

【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】令和 3 年 2 月 4 日 (2021.2.4)

【公表番号】特表 2020-504735 (P2020-504735A)

【公表日】令和 2 年 2 月 13 日 (2020.2.13)

【年通号数】公開・登録公報 2020-006

【出願番号】特願 2019-533622 (P2019-533622)

【国際特許分類】

C 07 H 19/16 (2006.01)

C 07 H 19/167 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 P 37/00 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 25/20 (2006.01)

A 61 K 31/7076 (2006.01)

A 61 K 45/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 35/02 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

【F I】

C 07 H 19/16 C S P

C 07 H 19/167

A 61 P 35/00

A 61 P 9/10

A 61 P 11/00

A 61 P 37/00

A 61 P 29/00

A 61 P 1/04

A 61 P 25/00

A 61 P 25/24

A 61 P 25/16

A 61 P 25/20

A 61 K 31/7076

A 61 K 45/00

A 61 P 43/00 1 2 1

A 61 P 35/02

A 61 P 25/28

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 12 月 21 日 (2020.12.21)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

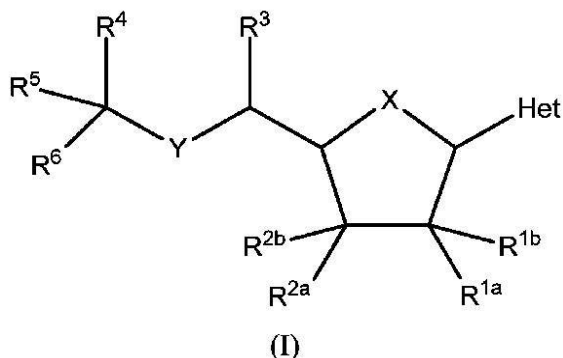
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物：

【化219】



[式中、

XはO、NR⁷またはCR⁷R⁸であり、

YはOまたはSであり、

ZはNR¹⁹、OまたはSであり、

Hetはヘテロシクリルまたはヘテロアリアルであり、

R^{1a}は、H、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、アジド、アミノ、C₁～6アルキル、ヒドロキシC₁～6アルキル、アミノ-C₁～6アルキル、-O-C(O)-O-C₁～6アルキル、C₁～6アシルオキシ、C₁～6アルコキシ、C₂～6アルケニル、およびC₂～6アルキニルから選択され、そして

R^{1b}は、H、ハロ、C₁～6アルキル、ヒドロキシ-C₁～6アルキル、アミノ-C₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、およびC₂～6アルキニルから選択されるか、または

R^{1a}およびR^{1b}は、これらが結合している炭素原子と一緒に、C=CH₂もしくはC=C(H)C₁～6アルキルを形成し、

R^{2a}は、H、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、アジド、アミノ、C₁～6アルキル、ヒドロキシ-C₁～6アルキル、アミノ-C₁～6アルキル、C₁～6アシルオキシ、-O-C(O)-O-C₁～6アルキル、C₁～6アルコキシ、C₂～6アルケニル、およびC₂～6アルキニルから選択され、

R^{2b}は、ハロ、C₁～6アルキル、ヒドロキシ-C₁～6アルキル、アミノ-C₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、およびC₂～6アルキニルから選択されるか、または

R^{2a}およびR^{2b}は、これらが結合している炭素原子と一緒に、C=CH₂もしくはC=C(H)C₁～6アルキルを形成し、

R³は、H、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリアル、アラルキル、ヘテロアリアル、ヘテロアラルキル、および-(CH₂)-C(O)OR₉から選択され、

R⁴は、ヘテロアリアル、アルキル、-C(O)OR⁹、-C(O)NR¹¹R¹²、-S(O)₂R¹⁰、-P(O)(OR¹¹)(OR¹²)、および-P(O)(OR¹¹)(NR¹³R¹⁵)から選択され、

R⁵は、H、シアノ、アルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリルアルキル、アラルキル、ヘテロアラルキル、および-C(O)OR⁹から選択され、

R₆は、-C(O)OR⁹および-P(O)(OR¹¹)(OR¹²)から選択され、

各R⁷およびR⁸はHであり、

R⁹は、独立して、H、アルキル、アシルオキシアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ア

リール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキル、および $-(CHR^{13})_m-Z-C(O)-R^{14}$ から選択され、

各 R^{10} は、独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、アミノ、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキルから選択され、そして

各 R^{11} および R^{12} は、独立して、H、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルおよび $-(CHR^{13})_m-Z-C(O)-R^{14}$ から選択されるか、または

R^{11} および R^{12} は、これらが結合している原子と一緒にあって、5～7員のヘテロシクリルを形成し、そして

各 R^{13} は、独立して、Hまたはアルキルであり、

各 R^{14} は、独立して、アルキル、アミノアルキル、ヘテロシクリル、およびヘテロシクリルアルキルから選択され、

R^{15} は、アルキル、アラルキル、 $-C(R^{16})(R^{17})-C(O)O-R^{18}$ から選択され、

各 R^{16} および R^{17} は、H、アルキル、アミノ-アルキル、ヒドロキシ-アルキル、メルカプト-アルキル、スルホニル-アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアラルキル、および $-(CH_2)C(O)OR^9$ から選択され、

R^{18} は、H、アルキル、アルコキシアルキル、アミノアルキル、ハロアルキル、アミド、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルから選択され、

R^{19} はHまたはアルキル、好ましくはHであり、

mは1または2であり、

ただし、 R^4 がテトラゾリルであるか、または R^5 がアラルキルもしくはヘテロアラルキルであるかのいずれか、または両方を条件とする]またはその薬学的に許容される塩および/もしくはプロドラッグ。

【請求項2】

R^{1a} が、H、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、アジド、アミノ、 C_{1-6} アルキル、ヒドロキシ C_{1-6} アルキル、アミノ- C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アシルオキシ、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、および C_{2-6} アルキニルから選択される、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および/もしくはプロドラッグ。

【請求項3】

R^{1a} がフルオロである、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および/もしくはプロドラッグ。

【請求項4】

R^{1a} がヒドロキシである、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および/もしくはプロドラッグ。

【請求項5】

R^{2a} が、H、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、アジド、アミノ、 C_{1-6} アルキル、ヒドロキシ C_{1-6} アルキル、アミノ- C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アシルオキシ、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、および C_{2-6} アルキニルから選択される、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および/もしくはプロドラッグ。

【請求項6】

R^{2a} がヒドロキシである、請求項1から4のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩および/もしくはプロドラッグ。

【請求項7】

R^{2b} が C_{1-6} アルキルである、請求項1から6のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩および/もしくはプロドラッグ。

【請求項 8】

R^{1a} がヒドロキシであり、 R^{2a} が C_{1-6} 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および / もしくはプロドラッグ。

【請求項 9】

R^{1a} がヒドロキシであり、 R^{2a} がヒドロキシルであり、 R^{2b} が C_{2-6} アルキニルである、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および / もしくはプロドラッグ。

【請求項 10】

R^{2b} が C_{2-6} アルキニルである、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および / もしくはプロドラッグ。

【請求項 11】

R^4 が $-C(O)OR_9$ である、請求項 1 から 10 のいずれか一項に記載の化合物 またはその薬学的に許容される塩および / もしくはプロドラッグ。

【請求項 12】

R^5 がアラルキルまたはヘテロアラルキルである、請求項 1 から 11 のいずれか一項に記載の化合物 またはその薬学的に許容される塩および / もしくはプロドラッグ。

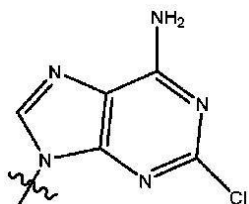
【請求項 13】

Het が 5 ~ 8 員の単環式または 5 ~ 10 員の二環式ヘテロアリールであり、非置換であるか、またはハロ、CN、 NO_2 、アジド、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、チオアルコキシ、カルボニル、チオカルボニル、アミジノ、イミノ、アミノ、アミド、アルコキシカルボニル、カルバメート、ウレア、スルフィンアミド、スルホンアミド、スルフィニル、スルフィンアミド、スルホニル、ホスホリル、ホスフェート、ホスホネート、およびホスフィネートから選択される 1 つもしくは複数の置換基で置換されている、請求項 1 から 12 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩および / もしくはプロドラッグ。

【請求項 14】

Het が、

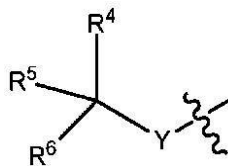
【化 2 2 6】



である、請求項 1 から 12 のいずれか一項に記載の化合物 またはその薬学的に許容される塩および / もしくはプロドラッグ。

【請求項 15】

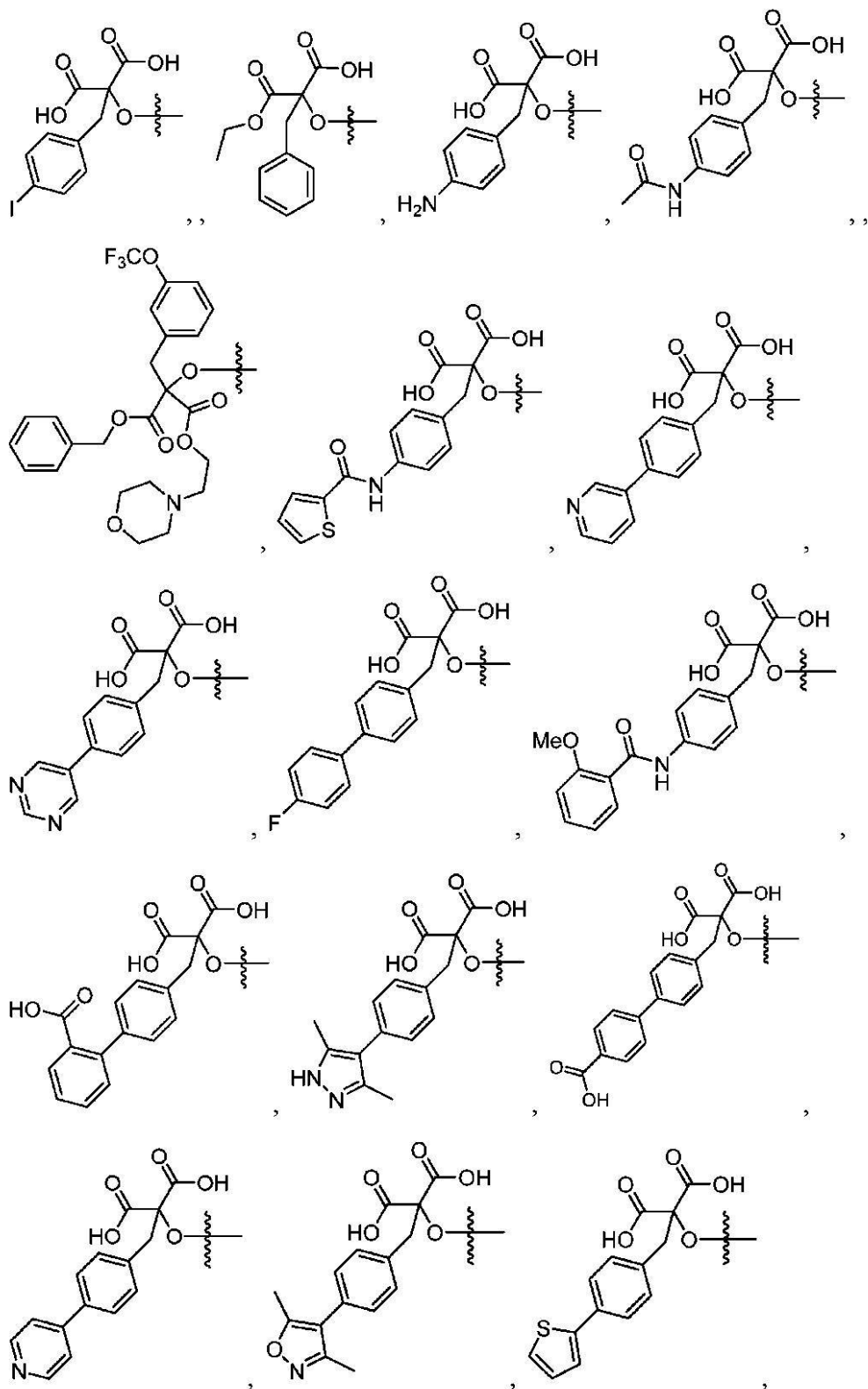
【化 2 3 3】



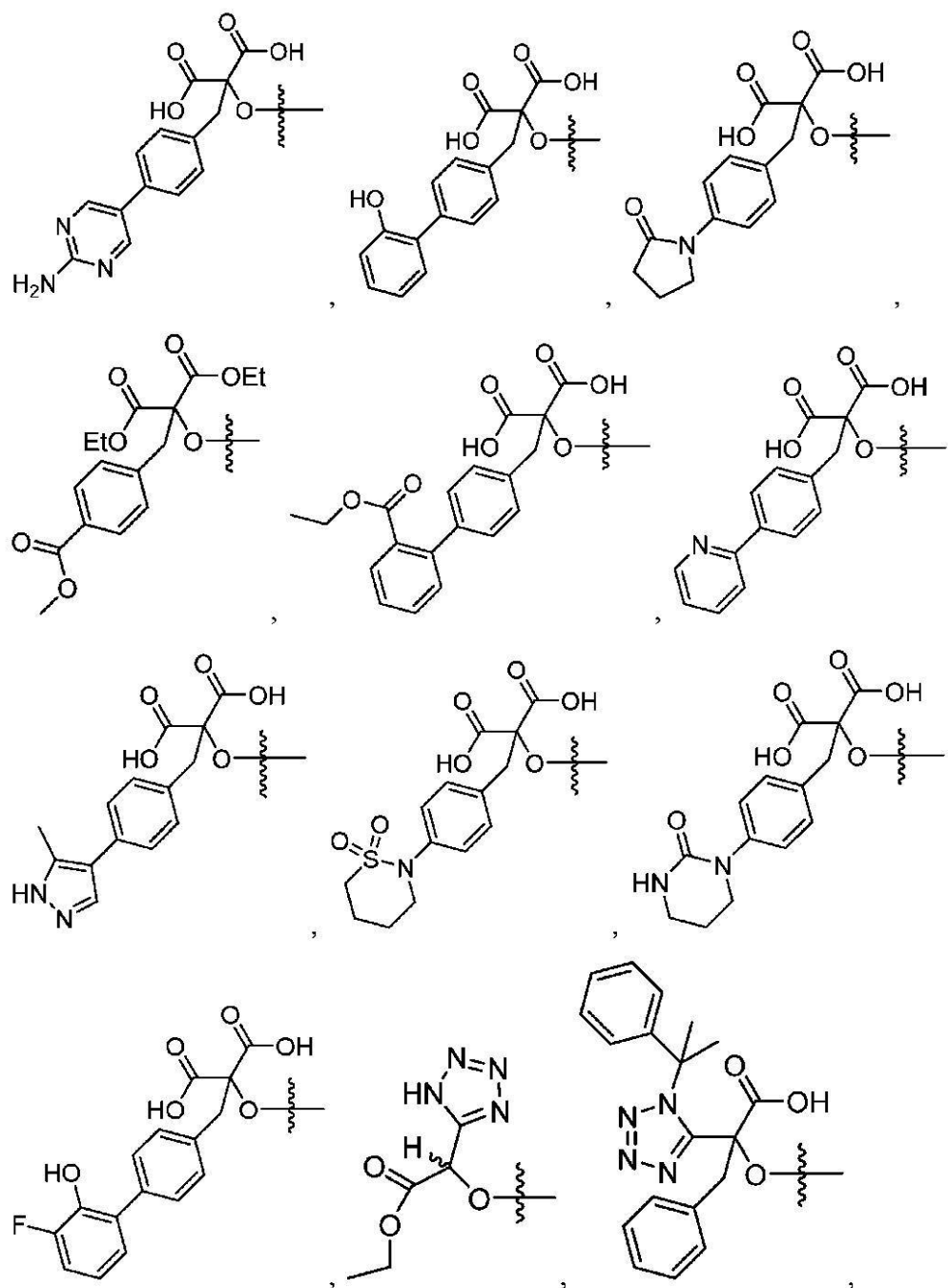
が、

[illegible]

