

【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23年3月31日(2011.3.31)

【公表番号】特表2010-518085(P2010-518085A)

【公表日】平成22年5月27日(2010.5.27)

【年通号数】公開・登録公報2010-021

【出願番号】特願2009-549116(P2009-549116)

【国際特許分類】

C 0 7 D 249/08 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 249/10 (2006.01)

C 0 7 D 405/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/10 (2006.01)

C 0 7 D 405/06 (2006.01)

C 0 7 D 249/12 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/4196 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/427 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/10 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 33/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 249/08 5 3 5

C 0 7 D 403/04 C S P

C 0 7 D 403/14

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 405/14  
C 0 7 D 401/12  
C 0 7 D 401/04  
C 0 7 D 417/12  
C 0 7 D 249/10  
C 0 7 D 405/04  
C 0 7 D 401/10  
C 0 7 D 405/06  
C 0 7 D 249/12 5 1 2  
C 0 7 D 249/12 5 1 1  
C 0 7 D 249/12 5 0 2  
C 0 7 D 403/12  
C 0 7 D 405/12  
A 6 1 K 31/4196  
A 6 1 K 31/506  
A 6 1 K 31/4439  
A 6 1 K 31/427  
A 6 1 K 31/5377  
A 6 1 K 31/454  
A 6 1 K 31/496  
A 6 1 K 31/444  
A 6 1 K 31/541  
A 6 1 P 35/00  
A 6 1 P 9/00  
A 6 1 P 31/10  
A 6 1 P 31/04  
A 6 1 P 31/12  
A 6 1 P 33/00  
A 6 1 P 43/00 1 1 1  
A 6 1 P 29/00  
A 6 1 P 37/02  
A 6 1 P 37/06

【手続補正書】

【提出日】平成23年2月7日(2011.2.7)

【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

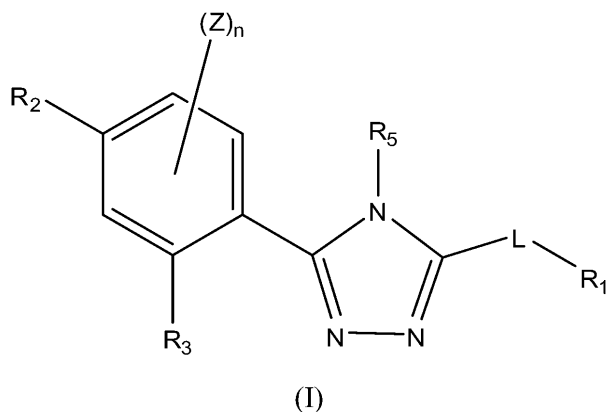
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の構造式で表される化合物またはその薬学的に許容される塩：



式中、

L は、ヌル、 $-S-CR_{12}-$ 、 $-O-CR_{12}-$ 、 $-NR_{14}-CR_{12}-$ 、 $-CR_{12}-S-$ 、 $-CR_{12}-O-$ 、 $-CR_{12}-NR_{13}-$ 、 $-CR_{12}-CR_{12}-$ 、 $-CR_{12}-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NR_{14}-$ 、 $-O-O-$ 、 $-S-S-$ 、 $-NR_{13}-NR_{13}-$ 、 $-O-S-$ 、 $-S-O-$ 、 $-S-NR_{13}-$ 、 $-O-NR_{13}-$ 、 $-NR_{13}-O-$ または $-NR_{13}-S-$ であり、

$R_1$  は、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキルまたは $-C(O)N(R_{13})_2$ であり、

$R_2$  および  $R_3$  は独立して、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NR_7H$ 、 $-OR_{26}$ 、 $-SR_{26}$ 、 $-O(CH_2)_mOH$ 、 $-O(CH_2)_mSH$ 、 $-O(CH_2)_mNR_7H$ 、 $-S(CH_2)_mOH$ 、 $-S(CH_2)_mSH$ 、 $-S(CH_2)_mNR_7H$ 、 $-OC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-SC(O)R_7$ 、 $-NR_7C(O)R_7$ 、 $-OC(O)OR_7$ 、 $-SC(O)OR_7$ 、 $-NR_7C(O)OR_7$ 、 $-OCH_2C(O)R_7$ 、 $-SCH_2C(O)R_7$ 、 $-NR_7CH_2C(O)R_7$ 、 $-OCH_2C(O)OR_7$ 、 $-SCH_2C(O)OR_7$ 、 $-NR_7CH_2C(O)OR_7$ 、 $-OCH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SCH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7CH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-SS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-SS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-OS(O)_pOR_7$ 、 $-SS(O)_pOR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pOR_7$ 、 $-OC(S)R_7$ 、 $-SC(S)R_7$ 、 $-NR_7C(S)R_7$ 、 $-OC(S)OR_7$ 、 $-SC(S)OR_7$ 、 $-NR_7C(S)OR_7$ 、 $-OC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(NR_8)R_7$ 、 $-SC(NR_8)R_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)R_7$ 、 $-OC(NR_8)OR_7$ 、 $-SC(NR_8)OR_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)OR_7$ 、 $-OC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ であり、

$R_5$  は、 $-H$ 、 $-X_{20}R_{50}$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

$R_7$  および  $R_8$  は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

もよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

$R_{10}$  および  $R_{11}$  は、それぞれについて独立して、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであるか、または  $R_{10}$  および  $R_{11}$  が、それらが結合する窒素と一緒にあって、置換されていてもよいヘテロシクリルまたは置換されていてもよいヘテロアリールを形成し、

各  $R_{12}$  は独立して、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

各  $R_{13}$  は独立して、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

各  $R_{14}$  は独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

$R_{26}$  は、C 1 ~ C 4 アルキルであり、

$R_{50}$  は、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールであり、

$X_{20}$  は、C 1 ~ C 4 アルキル、 $NR_7$ 、C(O)、C(S)、C( $NR_8$ )またはS(O)<sub>p</sub>であり、

Z は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ (guanadino)、ハロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、

-  $NR_{10}R_{11}$ 、-  $OR_7$ 、- C(O) $R_7$ 、- C(O) $OR_7$ 、- C(S) $R_7$ 、- C(O)S $R_7$ 、- C(S)S $R_7$ 、- C(S) $OR_7$ 、- C(S) $NR_{10}R_{11}$ 、- C( $NR_8$ ) $OR_7$ 、- C( $NR_8$ ) $R_7$ 、- C( $NR_8$ ) $NR_{10}R_{11}$ 、- C( $NR_8$ )S $R_7$ 、- OC(O) $R_7$ 、- OC(O) $OR_7$ 、- OC(S) $OR_7$ 、- OC( $NR_8$ ) $OR_7$ 、- SC(O) $R_7$ 、- SC(O) $OR_7$ 、- SC( $NR_8$ ) $OR_7$ 、- OC(S) $R_7$ 、- SC(S) $R_7$ 、- SC(S) $OR_7$ 、- OC(O) $NR_{10}R_{11}$ 、- OC(S) $NR_{10}R_{11}$ 、- OC( $NR_8$ ) $NR_{10}R_{11}$ 、- SC(O) $NR_{10}R_{11}$ 、- SC( $NR_8$ ) $NR_{10}R_{11}$ 、- SC(S) $NR_{10}R_{11}$ 、- OC( $NR_8$ ) $R_7$ 、- SC( $NR_8$ ) $R_7$ 、- C(O) $NR_{10}R_{11}$ 、-  $NR_8$ C(O) $R_7$ 、-  $NR_7$ C(S) $R_7$ 、-  $NR_7$ C(S) $OR_7$ 、-  $NR_7$ C( $NR_8$ ) $R_7$ 、-  $NR_7$ C(O) $OR_7$ 、-  $NR_7$ C( $NR_8$ ) $OR_7$ 、-  $NR_7$ C(O) $NR_{10}R_{11}$ 、-  $NR_7$ C(S) $NR_{10}R_{11}$ 、-  $NR_7$ C( $NR_8$ ) $NR_{10}R_{11}$ 、- S $R_7$ 、- S(O)<sub>p</sub> $R_7$ 、- OS(O)<sub>p</sub> $R_7$ 、- OS(O)<sub>p</sub> $OR_7$ 、- OS(O)<sub>p</sub> $NR_{10}R_{11}$

$\text{R}_1$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{OR}_7$ 、 $-\text{NR}_8\text{S}(\text{O})_p\text{R}_7$ 、 $-\text{NR}_7\text{S}(\text{O})_p\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_7\text{S}(\text{O})_p\text{OR}_7$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{SS}(\text{O})_p\text{R}_7$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{OR}_7$ 、 $-\text{SS}(\text{O})_p\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}_7)_2$ または $-\text{SP}(\text{O})(\text{OR}_7)_2$ であり、

mは、それぞれについて独立して、1、2、3または4であり、

pは、それぞれについて独立して、1または2であり、

nは、0、1、2または3であり、

ただし、Lが、 $-\text{S}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{O}-$ または $-\text{O}-\text{CH}_2-$ であれば、 $\text{R}_1$ は、置換されていてもよいC1～C4アルキルではなく、

Lが $-\text{S}-\text{CH}_2-$ かつ $\text{R}_5$ がメトキシフェニルであれば、 $\text{R}_1$ はテトラヒドロ-2H-ピラン-2-イルではなく、

Lが $-\text{S}-\text{CH}_2-$ かつ $\text{R}_5$ が $-\text{H}$ であれば、 $\text{R}_1$ は置換されていてもよいピリジルまたはフルオロフェニルではなく、

Lが $-\text{O}-$ または $-\text{S}-$ であれば、 $\text{R}_1$ は $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}_{13})_2$ または置換されていてもよいC1～C4アルキルではなく、

Lが $-\text{N}(\text{CH}_3)-$ または $-\text{O}-$ であれば、 $\text{R}_1$ は置換されていてもよいフルオロフェニルではなく、

Lが $-\text{CH}_2-$ であれば、 $\text{R}_1$ は1, 2, 3-トリアゾリルではなく、

Lが $-\text{CH}_2-$ または $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ であれば、 $\text{R}_1$ は置換されていてもよいC1～C7アルキルではなく、

Lが $-\text{CH}_2-\text{S}-$ であれば、 $\text{R}_1$ はクロロフェニルではない。

#### 【請求項2】

Lが、ヌル、 $-\text{S}-\text{CR}_{12}-$ 、 $-\text{O}-\text{CR}_{12}-$ 、 $-\text{NR}_{14}-\text{CR}_{12}-$ 、 $-\text{CR}_{12}-\text{CR}_{12}-$ 、 $-\text{CR}_{12}-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ または $-\text{NR}_{14}-$ である、請求項1に記載の化合物。

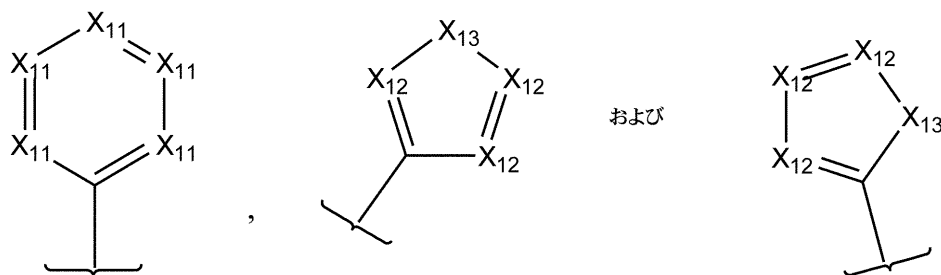
#### 【請求項3】

$\text{R}_5$ が、置換されていてもよいインドリル、置換されていてもよいベンゾイミダゾリル、置換されていてもよいインダゾリル、置換されていてもよい3H-インダゾリル、置換されていてもよいインドリジニル、置換されていてもよいキノリニル、置換されていてもよいイソキノリニル、置換されていてもよいベンゾキサゾリル、置換されていてもよいベンゾ[1,3]ジオキサゾリル、置換されていてもよいベンゾフリル、置換されていてもよいベンゾチアゾリル、置換されていてもよいベンゾ[d]イソキサゾリル、置換されていてもよいベンゾ[d]イソチアゾリル、置換されていてもよいチアゾロ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[5,4-c]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[5,4-b]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[5,4-c]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[5,4-b]ピリジニル、置換されていてもよいイミダゾピリジニル、置換されていてもよいベンゾチアジアゾリル、ベンゾキサジアゾリル、置換されていてもよいベンゾトリアゾリル、置換されていてもよいテトラヒドロインドリル、置換されていてもよいアザインドリル、置換されていてもよいキナゾリニル、置換されていてもよいプリニル、置換されていてもよいイミダゾ[4,5-a]ピリジニル、置換されていてもよいイミダゾ[1,2-a]ピリジニル、置換されていてもよい3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよい1H-イミダゾ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよい3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいピリドピルダジニルおよび置換されていてもよいピリドピリミジニル、置換されていてもよいピロロ[2,3]ピリミジル、置換されていてもよいピラゾロ[3,4]ピリミジル、置換されていてもよいシクロペンタイミダゾリル、置換されていてもよいシクロペンタトリアゾリル、置換されていてもよいピロロピラゾリル、置換されていても

よいピロロイミダゾリル、置換されていてもよいピロロトリアゾリルまたは置換されていてもよいベンゾ(b)チエニルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

R<sub>5</sub>が、



からなる群から選択され、式中、

X<sub>11</sub>は、それぞれについて独立して、CH、CR<sub>9</sub>、N、N(O)またはN<sup>+</sup>(R<sub>17</sub>)であり、

X<sub>12</sub>は、それぞれについて独立して、CH、CR<sub>9</sub>、N、N(O)、N<sup>+</sup>(R<sub>17</sub>)であり、但し、少なくとも1つのX<sub>12</sub>基が、CHおよびCR<sub>9</sub>から独立して選択され、

X<sub>13</sub>は、それぞれについて独立して、O、S、S(O)<sub>p</sub>、NR<sub>7</sub>またはNR<sub>17</sub>であり、

R<sub>9</sub>は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、  
-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OR<sub>7</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、  
-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、  
-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、  
-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、  
-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>からなる群から選択される置換基であるか、

または2つのR<sub>9</sub>基が、それらが結合する炭素原子と一緒になって縮合環を形成し、

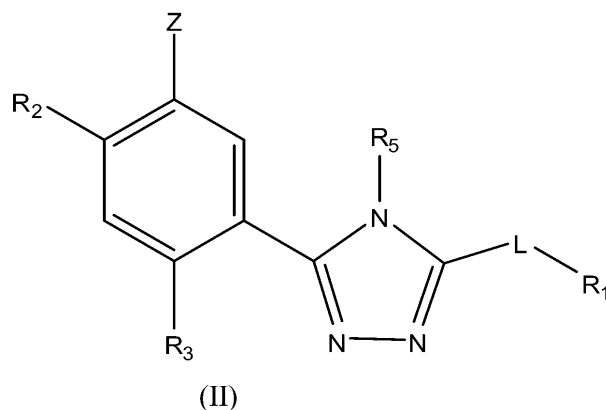
R<sub>17</sub>は、それぞれについて独立して、アルキルまたはアラルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

R<sub>5</sub>がX<sub>20</sub>R<sub>50</sub>であり、X<sub>20</sub>がC1~C4アルキルであり、R<sub>50</sub>が置換されていてもよいフェニルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

化合物が、式(II)



の化合物であって、

式中、

L は、ヌル、 $-S-CR_{12}-$ 、 $-O-CR_{12}-$ 、 $-NR_{14}-CR_{12}-$ 、 $-CR_{12}-CR_{12}-$ 、 $-CR_{12}-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$  または  $-NR_{14}-$  であり、

$R_1$  は、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよいチアゾリル、置換されていてもよいピリジニル、置換されていてもよいジヒドロフラン、置換されていてもよいピリミジン-ジオン、置換されていてもよいイミダゾリルまたは  $-C(O)N(R_{13})_2$  であり、かつ

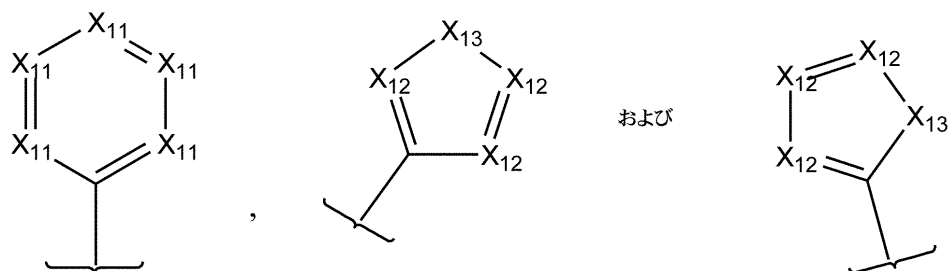
Z は、C 1 ~ C 6 アルキル、C 1 ~ C 6 ハロアルキル、C 1 ~ C 6 アルコキシ、C 1 ~ C 6 ハロアルコキシ、C 1 ~ C 6 アルキルスルファニルまたは C 3 ~ C 6 シクロアルキルである、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 7】

$R_5$  が、置換されていてもよいインドリル、置換されていてもよいベンゾイミダゾリル、置換されていてもよいインダゾリル、置換されていてもよい 3 H - インダゾリル、置換されていてもよいインドリジニル、置換されていてもよいキノリニル、置換されていてもよいイソキノリニル、置換されていてもよいベンゾキサゾリル、置換されていてもよいベンゾ [ 1 , 3 ] ジオキサゾリル、置換されていてもよいベンゾフリル、置換されていてもよいベンゾチアゾリル、置換されていてもよいベンゾ [ d ] イソキサゾリル、置換されていてもよいベンゾ [ d ] イソチアゾリル、置換されていてもよいチアゾロ [ 4 , 5 - c ] ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ [ 5 , 4 - c ] ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ [ 4 , 5 - b ] ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ [ 5 , 4 - b ] ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ [ 4 , 5 - c ] ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ [ 5 , 4 - c ] ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ [ 4 , 5 - b ] ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ [ 5 , 4 - b ] ピリジニル、置換されていてもよいイミダゾピリジニル、置換されていてもよいベンゾチアジアゾリル、ベンゾキサジアゾリル、置換されていてもよいベンゾトリアゾリル、置換されていてもよいテトラヒドロインドリル、置換されていてもよいアザインドリル、置換されていてもよいキナゾリニル、置換されていてもよいブリニル、置換されていてもよいイミダゾ [ 4 , 5 - a ] ピリジニル、置換されていてもよいイミダゾ [ 1 , 2 - a ] ピリジニル、置換されていてもよい 3 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジニル、置換されていてもよい 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジニル、置換されていてもよい 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジニル、置換されていてもよい 3 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジニル、置換されていてもよいピリドピルダジニルおよび置換されていてもよいピリドピリミジニル、置換されていてもよいピロロ [ 2 , 3 ] ピリミジニル、置換されていてもよいピラゾロ [ 3 , 4 ] ピリミジニル、置換されていてもよいシクロペンタイミダゾリル、置換されていてもよいシクロペンタトリアゾリル、置換されていてもよいピロロピラゾリル、置換されていてもよいピロロイミダゾリル、置換されていてもよいピロロトリアゾリルまたは置換されていてもよいベンゾ ( b ) チエニルである、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

R<sub>5</sub> が、



からなる群から選択され、式中、

X<sub>11</sub> は、それぞれについて独立して、CH、CR<sub>9</sub>、N、N(O) または N<sup>+</sup>(R<sub>17</sub>) であり、

X<sub>12</sub> は、それぞれについて独立して、CH、CR<sub>9</sub>、N、N(O)、N<sup>+</sup>(R<sub>17</sub>) であり、但し、少なくとも1つのX<sub>12</sub>基が、CHおよびCR<sub>9</sub>から独立して選択され、

X<sub>13</sub> は、それぞれについて独立して、O、S、S(O)<sub>p</sub>、NR<sub>7</sub> または NR<sub>17</sub> であり、

R<sub>9</sub> は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、  
 -NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OR<sub>7</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、  
 -C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、  
 -S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub> または -S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、  
 -S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub> または -SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、  
 -S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub> または -SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub> からなる群から選択される置換基であるか、

または2つのR<sub>9</sub>基が、それらが結合する炭素原子と一緒になって縮合環を形成し、

R<sub>17</sub> は、それぞれについて独立して、アルキルまたはアラルキルである、請求項6に記載の化合物。

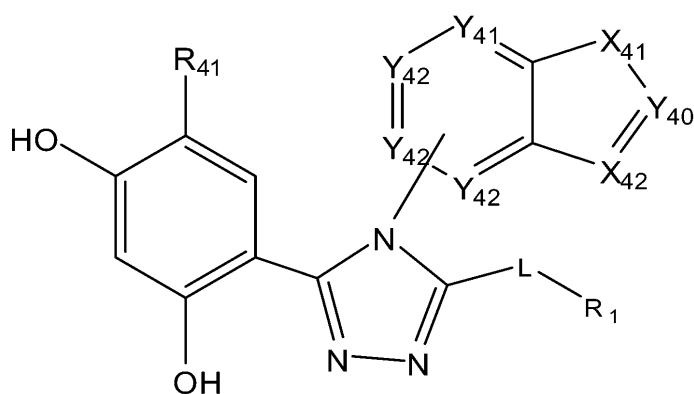
【請求項9】

R<sub>5</sub> が X<sub>20</sub>R<sub>50</sub> であり、X<sub>20</sub> が C1 ~ C4 アルキルであり、R<sub>50</sub> が置換されていてもよいフェニルである、請求項6に記載の化合物。

【請求項10】

化合物が、以下の構造





(IV)

で表され、

式中、

$X_{41}$  は、O、S または  $NR_{42}$  であり、

$X_{42}$  は、 $CR_{44}$  または N であり、

$Y_{40}$  は、N または  $CR_{43}$  であり、

$Y_{41}$  は、N または  $CR_{45}$  であり、

$Y_{42}$  は、それぞれについて独立して、N、C または  $CR_{46}$  であり、

$R_{41}$  は、-H、-OH、-SH、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシまたはシクロアルコキシ、ハロアルコキシ、- $NR_{10}R_{11}$ 、- $OR_7$ 、- $C(O)R_7$ 、- $C(O)OR_7$ 、- $C(S)R_7$ 、- $C(OS)R_7$ 、- $C(S)SR_7$ 、- $C(S)OR_7$ 、- $C(S)NR_{10}R_{11}$ 、- $C(NR_8)OR_7$ 、- $C(NR_8)R_7$ 、- $C(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、- $C(NR_8)SR_7$ 、- $OC(O)R_7$ 、- $OC(O)OR_7$ 、- $OC(S)OR_7$ 、- $OC(NR_8)OR_7$ 、- $SC(O)R_7$ 、- $SC(O)OR_7$ 、- $SC(NR_8)OR_7$ 、- $OC(S)R_7$ 、- $SC(S)R_7$ 、- $SC(S)OR_7$ 、- $OC(O)NR_{10}R_{11}$ 、- $OC(S)NR_{10}R_{11}$ 、- $OC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、- $SC(O)NR_{10}R_{11}$ 、- $SC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、- $SC(S)NR_{10}R_{11}$ 、- $OC(NR_8)R_7$ 、- $SC(NR_8)R_7$ 、- $C(O)NR_{10}R_{11}$ 、- $NR_8C(O)R_7$ 、- $NR_7C(S)R_7$ 、- $NR_7C(S)OR_7$ 、- $NR_7C(NR_8)R_7$ 、- $NR_7C(O)OR_7$ 、- $NR_7C(NR_8)OR_7$ 、- $NR_7C(O)NR_{10}R_{11}$ 、- $NR_7C(S)NR_{10}R_{11}$ 、- $NR_7C(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、- $SR_7$ 、- $S(O)_pR_7$ 、- $OS(O)_pR_7$ 、- $OS(O)_pOR_7$ 、- $OS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、- $S(O)_pOR_7$ 、- $NR_8S(O)_pR_7$ 、- $NR_7S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、- $NR_7S(O)_pOR_7$ 、- $S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、- $SS(O)_pR_7$ 、- $SS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、- $OP(O)(OR_7)_2$  または - $SP(O)(OR_7)_2$  であり、

$R_{42}$  は、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、- $C(O)R_7$ 、- $(CH_2)_mC(O)OR_7$ 、- $C(O)OR_7$ 、- $OC(O)R_7$ 、- $C(O)NR_{10}R_{11}$ 、- $S(O)_pR_7$ 、- $S(O)_pOR_7$  または - $S(O)_pNR_{10}R_{11}$  であり、

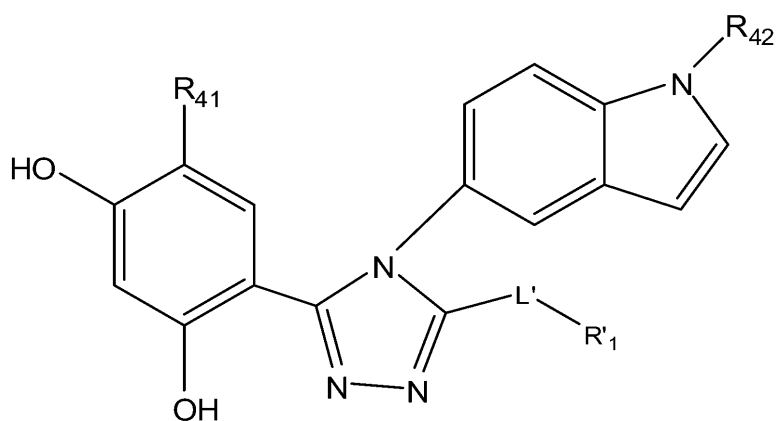
$R_{43}$  および  $R_{44}$  は、独立して、-H、-OH、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$  であるが、 $R_{43}$  および  $R_{44}$  が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロシクリルまたは置換されていてもよいヘテロアリールを形成し、

