

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成21年9月10日 (2009.9.10)

【公表番号】特表2009-502801 (P2009-502801A)

【公表日】平成21年1月29日 (2009.1.29)

【年通号数】公開・登録公報2009-004

【出願番号】特願2008-522958 (P2008-522958)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 487/16 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 37/04 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 487/04 1 4 2

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 487/16 C S P

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 37/04

A 6 1 P 29/00

A 6 1 K 45/00

【手続補正書】

【提出日】平成21年7月21日 (2009.7.21)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

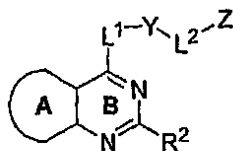
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

構造：

【化 1】

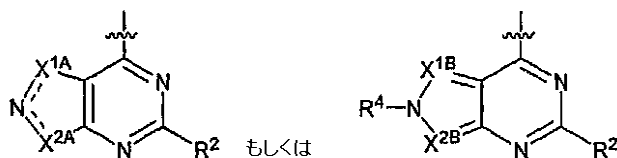


(I)

を有する単離された化合物、またはその医薬上許容される誘導体であり、

A ~ B は共に、以下の構造：

【化 2 - 1】



のうちの 1 つを表し、ここで、

【化 2 - 2】

のうちの 1 つは、原子価が許容する二重結合であり；

R² は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、または脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、芳香族もしくはヘテロ芳香族成分であり；

R⁴ は、水素、または脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、芳香族もしくはヘテロ芳香族成分であり；

X^{1A} は、NR¹ もしくは -C(R^{X1})- (式中、R¹ は L¹ 上に存在する成分と共に任意に置換された複素環を形成し得る) であり；

X^{2A} は NR³ もしくは -C(R^{X1})- (式中、X^{1A} および X^{2A} のうちの一方は -C(R^{X1})- であるが、両方ではない) であり；

X^{1B} および X^{2B} は -N- もしくは -C(R^{X1})- (式中、X^{1B} および X^{2B} のうちの一方は -C(R^{X1})- であるが、両方ではなく；

R¹ および R³ は、独立して水素、窒素保護基、または脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、芳香族もしくはヘテロ芳香族成分であり；R^{X1} は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、または脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、芳香族もしくはヘテロ芳香族成分であり；

L¹ は、ヘテロ脂肪族主鎖内に少なくとも 1 つの N、O もしくは S 原子を有する 2 ~ 8 原子のヘテロ脂肪族リンカーであり；

L² は、ヘテロ脂肪族主鎖内に少なくとも 1 つの N 原子を有する 1 ~ 6 原子のヘテロ脂肪族リンカーであり；

Y は、脂環式、ヘテロ脂環式、芳香族もしくはヘテロ芳香族成分であり；そして

Z は、脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、芳香族もしくはヘテロ芳香族成分であり；

ただし、R¹、R³、R⁴ もしくは R^{X1} の不在は Q¹、Q² もしくは Q³ であり、ここで、

Q^1 は、 $-(CR^1AR^1B)_mC-C-(CR^1AR^1B)_tR^1C$ 、 $-(CR^1AR^1B)_mC=C-(CR^1AR^1B)_tR^1C$ 、 $-C=NOR^1D$ 、もしくは $-X^3R^1D$ （式中、 m は0～3の整数であり、 t は0～5の整数であり、および X^3 はアゼチジン、オキセタンもしくは C_{3-4} 炭素環基に由来する二価基である）であり；

Q^2 は、 $-(CR^1AR^1B)_mC-C-(CR^1AR^1B)_kR^1E$ 、 $-(CR^1AR^1B)_mC=C-(CR^1AR^1B)_kR^1E$ （式中、 k は1～3の整数であり、 m は0～3の整数である）であり；そして

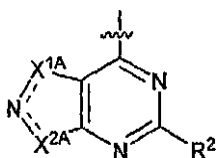
Q^3 は、 $-(CR^1AR^1B)_tR^1C$ （式中、 t は0～5の整数であり、 R^1C への結合点は R^1C 基の炭素原子を通してである）であり；ここで、 R^1A および R^1B は、独立してHもしくは C_{1-6} アルキルであり； R^1C は、任意に置換された非芳香族単環式環、縮合もしくは架橋二環式環もしくはスピロ環式環であり； R^1E は $-NR^1AR^1D$ もしくは $-OR^1D$ であり； R^1D は、 R^1F 、 $-C(=O)R^1F$ 、 $-SO_2R^1F$ 、 $-C(=O)N(R^1F)_2$ 、 $-SO_2N(R^1F)_2$ 、もしくは $-CO_2R^1F$ であり；ここで、 R^1F は、H、 C_{1-6} アルキル、 $-(CR^1AR^1B)_t(C_{6-10}$ アリール)もしくは $-(CR^1AR^1B)_t(4\sim10$ 員の複素環)である、単離された化合物。

【請求項2】

1つ以上のいずれの以下の基においても、以下：

(i) A～Bは共に

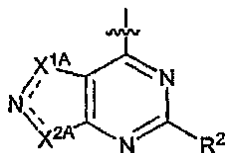
【化3】



を表し； X^1A は NR^1 であり、 X^2A は CR^X であるか、または X^1A は CR^X であり、 X^2A は NR^3 であり； L^1 は $-X(CHR^X)_{0-2}$ （式中、 X はO、S、N、Hもしくは NC_{1-4} アルキルであり、 R^X はHもしくは C_{1-4} アルキルである）であり； Y は、フェニル、チエニル、フラニル、ピロリル、ピリジル、ピリミジル、イミダゾリル、ピラジニル、オキサゾリル、チアゾリル、ナフチル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル、インドリル、キノリニル、イソキノリニルもしくはキナゾリニルであり；そして L^2-Z は、低級アルキル（1～4個の炭素原子）、シクロアルキル（3～8個の炭素原子）、低級アルコキシ（1～4個の炭素原子）、シクロアルコキシ（3～8個の炭素原子）、低級ペルフルオロアルキル（1～4個の炭素原子）、低級アシルオキシ（1～4個の炭素原子； $-OC(O)R$ ）、アミノ、低級モノもしくはジアルキルアミノ（1～4個の炭素原子）、低級モノもしくはジシクロアルキルアミノ（3～8個の炭素原子）、ヒドロキシメチル、低級アシル（1～4個の炭素原子； $-C(O)R$ ）、低級チオアルキル（1～4個の炭素原子）、低級スルフィニルアルキル（1～4個の炭素原子）、低級スルホニルアルキル（1～4個の炭素原子）、チオシクロアルキル（3～8個の炭素原子）、スルフィニルシクロアルキル（3～8個の炭素原子）、スルホニルシクロアルキル（3～8個の炭素原子）、スルホンアミド、低級モノもしくはジアルキルスルホンアミド（1～4個の炭素原子）、モノもしくはジシクロアルキルスルホンアミド（3～8個の炭素原子）、メルカプト、カルボキシ、カルボキサミド（ $-C(O)NH_2$ ）、低級モノもしくはジアルキルカルボキサミド（1～4個の炭素原子）、モノもしくはジシクロアルキルカルボキサミド（3～8個の炭素原子）、低級アルコキシカルボニル（1～4個の炭素原子）、シクロアルコキシカルボニル（3～8個の炭素原子）、低級アルケニル（2～4個の炭素原子）、シクロアルケニル（4～8個の炭素原子）、低級アルキニル（2～4個の炭素原子）である；および

(ii) A～Bは共に

【化 4】

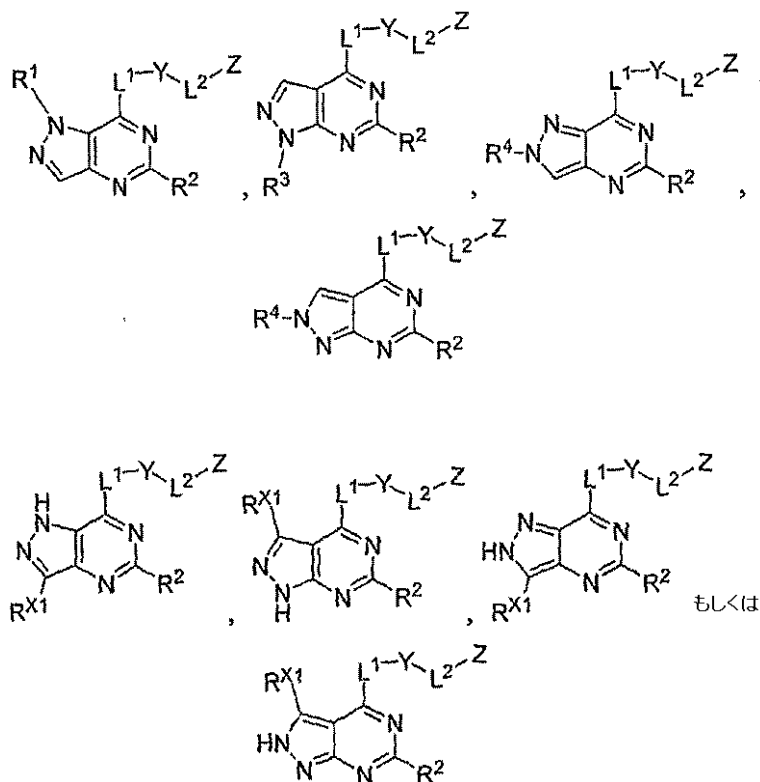


を表し； X^{1A} は NR^1 であり、 X^{2A} は CR^{X1} であるか、または X^{1A} は CR^{X1} であり、 X^{2A} は NR^3 であり； R^{X1} は、水素、ハロ、ニトロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 $-CONR^aR^b$ 、 $-O(CH_2)_nNR^aR^b$ 、 $-(CH_2)_nNR^aR^b$ もしくは $-NR^aR^b$ であり； L^1 は、 $-NHCH_2-$ であり； $Y-L^2-Z$ は、各々がハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 $-O(CH_2)_nNR^xR^y$ 、 $-O(CH_2)_nOR^x$ 、 $-NR^xR^y$ 、 $-(CH_2)_nNR^xR^y$ 、 $-CH_2OR^x$ 、 $-COOR^x$ 、 $-CONR^xR^y$ 、 $-CH_2SO_2NR^xR^y$ 、 $-SO_2NR^xR^y$ で任意に置換されたピリジニル、ピリミジニル、インダゾリル、ジヒドロイソインドリル、ベンズイソキサゾリル、オキサゾリル、イミダゾリル、オキサジアゾリルもしくはチアゾリル、または任意に置換されたフェニルであり；そして R^2 は、ピリジン-2-イル、 C_{1-6} アルキルピリジン-2-イル、 C_{1-6} アルキルピロル-2-イルもしくは C_{1-6} アルキルチアゾール-2-イルであり；ここで、 R^a はHもしくは C_{1-4} アルキルであり、 R^b は C_{1-4} アルキルであるか、または R^a および R^b は共に3～7員の複素環を形成し；そして R^x および R^y は、独立してHもしくは C_{1-6} アルキルである）、に規定したようには、言及した変量は同時には発生しない、請求項1に記載の化合物。

【請求項 3】

構造：

【化 5】

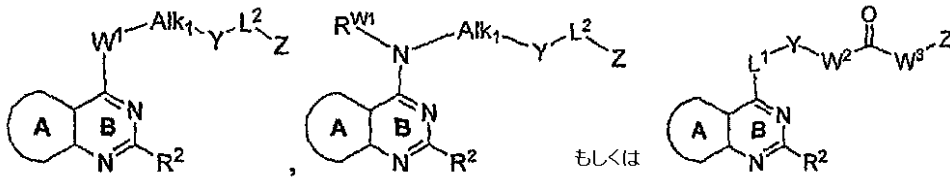


を有する、請求項1に記載の化合物。

【請求項 4】

構造：

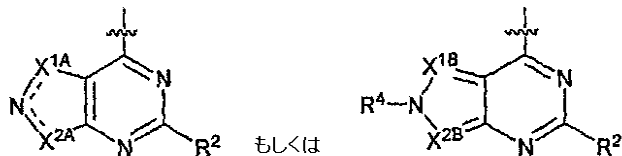
【化 6】



を有し、ここで、

A ~ B は共に、以下の構造：

【化 7】



の 1 つを表し、ここで、

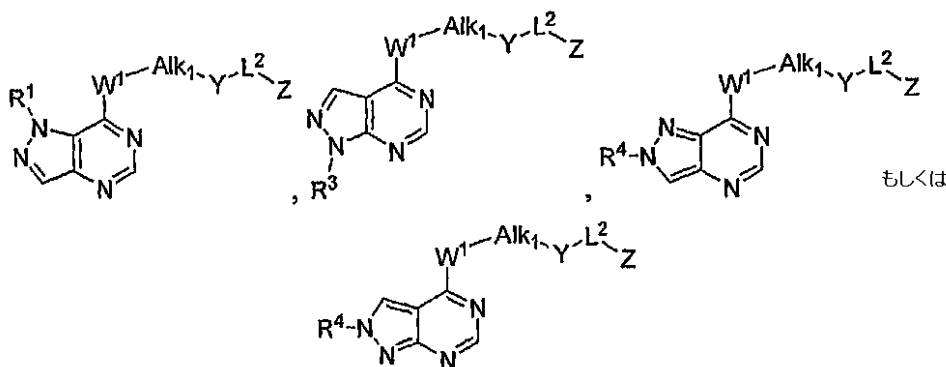
W^1 は、O もしくは NR^{W1} (式中、 R^{W1} は水素、脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、芳香族、ヘテロ芳香族、もしくはアシルである) であり；そして Alk_1 は、 C_{1-6} アルキレンもしくは C_{2-6} アルケニレン成分であり； W^2 および W^3 は、独立して不在、O、 NR^W 、 $CR^{W1}R^{W2}$ 、もしくは $NR^WCR^{W1}R^{W2}$ (式中、 R^W は水素、脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、芳香族、ヘテロ芳香族、もしくはアシルである) であり；そして R^{W1} および R^{W2} は、独立して水素、脂肪族、ヘテロ脂肪族、脂環式、ヘテロ脂環式、芳香族もしくはヘテロ芳香族であり；ただし W^2 および W^3 は各々が不在ではなく、かつ W^2 および W^3 のうちの少なくとも 1 つは NR^W もしくは $NR^WCR^{W1}R^{W2}$ であるか；または R^{W1} は Alk_1 上に存在する炭素原子と共に複素環成分を形成し得る、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

