A61P 43/00 111	
A61P 9/00 (2006.01)	A61P 35/00	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 143 頁) 最終頁に続く

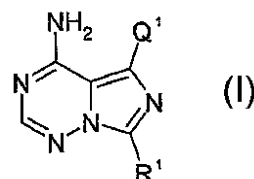
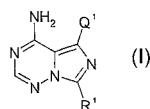
(21) 出願番号	特願2007-522756 (P2007-522756)	(71) 出願人	506330575 オーエスアイ・ファーマスーティカルズ・ インコーポレーテッド アメリカ合衆国、ニューヨーク・1174 7, メルビル, パインローン・ロード・4 1
(86) (22) 出願日	平成17年7月20日 (2005.7.20)	(74) 代理人	100062007 弁理士 川口 義雄
(85) 翻訳文提出日	平成19年3月13日 (2007.3.13)	(74) 代理人	100114188 弁理士 小野 誠
(86) 国際出願番号	PCT/US2005/025891	(74) 代理人	100140523 弁理士 渡邊 千尋
(87) 国際公開番号	W02006/012422	(74) 代理人	100119253 弁理士 金山 賢教
(87) 国際公開日	平成18年2月2日 (2006.2.2)		
(31) 優先権主張番号	60/589,514		
(32) 優先日	平成16年7月20日 (2004.7.20)		
(33) 優先権主張国	米国 (US)		

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 チロシンキナーゼ阻害剤としてのイミダゾピラジン

(57) 【要約】

式 (I) の化合物及び薬剤として許容されるその塩



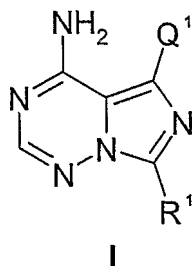
(式中、Q¹及びR¹は本明細書に定義されている。)
は、IGF-1R酵素を阻害し、チロシンキナーゼ阻害
による治療に応答する様々な疾患及び症状の治療及び/
又は予防に有用である。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物

【化 1】



10

又は薬剤として許容されるその塩。(式中、

Q^1 はアリール¹、ヘテロアリール¹、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニルであり、そのいずれも1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよく、

R^1 は C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-10} アルキル、ビスシクロ C_{5-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、ヘテロシクリル又はヘテロビスシクロ C_{5-10} アルキルであり、そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよく、

G^{10} 及び G^{41} は各々独立にハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^2$ 、 $-NR^2R^3$ (R^{2a})_{j1}、 $-C(O)R^2$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-CONR^2R^3$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)$ _{j1} R^2 、 $-SO_2NR^2R^3$ 、 $-NR^2C(=O)R^3$ 、 $-NR^2C(=O)OR^3$ 、 $-NR^2C(=O)NR^3R^{2a}$ 、 $-NR^2S(O)$ _{j1} R^3 、 $-C(=S)OR^2$ 、 $-C(=O)SR^2$ 、 $-NR^2C(=NR^3)NR^{2a}R^{3a}$ 、 $-NR^2C(=NR^3)OR^{2a}$ 、 $-NR^2C(=NR^3)SR^{2a}$ 、 $-OC(=O)OR^2$ 、 $-OC(=O)NR^2R^3$ 、 $-OC(=O)SR^2$ 、 $-SC(=O)OR^2$ 、 $-SC(O)NR^2R^3$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルコキシ C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{2-10} アルキニル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{2-10} アルキニル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、シクロ C_{3-8} アルキル C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル C_{2-10} アルケニル、シクロ C_{3-8} アルケニル C_{2-10} アルケニル、シクロ C_{3-8} アルキル C_{2-10} アルキニル、シクロ C_{3-8} アルケニル C_{2-10} アルキニル、ヘテロシクリル $-C_{0-10}$ アルキル、ヘテロシクリル $-C_{2-10}$ アルケニル若しくはヘテロシクリル $-C_{2-10}$ アルキニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ (R^{222a})_{j1a}、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)$ _{j1a} R^{222} 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)NR^{333}R^{222a}$ 、 $-NR^{222}S(O)$ _{j1a} R^{333} 、 $-C(=S)OR^{222}$ 、 $-C(O)SR^{222}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})NR^{222a}R^{333a}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})OR^{222a}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})SR^{222a}$ 、 $-OC(=O)OR^{222}$ 、 $-OC(=O)NR^{222}R^{333}$ 、 $-OC(=O)SR^{222}$ 、 $-SC(=O)OR^{222}$ 若しくは $-SC(=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよく、

又は G^{10} は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であってもよく、

又は G^{41} は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - C_{0-10}$ アルキルであってもよく、

又は G^{10} 及び G^{41} は各々独立にアリール $-C_{0-10}$ アルキル、アリール $-C_{2-10}$

20

30

40

50

1_0 アルケニル、アリール - C_{2-1_0} アルキニル、ヘタリール - C_{0-1_0} アルキル、ヘタリール - C_{2-1_0} アルケニル若しくはヘタリール - C_{2-1_0} アルキニルであつてもよく、そのいずれも1個以上の独立した八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ (R^{222a}) $_j$ $_{2a}$ 、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_j$ $_{2a}R^{222}$ 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)NR^{333}R^{222a}$ 、 $-NR^{222}S(O)_j$ $_{2a}R^{333}$ 、 $-C(=S)OR^{222}$ 、 $-C(=O)SR^{222}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})NR^{222a}R^{333a}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})OR^{222a}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})SR^{222a}$ 、 $-OC(=O)OR^{222}$ 、 $-OC(=O)NR^{222}R^{333}$ 、 $-OC(=O)SR^{222}$ 、 $-SC(=O)OR^{222}$ 若しくは $-SC(=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよく、
 G^{11} は八口、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ (R^{21a}) $_j$ $_{3}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_j$ $_{3}R^{21}$ 、 $-SO_2NR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_j$ $_{3}R^{31}$ 、 $-C(=S)OR^{21}$ 、 $-C(=O)SR^{21}$ 、 $-NR^{21}C(=NR^{31})NR^{21a}R^{31a}$ 、 $-NR^{21}C(=NR^{31})OR^{21a}$ 、 $-NR^{21}C(=NR^{31})SR^{21a}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 $-OC(=O)SR^{21}$ 、 $-SC(=O)OR^{21}$ 、 $-SC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 $-P(O)OR^{21}OR^{31}$ 、 C_{0-1_0} アルキル、 C_{2-1_0} アルケニル、 C_{2-1_0} アルキニル、 C_{1-1_0} アルコキシ C_{1-1_0} アルキル、 C_{1-1_0} アルコキシ C_{2-1_0} アルケニル、 C_{1-1_0} アルコキシ C_{2-1_0} アルキニル、 C_{1-1_0} アルキルチオ C_{1-1_0} アルキル、 C_{1-1_0} アルキルチオ C_{2-1_0} アルケニル、 C_{1-1_0} アルキルチオ C_{2-1_0} アルキニル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、シクロ C_{3-8} アルキル C_{1-1_0} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル C_{1-1_0} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル C_{2-1_0} アルケニル、シクロ C_{3-8} アルケニル C_{2-1_0} アルケニル、シクロ C_{3-8} アルキル C_{2-1_0} アルキニル、シクロ C_{3-8} アルケニル C_{2-1_0} アルキニル、ヘテロシクリル - C_{0-1_0} アルキル、ヘテロシクリル - C_{2-1_0} アルケニル若しくはヘテロシクリル - C_{2-1_0} アルキニルであり、そのいずれも1個以上の独立した八口、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}$ (R^{2221a}) $_j$ $_{3a}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_j$ $_{3a}R^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_j$ $_{3a}R^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 、 $-P(O)OR^{2221}OR^{3331}$ 若しくは $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、
又は G^{11} はアリール - C_{0-1_0} アルキル、アリール - C_{2-1_0} アルケニル、アリール - C_{2-1_0} アルキニル、ヘタリール - C_{0-1_0} アルキル、ヘタリール - C_{2-1_0} アルケニル若しくはヘタリール - C_{2-1_0} アルキニルであり、そのいずれも1個以上の独立した八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}$ (R^{2221a}) $_j$ $_{3a}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_j$ $_{3a}R^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_j$ $_{3a}R^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 、 $-P(O)OR^{2221}OR^{3331}$ 若しくは $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、

10

20

30

40

50

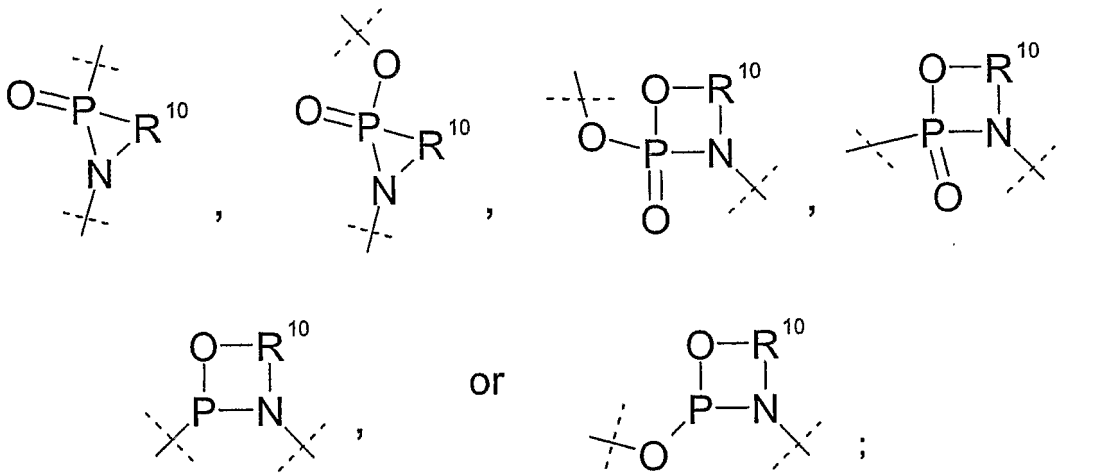
$^1 C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 、 $-P(O)OR^{2221}OR^{3331}$ 若しくは $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、
 又は G^{11} は C であり、 G^{11} が結合している炭素と一緒に、 R^5 及び G^{12} で置換された $C=C$ 二重結合を形成し、
 R^2 、 R^{2a} 、 R^3 、 R^{3a} 、 R^{222} 、 R^{222a} 、 R^{333} 、 R^{333a} 、 R^{21} 、 R^{21a} 、 R^{31} 、 R^{31a} 、 R^{2221} 、 R^{2221a} 、 R^{3331} 及び R^{3331a} は各々独立に C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルコキシ C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{2-10} アルキニル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{2-10} アルキニル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、シクロ C_{3-8} アルキル C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル C_{2-10} アルケニル、シクロ C_{3-8} アルケニル C_{2-10} アルケニル、シクロ C_{3-8} アルキル C_{2-10} アルキニル、シクロ C_{3-8} アルケニル C_{2-10} アルキニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル、ヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{2-10} アルキニル、アリール - C_{0-10} アルキル、アリール - C_{2-10} アルケニル、アリール - C_{2-10} アルキニル、ヘタリール - C_{0-10} アルキル、ヘタリール - C_{2-10} アルケニル 又は ヘタリール - C_{2-10} アルキニル であり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{13} 置換基で置換されていてもよく、
 又は $-NR^2R^3(R^{2a})_{j_1}$ 若しくは $-NR^{21}R^{31}(R^{21a})_{j_3}$ 若しくは $-NR^{222}R^{333}(R^{222a})_{j_1a}$ 若しくは $-NR^{222}R^{333}(R^{222a})_{j_2a}$ 若しくは $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_{j_3a}$ の場合、 R^2 及び R^3 若しくは R^{21} 及び R^{31} 若しくは R^{222} 及び R^{333} 若しくは R^{2221} 及び R^{3331} は、謹んで、これらが結合している窒素原子と一緒に飽和若しくは不飽和の 3 員環から 10 員環を形成していてもよく、ここで前記環は 1 個以上の独立した G^{14} 置換基で置換されていてもよく、および前記環は、 R^2 及び R^3 若しくは R^{222} 及び R^{333} 若しくは R^{2221} 及び R^{3331} が結合した窒素以外の 1 個以上の独立したヘテロ原子を含んでいてもよく、
 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 、 $-NR^7-$ 、 $-S(O)_{j_4}-$ 、 $-CR^5R^6-$ 、 $-N(C(O)OR^7)-$ 、 $-N(C(O)R^7)-$ 、 $-N(SO_2R^7)-$ 、 $-CH_2O-$ 、 $-CH_2S-$ 、 $-CH_2N(R^7)-$ 、 $-CH(NR^7)-$ 、 $-CH_2N(C(O)R^7)-$ 、 $-CH_2N(C(O)OR^7)-$ 、 $-CH_2N(SO_2R^7)-$ 、 $-CH(NHR^7)-$ 、 $-CH(NHC(O)R^7)-$ 、 $-CH(NHSO_2R^7)-$ 、 $-CH(NHC(O)OR^7)-$ 、 $-CH(OC(O)R^7)-$ 、 $-CH(OC(O)NHR^7)-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-C-C-$ 、 $-C(=NOR^7)-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CH(OR^7)-$ 、 $-C(O)N(R^7)-$ 、 $-N(R^7)C(O)-$ 、 $-N(R^7)S(O)-$ 、 $-N(R^7)S(O)_2-$ 、 $-OC(O)N(R^7)-$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^8)-$ 、 $-NR^7C(O)O-$ 、 $-S(O)N(R^7)-$ 、 $-S(O)_2N(R^7)-$ 、 $-N(C(O)R^7)S(O)-$ 、 $-N(C(O)R^7)S(O)_2-$ 、 $-N(R^7)S(O)N(R^8)-$ 、 $-N(R^7)S(O)_2N(R^8)-$ 、 $-C(O)N(R^7)C(O)-$ 、 $-S(O)N(R^7)C(O)-$ 、 $-S(O)_2N(R^7)C(O)-$ 、 $-OS(O)N(R^7)-$ 、 $-OS(O)_2N(R^7)-$ 、 $-N(R^7)S(O)O-$ 、 $-N(R^7)S(O)_2O-$ 、 $-N(R^7)S(O)C(O)-$ 、 $-N(R^7)S(O)_2C(O)-$ 、 $-SON(C(O)R^7)-$ 、 $-SO_2N(C(O)R^7)-$ 、 $-N(R^7)SON(R^8)-$ 、 $-N(R^7)SO_2N(R^8)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-N(R^7)P(OR^8)O-$ 、 $-N(R^7)P(OR^8)-$ 、 $-N(R^7)P(O)(OR^8)O-$ 、 $-N(R^7)P(O)(OR^8)-$ 、 $-N(C(O)R^7)P(OR^8)O-$ 、 $-N(C(O)$

$R^7)P(OR^8)-$ 、 $-N(C(O)R^7)P(O)(OR^8)O-$ 、 $-N(C(O)R^7)P(OR^8)-$ 、 $-CH(R^7)S(O)-$ 、 $-CH(R^7)S(O)_2-$ 、 $-CH(R^7)N(C(O)OR^8)-$ 、 $-CH(R^7)N(C(O)R^8)-$ 、 $-CH(R^7)N(SO_2R^8)-$ 、 $-CH(R^7)O-$ 、 $-CH(R^7)S-$ 、 $-CH(R^7)N(R^8)-$ 、 $-CH(R^7)N(C(O)R^8)-$ 、 $-CH(R^7)N(C(O)OR^8)-$ 、 $-CH(R^7)N(SO_2R^8)-$ 、 $-CH(R^7)C(=NOR^8)-$ 、 $-CH(R^7)C(O)-$ 、 $-CH(R^7)CH(OR^8)-$ 、 $-CH(R^7)C(O)N(R^8)-$ 、 $-CH(R^7)N(R^8)C(O)-$ 、 $-CH(R^7)N(R^8)S(O)-$ 、 $-CH(R^7)N(R^8)S(O)_2-$ 、 $-CH(R^7)OC(O)N(R^8)-$ 、 $-CH(R^7)N(R^8)C(O)N(R^7a)-$ 、 $-CH(R^7)NR^8C(O)O-$ 、 $-CH(R^7)S(O)N(R^8)-$ 、 $-CH(R^7)S(O)_2N(R^8)-$ 、 $-CH(R^7)N(C(O)R^8)S(O)-$ 、 $-CH(R^7)N(C(O)R^8)S(O)-$ 、 $-CH(R^7)N(R^8)S(O)N(R^7a)-$ 、 $-CH(R^7)N(R^8)S(O)_2N(R^7a)-$ 、 $-CH(R^7)C(O)N(R^8)C(O)-$ 、 $-CH(R^7)S(O)N(R^8)C(O)-$ 、 $-CH(R^7)S(O)_2N(R^8)C(O)-$ 、 $-CH(R^7)OS(O)N(R^8)-$ 、 $-CH(R^7)OS(O)_2N(R^8)-$ 、 $-CH(R^7)N(R^8)S(O)O-$ 、 $-CH(R^7)N(R^8)S(O)_2O-$ 、 $-CH(R^7)N(R^8)S(O)C(O)-$ 、 $-CH(R^7)N(R^8)S(O)_2C(O)-$ 、 $-CH(R^7)SON(C(O)R^8)-$ 、 $-CH(R^7)SO_2N(C(O)R^8)-$ 、 $-CH(R^7)N(R^8)SON(R^7a)-$ 、 $-CH(R^7)N(R^8)SO_2N(R^7a)-$ 、 $-CH(R^7)C(O)O-$ 、 $-CH(R^7)N(R^8)P(OR^7a)O-$ 、 $-CH(R^7)N(R^8)P(OR^7a)-$ 、 $-CH(R^7)N(R^8)P(O)(OR^7a)O-$ 、 $-CH(R^7)N(C(O)R^8)P(OR^7a)O-$ 、 $-CH(R^7)N(C(O)R^8)P(OR^7a)-$ 、 $-CH(R^7)N(C(O)R^8)P(O)(OR^7a)O-$ 又は $-CH(R^7)N(C(O)R^8)P(OR^7a)-$ であり、

10

20

又は X^1 及び Y^1 は各々独立に以下の構造式の1つによって表され、



30

40

R^{10} は、ホスフィンアミド又はホスホンアミドと一緒に、5、6又は7員のアリアル、ヘテロアリアル又はヘテロシクリル環構造を形成し、

R^5 、 R^6 、 G^{12} 、 G^{13} 、 G^{14} 及び G^{15} は各々独立に C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルコキシ C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{2-10} アルキニル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{2-10} アルキニル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、シクロ C_{3-8} アルキル C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル C_{2-10} アルケニル、シク

50

口 C_{3-8} アルケニル C_{2-10} アルケニル、シクロ C_{3-8} アルキル C_{2-10} アルキニル、シクロ C_{3-8} アルケニル C_{2-10} アルキニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル、ヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{2-10} アルキニル、アリール - C_{0-10} アルキル、アリール - C_{2-10} アルケニル、アリール - C_{2-10} アルキニル、ヘタリール - C_{0-10} アルキル、ヘタリール - C_{2-10} アルケニル又はヘタリール - C_{2-10} アルキニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{77}$ 、 $-NR^{77}R^{87}$ 、 $-C(O)R^{77}$ 、 $-CO_2R^{77}$ 、 $-CONR^{77}R^{87}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_{j5a}R^{77}$ 、 $-SO_2NR^{77}R^{87}$ 、 $-NR^{77}C(=O)R^{87}$ 、 $-NR^{77}C(=O)OR^{87}$ 、 $-NR^{77}C(=O)NR^{87}R^{77a}$ 、 $-NR^{77}S(O)_{j5a}R^{87}$ 、 $-C(=S)OR^{77}$ 、 $-C(=O)SR^{77}$ 、 $-NR^{77}C(=NR^{87})NR^{77a}R^{87a}$ 、 $-NR^{77}C(=NR^{87})OR^{77a}$ 、 $-NR^{77}C(=NR^{87})SR^{77a}$ 、 $-OC(=O)OR^{77}$ 、 $-OC(=O)NR^{77}R^{87}$ 、 $-OC(=O)SR^{77}$ 、 $-SC(=O)OR^{77}$ 、 $-P(O)OR^{77}OR^{87}$ 又は $-SC(=O)NR^{77}R^{87}$ 置換基で置換されていてもよく、

又は R^5 と R^6 は、これらが結合しているそれぞれの炭素原子と一緒に飽和若しくは不飽和の 3 員環から 10 員環を形成していてもよく、前記環は R^{69} で置換されていてもよく、及び前記環は 1 個以上の独立したヘテロ原子を含んでいてもよく、

R^7 、 R^{7a} 及び R^8 は各々独立にアシル、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル又はシクロ C_{3-10} アルキルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{15} 置換基で置換されていてもよく、

R^4 は C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよく、

R^{69} は八口、 $-OR^{41}$ 、 $-SH$ 、 $-NR^{41}R^{51}$ 、 $-CO_2R^{41}$ 、 $-CONR^{41}R^{51}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_j6R^{41}$ 、 $-SO_2NR^{41}R^{51}$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルコキシ C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{2-10} アルキニル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{2-10} アルキニル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、シクロ C_{3-8} アルキル C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル C_{2-10} アルケニル、シクロ C_{3-8} アルキル C_{2-10} アルケニル、シクロ C_{3-8} アルケニル C_{2-10} アルキニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル、ヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニル若しくはヘテロシクリル - C_{2-10} アルキニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した八口、シアノ、ニトロ、 $-OR^{778}$ 、 $-SO_2NR^{778}R^{888}$ 若しくは $-NR^{778}R^{888}$ 置換基で置換されていてもよく、

又は R^{69} はアリール - C_{0-10} アルキル、アリール - C_{2-10} アルケニル、アリール - C_{2-10} アルキニル、ヘタリール - C_{0-10} アルキル、ヘタリール - C_{2-10} アルケニル、ヘタリール - C_{2-10} アルキニル、モノ (C_{1-6} アルキル) アミノ C_{1-6} アルキル、ジ (C_{1-6} アルキル) アミノ C_{1-6} アルキル、モノ (アリール) アミノ C_{1-6} アルキル、ジ (アリール) アミノ C_{1-6} アルキル、モノヘタリールアミノアルキル、ジヘタリールアミノアルキル若しくは $-N(C_{1-6}$ アルキル) - C_{1-6} アルキル - アリールであり、そのいずれも 1 個以上の独立した八口、シアノ、ニトロ、 $-OR^{778}$ 、 C_{1-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、八口 C_{1-10} アルキル、八口 C_{2-10} アルケニル、八口 C_{2-10} アルキニル、 $-COOH$ 、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 $-CONR^{778}R^{888}$ 、 $-SO_2NR^{778}R^{888}$ 若しくは $-NR^{778}R^{888}$ 置換基で置換されていてもよく、

又は -NR^{4 1}R^{5 1} の場合には、R^{4 1} 及び R^{5 1} は、これらが結合している窒素原子と一緒に飽和若しくは不飽和の 3 員環から 10 員環を形成していてもよく、前記環は 1 個以上の独立したハロ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、C₁₋₁₀ アルコキシ、-SO₂ NR^{7 7 8}R^{8 8 8} 若しくは -NR^{7 7 8}R^{8 8 8} 置換基で置換されていてもよく、及び前記環は R^{4 1} 及び R^{5 1} が結合した窒素以外の 1 個以上の独立したヘテロ原子を含んでいてもよく、

R^{4 1}、R^{5 1}、R^{7 7}、R^{7 7 a}、R^{8 7}、R^{8 7 a}、R^{7 7 8} 及び R^{8 8 8} は各々独立に C₀₋₁₀ アルキル、C₂₋₁₀ アルケニル、C₂₋₁₀ アルキニル、C₁₋₁₀ アルコキシ C₁₋₁₀ アルキル、C₁₋₁₀ アルコキシ C₂₋₁₀ アルケニル、C₁₋₁₀ アルコキシ C₂₋₁₀ アルキニル、C₁₋₁₀ アルキルチオ C₁₋₁₀ アルキル、C₁₋₁₀ アルキルチオ C₂₋₁₀ アルケニル、C₁₋₁₀ アルキルチオ C₂₋₁₀ アルキニル、シクロ C₃₋₈ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルケニル、シクロ C₃₋₈ アルキル C₁₋₁₀ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルケニル C₁₋₁₀ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルキル C₂₋₁₀ アルケニル、シクロ C₃₋₈ アルケニル C₂₋₁₀ アルケニル、シクロ C₃₋₈ アルキル C₂₋₁₀ アルキニル、シクロ C₃₋₈ アルケニル C₂₋₁₀ アルキニル、ヘテロシクリル - C₀₋₁₀ アルキル、ヘテロシクリル - C₂₋₁₀ アルケニル、ヘテロシクリル - C₂₋₁₀ アルキニル、C₁₋₁₀ アルキルカルボニル、C₂₋₁₀ アルケニルカルボニル、C₂₋₁₀ アルキニルカルボニル、C₁₋₁₀ アルコキシカルボニル、C₁₋₁₀ アルコキシカルボニル C₁₋₁₀ アルキル、モノ C₁₋₆ アルキルアミノカルボニル、ジ C₁₋₆ アルキルアミノカルボニル、モノ (アリアル) アミノカルボニル、ジ (アリアル) アミノカルボニル、C₁₋₁₀ アルキル (アリアル) アミノカルボニル、モノヘタリアルアミノカルボニル、ジヘタリアルアミノカルボニル若しくはアルキルヘタリアルアミノカルボニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、C₁₋₁₀ アルコキシ、-SO₂N (C₀₋₄ アルキル) (C₀₋₄ アルキル) 若しくは -N (C₀₋₄ アルキル) (C₀₋₄ アルキル) 置換基で置換されていてもよく、

又は R^{4 1}、R^{5 1}、R^{7 7}、R^{7 7 a}、R^{8 7}、R^{8 7 a}、R^{7 7 8} 及び R^{8 8 8} は各々独立にアリアル - C₀₋₁₀ アルキル、アリアル - C₂₋₁₀ アルケニル、アリアル - C₂₋₁₀ アルキニル、ヘタリアル - C₀₋₁₀ アルキル、ヘタリアル - C₂₋₁₀ アルケニル、ヘタリアル - C₂₋₁₀ アルキニル、モノ (C₁₋₆ アルキル) アミノ C₁₋₆ アルキル、ジ (C₁₋₆ アルキル) アミノ C₁₋₆ アルキル、モノ (アリアル) アミノ C₁₋₆ アルキル、ジ (アリアル) アミノ C₁₋₆ アルキル、モノヘタリアルアミノアルキル、ジヘタリアルアミノアルキル若しくは -N (C₁₋₆ アルキル) - C₁₋₆ アルキル - アリアルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、シアノ、ニトロ、-O (C₀₋₄ アルキル)、C₁₋₁₀ アルキル、C₂₋₁₀ アルケニル、C₂₋₁₀ アルキニル、ハロ C₁₋₁₀ アルキル、ハロ C₂₋₁₀ アルケニル、ハロ C₂₋₁₀ アルキニル、-COOH、C₁₋₄ アルコキシカルボニル、-CON (C₀₋₄ アルキル) (C₀₋₄ アルキル)、-SO₂N (C₀₋₄ アルキル) (C₀₋₄ アルキル) 若しくは -N (C₀₋₄ アルキル) (C₀₋₄ アルキル) 置換基で置換されていてもよく、及び

n、m、j₁、j_{1 a}、j_{2 a}、j₃、j_{3 a}、j₄、j_{5 a} 及び j₆ は各々独立に 0、1 又は 2 である。) 40

【請求項 2】

R¹ がシクロ C₃₋₁₀ アルキル、ピシクロ C₅₋₁₀ アルキル、アリアル、ヘテロアリアル、アラルキル、ヘテロアラルキル、ヘテロシクリル又はヘテロピシクロ C₅₋₁₀ アルキルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{1 1} 置換基で置換されていてもよい、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R¹ がシクロ C₃₋₁₀ アルキル、アリアル、ヘテロアリアル、アラルキル、ヘテロアラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{1 1} 置換基で置換されていてもよい、請求項 2 に記載の化合物。

10

20

30

40

50

【請求項 4】

R¹ がシクロアルキル、アリアル、ヘテロアリアル、アラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{1 1} 置換基で置換されていてもよく、及び Q¹ がアリアル¹ 又はヘテロアリアル¹ であり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{1 0} 置換基で置換されていてもよい、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

Q¹ が前記 1 から 5 個の独立した G^{1 0} 置換基で置換されたアリアル¹ であり、前記 G^{1 0} 置換基の少なくとも 1 個が - (X¹)_n - (Y¹)_m - R⁴ であり、n 及び m がどちらも 1 であり、R⁴ が 1 個以上の G^{4 1} 置換基で置換されていてもよいアリアルであり、X¹ が - O - であり、Y¹ が - CH₂ - である、請求項 4 に記載の化合物。

10

【請求項 6】

G^{1 0} がハロ、- OR²、- NR²R³、- C(O)R²、- CO₂R²、- CONR²R³、- SO₂NR²R³、- NR²C(=O)R³、- NR²C(=O)OR³、- NR²C(=O)NR³R^{2 a}、- NR²S(O)_{j 1}R³、- OC(=O)OR²、- OC(=O)NR²R³、C_{0-1 0}アルキル、C_{2-1 0}アルケニル、C_{1-1 0}アルコキシC_{1-1 0}アルキル、C_{1-1 0}アルキルチオC_{1-1 0}アルキル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、ヘテロシクリル-C_{0-1 0}アルキル若しくはヘテロシクリル-C_{2-1 0}アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したオキソ、- CF₃、- OCF₃、- OR^{2 2 2}、- NR^{2 2 2}R^{3 3 3}、- C(O)R^{2 2 2}、- CO₂R^{2 2 2}、- CONR^{2 2 2}R^{3 3 3}、- SO₂NR^{2 2 2}R^{3 3 3}、- NR^{2 2 2}C(=O)R^{3 3 3}、- NR^{2 2 2}C(=O)OR^{3 3 3}、- NR^{2 2 2}(C=O)NR^{3 3 3}R^{2 2 2 a}、- NR^{2 2 2}S(O)_{j 1 a}R^{3 3 3}、- NR^{2 2 2}C(=NR^{3 3 3})NR^{2 2 2 a}R^{3 3 3 a}若しくは - O(C=O)NR^{2 2 2}R^{3 3 3} 置換基で置換されていてもよく、

20

又は G^{1 0} が - (X¹)_n - (Y¹)_m - R⁴ であり、

又は G^{1 0} がアリアル-C_{0-1 0}アルキル若しくはヘタリアル-C_{0-1 0}アルキルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、- CF₃、- OCF₃、- OR^{2 2 2}、- NR^{2 2 2}R^{3 3 3}、- C(O)R^{2 2 2}、- CO₂R^{2 2 2}、- CONR^{2 2 2}R^{3 3 3}、- SO₂NR^{2 2 2}R^{3 3 3}、- NR^{2 2 2}C(=O)R^{3 3 3}、- NR^{2 2 2}C(=O)OR^{3 3 3}、- NR^{2 2 2}C(=O)NR^{3 3 3}R^{2 2 2 a}、- NR^{2 2 2}S(O)_{j 2 a}R^{3 3 3}、- NR^{2 2 2}C(=NR^{3 3 3})NR^{2 2 2 a}R^{3 3 3 a}若しくは - OC(=O)NR^{2 2 2}R^{3 3 3} 置換基で置換されていてもよい、請求項 4 に記載の化合物。

30

【請求項 7】

Q¹ が前記 1 から 5 個の独立した G^{1 0} 置換基で置換され、前記 G^{1 0} 置換基の少なくとも 1 個が - (X¹)_n - (Y¹)_m - R⁴ である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 8】

R⁴ が C_{0-1 0}アルキル、アリアル、ヘテロアリアル、シクロC_{3-1 0}アルキル、ヘテロシクリル、シクロC_{3-1 0}アルケニル又はヘテロシクロアルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{4 1} 置換基で置換されていてもよい、請求項 7 に記載の化合物。

40

【請求項 9】

G^{1 1} が - OR^{2 1}、- NR^{2 1}R^{3 1}、- CO₂R^{2 1}、- C(O)R^{2 1}、- CONR^{2 1}R^{3 1}、- NR^{2 1}C(=O)R^{3 1}、- NR^{2 1}C(=O)OR^{3 1}、- NR^{2 1}C(=O)NR^{3 1}R^{2 1 a}、- NR^{2 1}S(O)_{j 3}R^{3 1}、- OC(=O)OR^{2 1}、- OC(=O)NR^{2 1}R^{3 1}、C_{0-1 0}アルキル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、ヘテロシクリル-C_{0-1 0}アルキル又はヘテロシクリル-C_{2-1 0}アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、- CF₃、- OCF₃、- OR^{2 2 2 1}、- NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}(R^{2 2 2 1 a})_{j 3 a}、- C(O)R^{2 2 2 1}、- CO₂R^{2 2 2 1}、- CONR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、- NO₂、

50

- CN、- S(O)_j R^{2 2 2 1}、- SO₂ NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、- NR^{2 2 2 1} C(=O) R^{3 3 3 1}、- NR^{2 2 2 1} C(=O) OR^{3 3 3 1}、- NR^{2 2 2 1} C(=O) NR^{3 3 3 1} R^{2 2 2 1 a}、- NR^{2 2 2 1} S(O)_j R^{3 3 3 1}、- C(=S) OR^{2 2 2 1}、- C(=O) SR^{2 2 2 1}、- NR^{2 2 2 1} C(=NR^{3 3 3 1}) NR^{2 2 2 1 a} R^{3 3 3 1 a}、- NR^{2 2 2 1} C(=NR^{3 3 3 1}) OR^{2 2 2 1 a}、- NR^{2 2 2 1} C(=NR^{3 3 3 1}) SR^{2 2 2 1 a}、- OC(=O) OR^{2 2 2 1}、- OC(=O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、- OC(=O) SR^{2 2 2 1}、- SC(=O) OR^{2 2 2 1} 又は - SC(=O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} 置換基で置換されていてもよい、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

Q¹ が前記 1 から 5 個の独立した G^{1 0} 置換基で置換され、前記 G^{1 0} 置換基の少なくとも 1 個が - (X¹)_n - (Y¹)_m - R⁴ であり、X¹ 及び Y¹ が各々独立に - O -、- NR⁷ -、- CR⁵ R⁶ -、- S(O)_j - 又は - C(O) - であり、n 及び m がどちらも 1 であり、j₄ が 1 又は 2 である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 11】

R⁴ が C₀₋₁₀ アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C₃₋₁₀ アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C₃₋₁₀ アルケニル又はヘテロシクロアルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{4 1} 置換基で置換されていてもよい、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

G^{1 1} が - OR^{2 1}、- NR^{2 1} R^{3 1}、- CO₂ R^{2 1}、- C(O) R^{2 1}、- CONR^{2 1} R^{3 1}、- NR^{2 1} C(=O) R^{3 1}、- NR^{2 1} C(=O) OR^{3 1}、- NR^{2 1} C(=O) NR^{3 1} R^{2 1 a}、- NR^{2 1} S(O)_j R^{3 1}、- OC(=O) OR^{2 1}、- OC(=O) NR^{2 1} R^{3 1}、C₀₋₁₀ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルケニル、ヘテロシクリル - C₀₋₁₀ アルキル又はヘテロシクリル - C₂₋₁₀ アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、- CF₃、- OCF₃、- OR^{2 2 2 1}、- NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} (R^{2 2 2 1 a})_j R^{3 a}、- C(O) R^{2 2 2 1}、- CO₂ R^{2 2 2 1}、- CONR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、- NO₂、- CN、- S(O)_j R^{2 2 2 1}、- SO₂ NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、- NR^{2 2 2 1} C(=O) R^{3 3 3 1}、- NR^{2 2 2 1} C(=O) OR^{3 3 3 1}、- NR^{2 2 2 1} C(=O) NR^{3 3 3 1} R^{2 2 2 1 a}、- NR^{2 2 2 1} S(O)_j R^{3 3 3 1}、- C(=S) OR^{2 2 2 1}、- C(=O) SR^{2 2 2 1}、- NR^{2 2 2 1} C(=NR^{3 3 3 1}) NR^{2 2 2 1 a} R^{3 3 3 1 a}、- NR^{2 2 2 1} C(=NR^{3 3 3 1}) OR^{2 2 2 1 a}、- NR^{2 2 2 1} C(=NR^{3 3 3 1}) SR^{2 2 2 1 a}、- OC(=O) OR^{2 2 2 1}、- OC(=O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、- OC(=O) SR^{2 2 2 1}、- SC(=O) OR^{2 2 2 1} 又は - SC(=O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} 置換基で置換されていてもよい、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】

Q¹ が前記 1 から 5 個の独立した G^{1 0} 置換基で置換され、前記 G^{1 0} 置換基の少なくとも 1 個が - (X¹)_n - (Y¹)_m - R⁴ であり、X¹ 及び Y¹ が各々独立に - O - 又は - CR⁵ R⁶ - であり、及び n 及び m がどちらも 1 である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 14】

R⁴ が C₀₋₁₀ アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C₃₋₁₀ アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C₃₋₁₀ アルケニル又はヘテロシクロアルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{4 1} 置換基で置換されていてもよい、請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 15】

G^{1 1} が - OR^{2 1}、- NR^{2 1} R^{3 1}、- CO₂ R^{2 1}、- C(O) R^{2 1}、- CONR^{2 1} R^{3 1}、- NR^{2 1} C(=O) R^{3 1}、- NR^{2 1} C(=O) OR^{3 1}、- NR

10

20

30

40

50

${}^2_1C(=O)NR^3_1R^2_1a$ 、 $-NR^2_1S(O)_j_3R^3_1$ 、 $-OC(=O)OR^2_1$ 、 $-OC(=O)NR^2_1R^3_1$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立した八口、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^2_2R^2_1$ 、 $-NR^2_2R^3_3R^2_1(R^2_2R^2_1a)_j_3a$ 、 $-C(O)R^2_2R^2_1$ 、 $-CO_2R^2_2R^2_1$ 、 $-CONR^2_2R^3_3R^2_1R^3_3R^3_1$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_j_3aR^2_2R^2_1$ 、 $-SO_2NR^2_2R^3_3R^3_1$ 、 $-NR^2_2R^2_1C(=O)R^3_3R^3_1$ 、 $-NR^2_2R^2_1C(=O)OR^3_3R^3_1$ 、 $-NR^2_2R^2_1C(=O)NR^3_3R^3_1R^2_2R^2_1a$ 、 $-NR^2_2R^2_1S(O)_j_3aR^3_3R^3_1$ 、 $-C(=S)OR^2_2R^2_1$ 、 $-C(=O)SR^2_2R^2_1$ 、 $-NR^2_2R^2_1C(=NR^3_3R^3_1)NR^2_2R^2_1aR^3_3R^3_1a$ 、 $-NR^2_2R^2_1C(=NR^3_3R^3_1)OR^2_2R^2_1a$ 、 $-NR^2_2R^2_1C(=NR^3_3R^3_1)SR^2_2R^2_1a$ 、 $-OC(=O)OR^2_2R^2_1$ 、 $-OC(=O)NR^2_2R^2_1R^3_3R^3_1$ 、 $-OC(=O)SR^2_2R^2_1$ 、 $-SC(=O)OR^2_2R^2_1$ 又は $-SC(=O)NR^2_2R^2_1R^3_3R^3_1$ 置換基で置換されていてもよい、請求項14に記載の化合物。

10

【請求項16】

R^1 がアリール、ヘテロアリール、アラルキル又はヘテロアラルキルであり、そのいずれも1個以上の独立した G^1_1 置換基で置換されていてもよい、請求項1に記載の化合物。

【請求項17】

R^1 が、1個以上の独立した G^1_1 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 Q^1 が、前記1から5個の独立した G^1_0 置換基で置換されたアリール 1 であり、前記 G^1_0 置換基の少なくとも1個が $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n 及び m がどちらも1であり、 R^4 が、1個以上の G^4_1 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 X^1 が $-O-$ であり、及び Y^1 が $-CH_2-$ である、請求項16に記載の化合物。

20

【請求項18】

R^1 が、1個以上の独立した G^1_1 置換基で置換されていてもよいアリールであり、及び Q^1 がアリール 1 又はヘテロアリール 1 であり、そのいずれも1個以上の独立した G^1_0 置換基で置換されていてもよい、請求項16に記載の化合物。

【請求項19】

Q^1 が、1個以上の独立した G^1_0 置換基で置換されていてもよいヘテロアリール 1 であり、 G^1_0 が八口、 $-OR^2$ 、 $-NR^2R^3$ 、 $-C(O)R^2$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-CONR^2R^3$ 、 $-SO_2NR^2R^3$ 、 $-NR^2C(=O)R^3$ 、 $-NR^2C(=O)OR^3$ 、 $-NR^2C(=O)NR^3R^2a$ 、 $-NR^2S(O)_j_1R^3$ 、 $-OC(=O)OR^2$ 、 $-OC(=O)NR^2R^3$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^2_2R^2_2$ 、 $-NR^2_2R^3_3R^3_3$ 、 $-C(O)R^2_2R^2_2$ 、 $-CO_2R^2_2R^2_2$ 、 $-CONR^2_2R^3_3R^3_3$ 、 $-SO_2NR^2_2R^3_3R^3_3$ 、 $-NR^2_2R^2_2C(=O)R^3_3R^3_3$ 、 $-NR^2_2R^2_2C(=O)OR^3_3R^3_3$ 、 $-NR^2_2R^2_2(C(=O)NR^3_3R^3_3R^2_2R^2_2a)$ 、 $-NR^2_2R^2_2S(O)_j_1aR^3_3R^3_3$ 、 $-NR^2_2R^2_2C(=NR^3_3R^3_3)NR^2_2R^2_2aR^3_3R^3_3a$ 若しくは $-OC(=O)NR^2_2R^2_2R^3_3R^3_3$ 置換基で置換されていてもよく、

40

又は G^1_0 が $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、又は G^1_0 がアリール- C_{0-10} アルキル若しくはヘタリール- C_{0-10} アルキルであり、そのいずれも1個以上の独立した八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^2_2R^2_2$ 、 $-NR^2_2R^3_3R^3_3$ 、 $-C(O)R^2_2R^2_2$ 、 $-CO_2R^2_2R^2_2$ 、 $-CONR^2_2R^3_3R^3_3$ 、 $-SO_2NR^2_2R^3_3R^3_3$ 、 $-NR^2_2R^2_2C(=O)R^3_3R^3_3$ 、 $-NR^2_2R^2_2C(=O)OR^3_3R^3_3$ 、 $-NR^2_2R^2_2C(=O)NR^3_3R^3_3R^2_2R^2_2a$ 、 $-NR^2_2R^2_2S(O)_j_2aR^3_3R^3_3$ 、 $-NR^2_2R^2_2$

50

$^2 C (=NR^{333})NR^{222}R^{333}$ a 若しくは $-OC(=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよい、請求項 18 に記載の化合物。

【請求項 20】

Q^1 が前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個が $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、並びに n 及び m がどちらも 1 である、請求項 18 に記載の化合物。

【請求項 21】

R^4 が C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい、請求項 20 に記載の化合物。

10

【請求項 22】

G^{11} が $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_j R^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_j$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_j R^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_j R^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよい、請求項 21 に記載の化合物。

20

30

【請求項 23】

Q^1 が前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個が $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 が各々独立に $-O-$ 、 $-NR^7-$ 、 $-CR^5R^6-$ 、 $-S(O)_j$ 又は $-C(O)-$ であり、 n 及び m がどちらも 1 であり、及び j が 1 又は 2 である、請求項 18 に記載の化合物。

【請求項 24】

R^4 が C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい、請求項 23 に記載の化合物。

40

【請求項 25】

G^{11} が $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_j R^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_j$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_j R^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_j R^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよい、請求項 24 に記載の化合物。

50

$^1C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_j R^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよい、請求項24に記載の化合物。

【請求項26】

Q^1 が前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個が $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 が各々独立に $-O-$ 又は $-CH_2-$ であり、並びに n 及び m がどちらも1である、請求項23に記載の化合物。

10

【請求項27】

R^4 が C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい、請求項26に記載の化合物。

【請求項28】

G^{11} が $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_j R^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_j R^{3a}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_j R^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_j R^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよい、請求項27に記載の化合物。

20

30

【請求項29】

R^1 がシクロ C_{3-10} アルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい、請求項1に記載の化合物。

【請求項30】

R^1 が、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいヘテロシクリルであり、及び Q^1 がアリール 1 又はヘテロアリール 1 であり、そのいずれも1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよい、請求項29に記載の化合物。

40

【請求項31】

Q^1 が、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよいヘテロアリール 1 であり、及び G^{10} がハロ、 $-OR^2$ 、 $-NR^2R^3$ 、 $-C(O)R^2$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-CONR^2R^3$ 、 $-SO_2NR^2R^3$ 、 $-NR^2C(=O)R^3$ 、 $-NR^2C(=O)OR^3$ 、 $-NR^2C(=O)NR^3R^{2a}$ 、 $-NR^2S(O)_j R^3$ 、 $-OC(=O)OR^2$ 、 $-OC(=O)NR^2R^3$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル

50

若しくはヘテロシクリル - C₂₋₁₀ アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したオキソ、-CF₃、-OCF₃、-OR^{2 2 2}、-NR^{2 2 2}R^{3 3 3}、-C(O)R^{2 2 2}、-CO₂R^{2 2 2}、-CONR^{2 2 2}R^{3 3 3}、-SO₂NR^{2 2 2}R^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=O)R^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=O)OR^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}(C=O)NR^{3 3 3}R^{2 2 2 a}、-NR^{2 2 2}S(O)_{j 1 a}R^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=NR^{3 3 3})NR^{2 2 2 a}R^{3 3 3 a}若しくは-OC(=O)NR^{2 2 2}R^{3 3 3}置換基で置換されていてもよく、

又はG^{1 0}が-(X¹)_n-(Y¹)_m-R⁴であり、又はG^{1 0}がアリール-C₀₋₁₀アルキル若しくはヘタリール-C₀₋₁₀アルキルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、-CF₃、-OCF₃、-OR^{2 2 2}、-NR^{2 2 2}R^{3 3 3}、-C(O)R^{2 2 2}、-CO₂R^{2 2 2}、-CONR^{2 2 2}R^{3 3 3}、-SO₂NR^{2 2 2}R^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=O)R^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=O)OR^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=O)NR^{3 3 3}R^{2 2 2 a}、-NR^{2 2 2}S(O)_{j 2 a}R^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=NR^{3 3 3})NR^{2 2 2 a}R^{3 3 3 a}若しくは-OC(=O)NR^{2 2 2}R^{3 3 3}置換基で置換されていてもよい、
請求項 30 に記載の化合物。

【請求項 32】

Q¹が、前記 1 から 5 個の独立したG^{1 0}置換基で置換されたアリール¹であり、前記G^{1 0}置換基の少なくとも 1 個が-(X¹)_n-(Y¹)_m-R⁴であり、n及びmがどちらも 1 であり、R⁴が 1 個以上のG^{4 1}置換基で置換されていてもよいアリールであり、X¹が-O-であり、及びY¹が-CH₂-である、請求項 30 に記載の化合物。

【請求項 33】

Q¹が前記 1 から 5 個の独立したG^{1 0}置換基で置換され、前記G^{1 0}置換基の少なくとも 1 個が-(X¹)_n-(Y¹)_m-R⁴である、請求項 30 に記載の化合物。

【請求項 34】

R⁴がC₀₋₁₀アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロC₃₋₁₀アルキル、ヘテロシクリル、シクロC₃₋₁₀アルケニル又はヘテロシクロアルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したG^{4 1}置換基で置換されていてもよい、請求項 33 に記載の化合物。

【請求項 35】

G^{1 1}が-OR^{2 1}、-NR^{2 1}R^{3 1}、-CO₂R^{2 1}、-C(O)R^{2 1}、-CONR^{2 1}R^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)R^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)OR^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)NR^{3 1}R^{2 1 a}、-NR^{2 1}S(O)_{j 3}R^{3 1}、-OC(=O)OR^{2 1}、-OC(=O)NR^{2 1}R^{3 1}、C₀₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、ヘテロシクリル-C₀₋₁₀アルキル又はヘテロシクリル-C₂₋₁₀アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、-CF₃、-OCF₃、-OR^{2 2 2 1}、-NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}(R^{2 2 2 1 a})_{j 3 a}、-C(O)R^{2 2 2 1}、-CO₂R^{2 2 2 1}、-CONR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、-NO₂、-CN、-S(O)_{j 3 a}R^{2 2 2 1}、-SO₂NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=O)R^{3 3 3 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=O)OR^{3 3 3 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=O)NR^{3 3 3 1}R^{2 2 2 1 a}、-NR^{2 2 2 1}S(O)_{j 3 a}R^{3 3 3 1}、-C(=S)OR^{2 2 2 1}、-C(=O)SR^{2 2 2 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})NR^{2 2 2 1 a}R^{3 3 3 1 a}、-NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})OR^{2 2 2 1 a}、-NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})SR^{2 2 2 1 a}、-OC(=O)OR^{2 2 2 1}、-OC(=O)NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、-OC(=O)SR^{2 2 2 1}、-SC(=O)OR^{2 2 2 1}又は-SC(=O)NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}置換基で置換されていてもよい、請求項 34 に記載の化合物。

【請求項 36】

Q¹が前記 1 から 5 個の独立したG^{1 0}置換基で置換され、前記G^{1 0}置換基の少なくとも 1 個が-(X¹)_n-(Y¹)_m-R⁴であり、X¹及びY¹が各々独立に-O-

10

20

30

40

50

- NR⁷ -, - CR⁵R⁶ -, - S(O)_j⁴ - 又は - C(O) - であり、n 及び m がどちらも 1 であり、及び j⁴ が 1 又は 2 である、請求項 30 に記載の化合物。

【請求項 37】

R⁴ が C₀₋₁₀ アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C₃₋₁₀ アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C₃₋₁₀ アルケニル又はヘテロシクロアルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G⁴¹ 置換基で置換されていてもよい、請求項 36 に記載の化合物。