$R_{45}$  は、-H、-OH、-SH、 $-NR_7H$ 、 $-OR_{26}$ 、 $-SR_{26}$ 、 $-NHR_{26}$ 、 $-O(CH_2)_mOH$ 、 $-O(CH_2)_mSH$ 、 $-O(CH_2)_mNR_7H$ 、 $-S(CH_2)_mOH$ 、 $-S(CH_2)_mSH$ 、 $-S(CH_2)_mNR_7H$ 、 $-OC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-SC(O)R_7$ 、 $-NR_7C(O)R_7$ 、 $-OC(O)OR_7$ 、 $-SC(O)OR_7$ 、 $-NR_7C(O)OR_7$ 、 $-OCH_2C(O)R_7$ 、 $-SCH_2C(O)R_7$ 、 $-NR_7CH_2C(O)R_7$ 、 $-OCH_2C(O)OR_7$ 、 $-SCH_2C(O)OR_7$ 、 $-NR_7CH_2C(O)OR_7$ 、 $-OCH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SCH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7CH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-SS(O)_pR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-SS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-OS(O)_pOR_7$ 、 $-SS(O)_pOR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pOR_7$ 、 $-OC(S)R_7$ 、 $-SC(S)R_7$ 、 $-NR_7C(S)R_7$ 、 $-OC(S)OR_7$ 、 $-SC(S)OR_7$ 、 $-NR_7C(S)OR_7$ 、 $-OC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(NR_8)R_7$ 、 $-SC(NR_8)R_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)R_7$ 、 $-OC(NR_8)OR_7$ 、 $-SC(NR_8)OR_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)OR_7$ 、 $-OC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(NR_8)NR_{10}R_{11}$  または  $-NR_7C(NR_8)NR_{10}R_{11}$  であり、

$R_{46}$  は、それぞれについて独立して、H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$  または  $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$  からなる群から選択される、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 11】

化合物が、以下の構造式



(VII)

で表され

式中、

L' は - S - C R<sub>1 2</sub> - または - S - であり、

R' <sub>1</sub> は、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよいチアゾリル、置換されていてもよいピリジニル、置換されていてもよいジヒドロフラン、置換されていてもよいピリミジン - ジオン、置換されていてもよいイミダゾリルまたは - C ( O ) N ( R<sub>1 3</sub> )<sub>2</sub> であり、

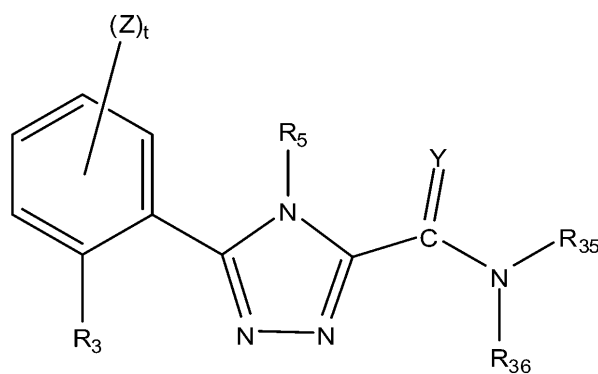
R<sub>4 1</sub> は、 - H、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、プロポキシおよびシクロプロポキシからなる群から選択され、かつ、

R<sub>4 2</sub> は、 - H または置換されていてもよい C 1 ~ C 4 アルキルである、

請求項 1 0 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 2】

以下の構造式



(VIII)

で表され、

式中、

Y は、O または S であり、

R<sub>3</sub> は、 - OH、 - SH、 - N R<sub>7</sub> H、 - O R<sub>2 6</sub>、 - S R<sub>2 6</sub>、 - O ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> O H、 - O ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> S H、 - O ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> N R<sub>7</sub> H、 - S ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> O H、 - S ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> S H、 - S ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> N R<sub>7</sub> H、 - O C ( O ) N R<sub>1 0</sub> R<sub>1 1</sub>、 - S C ( O ) N R<sub>1 0</sub> R<sub>1 1</sub>、 - N R<sub>7</sub> C ( O ) N R<sub>1 0</sub> R<sub>1 1</sub>、 - O C ( O ) R<sub>7</sub>、 - S C ( O ) R<sub>7</sub>、 - N R<sub>7</sub> C ( O ) R<sub>7</sub>、 - O C ( O ) O R<sub>7</sub>、 - S C ( O ) O R<sub>7</sub>、 - N R<sub>7</sub> C ( O ) O R<sub>7</sub>、 - O C H<sub>2</sub> C ( O ) R<sub>7</sub>、 - S C H<sub>2</sub> C ( O ) R<sub>7</sub>、 - N R<sub>7</sub> C H<sub>2</sub> C ( O ) R<sub>7</sub>、 - O C H<sub>2</sub> C ( O ) O R<sub>7</sub>、 - S C H<sub>2</sub> C ( O ) O R<sub>7</sub>、 - N R<sub>7</sub> C H<sub>2</sub> C ( O ) O R<sub>7</sub>、 - O C H<sub>2</sub> C ( O ) N R<sub>1 0</sub> R<sub>1 1</sub>、 - S C H<sub>2</sub> C ( O ) N R<sub>1 0</sub> R<sub>1 1</sub>、 -

NR<sub>7</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-SS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SS(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-SS(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OC(S)R<sub>7</sub>、-SC(S)R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(S)R<sub>7</sub>、-OC(S)OR<sub>7</sub>、-SC(S)OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(S)OR<sub>7</sub>、-OC(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>C(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>C(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>であり、

R<sub>5</sub>は、-H、-X<sub>20</sub>R<sub>50</sub>、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は、それぞれについて独立して、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

R<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>は、それぞれについて独立して、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであるか、またはR<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>が、それらが結合する窒素と一緒にあって、置換されていてもよいヘテロシクリルまたは置換されていてもよいヘテロアリールを形成し、

R<sub>26</sub>は、C1~C4アルキルであり、

R<sub>35</sub>およびR<sub>36</sub>は、それぞれについて独立して、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであるか、R<sub>35</sub>およびR<sub>36</sub>が、それらが結合するNと一緒にあって、5から7員環の複素環を形成し、

R<sub>50</sub>は、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールであり、

X<sub>20</sub>は、C1~C4アルキル、NR<sub>7</sub>、C(O)、C(S)、C(NR<sub>8</sub>)またはS(O)<sub>p</sub>であり、

Zは、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ(guanadino)、ハロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OR<sub>7</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-C(S)R<sub>7</sub>、-C(O)SR<sub>7</sub>、-C(S)SR<sub>7</sub>、-C(S)OR<sub>7</sub>、-C(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(NR

$R_8$ )  $SR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-OC(O)OR_7$ 、 $-OC(S)OR_7$ 、 $-OC(NR_8)OR_7$ 、 $-SC(O)R_7$ 、 $-SC(O)OR_7$ 、 $-SC(NR_8)OR_7$ 、 $-OC(S)R_7$ 、 $-SC(S)R_7$ 、 $-SC(S)OR_7$ 、 $-OC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(NR_8)R_7$ 、 $-SC(NR_8)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-NR_7C(S)R_7$ 、 $-NR_7C(S)OR_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)R_7$ 、 $-NR_7C(O)OR_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)OR_7$ 、 $-NR_7C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pOR_7$ 、 $-OS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7S(O)_pOR_7$ 、 $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-SS(O)_pR_7$ 、 $-SS(O)_pOR_7$ 、 $-SS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ であり、

$t$  は、0、1、2、3または4であり、

$p$  は、それぞれについて独立して、1または2である、

化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 13】

$R_3$  が、 $-OH$ 、 $-SH$ または $-NHR_7$ であり、

$R_{35}$ または $R_{36}$ のうちの一方が $-H$ であり、

$Z$  が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニルまたは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルである、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 14】

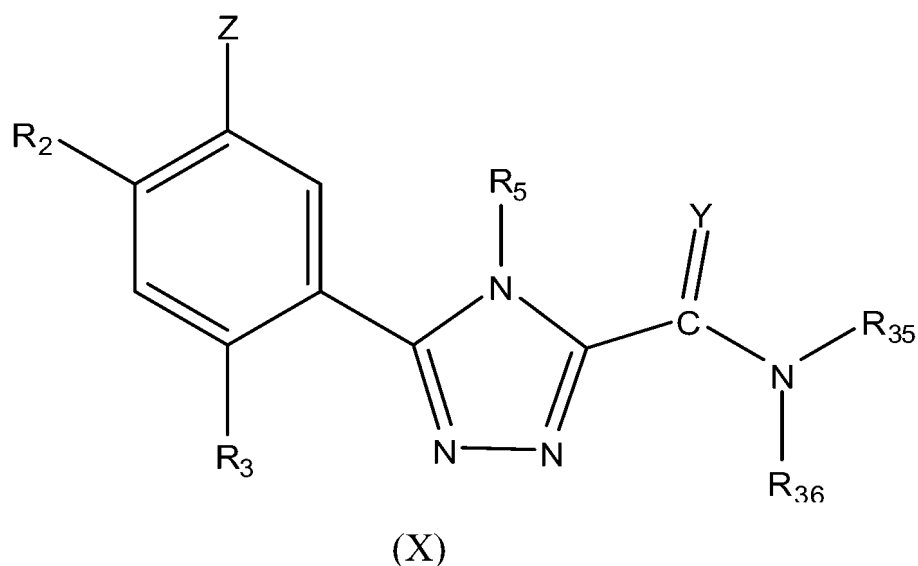
$R_{35}$ および $R_{36}$ がともに $-H$ であり、 $R_{35}$ および $R_{36}$ が、それらが結合するNと一緒にあって、5員環または6員環の複素環を形成する、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 15】

$R_5$  が $X_{20}R_{50}$ であり、 $X_{20}$  が $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、 $R_{50}$  が置換されていてもよいフェニルである、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 16】

化合物が、以下の構造式



で表され、  
 式中、

$R_2$  は -OH、-SH、-NR<sub>7</sub>H、-OR<sub>26</sub>、-SR<sub>26</sub>、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、  
 -O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>SH、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NR<sub>7</sub>H、-S(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-S(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>SH、  
 -S(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NR<sub>7</sub>H、-OC(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、  
 -NR<sub>7</sub>C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-SC(O)R<sub>7</sub>、  
 -NR<sub>7</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OC(O)OR<sub>7</sub>、-SC(O)OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(O)  
 OR<sub>7</sub>、-OCH<sub>2</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-SCH<sub>2</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>CH<sub>2</sub>C(O)R<sub>7</sub>、  
 -OCH<sub>2</sub>C(O)OR<sub>7</sub>、-SCH<sub>2</sub>C(O)OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>CH<sub>2</sub>C(O)O  
 R<sub>7</sub>、-OCH<sub>2</sub>C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SCH<sub>2</sub>C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>  
 CH<sub>2</sub>C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OS(O)pR<sub>7</sub>、-SS(O)pR<sub>7</sub>、-S(O)  
 )pOR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>S(O)pR<sub>7</sub>、-OS(O)pNR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SS(O)p  
 NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>S(O)pNR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OS(O)pOR<sub>7</sub>、-SS(O)  
 )pOR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>S(O)pOR<sub>7</sub>、-OC(S)R<sub>7</sub>、-SC(S)R<sub>7</sub>、-N  
 R<sub>7</sub>C(S)R<sub>7</sub>、-OC(S)OR<sub>7</sub>、-SC(S)OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(S)OR<sub>7</sub>、  
 -OC(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>C(S)NR<sub>10</sub>  
 R<sub>11</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、  
 -OC(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-O  
 C(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>C(NR<sub>8</sub>)  
 NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、または -SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub> である、  
 請求項 12 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 17】

$R_2$  および  $R_3$  が独立して、-OH、-SH または -NHR<sub>7</sub> である、請求項 16 に記載の化合物。

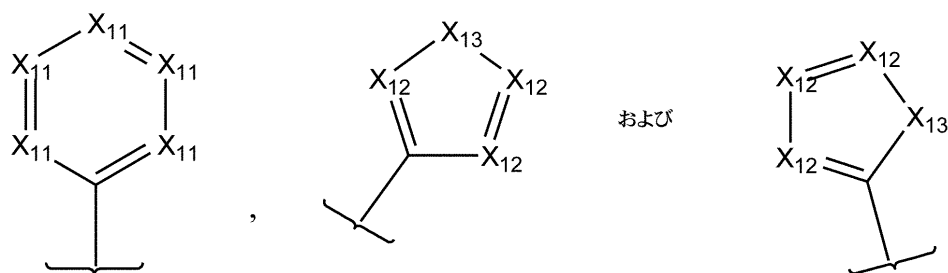
【請求項 18】

$R_5$  が、置換されていてもよいインドリル、置換されていてもよいベンゾイミダゾリル、置換されていてもよいインダゾリル、置換されていてもよい 3H-インダゾリル、置換されていてもよいインドリジニル、置換されていてもよいキノリニル、置換されていてもよいイソキノリニル、置換されていてもよいベンゾキサゾリル、置換されていてもよいベンゾ[1,3]ジオキサゾリル、置換されていてもよいベンゾフリル、置換されていてもよい

いベンゾチアゾリル、置換されていてもよいベンゾ[ d ]イソキサゾリル、置換されていてもよいベンゾ[ d ]イソチアゾリル、置換されていてもよいチアゾロ[ 4 , 5 - c ]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[ 5 , 4 - c ]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[ 4 , 5 - b ]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[ 5 , 4 - b ]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[ 4 , 5 - c ]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[ 5 , 4 - c ]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[ 4 , 5 - b ]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[ 5 , 4 - b ]ピリジニル、置換されていてもよいイミダゾピリジニル、置換されていてもよいベンゾチアジアゾリル、ベンゾキサジアゾリル、置換されていてもよいベンゾトリアゾリル、置換されていてもよいテトラヒドロインドリル、置換されていてもよいアザインドリル、置換されていてもよいキナゾリニル、置換されていてもよいプリニル、置換されていてもよいイミダゾ[ 4 , 5 - a ]ピリジニル、置換されていてもよいイミダゾ[ 1 , 2 - a ]ピリジニル、置換されていてもよい3 H - イミダゾ[ 4 , 5 - b ]ピリジニル、置換されていてもよい1 H - イミダゾ[ 4 , 5 - b ]ピリジニル、置換されていてもよい1 H - イミダゾ[ 4 , 5 - c ]ピリジニル、置換されていてもよい3 H - イミダゾ[ 4 , 5 - c ]ピリジニル、置換されていてもよいピリドピルダジニルおよび置換されていてもよいピリドピリミジニル、置換されていてもよいピロロ[ 2 , 3 ]ピリミジニル、置換されていてもよいピラゾロ[ 3 , 4 ]ピリミジニル、置換されていてもよいシクロペンタイミダゾリル、置換されていてもよいシクロペンタトリアゾリル、置換されていてもよいピロロピラゾリル、置換されていてもよいピロロイミダゾリル、置換されていてもよいピロロトリアゾリルまたは置換されていてもよいベンゾ( b )チエニルである、請求項 1 6 に記載の化合物。

【請求項 1 9】

R<sub>5</sub> が、



からなる群から選択され、式中、

X<sub>11</sub> は、それぞれについて独立して、CH、CR<sub>9</sub>、N、N(O)またはN<sup>+</sup>(R<sub>17</sub>)であり、

X<sub>12</sub> は、それぞれについて独立して、CH、CR<sub>9</sub>、N、N(O)、N<sup>+</sup>(R<sub>17</sub>)であり、但し、少なくとも1つのX<sub>12</sub>基が、CHおよびCR<sub>9</sub>から独立して選択され、

X<sub>13</sub> は、それぞれについて独立して、O、S、S(O)<sub>p</sub>、NR<sub>7</sub>またはNR<sub>17</sub>であり、

R<sub>9</sub> は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、  
- NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、- OR<sub>7</sub>、- C(O)R<sub>7</sub>、- C(O)OR<sub>7</sub>、- OC(O)R<sub>7</sub>、  
- C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、- NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、- SR<sub>7</sub>、- S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、- OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、- S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、- NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または- S(O)<sub>p</sub>NR

$R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$  または  $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$  または  $-SP(O)(OR_7)_2$  からなる群から選択される置換基であるか、

または 2 つの  $R_9$  基が、それらが結合する炭素原子と一緒になって縮合環を形成し、

$R_{17}$  は、それぞれについて独立して、アルキルまたはアラキルである、

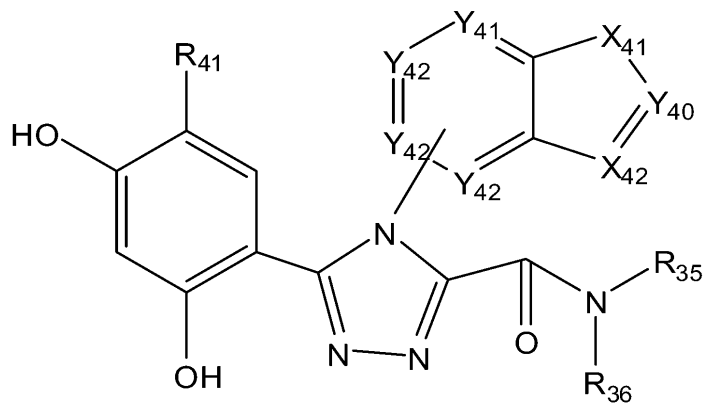
請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 20】

$R_5$  が  $X_{20}R_{50}$  であり、 $X_{20}$  が C1 ~ C4 アルキルであり、 $R_{50}$  が置換されていてもよいフェニルである、請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 21】

化合物が、以下の構造



(XI)

で表され、

式中、

$X_{41}$  は、O、S または  $NR_{42}$  であり、

$X_{42}$  は、 $CR_{44}$  または N であり、

$Y_{40}$  は、N または  $CR_{43}$  であり、

$Y_{41}$  は、N または  $CR_{45}$  であり、

$Y_{42}$  は、それぞれについて独立して、N、C または  $CR_{46}$  であり、

$R_{41}$  は、 $-H$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラキル、置換されていてもよいヘテロアラキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシまたはシクロアルコキシ、ハロアルコキシ、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-C(S)R_7$ 、 $-C(OS)R_7$ 、 $-C(S)SR_7$ 、 $-C(S)OR_7$ 、 $-C(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-C(NR_8)OR_7$ 、 $-C(NR_8)R_7$ 、 $-C(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-C(NR_8)SR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-OC(O)OR_7$ 、 $-OC(S)OR_7$ 、 $-OC(NR_8)OR_7$ 、 $-SC(O)R_7$ 、 $-SC(O)OR_7$ 、 $-SC(NR_8)OR_7$ 、 $-OC(S)R_7$ 、 $-SC(S)R_7$ 、 $-SC(S)OR_7$ 、 $-OC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(NR_8)R_7$ 、 $-SC(NR_8)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-NR_7C(S)R_7$ 、 $-NR_7C(S)OR_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)R_7$ 、 $-NR_7C(O)OR_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)OR_7$ 、 $-NR_7C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pOR_7$ 、 $-OS(O)_pNR$



${}_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7S(O)_pOR_7$ 、 $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-SS(O)_pR_7$ 、 $-SS(O)_pOR_7$ 、 $-SS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$  または  $-SP(O)(OR_7)_2$  であり、

$R_{42}$  は、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-C(O)R_7$ 、 $-(CH_2)_mC(O)OR_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$  または  $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$  であり、

$R_{43}$  および  $R_{44}$  は、独立して、 $-H$ 、 $-OH$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$  であるが、 $R_{43}$  および  $R_{44}$  が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロシクリルまたは置換されていてもよいヘテロアリールを形成し、

$R_{45}$  は、 $-H$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NR_7H$ 、 $-OR_{26}$ 、 $-SR_{26}$ 、 $-NHR_{26}$ 、 $-O(CH_2)_mOH$ 、 $-O(CH_2)_mSH$ 、 $-O(CH_2)_mNR_7H$ 、 $-S(CH_2)_mOH$ 、 $-S(CH_2)_mSH$ 、 $-S(CH_2)_mNR_7H$ 、 $-OC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-SC(O)R_7$ 、 $-NR_7C(O)R_7$ 、 $-OC(O)OR_7$ 、 $-SC(O)OR_7$ 、 $-NR_7C(O)OR_7$ 、 $-OCH_2C(O)R_7$ 、 $-SCH_2C(O)R_7$ 、 $-NR_7CH_2C(O)R_7$ 、 $-OCH_2C(O)OR_7$ 、 $-SCH_2C(O)OR_7$ 、 $-NR_7CH_2C(O)OR_7$ 、 $-OCH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SCH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7CH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-SS(O)_pR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-SS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-OS(O)_pOR_7$ 、 $-SS(O)_pOR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pOR_7$ 、 $-OC(S)R_7$ 、 $-SC(S)R_7$ 、 $-NR_7C(S)R_7$ 、 $-OC(S)OR_7$ 、 $-SC(S)OR_7$ 、 $-NR_7C(S)OR_7$ 、 $-OC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(NR_8)R_7$ 、 $-SC(NR_8)R_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)R_7$ 、 $-OC(NR_8)OR_7$ 、 $-SC(NR_8)OR_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)OR_7$ 、 $-OC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(NR_8)NR_{10}R_{11}$  または  $-NR_7C(NR_8)NR_{10}R_{11}$  であり、

$R_{46}$  は、それぞれについて独立して、 $H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$

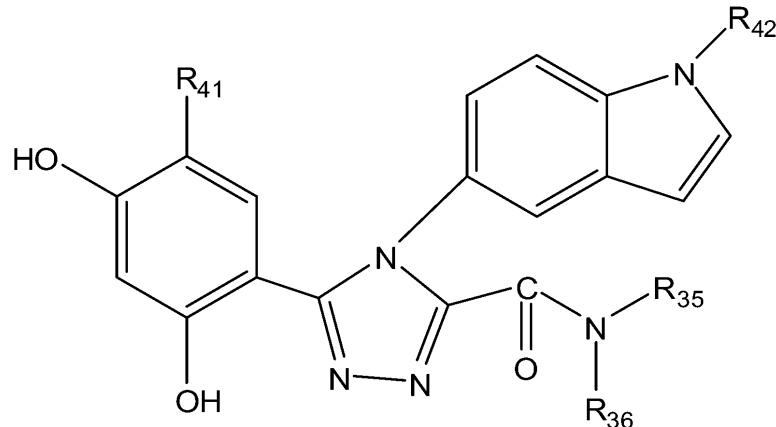
、 $-NR_8S(O)_pR_7$  または  $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$  からなる群から選択される、請求項 16 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 22】

$R_{41}$  が、 $-H$ 、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、プロポキシおよびシクロプロポキシからなる群から選択される、請求項 21 に記載の化合物。

【請求項 23】

化合物が、以下の構造式：



(XIV)

で表される、請求項 21 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 24】

$R_{41}$  が、 $-H$ 、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、プロポキシおよびシクロプロポキシからなる群から選択され、

$R_{42}$  が  $-H$  または置換されていてもよい  $C1 \sim C4$  アルキルであり、および、 $R_{35}$  または  $R_{36}$  のうちの一方が  $-H$  である、請求項 23 に記載の化合物。

【請求項 25】

哺乳動物における増殖障害を治療または予防するための製剤組成物であって、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩の有効量を含む、製剤組成物。

【請求項 26】

$c-kit$  タンパク質、 $Bcr-Abl$  タンパク質、 $FLT3$  タンパク質または  $EGFR$  タンパク質の分解を誘導するための製剤組成物であって、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩の有効量を含む、製剤組成物。

【請求項 27】

哺乳動物における  $c-kit$  関連癌、 $Bcr-Abl$  関連癌、 $FLT3$  関連癌、または  $EGFR$  関連癌を治療するための製剤組成物であって、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩の有効量を含む、製剤組成物。

【請求項 28】

血管形成の治療または阻害を必要とする被検体における血管形成を治療または阻害のための製剤組成物であって、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩の有効量を含む、製剤組成物。

【請求項 29】

新生血管における血流を遮断、妨害、そうでなければ乱すための製剤組成物であって、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩の有効量を含む、製剤組成物。

【請求項 30】

請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含む、被検体における真菌感染、細菌感染、ウイルス感染、または寄生虫感染を治療または予防するための製剤組成物。

【請求項 31】

請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩の有効量を含む、被検体におけるトポイソメラーゼ II を阻害するための製剤組成物。

【請求項 3 2】

請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含む、被検体における炎症性疾患または免疫疾患を治療または予防する、または免疫系を抑制するための製剤組成物。

【請求項 3 3】

薬学的に許容されるキャリアと請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩とを含む、製剤組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 5 6

【補正方法】変更

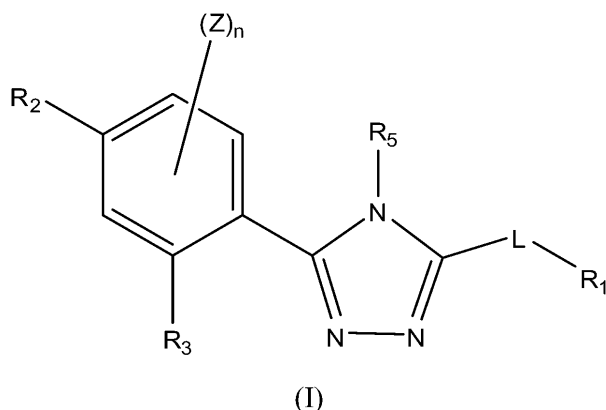
【補正の内容】

【0 0 5 6】

化学療法剤を用いると、最初のうちは腫瘍の退縮が生じるが、現時点で癌の治療に用いられているほとんどの作用剤は、腫瘍の進行に対して 1 つの経路のみ標的としている。このため、多くの場合、1 種または複数種の化学療法剤での治療後、腫瘍に多剤耐性が生じてしまい、治療に対して確実に応答することはなくなる。H s p 9 0 活性を阻害することの利点の 1 つに、そのクライアントタンパク質（ほとんどがシグナルトランスダクションに関与するタンパク質キナーゼまたは転写因子である）のうちのいくつかは、癌の進行に関与することが示されていることである。よって、H s p 9 0 を阻害することで、腫瘍を進行させるいくつかの経路を同時に短絡する方法が得られる。したがって、本発明の H s p 9 0 阻害剤を単独または他の化学療法剤との組み合わせで用いて腫瘍を治療すると、腫瘍の退縮または除去につながりやすく、現時点で利用可能な他の処置剤に比して攻撃的な多剤耐性腫瘍が発生しにくい。

[請求項 1001]

以下の構造式で表される化合物またはそれらの互変異性体、薬学的に許容される塩またはプロドラッグ：



式中、

L は、ヌル、-S-CR<sub>12</sub>-、-O-CR<sub>12</sub>-、-NR<sub>14</sub>-CR<sub>12</sub>-、-CR<sub>12</sub>-S-、-CR<sub>12</sub>-O-、-CR<sub>12</sub>-NR<sub>13</sub>-、-CR<sub>12</sub>-CR<sub>12</sub>-、-CR<sub>12</sub>-、-O-、-S-、-NR<sub>14</sub>-、-O-O-、-S-S-、-NR<sub>13</sub>-NR<sub>13</sub>-、-O-S-、-S-O-、-S-NR<sub>13</sub>-、-O-NR<sub>13</sub>-、-NR<sub>13</sub>-O-または-NR<sub>13</sub>-S-であり、