構造：

【化 8】



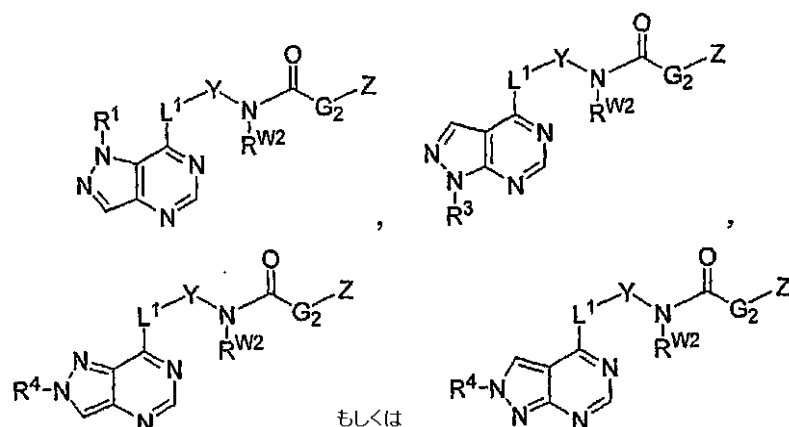
(式中、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 L^2 、Y および Z は、請求項 1 に規定されたとおりであり； W^1 は、O もしくは $-NR^{W1}$ (式中、 R^{W1} は、水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(アルキル)アリール$ 、 $-(アルキル)ヘテロアリール$ もしくはアシルである) であり；そして Alk_1 は、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキレンもしくは C_{2-6} アルキレン鎖であり、ここで 2 つまでの非隣接メチレンユニットは、独立して任意で $-C(=O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(=O)C(=O)-$ 、 $-C(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}CO_2-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)NR^{L1B}-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2-$ 、 $-SO_2NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2NR^{L1B}-$ 、 $-O$

-、-S-、もしくは- $\text{NR}^{\text{L}1\text{A}}$ -で置換されており；ここで $\text{R}^{\text{L}1\text{A}}$ および $\text{R}^{\text{L}1\text{B}}$ の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリールもしくはアシルである）
を有する、請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

構造：

【化9】

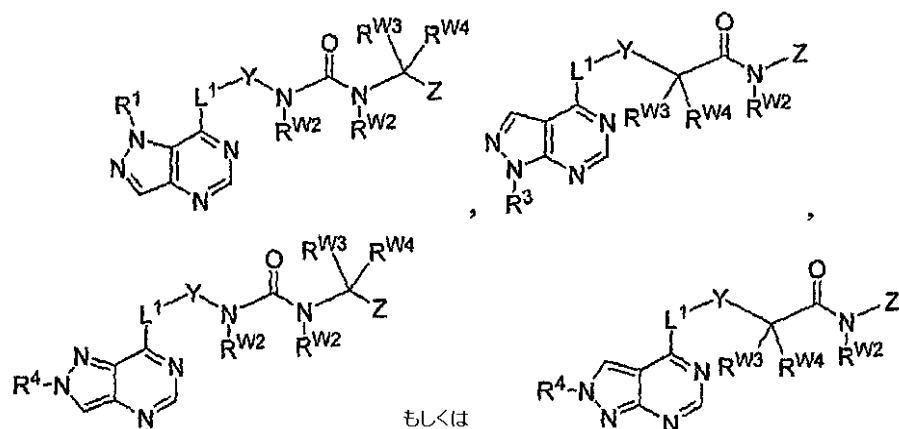


（式中、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 L^1 、 Y および Z は、請求項1に規定されたとおりであり； G_2 は、不在、 O もしくは $\text{NR}^{\text{G}2}$ であり；そして $\text{R}^{\text{W}2}$ および $\text{R}^{\text{G}2}$ は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、-（アルキル）アリール、-（アルキル）ヘテロアリールもしくはアシルである）
を有する、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

構造：

【化10】

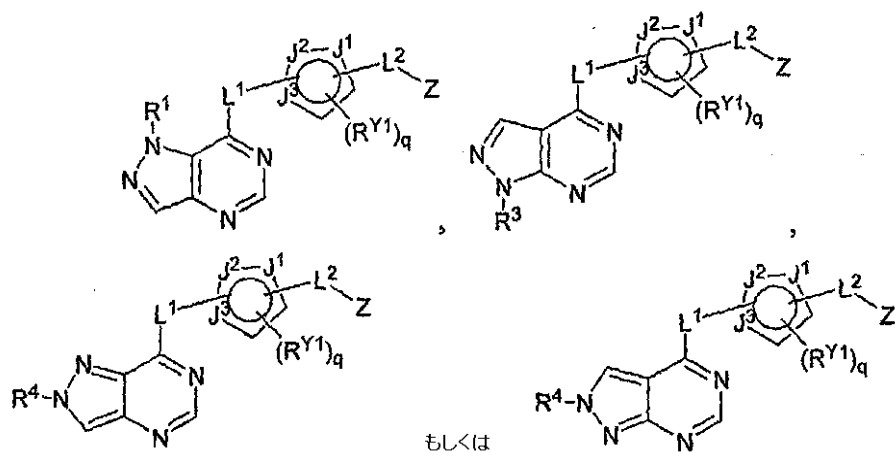


（式中、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 L^1 、 Y および Z は、請求項1に規定されたとおりであり；そして $\text{R}^{\text{W}2}$ 、 $\text{R}^{\text{W}3}$ および $\text{R}^{\text{W}4}$ は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、もしくはアシルである）
を有する、請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

構造：

【化 1 1】



(式中、 q は 0 ~ 2 の整数であり； R^1 、 R^3 、 R^4 、 L^1 、 L^2 および Z は、請求項 1 に規定されたとおりであり；そして J^1 、 J^2 および J^3 は、独立して O、S、N、 NR^{Y1} もしくは CR^{Y1} であり；ここで、 R^{Y1} の各存在は、独立して水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、- (アルキル) アリールもしくは - (アルキル) ヘテロアリール、- OR^{Y3} 、- SR^{Y3} 、- $NR^{Y2}R^{Y3}$ 、- $SO_2NR^{Y2}R^{Y3}$ 、- $C(=O)NR^{Y2}R^{Y3}$ 、ハロゲン、- CN 、- NO_2 、- $C(=O)OR^{Y3}$ 、- $N(R^{Y2})C(=O)R^{Y3}$ であり、

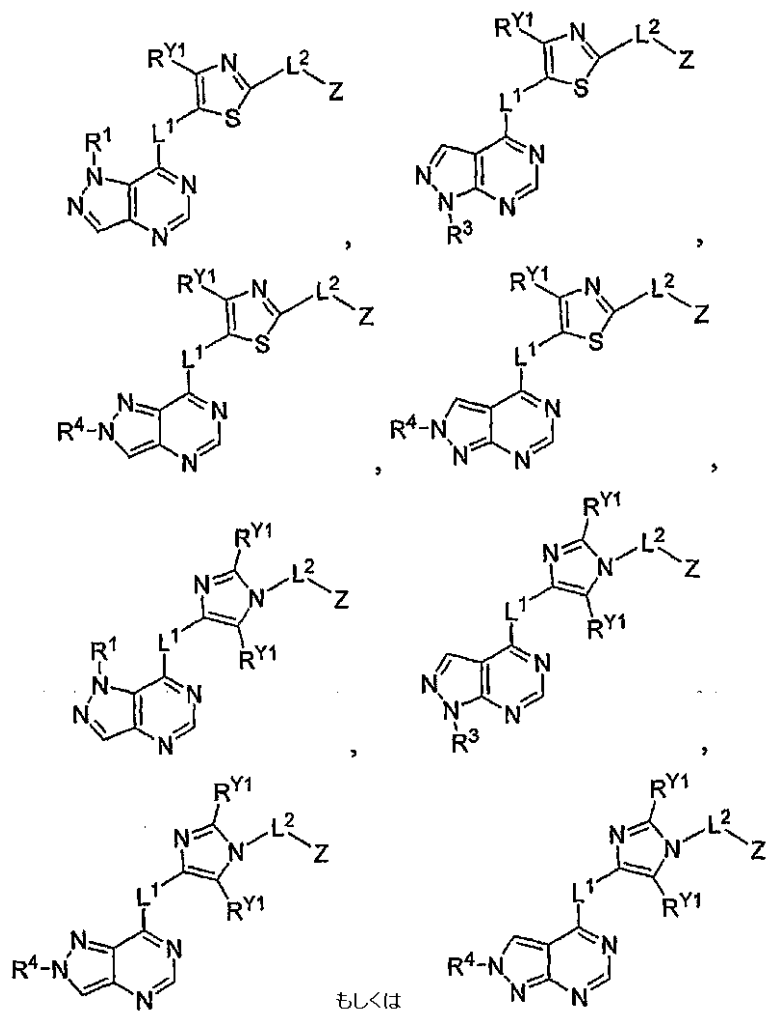
ここで、 R^{Y2} および R^{Y3} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、- (アルキル) アリール、- (アルキル) ヘテロアリールもしくはアシルであるか、または R^{Y2} および R^{Y3} は、それらが結合している窒素原子と共に 5 ~ 6 員の複素環を形成する)

を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

構造：

【化 1 2】

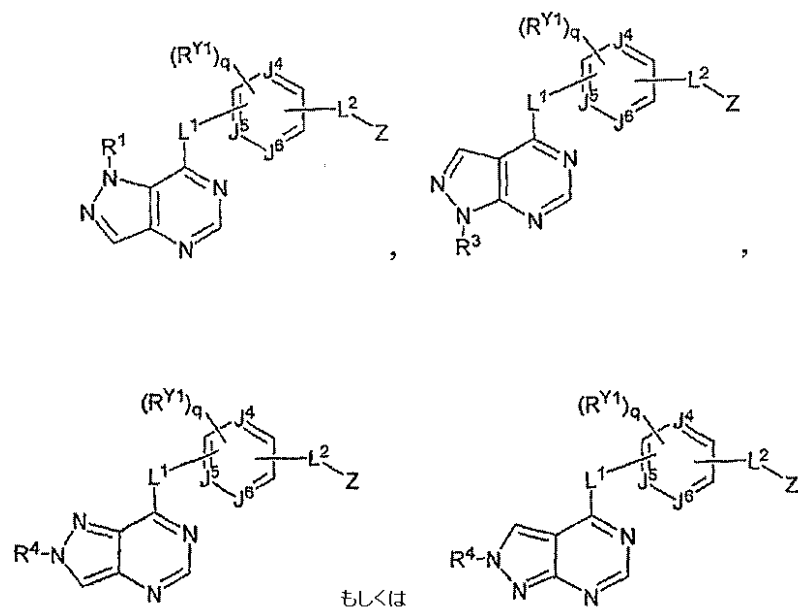


を有する、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

構造：

【化 1 3】



(式中、 q は 0 ~ 3 の整数であり； R^1 、 R^3 、 R^4 、 L^1 、 L^2 および Z は、請求項 1 に規定されたとおりであり；そして J^4 、 J^5 および J^6 は、独立して N もしくは CR^{Y1} であり；ここで、 R^{Y1} の各存在は、独立して水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、- (アルキル) アリールもしくは - (アルキル) ヘテロアリール、- OR^{Y3} 、- SR^{Y3} 、- $NR^{Y2}R^{Y3}$ 、- $SO_2NR^{Y2}R^{Y3}$ 、- $C(=O)NR^{Y2}R^{Y3}$ 、ハロゲン、- CN 、- NO_2 、- $C(=O)OR^{Y3}$ 、- $N(R^{Y2})C(=O)R^{Y3}$ であり、

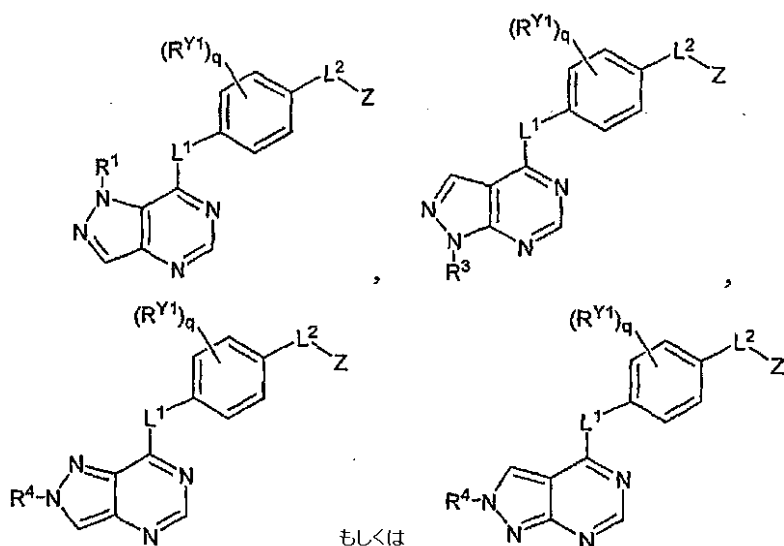
ここで、 R^{Y2} および R^{Y3} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、- (アルキル) アリール、- (アルキル) ヘテロアリールもしくはアシルである、または R^{Y2} および R^{Y3} は、それらが結合している窒素原子と共に 5 ~ 6 員の複素環を形成する)