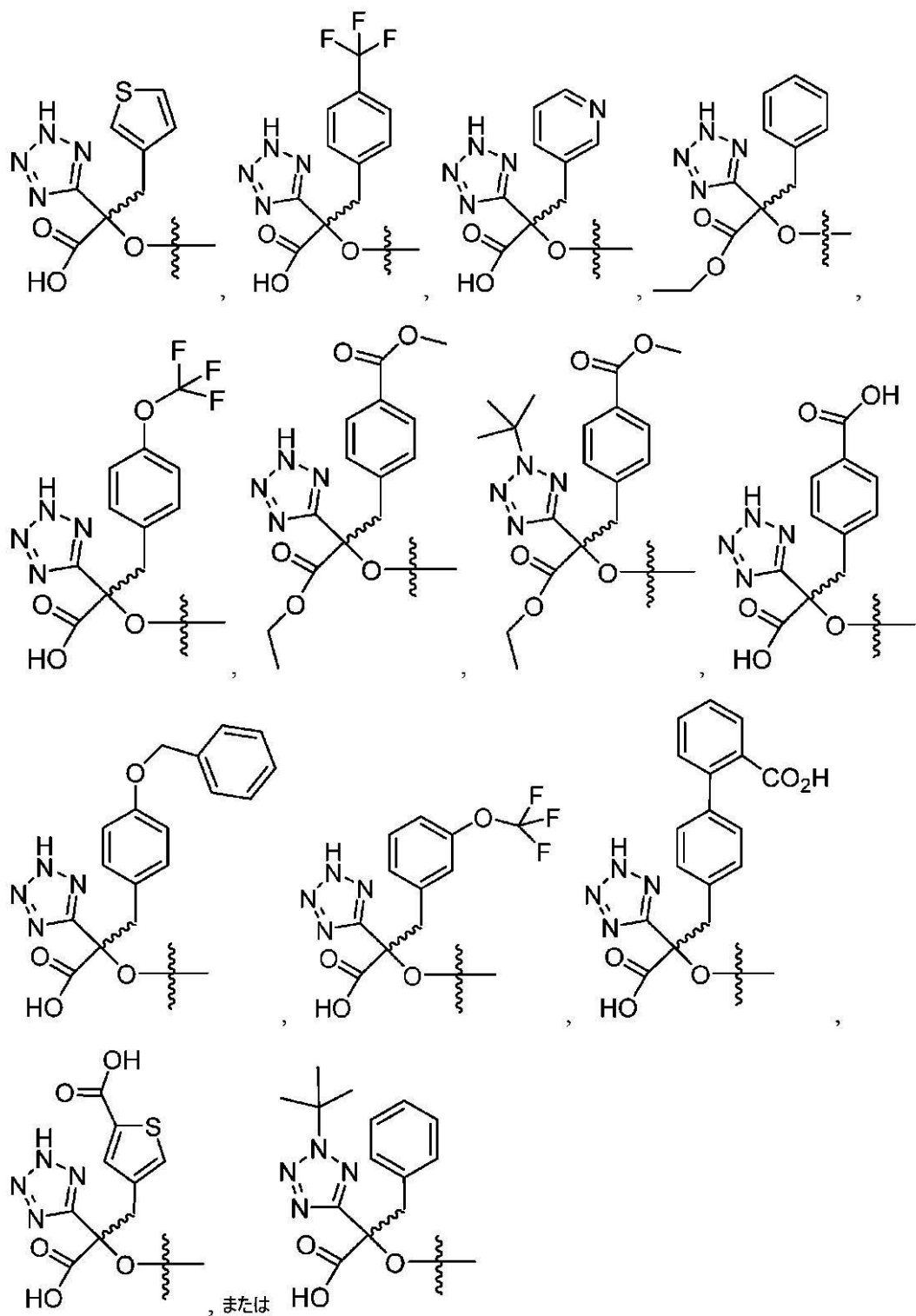
【化 2 3 5】



【化 2 3 6】



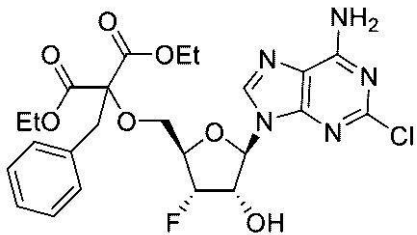
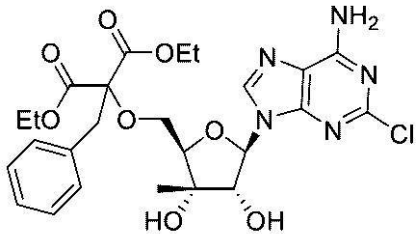
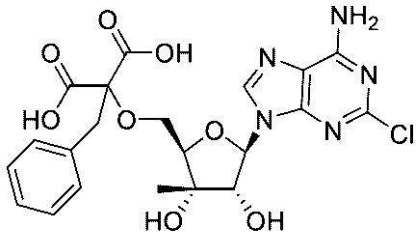
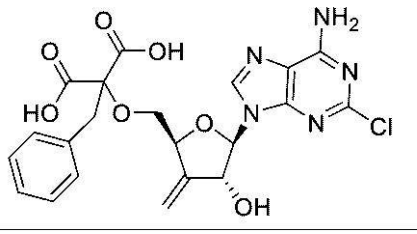
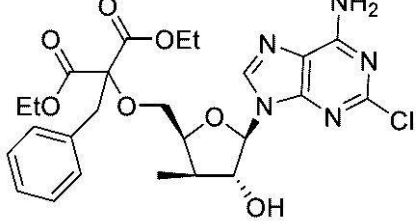
【化 2 3 7】



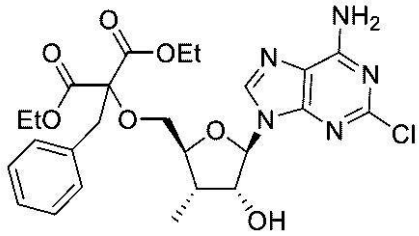
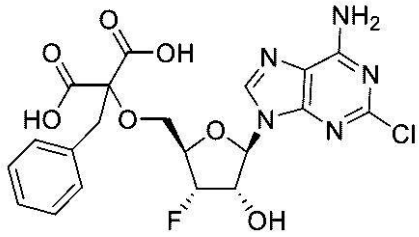
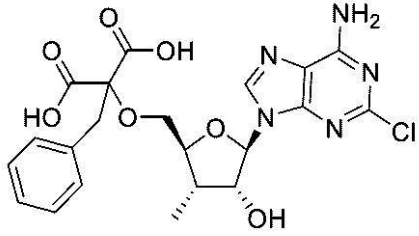
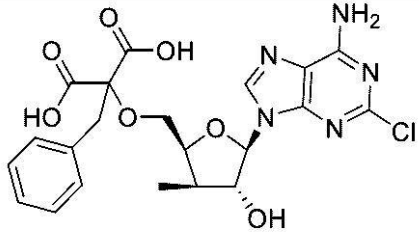
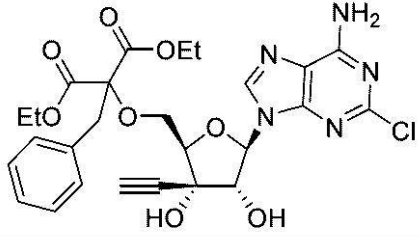
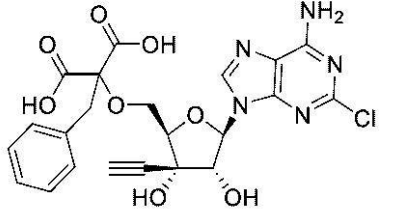
を表す、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩および／もしくはプロドラッグ。

【請求項 1 6】

【表 7 - 2 8】

化合物 番号	化合物
147	
148	
149	
154	
163	

【表 7 - 2 9】

164	
165	
167	
168	
173	
174	

から選択される化合物またはその薬学的に許容される塩および／もしくはプロドラッグ。

【請求項 17】

請求項 1 から 16 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩および／もしくはプロドラッグと、1 種または複数種の薬学的に許容される賦形剤とを含む、薬学的組成物。

【請求項 18】

細胞において CD73 を阻害する *in vitro* の方法であって、前記細胞を、請求項 1 から 16 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物、またはその薬学的に許容される塩および／もしくはプロドラッグに接触させることを含む、方法。

【請求項 19】

膀胱がん、骨がん、脳がん、乳がん、心臓がん、子宮頸がん、結腸がん、直腸結腸がん

、食道がん、線維肉腫、胃のがん、消化器がん、頭頸部がん、カボジ肉腫、腎臓がん、白血病、肝がん、肺がん、リンパ腫、黒色腫、骨髄腫、卵巣がん、膵がん、陰茎がん、前立腺がん、精巣胚細胞性がん、胸腺腫および胸腺癌から選択されるがんの処置において使用するための、請求項 1 から 16 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物、またはその薬学的に許容される塩および / もしくはプロドラッグを含む組成物。

【請求項 20】

膀胱がん、骨がん、脳がん、乳がん、心臓がん、子宮頸がん、結腸がん、直腸結腸がん、食道がん、線維肉腫、胃のがん、消化器がん、頭頸部がん、カボジ肉腫、腎臓がん、白血病、肝がん、肺がん、リンパ腫、黒色腫、骨髄腫、卵巣がん、膵がん、陰茎がん、前立腺がん、精巣胚細胞性がん、胸腺腫および胸腺癌から選択されるがんを処置するための医薬の製造における、請求項 1 から 16 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物、またはその薬学的に許容される塩および / もしくはプロドラッグの使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0960

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0960】

均等物

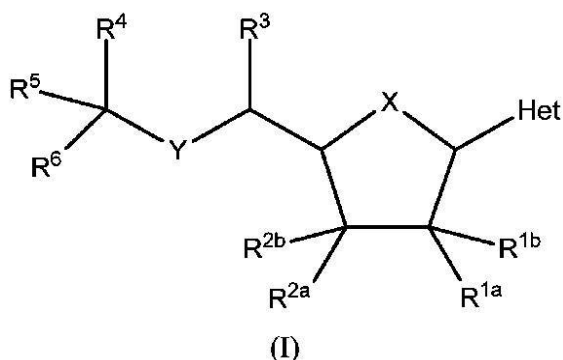
本発明の具体的な実施形態が論じられているが、上記明細書は例証となるものであり、限定するものではない。本発明の多くの変化形が、本明細書および以下の特許請求の範囲を再検討した際に当業者には明らかとなる。同等物の全範囲と共に特許請求の範囲を参照し、そしてこのような変化形と共に明細書を参照して、本発明の全範囲が判定されるべきである。

特定の実施形態では、例えば以下の項目が提供される。

(請求項 1)

式 (I) の化合物：

【化 219】



[式中、

X は O、N R⁷ または C R⁷ R⁸ であり、

Y は O または S であり、

Z は N R¹⁹、O または S であり、

H e t はヘテロシクリルまたはヘテロアリールであり、

R^{1a} は、H、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、アジド、アミノ、C₁ - 6 アルキル、ヒドロキシ C₁ - 6 アルキル、アミノ - C₁ - 6 アルキル、- O - C (O) - O - C₁ - 6 アルキル、C₁ - 6 アシルオキシ、C₁ - 6 アルコキシ、C₂ - 6 アルケニル、および C₂ - 6 アルキニルから選択され、そして

R^{1b} は、H、ハロ、C₁ - 6 アルキル、ヒドロキシ - C₁ - 6 アルキル、アミノ - C₁ - 6 アルキル、C₂ - 6 アルケニル、および C₂ - 6 アルキニルから選択されるか、または

R^{1a} および R^{1b} は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C = CH_2$ もしくは $C = C(H)C_{1-6}$ アルキルを形成し、

R^{2a} は、H、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、アジド、アミノ、 C_{1-6} アルキル、ヒドロキシ- C_{1-6} アルキル、アミノ- C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アシルオキシ、 $-O-C(O)-O-C_{1-6}$ アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、および C_{2-6} アルキニルから選択され、

R^{2b} は、H、ハロ、 C_{1-6} アルキル、ヒドロキシ- C_{1-6} アルキル、アミノ- C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、および C_{2-6} アルキニルから選択されるか、または

R^{2a} および R^{2b} は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C = CH_2$ もしくは $C = C(H)C_{1-6}$ アルキルを形成し、

R^3 は、H、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、および $-(CH_2)-C(O)OR^9$ から選択され、

R^4 は、ヘテロアリール、アルキル、 $-C(O)OR^9$ 、 $-C(O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-P(O)(OR^{11})(OR^{12})$ 、および $-P(O)(OR^{11})(NR^{13}R^{15})$ から選択され、

R^5 は、H、シアノ、アルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリルアルキル、アラルキル、ヘテロアラルキル、および $-C(O)OR^9$ から選択され、