R<sub>1</sub> は、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアラルキル、置換されて

いてもよいヘテロアラルキルまたは  $-C(O)N(R_{13})_2$  であり、

$R_2$  および  $R_3$  は独立して、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NR_7H$ 、 $-OR_{26}$ 、 $-SR_{26}$ 、 $-O(CH_2)_mOH$ 、 $-O(CH_2)_mSH$ 、 $-(CH_2)_mNR_7H$ 、 $-S(CH_2)_mOH$ 、 $-S(CH_2)_mSH$ 、 $-S(CH_2)_mNR_7H$ 、 $-OC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-SC(O)R_7$ 、 $-NR_7C(O)R_7$ 、 $-OC(O)OR_7$ 、 $-SC(O)OR_7$ 、 $-NR_7C(O)OR_7$ 、 $-OCH_2C(O)R_7$ 、 $-SCH_2C(O)R_7$ 、 $-NR_7CH_2C(O)R_7$ 、 $-OCH_2C(O)OR_7$ 、 $-SCH_2C(O)OR_7$ 、 $-NR_7CH_2C(O)OR_7$ 、 $-OCH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SCH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7CH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-SS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-SS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-OS(O)_pOR_7$ 、 $-SS(O)_pOR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pOR_7$ 、 $-OC(S)R_7$ 、 $-SC(S)R_7$ 、 $-NR_7C(S)R_7$ 、 $-OC(S)OR_7$ 、 $-SC(S)OR_7$ 、 $-NR_7C(S)OR_7$ 、 $-OC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(NR_8)R_7$ 、 $-SC(NR_8)R_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)R_7$ 、 $-OC(NR_8)OR_7$ 、 $-SC(NR_8)OR_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)OR_7$ 、 $-OC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$  または  $-SP(O)(OR_7)_2$  であり、

$R_5$  は、 $-H$ 、 $-X_{20}R_{50}$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

$R_7$  および  $R_8$  は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

$R_{10}$  および  $R_{11}$  は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであるか、または  $R_{10}$  および  $R_{11}$  が、それらが結合する窒素と一緒にあって、置換されていてもよいヘテロシクリルまたは置換されていてもよいヘテロアリールを形成し、

各  $R_{12}$  は独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

各  $R_{13}$  は独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

各  $R_{14}$  は独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

$R_{26}$  は、低級アルキルであり、

$R_{50}$  は、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールであり、

$X_{20}$  は、 $C1 \sim C4$ アルキル、 $NR_7$ 、 $C(O)$ 、 $C(S)$ 、 $C(NR_8)$  または  $S(O)_p$  であり、

$Z$  は、置換基であり、

$m$  は、それぞれについて独立して、1、2、3または4であり、

pは、それぞれについて独立して、1または2であり、  
nは、0、1、2または3であり、  
ただし、Lが、-S-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>-O-または-O-CH<sub>2</sub>-であれば、R<sub>1</sub>は、置換されていてもよい低級アルキルではなく、  
Lが-S-CH<sub>2</sub>-かつR<sub>5</sub>がメトキシフェニルであれば、R<sub>1</sub>はテトラヒドロ-2H-ピラン-2-イルではなく、  
Lが-S-CH<sub>2</sub>-かつR<sub>5</sub>が-Hであれば、R<sub>1</sub>は置換されていてもよいピリジルまたはフルオロフェニルではなく、  
Lが-O-または-S-であれば、R<sub>1</sub>は-C(O)N(R<sub>13</sub>)<sub>2</sub>または置換されていてもよい低級アルキルではなく、  
Lが-N(CH<sub>3</sub>)-または-O-であれば、R<sub>1</sub>は置換されていてもよいフルオロフェニルではなく、  
、  
Lが-CH<sub>2</sub>-であれば、R<sub>1</sub>は1,2,3-トリアゾリルではなく、  
Lが-CH<sub>2</sub>-または-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-であれば、R<sub>1</sub>は置換されていてもよいC1～C7アルキルではなく、  
、  
Lが-CH<sub>2</sub>-S-であれば、R<sub>1</sub>はクロロフェニルではない。

[請求項1002]

Lが、ヌル、-S-CR<sub>12</sub>-、-O-CR<sub>12</sub>-、-NR<sub>14</sub>-CR<sub>12</sub>-、-CR<sub>12</sub>-CR<sub>12</sub>-、-CR<sub>12</sub>-、-O-、-S-または-NR<sub>14</sub>-である、請求項1001に記載の化合物。

[請求項1003]

R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>が各々独立して、-OH、-SHまたは-NHR<sub>7</sub>である、請求項1001に記載の化合物。

[請求項1004]

R<sub>1</sub>が、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよいチアゾリル、置換されていてもよいピリジニル、置換されていてもよいジヒドロフラン、置換されていてもよいピリジン-ジオン、置換されていてもよいイミダゾリルまたは-C(O)N(R<sub>13</sub>)<sub>2</sub>である、請求項1001に記載の化合物。

[請求項1005]

nが1である、請求項1001に記載の化合物。

[請求項1006]

nが0である、請求項1001に記載の化合物。

[請求項1007]

Zが、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ(guanadino)、ハロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OR<sub>7</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-C(S)R<sub>7</sub>、-C(O)SR<sub>7</sub>、-C(S)SR<sub>7</sub>、-C(S)OR<sub>7</sub>、-C(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)SR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-OC(O)OR<sub>7</sub>、-OC(S)OR<sub>7</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-SC(O)R<sub>7</sub>、-SC(O)OR<sub>7</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-OC(S)R<sub>7</sub>、-SC(S)R<sub>7</sub>、-SC(S)OR<sub>7</sub>、-OC(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OC(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(S)R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(S)OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(O)OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>C(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>C(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-SS(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-SS(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>である、請求項1001に記載の化合物。

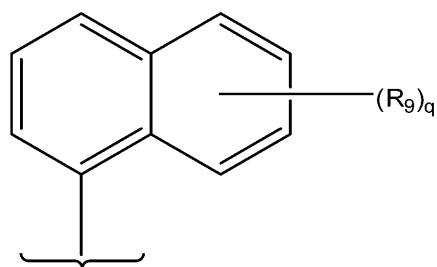
[請求項1008]

Zが、C1～C6アルキル、C1～C6ハロアルキル、C1～C6アルコキシ、C1～C6ハロアルコキシ、C1～C6アルキルスルファニルまたはC3～C6シクロアルキルである、請求項1007に記載の

化合物。

[請求項1009]

$R_5$ が、以下の式で表される、請求項1001に記載の化合物：



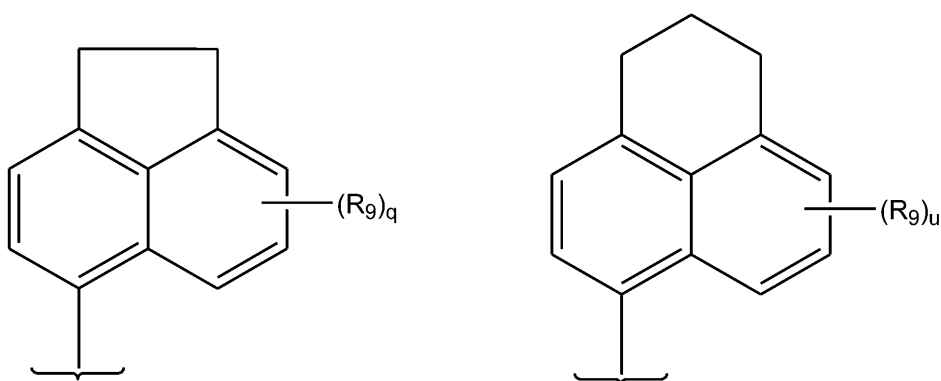
式中、

$R_9$ は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ からなる群から選択される置換基であるか、

または2つの $R_9$ 基が、それらが結合する炭素原子と一緒になって縮合環を形成し、 $q$ は、ゼロまたは1から7の整数である。

[請求項1010]

$R_5$ が、以下の式で表される、請求項1009に記載の化合物：



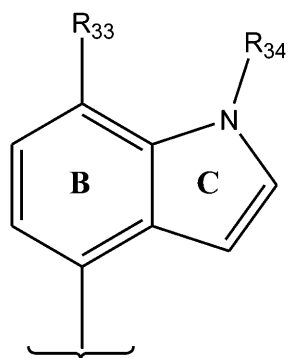
式中、

$q$ は、ゼロまたは1から5の整数であり、

$u$ は、ゼロまたは1から5の整数である。

[請求項1011]

$R_5$ が、以下の式で表される、請求項1001に記載の化合物：



式中、

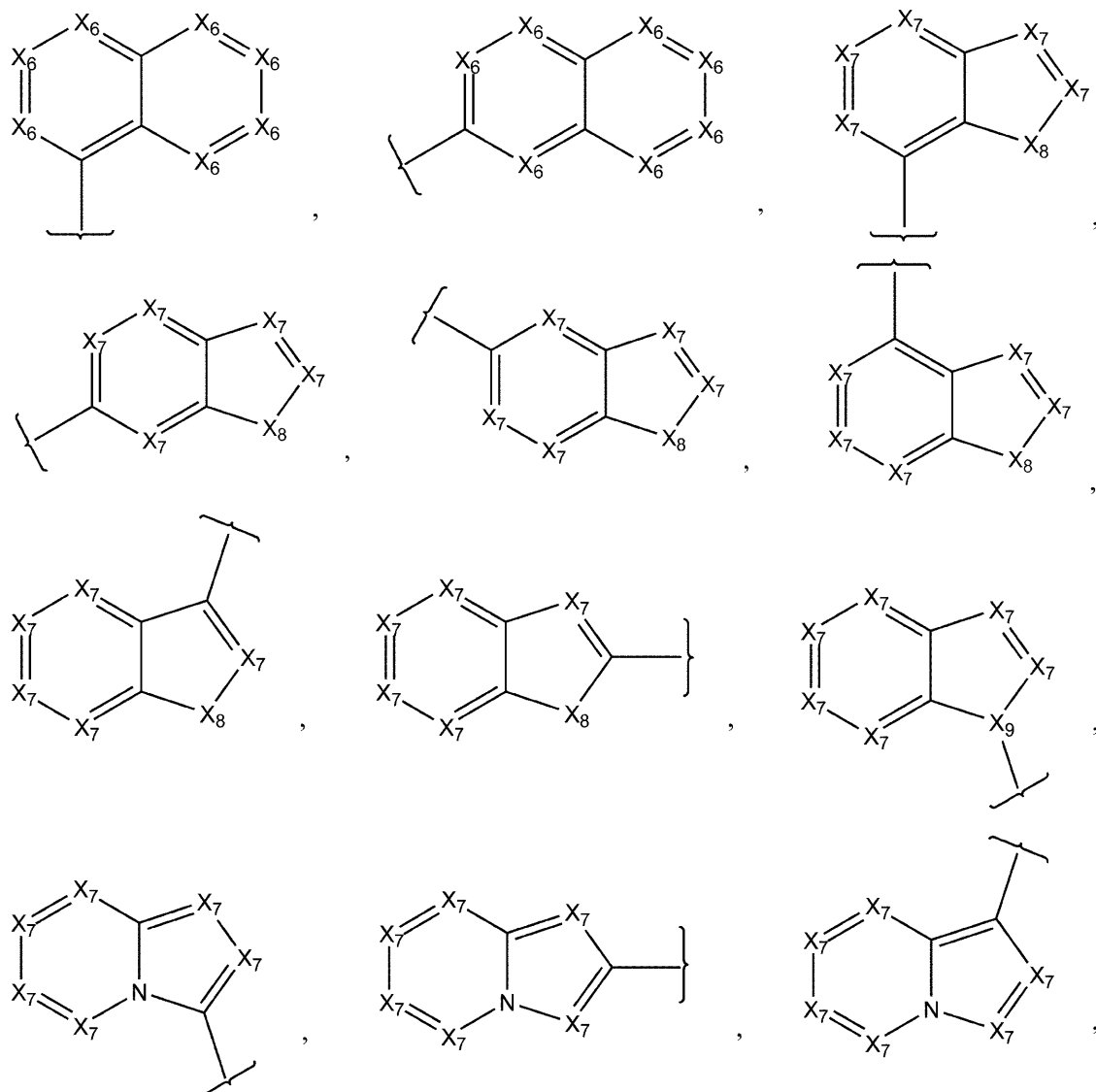
$R_{33}$  は、ハロ、低級アルキル、低級アルコキシ、低級ハロアルキル、低級ハロアルコキシ  
および低級アルキルスルファニルであり、

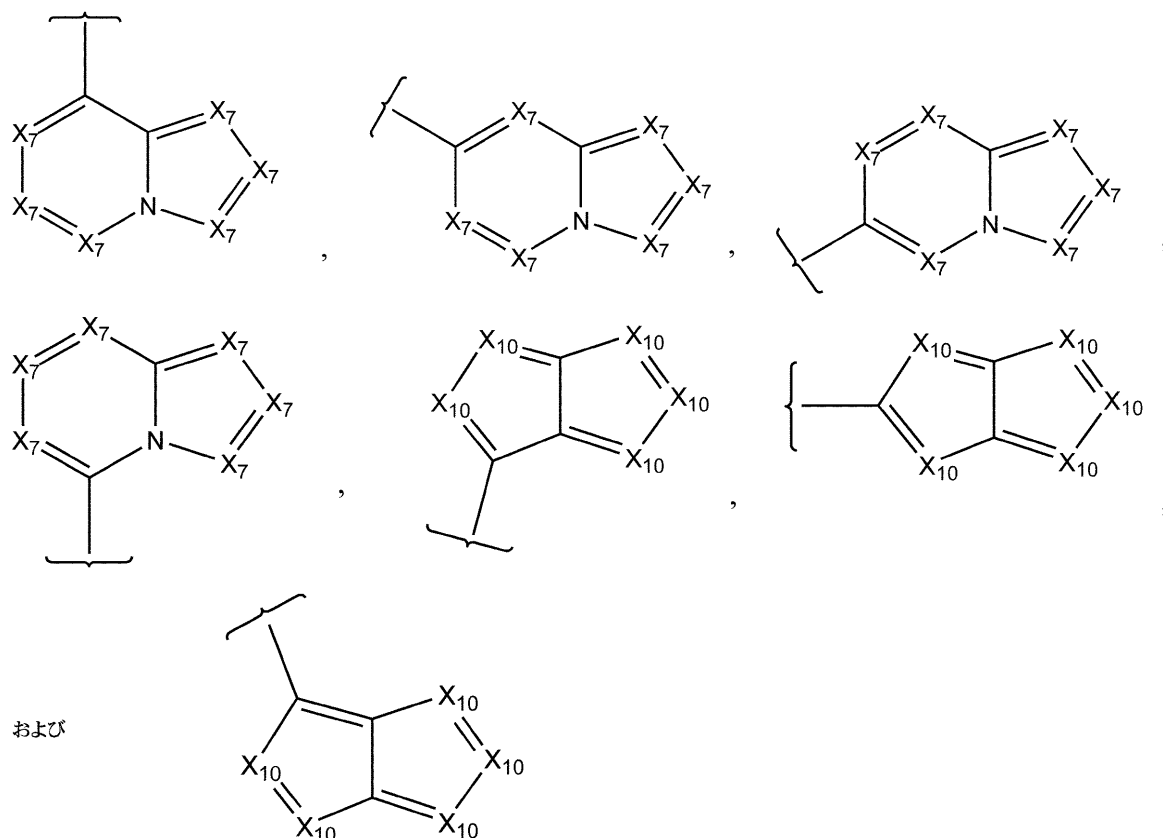
$R_{34}$  は、H、低級アルキルまたは低級アルキルカルボニルであり、

環Bおよび環Cは、1種または複数種の置換基で置換されていてもよい。

[請求項1012]

$R_5$  が、





からなる群から選択され、式中、

$X_6$ は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、 $N(O)$ 、 $N^+(R_{17})$ であり、但し、少なくとも3つの $X_6$ 基が、CHおよび $CR_9$ から独立して選択され、

$X_7$ は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、 $N(O)$ 、 $N^+(R_{17})$ であり、但し、少なくとも3つの $X_7$ 基が、CHおよび $CR_9$ から独立して選択され、

$X_8$ は、それぞれについて独立して、 $CH_2$ 、 $CHR_9$ 、 $C(R_9)_2$ 、S、 $S(O)_p$ 、 $NR_7$ または $NR_{17}$ であり、

$X_9$ は、それぞれについて独立して、NまたはCHであり、

$X_{10}$ は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、 $N(O)$ 、 $N^+(R_{17})$ であり、但し、少なくとも1つの $X_{10}$ が、CHおよび $CR_9$ から選択され、

$R_9$ は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ または $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ からなる群から選択される置換基であるか、

または2つの $R_9$ 基が、それらが結合する炭素原子と一緒になって縮合環を形成し、

$R_{17}$ は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、アルキル、アラルキル、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ または $-C(O)NR_{10}R_{11}$ である、請求項1001に記載の化合物。

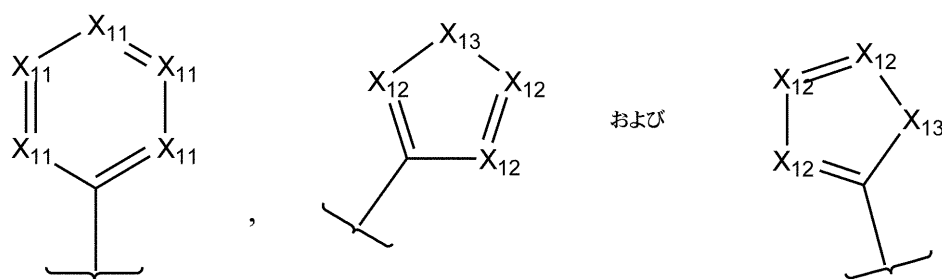
[請求項1013]



$R_5$  が、置換されていてもよいインドリル、置換されていてもよいベンゾイミダゾリル、置換されていてもよいインダゾリル、置換されていてもよい3H-インダゾリル、置換されていてもよいインドリジニル、置換されていてもよいキノリニル、置換されていてもよいイソキノリニル、置換されていてもよいベンゾキサゾリル、置換されていてもよいベンゾ[1,3]ジオキサゾリル、置換されていてもよいベンゾフリル、置換されていてもよいベンゾチアゾリル、置換されていてもよいベンゾ[d]イソキサゾリル、置換されていてもよいベンゾ[d]イソチアゾリル、置換されていてもよいチアゾロ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[5,4-c]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[5,4-b]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[5,4-c]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[5,4-b]ピリジニル、置換されていてもよいイミダゾピリジニル、置換されていてもよいベンゾチアジアゾリル、ベンゾキサジアゾリル、置換されていてもよいベンゾトリアゾリル、置換されていてもよいテトラヒドロインドリル、置換されていてもよいアザインドリル、置換されていてもよいキナゾリニル、置換されていてもよいプリニル、置換されていてもよいイミダゾ[4,5-a]ピリジニル、置換されていてもよいイミダゾ[1,2-a]ピリジニル、置換されていてもよい3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよい1H-イミダゾ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよい1H-イミダゾ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよい3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいピリドビルダジニルおよび置換されていてもよいピリドピリミジニル、置換されていてもよいピロロ[2,3]ピリミジル、置換されていてもよいピラゾロ[3,4]ピリミジル、置換されていてもよいシクロペンタイミダゾリル、置換されていてもよいシクロペンタトリアゾリル、置換されていてもよいピロロピラゾリル、置換されていてもよいピロロイミダゾリル、置換されていてもよいピロロトリアゾリルまたは置換されていてもよいベンゾ(b)チエニルである、請求項1012に記載の化合物。

[請求項1014]

$R_5$  が、



からなる群から選択され、式中、

$X_{11}$  は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、N(O)または $N^+(R_{17})$ であり、

$X_{12}$  は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、N(O)、 $N^+(R_{17})$ であり、但し、少なくとも1つの $X_{12}$ 基が、CHおよび $CR_9$ から独立して選択され、

$X_{13}$  は、それぞれについて独立して、O、S、 $S(O)_p$ 、 $NR_7$ または $NR_{17}$ であり、

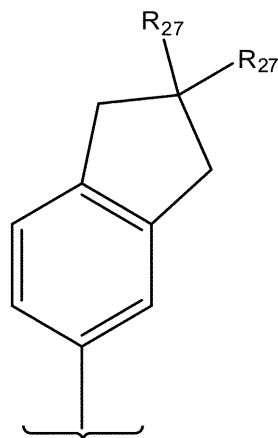
$R_9$  は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラールキル、置換されていてもよいヘテロアラールキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)$

)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>からなる群から選択される置換基であるか、

または2つのR<sub>9</sub>基が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって縮合環を形成し、R<sub>17</sub>は、それぞれについて独立して、アルキルまたはアラルキルである、請求項1001に記載の化合物。

[請求項1015]

R<sub>5</sub>が、



であり、

式中、R<sub>27</sub>は、それぞれについて独立して、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OR<sub>7</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>からなる群から選択される置換基であるか、

または2つのR<sub>27</sub>基が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、置換されていてもよいシクロアルキル環または置換されていてもよいヘテロシクリル環を形成する、請求項1001に記載の化合物。

[請求項1016]

R<sub>5</sub>がX<sub>20</sub>R<sub>50</sub>である、請求項1001に記載の化合物。

[請求項1017]

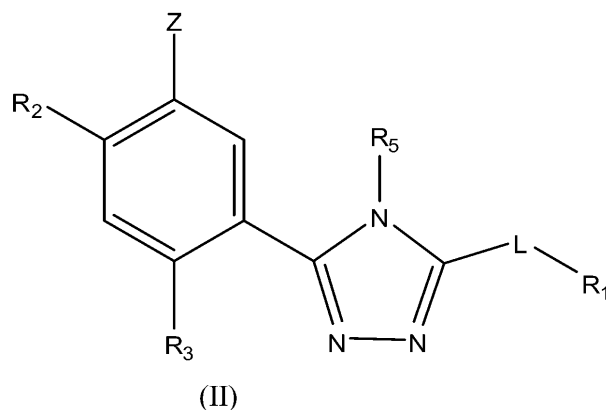
X<sub>20</sub>がC1~C4アルキルであり、R<sub>50</sub>が置換されていてもよいフェニルである、請求項1016に記載の化合物。

[請求項1018]

R<sub>5</sub>が-Hである、請求項1001に記載の化合物。

[請求項1019]

化合物が、式(II)



の化合物である、請求項1001に記載の化合物。

[請求項1020]

Lが、ヌル、-S-CR<sub>12</sub>-、-O-CR<sub>12</sub>-、-NR<sub>14</sub>-CR<sub>12</sub>-、-CR<sub>12</sub>-CR<sub>12</sub>-、-CR<sub>12</sub>-、-O-、-S-または-NR<sub>14</sub>-である、請求項1019に記載の化合物。

[請求項1021]

R<sub>1</sub>が、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよいチアゾリル、置換されていてもよいピリジニル、置換されていてもよいジヒドロフラン、置換されていてもよいピリミジン-ジオン、置換されていてもよいイミダゾリルまたは-C(O)N(R<sub>13</sub>)<sub>2</sub>である、請求項1019に記載の化合物。

[請求項1022]

R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>が各々独立して、-OH、-SHまたは-NHR<sub>7</sub>である、請求項1019に記載の化合物。

[請求項1023]

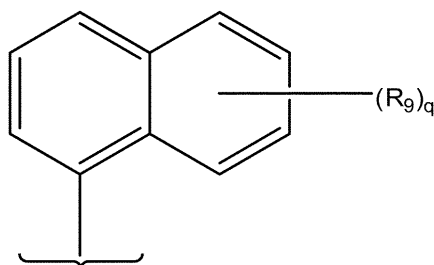
Zが独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OR<sub>7</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-C(S)R<sub>7</sub>、-C(O)SR<sub>7</sub>、-C(S)SR<sub>7</sub>、-C(S)OR<sub>7</sub>、-C(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)SR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-OC(O)OR<sub>7</sub>、-OC(S)OR<sub>7</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-SC(O)R<sub>7</sub>、-SC(O)OR<sub>7</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-OC(S)R<sub>7</sub>、-SC(S)R<sub>7</sub>、-SC(S)OR<sub>7</sub>、-OC(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OC(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(S)R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(S)OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(O)OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>C(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>C(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-SS(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-SS(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>である、請求項1019に記載の化合物。

[請求項1024]

Zが、C1～C6アルキル、C1～C6ハロアルキル、C1～C6アルコキシ、C1～C6ハロアルコキシ、C1～C6アルキルスルファニルまたはC3～C6シクロアルキルである、請求項1023に記載の化合物。

[請求項1025]

R<sub>5</sub>が、以下の式で表される、請求項1019に記載の化合物：



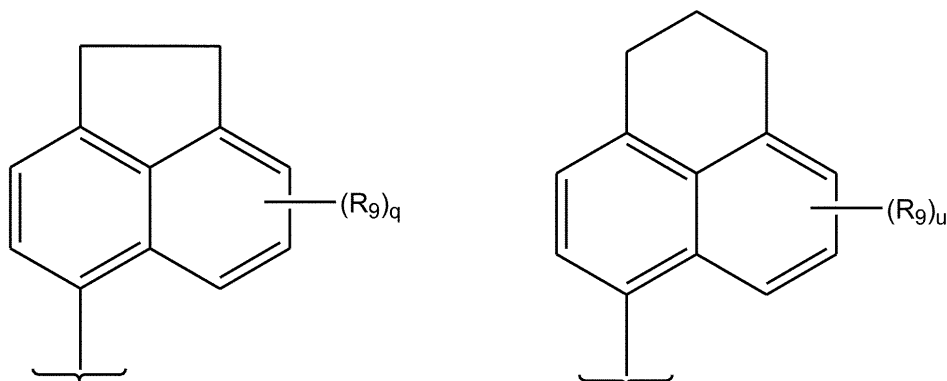
式中、

$R_9$ は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ からなる群から選択される置換基であるか、

または2つの $R_9$ 基が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって縮合環を形成し、 $q$ は、ゼロまたは1から7の整数である。

[請求項1026]