を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

構造：

【化 14】

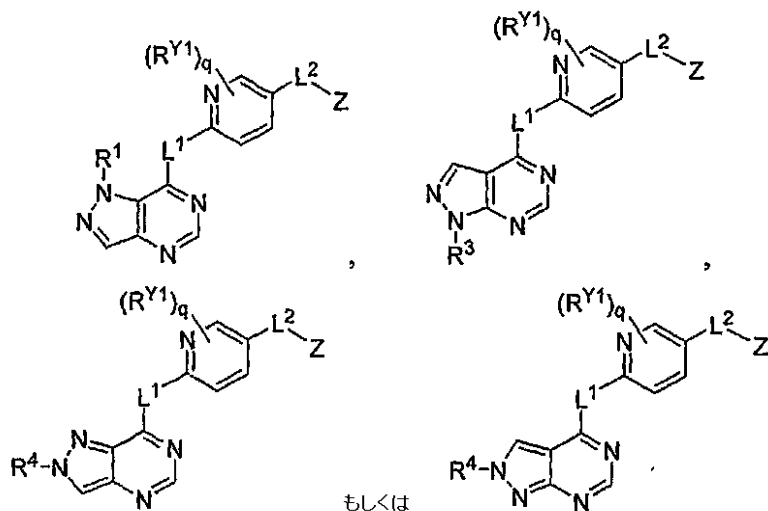


を有する、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 12】

構造：

【化 15】

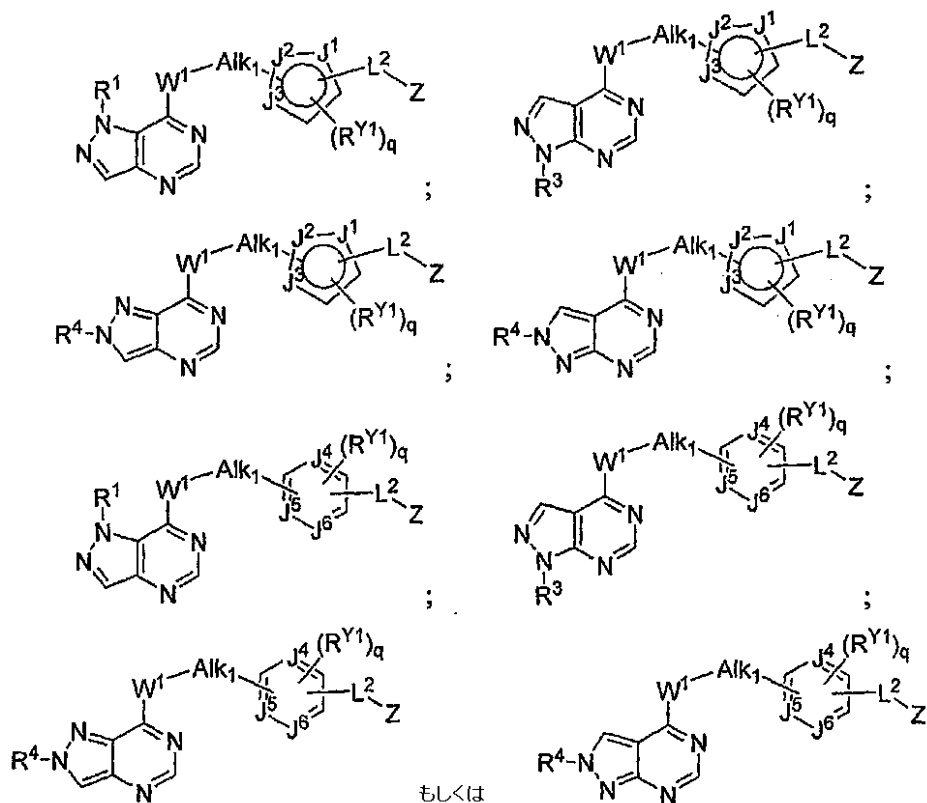


を有する、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】

構造：

【化 16】



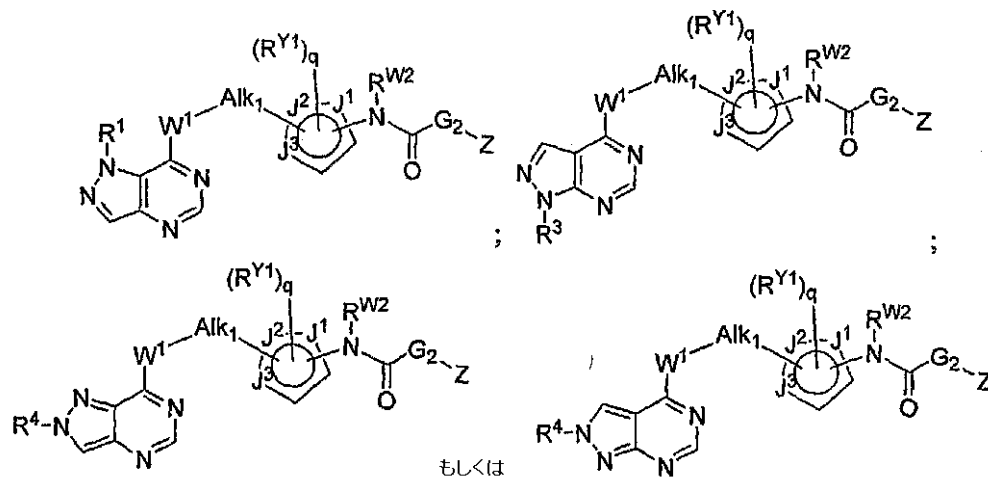
(式中、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 L^2 および Z は、請求項 1 に規定されたとおりであり； W^1 は、 O もしくは $-NR^{W1}$ (式中、 R^{W1} は、水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})$ アリール、 $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリールもしくはアシルである)であり； Alk_1 は、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキレンもしくは C_{2-6} アルキレン鎖であり、ここで、2 つまでの非隣接メチレンユニットは、独立して任意で $-C(=O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(=O)C(=O)-$ 、 $-C(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}CO_2-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)NR^{L1B}-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2-$ 、 $-SO_2NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2NR^{L1B}-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、もしくは $-NR^{L1A}-$ で置換されており；ここで、 R^{L1A} および R^{L1B} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリールもしくはアシルであり； q は 0 ~ 3 の整数であり； J^1 、 J^2 および J^3 は、独立して O 、 S 、 N 、 NR^{Y1} もしくは CR^{Y1} であり； J^4 、 J^5 および J^6 は、独立して N もしくは CR^{Y1} であり；ここで、 R^{Y1} の各存在は、独立して水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})$ アリールもしくは $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリール、 $-OR^{Y3}$ 、 $-SR^{Y3}$ 、 $-NR^{Y2}R^{Y3}$ 、 $-SO_2NR^{Y2}R^{Y3}$ 、 $-C(=O)NR^{Y2}R^{Y3}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OR^{Y3}$ 、 $-N(R^{Y2})C(=O)R^{Y3}$ (式中、 R^{Y2} および R^{Y3} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})$ アリール、 $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリールもしくはアシルである、または R^{Y2} および R^{Y3} は、それらが結合している窒素原子と共に 5 ~ 6 員の複素環を形成する)である)

を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 14】

構造：

【化 17】



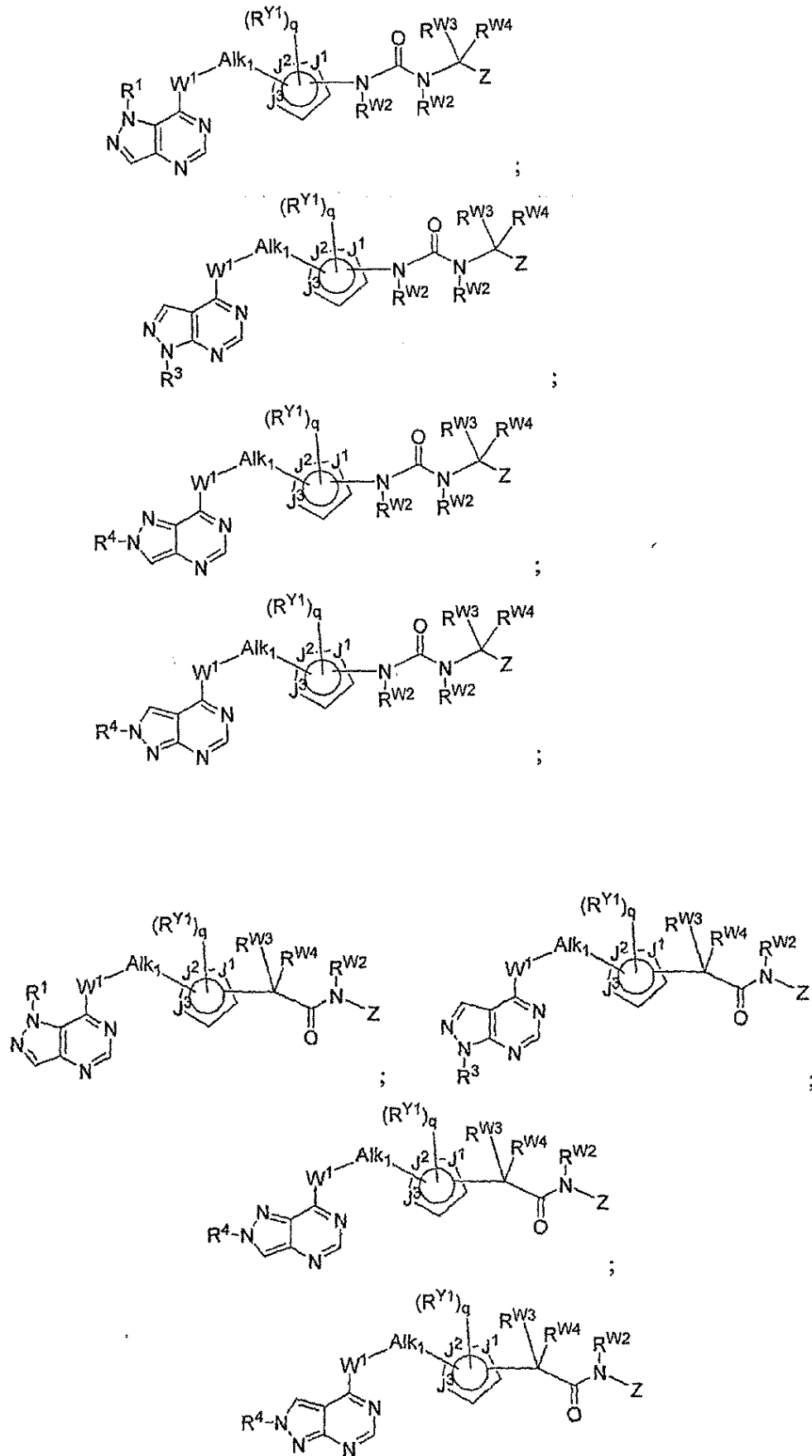
(式中、 R^1 、 R^3 、 R^4 および Z は、請求項 1 に規定されたとおりであり； W^1 は、 O もしくは $-NR^{W1}$ (式中、 R^{W1} は、水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})$ アリール、 $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリールもしくはアシルである)であり； Alk_1 は、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキレンもしくは C_{2-6} アルキレン鎖であり、ここで、2 つまでの非隣接メチレンユニットは、独立して任意で $-C(=O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(=O)C(=O)-$ 、 $-C(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}CO_2-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)NR^{L1B}-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2-$ 、 $-SO_2NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2NR^{L1B}-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、もしくは $-NR^{L1A}-$ で置換されており；ここで、 R^{L1A} および R^{L1B} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリールもしくはアシルであり； q は 0 ~ 3 の整数であり； J^1 、 J^2 および J^3 は、独立して O 、 S 、 N 、 NR^{Y1} もしくは CR^{Y1} であり；ここで、 R^{Y1} の各存在は、独立して水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})$ アリールもしくは $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリール、 $-OR^{Y3}$ 、 $-SR^{Y3}$ 、 $-NR^{Y2}R^{Y3}$ 、 $-SO_2NR^{Y2}R^{Y3}$ 、 $-C(=O)NR^{Y2}R^{Y3}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OR^{Y3}$ 、 $-N(R^{Y2})C(=O)R^{Y3}$ (式中、 R^{Y2} および R^{Y3} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})$ アリール、 $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリールもしくはアシルであるか、または R^{Y2} および R^{Y3} は、それらが結合している窒素原子と共に 5 ~ 6 員の複素環を形成する)であり； G_2 は、不在、 O もしくは NR^{G2} であり；そして R^{W2} および R^{G2} は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})$ アリール、 $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリールもしくはアシルである)

を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 15】

構造：

【化 1 8】



(式中、 R^1 、 R^3 、 R^4 および Z は、請求項1に規定されたとおりであり； W^1 は、 O

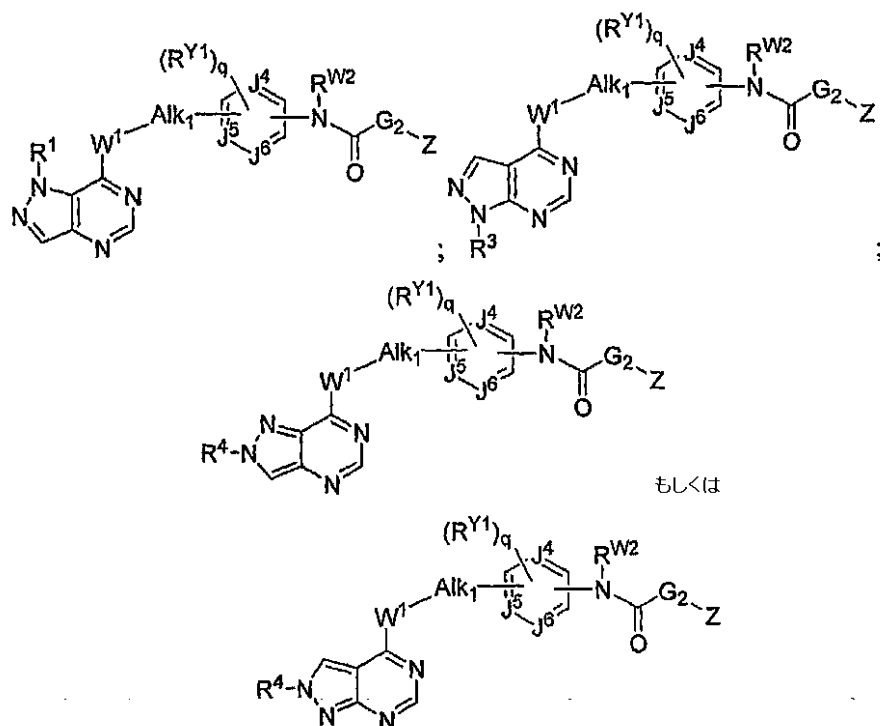
もしくは $-NR^{W1}$ (式中、 R^{W1} は、水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、 $-(\text{アルキル})$ アリーール、 $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリーールもしくはアシルである) であり; Alk_1 は、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキレンもしくは C_{2-6} アルキレン鎖であり、ここで、2つまでの非隣接メチレンユニットは、独立して任意で $-C(=O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(=O)C(=O)-$ 、 $-C(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}CO_2-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)NR^{L1B}-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2-$ 、 $-SO_2NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2NR^{L1B}-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、もしくは $-NR^{L1A}-$ で置換されており; ここで、 R^{L1A} および R^{L1B} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリーール、ヘテロアリーールもしくはアシルであり; q は 0 ~ 3 の整数であり; J^1 、 J^2 および J^3 は、独立して O、S、N、 NR^{Y1} もしくは CR^{Y1} であり; ここで、 R^{Y1} の各存在は、独立して水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、 $-(\text{アルキル})$ アリーールもしくは $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリーール、 $-OR^{Y3}$ 、 $-SR^{Y3}$ 、 $-NR^{Y2}R^{Y3}$ 、 $-SO_2NR^{Y2}R^{Y3}$ 、 $-C(=O)NR^{Y2}R^{Y3}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OR^{Y3}$ 、 $-N(R^{Y2})C(=O)R^{Y3}$ (式中、 R^{Y2} および R^{Y3} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、 $-(\text{アルキル})$ アリーール、 $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリーールもしくはアシルであるか、または R^{Y2} および R^{Y3} は、それらが結合している窒素原子と共に 5 ~ 6 員の複素環を形成する) であり; そして R^{W2} 、 R^{W3} および R^{W4} は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリーール、ヘテロアリーール、 $-(\text{アルキル})$ アリーール、 $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリーールもしくはアシルである)

を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 16】

構造:

【化 19】



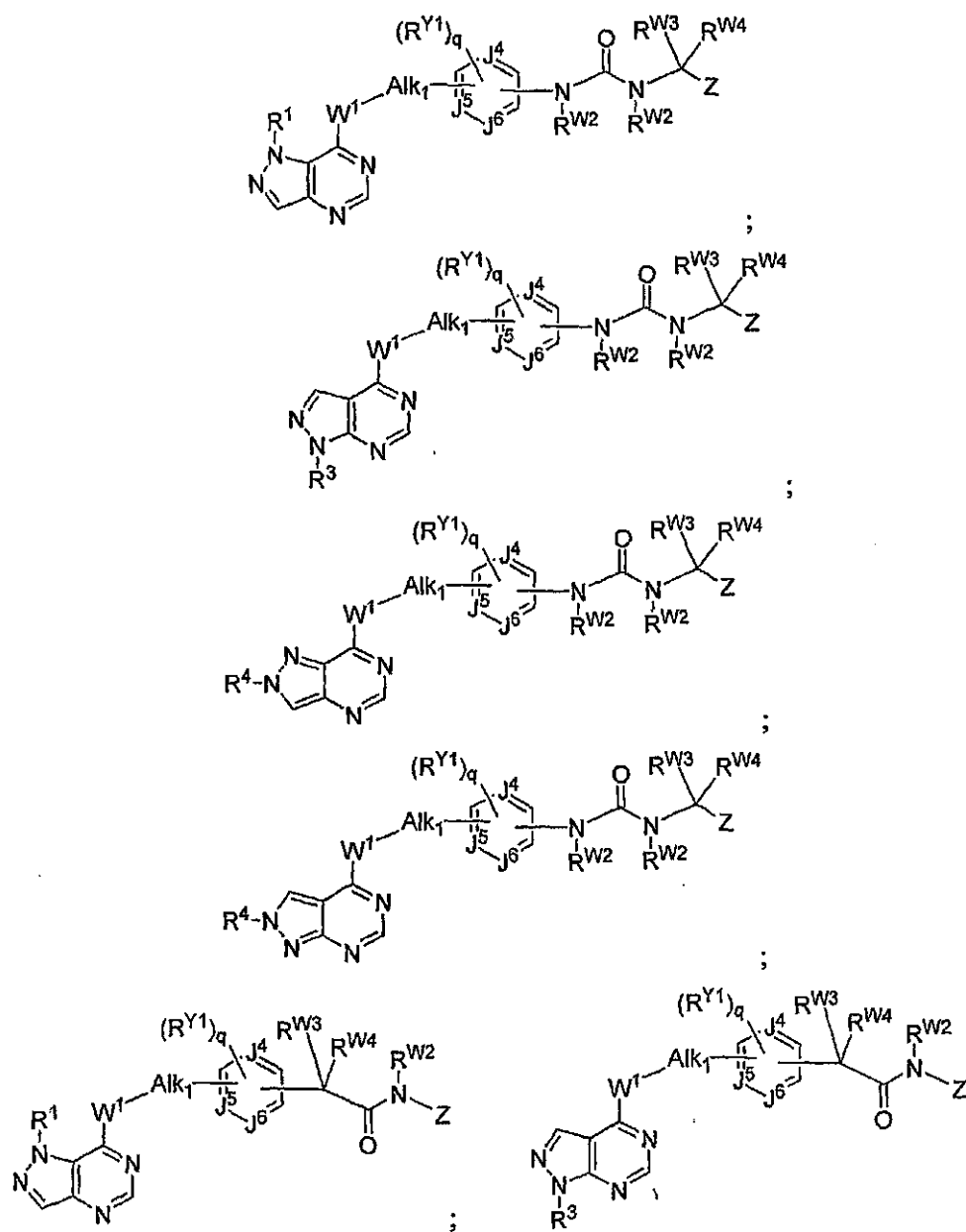
(式中、 R^1 、 R^3 、 R^4 および Z は、請求項 1 に規定されたとおりであり; W^1 は、O もしくは $-NR^{W1}$ (式中、 R^{W1} は、水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、 $-(\text{アルキル})$ アリーール、 $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリーールもしくは

はアシルである)であり; Alk_1 は、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキレンもしくは C_{2-6} アルキレン鎖であり、ここで、2つまでの非隣接メチレンユニットは、独立して任意で $-C(=O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(=O)C(=O)-$ 、 $-C(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}CO_2-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)NR^{L1B}-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2-$ 、 $-SO_2NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2NR^{L1B}-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、もしくは $-NR^{L1A}-$ で置換されており; ここで、 R^{L1A} および R^{L1B} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリールもしくはアシルであり; q は0~3の整数であり; J^4 、 J^5 および J^6 は、独立してNもしくは CR^{Y1} であり; ここで、 R^{Y1} の各存在は、独立して水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(アルキル)アリール$ もしくは $-(アルキル)ヘテロアリール$ 、 $-OR^{Y3}$ 、 $-SR^{Y3}$ 、 $-NR^{Y2}R^{Y3}$ 、 $-SO_2NR^{Y2}R^{Y3}$ 、 $-C(=O)NR^{Y2}R^{Y3}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OR^{Y3}$ 、 $-N(R^{Y2})C(=O)R^{Y3}$ (式中、 R^{Y2} および R^{Y3} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(アルキル)アリール$ 、 $-(アルキル)ヘテロアリール$ もしくはアシルであるか、または R^{Y2} および R^{Y3} は、それらが結合している窒素原子と共に5~6員の複素環を形成する)であり; G_2 は、不在、Oもしくは NR^{G2} であり; そして R^{W2} および R^{G2} は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、 $-(アルキル)アリール$ 、 $-(アルキル)ヘテロアリール$ もしくはアシルである)を有する、請求項1に記載の化合物。

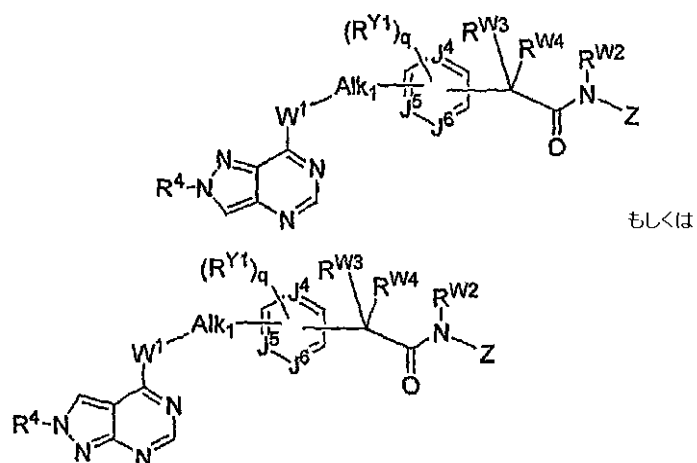
【請求項17】

構造:

【化 2 0】



【化 2 1】



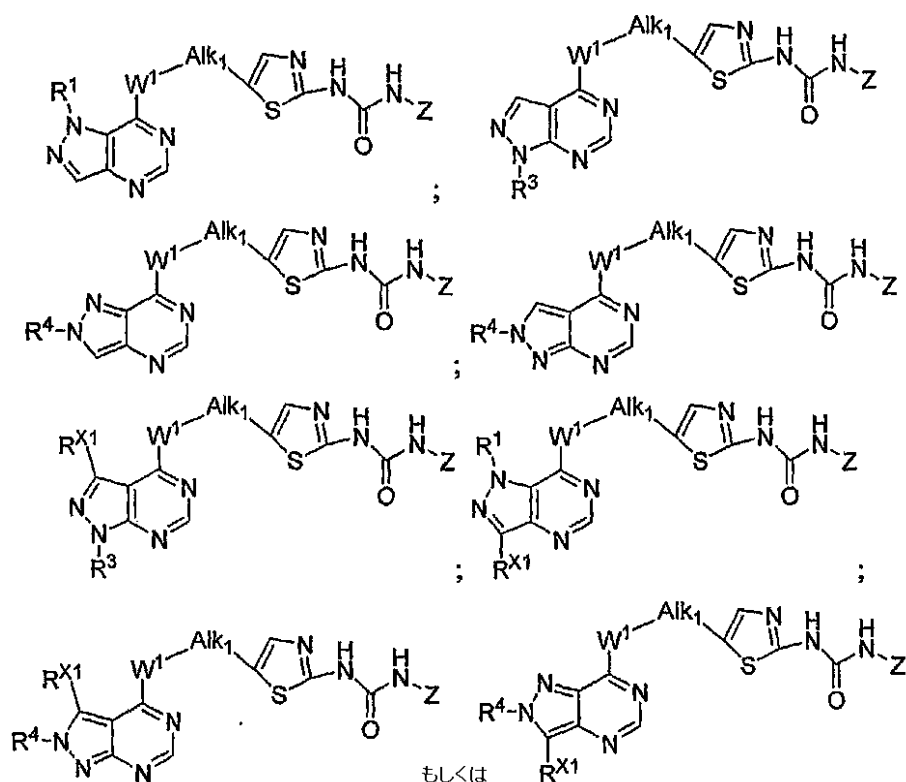
(式中、 R^1 、 R^3 、 R^4 および Z は、請求項1に規定されたとおりであり； W^1 は、Oもしくは $-NR^{W^1}$ （式中、 R^{W^1} は、水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(アルキル)アリール$ 、 $-(アルキル)ヘテロアリール$ もしくはアシルである）である； Alk_1 は、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキレンもしくは C_{2-6} アルキレン鎖であり、ここで、2つまでの非隣接メチレンユニットは、独立して任意で $-C(=O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(=O)C(=O)-$ 、 $-C(=O)NR^{L^1A}-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)NR^{L^1A}-$ 、 $-NR^{L^1A}NR^{L^1B}-$ 、 $-NR^{L^1A}NR^{L^1B}C(=O)-$ 、 $-NR^{L^1A}C(=O)-$ 、 $-NR^{L^1A}CO_2-$ 、 $-NR^{L^1A}C(=O)NR^{L^1B}-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^{L^1A}SO_2-$ 、 $-SO_2NR^{L^1A}-$ 、 $-NR^{L^1A}SO_2NR^{L^1B}-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、もしくは $-NR^{L^1A}-$ で置換されており；ここで、 R^{L^1A} および R^{L^1B} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリールもしくはアシルであり； q は0～3の整数であり； J^4 、 J^5 および J^6 は、独立してNもしくは CR^{Y^1} であり；ここで、 R^{Y^1} の各存在は、独立して水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(アルキル)アリール$ もしくは $-(アルキル)ヘテロアリール$ 、 $-OR^{Y^3}$ 、 $-SR^{Y^3}$ 、 $-NR^{Y^2}R^{Y^3}$ 、 $-SO_2NR^{Y^2}R^{Y^3}$ 、 $-C(=O)NR^{Y^2}R^{Y^3}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OR^{Y^3}$ 、 $-N(R^{Y^2})C(=O)R^{Y^3}$ （式中、 R^{Y^2} および R^{Y^3} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(アルキル)アリール$ 、 $-(アルキル)ヘテロアリール$ もしくはアシルであるか、または R^{Y^2} および R^{Y^3} は、それらが結合している窒素原子と共に5～6員の複素環を形成する）であり；そして R^{W^2} 、 R^{W^3} および R^{W^4} は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、 $-(アルキル)アリール$ 、 $-(アルキル)ヘテロアリール$ もしくはアシルである）

を有する、請求項1に記載の化合物。

【請求項18】

構造：

【化22】



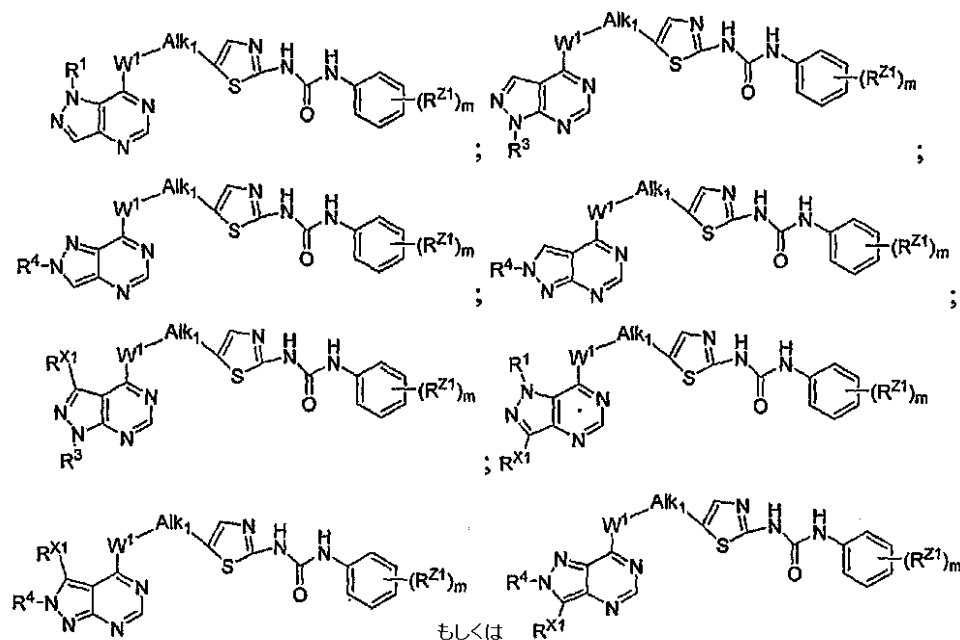
(式中、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^{X^1} は、請求項1に規定されたとおりであり； Z は、

アリール、ヘテロアリールもしくは複素環成分であり； W^1 は、Oもしくは $-NR^{W^1}$ （式中、 R^{W^1} は、水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})$ アリール、 $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリールもしくはアシルである）であり； Alk_1 は、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキレンもしくは C_{2-6} アルキレン鎖であり、ここで、2つまでの非隣接メチレンユニットは、独立して任意で $-C(=O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(=O)C(=O)-$ 、 $-C(=O)NR^{L^1A}-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)NR^{L^1A}-$ 、 $-NR^{L^1A}NR^{L^1B}-$ 、 $-NR^{L^1A}NR^{L^1B}C(=O)-$ 、 $-NR^{L^1A}C(=O)-$ 、 $-NR^{L^1A}CO_2-$ 、 $-NR^{L^1A}C(=O)NR^{L^1B}-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^{L^1A}SO_2-$ 、 $-SO_2NR^{L^1A}-$ 、 $-NR^{L^1A}SO_2NR^{L^1B}-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、もしくは $-NR^{L^1A}-$ で置換されており；ここで、 R^{L^1A} および R^{L^1B} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリールもしくはアシルである； m は0～3の整数であり； r は1～4の整数であり；そして R^{Z^1} の各存在は、独立して水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})$ アリールもしくは $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリール、 $-OR^{Z^2}$ 、 $-SR^{Z^2}$ 、 $-NR^{Z^2}R^{Z^3}$ 、 $-SO_2NR^{Z^2}R^{Z^3}$ 、 $-SO_2R^{Z^1}$ 、 $-C(=O)NR^{Z^2}R^{Z^3}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OR^{Z^3}$ 、 $-N(R^{Z^2})C(=O)R^{Z^3}$ （式中、 R^{Z^2} および R^{Z^3} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})$ アリール、 $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリールもしくはアシルである；または R^{Z^2} および R^{Z^3} はそれらが結合している窒素原子と共に5～6員の複素環、アリールもしくはヘテロアリール環を形成する）である）を有する、請求項1に記載の化合物。

【請求項19】

構造：

【化23】



（式中、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^{X^1} は、請求項1に規定されたとおりであり； W^1 は、Oもしくは $-NR^{W^1}$ （式中、 R^{W^1} は、水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})$ アリール、 $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリールもしくはアシルである）であり； Alk_1 は、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキレンもしくは C_{2-6} アルキレン鎖であり、ここで、2つまでの非隣接メチレンユニットは、独立して任意で $-C(=O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(=O)C(=O)-$ 、 $-C(=O)NR^{L^1A}-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)NR^{L^1A}-$ 、 $-NR^{L^1A}NR^{L^1B}-$ 、