R_6 は、 $-C(O)OR^9$ および $-P(O)(OR^{11})(OR^{12})$ から選択され、各 R^7 および R^8 は H であり、

R^9 は、独立して、H、アルキル、アシルオキシアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキル、および $-(CHR^{13})_m-Z-C(O)-R^{14}$ から選択され、

各 R^{10} は、独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、アミノ、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキルから選択され、そして

各 R^{11} および R^{12} は、独立して、H、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルおよび $-(CHR^{13})_m-Z-C(O)-R^{14}$ から選択されるか、または

R^{11} および R^{12} は、これらが結合している原子と一緒にあって、5～7員のヘテロシクリルを形成し、そして

各 R^{13} は、独立して、Hまたはアルキルであり、

各 R^{14} は、独立して、アルキル、アミノアルキル、ヘテロシクリル、およびヘテロシクリルアルキルから選択され、

R^{15} は、アルキル、アラルキル、 $-C(R^{16})(R^{17})-C(O)O-R^{18}$ から選択され、

各 R^{16} および R^{17} は、H、アルキル、アミノ-アルキル、ヒドロキシ-アルキル、メルカプト-アルキル、スルホニル-アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアラルキル、および $-(CH_2)C(O)OR^9$ から選択され、

R^{18} は、H、アルキル、アルコキシアルキル、アミノアルキル、ハロアルキル、アミド、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルから選択され、

R^{19} は H または アルキル、好ましくは H であり、

m は 1 または 2 であり、

ただし、 R^4 がテトラゾリルであるか、または R^5 がアラルキルもしくはヘテロアラルキルであるかのいずれか、または両方を条件とする] またはその薬学的に許容される塩およ

びノもしくはプロドラッグ。

(請求項 2)

R^{1a} が、H、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、アジド、アミノ、C₁～₆ アルキル、ヒドロキシC₁～₆ アルキル、アミノ-C₁～₆ アルキル、C₁～₆ アシルオキシ、C₁～₆ アルコキシ、C₂～₆ アルケニル、およびC₂～₆ アルキニルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 3)

R^{1a} がフルオロである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 4)

R^{1a} がクロロである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 5)

R^{1a} がブromoである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 6)

R^{1a} がC₁～₆ アルコキシである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 7)

R^{1a} がC₁～₆ アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 8)

R^{1a} がヒドロキシである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 9)

R^{1a} がシアノである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 10)

R^{1a} がアジドである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 11)

R^{1a} がアミノである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 12)

R_{1a} がビニルである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 13)

R_{1a} がエチニルである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 14)

R^{1a} が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 15)

R^{2a} が、H、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、アジド、アミノ、C₁～₆ アルキル、ヒドロキシC₁～₆ アルキル、アミノ-C₁～₆ アルキル、C₁～₆ アシルオキシ、C₁～₆ アルコキシ、C₂～₆ アルケニル、およびC₂～₆ アルキニルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 16)

R^{2a} がフルオロである、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 17)

R^{2a} がクロロである、請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 18)

R^{2a} がブromoである、請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 19)

R^{2a} がC₁～₆ アルコキシである、請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 20)

R^{2a} がC₁～₆ アルキルである、請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 21)

R^{2a} がヒドロキシである、請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 22)

R^{2a} がシアノである、請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 23)

R^{2a} がアジドである、請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 24)

R^{2a} がアミノである、請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 25)

R^{2a} がビニルである、請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 26)

R^{2a} がエチニルである、請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 27)

R^{2a} が C_{1-6} アシルオキシである、請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 28)

R^{1b} が H である、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 29)

R^{1b} がフルオロである、請求項 1 から 28 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 30)

R^{1b} が C_{1-6} アルキルである、請求項 1 から 28 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 31)

R^{2b} が H である、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 32)

R^{2b} がフルオロである、請求項 1 から 30 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 33)

R^{2b} が C_{1-6} アルキルである、請求項 1 から 30 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 34)

R_{1a} がフルオロであり、 R^{1b} が H である、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 35)

R_{2a} がフルオロであり、 R^{2b} が H である、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 36)

R^{1a} および R^{1b} がそれぞれフルオロである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 37)

R^{2a} および R^{2b} がそれぞれフルオロである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 38)

R^{1a} がフルオロであり、 R^{2a} が C_{1-6} アルコキシである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 39)

R^{1a} がフルオロであり、 R^{2a} が C_{1-6} アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 40)

R^{1a} がフルオロであり、 R^{2a} がメチルまたはエチルである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 41)

R^{1a} がヒドロキシであり、 R^{2b} がメチルである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 42)

R^{1a} がフルオロであり、 R^{2a} がヒドロキシである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 43)

R^{1a} がクロロであり、 R^{2a} がヒドロキシである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 44)

R^{1a} がヒドロキシであり、 R^{2a} が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 45)

R^{1a} がフルオロであり、 R^{2a} が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 46)

R^{1a} がヒドロキシであり、 R^{2a} が C_{1-6} アルコキシである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 47)

R^{1a} がヒドロキシであり、 R^{2a} がフルオロである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 48)

R^{1a} がヒドロキシであり、 R^{2a} および R^{2b} が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、エチニルを形成する、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 49)

R^{1a} がヒドロキシであり、 R^{2a} が C_{1-6} アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 50)

R^{1a} がフルオロであり、 R^{2a} がフルオロであり、 R^{2a} がヒドロキシである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 51)

R^{1a} がヒドロキシであり、 R^{2a} がヒドロキシルであり、 R^{2b} が C_{1-6} アルキニルである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 52)

R^{1a} がヒドロキシであり、 R^{2a} が C_{1-6} アルキニルである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 53)

R^{1a} がヒドロキシであり、 R^{2a} が C_{2-6} アルケニルである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 54)

R^{1a} がヒドロキシであり、 R^{2a} がアミノである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 55)

R^{1a} がヒドロキシであり、 R^{2a} がアジドである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 56)

R^{1a} がアジドであり、 R^{2a} がヒドロキシである、請求項 1 に記載の化合物。

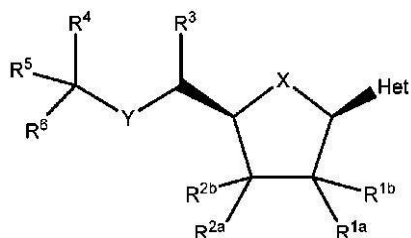
(請求項 57)

R^{1a} が C_{1-6} アルキルであり、 R^{2a} がヒドロキシルである、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 58)

構造：

【化 220】



を有する、任意の先行する請求項に記載の化合物。

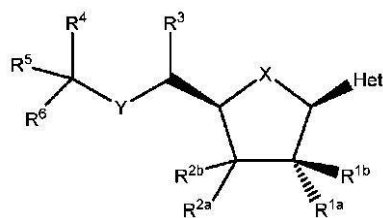
(請求項 59)

R^{1a} が - 立体配置にある、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 60)

前記式 (I) の化合物が、構造 (IA)：

【化 2 2 1】



(IA)

を有する、請求項 5 9 に記載の化合物。

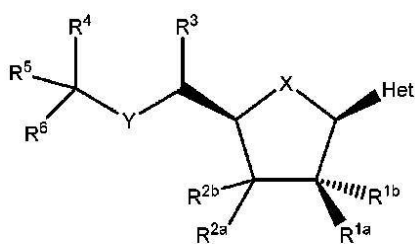
(請求項 6 1)

R^{1a} が - 立体配置にある、請求項 1 から 5 8 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 6 2)

前記式 (I) の化合物が、構造 (I B) :

【化 2 2 2】



(IB)

を有する、請求項 6 1 に記載の化合物。

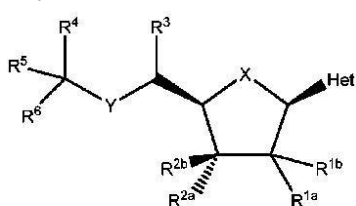
(請求項 6 3)

R^{2a} が - 立体配置にある、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 6 4)

前記式 (I) の化合物が構造 (I C) :

【化 2 2 3】



(IC)

を有する、請求項 6 3 に記載の化合物。

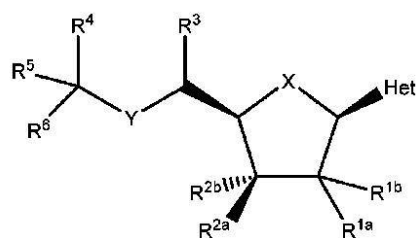
(請求項 6 5)

R^{2a} が - 立体配置にある、請求項 1 から 6 2 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 6 6)

前記式 (I) の化合物が、構造 (I D) :

【化 2 2 4】



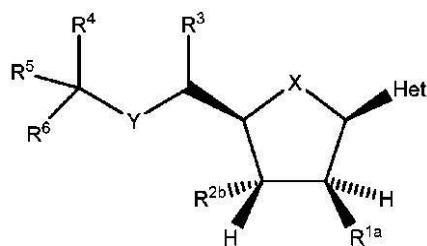
(ID)

を有する、請求項 65 に記載の化合物。

(請求項 67)

前記式 (I) の化合物が、構造 (IE) :

【化 225】



(IE)

を有する、請求項 68 に記載の化合物。

(請求項 68)

R^3 が H である、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 69)

R^3 が非置換の C_{1-6} アルキルである、請求項 1 から 67 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 70)

R^3 がアルキルであり、前記アルキルが非置換であるか、またはハロ、CN、NO₂、アジド、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、チオアルコキシ、カルボニル、チオカルボニル、アミジノ、イミノ、アミノ、アミド、アルコキシカルボニル、カルバメート、ウレア、スルフィンアミド、スルホンアミド、スルフィニル、スルフィンアミド、スルホニル、ホスホリル、ホスフェート、ホスホネート、およびホスフィネートから選択される 1 つもしくは複数の置換基で置換されている、請求項 1 から 67 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 71)

前記置換基が、ハロ、CN、アジド、アルコキシ、カルボニル、アミノ、アミド、およびアルコキシカルボニルから選択される、請求項 70 に記載の化合物。

(請求項 72)

R^3 が R - 立体配置にある、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 73)

R^3 が S - 立体配置にある、請求項 1 から 69 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 74)

R^4 がヘテロアリールである、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 75)

R^4 がテトラゾリルである、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 76)

R^4 が、 $-C(O)OR_{9-}$ 、 $-C(O)NR_{11}R_{12-}$ 、 $-S(O)_2R_{10-}$ 、および $-P(O)(OR_{11})(OR_{12-})$ から選択される、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 77)

R^4 が $-C(O)OR_9$ である、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 78)

R^4 がアルキルである、請求項 1 から 73 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 79)

R^4 が $-C(O)NR^{11}R^{12}$ である、請求項 1 から 74 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 80)

R^5 が、アルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリルアルキル、アラルキルお

よびヘテロアラルキルから選択され、それぞれが非置換であるか、または、ハロ、C N、 NO_2 、アジド、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、チオアルコキシ、カルボニル、チオカルボニル、アミジノ、イミノ、アミノ、アミド、アルコキシカルボニル、カルバメート、ウレア、スルフィンアミド、スルホンアミド、スルフィニル、スルフィンアミド、スルホニル、ホスホリル、ホスフェート、ホスホネート、ホスフィネート、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールアルキル、およびヘテロアリールアルキルから選択される1つもしくは複数の置換基で置換されている、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 8 1)

前記置換基が、ハロ、C N、アジド、アルコキシ、カルボニル、アミノ、アミド、およびアルコキシカルボニルから選択される、請求項 8 0 に記載の化合物。

(請求項 8 2)

R^5 が、H、アルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリルアルキル、アラルキル、およびヘテロアラルキルから選択される、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 8 3)

R^5 が H、アラルキル、またはヘテロアラルキルである、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 8 4)

R^5 が H またはアラルキルである、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 8 5)

R^5 がアラルキルまたはヘテロアラルキルである、請求項 1 から 8 3 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 8 6)

R^5 がヘテロアラルキルであり、前記ヘテロアリール環が、それぞれ置換または非置換であってよい、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、ベンゾチアゾリル、ピリジル、チエニル、フラニル、ピラゾリル、チアゾリル、およびオキサゾリル、およびオキサジアゾリルから選択される、請求項 8 5 に記載の化合物。

(請求項 8 7)

R^5 が非置換であるか、またはハロ、C N、OH、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アリーロキシ、アラルキルオキシ、アルキルスルホニル、スルホンアミド、アミド、アミノ、ヒドロキシカルボニル、アルコキシカルボニル、ヘテロアリール、アリール、アラルキル、およびヘテロアラルキルから選択される1つもしくは複数の置換基で置換されている、請求項 8 5 から 8 6 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 8 8)

前記置換基が、ハロ、C N、ハロアルキル、ハロアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、およびアリールから選択される、請求項 8 7 に記載の化合物。

(請求項 8 9)

前記置換基が、テトラゾリル、置換もしくは非置換のフェニル、または置換もしくは非置換のベンジルから選択される、請求項 8 7 に記載の化合物。

(請求項 9 0)

R^5 が CH_2 - ピリジニルである、請求項 1 から 8 3 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 9 1)

R^5 が - CH_2 - チオフェニルである、請求項 1 から 8 3 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 9 2)

R^5 がベンジルまたは - ナフチルである、請求項 1 から 8 3 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 9 3)

R^5 が、非置換であるか、またはクロロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、フェニロキシ、ジメチルアミド、メチルスルホニル、C N、およびカルボン酸から選

択される１つもしくは複数の置換基で置換されている、請求項 87 に記載の化合物。

(請求項 94)

R^6 が $-C(O)OR_9$ である、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 95)

R^6 が $-P(O)(OR_{11})(OR_{12})$ であり、 R_{11} および R_{12} がそれぞれ H である、請求項 1 から 93 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 96)

R^7 が H または C_{1-6} アルキルである、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 97)

R^8 が H である、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 98)

R^9 が H、 C_{1-6} アルキルまたはアミドである、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 99)

R^9 が H、メチルまたはエチルである、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 100)

R^{11} および R^{12} がそれぞれ H である、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 101)

R^{11} および R^{12} がそれぞれアルキルである、請求項 1 から 99 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 102)

各 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} および R^{12} が、アルキル、アルケニル、アルキニル、アミド、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクロアルキル (heterocyclalkyl)、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキルから独立して選択され、それぞれが非置換であるか、または、ハロ、CN、 NO_2 、アジド、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、チオアルコキシ、カルボニル、チオカルボニル、アミジノ、イミノ、アミノ、アミド、アルコキシカルボニル、カルバメート、ウレア、スルフィンアミド、スルホンアミド、スルフィニル、スルフィンアミド、スルホニル、ホスホリル、ホスフェート、ホスホネート、およびホスフィネートから選択される１つもしくは複数で置換されている、請求項 1 から 95 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 103)