【請求項 38】

G¹¹ が - OR²¹、- NR²¹R³¹、- CO₂R²¹、- C(O)R²¹、- CONR²¹R³¹、- NR²¹C(=O)R³¹、- NR²¹C(=O)OR³¹、- NR²¹C(=O)NR³¹R²^{1a}、- NR²¹S(O)_j³R³¹、- OC(=O)OR²¹、- OC(=O)NR²¹R³¹、C₀₋₁₀ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルケニル、ヘテロシクリル - C₀₋₁₀ アルキル又はヘテロシクリル - C₂₋₁₀ アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、- CF₃、- OCF₃、- OR²²²¹、- NR²²²¹R³³³¹(R²²²^{1a})_j^{3a}、- C(O)R²²²¹、- CO₂R²²²¹、- CONR²²²¹R³³³¹、- NO₂、- CN、- S(O)_j^{3a}R²²²¹、- SO₂NR²²²¹R³³³¹、- NR²²²¹C(=O)R³³³¹、- NR²²²¹C(=O)OR³³³¹、- NR²²²¹C(=O)NR³³³¹R²²²^{1a}、- NR²²²¹S(O)_j^{3a}R³³³¹、- C(=S)OR²²²¹、- C(=O)SR²²²¹、- NR²²²¹C(=NR³³³¹)NR²²²^{1a}R³³³^{1a}、- NR²²²¹C(=NR³³³¹)OR²²²^{1a}、- NR²²²¹C(=NR³³³¹)SR²²²^{1a}、- OC(=O)OR²²²¹、- OC(=O)NR²²²¹R³³³¹、- OC(=O)SR²²²¹、- SC(=O)OR²²²¹ 又は - SC(=O)NR²²²¹R³³³¹ 置換基で置換されていてもよい、請求項 37 に記載の化合物。

10

20

【請求項 39】

Q¹ が前記 1 から 5 個の独立した G¹⁰ 置換基で置換され、前記 G¹⁰ 置換基の少なくとも 1 個が - (X¹)_n - (Y¹)_m - R⁴ であり、X¹ 及び Y¹ が各々独立に - O - 又は - CH₂ - であり、並びに n 及び m がどちらも 1 である、請求項 36 に記載の化合物。

【請求項 40】

R⁴ が C₀₋₁₀ アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C₃₋₁₀ アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C₃₋₁₀ アルケニル又はヘテロシクロアルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G⁴¹ 置換基で置換されていてもよい、請求項 39 に記載の化合物。

30

【請求項 41】

G¹¹ が - OR²¹、- NR²¹R³¹、- CO₂R²¹、- C(O)R²¹、- CONR²¹R³¹、- NR²¹C(=O)R³¹、- NR²¹C(=O)OR³¹、- NR²¹C(=O)NR³¹R²^{1a}、- NR²¹S(O)_j³R³¹、- OC(=O)OR²¹、- OC(=O)NR²¹R³¹、C₀₋₁₀ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルケニル、ヘテロシクリル - C₀₋₁₀ アルキル又はヘテロシクリル - C₂₋₁₀ アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、- CF₃、- OCF₃、- OR²²²¹、- NR²²²¹R³³³¹(R²²²^{1a})_j^{3a}、- C(O)R²²²¹、- CO₂R²²²¹、- CONR²²²¹R³³³¹、- NO₂、- CN、- S(O)_j^{3a}R²²²¹、- SO₂NR²²²¹R³³³¹、- NR²²²¹C(=O)R³³³¹、- NR²²²¹C(=O)OR³³³¹、- NR²²²¹C(=O)NR³³³¹R²²²^{1a}、- NR²²²¹S(O)_j^{3a}R³³³¹、- C(=S)OR²²²¹、- C(=O)SR²²²¹、- NR²²²¹C(=NR³³³¹)NR²²²^{1a}R³³³^{1a}、- NR²²²¹C(=NR³³³¹)OR²²²^{1a}、- NR²²²¹C(=NR³³³¹)SR²²²^{1a}、- OC(=O)OR²²²¹、- OC(=O)NR²²²¹R³³³¹、- OC(=O)SR²²²¹、- SC(=O)OR²²²¹

40

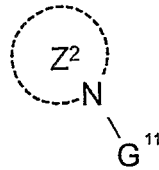
50

$R^2 R^2 R^1$ 又は $-SC(=O)NR^2 R^2 R^2 R^1 R^3 R^3 R^3 R^1$ 置換基で置換されていてもよい、請求項 40 に記載の化合物。

【請求項 42】

R^1 が下記構造式で表される、請求項 29 に記載の化合物。

【化 3】



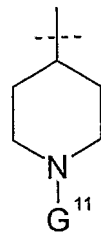
10

(式中、 Z^2 は、 G^{11} で置換された N を含むヘテロシクリルである。)

【請求項 43】

R^1 が下記構造式で表される、請求項 29 に記載の化合物。

【化 4】



20

(式中、 G^{11} は $-C(O)R^{21}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-SO_2NR^{21}R^{31}$ 、 $-S(O)_jR^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル $-C_{0-10}$ アルキル若しくはヘテロシクリル $-C_{2-10}$ アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_jR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、

30

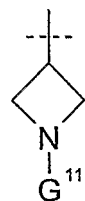
又は G^{11} はアリール $-C_{0-10}$ アルキル若しくはヘタリール $-C_{0-10}$ アルキルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_jR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 若しくは $OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよい。)

40

【請求項 44】

R^1 が下記構造式で表される、上記請求項 29 に記載の化合物。

【化 5】



50

(式中、 G^{11} は $-C(O)R^{21}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-SO_2NR^{21}R^{31}$ 、 $-S(O)_jR^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_jR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221}R^{3331}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、

又はアリール - C_{0-10} アルキル若しくはヘタリール - C_{0-10} アルキルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_jR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221}R^{3331}$ 又は $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよい。) 20

【請求項 45】

R^1 が、 G^{11} で 3 位が置換されたシス - 若しくはトランス - シクロブチルであり、又は R^1 が、 G^{11} で 4 位が置換されたシス - 若しくはトランス - シクロヘキシルである、請求項 29 に記載の化合物。

【請求項 46】

Q^1 がアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよい、請求項 45 に記載の化合物。

【請求項 47】

Q^1 が、1 個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよいアリール¹ である、請求項 46 に記載の化合物。 30

【請求項 48】

G^{10} がハロ、 $-OR^2$ 、 $-NR^2R^3$ 、 $-C(O)R^2$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-CONR^2R^3$ 、 $-SO_2NR^2R^3$ 、 $-NR^2C(=O)R^3$ 、 $-NR^2C(=O)OR^3$ 、 $-NR^2C(=O)NR^3R^{2a}$ 、 $-NR^2S(O)_jR^3$ 、 $-OC(=O)OR^2$ 、 $-OC(=O)NR^2R^3$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ 、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}(C=O)NR^{333}R^{222a}$ 、 $-NR^{222}S(O)_jR^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})NR^{222}R^{333}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよく、

又は G^{10} が $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、又は G^{10} がアリール - C_{0-10} アルキル若しくはヘタリール - C_{0-10} アルキルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ 、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)NR^{333}R^{222a}$ 、 $-NR^{222}S(O)_jR^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})NR^{222}R^{333}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよく、 50

$^2 C(=NR^{333})NR^{222}R^{333}$ a 若しくは $-OC(=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよい、請求項 47 に記載の化合物。

【請求項 49】

Q^1 が前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個が $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、並びに n 及び m がどちらも 1 である、請求項 46 に記載の化合物。

【請求項 50】

R^4 が C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい、請求項 49 に記載の化合物。

10

【請求項 51】

G^{11} が $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_j R^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル $-C_{0-10}$ アルキル又はヘテロシクリル $-C_{2-10}$ アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_j$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_j R^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_j R^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよい、請求項 50 に記載の化合物。

20

30

【請求項 52】

Q^1 が前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個が $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 が各々独立に $-O-$ 、 $-NR^7-$ 、 $-CR^5R^6-$ 、 $-S(O)_j$ 又は $-C(O)-$ であり、 n 及び m がどちらも 1 であり、及び j が 1 又は 2 である、請求項 46 に記載の化合物。

【請求項 53】

R^4 が C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい、請求項 52 に記載の化合物。

40

【請求項 54】

G^{11} が $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_j R^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル $-C_{0-10}$ アルキル又はヘテロシクリル $-C_{2-10}$ アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_j$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_j R^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_j R^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよい、請求項 50 に記載の化合物。

50

$^1 C (=O) R^{3 3 3 1}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} C (=O) OR^{3 3 3 1}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} C (=O) NR^{3 3 3 1} R^{2 2 2 1 a}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} S(O)_{j 3 a} R^{3 3 3 1}$ 、 $-C (=S) OR^{2 2 2 1}$ 、 $-C (=O) SR^{2 2 2 1}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} C (=NR^{3 3 3 1}) NR^{2 2 2 1 a} R^{3 3 3 1 a}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} C (=NR^{3 3 3 1}) OR^{2 2 2 1 a}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} C (=NR^{3 3 3 1}) SR^{2 2 2 1 a}$ 、 $-OC (=O) OR^{2 2 2 1}$ 、 $-OC (=O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}$ 、 $-OC (=O) SR^{2 2 2 1}$ 、 $-SC (=O) OR^{2 2 2 1}$ 又は $-SC (=O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}$ 置換基で置換されていてもよい、請求項 5 3 に記載の化合物。

【請求項 5 5】

Q^1 が、前記 1 から 5 個の独立した $G^{1 0}$ 置換基で置換されたアリール¹ であり、前記 $G^{1 0}$ 置換基の少なくとも 1 個が $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n 及び m がどちらも 1 であり、 R^4 が 1 個以上の $G^{4 1}$ 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 X^1 が $-O-$ であり、及び Y^1 が $-CH_2-$ である、請求項 4 7 に記載の化合物。

10

【請求項 5 6】

R^1 が、 $G^{1 1}$ で 3 位が置換されたシス - 又はトランス - シクロブチルである、請求項 5 5 に記載の化合物。

【請求項 5 7】

Q^1 が前記 1 から 5 個の独立した $G^{1 0}$ 置換基で置換され、前記 $G^{1 0}$ 置換基の少なくとも 1 個が $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 が各々独立に $-O-$ 、 $-NR^7-$ 、 $-CR^5 R^6-$ 、 $-S(O)_{j 4}$ - 又は $-C(O)-$ であり、 n 及び m がどちらも 1 であり、及び $j 4$ が 1 又は 2 である、請求項 4 5 に記載の化合物。

20

【請求項 5 8】

$G^{1 1}$ が $-OR^{2 1}$ 、 $-NR^{2 1} R^{3 1} (R^{2 1 a})_{j 3}$ 、 $-C(O) R^{2 1}$ 、 $-CO_2 R^{2 1}$ 、 $-CONR^{2 1} R^{3 1}$ 、 $-NR^{2 1} C (=O) R^{3 1}$ 、 $-NR^{2 1} C (=O) OR^{3 1}$ 、 $-NR^{2 1} C (=O) NR^{2 1} R^{3 1}$ 、 $-NR^{2 1} S(O)_{j 3} R^{3 1}$ 、 $-OC (=O) OR^{2 1}$ 、 $-O(C=O) NR^{2 1} R^{3 1}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_3-8 アルキル、シクロ C_3-8 アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した八口、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2 2 2 1}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} (R^{3 3 3 a})_{j 3 a}$ 、 $-C(O) R^{2 2 2 1}$ 、 $-CO_2 R^{2 2 2 1}$ 、 $-CONR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_{j 3 a} R^{2 2 2 1}$ 、 $-SO_2 NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} C (=O) R^{3 3 3 1}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} C (=O) OR^{3 3 3 1}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} C (=O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} S(O)_{j 3 a} R^{3 3 3 1}$ 、 $-C (=S) OR^{2 2 2 1}$ 、 $-C (=O) SR^{2 2 2 1}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} C (=NR^{3 3 3 1}) NR^{2 2 2 1 a} R^{3 3 3 1 a}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} C (=NR^{3 3 3 1}) OR^{2 2 2 1 a}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} C (=NR^{3 3 3 1}) SR^{3 3 3 1 a}$ 、 $-OC (=O) OR^{2 2 2 1}$ 、 $OC (=O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}$ 、 $OC (=O) SR^{2 2 2 1}$ 、 $-SC (=O) OR^{2 2 2 1}$ 又は $-SC (=O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}$ 置換基で置換されていてもよく、

30

又は $G^{1 1}$ がアリール - C_{0-10} アルキル、アリール - C_{2-10} アルケニル、アリール - C_{2-10} アルキニル、ヘタリール - C_{0-10} アルキル、ヘタリール - C_{2-10} アルケニル若しくはヘタリール - C_{2-10} アルキニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2 2 2 1}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} (R^{2 2 2 1 a})_{j 3 a}$ 、 $-C(O) R^{2 2 2 1}$ 、 $-CO_2 R^{2 2 2 1}$ 、 $-CONR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_{j 5 a} R^{2 2 2 1}$ 、 $-SO_2 NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} C (=O) R^{3 3 3 1}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} C (=O) OR^{3 3 3 1}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} C (=O) NR^{3 3 3 1} R^{2 2 2 1 a}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} S(O)_{j 3 a} R^{3 3 3 1}$ 、 $-C (=S) OR^{2 2 2 1}$ 、 $-C (=O) SR^{2 2 2 1}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} C (=NR^{3 3 3 1}) NR^{2 2 2 1 a} R^{3 3 3 1 a}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} C (=NR^{3 3 3 1}) OR^{2 2 2 1 a}$ 、 $-NR^{2 2 2 1} C (=NR^{3 3 3 1}) SR^{2 2 2 1 a}$ 、 $-OC (=$

40

50

O) OR^{2 2 2 1}、-OC(=O)NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、-OC(=O)SR^{2 2 2 1}、-SC(=O)OR^{2 2 2 1}若しくは-SC(=O)NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}置換基で置換されていてもよい、請求項57に記載の化合物。

【請求項59】

Q¹が、前記1から5個の独立したG^{1 0}置換基で置換されたフェニルであり、前記G^{1 0}置換基の少なくとも1個が-(X¹)_n-(Y¹)_m-R⁴であり、nが1であり、X¹が3-(-O-)又は4-(-O-)であり、mが1であり、Y¹が(-CH₂-)であり、及びR⁴が、1個以上の独立したG^{4 1}置換基で置換されていてもよいアリアルである、請求項1に記載の化合物。

10

【請求項60】

R¹がアリアル、ヘテロアリアル、シクロC₃₋₁₀アルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも1個以上の独立したG^{1 1}置換基で置換されていてもよい、請求項59に記載の化合物。

【請求項61】

R¹が、1個以上の独立したG^{1 1}置換基で置換されていてもよいシクロC₃₋₁₀アルキルであり、及びG^{1 1}が-OR^{2 1}、-NR^{2 1}R^{3 1}、-CO₂R^{2 1}、-C(O)R^{2 1}、-CONR^{2 1}R^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)R^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)OR^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)NR^{3 1}R^{2 1 a}、-NR^{2 1}S(O)_{j 3}R^{3 1}、-OC(=O)OR^{2 1}、-OC(=O)NR^{2 1}R^{3 1}、C₀₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、ヘテロシクリル-C₀₋₁₀アルキル又はヘテロシクリル-C₂₋₁₀アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、-CF₃、-OCF₃、-OR^{2 2 2 1}、-NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}(R^{2 2 2 1 a})_{j 3 a}、-C(O)R^{2 2 2 1}、-CO₂R^{2 2 2 1}、-CONR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、-NO₂、-CN、-S(O)_{j 3 a}R^{2 2 2 1}、-SO₂NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=O)R^{3 3 3 1}R^{2 2 2 1 a}、-NR^{2 2 2 1}C(=O)OR^{3 3 3 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=S)OR^{2 2 2 1}、-C(=O)SR^{2 2 2 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})NR^{2 2 2 1 a}R^{3 3 3 1 a}、-NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})OR^{2 2 2 1 a}、-NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})SR^{2 2 2 1 a}、-OC(=O)OR^{2 2 2 1}、-OC(=O)NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、-OC(=O)SR^{2 2 2 1}、-SC(=O)OR^{2 2 2 1}又は-SC(=O)NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}置換基で置換されていてもよい、請求項60に記載の化合物。

20

30

【請求項62】

R¹がシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルであり、そのいずれも1個以上の独立したG^{1 1}置換基で置換されていてもよい、請求項60に記載の化合物。

【請求項63】

G^{1 1}が-OR^{2 1}、-NR^{2 1}R^{3 1}、-CO₂R^{2 1}、-C(O)R^{2 1}、-CONR^{2 1}R^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)R^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)OR^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)NR^{3 1}R^{2 1 a}、-NR^{2 1}S(O)_{j 3}R^{3 1}、-OC(=O)OR^{2 1}、-OC(=O)NR^{2 1}R^{3 1}、C₀₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、ヘテロシクリル-C₀₋₁₀アルキル又はヘテロシクリル-C₂₋₁₀アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、-CF₃、-OCF₃、-OR^{2 2 2 1}、-NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}(R^{2 2 2 1 a})_{j 3 a}、-C(O)R^{2 2 2 1}、-CO₂R^{2 2 2 1}、-CONR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、-NO₂、-CN、-S(O)_{j 3 a}R^{2 2 2 1}、-SO₂NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=O)R^{3 3 3 1}R^{2 2 2 1 a}、-NR^{2 2 2 1}C(=O)OR^{3 3 3 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=O)NR^{3 3 3 1}R^{2 2 2 1 a}、-NR^{2 2 2 1}S(O)_{j 3 a}R^{3 3 3 1}、-C(=S)OR^{2 2 2 1}、-C(=O)SR^{2 2 2 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})NR^{2 2 2 1 a}R^{3 3 3 1 a}、-NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})OR^{2 2 2 1 a}、-N

40

50

$R^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})SR^{2,2,2,1a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2,2,2,1}$ 、 $-OC(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-OC(=O)SR^{2,2,2,1}$ 、 $-SC(=O)OR^{2,2,2,1}$ 又は $-SC(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 置換基で置換されていてもよい、請求項62に記載の化合物。

【請求項64】

Q^1 が、前記1から5個の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換されたフェニルであり、前記 $G^{1,0}$ 置換基の少なくとも1個が $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n が1であり、 X^1 が3-(-O-)であり、 m が0であり、及び R^4 が C_{0-8} アルキル又はシクロ C_{3-10} アルキルであり、そのいずれも1個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されていてもよい、請求項1に記載の化合物。

10

【請求項65】

R^4 が C_{0-6} アルキルである、請求項64に記載の化合物。

【請求項66】

R^4 がH又はメチルである、請求項65に記載の化合物。

【請求項67】

R^1 がアリアル、ヘテロアリアル、シクロ C_{3-10} アルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも1個以上の独立した $G^{1,1}$ 置換基で置換されていてもよい、請求項64に記載の化合物。

【請求項68】

R^4 が C_{0-6} アルキルである、請求項67に記載の化合物。

20

【請求項69】

R^4 がH又はメチルである、請求項68に記載の化合物。

【請求項70】

R^1 がシクロ C_{3-10} アルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも1個以上の独立した $G^{1,1}$ 置換基で置換されていてもよい、請求項67に記載の化合物。

【請求項71】

R^1 が、1個以上の独立した $G^{1,1}$ 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルである、請求項70に記載の化合物。

【請求項72】

$G^{1,1}$ が $-OR^{2,1}$ 、 $-NR^{2,1}R^{3,1}$ 、 $-CO_2R^{2,1}$ 、 $-C(O)R^{2,1}$ 、 $-CONR^{2,1}R^{3,1}$ 、 $-NR^{2,1}C(=O)R^{3,1}$ 、 $-NR^{2,1}C(=O)OR^{3,1}$ 、 $-NR^{2,1}C(=O)NR^{3,1}R^{2,1a}$ 、 $-NR^{2,1}S(O)_{j,4}R^{3,1}$ 、 $-OC(=O)OR^{2,1}$ 、 $-O(C=O)NR^{2,1}R^{3,1}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2,2,2,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}(R^{2,2,2,1a})_{j,4a}$ 、 $-C(O)R^{2,2,2,1}$ 、 $-CO_2R^{2,2,2,1}$ 、 $-CONR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_{j,4a}R^{2,2,2,1}$ 、 $-SO_2NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)OR^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)NR^{3,3,3,1}R^{2,2,2,1a}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}S(O)_{j,4a}R^{3,3,3,1}$ 、 $-C(=S)OR^{2,2,2,1}$ 、 $-C(=O)SR^{2,2,2,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})NR^{2,2,2,1a}R^{3,3,3,1a}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})OR^{2,2,2,1a}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})SR^{2,2,2,1a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2,2,2,1}$ 、 $-OC(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-OC(=O)SR^{2,2,2,1}$ 、 $-SC(=O)OR^{2,2,2,1}$ 又は $-SC(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 置換基で置換されていてもよい、請求項71に記載の化合物。

30

40

【請求項73】

R^4 が C_{0-6} アルキルである、請求項71に記載の化合物。

【請求項74】

R^4 がH又はメチルである、請求項73に記載の化合物。

50

【請求項 75】

R¹ がシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{1 1} 置換基で置換されていてもよい、請求項 71 に記載の化合物。

【請求項 76】

G^{1 1} が -OR^{2 1}、-NR^{2 1}R^{3 1}、-CO₂R^{2 1}、-C(O)R^{2 1}、-CONR^{2 1}R^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)R^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)OR^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)NR^{3 1}R^{2 1 a}、-NR^{2 1}S(O)_{j 4}R^{3 1}、-OC(=O)OR^{2 1}、-OC(=O)NR^{2 1}R^{3 1}、C₀₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、ヘテロシクリル-C₀₋₁₀アルキル又はヘテロシクリル-C₂₋₁₀アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、-CF₃、-OCF₃、-OR^{2 2 2 1}、-NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}(R^{2 2 2 1 a})_{j 4 a}、-C(O)R^{2 2 2 1}、-CO₂R^{2 2 2 1}、-CONR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、-NO₂、-CN、-S(O)_{j 4 a}R^{2 2 2 1}、-SO₂NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=O)R^{3 3 3 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=O)OR^{3 3 3 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=O)NR^{3 3 3 1}R^{2 2 2 1 a}、-NR^{2 2 2 1}S(O)_{j 4 a}R^{3 3 3 1}、-C(=S)OR^{2 2 2 1}、-C(=O)SR^{2 2 2 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})NR^{2 2 2 1 a}R^{3 3 3 1 a}、-NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})OR^{2 2 2 1 a}、-NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})SR^{2 2 2 1 a}、-OC(=O)OR^{2 2 2 1}、-OC(=O)NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、-OC(=O)SR^{2 2 2 1}、-SC(=O)OR^{2 2 2 1}又は-SC(=O)NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}置換基で置換されていてもよい、請求項 75 に記載の化合物。

10

20

【請求項 77】

R⁴ が C₀₋₆アルキルである、請求項 75 に記載の化合物。

【請求項 78】

R⁴ が H 又はメチルである、請求項 77 に記載の化合物。

【請求項 79】

Q¹ が、前記 1 から 5 個の独立した G^{1 0} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{1 0} 置換基の少なくとも 1 個が -(X¹)_n-(Y¹)_m-R⁴ であり、n が 1 であり、X¹ が 3-(-O-) であり、m が 0 であり、及び R⁴ が、1 個以上の独立した G^{4 1} 置換基で置換されていてもよいアリールである、請求項 1 に記載の化合物。

30

【請求項 80】

R¹ がアリール、ヘテロアリール、シクロC₃₋₁₀アルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{1 1} 置換基で置換されていてもよい、請求項 79 に記載の化合物。

【請求項 81】

R⁴ が、G^{4 1} で置換されていてもよいフェニルである、請求項 80 に記載の化合物。

【請求項 82】

R¹ がシクロC₃₋₁₀アルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{1 1} 置換基で置換されていてもよい、請求項 80 に記載の化合物。

【請求項 83】

G^{1 1} が -OR^{2 1}、-NR^{2 1}R^{3 1}、-CO₂R^{2 1}、-C(O)R^{2 1}、-CONR^{2 1}R^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)R^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)OR^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)NR^{3 1}R^{2 1 a}、-NR^{2 1}S(O)_{j 3}R^{3 1}、-OC(=O)OR^{2 1}、-OC(=O)NR^{2 1}R^{3 1}、C₀₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、ヘテロシクリル-C₀₋₁₀アルキル又はヘテロシクリル-C₂₋₁₀アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、-CF₃、-OCF₃、-OR^{2 2 2 1}、-NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}(R^{2 2 2 1 a})_{j 3 a}、-C(O)R^{2 2 2 1}、-CO₂R^{2 2 2 1}、-CONR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、-NO₂、-CN、-S(O)_{j 3 a}R^{2 2 2 1}、-SO₂NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=O)R^{3 3 3 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=O)OR^{3 3 3 1}、-NR^{2 2 2 1}C(

40

50

= O) NR^{3 3 3 1} R^{2 2 2 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} S (O)_{j 3 a} R^{3 3 3 1}、 - C (= S) OR^{2 2 2 1}、 - C (= O) SR^{2 2 2 1}、 - NR^{2 2 2 1} C (= NR^{3 3 3 1}) NR^{2 2 2 1 a} R^{3 3 3 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} C (= NR^{3 3 3 1}) OR^{2 2 2 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} C (= NR^{3 3 3 1}) SR^{2 2 2 1 a}、 - OC (= O) OR^{2 2 2 1}、 - OC (= O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - OC (= O) SR^{2 2 2 1}、 - SC (= O) OR^{2 2 2 1} 又は - SC (= O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} 置換基で置換されていてもよい、請求項 8 2 に記載の化合物。

【請求項 8 4】

R¹ がシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{1 1} 置換基で置換されていてもよい、請求項 8 2 に記載の化合物。

10

【請求項 8 5】

G^{1 1} が - OR^{2 1}、 - NR^{2 1} R^{3 1}、 - CO₂ R^{2 1}、 - C (O) R^{2 1}、 - CO NR^{2 1} R^{3 1}、 - NR^{2 1} C (= O) R^{3 1}、 - NR^{2 1} C (= O) OR^{3 1}、 - NR^{2 1} C (= O) NR^{3 1} R^{2 1 a}、 - NR^{2 1} S (O)_{j 3} R^{3 1}、 - OC (= O) OR^{2 1}、 - OC (= O) NR^{2 1} R^{3 1}、 C_{0 - 10} アルキル、シクロ C_{3 - 8} アルキル、シクロ C_{3 - 8} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0 - 10} アルキル又はヘテロシクリル - C_{2 - 10} アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、 - CF₃、 - OCF₃、 - OR^{2 2 2 1}、 - NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} (R^{2 2 2 1 a})_{j 3 a}、 - C (O) R^{2 2 2 1}、 - CO₂ R^{2 2 2 1}、 - CONR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - NO₂、 - CN、 - S (O)_{j 3 a} R^{2 2 2 1}、 - SO₂ NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1} C (= O) R^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1} C (= O) OR^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1} C (= O) NR^{3 3 3 1} R^{2 2 2 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} S (O)_{j 3 a} R^{3 3 3 1}、 - C (= S) OR^{2 2 2 1}、 - C (= O) SR^{2 2 2 1}、 - NR^{2 2 2 1} C (= NR^{3 3 3 1}) NR^{2 2 2 1 a} R^{3 3 3 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} C (= NR^{3 3 3 1}) OR^{2 2 2 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} C (= NR^{3 3 3 1}) SR^{2 2 2 1 a}、 - OC (= O) OR^{2 2 2 1}、 - OC (= O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - OC (= O) SR^{2 2 2 1}、 - SC (= O) OR^{2 2 2 1} 又は - SC (= O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} 置換基で置換されていてもよい、請求項 8 4 に記載の化合物。

20

【請求項 8 6】

Q¹ が、前記 1 から 5 個の独立した G^{1 0} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{1 0} 置換基の少なくとも 1 個が - (X¹)_n - (Y¹)_m - R⁴ であり、n が 1 であり、X¹ が 3 - 又は 4 - (- NH -) であり、m が 1 であり、Y¹ が (- SO₂ -) であり、及び R⁴ が、1 個以上の独立した G^{4 1} 置換基で置換されていてもよいアリーールである、請求項 1 に記載の化合物。

30

【請求項 8 7】

R¹ がアリーール、ヘテロアリーール、シクロ C_{3 - 10} アルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{1 1} 置換基で置換されていてもよい、請求項 8 6 に記載の化合物。

【請求項 8 8】

R¹ がシクロ C_{3 - 10} アルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{1 1} 置換基で置換されていてもよく、G^{1 1} が - OR^{2 1}、 - NR^{2 1} R^{3 1}、 - CO₂ R^{2 1}、 - C (O) R^{2 1}、 - CONR^{2 1} R^{3 1}、 - NR^{2 1} C (= O) R^{3 1}、 - NR^{2 1} C (= O) OR^{3 1}、 - NR^{2 1} C (= O) NR^{3 1} R^{2 1 a}、 - NR^{2 1} S (O)_{j 3} R^{3 1}、 - OC (= O) OR^{2 1}、 - OC (= O) NR^{2 1} R^{3 1}、 C_{0 - 10} アルキル、シクロ C_{3 - 8} アルキル、シクロ C_{3 - 8} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0 - 10} アルキル又はヘテロシクリル - C_{2 - 10} アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、 - CF₃、 - OCF₃、 - OR^{2 2 2 1}、 - NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} (R^{2 2 2 1 a})_{j 3 a}、 - C (O) R^{2 2 2 1}、 - CO₂ R^{2 2 2 1}、 - CONR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - NO₂、 - CN、 - S (O)_{j 3 a} R^{2 2 2 1}、 - SO₂ NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1} C (= O) R^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1}

40

50

$C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_j R^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよい、請求項87に記載の化合物。

【請求項89】

R^1 が、 G^{11} で4位が置換されたシス-又はトランス-シクロヘキシルであり、 G^{11} が $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHAc$ 、 $-NH(CO)NHCH_3$ 、 $-NH(CO)OCH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2NH_2$ 、 $-CH_2NHAc$ 、 $CONH_2$ 、 $-CH_2N(CH_3)_2$ 、 $-CH_2NH(CO)NHMe$ 、 $-CH_2NH(CO)OCH_3$ 、 CO_2CH_3 又は $CONHCH_3$ である、請求項88に記載の化合物。

10

【請求項90】

R^1 がシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルであり、そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい、請求項87に記載の化合物。

【請求項91】

G^{11} が $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_j R^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立した八口、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_j R^{3331a}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_j R^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_j R^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよい、請求項90に記載の化合物。

20

30

【請求項92】

R^1 が、 G^{11} で4位が置換されたシス-又はトランス-シクロヘキシルであり、 G^{11} が $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHAc$ 、 $-NH(CO)NHCH_3$ 、 $-NH(CO)OCH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2NH_2$ 、 $-CH_2NHAc$ 、 $CONH_2$ 、 $-CH_2N(CH_3)_2$ 、 $-CH_2NH(CO)NHMe$ 、 $-CH_2NH(CO)OCH_3$ 、 CO_2CH_3 又は $CONHCH_3$ である、請求項91に記載の化合物。

40

【請求項93】

R^1 が、 G^{11} で3位が置換されたシス-又はトランス-シクロブチルであり、 G^{11} が $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHAc$ 、 $-NH(CO)NHCH_3$ 、 $-NH(CO)OCH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2NH_2$ 、 $-CH_2NHAc$ 、 $CONH_2$ 、 $-CH_2N(CH_3)_2$ 、 $-CH_2NH(CO)NHMe$ 、 $-CH_2NH(CO)OCH_3$ 、 CO_2CH_3 又は $CONHCH_3$ である、請求項90に記載の化合物。

【請求項94】

Q^1 が、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも1個の G^{10} 置換基が $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 X^1 が3-(O)-、4-(O)-、3-(NH)-又は4-(NH)-であり、 Y^1 が $-CH_2-$ 又は $-(SO_2-$

50

) - であり、並びに n 及び m が独立に 0 又は 1 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 95】

X¹ が 3 - (O) - 又は 4 - (O) - であり、Y¹ が - CH₂ - であり、並びに n 及び m が各々 1 である、請求項 94 に記載の化合物。

【請求項 96】

R⁴ がアリール、C₀₋₁₀ アルキル又はシクロ C₃₋₁₀ アルキルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G⁴⁻¹ 置換基で置換されていてもよい、請求項 95 に記載の化合物。

【請求項 97】

R⁴ が、1 個以上の独立した G⁴⁻¹ 置換基で置換されていてもよいフェニルである、請求項 96 に記載の化合物。

10

【請求項 98】

R¹ がアリール、ヘテロアリール、シクロ C₃₋₁₀ アルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも G¹⁻¹ で置換されていてもよい、請求項 96 に記載の化合物。

【請求項 99】

R¹ が、G¹⁻¹ で置換されていてもよいシクロ C₃₋₁₀ アルキルである、請求項 98 に記載の化合物。

【請求項 100】

R¹ がアリール、ヘテロアリール、シクロ C₃₋₁₀ アルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも G¹⁻¹ で置換されていてもよい、請求項 87 に記載の化合物。

20

【請求項 101】

R¹ が、G¹⁻¹ で置換されていてもよいシクロ C₃₋₁₀ アルキルである、請求項 100 に記載の化合物。

【請求項 102】

R¹ がシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルであり、そのいずれも G¹⁻¹ で置換されていてもよい、請求項 101 に記載の化合物。

【請求項 103】

R¹ が、G¹⁻¹ で 3 位が置換されたシス - 若しくはトランス - シクロブチルであり、又は R¹ が、G¹⁻¹ で 4 位が置換されたシス - 若しくはトランス - シクロヘキシルである、請求項 102 に記載の化合物。

30

【請求項 104】

R¹ が、G¹⁻¹ で 3 位が置換されたシス - 又はトランス - シクロブチルであり、G¹⁻¹ が - OH、- NH₂、- N(CH₃)₂、- NHAc、- NH(CO)NHCH₃、- NH(CO)OCH₃、- CH₂OH、- CH₂NH₂、- CH₂NHAc、CONH₂、- CH₂N(CH₃)₂、- CH₂NH(CO)NHMe、- CH₂NH(CO)OCH₃、CO₂CH₃ 又は CONHCH₃ である、請求項 103 に記載の化合物。

【請求項 105】

R¹ が、G¹⁻¹ で 4 位が置換されたシス - 又はトランス - シクロヘキシルであり、G¹⁻¹ が - OH、- NH₂、- N(CH₃)₂、- NHAc、- NH(CO)NHCH₃、- NH(CO)OCH₃、- CH₂OH、- CH₂NH₂、- CH₂NHAc、CONH₂、- CH₂N(CH₃)₂、- CH₂NH(CO)NHMe、- CH₂NH(CO)OCH₃、CO₂CH₃ 又は CONHCH₃ である、請求項 103 に記載の化合物。

40

【請求項 106】

G¹⁻¹ が - OR²⁻¹、- NR²⁻¹R³⁻¹、- CO₂R²⁻¹、- C(O)R²⁻¹、- CONR²⁻¹R³⁻¹、- NR²⁻¹C(=O)R³⁻¹、- NR²⁻¹C(=O)OR³⁻¹、- NR²⁻¹C(=O)NR³⁻¹R^{2-1a}、- NR²⁻¹S(O)_j₃R³⁻¹、- OC(=O)OR²⁻¹、- OC(=O)NR²⁻¹R³⁻¹、C₀₋₁₀ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルケニル、ヘテロシクリル - C₀₋₁₀ アルキル又はヘテロシクリル - C₂₋₁₀ アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、- CF₃、- OCF₃、- OR²⁻²⁻²⁻¹、- NR²⁻²⁻²⁻¹R³⁻³⁻³⁻¹(R^{2-2-2-1a})_j_{3a}、-

50

$C(O)R^{2,2,2,1}$ 、 $-CO_2R^{2,2,2,1}$ 、 $-CONR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-NO_2$ 、
 $-CN$ 、 $-S(O)_j R^{2,2,2,1}$ 、 $-SO_2NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}$
 $C(=O)R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)OR^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)NR^{3,3,3,1}R^{2,2,2,1a}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}S(O)_j R^{3,3,3,1}$ 、 $-C(=S)OR^{2,2,2,1}$ 、 $-C(=O)SR^{2,2,2,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})NR^{2,2,2,1a}R^{3,3,3,1a}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})OR^{2,2,2,1a}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})SR^{2,2,2,1a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2,2,2,1}$ 、 $-OC(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-OC(=O)SR^{2,2,2,1}$ 、 $-SC(=O)OR^{2,2,2,1}$ 又は $-SC(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 置換基で置換されていてもよい、請求項 99 に記載の化合物。

10

【請求項 107】

$G^{1,1}$ が $-OR^{2,1}$ 、 $-NR^{2,1}R^{3,1}$ 、 $-CO_2R^{2,1}$ 、 $-C(O)R^{2,1}$ 、 $-CONR^{2,1}R^{3,1}$ 、 $-NR^{2,1}C(=O)R^{3,1}$ 、 $-NR^{2,1}C(=O)OR^{3,1}$ 、 $-NR^{2,1}C(=O)NR^{3,1}R^{2,1a}$ 、 $-NR^{2,1}S(O)_j R^{3,1}$ 、 $-OC(=O)OR^{2,1}$ 、 $-OC(=O)NR^{2,1}R^{3,1}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した八口、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2,2,2,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}(R^{2,2,2,1a})_j R^{3,3,3,1}$ 、 $-C(O)R^{2,2,2,1}$ 、 $-CO_2R^{2,2,2,1}$ 、 $-CONR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-NO_2$ 、
 $-CN$ 、 $-S(O)_j R^{2,2,2,1}$ 、 $-SO_2NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}$
 $C(=O)R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)OR^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)NR^{3,3,3,1}R^{2,2,2,1a}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}S(O)_j R^{3,3,3,1}$ 、 $-C(=S)OR^{2,2,2,1}$ 、 $-C(=O)SR^{2,2,2,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})NR^{2,2,2,1a}R^{3,3,3,1a}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})OR^{2,2,2,1a}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})SR^{2,2,2,1a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2,2,2,1}$ 、 $-OC(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-OC(=O)SR^{2,2,2,1}$ 、 $-SC(=O)OR^{2,2,2,1}$ 又は $-SC(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 置換基で置換されていてもよい、請求項 100 に記載の化合物。

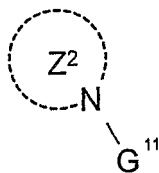
20

【請求項 108】

R^1 が下記構造式で表される、請求項 94 に記載の化合物。

30

【化 6】



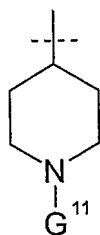
(式中、 Z^2 は、 $G^{1,1}$ で置換された N を含むヘテロシクリルである。)

【請求項 109】

R^1 が下記構造式で表される、請求項 94 に記載の化合物。

40

【化 7】



(式中、 $G^{1,1}$ は $-C(O)R^{2,1}$ 、 $-CO_2R^{2,1}$ 、 $-CONR^{2,1}R^{3,1}$ 、 $-SO_2NR^{2,1}R^{3,1}$ 、 $-S(O)_j R^{3,1}$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル

50

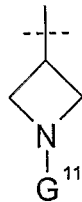
、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2,2,2,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-C(O)R^{2,2,2,1}$ 、 $-CO_2R^{2,2,2,1}$ 、 $-CONR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-SO_2NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)OR^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)NR^{3,3,3,1}R^{2,2,2,1a}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}S(O)_jR^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})NR^{2,2,2,1a}R^{3,3,3,1a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 置換基で置換されていてもよく、

又は $G^{1,1}$ はアリール- C_{0-10} アルキル若しくはヘタリール- C_{0-10} アルキルであり、そのいずれも1個以上の独立した八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2,2,2,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-C(O)R^{2,2,2,1}$ 、 $-CO_2R^{2,2,2,1}$ 、 $-CONR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-SO_2NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)OR^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)NR^{3,3,3,1}R^{2,2,2,1a}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}S(O)_jR^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})NR^{2,2,2,1a}R^{3,3,3,1a}$ 若しくは $OC(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 置換基で置換されていてもよい。))

【請求項110】

R^1 が下記構造式で表される、上記請求項94に記載の化合物。

【化8】



(式中、 $G^{1,1}$ は $-C(O)R^{2,1}$ 、 $-CO_2R^{2,1}$ 、 $-CONR^{2,1}R^{3,1}$ 、 $-SO_2NR^{2,1}R^{3,1}$ 、 $-S(O)_jR^{3,1}$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2,2,2,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-C(O)R^{2,2,2,1}$ 、 $-CO_2R^{2,2,2,1}$ 、 $-CONR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-SO_2NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)OR^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}S(O)_jR^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})NR^{2,2,2,1a}R^{3,3,3,1a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 置換基で置換されていてもよく、

又はアリール- C_{0-10} アルキル若しくはヘタリール- C_{0-10} アルキルであり、そのいずれも1個以上の独立した八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2,2,2,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-C(O)R^{2,2,2,1}$ 、 $-CO_2R^{2,2,2,1}$ 、 $-CONR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-SO_2NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)OR^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}S(O)_jR^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})NR^{2,2,2,1a}R^{3,3,3,1a}$ 又は $-OC(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 置換基で置換されていてもよい。))

【請求項111】

5-(3-ベンジルオキシ-2-フルオロ-フェニル)-7-シクロブチル-イミダゾ

- [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - シクロブチル - イミダゾ [5 , 1 - f]
- [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f]
- [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロブタン、
 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f]
- [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロブタノール、
 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f]
- [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - 1 - メチル - シクロブタノール、
 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] 10
- [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - 1 - エチル - シクロブタノール、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - メチルアミノ - シクロブチル) -
 イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ジメチルアミノ - シクロブチル)
 - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 7 - (3 - アゼチジン - 1 - イル - シクロブチル) - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェ
 ニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ピペリジン - 1 - イル - シクロブ
 チル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
- N - { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 20
 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロブチル } - アセトアミド、
 { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f
] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロブチル } - カルバミン酸メチルエステ
 ル、
 1 - { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1
 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロブチル } - 3 - メチル - ウレア、
 N - { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1
 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロブチル } - メタンスルホンアミド
 、
- 7 - アゼチジン - 3 - イル - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 30
 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 1 - { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1
 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - アゼチジン - 1 - イル } - エタノン、
 { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f
] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロブチル } - メタノール、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ジメチルアミノメチル - シクロブ
 チル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ジエチルアミノメチル - シクロブ
 チル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
- 7 - (3 - アゼチジン - 1 - イルメチル - シクロブチル) - 5 - (3 - ベンジルオキシ 40
 - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ピペリジン - 1 - イルメチル - シ
 クロブチル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f]
 [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロブタンカルボン酸アミド、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - シクロヘキシル - イミダゾ [5 , 1 - f
] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 4 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f]
 [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロヘキサノン、
- 4 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] 50

3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - ベンズアミド、

3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - N - メチル - ベンズアミド、

{ 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - フェニル } - メタノール、

7 - (3 - アミノメチル - フェニル) - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、

N - { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - ベンジル } - アセトアミド、

{ 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - ベンジル } - カルバミン酸メチルエステル、

1 - { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - ベンジル } - 3 - メチル - ウレア、

N - { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - ベンジル } - メタンスルホンアミド、

5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ジメチルアミノメチル - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、

5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ジエチルアミノメチル - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、

7 - (3 - アゼチジン - 1 - イルメチル - フェニル) - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、

5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ピロリジン - 1 - イルメチル - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、

5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ピペリジン - 1 - イルメチル - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、

5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - ピリジン - 4 - イル - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、

5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - オキサゾル - 2 - イル - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、

5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - チオフェン - 3 - イル - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、

5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - チオフェン - 2 - イル - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、

5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - チアゾル - 5 - イル - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、

5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - チアゾル - 2 - イル - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、

5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (1 H - イミダゾル - 2 - イル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、

5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (1 H - イミダゾル - 4 - イル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン

からなる群から選択される化合物又は薬剤として許容されるその塩。

【請求項 1 1 2】

5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - シクロブチル - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、 5 - (3 - ベンジルオキシ - 2 - フルオロ - フェニル) - 7 - シクロブチル - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン又は薬剤として許容されるその塩からなる化合物。

【請求項 1 1 3】

請求項 1 に記載の化合物又は薬剤として許容されるその塩を投与することを含む、プロ

10

20

30

40

50

テインキナーゼ活性阻害方法。

【請求項 114】

前記プロテインキナーゼが IGF-1R である、請求項 113 に記載の方法。

【請求項 115】

前記プロテインキナーゼの活性が過剰増殖障害 (hyperproliferative disorder) に影響を及ぼす、請求項 113 に記載の方法。

【請求項 116】

前記プロテインキナーゼの活性が血管新生、血管透過性、免疫応答、細胞アポトーシス、腫瘍成長又は炎症に影響を及ぼす、請求項 113 に記載の方法。

【請求項 117】

請求項 1 に記載の式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法。

【請求項 118】

前記プロテインキナーゼが IGF-1R である、請求項 117 に記載の方法。

【請求項 119】

プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が過剰増殖障害である、請求項 117 に記載の方法。

【請求項 120】

前記プロテインキナーゼの活性が血管新生、血管透過性、免疫応答、細胞アポトーシス、腫瘍成長又は炎症に影響を及ぼす、請求項 117 に記載の方法。

【請求項 121】

プロテインキナーゼがタンパク質セリン/トレオニンキナーゼ又はタンパク質チロシンキナーゼである、請求項 117 に記載の方法。

【請求項 122】

プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が 1 個以上の潰瘍である、請求項 117 に記載の方法。

【請求項 123】

潰瘍が細菌感染若しくは真菌感染によって引き起こされる、又は潰瘍がモーレン潰瘍である、又は潰瘍が潰瘍性大腸炎症候である、請求項 122 に記載の方法。

【請求項 124】

プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状がライム病、単純ヘルペス、帯状疱疹ウイルス、ヒト免疫不全症ウイルス、パラボックスウイルス、原生動物による敗血症若しくは感染症又はトキソプラズマ症である、請求項 117 に記載の方法。

【請求項 125】

プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状がフォンヒッペルリンドウ病、類天ほうそう、乾せん、パジェット病又は多発性嚢胞腎である、請求項 117 に記載の方法。

【請求項 126】

プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が線維症、サルコイドーシス、肝硬変、甲状腺炎、過粘ちゅう度症候群、オースラー-ウェーバー-ランデュ病、慢性閉塞性肺疾患、ぜん息、しん出物 (exudates)、腹水、胸水、肺水腫、脳浮腫又は火傷後の浮腫、外傷、放射、発作、低酸素症又は虚血である、請求項 117 に記載の方法。

【請求項 127】

プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が卵巣過剰刺激症候群、子かん前症 (pre-eclampsia)、機能性子宮出血又は子宮内膜症である、請求項 117 に記載の方法。

【請求項 128】

プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が慢性炎症、全身性ループス、糸球体腎炎、滑膜炎、炎症性腸疾患、クローン病、糸球体腎炎、リウマチ様関節炎及び骨関節炎、多発性硬化症又は移植片拒絶である、請求項 117 に記載の方法。

10

20

30

40

50

- 【請求項 1 2 9】
 プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が鎌状赤血球貧血である、請求項 1 1 7 に記載の方法。
- 【請求項 1 3 0】
 プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が眼球の症状である、請求項 1 1 8 に記載の方法。
- 【請求項 1 3 1】
 眼球の症状が眼球又は黄斑の浮腫、眼球新生血管疾患、強膜炎 (s e l e r i t i s)、放射状角膜切開術、ブドウ膜炎、硝子体炎、近視、乳頭小か、慢性網膜剥離、レーザー治療後合併症、結膜炎、スタルガルド病、イールズ病、網膜症又は黄斑変性症である、請求項 1 3 0 に記載の方法。 10
- 【請求項 1 3 2】
 プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が心血管の症状である、請求項 1 1 7 に記載の方法。
- 【請求項 1 3 3】
 プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状がアテローム性動脈硬化症、再狭窄、虚血 / 再かん流傷害、血管閉塞、静脈奇形又は頸動脈閉塞性疾患である、請求項 1 1 7 に記載の方法。
- 【請求項 1 3 4】
 プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が癌である、請求項 1 1 7 に記載の方法。 20
- 【請求項 1 3 5】
 癌が固形腫瘍、肉腫、線維肉腫、骨腫、黒色腫、網膜芽細胞腫、横紋筋肉腫、グリア芽細胞腫、神経芽細胞腫、奇形癌腫、造血器悪性腫瘍又は悪性腹水である、請求項 1 3 4 に記載の方法。
- 【請求項 1 3 6】
 癌がカポジ肉腫、ホジキン病、リンパ腫、骨髄腫又は白血病である、請求項 1 1 8 に記載の方法。
- 【請求項 1 3 7】
 プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状がクロー - 深瀬 (P O E M S) 症候群又は糖尿病性症状である、請求項 1 1 7 に記載の方法。 30
- 【請求項 1 3 8】
 糖尿病性症状がインスリン依存性糖尿病緑内障、糖尿病性網膜症又は微小血管障害である、請求項 1 3 7 に記載の方法。
- 【請求項 1 3 9】
 プロテインキナーゼ活性が、T細胞活性化、B細胞活性化、肥満細胞脱顆粒、単球活性化、シグナル伝達、アポトーシス、炎症反応の増強又はこれらの組合せに關与する、請求項 1 1 7 に記載の方法。
- 【請求項 1 4 0】
 I G F - 1 R 依存性細胞増殖の障害に応答する疾患の治療用薬剤組成物を調製するための、請求項 1 に記載の式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の使用。 40
- 【請求項 1 4 1】
 I G F - 1 R チロシンキナーゼの障害に応答する疾患の治療用薬剤組成物を調製するための、請求項 1 に記載の式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の使用。
- 【請求項 1 4 2】
 請求項 1 に記載の化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量と薬剤として許容される担体とを含む薬剤組成物。
- 【請求項 1 4 3】
 請求項 1 4 2 に記載の薬剤組成物を投与することを含む、プロテインキナーゼ活性阻害方法。 50