$R_5$ が、以下の式で表される、請求項1025に記載の化合物：



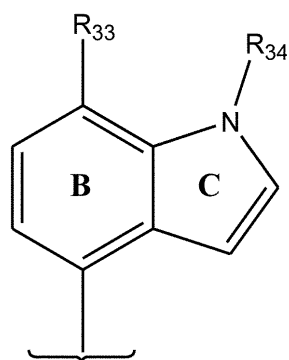
式中、

$q$ は、ゼロまたは1から5の整数であり、

$u$ は、ゼロまたは1から5の整数である。

[請求項1027]

$R_5$ が、以下の式で表される、請求項1019に記載の化合物：



式中、

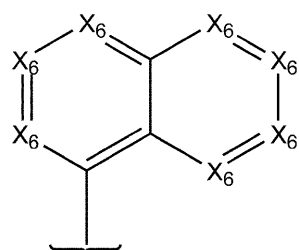
$R_{33}$  は、ハロ、低級アルキル、低級アルコキシ、低級ハロアルキル、低級ハロアルコキシ  
および低級アルキルスルファニルであり、

$R_{34}$  は、H、低級アルキルまたは低級アルキルカルボニルであり、

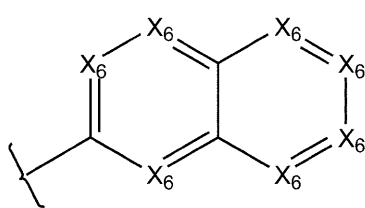
環Bおよび環Cは、1種または複数種の置換基で置換されていてもよい。

[請求項1028]

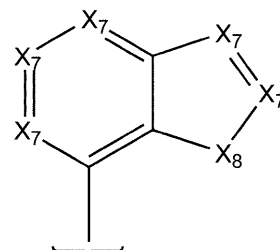
$R_5$  が、



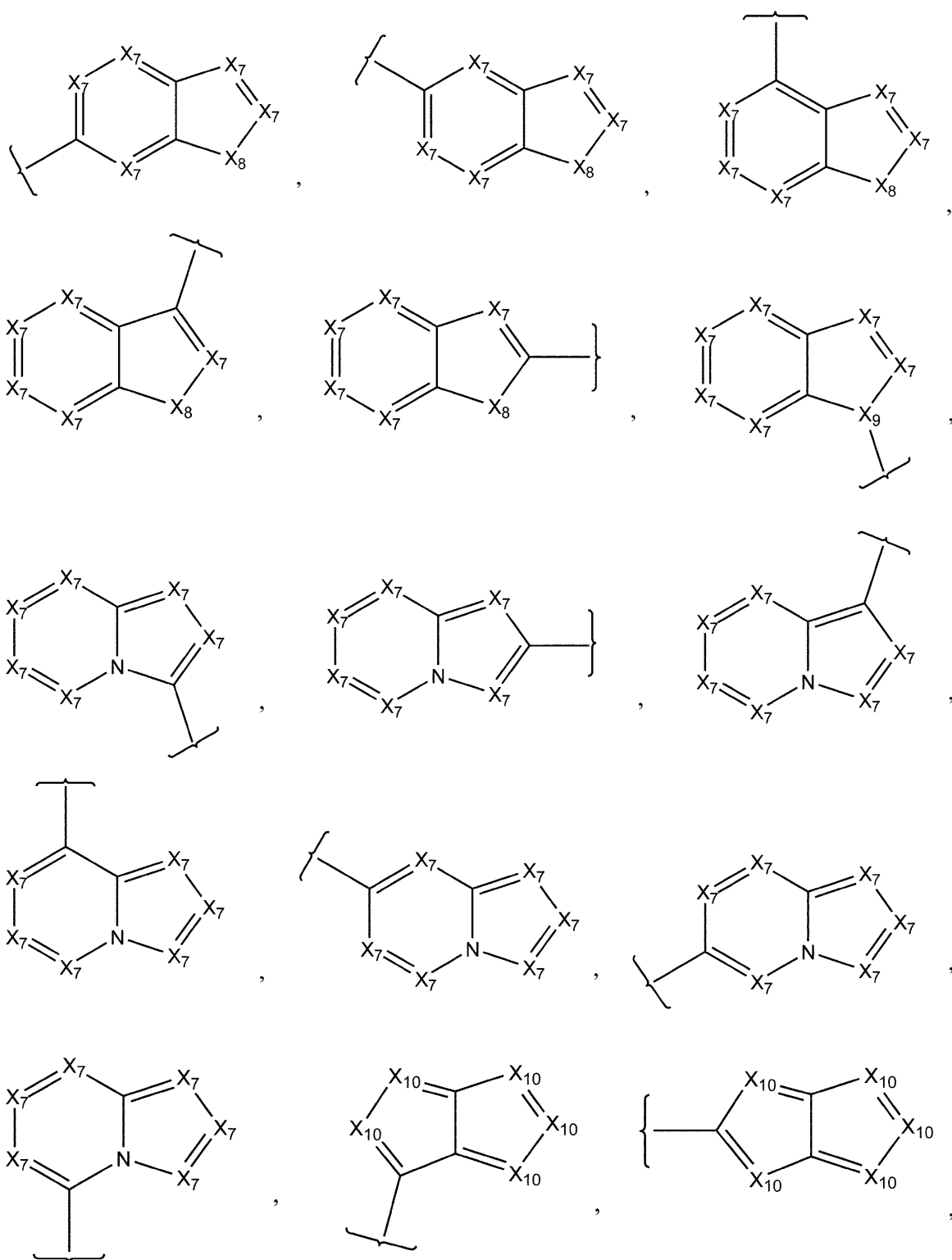
,



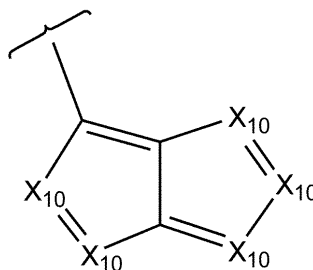
,



,



および



からなる群から選択され、式中、

$X_6$ は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、 $N(O)$ 、 $N^+(R_{17})$ であり、但し、少なくとも3つの $X_6$ 基が、CHおよび $CR_9$ から独立して選択され、

$X_7$ は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、 $N(O)$ 、 $N^+(R_{17})$ であり、但し、少なくとも3つの $X_7$ 基が、CHおよび $CR_9$ から独立して選択され、

$X_8$ は、それぞれについて独立して、 $CH_2$ 、 $CHR_9$ 、 $C(R_9)_2$ 、S、 $S(O)_p$ 、 $NR_7$ または $NR_{17}$ であり、

$X_9$ は、それぞれについて独立して、NまたはCHであり、

$X_{10}$ は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、 $N(O)$ 、 $N^+(R_{17})$ であり、但し、少なくとも1つの $X_{10}$ が、CHおよび $CR_9$ から選択され、

$R_9$ は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ からなる群から選択される置換基であるか、

または2つの $R_9$ 基が、それらが結合する炭素原子と一緒になって縮合環を形成し、

$R_{17}$ は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、アルキル、アラルキル、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ または $-C(O)NR_{10}R_{11}$ である、請求項1019に記載の化合物。

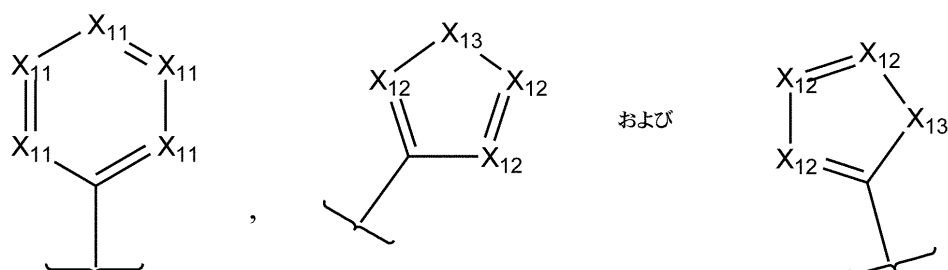
[請求項1029]

$R_5$ が、置換されていてもよいインドリル、置換されていてもよいベンゾイミダゾリル、置換されていてもよいインダゾリル、置換されていてもよい3H-インダゾリル、置換されていてもよいインドリジニル、置換されていてもよいキノリニル、置換されていてもよいイソキノリニル、置換されていてもよいベンゾキサゾリル、置換されていてもよいベンゾ[1,3]ジオキサゾリル、置換されていてもよいベンゾフリル、置換されていてもよいベンゾチアゾリル、置換されていてもよいベンゾ[d]イソキサゾリル、置換されていてもよいベンゾ[d]イソチアゾリル、置換されていてもよいチアゾロ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[5,4-c]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[5,4-b]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[5,4-c]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[5,4-b]ピリジニル、置換されていてもよいイミダゾピリジニル、置換されていてもよいベンゾチアジアゾリル、ベンゾキサジアゾリル、置換されていてもよいベンゾトリアゾリル、置換されていてもよいテトラヒドロインドリル、置換されていてもよいアザインドリル、置換されていてもよいキナゾリニル、置換されていてもよいブリニル、置換されていてもよいイミダゾ[4,5-a]ピリジニル、置換されていてもよいイミダゾ[1,2-a]ピリジニル、置換されていてもよい3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよい1H-イミダゾ[4,5-b]ピ

リジニル、置換されていてもよい1H-イミダゾ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよい3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいピリドピルダジニルおよび置換されていてもよいピリドピリミジニル、置換されていてもよいピロロ[2,3]ピリミジル、置換されていてもよいピラゾロ[3,4]ピリミジル、置換されていてもよいシクロペンタイミダゾリル、置換されていてもよいシクロペンタトリアゾリル、置換されていてもよいピロロピラゾリル、置換されていてもよいピロロイミダゾリル、置換されていてもよいピロロトリアゾリルまたは置換されていてもよいベンゾ(b)チエニルである、請求項1028に記載の化合物。

[請求項1030]

$R_5$ が、



からなる群から選択され、式中、

$X_{11}$ は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、N(O)または $N^+(R_{17})$ であり、

$X_{12}$ は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、N(O)、 $N^+(R_{17})$ であり、但し、少なくとも1つの $X_{12}$ 基が、CHおよび $CR_9$ から独立して選択され、

$X_{13}$ は、それぞれについて独立して、O、S、 $S(O)_p$ 、 $NR_7$ または $NR_{17}$ であり、

$R_9$ は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ からなる群から選択される置換基であるか、

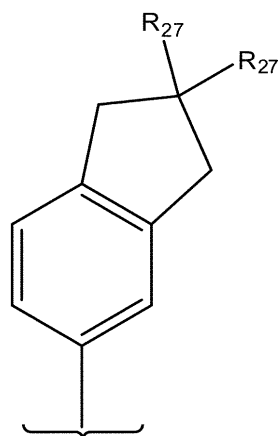
または2つの $R_9$ 基が、それらが結合する炭素原子と一緒になって縮合環を形成し、

$R_{17}$ は、それぞれについて独立して、アルキルまたはアラルキルである、請求項1019に記載の化合物。

[請求項1031]

$R_5$ が





であり、

式中、 $R_{27}$ は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ からなる群から選択される置換基であるか、

または2つの $R_{27}$ 基が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、置換されていてもよいシクロアルキル環または置換されていてもよいヘテロシクリル環を形成する、請求項1019に記載の化合物。

[請求項1032]

$R_5$ が $X_{20}R_{50}$ である、請求項1019に記載の化合物。

[請求項1033]

$X_{20}$ がC1～C4アルキルであり、 $R_{50}$ が置換されていてもよいフェニルである、請求項1032に記載の化合物。

[請求項1034]

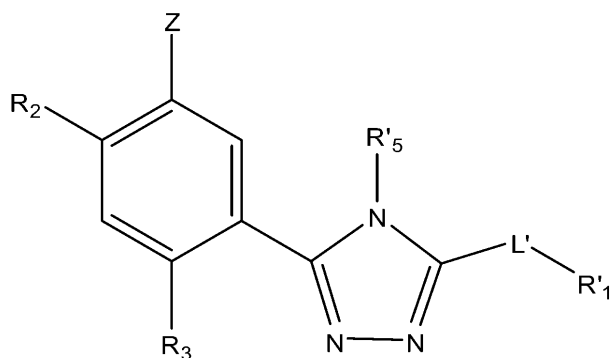
$R_5$ が $-H$ である、請求項1019に記載の化合物。

[請求項1035]

$L$ が $-S-CH_2-$ または $-S-$ であり、 $R_1$ が、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよいチアゾリル、置換されていてもよいピリジニル、置換されていてもよいジヒドロフラン、置換されていてもよいピリミジン-ジオン、置換されていてもよいイミダゾリルまたは $-C(O)N(R_{13})_2$ である、請求項1022～1034のいずれか一項に記載の化合物。

[請求項1036]

以下の構造式で表される化合物またはそれらの互変異性体、薬学的に許容される塩またはプロドラッグ：



(III)

式中、

$L'$  は、 $-S-CR_{12}-$ 、 $-O-CR_{12}-$ 、 $-O-$  または  $-S-$  であり、

$R'_1$  は、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアラールキル、置換されていてもよいヘテロアラールキルまたは  $-C(O)N(R_{13})_2$  であり、

$R_2$  および  $R_3$  は独立して、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NR_7H$ 、 $-OR_{26}$ 、 $-SR_{26}$ 、 $-O(CH_2)_mOH$ 、 $-O(CH_2)_mSH$ 、 $-O(CH_2)_mNR_7H$ 、 $-S(CH_2)_mOH$ 、 $-S(CH_2)_mSH$ 、 $-S(CH_2)_mNR_7H$ 、 $-OC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-SC(O)R_7$ 、 $-NR_7C(O)R_7$ 、 $-OC(O)OR_7$ 、 $-SC(O)OR_7$ 、 $-NR_7C(O)OR_7$ 、 $-OCH_2C(O)R_7$ 、 $-SCH_2C(O)R_7$ 、 $-NR_7CH_2C(O)R_7$ 、 $-OCH_2C(O)OR_7$ 、 $-SCH_2C(O)OR_7$ 、 $-NR_7CH_2C(O)OR_7$ 、 $-OCH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SCH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7CH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-SS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-SS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-OS(O)_pOR_7$ 、 $-SS(O)_pOR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pOR_7$ 、 $-OC(S)R_7$ 、 $-SC(S)R_7$ 、 $-NR_7C(S)R_7$ 、 $-OC(S)OR_7$ 、 $-SC(S)OR_7$ 、 $-NR_7C(S)OR_7$ 、 $-OC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(NR_8)R_7$ 、 $-SC(NR_8)R_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)R_7$ 、 $-OC(NR_8)OR_7$ 、 $-SC(NR_8)OR_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)OR_7$ 、 $-OC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$  または  $-SP(O)(OR_7)_2$  であり、

$R'_5$  は、 $-X_{20}R_{50}$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラールキルまたは置換されていてもよいヘテロアラールキルであり、

$R_7$  および  $R_8$  は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラールキルまたは置換されていてもよいヘテロアラールキルであり、

$R_{10}$  および  $R_{11}$  は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラールキルまたは置換されていてもよいヘテロアラールキルであるが、または  $R_{10}$  および  $R_{11}$  が、それらが結合する窒素と一緒にあって、置換されていてもよいヘテロシクリルまたは置換されていてもよいヘテロアリールを形成し、

各  $R_{12}$  は独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいヘテロアラールキル

もよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアララルキルまたは置換されていてもよいヘテロアララルキルであり、

各 $R_{13}$ は独立して、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアララルキルまたは置換されていてもよいヘテロアララルキルであり、

$R_{26}$ は、低級アルキルであり、

$R_{50}$ は、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールであり、

$X_{20}$ は、C1～C4アルキル、 $NR_7$ 、C(O)、C(S)、C( $NR_8$ )または $S(O)_p$ であり、

Zは、置換基であり、

pは、それぞれについて独立して、1または2であり、

mは、それぞれについて独立して、1、2、3または4であり、

nは、0、1、2または3であり、

ただし、 $L'$ が-S- $CH_2$ -かつ $R'_5$ がメトキシフェニルであれば、 $R'_1$ はテトラヒドロ-2H-ピラン-2-イルではなく、

$L'$ が-O-または-S-であれば、 $R'_1$ は-C(O) $N(R_{13})_2$ ではない。

[請求項1037]

$L'$ が-S- $CR_{12}$ -または-S-である、請求項1036に記載の化合物。

[請求項1038]

$R'_1$ が、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよいチアゾリル、置換されていてもよいピリジニル、置換されていてもよいジヒドロフラン、置換されていてもよいピリミジン-ジオン、置換されていてもよいイミダゾリルまたは-C(O) $N(R_{13})_2$ である、請求項1036に記載の化合物。

[請求項1039]

$R_2$ および $R_3$ が各々独立して、-OH、-SHまたは-NH $R_7$ である、請求項1036に記載の化合物。

[請求項1040]

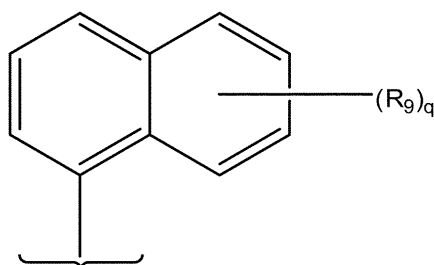
Zが、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアララルキル、置換されていてもよいヘテロアララルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、-N $R_{10}R_{11}$ 、-OR $_7$ 、-C(O)R $_7$ 、-C(O)OR $_7$ 、-C(S)R $_7$ 、-C(S)SR $_7$ 、-C(S)OR $_7$ 、-C(S)N $R_{10}R_{11}$ 、-C(N $R_8$ )OR $_7$ 、-C(N $R_8$ )R $_7$ 、-C(N $R_8$ )N $R_{10}R_{11}$ 、-C(N $R_8$ )SR $_7$ 、-OC(O)R $_7$ 、-OC(O)OR $_7$ 、-OC(S)OR $_7$ 、-OC(N $R_8$ )OR $_7$ 、-SC(O)R $_7$ 、-SC(O)OR $_7$ 、-SC(N $R_8$ )OR $_7$ 、-OC(S)R $_7$ 、-SC(S)R $_7$ 、-SC(S)OR $_7$ 、-OC(O)N $R_{10}R_{11}$ 、-OC(S)N $R_{10}R_{11}$ 、-OC(N $R_8$ )N $R_{10}R_{11}$ 、-SC(O)N $R_{10}R_{11}$ 、-SC(N $R_8$ )N $R_{10}R_{11}$ 、-SC(S)N $R_{10}R_{11}$ 、-OC(N $R_8$ )R $_7$ 、-SC(N $R_8$ )R $_7$ 、-C(O)N $R_{10}R_{11}$ 、-N $R_8$ C(O)R $_7$ 、-N $R_7$ C(S)R $_7$ 、-N $R_7$ C(S)OR $_7$ 、-N $R_7$ C(N $R_8$ )R $_7$ 、-N $R_7$ C(O)OR $_7$ 、-N $R_7$ C(N $R_8$ )OR $_7$ 、-N $R_7$ C(O)N $R_{10}R_{11}$ 、-N $R_7$ C(S)N $R_{10}R_{11}$ 、-N $R_7$ C(N $R_8$ )N $R_{10}R_{11}$ 、-SR $_7$ 、-S(O) $_p$ R $_7$ 、-OS(O) $_p$ R $_7$ 、-OS(O) $_p$ OR $_7$ 、-OS(O) $_p$ N $R_{10}R_{11}$ 、-S(O) $_p$ OR $_7$ 、-N $R_8$ S(O) $_p$ R $_7$ 、-N $R_7$ S(O) $_p$ N $R_{10}R_{11}$ 、-N $R_7$ S(O) $_p$ OR $_7$ 、-S(O) $_p$ N $R_{10}R_{11}$ 、-SS(O) $_p$ R $_7$ 、-SS(O) $_p$ OR $_7$ 、-SS(O) $_p$ N $R_{10}R_{11}$ 、-OP(O)(OR $_7$ ) $_2$ または-SP(O)(OR $_7$ ) $_2$ である、請求項1036に記載の化合物。

[請求項1041]

Zが、C1～C6アルキル、C1～C6ハロアルキル、C1～C6アルコキシ、C1～C6ハロアルコキシ、C1～C6アルキルスルファニルまたはC3～C6シクロアルキルである、請求項1040に記載の化合物。

[請求項1042]

$R'_5$ が以下の式



で表され、

式中、

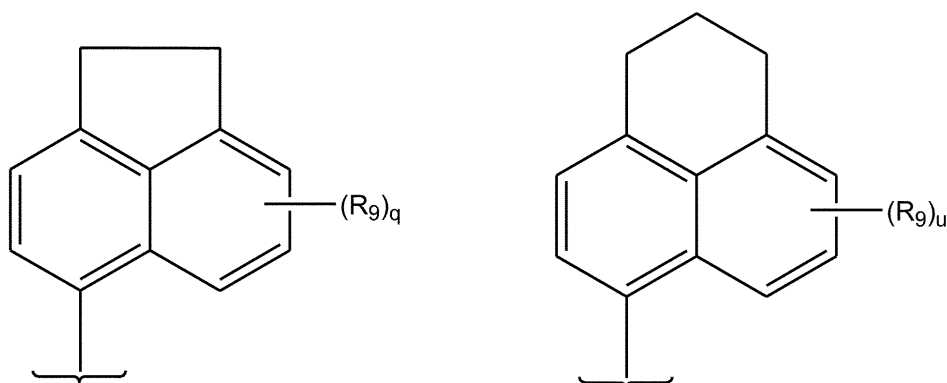
$R_9$ は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ からなる群から選択される置換基であるか、

または2つの $R_9$ 基が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって縮合環を形成し、

$q$ は、0または1から7の整数である、請求項1036に記載の化合物。

[請求項1043]

$R'_5$ が以下の式



で表され、

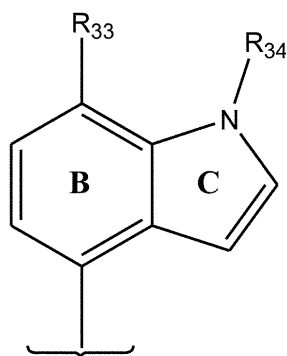
式中、

$q$ は、0または1から5の整数であり、

$u$ は、0または1から5の整数である、請求項1042に記載の化合物。

[請求項1044]

$R'_5$ が以下の式



で表され、

式中、

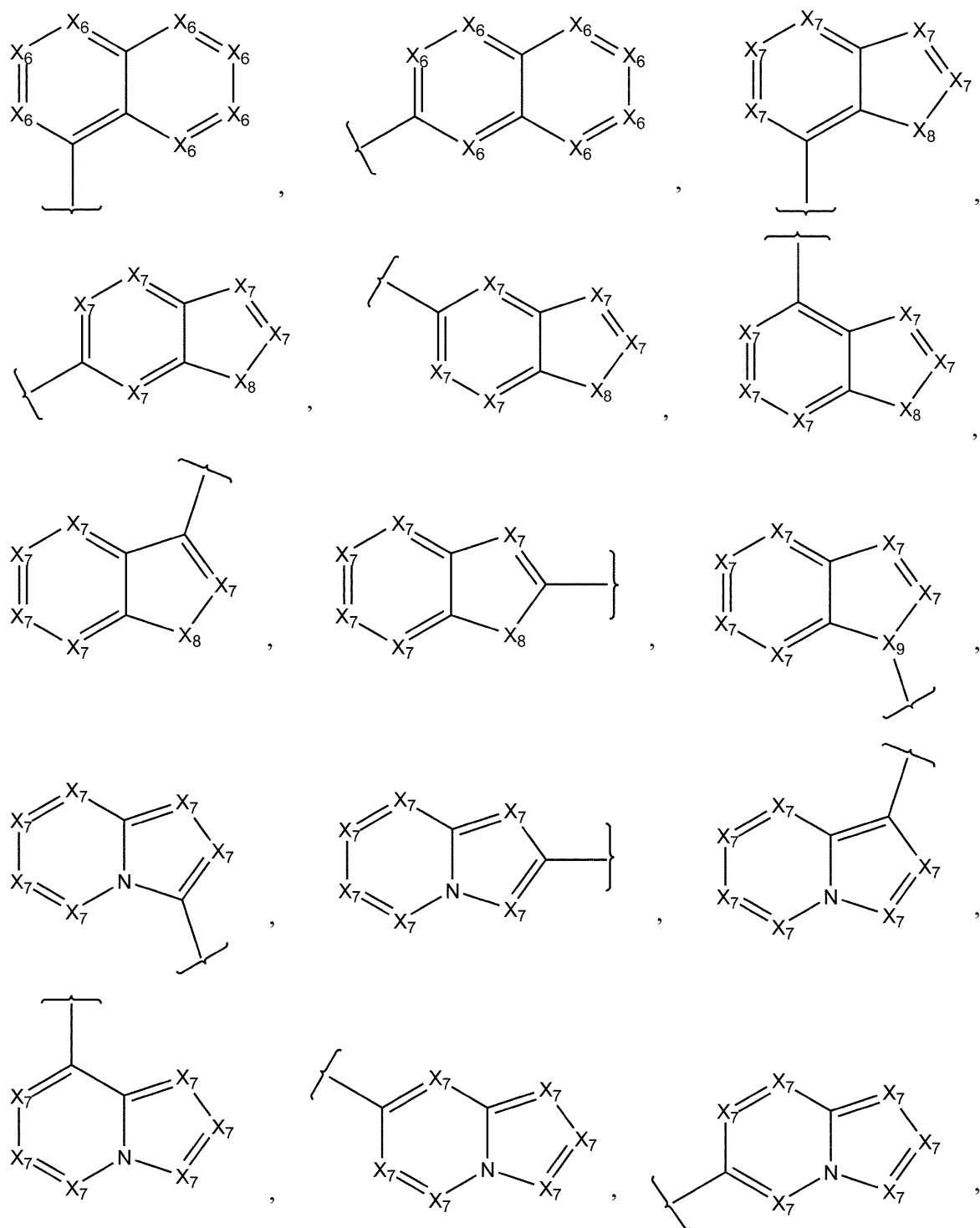
$R_{33}$ は、ハロ、低級アルキル、低級アルコキシ、低級ハロアルキル、低級ハロアルコキシ  
および低級アルキルスルファニルであり、