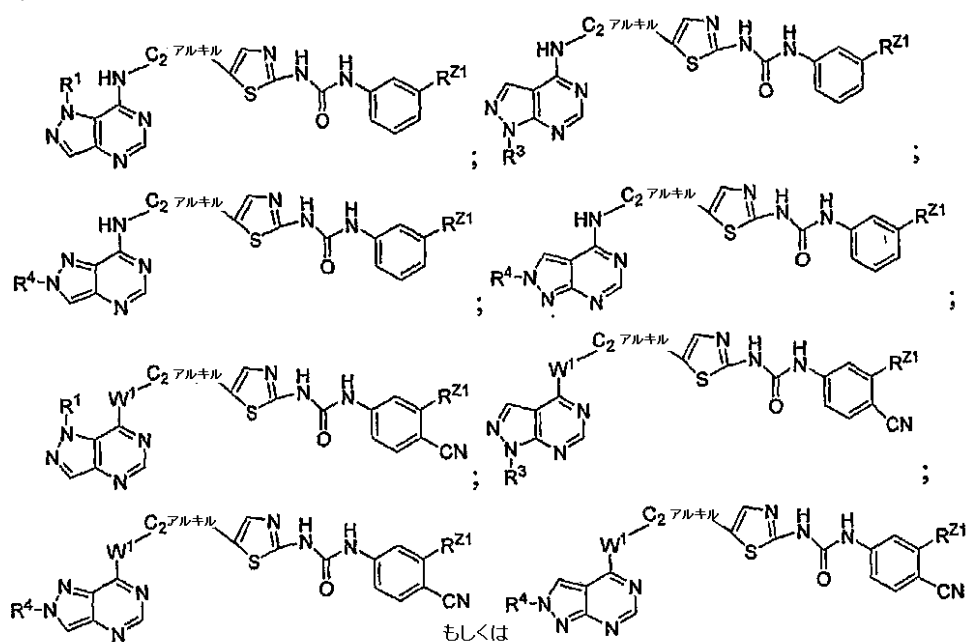
、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}CO_2-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)NR^{L1B}-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2-$ 、 $-SO_2NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2NR^{L1B}-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、もしくは $-NR^{L1A}-$ で置換されており；ここで、 R^{L1A} および R^{L1B} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリールもしくはアシルであり； m は0～3の整数であり； r は1～4の整数であり；そして R^{Z1} の各存在は、独立して水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})\text{アリール}$ もしくは $-(\text{アルキル})\text{ヘテロアリール}$ 、 $-OR^{Z2}$ 、 $-SR^{Z2}$ 、 $-NR^{Z2}R^{Z3}$ 、 $-SO_2NR^{Z2}R^{Z3}$ 、 $-SO_2R^{Z1}$ 、 $-C(=O)NR^{Z2}R^{Z3}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OR^{Z3}$ 、 $-N(R^{Z2})C(=O)R^{Z3}$ （式中、 R^{Z2} および R^{Z3} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})\text{アリール}$ 、 $-(\text{アルキル})\text{ヘテロアリール}$ もしくはアシルであるか；または R^{Z2} および R^{Z3} はそれらが結合している窒素原子と共に5～6員の複素環、アリールもしくはヘテロアリール環を形成する）である）

を有する、請求項1に記載の化合物。

【請求項20】

構造：

【化24】

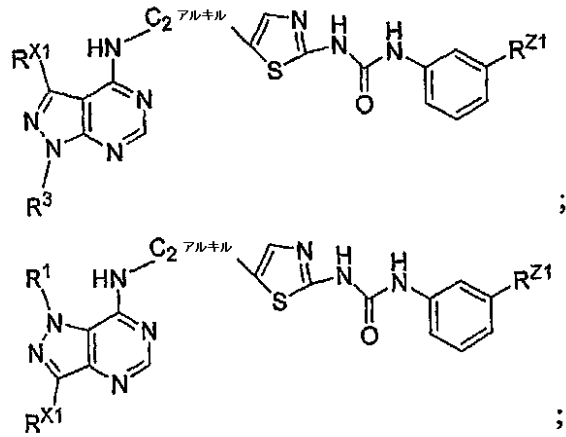


（式中、 R^{Z1} は、ハロゲン、低級アルキルもしくは低級ハロアルキルである）
を有する、請求項19に記載の化合物。

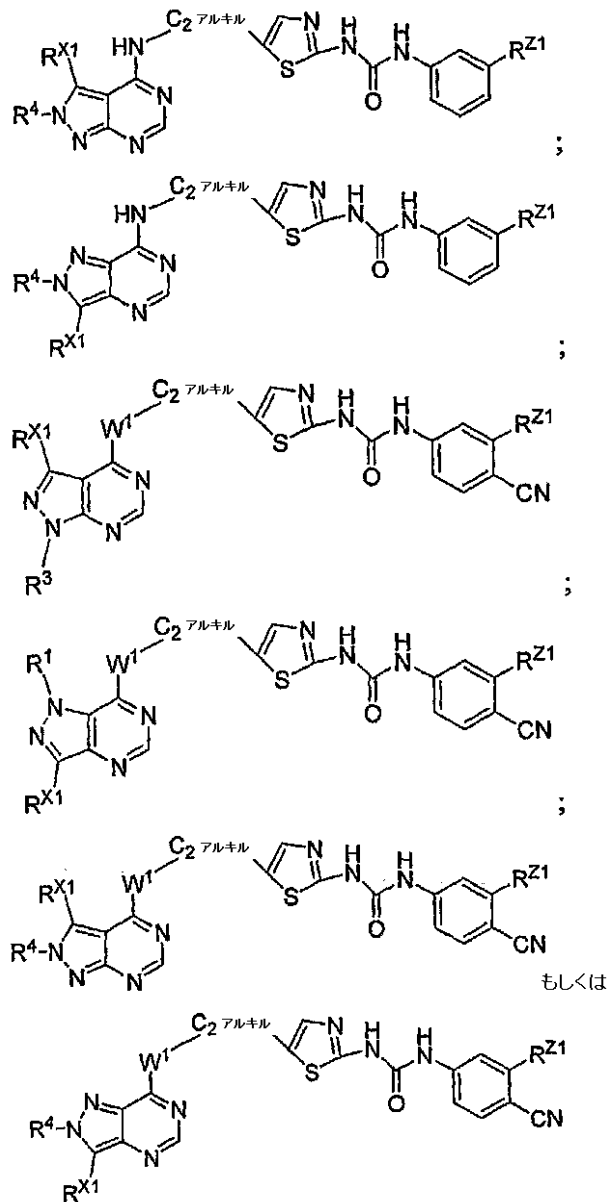
【請求項21】

構造：

【化 2 5】



【化 2 6】



(式中、 R^1 、 R^3 および R^4 は、独立して水素、低級アルキルもしくは $-CO_2R^{1A}$ (式中、 R^{1A} は水素もしくは低級アルキルである) であり； R^{X1} は、水素、低級アルキルもしくはヘテロシクリルであり；そして R^{Z1} は、ハロゲン、低級アルキルもしくは

低級ハロアルキルである)

を有する、請求項 19 に記載の化合物。

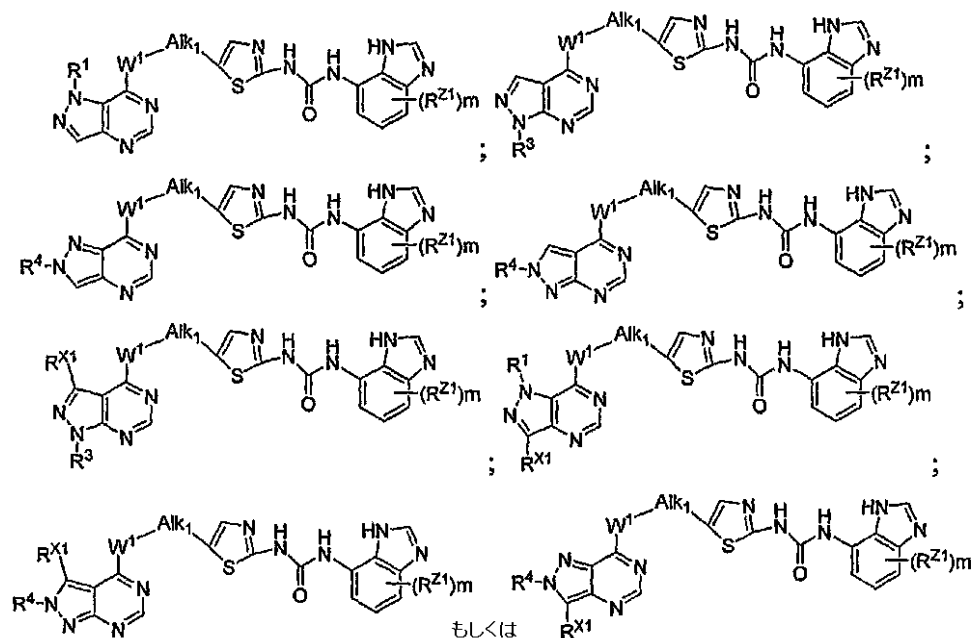
【請求項 22】

R^{Z1} は、 Cl 、 F 、メチルもしくは $-CF_3$ である、請求項 20 または 21 に記載の化合物。

【請求項 23】

構造：

【化 27】



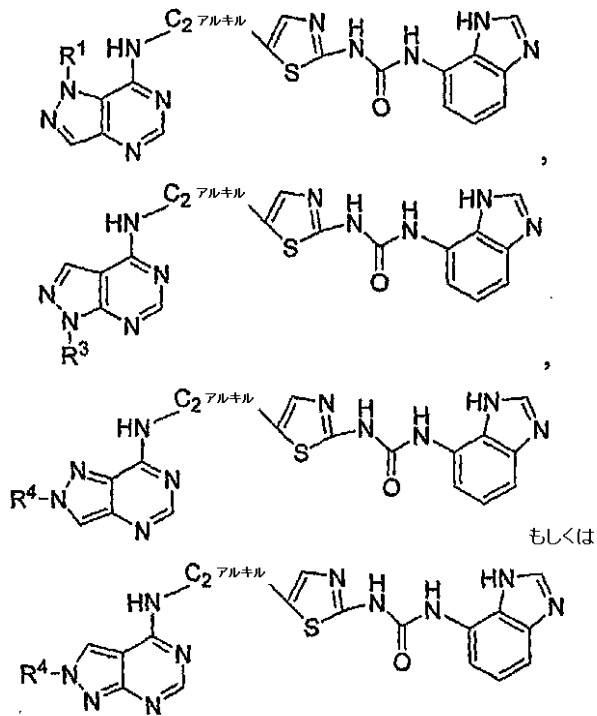
(式中、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^{X1} は、請求項 1 に規定されたとおりであり； W^1 は、 O もしくは $-NR^{W1}$ (式中、 R^{W1} は、水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(アルキル)アリール$ 、 $-(アルキル)ヘテロアリール$ もしくはアシルである)であり； Alk_1 は、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキレンもしくは C_{2-6} アルキレン鎖であり、ここで、2 つまでの非隣接メチレンユニットは、独立して任意で $-C(=O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(=O)C(=O)-$ 、 $-C(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}CO_2-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)NR^{L1B}-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2-$ 、 $-SO_2NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2NR^{L1B}-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、もしくは $-NR^{L1A}-$ で置換されており；ここで、 R^{L1A} および R^{L1B} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリールもしくはアシルであり； m は 0 ~ 3 の整数であり； r は 1 ~ 4 の整数であり；そして R^{Z1} の各存在は、独立して水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(アルキル)アリール$ もしくは $-(アルキル)ヘテロアリール$ 、 $-OR^{Z2}$ 、 $-SR^{Z2}$ 、 $-NR^{Z2}R^{Z3}$ 、 $-SO_2NR^{Z2}R^{Z3}$ 、 $-SO_2R^{Z1}$ 、 $-C(=O)NR^{Z2}R^{Z3}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OR^{Z3}$ 、 $-N(R^{Z2})C(=O)R^{Z3}$ (式中、 R^{Z2} および R^{Z3} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(アルキル)アリール$ 、 $-(アルキル)ヘテロアリール$ もしくはアシルであるか；または R^{Z2} および R^{Z3} はそれらが結合している窒素原子と共に 5 ~ 6 員の複素環、アリールもしくはヘテロアリール環を形成する)である)

を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 24】

構造：

【化 2 8】

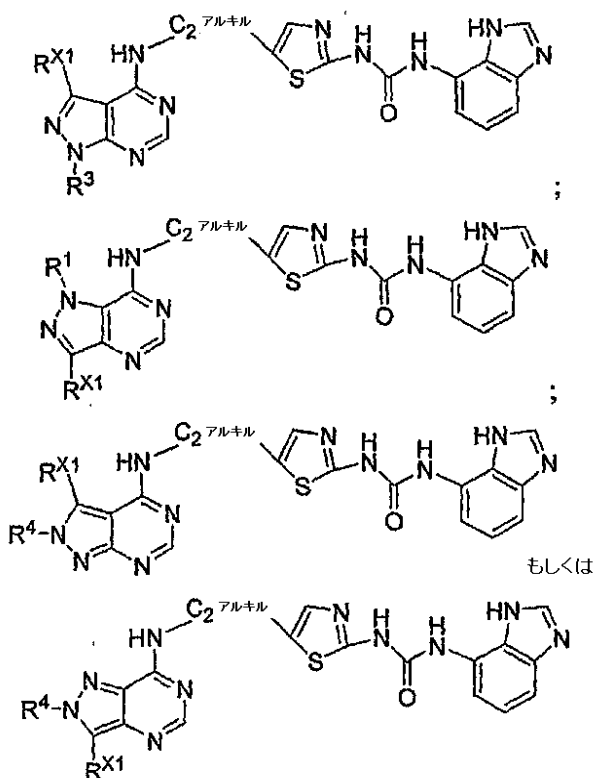


を有する、請求項 2 3 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

構造：

【化 2 9】



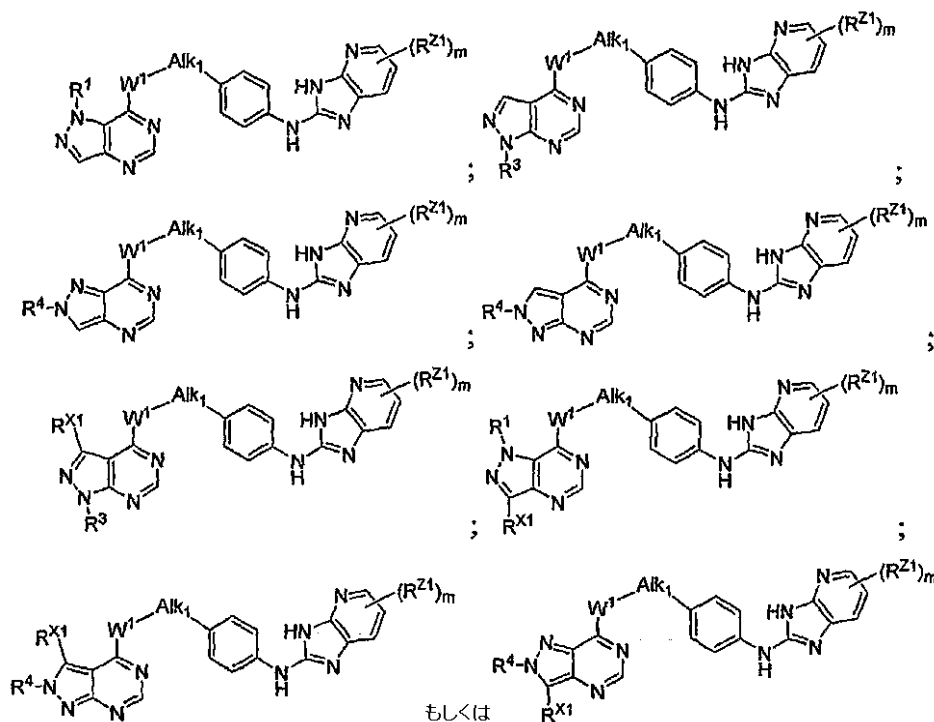
(式中、 R^1 、 R^3 および R^4 は、独立して水素、低級アルキルもしくは $-\text{CO}_2\text{R}^{1A}$ (式中、 R^{1A} は水素もしくは低級アルキルである) であり；そして $\text{R}^{\text{X}1}$ は、水素、低