各 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} および R^{12} 上の置換基が、ハロ、CN、アジド、アルコキシ、カルボニル、アミノ、アミド、およびアルコキシカルボニルから選択される、請求項 102 に記載の化合物。

(請求項 104)

X が O である、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 105)

Y が O である、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 106)

前記 Y を保有する置換基が R - 立体配置にある、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 107)

前記 Y を保有する置換基が S - 立体配置にある、請求項 1 から 105 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 108)

Z が O である、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 109)

H e t が窒素含有ヘテロシクリルまたはヘテロアリールである、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 1 1 0)

H e t が窒素原子を介して結合されている、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 1 1 1)

H e t が、炭素原子を介して結合している、請求項 1 から 1 0 7 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 1 1 2)

H e t が 5 ～ 8 員の単環式または 5 ～ 1 0 員の二環式ヘテロアリールであり、非置換であるか、またはハロ、C N、N O₂、アジド、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、チオアルコキシ、カルボニル、チオカルボニル、アミジノ、イミノ、アミノ、アミド、アルコキシカルボニル、カルバメート、ウレア、スルフィンアミド、スルホンアミド、スルフィニル、スルフィンアミド、スルホニル、ホスホリル、ホスフェート、ホスホネート、およびホスフィネートから選択される 1 つもしくは複数の置換基で置換されている、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 1 1 3)

前記置換基が、ハロ、C N、アジド、アルコキシ、カルボニル、アミノ、アミド、およびアルコキシカルボニルから選択される、請求項 1 1 2 に記載の化合物。

(請求項 1 1 4)

H e t が、プリニル、イミダゾピリミジニル、およびピロロピリミジニルから選択される、任意の先行する請求項に記載の化合物。

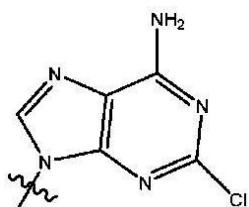
(請求項 1 1 5)

H e t が、1 つのハロおよび 1 つのアミノ置換基で置換されている、任意の先行する請求項に記載の化合物。

(請求項 1 1 6)

H e t が、

【化 2 2 6】

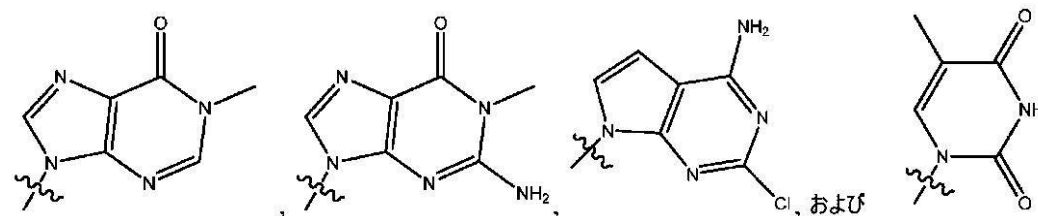


である、請求項 1 から 1 1 0 のいずれか一項に記載の化合物。

(請求項 1 1 7)

H e t が、

【化 2 2 7】



から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

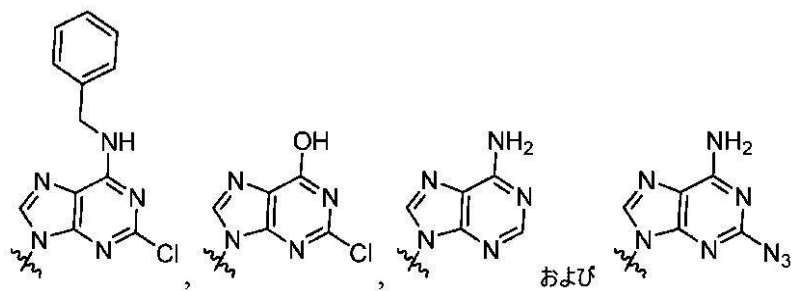
(請求項 1 1 8)

H e t が、ハロ、アラルキル、アミノ、アジドおよびヒドロキシから選択される 1 または 2 つの置換基で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 1 1 9)

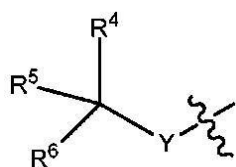
H e t が、

【化 2 2 8】



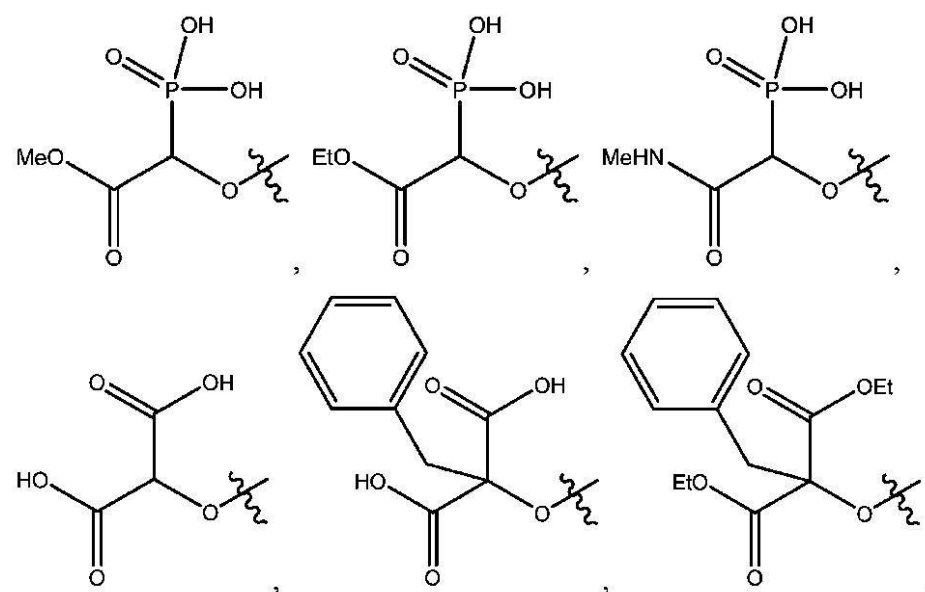
(請求項 1 2 0)

【化 2 2 9】

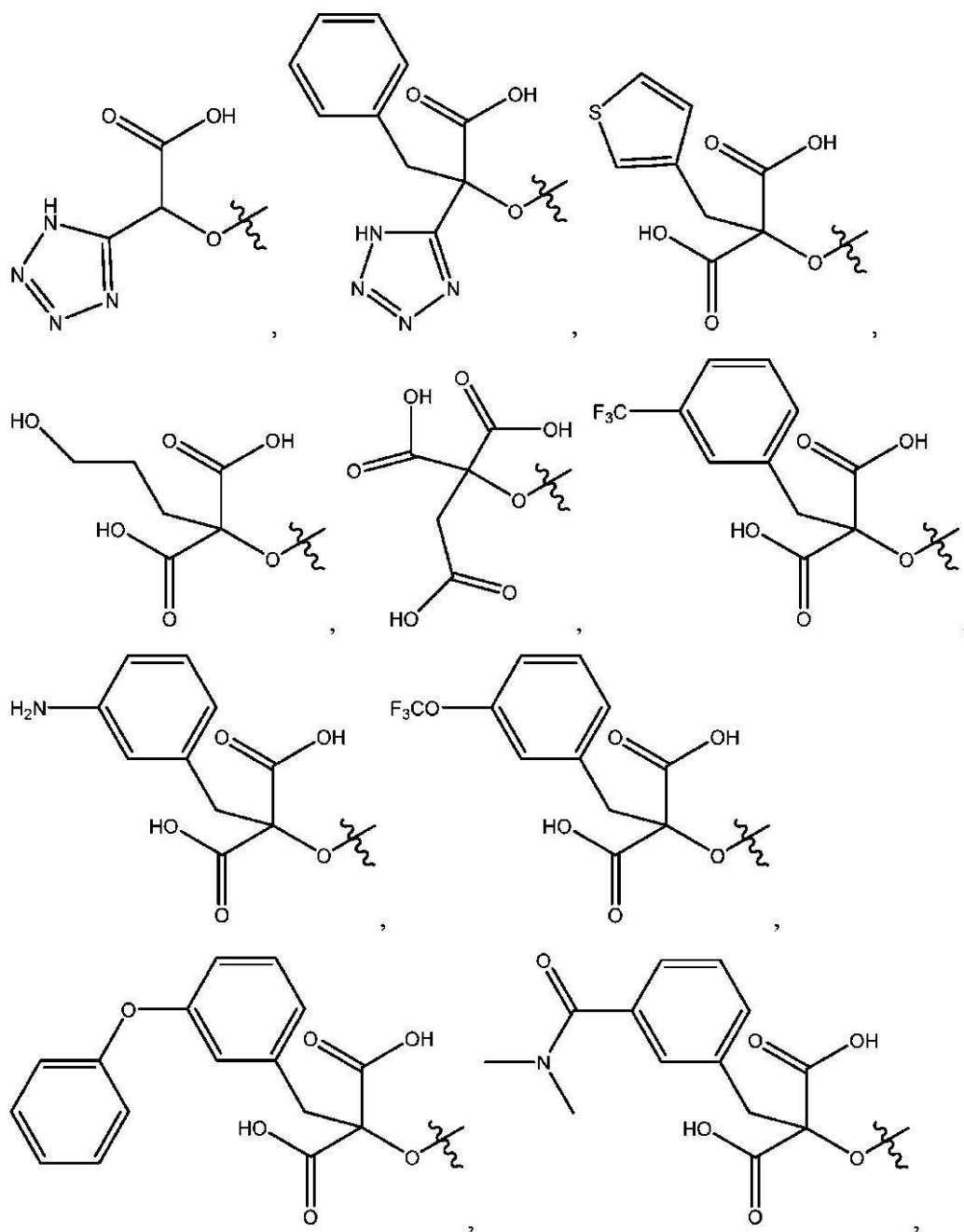


が、

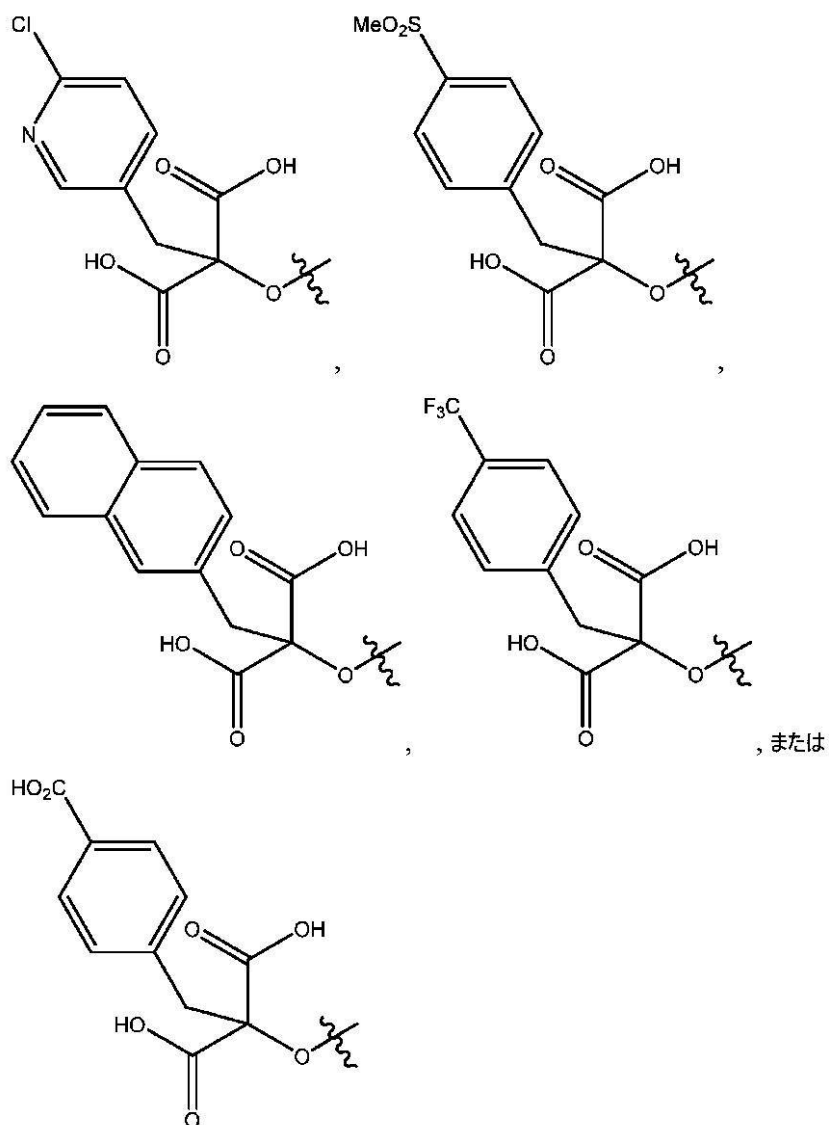
【化 2 3 0】



【化 2 3 1】



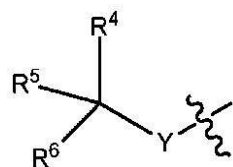
【化 2 3 2】



を表す、請求項 1 に記載の化合物。

(請求項 1 2 1)