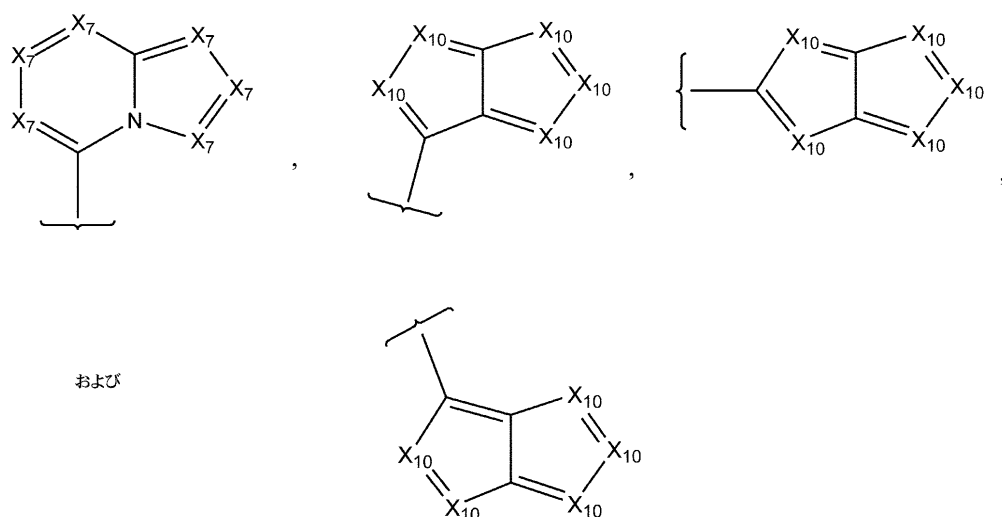
$R_{34}$ は、H、低級アルキルまたは低級アルキルカルボニルであり、

環Bおよび環Cは、1つまたは複数の置換基で置換されていてもよい、請求項1036に記載の  
化合物。

[請求項1045]

$R'_5$ が、





からなる群から選択され、

式中、

$X_6$ は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、N(O)、 $N^+(R_{17})$ であり、ただし、少なくとも3つの $X_6$ 基が、CHおよび $CR_9$ から独立して選択され、

$X_7$ は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、N(O)、 $N^+(R_{17})$ であり、ただし、少なくとも3つの $X_7$ 基が、CHおよび $CR_9$ から独立して選択され、

$X_8$ は、それぞれについて独立して、 $CH_2$ 、 $CHR_9$ 、 $C(R_9)_2$ 、S、S(O)<sub>p</sub>、 $NR_7$ または $NR_{17}$ であり、

$X_9$ は、それぞれについて独立して、NまたはCHであり、

$X_{10}$ は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、N(O)、 $N^+(R_{17})$ であり、ただし、少なくとも1つの $X_{10}$ が、CHおよび $CR_9$ から選択され、

$R_9$ は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、-N $R_{10}R_{11}$ 、-OR<sub>7</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>からなる群から選択される置換基であるか、

または2つの $R_9$ 基が、それらが結合する炭素原子と一緒になって縮合環を形成し、

$R_{17}$ は、それぞれについて独立して、-H、アルキル、アラルキル、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>または-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>である、請求項1036に記載の化合物。

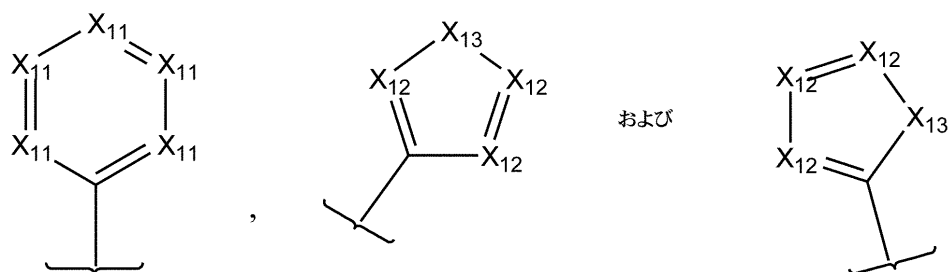
[請求項1046]

$R'_{15}$ が、置換されていてもよいインドリル、置換されていてもよいベンゾイミダゾリル、置換されていてもよいインダゾリル、置換されていてもよい3H-インダゾリル、置換されていてもよいインドリジニル、置換されていてもよいキノリニル、置換されていてもよいイソキノリニル、置換されていてもよいベンゾキサゾリル、置換されていてもよいベンゾ[1,3]ジオキサゾリル、置換されていてもよいベンゾフリル、置換されていてもよいベンゾチアゾリル、置換されていてもよいベンゾ[d]イソキサゾリル、置換されていてもよいベンゾ[d]イソチアゾリル、置換されていてもよいチアゾロ[4,5-c]ピリジニル、置換されて

いてもよいチアゾロ[5,4-c]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[5,4-b]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[5,4-c]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[5,4-b]ピリジニル、置換されていてもよいイミダゾピリジニル、置換されていてもよいベンゾチアジアゾリル、ベンゾキサジアゾリル、置換されていてもよいベンゾトリアゾリル、置換されていてもよいテトラヒドロインドリル、置換されていてもよいアザインドリル、置換されていてもよいキナゾリニル、置換されていてもよいプリニル、置換されていてもよいイミダゾ[4,5-a]ピリジニル、置換されていてもよいイミダゾ[1,2-a]ピリジニル、置換されていてもよい3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよい1H-イミダゾ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよい1H-イミダゾ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよい3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいピリドピルダジニルおよび置換されていてもよいピリドピリミジニル、置換されていてもよいピロロ[2,3]ピリミジニル、置換されていてもよいピラゾロ[3,4]ピリミジニル、置換されていてもよいシクロペンタイミダゾリル、置換されていてもよいシクロペンタトリアゾリル、置換されていてもよいピロロピラゾリル、置換されていてもよいピロロイミダゾリル、置換されていてもよいピロロトリアゾリルまたは置換されていてもよいベンゾ(b)チエニルである、請求項1045に記載の化合物。

[請求項1047]

R'<sub>5</sub>が、



からなる群から選択され、

式中、

X<sub>11</sub>は、それぞれについて独立して、CH、CR<sub>9</sub>、N、N(O)またはN<sup>+</sup>(R<sub>17</sub>)であり、

X<sub>12</sub>は、それぞれについて独立して、CH、CR<sub>9</sub>、N、N(O)、N<sup>+</sup>(R<sub>17</sub>)であり、ただし、少なくとも1つのX<sub>12</sub>基が、CHおよびCR<sub>9</sub>から独立して選択され、

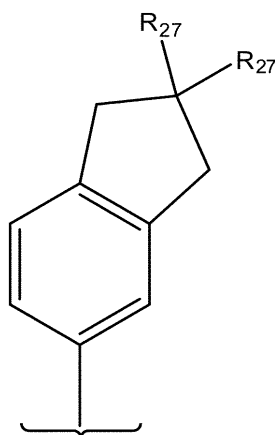
X<sub>13</sub>は、それぞれについて独立して、O、S、S(O)<sub>p</sub>、NR<sub>7</sub>またはNR<sub>17</sub>であり、

R<sub>9</sub>は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OR<sub>7</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>からなる群から選択される置換基であるか、

または2つのR<sub>9</sub>基が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって縮合環を形成し、

R<sub>17</sub>は、それぞれについて独立して、アルキルまたはアラルキルである、請求項1036に記載の化合物。



[請求項1048]R'<sub>5</sub>が、であり、

式中、R<sub>27</sub>は、それぞれについて独立して、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OR<sub>7</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>からなる群から選択される置換基であるか、

または2つのR<sub>27</sub>基が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、置換されていてもよいシクロアルキル環または置換されていてもよいヘテロシクリル環である、請求項1036に記載の化合物。

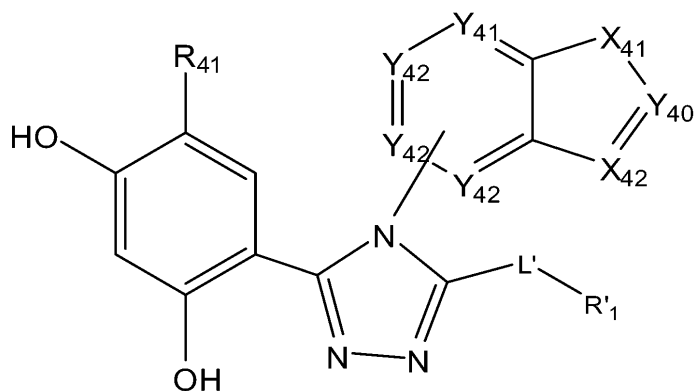
[請求項1049]R'<sub>5</sub>がX<sub>20</sub>R<sub>50</sub>である、請求項1036に記載の化合物。[請求項1050]

X<sub>20</sub>がC1~C4アルキルであり、R<sub>50</sub>が置換されていてもよいフェニルである、請求項1049に記載の化合物。

[請求項1051]

L'が-S-CH<sub>2</sub>-または-S-であり、R'<sub>1</sub>が、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよいチアゾリル、置換されていてもよいピリジニル、置換されていてもよいジヒドロフラン、置換されていてもよいピリミジン-ジオン、置換されていてもよいイミダゾリルまたは-C(O)N(R<sub>13</sub>)<sub>2</sub>である、請求項1039~1050のいずれか一項に記載の化合物。

[請求項1052]化合物が、以下の構造



(IV)

で表され、

式中、

$X_{41}$  は、O、Sまたは $NR_{42}$ であり、

$X_{42}$  は、 $CR_{44}$ またはNであり、

$Y_{40}$  は、Nまたは $CR_{43}$ であり、

$Y_{41}$  は、Nまたは $CR_{45}$ であり、

$Y_{42}$  は、それぞれについて独立して、N、Cまたは $CR_{46}$ であり、

$R_{41}$  は、-H、-OH、-SH、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアララルキル、置換されていてもよいヘテロアララルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシまたはシクロアルコキシ、ハロアルコキシ、- $NR_{10}R_{11}$ 、- $OR_7$ 、- $C(O)R_7$ 、- $C(O)OR_7$ 、- $C(S)R_7$ 、- $C(O)SR_7$ 、- $C(S)SR_7$ 、- $C(S)OR_7$ 、- $C(S)NR_{10}R_{11}$ 、- $C(NR_8)OR_7$ 、- $C(NR_8)R_7$ 、- $C(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、- $C(NR_8)SR_7$ 、- $OC(O)R_7$ 、- $OC(O)OR_7$ 、- $OC(S)OR_7$ 、- $OC(NR_8)OR_7$ 、- $SC(O)R_7$ 、- $SC(O)OR_7$ 、- $SC(NR_8)OR_7$ 、- $OC(S)R_7$ 、- $SC(S)R_7$ 、- $SC(S)OR_7$ 、- $OC(O)NR_{10}R_{11}$ 、- $OC(S)NR_{10}R_{11}$ 、- $OC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、- $SC(O)NR_{10}R_{11}$ 、- $SC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、- $SC(S)NR_{10}R_{11}$ 、- $OC(NR_8)R_7$ 、- $SC(NR_8)R_7$ 、- $C(O)NR_{10}R_{11}$ 、- $NR_8C(O)R_7$ 、- $NR_7C(S)R_7$ 、- $NR_7C(S)OR_7$ 、- $NR_7C(NR_8)R_7$ 、- $NR_7C(O)OR_7$ 、- $NR_7C(NR_8)OR_7$ 、- $NR_7C(O)NR_{10}R_{11}$ 、- $NR_7C(S)NR_{10}R_{11}$ 、- $NR_7C(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、- $SR_7$ 、- $S(O)_pR_7$ 、- $OS(O)_pR_7$ 、- $OS(O)_pOR_7$ 、- $OS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、- $S(O)_pOR_7$ 、- $NR_8S(O)_pR_7$ 、- $NR_7S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、- $NR_7S(O)_pOR_7$ 、- $S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、- $SS(O)_pR_7$ 、- $SS(O)_pOR_7$ 、- $SS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、- $OP(O)(OR_7)_2$ または- $SP(O)(OR_7)_2$ であり、

$R_{42}$  は、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアララルキル、置換されていてもよいヘテロアララルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、- $C(O)R_7$ 、- $(CH_2)_mC(O)OR_7$ 、- $C(O)OR_7$ 、- $OC(O)R_7$ 、- $C(O)NR_{10}R_{11}$ 、- $S(O)_pR_7$ 、- $S(O)_pOR_7$ または- $S(O)_pNR_{10}R_{11}$ であり、

$R_{43}$  および  $R_{44}$  は、独立して、-H、-OH、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアララルキル、置換されていてもよいヘテロアララルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、- $C(O)R_7$ 、- $C(O)OR_7$ 、- $OC(O)R_7$ 、- $C(O)NR_{10}R_{11}$ 、- $NR_8C(O)R_7$ 、- $SR_7$ 、- $S(O)_pR_7$ 、- $OS(O)_pR_7$ 、- $S(O)_pOR_7$ 、- $NR_8S(O)_pR_7$ 、- $S(O)_pNR_{10}R_{11}$ であるが、 $R_{43}$  および  $R_{44}$  が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていても

よいアリール、置換されていてもよいヘテロシクリルまたは置換されていてもよいヘテロアリールを形成し、

$R_{45}$  は、 $-H$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NR_7H$ 、 $-OR_{26}$ 、 $-SR_{26}$ 、 $-NHR_{26}$ 、 $-O(CH_2)_mOH$ 、 $-O(CH_2)_mSH$ 、 $-O(CH_2)_mNR_7H$ 、 $-S(CH_2)_mOH$ 、 $-S(CH_2)_mSH$ 、 $-S(CH_2)_mNR_7H$ 、 $-OC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-SC(O)R_7$ 、 $-NR_7C(O)R_7$ 、 $-OC(O)OR_7$ 、 $-SC(O)OR_7$ 、 $-NR_7C(O)OR_7$ 、 $-OCH_2C(O)R_7$ 、 $-SCH_2C(O)R_7$ 、 $-NR_7CH_2C(O)R_7$ 、 $-OCH_2C(O)OR_7$ 、 $-SCH_2C(O)OR_7$ 、 $-NR_7CH_2C(O)OR_7$ 、 $-OCH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SCH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7CH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-SS(O)_pR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-SS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-OS(O)_pOR_7$ 、 $-SS(O)_pOR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pOR_7$ 、 $-OC(S)R_7$ 、 $-SC(S)R_7$ 、 $-NR_7C(S)R_7$ 、 $-OC(S)OR_7$ 、 $-SC(S)OR_7$ 、 $-NR_7C(S)OR_7$ 、 $-OC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(NR_8)R_7$ 、 $-SC(NR_8)R_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)R_7$ 、 $-OC(NR_8)OR_7$ 、 $-SC(NR_8)OR_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)OR_7$ 、 $-OC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(NR_8)NR_{10}R_{11}$  または  $-NR_7C(NR_8)NR_{10}R_{11}$  であり、

$R_{46}$  は、それぞれについて独立して、 $H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$  または  $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$  からなる群から選択される、請求項1036に記載の化合物。

[請求項1053]

$X_{41}$  が  $NR_{42}$  であり、 $X_{42}$  が  $CR_{44}$  である、請求項1052に記載の化合物。

[請求項1054]

$X_{41}$  が  $NR_{42}$  であり、 $X_{42}$  が  $N$  である、請求項1052に記載の化合物。

[請求項1055]

$R_{41}$  が、 $-H$ 、低級アルキル、低級アルコキシ、低級シクロアルキルおよび低級シクロアルコキシからなる群から選択される、請求項1052に記載の化合物。

[請求項1056]

$R_{41}$  が、 $-H$ 、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、プロポキシおよびシクロプロポキシからなる群から選択される、請求項1052に記載の化合物。

[請求項1057]

$X_{41}$  が  $NR_{42}$  であり、 $R_{42}$  が、 $-H$ 、低級アルキル、低級シクロアルキル、 $-C(O)N(R_{27})_2$  および  $-C(O)OH$  からなる群から選択され、式中、各  $R_{27}$  は独立して、 $-H$  または低級アルキルである、請求項1052に記載の化合物。

[請求項1058]

$X_{41}$  が  $NR_{42}$  であり、 $R_{42}$  が、 $-H$ 、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、 $n$ -ブチル、 $sec$ -ブチル、 $tert$ -ブチル、 $n$ -ペンチル、 $n$ -ヘキシル、 $-C(O)OH$ 、 $-(CH_2)_mC(O)OH$ 、 $-CH_2OCH_3$ 、 $-CH_2CH_2OCH_3$  および  $-C(O)N(CH_3)_2$  からなる群から選択される、請求項1052に記載の化合物。

[請求項1059]

$R_{43}$  および  $R_{44}$  が、独立して、 $-H$ 、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、プロポキシおよびシクロプロポキシからなる群から選択される、請求項1052に記載の化合物。

[請求項1060]

$X_{42}$  が  $CR_{44}$  であり、 $Y_{40}$  が  $CR_{43}$  であり、 $R_{43}$  および  $R_{44}$  が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、シクロアルケニル、アリール、ヘテロシクリルまたはヘテロアリール環を形成する、請求項1052に記載の化合物。

[請求項1061]

$R_{43}$  および  $R_{44}$  が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、 $C_5 \sim C_8$  シクロアルケニル

または $C_5 \sim C_8$ アリールを形成する、請求項1060に記載の化合物。

[請求項1062]

$R_{45}$ または $CR_{45}$ が、-H、-OH、-SH、-NH<sub>2</sub>、低級アルコキシ、低級アルキルアミノおよび低級ジアルキルアミノからなる群から選択される、請求項1060に記載の化合物。

[請求項1063]

$R_{45}$ が、-H、-OH、メトキシおよびエトキシからなる群から選択される、請求項1062に記載の化合物。

[請求項1064]

$X_{41}$ がOである、請求項1060に記載の化合物。

[請求項1065]

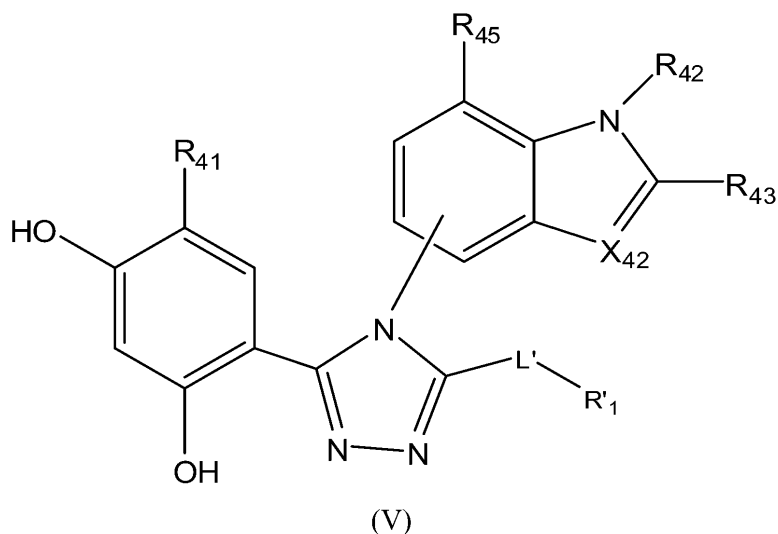
$L'$ が-S-CR<sub>12</sub>-または-S-である、請求項1052に記載の化合物。

[請求項1066]

$R'_{11}$ が、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよいチアゾリル、置換されていてもよいピリジニル、置換されていてもよいジヒドロフラン、置換されていてもよいピリミジン-ジオン、置換されていてもよいイミダゾリルまたは-C(O)N(R<sub>13</sub>)<sub>2</sub>である、請求項1065に記載の化合物。

[請求項1067]

化合物が、以下の構造式



で表されるか、それらの互変異性体、薬学的に許容される塩またはプロドラッグである、請求項1052に記載の化合物。

[請求項1068]

$X_{42}$ が $CR_{44}$ であり、 $R_{43}$ および $R_{44}$ が独立して、-H、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、プロポキシおよびシクロプロポキシからなる群から選択される、請求項1067に記載の化合物。

[請求項1069]

$X_{42}$ が $CR_{44}$ であり、 $R_{43}$ および $R_{44}$ が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、シクロアルケニル、アリール、ヘテロシクリルまたはヘテロアリール環を形成する、請求項1067に記載の化合物。

[請求項1070]

$R_{43}$ および $R_{44}$ が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、 $C_5 \sim C_8$ シクロアルケニルまたは $C_5 \sim C_8$ アリールを形成する、請求項1069に記載の化合物。

[請求項1071]

$X_{42}$ が $CR_{44}$ である、請求項1067に記載の化合物。

[請求項1072]

$X_{42}$ がNである、請求項1067に記載の化合物。

[請求項1073]

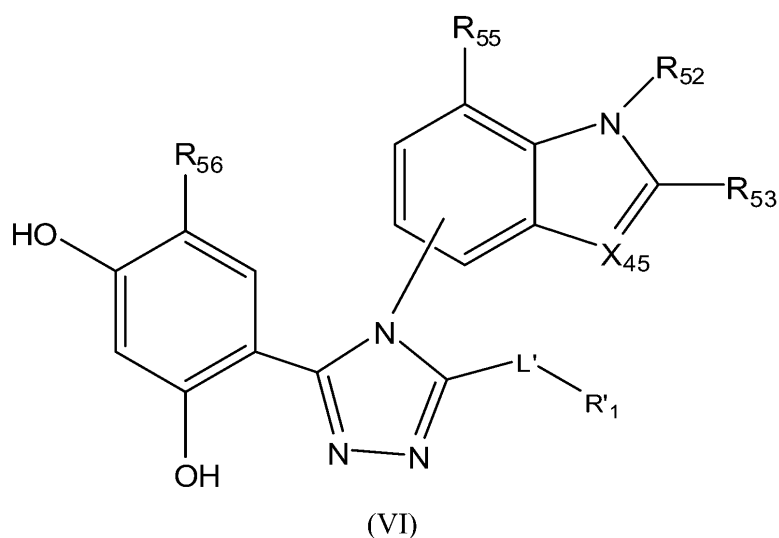
L'が-S-CR<sub>12</sub>-または-S-である、請求項1067に記載の化合物。

[請求項1074]

R'<sub>1</sub>が、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよいチアゾリル、置換されていてもよいピリジニル、置換されていてもよいジヒドロフラン、置換されていてもよいピリミジン-ジオン、置換されていてもよいイミダゾリルまたは-C(O)N(R<sub>13</sub>)<sub>2</sub>である、請求項1073に記載の化合物。

[請求項1075]

化合物が、以下の構造式



で表されるか、それらの互変異性体、薬学的に許容される塩またはプロドラッグであり、式中、

X<sub>45</sub>は、CR<sub>54</sub>またはNであり、

R<sub>56</sub>は、-H、メチル、エチル、イソプロピルおよびシクロプロピルからなる群から選択され、

R<sub>52</sub>は、-H、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>C(O)OHおよび-C(O)N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>からなる群から選択され、

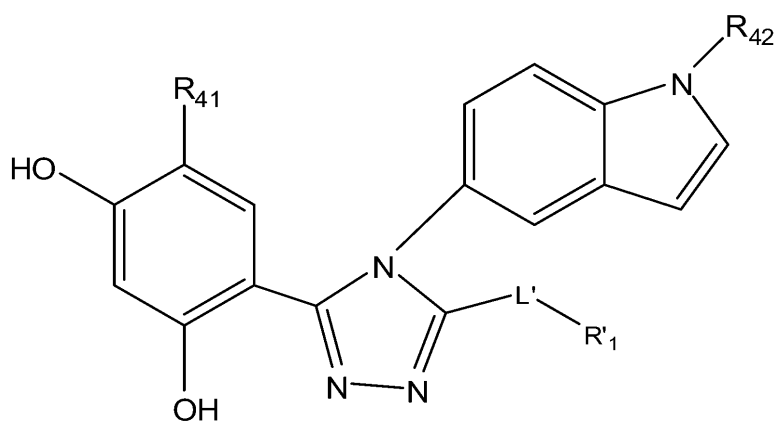
R<sub>53</sub>およびR<sub>54</sub>は、各々独立して、-H、メチル、エチルまたはイソプロピルであるか、または

R<sub>53</sub>およびR<sub>54</sub>が、それらが結合する炭素原子と一緒に、フェニル環、シクロヘキセニル環またはシクロオクテニル環を形成し、

R<sub>55</sub>は、-H、-OH、-OCH<sub>3</sub>およびOCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>からなる群から選択される、請求項1067に記載の化合物。

[請求項1076]

化合物が、以下の構造式



(VII)

で表される、請求項1052に記載の化合物。

[請求項1077]

R<sub>41</sub>が、-H、低級アルキル、低級アルコキシ、低級シクロアルキルおよび低級シクロアルコキシからなる群から選択される、請求項1076に記載の化合物。

[請求項1078]

R<sub>41</sub>が、-H、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、プロポキシおよびシクロプロポキシからなる群から選択される、請求項1077に記載の化合物。

[請求項1079]

R<sub>42</sub>が、-Hまたは置換されていてもよい低級アルキルである、請求項1078に記載の化合物。

[請求項1080]

L'が-S-CR<sub>12</sub>-または-S-である、請求項1079に記載の化合物。

[請求項1081]

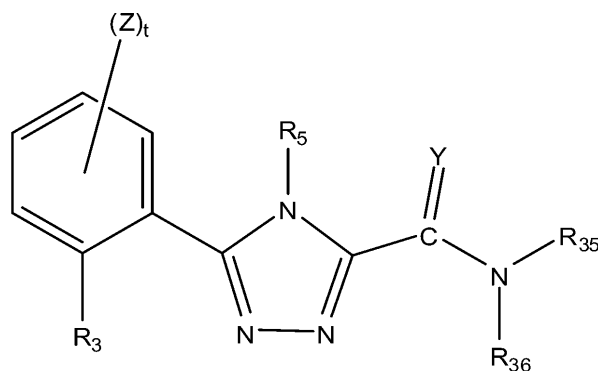
R'<sub>1</sub>が、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよいチアゾリル、置換されていてもよいピリジニル、置換されていてもよいジヒドロフラン、置換されていてもよいピリミジン-ジオン、置換されていてもよいイミダゾリルまたは-C(O)N(R<sub>13</sub>)<sub>2</sub>である、請求項1080に記載の化合物。

[請求項1082]

L'が-S-CH<sub>2</sub>-である、請求項1081に記載の化合物。

[請求項1083]

以下の構造式



(VIII)