級アルキルもしくはヘテロシクリルである)
を有する、請求項 23 に記載の化合物。

【請求項 26】

構造：

【化 30】



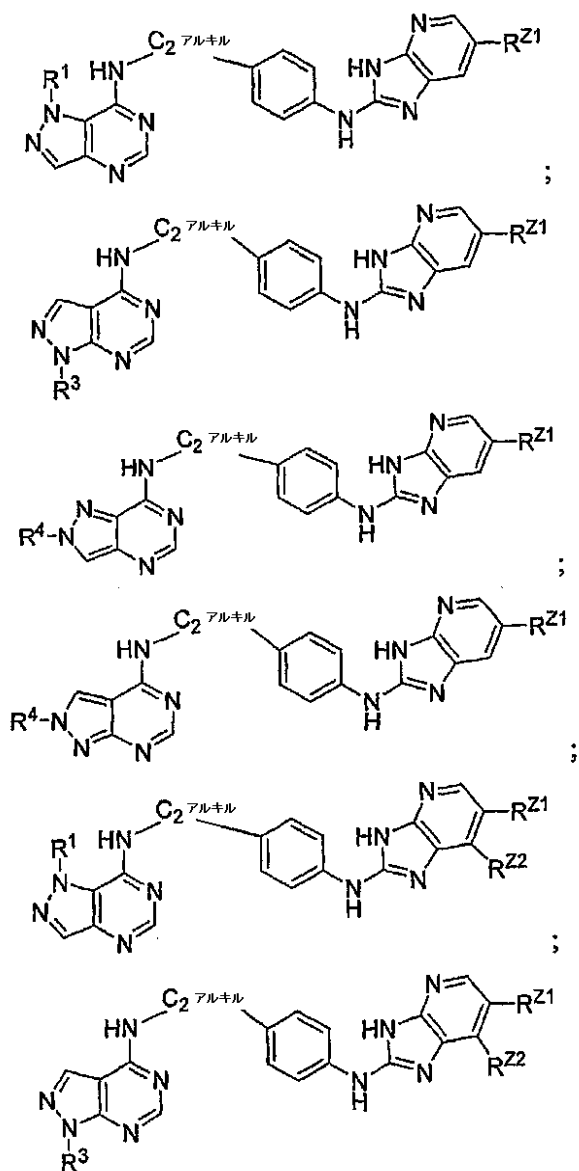
(式中、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^{X1} は、請求項 1 に規定されたとおりであり； W^1 は、O もしくは $-NR^{W1}$ (式中、 R^{W1} は、水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})$ アリール、 $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリールもしくはアシルである)であり； Alk_1 は、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキレンもしくは C_{2-6} アルキレン鎖であり、ここで、2 つまでの非隣接メチレンユニットは、独立して任意で $-C(=O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(=O)C(=O)-$ 、 $-C(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}CO_2-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)NR^{L1B}-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2-$ 、 $-SO_2NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2NR^{L1B}-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、もしくは $-NR^{L1A}-$ で置換されており；ここで、 R^{L1A} および R^{L1B} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリールもしくはアシルであり； m は 0 ~ 3 の整数であり； r は 1 ~ 4 の整数であり；そして R^{Z1} の各存在は、独立して水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})$ アリールもしくは $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリール、 $-OR^{Z2}$ 、 $-SR^{Z2}$ 、 $-NR^{Z2}R^{Z3}$ 、 $-SO_2NR^{Z2}R^{Z3}$ 、 $-SO_2R^{Z1}$ 、 $-C(=O)NR^{Z2}R^{Z3}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OR^{Z3}$ 、 $-N(R^{Z2})C(=O)R^{Z3}$ (式中、 R^{Z2} および R^{Z3} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})$ アリール、 $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリールもしくはアシルである；または R^{Z2} および R^{Z3} はそれらが結合している窒素原子と共に 5 ~ 6 員の複素環、アリールもしくはヘテロアリール環を形成する)である)

を有する、請求項 1 に記載の化合物。

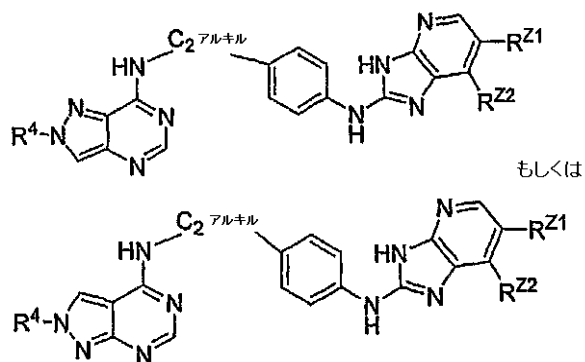
【請求項 27】

構造：

【化 3 1】



【化 3 2】



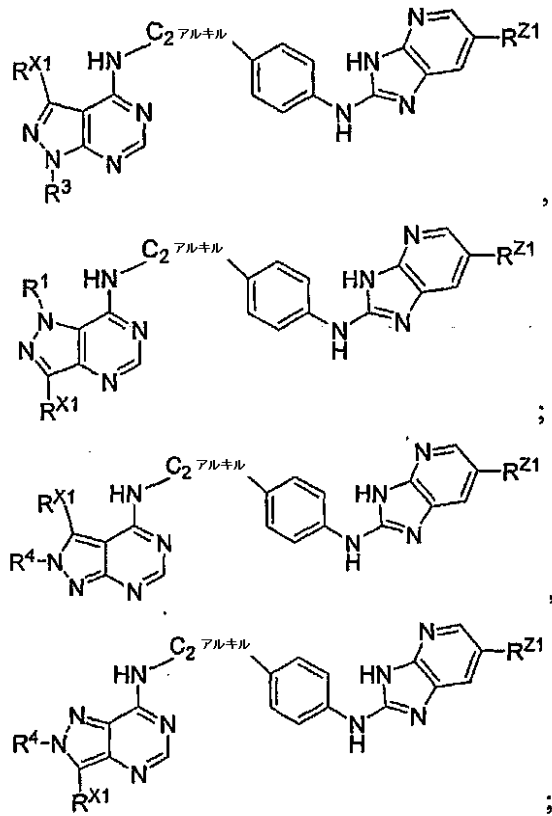
(式中、 R^{Z1} および R^{Z2} は、独立してハロゲン、低級アルキルもしくは低級ハロアルキルである)

を有する、請求項 26 に記載の化合物。

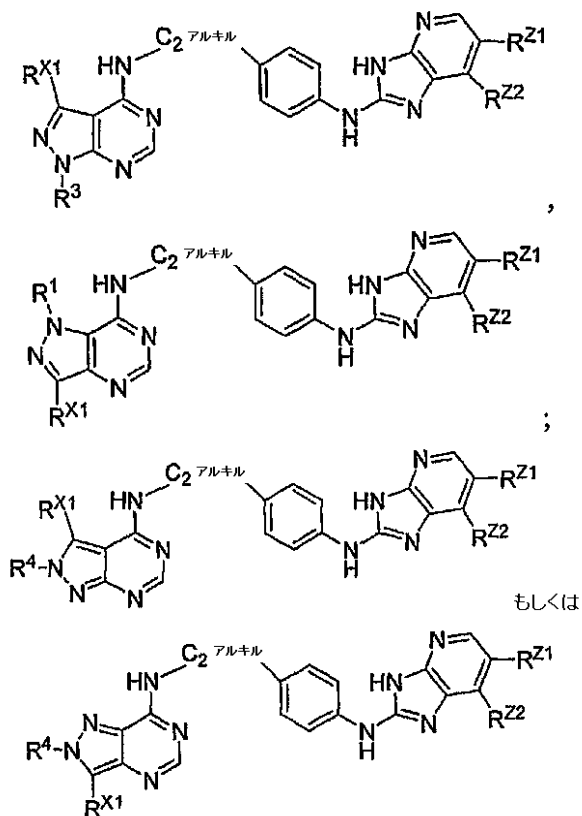
【請求項 28】

構造：

【化 3 3】



【化 3 4】



(式中、 R^1 、 R^3 および R^4 は、独立して水素、低級アルキルもしくは $-\text{CO}_2\text{R}^{1A}$ (式中、 R^{1A} は水素もしくは低級アルキルである) であり； R^{X1} は、水素、低級アルキルもしくはヘテロシクリルであり；そして R^{Z1} および R^{Z2} は、独立してハロゲン、低級アルキルもしくは低級ハロアルキルである)

を有する、請求項 26 に記載の化合物。

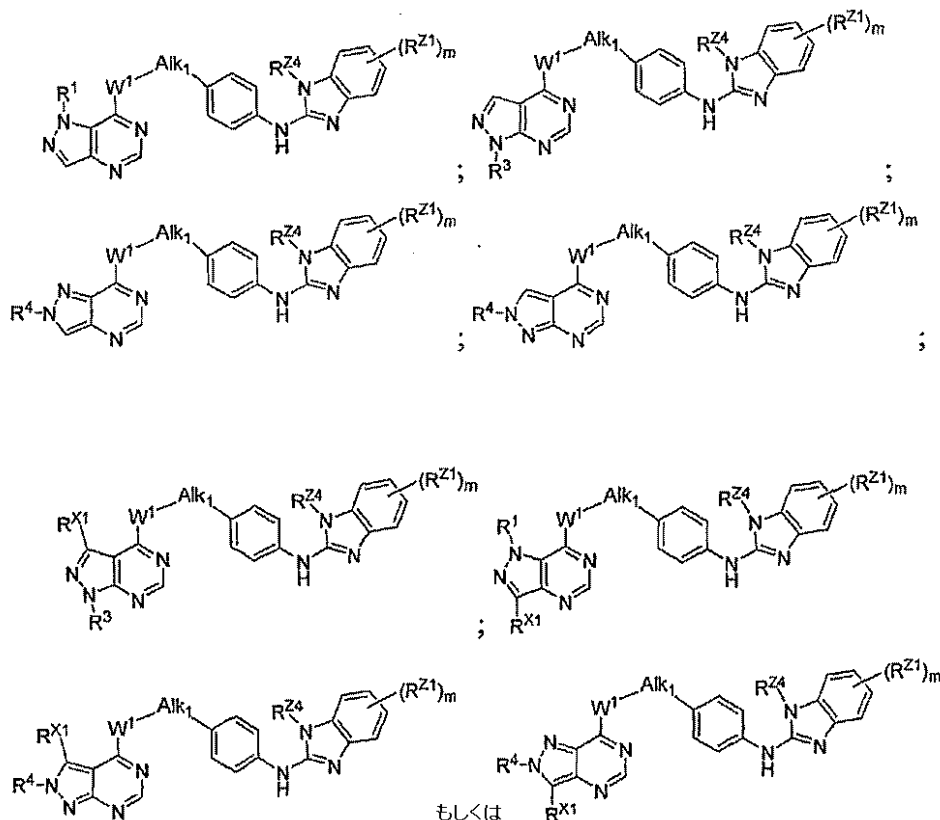
【請求項 29】

R^{Z1} および R^{Z2} は、各々 C1、F、メチルもしくは $-CF_3$ である、請求項 27 または 28 に記載の化合物。

【請求項 30】

構造：

【化 35】



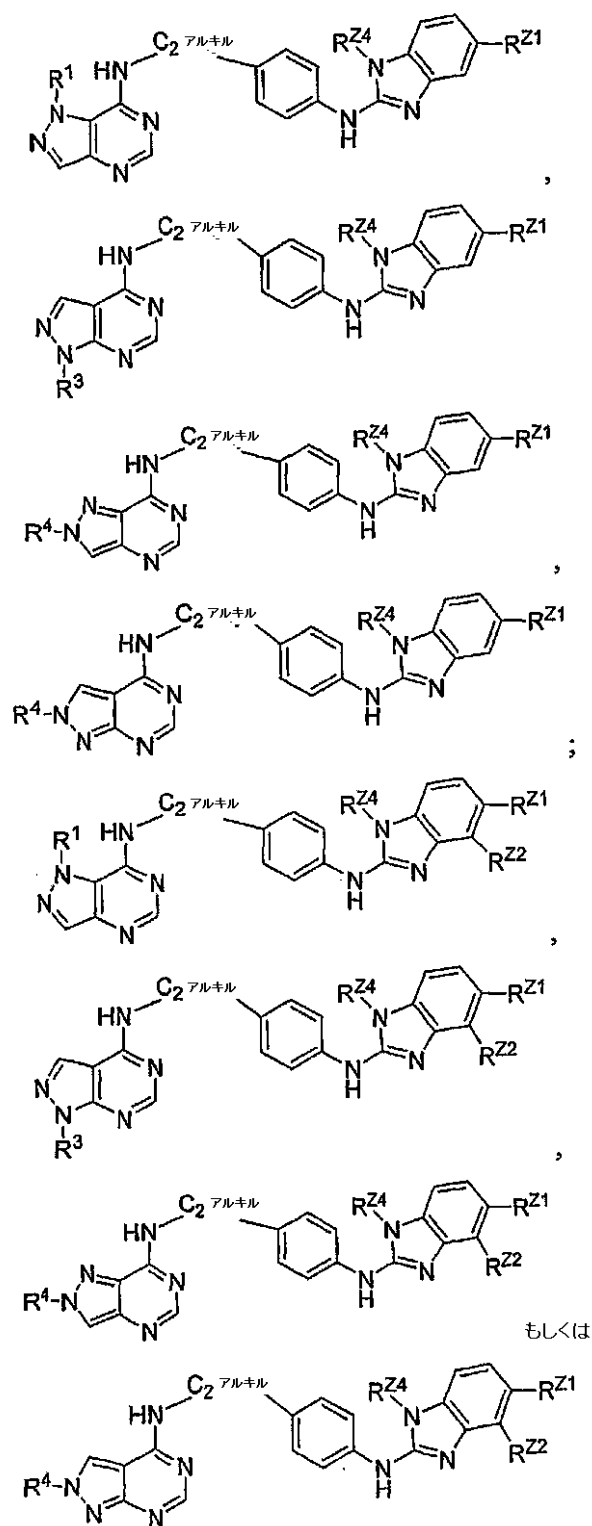
(式中、 R^1 、 R^3 、 R^4 および R^{X1} は、請求項 1 に規定されたとおりであり； W^1 は、O もしくは $-NR^{W1}$ (式中、 R^{W1} は、水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})$ アリール、 $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリールもしくはアシルである)であり； Alk_1 は、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキレンもしくは C_{2-6} アルキレン鎖であり、ここで、2 つまでの非隣接メチレンユニットは、独立して任意で $-C(=O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(=O)C(=O)-$ 、 $-C(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}CO_2-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)NR^{L1B}-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2-$ 、 $-SO_2NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2NR^{L1B}-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、もしくは $-NR^{L1A}-$ で置換されており；ここで、 R^{L1A} および R^{L1B} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリールもしくはアシルであり； m は 0 ~ 3 の整数であり； r は 1 ~ 4 の整数であり；そして R^{Z1} の各存在は、独立して水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})$ アリールもしくは $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリール、 $-OR^{Z2}$ 、 $-SR^{Z2}$ 、 $-NR^{Z2}R^{Z3}$ 、 $-SO_2NR^{Z2}R^{Z3}$ 、 $-SO_2R^{Z1}$ 、 $-C(=O)NR^{Z2}R^{Z3}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OR^{Z3}$ 、 $-N(R^{Z2})C(=O)R^{Z3}$ (式中、 R^{Z2} 、 R^{Z3} および R^{Z4} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(\text{アルキル})$ アリール、 $-(\text{アルキル})$ ヘテロアリールもしくはアシルであるか；または R^{Z2} および R^{Z3} はそれらが結合している窒素原子と共に 5 ~ 6 員の複素環、アリールもしくはヘテロア