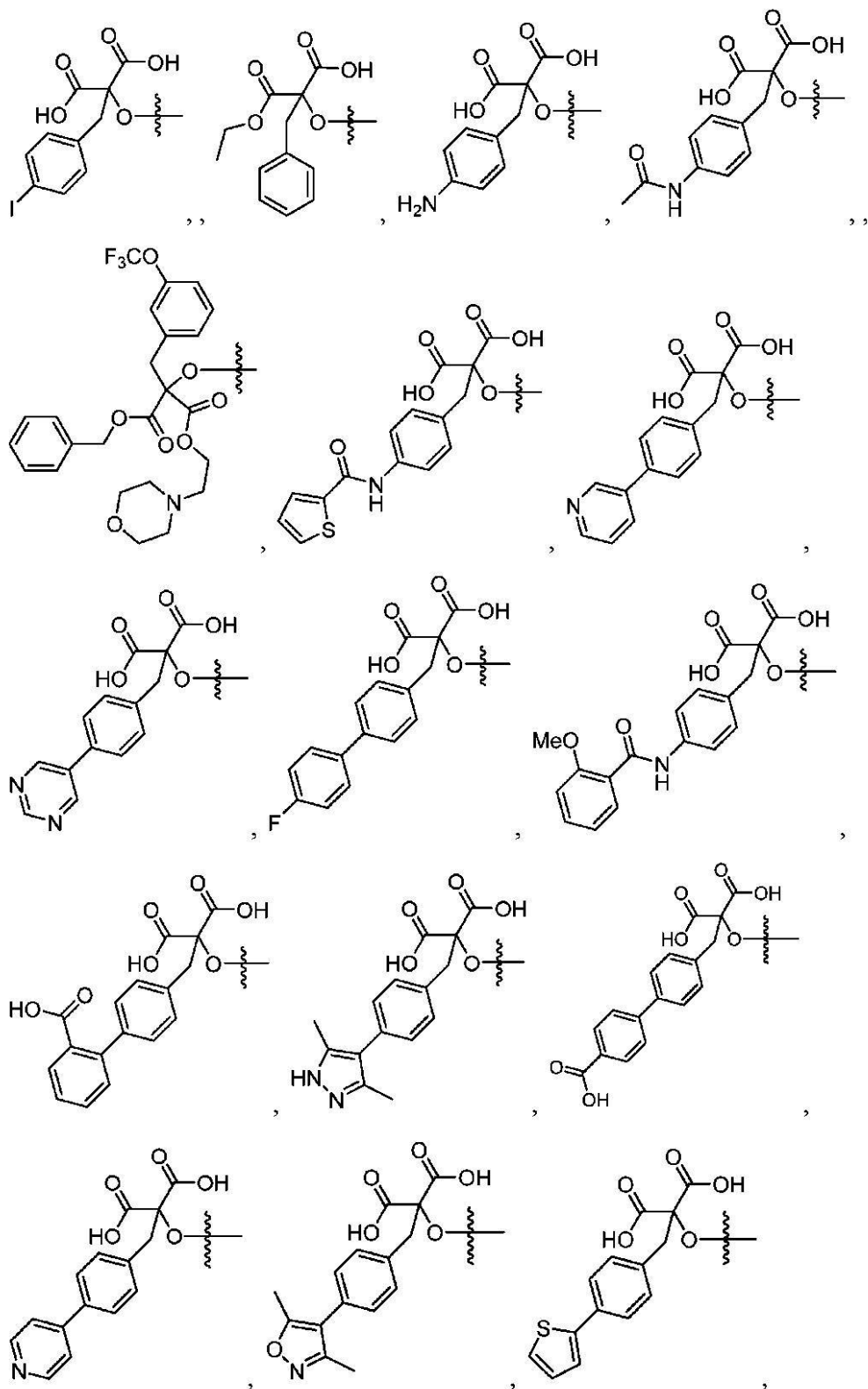
【化 2 3 3】



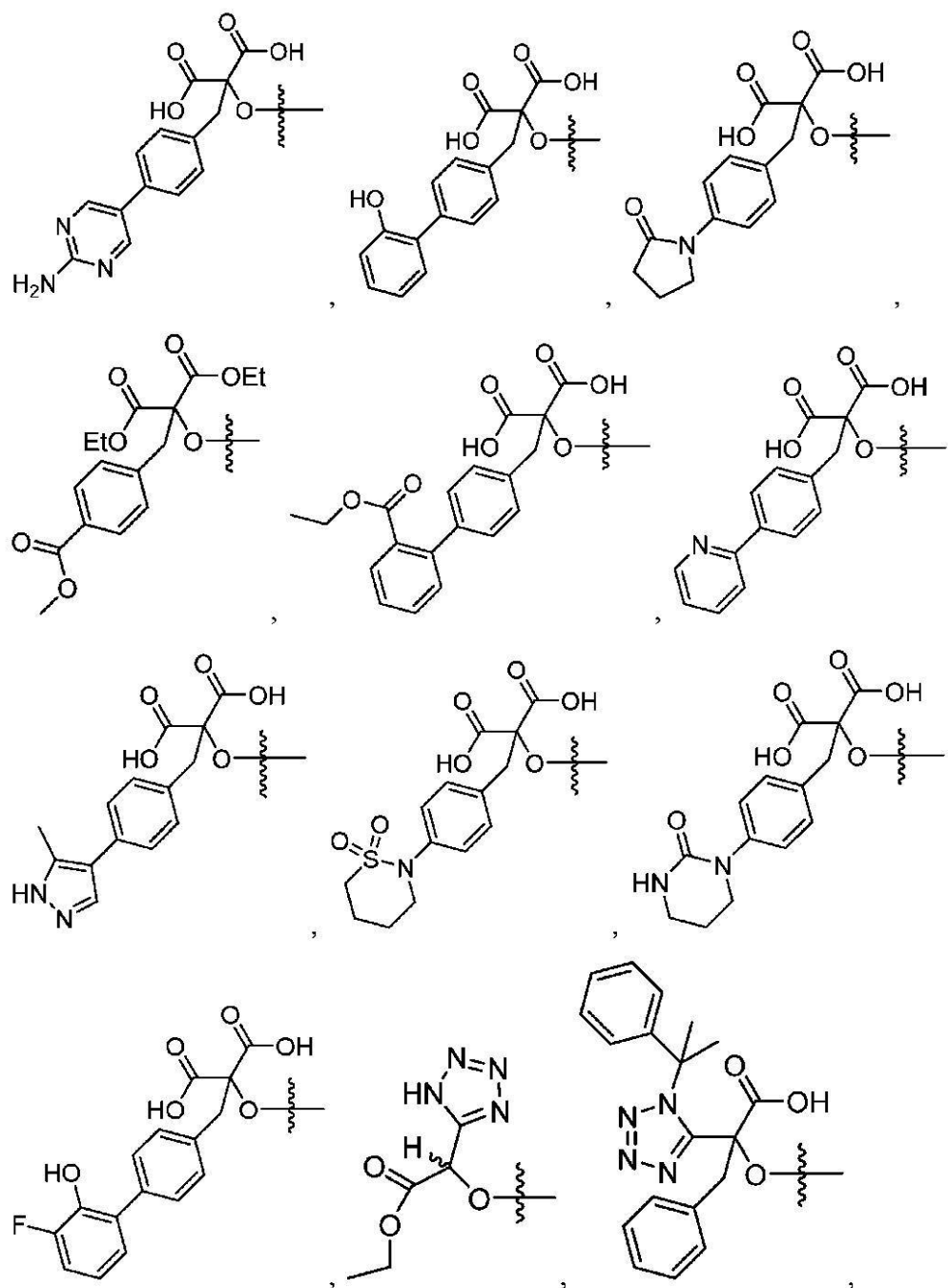
が、

[illegible]

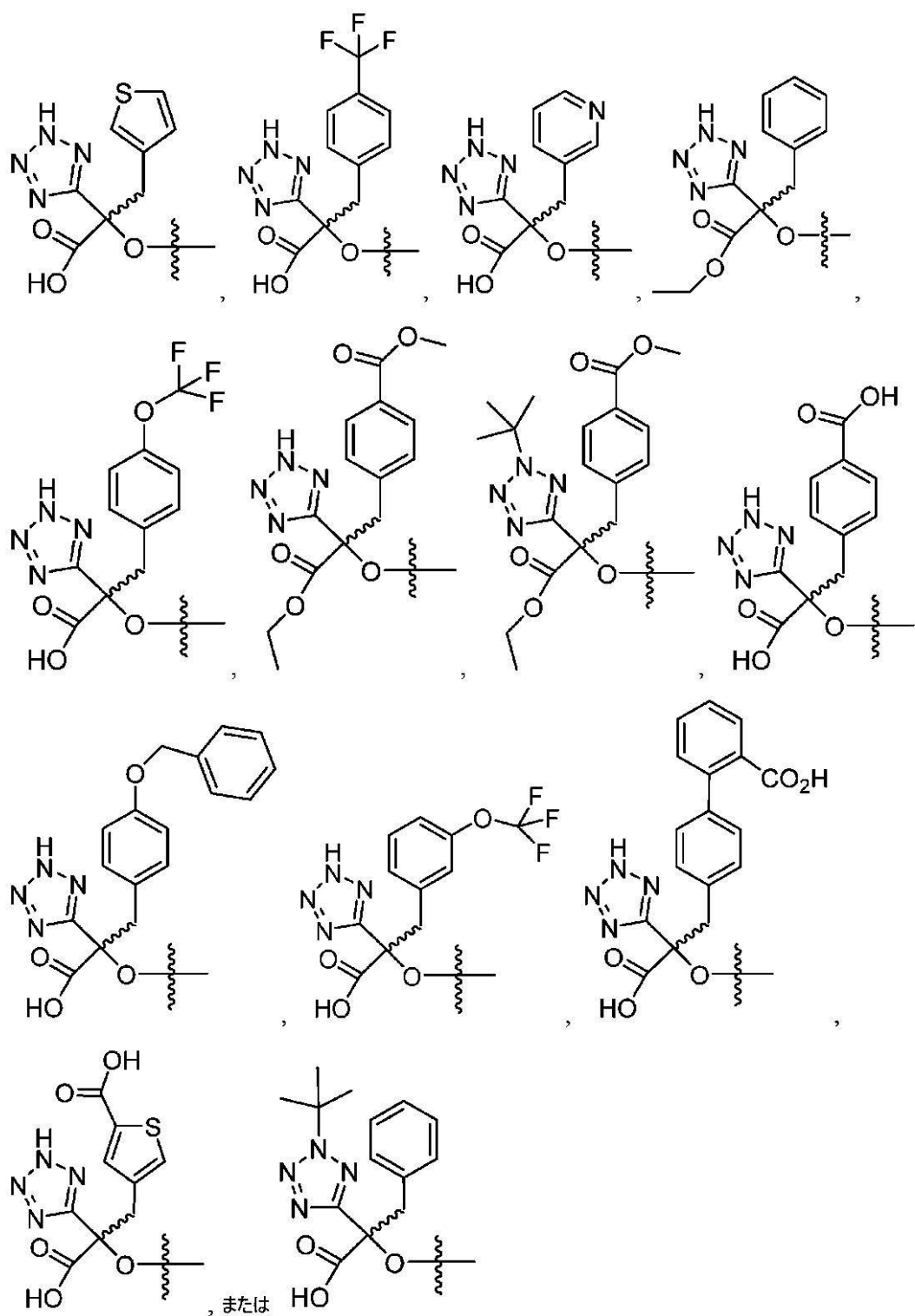
【化 2 3 5】



【化 2 3 6】



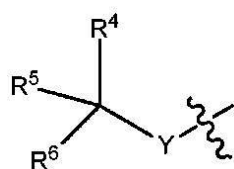
【化 2 3 7】



を表す、請求項 1 に記載の化合物。

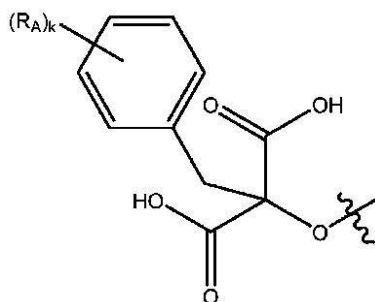
(請求項 1 2 2)

【化 2 3 8】



が、

【化 2 3 9】



(式中、各 R_A は、独立して、H、ハロ、CN、OH、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アリーロキシ、アラルキルオキシ、アルキルスルホニル、スルホンアミド、アミド、アミノ、ヒドロキシカルボニル、アルコキシカルボニル、ヘテロアリール、アリール、アラルキル、およびヘテロアラルキルから選択され、

k は 1、2、または 3 である) を表す、請求項 1 に記載の化合物。

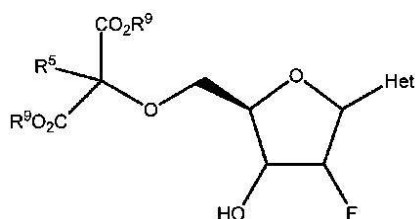
(請求項 1 2 3)

R_A が、ピリジル、ピラゾリル、ピロリジノニル、アザパノニル、モルホリノニル、ピペラゾニル、テトラヒドロピリミジノニル、フェニル、およびベンジルオキシから選択される、請求項 1 2 2 に記載の化合物。

(請求項 1 2 4)

構造：

【化 2 4 0】



[式中、

R^5 は、

(i) フェニル C_{1-6} アルキルもしくはナフチル C_{1-6} アルキルであり、フェニルおよびナフチルは、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル (1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、 $-OC_{1-6}$ アルキル (1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、 $-C_{1-6}$ アルキレン- CO_2H 、 $-C_{1-6}$ アルキレン- CO_2C_{1-6} アルキル、 $-C_{2-6}$ アルケニレン- CO_2H 、 $-OC_{1-6}$ アルキレン- CO_2H 、 $-OC_{1-6}$ アルキレン- CO_2C_{1-6} アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル (1 または 2 つのヒドロキシで置換されている)、 $-OC_{1-6}$ アルキル (1 または 2 つのヒドロキシで置換されている)、 $-C_{1-6}$ アルキル (1 または 2 つの $-OC_{1-6}$ アルキルで置換されている)、 $-OC_{1-6}$ アルキル (1 または 2 つの $-OC_{1-6}$ アルキルで置換されている)、 $-CO_2H$ 、 $-COOC_{1-6}$ アルキル、ヒドロキシ、ハロ、ニトロ、 $-PO_3H_2$ 、シアノ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-6}$ アルキル)、 $-N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、 $-CONR^eR^f$ [式中、 R^e および R^f は、独立して、水素、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキレン- CO_2H 、 $-C_{1-6}$ アルキレン- CO_2C_{1-6} アルキル、または $-C_{1-6}$ アルキレン- (ヒドロキシ、 NH_2 、 $-NHC_{1-6}$ アルキルまたは $-N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ から独立して選択される 1 または 2 つの置換基で置換されている) である]、 $-SO_2(C_{1-6}$ アルキル)、 $-SO_2NR^gR^h$ (式中、 R^g および R^h は、独立して、水素、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキレン- CO_2H 、または $-C_{1-6}$ アルキレン- CO_2C_{1-6} アルキルである)、 $-SC_{1-6}$ アルキル、 $-SOC_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2NHCOR^j$ (式中、 R^j は $-C_{1-6}$ アルキル、 $-NHC_{1-6}$ アルキル、または $-N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ である)、フェニル、 $-C_{1-6}$