で表される化合物またはそれらの互変異性体、薬学的に許容される塩またはプロドラッグ

：

式中、

Yは、OまたはSであり、

$R_3$ は、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NR_7H$ 、 $-OR_{26}$ 、 $-SR_{26}$ 、 $-O(CH_2)_mOH$ 、 $-O(CH_2)_mSH$ 、 $-O(CH_2)_mNR_7H$ 、 $-S(CH_2)_mOH$ 、 $-S(CH_2)_mSH$ 、 $-S(CH_2)_mNR_7H$ 、 $-OC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-SC(O)R_7$ 、 $-NR_7C(O)R_7$ 、 $-OC(O)OR_7$ 、 $-SC(O)OR_7$ 、 $-NR_7C(O)OR_7$ 、 $-OCH_2C(O)R_7$ 、 $-SCH_2C(O)R_7$ 、 $-NR_7CH_2C(O)R_7$ 、 $-OCH_2C(O)OR_7$ 、 $-SCH_2C(O)OR_7$ 、 $-NR_7CH_2C(O)OR_7$ 、 $-OCH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SCH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7CH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-SS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-SS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-OS(O)_pOR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pOR_7$ 、 $-OC(S)R_7$ 、 $-SC(S)R_7$ 、 $-NR_7C(S)R_7$ 、 $-OC(S)OR_7$ 、 $-SC(S)OR_7$ 、 $-NR_7C(S)OR_7$ 、 $-OC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(NR_8)R_7$ 、 $-SC(NR_8)R_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)R_7$ 、 $-OC(NR_8)OR_7$ 、 $-SC(NR_8)OR_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)OR_7$ 、 $-OC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ であり、

$R_5$ は、 $-H$ 、 $-X_{20}R_{50}$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアララルキルまたは置換されていてもよいヘテロアララルキルであり、

$R_7$ および $R_8$ は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアララルキルまたは置換されていてもよいヘテロアララルキルであり、

$R_{10}$ および $R_{11}$ は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアララルキルまたは置換されていてもよいヘテロアララルキルであるか、または $R_{10}$ および $R_{11}$ が、それらが結合する窒素と一緒にあって、置換されていてもよいヘテロシクリルまたは置換されていてもよいヘテロアリールを形成し、

$R_{26}$ は、低級アルキルであり、

$R_{35}$ および $R_{36}$ は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアララルキルまたは置換されていてもよいヘテロアララルキルであるか、 $R_{35}$ および $R_{36}$ が、それらが結合するNと一緒にあって、5から7員環の複素環を形成し、

$R_{50}$ は、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールであり、

$X_{20}$ は、C1～C4アルキル、 $NR_7$ 、 $C(O)$ 、 $C(S)$ 、 $C(NR_8)$ または $S(O)_p$ であり、

Zは、置換基であり、

tは、0、1、2、3または4であり、

pは、それぞれについて独立して、1または2である。

[請求項1084]

$R_3$ が、 $-OH$ 、 $-SH$ または $-NHR_7$ である、請求項1083に記載の化合物。

[請求項1085]

nが1である、請求項1083に記載の化合物。

[請求項1086]

nが0である、請求項1083に記載の化合物。

[請求項1087]

$R_{35}$ または $R_{36}$ のうちの一方が $-H$ である、請求項1083に記載の化合物。

[請求項1088]

$R_{35}$ および $R_{36}$ がともに-Hである、請求項1087に記載の化合物。

[請求項1089]

$R_{35}$ および $R_{36}$ が、それらが結合するNと一緒にあって、5員環または6員環の複素環を形成する、請求項1083に記載の化合物。

[請求項1090]

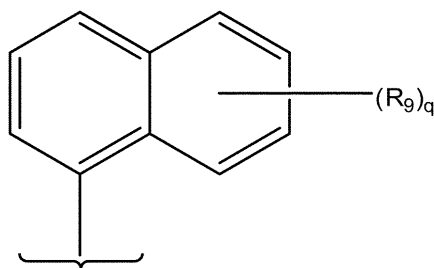
Zが、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-C(S)R_7$ 、 $-C(O)SR_7$ 、 $-C(S)SR_7$ 、 $-C(S)OR_7$ 、 $-C(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-C(NR_8)OR_7$ 、 $-C(NR_8)R_7$ 、 $-C(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-C(NR_8)SR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-OC(O)OR_7$ 、 $-OC(S)OR_7$ 、 $-OC(NR_8)OR_7$ 、 $-SC(O)R_7$ 、 $-SC(O)OR_7$ 、 $-SC(NR_8)OR_7$ 、 $-OC(S)R_7$ 、 $-SC(S)R_7$ 、 $-SC(S)OR_7$ 、 $-OC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(NR_8)R_7$ 、 $-SC(NR_8)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-NR_7C(S)R_7$ 、 $-NR_7C(S)OR_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)R_7$ 、 $-NR_7C(O)OR_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)OR_7$ 、 $-NR_7C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pOR_7$ 、 $-OS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7S(O)_pOR_7$ 、 $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-SS(O)_pR_7$ 、 $-SS(O)_pOR_7$ 、 $-SS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ である、請求項1083に記載の化合物。

[請求項1091]

Zが、C1～C6アルキル、C1～C6ハロアルキル、C1～C6アルコキシ、C1～C6ハロアルコキシ、C1～C6アルキルスルファニルまたはC3～C6シクロアルキルである、請求項1090に記載の化合物。

[請求項1092]

$R_5$ が、以下の式



で表され、

式中、

$R_9$ は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ からなる群から選択される置換基であるか、

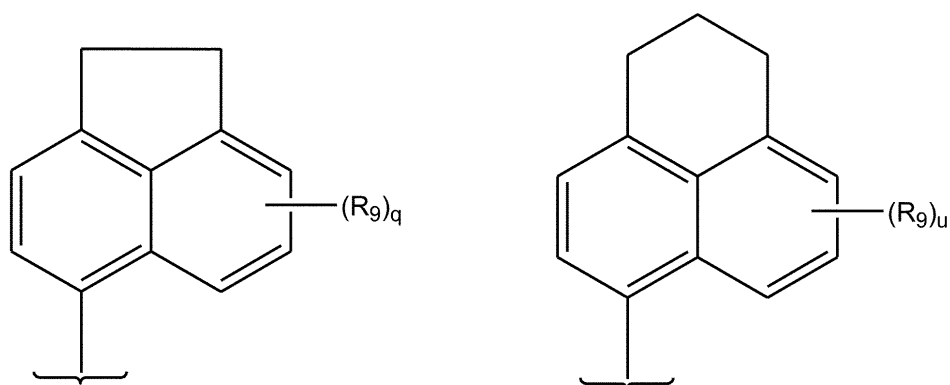
または2つの $R_9$ 基が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって縮合環を形成し、

$q$ は、0または1から7の整数である、請求項1083に記載の化合物。

[請求項1093]



R<sub>5</sub>が、以下の式



で表され、

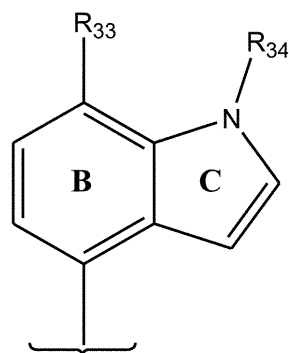
式中、

qは、0または1から5の整数であり、

uは、0または1から5の整数である、請求項1092に記載の化合物。

[請求項1094]

R<sub>5</sub>が、以下の式



で表され、

式中、

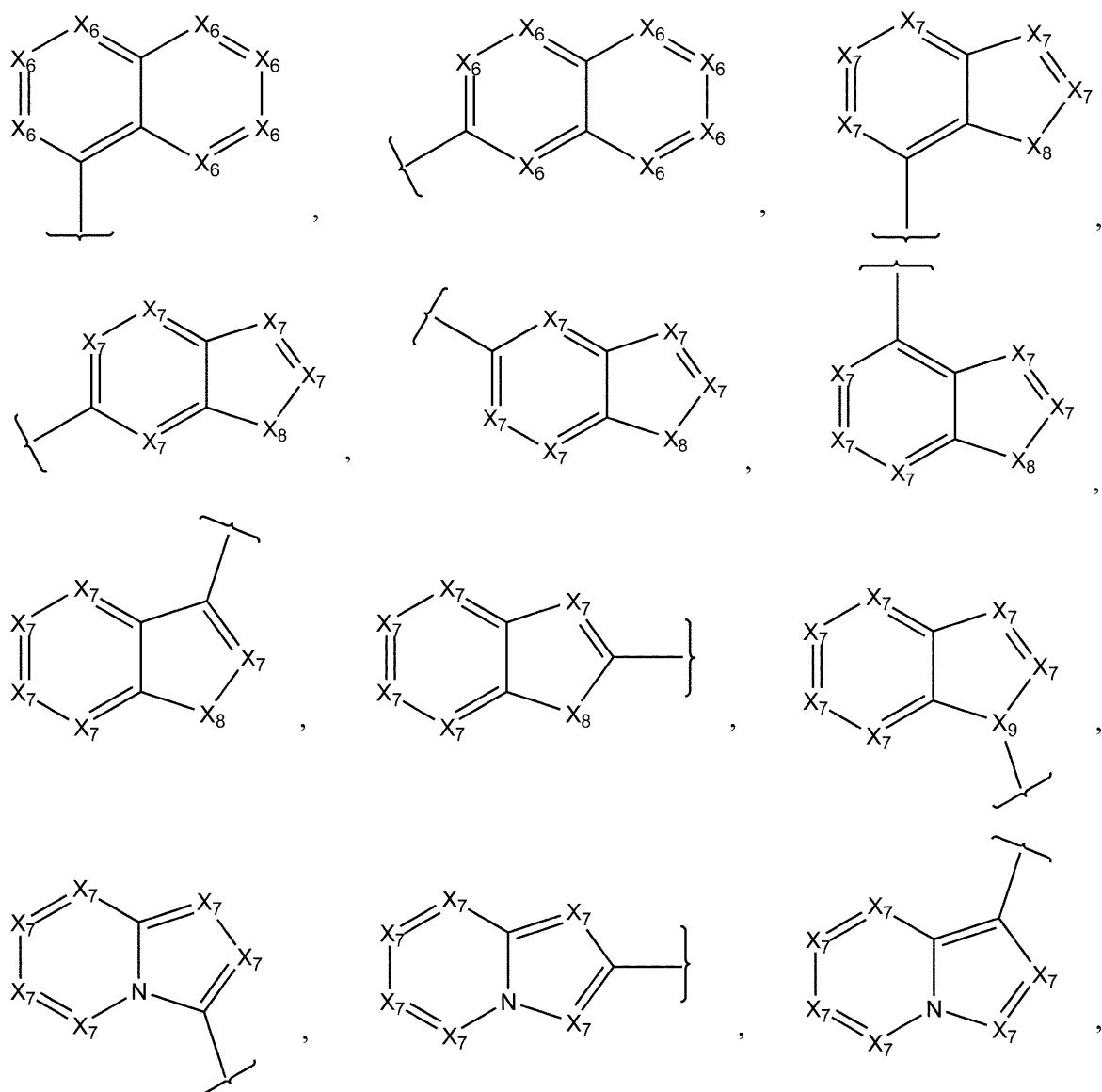
R<sub>33</sub>は、ハロ、低級アルキル、低級アルコキシ、低級ハロアルキル、低級ハロアルコキシおよび低級アルキルスルファニルであり、

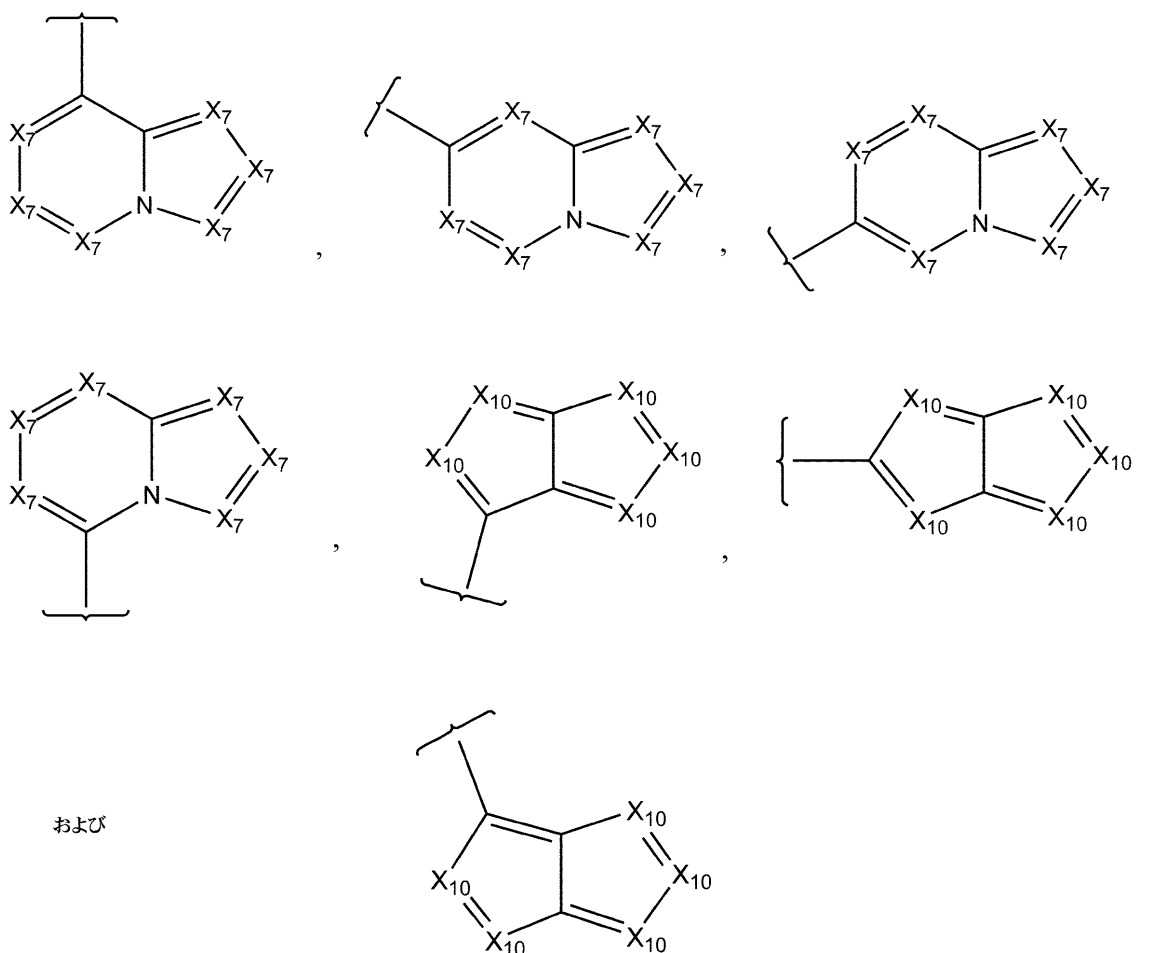
R<sub>34</sub>は、H、低級アルキルまたは低級アルキルカルボニルであり、

環Bおよび環Cは、1つまたは複数の置換基で置換されていてもよい、請求項1083に記載の化合物。

[請求項1095]

R<sub>5</sub>が、





および

からなる群から選択され、

式中、

$X_6$  は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、N(O)、 $N^+(R_{17})$  であり、ただし、少なくとも3つの $X_6$ 基が、CHおよび $CR_9$ から独立して選択され、

$X_7$  は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、N(O)、 $N^+(R_{17})$  であり、ただし、少なくとも3つの $X_7$ 基が、CHおよび $CR_9$ から独立して選択され、

$X_8$  は、それぞれについて独立して、 $CH_2$ 、 $CHR_9$ 、 $C(R_9)_2$ 、S、S(O)<sub>p</sub>、 $NR_7$ または $NR_{17}$ であり、

$X_9$  は、それぞれについて独立して、NまたはCHであり、

$X_{10}$  は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、N(O)、 $N^+(R_{17})$  であり、ただし、少なくとも1つの $X_{10}$ が、CHおよび $CR_9$ から選択され、

$R_9$  は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ からなる群から選択される置換基であるか、

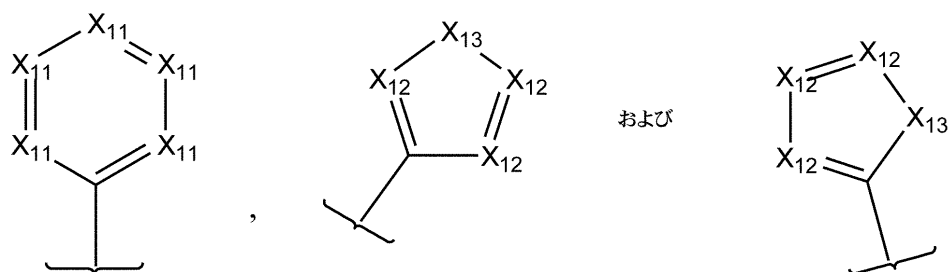
または2つの $R_9$ 基が、それらが結合する炭素原子と一緒になって縮合環を形成し、 $R_{17}$ は、それぞれについて独立して、-H、アルキル、アラルキル、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ または $-C(O)NR_{10}R_{11}$ である、請求項1083に記載の化合物。

[請求項1096]

$R_5$ が、置換されていてもよいインドリル、置換されていてもよいベンゾイミダゾリル、置換されていてもよいインダゾリル、置換されていてもよい3H-インダゾリル、置換されていてもよいインドリジニル、置換されていてもよいキノリニル、置換されていてもよいイソキノリニル、置換されていてもよいベンゾキサゾリル、置換されていてもよいベンゾ[1,3]ジオキサゾリル、置換されていてもよいベンゾフリル、置換されていてもよいベンゾチアゾリル、置換されていてもよいベンゾ[d]イソキサゾリル、置換されていてもよいベンゾ[d]イソチアゾリル、置換されていてもよいチアゾロ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[5,4-c]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[5,4-b]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[5,4-c]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[5,4-b]ピリジニル、置換されていてもよいイミダゾピリジニル、置換されていてもよいベンゾチアジアゾリル、ベンゾキサジアゾリル、置換されていてもよいベンゾトリアゾリル、置換されていてもよいテトラヒドロインドリル、置換されていてもよいアザインドリル、置換されていてもよいキナゾリニル、置換されていてもよいブリニル、置換されていてもよいイミダゾ[4,5-a]ピリジニル、置換されていてもよいイミダゾ[1,2-a]ピリジニル、置換されていてもよい3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよい1H-イミダゾ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよい1H-イミダゾ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよい3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいピリドピルダジニルおよび置換されていてもよいピリドピリミジニル、置換されていてもよいピロロ[2,3]ピリミジニル、置換されていてもよいピラゾロ[3,4]ピリミジニル、置換されていてもよいシクロペンタイミダゾリル、置換されていてもよいシクロペンタトリアゾリル、置換されていてもよいピロロピラゾリル、置換されていてもよいピロロイミダゾリル、置換されていてもよいピロロトリアゾリルまたは置換されていてもよいベンゾ(b)チエニルである、請求項1095に記載の化合物。

[請求項1097]

$R_5$ が、



からなる群から選択され、

式中、

$X_{11}$ は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、N(O)または $N^+(R_{17})$ であり、

$X_{12}$ は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、N(O)、 $N^+(R_{17})$ であり、ただし、少なくとも1つの $X_{12}$ 基が、CHおよび $CR_9$ から独立して選択され、

$X_{13}$ は、それぞれについて独立して、O、S、S(O)p、 $NR_7$ または $NR_{17}$ であり、

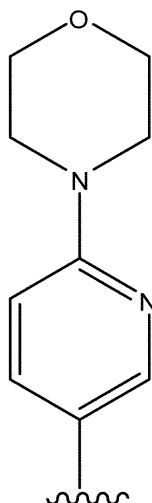
$R_9$ は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキ

ル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ からなる群から選択される置換基であるか、

または2つの $R_9$ 基が、それらが結合する炭素原子と一緒に縮合環を形成し、 $R_{17}$ は、それぞれについて独立して、アルキルまたはアラルキルである、請求項1083に記載の化合物。

[請求項1098]

$R_5$ が、



である、請求項1083に記載の化合物。

[請求項1099]

$R_5$ が $X_{20}R_{50}$ である、請求項1083に記載の化合物。

[請求項1100]

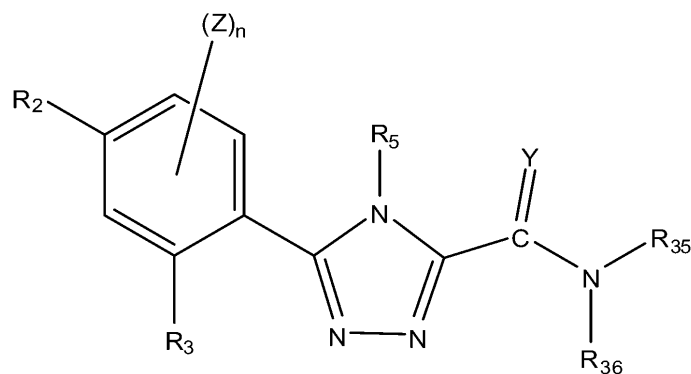
$X_{20}$ がC1～C4アルキルであり、 $R_{50}$ が置換されていてもよいフェニルである、請求項1099に記載の化合物。

[請求項1101]

$R_5$ が-Hである、請求項1083に記載の化合物。

[請求項1102]

化合物が、以下の構造式



(IX)

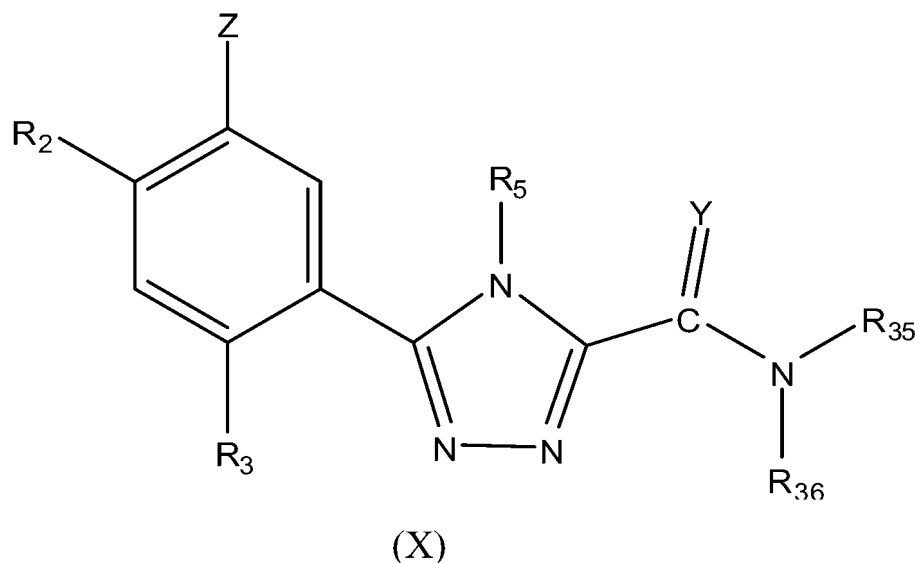
で表され、

式中、

$R_2$  は、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NR}_7\text{H}$ 、 $-\text{OR}_{26}$ 、 $-\text{SR}_{26}$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{OH}$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{SH}$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{NR}_7\text{H}$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{OH}$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{SH}$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{NR}_7\text{H}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{SC}(\text{O})\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_7\text{C}(\text{O})\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}_7$ 、 $-\text{SC}(\text{O})\text{R}_7$ 、 $-\text{NR}_7\text{C}(\text{O})\text{R}_7$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{OR}_7$ 、 $-\text{SC}(\text{O})\text{OR}_7$ 、 $-\text{NR}_7\text{C}(\text{O})\text{OR}_7$ 、 $-\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{R}_7$ 、 $-\text{SCH}_2\text{C}(\text{O})\text{R}_7$ 、 $-\text{NR}_7\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{R}_7$ 、 $-\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{OR}_7$ 、 $-\text{SCH}_2\text{C}(\text{O})\text{OR}_7$ 、 $-\text{NR}_7\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OR}_7$ 、 $-\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{SCH}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_7\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{OS}(\text{O})_p\text{R}_7$ 、 $-\text{SS}(\text{O})_p\text{R}_7$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{OR}_7$ 、 $-\text{NR}_7\text{S}(\text{O})_p\text{R}_7$ 、 $-\text{OS}(\text{O})_p\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{SS}(\text{O})_p\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_7\text{S}(\text{O})_p\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{OS}(\text{O})_p\text{OR}_7$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{OR}_7$ 、 $-\text{NR}_7\text{S}(\text{O})_p\text{OR}_7$ 、 $-\text{OC}(\text{S})\text{R}_7$ 、 $-\text{SC}(\text{S})\text{R}_7$ 、 $-\text{NR}_7\text{C}(\text{S})\text{R}_7$ 、 $-\text{OC}(\text{S})\text{OR}_7$ 、 $-\text{SC}(\text{S})\text{OR}_7$ 、 $-\text{NR}_7\text{C}(\text{S})\text{OR}_7$ 、 $-\text{OC}(\text{S})\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{SC}(\text{S})\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_7\text{C}(\text{S})\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{OC}(\text{NR}_8)\text{R}_7$ 、 $-\text{SC}(\text{NR}_8)\text{R}_7$ 、 $-\text{NR}_7\text{C}(\text{NR}_8)\text{R}_7$ 、 $-\text{OC}(\text{NR}_8)\text{OR}_7$ 、 $-\text{SC}(\text{NR}_8)\text{OR}_7$ 、 $-\text{NR}_7\text{C}(\text{NR}_8)\text{OR}_7$ 、 $-\text{OC}(\text{NR}_8)\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{SC}(\text{NR}_8)\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_7\text{C}(\text{NR}_8)\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}_7)_2$ または $-\text{SP}(\text{O})(\text{OR}_7)_2$ であり、  
 $n$ は、0、1、2または3である、請求項1083に記載の化合物。

[請求項1103]

化合物が、以下の構造式



で表される、請求項1102に記載の化合物。

[請求項1104]

$R_2$ および $R_3$ が独立して、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ または $-\text{NHR}_7$ である、請求項1103に記載の化合物。

[請求項1105]

$R_{35}$ または $R_{36}$ のうちの一方が $-\text{H}$ である、請求項1103に記載の化合物。

[請求項1106]

$R_{35}$ および $R_{36}$ がともに $-\text{H}$ である、請求項1105に記載の化合物。

[請求項1107]