リール環を形成する)である)
を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3 1】

構造：

【化 3 6】

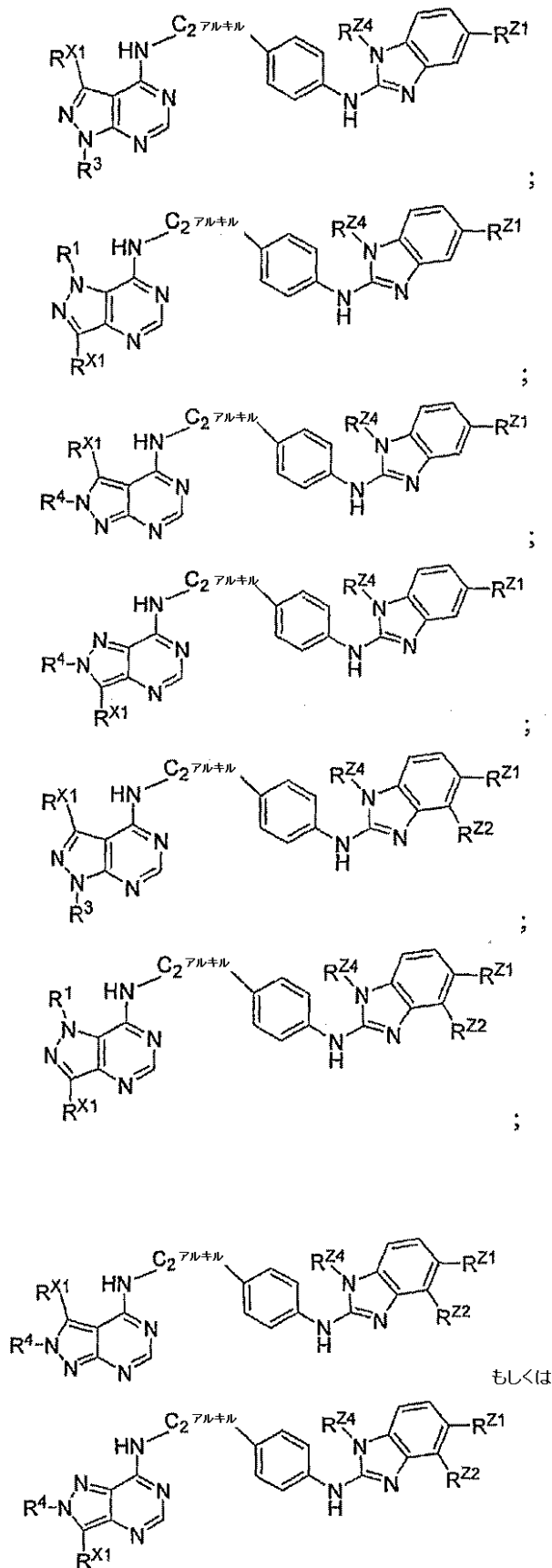


(式中、 R^{Z1} および R^{Z2} は、独立してハロゲン、低級アルキルもしくは低級ハロアルキルであり、 R^{Z4} は水素もしくは低級アルキルである)
を有する、請求項 3 0 に記載の化合物。

【請求項 3 2】

構造：

【化 3 7】



(式中、 R^1 、 R^3 および R^4 は、独立して水素、低級アルキルもしくは $-CO_2R^{1A}$ (式中、 R^{1A} は水素もしくは低級アルキルである) であり； R^{X1} は、水素、低級アルキルもしくはヘテロシクリルであり； R^{Z1} および R^{Z2} は、独立してハロゲン、低級ア

ルキルもしくは低級ハロアルキルであり、 R^{Z4} は水素もしくは低級アルキルである) を有する、請求項30に記載の化合物。

【請求項33】

R^{Z1} および R^{Z2} は、各々 C1、F、メチルもしくは $-CF_3$ である、請求項31または32に記載の化合物。

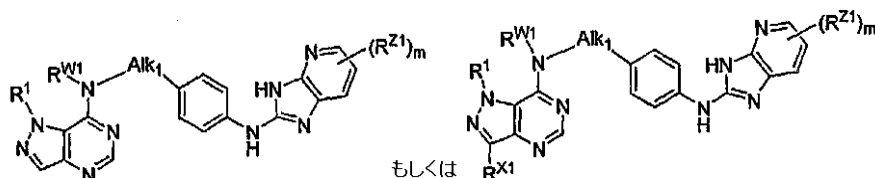
【請求項34】

R^{Z4} は、水素またはイソプロピルである、請求項31または32に記載の化合物。

【請求項35】

構造：

【化38】



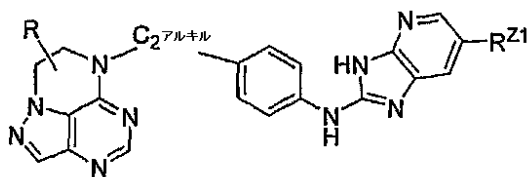
(式中、 R^{X1} は請求項1に記載したとおりであり； R^1 および R^{W1} は共に、任意に置換された5～6員環を形成し； Alk_1 は、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキレンもしくは C_{2-6} アルキレン鎖であり、ここで、2つまでの非隣接メチレンユニットは、独立して任意で $-C(=O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(=O)C(=O)-$ 、 $-C(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}CO_2-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)NR^{L1B}-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2-$ 、 $-SO_2NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2NR^{L1B}-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、もしくは $-NR^{L1A}-$ で置換されており；ここで、 R^{L1A} および R^{L1B} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリールもしくはアシルであり； m は0～3の整数であり； r は1～4の整数であり； R^{Z1} の各存在は、独立して水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(アルキル)アリール$ もしくは $-(アルキル)ヘテロアリール$ 、 $-OR^{Z2}$ 、 $-SR^{Z2}$ 、 $-NR^{Z2}R^{Z3}$ 、 $-SO_2NR^{Z2}R^{Z3}$ 、 $-SO_2R^{Z1}$ 、 $-C(=O)NR^{Z2}R^{Z3}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OR^{Z3}$ 、 $-N(R^{Z2})C(=O)R^{Z3}$ であり；ここで、 R^{Z2} および R^{Z3} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(アルキル)アリール$ 、 $-(アルキル)ヘテロアリール$ もしくはアシルであり；または R^{Z2} および R^{Z3} はそれらが結合している窒素原子と共に5～6員の複素環、アリールもしくはヘテロアリール環を形成する)

を有する、請求項1に記載の化合物。

【請求項36】

構造：

【化39】



(式中、 R は、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、低級アルキルもしくは低級アルコキシであり；そして R^{Z1} は、水素、ハロゲン、低級アルキルもしくは低級アルコキシである) を有する、請求項35に記載の化合物。

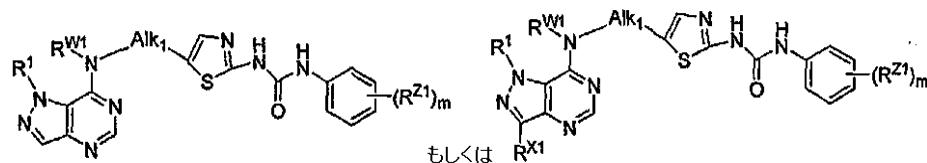
【請求項37】

R および R^{Z1} は各々水素である、請求項 36 に記載の化合物。

【請求項 38】

構造：

【化 40】



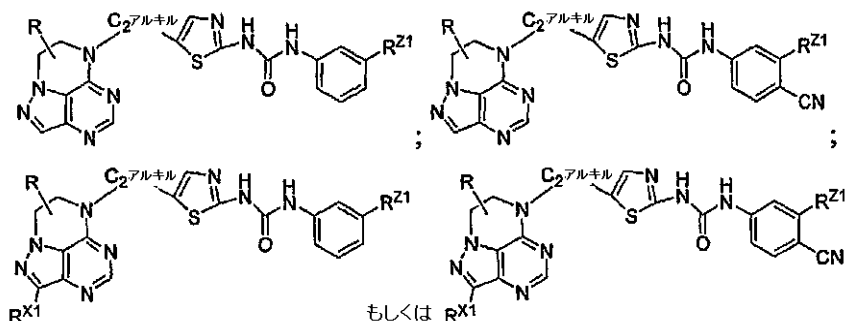
(式中、 R^{X1} は一般に、ならびに本明細書のクラスおよびサブクラスに規定されたとおりであり； R^1 および R^{W1} は共に、任意に置換された 5 ~ 6 員環を形成し； Alk_1 は、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキレンもしくは C_{2-6} アルキレン鎖であり、ここで、2 つまでの非隣接メチレンユニットは、独立して任意で $-C(=O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(=O)C(=O)-$ 、 $-C(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}CO_2-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)NR^{L1B}-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2-$ 、 $-SO_2NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2NR^{L1B}-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、もしくは $-NR^{L1A}-$ で置換されており；ここで、 R^{L1A} および R^{L1B} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリールもしくはアシルであり；m は 0 ~ 3 の整数であり；r は 1 ~ 4 の整数であり； R^{Z1} の各存在は、独立して水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(アルキル)アリール$ もしくは $-(アルキル)ヘテロアリール$ 、 $-OR^{Z2}$ 、 $-SR^{Z2}$ 、 $-NR^{Z2}R^{Z3}$ 、 $-SO_2NR^{Z2}R^{Z3}$ 、 $-SO_2R^{Z1}$ 、 $-C(=O)NR^{Z2}R^{Z3}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OR^{Z3}$ 、 $-N(R^{Z2})C(=O)R^{Z3}$ (式中、 R^{Z2} および R^{Z3} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(アルキル)アリール$ 、 $-(アルキル)ヘテロアリール$ もしくはアシルであるか、または R^{Z2} および R^{Z3} は、それらが結合している窒素原子と共に 5 ~ 6 員の複素環を形成する) である)

を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 39】

構造：

【化 41】



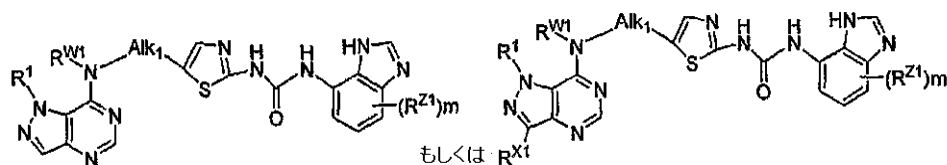
(式中、R は、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、低級アルキルもしくは低級アルコキシであり； R^{X1} は、水素、メチルもしくはチエニルであり、そして R^{Z1} は水素、ハロゲン、低級アルキルもしくは低級ハロアルキルである)

を有する、請求項 38 に記載の化合物。

【請求項 40】

構造：

【化 4 2】



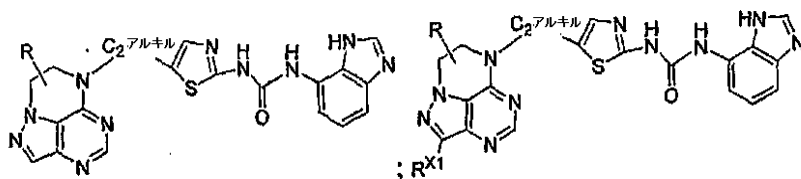
(式中、 R^{X1} は一般に、ならびに本明細書のクラスおよびサブクラスに規定されたとおりであり； R^1 および R^{W1} は共に、任意に置換された 5 ~ 6 員環を形成する； Alk_1 は、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキレンもしくは C_{2-6} アルキレン鎖であり、ここで、2 つまでの非隣接メチレンユニットは、独立して任意で $-C(=O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(=O)C(=O)-$ 、 $-C(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}-$ 、 $-NR^{L1A}NR^{L1B}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)-$ 、 $-NR^{L1A}CO_2-$ 、 $-NR^{L1A}C(=O)NR^{L1B}-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2-$ 、 $-SO_2NR^{L1A}-$ 、 $-NR^{L1A}SO_2NR^{L1B}-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、もしくは $-NR^{L1A}-$ で置換されており；ここで、 R^{L1A} および R^{L1B} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリールもしくはアシルであり； m は 0 ~ 3 の整数であり； r は 1 ~ 4 の整数であり； R^{Z1} の各存在は、独立して水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(アルキル)アリール$ もしくは $-(アルキル)ヘテロアリール$ 、 $-OR^{Z2}$ 、 $-SR^{Z2}$ 、 $-NR^{Z2}R^{Z3}$ 、 $-SO_2NR^{Z2}R^{Z3}$ 、 $-SO_2R^{Z1}$ 、 $-C(=O)NR^{Z2}R^{Z3}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OR^{Z3}$ 、 $-N(R^{Z2})C(=O)R^{Z3}$ (式中、 R^{Z2} および R^{Z3} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(アルキル)アリール$ 、 $-(アルキル)ヘテロアリール$ もしくはアシルであるか、または R^{Z2} および R^{Z3} は、それらが結合している窒素原子と共に 5 ~ 6 員の複素環を形成する) である)

を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4 1】

構造：

【化 4 3】



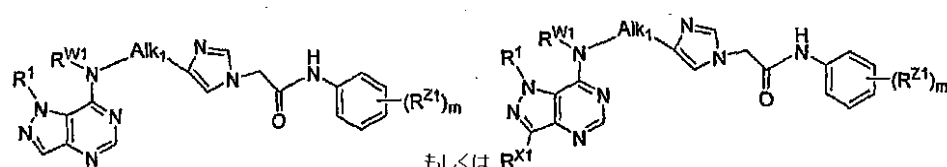
(式中、 R は、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、低級アルキルもしくは低級アルコキシであり；そして R^{X1} は、水素、メチルもしくはチエニルである)