アルキレンフェニル、フェノキシ、 $-OC_{1\sim 6}$ アルキレンフェニル、O、N、およびSから独立して選択される1～4個のヘテロ原子を含有する5または6員の単環式ヘテロアリール〔ヘテロアリール環は、ヒドロキシル、ハロ、CN、 $-CO_2H$ 、 $-COOC_{1\sim 6}$ アルキル、 $-C_{1\sim 6}$ アルキル、 $-OC_{1\sim 6}$ アルキル、 $-C_{1\sim 6}$ アルキル(1～5つのフルオロで置換されている)、 $-OC_{1\sim 6}$ アルキル(1～5つのフルオロで置換されている)、 $-C_{1\sim 6}$ アルキレン $-CO_2H$ 、 $-C_{1\sim 6}$ アルキレン $-CO_2C_{1\sim 6}$ アルキル、テトラゾリル、 $-SO_2C_{1\sim 6}$ アルキル、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHC_{1\sim 6}$ アルキル、 $-SO_2N(C_{1\sim 6}$ アルキル) $_2$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CONHC_{1\sim 6}$ アルキル、または $-CON(C_{1\sim 6}$ アルキル) $_2$ から独立して選択される1、2、または3つの置換基で必要に応じて置換されている〕、 $-OR^i$ 、 $-C_{1\sim 6}$ アルキレン $-R^i$ 、 $-OC_{1\sim 6}$ アルキレン $-R^i$ 、 $-SR^i$ 、 $-SC_{1\sim 6}$ アルキレン $-R^i$ 、ヘテロシクリル、 $-C_{1\sim 6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-OC_{1\sim 6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-SC_{1\sim 6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-CONR^mC_{1\sim 6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-NR^mCOC_{1\sim 6}$ アルキレン NR^oR^p 、 $-NR^mCO$ ヘテロシクリル、 $-NR^mCOC_{1\sim 6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-CO$ ヘテロシクリル、 $-CONR^mR^i$ 、 $-CONR^mC_{1\sim 6}$ アルキレン $-R^i$ 、 $-OCONR^mR^m$ 、 $-NR^m-COR^y$ 、 $-NR^m-CO-NR^mR^y$ 、 $-NR^m-SO_2-R^y$ 、 $-NR^m-SO_2-NR^mR^y$ 、および $-CONHSO_2R^z$ から独立して選択される1、2、もしくは3つの置換基で必要に応じて置換されているか、または

(ii) N、O、もしくはSから独立して選択される1～3個のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリール $C_{1\sim 6}$ アルキルであり、5～10員のヘテロアリール $C_{1\sim 6}$ アルキルの5～10員のヘテロアリールは、 $-C_{1\sim 6}$ アルキル、 $-OC_{1\sim 6}$ アルキル、 $-C_{1\sim 6}$ アルキル(1～5つのフルオロで置換されている)、 $-OC_{1\sim 6}$ アルキル(1～5つのフルオロで置換されている)、 $-C_{1\sim 6}$ アルキレン $-CO_2H$ 、 $-C_{1\sim 6}$ アルキレン $-CO_2C_{1\sim 6}$ アルキル、 $-C_{2\sim 6}$ アルケニレン $-CO_2H$ 、 $-C_{1\sim 6}$ アルキル(1または2つのヒドロキシで置換されている)、 $-OC_{1\sim 6}$ アルキル(1または2つのヒドロキシで置換されている)、 $-C_{1\sim 6}$ アルキル(1または2つの $-OC_{1\sim 6}$ アルキルで置換されている)、 $-OC_{1\sim 6}$ アルキル(1または2つの $-OC_{1\sim 6}$ アルキルで置換されている)、 $-CO_2H$ 、 $-COOC_{1\sim 6}$ アルキル、ヒドロキシ、ハロ、ニトロ、 $-PO_3H_2$ 、シアノ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1\sim 6}$ アルキル)、 $-N(C_{1\sim 6}$ アルキル) $_2$ 、 $-CONR^eR^f$ 〔式中、 R^e および R^f は、独立して、水素、 $-C_{1\sim 6}$ アルキル、 $-C_{1\sim 6}$ アルキレン $-CO_2H$ 、 $-C_{1\sim 6}$ アルキレン $-CO_2C_{1\sim 6}$ アルキル、または $-C_{1\sim 6}$ アルキル(1または2つのヒドロキシル、 $-NHC_{1\sim 6}$ アルキルまたは $-N(C_{1\sim 6}$ アルキル) $_2$ で置換されている)である〕、 $-SO_2(C_{1\sim 6}$ アルキル)、 $-SO_2NR^gR^h$ (式中、 R^g および R^h は、独立して、水素、 $-C_{1\sim 6}$ アルキル、 $-C_{1\sim 6}$ アルキレン $-CO_2H$ 、または $-C_{1\sim 6}$ アルキレン $-CO_2C_{1\sim 6}$ アルキルである)、 $-SC_{1\sim 6}$ アルキル、 $-SOC_{1\sim 6}$ アルキル、 $-SO_2NHCOR^j$ (式中、 R^j は $-C_{1\sim 6}$ アルキル、 $-NH_2$ 、 $-NHC_{1\sim 6}$ アルキル、または $-N(C_{1\sim 6}$ アルキル) $_2$ である)、フェニル、 $-C_{1\sim 6}$ アルキレンフェニル、フェノキシ、 $-OC_{1\sim 6}$ アルキレンフェニル、O、N、およびSから独立して選択される1～4個のヘテロ原子を含有する5もしくは6員の単環式ヘテロアリール〔前記ヘテロアリール環は、ヒドロキシル、ハロ、CN、 $-CO_2H$ 、 $-COOC_{1\sim 6}$ アルキル、 $-C_{1\sim 6}$ アルキル、 $-OC_{1\sim 6}$ アルキル、 $-C_{1\sim 6}$ アルキル(1～5つのフルオロで置換されている)、 $-OC_{1\sim 6}$ アルキル(1～5つのフルオロで置換されている)、 $-C_{1\sim 6}$ アルキレン $-CO_2H$ 、 $-C_{1\sim 6}$ アルキレン $-CO_2C_{1\sim 6}$ アルキル、テトラゾリル、 $-SO_2C_{1\sim 6}$ アルキル、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHC_{1\sim 6}$ アルキル、 $-SO_2N(C_{1\sim 6}$ アルキル) $_2$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CONHC_{1\sim 6}$ アルキル、および $-CON(C_{1\sim 6}$ アルキル) $_2$ から独立して選択される1、2、または3つの置換基で必要に応じて置換されている〕、 $-OR^i$ 、 $-C_{1\sim 6}$ アルキレン $-R^i$ 、 $-OC_{1\sim 6}$ アルキレン $-R^i$ 、 $-SR^i$ 、 $-SC_{1\sim 6}$ アルキレン $-R^i$ 、ヘテ

ロシクリル、 $-C_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-OC_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-SC_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-CONR^m C_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-NR^m COC_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-NR^m CO$ ヘテロシクリル、 $-NR^m COC_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-CO$ ヘテロシクリル、 $-CONR^m R^i$ 、 $-CONR^m$ アルキレン $-R^i$ 、 $-OCONR^m R^m$ 、 $-NR^m -COR^y$ 、 $-NR^m -CO -NR^m R^y$ 、 $-NR^m -SO_2 -R^y$ 、 $-NR^m -SO_2 -NR^m R^y$ 、および $-CONHSO_2 R^z$ から独立して選択される 1 もしくは 2 つの置換基で必要に応じて置換されており、

前記 R^5 の 5 ~ 10 員のヘテロアリール環は、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル (アルキルは 1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、 $-O - C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル (アルキルは 1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、ハロ、 CN 、 $-NH_2$ 、およびヒドロキシから選択される追加の置換基でさらに必要に応じて置換されており、

各 R^m は水素または $-C_{1-6}$ アルキルであり、

R^o 、 R^p 、および R^y は、それぞれ独立して、水素または $-C_{1-6}$ アルキルであり、 R^z は、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-NHC_{1-6}$ アルキル、または $-N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ であり、

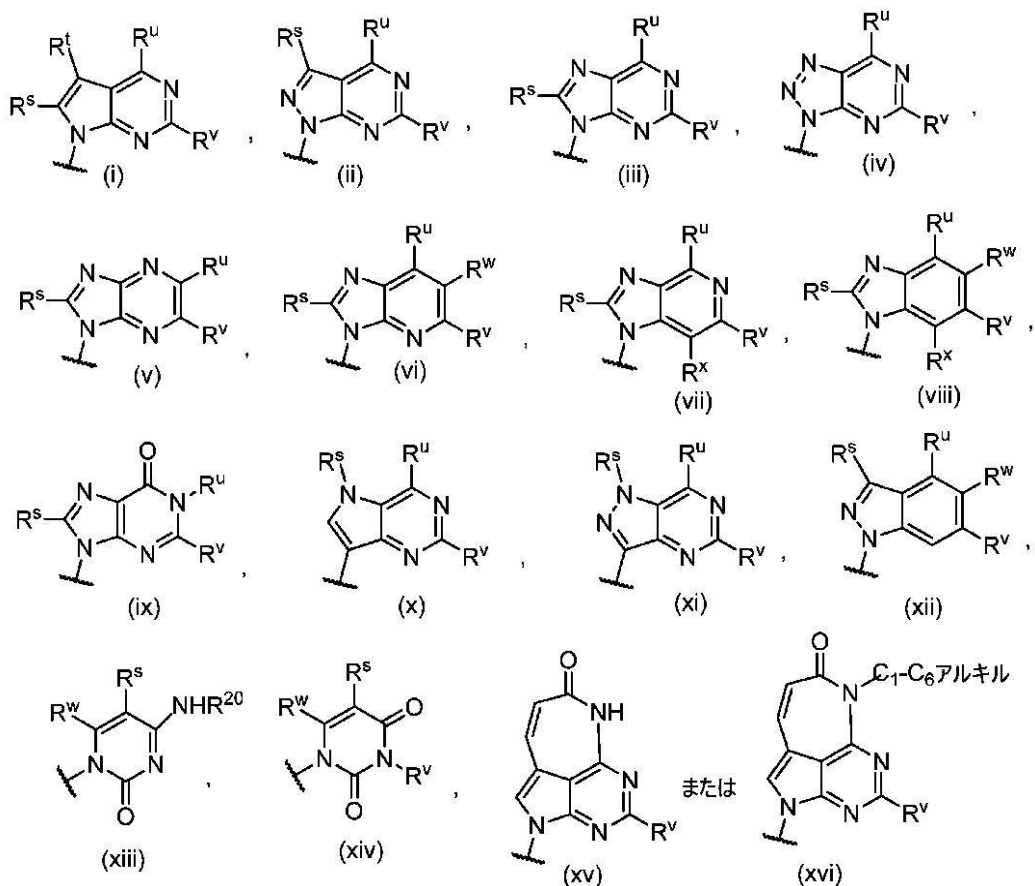
フェニルは、それ自体でまたは $-C_{1-6}$ アルキレンフェニル、フェノキシ、もしくは $-OC_{1-6}$ アルキレンフェニルの一部として、ヒドロキシル、ハロ、 CN 、 $-CO_2H$ 、 $-COOC_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル (1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、 $-OC_{1-6}$ アルキル (1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2H$ 、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2C_{1-6}$ アルキル、テトラゾリル、 $-SO_2C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHC_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CONHC_{1-6}$ アルキル、または $-CON(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ から独立して選択される 1、2、または 3 つの置換基で必要に応じて置換されており、

各 R^i は、独立して、 O 、 N 、および S から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含有する 5 または 6 員の単環式ヘテロアリールであり、前記ヘテロアリール環は、ヒドロキシル、ハロ、 CN 、 $-CO_2H$ 、 $-COOC_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル (1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、 $-OC_{1-6}$ アルキル (1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2H$ 、および $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2C_{1-6}$ アルキル (alky)、テトラゾリル、 $-SO_2C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHC_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CONHC_{1-6}$ アルキル、または $-CON(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ から独立して選択される 1、2、または 3 つの置換基で必要に応じて置換されており、

ヘテロシクリルは、それ自体でまたは $-C_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-OC_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-SC_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-CONR^m C_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-NR^m COC_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-CO$ ヘテロシクリル、もしくは $-NR^m CO$ ヘテロシクリルの一部として、ヒドロキシ、ハロ、 $-COOC_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル、または $-C_{1-6}$ アルキル (ヒドロキシまたは $-OC_{1-6}$ アルキルで置換されている) から独立して選択される 1、2、または 3 つの置換基で必要に応じて置換されており、

Het は、以下の式 (i) から (xvi) の基：

【化 2 4 1】



(式中、

R^u は、水素、ハロ、シアノ、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{20}$ 、 $-NHCOR^{20}$ 、 $-NR^{20}$ 、 R^{21} 、 $-R^{20}$ 、 $-SR^{20}$ 、 $-OH$ 、および $-OR^{20}$ であり、

R^w は水素、ハロ、 $-NHR^{22}$ 、 $-NR^{22}R^{23}$ 、 $-R^{22}$ 、 $-OH$ 、および $-OR^{22}$ であり、

R^v および R^x は、独立して、水素、ハロ、ハロ C_{1-6} アルキル、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{24}$ 、 $-NR^{24}R^{25}$ 、 $-R^{24}$ 、 $-SR^{24}$ 、シアノ、 $-OH$ 、 $-OR^{24}$ 、 $-SO_2R^{24}$ 、 $-C_{1-6}$ アルキレン NH_2 、 $-C_{1-6}$ アルキレン NHR^{24} 、 $-C_{1-6}$ アルキレン $NR^{24}R^{25}$ 、 $-R^{24}$ 、 $-C_{1-6}$ アルキレン SR^{24} 、 $-C_{1-6}$ アルキレン OH 、 $-C_{1-6}$ アルキレン OR^{24} 、 $-C_{1-6}$ アルキレン SO_2R^{24} であり、

R^s および R^t は、独立して、水素、ハロ、または C_{1-6} アルキルであり、

R^{20} 、 R^{21} 、 R^{22} 、 R^{23} 、 R^{24} および R^{25} は、独立して、必要に応じて置換されている C_{1-6} アルキル、 $-C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $-C_2 \sim C_6$ アルキニル、必要に応じて置換されているカルボシクリル、必要に応じて置換されているカルボシクリル C_{1-6} アルキル、必要に応じて置換されているヘテロシクリル、必要に応じて置換されているヘテロシクリル C_{1-6} アルキル、必要に応じて置換されているアリール、必要に応じて置換されているアリール C_{1-6} アルキル、必要に応じて置換されているヘテロアリール、もしくは必要に応じて置換されているヘテロアリール C_{1-6} アルキルであるが、または R^{20} と R^{21} 、 R^{22} と R^{23} 、および R^{24} と R^{25} は、これらが結合している窒素と一緒に、必要に応じて置換されている窒素含有ヘテロシクリルを形成する) から選択される基であり、