$Z$ が、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアララルキル、置換されていてもよいヘテロアララルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、 $-\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{OR}_7$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}_7$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}_7$ 、 $-\text{C}(\text{S})\text{R}_7$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{SR}_7$ 、 $-\text{C}(\text{S})\text{SR}_7$ 、 $-\text{C}(\text{S})\text{OR}_7$ 、 $-\text{C}(\text{S})\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{C}(\text{NR}_8)\text{OR}_7$ 、 $-\text{C}(\text{NR}_8)\text{R}_7$ 、 $-\text{C}(\text{NR}_8)\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{C}(\text{NR}_8)\text{SR}_7$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}_7$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{OR}_7$ 、 $-\text{OC}(\text{S})\text{OR}_7$ 、 $-\text{OC}(\text{N}$

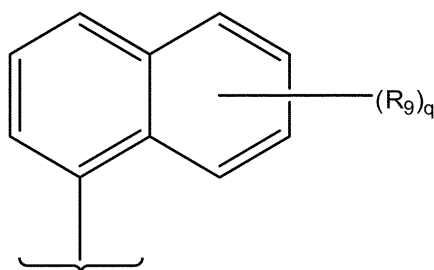
$R_8$ )OR<sub>7</sub>、-SC(O)R<sub>7</sub>、-SC(O)OR<sub>7</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-OC(S)R<sub>7</sub>、-SC(S)R<sub>7</sub>、-SC(S)OR<sub>7</sub>、-OC(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OC(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(S)R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(S)OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(O)OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>C(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>C(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-SS(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-SS(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>である、請求項1103に記載の化合物。

[請求項1108]

Zが、C1～C6アルキル、C1～C6ハロアルキル、C1～C6アルコキシ、C1～C6ハロアルコキシ、C1～C6アルキルスルファニルまたはC3～C6シクロアルキルである、請求項1107に記載の化合物。

[請求項1109]

R<sub>5</sub>が、以下の式で表される、請求項1103に記載の化合物：



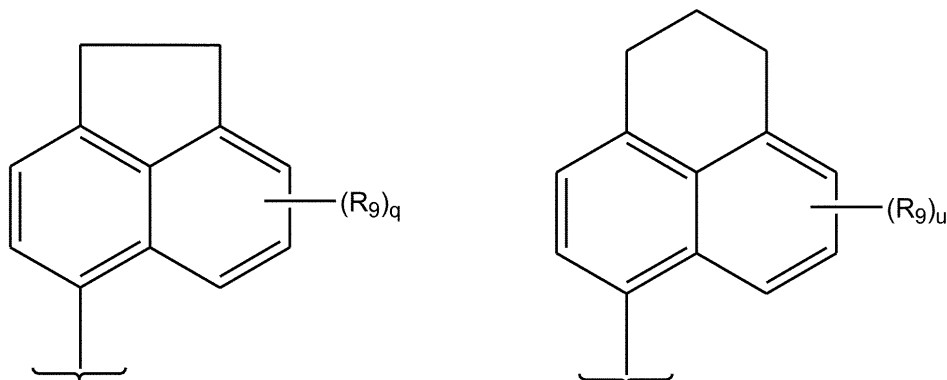
式中、

R<sub>9</sub>は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OR<sub>7</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>からなる群から選択される置換基であるか、

または2つのR<sub>9</sub>基が、それらが結合する炭素原子と一緒になって縮合環を形成し、qは、ゼロまたは1から7の整数である。

[請求項1110]

R<sub>5</sub>が、以下の式で表される、請求項1109に記載の化合物：



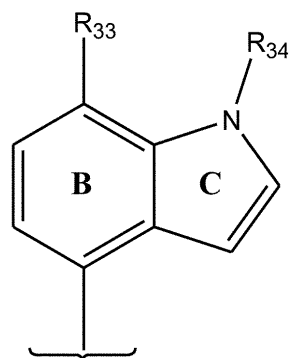
式中、

qは、ゼロまたは1から5の整数であり、

uは、ゼロまたは1から5の整数である。

[請求項1111]

R<sub>5</sub>が、以下の式で表される、請求項1103に記載の化合物：



式中、

R<sub>33</sub>は、ハロ、低級アルキル、低級アルコキシ、低級ハロアルキル、低級ハロアルコキシ  
および低級アルキルスルファニルであり、

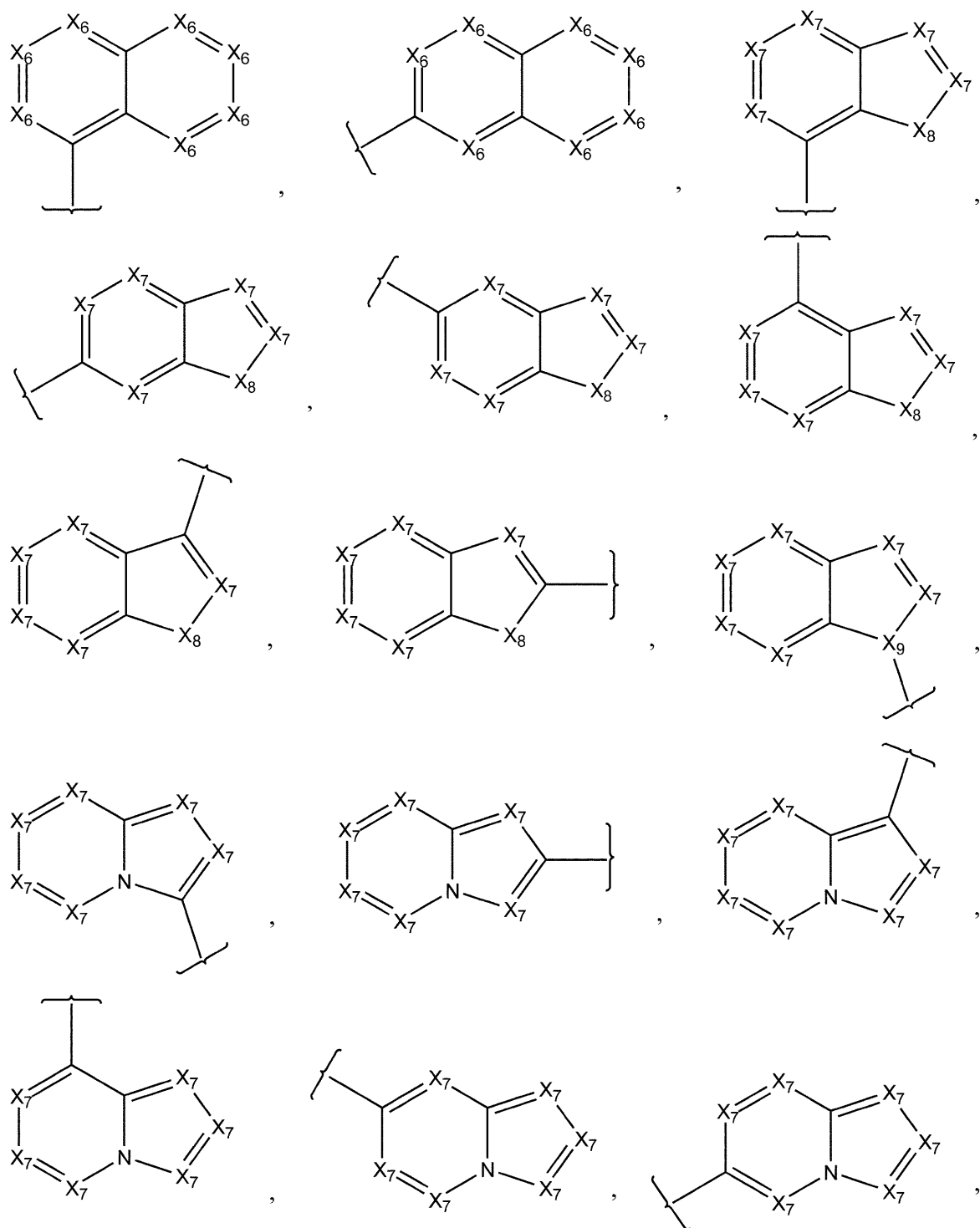
R<sub>34</sub>は、H、低級アルキルまたは低級アルキルカルボニルであり、

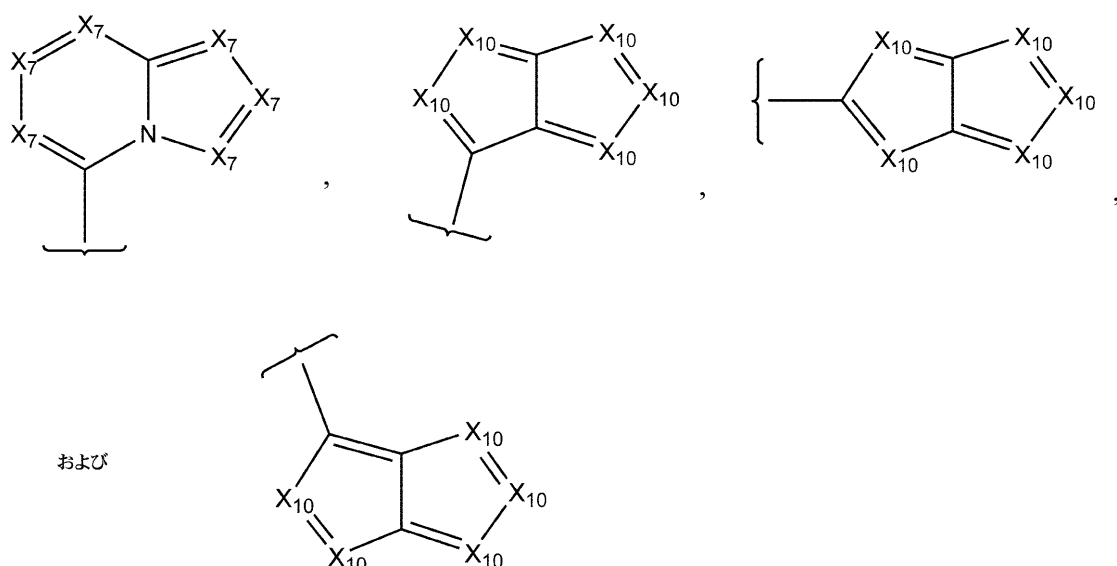
環Bおよび環Cは、1種または複数種の置換基で置換されていてもよい。

[請求項1112]

R<sub>5</sub>が、







からなる群から選択され、式中、

$X_6$ は、それぞれについて独立して、 $CH$ 、 $CR_9$ 、 $N$ 、 $N(O)$ 、 $N^+(R_{17})$ であり、但し、少なくとも3つの $X_6$ 基が、 $CH$ および $CR_9$ から独立して選択され、

$X_7$ は、それぞれについて独立して、 $CH$ 、 $CR_9$ 、 $N$ 、 $N(O)$ 、 $N^+(R_{17})$ であり、但し、少なくとも3つの $X_7$ 基が、 $CH$ および $CR_9$ から独立して選択され、

$X_8$ は、それぞれについて独立して、 $CH_2$ 、 $CHR_9$ 、 $C(R_9)_2$ 、 $S$ 、 $S(O)_p$ 、 $NR_7$ または $NR_{17}$ であり、

$X_9$ は、それぞれについて独立して、 $N$ または $CH$ であり、

$X_{10}$ は、それぞれについて独立して、 $CH$ 、 $CR_9$ 、 $N$ 、 $N(O)$ 、 $N^+(R_{17})$ であり、但し、少なくとも1つの $X_{10}$ が、 $CH$ および $CR_9$ から選択され、

$R_9$ は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-N R_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ からなる群から選択される置換基であるか、

または2つの $R_9$ 基が、それらが結合する炭素原子と一緒になって縮合環を形成し、

$R_{17}$ は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、アルキル、アラルキル、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ または $-C(O)NR_{10}R_{11}$ である、請求項1103に記載の化合物。

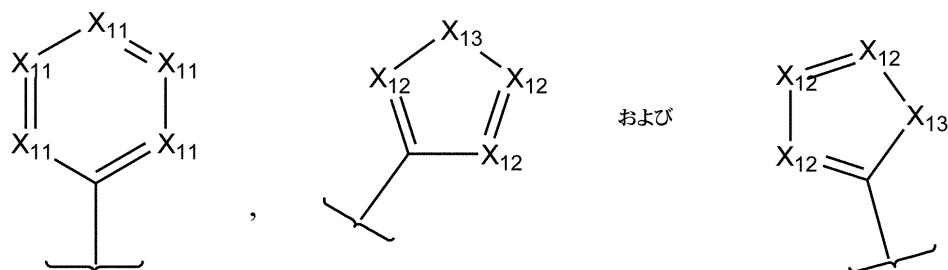
[請求項1113]

$R_5$ が、置換されていてもよいインドリル、置換されていてもよいベンゾイミダゾリル、置換されていてもよいインダゾリル、置換されていてもよい3H-インダゾリル、置換されていてもよいインドリジニル、置換されていてもよいキノリニル、置換されていてもよいイソキノリニル、置換されていてもよいベンゾキサゾリル、置換されていてもよいベンゾ[1,3]ジオキサゾリル、置換されていてもよいベンゾフリル、置換されていてもよいベンゾチアゾリル、置換されていてもよいベンゾ[d]イソキサゾリル、置換されていてもよいベ

ンゾ[d]イソチアゾリル、置換されていてもよいチアゾロ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[5,4-c]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[5,4-b]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[5,4-c]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[5,4-b]ピリジニル、置換されていてもよいイミダゾピリジニル、置換されていてもよいベンゾチアジアゾリル、ベンゾキサジアゾリル、置換されていてもよいベンゾトリアゾリル、置換されていてもよいテトラヒドロインドリル、置換されていてもよいアザインドリル、置換されていてもよいキナゾリニル、置換されていてもよいプリニル、置換されていてもよいイミダゾ[4,5-a]ピリジニル、置換されていてもよいイミダゾ[1,2-a]ピリジニル、置換されていてもよい3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよい1H-イミダゾ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよい1H-イミダゾ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよい3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいピリドピルダジニルおよび置換されていてもよいピリドピリミジニル、置換されていてもよいピロロ[2,3]ピリミジニル、置換されていてもよいピラゾロ[3,4]ピリミジニル、置換されていてもよいシクロペンタイミダゾリル、置換されていてもよいシクロペンタトリアゾリル、置換されていてもよいピロロピラゾリル、置換されていてもよいピロロイミダゾリル、置換されていてもよいピロロトリアゾリルまたは置換されていてもよいベンゾ(b)チエニルである、請求項1112に記載の化合物。

[請求項1114]

$R_5$ が、



からなる群から選択され、式中、

$X_{11}$ は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、N(O)または $N^+(R_{17})$ であり、

$X_{12}$ は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、N(O)、 $N^+(R_{17})$ であり、但し、少なくとも1つの $X_{12}$ 基が、CHおよび $CR_9$ から独立して選択され、

$X_{13}$ は、それぞれについて独立して、O、S、 $S(O)_p$ 、 $NR_7$ または $NR_{17}$ であり、

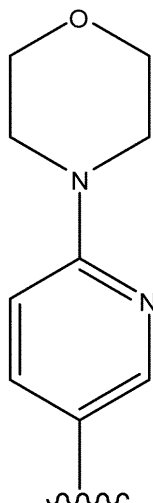
$R_9$ は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ からなる群から選択される置換基であるか、

または2つの $R_9$ 基が、それらが結合する炭素原子と一緒になって縮合環を形成し、

$R_{17}$ は、それぞれについて独立して、アルキルまたはアラルキルである、請求項1103に記載の化合物。

[請求項1115]

R<sub>5</sub>が



である、請求項1103に記載の化合物。

[請求項1116]

R<sub>5</sub>がX<sub>20</sub>R<sub>50</sub>である、請求項1103に記載の化合物。

[請求項1117]

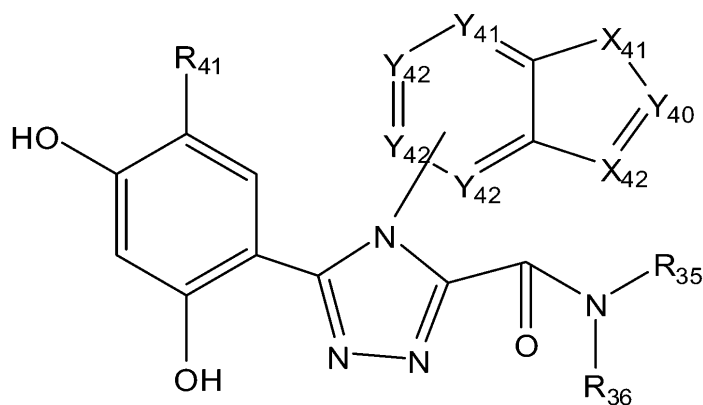
X<sub>20</sub>がC1～C4アルキルであり、R<sub>50</sub>が置換されていてもよいフェニルである、請求項1116に記載の化合物。

[請求項1118]

R<sub>5</sub>が-Hである、請求項1103に記載の化合物。

[請求項1119]

化合物が、以下の構造



(XI)

で表され、

式中、

X<sub>41</sub>は、O、SまたはNR<sub>42</sub>であり、

X<sub>42</sub>は、CR<sub>44</sub>またはNであり、

Y<sub>40</sub>は、NまたはCR<sub>43</sub>であり、

Y<sub>41</sub>は、NまたはCR<sub>45</sub>であり、

Y<sub>42</sub>は、それぞれについて独立して、N、CまたはCR<sub>46</sub>であり、

R<sub>41</sub>は、-H、-OH、-SH、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラールキ

ル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシまたはシクロアルコキシ、ハロアルコキシ、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-C(S)R_7$ 、 $-C(O)SR_7$ 、 $-C(S)SR_7$ 、 $-C(S)OR_7$ 、 $-C(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-C(NR_8)OR_7$ 、 $-C(NR_8)R_7$ 、 $-C(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-C(NR_8)SR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-OC(O)OR_7$ 、 $-OC(S)OR_7$ 、 $-OC(NR_8)OR_7$ 、 $-SC(O)R_7$ 、 $-SC(O)OR_7$ 、 $-SC(NR_8)OR_7$ 、 $-OC(S)R_7$ 、 $-SC(S)R_7$ 、 $-SC(S)OR_7$ 、 $-OC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(NR_8)R_7$ 、 $-SC(NR_8)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-NR_7C(S)R_7$ 、 $-NR_7C(S)OR_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)R_7$ 、 $-NR_7C(O)OR_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)OR_7$ 、 $-NR_7C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pOR_7$ 、 $-OS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7S(O)_pOR_7$ 、 $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-SS(O)_pR_7$ 、 $-SS(O)_pOR_7$ 、 $-SS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ であり、

$R_{42}$ は、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-C(O)R_7$ 、 $-(CH_2)_mC(O)OR_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ であり、

$R_{43}$ および $R_{44}$ は、独立して、 $-H$ 、 $-OH$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ であるが、 $R_{43}$ および $R_{44}$ が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロシクリルまたは置換されていてもよいヘテロアリールを形成し、

$R_{45}$ は、 $-H$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NR_7H$ 、 $-OR_{26}$ 、 $-SR_{26}$ 、 $-NHR_{26}$ 、 $-O(CH_2)_mOH$ 、 $-O(CH_2)_mSH$ 、 $-O(CH_2)_mNR_7H$ 、 $-S(CH_2)_mOH$ 、 $-S(CH_2)_mSH$ 、 $-S(CH_2)_mNR_7H$ 、 $-OC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-SC(O)R_7$ 、 $-NR_7C(O)R_7$ 、 $-OC(O)OR_7$ 、 $-SC(O)OR_7$ 、 $-NR_7C(O)OR_7$ 、 $-OCH_2C(O)R_7$ 、 $-SCH_2C(O)R_7$ 、 $-NR_7CH_2C(O)R_7$ 、 $-OCH_2C(O)OR_7$ 、 $-SCH_2C(O)OR_7$ 、 $-NR_7CH_2C(O)OR_7$ 、 $-OCH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SCH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7CH_2C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-SS(O)_pR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-SS(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-OS(O)_pOR_7$ 、 $-SS(O)_pOR_7$ 、 $-NR_7S(O)_pOR_7$ 、 $-OC(S)R_7$ 、 $-SC(S)R_7$ 、 $-NR_7C(S)R_7$ 、 $-OC(S)OR_7$ 、 $-SC(S)OR_7$ 、 $-NR_7C(S)OR_7$ 、 $-OC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_7C(S)NR_{10}R_{11}$ 、 $-OC(NR_8)R_7$ 、 $-SC(NR_8)R_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)R_7$ 、 $-OC(NR_8)OR_7$ 、 $-SC(NR_8)OR_7$ 、 $-NR_7C(NR_8)OR_7$ 、 $-OC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SC(NR_8)NR_{10}R_{11}$ または $-NR_7C(NR_8)NR_{10}R_{11}$ であり、

$R_{46}$ は、それぞれについて独立して、 $H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ からなる群から選択される、請求項1103に記載の化合物。

[請求項1120]

$X_{41}$ が $NR_{42}$ であり、 $X_{42}$ が $CR_{44}$ である、請求項1119に記載の化合物。

[請求項1121]

X<sub>41</sub>がNR<sub>42</sub>であり、X<sub>42</sub>がNである、請求項1119に記載の化合物。

[請求項1122]

R<sub>41</sub>が、-H、低級アルキル、低級アルコキシ、低級シクロアルキルおよび低級シクロアルコキシからなる群から選択される、請求項1119に記載の化合物。

[請求項1123]

R<sub>41</sub>が、-H、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、プロボキシおよびシクロプロボキシからなる群から選択される、請求項1119に記載の化合物。

[請求項1124]

X<sub>41</sub>がNR<sub>42</sub>であり、R<sub>42</sub>が、-H、低級アルキル、低級シクロアルキル、-C(O)N(R<sub>27</sub>)<sub>2</sub>および-C(O)OHからなる群から選択され、式中、各R<sub>27</sub>は独立して、-Hまたは低級アルキルである、請求項1119に記載の化合物。

[請求項1125]

X<sub>41</sub>がNR<sub>42</sub>であり、R<sub>42</sub>が、-H、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシル、-C(O)OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>C(O)OH、-CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>および-C(O)N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>からなる群から選択される、請求項1119に記載の化合物。

[請求項1126]

R<sub>43</sub>およびR<sub>44</sub>が独立して、-H、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、プロボキシおよびシクロプロボキシからなる群から選択される、請求項1119に記載の化合物。

[請求項1127]

X<sub>42</sub>がCR<sub>44</sub>であり、Y<sub>40</sub>がCR<sub>43</sub>であり、R<sub>43</sub>およびR<sub>44</sub>が、それらが結合する炭素原子と一緒に、シクロアルケニル、アリール、ヘテロシクリルまたはヘテロアリール環を形成する、請求項1119に記載の化合物。

[請求項1128]

R<sub>43</sub>およびR<sub>44</sub>が、それらが結合する炭素原子と一緒に、C<sub>5</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルケニルまたはC<sub>5</sub>~C<sub>8</sub>アリールを形成する、請求項1127に記載の化合物。

[請求項1129]

R<sub>45</sub>またはCR<sub>45</sub>が、-H、-OH、-SH、-NH<sub>2</sub>、低級アルコキシ、低級アルキルアミノおよび低級ジアルキルアミノからなる群から選択される、請求項1127に記載の化合物。

[請求項1130]

R<sub>45</sub>が、-H、-OH、メトキシおよびエトキシからなる群から選択される、請求項1129に記載の化合物。

[請求項1131]

X<sub>41</sub>がOである、請求項1127に記載の化合物。

[請求項1132]

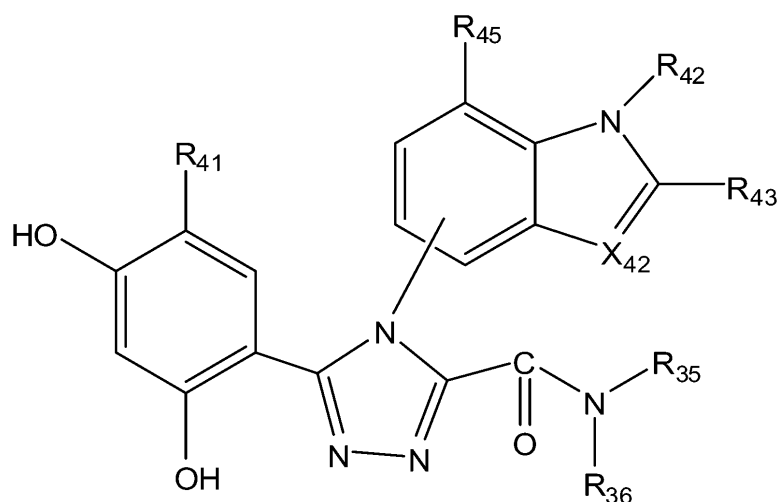
R<sub>35</sub>またはR<sub>36</sub>のうちの一方が-Hである、請求項1119に記載の化合物。

[請求項1133]

R<sub>35</sub>およびR<sub>36</sub>がともに-Hである、請求項1132に記載の化合物。

[請求項1134]

化合物が、以下の構造式



(XII)

で表されるか、それらの互変異性体、薬学的に許容される塩またはプロドラッグである、請求項1119に記載の化合物。

[請求項1135]

$X_{42}$ が $CR_{44}$ であり、 $R_{43}$ および $R_{44}$ が独立して、-H、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、プロボキシおよびシクロプロボキシからなる群から選択される、請求項1134に記載の化合物。

[請求項1136]

$X_{42}$ が $CR_{44}$ であり、 $R_{43}$ および $R_{44}$ が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、シクロアルケニル、アリール、ヘテロシクリルまたはヘテロアリール環を形成する、請求項1134に記載の化合物。

[請求項1137]

$R_{43}$ および $R_{44}$ が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、 $C_5 \sim C_8$ シクロアルケニルまたは $C_5 \sim C_8$ アリールを形成する、請求項1136に記載の化合物。

[請求項1138]

$X_{42}$ が $CR_{44}$ である、請求項1134に記載の化合物。

[請求項1139]

$X_{42}$ がNである、請求項1134に記載の化合物。

[請求項1140]