を有する、請求項 4 0 に記載の化合物。

【請求項 4 2】

構造：

【化 4 4】



(式中、 R^{X1} は一般に、ならびに本明細書のクラスおよびサブクラスに規定されたとおりであり； R^1 および R^{W1} は共に、任意に置換された 5 ~ 6 員環を形成し； Alk_1 は、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキレンもしくは C_{2-6} アルキレン鎖であり、ここで、2 つまでの非隣接メチレンユニットは、独立して任意で $-C(=O)-$ 、 $-CO_2-$ 、

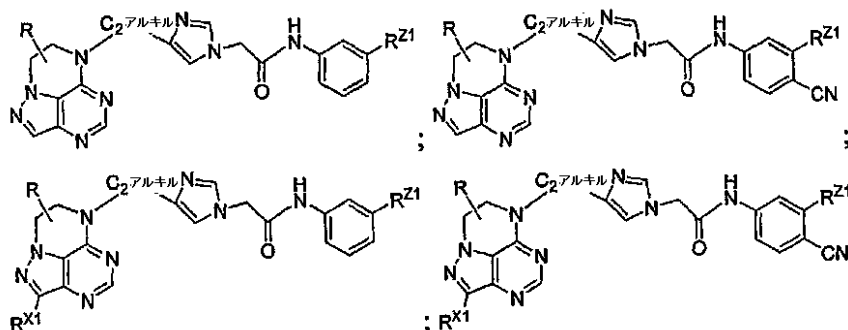
- C(=O)C(=O)-、- C(=O)NR^{L1A}-、- OC(=O)-、- OC(=O)NR^{L1A}-、- NR^{L1A}NR^{L1B}-、- NR^{L1A}NR^{L1B}C(=O)-、- NR^{L1A}C(=O)-、- NR^{L1A}CO₂-、- NR^{L1A}C(=O)NR^{L1B}-、- S(=O)-、- SO₂-、- NR^{L1A}SO₂-、- SO₂NR^{L1A}-、- NR^{L1A}SO₂NR^{L1B}-、- O-、- S-、もしくは- NR^{L1A}-で置換されており；ここで、R^{L1A}およびR^{L1B}の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリールもしくはアシルであり；mは0～3の整数であり；rは1～4の整数であり；R^{Z1}の各存在は、独立して水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、- (アルキル)アリールもしくは- (アルキル)ヘテロアリール、- OR^{Z2}、- SR^{Z2}、- NR^{Z2}R^{Z3}、- SO₂NR^{Z2}R^{Z3}、- SO₂R^{Z1}、- C(=O)NR^{Z2}R^{Z3}、ハロゲン、- CN、- NO₂、- C(=O)OR^{Z3}、- N(R^{Z2})C(=O)R^{Z3} (式中、R^{Z2}およびR^{Z3}の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、- (アルキル)アリール、- (アルキル)ヘテロアリールもしくはアシルであるか、またはR^{Z2}およびR^{Z3}は、それらが結合している窒素原子と共に5～6員の複素環を形成する)である)

を有する、請求項1に記載の化合物。

【請求項43】

構造：

【化45】



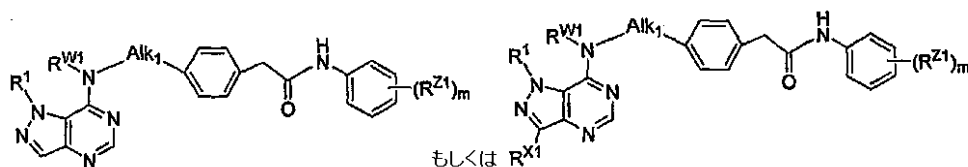
(式中、Rは、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、低級アルキルもしくは低級アルコキシであり；R^{X1}は、水素、メチルもしくはチエニルであり、そしてR^{Z1}は水素、ハロゲン、低級アルキルもしくは低級ハロアルキルである)

を有する、請求項42に記載の化合物。

【請求項44】

構造：

【化46】



(式中、R^{X1}は一般に、ならびに本明細書のクラスおよびサブクラスに規定されたとおりであり；R¹およびR^{W1}は共に、任意に置換された5～6員環を形成し；Alk₁は、置換もしくは非置換C₁～6アルキレンもしくはC₂～6アルキレン鎖であり、ここで、2つまでの非隣接メチレンユニットは、独立して任意で- C(=O)-、- CO₂-、- C(=O)C(=O)-、- C(=O)NR^{L1A}-、- OC(=O)-、- OC(=O)NR^{L1A}-、- NR^{L1A}NR^{L1B}-、- NR^{L1A}NR^{L1B}C(=O)-、- NR^{L1A}C(=O)-、- NR^{L1A}CO₂-、- NR^{L1A}C(=O)NR^{L1B}-、- S(=O)-、- SO₂-、- NR^{L1A}SO₂-、- SO₂NR^{L1A}-、- NR^{L1A}SO₂NR^{L1B}-、- O-、- S-、もしくは- NR^{L1A}-で置換されてお

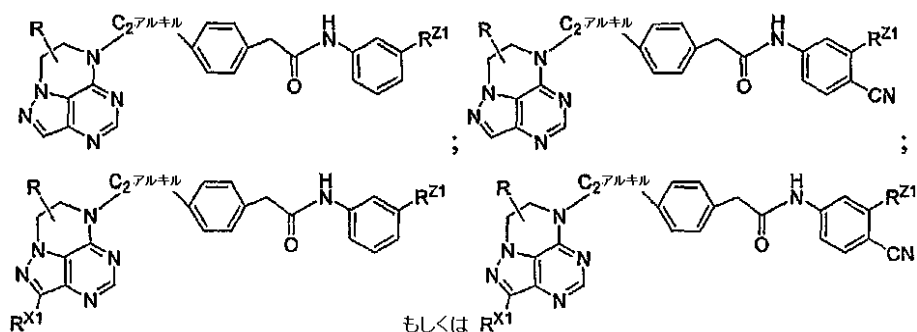
り；ここで、 R^{L1A} および R^{L1B} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリールもしくはアシルであり； m は 0 ~ 3 の整数であり； r は 1 ~ 4 の整数であり； R^{Z1} の各存在は、独立して水素、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、- (アルキル) アリールもしくは - (アルキル) ヘテロアリール、- OR^{Z2} 、- SR^{Z2} 、- $NR^{Z2}R^{Z3}$ 、- $SO_2NR^{Z2}R^{Z3}$ 、- SO_2R^{Z1} 、- $C(=O)NR^{Z2}R^{Z3}$ 、ハロゲン、- CN 、- NO_2 、- $C(=O)OR^{Z3}$ 、- $N(R^{Z2})C(=O)R^{Z3}$ (式中、 R^{Z2} および R^{Z3} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、- (アルキル) アリール、- (アルキル) ヘテロアリールもしくはアシルであるか、または R^{Z2} および R^{Z3} は、それらが結合している窒素原子と共に 5 ~ 6 員の複素環を形成する) である)

を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 45】

構造：

【化 47】



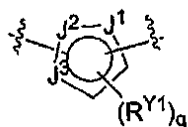
(式中、 R は、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、低級アルキルもしくは低級アルコキシであり； R^{X1} は、水素、メチルもしくはチエニルであり、そして R^{Z1} は水素、ハロゲン、低級アルキルもしくは低級ハロアルキルである)

を有する、請求項 44 に記載の化合物。

【請求項 46】

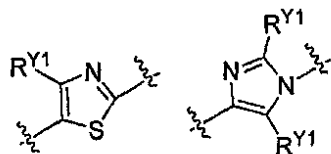
構造：

【化 48】



を有する前記 5 員環は、以下の構造：

【化 49】

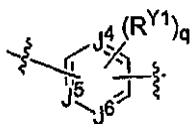


の 1 つを有する、請求項 13、14 または 15 に記載の化合物。

【請求項 47】

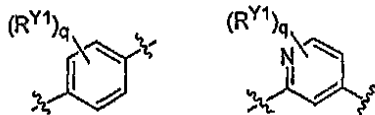
構造：

【化 5 0】



を有する前記 6 員環は、以下の構造：

【化 5 1】



の 1 つを有する、請求項 13、16 または 17 に記載の化合物。

【請求項 48】

- W^1 - Alk₁ - は、- NH - C₁₋₆ アルキル - もしくは - O - C₁₋₆ アルキル - (式中、C₁₋₆ アルキル成分は任意に置換されていても非置換であってもよい) である、請求項 6、13、14、15、16、17 または 18 に記載の化合物。

【請求項 49】

- W^1 - Alk₁ - は、- NHCH₂CH₂ -、- OCH₂CH₂ - もしくは - NH - CH₂CH(CH₂OH) - である、請求項 48 に記載の化合物。

【請求項 50】

- N(R^{W2})C(=O)G₂ - は、- NHC(=O) -、NHC(=O)O -、または - NHC(=O)NH - である、請求項 7、14 または 16 に記載の化合物。

【請求項 51】

- N(R^{W2})C(=O)G₂ - は - NHC(=O)NH - である、請求項 50 に記載の化合物。

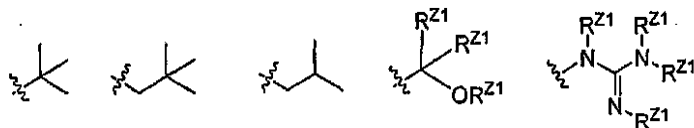
【請求項 52】

- N(R^{W2})C(=O)N(R^{W2})CR^{W3}R^{W4} - は - NHC(=O)NHCH₂ - であり、そして - CR^{W3}R^{W4}C(=O)N(R^{W2}) - は - CH₂C(=O)NH - である、請求項 8、15 もしくは 17 に記載の化合物。

【請求項 53】

Z は以下の構造：

【化 5 2】



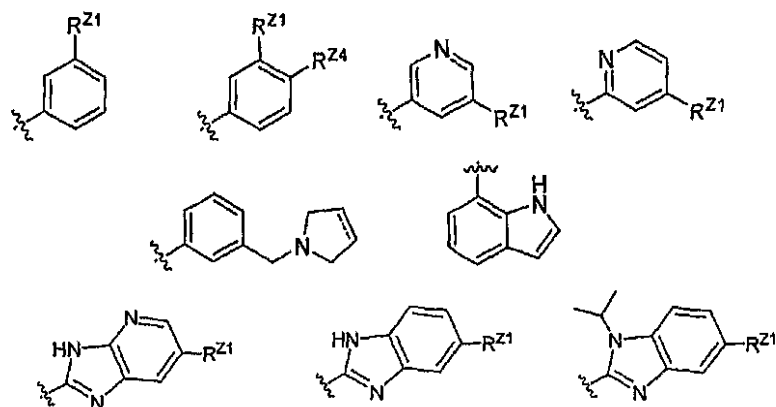
(式中、R^{Z1} の各存在は、独立して水素、低級アルキル、低級アルケニル、アリール、ヘテロアリールもしくはアシルである)

の 1 つを有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 54】

Z は以下の構造：

【化 5 3】



(式中、 R^{Z1} は、Cl、F、メチルもしくは $-CF_3$ である；および R^{Z4} は、水素もしくはシアノである)

の1つを有する、請求項1に記載の化合物。

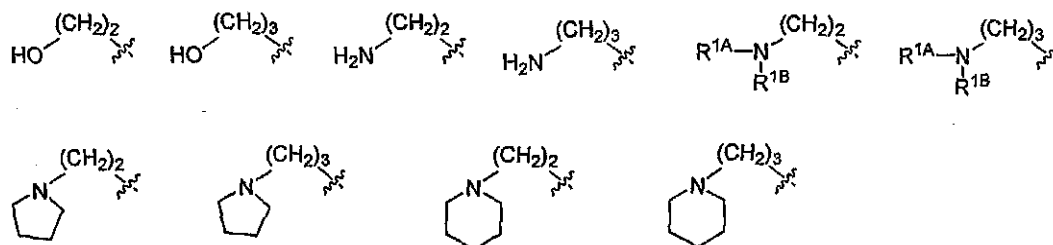
【請求項55】

R^1 、 R^3 および R^4 は、独立して水素または低級アルキルである、請求項1～54のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項56】

R^1 、 R^3 および R^4 は独立して水素、メチル、エチル、イソプロピルまたは：

【化 5 4】



(式中、 R^{1A} および R^{1B} は、独立して水素、メチルもしくはエチルである)の1つである、請求項55に記載の化合物。

【請求項57】

有効量の請求項1～56のいずれか一項に記載の化合物、および医薬上許容される担体、アジュバント、またはビヒクルを含む、組成物。

【請求項58】

前記化合物はAuroraプロテインキナーゼ活性を検出可能に阻害する量にある、請求項57に記載の組成物。

【請求項59】

化学療法薬もしくは抗増殖薬、免疫調節もしくは免疫抑制薬、神経栄養因子、心血管疾患を治療するための薬物、破壊性骨疾患を治療するための薬物、肝臓疾患を治療するための薬物、抗ウイルス薬、血液疾患を治療するための薬物、糖尿病を治療するための薬物、または免疫不全性疾患を治療するための薬物から選択された薬物をさらに含む、請求項57に記載の組成物。

【請求項60】

被験体におけるAuroraキナーゼ活性を阻害するための組成物であって、該組成物は：

a) 請求項57に記載の組成物；または

b) 請求項1～56のいずれか一項に記載の化合物

を含む、組成物。

【請求項 6 1】

前記組成物は、A u r o r a キナーゼ活性を阻害することを特徴とする、請求項 6 0 に記載の組成物。

【請求項 6 2】

増殖性疾患、心疾患、神経変性疾患、自己免疫疾患、臓器移植に関連する状態、炎症性疾患、免疫媒介性疾患、ウイルス疾患、または骨疾患から選択された状態の疾患を治療するか、または重症度を緩和するための組成物であって：

a) 請求項 5 7 に記載の組成物；または

b) 請求項 1 ~ 5 6 のいずれか一項に記載の化合物

を含む、組成物。

【請求項 6 3】

前記組成物は、化学療法薬もしくは抗増殖薬、免疫調節もしくは免疫抑制薬、神経栄養因子、心血管疾患を治療するための薬物、破壊性骨疾患を治療するための薬物、肝臓疾患を治療するための薬物、抗ウイルス薬、血液疾患を治療するための薬物、糖尿病を治療するための薬物、または免疫不全性疾患を治療するための薬物から選択された追加の治療薬と共に投与されることを特徴とし、該追加の治療薬は治療されている疾患のために適切であり；かつ該追加の治療薬は、単回投与製剤として該組成物と共に投与されるか、または複数回製剤の一部として該組成物とは別個に投与されることを特徴とする、請求項 6 2 に記載の組成物。

【請求項 6 4】

生物学的サンプルにおける A u r o r a キナーゼ活性を阻害する方法であって、該方法は：

a) 請求項 5 7 に記載の組成物；または

b) 請求項 1 ~ 5 6 のいずれか一項に記載の化合物

を、該生物学的サンプルと接触させる工程を含む方法。