さらに、特に明記しない限り、

C_{1-6} アルキルは非置換であり、

C_{1-6} アルキルオキシの C_{1-6} アルキルは非置換であり、

ハロ C_{1-6} アルキルは 1 ~ 5 個のハロ原子で置換されている C_{1-6} アルキルであり、

ハロ C₁ ~ 6 アルキルオキシは 1 ~ 5 個のハロ原子で置換されている C₁ ~ 6 アルキルオキシであり、

C₂ ~ 6 アルケニルは非置換であり、

C₂ ~ 6 アルキニルは非置換であり、

C₁ ~ 6 アルキレンは非置換であり、

C₂ ~ 6 アルケニレンは非置換であり、

必要に応じて置換されている C₁ ~ 6 アルキルは、ヒドロキシ、C₁ ~ 6 アルキルオキシ、ハロ、ハロ C₁ ~ 6 アルキル、ハロ C₁ ~ 6 アルキルオキシ、シアノ、-NH₂、-NH(C₁ ~ 6 アルキル)、-N(C₁ ~ 6 アルキル)₂、必要に応じて置換されているカルボシクリル、必要に応じて置換されているアリール、必要に応じて置換されているヘテロアリール、および必要に応じて置換されているヘテロシクリルから独立して選択される 1 または 2 つの置換基で必要に応じて置換されており、

カルボシクリルは、3 ~ 10 個の炭素原子を含有する、非置換の飽和したもしくは部分的に不飽和の単環式または二環式の環であり、

必要に応じて置換されているカルボシクリルは、C₁ ~ 6 アルキル、ハロ、ヒドロキシ、または C₁ ~ 6 アルコキシから独立して選択される 1、2、または 3 つの置換基で必要に応じて置換されており、

必要に応じて置換されているアリールは、ヒドロキシ、C₁ ~ 6 アルキルオキシ、ハロ、ハロ C₁ ~ 6 アルキル、ハロ C₁ ~ 6 アルキルオキシ、シアノ、-NH₂、-NH(C₁ ~ 6 アルキル)、-N(C₁ ~ 6 アルキル)₂ から独立して選択される 1、2、または 3 つの置換基で必要に応じて置換されており、

アリールはフェニルまたはナフチルであり、

必要に応じて置換されているカルボシクリル、アリール [ヒドロキシ、C₁ ~ 6 アルキルオキシ、ハロ、ハロ C₁ ~ 6 アルキル、ハロ C₁ ~ 6 アルキルオキシ、シアノ、-NH₂、-NH(C₁ ~ 6 アルキル)、および -N(C₁ ~ 6 アルキル)₂ から独立して選択される 1、2、または 3 つの置換基で必要に応じて置換されている]、ヘテロアリール [ヒドロキシ、C₁ ~ 6 アルキルオキシ、ハロ、ハロ C₁ ~ 6 アルキル、ハロ C₁ ~ 6 アルキルオキシ、シアノ、-NH₂、-NH(C₁ ~ 6 アルキル)、-N(C₁ ~ 6 アルキル)₂ から独立して選択される 1、2、または 3 つの置換基で必要に応じて置換されている]、およびヘテロシクリル [ヒドロキシ、C₁ ~ 6 アルキルオキシ、ハロ、ハロ C₁ ~ 6 アルキル、ハロ C₁ ~ 6 アルキルオキシ、シアノ、-NH₂、-NH(C₁ ~ 6 アルキル)、-N(C₁ ~ 6 アルキル)₂ から独立して選択される 1、2、または 3 つの置換基で必要に応じて置換されている]、

ヘテロアリールは、N、O、および S から独立して選択される 1 ~ 4 個または 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含有する非置換の 5 ~ 10 員のまたは 5 ~ 6 員の芳香族環であり、残りの環原子は炭素であり、

必要に応じて置換されているヘテロアリールは、N、O、および S から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含有する 5 ~ 10 員の芳香族環であり、残りの環原子は炭素であり、ヒドロキシ、C₁ ~ 6 アルキルオキシ、ハロ、ハロ C₁ ~ 6 アルキル、ハロ C₁ ~ 6 アルキルオキシ、シアノ、-NH₂、-NH(C₁ ~ 6 アルキル)、-N(C₁ ~ 6 アルキル)₂、必要に応じて置換されているカルボシクリル、アリール [ヒドロキシ、C₁ ~ 6 アルキルオキシ、ハロ、ハロ C₁ ~ 6 アルキル、ハロ C₁ ~ 6 アルキルオキシ、シアノ、-NH₂、-NH(C₁ ~ 6 アルキル)、および -N(C₁ ~ 6 アルキル)₂ から独立して選択される 1、2、または 3 つの置換基で必要に応じて置換されている]、ヘテロアリール [ヒドロキシ、非置換の C₁ ~ 6 アルキルオキシ、ハロ、ハロ C₁ ~ 6 アルキル、ハロ C₁ ~ 6 アルキルオキシ、シアノ、-NH₂、-NH(C₁ ~ 6 アルキル)、-N(C₁ ~ 6 アルキル)₂ から独立して選択される 1、2、または 3 つの置換基で必要に応じて置換されている]、およびヘテロシクリル [ヒドロキシ、C₁ ~ 6 アルキルオキシ、ハロ、ハロ C₁ ~ 6 アルキル、ハロ C₁ ~ 6 アルキルオキシ、シアノ、-NH₂、-NH(C₁ ~ 6 アルキル)、-N(C₁ ~ 6 アルキル)₂ から独立して選択される 1、2、ま

たは3つの置換基で必要に応じて置換されている]から独立して選択される1、2、または3つの置換基で必要に応じて置換されており、

ヘテロシクリルは、N、O、S、SO、およびSO₂から独立して選択される1～3個のヘテロ原子を含有し、1または2つのCOを必要に応じて含有し、この環内の残りの原子が、フェニルまたは5～6員のカルボシクリルまたは5もしくは6のヘテロアリール環に必要に応じて縮合している炭素である、非置換の単環式の、飽和したまたは部分的に不飽和の4～8員環であり、

窒素含有ヘテロシクリルは少なくとも窒素原子を有するヘテロシクリル環であり、必要に応じて置換されているヘテロシクリルは、ヒドロキシ、C₁～6アルキルオキシ、ハロ、ハロC₁～6アルキル、ハロC₁～6アルキルオキシ、シアノ、-NH₂、-NH(C₁～6アルキル)、-N(C₁～6アルキル)₂、必要に応じて置換されているカルボシクリル、アリール[ヒドロキシ、C₁～6アルキルオキシ、ハロ、ハロC₁～6アルキル、ハロC₁～6アルキルオキシ、シアノ、-NH₂、-NH(C₁～6アルキル)、および-N(C₁～6アルキル)₂から独立して選択される1、2、または3つの置換基で必要に応じて置換されている]、ヘテロアリール[ヒドロキシ、C₁～6アルキルオキシ、ハロ、ハロC₁～6アルキル、ハロC₁～6アルキルオキシ、シアノ、-NH₂、-NH(C₁～6アルキル)、-N(C₁～6アルキル)₂から独立して選択される1、2、または3つの置換基で必要に応じて置換されている]、およびヘテロシクリル[ヒドロキシ、C₁～6アルキルオキシ、ハロ、ハロC₁～6アルキル、ハロC₁～6アルキルオキシ、シアノ、-NH₂、-NH(C₁～6アルキル)、-N(C₁～6アルキル)₂から独立して選択される1、2、または3つの置換基で必要に応じて置換されている]から独立して選択される1、2、または3つの置換基で必要に応じて置換されているヘテロシクリルであり、

必要に応じて置換されているカルボシクリルC₁～6アルキルは、C₁～6アルキルを介して結合された、必要に応じて置換されているカルボシクリルであり、

必要に応じて置換されているヘテロシクリルC₁～6アルキルは、C₁～6アルキルを介して結合された、必要に応じて置換されているヘテロシクリルであり、

必要に応じて置換されているアリールC₁～6アルキルは、C₁～6アルキルを介して結合された、必要に応じて置換されているアリールであり、そして

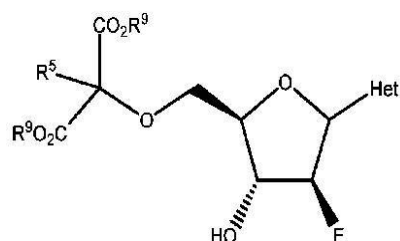
必要に応じて置換されているヘテロアリールC₁～6アルキルは、C₁～6アルキルを介して結合された、必要に応じて置換されているヘテロアリールである]

を有する、請求項1に記載の化合物。

(請求項125)

構造：

【化242】



を有する、請求項124に記載の化合物。

(請求項126)

R⁵が、フェニルC₁～6アルキルであり、フェニルが、-C₁～6アルキル、-OC₁～6アルキル、-C₁～6アルキル(1～5つのフルオロで置換されている)、-OC₁～6アルキル(1～5つのフルオロで置換されている)、-C₁～6アルキレン-CO₂H、-C₁～6アルキレン-CO₂C₁～6アルキル、-OC₁～6アルキレン-CO₂H、-OC₁～6アルキレン-CO₂C₁～6アルキル、-C₁～6アルキル(1または2つのヒドロキシで置換されている)、-OC₁～6アルキル(1または2つのヒドロ

キシで置換されている)、 $-C_{1-6}$ アルキル(1または2つの $-OC_{1-6}$ アルキルで置換されている)、 $-OC_{1-6}$ アルキル(1または2つの $-OC_{1-6}$ アルキルで置換されている)、 $-CO_2H$ 、 $-COOC_{1-6}$ アルキル、ハロ、ヒドロキシ、ニトロ、 $-PO_3H_2$ 、シアノ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-6}$ アルキル)、 $-N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、 $-CONR^eR^f$ [式中、 R^e および R^f は、独立して水素、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2H$ 、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2C_{1-6}$ アルキル、または $-C_{1-6}$ アルキル(ヒドロキシル、 NH_2 、 $-NHC_{1-6}$ アルキルまたは $-N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ から独立して選択される1または2つの置換基で置換されている)である]、 $-SO_2(C_{1-6}$ アルキル)、 $-SO_2NR^gR^h$ (式中、 R^g および R^h は、独立して、水素、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2H$ 、または $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2C_{1-6}$ アルキルである)、 $-SC_{1-6}$ アルキル、 $-SOC_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2NHCOR^j$ (式中、 R^j は $-C_{1-6}$ アルキル、 $-NHC_{1-6}$ アルキル、または $-N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ である)、フェニル、フェノキシ、ベンジル、 $-OC_{1-6}$ アルキレンフェニル、O、N、およびSから独立して選択される1~4個のヘテロ原子を含有する5または6員の単環式ヘテロアリール[ヘテロアリール環は、ヒドロキシル、ハロ、CN、 $-CO_2H$ 、 $-COOC_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル(1~5つのフルオロで置換されている)、 $-OC_{1-6}$ アルキル(アルキルは1~5つのフルオロで置換されている)、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2H$ 、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2C_{1-6}$ アルキル、テトラゾリル、 $-SO_2C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHC_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CONHC_{1-6}$ アルキル、および $-CON(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ から独立して選択される1、2、または3つの置換基で必要に応じて置換されている]、 $-OR^i$ 、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-R^i$ 、 $-OC_{1-6}$ アルキレン $-R^i$ 、 $-SR^i$ 、 $-SC_{1-6}$ アルキレン $-R^i$ 、ヘテロシクリル、 $-C_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-OC_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-SC_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-CONR^mC_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-NR^mCOC_{1-6}$ アルキレン NR^oR^p 、 $-NR^mCO$ ヘテロシクリル、 $-NR^mCOC_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-CO$ ヘテロシクリル、 $-CONR^mR^i$ 、 $-CONR^m$ アルキレン $-R^i$ 、ならびに $-CONHSO_2R^z$ から独立して選択される1または2つの置換基で必要に応じて置換されており、さらに前記 R^5 フェニルが、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル(アルキルは1~5つのフルオロで置換されている)、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル(アルキルは1~5つのフルオロで置換されている)、ハロ、CN、 $-NH_2$ 、およびヒドロキシルから選択される追加の置換基で必要に応じて置換されており、フェニルが、それ自体でまたはフェノキシ、ベンジル、もしくは $-OC_{1-6}$ アルキレンフェニルの一部として、ヒドロキシル、ハロ、CN、 $-CO_2H$ 、 $-COOC_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル(1~5つのフルオロで置換されている)、 $-OC_{1-6}$ アルキル(1~5つのフルオロで置換されている)、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2H$ 、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2C_{1-6}$ アルキル、テトラゾリル、 $-SO_2C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHC_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CONHC_{1-6}$ アルキル、または $-CON(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ から独立して選択される1、2、または3つの置換基で必要に応じて置換されている、請求項124または125に記載の化合物。(請求項127)

R^5 がベンジルであり、フェニル環が、前記ベンジル環の結合した $-CH_2-$ 基である前記フェニル環の炭素原子に対してメタ位またはパラ位にある1つの置換基で置換されており、1つの置換基が、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル(1~5つのフルオロで置換されている)、 $-OC_{1-6}$ アルキル(1~5つのフルオロで置換されている)、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2H$ 、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキレン $-CO_2H$ 、 $-OC_{1-6}$ アルキレン $-C$