【請求項 1 4 4】

請求項 1 4 2 に記載の薬剤組成物の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規イミダゾトリアジン化合物、その塩及びこれらを含む組成物を対象とする。特に、本発明は、癌などの様々な疾患及び症状を治療及び/又は予防するための、ヒトを含めた動物においてチロシンキナーゼ酵素の活性を阻害する新規イミダゾトリアジン化合物を対象とする。

10

【背景技術】

【0002】

タンパク質チロシンキナーゼ (PTK) は、細胞の増殖、活性化又は分化の調節に関する様々な細胞タンパク質において特定のチロシン残基のリン酸化を触媒する酵素である (Schlessinger and Ullrich, 1992, Neuron 9: 383 - 391)。異常な、過剰な、又は制御されない PTK 活性は、制御されない細胞増殖をもたらすことが判明し、良性及び悪性の増殖性障害などの疾患において認められ、免疫系の不適当な活性化 (例えば、自己免疫異常)、同種移植片拒絶及び移植片対宿主病に起因する疾患において認められる。また、KDR、Tie-2 などの内皮細胞特異的受容体 PTK は、血管形成プロセスを媒介し、従って癌及び不適当な血管新生を含む他の疾患 (例えば、糖尿病性網膜症、加齢黄斑変性症による脈絡膜血管新生、乾せん、関節炎、未熟児網膜症、小児血管腫) の進行を支える。

20

【0003】

チロシンキナーゼには、(細胞外、膜貫通及び細胞内のドメインを有する) 受容体タイプもあれば (完全に細胞内である) 非受容体タイプもある。受容体チロシンキナーゼ (RTK) は、大きな膜貫通受容体ファミリーを含み、多様な生物活性を有する少なくとも 19 の異なる RTK サブファミリーがある。RTK ファミリーは、様々な細胞タイプの増殖及び分化に極めて重要である受容体を含む (Yarden and Ullrich, Ann. Rev. Biochem. 57: 433 - 478, 1988; Ullrich and Schlessinger, Cell 61: 243 - 254, 1990)。RTK の固有の機能は、リガンドの結合によって活性化され、受容体及び複数の細胞基質のリン酸化をもたらす、続いて様々な細胞応答をもたらす (Ullrich & Schlessinger, 1990, Cell 61: 203 - 212)。従って、RTK によって媒介されるシグナル伝達は、特定の成長因子 (リガンド) との細胞外相互作用によって惹起され、典型的には続いて受容体の 2 量体化が起こり、内在性タンパク質チロシンキナーゼ活性及び受容体トランスリン酸化を刺激する。それによって、細胞内シグナル伝達分子に対する結合部位が生成し、細胞分裂、分化、代謝的効果、細胞外微小環境の変化などの対応する細胞応答を促進する一連の細胞質シグナル伝達分子との複合体が形成される (Schlessinger and Ullrich, 1992, Neuron 9: 1 - 20)。

30

40

【0004】

悪性細胞は、1 つ以上の細胞周期要素の制御が失われることと関連がある。これらの要素は、インスリン様成長因子、インスリン成長因子 - I (IGF - I) 及びインスリン成長因子 - 2 (IGF - 2) を含めて、細胞表面受容体から転写及び翻訳の制御因子にまで及ぶ (M. J. Ellis, "The Insulin-Like Growth Factor Network and Breast Cancer", Breast Cancer, Molecular Genetics, Pathogenesis and Therapeutics, Humana Press 1999)。インスリン成長因子系は、リガンドファミリー、インスリン成長因子結合タンパク質及び受容体からなる。

50

【0005】

I G F - 1 系の主要な生理学的役割は、正常な成長及び再生の促進である。過剰発現された I G F - 1 R (1 型インスリン様成長因子受容体) は、有糸分裂を誘発させることができ、リガンド依存的腫瘍性転化を促進する。また、I G F - 1 R は、悪性表現型の確立及び維持に重要な役割を果たす。

【0006】

I G F - 1 R はヘテロ 2 量体として存在し、幾つかのジスルフィド架橋を有する。チロシンキナーゼ触媒作用部位及び A T P 結合部位は、ベータサブユニットの細胞質部分上にある。上皮成長因子 (E G F) 受容体とは異なり、I G F - 1 R の発癌性変異体は特定されていない。しかし、幾つかの癌遺伝子は、I G F - 1 及び I G F - 1 R の発現に影響を及ぼすことが示された。I G F - 1 R 発現の減少と形質転換に対する抵抗性との相関が見られた。I G F - 1 R R N A に対してアンチセンスの m R N A に細胞を暴露すると、幾つかのヒト腫瘍細胞系の軟寒天での成長が阻害される。

10

【0007】

アポトーシスは、多細胞生物において、損傷を受けた細胞又は望ましくない細胞を除去するために用いられる遍在性の生理的プロセスである。アポトーシスの制御不良は、多数のヒト疾患の原因に関与していると考えられる。アポトーシス細胞死の失敗は、様々な癌及び自己免疫異常と関係付けられている。逆に、アポトーシスの増加は、神経変性疾患、A I D S などの細胞消失を含む様々な疾患と関連がある。従って、アポトーシスの制御因子は重要な治療標的となっている。腫瘍が生き延びる主な方法はアポトーシスからの逸脱であることが現在証明されている。I G F - 1 R は、アポトーシスへの進行をインビボとインビトロの両方で抑止する。I G F - 1 R レベルが野生型レベル未満に減少すると腫瘍細胞のアポトーシスがインビボで生じることも判明した。I G F - 1 R の破損がアポトーシスを生じる能力は、正常な非腫瘍形成性細胞では減少すると考えられる。

20

【0008】

過度に高いプロテインキナーゼ活性は、異常な細胞機能に起因する多数の疾患と関係付けられている。過度に高いプロテインキナーゼ活性は、キナーゼの変異、過剰発現若しくは不適当な活性化に関与した、キナーゼの適切な制御機構の不全によって、又はキナーゼの上流若しくは下流のシグナル伝達に関与するサイトカイン若しくは成長因子の過剰産生若しくは産生不足によって、直接的にも間接的にも生じ得る。これらの場合の全てにおいて、キナーゼの作用を選択的に阻害することによって有益な効果が得られると考えられる。

30

【0009】

I G F - 1 R は、主に I G F - 1 に結合する膜貫通 R T K であるが、I G F - I I 及びインスリンにもより低い親和性で結合する。I G F - 1 がその受容体に結合すると、受容体オリゴマーが形成され、チロシンキナーゼが活性化され、細胞基質の分子間受容体の自己リン酸化及びリン酸化が起こる (主要な基質は I R S 1 及び S h c である。) 。リガンドによって活性化された I G F - 1 R は、正常細胞において分裂促進的な活動を誘発し、異常成長に重要な役割を果たす。

【0010】

ヒトの腫瘍発生における I G F - 1 経路は重要な役割を有する。1) I G F - 1 R の過剰発現は、様々な腫瘍 (乳房、結腸、肺、肉腫) において頻繁に見られ、高悪性度の表現型と関連することが多い。2) 高い循環 I G F 1 濃度は、前立腺癌、肺癌及び乳癌のリスクと強く相関する。また、I G F - 1 R は、インビトロ及びインビボでの形質転換表現型の確立及び維持に必要である (B a s e r g a R . E x p . C e l l . R e s . , 1 9 9 9 , 2 5 3 , 1 - 6) 。 I G F - 1 R のキナーゼ活性は、幾つかの癌遺伝子、すなわち、E G F R、P D G F R、S V 4 0 T 抗原、活性化 R a s、R a f 及び v - S r c の形質転換活性に必須である。正常線維芽細胞において I G F - 1 R が発現されると新生物表現型が誘導され、次いでインビボで腫瘍が形成され得る。I G F - 1 R の発現は、足場非依存性成長に重要な役割を果たす。I G F - 1 R は、化学療法、放射

40

50

及びサイトカインによって誘導されるアポトーシスから細胞を保護することも示された。逆に、ドミナントネガティブな IGF-1R、三重らせん体形成又はアンチセンス発現ベクターによって内因性 IGF-1R が阻害されると、インビトロでの形質転換活性及び動物モデルにおける腫瘍成長が抑制されることが判明した。

【0011】

RTKでも非受容体チロシンキナーゼでも、チロシンキナーゼの多くは、癌、乾せん、線維症、アテローム性動脈硬化症、再狭窄、自己免疫疾患、アレルギー、ぜん息、移植拒絶、炎症、血栓症、神経系疾患及び他の過剰増殖障害 (hyperproliferative disorder) 又は過免疫応答を含めて、多数の障害に關与する細胞シグナル伝達経路に關与することが判明した。かかる疾患を治療するために病態の調整又は維持に關与する新規キナーゼ阻害剤を提供することが望ましい。

10

【0012】

従って、異常な又は不適当な細胞増殖、分化又は代謝を調節及び調整するために、受容体及び非受容体のチロシン及びセリン/トレオニンキナーゼ活性を調整することによって、シグナル伝達及び細胞増殖を特異的に阻害する有効な小化合物を特定することが望ましい。特に、血管形成のプロセスに必須であり、又は浮腫、腹水、流出物、しん出液、巨大分子の血管外遊走、基質の沈着及びそれらの関連障害をもたらす血管透過性亢進の形成に必須であるチロシンキナーゼの機能を特異的に阻害する方法及び化合物は有利なはずである。

20

【0013】

タンパク質-チロシンキナーゼの阻害剤は、哺乳動物の癌細胞の増殖の選択的阻害剤として有用であることが認められた。例えば、BCR-ABL融合遺伝子産物のキナーゼ活性を阻害する2-フェニルピリミジンチロシンキナーゼ阻害剤(メシル酸イマチニブ又はSTI571としても知られる)Gleevec(商標)は、米国食品医薬品局によってCML治療用に最近認可された。この化合物は、BCR-ABLキナーゼを阻害するのに加えて、KITキナーゼ及びPDGF受容体キナーゼも阻害するが、KITキナーゼの全ての変異体アイソフォームに対して有効なわけではない。KITキナーゼが細胞の形質転換に關与する疾患であるGISTの患者を治療するためのGleevec(商標)の使用に關する最近の臨床試験において、患者の多くが顕著な臨床的改善を示した。他のキナーゼ阻害剤は、選択的にさらに大きい。例えば、4-アニリノキナゾリン化合物Tarcava(商標)は、EGF受容体キナーゼのみを高い効力で阻害する。Tarcava(商標)は、他の受容体キナーゼのシグナル伝達を阻害することができるが、これはおそらくかかる受容体がEGF受容体とヘテロ2量体化するためである。

30

【0014】

細胞増殖の制御、調節及び調整並びに異常細胞増殖に關連する疾患及び障害に対するPTKの重要性を考慮して、小分子のチロシンキナーゼ阻害剤を特定する多数の試みがなされてきた。ビス、単環式、二環式又は複素環式アリール化合物(国際公開第92/20642号)及びビニレン-アザインドール誘導体(国際公開第94/14808号)は、チロシンキナーゼ阻害剤として一般に記載されている。スチリル化合物(米国特許第5,217,999号)、スチリル置換ピリジル化合物(米国特許第5,302,606号)、ある種のキナゾリン誘導体(EP出願第0566266号A1; Expert Opin. Ther. Pat. (1998), 8(4): 475-478)、セレノインドール及びセレン化物(国際公開第94/03427号)、三環式ポリヒドロキシル化合物(国際公開第92/21660号)及びベンジルホスホン酸化合物(国際公開第91/15495号)は、癌治療用チロシンキナーゼ阻害剤として使用される化合物として記載されている。アニリノキノリン(国際公開第97/34876号)及びキナゾリン誘導体化合物(国際公開第97/22596号; 国際公開第97/42187号)は、血管新生及び血管透過性の阻害剤として記載されている。ビス(インドリルマレイミド)化合物は、そのシグナル伝達機能がVEGF関連疾患における血管透過性の変化と關連がある特定のPKCセリン/トレオニンキナーゼアイソフォームを阻害するとされている(国際公

40

50

開第 97 / 40830 号及び同 97 / 40831 号)。

【 0015 】

国際公開第 03 / 018021 号及び同 03 / 018022 号は、IGF - 1 R 関連障害治療用のピリミジンを記載している。国際公開第 02 / 102804 号及び同 02 / 102805 号は、IGF - 1 R 阻害剤としてシクロリグナンを記載している。国際公開第 02 / 092599 号は、IGF - 1 R チロシンキナーゼの阻害に应答する疾患の治療用にピロロピリミジンを記載している。国際公開第 01 / 72751 号は、チロシンキナーゼ阻害剤としてピロロピリミジンを記載している。国際公開第 00 / 71129 号は、キナーゼのピロロトリアジン阻害剤を記載している。国際公開第 97 / 28161 号は、ピロロ [2 , 3 - d] ピリミジン及びチロシンキナーゼ阻害剤としてのその使用を記載している。

10

【 0016 】

Parrizas 等は、インビトロ及びインビボでの IGF - 1 R 阻害活性を有するチロホスチンを記載している (*Endocrinology* , 138 : 1427 - 1433 (1997)) 。国際公開第 00 / 35455 号は IGF - 1 R 阻害剤としてヘテロアリール - アリールウレアを記載している。国際公開第 03 / 048133 号は、IGF - 1 R の調節物質としてピリミジン誘導体を記載している。国際公開第 03 / 024967 号は、キナーゼタンパク質に対して阻害効果を有する化学物質を記載している。国際公開第 03 / 068265 号は、過剰増殖症状を治療する方法及び組成物を記載している。国際公開第 00 / 17203 号は、プロテインキナーゼ阻害剤としてピロロピリミジンを記載している。日本国特許公報第 07 / 133280 号は、セフェム化合物、その製造及び抗菌組成物を記載している。A. Albert et al. , *Journal of the Chemical Society* , 11 : 1540 - 1547 (1970) は、プテリジン試験及び 4 位が置換されていないプテリジン、3 , 4 - ジヒドロプテリジン (dhydropteridine) を経由したピラジンからの合成を記載している。A. Albert et al. , *Chem. Biol. Pteridines Proc. Int. Symp.* , 4th , 4 : 1 - 5 (1969) は、3 , 4 - ジヒドロプテリジンを経由したピラジンからの (4 位が置換されていない) プテリジンの合成を記載している。

20

【 0017 】

IGF - 1 R は、細胞分裂、発生及び代謝において、並びにその活性化状態において重要な役割を果たし、発癌及びアポトーシス抑制においてある役割を果たす。IGF - 1 R は、幾つかの癌細胞系において過剰発現することが知られている (IGF - 1 R の過剰発現は末端肥大症及び前立腺癌と関連がある。) 。これに対し、IGF - 1 R 発現の減少は、腫瘍形成を阻害し、腫瘍細胞のアポトーシスを増加させることが示された。

30

【 発明の開示 】

【 発明が解決しようとする課題 】

【 0018 】

上記抗癌化合物は当該技術に多大な寄与をしたが、抗癌剤を改善して選択性若しくは効力を増大させ、毒性を低下させ、又は副作用を少なくすることが、当技術分野において引き続き求められている。

40

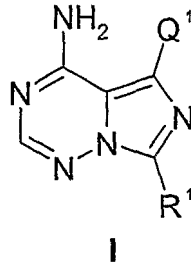
【 課題を解決するための手段 】

【 0019 】

本発明は、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩に関する。

【 0020 】

【化9】



【0021】

10

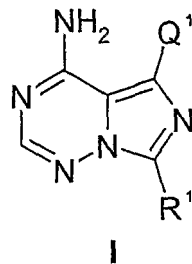
式Iの化合物は、IGF-1R酵素を阻害し、IGF-1Rの阻害による治療に応答する様々な疾患及び症状の治療及び/又は予防に有用である。特に、本発明の化合物は、過剰増殖疾患、特に癌において重要であるチロシンキナーゼの阻害剤として有用である。

【0022】

本発明は、式Iの化合物又は薬剤として許容されるその塩に関する。

【0023】

【化10】



20

【0024】

式中、

Q¹はアリール¹、ヘテロアリール¹、シクロC₃₋₁₀アルキル、ヘテロシクリル、シクロC₃₋₁₀アルケニル又はヘテロシクロアルケニルであり、そのいずれも1から5個の独立したG¹⁰置換基で置換されていてもよく、

30

R¹はC₀₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₁₀アルキル、ビスシクロC₅₋₁₀アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、ヘテロシクリル又はヘテロビスシクロC₅₋₁₀アルキルであり、そのいずれも1個以上の独立したG¹¹置換基で置換されていてもよく、

G¹⁰及びG⁴¹は各々独立にハロ、オキソ、-CF₃、-OCF₃、-OR²、-NR²R³(R^{2a})_{j1}、-C(O)R²、-CO₂R²、-CONR²R³、-NO₂、-CN、-S(O)_{j1}R²、-SO₂NR²R³、-NR²C(=O)R³、-NR²C(=O)OR³、-NR²C(=O)NR³R^{2a}、-NR²S(O)_{j1}R³、-C(=S)OR²、-C(=O)SR²、-NR²C(=NR³)NR^{2a}R^{3a}、-NR²C(=NR³)OR^{2a}、-NR²C(=NR³)SR^{2a}、-OC(=O)OR²、-OC(=O)NR²R³、-OC(=O)SR²、-SC(=O)OR²、-SC(O)NR²R³、C₀₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケニル、C₂₋₁₀アルキニル、C₁₋₁₀アルコキシC₁₋₁₀アルキル、C₁₋₁₀アルコキシC₂₋₁₀アルケニル、C₁₋₁₀アルコキシC₂₋₁₀アルキニル、C₁₋₁₀アルキルチオC₁₋₁₀アルキル、C₁₋₁₀アルキルチオC₂₋₁₀アルケニル、C₁₋₁₀アルキルチオC₂₋₁₀アルキニル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、シクロC₃₋₈アルキルC₁₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルケニルC₁₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルキルC₂₋₁₀アルケニル、シクロC₃₋₈アルケニルC₂₋₁₀アルケニル、シクロC₃₋₈アルキルC₂₋₁₀アルキニル、シクロC₃₋₈アルケニルC₂₋₁₀アルキニル、ヘテロシクリル-C₀₋₁₀アルキル、ヘテロシクリル-C₂₋₁₀アルケニ

40

50

ル若しくはヘテロシクリル - C₂₋₁₀ アルキニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した八口、オキソ、 - CF₃、 - OCF₃、 - OR^{2 2 2}、 - NR^{2 2 2} R^{3 3 3} (R^{2 2 a})_{j 1 a}、 - C(O) R^{2 2 2}、 - CO₂ R^{2 2 2}、 - CONR^{2 2 2} R^{3 3 3}、 - NO₂、 - CN、 - S(O)_{j 1 a} R^{2 2 2}、 - SO₂ NR^{2 2 2} R^{3 3 3}、 - NR^{2 2 2} C(=O) R^{3 3 3}、 - NR^{2 2 2} C(=O) OR^{3 3 3}、 - NR^{2 2 2} C(=O) NR^{3 3 3} R^{2 2 2 a}、 - NR^{2 2 2} S(O)_{j 1 a} R^{3 3 3}、 - C(=S) OR^{2 2 2}、 - C(O) SR^{2 2 2}、 - NR^{2 2 2} C(=NR^{3 3 3}) NR^{2 2 2 a} R^{3 3 3 a}、 - NR^{2 2 2} C(=NR^{3 3 3}) OR^{2 2 2 a}、 - NR^{2 2 2} C(=NR^{3 3 3}) SR^{2 2 a}、 - OC(=O) OR^{2 2 2}、 - OC(=O) NR^{2 2 2} R^{3 3 3}、 - OC(=O) SR^{2 2 2}、 - SC(=O) OR^{2 2 2} 若しくは - SC(=O) NR^{2 2 2} R^{3 3 3} 置換基で置換されていてもよく、

又は G^{1 0} は - (X¹)_n - (Y¹)_m - R⁴ であってもよく、
 又は G^{4 1} は - (X¹)_n - (Y¹)_m - C₀₋₁₀ アルキルであってもよく、
 又は G^{1 0} 及び G^{4 1} は各々独立にアリール - C₀₋₁₀ アルキル、アリール - C₂₋₁₀ アルケニル、アリール - C₂₋₁₀ アルキニル、ヘタリール - C₀₋₁₀ アルキル、ヘタリール - C₂₋₁₀ アルケニル若しくはヘタリール - C₂₋₁₀ アルキニルであってもよく、そのいずれも 1 個以上の独立した八口、 - CF₃、 - OCF₃、 - OR^{2 2 2}、 - NR^{2 2 2} R^{3 3 3} (R^{2 2 a})_{j 2 a}、 - C(O) R^{2 2 2}、 - CO₂ R^{2 2 2}、 - CONR^{2 2 2} R^{3 3 3}、 - NO₂、 - CN、 - S(O)_{j 2 a} R^{2 2 2}、 - SO₂ NR^{2 2 2} R^{3 3 3}、 - NR^{2 2 2} C(=O) R^{3 3 3}、 - NR^{2 2 2} C(=O) OR^{3 3 3}、 - NR^{2 2 2} C(=O) NR^{3 3 3} R^{2 2 2 a}、 - NR^{2 2 2} S(O)_{j 2 a} R^{3 3 3}、 - C(=S) OR^{2 2 2}、 - C(=O) SR^{2 2 2}、 - NR^{2 2 2} C(=NR^{3 3 3}) NR^{2 2 2 a} R^{3 3 3 a}、 - NR^{2 2 2} C(=NR^{3 3 3}) OR^{2 2 2 a}、 - NR^{2 2 2} C(=NR^{3 3 3}) SR^{2 2 a}、 - OC(=O) OR^{2 2 2}、 - OC(=O) NR^{2 2 2} R^{3 3 3}、 - OC(=O) SR^{2 2 2}、 - SC(=O) OR^{2 2 2} 若しくは - SC(=O) NR^{2 2 2} R^{3 3 3} 置換基で置換されていてもよく、

G^{1 1} は八口、オキソ、 - CF₃、 - OCF₃、 - OR^{2 1}、 - NR^{2 1} R^{3 1} (R^{2 1 a})_{j 3}、 - C(O) R^{2 1}、 - CO₂ R^{2 1}、 - CONR^{2 1} R^{3 1}、 - NO₂、 - CN、 - S(O)_{j 3} R^{2 1}、 - SO₂ NR^{2 1} R^{3 1}、 - NR^{2 1} C(=O) R^{3 1}、 - NR^{2 1} C(=O) OR^{3 1}、 - NR^{2 1} C(=O) NR^{3 1} R^{2 1 a}、 - NR^{2 1} S(O)_{j 3} R^{3 1}、 - C(=S) OR^{2 1}、 - C(-O) SR^{2 1}、 - NR^{2 1} C(=NR^{3 1}) NR^{2 1 a} R^{3 1 a}、 - NR^{2 1} C(=NR^{3 1}) OR^{2 1 a}、 - NR^{2 1} C(=NR^{3 1}) SR^{2 1 a}、 - OC(=O) OR^{2 1}、 - OC(=O) NR^{2 1} R^{3 1}、 - OC(=O) SR^{2 1}、 - SC(=O) OR^{2 1}、 - SC(=O) NR^{2 1} R^{3 1}、 - P(O) OR^{2 1} OR^{3 1}、 C₀₋₁₀ アルキル、 C₂₋₁₀ アルケニル、 C₂₋₁₀ アルキニル、 C₁₋₁₀ アルコキシ C₁₋₁₀ アルキル、 C₁₋₁₀ アルコキシ C₂₋₁₀ アルケニル、 C₁₋₁₀ アルコキシ C₂₋₁₀ アルキニル、 C₁₋₁₀ アルキルチオ C₁₋₁₀ アルキル、 C₁₋₁₀ アルキルチオ C₂₋₁₀ アルケニル、 C₁₋₁₀ アルキルチオ C₂₋₁₀ アルキニル、シクロ C₃₋₈ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルケニル、シクロ C₃₋₈ アルキル C₁₋₁₀ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルケニル C₁₋₁₀ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルキル C₂₋₁₀ アルケニル、シクロ C₃₋₈ アルケニル C₂₋₁₀ アルケニル、シクロ C₃₋₈ アルキル C₂₋₁₀ アルキニル、シクロ C₃₋₈ アルケニル C₂₋₁₀ アルキニル、ヘテロシクリル - C₀₋₁₀ アルキル、ヘテロシクリル - C₂₋₁₀ アルケニル若しくはヘテロシクリル - C₂₋₁₀ アルキニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した八口、オキソ、 - CF₃、 - OCF₃、 - OR^{2 2 2 1}、 - NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} (R^{2 2 2 1 a})_{j 3 a}、 - C(O) R^{2 2 2 1}、 - CO₂ R^{2 2 2 1}、 - CONR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - NO₂、 - CN、 - S(O)_{j 3 a} R^{2 2 2 1}、 - SO₂ NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1} C(=O) R^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1} C(=O) OR^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1} C(=O) NR^{3 3 3 1} R^{2 2 2 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} S(O)_{j 3 a} R^{3 3 3 1}、 - C(=S) OR^{2 2 2 1}、 - C(=O) SR^{2 2 2 1}、 -

10

20

30

40

50

NR^{2 2 2 1} C (= NR^{3 3 3 1}) NR^{2 2 2 1 a} R^{3 3 3 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} C (= NR^{3 3 3 1}) OR^{2 2 2 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} C (= NR^{3 3 3 1}) SR^{2 2 2 1 a}、
 - OC (= O) OR^{2 2 2 1}、 - OC (= O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - OC (= O) SR^{2 2 2 1}、 - SC (= O) OR^{2 2 2 1}、 - P (O) OR^{2 2 2 1} OR^{3 3 3 1} 若しくは - SC (= O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} 置換基で置換されていてもよく、

又はG^{1 1}はアリール - C_{0 - 1 0} アルキル、アリール - C_{2 - 1 0} アルケニル、アリール - C_{2 - 1 0} アルキニル、ヘタリール - C_{0 - 1 0} アルキル、ヘタリール - C_{2 - 1 0} アルケニル若しくはヘタリール - C_{2 - 1 0} アルキニルであり、そのいずれも1個以上の独立した八口、 - CF₃、 - OCF₃、 - OR^{2 2 2 1}、 - NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} (R^{2 2 2 1 a})_{j 3 a}、 - C (O) R^{2 2 2 1}、 - CO₂ R^{2 2 2 1}、 - CONR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - NO₂、 - CN、 - S (O)_{j 3 a} R^{2 2 2 1}、 - SO₂ NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1} C (= O) R^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1} C (= O) OR^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1} C (= O) NR^{3 3 3 1} R^{2 2 2 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} S (O)_{j 3 a} R^{3 3 3 1}、 - C (= S) OR^{2 2 2 1}、 - C (= O) SR^{2 2 2 1}、 - NR^{2 2 2 1} C (= NR^{3 3 3 1}) NR^{2 2 2 1 a} R^{3 3 3 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} C (= NR^{3 3 3 1}) OR^{2 2 2 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} C (= NR^{3 3 3 1}) SR^{2 2 2 1 a}、 - OC (= O) OR^{2 2 2 1}、 - OC (= O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - OC (= O) SR^{2 2 2 1}、 - SC (= O) OR^{2 2 2 1}、 - P (O) OR^{2 2 2 1} OR^{3 3 3 1} 若しくは - SC (= O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} 置換基で置換されていてもよく、

又はG^{1 1}はCであり、G^{1 1}が結合している炭素と一緒に、R⁵及びG^{1 2}で置換されたC=C二重結合を形成し、

R²、R^{2 a}、R³、R^{3 a}、R^{2 2 2}、R^{2 2 2 a}、R^{3 3 3}、R^{3 3 3 a}、R^{2 1}、R^{2 1 a}、R^{3 1}、R^{3 1 a}、R^{2 2 2 1}、R^{2 2 2 1 a}、R^{3 3 3 1}及びR^{3 3 3 1 a}は各々独立にC_{0 - 1 0} アルキル、C_{2 - 1 0} アルケニル、C_{2 - 1 0} アルキニル、C_{1 - 1 0} アルコキシC_{1 - 1 0} アルキル、C_{1 - 1 0} アルコキシC_{2 - 1 0} アルケニル、C_{1 - 1 0} アルコキシC_{2 - 1 0} アルキニル、C_{1 - 1 0} アルキルチオC_{1 - 1 0} アルキル、C_{1 - 1 0} アルキルチオC_{2 - 1 0} アルケニル、C_{1 - 1 0} アルキルチオC_{2 - 1 0} アルキニル、シクロC_{3 - 8} アルキル、シクロC_{3 - 8} アルケニル、シクロC_{3 - 8} アルキルC_{1 - 1 0} アルキル、シクロC_{3 - 8} アルケニルC_{1 - 1 0} アルキル、シクロC_{3 - 8} アルキルC_{2 - 1 0} アルケニル、シクロC_{3 - 8} アルケニルC_{2 - 1 0} アルケニル、シクロC_{3 - 8} アルキルC_{2 - 1 0} アルキニル、シクロC_{3 - 8} アルケニルC_{2 - 1 0} アルキニル、ヘテロシクリル - C_{0 - 1 0} アルキル、ヘテロシクリル - C_{2 - 1 0} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{2 - 1 0} アルキニル、アリール - C_{0 - 1 0} アルキル、アリール - C_{2 - 1 0} アルケニル、アリール - C_{2 - 1 0} アルキニル、ヘタリール - C_{0 - 1 0} アルキル、ヘタリール - C_{2 - 1 0} アルケニル又はヘタリール - C_{2 - 1 0} アルキニルであり、そのいずれも1個以上の独立したG^{1 3}置換基で置換されていてもよく、

又は - NR² R³ (R^{2 a})_{j 1} 若しくは - NR^{2 1} R^{3 1} (R^{2 1 a})_{j 3} 若しくは - NR^{2 2 2} R^{3 3 3} (R^{2 2 2 a})_{j 1 a} 若しくは - NR^{2 2 2} R^{3 3 3} (R^{2 2 2 a})_{j 2 a} 若しくは - NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} (R^{2 2 2 1 a})_{j 3 a} の場合、R²及びR³若しくはR^{2 1}及びR^{3 1}若しくはR^{2 2 2}及びR^{3 3 3}若しくはR^{2 2 2 1}及びR^{3 3 3 1}は、謹んで、これらが結合している窒素原子と一緒に飽和若しくは不飽和の3員環から10員環を形成していてもよく、前記環は1個以上の独立したG^{1 4}置換基で置換されていてもよく、前記環は、R²及びR³若しくはR^{2 2 2}及びR^{3 3 3}若しくはR^{2 2 2 1}及びR^{3 3 3 1}が結合した窒素以外の1個以上の独立したヘテロ原子を含んでいてもよく、

X¹及びY¹は各々独立に - O -、 - NR⁷ -、 - S (O)_{j 4} -、 - CR⁵ R⁶ -、 - N (C (O) OR⁷) -、 - N (C (O) R⁷) -、 - N (SO₂ R⁷) -、 - CH₂ O -、 - CH₂ S -、 - CH₂ N (R⁷) -、 - CH (NR⁷) -、 - CH₂ N (C (O) R⁷) -、 - CH₂ N (C (O) OR⁷) -、 - CH₂ N (SO₂ R⁷) -、 - CH (NHR⁷) -、 - CH (NH C (O) R⁷) -、 - CH (NH SO₂ R⁷) -、 - CH (

10

20

30

40

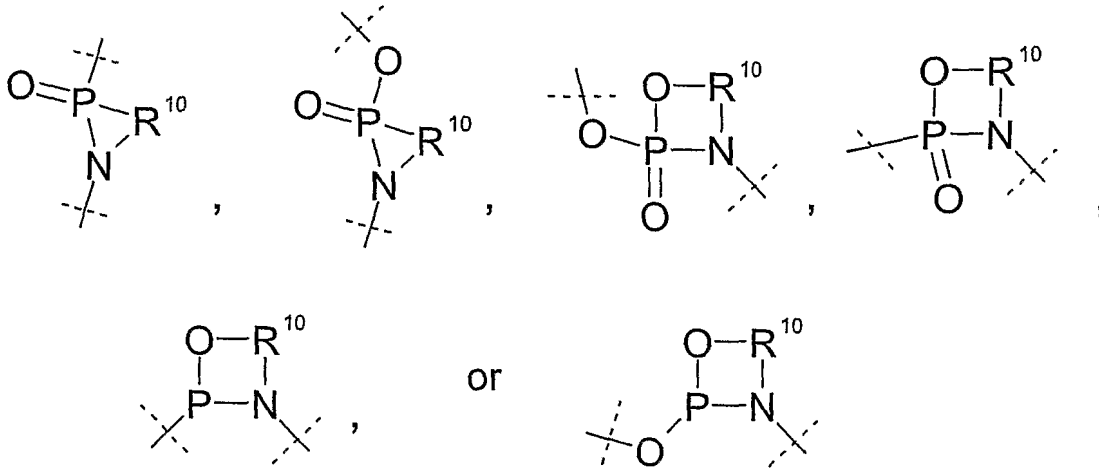
50

$\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^7$) -、 - $\text{CH}(\text{OC}(\text{O})\text{R}^7)$ -、 - $\text{CH}(\text{OC}(\text{O})\text{NHR}^7)$)
 -、 - $\text{CH}=\text{CH}$ -、 - $\text{C}-\text{C}$ -、 - $\text{C}(\text{=NOR}^7)$ -、 - $\text{C}(\text{O})$ -、 - $\text{CH}(\text{OR}^7)$) -、
 - $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^7)$ -、 - $\text{N}(\text{R}^7)\text{C}(\text{O})$ -、 - $\text{N}(\text{R}^7)\text{S}(\text{O})$ -、
 - $\text{N}(\text{R}^7)\text{S}(\text{O})_2$ -、 - $\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^7)$ 、 - $\text{N}(\text{R}^7)\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^8)$)
 -、 - $\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{O}$ -、 - $\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^7)$ -、 - $\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^7)$ -、 - N
 ($\text{C}(\text{O})\text{R}^7$) $\text{S}(\text{O})$ -、 - $\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{R}^7)\text{S}(\text{O})_2$ -、 - $\text{N}(\text{R}^7)\text{S}(\text{O})$
) $\text{N}(\text{R}^8)$ -、 - $\text{N}(\text{R}^7)\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^8)$ -、 - $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^7)\text{C}(\text{O})$
 -、 - $\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^7)\text{C}(\text{O})$ -、 - $\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^7)\text{C}(\text{O})$ -、 - $\text{OS}(\text{O})$
) $\text{N}(\text{R}^7)$ -、 - $\text{OS}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^7)$ -、 - $\text{N}(\text{R}^7)\text{S}(\text{O})\text{O}$ -、 - $\text{N}(\text{R}^7)$
) $\text{S}(\text{O})_2\text{O}$ -、 - $\text{N}(\text{R}^7)\text{S}(\text{O})\text{C}(\text{O})$ -、 - $\text{N}(\text{R}^7)\text{S}(\text{O})_2\text{C}(\text{O})$ 10
 -、 - $\text{SON}(\text{C}(\text{O})\text{R}^7)$ -、 - $\text{SO}_2\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{R}^7)$ -、 - $\text{N}(\text{R}^7)\text{SON}$
 (R^8) -、 - $\text{N}(\text{R}^7)\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^8)$ -、 - $\text{C}(\text{O})\text{O}$ -、 - $\text{N}(\text{R}^7)\text{P}(\text{OR}^8)$
) O -、 - $\text{N}(\text{R}^7)\text{P}(\text{OR}^8)$ -、 - $\text{N}(\text{R}^7)\text{P}(\text{O})(\text{OR}^8)\text{O}$ -、 - N
 (R^7) $\text{P}(\text{O})(\text{OR}^8)$ -、 - $\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{R}^7)\text{P}(\text{OR}^8)\text{O}$ -、 - $\text{N}(\text{C}(\text{O})$
) $\text{P}(\text{OR}^8)$ -、 - $\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{R}^7)\text{P}(\text{O})(\text{OR}^8)\text{O}$ -、 - $\text{N}(\text{C}(\text{O})$
) $\text{P}(\text{OR}^8)$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{S}(\text{O})$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{S}(\text{O})_2$ -、 - C
) $\text{H}(\text{R}^7)\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{OR}^8)$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{R}^8)$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)$
) $\text{N}(\text{SO}_2\text{R}^8)$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{O}$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{S}$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}$
 (R^8) -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{R}^8)$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{OR}^8)$
) -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{SO}_2\text{R}^8)$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{C}(\text{=NOR}^8)$ -、 - CH 20
 (R^7) $\text{C}(\text{O})$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{CH}(\text{OR}^8)$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^8)$
) -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{R}^8)\text{C}(\text{O})$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{R}^8)\text{S}(\text{O})$ -、
 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{R}^8)\text{S}(\text{O})_2$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^8)$ -、 - C
) $\text{H}(\text{R}^7)\text{N}(\text{R}^8)\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^7\text{a})$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{O}$ -、 -
) $\text{CH}(\text{R}^7)\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^8)$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^8)$ -、 - CH
 (R^7) $\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{R}^8)\text{S}(\text{O})$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{R}^8)\text{S}(\text{O})$ -、
 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{R}^8)\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^7\text{a})$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{R}^8)\text{S}(\text{O})$
) $_2\text{N}(\text{R}^7\text{a})$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^8)\text{C}(\text{O})$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{S}$
 ($\text{O})\text{N}(\text{R}^8)\text{C}(\text{O})$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^8)\text{C}(\text{O})$ -、 - CH 30
 (R^7) $\text{OS}(\text{O})\text{N}(\text{R}^8)$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{OS}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^8)$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)$
) $\text{N}(\text{R}^8)\text{S}(\text{O})\text{O}$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{R}^8)\text{S}(\text{O})_2\text{O}$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)$
) $\text{N}(\text{R}^8)\text{S}(\text{O})\text{C}(\text{O})$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{R}^8)\text{S}(\text{O})_2\text{C}(\text{O})$ -、 -
) $\text{CH}(\text{R}^7)\text{SON}(\text{C}(\text{O})\text{R}^8)$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{SO}_2\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{R}^8)$ -、
 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{R}^8)\text{SON}(\text{R}^7\text{a})$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{R}^8)\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^7\text{a})$ -、
 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{C}(\text{O})\text{O}$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{R}^8)\text{P}(\text{OR}^7\text{a})\text{O}$ -
 -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{R}^8)\text{P}(\text{OR}^7\text{a})$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{R}^8)\text{P}(\text{O})(\text{O}$
) $\text{R}^7\text{a})\text{O}$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{R}^8)\text{P}(\text{O})(\text{OR}^7\text{a})$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}$
 ($\text{C}(\text{O})\text{R}^8$) $\text{P}(\text{OR}^7\text{a})\text{O}$ -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{R}^8)\text{P}(\text{OR}^7\text{a})$
) -、 - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{R}^8)\text{P}(\text{O})(\text{OR}^7\text{a})\text{O}$ - 又は - $\text{CH}(\text{R}^7)\text{N}$
 ($\text{C}(\text{O})\text{R}^8$) $\text{P}(\text{OR}^7\text{a})$ - であり、 40

又は X^1 及び Y^1 は各々独立に以下の構造式の 1 つによって表され、

【 0 0 2 5 】

【化 1 1】



10

【0026】

R¹⁰は、ホスフィンアミド又はホスホンアミドと一緒に、5、6又は7員のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル環構造を形成し、

R⁵、R⁶、G¹²、G¹³、G¹⁴及びG¹⁵は各々独立にC₀₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケニル、C₂₋₁₀アルキニル、C₁₋₁₀アルコキシC₁₋₁₀アルキル、C₁₋₁₀アルコキシC₂₋₁₀アルケニル、C₁₋₁₀アルコキシC₂₋₁₀アルキニル、C₁₋₁₀アルキルチオC₁₋₁₀アルキル、C₁₋₁₀アルキルチオC₂₋₁₀アルケニル、C₁₋₁₀アルキルチオC₂₋₁₀アルキニル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、シクロC₃₋₈アルキルC₁₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルケニルC₁₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルキルC₂₋₁₀アルケニル、シクロC₃₋₈アルケニルC₂₋₁₀アルケニル、シクロC₃₋₈アルキルC₂₋₁₀アルキニル、シクロC₃₋₈アルケニルC₂₋₁₀アルキニル、ヘテロシクリル-C₀₋₁₀アルキル、ヘテロシクリル-C₂₋₁₀アルケニル、ヘテロシクリル-C₂₋₁₀アルキニル、アリール-C₀₋₁₀アルキル、アリール-C₂₋₁₀アルケニル、アリール-C₂₋₁₀アルキニル、ヘタリール-C₀₋₁₀アルキル、ヘタリール-C₂₋₁₀アルケニル又はヘタリール-C₂₋₁₀アルキニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロゲン、-CF₃、-OCF₃、-OR⁷⁷、-NR⁷⁷R⁸⁷、-C(O)R⁷⁷、-CO₂R⁷⁷、-CONR⁷⁷R⁸⁷、-NO₂、-CN、-S(O)_jR⁷⁷、-SO₂NR⁷⁷R⁸⁷、-NR⁷⁷C(=O)R⁸⁷、-NR⁷⁷C(=O)OR⁸⁷、-NR⁷⁷C(=O)NR⁸⁷R^{77a}、-NR⁷⁷S(O)_jR⁸⁷、-C(=S)OR⁷⁷、-C(=O)SR⁷⁷、-NR⁷⁷C(=NR⁸⁷)NR^{77a}R^{87a}、-NR⁷⁷C(=NR⁸⁷)OR^{77a}、-NR⁷⁷C(=NR⁸⁷)SR^{77a}、-OC(=O)OR⁷⁷、-OC(=O)NR⁷⁷R⁸⁷、-OC(=O)SR⁷⁷、-SC(=O)OR⁷⁷、-P(O)OR⁷⁷OR⁸⁷又は-SC(=O)NR⁷⁷R⁸⁷置換基で置換されていてもよく、

20

30

40

又はR⁵とR⁶は、これらが結合しているそれぞれの炭素原子と一緒に飽和若しくは不飽和の3員環から10員環を形成していてもよく、前記環はR⁶⁹で置換されていてもよく、前記環は1個以上の独立したヘテロ原子を含んでいてもよく、

R⁷、R^{7a}及びR⁸は各々独立にアシル、C₀₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル又はシクロC₃₋₁₀アルキルであり、そのいずれも1個以上の独立したG¹⁵置換基で置換されていてもよく、

R⁴はC₀₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケニル、C₂₋₁₀アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロC₃₋₁₀アルキル、ヘテロシクリル、シクロC₃₋₁₀アルケニル又はヘテロシクロアルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したG⁴¹置換基で置換されていてもよく、

50

R^{6 9} は八口、-OR^{4 1}、-SH、-NR^{4 1}R^{5 1}、-CO₂R^{4 1}、-CONR^{4 1}R^{5 1}、-NO₂、-CN、-S(O)_jR^{4 1}、-SO₂NR^{4 1}R^{5 1}、C₀₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケニル、C₂₋₁₀アルキニル、C₁₋₁₀アルコキシC₁₋₁₀アルキル、C₁₋₁₀アルコキシC₂₋₁₀アルケニル、C₁₋₁₀アルコキシC₂₋₁₀アルキニル、C₁₋₁₀アルキルチオC₁₋₁₀アルキル、C₁₋₁₀アルキルチオC₂₋₁₀アルケニル、C₁₋₁₀アルキルチオC₂₋₁₀アルキニル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、シクロC₃₋₈アルキルC₁₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルケニルC₁₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルキルC₂₋₁₀アルケニル、シクロC₃₋₈アルケニルC₂₋₁₀アルケニル、シクロC₃₋₈アルキルC₂₋₁₀アルキニル、シクロC₃₋₈アルケニルC₂₋₁₀アルキニル、ヘテロシクリル-C₀₋₁₀アルキル、ヘテロシクリル-C₂₋₁₀アルケニル若しくはヘテロシクリル-C₂₋₁₀アルキニルであり、そのいずれも1個以上の独立した八口、シアノ、ニトロ、-OR^{7 7 8}、-SO₂NR^{7 7 8}R^{8 8 8}若しくは-NR^{7 7 8}R^{8 8 8}置換基で置換されていてもよく、

又はR^{6 9} はアリール-C₀₋₁₀アルキル、アリール-C₂₋₁₀アルケニル、アリール-C₂₋₁₀アルキニル、ヘタリール-C₀₋₁₀アルキル、ヘタリール-C₂₋₁₀アルケニル、ヘタリール-C₂₋₁₀アルキニル、モノ(C₁₋₆アルキル)アミノC₁₋₆アルキル、ジ(C₁₋₆アルキル)アミノC₁₋₆アルキル、モノ(アリール)アミノC₁₋₆アルキル、ジ(アリール)アミノC₁₋₆アルキル、モノ(ヘタリール)アミノC₁₋₆アルキル、ジ(ヘタリール)アミノC₁₋₆アルキル若しくは-N(C₁₋₆アルキル)-C₁₋₆アルキル-アリールであり、そのいずれも1個以上の独立した八口、シアノ、ニトロ、-OR^{7 7 8}、C₁₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケニル、C₂₋₁₀アルキニル、八口C₁₋₁₀アルキル、八口C₂₋₁₀アルケニル、八口C₂₋₁₀アルキニル、-COOH、C₁₋₄アルコキシカルボニル、-CONR^{7 7 8}R^{8 8 8}、-SO₂NR^{7 7 8}R^{8 8 8}若しくは-NR^{7 7 8}R^{8 8 8}置換基で置換されていてもよく、

又は-NR^{4 1}R^{5 1}の場合には、R^{4 1}及びR^{5 1}は、これらが結合している窒素原子と一緒に飽和若しくは不飽和の3員環から10員環を形成していてもよく、前記環は1個以上の独立した八口、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、C₁₋₁₀アルコキシ、-SO₂NR^{7 7 8}R^{8 8 8}若しくは-NR^{7 7 8}R^{8 8 8}置換基で置換されていてもよく、前記環はR^{4 1}及びR^{5 1}が結合した窒素以外の1個以上の独立したヘテロ原子を含んでいてもよく、

R^{4 1}、R^{5 1}、R^{7 7}、R^{7 7 a}、R^{8 7}、R^{8 7 a}、R^{7 7 8}及びR^{8 8 8}は各々独立にC₀₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケニル、C₂₋₁₀アルキニル、C₁₋₁₀アルコキシC₁₋₁₀アルキル、C₁₋₁₀アルコキシC₂₋₁₀アルケニル、C₁₋₁₀アルコキシC₂₋₁₀アルキニル、C₁₋₁₀アルキルチオC₁₋₁₀アルキル、C₁₋₁₀アルキルチオC₂₋₁₀アルケニル、C₁₋₁₀アルキルチオC₂₋₁₀アルキニル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、シクロC₃₋₈アルキルC₁₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルケニルC₁₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルキルC₂₋₁₀アルケニル、シクロC₃₋₈アルケニルC₂₋₁₀アルケニル、シクロC₃₋₈アルキルC₂₋₁₀アルキニル、シクロC₃₋₈アルケニルC₂₋₁₀アルキニル、ヘテロシクリル-C₀₋₁₀アルキル、ヘテロシクリル-C₂₋₁₀アルケニル、ヘテロシクリル-C₂₋₁₀アルキニル、C₁₋₁₀アルキルカルボニル、C₂₋₁₀アルケニルカルボニル、C₂₋₁₀アルキニルカルボニル、C₁₋₁₀アルコキシカルボニル、C₁₋₁₀アルコキシカルボニルC₁₋₁₀アルキル、モノC₁₋₆アルキルアミノカルボニル、ジC₁₋₆アルキルアミノカルボニル、モノ(アリール)アミノカルボニル、ジ(アリール)アミノカルボニル、C₁₋₁₀アルキル(アリール)アミノカルボニル、モノ(ヘタリール)アミノカルボニル、ジ(ヘタリール)アミノカルボニル若しくはC₁₋₁₀アルキルアルキル(ヘタリール)アミノカルボニルであり、そのいずれも1個以上の独立した八口、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、C₁₋₁₀アルコキシ、-SO₂N(C₀₋

10

20

30

40

50

$_4$ アルキル) (C_{0-4} アルキル)若しくは -N (C_{0-4} アルキル) (C_{0-4} アルキル)置換基で置換されていてもよく、

又は R^{41} 、 R^{51} 、 R^{77} 、 R^{77a} 、 R^{87} 、 R^{87a} 、 R^{778} 及び R^{888} は各々独立にアリアル - C_{0-10} アルキル、アリアル - C_{2-10} アルケニル、アリアル - C_{2-10} アルキニル、ヘタリアル - C_{0-10} アルキル、ヘタリアル - C_{2-10} アルケニル、ヘタリアル - C_{2-10} アルキニル、モノ (C_{1-6} アルキル)アミノ C_{1-6} アルキル、ジ (C_{1-6} アルキル)アミノ C_{1-6} アルキル、モノ (アリアル)アミノ C_{1-6} アルキル、ジ (アリアル)アミノ C_{1-6} アルキル、モノ (ヘタリアル)アミノ C_{1-6} アルキル、ジ (ヘタリアル)アミノ C_{1-6} アルキル若しくは -N (C_{1-6} アルキル) - C_{1-6} アルキル - アリアルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、シアノ、ニトロ、-O (C_{0-4} アルキル)、 C_{1-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、ハロ C_{1-10} アルキル、ハロ C_{2-10} アルケニル、ハロ C_{2-10} アルキニル、-COOH、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、-CON (C_{0-4} アルキル) (C_{0-4} アルキル)、-SO₂N (C_{0-4} アルキル) (C_{0-4} アルキル)若しくは -N (C_{0-4} アルキル) (C_{0-4} アルキル)置換基で置換されていてもよく、

n、m、j₁、j_{1a}、j_{2a}、j₃、j_{3a}、j₄、j_{5a} 及び j₆ は各々独立に 0、1 又は 2 である。) 10

【0027】

本発明の一態様においては、化合物は、式 I によって表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、ピシクロ C_{5-10} アルキル、アリアル、ヘテロアリアル、アラルキル、ヘテロアラルキル、ヘテロシクリル又はヘテロピシクロ C_{5-10} アルキルであり、そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。 20