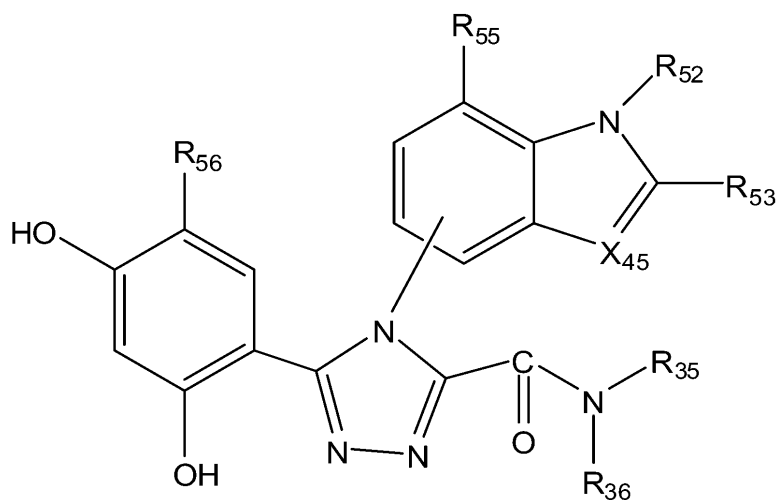
$R_{35}$ または $R_{36}$ のうちの一方が-Hである、請求項1134に記載の化合物。

[請求項1141]

$R_{35}$ および $R_{36}$ がともに-Hである、請求項1140に記載の化合物。

[請求項1142]

化合物が、以下の構造式



(XIII)

で表されるか、それらの互変異性体、薬学的に許容される塩またはプロドラッグであり、式中、

$X_{45}$  は、 $CR_{54}$  または N であり、

$R_{56}$  は、-H、メチル、エチル、イソプロピルおよびシクロプロピルからなる群から選択され、

$R_{52}$  は、-H、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシル、 $-(CH_2)_2OCH_3$ 、 $-CH_2C(O)OH$ 、および  $-C(O)N(CH_3)_2$  からなる群から選択され、

$R_{53}$  および  $R_{54}$  は、各々独立して、-H、メチル、エチルまたはイソプロピルであるか、

$R_{53}$  および  $R_{54}$  が、それらが結合する炭素原子と一緒に、フェニル環、シクロヘキセニル環またはシクロオクテニル環を形成し、

$R_{55}$  は、-H、-OH、 $-OCH_3$  および  $OCH_2CH_3$  からなる群から選択される、請求項1134に記載の化合物。

[請求項1143]

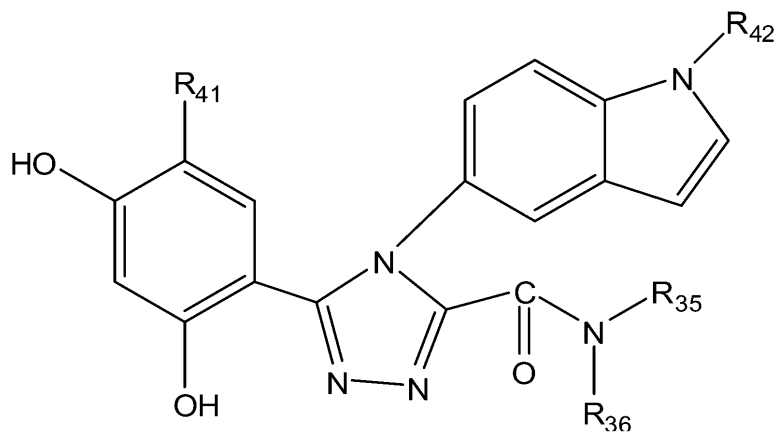
$R_{35}$  または  $R_{36}$  のうち的一方が -H である、請求項1142に記載の化合物。

[請求項1144]

$R_{35}$  および  $R_{36}$  がともに -H である、請求項1143に記載の化合物。

[請求項1145]

化合物が、以下の構造式：



(XIV)

で表される、請求項1119に記載の化合物。

[請求項1146]

$R_{41}$  が、-H、低級アルキル、低級アルコキシ、低級シクロアルキルおよび低級シクロアルコキシからなる群から選択される、請求項1145に記載の化合物。



[請求項1147]

R<sub>41</sub>が、-H、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、プロポキシおよびシクロプロポキシからなる群から選択される、請求項1146に記載の化合物。

[請求項1148]

R<sub>42</sub>が-Hまたは置換されていてもよい低級アルキルである、請求項1147に記載の化合物。

[請求項1149]

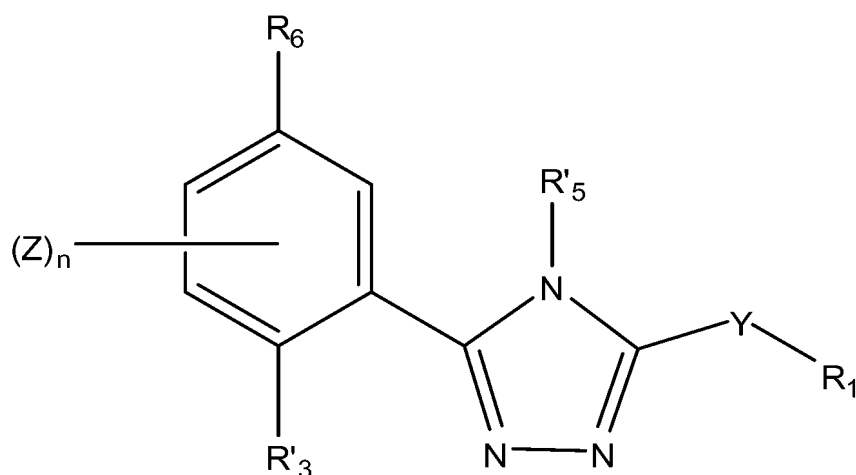
R<sub>35</sub>またはR<sub>36</sub>のうちの一方が-Hである、請求項1148に記載の化合物。

[請求項1150]

R<sub>35</sub>およびR<sub>36</sub>がともに-Hである、請求項1149に記載の化合物。

[請求項1151]

以下の構造式



(XV)

で表される化合物またはそれらの互変異性体、薬学的に許容される塩またはプロドラッグ

:

式中、

Yは、-O-または-S-であり、

R<sub>1</sub>は、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキルまたは-C(O)N(R<sub>13</sub>)<sub>2</sub>であり、

R'<sub>3</sub>は、-OH、-SH、-OR<sub>26</sub>、-SR<sub>26</sub>、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>SH、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NR<sub>7</sub>H、-S(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-S(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>SH、-S(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NR<sub>7</sub>H、-OC(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-SC(O)R<sub>7</sub>、-OC(O)OR<sub>7</sub>、-SC(O)OR<sub>7</sub>、-OCH<sub>2</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-SCH<sub>2</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-OCH<sub>2</sub>C(O)OR<sub>7</sub>、-SCH<sub>2</sub>C(O)OR<sub>7</sub>、-OCH<sub>2</sub>C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SCH<sub>2</sub>C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-SS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SS(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-SS(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OC(S)R<sub>7</sub>、-SC(S)R<sub>7</sub>、-OC(S)OR<sub>7</sub>、-SC(S)OR<sub>7</sub>、-OC(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>であり、

R'<sub>5</sub>は、-X<sub>20</sub>R<sub>50</sub>、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルま

たは置換されていてもよいヘテロアルキルであり、

R<sub>6</sub>は、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OR<sub>7</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-C(S)R<sub>7</sub>、-C(S)SR<sub>7</sub>、-C(S)SR<sub>7</sub>、-C(S)OR<sub>7</sub>、-C(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)SR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-OC(O)OR<sub>7</sub>、-OC(S)OR<sub>7</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-SC(O)R<sub>7</sub>、-SC(O)OR<sub>7</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-OC(S)R<sub>7</sub>、-SC(S)R<sub>7</sub>、-SC(S)OR<sub>7</sub>、-OC(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OC(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SC(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(S)R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(S)OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(NR<sub>8</sub>)R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(O)OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(NR<sub>8</sub>)OR<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>C(S)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>C(NR<sub>8</sub>)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-NR<sub>7</sub>S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>7</sub>S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-SS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-SS(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-SS(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>であり、

R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は、それぞれについて独立して、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

R<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>は、それぞれについて独立して、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいヘテロアラルキルであるか、またはR<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>が、それらが結合する窒素と一緒にあって、置換されていてもよいヘテロシクリルまたは置換されていてもよいヘテロアリールを形成し、

R<sub>26</sub>は、低級アルキルであり、

R<sub>50</sub>は、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールであり、

X<sub>20</sub>は、C1～C4アルキル、NR<sub>7</sub>、C(O)、C(S)、C(NR<sub>8</sub>)またはS(O)<sub>p</sub>であり、

Zは、置換基であり、

mは、それぞれについて独立して、1、2、3または4であり、

pは、それぞれについて独立して、1または2であり、

nは、0、1、2または3であり、

ただし、Yが-S-かつR<sub>1</sub>が置換されていてもよいC1～C3アルキルであれば、R'<sub>3</sub>は-OCH<sub>2</sub>OMeではなく、

Yが-S-、R<sub>1</sub>がMe、R'<sub>5</sub>が低級アルキルであれば、R<sub>6</sub>はハロではない。

[請求項1152]

nが0または1である、請求項1151に記載の化合物。

[請求項1153]

nが0である、請求項1152に記載の化合物。

[請求項1154]

Yが-O-である、請求項1151に記載の化合物。

[請求項1155]

Yが-S-である、請求項1151に記載の化合物。

[請求項1156]

R<sub>1</sub>が置換されていてもよい低級アルキルである、請求項1151に記載の化合物。

[請求項1157]

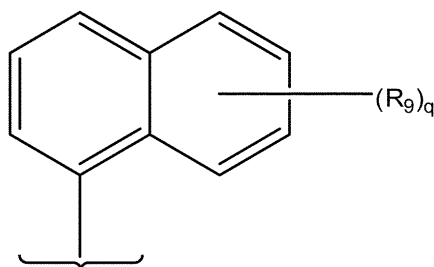
R'<sub>3</sub>がC1～C6アルコキシまたは-OHである、請求項1151に記載の化合物。

[請求項1158]

R<sub>6</sub>が、C1～C6アルキル、C1～C6ハロアルキル、C1～C6アルコキシ、C1～C6ハロアルコキシ、C1～C6アルキルスルファニルまたはC3～C6シクロアルキルである、請求項1151に記載の化合物。

[請求項1159]

R'<sub>5</sub>が以下の式



で表され、

式中、

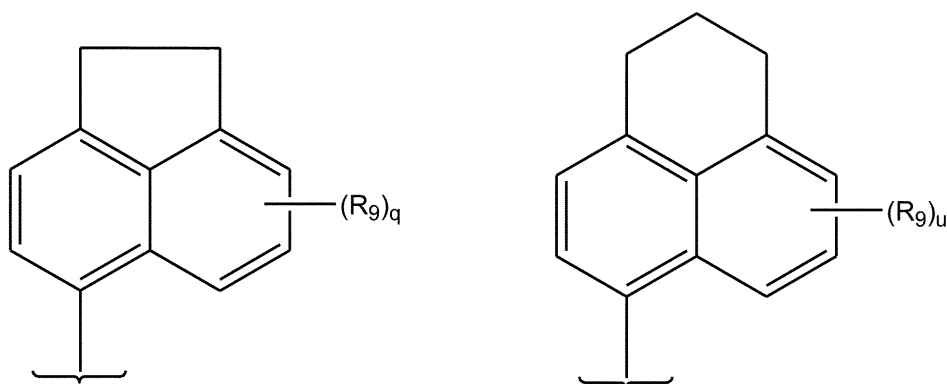
R<sub>9</sub>は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OR<sub>7</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>からなる群から選択される置換基であるか、

または2つのR<sub>9</sub>基が、それらが結合する炭素原子と一緒になって縮合環を形成し、

qは、0または1から7の整数である、請求項1151に記載の化合物。

[請求項1160]

R'<sub>5</sub>が以下の式



で表され、

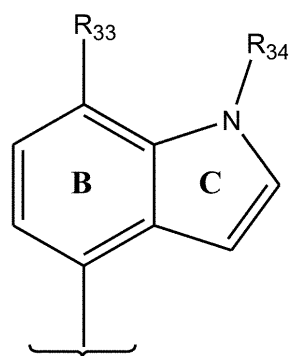
式中、

qは、0または1から5の整数であり、

uは、0または1から5の整数である、請求項1159に記載の化合物。

[請求項1161]

R'<sub>5</sub>が以下の式



で表され、

式中、

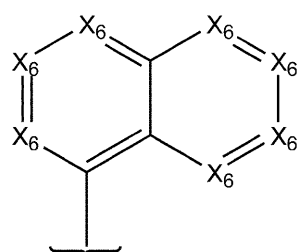
$R_{33}$  は、ハロ、低級アルキル、低級アルコキシ、低級ハロアルキル、低級ハロアルコキシ  
および低級アルキルスルファニルであり、

$R_{34}$  は、H、低級アルキルまたは低級アルキルカルボニルであり、

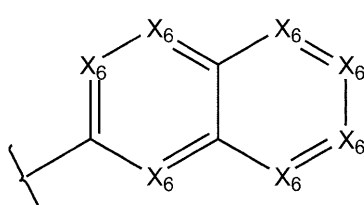
環Bおよび環Cは、1つまたは複数の置換基で置換されていてもよい、請求項1151に記載の  
化合物。

[請求項1162]

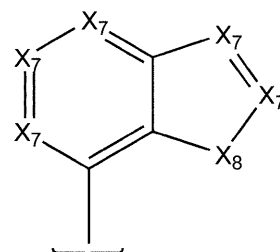
$R'_5$  が、



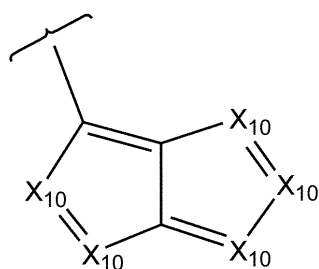
,



,



,



からなる群から選択され、

式中、

$X_6$ は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、N(O)、 $N^+(R_{17})$ であり、ただし、少なくとも3つの $X_6$ 基が、CHおよび $CR_9$ から独立して選択され、

$X_7$ は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、N(O)、 $N^+(R_{17})$ であり、ただし、少なくとも3つの $X_7$ 基が、CHおよび $CR_9$ から独立して選択され、

$X_8$ は、それぞれについて独立して、 $CH_2$ 、 $CHR_9$ 、 $C(R_9)_2$ 、S、S(O)<sub>p</sub>、 $NR_7$ または $NR_{17}$ であり、

$X_9$ は、それぞれについて独立して、NまたはCHであり、

$X_{10}$ は、それぞれについて独立して、CH、 $CR_9$ 、N、N(O)、 $N^+(R_{17})$ であり、ただし、少なくとも1つの $X_{10}$ が、CHおよび $CR_9$ から選択され、

$R_9$ は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ からなる群から選択される置換基であるか、

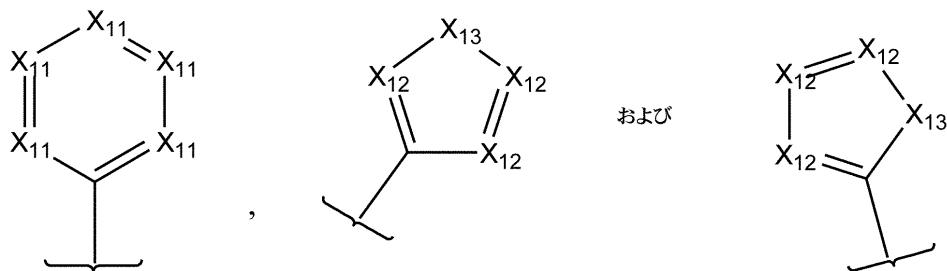
または2つの $R_9$ 基が、それらが結合する炭素原子と一緒になって縮合環を形成し、

$R_{17}$ は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、アルキル、アラルキル、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ または $-C(O)NR_{10}R_{11}$ である、請求項1151に記載の化合物。

[請求項1163]

$R'_5$ が、置換されていてもよいインドリル、置換されていてもよいベンゾイミダゾリル、置換されていてもよいインダゾリル、置換されていてもよい3H-インダゾリル、置換されていてもよいインドリジニル、置換されていてもよいキノリニル、置換されていてもよいイソキノリニル、置換されていてもよいベンゾキサゾリル、置換されていてもよいベンゾ[1,3]ジオキサゾリル、置換されていてもよいベンゾフリル、置換されていてもよいベンゾチアゾリル、置換されていてもよいベンゾ[d]イソキサゾリル、置換されていてもよいベンゾ[d]イソチアゾリル、置換されていてもよいチアゾロ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[5,4-c]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよいチアゾロ[5,4-b]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[5,4-c]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよいオキサゾロ[5,4-b]ピリジニル、置換されていてもよいイミダゾピリジニル、置換されていてもよいベンゾチアジアゾリル、ベンゾキサジアゾリル、置換されていてもよいベンゾトリアゾリル、置換されていてもよいテトラヒドロインドリル、置換されていてもよいアザインドリル、置換されていてもよいキナゾリニル、置換されていてもよいブリニル、置換されていてもよいイミダゾ[4,5-a]ピリジニル、置換されていてもよいイミダゾ[1,2-a]ピリジニル、置換されていてもよい3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよい1H-イミダゾ[4,5-b]ピリジニル、置換されていてもよい1H-イミダゾ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよい3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジニル、置換されていてもよいピリドピリミジニル、置換されていてもよいピロロ[2,3]ピリミジニル、置換されていてもよいピラゾロ[3,4]ピリミジニル、置換されていてもよいシクロペンタイミダゾリル、置換されていてもよいシクロペンタトリアゾリル、置換されていてもよいピロロピラゾリル、置換されていてもよいピロロイミダゾリル、置換されていてもよいピロロトリアゾリルまたは置換されていてもよいベンゾ(b)チエニルである、請求項1162に記載の化合物。

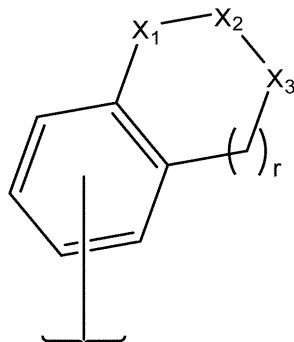
[請求項1164]

R'<sub>5</sub>が、からなる群から選択され、式中、X<sub>11</sub>は、それぞれについて独立して、CH、CR<sub>9</sub>、N、N(O)またはN<sup>+</sup>(R<sub>17</sub>)であり、X<sub>12</sub>は、それぞれについて独立して、CH、CR<sub>9</sub>、N、N(O)、N<sup>+</sup>(R<sub>17</sub>)であり、ただし、少なくとも1つのX<sub>12</sub>基が、CHおよびCR<sub>9</sub>から独立して選択され、X<sub>13</sub>は、それぞれについて独立して、O、S、S(O)<sub>p</sub>、NR<sub>7</sub>またはNR<sub>17</sub>であり、

R<sub>9</sub>は、それぞれについて独立して、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、-NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-OR<sub>7</sub>、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>7</sub>、-OC(O)R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>7</sub>、-SR<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-NR<sub>8</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>7</sub>または-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>7</sub>、-OP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>または-SP(O)(OR<sub>7</sub>)<sub>2</sub>からなる群から選択される置換基であるか、

または2つのR<sub>9</sub>基が、それらが結合する炭素原子と一緒になって縮合環を形成し、R<sub>17</sub>は、それぞれについて独立して、アルキルまたはアラルキルである、請求項1151に記載の化合物。

[請求項1165]

R'<sub>5</sub>がであり、式中、X<sub>1</sub>、X<sub>2</sub>およびX<sub>3</sub>は、各々独立して、C(R<sub>27</sub>)<sub>2</sub>、NR<sub>77</sub>、C(O)、S(O)<sub>2</sub>、OまたはSであり、R<sub>27</sub>は、それぞれについて独立して、-H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル

、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、グアナジノ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-NR_8C(O)R_7$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-NR_8S(O)_pR_7$ または $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ からなる群から選択される置換基であるか、

または2つの $R_{27}$ 基が、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、置換されていてもよいシクロアルキル環または置換されていてもよいヘテロシクリル環を形成し、

$R_{77}$ は、それぞれについて独立して、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ハロ、グアナジノ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、 $-OR_7$ 、 $-C(O)R_7$ 、 $-C(O)OR_7$ 、 $-OC(O)R_7$ 、 $-C(O)NR_{10}R_{11}$ 、 $-SR_7$ 、 $-S(O)_pR_7$ 、 $-OS(O)_pR_7$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-S(O)_pNR_{10}R_{11}$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ 、 $-SP(O)(OR_7)_2$ 、 $-S(O)_pOR_7$ 、 $-OP(O)(OR_7)_2$ または $-SP(O)(OR_7)_2$ からなる群から選択される置換基であり、

$r$ は、0または1である、請求項1151に記載の化合物。

[請求項1166]

$R'_5$ が $X_{20}R_{50}$ である、請求項1151に記載の化合物。

[請求項1167]

$X_{20}$ がC1～C4アルキルであり、 $R_{50}$ が置換されていてもよいフェニルである、請求項1166に記載の化合物。

[請求項1168]

細胞においてHsp90を阻害する方法であって、請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物を細胞に投与する段階を含む、方法。

[請求項1169]

哺乳動物における増殖障害を治療または予防する方法であって、請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物を哺乳動物に投与する段階を含む、方法。

[請求項1170]

哺乳動物における癌を治療する方法であって、請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物を哺乳動物に投与する段階を含む、方法。

[請求項1171]

c-kitタンパク質の分解を誘導する方法であって、請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物を哺乳動物に投与する段階を含む、方法。

[請求項1172]

哺乳動物におけるc-kit関連癌を治療する方法であって、請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物を哺乳動物に投与する段階を含む、方法。

[請求項1173]

Bcr-Ablタンパク質の分解を誘導する方法であって、請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物を哺乳動物に投与する段階を含む、方法。

[請求項1174]

哺乳動物におけるBcr-Abl関連癌を治療する方法であって、請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物を哺乳動物に投与する段階を含む、方法。

[請求項1175]

FLT3タンパク質の分解を誘導する方法であって、請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物を哺乳動物に投与する段階を含む、方法。

[請求項1176]

哺乳動物におけるFLT3関連癌を治療する方法であって、請求項1001～1167のいずれか一



項に記載の有効量の化合物を哺乳動物に投与する段階を含む、方法。

[請求項1177]

EGFRタンパク質の分解を誘導する方法であって、請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物を哺乳動物に投与する段階を含む、方法。

[請求項1178]

哺乳動物におけるEGFR関連癌を治療する方法であって、請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物を哺乳動物に投与する段階を含む、方法。

[請求項1179]

血管形成の治療または阻害を必要とする被検体における血管形成を治療または阻害する方法であって、請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物を被検体に投与する段階を含む、方法。

[請求項1180]

新生血管における血流を遮断、妨害、そうでなければ乱す方法であって、新生血管を請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物と接触させることを含む、方法。

[請求項1181]

新生血管が、被検体におけるものであり、新生血管の血流が、有効量の化合物を被検体に投与することによって、被検体において遮断、妨害、そうでなければ乱される、請求項1180に記載の方法。

[請求項1182]

被検体がヒトである、請求項1181に記載の方法。

[請求項1183]

請求項1001～1167のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの互変異性体、薬学的に許容される塩またはプロドラッグを、有効量で哺乳動物に投与する段階を含む、非ホジキンリンパ腫を治療する方法。

[請求項1184]

非ホジキンリンパ腫がB細胞非ホジキンリンパ腫である、請求項1183に記載の方法。

[請求項1185]

B細胞非ホジキンリンパ腫が、パーキットリンパ腫、濾胞性リンパ腫、びまん性大細胞型B細胞リンパ腫、結節辺縁帯B細胞リンパ腫、形質細胞腫瘍、小リンパ球性リンパ腫/慢性リンパ球性白血病、マントル細胞リンパ腫、リンパ形質細胞性リンパ腫/ワルデンストロームマクログロブリン血症からなる群から選択される、請求項1184に記載の方法。

[請求項1186]

非ホジキンリンパ腫がT細胞非ホジキンリンパ腫である、請求項1183に記載の方法。

[請求項1187]

T細胞非ホジキンリンパ腫が、未分化大細胞リンパ腫、前駆T細胞リンパ芽球性白血病/リンパ腫、不特定末梢性T細胞リンパ腫、血管免疫芽球性T細胞リンパ腫からなる群から選択される、請求項1186に記載の方法。

[請求項1188]

請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物またはその互変異性体、薬学的に許容される塩、またはプロドラッグを被検体に投与する段階を含む、被検体における感染を治療または予防する方法。

[請求項1189]

請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物またはその互変異性体、薬学的に許容される塩またはプロドラッグを、被検体に投与する段階を含む、被検体における真菌感染を治療または予防する方法。

[請求項1190]

請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物またはその互変異性体、薬学的に許容される塩またはプロドラッグを、被検体に投与する段階を含む、被検体における細菌感染を治療または予防する方法。

[請求項1191]

請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物またはその互変異性体、薬学的に許容される塩またはプロドラッグを、被検体に投与する段階を含む、被検体におけるウイルス感染を治療または予防する方法。

[請求項1192]

請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物またはその互変異性体、薬学的に許容される塩またはプロドラッグを、被検体に投与する段階を含む、被検体における寄生虫感染を治療または予防する方法。

[請求項1193]

化合物を別の治療薬とともに投与する、請求項1188～1192のいずれか一項に記載の方法。

[請求項1194]

請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物またはその互変異性体、薬学的に許容される塩またはプロドラッグを、被検体に投与する段階を含む、被検体におけるトポイソメラーゼIIを阻害する方法。

[請求項1195]

請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物またはその互変異性体、薬学的に許容される塩またはプロドラッグを、細胞に投与する段階を含む、細胞における糖質コルチコイド受容体の活性を調節する方法。

[請求項1196]

請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物またはその互変異性体、薬学的に許容される塩またはプロドラッグを、被検体に投与する段階を含む、被検体における炎症性疾患を治療または予防する方法。

[請求項1197]

請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物またはその互変異性体、薬学的に許容される塩またはプロドラッグを、被検体に投与する段階を含む、被検体における免疫疾患を治療または予防する方法。

[請求項1198]

請求項1001～1167のいずれか一項に記載の有効量の化合物またはその互変異性体、薬学的に許容される塩またはプロドラッグを、被検体に投与する段階を含む、免疫系の抑制を必要とする被検体において免疫系を抑制する方法。

[請求項1199]

薬学的に許容されるキャリアと請求項1001～1167のいずれか一項に記載の化合物とを含む、製剤組成物。

[請求項1200]

1種または複数種の別の治療薬をさらに含む、請求項1199に記載の製剤組成物。