【0028】

この態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリアル、ヘテロアリアル、アラルキル、ヘテロアラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。 30

【0029】

この態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリアル、ヘテロアリアル、アラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0030】

この態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリアル、ヘテロアリアル、アラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよく、 Q^1 はアリアル¹又はヘテロアリアル¹ (そのいずれも1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。 40

【0031】

この態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリアル、ヘテロアリアル、アラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよく、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよいヘテロアリアル¹であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0032】

この態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容される 50

その塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよく、 Q^1 は、1 個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよいアリール¹ であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0033】

この態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよく、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ (そのいずれも 1 個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよい。) であり、

G^{10} はハロ、 $-OR^2$ 、 $-NR^2R^3$ 、 $-C(O)R^2$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-CONR^2R^3$ 、 $-SO_2NR^2R^3$ 、 $-NR^2C(=O)R^3$ 、 $-NR^2C(=O)OR^3$ 、 $-NR^2C(=O)NR^3R^{2a}$ 、 $-NR^2S(O)_{j1}R^3$ 、 $-OC(=O)OR^2$ 、 $-OC(=O)NR^2R^3$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 OCF_3 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ 、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}(C=O)NR^{333}R^{222a}$ 、 $-NR^{222}S(O)_{j1a}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})NR^{222a}R^{333a}$ 若しくは $-O(C=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよく、又は G^{10} は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、又は G^{10} はアリール- C_{0-10} アルキル若しくはヘタリール- C_{0-10} アルキル (そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、 $-CF_3$ 、 OCF_3 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ 、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)NR^{333}R^{222a}$ 、 $-NR^{222}S(O)_{j2a}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})NR^{222a}R^{333a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0034】

この態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよく、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ (そのいずれも 1 個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよい。) であり、

G^{10} はハロ、 $-OR^2$ 、 $-NR^2R^3$ 、 $-C(O)R^2$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-CONR^2R^3$ 、 $-SO_2NR^2R^3$ 、 $-NR^2C(=O)R^3$ 、 $-NR^2C(=O)OR^3$ 、 $-NR^2C(=O)NR^3R^{2a}$ 、 $-NR^2S(O)_{j1}R^3$ 、 $-OC(=O)OR^2$ 、 $-OC(=O)NR^2R^3$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 OCF_3 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ 、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)NR^{333}R^{222a}$ 、 $-NR^{222}S(O)_{j1a}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})NR^{222a}R^{333a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよく、又は G^{10} は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、その他の変

10

20

30

40

50

数は式 I に対して上述した通りである。

【0035】

この態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよく、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0036】

この態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよく、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 、 $-NR^7-$ 、 $-CR^5R^6-$ 、 $-S(O)_j$ 又は $-C(O)-$ であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、 j は 1 又は 2 であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

10

【0037】

この態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよく、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CR^5R^6-$ であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

20

【0038】

この態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよく、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CH_2-$ であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

30

【0039】

この態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよく、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル (そのいずれも 1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されているもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

40

【0040】

この態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよく、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 、 $-NR^7-$ 、 $-CR$

50

$^5 R^6 -$ 、 $-S(O)_j$ 、 $-C(O)-$ であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、 j は 1 又は 2 であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル（そのいずれも 1 個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されている）であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0041】

この態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した $G^{1,1}$ 置換基で置換されているもよく、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換され、前記 $G^{1,0}$ 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CR^5R^6-$ であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル（そのいずれも 1 個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されている）であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

10

【0042】

この態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した $G^{1,1}$ 置換基で置換されているもよく、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換され、前記 $G^{1,0}$ 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CH_2-$ であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル（そのいずれも 1 個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されている）であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

20

【0043】

この態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した $G^{1,1}$ 置換基で置換されているもよく、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換され、前記 $G^{1,0}$ 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 R^4 はアリール又はヘテロアリール（そのいずれも 1 個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されている）であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

30

【0044】

この態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した $G^{1,1}$ 置換基で置換されているもよく、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換され、前記 $G^{1,0}$ 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 、 $-NR^7-$ 、 $-CR^5R^6-$ 、 $-S(O)_j$ 、 $-C(O)-$ であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、 j は 1 又は 2 であり、 R^4 はアリール又はヘテロアリール（そのいずれも 1 個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されている）であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

40

【0045】

この態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、ア

50

ラルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよく、 Q^1 はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CR^5R^6-$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 R^4 はアリール又はヘテロアリール(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0046】

この態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよく、 Q^1 はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CH_2-$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 R^4 はアリール又はヘテロアリール(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

10

【0047】

この態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよく、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたアリール¹であり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 R^4 は1個以上の G^{41} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 X^1 は $-O-$ であり、 Y^1 は $-CH_2-$ であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

20

【0048】

この態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよく、 Q^1 はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、

30

G^{11} は $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_jR^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル $-C_{0-10}$ アルキル又はヘテロシクリル $-C_{2-10}$ アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立した八口、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_jR^{3a}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_jR^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_jR^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC$

40

50

$(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0049】

本発明の第 2 の態様においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はアリール、ヘテロアリール、アラルキル又はヘテロアラルキルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0050】

この第 2 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はアリール又はヘテロアリールであり、そのいずれも 1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

10

【0051】

この第 2 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0052】

この第 2 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ (そのいずれも 1 個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

20

【0053】

この第 2 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 Q^1 は、1 個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよいヘテロアリール¹ であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0054】

この第 2 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 Q^1 は、1 個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよいアリール¹ であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

30

【0055】

この第 2 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 Q^1 は、1 個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよいヘテロアリール¹ であり、

G^{10} はハロ、 $-OR^2$ 、 $-NR^2R^3$ 、 $-C(O)R^2$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-CONR^2R^3$ 、 $-SO_2NR^2R^3$ 、 $-NR^2C(=O)R^3$ 、 $-NR^2C(=O)OR^3$ 、 $-NR^2C(=O)NR^3R^{2a}$ 、 $-NR^2S(O)_{j1}R^3$ 、 $-OC(=O)OR^2$ 、 $-OC(=O)NR^2R^3$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 OCF_3 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ 、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}(C=O)NR^{333}R^{222a}$ 、 $-NR^{222}S(O)_{j1a}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^333)NR^{222a}R^{333a}$ 若しくは $-O(C=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換

40

50

されていてもよく、又は G^{10} は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、又は G^{10} はアリール- C_{0-10} アルキル若しくはヘタリール- C_{0-10} アルキル(そのいずれも1個以上の独立したハロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ 、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)NR^{333}R^{222a}$ 、 $-NR^{222}S(O)_{j2a}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})NR^{222a}R^{333a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0056】

この第2の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよいアリール¹であり、

G^{10} はハロ、 $-OR^2$ 、 $-NR^2R^3$ 、 $-C(O)R^2$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-CONR^2R^3$ 、 $-SO_2NR^2R^3$ 、 $-NR^2C(=O)R^3$ 、 $-NR^2C(=O)OR^3$ 、 $-NR^2C(=O)NR^3R^{2a}$ 、 $-NR^2S(O)_{j1}R^3$ 、 $-OC(=O)OR^2$ 、 $-OC(=O)NR^2R^3$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ 、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}(C=O)NR^{333}R^{222a}$ 、 $-NR^{222}S(O)_{j1a}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^3)NR^{222a}R^{333a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよく、又は G^{10} は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、又は G^{10} はアリール- C_{0-10} アルキル若しくはヘタリール- C_{0-10} アルキル(そのいずれも1個以上の独立したハロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ 、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)NR^{333}R^{222a}$ 、 $-NR^{222}S(O)_{j2a}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})NR^{222a}R^{333a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0057】

この第2の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよいヘテロアリール¹であり、

G^{10} はハロ、 OR^2 、 $-NR^2R^3$ 、 $-C(O)R^2$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-CONR^2R^3$ 、 $-SO_2NR^2R^3$ 、 $-NR^2C(=O)R^3$ 、 $-NR^2C(=O)OR^3$ 、 $-NR^2C(=O)NR^3R^{2a}$ 、 $-NR^2S(O)_{j1}R^3$ 、 $OC(=O)OR^2$ 、 $-OC(=O)NR^2R^3$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ 、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)NR^{333}R^{222a}$ 、 $-NR^{222}S(O)_{j2a}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})NR^{222a}R^{333a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

10

20

30

40

50

R^3 、 R^2 、 R^2 、 R^2 、 a 、 $-NR^2$ 、 R^2 、 R^2 、 $S(O)$ 、 j 、 1 、 a 、 R^3 、 R^3 、 R^3 、 $-NR^2$ 、 R^2 、 R^2 、 $C(=NR^3$ 、 R^3)、 NR^2 、 R^2 、 R^2 、 a 、 R^3 、 R^3 、 R^3 、 a 若しくは $-OC(=O)NR^2$ 、 R^2 、 R^2 、 R^3 、 R^3 、 R^3 置換基で置換されていてもよく、又は G^1 は $(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0058】

この第2の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^1 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 Q^1 は、1個以上の独立した G^1 置換基で置換されていてもよいアリール¹ であり、

G^1 は H 、 $-OR^2$ 、 $-NR^2R^3$ 、 $-C(O)R^2$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-CONR^2R^3$ 、 $-SO_2NR^2R^3$ 、 $-NR^2C(=O)R^3$ 、 $-NR^2C(=O)OR^3$ 、 $-NR^2C(=O)NR^3R^2$ 、 a 、 $-NR^2S(O)j$ 、 1 、 R^3 、 $-OC(=O)OR^2$ 、 $-OC(=O)NR^2R^3$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ、 C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル 若しくはヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^2$ 、 R^2 、 R^2 、 R^2 、 $-NR^2$ 、 R^2 、 R^2 、 R^3 、 R^3 、 R^3 、 $-C(O)R^2$ 、 R^2 、 R^2 、 R^2 、 $-CO_2R^2$ 、 R^2 、 R^2 、 R^2 、 R^3 、 R^3 、 R^3 、 $-NR^2$ 、 R^2 、 R^2 、 R^2 、 $C(=O)R^3$ 、 R^3 、 R^3 、 R^3 、 $-NR^2$ 、 R^2 、 R^2 、 R^2 、 $C(=O)OR^3$ 、 R^3 、 R^3 、 R^3 、 $-NR^2$ 、 R^2 、 R^2 、 R^2 、 $C(=NR^3$ 、 R^3 、 R^3 、 R^3)、 NR^2 、 R^2 、 R^2 、 R^2 、 a 、 $-NR^2$ 、 R^2 、 R^2 、 R^2 、 $S(O)j$ 、 1 、 a 、 R^3 、 R^3 、 R^3 、 $-NR^2$ 、 R^2 、 R^2 、 R^2 、 $C(=NR^3$ 、 R^3 、 R^3 、 R^3)、 NR^2 、 R^2 、 R^2 、 R^2 、 a 、 R^3 、 R^3 、 R^3 、 a 若しくは $-OC(=O)NR^2$ 、 R^2 、 R^2 、 R^3 、 R^3 、 R^3 置換基で置換されていてもよく、又は G^1 は $(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0059】

この第2の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^1 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^1 置換基で置換され、前記 G^1 置換基の少なくとも1個は $(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0060】

この第2の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^1 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^1 置換基で置換され、前記 G^1 置換基の少なくとも1個は $(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 、 $-NR^7-$ 、 $-CR^5R^6-$ 、 $-S(O)j$ 、 $4-$ 又は $-C(O)-$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 j は1又は2であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0061】

この第2の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^1 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^1 置換基で置換され、前記 G^1 置換基の少なくとも1個は $(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CR^5R^6-$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0062】

この第2の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^1 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記1か

ら5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CH_2-$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0063】

この第2の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよいアリールであり、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されているもよい。)であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

10

【0064】

この第2の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよいアリールであり、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 、 $-NR^7-$ 、 $-CR^5R^6-$ 、 $-S(O)_j$ 、 $-C(O)-$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 j は1又は2であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されているもよい。)であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

20

【0065】

この第2の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよいアリールであり、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CR^5R^6-$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されているもよい。)であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

30

【0066】

この第2の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよいアリールであり、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CH_2-$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されているもよい。)であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

40

【0067】

この第2の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよいアリールであり、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 R^4 はアリール又はヘ

50

テロアリアル（そのいずれも 1 個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されていてもよい。）であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0068】

この第 2 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した $G^{1,1}$ 置換基で置換されていてもよいアリアルであり、 Q^1 はアリアル¹ 又はヘテロアリアル¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換され、前記 $G^{1,0}$ 置換基の少なくとも 1 個は - (X^1)_n - (Y^1)_m - R^4 であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に - O -、- NR⁷ -、- CR⁵R⁶ -、- S(O)_j₄ - 又は - C(O) - であり、n 及び m はどちらも 1 であり、j₄ は 1 又は 2 であり、 R^4 はアリアル又はヘテロアリアル（そのいずれも 1 個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されていてもよい。）であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

10

【0069】

この第 2 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した $G^{1,1}$ 置換基で置換されていてもよいアリアルであり、 Q^1 はアリアル¹ 又はヘテロアリアル¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換され、前記 $G^{1,0}$ 置換基の少なくとも 1 個は - (X^1)_n - (Y^1)_m - R^4 であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に - O - 又は - CR⁵R⁶ - であり、n 及び m はどちらも 1 であり、 R^4 はアリアル又はヘテロアリアル（そのいずれも 1 個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されていてもよい。）であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

20

【0070】

この第 2 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した $G^{1,1}$ 置換基で置換されていてもよいアリアルであり、 Q^1 はアリアル¹ 又はヘテロアリアル¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換され、前記 $G^{1,0}$ 置換基の少なくとも 1 個は - (X^1)_n - (Y^1)_m - R^4 であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に - O - 又は - CH₂ - であり、n 及び m はどちらも 1 であり、 R^4 はアリアル又はヘテロアリアル（そのいずれも 1 個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されていてもよい。）であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

30

【0071】

この第 2 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した $G^{1,1}$ 置換基で置換されていてもよいアリアルであり、 Q^1 はアリアル¹ 又はヘテロアリアル¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換され、前記 $G^{1,0}$ 置換基の少なくとも 1 個は - (X^1)_n - (Y^1)_m - R^4 であり、n 及び m はどちらも 1 であり、 R^4 は C₀₋₁₀ アルキル、アリアル、ヘテロアリアル、シクロ C₃₋₁₀ アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C₃₋₁₀ アルケニル又はヘテロシクロアルケニル（そのいずれも 1 個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されていてもよい。）であり、

$G^{1,1}$ は - OR^{2,1}、- NR^{2,1}R^{3,1}、- CO₂R^{2,1}、- C(O)R^{2,1}、- CONR^{2,1}R^{3,1}、- NR^{2,1}C(=O)R^{3,1}、- NR^{2,1}C(=O)OR^{3,1}、- NR^{2,1}C(=O)NR^{3,1}R^{2,1a}、- NR^{2,1}S(O)_j₃R^{3,1}、- OC(=O)OR^{2,1}、- OC(=O)NR^{2,1}R^{3,1}、C₀₋₁₀ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルケニル、ヘテロシクリル - C₀₋₁₀ アルキル又はヘテロシクリル - C₂₋₁₀ アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、- CF₃、- OCF₃、- OR^{2,2,2,1}、- NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}(R^{2,2,2,1a})_j_{3a}、- C(O)R^{2,2,2,1}、- CO₂R^{2,2,2,1}、- CONR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}、- NO₂、- CN、- S(O)_j_{3a}R^{2,2,2,1}、- SO₂NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}、- NR^{2,2,2,1}C(=O)R^{3,3,3,1}、- NR^{2,2,2,1}C(=O)OR^{3,3,3,1}、- NR^{2,2,2,1}C(=O)NR^{3,3,3,1}R^{2,2,2,1a}、- NR^{2,2,2,1}S(O)_j_{3a}R^{3,3,3,1}、- C(=

40

50

S) OR^{2 2 2 1}、-C(=O)SR^{2 2 2 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})NR^{2 2 2 1}aR^{3 3 3 1}a、-NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})OR^{2 2 2 1}a、-NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})SR^{2 2 2 1}a、-OC(=O)OR^{2 2 2 1}、-OC(=O)NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、-OC(=O)SR^{2 2 2 1}、-SC(=O)OR^{2 2 2 1}又は-SC(=O)NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0072】

この第2の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、R¹は、1個以上の独立したG^{1 1}置換基で置換されていてもよいアリールであり、Q¹はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、Q¹は前記1から5個の独立したG^{1 0}置換基で置換され、前記G^{1 0}置換基の少なくとも1個は-(X¹)_n-(Y¹)_m-R⁴であり、X¹及びY¹は各々独立に-O-、-NR⁷-、-CR⁵R⁶-、-S(O)_{j 4}-又は-C(O)-であり、n及びmはどちらも1であり、j₄は1又は2であり、R⁴はC₀₋₁₀アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロC₃₋₁₀アルキル、ヘテロシクリル、シクロC₃₋₁₀アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立したG^{4 1}置換基で置換されていてもよい。)であり、

G^{1 1}は-OR^{2 1}、-NR^{2 1}R^{3 1}、-CO₂R^{2 1}、-C(O)R^{2 1}、-CONR^{2 1}R^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)R^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)OR^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)NR^{3 1}R^{2 1 a}、-NR^{2 1}S(O)_{j 3}R^{3 1}、-OC(=O)OR^{2 1}、-OC(=O)NR^{2 1}R^{3 1}、C₀₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、ヘテロシクリル-C₀₋₁₀アルキル又はヘテロシクリル-C₂₋₁₀アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、-CF₃、-OCF₃、-OR^{2 2 2 1}、-NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}(R^{2 2 2 1 a})_{j 3 a}、-C(O)R^{2 2 2 1}、-CO₂R^{2 2 2 1}、-CONR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、-NO₂、-CN、-S(O)_{j 3 a}R^{2 2 2 1}、-SO₂NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=O)R^{3 3 3 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=O)OR^{3 3 3 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=O)NR^{3 3 3 1}R^{2 2 2 1 a}、-NR^{2 2 2 1}S(O)_{j 3 a}R^{3 3 3 1}、-C(=S)OR^{2 2 2 1}、-C(=O)SR^{2 2 2 1}、-NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})NR^{2 2 2 1 a}R^{3 3 3 1 a}、-NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})OR^{2 2 2 1 a}、-NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})SR^{2 2 2 1 a}、-OC(=O)OR^{2 2 2 1}、-OC(=O)NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、-OC(=O)SR^{2 2 2 1}、-SC(=O)OR^{2 2 2 1}又は-SC(=O)NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0073】

この第2の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、R¹は、1個以上の独立したG^{1 1}置換基で置換されていてもよいアリールであり、Q¹はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、Q¹は前記1から5個の独立したG^{1 0}置換基で置換され、前記G^{1 0}置換基の少なくとも1個は-(X¹)_n-(Y¹)_m-R⁴であり、X¹及びY¹は各々独立に-O-又は-CR⁵R⁶-であり、n及びmはどちらも1であり、R⁴はC₀₋₁₀アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロC₃₋₁₀アルキル、ヘテロシクリル、シクロC₃₋₁₀アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立したG^{4 1}置換基で置換されていてもよい。)であり、

G^{1 1}は-OR^{2 1}、-NR^{2 1}R^{3 1}、-CO₂R^{2 1}、-C(O)R^{2 1}、-CONR^{2 1}R^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)R^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)OR^{3 1}、-NR^{2 1}C(=O)NR^{3 1}R^{2 1 a}、-NR^{2 1}S(O)_{j 3}R^{3 1}、-OC(=O)OR^{2 1}、-OC(=O)NR^{2 1}R^{3 1}、C₀₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、ヘテロシクリル-C₀₋₁₀アルキル又はヘテロシクリル-C₂₋₁₀アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、-CF₃

、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_{j3a}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_{j3a}R^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_{j3a}R^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0074】

この第2の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 Q^1 はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CH_2-$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、

G^{11} は $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_{j3}R^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_{j3a}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_{j3a}R^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_{j3a}R^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0075】

この第2の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいフェニルであり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0076】

この第2の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたアリール¹であり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 R^4 は1個以上の G^{41} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 X^1 は $-O-$ であり、 Y^1 は $-CH_2-$ であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0077】

この第2の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよいフェニルであり、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたアリーール¹であり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 R^4 は1個以上の G^{41} 置換基で置換されているもよいアリーールであり、 X^1 は $-O-$ であり、 Y^1 は $-CH_2-$ であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0078】

本発明の第3の態様においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル又はヘテロシクリルであり、そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよく、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

10

【0079】

この第3の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよいヘテロシクリルであり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0080】

この第3の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 はアリーール¹又はヘテロアリーール¹（そのいずれも1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されているもよい。）であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

20

【0081】

この第3の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されているもよいヘテロアリーール¹であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0082】

この第3の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されているもよいアリーール¹であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

30

【0083】

この第3の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されているもよいヘテロアリーール¹であり、

G^{10} はハロ、 $-OR^2$ 、 $-NR^2R^3$ 、 $-C(O)R^2$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-CONR^2R^3$ 、 $-SO_2NR^2R^3$ 、 $-NR^2C(=O)R^3$ 、 $-NR^2C(=O)OR^3$ 、 $-NR^2C(=O)NR^3R^{2a}$ 、 $-NR^2S(O)_{j-1}R^3$ 、 $-OC(=O)OR^2$ 、 $-OC(=O)NR^2R^3$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル $-C_{0-10}$ アルキル若しくはヘテロシクリル $-C_{2-10}$ アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 OCF_3 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ 、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}(C=O)NR^{333}R^{222a}$ 、 $-NR^{222}S(O)_{j-1}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})NR^{222a}R^{333a}$ 若しくは $-O(C=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換

40

50

されていてもよく、又は G^{10} は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、又は G^{10} はアリール- C_{0-10} アルキル若しくはヘタリール- C_{0-10} アルキル(そのいずれも1個以上の独立した八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ 、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)NR^{333}R^{222a}$ 、 $-NR^{222}S(O)_{j2a}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})NR^{222a}R^{333a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0084】

この第3の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよいアリール¹であり、

G^{10} は八口、 $-OR^2$ 、 $-NR^2R^3$ 、 $-C(O)R^2$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-CONR^2R^3$ 、 $-SO_2NR^2R^3$ 、 $-NR^2C(=O)R^3$ 、 $-NR^2C(=O)OR^3$ 、 $-NR^2C(=O)NR^3R^{2a}$ 、 $-NR^2S(O)_{j1}R^3$ 、 $-OC(=O)OR^2$ 、 $-OC(=O)NR^2R^3$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 OCF_3 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ 、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}(C=O)NR^{333}R^{222a}$ 、 $-NR^{222}S(O)_{j1a}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})NR^{222a}R^{333a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよく、又は G^{10} は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、又は G^{10} はアリール- C_{0-10} アルキル若しくはヘタリール- C_{0-10} アルキル(そのいずれも1個以上の独立した八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ 、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)NR^{333}R^{222a}$ 、 $-NR^{222}S(O)_{j2a}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})NR^{222a}R^{333a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0085】

この第3の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよいヘテロアリール¹であり、

G^{10} は八口、 OR^2 、 $-NR^2R^3$ 、 $-C(O)R^2$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-CONR^2R^3$ 、 $-SO_2NR^2R^3$ 、 $-NR^2C(=O)R^3$ 、 $-NR^2C(=O)OR^3$ 、 $-NR^2C(=O)NR^3R^{2a}$ 、 $-NR^2S(O)_{j1}R^3$ 、 $OC(=O)OR^2$ 、 $-OC(=O)NR^2R^3$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ 、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)NR^{333}R^{222a}$ 、 $-NR^{222}S(O)_{j1a}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})NR^{222a}R^{333a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

10

20

30

40

50

R^3 、 R^2 、 R^2 、 R^2 、 a 、 $-NR^{222}S(O)_{j1}aR^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})NR^{222}aR^{333}a$ 若しくは $-OC(=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよく、又は G^{10} は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0086】

この第3の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよいアリール¹であり、

G^{10} は H 、 OR^2 、 $-NR^2R^3$ 、 $-C(O)R^2$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-CONR^2R^3$ 、 $-SO_2NR^2R^3$ 、 $-NR^2C(=O)R^3$ 、 $-NR^2C(=O)OR^3$ 、 $-NR^2C(=O)NR^3R^2a$ 、 $-NR^2S(O)_{j1}R^3$ 、 $OC(=O)OR^2$ 、 $-OC(=O)NR^2R^3$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル 若しくはヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ 、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)NR^{333}R^{222}a$ 、 $-NR^{222}S(O)_{j1}aR^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})NR^{222}aR^{333}a$ 若しくは $-OC(=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよく、又は G^{10} は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0087】

この第3の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0088】

この第3の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 、 $-NR^7-$ 、 $-CR^5R^6-$ 、 $-S(O)_{j4}$ - 又は $-C(O)-$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 $j4$ は1又は2であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0089】

この第3の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CR^5R^6-$ 、 $-S(O)_{j4}$ - 又は $-C(O)-$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0090】

この第3の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、 Q^1 は前

10

20

30

40

50

記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CH_2-$ 、 $-S(O)_j$ 、 $-C(O)-$ であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0091】

この第 3 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 はアリーール¹ 又はヘテロアリーール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル (そのいずれも 1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されているもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

10

【0092】

この第 3 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 はアリーール¹ 又はヘテロアリーール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 、 $-NR^7-$ 、 $-CR^5R^6-$ 、 $-S(O)_j$ 、 $-C(O)-$ であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、 j は 1 又は 2 であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル (そのいずれも 1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されているもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

20

【0093】

この第 3 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 はアリーール¹ 又はヘテロアリーール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CR^5R^6-$ 、 $-S(O)_j$ 、 $-C(O)-$ であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル (そのいずれも 1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されているもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

30

【0094】

この第 3 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 はアリーール¹ 又はヘテロアリーール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CH_2-$ 、 $-S(O)_j$ 、 $-C(O)-$ であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル (そのいずれも 1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されているもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

40

【0095】

この第 3 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されているもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 はアリーール¹ 又はヘテロアリーール¹ であり、 Q^1 は前

50

記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 R^4 はアリール又はヘテロアリール（そのいずれも 1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。）であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0096】

この第 3 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 、 $-NR^7-$ 、 $-CR^5R^6-$ 、 $-S(O)_{j4}$ - 又は $-C(O)-$ であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、 j_4 は 1 又は 2 であり、 R^4 はアリール又はヘテロアリール（そのいずれも 1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。）であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

10

【0097】

この第 3 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CR^5R^6-$ 、 $-S(O)_{j4}$ - 又は $-C(O)-$ であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、 R^4 はアリール又はヘテロアリール（そのいずれも 1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。）であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

20

【0098】

この第 3 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CH_2-$ 、 $-S(O)_{j4}$ - 又は $-C(O)-$ であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、 R^4 はアリール又はヘテロアリール（そのいずれも 1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。）であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

30

【0099】

この第 3 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 は、前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換されたアリール¹ であり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、 R^4 は 1 個以上の G^{41} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 X^1 は $-O-$ であり、 Y^1 は $-CH_2-$ であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

40

【0100】

この第 3 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル（そのいずれも 1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。）であり、

G^{11} は $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CO$

50

$NR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_{j3}R^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_{j3a}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_{j3a}R^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_{j3a}R^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

10

【0101】

この第3の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 、 $-NR^7-$ 、 $-CR^5R^6-$ 、 $-S(O)_{j4}$ 又は $-C(O)-$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 $j4$ は1又は2であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、

20

G^{11} は $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_{j3}R^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_{j3a}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_{j3a}R^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_{j3a}R^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

30

40

【0102】

この第3の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CR^5$

50

R^6 -、 - $S(O)_j$ R^4 - 又は - $C(O)$ - であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル (そのいずれも 1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。) であり、

G^{11} は - OR^{21} 、 - $NR^{21}R^{31}$ 、 - CO_2R^{21} 、 - $C(O)R^{21}$ 、 - $CONR^{21}R^{31}$ 、 - $NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 - $NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 - $NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 - $NR^{21}S(O)_jR^{31}$ 、 - $OC(=O)OR^{21}$ 、 - $OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、 - CF_3 、 - OCF_3 、 - OR^{2221} 、 - $NR^{2221}R^{3331}$ (R^{2221a}) j_{3a} 、 - $C(O)R^{2221}$ 、 - CO_2R^{2221} 、 - $CONR^{2221}R^{3331}$ 、 - NO_2 、 - CN 、 - $S(O)_jR^{2221}$ 、 - $SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 - $NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 - $NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 - $NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 - $NR^{2221}S(O)_jR^{3331}$ 、 - $C(=S)OR^{2221}$ 、 - $C(=O)SR^{2221}$ 、 - $NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 - $NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 - $NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 - $OC(=O)OR^{2221}$ 、 - $OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 - $OC(=O)SR^{2221}$ 、 - $SC(=O)OR^{2221}$ 又は - $SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

10

20

【0103】

この第 3 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいヘテロシクリルであり、 Q^1 はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ であり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は - $(X^1)_n$ - $(Y^1)_m$ - R^4 であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に - O - 又は - CH_2 、 - $S(O)_j$ R^4 - 又は - $C(O)$ - であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル (そのいずれも 1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。) であり、

30

G^{11} は - OR^{21} 、 - $NR^{21}R^{31}$ 、 - CO_2R^{21} 、 - $C(O)R^{21}$ 、 - $CONR^{21}R^{31}$ 、 - $NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 - $NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 - $NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 - $NR^{21}S(O)_jR^{31}$ 、 - $OC(=O)OR^{21}$ 、 - $OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、 - CF_3 、 - OCF_3 、 - OR^{2221} 、 - $NR^{2221}R^{3331}$ (R^{2221a}) j_{3a} 、 - $C(O)R^{2221}$ 、 - CO_2R^{2221} 、 - $CONR^{2221}R^{3331}$ 、 - NO_2 、 - CN 、 - $S(O)_jR^{2221}$ 、 - $SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 - $NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 - $NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 - $NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 - $NR^{2221}S(O)_jR^{3331}$ 、 - $C(=S)OR^{2221}$ 、 - $C(=O)SR^{2221}$ 、 - $NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 - $NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 - $NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 - $OC(=O)OR^{2221}$ 、 - $OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 - $OC(=O)SR^{2221}$ 、 - $SC(=O)OR^{2221}$ 又は - $SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

40

【0104】

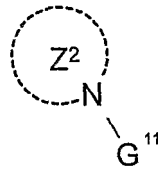
この第 3 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容

50

されるその塩であり、式中、 R^1 は下記構造式で表される。

【0105】

【化12】



【0106】

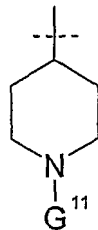
Z^2 は、 G^{11} で置換された N を含むヘテロシクリルであり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。 10

【0107】

この第3の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は下記構造式で表される。

【0108】

【化13】



20

【0109】

式中、 G^{11} は $-C(O)R^{21}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-SO_2NR^{21}R^{31}$ 、 $-S(O)_jR^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル $-C_{0-10}$ アルキル若しくはヘテロシクリル $-C_{2-10}$ アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_jR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、

30

又は G^{11} はアリール $-C_{0-10}$ アルキル若しくはヘタリール $-C_{0-10}$ アルキルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_jR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

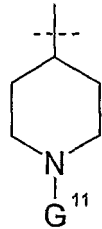
40

【0110】

この第3の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は下記構造式で表される。

【0111】

【化 1 4】



【 0 1 1 2】

式中、 G^{11} は $-C(O)R^{21}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-SO_2NR^{21}R^{31}$ 、 $-S(O)_jR^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_jR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 又は $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【 0 1 1 3】

この第 3 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は下記構造式で表される。

【 0 1 1 4】

【化 1 5】



【 0 1 1 5】

式中、 G^{11} は $-C(O)R^{21}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-SO_2NR^{21}R^{31}$ 、 $-S(O)_jR^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_jR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、又はアリール - C_{0-10} アルキル若しくはヘタリール - C_{0-10} アルキル (そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、

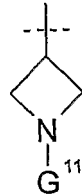
- NR^{2 2 2 1} S(O)_{j 3 a} R^{3 3 3 1}、- NR^{2 2 2 1} C(=NR^{3 3 3 1}) NR^{2 2 2 1 a} R^{3 3 3 1 a} 又は - OC(=O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0116】

この第3の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、R¹ は下記構造式で表される。

【0117】

【化16】



10

【0118】

式中、G^{1 1} は - C(O) R^{2 1}、- CO₂ R^{2 1}、- CONR^{2 1} R^{3 1}、- SO₂ NR^{2 1} R^{3 1}、- S(O)_{j 3} R^{3 1}、C₀₋₁₀ アルキル、C₂₋₁₀ アルケニル、C₁₋₁₀ アルコキシ C₁₋₁₀ アルキル、C₁₋₁₀ アルキルチオ C₁₋₁₀ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルケニル、ヘテロシクリル - C₀₋₁₀ アルキル又はヘテロシクリル - C₂₋₁₀ アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、- CF₃、- OCF₃、- OR^{2 2 2 1}、- NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、- C(O) R^{2 2 2 1}、- CO₂ R^{2 2 2 1}、- CONR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、- SO₂ NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、- NR^{2 2 2 1} C(=O) R^{3 3 3 1}、- NR^{2 2 2 1} C(=O) OR^{3 3 3 1}、- NR^{2 2 2 1} C(=O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、- NR^{2 2 2 1} S(O)_{j 3 a} R^{3 3 3 1}、- NR^{2 2 2 1} C(=NR^{3 3 3 1}) NR^{2 2 2 1 a} R^{3 3 3 1 a} 又は - OC(=O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

20

【0119】

本発明の第4の態様においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、R¹ は、1個以上の独立した G^{1 1} 置換基で置換されていてもよいシクロ C₃₋₁₀ アルキルであり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

30

【0120】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、R¹ は、1個以上の独立した G^{1 1} 置換基で置換されていてもよいシクロ C₃₋₁₀ アルキルであり、Q¹ はアリール¹ 又はヘテロアリール¹ (そのいずれも1個以上の独立した G^{1 0} 置換基で置換されていてもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0121】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、R¹ は、1個以上の独立した G^{1 1} 置換基で置換されていてもよいシクロ C₃₋₁₀ アルキルであり、Q¹ は、1個以上の独立した G^{1 0} 置換基で置換されていてもよいヘテロアリール¹ であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

40

【0122】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、R¹ は、1個以上の独立した G^{1 1} 置換基で置換されていてもよいシクロ C₃₋₁₀ アルキルであり、Q¹ は、1個以上の独立した G^{1 0} 置換基で置換されていてもよいアリール¹ であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0123】

50

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、R¹は、1個以上の独立したG^{1 1}置換基で置換されていてもよいシクロC₃₋₁₀アルキルであり、Q¹は、1個以上の独立したG^{1 0}置換基で置換されていてもよいヘテロアリール¹であり、

G^{1 0}は八口、-OR²、-NR²R³、-C(O)R²、-CO₂R²、-CONR²R³、-SO₂NR²R³、-NR²C(=O)R³、-NR²C(=O)OR³、-NR²C(=O)NR³R^{2 a}、-NR²S(O)_{j 1}R³、-OC(=O)OR²、-OC(=O)NR²R³、C₀₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケニル、C₁₋₁₀アルコキシC₁₋₁₀アルキル、C₁₋₁₀アルキルチオC₁₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、ヘテロシクリル-C₀₋₁₀アルキル若しくはヘテロシクリル-C₂₋₁₀アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、-CF₃、OCF₃、-OR^{2 2 2}、-NR^{2 2 2}R^{3 3 3}、-C(O)R^{2 2 2}、-CO₂R^{2 2 2}、-CONR^{2 2 2}R^{3 3 3}、-SO₂NR^{2 2 2}R^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=O)R^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=O)OR^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}(C=O)NR^{3 3 3}R^{2 2 2 a}、-NR^{2 2 2}S(O)_{j 1 a}R^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=NR^{3 3 3})NR^{2 2 2 a}R^{3 3 3 a}若しくは-O(C=O)NR^{2 2 2}R^{3 3 3}置換基で置換されていてもよく、又はG^{1 0}は-(X¹)_n-(Y¹)_m-R⁴であり、又はG^{1 0}はアリール-C₀₋₁₀アルキル若しくはヘタリール-C₀₋₁₀アルキル(そのいずれも1個以上の独立した八口、-CF₃、-OCF₃、-OR^{2 2 2}、-NR^{2 2 2}R^{3 3 3}、-C(O)R^{2 2 2}、-CO₂R^{2 2 2}、-CONR^{2 2 2}R^{3 3 3}、-SO₂NR^{2 2 2}R^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=O)R^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=O)OR^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=O)NR^{3 3 3}R^{2 2 2 a}、-NR^{2 2 2}S(O)_{j 2 a}R^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=NR^{3 3 3})NR^{2 2 2 a}R^{3 3 3 a}若しくは-OC(=O)NR^{2 2 2}R^{3 3 3}置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0124】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、R¹は、1個以上の独立したG^{1 1}置換基で置換されていてもよいシクロC₃₋₁₀アルキルであり、Q¹は、1個以上の独立したG^{1 0}置換基で置換されていてもよいアリール¹であり、

G^{1 0}は八口、-OR²、-NR²R³、-C(O)R²、-CO₂R²、-CONR²R³、-SO₂NR²R³、-NR²C(=O)R³、-NR²C(=O)OR³、-NR²C(=O)NR³R^{2 a}、-NR²S(O)_{j 1}R³、-OC(=O)OR²、-OC(=O)NR²R³、C₀₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケニル、C₁₋₁₀アルコキシC₁₋₁₀アルキル、C₁₋₁₀アルキルチオC₁₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、ヘテロシクリル-C₀₋₁₀アルキル若しくはヘテロシクリル-C₂₋₁₀アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、-CF₃、OCF₃、-OR^{2 2 2}、-NR^{2 2 2}R^{3 3 3}、-C(O)R^{2 2 2}、-CO₂R^{2 2 2}、-CONR^{2 2 2}R^{3 3 3}、-SO₂NR^{2 2 2}R^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=O)R^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=O)OR^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}(C=O)NR^{3 3 3}R^{2 2 2 a}、-NR^{2 2 2}S(O)_{j 1 a}R^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=NR^{3 3 3})NR^{2 2 2 a}R^{3 3 3 a}若しくは-O(C=O)NR^{2 2 2}R^{3 3 3}置換基で置換されていてもよく、又はG^{1 0}は-(X¹)_n-(Y¹)_m-R⁴であり、又はG^{1 0}はアリール-C₀₋₁₀アルキル若しくはヘタリール-C₀₋₁₀アルキル(そのいずれも1個以上の独立した八口、-CF₃、-OCF₃、-OR^{2 2 2}、-NR^{2 2 2}R^{3 3 3}、-C(O)R^{2 2 2}、-CO₂R^{2 2 2}、-CONR^{2 2 2}R^{3 3 3}、-SO₂NR^{2 2 2}R^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=O)R^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=O)OR^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=O)NR^{3 3 3}R^{2 2 2 a}、-NR^{2 2 2}S(O)_{j 2 a}R^{3 3 3}、-NR^{2 2 2}C(=NR^{3 3 3})NR^{2 2 2 a}R^{3 3 3 a}若しくは-OC(=O)NR^{2 2 2}R^{3 3 3}置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上

10

20

30

40

50

述した通りである。

【0125】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されていてもよいアリール¹であり、

G^{10} はハロ、 $-OR^2$ 、 $-NR^2R^3$ 、 $-C(O)R^2$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-CONR^2R^3$ 、 $-SO_2NR^2R^3$ 、 $-NR^2C(=O)R^3$ 、 $-NR^2C(=O)OR^3$ 、 $-NR^2C(=O)NR^3R^{2a}$ 、 $-NR^2S(O)_{j1}R^3$ 、 $-OC(=O)OR^2$ 、 $-OC(=O)NR^2R^3$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{222}$ 、 $-NR^{222}R^{333}$ 、 $-C(O)R^{222}$ 、 $-CO_2R^{222}$ 、 $-CONR^{222}R^{333}$ 、 $-SO_2NR^{222}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=O)OR^{333}$ 、 $-NR^{222}(C=O)NR^{333}R^{222a}$ 、 $-NR^{222}S(O)_{j1a}R^{333}$ 、 $-NR^{222}C(=NR^{333})NR^{222a}R^{333a}$ 若しくは $-O(C=O)NR^{222}R^{333}$ 置換基で置換されていてもよく、又は G^{10} は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

10

20

【0126】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0127】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 、 $-NR^7-$ 、 $-CR^5R^6-$ 、 $-S(O)_{j4}-$ 又は $-C(O)-$ であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

30

【0128】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CR^5R^6-$ であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

40

【0129】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CH_2-$ であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0130】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CH_2-$ であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

50

もよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0131】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 、 $-NR^7-$ 、 $-CR^5R^6-$ 、 $-S(O)_j$ 、 $-C(O)-$ であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

10

【0132】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CR^5R^6-$ であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

20

【0133】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CH_2-$ であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

30

【0134】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 、 $-NR^7-$ 、 $-CR^5R^6-$ 、 $-S(O)_j$ 、 $-C(O)-$ であり、 R^4 はアリール又はヘテロアリール(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

40

【0135】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたアリール¹であり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n -$

50

(Y¹)_m - R⁴であり、n及びmはどちらも1であり、R⁴は1個以上のG⁴¹置換基で置換されていてもよいアリールであり、X¹は-O-であり、Y¹は-CH₂-であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0136】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、R¹は、1個以上の独立したG¹¹置換基で置換されていてもよいシクロC₃₋₁₀アルキルであり、Q¹は前記1から5個の独立したG¹⁰置換基で置換され、前記G¹⁰置換基の少なくとも1個は-(X¹)_n-(Y¹)_m-R⁴であり、R⁴はC₀₋₁₀アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロC₃₋₁₀アルキル、ヘテロシクリル、シクロC₃₋₁₀アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立したG⁴¹置換基で置換されていてもよい。)であり、

G¹¹は-OR²¹、-NR²¹R³¹、-CO₂R²¹、-C(O)R²¹、-CONR²¹R³¹、-NR²¹C(=O)R³¹、-NR²¹C(=O)OR³¹、-NR²¹C(=O)NR³¹R²^{1a}、-NR²¹S(O)_j₃R³¹、-OC(=O)OR²¹、-OC(=O)NR²¹R³¹、C₀₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、ヘテロシクリル-C₀₋₁₀アルキル又はヘテロシクリル-C₂₋₁₀アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、-CF₃、-OCF₃、-OR²²²¹、-NR²²²¹R³³³¹(R²²²^{1a})_j_{3a}、-C(O)R²²²¹、-CO₂R²²²¹、-CONR²²²¹R³³³¹、-NO₂、-CN、-S(O)_j_{3a}R²²²¹、-SO₂NR²²²¹R³³³¹、-NR²²²¹C(=O)R³³³¹、-NR²²²¹C(=O)OR³³³¹、-NR²²²¹C(=O)NR³³³¹R²²²^{1a}、-NR²²²¹S(O)_j_{3a}R³³³¹、-C(=S)OR²²²¹、-C(=O)SR²²²¹、-NR²²²¹C(=NR³³³¹)NR²²²^{1a}R³³³^{1a}、-NR²²²¹C(=NR³³³¹)OR²²²^{1a}、-NR²²²¹C(=NR³³³¹)SR²²²^{1a}、-OC(=O)OR²²²¹、-OC(=O)NR²²²¹R³³³¹、-OC(=O)SR²²²¹、-SC(=O)OR²²²¹又は-SC(=O)NR²²²¹R³³³¹置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0137】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、R¹は、1個以上の独立したG¹¹置換基で置換されていてもよいシクロC₃₋₁₀アルキルであり、Q¹は前記1から5個の独立したG¹⁰置換基で置換され、前記G¹⁰置換基の少なくとも1個は-(X¹)_n-(Y¹)_m-R⁴であり、X¹及びY¹は各々独立に-O-、-NR⁷-、-CR⁵R⁶-、-S(O)_j₄-又は-C(O)-であり、R⁴はC₀₋₁₀アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロC₃₋₁₀アルキル、ヘテロシクリル、シクロC₃₋₁₀アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立したG⁴¹置換基で置換されていてもよい。)であり、

G¹¹は-OR²¹、-NR²¹R³¹、-CO₂R²¹、-C(O)R²¹、-CONR²¹R³¹、-NR²¹C(=O)R³¹、-NR²¹C(=O)OR³¹、-NR²¹C(=O)NR³¹R²^{1a}、-NR²¹S(O)_j₃R³¹、-OC(=O)OR²¹、-OC(=O)NR²¹R³¹、C₀₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、ヘテロシクリル-C₀₋₁₀アルキル又はヘテロシクリル-C₂₋₁₀アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、-CF₃、-OCF₃、-OR²²²¹、-NR²²²¹R³³³¹(R²²²^{1a})_j_{3a}、-C(O)R²²²¹、-CO₂R²²²¹、-CONR²²²¹R³³³¹、-NO₂、-CN、-S(O)_j_{3a}R²²²¹、-SO₂NR²²²¹R³³³¹、-NR²²²¹C(=O)R³³³¹、-NR²²²¹C(=O)OR³³³¹、-NR²²²¹C(=O)NR³³³¹R²²²^{1a}、-NR²²²¹S(O)_j_{3a}R³³³¹、-C(=S)OR²²²¹、-C(=O)SR²²²¹、-NR²²²¹C(=NR³³³¹)N

$R^{2,2,2,1} a R^{3,3,3,1} a$ 、 $-NR^{2,2,2,1} C (=NR^{3,3,3,1}) OR^{2,2,2,1} a$ 、 $-NR^{2,2,2,1} C (=NR^{3,3,3,1}) SR^{2,2,2,1} a$ 、 $-OC (=O) OR^{2,2,2,1}$ 、 $-OC (=O) NR^{2,2,2,1} R^{3,3,3,1}$ 、 $-OC (=O) SR^{2,2,2,1}$ 、 $-SC (=O) OR^{2,2,2,1}$ 又は $-SC (=O) NR^{2,2,2,1} R^{3,3,3,1}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0138】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した $G^{1,1}$ 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換され、前記 $G^{1,0}$ 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CR^5R^6-$ であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル (そのいずれも 1 個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されていてもよい。) であり、

$G^{1,1}$ は $-OR^{2,1}$ 、 $-NR^{2,1}R^{3,1}$ 、 $-CO_2R^{2,1}$ 、 $-C(O)R^{2,1}$ 、 $-CONR^{2,1}R^{3,1}$ 、 $-NR^{2,1}C(=O)R^{3,1}$ 、 $-NR^{2,1}C(=O)OR^{3,1}$ 、 $-NR^{2,1}C(=O)NR^{3,1}R^{2,1} a$ 、 $-NR^{2,1}S(O)_j R^{3,1}$ 、 $-OC(=O)OR^{2,1}$ 、 $-OC(=O)NR^{2,1}R^{3,1}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル $-C_{0-10}$ アルキル又はヘテロシクリル $-C_{2-10}$ アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2,2,2,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}(R^{2,2,2,1} a)_j$ 、 $-C(O)R^{2,2,2,1}$ 、 $-CO_2R^{2,2,2,1}$ 、 $-CONR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_j R^{2,2,2,1}$ 、 $-SO_2NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)OR^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)NR^{3,3,3,1}R^{2,2,2,1} a$ 、 $-NR^{2,2,2,1}S(O)_j R^{3,3,3,1}$ 、 $-C(=S)OR^{2,2,2,1}$ 、 $-C(=O)SR^{2,2,2,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})NR^{2,2,2,1} a R^{3,3,3,1} a$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})OR^{2,2,2,1} a$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})SR^{2,2,2,1} a$ 、 $-OC(=O)OR^{2,2,2,1}$ 、 $-OC(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-OC(=O)SR^{2,2,2,1}$ 、 $-SC(=O)OR^{2,2,2,1}$ 又は $-SC(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0139】

この第4の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、1個以上の独立した $G^{1,1}$ 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換され、前記 $G^{1,0}$ 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CH_2-$ であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル (そのいずれも 1 個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されていてもよい。) であり、

$G^{1,1}$ は $-OR^{2,1}$ 、 $-NR^{2,1}R^{3,1}$ 、 $-CO_2R^{2,1}$ 、 $-C(O)R^{2,1}$ 、 $-CONR^{2,1}R^{3,1}$ 、 $-NR^{2,1}C(=O)R^{3,1}$ 、 $-NR^{2,1}C(=O)OR^{3,1}$ 、 $-NR^{2,1}C(=O)NR^{3,1}R^{2,1} a$ 、 $-NR^{2,1}S(O)_j R^{3,1}$ 、 $-OC(=O)OR^{2,1}$ 、 $-OC(=O)NR^{2,1}R^{3,1}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル $-C_{0-10}$ アルキル又はヘテロシクリル $-C_{2-10}$ アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2,2,2,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}(R^{2,2,2,1} a)_j$ 、 $-C(O)R^{2,2,2,1}$ 、 $-CO_2R^{2,2,2,1}$ 、 $-CONR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_j R^{2,2,2,1}$ 、 $-SO_2NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)OR^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C($

10

20

30

40

50

= O) NR^{3 3 3 1} R^{2 2 2 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} S (O)_{j 3 a} R^{3 3 3 1}、 - C (= S) OR^{2 2 2 1}、 - C (= O) SR^{2 2 2 1}、 - NR^{2 2 2 1} C (= NR^{3 3 3 1}) NR^{2 2 2 1 a} R^{3 3 3 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} C (= NR^{3 3 3 1}) OR^{2 2 2 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} C (= NR^{3 3 3 1}) SR^{2 2 2 1 a}、 - OC (= O) OR^{2 2 2 1}、 - OC (= O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - OC (= O) SR^{2 2 2 1}、 - SC (= O) OR^{2 2 2 1} 又は - SC (= O) NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【 0 1 4 0 】

本発明の第 5 の態様においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、R¹ は、3 位が G^{1 1} で置換されたシス - 若しくはトランス - シクロブチルであり、又は R¹ は、4 位が G^{1 1} で置換されたシス - 若しくはトランス - シクロヘキシルであり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

10

【 0 1 4 1 】

この第 5 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、R¹ は、3 位が G^{1 1} で置換されたシス - 若しくはトランス - シクロブチルであり、又は R¹ は、4 位が G^{1 1} で置換されたシス - 若しくはトランス - シクロヘキシルであり、そのどちらの R¹ も 1 個以上の独立した G^{1 0} 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【 0 1 4 2 】

この第 5 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、R¹ は、3 位が G^{1 1} で置換されたシス - 若しくはトランス - シクロブチルであり、又は R¹ は、4 位が G^{1 1} で置換されたシス - 若しくはトランス - シクロヘキシルであり、Q¹ は、1 個以上の独立した G^{1 0} 置換基で置換されていてもよいヘテロアリール¹ であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

20

【 0 1 4 3 】

この第 5 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、R¹ は、3 位が G^{1 1} で置換されたシス - 若しくはトランス - シクロブチルであり、又は R¹ は、4 位が G^{1 1} で置換されたシス - 若しくはトランス - シクロヘキシルであり、Q¹ は、1 個以上の独立した G^{1 0} 置換基で置換されていてもよいアリール¹ であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

30

【 0 1 4 4 】

この第 5 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、R¹ は、3 位が G^{1 1} で置換されたシス - 若しくはトランス - シクロブチルであり、又は R¹ は、4 位が G^{1 1} で置換されたシス - 若しくはトランス - シクロヘキシルであり、Q¹ は、1 個以上の独立した G^{1 0} 置換基で置換されていてもよいヘテロアリール¹ であり、

G^{1 0} はハロ、- OR²、- NR² R³、- C (O) R²、- CO₂ R²、- CONR² R³、- SO₂ NR² R³、- NR² C (= O) R³、- NR² C (= O) OR³、- NR² C (= O) NR³ R^{2 a}、- NR² S (O)_{j 1} R³、- OC (= O) OR²、- OC (= O) NR² R³、C_{0 - 1 0} アルキル、C_{2 - 1 0} アルケニル、C_{1 - 1 0} アルコキシ C_{1 - 1 0} アルキル、C_{1 - 1 0} アルキルチオ C_{1 - 1 0} アルキル、シクロ C_{3 - 8} アルキル、シクロ C_{3 - 8} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0 - 1 0} アルキル若しくはヘテロシクリル - C_{2 - 1 0} アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したオキソ、- CF₃、OCF₃、- OR^{2 2 2}、- NR^{2 2 2} R^{3 3 3}、- C (O) R^{2 2 2}、- CO₂ R^{2 2 2}、- CONR^{2 2 2} R^{3 3 3}、- SO₂ NR^{2 2 2} R^{3 3 3}、- NR^{2 2 2} C (= O) R^{3 3 3}、- NR^{2 2 2} C (= O) OR^{3 3 3}、- NR^{2 2 2} (C = O) NR^{3 3 3} R^{2 2 2 a}、- NR^{2 2 2} S (O)_{j 1 a} R^{3 3 3}、- NR^{2 2 2} C (= NR^{3 3 3}) NR^{2 2 2 a} R^{3 3 3 a} 若しくは - O (C = O) NR^{2 2 2} R^{3 3 3} 置換基で置換されていてもよく、又は G^{1 0} は - (X¹)_n - (Y¹)_m - R⁴ であり、又は G^{1 0} はアリール - C_{0 - 1 0} アルキル若しくはヘタリール - C_{0 - 1 0} アルキル (そのいずれも

40

50

1個以上の独立した八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2,2,2}$ 、 $-NR^{2,2,2}R^{3,3,3}$ 、 $-C(O)R^{2,2,2}$ 、 $-CO_2R^{2,2,2}$ 、 $-CONR^{2,2,2}R^{3,3,3}$ 、 $-SO_2NR^{2,2,2}R^{3,3,3}$ 、 $-NR^{2,2,2}C(=O)R^{3,3,3}$ 、 $-NR^{2,2,2}C(=O)OR^{3,3,3}$ 、 $-NR^{2,2,2}C(=O)NR^{3,3,3}R^{2,2,2a}$ 、 $-NR^{2,2,2}S(O)_j R^{3,3,3}$ 、 $-NR^{2,2,2}C(=NR^{3,3,3})NR^{2,2,2a}R^{3,3,3a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{2,2,2}R^{3,3,3}$ 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0145】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3位が $G^{1,1}$ で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が $G^{1,1}$ で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、 Q^1 は、1個以上の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換されていてもよいアリール¹であり、

$G^{1,0}$ は八口、 $-OR^2$ 、 $-NR^2R^3$ 、 $-C(O)R^2$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-CONR^2R^3$ 、 $-SO_2NR^2R^3$ 、 $-NR^2C(=O)R^3$ 、 $-NR^2C(=O)OR^3$ 、 $-NR^2C(=O)NR^3R^{2a}$ 、 $-NR^2S(O)_j R^3$ 、 $-OC(=O)OR^2$ 、 $-OC(=O)NR^2R^3$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 OCF_3 、 $-OR^{2,2,2}$ 、 $-NR^{2,2,2}R^{3,3,3}$ 、 $-C(O)R^{2,2,2}$ 、 $-CO_2R^{2,2,2}$ 、 $-CONR^{2,2,2}R^{3,3,3}$ 、 $-SO_2NR^{2,2,2}R^{3,3,3}$ 、 $-NR^{2,2,2}C(=O)R^{3,3,3}$ 、 $-NR^{2,2,2}C(=O)OR^{3,3,3}$ 、 $-NR^{2,2,2}(C=O)NR^{3,3,3}R^{2,2,2a}$ 、 $-NR^{2,2,2}S(O)_j R^{3,3,3}$ 、 $-NR^{2,2,2}C(=NR^{3,3,3})NR^{2,2,2a}R^{3,3,3a}$ 若しくは $-O(C=O)NR^{2,2,2}R^{3,3,3}$ 置換基で置換されていてもよく、又は $G^{1,0}$ は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、又は $G^{1,0}$ はアリール- C_{0-10} アルキル若しくはヘタリール- C_{0-10} アルキル(そのいずれも1個以上の独立した八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2,2,2}$ 、 $-NR^{2,2,2}R^{3,3,3}$ 、 $-C(O)R^{2,2,2}$ 、 $-CO_2R^{2,2,2}$ 、 $-CONR^{2,2,2}R^{3,3,3}$ 、 $-SO_2NR^{2,2,2}R^{3,3,3}$ 、 $-NR^{2,2,2}C(=O)R^{3,3,3}$ 、 $-NR^{2,2,2}C(=O)OR^{3,3,3}$ 、 $-NR^{2,2,2}C(=O)NR^{3,3,3}R^{2,2,2a}$ 、 $-NR^{2,2,2}S(O)_j R^{3,3,3}$ 、 $-NR^{2,2,2}C(=NR^{3,3,3})NR^{2,2,2a}R^{3,3,3a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{2,2,2}R^{3,3,3}$ 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0146】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3位が $G^{1,1}$ で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が $G^{1,1}$ で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、 Q^1 は、1個以上の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換されていてもよいヘテロアリール¹であり、

$G^{1,0}$ は八口、 $-OR^2$ 、 $-NR^2R^3$ 、 $-C(O)R^2$ 、 $-CO_2R^2$ 、 $-CONR^2R^3$ 、 $-SO_2NR^2R^3$ 、 $-NR^2C(=O)R^3$ 、 $-NR^2C(=O)OR^3$ 、 $-NR^2C(=O)NR^3R^{2a}$ 、 $-NR^2S(O)_j R^3$ 、 $-OC(=O)OR^2$ 、 $-OC(=O)NR^2R^3$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2,2,2}$ 、 $-NR^{2,2,2}R^{3,3,3}$ 、 $-C(O)R^{2,2,2}$ 、 $-CO_2R^{2,2,2}$ 、 $-CONR^{2,2,2}R^{3,3,3}$ 、 $-SO_2NR^{2,2,2}R^{3,3,3}$ 、 $-NR^{2,2,2}C(=O)R^{3,3,3}$ 、 $-NR^{2,2,2}C(=O)OR^{3,3,3}$ 、 $-NR^{2,2,2}(C=O)NR^{3,3,3}R^{2,2,2a}$ 、 $-NR^{2,2,2}S(O)_j R^{3,3,3}$ 、 $-NR^{2,2,2}C(=NR^{3,3,3})NR^{2,2,2a}R^{3,3,3a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{2,2,2}R^{3,3,3}$ 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

10

20

30

40

50

$\text{NR}^3_3\text{R}^2_2\text{a}$ 、 $-\text{NR}^2_2\text{S}(\text{O})_{j_1}\text{R}^3_3$ 、 $-\text{NR}^2_2\text{C}(=\text{NR}^3_3)$
 $\text{NR}^2_2\text{aR}^3_3\text{a}$ 若しくは $-\text{O}(\text{C}=\text{O})\text{NR}^2_2\text{R}^3_3$ 置換基で置換されていてもよく、又は G^1_0 は $-(\text{X}^1)_n - (\text{Y}^1)_m - \text{R}^4$ であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0147】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3位が G^1_1 で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が G^1_1 で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、 Q^1 は、1個以上の独立した G^1_0 置換基で置換されていてもよいアリール¹であり、

G^1_0 はハロ、 OR^2 、 $-\text{NR}^2\text{R}^3$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^2$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^2$ 、 $-\text{CONR}^2$
 R^3 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^2\text{R}^3$ 、 $-\text{NR}^2\text{C}(=\text{O})\text{R}^3$ 、 $-\text{NR}^2\text{C}(=\text{O})\text{OR}^3$ 、 $-\text{NR}^2\text{C}(=\text{O})\text{NR}^3\text{R}^2\text{a}$ 、 $-\text{NR}^2\text{S}(\text{O})_{j_1}\text{R}^3$ 、 $\text{OC}(=\text{O})\text{OR}^2$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}^2\text{R}^3$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ
 C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、
 CF_3 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}^2_2$ 、 $-\text{NR}^2_2\text{R}^3_3$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^2_2$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^2_2$ 、 $-\text{CONR}^2_2\text{R}^3_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^2_2\text{R}^3_3$ 、 $-\text{NR}^2_2\text{C}(=\text{O})\text{R}^3_3$ 、 $-\text{NR}^2_2\text{C}(=\text{O})\text{OR}^3_3$ 、 $-\text{NR}^2_2\text{C}(=\text{O})\text{NR}^3_3\text{R}^2_2\text{a}$ 、 $-\text{NR}^2_2\text{S}(\text{O})_{j_1}\text{R}^3_3$ 、 $-\text{NR}^2_2\text{C}(=\text{NR}^3_3)$
 $\text{NR}^2_2\text{aR}^3_3\text{a}$ 若しくは $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}^2_2\text{R}^3_3$ 置換基で置換されていてもよく、又は G^1_0 は $-(\text{X}^1)_n - (\text{Y}^1)_m - \text{R}^4$ であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0148】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3位が G^1_1 で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が G^1_1 で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、 Q^1 はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^1_0 置換基で置換され、前記 G^1_0 置換基の少なくとも1個は $-(\text{X}^1)_n - (\text{Y}^1)_m - \text{R}^4$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0149】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3位が G^1_1 で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が G^1_1 で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、 Q^1 はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^1_0 置換基で置換され、前記 G^1_0 置換基の少なくとも1個は $-(\text{X}^1)_n - (\text{Y}^1)_m - \text{R}^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-\text{O}-$ 、 $-\text{NR}^7-$ 、 $-\text{CR}^5\text{R}^6-$ 、 $-\text{S}(\text{O})_{j_4}$ - 又は $-\text{C}(\text{O})-$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 j_4 は1又は2であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0150】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3位が G^1_1 で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が G^1_1 で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、 Q^1 はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^1_0 置換基で置換され、前記 G^1_0 置換基の少なくとも1個は $-(\text{X}^1)_n - (\text{Y}^1)_m - \text{R}^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-\text{O}-$ 又は $-\text{CR}^5\text{R}^6-$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

10

20

30

40

50

【0151】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、 Q^1 はアリーール¹又はヘテロアリーール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CH_2-$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0152】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、 Q^1 はアリーール¹又はヘテロアリーール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0153】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、 Q^1 はアリーール¹又はヘテロアリーール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 、 $-NR^7-$ 、 $-CR^5R^6-$ 、 $-S(O)_j$ 又は $-C(O)-$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 j は1又は2であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0154】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、 R^1 は、3位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、 Q^1 はアリーール¹又はヘテロアリーール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CR^5R^6-$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0155】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、 R^1 は、3位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、 Q^1 はアリーール¹又はヘテロアリーール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CH_2-$ であり、 n 及び m はどちらも1であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、

10

20

30

40

50

シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル（そのいずれも1個以上の独立した G^{4-1} 置換基で置換されていてもよい。）であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0156】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3位が G^{1-1} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が G^{1-1} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、 Q^1 はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{1-0} 置換基で置換され、前記 G^{1-0} 置換基の少なくとも1個は - (X^1)_n - (Y^1)_m - R^4 であり、n及びmはどちらも1であり、 R^4 はアリール又はヘテロアリール（そのいずれも1個以上の独立した G^{4-1} 置換基で置換されていてもよい。）であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

10

【0157】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3位が G^{1-1} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が G^{1-1} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、 Q^1 はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{1-0} 置換基で置換され、前記 G^{1-0} 置換基の少なくとも1個は - (X^1)_n - (Y^1)_m - R^4 であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に - O - 、 - NR⁷ - 、 - CR⁵R⁶ - 、 - S(O)_{j4} - 又は - C(O) - であり、n及びmはどちらも1であり、j₄は1又は2であり、 R^4 はアリール又はヘテロアリール（そのいずれも1個以上の独立した G^{4-1} 置換基で置換されていてもよい。）であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

20

【0158】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3位が G^{1-1} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が G^{1-1} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、 Q^1 はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{1-0} 置換基で置換され、前記 G^{1-0} 置換基の少なくとも1個は - (X^1)_n - (Y^1)_m - R^4 であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に - O - 又は - CR⁵R⁶ - であり、n及びmはどちらも1であり、 R^4 はアリール又はヘテロアリール（そのいずれも1個以上の独立した G^{4-1} 置換基で置換されていてもよい。）であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

30

【0159】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3位が G^{1-1} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が G^{1-1} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、 Q^1 はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{1-0} 置換基で置換され、前記 G^{1-0} 置換基の少なくとも1個は - (X^1)_n - (Y^1)_m - R^4 であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に - O - 又は - CH₂ - であり、n及びmはどちらも1であり、 R^4 はアリール又はヘテロアリール（そのいずれも1個以上の独立した G^{4-1} 置換基で置換されていてもよい。）であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

40

【0160】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3位が G^{1-1} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が G^{1-1} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{1-0} 置換基で置換されたアリール¹であり、前記 G^{1-0} 置換基の少なくとも1個は - (X^1)_n - (Y^1)_m - R^4 であり、n及びmはどちらも1であり、 R^4 は1個以上の G^{4-1} 置換基で置換されてい

50

てもよいアリールであり、 X^1 は - O - であり、 Y^1 は - CH₂ - であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0161】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたアリール¹であり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は - (X^1)_n - (Y^1)_m - R^4 であり、n及びmはどちらも1であり、 R^4 は1個以上の G^{41} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 X^1 は - O - であり、 Y^1 は - CH₂ - であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

10

【0162】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、 Q^1 はアリール¹又はヘテロアリール¹であり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は - (X^1)_n - (Y^1)_m - R^4 であり、n及びmはどちらも1であり、 R^4 は C_{0-10} アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル、ヘテロシクリル、シクロ C_{3-10} アルケニル又はヘテロシクロアルケニル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、

20

G^{11} は - OR²¹、- NR²¹R³¹、- CO₂R²¹、- C(O)R²¹、- CONR²¹R³¹、- NR²¹C(=O)R³¹、- NR²¹C(=O)OR³¹、- NR²¹C(=O)NR³¹R^{21a}、- NR²¹S(O)_{j3}R³¹、- OC(=O)OR²¹、- OC(=O)NR²¹R³¹、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、- CF₃、- OCF₃、- OR²²²¹、- NR²²²¹R³³³¹(R^{2221a})_{j3a}、- C(O)R²²²¹、- CO₂R²²²¹、- CONR²²²¹R³³³¹、- NO₂、- CN、- S(O)_{j3a}R²²²¹、- SO₂NR²²²¹R³³³¹、- NR²²²¹C(=O)R³³³¹、- NR²²²¹C(=O)OR³³³¹、- NR²²²¹C(=O)NR³³³¹R^{2221a}、- NR²²²¹S(O)_{j3a}R³³³¹、- C(=S)OR²²²¹、- C(=O)SR²²²¹、- NR²²²¹C(=NR³³³¹)NR^{2221a}R^{3331a}、- NR²²²¹C(=NR³³³¹)OR^{2221a}、- NR²²²¹C(=NR³³³¹)SR^{2221a}、- OC(=O)OR²²²¹、- OC(=O)NR²²²¹R³³³¹、- OC(=O)SR²²²¹、- SC(=O)OR²²²¹又は - SC(=O)NR²²²¹R³³³¹ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

30

【0163】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、 Q^1 は前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は - (X^1)_n - (Y^1)_m - R^4 であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に - O -、- NR⁷、- CR⁵R⁶、- S(O)_{j4} - 又は - C(O) - であり、n及びmはどちらも1であり、j₄は1又は2であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

40

【0164】

この第5の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス

50

- シクロヘキシルであり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CR^5R^6-$ であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0165】

この第 5 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3 位が G^{11} で置換されたシス - 若しくはトランス - シクロブチルであり、又は R^1 は、4 位が G^{11} で置換されたシス - 若しくはトランス - シクロヘキシルであり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 、 $-NR^7-$ 、 $-CR^5R^6-$ 、 $-S(O)_{j4}$ - 又は $-C(O)$ - であり、

G^{11} は $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}(R^{21})_{j3}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}S(O)_{j3}R^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した八口、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{3331})_{j3a}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_{j3a}R^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_{j3a}R^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221}aR^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{3331a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 若しくは $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、

又は G^{11} はアリアル - C_{0-10} アルキル、アリアル - C_{2-10} アルケニル、アリアル - C_{2-10} アルキニル、ヘタリアル - C_{0-10} アルキル、ヘタリアル - C_{2-10} アルケニル若しくはヘタリアル - C_{2-10} アルキニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立した八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_{j3a}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_{j5a}R^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_{j3a}R^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221}aR^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 若しくは $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0166】

この第 5 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 R^1 は、3 位が G^{11} で置換されたシス - 若しくはトランス - シクロブチルであり、又は R^1 は、4 位が G^{11} で置換されたシス - 若しくはトランス - シクロヘキシルであり、 Q^1 は前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換され、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 及び Y^1 は各々独立に $-O-$ 又は $-CR^5R^6-$ であり、 n 及び m はどちらも 1 であり、 $j4$ は

1又は2であり、

G^{11} は -OR²¹、 -NR²¹R³¹(R²¹)_{j3}、 -C(O)R²¹、 -CO₂R²¹、 -CONR²¹R³¹、 -NR²¹C(=O)R³¹、 -NR²¹C(=O)OR³¹、 -NR²¹C(=O)NR²¹R³¹、 -NR²¹S(O)_{j3}R³¹、 -OC(=O)OR²¹、 -OC(=O)NR²¹R³¹、 C₀₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、ヘテロシクリル - C₀₋₁₀アルキル又はヘテロシクリル - C₂₋₁₀アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立した八口、オキソ、 -CF₃、 -OCF₃、 -OR²²²¹、 -NR²²²¹R³³³¹(R^{333a})_{j3a}、 -C(O)R²²²¹、 -CO₂R²²²¹、 -CONR²²²¹R³³³¹、 -NO₂、 -CN、 -S(O)_{j3a}R²²²¹、 -SO₂NR²²²¹R³³³¹、 -NR²²²¹C(=O)R³³³¹、 -NR²²²¹C(=O)OR³³³¹、 -NR²²²¹C(=O)NR²²²¹R³³³¹、 -NR²²²¹S(O)_{j3a}R³³³¹、 -C(=S)OR²²²¹、 -C(=O)SR²²²¹、 -NR²²²¹C(=NR³³³¹)NR²²²¹aR^{3331a}、 -NR²²²¹C(=NR³³³¹)OR²²²¹a、 -NR²²²¹C(=NR³³³¹)SR^{3331a}、 -OC(=O)OR²²²¹、 -OC(=O)NR²²²¹R³³³¹、 -OC(=O)SR²²²¹、 -SC(=O)OR²²²¹又は -SC(=O)NR²²²¹R³³³¹置換基で置換されていてもよく、

10

又は G^{11} はアリール - C₀₋₁₀アルキル、アリール - C₂₋₁₀アルケニル、アリール - C₂₋₁₀アルキニル、ヘタリール - C₀₋₁₀アルキル、ヘタリール - C₂₋₁₀アルケニル若しくはヘタリール - C₂₋₁₀アルキニルであり、そのいずれも1個以上の独立した八口、 -CF₃、 -OCF₃、 -OR²²²¹、 -NR²²²¹R³³³¹(R^{2221a})_{j3a}、 -C(O)R²²²¹、 -CO₂R²²²¹、 -CONR²²²¹R³³³¹、 -NO₂、 -CN、 -S(O)_{j5a}R²²²¹、 -SO₂NR²²²¹R³³³¹、 -NR²²²¹C(=O)R³³³¹、 -NR²²²¹C(=O)OR³³³¹、 -NR²²²¹C(=O)NR³³³¹R^{2221a}、 -NR²²²¹S(O)_{j3a}R³³³¹、 -C(=S)OR²²²¹、 -C(=O)SR²²²¹、 -NR²²²¹C(=NR³³³¹)NR²²²¹aR^{3331a}、 -NR²²²¹C(=NR³³³¹)OR²²²¹a、 -NR²²²¹C(=NR³³³¹)SR^{2221a}、 -OC(=O)OR²²²¹、 -OC(=O)NR²²²¹R³³³¹、 -OC(=O)SR²²²¹、 -SC(=O)OR²²²¹若しくは -SC(=O)NR²²²¹R³³³¹置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

20

30

【0167】

本発明の第6の態様においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は - (X¹)_n - (Y¹)_m - R⁴であり、nは1であり、X¹は3 - (-O-)又は4 - (-O-)であり、mは1であり、Y¹は(-CH₂-)であり、R⁴は、1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0168】

この第6の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は - (X¹)_n - (Y¹)_m - R⁴であり、nは1であり、X¹は3 - (-O-)又は4 - (-O-)であり、mは1であり、Y¹は(-CH₂-)であり、R⁴は、1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、R¹はアリール、ヘテロアリール、シクロC₃₋₁₀アルキル又はヘテロシクリル(そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

40

【0169】

この第6の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容

50

されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n は 1 であり、 X^1 は 3 - (- O -) 又は 4 - (- O -) であり、 m は 1 であり、 Y^1 は (- CH₂ -) であり、 R^4 は、1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいアリーールであり、 R^1 はシクロ C₃₋₁₀ アルキル又はヘテロシクリル (そのいずれも 1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【 0 1 7 0 】

この第 6 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n は 1 であり、 X^1 は 3 - (- O -) 又は 4 - (- O -) であり、 m は 1 であり、 Y^1 は (- CH₂ -) であり、 R^4 は、1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいアリーールであり、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいシクロ C₃₋₁₀ アルキルであり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

10

【 0 1 7 1 】

この第 6 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n は 1 であり、 X^1 は 3 - (- O -) 又は 4 - (- O -) であり、 m は 1 であり、 Y^1 は (- CH₂ -) であり、 R^4 は、1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいアリーールであり、 R^1 はシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル (そのいずれも 1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

20

【 0 1 7 2 】

この第 6 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n は 1 であり、 X^1 は 3 - (- O -) 又は 4 - (- O -) であり、 m は 1 であり、 Y^1 は (- CH₂ -) であり、 R^4 は、1 個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいアリーールであり、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいシクロ C₃₋₁₀ アルキルであり、

30

G^{11} は $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_jR^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C₃₋₈ アルキル、シクロ C₃₋₈ アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_jR^{3a}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_jR^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_jR^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

40

50

【0173】

この第6の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3-(-O-)又は4-(-O-)であり、 m は1であり、 Y^1 は(-CH₂-)であり、 R^4 は、1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 R^1 はシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル(そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。)であり、

G^{11} は $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_jR^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル $-C_{0-10}$ アルキル又はヘテロシクリル $-C_{2-10}$ アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}$ (R^{2221a}) $_jR^{3a}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_jR^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_jR^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

10

20

【0174】

本発明の第7の態様においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3-(-O-)であり、 m は0であり、 R^4 は C_{0-8} アルキル又はシクロ C_{3-10} アルキル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

30

【0175】

この第7の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3-(-O-)であり、 m は0であり、 R^4 は C_{0-8} アルキル又はシクロ C_{3-10} アルキル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、 R^1 はアリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル又はヘテロシクリル(そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

40

【0176】

この第7の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3-(-O-)であり、 m は0であり、 R^4 は C_{0-8} アルキル又はシクロ C_{3-10} アルキル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル又はヘテロシクリル(そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

50

【0177】

この第7の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は $3-(O-)$ であり、 m は0であり、 R^4 は C_{0-8} アルキル又はシクロ C_{3-10} アルキル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0178】

この第7の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は $3-(O-)$ であり、 m は0であり、 R^4 は C_{0-8} アルキル又はシクロ C_{3-10} アルキル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、 R^1 はシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル(そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0179】

この第7の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は $3-(O-)$ であり、 m は0であり、 R^4 は C_{0-8} アルキル又はシクロ C_{3-10} アルキル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、

G^{11} は $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_jR^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル $-C_{0-10}$ アルキル又はヘテロシクリル $-C_{2-10}$ アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_jR^{3331}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_jR^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_jR^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0180】

この第7の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は $3-(O-)$ であり、 m は0であり、 R^4 は C_{0-8} アルキル又はシクロ C_{3-10} アルキル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、 R^1 はシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘ

10

20

30

40

50

キシル（そのいずれも 1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。）であり、

G^{11} は $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_{j4}R^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル $-C_{0-10}$ アルキル又はヘテロシクリル $-C_{2-10}$ アルケニルであり、そのいずれも 1 個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_{j4a}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_{j4a}R^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_{j4a}R^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

10

20

【0181】

本発明の第 8 の態様においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は 1 であり、 X^1 は 3 - (-O-) であり、 m は 0 であり、 R^4 は C_{0-6} アルキルであり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0182】

この第 8 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は 1 であり、 X^1 は 3 - (-O-) であり、 m は 0 であり、 R^4 は C_{0-6} アルキルであり、 R^1 はアリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル又はヘテロシクリル（そのいずれも 1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。）であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

30

【0183】

この第 8 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は 1 であり、 X^1 は 3 - (-O-) であり、 m は 0 であり、 R^4 は C_{0-6} アルキルであり、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル又はヘテロシクリル（そのいずれも 1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。）であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

40

【0184】

この第 8 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記 1 から 5 個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも 1 個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は 1 であり、 X^1 は 3 - (-O-) であり、 m は 0 であり、 R^4 は C_{0-6} アルキルであり、 R^1 は、1 個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0185】

この第 8 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容

50

されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3-(-O-)であり、 m は0であり、 R^4 は C_{0-6} アルキルであり、 R^1 はシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル(そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0186】

この第8の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3-(-O-)であり、 m は0であり、 R^4 は C_{0-6} アルキルであり、 R^1 は、1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよいシクロ

C_{3-10} アルキルであり、
 G^{11} は $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_jR^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_j$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_jR^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_jR^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0187】

この第8の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3-(-O-)であり、 m は0であり、 R^4 は C_{0-6} アルキルであり、 R^1 はシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル(そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。)であり、

G^{11} は $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_jR^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_j$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_jR^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_jR^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

$R^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})SR^{2,2,2,1}a$ 、 $-OC(=O)OR^{2,2,2,1}$ 、 $-OC(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-OC(=O)SR^{2,2,2,1}$ 、 $-SC(=O)OR^{2,2,2,1}$ 又は $-SC(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0188】

本発明の第9の態様においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換されたフェニルであり、前記 $G^{1,0}$ 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3-(-O-)であり、 m は0であり、 R^4 はH又はメチルであり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

10

【0189】

この第9の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換されたフェニルであり、前記 $G^{1,0}$ 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3-(-O-)であり、 m は0であり、 R^4 はH又はメチルであり、 R^1 はアリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル又はヘテロシクリル(そのいずれも1個以上の独立した $G^{1,1}$ 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0190】

この第9の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換されたフェニルであり、前記 $G^{1,0}$ 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3-(-O-)であり、 m は0であり、 R^4 はH又はメチルであり、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル又はヘテロシクリル(そのいずれも1個以上の独立した $G^{1,1}$ 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

20

【0191】

この第9の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換されたフェニルであり、前記 $G^{1,0}$ 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3-(-O-)であり、 m は0であり、 R^4 はH又はメチルであり、 R^1 は、1個以上の独立した $G^{1,1}$ 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

30

【0192】

この第9の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換されたフェニルであり、前記 $G^{1,0}$ 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3-(-O-)であり、 m は0であり、 R^4 はH又はメチルであり、 R^1 はシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル(そのいずれも1個以上の独立した $G^{1,1}$ 置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

40

【0193】

この第9の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換されたフェニルであり、前記 $G^{1,0}$ 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3-(-O-)であり、 m は0であり、 R^4 はH又はメチルであり、 R^1 は、1個以上の独立した $G^{1,1}$ 置換基で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、

$G^{1,1}$ は $-OR^{2,1}$ 、 $-NR^{2,1}R^{3,1}$ 、 $-CO_2R^{2,1}$ 、 $-C(O)R^{2,1}$ 、 $-CONR^{2,1}R^{3,1}$ 、 $-NR^{2,1}C(=O)R^{3,1}$ 、 $-NR^{2,1}C(=O)OR^{3,1}$ 、 $-NR$

50

${}^2_1C(=O)NR^3_1R^2_1a$ 、 $-NR^2_1S(O)_jR^3_1$ 、 $-OC(=O)OR^2_1$ 、 $-OC(=O)NR^2_1R^3_1$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^2_2R^2_2R^2_1$ 、 $-NR^2_2R^2_2R^3_3R^3_1(R^2_2R^2_1a)_jR^4_a$ 、 $-C(O)R^2_2R^2_1$ 、 $-CO_2R^2_2R^2_1$ 、 $-CONR^2_2R^2_1R^3_3R^3_1$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_jR^4_aR^2_2R^2_1$ 、 $-SO_2NR^2_2R^2_1R^3_3R^3_1$ 、 $-NR^2_2R^2_1C(=O)R^3_3R^3_1$ 、 $-NR^2_2R^2_1C(=O)OR^3_3R^3_1$ 、 $-NR^2_2R^2_1C(=O)NR^3_3R^3_1R^2_2R^2_1a$ 、 $-NR^2_2R^2_1S(O)_jR^4_aR^3_3R^3_1$ 、 $-C(=S)OR^2_2R^2_1$ 、 $-C(=O)SR^2_2R^2_1$ 、 $-NR^2_2R^2_1C(=NR^3_3R^3_1)NR^2_2R^2_1aR^3_3R^3_1a$ 、 $-NR^2_2R^2_1C(=NR^3_3R^3_1)OR^2_2R^2_1a$ 、 $-NR^2_2R^2_1C(=NR^3_3R^3_1)SR^2_2R^2_1a$ 、 $-OC(=O)OR^2_2R^2_1$ 、 $-OC(=O)NR^2_2R^2_1R^3_3R^3_1$ 、 $-OC(=O)SR^2_2R^2_1$ 、 $-SC(=O)OR^2_2R^2_1$ 又は $-SC(=O)NR^2_2R^2_1R^3_3R^3_1$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

10

【0194】

この第9の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^1_0 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^1_0 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3-(-O-)であり、 m は0であり、 R^4 はH又はメチルであり、 R^1 はシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル(そのいずれも1個以上の独立した G^1_1 置換基で置換されていてもよい。)であり、

20

G^1_1 は $-OR^2_1$ 、 $-NR^2_1R^3_1$ 、 $-CO_2R^2_1$ 、 $-C(O)R^2_1$ 、 $-CONR^2_1R^3_1$ 、 $-NR^2_1C(=O)R^3_1$ 、 $-NR^2_1C(=O)OR^3_1$ 、 $-NR^2_1C(=O)NR^3_1R^2_1a$ 、 $-NR^2_1S(O)_jR^3_1$ 、 $-OC(=O)OR^2_1$ 、 $-OC(=O)NR^2_1R^3_1$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^2_2R^2_2R^2_1$ 、 $-NR^2_2R^2_2R^3_3R^3_1(R^2_2R^2_1a)_jR^4_a$ 、 $-C(O)R^2_2R^2_1$ 、 $-CO_2R^2_2R^2_1$ 、 $-CONR^2_2R^2_1R^3_3R^3_1$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_jR^4_aR^2_2R^2_1$ 、 $-SO_2NR^2_2R^2_1R^3_3R^3_1$ 、 $-NR^2_2R^2_1C(=O)R^3_3R^3_1$ 、 $-NR^2_2R^2_1C(=O)OR^3_3R^3_1$ 、 $-NR^2_2R^2_1C(=O)NR^3_3R^3_1R^2_2R^2_1a$ 、 $-NR^2_2R^2_1S(O)_jR^4_aR^3_3R^3_1$ 、 $-C(=S)OR^2_2R^2_1$ 、 $-C(=O)SR^2_2R^2_1$ 、 $-NR^2_2R^2_1C(=NR^3_3R^3_1)NR^2_2R^2_1aR^3_3R^3_1a$ 、 $-NR^2_2R^2_1C(=NR^3_3R^3_1)OR^2_2R^2_1a$ 、 $-NR^2_2R^2_1C(=NR^3_3R^3_1)SR^2_2R^2_1a$ 、 $-OC(=O)OR^2_2R^2_1$ 、 $-OC(=O)NR^2_2R^2_1R^3_3R^3_1$ 、 $-OC(=O)SR^2_2R^2_1$ 、 $-SC(=O)OR^2_2R^2_1$ 又は $-SC(=O)NR^2_2R^2_1R^3_3R^3_1$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

30

【0195】

本発明の第10の態様においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^1_0 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^1_0 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3-(-O-)であり、 m は0であり、 R^4 は、1個以上の独立した G^4_1 置換基で置換されていてもよいアールであり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

40

【0196】

この第10の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^1_0 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^1_0 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-$

50

R⁴であり、nは1であり、X¹は3 - (- O -)であり、mは0であり、Y¹は(- C H₂ -)であり、R⁴は、1個以上の独立したG^{4 1}置換基で置換されていてもよいアリールであり、R¹はアリール、ヘテロアリール、シクロC_{3 - 10}アルキル又はヘテロシクリル(そのいずれも1個以上の独立したG^{1 1}置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0197】

この第10の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、Q¹は、前記1から5個の独立したG^{1 0}置換基で置換されたフェニルであり、前記G^{1 0}置換基の少なくとも1個は - (X¹)_n - (Y¹)_m - R⁴であり、nは1であり、X¹は3 - (- O -)であり、mは0であり、Y¹は(- C H₂ -)であり、R⁴は、1個以上の独立したG^{4 1}置換基で置換されていてもよいアリールであり、R¹はシクロC_{3 - 10}アルキル又はヘテロシクリル(そのいずれも1個以上の独立したG^{1 1}置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

10

【0198】

この第10の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、Q¹は、前記1から5個の独立したG^{1 0}置換基で置換されたフェニルであり、前記G^{1 0}置換基の少なくとも1個は - (X¹)_n - (Y¹)_m - R⁴であり、nは1であり、X¹は3 - (- O -)であり、mは0であり、R⁴は、1個以上の独立したG^{4 1}置換基で置換されていてもよいアリールであり、R¹はシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル(そのいずれも1個以上の独立したG^{1 1}置換基で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

20

【0199】

この第10の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、Q¹は、前記1から5個の独立したG^{1 0}置換基で置換されたフェニルであり、前記G^{1 0}置換基の少なくとも1個は - (X¹)_n - (Y¹)_m - R⁴であり、nは1であり、X¹は3 - (- O -)であり、mは0であり、Y¹は(- C H₂ -)であり、R⁴は、1個以上の独立したG^{4 1}置換基で置換されていてもよいアリールであり、R¹はシクロC_{3 - 10}アルキル又はヘテロシクリル(そのいずれも1個以上の独立したG^{1 1}置換基で置換されていてもよい。)であり、

30

G^{1 1}は - OR^{2 1}、 - NR^{2 1}R^{3 1}、 - CO₂R^{2 1}、 - C(O)R^{2 1}、 - CONR^{2 1}R^{3 1}、 - NR^{2 1}C(=O)R^{3 1}、 - NR^{2 1}C(=O)OR^{3 1}、 - NR^{2 1}C(=O)NR^{3 1}R^{2 1 a}、 - NR^{2 1}S(O)_{j 3}R^{3 1}、 - OC(=O)OR^{2 1}、 - OC(=O)NR^{2 1}R^{3 1}、C_{0 - 10}アルキル、シクロC_{3 - 8}アルキル、シクロC_{3 - 8}アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0 - 10}アルキル又はヘテロシクリル - C_{2 - 10}アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、 - CF₃、 - OCF₃、 - OR^{2 2 2 1}、 - NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}(R^{2 2 2 1 a})_{j 3 a}、 - C(O)R^{2 2 2 1}、 - CO₂R^{2 2 2 1}、 - CONR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、 - NO₂、 - CN、 - S(O)_{j 3 a}R^{2 2 2 1}、 - SO₂NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1}C(=O)R^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1}C(=O)OR^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1}C(=O)NR^{3 3 3 1}R^{2 2 2 1 a}、 - NR^{2 2 2 1}S(O)_{j 3 a}R^{3 3 3 1}、 - C(=S)OR^{2 2 2 1}、 - C(=O)SR^{2 2 2 1}、 - NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})NR^{2 2 2 1 a}R^{3 3 3 1 a}、 - NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})OR^{2 2 2 1 a}、 - NR^{2 2 2 1}C(=NR^{3 3 3 1})SR^{2 2 2 1 a}、 - OC(=O)OR^{2 2 2 1}、 - OC(=O)NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}、 - OC(=O)SR^{2 2 2 1}、 - SC(=O)OR^{2 2 2 1}又は - SC(=O)NR^{2 2 2 1}R^{3 3 3 1}置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

40

【0200】

この第10の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、Q¹は、前記1から5個の独立したG^{1 0}置換基で置換さ

50

れたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3 - (- O -) であり、 m は0であり、 R^4 は、1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいアリーールであり、 R^1 はシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル(そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。) であり、

G^{11} は $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_{j3}R^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル $-C_{0-10}$ アルキル又はヘテロシクリル $-C_{2-10}$ アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}(R^{2221a})_{j3a}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_{j3a}R^{2221}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_{j3a}R^{3331}$ 、 $-C(=S)OR^{2221}$ 、 $-C(=O)SR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})OR^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})SR^{2221a}$ 、 $-OC(=O)OR^{2221}$ 、 $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-OC(=O)SR^{2221}$ 、 $-SC(=O)OR^{2221}$ 又は $-SC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

10

20

【0201】

本発明の第11の態様においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3 - (- O -) であり、 m は0であり、 R^4 は、1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいフェニルであり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0202】

この第11の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3 - (- O -) であり、 m は0であり、 Y^1 は(- CH_2 -) であり、 R^4 は、1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいフェニルであり、 R^1 はアリーール、ヘテロアリーール、シクロ C_{3-10} アルキル又はヘテロシクリル(そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

30

【0203】

この第11の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3 - (- O -) であり、 m は0であり、 Y^1 は(- CH_2 -) であり、 R^4 は、1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいフェニルであり、 R^1 はシクロ C_{3-10} アルキル又はヘテロシクリル(そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

40

【0204】

この第11の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換さ

50

れたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3 - (- O -) であり、 m は0であり、 R^4 は、1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいフェニルであり、 R^1 はシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル (そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0205】

本発明の第12の態様においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3 - 又は4 - (- NH -) であり、 m は1であり、 Y^1 は (- SO₂ -) であり、 R^4 は、1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

10

【0206】

この第12の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3 - 又は4 - (- NH -) であり、 m は1であり、 Y^1 は (- SO₂ -) であり、 R^4 は、1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 R^1 はアリール、ヘテロアリール、シクロC₃₋₁₀アルキル又はヘテロシクリル (そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

20

【0207】

この第12の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3 - 又は4 - (- NH -) であり、 m は1であり、 Y^1 は (- SO₂ -) であり、 R^4 は、1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 R^1 はシクロC₃₋₁₀アルキル又はヘテロシクリル (そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

30

【0208】

この第12の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3 - 又は4 - (- NH -) であり、 m は1であり、 Y^1 は (- SO₂ -) であり、 R^4 は、1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 R^1 はシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル (そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

40

【0209】

この第12の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3 - 又は4 - (- NH -) であり、 m は1であり、 Y^1 は (- SO₂ -) であり、 R^4 は、1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいアリールであり、 R^1 はシクロC₃₋₁₀アルキル又はヘテロシクリル (そのいずれも1個以上の独立した G^{11} 置換基で置換されていてもよい。) であり、

G^{11} は $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_jR^{31}$ 、 $-OC(=O)OR$

50

2 1 、 $-OC(=O)NR^2$ $^1R^3$ 1 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^2$ 2 2 1 、 $-NR^2$ 2 2 $^1R^3$ 3 3 1 (R^2 2 2 1a) j 3 a 、 $-C(O)R^2$ 2 2 1 、 $-CO_2R^2$ 2 2 1 、 $-CONR^2$ 2 2 $^1R^3$ 3 3 1 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_j$ 3 a R^2 2 2 1 、 $-SO_2NR^2$ 2 2 $^1R^3$ 3 3 1 、 $-NR^2$ 2 2 $^1C(=O)R^3$ 3 3 1 、 $-NR^2$ 2 2 $^1C(=O)OR^3$ 3 3 1 、 $-NR^2$ 2 2 $^1C(=O)NR^3$ 3 3 $^1R^2$ 2 2 1a 、 $-NR^2$ 2 2 $^1S(O)_j$ 3 a R^3 3 3 1 、 $-C(=S)OR^2$ 2 2 1 、 $-C(=O)SR^2$ 2 2 1 、 $-NR^2$ 2 2 $^1C(=NR^3$ 3 3 $^1)NR^2$ 2 2 $^1aR^3$ 3 3 1a 、 $-NR^2$ 2 2 $^1C(=NR^3$ 3 3 $^1)OR^2$ 2 2 1a 、 $-NR^2$ 2 2 $^1C(=NR^3$ 3 3 $^1)SR^2$ 2 2 1a 、 $-OC(=O)OR^2$ 2 2 1 、 $-OC(=O)NR^2$ 2 2 $^1R^3$ 3 3 1 、 $-OC(=O)SR^2$ 2 2 1 、 $-SC(=O)OR^2$ 2 2 1 又は $-SC(=O)NR^2$ 2 2 $^1R^3$ 3 3 1 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

10

【0210】

この第12の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^1 0 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^1 0 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3-又は4- ($-NH-$) であり、 m は1であり、 Y^1 は ($-SO_2-$) であり、 R^4 は、1個以上の独立した G^4 1 置換基で置換されていてもよいアリアルであり、 R^1 はシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル(そのいずれも1個以上の独立した G^1 1 置換基で置換されていてもよい。) であり、

20

G^1 1 は $-OR^2$ 1 、 $-NR^2$ $^1R^3$ 1 、 $-CO_2R^2$ 1 、 $-C(O)R^2$ 1 、 $-CONR^2$ $^1R^3$ 1 、 $-NR^2$ $^1C(=O)R^3$ 1 、 $-NR^2$ $^1C(=O)OR^3$ 1 、 $-NR^2$ $^1C(=O)NR^3$ $^1R^2$ 1a 、 $-NR^2$ $^1S(O)_j$ 3 R^3 1 、 $-OC(=O)OR^2$ 1 、 $-OC(=O)NR^2$ $^1R^3$ 1 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^2$ 2 2 1 、 $-NR^2$ 2 2 $^1R^3$ 3 3 1 (R^2 2 2 1a) j 3 a 、 $-C(O)R^2$ 2 2 1 、 $-CO_2R^2$ 2 2 1 、 $-CONR^2$ 2 2 $^1R^3$ 3 3 1 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_j$ 3 a R^2 2 2 1 、 $-SO_2NR^2$ 2 2 $^1R^3$ 3 3 1 、 $-NR^2$ 2 2 $^1C(=O)R^3$ 3 3 1 、 $-NR^2$ 2 2 $^1C(=O)OR^3$ 3 3 1 、 $-NR^2$ 2 2 $^1C(=O)NR^3$ 3 3 $^1R^2$ 2 2 1a 、 $-NR^2$ 2 2 $^1S(O)_j$ 3 a R^3 3 3 1 、 $-C(=S)OR^2$ 2 2 1 、 $-C(=O)SR^2$ 2 2 1 、 $-NR^2$ 2 2 $^1C(=NR^3$ 3 3 $^1)NR^2$ 2 2 $^1aR^3$ 3 3 1a 、 $-NR^2$ 2 2 $^1C(=NR^3$ 3 3 $^1)OR^2$ 2 2 1a 、 $-NR^2$ 2 2 $^1C(=NR^3$ 3 3 $^1)SR^2$ 2 2 1a 、 $-OC(=O)OR^2$ 2 2 1 、 $-OC(=O)NR^2$ 2 2 $^1R^3$ 3 3 1 、 $-OC(=O)SR^2$ 2 2 1 、 $-SC(=O)OR^2$ 2 2 1 又は $-SC(=O)NR^2$ 2 2 $^1R^3$ 3 3 1 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

30

【0211】

この第12の態様の実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^1 0 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^1 0 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3-又は4- ($-NH-$) であり、 m は1であり、 Y^1 は ($-SO_2-$) であり、 R^4 は、1個以上の独立した G^4 1 置換基で置換されていてもよいアリアルであり、 R^1 は、 G^1 1 で3位が置換されたシス-又はトランス-シクロブチルであり、 G^1 1 は $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHAc$ 、 $-NH(CO)NHCH_3$ 、 $-NH(CO)OCH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2NH_2$ 、 $-CH_2NHAc$ 、 $CONH_2$ 、 $-CH_2N(CH_3)_2$ 、 $-CH_2NH(CO)NHMe$ 、 $-CH_2NH(CO)OCH_3$ 、 CO_2CH_3 又は $CONHCH_3$ であり、その他の変数は式 I

40

50

に対して上述した通りである。

【0212】

この第12の態様の実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、前記1から5個の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、前記 G^{10} 置換基の少なくとも1個は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 n は1であり、 X^1 は3-又は4- $(-NH-)$ であり、 m は1であり、 Y^1 は $-(SO_2-)$ であり、 R^4 は、1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されているもよいアリーールであり、 R^1 は、 G^{11} で4位が置換されたシス-又はトランス-シクロヘキシルであり、 G^{11} は $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHAc$ 、 $-NH(CO)NHCH_3$ 、 $-NH(CO)OCH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2NH_2$ 、 $-CH_2NHAc$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CH_2N(CH_3)_2$ 、 $-CH_2NH(CO)NHMe$ 、 $-CH_2NH(CO)OCH_3$ 、 CO_2CH_3 又は $CONHCH_3$ であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

10

【0213】

本発明の第13の態様においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されたアリーール¹であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0214】

この第13の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

20

【0215】

本発明の第14の態様においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されたアリーール¹であり、少なくとも1個の G^{10} 置換基は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0216】

この第14の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも1個の G^{10} 置換基は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

30

【0217】

この第14の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも1個の G^{10} 置換基は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 X^1 は3- $(O)-$ 、4- $(O)-$ 、3- $(NH)-$ 又は4- $(NH)-$ であり、 Y^1 は $-CH_2-$ 又は $-(SO_2)-$ であり、 n 及び m は独立に0又は1であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0218】

この第14の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも1個の G^{10} 置換基は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 X^1 は3- $(O)-$ 又は4- $(O)-$ であり、 Y^1 は $-CH_2-$ であり、 n 及び m は各々1であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

40

【0219】

この第14の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも1個の G^{10} 置換基は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 X^1 は3- $(O)-$ 又は4- $(O)-$ であり、 Y^1 は $-CH_2-$ であり、 n 及び m は各々1であり、 R^4 はアリーール、 C_{0-10} アルキル又はシクロ C_{3-10} アルキル(その

50

いずれも 1 個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されていてもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0220】

この第 14 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1 個以上の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも 1 個の $G^{1,0}$ 置換基は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 は 3 - (O) - 又は 4 - (O) - であり、 Y^1 は $-CH_2-$ であり、 n 及び m は各々 1 であり、 R^4 は 1 個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されていてもよいフェニルであり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0221】

この第 14 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1 個以上の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも 1 個の $G^{1,0}$ 置換基は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 は 3 - (O) - 又は 4 - (O) - であり、 Y^1 は $-CH_2-$ であり、 n 及び m は各々 1 であり、 R^4 はアリール、 C_{0-10} アルキル又はシクロ C_{3-10} アルキル (そのいずれも 1 個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されていてもよい。) であり、 R^1 はアリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル又はヘテロシクリル (そのいずれも $G^{1,1}$ で置換されていてもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0222】

この第 14 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1 個以上の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも 1 個の $G^{1,0}$ 置換基は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 は 3 - (O) - 又は 4 - (O) - であり、 Y^1 は $-CH_2-$ であり、 n 及び m は各々 1 であり、 R^4 はアリール、 C_{0-10} アルキル又はシクロ C_{3-10} アルキル (そのいずれも 1 個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されていてもよい。) であり、 R^1 は、 $G^{1,1}$ で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0223】

この第 14 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1 個以上の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも 1 個の $G^{1,0}$ 置換基は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 は 3 - (O) - 又は 4 - (O) - であり、 Y^1 は $-CH_2-$ であり、 n 及び m は各々 1 であり、 R^4 は、1 個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されていてもよいフェニルであり、 R^1 はアリール、ヘテロアリール、シクロ C_{3-10} アルキル又はヘテロシクリル (そのいずれも $G^{1,1}$ で置換されていてもよい。) であり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0224】

この第 14 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1 個以上の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも 1 個の $G^{1,0}$ 置換基は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 は 3 - (O) - 又は 4 - (O) - であり、 Y^1 は $-CH_2-$ であり、 n 及び m は各々 1 であり、 R^4 は、1 個以上の独立した $G^{4,1}$ 置換基で置換されていてもよいフェニルであり、 R^1 は、 $G^{1,1}$ で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0225】

この第 14 の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1 個以上の独立した $G^{1,0}$ 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも 1 個の $G^{1,0}$ 置換基は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、 X^1 は 3 - (O) - 又は 4 - (O) - であり、 Y^1 は $-CH_2-$ であり、 n 及び m は各

10

20

30

40

50

々1であり、 R^4 は1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいフェニルであり、 R^1 はシクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル(そのいずれも G^{11} で置換されていてもよい。)であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

【0226】

この第14の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも1個の G^{10} 置換基は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 X^1 は3-(O)-又は4-(O)-であり、 Y^1 は $-CH_2-$ であり、 n 及び m は各々1であり、 R^4 は1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいフェニルであり、 R^1 は、3位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロブチルであり、又は R^1 は、4位が G^{11} で置換されたシス-若しくはトランス-シクロヘキシルであり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

10

【0227】

この第14の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも1個の G^{10} 置換基は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 X^1 は3-(O)-又は4-(O)-であり、 Y^1 は $-CH_2-$ であり、 n 及び m は各々1であり、 R^4 は1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいフェニルであり、 R^1 は、3位が G^{11} で置換されたシス-又はトランス-シクロブチルであり、 G^{11} は $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHAc$ 、 $-NH(CO)NHCH_3$ 、 $-NH(CO)OCH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2NH_2$ 、 $-CH_2NHAc$ 、 $CONH_2$ 、 $-CH_2N(CH_3)_2$ 、 $-CH_2NH(CO)NHMe$ 、 $-CH_2NH(CO)OCH_3$ 、 CO_2CH_3 又は $CONHCH_3$ であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

20

【0228】

この第14の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも1個の G^{10} 置換基は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 X^1 は3-(O)-又は4-(O)-であり、 Y^1 は $-CH_2-$ であり、 n 及び m は各々1であり、 R^4 は1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよいフェニルであり、 R^1 は、4位が G^{11} で置換されたシス-又はトランス-シクロヘキシルであり、 G^{11} は $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHAc$ 、 $-NH(CO)NHCH_3$ 、 $-NH(CO)OCH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2NH_2$ 、 $-CH_2NHAc$ 、 $CONH_2$ 、 $-CH_2N(CH_3)_2$ 、 $-CH_2NH(CO)NHMe$ 、 $-CH_2NH(CO)OCH_3$ 、 CO_2CH_3 又は $CONHCH_3$ であり、その他の変数は式Iに対して上述した通りである。

30

【0229】

この第14の態様の一実施形態においては、化合物は式Iで表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも1個の G^{10} 置換基は $-(X^1)_n-(Y^1)_m-R^4$ であり、 X^1 は3-(O)-又は4-(O)-であり、 Y^1 は $-CH_2-$ であり、 n 及び m は各々1であり、 R^4 はアリール、 C_{0-10} アルキル又はシクロ C_{3-10} アルキル(そのいずれも1個以上の独立した G^{41} 置換基で置換されていてもよい。)であり、 R^1 は、 G^{11} で置換されていてもよいシクロ C_{3-10} アルキルであり、

40

G^{11} は $-OR^{21}$ 、 $-NR^{21}R^{31}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-C(O)R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)R^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)OR^{31}$ 、 $-NR^{21}C(=O)NR^{31}R^{21a}$ 、 $-NR^{21}S(O)_jR^{31}$ 、 $-OC(=O)OR^{21}$ 、 $-OC(=O)NR^{21}R^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル- C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル- C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、 $-CF_3$

50

、 - OCF₃、 - OR^{2 2 2 1}、 - NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} (R^{2 2 2 1 a})_{j 3 a}、 - C(O)R^{2 2 2 1}、 - CO₂R^{2 2 2 1}、 - CONR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - NO₂、 - CN、 - S(O)_{j 3 a} R^{2 2 2 1}、 - SO₂NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1} C(=O)R^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1} C(=O)OR^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1} C(=O)NR^{3 3 3 1} R^{2 2 2 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} S(O)_{j 3 a} R^{3 3 3 1}、 - C(=S)OR^{2 2 2 1}、 - C(=O)SR^{2 2 2 1}、 - NR^{2 2 2 1} C(=NR^{3 3 3 1})NR^{2 2 2 1 a} R^{3 3 3 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} C(=NR^{3 3 3 1})OR^{2 2 2 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} C(=NR^{3 3 3 1})SR^{2 2 2 1 a}、 - OC(=O)OR^{2 2 2 1}、 - OC(=O)NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - OC(=O)SR^{2 2 2 1}、 - SC(=O)OR^{2 2 2 1} 又は - SC(=O)NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

10

【0230】

この第14の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、Q¹ は、1個以上の独立した G^{1 0} 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも1個の G^{1 0} 置換基は - (X¹)_n - (Y¹)_m - R⁴ であり、X¹ は3 - (O) - 又は4 - (O) - であり、Y¹ は - CH₂ - であり、n 及び m は各々1であり、R⁴ は、1個以上の独立した G^{4 1} 置換基で置換されていてもよいフェニルであり、R¹ はアリアル、ヘテロアリアル、シクロC₃₋₁₀ アルキル又はヘテロシクリル(そのいずれも G^{1 1} で置換されていてもよい。)であり、

G^{1 1} は - OR^{2 1}、 - NR^{2 1} R^{3 1}、 - CO₂R^{2 1}、 - C(O)R^{2 1}、 - CONR^{2 1} R^{3 1}、 - NR^{2 1} C(=O)R^{3 1}、 - NR^{2 1} C(=O)OR^{3 1}、 - NR^{2 1} C(=O)NR^{3 1} R^{2 1 a}、 - NR^{2 1} S(O)_{j 3} R^{3 1}、 - OC(=O)OR^{2 1}、 - OC(=O)NR^{2 1} R^{3 1}、 C₀₋₁₀ アルキル、シクロC₃₋₈ アルキル、シクロC₃₋₈ アルケニル、ヘテロシクリル - C₀₋₁₀ アルキル又はヘテロシクリル - C₂₋₁₀ アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したハロ、オキソ、 - CF₃、 - OCF₃、 - OR^{2 2 2 1}、 - NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} (R^{2 2 2 1 a})_{j 3 a}、 - C(O)R^{2 2 2 1}、 - CO₂R^{2 2 2 1}、 - CONR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - NO₂、 - CN、 - S(O)_{j 3 a} R^{2 2 2 1}、 - SO₂NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1} C(=O)R^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1} C(=O)OR^{3 3 3 1}、 - NR^{2 2 2 1} C(=O)NR^{3 3 3 1} R^{2 2 2 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} S(O)_{j 3 a} R^{3 3 3 1}、 - C(=S)OR^{2 2 2 1}、 - C(=O)SR^{2 2 2 1}、 - NR^{2 2 2 1} C(=NR^{3 3 3 1})NR^{2 2 2 1 a} R^{3 3 3 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} C(=NR^{3 3 3 1})OR^{2 2 2 1 a}、 - NR^{2 2 2 1} C(=NR^{3 3 3 1})SR^{2 2 2 1 a}、 - OC(=O)OR^{2 2 2 1}、 - OC(=O)NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1}、 - OC(=O)SR^{2 2 2 1}、 - SC(=O)OR^{2 2 2 1} 又は - SC(=O)NR^{2 2 2 1} R^{3 3 3 1} 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

20

30

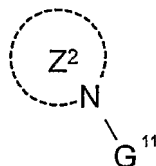
【0231】

この第14の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、Q¹ は、1個以上の独立した G^{1 0} 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも1個の G^{1 0} 置換基は - (X¹)_n - (Y¹)_m - R⁴ であり、R¹ は下記構造式で表される。

40

【0232】

【化17】



【0233】

50

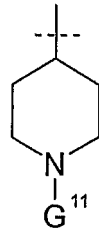
Z² は、G¹¹ で置換された N を含むヘテロシクリルであり、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0234】

この第14の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、Q¹ は、1個以上の独立した G¹⁰ 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも1個の G¹⁰ 置換基は - (X¹)_n - (Y¹)_m - R⁴ であり、R¹ は下記構造式で表される。

【0235】

【化18】



10

【0236】

式中、G¹¹ は - C(O)R²¹、- CO₂R²¹、- CONR²¹R³¹、- SO₂NR²¹R³¹、- S(O)_{j3}R³¹、C₀₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケニル、C₁₋₁₀アルコキシC₁₋₁₀アルキル、C₁₋₁₀アルキルチオC₁₋₁₀アルキル、シクロC₃₋₈アルキル、シクロC₃₋₈アルケニル、ヘテロシクリル - C₀₋₁₀アルキル若しくはヘテロシクリル - C₂₋₁₀アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、- CF₃、- OCF₃、- OR²²²¹、- NR²²²¹R³³³¹、- C(O)R²²²¹、- CO₂R²²²¹、- CONR²²²¹R³³³¹、- SO₂NR²²²¹R³³³¹、- NR²²²¹C(=O)R³³³¹、- NR²²²¹C(=O)OR³³³¹、- NR²²²¹C(=O)NR³³³¹R^{2221a}、- NR²²²¹S(O)_{j3a}R³³³¹、- NR²²²¹C(=NR³³³¹)NR^{2221a}R^{3331a}若しくは - OC(=O)NR²²²¹R³³³¹ 置換基で置換されていてもよく、

20

又は G¹¹ はアリール - C₀₋₁₀アルキル若しくはヘタリール - C₀₋₁₀アルキルであり、そのいずれも1個以上の独立した八口、- CF₃、- OCF₃、- OR²²²¹、- NR²²²¹R³³³¹、- C(O)R²²²¹、- CO₂R²²²¹、- CONR²²²¹R³³³¹、- SO₂NR²²²¹R³³³¹、- NR²²²¹C(=O)R³³³¹、- NR²²²¹C(=O)OR³³³¹、- NR²²²¹C(=O)NR³³³¹R^{2221a}、- NR²²²¹S(O)_{j3a}R³³³¹、- NR²²²¹C(=NR³³³¹)NR^{2221a}R^{3331a}若しくは - OC(=O)NR²²²¹R³³³¹ 置換基で置換されていてもよく、他の変数は式 I に対して上述した通りである。

30

【0237】

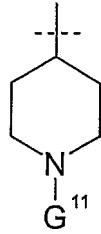
この第14の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、Q¹ は、1個以上の独立した G¹⁰ 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも1個の G¹⁰ 置換基は - (X¹)_n - (Y¹)_m - R⁴ であり、

40

R¹ は下記構造式で表される。

【0238】

【化19】



【0239】

式中、 G^{11} は $-C(O)R^{21}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-SO_2NR^{21}R^{31}$ 、 $-S(O)_jR^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル又はヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{3331}R^{2221a}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_jR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 又は $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、他の変数は式 I に対して上述した通りである。

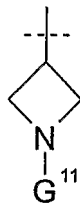
【0240】

この第14の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1個以上の独立した G^{10} 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも1個の G^{10} 置換基は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり、

R^1 は下記構造式で表される。

【0241】

【化20】



【0242】

式中、 G^{11} は $-C(O)R^{21}$ 、 $-CO_2R^{21}$ 、 $-CONR^{21}R^{31}$ 、 $-SO_2NR^{21}R^{31}$ 、 $-S(O)_jR^{31}$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル - C_{0-10} アルキル若しくはヘテロシクリル - C_{2-10} アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-C(O)R^{2221}$ 、 $-CO_2R^{2221}$ 、 $-CONR^{2221}R^{3331}$ 、 $-SO_2NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)OR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 、 $-NR^{2221}S(O)_jR^{3331}$ 、 $-NR^{2221}C(=NR^{3331})NR^{2221a}R^{3331a}$ 若しくは $-OC(=O)NR^{2221}R^{3331}$ 置換基で置換されていてもよく、又は G^{11} アリール - C_{0-10} アルキル若しくはヘタリール - C_{0-10} アルキル (そのいずれも1個以上の独立したハロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2221}$ 、 $-NR$

$R^{2,2,2,1}$ 、 $R^{3,3,3,1}$ 、 $-C(O)R^{2,2,2,1}$ 、 $-CO_2R^{2,2,2,1}$ 、 $-CONR^{2,2,2,1}$
 $R^{3,3,3,1}$ 、 $-SO_2NR^{2,2,2,1}$ 、 $R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)R^{3,3,3,1}$ 、
 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)OR^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、
 $-NR^{2,2,2,1}S(O)_j R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})$
 $NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ または $-OC(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 置換基で置換さ
 れていてもよく、他の変数は式 I に対して上述した通りである。

【0243】

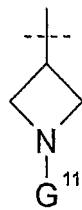
この第14の態様の一実施形態においては、化合物は式 I で表され、又は薬剤として許容されるその塩であり、式中、 Q^1 は、1個以上の独立した G^1 置換基で置換されたフェニルであり、少なくとも1個の G^1 置換基は $-(X^1)_n - (Y^1)_m - R^4$ であり

10

R^1 は下記構造式で表される。

【0244】

【化21】



20

【0245】

式中、 G^1 は $-C(O)R^{2,1}$ 、 $-CO_2R^{2,1}$ 、 $-CONR^{2,1}R^{3,1}$ 、 $-SO_2NR^{2,1}R^{3,1}$ 、 $-S(O)_j R^{3,1}$ 、 C_{0-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{1-10} アルコキシ C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルチオ C_{1-10} アルキル、シクロ C_{3-8} アルキル、シクロ C_{3-8} アルケニル、ヘテロシクリル $-C_{0-10}$ アルキル又はヘテロシクリル $-C_{2-10}$ アルケニルであり、そのいずれも1個以上の独立したオキソ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{2,2,2,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-C(O)R^{2,2,2,1}$ 、 $-CO_2R^{2,2,2,1}$ 、 $-CONR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-SO_2NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)OR^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}S(O)_j R^{3,3,3,1}$ 、 $-NR^{2,2,2,1}C(=NR^{3,3,3,1})NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ または $-OC(=O)NR^{2,2,2,1}R^{3,3,3,1}$ 置換基で置換されていてもよく、その他の変数は式 I に対して上述した通りである。

30

【0246】

本発明は以下の化合物を含む。

【0247】

5 - (3 - ベンジルオキシ - 2 - フルオロ - フェニル) - 7 - シクロブチル - イミダゾ
 [5, 1 - f] [1, 2, 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - シクロブチル - イミダゾ [5, 1 - f]
 [1, 2, 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5, 1 - f]
 [1, 2, 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロブタノン、
 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5, 1 - f]
 [1, 2, 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロブタノール、
 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5, 1 - f]
 [1, 2, 4] トリアジン - 7 - イル] - 1 - メチル - シクロブタノール、
 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5, 1 - f]
 [1, 2, 4] トリアジン - 7 - イル] - 1 - エチル - シクロブタノール、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - メチルアミノ - シクロブチル) -

40

50

- イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ジメチルアミノ - シクロブチル)
 - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 7 - (3 - アゼチジン - 1 - イル - シクロブチル) - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェ
 ニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ピペリジン - 1 - イル - シクロブ
 チル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 N - { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1
 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロブチル } - アセトアミド、
 { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f
] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロブチル } - カルバミン酸メチルエステ
 ル、
 1 - { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1
 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロブチル } - 3 - メチル - ウレア、
 N - { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1
 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロブチル } - メタンスルホンアミド
 、
 7 - アゼチジン - 3 - イル - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 ,
 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 1 - { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1
 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - アゼチジン - 1 - イル } - エタノン、
 { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f
] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロブチル } - メタノール、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ジメチルアミノメチル - シクロブ
 チル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ジエチルアミノメチル - シクロブ
 チル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 7 - (3 - アゼチジン - 1 - イルメチル - シクロブチル) - 5 - (3 - ベンジルオキシ
 - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ピペリジン - 1 - イルメチル - シ
 クロブチル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f]
 [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロブタンカルボン酸アミド、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - シクロヘキシル - イミダゾ [5 , 1 - f
] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 4 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f]
 [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロヘキサノン、
 4 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f]
 [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロヘキサノール、
 4 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f]
 [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - 1 - メチル - シクロヘキサノール、
 4 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f]
 [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - 1 - エチル - シクロヘキサノール、
 4 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f]
 [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロヘキサノールカルボン酸メチルエステル、
 4 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f]
 [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロヘキサノールカルボン酸アミド、
 4 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f]
 [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロヘキサノールカルボン酸メチルアミド、
 { 4 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f

-] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロヘキシル } - メタノール、
 7 - (4 - アミノメチル - シクロヘキシル) - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル)
 - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (4 - ジメチルアミノメチル - シクロヘ
 キシル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 7 - (4 - アゼチジン - 1 - イルメチル - シクロヘキシル) - 5 - (3 - ベンジルオキ
 シ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチル - シ
 クロヘキシル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチル - シ 10
 クロヘキシル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - ピペリジン - 4 - イル - イミダゾ [5 ,
 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 1 - { 4 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1
 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - ピペリジン - 1 - イル } - エタノン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - シクロペンチル - イミダゾ [5 , 1 - f
] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f]
 [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロペンタンカルボン酸メチルエステル、
 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] 20
 [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロペンタンカルボン酸アミド、
 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f]
 [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロペンタンカルボン酸メチルアミド、
 { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f
] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロペンチル } - メタノール、
 7 - (3 - アミノメチル - シクロペンチル) - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル)
 - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ジメチルアミノメチル - シクロペ
 ンチル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 7 - (3 - アゼチジン - 1 - イルメチル - シクロペンチル) - 5 - (3 - ベンジルオキ 30
 シ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ピロリジン - 1 - イルメチル - シ
 クロペンチル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ピペリジン - 1 - イルメチル - シ
 クロペンチル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 N - { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1
 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロペンチルメチル } - アセトアミド
 、
 { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f
] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロペンチルメチル } - カルバミン酸メチ 40
 ルエステル、
 1 - { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1
 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロペンチルメチル } - 3 - メチル -
 ウレア、
 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f]
 [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロペンタノン、
 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f]
 [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - シクロペンタノール、
 7 - (3 - アミノ - シクロペンチル) - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミ
 ダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、 50

1 - { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - ベンジル } - 3 - メチル - ウレア、
 N - { 3 - [4 - アミノ - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 7 - イル] - ベンジル } - メタンスルホンアミド、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ジメチルアミノメチル - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ジエチルアミノメチル - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 7 - (3 - アゼチジン - 1 - イルメチル - フェニル) - 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ピロリジン - 1 - イルメチル - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (3 - ピペリジン - 1 - イルメチル - フェニル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - ピリジン - 4 - イル - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - オキサゾル - 2 - イル - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - チオフエン - 3 - イル - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - チオフエン - 2 - イル - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - チアゾル - 5 - イル - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - チアゾル - 2 - イル - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (1 H - イミダゾル - 2 - イル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、
 5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - (1 H - イミダゾル - 4 - イル) - イミダゾ [5 , 1 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 4 - イルアミン、又は薬剤として許容されるその塩。

【 0 2 4 8 】

本発明は、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩を投与することを含む、プロテインキナーゼ活性を阻害する方法を含む。

【 0 2 4 9 】

本発明は、プロテインキナーゼが IGF - 1 R である、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩を投与することを含む、プロテインキナーゼ活性を阻害する方法を含む。

【 0 2 5 0 】

本発明は、プロテインキナーゼの活性が過剰増殖障害に影響を及ぼす、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩を投与することを含む、プロテインキナーゼ活性を阻害する方法を含む。

【 0 2 5 1 】

本発明は、プロテインキナーゼの活性が血管新生、血管透過性、免疫応答、細胞アポトーシス、腫瘍成長又は炎症に影響を及ぼす、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩を投与することを含む、プロテインキナーゼ活性を阻害する方法を含む。

【 0 2 5 2 】

本発明は、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

【 0 2 5 3 】

10

20

30

40

50

本発明は、プロテインキナーゼが IGF-1R である、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

【0254】

本発明は、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が過剰増殖障害である、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

【0255】

本発明は、プロテインキナーゼの活性が血管新生、血管透過性、免疫応答、細胞アポトーシス、腫瘍成長又は炎症に影響を及ぼす、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

10

【0256】

本発明は、プロテインキナーゼがタンパク質セリン/トレオニンキナーゼ又はタンパク質チロシンキナーゼである、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

【0257】

本発明は、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が1個以上の潰瘍である、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

20

【0258】

本発明は、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が1個以上の潰瘍であり、潰瘍が細菌感染若しくは真菌感染によって引き起こされる、又は潰瘍がモーレン潰瘍である、又は潰瘍が潰瘍性大腸炎症候である、式 I の化合物若しくは薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

【0259】

本発明は、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状がライム病、単純ヘルペス、帯状疱疹ウイルス、ヒト免疫不全症ウイルス、パラポックスウイルス、原生動物による敗血症若しくは感染症又はトキソプラズマ症である、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

30

【0260】

本発明は、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状がフォンヒッペルリンドウ病、類天ほうそう、乾せん、パジェット病又は多発性嚢胞腎である、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

【0261】

本発明は、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が線維症、サルコイドーシス、硬変、甲状腺炎、過粘ちゅう度症候群、オスラー-ウェーバー-ランデュ病、慢性閉塞性肺疾患、ぜん息、しん出物、腹水、胸水、肺水腫、脳浮腫又は火傷後の浮腫、外傷、放射、発作、低酸素症又は虚血である、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

40

【0262】

本発明は、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が卵巣過剰刺激症候群、子かん前症、機能性子宮出血又は子宮内膜症である、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

50

【0263】

本発明は、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が慢性炎症、全身性ループス、糸球体腎炎、滑膜炎、炎症性腸疾患、クローン病、糸球体腎炎、リウマチ様関節炎及び骨関節炎、多発性硬化症又は移植片拒絶である、式Iの化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

【0264】

本発明は、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が鎌状赤血球貧血である、式Iの化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

10

【0265】

本発明は、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が眼球の症状である、式Iの化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

【0266】

本発明は、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が眼球の症状であり、眼球の症状が眼球又は黄斑の浮腫、眼球新生血管疾患、強膜炎、放射状角膜切開術、ブドウ膜炎、硝子体炎、近視、乳頭小か、慢性網膜剥離、レーザー治療後合併症、結膜炎、スタルガルド病、イールズ病、網膜症又は黄斑変性症である、式Iの化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

20

【0267】

本発明は、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が心血管の症状である、式Iの化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

【0268】

本発明は、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状がアテローム性動脈硬化症、再狭窄、虚血/再かん流傷害、血管閉塞、静脈奇形又は頸動脈の閉塞性疾患である、式Iの化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

30

【0269】

本発明は、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が癌である、式Iの化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

【0270】

本発明は、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が癌であり、癌が固形腫瘍、肉腫、線維肉腫、骨腫、黒色腫、網膜芽細胞腫、横紋筋肉腫、グリア芽細胞腫、神経芽細胞腫、奇形癌腫、造血器悪性腫瘍又は悪性腹水である、式Iの化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

40

【0271】

本発明は、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状が癌であり、癌がカポジ肉腫、ホジキン病、リンパ腫、骨髄腫又は白血病である、式Iの化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

【0272】

本発明は、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状がクロー - 深瀬 (P O E M S) 症候群又は糖尿病性症状である、式Iの化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

50

【0273】

本発明は、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状がクロー - 深瀬 (P O E M S) 症候群又は糖尿病性症状であり、糖尿病性症状がインスリン依存性糖尿病緑内障、糖尿病性網膜症又は微小血管障害である、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

【0274】

本発明は、プロテインキナーゼ活性が T 細胞活性化、B 細胞活性化、肥満細胞脱顆粒、単球活性化、シグナル伝達、アポトーシス、炎症反応の増強又はこれらの組合せに関与する、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

10

【0275】

本発明は、IGF - 1 R 依存性細胞増殖の阻害に応答する疾患の治療用薬剤組成物を調製するための、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の使用を含む。

【0276】

本発明は、IGF - 1 R チロシンキナーゼの阻害に応答する疾患の治療用薬剤組成物を調製するための、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の使用を含む。

【0277】

本発明は、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量と薬剤として許容される担体とを含む薬剤組成物を投与することを含む、プロテインキナーゼ活性阻害方法を含む。

20

【0278】

本発明は、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩の治療有効量と薬剤として許容される担体とを含む薬剤組成物の治療有効量を患者に投与することを含む、プロテインキナーゼ活性によって媒介される症状を有する患者の治療方法を含む。

【0279】

別段の記載がないかぎり、化合物名部分は、列挙した最も右側の部分で結合する。すなわち、置換基名は、末端部分から始まり、架橋部分が続き、結合部分で終わる。例えば、ヘタリールチオ C₁₋₄ アルキルは、チオ硫黄を介して C₁₋₄ アルキルと結合したヘテロアリール基を有し、C₁₋₄ アルキルは、置換基を有する化学種と結合する。

30

【0280】

本明細書では、例えば「C₀₋₄ アルキル」は、0 から 4 個の炭素、すなわち、0、1、2、3 又は 4 個の炭素を有する、直鎖又は分枝構造のアルキルを意味するのに使用する。アルキルが末端基であるときに、炭素を持たないアルキルは水素である。アルキルが架橋 (連結) 基であるときには、炭素を持たないアルキルは直接の結合である。

【0281】

本発明の全ての実施形態において、「アルキル」という用語は、分枝と直鎖の両方のアルキル基を含む。典型的なアルキル基は、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、sec - ブチル、イソブチル、tert - ブチル、n - ペンチル、イソペンチル、n - ヘキシル、n - ヘプチル、イソオクチル、ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、テトラデシル、ヘキサデシル、オクタデシル、エイコシルなどである。

40

【0282】

「アシル」という用語は、アルキルケト又はアリールケト基、例えば、ホルミル、アセチル、ブチリル、ベンゾイルなどを指す。

【0283】

「ハロ」という用語は、フルオロ、クロロ、プロモ又はヨードを指す。

【0284】

「ハロアルキル」という用語は、1 個以上のハロ基で置換されたアルキル基、例えば、クロロメチル、2 - プロモエチル、3 - ヨードプロピル、トリフルオロメチル、パーフルオロプロピル、8 - クロロノニルなどを指す。

50

【0285】

「シクロアルキル」という用語は、シクロプロピル、メチルシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、2 - ヒドロキシシクロペンチル、シクロヘキシル、4 - クロロシクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチルなどアルキル、ヒドロキシ及びハロで置換されていてもよい脂肪族環構造を指す。

【0286】

「アルキルカルボニルオキシアルキル」という用語は、エステル部分、例えば、アセトキシメチル、n - ブチリルオキシエチルなどを指す。

【0287】

「アルキニルカルボニル」という用語は、アルキニルケト官能基、例えばプロピノイルなどを指す。

10

【0288】

「ヒドロキシアルキル」という用語は、1個以上のヒドロキシ基で置換されたアルキル基、例えば、ヒドロキシメチル、2, 3 - ジヒドロキシブチルなどを指す。

【0289】

「アルキルスルホニルアルキル」という用語は、アルキルスルホニル部分で置換されたアルキル基、例えば、メシルメチル、イソプロピルスルホニルエチルなどを指す。

【0290】

「アルキルスルホニル」という用語は、アルキル基で置換されたスルホニル部分、例えば、メシル、n - プロピルスルホニルなどを指す。

20

【0291】

「モノアルキルアミノアルキル」という用語は、1個のアルキル基でそれ自体が置換されたアミン部分で置換されたアルキル基、例えば、N - メチルアミノエチルなどを指す。

【0292】

「ジアルキルアミノアルキル」という用語は、2個のアルキル基でそれ自体が置換されたアミン部分で置換されたアルキル基、例えば、N, N - ジメチルアミノエチル、N - エチル - N - メチルアミノメチルなどを指す。

【0293】

「モノアリールアミノアルキル」という用語は、1個のアリール基でそれ自体が置換されたアミン部分で置換されたアルキル基、例えば、N - フェニルアミノエチルなどを指す。

30

【0294】

「ジアリールアミノアルキル」という用語は、2個のアリール基でそれ自体が置換されたアミン部分で置換されたアルキル基、例えば、N, N - ジフェニルアミノエチルなどを指す。

【0295】

「モノヘタリールアミノアルキル」又は「モノヘテロアリールアミノアルキル」という用語は、1個のヘタリール基でそれ自体が置換されたアミン部分で置換されたアルキル基を指す。

【0296】

「ジヘタリールアミノアルキル」又は「ジヘテロアリールアミノアルキル」という用語は、2個のヘタリール基でそれ自体が置換されたアミン部分で置換されたアルキル基を指す。

40

【0297】

「モノアルキルアミノカルボニル」という用語は、1個のアルキル基で置換されたアミド基、例えばN - メチルアミドなどを指す。

【0298】

「ジアルキルアミノカルボニル」という用語は、2個のアルキル基で置換されたアミド基、例えば、N, N - ジメチルアミド、N - メチル - N - エチルアミドなどを指す。

【0299】

50

「モノアリアルアミノカルボニル」という用語は、1個のアリアル基で置換されたアミド基、例えばN-フェニルアミドなどを指す。

【0300】

「ジアリアルアミノカルボニル」という用語は、2個のアリアル基で置換されたアミド基、例えばN,N-ジフェニルアミドなどを指す。

【0301】

「アルキルアリアルアミノカルボニル」という用語は、1個のアルキルと1個のアリアル基で置換されたアミド基、例えばN-メチル-N-フェニルアミドなどを指す。

【0302】

「モノヘタリアルアミノカルボニル」又は「モノヘテロアリアルアミノカルボニル」という用語は、1個のヘタリアル基で置換されたアミド基を指す。

10

【0303】

「ジヘタリアルアミノカルボニル」又は「ジヘテロアリアルアミノカルボニル」という用語は、2個のヘタリアル基で置換されたアミド基を指す。

【0304】

「アルキルヘタリアルアミノカルボニル」又は「アルキルヘテロアリアルアミノカルボニル」という用語は、1個のアルキルと1個のヘタリアル基で置換されたアミド基を指す。

。

【0305】

「アセチルアミノアルキル」という用語は、アミド部分で置換されたアルキル基、例えばアセチルアミノメチルなどを指す。

20

【0306】

「アセチルアミノアルケニル」という用語は、アミド部分で置換されたアルケニル基、例えば2-(アセチルアミノ)ビニルなどを指す。

【0307】

「アルケニル」という用語は、少なくとも1個のエチレン結合を有する直鎖又は分岐鎖のエチレン性不飽和炭化水素基、例えば、ビニル、アリル、1-ブテニル、2-ブテニル、イソプロペニル、2-ペンテニルなどを指す。

【0308】

「ハロアルケニル」という用語は、1個以上のハロ基で置換されたアルケニル基を指す。

30

。

【0309】

「シクロアルケニル」という用語は、アルキル、ヒドロキシ、ハロなどの1個以上の独立した置換基で置換されていてもよい、少なくとも1個の環内エチレン結合を有する脂肪族環構造を指す。シクロアルケニルの例としては、メチルシクロプロペニル、トリフルオロメチルシクロプロペニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、1,4-シクロヘキサジエニルなどが挙げられるが、これらだけに限定されない。

【0310】

「アルキニル」という用語は、少なくとも1個のアセチレン結合を有する、直鎖又は分岐の不飽和炭化水素基、例えば、エチニル、プロパルギルなどを指す。

40

【0311】

「ハロアルキニル」という用語は、1個以上のハロ基で置換されたアルキニル基を指す。

。

【0312】

「アルキルカルボニル」という用語はアルキルケト官能基、例えば、アセチル、n-ブチリルなどを指す。

【0313】

「アルケニルカルボニル」という用語はアルケニルケト官能基、例えばプロペノイルなどを指す。

【0314】

50

t h o x p h e n y l)) プチル、10 - フェニルデシルなどの置換されていてもよいベンジル、フェネチル、フェンプロピル及びフェンプチルが挙げられるが、これらだけに限定されない。

【0319】

「アリール - シクロアルキル」又は「アリールシクロアルキル」という用語は、アリール基がシクロアルキル基に結合した基、例えばフェニルシクロペンチルなどを記述するのに使用する。

【0320】

「アリール - アルケニル」又は「アリールアルケニル」という用語は、アルケニル鎖が分岐していても直鎖でもよく、上記アリール部がアルケニル部分の架橋部を形成する基、例えば、スチリル(2 - フェニルビニル)、フェンプロペニルなどを記述するのに使用する。

10

【0321】

「アリール - アルキニル」又は「アリールアルキニル」という用語は、アルキニル鎖が分岐していても直鎖でもよく、上記アリール部がアリール - アルキニル部分の架橋部を形成する基、例えば3 - フェニル - 1 - プロピニルなどを記述するのに使用する。

【0322】

「アリール - オキシ」又は「アリールオキシ」という用語は、架橋酸素原子に結合した末端アリール基を記述するのに使用する。典型的なアリール - オキシ基としてはフェノキシ、3, 4 - ジクロロフェノキシなどが挙げられる。

20

【0323】

「アリール - オキシアルキル」又は「アリールオキシアルキル」という用語は、アルキル基がアリール - オキシ基で置換された基、例えばペンタフルオロフェノキシメチルなどを記述するのに使用する。

【0324】

「ヘタリール - オキシ」又は「ヘテロアリール - オキシ」又は「ヘタリールオキシ」又は「ヘテロアリールオキシ」という用語は、架橋酸素原子に結合した末端ヘタリール基を記述するのに使用する。典型的なヘタリール - オキシ基としては4, 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イルオキシなどが挙げられる。

【0325】

「ヘタリールアルキル」又は「ヘテロアリールアルキル」又は「ヘテロアラルキル」又は「ヘタリール - アルキル」又は「ヘテロアリール - アルキル」という用語は、アルキル鎖が分岐していても直鎖でもよく、上記ヘテロアリール部がヘテロアラルキル部分の架橋部を形成する基、例えば3 - フリルメチル、テニル、フルフリルなどを記述するのに使用する。

30

【0326】

「ヘタリールアルケニル」又は「ヘテロアリールアルケニル」又は「ヘタリール - アルケニル」又は「ヘテロアリール - アルケニル」という用語は、アルケニル鎖が分岐していても直鎖でもよく、上記ヘテロアリール部がヘテロアラルケニル部分の架橋部を形成する基、例えば3 - (4 - ピリジル) - 1 - プロペニルを記述するのに使用する。

40

【0327】

「ヘタリールアルキニル」又は「ヘテロアリールアルキニル」又は「ヘタリール - アルキニル」又は「ヘテロアリール - アルキニル」という用語は、アルキニル鎖が分岐していても直鎖でもよく、上記ヘテロアリール部がヘテロアラルキニル部分の架橋部を形成する基、例えば4 - (2 - チエニル) - 1 - プチニルを記述するのに使用する。

【0328】

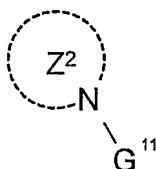
「ヘテロシクリル」という用語は、酸素、窒素及び硫黄から独立に選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子、好ましくは1若しくは2個のヘテロ原子を含む、置換若しくは非置換の3から10員の飽和環を指し、又は酸素、窒素及び硫黄から選択される少なくとも1個のヘテロ原子を含めて最高10個の原子を含み、ヘテロ原子を含む環が飽和である

50

、置換若しくは非置換の二環式環構造を指す。ヘテロシクリルは、1個以上の独立した置換基で置換することができる。ヘテロシクリルの例としては、オキセタン、アゼチジン、アジリジン (aziridine)、テトラヒドロフラン、テトラヒドロフリル、アゼチジニル、ピロリジニル、ペペリジニル、ピラニル、テトラヒドロピラニル、チオラニル、モルホリニル、ピペラジニル、ジオキサニル、ジオキサニル、インドリニル、5-メチル-6-クロマニル及び

【0329】

【化22】



10

(式中、 Z^2 は、 G^{11} で置換されたNを含むヘテロシクリルである。)が挙げられるが、これらだけに限定されない。

【0330】

「ヘテロシクリルアルキル」又は「ヘテロシクリル-アルキル」という用語は、アルキル鎖が分岐していても直鎖でもよく、上記ヘテロシクリル部がヘテロシクリルアルキル部分の架橋部を形成する基、例えば3-ピペリジニルメチルなどを記述するのに使用する。

20

【0331】

「ヘテロシクリルアルケニル」又は「ヘテロシクリル-アルケニル」又は「ヘテロシクロアルケニル」又は「ヘテロシクロ-アルケニル」という用語は、アルケニル鎖が分岐していても直鎖でもよく、上記ヘテロシクリル部がヘテロシクリルアルケニル部分の架橋部を形成する基、例えば2-モルホリニル-1-プロペニルを記述するのに使用する。

【0332】

「ヘテロシクリルアルキニル」又は「ヘテロシクリル-アルキニル」という用語は、アルキニル鎖が分岐していても直鎖でもよく、上記ヘテロシクリル部がヘテロシクリルアルキニル部分の架橋部を形成する基、例えば2-ピロリジニル-1-ブチニルを記述するのに使用する。

30

【0333】

「カルボキシルアルキル」という用語は、カルボキシル(-COOH)基に結合した分枝鎖及び直鎖の上記アルキル基を含む。

【0334】

「カルボキシルアルケニル」という用語は、カルボキシル(-COOH)基に結合した分枝鎖及び直鎖の上記アルケニル基を含む。

【0335】

「カルボキシルアルキニル」という用語は、カルボキシル(-COOH)基に結合した分枝鎖及び直鎖の上記アルキニル基を含む。

【0336】

「カルボキシルシクロアルキル」という用語は、上記脂肪族環構造に結合したカルボキシル(-COOH)基を指す。

40

【0337】

「カルボキシルシクロアルケニル」という用語は、1又は2個のエチレン結合を有する上記脂肪族環構造に結合したカルボキシル(-COOH)基を指す。

【0338】

「シクロアルキルアルキル」又は「シクロアルキル-アルキル」という用語は、アルキル基に結合した上記シクロアルキル基、例えば、シクロプロピルメチル、シクロヘキシルエチルなどを指す。

【0339】

50

「シクロアルキルアルケニル」又は「シクロアルキル - アルケニル」という用語は、アルケニル基に結合した上記シクロアルキル基、例えば、シクロヘキシルビニル、シクロヘプチルアリルなどを指す。

【0340】

「シクロアルキルアルキニル」又は「シクロアルキル - アルキニル」という用語は、アルキニル基に結合した上記シクロアルキル基、例えば、シクロプロピルプロパルギル、4 - シクロペンチル - 2 - ブチニルなどを指す。

【0341】

「シクロアルケニルアルキル」又は「シクロアルケニル - アルキル」という用語は、アルキル基に結合した上記シクロアルケニル基、例えば 2 - (シクロペンテン - 1 - イル) エチルなどを指す。

10

【0342】

「シクロアルケニルアルケニル」又は「シクロアルケニル - アルケニル」という用語は、アルケニル基に結合した上記シクロアルケニル基、例えば 1 - (シクロヘキセン - 3 - イル) アリルなどを指す。

【0343】

「シクロアルケニルアルキニル」又は「シクロアルケニル - アルキニル」という用語は、アルキニル基に結合した上記シクロアルケニル基、例えば 1 - (シクロヘキセン - 3 - イル) プロパルギルなどを指す。

【0344】

「カルボキシルシクロアルキルアルキル」という用語は、上記シクロアルキルアルキル基のシクロアルキル環部に結合したカルボキシル (-COOH) 基を指す。

20

【0345】

「カルボキシルシクロアルキルアルケニル」という用語は、上記シクロアルキルアルケニル基のシクロアルキル環部に結合したカルボキシル (-COOH) 基を指す。

【0346】

「カルボキシルシクロアルキルアルキニル」という用語は、上記シクロアルキルアルキニル基のシクロアルキル環部に結合したカルボキシル (-COOH) 基を指す。

【0347】

「カルボキシルシクロアルケニルアルキル」という用語は、上記シクロアルケニルアルキル基のシクロアルケニル環部に結合したカルボキシル (-COOH) 基を指す。

30

【0348】

「カルボキシルシクロアルケニルアルケニル」という用語は、上記シクロアルケニルアルケニル基のシクロアルケニル環部に結合したカルボキシル (-COOH) 基を指す。

【0349】

「カルボキシルシクロアルケニルアルキニル」という用語は、上記シクロアルケニルアルキニル基のシクロアルケニル環部に結合したカルボキシル (-COOH) 基を指す。

【0350】

「ビスシクロアルキル」という用語は、2 個の環を有する環式脂肪族基を指し、前記環は 1 又は 2 個の炭素原子を共有し、1 個以上の独立した置換基で置換されていてもよい。ビスシクロアルキルの例としては、スピロペンタン、ノルボルニル、ビスシクロ [3.1.0] ヘキシル、スピロ [4.4] ノニルなどが挙げられるが、これらだけに限定されない。

40

【0351】

「ヘテロビスシクロアルキル」という用語は、2 個の環を有する環式脂肪族基を指し、前記環は 1 又は 2 個の原子を共有し、環の少なくとも 1 個は少なくとも 1 個のヘテロ原子を有し、1 個以上の独立した置換基で置換されていてもよい。ヘテロビスシクロアルキルの例としては、3 - アザ - ビシクロ [4.1.0] ヘプタニル、1, 4 - ジオキサスピロ [4.4] ノニルなどが挙げられるが、これらだけに限定されない。

【0352】

「アルコキシ」という用語は、架橋酸素原子に結合した分枝鎖及び直鎖の末端アルキル

50

基を含む。典型的なアルコキシ基としては、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、イソプロポキシ、*tert*-ブトキシなどが挙げられる。

【0353】

「ハロアルコキシ」という用語は、1個以上のハロ基で置換されたアルコキシ基、例えば、クロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、パーフルオロイソブトキシなどを指す。

【0354】

「アルコキシアルコキシアルキル」という用語は、第2のアルコキシ部分で置換されたアルコキシ部分で置換されたアルキル基、例えば、メトキシメトキシメチル、イソプロポキシメトキシエチルなどを指す。

10

【0355】

「アルキルチオ」という用語は、架橋硫黄原子に結合した分枝鎖及び直鎖のアルキル基、例えばメチルチオなどを含む。

【0356】

「ハロアルキルチオ」という用語は、1個以上のハロ基で置換されたアルキルチオ基、例えばトリフルオロメチルチオなどを指す。

【0357】

「アルコキシアルキル」という用語は、アルコキシ基で置換されたアルキル基、例えばイソプロポキシメチルを指す。

【0358】

「アルコキシアルケニル」という用語は、アルコキシ基で置換されたアルケニル基、例えば3-メトキシアリルを指す。

20

【0359】

「アルコキシアルキニル」という用語は、アルコキシ基で置換されたアルキニル基、例えば3-メトキシプロパルギルを指す。

【0360】

「アルコキシカルボニルアルキル」という用語は、アルコキシカルボニルで置換された直鎖又は分枝のアルキル、例えば、エトキシカルボニルメチル、2-(メトキシカルボニル)プロピルなどを指す。

【0361】

「アルコキシカルボニルアルケニル」という用語は、アルコキシカルボニルで置換された直鎖又は分枝の上記アルケニル、例えば4-(エトキシカルボニル)-2-ブテニルなどを指す。

30

【0362】

「アルコキシカルボニルアルキニル」という用語は、アルコキシカルボニルで置換された直鎖又は分枝の上記アルキニル、例えば4-(エトキシカルボニル)-2-ブチニルなどを指す。

【0363】

「ハロアルコキシアルキル」という用語は、ハロアルコキシで置換された直鎖又は分枝の上記アルキル、例えば、2-クロロエトキシメチル、トリフルオロメトキシメチルなどを指す。

40

【0364】

「ハロアルコキシアルケニル」という用語は、ハロアルコキシで置換された直鎖又は分枝の上記アルケニル、例えば4-(クロロメトキシ)-2-ブテニルなどを指す。

【0365】

「ハロアルコキシアルキニル」という用語は、ハロアルコキシで置換された直鎖又は分枝の上記アルキニル、例えば4-(2-フルオロエトキシ)-2-ブチニルなどを指す。

【0366】

「アルキルチオアルキル」又は「アルキルチオ-アルキル」という用語は、アルキルチオ基で置換された直鎖又は分枝の上記アルキル、例えば、メチルチオメチル、3-(イソ

50

ブチルチオ)ヘブチルなどを指す。

【0367】

「アルキルチオアルケニル」という用語は、アルキルチオ基で置換された直鎖又は分枝の上記アルケニル、例えば、4-(メチルチオ)-2-ブテニルなどを指す。

【0368】

「アルキルチオアルキニル」という用語は、アルキルチオ基で置換された直鎖又は分枝の上記アルキニル、例えば、4-(エチルチオ)-2-ブチニルなどを指す。

【0369】

「ハロアルキルチオアルキル」という用語は、ハロアルキルチオ基で置換された直鎖又は分枝の上記アルキル、例えば、2-クロロエチルチオメチル、トリフルオロメチルチオメチルなどを指す。

10

【0370】

「ハロアルキルチオアルケニル」という用語は、ハロアルキルチオ基で置換された直鎖又は分枝の上記アルケニル、例えば4-(クロロメチルチオ)-2-ブテニルなどを指す。

【0371】

「ハロアルキルチオアルキニル」という用語は、ハロアルキルチオ基で置換された直鎖又は分枝の上記アルキニル、例えば4-(2-フルオロエチルチオ)-2-ブチニルなどを指す。

【0372】

「ジアルコキシホスホリルアルキル」という用語は、アルキルに結合したオキソ置換基を含む、五価の垂リン酸原子に結合した2個の直鎖又は分枝の上記アルコキシ基、例えばジエトキシホスホリルメチルを指す。

20

【0373】

「オリゴマー」という用語は、数平均分子量が典型的には約5000g/mol未満であり、重合度(1本の鎖当たりの平均モノマー単位数)が1を超え、典型的には約50以下である低分子量ポリマーを指す。

【0374】

本明細書に記載した化合物は1個以上の不斉中心を含み、従ってジアステレオマー及び光学異性体が生じ得る。本発明は、かかる可能な全ジアステレオマー並びにそれらのラセミ混合物、それらの実質的に純粋な分離鏡像異性体、可能な全幾何異性体及び薬剤として許容されるそれらの塩を含む。上記式Iは、特定の位置における明確な立体化学なしに示されている。本発明は式Iの全立体異性体及び薬剤として許容されるそれらの塩を含む。また、立体異性体の混合物及び単離された特定の立体異性体も含まれる。かかる化合物の調製に用いる合成手順の過程で、又は当業者に公知のラセミ化若しくはエピマー化手順を用いる際に、かかる手順の生成物は立体異性体の混合物となり得る。

30

【0375】

本発明は、薬剤として許容される担体と組み合わせた式Iの化合物を含む薬剤組成物も含む。

【0376】

組成物は、薬剤として許容される担体と上記式Iの化合物(又は薬剤として許容されるその塩)の無毒の治療有効量とを含むことが好ましい。

40

【0377】

さらに、この好ましい実施形態内で、本発明は、薬剤として許容される担体と上記式Iの化合物(又は薬剤として許容されるその塩)の無毒の治療有効量とを含む、キナーゼを阻害することによって疾患を治療する薬剤組成物を包含する。

【0378】

「薬剤として許容される塩」という用語は、薬剤として許容される無毒の塩基又は酸から調製される塩を指す。本発明の化合物が酸性であるときには、その対応する塩は、無機及び有機の塩基を含めて薬剤として許容される無毒の塩基から好都合には調製することが

50

できる。かかる無機塩基から誘導される塩としては、アルミニウム、アンモニウム、カルシウム、銅（（I I）及び（I））、鉄（I I I）、鉄（I I）、リチウム、マグネシウム、マンガン（（I I I）及び（I I））、カリウム、ナトリウム、亜鉛などの塩が挙げられる。特に好ましい塩は、アンモニウム、カルシウム、マグネシウム、カリウム及びナトリウム塩である。薬剤として許容される無毒の有機塩基から誘導される塩としては、第一級、第二級及び第三級アミン並びに環式アミン及び天然置換アミン、合成置換アミンなどの置換アミンの塩などが挙げられる。塩を形成することができる、他の薬剤として許容される無毒の有機塩基としては、例えば、アルギニン、ペタイン、カフェイン、コリン、N', N' - ジベンジルエチレンジアミン、ジエチルアミン、2 - ジエチルアミノエタノール、2 - ジメチルアミノエタノール、エタノールアミン、エチレンジアミン、N - エチルモルホリン、N - エチルピペリジン、グルカミン、グルコサミン、ヒスチジン、ヒドラバミン、イソプロピルアミン、リジン、メチルグルカミン、モルホリン、ピペラジン、ピペリジン、ポリアミン樹脂、プロカイン、プリン、テオプロミン、トリエチルアミン（*triethylamine*）、トリメチルアミン、トリプロピルアミン、トロメタミンなどのイオン交換樹脂が挙げられる。

【0379】

本発明の化合物が塩基であるときには、その対応する塩は、無機及び有機の酸を含めて薬剤として許容される無毒の酸から好都合には調製することができる。かかる酸としては、例えば、酢酸、ベンゼンスルホン酸、安息香酸、カンファースルホン酸、クエン酸、エタンスルホン酸、ギ酸、フマル酸、グルコン酸、グルタミン酸、臭化水素酸、塩化水素酸、イセチオン酸、乳酸、マレイン酸、リンゴ酸、マンデル酸、メタンスルホン酸、粘液酸、硝酸、パモン酸、パントテン酸、リン酸、コハク酸、硫酸、酒石酸、p - トルエンズルホン酸などが挙げられる。好ましい酸は、クエン酸、臭化水素酸、ギ酸、塩化水素酸、マレイン酸、リン酸、硫酸及び酒石酸である。特に好ましい酸はギ酸及び塩酸である。

【0380】

本発明の薬剤組成物は、活性成分として式 I の化合物（又は薬剤として許容されるその塩）と薬剤として許容される担体とを含み、他の治療成分又はアジュバントを場合によっては含んでいてもよい。本組成物は、経口、直腸、局所及び（皮下、筋肉内及び静脈内を含めた）非経口投与に適切な組成物を含むが、任意の所与の症例において最も適切な経路は、個々の宿主並びに活性成分を投与する症状の性質及び重症度に応じて決まる。薬剤組成物は、好都合には単位剤形とすることができ、薬学分野で周知の方法のいずれかによって調製することができる。

【0381】

実際には、本発明の式 I の化合物、そのプロドラッグ、その代謝産物、又は薬剤として許容されるその塩は、従来の薬剤配合技術によって均質混合物中の活性成分として薬剤担体と混合することができる。担体は、投与、例えば、経口又は（静脈内を含めた）非経口投与に望ましい剤形に応じて多種多様な形をとることができる。従って、本発明の薬剤組成物は、活性成分の所定量を各々が含むカプセル剤、カシェ剤、錠剤などの経口投与に適切な分離単位として提供することができる。また、本組成物は、散剤、顆粒剤、溶液剤、水性液体中の懸濁液剤、非水系液剤、水中油型乳剤又は油中水型液体乳剤として提供することができる。上記一般的剤形に加えて、式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩は、制御放出手段及び / 又は送達装置によって投与することもできる。本組成物は、調剤方法のいずれかによって調製することができる。一般に、かかる方法は、活性成分を 1 種類以上の必要な成分を構成する担体と会合させる段階を含む。一般に、本組成物は、活性成分を液体担体又は微粉固体担体又はその両方と均一に十分混合することによって調製される。次いで、生成物を所望の形（*presentation*）に都合よく成形することができる。

【0382】

従って、本発明の薬剤組成物は、薬剤として許容される担体と式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩とを含むことができる。式 I の化合物又は薬剤として許容されるそ

10

20

30

40

50

の塩は、1種類以上の他の治療上有効な化合物と組み合わせることで薬剤組成物中に含めることもできる。

【0383】

使用する薬剤担体は、例えば、固体、液体又は気体とすることができる。固体担体の例としては、ラクトース、白土、スクロース、タルク、ゼラチン、寒天、ペクチン、アラビアゴム、ステアリン酸マグネシウム及びステアリン酸が挙げられる。液体担体の例は、糖シロップ、落花生油、オリーブ油及び水である。気体担体の例としては二酸化炭素及び窒素が挙げられる。

【0384】

経口剤形用組成物を調製するには、任意の好都合な薬剤媒体を使用することができる。例えば、水、グリコール、油、アルコール、香味剤、防腐剤、着色剤などを使用して懸濁液剤、エリキシル剤、溶液剤などの経口液体製剤を形成することができる。また、デンプン、糖、微結晶セルロース、希釈剤、造粒剤、潤滑剤、結合剤、崩壊剤などの担体を使用して、散剤、カプセル剤、錠剤などの経口固体製剤を形成することができる。錠剤及びカプセル剤は、投与が容易なので好ましい経口投与単位であり、そのため固体薬剤担体を使用される。錠剤は、標準の水系又は非水系技術によって被覆してもよい。

10

【0385】

本発明の組成物を含む錠剤は、1種類以上の副成分又はアジュバントと場合によっては一緒に、圧縮又はモールディングによって調製することができる。圧縮錠剤は、結合剤、潤滑剤、不活性希釈剤、界面活性剤又は分散剤と混合されていてもよい、散剤、顆粒剤などの易流動性の活性成分を適切な機械で圧縮することによって調製することができる。モールディングされた錠剤は、不活性希釈液で湿らせた粉末化合物の混合物を適切な機械でモールディングすることによって製造することができる。各錠剤は活性成分約0.05mgから約5gを好ましくは含有し、各カプセル剤又はカプセル剤は活性成分約0.05mgから約5gを好ましくは含有する。

20

【0386】

例えば、ヒトへの経口投与を目的とした製剤は、全組成物の約5から約95パーセントとすることができる適切で好都合な量の担体材料と配合された約0.5mgから約5gの活性薬剤を含むことができる。単位剤形は、活性成分を一般に約1mgから約2g、典型的には25mg、50mg、100mg、200mg、300mg、400mg、500mg、600mg、800mg又は1000mg含む。

30

【0387】

非経口投与に適切な本発明の薬剤組成物は、活性化合物の水溶液又は水懸濁液として調製することができる。例えばヒドロキシプロピルセルロースなどの適切な界面活性剤を含むことができる。分散剤は、グリセリン中で、液状ポリエチレングリコール中で、オイル中のそれらの混合物中で調製することもできる。また、防腐剤は、微生物の有害な増殖を防止するために含めることができる。

【0388】

注射用に適切な本発明の薬剤組成物としては、無菌水溶液又は分散液が挙げられる。また、本組成物は、かかる無菌注射用溶液又は分散液を即座に調製するための無菌散剤の形とすることができる。全ての場合において、最終注射用剤形は無菌でなければならず、注射を容易にするために効果的に流動性でなければならない。本薬剤組成物は、製造及び貯蔵条件下で安定でなければならず、従って、細菌、真菌などの微生物の汚染作用に対して好ましくは保護されるべきである。担体は、例えば、水、エタノール、ポリオール（例えば、グリセリン、プロピレングリコール及び液状ポリエチレングリコール）、植物油及びこれらの適切な混合物を含む溶媒又は分散媒とすることができる。

40

【0389】

本発明の薬剤組成物は、例えば、エアゾール剤、クリーム剤、軟膏剤、ローション剤、散布粉剤など局所用に適切な剤形とすることができる。また、本組成物は、経皮装置に使用するのに適切な剤形とすることができる。これらの製剤は、本発明の式Iの化合物又は

50

薬剤として許容されるその塩を利用して、従来の加工方法によって調製することができる。例として、クリーム剤又は軟膏剤は、親水性材料と水を本化合物の約5重量%から約10重量%と一緒に混合して、所望の粘ちゅう性を有するクリーム剤又は軟膏剤を製造することによって調製される。

【0390】

本発明の薬剤組成物は、担体が固体である直腸投与に適切な形とすることができる。混合物は単位用量坐剤を形成することが好ましい。適切な担体としては、カカオ脂、当分野で通常使用される他の材料などが挙げられる。坐剤は、本組成物を軟化又は溶融担体とまず混合し、続いて型の中で冷却及び成形することによって好都合には形成することができる。

10

【0391】

上記薬剤は、上述の担体成分に加えて、希釈剤、緩衝剤、香味剤、結合剤、界面活性剤、増粘剤、潤滑剤、(抗酸化剤を含めた)防腐剤などの1種類以上の追加の担体成分を適宜含むことができる。また、製剤を対象レシピエントの血液と等張性にするために他のアジュバントを含むことができる。式Iの化合物又は薬剤として許容されるその塩を含む組成物は、粉体又は濃縮液体の形で調製することもできる。

【0392】

一般に、約0.01mg/kgから約150mg/kg体重/日又は約0.5mgから約7g/患者/日の投与量レベルが上記症状の治療に有用である。例えば、炎症、癌、アレルギー/ぜん息、免疫系の疾患及び症状、中枢神経系(CNS)の疾患及び症状、循環器疾患、皮膚科学並びに血管新生は、化合物約0.01から50mg/キログラム体重/日又は約0.5mgから約3.5g/患者/日の投与によって効果的に治療することができる。

20

【0393】

しかし、任意の特定の患者に対する具体的用量レベルは、年齢、体重、全般的健康状態、性別、食餌、投与時間、投与経路、排出速度、薬物組合せ、治療を受ける特定の疾患の重篤度を含めて様々な要因に応じて決まることを理解されたい。

【0394】

本明細書に記載した化合物は1個以上の不斉中心を含み、従ってジアステレオマー及び光学異性体が生じ得る。本発明は、かかる可能な全ジアステレオマー並びにそれらのラセミ混合物、それらの実質的に純粋な分離鏡像異性体、可能な全幾何異性体及び薬剤として許容されるそれらの塩を含む。上記式Iは、特定の位置における明確な立体化学なしに示されている。本発明は式Iの全立体異性体及び薬剤として許容されるそれらの塩を含む。また、立体異性体の混合物及び単離された特定の立体異性体も含まれる。かかる化合物の調製に用いる合成手順の過程で、又は当業者に公知のラセミ化若しくはエピマー化手順を用いる際に、かかる手順の生成物は立体異性体の混合物となり得る。

30

【0395】

本発明は、薬剤として許容される担体と組み合わせた式Iの化合物を含む薬剤組成物も含む。

【0396】

組成物は、薬剤として許容される担体と上記式Iの化合物又は薬剤として許容されるその塩の無毒の治療有効量とを含むことが好ましい。

40

【0397】

さらに、この好ましい実施形態内で、本発明は、薬剤として許容される担体と上記式Iの化合物(又は薬剤として許容されるその塩)の無毒の治療有効量とを含み、チロシンキナーゼ酵素を阻害して細胞増殖、成長、分化、代謝、細胞周期現象、アポトーシス、運動性、転写、リン酸化、翻訳及び他のシグナル伝達プロセスをもたらすことによって疾患を治療する薬剤組成物を包含する。

【0398】

「薬剤として許容される塩」という用語は、薬剤として許容される無毒の塩基又は酸か

50

ら調製される塩を指す。本発明の化合物が酸性であるときには、その対応する塩は、無機及び有機の塩基を含めて薬剤として許容される無毒の塩基から好都合には調製することができる。かかる無機塩基から誘導される塩としては、アルミニウム、アンモニウム、カルシウム、銅（(II)及び(I)）、鉄（(III)、(II)）、リチウム、マグネシウム、マンガン（(III)及び(II)）、カリウム、ナトリウム、亜鉛などの塩が挙げられる。特に好ましい塩は、アンモニウム、カルシウム、マグネシウム、カリウム及びナトリウム塩である。薬剤として許容される無毒の有機塩基から誘導される塩としては、第一級、第二級及び第三級アミン並びに環式アミン及び天然置換アミン、合成置換アミンなどの置換アミンの塩などが挙げられる。塩を形成することができる、他の薬剤として許容される無毒の有機塩基としては、例えば、アルギニン、ペタイン、カフェイン、コリン、N', N' -ジベンジルエチレンジアミン、ジエチルアミン、2 -ジエチルアミノエタノール、2 -ジメチルアミノエタノール、エタノールアミン、エチレンジアミン、N -エチルモルホリン、N -エチルピペリジン、グルカミン、グルコサミン、ヒスチジン、ヒドラバミン、イソプロピルアミン、リジン、メチルグルカミン、モルホリン、ペペラジン、ピペリジン、ポリアミン樹脂、プロカイン、プリン、テオプロミン、トリエチルアミン (triethylamine)、トリメチルアミン、トリプロピルアミン、トロメタミンなどのイオン交換樹脂が挙げられる。

【0399】

本発明の化合物が塩基であるときには、その対応する塩は、無機及び有機の酸を含めて薬剤として許容される無毒の酸から好都合には調製することができる。かかる酸としては、例えば、酢酸、ベンゼンスルホン酸、安息香酸、カンファースルホン酸、クエン酸、エタンスルホン酸、フマル酸、グルコン酸、グルタミン酸、臭化水素酸、塩化水素酸、イセチオン酸、乳酸、マレイン酸、リンゴ酸、マンデル酸、メタンスルホン酸、粘液酸、硝酸、パモン酸、パントテン酸、リン酸、コハク酸、硫酸、酒石酸、p -トルエンスルホン酸などが挙げられる。特に好ましい酸は、クエン酸、臭化水素酸、塩化水素酸、マレイン酸、リン酸、硫酸及び酒石酸である。

【0400】

本発明の薬剤組成物は、活性成分として式Iの化合物又は薬剤として許容されるその塩と薬剤として許容される担体とを含み、他の治療成分又はアジュバントを場合によっては含んでいてもよい。本組成物は、経口、直腸、局所及び（皮下、筋肉内及び静脈内を含めた）非経口投与に適切な組成物を含むが、任意の所与の症例において最も適切な経路は、個々の宿主並びに活性成分を投与する症状の性質及び重症度に応じて決まる。薬剤組成物は、好都合には単位剤形とすることができ、薬学分野で周知の方法のいずれかによって調製することができる。

【0401】

実際には、本発明の式Iの化合物又は薬剤として許容されるその塩は、従来の薬剤配合技術によって均質混合物中の活性成分として薬剤担体と混合することができる。担体は、投与に望ましい剤形に応じて多種多様な形態をとることができる。例えば、経口又は（静脈内を含めた）非経口。従って、本発明の薬剤組成物は、活性成分の所定量を各々が含むカプセル剤、カシェ剤、錠剤などの経口投与に適切な分離単位として提供することができる。また、本組成物は、散剤、顆粒剤、溶液剤、水性液体中の懸濁液剤、非水系液剤、水中油型乳剤又は油中水型液体乳剤として提供することができる。上記一般的剤形に加えて、式Iの化合物又は薬剤として許容されるその塩は、制御放出手段及び/又は送達装置によって投与することもできる。本組成物は、調剤方法のいずれかによって調製することができる。一般に、かかる方法は、活性成分を1種類以上の必要な成分を構成する担体と会合させる段階を含む。一般に、本組成物は、活性成分を液体担体又は微粉固体担体又はその両方と均一に十分混合することによって調製される。次いで、生成物を所望の形 (presentation) に都合よく成形することができる。

【0402】

従って、本発明の薬剤組成物は、薬剤として許容される担体と式Iの化合物又は薬剤と

10

20

30

40

50

して許容されるその塩とを含むことができる。式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩は、1種類以上の他の治療上有効な化合物と組み合わせて薬剤組成物中に含めることもできる。

【0403】

使用する薬剤担体は、例えば、固体、液体又は気体とすることができる。固体担体の例としては、ラクトース、白土、スクロース、タルク、ゼラチン、寒天、ペクチン、アラビアゴム、ステアリン酸マグネシウム及びステアリン酸が挙げられる。液体担体の例は、糖シロップ、落花生油、オリーブ油及び水である。気体担体の例としては二酸化炭素及び窒素が挙げられる。

【0404】

経口剤形用組成物を調製する際には、任意の好都合な薬剤媒体を使用することができる。例えば、水、グリコール、油、アルコール、香味剤、防腐剤、着色剤などを使用して懸濁液剤、エリキシル剤、溶液剤などの経口液体製剤を形成することができる。また、デンプン、糖、微結晶セルロース、希釈剤、造粒剤、潤滑剤、結合剤、崩壊剤などの担体を使用して、散剤、カプセル剤、錠剤などの経口固体製剤を形成することができる。錠剤及びカプセル剤は、投与が容易なので好ましい経口投与単位であり、そのため固体薬剤担体が使用される。錠剤は、標準の水系又は非水系技術によって被覆してもよい。

10

【0405】

本発明の組成物を含む錠剤は、1種類以上の副成分又はアジュバントと場合によっては一緒に、圧縮又はモールディングによって調製することができる。圧縮錠剤は、結合剤、潤滑剤、不活性希釈剤、界面活性剤又は分散剤と混合されていてもよい、散剤、顆粒剤などの易流動性の活性成分を適切な機械で圧縮することによって調製することができる。モールディングされた錠剤は、不活性希釈液で湿らせた粉末化合物の混合物を適切な機械でモールディングすることによって製造することができる。各錠剤は活性成分約 0.05 mg から約 5 g を好ましくは含有し、各カプセル剤又はカプセル剤は活性成分約 0.05 mg から約 5 g を好ましくは含有する。

20

【0406】

例えば、ヒトへの経口投与を目的とした製剤は、全組成物の約 5 から約 95 パーセントとすることができる適切で好都合な量の担体材料と配合された約 0.5 mg から約 5 g の活性薬剤を含むことができる。単位剤形は、活性成分を一般に約 1 mg から約 2 g、典型的には 25 mg、50 mg、100 mg、200 mg、300 mg、400 mg、500 mg、600 mg、800 mg 又は 1000 mg 含む。

30

【0407】

非経口投与に適切な本発明の薬剤組成物は、活性化合物の水溶液又は水懸濁液として調製することができる。例えばヒドロキシプロピルセルロースなどの適切な界面活性剤を含むことができる。分散剤は、グリセリン中で、液状ポリエチレングリコール中で、オイル中のそれらの混合物中で調製することもできる。また、防腐剤は、微生物の有害な増殖を防止するために含めることができる。

【0408】

注射用に適切な本発明の薬剤組成物としては、無菌水溶液又は分散液が挙げられる。また、本組成物は、かかる無菌注射用溶液又は分散液を即座に調製するための無菌散剤の形とすることができる。全ての場合において、最終注射用剤形は無菌でなければならず、注射を容易にするために効果的に流動性でなければならない。本薬剤組成物は、製造及び貯蔵条件下で安定でなければならず、従って、細菌、真菌などの微生物の汚染作用に対して好ましくは保護されるべきである。担体は、例えば、水、エタノール、ポリオール（例えば、グリセリン、プロピレングリコール及び液状ポリエチレングリコール）、植物油及びこれらの適切な混合物を含む溶媒又は分散媒とすることができる。

40

【0409】

本発明の薬剤組成物は、例えば、エアゾール剤、クリーム剤、軟膏剤、ローション剤、散布粉剤など局所用に適切な剤形とすることができる。また、本組成物は、経皮装置に使

50

用するのに適切な剤形とすることができる。これらの製剤は、本発明の式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩を利用して、従来の加工方法によって調製することができる。例として、クリーム剤又は軟膏剤は、親水性材料と水を本化合物の約 5 重量%から約 10 重量%と一緒に混合して、所望の粘ちゅう性を有するクリーム剤又は軟膏剤を製造することによって調製する。

【0410】

本発明の薬剤組成物は、担体が固体である直腸投与に適切な形とすることができる。混合物は単位用量坐剤を形成することが好ましい。適切な担体としては、カカオ脂、当分野で通常使用される他の材料などが挙げられる。坐剤は、本組成物を軟化又は溶融担体とまぜ混合し、続いて型の中で冷却及び成形することによって好都合には形成することができる。

10

【0411】

上記薬剤は、上述の担体成分に加えて、希釈剤、緩衝剤、香味剤、結合剤、界面活性剤、増粘剤、潤滑剤、(抗酸化剤を含めた)防腐剤などの 1 種類以上の追加の担体成分を適宜含むことができる。また、製剤を対象レシピエントの血液と等張性にするために他のアジュバントを含むことができる。式 I の化合物又は薬剤として許容されるその塩を含む組成物は、粉体又は濃縮液体の形で調製することもできる。

【0412】

一般に、約 0.01 mg/kg から約 150 mg/kg 体重/日又は約 0.5 mg から約 7 g / 患者/日の投与量レベルが上記症状の治療に有用である。例えば、炎症、癌、アレルギー/ぜん息、免疫系の疾患及び症状、中枢神経系 (CNS) の疾患及び症状、循環器疾患、皮膚科学並びに血管新生は、化合物約 0.01 から 50 mg / キログラム体重/日又は約 0.5 mg から約 3.5 g / 患者/日の投与によって効果的に治療することができる。

20

【0413】

しかし、任意の特定の患者に対する具体的用量レベルは、年齢、体重、全般的健康状態、性別、食餌、投与時間、投与経路、排出速度、薬物組合せ、治療を受ける特定の疾患の重篤度を含めて様々な要因に応じて決まることを理解されたい。

【0414】

バイオアッセイ

本発明の実施例である式 I の化合物のインスリン様成長因子 - 1 受容体 (IGF - 1 R) 阻害剤としての効力を、幾つかの薬理的インビトロアッセイによって実証し、確認した。以下のアッセイ及びそのそれぞれの方法を本発明による化合物を用いて実施した。式 I の化合物が有する活性はインビボで実証することができる。

30

【0415】

インビトロでのチロシンキナーゼアッセイ

式 I の化合物の IGF - 1 R 抑制性は、Sf9 細胞において発現されるヒト IGF - 1 R の細胞質キナーゼドメインを含む精製 GST 融合タンパク質を用いたチロシンキナーゼアッセイにおいて示すことができる。このアッセイは、基質 poly - glu - tyr (4 : 1 比) のキナーゼ緩衝剤 (50 mM HEPES、pH 7.4、125 mM NaCl、24 mM MgCl₂、1 mM MnCl₂、1% グリセリン、200 μM Na₃VO₄ 及び 2 mM DTT) 溶液 1 μg / ウェルであらかじめ被覆された Immulon - 4 96 ウェルプレート (Thermo Lab systems) 中で (比活性に応じて) 1 - 100 nM を含む最終体積 90 μL で実施される。ATP を最終濃度 100 μM で添加することによって酵素反応を開始した。室温で 30 分間インキュベートした後、0.02% Tween - 20 を含む 2 mM イミダゾール緩衝食塩水でプレートを洗浄した。次いで、3% ウシ血清アルブミン (BSA)、0.5% Tween - 20 及び 200 μM Na₃VO₄ を含むリン酸緩衝食塩水 (PBS) で 167 ng / mL に希釈した、西洋わさびペルオキシダーゼ (HRP) (Calbiochem) と複合化された抗ホスチロシンマウスモノクローナル抗体 pY - 20 と一緒にプレートを室温で 2 時間インキュ

40

50

ベートした。250 μ Lで3回洗浄後、結合した抗ホスホチロシン抗体を、ABTS (Kirkegaard & Perry Labs, Inc.) 100 μ L / ウェルと一緒に室温で30分間インキュベートすることによって検出した。1% SDS 100 μ L / ウェルを添加することによって反応を停止させ、ホスホチロシンに依存するシグナルをプレートリーダーによって405 / 490 nmで測定した。

【0416】

全ての実施例がIGF-1Rを阻害した。以下の実施例は、生化学的アッセイにおいてIGF-1Rを阻害することによって効力及び活性を示し、IC₅₀値は15 μ M未満であった。IC₅₀値は5 μ Mであることが好ましい。より有利には、IC₅₀値は1 μ M未満である。さらに有利には、IC₅₀値は200 nM未満である。

10

【0417】

最も好ましい実施例はIGF-1Rに対して選択的である。

【0418】

細胞ベースのオートホスホチロシンアッセイ

完全長ヒトIGF-1Rを安定に発現するNIH 3T3細胞を、96ウェルプレート中の10%ウシ胎児血清(FCS)を補充したダルベッコ最少基本培地(DMEM) 0.1 ml / ウェルに 1×10^4 細胞 / ウェルで播いた。2日目に、培地を飢餓培地(0.5% FCSを含むDMEM)で2時間置換し、化合物を100%ジメチルスルホキシド(DMSO)で希釈し、細胞に6通りの最終濃度(20、6.6、2.2、0.74、0.25及び0.082 μ M)で2つ組で添加し、37 でさらに2時間インキュベートした。組換えヒトIGF-1 (100 ng / mL)を37 で15分間添加後、培地を取り出し、細胞をPBS (リン酸緩衝食塩水)で1回洗浄し、150 mM NaCl、1.5 mM MgCl、1 mM EDTA、新しいプロテアーゼ阻害剤及びホスファターゼ阻害剤 [10 μ g / ml ロイペプチン、25 μ g / ml アプロチニン、1 mM フェニルメチルスルホニルフルオリド(PMSF)及び200 μ M Na₃VO₄]を補充した冷TGH緩衝剤(1% Triton-100、10%グリセリン、50 mM HEPES [pH 7.4])を用いて溶解させた。細胞溶解物を、IGF-1R抗体(Calbiochem、Cat# GR31L) 10 ng / ウェルで被覆した96ウェルmicroplate 2プレート(Corning Costar #3922)に移し、4 で終夜インキュベートした。TGH緩衝剤で洗浄後、西洋わさびペルオキシダーゼ(HRP)と複合化された抗ホスホチロシンマウスモノクローナル抗体pY-20と一緒にプレートを室温で2時間インキュベートした。次いで、Super Signal ELISA Femto Maximum Sensitivity Substrate (Pierce)を添加することによってオートホスホチロシンを検出し、化学発光をWallac Victor² 1420 Multilabel Counterによって読み取った。化合物のIC₅₀曲線をExcelFitプログラムによってプロットした。

20

30

【0419】

全実施例がこの細胞ベースのアッセイにおいてIGF-1Rを阻害した。以下の実施例は、IGF-1Rを阻害することによって効力及び活性を示し、IC₅₀値が15 μ M未満であり、インスリン受容体の選択性が1から15倍と予想された。IC₅₀値は5 μ Mであることが好ましい。より有利には、IC₅₀値は1 μ M未満である。さらに有利には、IC₅₀値は200 nM未満である。本質的にIGF-1R細胞系アッセイに対して上述したようにインスリン受容体オートホスホチロシンアッセイを実施するが、インスリン(10 nM)を活性化リガンドとして、また、インスリン受容体抗体を捕捉抗体として、内因性ヒトインスリン受容体を発現するHepG2細胞と一緒に使用する。

40

【0420】

などのエーテル；メタノール、エタノール、イソプロパノール、トリフルオロエタノールなどのアルコール；塩化メチレン（ CH_2Cl_2 ）、クロロホルム（ CHCl_3 ）などの塩素系溶媒などが挙げられたが、これらだけに限定されなかった。必要に応じて、これらの溶媒の混合物を使用した。好ましい溶媒はイソプロパノールであった。上記プロセスを約 0 から約 50 の温度で実施した。好ましくは、反応を 0 から約 22 で実施した。本発明の化合物を生成する上記プロセスを好ましくはほぼ大気圧で実施したが、必要に応じてそれよりも高い圧力や低い圧力も使用した。実質的には、等モルの反応物を好ましく使用したが、必要に応じてそれよりも多い量や少ない量も使用した。

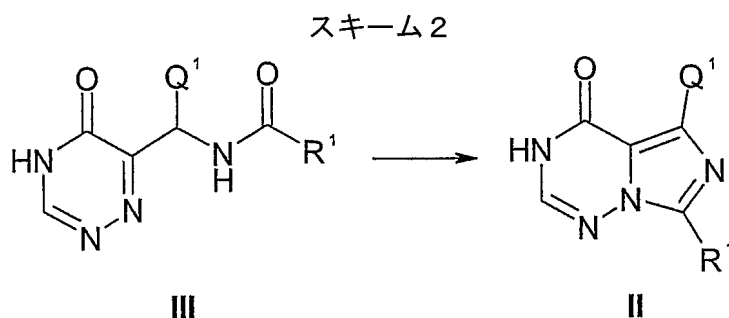
【0428】

スキーム 1 の式 I I の化合物を以下のスキーム 2 に示すように調製した。

10

【0429】

【化 2 5】



20

【0430】

式中、 Q^1 及び R^1 は、式 I の化合物に対して先に定義した通りである。

【0431】

式 I I の化合物の典型的な調製においては、式 I I I の中間体を適切な溶媒中で適切な反応温度でオキシ塩化リン（ POCl_3 ）で処理した。上記プロセスに使用するのに適切な溶媒としては、テトラヒドロフラン（THF）、グリムなどのエーテル；塩化メチレン（ CH_2Cl_2 ）、クロロホルム（ CHCl_3 ）などの塩素系溶媒；アセトニトリル（ CH_3CN ）などが挙げられたが、これらだけに限定されなかった。必要に応じて、これらの溶媒の混合物を使用した。好ましい溶媒は塩化メチレンであった。上記プロセスを約 -78 から約 120 の温度で実施した。好ましくは、反応を 40 から約 70 で実施した。本発明の化合物を生成する上記プロセスを好ましくはほぼ大気圧で実施したが、必要に応じてそれよりも高い圧力や低い圧力も使用した。実質的には、等モルの反応物を好ましく使用したが、必要に応じてそれよりも多い量や少ない量も使用した。

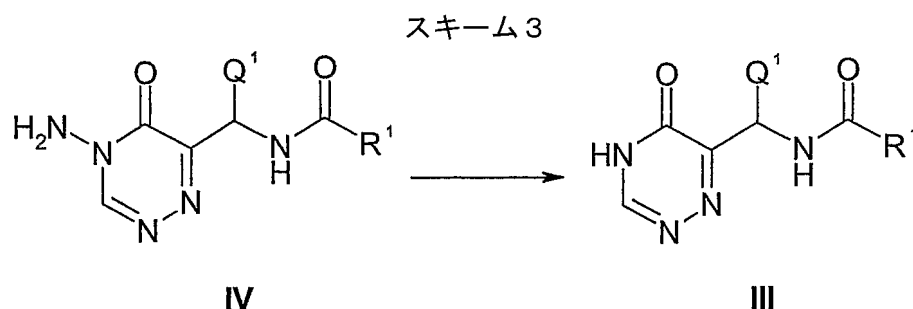
30

【0432】

スキーム 2 の式 I I I の化合物を以下のスキーム 3 に示すように調製した。

【0433】

【化 2 6】



40

【0434】

式中、 Q^1 及び R^1 は、式 I の化合物に対して先に定義した通りである。

【0435】

50

式 I I I の化合物の典型的な調製においては、式 I V の化合物を亜硝酸ナトリウム (NaNO_2)、適切な溶媒中の適切な酸及び適切な反応温度で処理した。上記プロセスに使用するのに適切な酸としては HCl 、 H_2SO_4 などが挙げられたが、これらだけに限定されなかった。好ましい酸は HCl であった。上記プロセスに使用するのに適切な溶媒としては、ジメチルホルムアミド (DMF)；メタノール、エタノール、イソプロパノール、トリフルオロエタノールなどのアルコール； H_2O などが挙げられたが、これらだけに限定されなかった。必要に応じて、これらの溶媒の混合物を使用した。好ましい溶媒は EtOH であった。上記プロセスを約 -20 から約 50 の温度で実施した。好ましくは、反応を 0 から 22 で実施した。本発明の化合物を生成する上記プロセスを好ましくはほぼ大気圧で実施したが、必要に応じてそれよりも高い圧力や低い圧力も使用した。実質的には、等モルの反応物を好ましく使用したが、必要に応じてそれよりも多い量や少ない量も使用した。

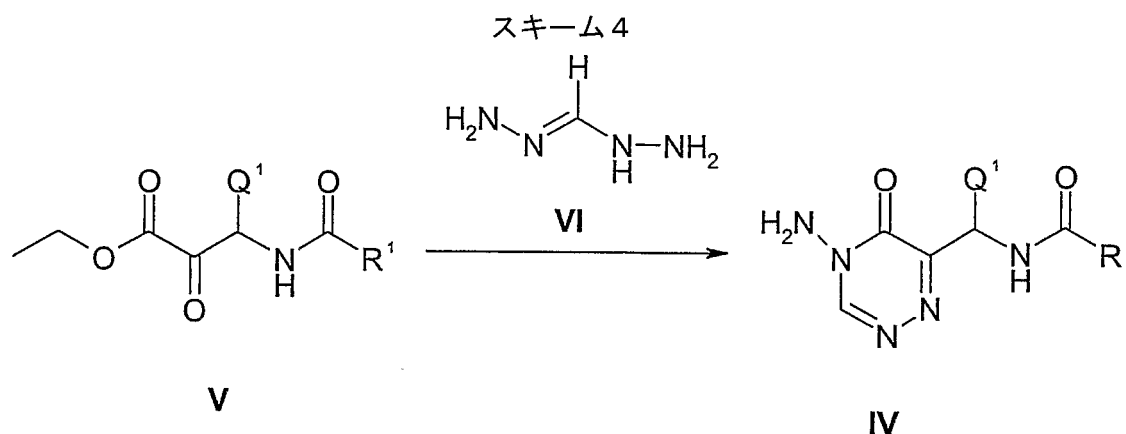
10

【0436】

スキーム 3 の式 I V の化合物を以下のスキーム 4 に示すように調製した。

【0437】

【化27】



20

【0438】

式中、 Q^1 及び R^1 は、式 I の化合物に対して先に定義した通りである。

30

【0439】

式 I V の化合物の典型的な調製においては、式 V の化合物をアミドラゾン VI と適切な溶媒中で適切な反応温度下で反応させた。上記プロセスに使用するのに適切な溶媒としては、テトラヒドロフラン (THF)、グリムなどのエーテル；メタノール、エタノール、イソプロパノール、トリフルオロエタノールなどのアルコール溶媒などが挙げられたが、これらだけに限定されなかった。必要に応じて、これらの溶媒の混合物を使用することができるが、好ましい溶媒はエタノールであった。上記プロセスを約 -78 から約 80 の温度で実施した。好ましくは、反応を -20 から 22 で実施した。本発明の化合物を生成する上記プロセスを好ましくはほぼ大気圧で実施したが、必要に応じてそれよりも高い圧力や低い圧力も使用した。実質的には、等モルの反応物を好ましく使用したが、必要に応じてそれよりも多い量や少ない量も使用した。

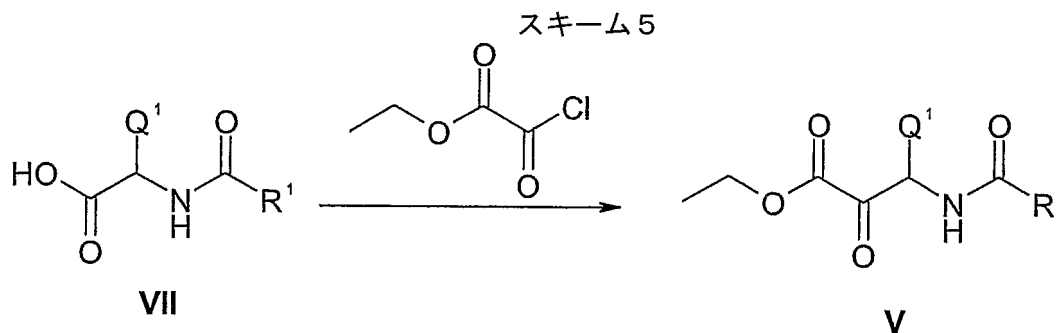
40

【0440】

スキーム 4 の式 V の化合物を以下のスキーム 5 に示すように調製した。

【0441】

【化28】



10

【0442】

式中、 Q^1 及び R^1 は、式 I の化合物に対して先に定義した通りである。

【0443】

式 V の化合物の典型的な調製においては、式 VII の化合物は、適切な溶媒を用いて、適切な反応温度下で反応させた塩化エチルオキサリル、ピリジン及び触媒の DMA P である。上記プロセスに使用する適切な溶媒としては、テトラヒドロフラン (THF)、グリムなどのエーテル；アセトニトリル (CH_3CN)；塩化メチレン (CH_2Cl_2)、クロロホルム ($CHCl_3$) などの塩素系溶媒などが挙げられたが、これらだけに限定されなかった。必要に応じて、これらの溶媒の混合物を使用した。好ましい溶媒は THF であった。上記プロセスを約 0 から約 100 の温度で実施することができる。好ましくは、反応を 70 で実施した。本発明の化合物を生成する上記プロセスを好ましくはほぼ大気圧で実施したが、必要に応じてそれよりも高い圧力や低い圧力も使用した。実質的には、等モルの反応物を好ましく使用したが、必要に応じてそれよりも多量や少量も使用した。当業者は、式 VII の化合物である N-アシル化アミノ酸が、一般に市販されていること、又はアミノ酸前駆体を適切なアシル化剤で処理することによって一般に合成できることを認識しているはずである (Larock, R. C. Comprehensive Organic Transformations, 2nd ed.; Wiley and Sons: New York, 1999, pp 1941-1949) に見出すことができる。当業者は、アミノ酸前駆体が一般に市販されていること、又はアミノ酸の公知の Strecker 合成などの従来法によって調製できることも認識しているはずである (March, Advanced Organic Chemistry: Reactions, Mechanisms, and Structure, 4th ed.; Wiley and Sons: New York, 1992, pp 965)。当業者は、式 VII のラセミの又は鏡像異性的に豊富なアミノ酸及び/又は誘導体を使用できることを認識しているはずである。

20

30

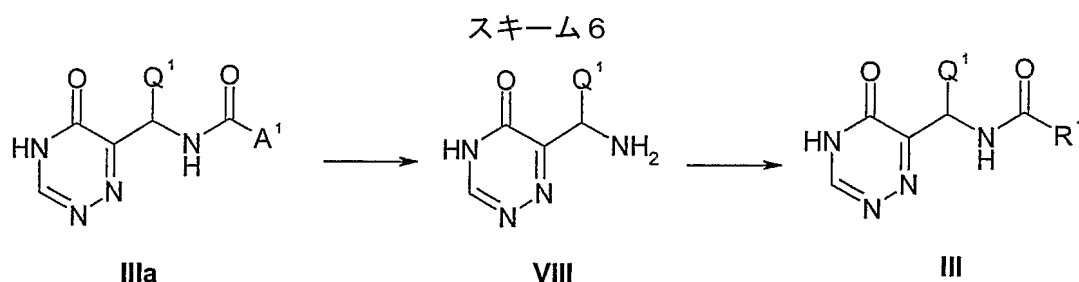
【0444】

スキーム 2 の式 III の化合物を以下のスキーム 6 に示すように調製することができる。

【0445】

40

【化29】



【0446】

50

式中、 Q^1 及び R^1 は式 I の化合物に対して先に定義した通りであり、 $A^1 - C = O$ は適切な反応条件下で除去可能なアシル基である。

【0447】

式 III の化合物の典型的な調製においては、適切な溶媒中で適切な温度で除去するのに適切な条件下で式 III a の化合物を処理して式 V III の化合物を生成することができる。上記プロセスに使用するのに適切な条件としては、水中での HCl などの加水分解条件下での、又は水中の NaOH などの塩基性条件下での式 III a の化合物の処理などが挙げられるが、これらだけに限定されない。上記プロセスに使用するのに適切な溶媒としては、ジメチルホルムアミド (DMF) ; メタノール、エタノール、イソプロパノール、トリフルオロエタノールなどのアルコール ; テトラヒドロフラン (THF)、グリムなどのエーテル ; アセトニトリル (CH_3CN)、 H_2O などが挙げられるが、これらだけに限定されなかった。必要に応じて、これらの溶媒の混合物を使用した。上記プロセスを約 -20 から約 100 の温度で実施することができる。好ましくは、反応を 22 から 80 で実施することができる。本発明の化合物を生成する上記プロセスは、好ましくはほぼ大気圧で実施することができるが、必要に応じてそれより高い圧力や低い圧力も使用することができる。実質的には、等モルの反応物を好ましく使用することができるが、必要に応じてそれよりも多い量や少ない量も使用することができる。式 III の化合物の典型的な調製においては、式 V III の化合物と適切なアシル化剤 (R^1CO_2H 又は R^1COCl) を適切なアミドカップリング条件下で反応させることができる。適切な条件としては、式 V III の化合物及び R^1CO_2H を、DMAP、HOBt、HOAt などと組み合わせた DCC、EDC などのカップリング試薬で処理すること、式 V III の化合物及び R^1COCl を DIEA などの塩基で処理することなどが挙げられるが、これらだけに限定されない。どちらの場合においても、上記プロセスに使用するのに適切な溶媒としては、テトラヒドロフラン (THF)、グリムなどのエーテル ; ジメチルホルムアミド (DMF) ; ジメチルスルホキシド (DMSO) ; アセトニトリル ; クロロホルム、塩化メチレンなどのハロゲン化溶媒などが挙げられたが、これらだけに限定されなかった。必要に応じて、これらの溶媒の混合物を使用した。上記プロセスを約 0 から約 80 の温度で実施することができる。本発明の化合物を生成する上記プロセスは、好ましくはほぼ大気圧で実施することができるが、必要に応じてそれより高い圧力や低い圧力も使用することができる。実質的には、等モルの反応物を好ましく使用することができるが、必要に応じてそれよりも多い量や少ない量も使用することができる。また、 RNH_2 を R^1CONHR に転化する他の適切な反応条件は、Larock, R. C. Comprehensive Organic Transformations, 2nd ed.; Wiley and Sons: New York, 1999, pp 1941 - 1949に見出すことができる。

【0448】

以下のスキーム 7 に示す式 I の化合物を調製するとき方法 B も使用した。

【0449】

方法 B :

【0450】

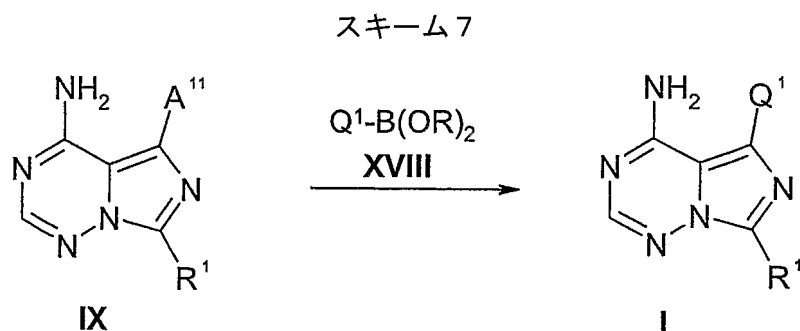
10

20

30

40

【化30】



10

【0451】

式中、 Q^1 及び R^1 は式 I の化合物に対して先に定義した通りであり、 $A^{11} = Cl, Br, I$ などのハロゲンであり、 $B(OR)_2 =$ 適切なボロン酸 / エステルである (式中、各 R は独立に C_{0-6} アルキルであり、又は各 R は独立に、これらが結合しているそれぞれの酸素原子と一緒に 5 から 15 員の飽和若しくは部分不飽和の環を形成し、前記環は 1 から 4 個の独立した C_{0-10} アルキル置換基で置換されていてもよい。)。

【0452】

式 I の化合物の典型的な調製においては、式 IX の化合物を式 XVIII の適切なボロン酸 / エステル ($Q^1 - B(OR)_2$) と適切な溶媒中で典型的な鈴木カップリング手順によって反応させた。式 XVIII の化合物は市販されていることもあり、又はハロゲン化アリール、ジボランなどの適切な試薬から文献の手順によって調製することができる。例として、2 - フルオロ - 3 - ベンジルオキシフェニルボロン酸ピナコールエステルを参照されたい。上記プロセスに使用するのに適切な溶媒としては、水、テトラヒドロフラン (THF)、グリムなどのエーテル; ジメチルホルムアミド (DMF); ジメチルスルホキシド (DMSO); アセトニトリル; メタノール、エタノール、イソプロパノール、トリフルオロエタノールなどのアルコール; 塩化メチレン (CH_2Cl_2)、クロロホルム ($CHCl_3$) などの塩素系溶媒などが挙げられたが、これらだけに限定されなかった。必要に応じて、これらの溶媒の混合物を使用した。好ましい溶媒はグリム / 水であった。上記プロセスを約 - 78 から約 120 の温度で実施した。好ましくは、反応を 80 から約 100 で実施した。本発明の化合物を生成する上記プロセスを好ましくはほぼ大気圧で実施したが、必要に応じてそれよりも高い圧力や低い圧力も使用した。実質的には、等モルの反応物を好ましく使用したが、必要に応じてそれよりも多い量や少ない量も使用した。当業者は、式 I の化合物を IX から調製するのに代替方法を適用できることを理解されたい。例えば、式 IX の化合物は、適切な有機スズ試薬 $Q^1 - SnBu_3$ などと適切な溶媒中で典型的な Stille カップリング手順によって反応させることができる。

20

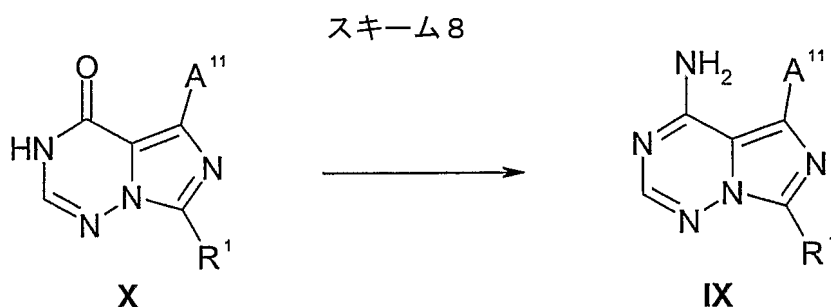
30

【0453】

スキーム7の式 XI の化合物を以下のスキーム8に示すように調製した。

【0454】

【化31】



50

【0455】

式中、 R^1 は式 I の化合物について先に定義した通りであり、 $A^{11} = Cl, Br, I$ などのハロゲンである。

【0456】

式 IX の化合物の典型的な調製においては、式 X の化合物をオキシ塩化リン ($POCl_3$)、トリアゾール及びピリジンと、続いてアンモニア (NH_3) と適切な溶媒中で反応させた。上記プロセスに使用するのに適切な溶媒としては、テトラヒドロフラン (THF)、グリムなどのエーテル；ジメチルホルムアミド (DMF)；ジメチルスルホキシド (DMSO)；アセトニトリル；メタノール、エタノール、イソプロパノール、トリフルオロエタノールなどのアルコール；塩化メチレン (CH_2Cl_2)、クロロホルム ($CHCl_3$) などの塩素系溶媒などが挙げられたが、これらだけに限定されなかった。必要に応じて、これらの溶媒の混合物を使用した。好ましい溶媒はイソプロパノールであった。上記プロセスを約 -20 から約 50 の温度で実施した。好ましくは、反応を 0 から約 25 で実施した。本発明の化合物を生成する上記プロセスを好ましくはほぼ大気圧で実施したが、必要に応じてそれよりも高い圧力や低い圧力も使用した。実質的には、等モルの反応物を好ましく使用したが、必要に応じてそれよりも多い量や少ない量も使用した。

10

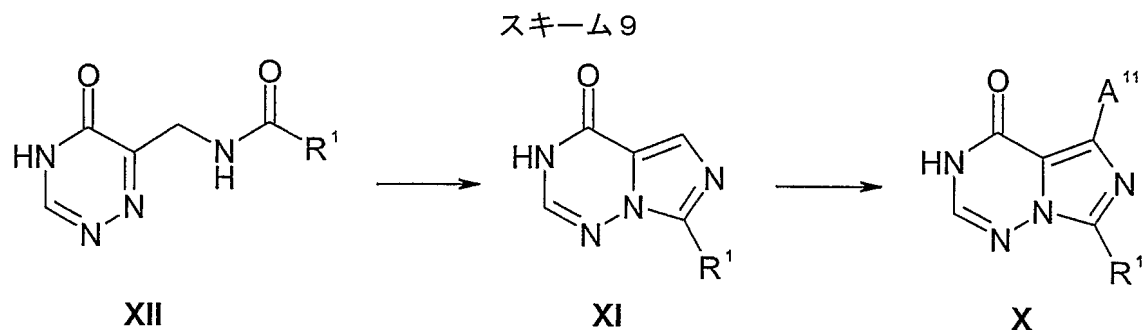
【0457】

スキーム 8 の式 X の化合物を以下のスキーム 9 に示すように調製した。

20

【0458】

【化32】



30

【0459】

式中、 R^1 は式 I の化合物について先に定義した通りであり、 $A^{11} = Cl, Br, I$ などのハロゲンである。

【0460】

式 X の化合物の典型的な調製においては、化合物 XII を式 XI の化合物に転化した。式 XII の化合物を適切な溶媒中で適切な反応温度でオキシ塩化リン ($POCl_3$) によって処理した。上記プロセスに使用するのに適切な溶媒としては、テトラヒドロフラン (THF)、グリムなどのエーテル；塩化メチレン (CH_2Cl_2)、クロロホルム ($CHCl_3$) などの塩素系溶媒；アセトニトリル (CH_3CN) などが挙げられたが、これらだけに限定されなかった。必要に応じて、これらの溶媒の混合物を使用した。好ましい溶媒はアセトニトリルであった。上記プロセスを約 -78 から約 120 の温度で実施した。好ましくは、反応を 40 から約 95 で実施した。本発明の化合物を生成する上記プロセスを好ましくはほぼ大気圧で実施したが、必要に応じてそれよりも高い圧力や低い圧力も使用した。式 XI の化合物を適切なハロゲン化剤と反応させて式 X の化合物を調製した。適切なハロゲン化剤としては、 Br_2 、 I_2 、 Cl_2 、N-クロロスクシンイミド、N-ブロモスクシンイミド、N-ヨードスクシンイミドなどが挙げられたが、これらだけに限定されなかった。好ましいハロゲン化剤は N-ヨードスクシンイミドであった。上記プロセスに使用するのに適切な溶媒としては、テトラヒドロフラン (THF)、グリムなどのエーテル；ジメチルホルムアミド (DMF)；ジメチルスルホキシド (DMSO)；アセトニトリル；メタノール、エタノール、イソプロパノール、トリフルオロエタノール

40

50

ルなどのアルコール；塩化メチレン（ CH_2Cl_2 ）、クロロホルム（ CHCl_3 ）などの塩素系溶媒などが挙げられたが、これらだけに限定されなかった。必要に応じて、これらの溶媒の混合物を使用した。好ましい溶媒はDMFであった。上記プロセスを約 - 78 から約 120 の温度で実施した。好ましくは、反応を 40 から約 75 で実施した。本発明の化合物を生成する上記プロセスを好ましくはほぼ大気圧で実施したが、必要に応じてそれよりも高い圧力や低い圧力も使用した。実質的には、等モルの反応物を好ましく使用したが、必要に応じてそれよりも多い量や少ない量も使用した。

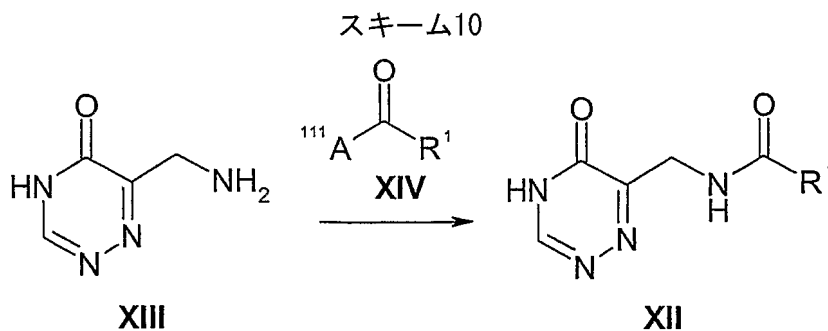
【0461】

スキーム9の式XIIの化合物を以下のスキーム10に示すように調製した。

【0462】

10

【化33】



20

【0463】

式中、 R^1 は式Iの化合物について先に定義した通りであり、 $\text{A}^{111} = \text{OH}$ 、アルコキシ、又はクロロ、イミダゾールなどの脱離基である。

【0464】

式XIIの化合物の典型的な調製においては、式XIIIの化合物と式XIVの化合物を適切なアミドカップリング条件下で反応させた。適切な条件としては、式XIII及びXIV（ $\text{A}^{111} = \text{OH}$ のとき）の化合物を、DMA P、HOBt、HOAtなどと組み合わせたDCC、EDCなどのカップリング試薬で処理することなどが挙げられるが、これらだけに限定されない。上記プロセスに使用する適切な溶媒としては、テトラヒドロフラン（THF）、グリムなどのエーテル；ジメチルホルムアミド（DMF）；ジメチルスルホキシド（DMSO）；アセトニトリル；クロロホルム、塩化メチレンなどのハロゲン化溶媒などが挙げられたが、これらだけに限定されなかった。必要に応じて、これらの溶媒の混合物を使用した。好ましい溶媒は塩化メチレンであった。上記プロセスを約 0 から約 80 の温度で実施した。好ましくは、反応を約 22 で実施した。本発明の化合物を生成する上記プロセスを好ましくはほぼ大気圧で実施したが、必要に応じてそれよりも高い圧力や低い圧力も使用した。実質的には、等モルの反応物を好ましく使用したが、必要に応じてそれよりも多い量や少ない量も使用した。或いは、式XIII及びXIV（式中、 $\text{A}^{111} = \text{Cl}$ 、 Br ）の化合物を、DMA Pなどと組み合わせたトリエチルアミン（TEA）、N,N'-ジイソプロピルエチルアミンなどの塩基と反応させた。このプロセスに使用する適切な溶媒としては、テトラヒドロフラン（THF）、グリムなどのエーテル；ジメチルホルムアミド（DMF）；ジメチルスルホキシド（DMSO）；アセトニトリル；ピリジン；クロロホルム、塩化メチレンなどのハロゲン化溶媒などが挙げられたが、これらだけに限定されなかった。必要に応じて、これらの溶媒の混合物を使用した。好ましい溶媒はDMFであった。上記プロセスを約 - 20 から約 40 の温度で実施した。好ましくは、反応を 0 から 25 で実施した。本発明の化合物を生成する上記プロセスを好ましくはほぼ大気圧で実施したが、必要に応じてそれよりも高い圧力や低い圧力も使用した。実質的に、式XIIIとXIV（式中、 $\text{A}^{111} = \text{Cl}$ 、 Br ）の化合物の等モル量及び塩基及びDMA Pの準化学量論的量を好ましくは使用したが、それよりも多い量や少ない量も必要に応じて使用した。また、アミン（式XIIIの化合物）をアミド（式XIIの化合物）に転化する他の適切な反応条件は、Larock, R.C.

30

40

50

Comprehensive Organic Transformations, 2nd ed.; Wiley and Sons: New York, 1999, pp 1941 - 1949に見出すことができる。

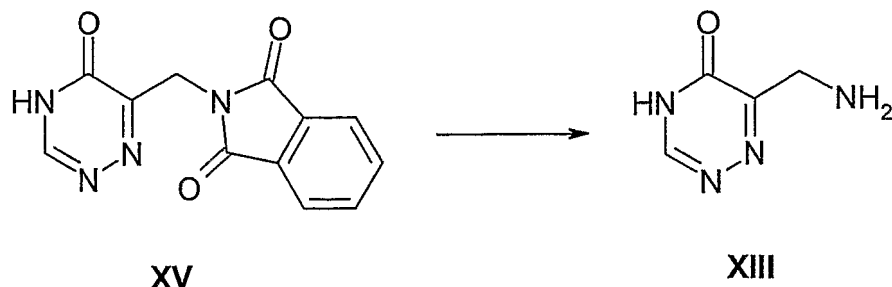
【0465】

スキーム10の式XIIIの化合物を以下のスキーム11に示すように調製した。

【0466】

【化34】

スキーム11



10

【0467】

式XIIIの化合物の典型的な調製においては、式XVの化合物を適切な反応条件下で適切な溶媒中で反応させた。適切な条件は、適切な溶媒中でヒドラジン又はアルキルヒドラジン誘導体で式XVの化合物を処理することを含む。上記プロセスに使用する適切な溶媒としては、テトラヒドロフラン（THF）、グリムなどのエーテル；ジメチルホルムアミド（DMF）；ジメチルスルホキシド（DMSO）；アセトニトリル；クロロホルム、塩化メチレンなどのハロゲン化溶媒；メタノール、エタノールなどのアルコール溶媒などが挙げられるた、これらだけに限定されなかった。必要に応じて、これらの溶媒の混合物を使用することができるが、好ましい溶媒はエタノール及び塩化メチレンであった。上記プロセスを約0 から約80 の温度で実施した。好ましくは、反応を約22 で実施した。本発明の化合物を生成する上記プロセスを好ましくはほぼ大気圧で実施したが、必要に応じてそれよりも高い圧力や低い圧力も使用した。実質的には、等モルの反応物を好ましく使用したが、必要に応じてそれよりも多い量や少ない量も使用した。

20

30

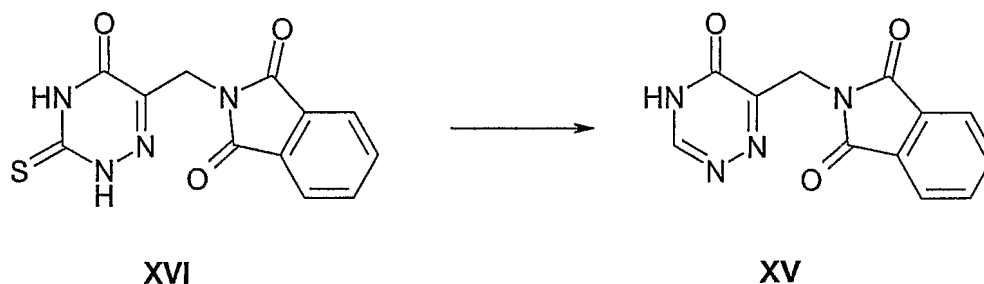
【0468】

スキーム11の式XVの化合物を以下のスキーム12に示すように調製した。

【0469】

【化35】

スキーム12



40

【0470】

式XVの化合物の典型的な調製においては、式XVIの化合物をラネーニッケルと適切な溶媒中で反応させた。上記プロセスに使用するのに適切な溶媒としては、テトラヒドロフラン（THF）、グリムなどのエーテル；ジメチルホルムアミド（DMF）；ジメチルスルホキシド（DMSO）；アセトニトリル（CH₃CN）；メタノール、エタノール、イソプロパノール、トリフルオロエタノールなどのアルコール；塩化メチレン（CH₂Cl₂）、クロロホルム（CHCl₃）などの塩素系溶媒などが挙げられたが、これらだけ

50

に限定されなかった。必要に応じて、これらの溶媒の混合物を使用した。好ましい溶媒はエタノールであった。上記プロセスを室温から約 100 の温度で実施することができる。好ましくは、反応を約 80 で実施した。本発明の化合物を生成する上記プロセスを好ましくはほぼ大気圧で実施したが、必要に応じてそれよりも高い圧力や低い圧力も使用した。実質的には、等モルの反応物を好ましく使用したが、必要に応じてそれよりも多い量や少ない量も使用した。また、式 X V の化合物は、式 X V I の化合物を適切な酸化剤と適切な溶媒中で反応させることによって調製することができる。適切な酸化剤としては、過酸化水素 (H₂O₂)、3-クロロペルオキシ安息香酸 (mCPBA) などが挙げられるが、これらだけに限定されない。上記プロセスに使用するのに適切な溶媒としては、T H F、グリムなどのエーテル；D M F；D M S O；C H₃ C N；ジメチルアセトアミド (D M A)；C H₂ C l₂、C H C l₃ などの塩素系溶媒などが挙げられたが、これらだけに限定されなかった。必要に応じて、これらの溶媒の混合物を使用した。好ましい溶媒は D M A であった。上記プロセスを約 0 から 100 の温度で実施することができる。好ましくは、反応をほぼ室温から 70 で実施した。本発明の化合物を生成する上記プロセスを好ましくはほぼ大気圧で実施したが、必要に応じてそれよりも高い圧力や低い圧力も使用した。実質的には、等モルの反応物を好ましく使用したが、必要に応じてそれよりも多い量や少ない量も使用した。

10

【0471】

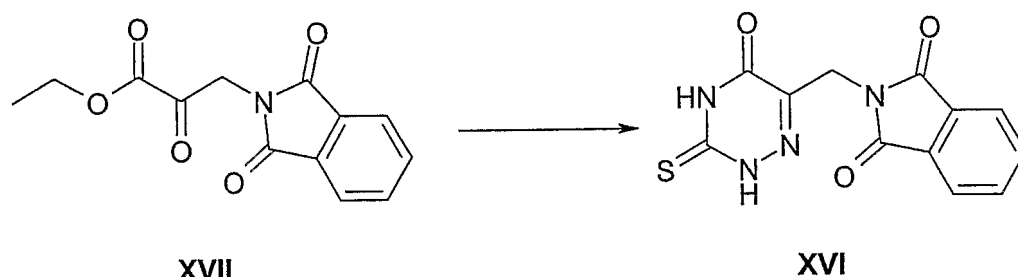
スキーム 12 の式 X V I の化合物を以下のスキーム 13 に示すように調製した。

20

【0472】

【化36】

スキーム13



30

【0473】

式 X V I の化合物の典型的な調製においては、式 X V I I の化合物をチオセミカルバジド及び適切な塩基と適切な溶媒中で反応させた。適切な塩基としては、トリエチルアミン、N, N' -ジイソプロピルエチルアミン (D I E A) などが挙げられるが、これらだけに限定されなかった。上記プロセスに使用するのに適切な溶媒としては、テトラヒドロフラン (T H F)、グリムなどのエーテル；ジメチルホルムアミド (D M F)；ジメチルアセトアミド (D M A)；ジメチルスルホキシド (D M S O)；アセトニトリル (C H₃ C N)；メタノール (M e O H)、エタノール (E t O H)、イソプロパノール (i - P r O H)、トリフルオロエタノールなどのアルコール；塩化メチレン (C H₂ C l₂)、クロロホルム (C H C l₃) などの塩素系溶媒などが挙げられたが、これらだけに限定されなかった。必要に応じて、これらの溶媒の混合物を使用した。好ましい溶媒はエタノールであった。上記プロセスを室温から約 100 の温度で実施することができる。好ましくは、反応を約 40 から 80 で実施した。本発明の化合物を生成する上記プロセスを好ましくはほぼ大気圧で実施したが、必要に応じてそれよりも高い圧力や低い圧力も使用した。実質的には、等モルの反応物を好ましく使用したが、必要に応じてそれよりも多い量や少ない量も使用した。式 X V I I の化合物は、文献の手順 Knutsen, Lars J. S. et. al, J. Chem. Soc. Perkin Trans 1: Organic and Bio-Organic Chemistry (1972 - 1999), 1984, 229 - 238 に従って調製することができる。

40

【0474】

50

ある状況においては、上記プロセスの1つにおいて改変された官能基と同一の置換基、又は同じ反応性を有する置換基は、所望の生成物を与え、かつ望ましくない副反応を回避するために、保護し、続いて脱保護しなければならないことを当業者は理解されたい。或いは、官能基の競合を回避するために、本発明で記載するプロセスのうち別のものを使用することができる。適切な保護基の例並びにその付加及び除去方法は、参考文献 "Protective Groups in Organic Syntheses", T. W. Greene and P. G. M. Wuts, John Wiley and Sons, 1989に見出すことができる。

【0475】

スキーム1から13を通して、 R^1 は、さらに改変することができる適切な官能基で置換することができる。例えば、式Iの化合物中の R^1 はシクロヘキシル-4-CO₂Meに等しい。続いて、4-CO₂Me官能基は、水素化アルミニウムリチウムなどの適切な還元剤で処理してCH₂OHに転化することができる。アルコールCH₂OHは、トシラート(CH₂OTs)、メシラート(CH₂OMs)などの適切な脱離基にさらに転化し、続いてジメチルアミンなどの適切な求核剤で置換してCH₂N(CH₃)₂を得ることができる。

10

【0476】

以下の実施例は、本発明の範囲を説明するものであって、限定するものではない。

【0477】

一般的実験情報：

20

融点は全てMel-Temp II装置によって測定し、未補正である。市販無水溶媒及びHPLC等級の溶媒をさらに精製せずに使用した。¹H NMR及び¹³C NMRスペクトルをVarian又はBrukerの機器(¹Hは400MHz、¹³Cは100.6MHz)を用いてTMS又は残留溶媒のピークを内部標準として周囲温度で記録した。線の位置又は多重項はppm()単位であり、結合定数(J)はヘルツ単位の絶対値である。¹H NMRスペクトルの多重度を以下の通り略記する：s(一重項)、d(二重項)、t(三重項)、q(四重項)、quint(五重項)、m(多重項)、mc(中心のある多重項(centered multiplet))、br(ブロード)、AA'BB'。¹³C NMRスペクトルのシグナル多重度をDEPT135パルスシーケンスを用いて測定し、以下の通り略記する：+(CH又はCH₃)、-(CH₂)、C quart(C)。LC/MS分析を、Hewlett Packard HP1100及びMicromass ZQ質量分析計又はHewlett Packard HP1050及びMicromass Platform II質量分析計に接続されたGilson 215自動試料採取装置及びGilson 819自動注入装置によって実施した。どちらの装置もXTEERRA MS C18 5µ 4.6×50mmカラムを用いて254nmで検出し、ポジティブモードのエレクトロスプレーイオン化を用いた。質量分離精製(MDP)にはWaters/Micromassシステムを使用した。

30

【0478】

下表に分析HPLCプログラムのための移動相勾配(溶媒A：アセトニトリル；溶媒B：0.01%ギ酸のHPLC水溶液)及び流量を示す。

40

【0479】

【表 1】

極性 5分

時間	A%	B%	流量 (mL/min) MicromassZQ	流量 (mL/min) Platform II
0.00	5	95	1.3	1.3
3.00	90	10	1.3	1.3
3.50	90	10	1.3	1.3
4.00	5	95	1.3	1.3
5.00	5	95	1.3	1.3

10

【0480】

【表 2】

非極性 5分

時間	A%	B%	流量 (mL/min) MicromassZQ	流量 (mL/min) Platform II
0.00	25	75	1.3	1.3
3.00	99	1	1.3	1.3
3.50	99	1	1.3	1.3
4.00	25	75	1.3	1.3
5.00	25	75	1.3	1.3

20

【実施例 1】

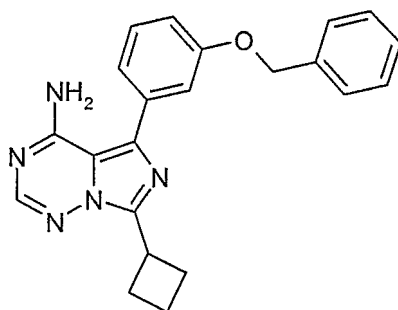
【0481】

5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - シクロブチル - イミダゾ [5, 1 - f] [1, 2, 4] トリアジン - 4 - イルアミン (R¹ = シクロブチル及び Q¹ = Ph - (3 - OBn) である式 I の化合物) を以下の通り調製した。

30

【0482】

【化 37】



40

【0483】

1, 2, 4 - トリアゾール (167 mg、2.417 mmol) の無水ピリジン (1.5 mL) 溶液にオキシ塩化リン (POCl₃) (75 μL、0.806 mmol) を添加し、室温で15分間攪拌した。この混合物に5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - シクロブチル - 3H - イミダゾ [5, 1 - f] [1, 2, 4] トリアジン - 4 - オン (100 mg、0.269 mmol) の無水ピリジン (2.5 mL) 溶液を3.5分間で滴下し、室温でさらに3時間攪拌した。反応物を0 に冷却し、2 M NH₃ の i - PrOH (10 mL) 溶液でクエンチし、室温でさらに30分間攪拌した。混合物をフリットの漏斗によつてろ過し、ろ液を減圧濃縮し、CHCl₃ と H₂O に分配し、分離させた。水

50

層を CHCl_3 で再抽出し(3×)、混合 CHCl_3 画分を塩水で洗浄し(1×)、 Na_2SO_4 を用いて脱水し、ろ過し、減圧濃縮し、粗製材料をシリカゲルクロマトグラフにかけると[2% MeOHの CHCl_3 溶液で溶出させて]、暗褐色オイルが生成した。このオイルをEtOAc/ヘキサンから結晶化させて標記化合物を淡褐色固体として得た。 $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 、400MHz) 1.95 - 2.08 (m、1H)、2.09 - 2.22 (m、1H)、2.39 - 2.50 (m、2H)、2.59 - 2.72 (m、2H)、4.14 (quint、 $J = 8.4\text{ Hz}$ 、1H)、5.16 (s、2H)、5.57 (brs、2H)、7.02 - 7.09 (m、1H)、7.22 - 7.28 (m、3H)、7.31 - 7.50 (m、5H)、7.85 (s、1H); MS (ES+): m/z 372.1 (100) [MH^+]; HPLC: $t_R = 3.05$ 分 (Micromass ZQ、非極性__5分)。

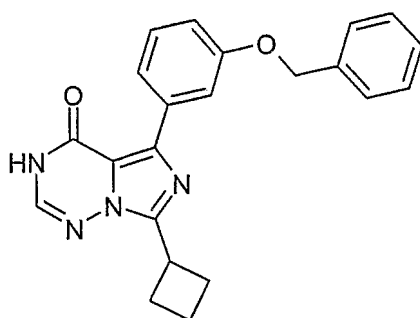
10

【0484】

5 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 7 - シクロブチル - 3H - イミダゾ [5, 1 - f] [1, 2, 4] トリアジン - 4 - オン ($R^1 = \text{シクロブチル}$ 及び $Q^1 = \text{Ph} - (3 - \text{OBn})$)である式IIの化合物)を以下の通り調製した。

【0485】

【化38】



20

【0486】

シクロブタンカルボン酸 [(3 - ベンジルオキシ - フェニル) - (5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - [1, 2, 4] トリアジン - 6 - イル) - メチル] - アミド (216 mg、0.553 mmol)の POCl_3 (5 mL)溶液を油浴中で55 に3時間加熱した。反応混合物を減圧濃縮し、0 に冷却し、わずかに塩基性になるまで2M NH_3 のi-PrOH溶液を充填した。溶液を減圧濃縮し、反応混合物をEtOAcと H_2O に分配し、分離させた。水層をEtOAcで再抽出し(3×)、混合EtOAc画分を Na_2SO_4 を用いて脱水し、ろ過し、減圧濃縮して、さらに精製せずに標記化合物をオフホワイトの泡状固体として得た。 $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 、400MHz) 1.98 - 2.07 (m、1H)、2.08 - 2.21 (m、1H)、2.36 - 2.48 (m、2H)、2.62 - 2.77 (m、2H)、4.09 (quint、 $J = 8.8\text{ Hz}$ 、1H)、5.13 (s、2H)、6.98 (dd、 $J = 2.0$ 、7.2 Hz、1H)、7.27 - 7.7.40 (m、4H)、7.42 - 7.49 (m、3H)、7.88 (d、 $J = 8.0\text{ Hz}$ 、1H)、7.99 (brs、1H); MS (ES+): m/z 373.1 (100) [MH^+]; HPLC: $t_R = 3.25$ 分 (Micromass ZQ、非極性__5分)。

30

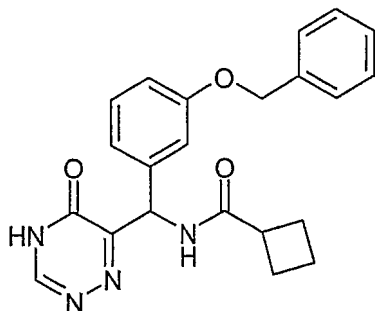
40

【0487】

シクロブタンカルボン酸 [(3 - ベンジルオキシ - フェニル) - (5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - [1, 2, 4] トリアジン - 6 - イル) - メチル] - アミド ($R^1 = \text{シクロブチル}$ 及び $Q^1 = \text{Ph} - (3 - \text{OBn})$)である式IIIの化合物)を以下の通り調製した。

【0488】

【化39】



10

【0489】

シクロブタンカルボン酸 [(4-アミノ-5-オキソ-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアジン-6-イル)-(3-ベンジルオキシ-フェニル)-メチル]-アミド (315 mg、0.777 mmol) と濃 HCl (344 μ L) の無水 EtOH (16 mL) 溶液に亜硝酸ナトリウム (120 mg、1.72 mmol) の H₂O (4 mL) 溶液を 0 で滴下し、30 分間攪拌し、室温にさらに 1.5 時間加温した。反応混合物を減圧濃縮し、粗製材料をシリカゲルクロマトグラフにかけて [3% MeOH の CHCl₃ 溶液で溶出させて] 標記化合物をオフホワイトの泡状固体として得た。¹H NMR (CDCl₃、400 MHz) 1.78 - 1.93 (m、1H)、1.93 - 2.04 (m、1H)、2.12 - 2.23 (m、4H)、3.13 (quint、J = 8.4 Hz、1H)、4.97 (s、2H)、6.35 (d、J = 8.8 Hz、1H)、6.85 (dd、J = 2.4、8.4 Hz、1H)、6.96 - 7.05 (m、2H)、7.20 (t、J = 8.0 Hz、1H)、7.27 - 7.41 (m、4H)、7.61 (br s、1H)、8.46 (s、1H); MS (ES⁺): m/z 391.04 (100) [MH⁺]; HPLC: t_R = 2.87 分 (Micromass ZQ、極性__5 分)。

20

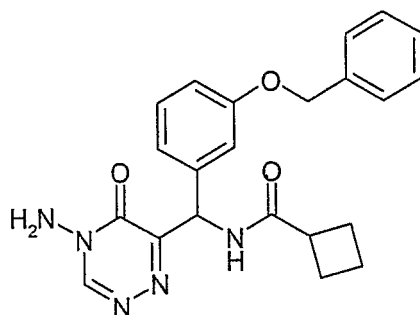
【0490】

シクロブタンカルボン酸 [(4-アミノ-5-オキソ-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアジン-6-イル)-(3-ベンジルオキシ-フェニル)-メチル]-アミド (R¹ = シクロブチル及び Q¹ = Ph-(3-OBn) である式 IV の化合物) を以下の通り調製した。

30

【0491】

【化40】



40

【0492】

ホルムアミジン HCl (163 mg、2.02 mmol) の無水 EtOH (8 mL) 溶液を 0 に冷却し、1 M ヒドラジンの THF (4.05 mL、4.05 mmol) 溶液を 4 分間充填し、室温で 8 分間攪拌した。反応混合物を -20 に冷却し、3-(3-ベンジルオキシ-フェニル)-3-(シクロブタンカルボニル-アミノ)-2-オキソ-プロピオン酸エチルエステル (800 mg、2.02 mmol) の無水 EtOH (16 mL) 溶液を 15 分間充填し、-20 でさらに 15 分間攪拌し、室温に 4 時間加温した。反応混合物を減圧濃縮し、粗製材料をシリカゲルクロマトグラフにかけて [3% MeOH の CHCl₃ 溶液で溶出させて] 標記化合物を淡黄色泡状固体として得た。¹H NMR (C

50

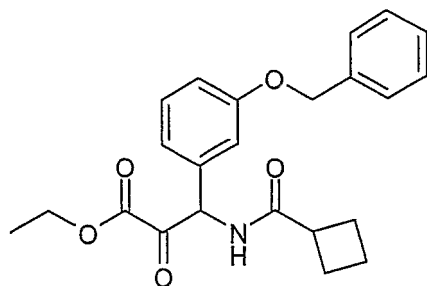
DCI₃、400MHz) 1.78 - 2.04 (m、2H)、2.08 - 2.34 (m、4H)、3.07 (quint、J = 8.4 Hz、1H)、4.92 (s、2H)、5.03 (s、1H)、6.49 (d、J = 8.0 Hz、1H)、6.84 - 6.92 (m、1H)、6.95 - 7.10 (m、3H)、7.23 (t、J = 8.0 Hz、1H)、7.28 - 7.46 (m、4H)、8.42 (s、1H); MS (ES+): m/z 406.08 (100) [MH⁺]; HPLC: t_R = 3.04分 (Micromass ZQ、極性__5分)。

【0493】

3 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 3 - (シクロブタンカルボニル - アミノ) - 2 - オキソ - プロピオン酸エチルエステル (R¹ = シクロブチル及び Q¹ = Ph - (3 - OBn) である式 V の化合物) を以下の通り調製した。

【0494】

【化41】



【0495】

(3 - ベンジルオキシ - フェニル) - (シクロブタンカルボニル - アミノ) - 酢酸 (4.77 g、14.1 mmol)、ピリジン (3.4 mL、42.2 mmol) 及び DMA P (触媒) の無水 THF (26 mL) スラリーにクロロ - オキソ - 酢酸エチルエステル (3.13 mL、28.1 mmol) を滴下し、1.5 時間加熱還流させた。白色沈殿物をフリットガラスのブフナー漏斗によって H₂O 及び EtOAc を含むフラスコにろ過し、水相を有機相から分離した。水溶液を EtOAc で洗浄し (3x)、混合 EtOAc 層を塩水で洗浄し (1x)、Na₂SO₄ を用いて脱水し、ろ過し、減圧濃縮すると、黄色 / オレンジ色のオイルが生成した。オイルを無水 EtOH (28 mL) に溶解し、21 wt % ナトリウムエトキシド (NaOEt) の EtOH (2.0 mL) 溶液を 0 で添加し、室温に加温した。反応混合物を減圧濃縮し、粗製材料をシリカゲルクロマトグラフにかけて [2% EtOAc の CHCl₃ 溶液で溶出させて] 標記化合物を淡黄色オイルとして得た。¹H NMR (CDCl₃、400MHz) 1.26 (t、J = 7.2 Hz、3H)、1.80 - 2.04 (m、2H)、2.09 (m、4H)、3.06 (quint、J = 8.4 Hz、1H) 4.17 - 4.30 (m、2H)、5.04 (s、2H)、6.18 - 6.32 (m、2H)、6.86 - 7.00 (m、3H)、7.22 - 7.48 (m、5H); MS (ES+): m/z 396.03 (100) [MH⁺]; HPLC: t_R = 3.09分 (Micromass ZQ、非極性__5分)。

【実施例2】

【0496】

5 - (3 - ベンジルオキシ - 2 - フルオロ - フェニル) - 7 - シクロブチル - イミダゾ [5, 1 - f] [1, 2, 4] トリアジン - 4 - イルアミン (R¹ = シクロブチル及び Q¹ = 2 - フルオロ - Ph - (3 - OBn) である式 I の化合物) を以下の通り調製した。

【0497】

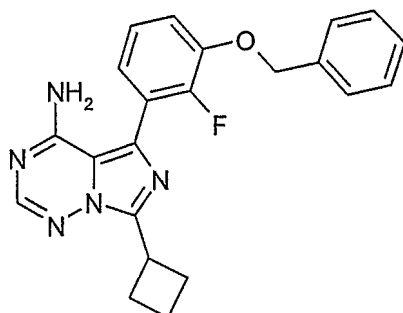
10

20

30

40

【化42】



10

【0498】

フラスコに7-シクロブチル-5-ヨード-イミダゾ[5,1-f][1,2,4]トリアジン-4-イルアミン(30mg、0.095mmol)、2-(3-ベンジルオキシ-2-フルオロ-フェニル)-4,4,5,5-テトラメチル[1,3,2]ジオキサボロラン(62.5mg、0.158mmol)及び炭酸ナトリウム(30mg、0.286mmol)を充填し、排気し、N₂を充填した(3x)。この混合物にテトラキス(トリフェニルホスフィンパラジウム(0))(Pd(PPh₃)₄(0))(36mg、0.0318mmol)を充填し、管を再排気し、N₂を充填した(2x)。次いで、この混合物に、あらかじめ脱気した溶媒DME/H₂O(5:1)(3mL)を充填し、75

に16時間加熱した。反応混合物を減圧濃縮し、MeOH/CH₃CN(1:1)(5

mL)に溶解し、0.45µMフリットautovialによる過し、質量分離精製(MDP)にかけると、標記化合物が白色固体として生成した。¹H NMR(DMSO-d₆ 400MHz) 1.86-1.98(m, 1H)、2.00-2.14(m, 1H)、2.30-2.41(m, 2H)、2.41-2.48(m, 2H)、3.98-4.09(m, 1H)、5.24(s, 2H)、6.27(brs, 1H)、7.05-7.12(m, 1H)、7.22(t, J=8.27Hz, 1H)、7.29-7.52(m, 6H)、7.88(s, 1H)、8.15(brs, 1H); MS(ES⁺): m/z 389.98(100), [MH⁺], HPLC: t_R=3.44分(Micromass ZQ、極性_5分)。

20

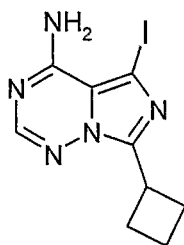
【0499】

7-シクロブチル-5-ヨード-イミダゾ[5,1-f][1,2,4]トリアジン-4-イルアミン(R¹=シクロブチル及びA¹¹=ヨウ素である式IXの化合物)を以下の通り調製した。

30

【0500】

【化43】



40

【0501】

1,2,4-トリアゾール(1.28g、18.59mmol)の無水ピリジン(10mL)溶液にオキシ塩化リン(POCl₃)(0.578mL、6.20mmol)を添加し、室温で15分間攪拌した。この混合物に7-シクロブチル-5-ヨード-3Hイミダゾ[5,1-f][1,2,4]トリアジン-4-オン(0.653mg、2.07mmol)の無水ピリジン(14mL)溶液を(3.5分間)滴下し、1.5時間攪拌した。反応混合物を0℃に冷却し、2M NH₃のイソプロパノール(i-PrOH)溶液で塩

50

基性になるまでクエンチし、次いで室温に昇温し、さらに2時間撹拌した。反応混合物をフリットのブフナー漏斗によつてろ過し、 CH_2Cl_2 で洗浄した。ろ液を減圧濃縮し、シリカゲルクロマトグラフィーによつて[30% EtOAcの CH_2Cl_2 溶液で溶出させて]精製すると、標記化合物がオフホワイト固体として生成した。 ^1H NMR (CDCl_3 、400 MHz) 1.93 - 2.04 (m、1H)、2.05 - 2.18 (m、1H)、2.35 - 2.45 (m、2H)、2.49 - 2.62 (m、2H)、4.00 - 4.12 (m、1H)、7.82 (s、1H); MS (ES+): m/z 316.08 (100) [MH^+], HPLC: t_R = 2.59分 (Micromass ZQ、極性__5分)。

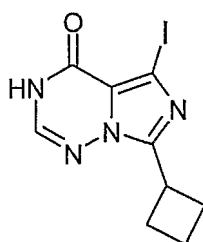
【0502】

10

7-シクロブチル-5-ヨード-3H-イミダゾ[5,1-f][1,2,4]トリアジン-4-オン (R^1 = シクロブチル及び A^{11} = ヨウ素である式Xの化合物)を以下の通り調製した。

【0503】

【化44】



20

【0504】

7-シクロブチル-3H-イミダゾ[5,1-f][1,2,4]トリアジン-4-オン (789 mg、4.15 mmol) と N-ヨードスクシンイミド (933 mg、4.15 mmol) の無水DMF (40 mL) 溶液を室温で終夜撹拌した。N-ヨードスクシンイミドをさらに4当量添加し、反応物を55℃に6時間加熱した。反応混合物を減圧濃縮し、 CH_2Cl_2 と H_2O に分配し、分離させた。水層を CH_2Cl_2 で洗浄し(3×)、混合有機画分を1Mチオ硫酸ナトリウム ($\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_3$) (1×)、塩水(1×)で洗浄し、硫酸ナトリウム (Na_2SO_4) を用いて脱水し、ろ過し、減圧濃縮した。固体を20% EtOAcのDCM溶液を用いてすり潰し、フリットのブフナー漏斗によつてろ過すると、標記化合物がオフホワイト固体として生成した。 ^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$ 、400 MHz) 1.84 - 1.96 (m、1H)、1.98 - 2.13 (m、1H)、2.25 - 2.43 (m、4H)、3.84 - 3.96 (m、1H)、7.87 (s、1H); MS (ES+): m/z 317.02 (100) [MH^+], HPLC: t_R = 2.62分 (Micromass ZQ、極性__5分)。

30

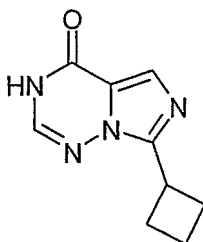
【0505】

7-シクロブチル-3H-イミダゾ[5,1-f][1,2,4]トリアジン-4-オン (R^1 = シクロブチルである式XIの化合物)を以下の通り調製した。

【0506】

40

【化45】



【0507】

50

シクロブタンカルボン酸(5-オキソ-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアジン-6-イルメチル)-アミド(1.33g、6.39mmol)のオキシ塩化リン(POCl_3)(10mL)溶液を55に加熱した。反応物を2時間加熱し、次いで減圧濃縮し、粗製オイルを氷浴で0に冷却し、わずかに塩基性になるまで2M NH_3 のイソプロパノール(*i*-PrOH)溶液でクエンチした。この粗製反応混合物を減圧濃縮し、 CH_2Cl_2 と H_2O に分配し、分離させた。水層を CH_2Cl_2 で抽出し(3x)、混合有機画分を硫酸ナトリウム(Na_2SO_4)を用いて脱水し、ろ過し、減圧濃縮した。粗製材料をシリカゲルクロマトグラフィーによって[5%MeOHの CH_2Cl_2 溶液で溶出させて]精製すると、標記化合物がオフホワイト固体として生成した。 ^1H NMR($\text{DMSO}-d_6$, 400MHz) 1.86-1.96(m, 1H)、2.00-2.13(m, 1H); 2.26-2.46(m, 4H); 3.87-4.00(m, 1H); 7.71(s, 1H); 7.87(d, $J=3.6\text{Hz}$, 1H); 11.7(br s, 1H); MS(ES+): m/z 191.27(100) [MH^+], HPLC: $t_R=2.06$ 分(Micromass ZQ、極性__5分)。

10

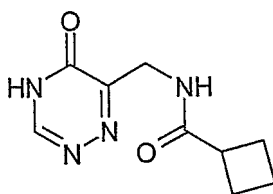
【0508】

シクロブタンカルボン酸(5-オキソ-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアジン-6-イルメチル)-アミド(R^1 =シクロブチルである式XIIの化合物)を以下の通り調製した。

【0509】

【化46】

20



【0510】

6-アミノメチル-4H-[1,2,4]トリアジン-5-オン(500mg、3.96mmol)とN,N'-ジイソプロピルエチルアミン(DIEA)(0.829mL、4.76mmol)の無水N,N'-ジメチルホルムアミド(DMF)(20mL)と無水ピリジン(2mL)の溶液に、塩化シクロブタンカルボニル(0.451mL、3.96mmol)を0で滴下し、次いで室温に加熱し、さらに1.5時間攪拌した。反応混合物を H_2O (2mL)でクエンチし、減圧濃縮し、シリカゲルクロマトグラフィーによって[5%MeOHの CH_2Cl_2 (200mL)溶液10%MeOHの CH_2Cl_2 (800mL)溶液で溶出させて]精製して、標記化合物を得た。 ^1H NMR($\text{DMSO}-d_6$, 400MHz) 1.7-1.82(m, 1H)、1.70-1.92(m, 1H); 1.97-2.07(m, 2H); 2.07-2.19(m, 2H); 3.55-3.67(m, 1H); 4.19(d, 2H); 7.97(br t, $J=5.6\text{Hz}$, 1H); 8.67(s, 1H); MS(ES+): m/z 209.25(100) [MH^+], HPLC: $t_R=1.56$ 分(Micromass ZQ、極性__5分)。

30

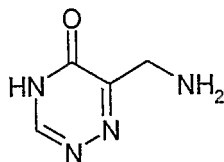
40

【0511】

6-アミノメチル-4H-[1,2,4]トリアジン-5-オン(式XIIIの化合物)を以下の通り調製した。

【0512】

【化47】



【0513】

2-(5-オキソ-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアジン-6-イルメチル)-イソインドール-1,3-ジオン(4g、15.6mmol)のCH₂Cl₂/EtOH(1:1)(150mL)スラリーに無水ヒドラジン(1.23mL、39.0mmol)を充填し、室温で18時間攪拌した。反応混合物を減圧濃縮し、オフホワイト固体を暖かいCHCl₃を用いてすり潰し、フリットの漏斗によってろ過した。次いで、固体を熱いメタノール(MeOH)を用いてすり潰し、フリットの漏斗によってろ過すると、オフホワイト固体が生成した。材料を前の通りにすり潰し、終夜乾燥させると標記化合物が白色固体として生成した。これを次の段階にさらに精製せずに使用した。¹H NMR(DMSO-d₆、400MHz) 3.88(s、2H)、8.31(2、1H); MS(ES+): m/z 127.07(100)[MH⁺], HPLC: t_R = 0.34分(Micromass ZQ、極性__5分)。

10

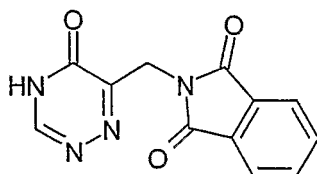
【0514】

2-(5-オキソ-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアジン-6-イルメチル)-イソインドール-1,3-ジオン(式XVの化合物)を以下の通り調製した。

20

【0515】

【化48】



30

【0516】

2-(5-オキソ-3-チオキソ-2,3,4,5-テトラヒドロ-[1,2,4]トリアジン-6-イルメチル)-イソインドール-1,3-ジオン(1.0g、3.47mmol)のEtOH(40mL)スラリーに過剰のラネーニッケル(3スパチュラ)を充填し、2時間加熱還流させた。反応混合物を小さなセライトパッドによって加温ろ過し、EtOH/THF(1:1)(100mL)の熱い混合物で洗浄し、ろ液を減圧濃縮すると、標記化合物がオフホワイト固体として生成した。¹H NMR(DMSO-d₆、400MHz) 4.75(s、2H)、7.84-7.98(m、4H)、8.66(s、1H); MS(ES+): m/z 257.22(100)[MH⁺], HPLC: t_R = 2.08分(Micromass ZQ、極性__5分)。

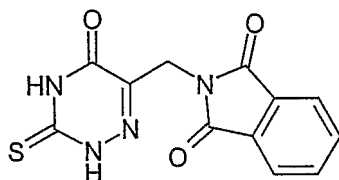
40

【0517】

2-(5-オキソ-3-チオキソ-2,3,4,5-テトラヒドロ-[1,2,4]トリアジン-6-イルメチル)-インダン-1,3-ジオン(式XVIの化合物)を以下の通り調製した。

【0518】

【化49】



【0519】

3 - (1 , 3 - ジオキソ - 1 , 3 - ジヒドロ - イソインドル - 2 - イル) - 2 - オキソ - プロピオン酸エチルエステル (20 g、76.6 mmol) の無水 EtOH (300 mL) スラリーにチオセミカルバジド (6.98 g、76.6 mmol) を一括充填し、80 に2時間加熱した。反応混合物に N , N' - ジイソプロピルエチルアミン (DIEA) (26.7 mL、76.56 mmol) を充填し、40 に6時間加熱し、次いで室温でさらに10時間撹拌した。反応混合物を減圧濃縮し、ろ過した熱い EtOH / EtOAc を用いて固体をすり潰し、EtOAc で洗浄した。固体を減圧乾燥機 (40) で終夜乾燥させると標記化合物がオフホワイト固体として生成した。¹H NMR (DMSO - d₆、400 MHz) 4.68 (s、2H)、7.85 - 7.95 (m、4H) ; MS (ES+) : m/z 289.2 (100) [MH⁺]、HPLC : t_R = 2.50 分 (Micromass ZQ、極性__5分)。

10

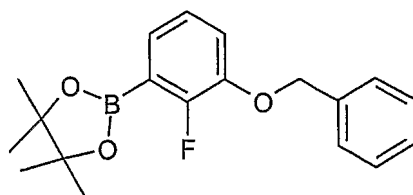
【0520】

2 - フルオロ - 3 - ベンジルオキシフェニルボロン酸ピナコールエステル (Q¹ = 2 - フルオロ - Ph である式 XVII I の化合物) を以下の通り調製した。

20

【0521】

【化50】



30

【0522】

1 - (ベンジルオキシ) - 3 - クロロ - 2 - フルオロベンゼン (7.1 g、30.0 mmol)、ビス (ピナコール) ジボロン (9.142 g、36.0 mmol)、酢酸パラジウム (II) (0.337 g、1.50 mmol)、酢酸カリウム (7.711 g、78.6 mmol) 及び塩化 1 , 3 - ビス (2 , 6 - ジイソプロピルフェニル) イミダゾリウム (0.9 g、2.12 mmol) の混合物の THF 溶液を窒素下で終夜還流させた。混合物を酢酸エチル (100 mL)、塩水 (30 mL) で希釈し、次いでセライトに通してろ過した。次いで、黄色液体を分離し、有機層を無水硫酸ナトリウムを用いて脱水した。液体を減圧下で濃縮すると灰色固体が生成した。これをヘキサンから再結晶させて標記化合物を白色粉末として得た。¹H NMR (CDCl₃、400 MHz) 1.37 (s、12Hs)、5.18 (s、2H)、7.04 - 7.18 (m、2Hs)、7.27 - 7.47 (m、6H)。

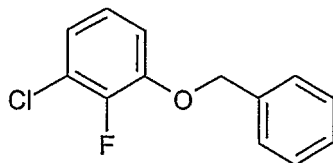
40

【0523】

1 - (ベンジルオキシ) - 3 - クロロ - 2 - フルオロベンゼン

【0524】

【化 5 1】



【 0 5 2 5 】

3 - クロロ - 2 - フルオロフェノール (1 . 5 g 、 1 0 . 2 m m o l) 、 臭化ベンジル (1 . 7 1 g 、 1 0 . 0 m m o l) 及び炭酸ナトリウム (1 . 1 0 g 、 1 0 . 3 8 m m o l) の混合物のエチレングリコールジメチルエーテル 2 0 m L と H₂O 1 0 m L の溶液を室温で 3 6 時間攪拌した。反応混合物に 1 N KOH 2 0 m L 及びジエチルエーテル 5 0 m L を充填した。有機層を分離し、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムを用いて脱水し、減圧濃縮して、標記化合物を白色固体として得た。これをさらに精製せずに使用した。¹H NMR (C D C l₃ 、 4 0 0 M H z) 5 . 1 6 (s 、 2 H s) 6 . 8 6 - 7 . 0 3 (m 、 3 H s) 7 . 3 1 - 7 . 4 8 (m 、 5 H s) 。

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		national Application No PCT/US2005/025891
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER C07D487/04 A61K31/53 A61P35/00		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D A61K A61P		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) EPO-Internal, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No
E	WO 2005/097800 A (OSI PHARMACEUTICALS, INC; ARNOLD, LEE, D; CESARIO, CARA; COATE, HEATHE) 20 October 2005 (2005-10-20) abstract, pages 510-511; claim 1, 241	1-144
A	WO 2004/005291 A (BAYER HEALTHCARE AG; HENDRIX, MARTIN; BRUECKNER, DAVID; FRIEDL, ARNO;) 15 January 2004 (2004-01-15) abstract; claims 1,8	1,134
A	WO 2004/005290 A (BAYER HEALTHCARE AG; HENDRIX, MARTIN; BRUECKNER, DAVID; FRIEDL, ARNO;) 15 January 2004 (2004-01-15) abstract; claims 1,8	1,134
----- -/--		
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of box C. <input checked="" type="checkbox"/> Patent family members are listed in annex		
* Special categories of cited documents "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance, the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
4 January 2006		16/01/2006
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P B 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel (+31-70) 340-2040, Tx 31 651 epo nl, Fax (+31-70) 340-3016		Authorized officer Rufet, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

national Application No
PCT/US2005/025891

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 01/72751 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; HIRST, GAVIN, C; CALDERWOOD, DAVID; MUNSCHAUE) 4 October 2001 (2001-10-04) abstract -----	1,134
A	WO 2004/056830 A (PFIZER PRODUCTS INC; ARCARI, JOEL, THOMAS; CHEN, JINSHAN; LAGRECA, SUS) 8 July 2004 (2004-07-08) abstract -----	1,134

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/US2005/025891**Box II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)**

This International Search Report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

Although claims 113-139, 143 and 144 are directed to a method of treatment of the human/animal body, the search has been carried out and based on the alleged effects of the compound/composition.
2. Claims Nos.:
because they relate to parts of the International Application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful International Search can be carried out, specifically:
3. Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple Inventions in this international application, as follows:

1. As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers all searchable claims.
2. As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this International Search Report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
- No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/US2005/025891

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2005097800 A	20-10-2005	NONE	
WO 2004005291 A	15-01-2004	AU 2003245984 A1 CA 2491921 A1 DE 10230604 A1 EP 1521756 A1	23-01-2004 15-01-2004 29-01-2004 13-04-2005
WO 2004005290 A	15-01-2004	AU 2003238043 A1 CA 2491500 A1 DE 10230605 A1 EP 1599479 A1	23-01-2004 15-01-2004 29-01-2004 30-11-2005
WO 0172751 A	04-10-2001	AU 4057000 A	08-10-2001
WO 2004056830 A	08-07-2004	AU 2003286317 A1 BR 0317524 A CA 2510853 A1 EP 1578751 A1 NL 1025068 C2 NL 1025068 A1	14-07-2004 16-11-2005 08-07-2004 28-09-2005 16-11-2004 22-06-2004

フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I	テーマコード(参考)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)	A 6 1 P 9/00	
A 6 1 P 37/00 (2006.01)	A 6 1 P 29/00	
A 6 1 P 1/04 (2006.01)	A 6 1 P 37/00	
A 6 1 P 31/22 (2006.01)	A 6 1 P 1/04	
A 6 1 P 31/12 (2006.01)	A 6 1 P 31/22	
A 6 1 P 31/18 (2006.01)	A 6 1 P 31/12	
A 6 1 P 31/04 (2006.01)	A 6 1 P 31/18	
A 6 1 P 33/02 (2006.01)	A 6 1 P 31/04	
A 6 1 P 19/04 (2006.01)	A 6 1 P 33/02	
A 6 1 P 1/16 (2006.01)	A 6 1 P 19/04	
A 6 1 P 5/14 (2006.01)	A 6 1 P 1/16	
A 6 1 P 11/00 (2006.01)	A 6 1 P 5/14	
A 6 1 P 17/02 (2006.01)	A 6 1 P 11/00	
A 6 1 P 11/06 (2006.01)	A 6 1 P 17/02	
A 6 1 P 9/10 (2006.01)	A 6 1 P 11/06	
A 6 1 P 15/00 (2006.01)	A 6 1 P 9/10	
A 6 1 P 7/06 (2006.01)	A 6 1 P 15/00	
A 6 1 P 27/02 (2006.01)	A 6 1 P 7/06	
	A 6 1 P 27/02	

(81)指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), EP(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW

(74)代理人 100103920

弁理士 大崎 勝真

(74)代理人 100124855

弁理士 坪倉 道明

(72)発明者 クルー, アンドリユー・ファイリツブ

アメリカ合衆国、ニュー・ヨーク・1 1 7 3 5、ファーマーミングデール、バイオサイエンス・パーク・ドライブ・1

(72)発明者 マルビヒル, マーク・ジョセフ

アメリカ合衆国、ニュー・ヨーク・1 1 7 3 5、ファーマーミングデール、バイオサイエンス・パーク・ドライブ・1

(72)発明者 ワーナー・ダグラス・スコット

アメリカ合衆国、ニュー・ヨーク・1 1 7 3 5、ファーマーミングデール、バイオサイエンス・パーク・ドライブ・1

Fターム(参考) 4C050 AA01 BB05 CC07 EE04 FF05 GG04 HH01

4C086 AA01 AA03 CB05 MA01 MA04 NA14 ZA01 ZA33 ZA36 ZA45

ZA59 ZA68 ZA75 ZA89 ZA96 ZB02 ZB15 ZB26 ZB33 ZB35

ZB38 ZC06 ZC20 ZC35