$\text{O}_2\text{C}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{COOC}_{1\sim6}$ アルキル、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、 $-\text{PO}_3\text{H}_2$ 、 $-\text{CONR}^e\text{R}^f$ [式中、 R^e および R^f は、独立して、水素、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキレン $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキレン $-\text{CO}_2\text{C}_{1\sim6}$ アルキル、または $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキル (ヒドロキシ、 NH_2 、 $-\text{NHC}_{1\sim6}$ アルキルまたは $-\text{N}(\text{C}_{1\sim6}\text{アルキル})_2$ から独立して選択される 1 または 2 つの置換基で置換されている) である]、 $-\text{SO}_2(\text{C}_{1\sim6}\text{アルキル})$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^g\text{R}^h$ (式中、 R^g および R^h は、独立して、水素、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキレン $-\text{CO}_2\text{H}$ 、または $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキレン $-\text{CO}_2\text{C}_{1\sim6}$ アルキルである)、フェニル、フェノキシ、ベンジル、ベンジロキシ、 O 、 N 、および S から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含有する 5 または 6 員の単環式ヘテロアリール [前記ヘテロアリール環は、ヒドロキシ、ハロ、 CN 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{COOC}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{OC}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキル (アルキルは 1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、 $-\text{OC}_{1\sim6}$ アルキル (アルキルは 1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキレン $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキレン $-\text{CO}_2\text{C}_{1\sim6}$ アルキル、テトラゾリル、 $-\text{SO}_2\text{C}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{SO}_2\text{NHC}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{C}_{1\sim6}\text{アルキル})_2$ 、 $-\text{CONH}_2$ 、 $-\text{CONHC}_{1\sim6}$ アルキル、および $-\text{CON}(\text{C}_{1\sim6}\text{アルキル})_2$ から独立して選択される 1、2、または 3 つの置換基で必要に応じて置換されている]、 $-\text{OR}^i$ 、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキレン $-\text{R}^i$ 、 $-\text{OC}_{1\sim6}$ アルキレン $-\text{R}^i$ 、 $-\text{SR}^i$ 、 $-\text{SC}_{1\sim6}$ アルキレン $-\text{R}^i$ 、ヘテロシクリル、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-\text{OC}_{1\sim6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-\text{SC}_{1\sim6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-\text{CONR}^m\text{C}_{1\sim6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-\text{NR}^m\text{COC}_{1\sim6}$ アルキレン NR^oR^p 、 $-\text{NR}^m\text{CO}$ ヘテロシクリル、 $-\text{NR}^m\text{COC}_{1\sim6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-\text{CO}$ ヘテロシクリル、 $-\text{CONR}^m\text{R}^i$ 、ならびに $-\text{CONR}^m$ アルキレン $-\text{R}^i$ から選択され、前記 R^5 フェニル環が、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキル (アルキルは 1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、 $-\text{O}-\text{C}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{OC}_{1\sim6}$ アルキル (アルキルは 1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、ハロ、 CN 、 $-\text{NH}_2$ 、およびヒドロキシから独立して選択される 1 または 2 つの置換基でさらに必要に応じて置換されており、フェニルが、それ自体でまたはベンジル、フェノキシ、もしくはベンジロキシの一部として、ヒドロキシル、ハロ、 CN 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{COOC}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{OC}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキル (1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、 $-\text{OC}_{1\sim6}$ アルキル (1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキレン $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキレン $-\text{CO}_2\text{C}_{1\sim6}$ アルキル、テトラゾリル、 $-\text{SO}_2\text{C}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{SO}_2\text{NHC}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{C}_{1\sim6}\text{アルキル})_2$ 、 $-\text{CONH}_2$ 、 $-\text{CONHC}_{1\sim6}$ アルキル、および $-\text{CON}(\text{C}_{1\sim6}\text{アルキル})_2$ から独立して選択される 1、2、または 3 つの置換基で必要に応じて置換されている、請求項 1 2 4 または 1 2 5 に記載の化合物。

(請求項 1 2 8)

R^5 がベンジルであり、前記フェニル環が、前記ベンジル環の前記 $-\text{CH}_2-$ 基に結合している前記フェニル環の前記炭素原子に対してメタ位またはパラ位にある 1 つの置換基で置換されており、1 つの置換基が、 $-\text{OC}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキル (1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、 $-\text{OC}_{1\sim6}$ アルキル (1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキル (ヒドロキシで置換されている)、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキレン $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキレン $-\text{CO}_2\text{C}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{OC}_{1\sim6}$ アルキレン $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{OC}_{1\sim6}$ アルキレン $-\text{CO}_2\text{C}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、ニトロ、 $-\text{COOC}_{1\sim6}$ アルキル、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、 $-\text{CONR}^e\text{R}^f$ [式中、 R^e は水素または $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキルであり、 R^f は $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキル、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキレン $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキレン $-\text{CO}_2\text{C}_{1\sim6}$ アルキル、または $-\text{C}_{1\sim6}$ アルキル (ヒドロキシル、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHC}_{1\sim6}$ アルキルまたは $-\text{N}(\text{C}_{1\sim6}\text{アルキル})_2$ から独立して選択される 1 または 2 つの置換基で置換されている) である]、

- SO_2 (C_{1-6} アルキル)、- $\text{SO}_2 \text{NR}^g \text{R}^h$ (式中、 R^g は水素または - C_{1-6} アルキルであり、 R^h は水素、- C_{1-6} アルキル、- C_{1-6} アルキレン - $\text{CO}_2 \text{H}$ 、または - C_{1-6} アルキレン - $\text{CO}_2 \text{C}_{1-6}$ アルキルである)、オキサジアゾリル、テトラゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、フラニル、チエニル、ピロリルまたはイソオキサゾリル [上述のヘテロアリール環のそれぞれは、 C_{1-6} アルキル、ハロ、 CN 、- $\text{CO}_2 \text{H}$ 、- COOC_{1-6} アルキル、- C_{1-6} アルキル、- OC_{1-6} アルキル、- C_{1-6} アルキル (1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、- OC_{1-6} アルキル (1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、テトラゾリル、- $\text{SO}_2 \text{C}_{1-6}$ アルキル、- $\text{SO}_2 \text{NH}_2$ 、- $\text{SO}_2 \text{NHC}_{1-6}$ アルキル、- $\text{SO}_2 \text{N}(\text{C}_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、- CONH_2 、- CONHC_{1-6} アルキル、および - $\text{CON}(\text{C}_{1-6} \text{ アルキル})_2$ から独立して選択される 1 または 2 つの置換基で必要に応じて置換されている] から選択され、

前記 R^5 フェニル環が、- C_{1-6} アルキル、- C_{1-6} アルキル (アルキルは 1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、- $\text{O}-\text{C}_{1-6}$ アルキル、- OC_{1-6} アルキル (アルキルは 1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、ハロ、 CN 、- NH_2 、およびヒドロキシから独立して選択される 1 または 2 つの置換基でさらに必要に応じて置換されている、請求項 1 2 4 または 1 2 5 に記載の化合物。

(請求項 1 2 9)

R^5 がベンジルであり、前記フェニル環が、前記ベンジル環の - CH_2 - 基に結合している前記フェニル環の前記炭素原子に対してメタ位またはパラ位にある 1 つの置換基で、フェニル、ベンジル、ベンジロキシ、またはフェノキシ [上述の基のそれぞれの前記フェニル環は、ヒドロキシ、ハロ、 CN 、- $\text{CO}_2 \text{H}$ 、- COOC_{1-6} アルキル、- C_{1-6} アルキル、- OC_{1-6} アルキル、- C_{1-6} アルキル (1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、- OC_{1-6} アルキル (1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、- C_{1-6} アルキレン - $\text{CO}_2 \text{H}$ 、- C_{1-6} アルキレン - $\text{CO}_2 \text{C}_{1-6}$ アルキル、テトラゾリル、- $\text{SO}_2 \text{C}_{1-6}$ アルキル、- $\text{SO}_2 \text{NH}_2$ 、- $\text{SO}_2 \text{NHC}_{1-6}$ アルキル、- $\text{SO}_2 \text{N}(\text{C}_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、- CONH_2 、- CONHC_{1-6} アルキル、および - $\text{CON}(\text{C}_{1-6} \text{ アルキル})_2$ から独立して選択される 1、2、または 3 つの置換基で必要に応じて置換されている] で置換されており、

R^5 フェニルが - C_{1-6} アルキル、- C_{1-6} アルキル (アルキルは 1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、- $\text{O}-\text{C}_{1-6}$ アルキル、- OC_{1-6} アルキル (アルキルは 1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、ハロ、 CN 、- NH_2 、およびヒドロキシから独立して選択される 1 または 2 つの置換基でさらに必要に応じて置換されている、請求項 1 2 4 または 1 2 5 に記載の化合物。

(請求項 1 3 0)

R^5 がベンジルであり、前記フェニル環が、前記ベンジル環の - CH_2 - 基に結合している前記フェニル環の前記炭素原子に対してメタ位またはパラ位にある 1 つの置換基で、ハロ C_{1-6} アルコキシまたはハロ C_{1-6} アルキルで置換されており、前記 R^5 フェニル環が、- C_{1-6} アルキル、- C_{1-6} アルキル (アルキルは 1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、- $\text{O}-\text{C}_{1-6}$ アルキル、- OC_{1-6} アルキル (アルキルは 1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、ハロ、 CN 、- NH_2 、およびヒドロキシから独立して選択される 1 または 2 つの置換基でさらに必要に応じて置換されている、請求項 1 2 4 または 1 2 5 に記載の化合物。

(請求項 1 3 1)

R^5 がベンジルであり、前記フェニル環が、前記ベンジル環の - CH_2 - 基に結合している前記ベンジル環の前記炭素原子に対してメタ位またはパラ位にある 1 つの置換基で、- $\text{CO}_2 \text{H}$ および前記ベンジル環で置換されており、前記 R^5 フェニル環が、- C_{1-6} アルキル、- C_{1-6} アルキル (アルキルは 1 ~ 5 つのフルオロで置換されている)、- $\text{O}-\text{C}_{1-6}$ アルキル、- OC_{1-6} アルキル (アルキルは 1 ~ 5 つのフルオロで置換さ

れている)、ハロ、CN、 $-NH_2$ 、およびヒドロキシから独立して選択される1または2つの置換基でさらに必要に応じて置換されている、請求項124または125に記載の化合物。

(請求項132)

R^5 がベンジルであり、前記フェニル環が、前記ベンジル環の $-CH_2-$ 基に結合している前記ベンジル環の前記炭素原子に対してメタ位またはパラ位にある1つの置換基で、 $-CO_2Me$ または $-CO_2$ エチルで置換されており、前記 R^5 フェニル環が、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル(アルキルは1~5つのフルオロで置換されている)、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル(アルキルは1~5つのフルオロで置換されている)、ハロ、CN、 $-NH_2$ 、およびヒドロキシから独立しての1または2つの置換基でさらに必要に応じて置換されている、請求項124または125に記載の化合物。

(請求項133)

R^5 がベンジルであり、前記フェニル環が、前記ベンジル環の $-CH_2-$ 基に結合している前記ベンジル環の前記炭素原子に対してメタ位またはパラ位にある1つの置換基で、テトラゾリルで置換されており、前記 R^5 フェニル環が、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル(アルキルは1~5つのフルオロで置換されている)、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル(アルキルは1~5つのフルオロで置換されている)、ハロ、CN、 $-NH_2$ 、およびヒドロキシから独立して選択される1または2つの置換基でさらに必要に応じて置換されている、請求項124または125に記載の化合物。

(請求項134)

R^5 が $-CH_2-$ またはN、O、もしくはSから独立して選択される1~3個のヘテロ原子を有する $-(CH_2)_2-5\sim 10$ 員のヘテロアリールであり、前記ヘテロアリール環が、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル(1~5つのフルオロで置換されている)、 $-OC_{1-6}$ アルキル(1~5つのフルオロで置換されている)、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2H$ 、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{2-6}$ アルケニレン $-CO_2H$ 、 $-C_{1-6}$ アルキル(1または2つのヒドロキシで置換されている)、 $-OC_{1-6}$ アルキル(1または2つのヒドロキシで置換されている)、 $-C_{1-6}$ アルキル(1または2つの $-OC_{1-6}$ アルキルで置換されている)、 $-OC_{1-6}$ アルキル(1または2つの $-OC_{1-6}$ アルキルで置換されている)、 $-CO_2H$ 、 $-COOC_{1-6}$ アルキル、ヒドロキシ、ハロ、ニトロ、 $-PO_3H_2$ 、シアノ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-6}$ アルキル)、 $-N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、 $-CONR^eR^f$ [式中、 R^e および R^f は、独立して、水素、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2H$ 、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2C_{1-6}$ アルキル、または $-C_{1-6}$ アルキル(ヒドロキシ、 $-NHC_{1-6}$ アルキルまたは $-N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ から独立して選択される1または2つの置換基で置換されている)である]、 $-SO_2(C_{1-6}$ アルキル)、 $-SO_2NR^gR^h$ (式中、 R^g および R^h は、独立して、水素、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2H$ 、または $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2C_{1-6}$ アルキルである)、 $-SC_{1-6}$ アルキル、 $-SOC_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2NHCOR^j$ (式中、 R^j は $-C_{1-6}$ アルキル、 $-NH_2$ 、 $-NHC_{1-6}$ アルキル、または $-N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ である)、フェニル、 $-C_{1-6}$ アルキレンフェニル、フェノキシ、 $-OC_{1-6}$ アルキレンフェニル、O、N、およびSから独立して選択される1~4個のヘテロ原子を含有する5または6員の単環式ヘテロアリール[前記ヘテロアリール環は、ヒドロキシ、ハロ、CN、 $-CO_2H$ 、 $-COOC_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル(1~5つのフルオロで置換されている)、 $-OC_{1-6}$ アルキル(1~5つのフルオロで置換されている)、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2H$ 、 $-C_{1-6}$ アルキレン $-CO_2C_{1-6}$ アルキル、テトラゾリル、 $-SO_2C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHC_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CONHC_{1-6}$ アルキル、および $-CON(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ から独立して選択される1、2、または3つ

の置換基で必要に応じて置換されている]、 $-OR^i$ 、 $-C_{1-6}$ アルキレン- R^i 、 $-OC_{1-6}$ アルキレン- R^i 、 $-SR^i$ 、 $-SC_{1-6}$ アルキレン- R^i 、ヘテロシクリル、 $-C_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-OC_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-SC_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-CONR^mC_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-NR^mCOC_{1-6}$ アルキレン NR^oR^p 、 $-NR^mCO$ ヘテロシクリル、 $-NR^mCOC_{1-6}$ アルキレンヘテロシクリル、 $-CO$ ヘテロシクリル、 $-CONR^mR^i$ 、 $-CONR^m$ アルキレン- R^i 、 $-OCONR^mR^m$ 、 $-NR^m-COR^y$ 、 $-NR^m-CO-NR^mR^y$ 、 $-NR^m-SO_2-R^y$ 、 $-NR^m-SO_2-NR^mR^y$ 、ならびに $-CONHSO_2R^z$ から独立して選択される1つの置換基で必要に応じて置換されており、

前記 R^5 ヘテロアリール環が、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル(アルキルは1~5つのフルオロで置換されている)、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル(アルキルは1~5つのフルオロで置換されている)、ハロ、 CN 、 $-NH_2$ 、およびヒドロキシから独立して選択される1または2つの置換基でさらに必要に応じて置換されている、請求項124または125に記載の化合物。

(請求項135)

R^5 がN、O、またはSから独立して選択される1~3個のヘテロ原子を有する5~10員のヘテロアリール C_{1-6} アルキルであり、ヘテロアリール環が、フェニル[前記フェニル環は、ヒドロキシ、ハロ、 CN 、 $-CO_2H$ 、 $-COOC_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル(アルキルは1~5つのフルオロで置換されている)、 $-OC_{1-6}$ アルキル(アルキルは1~5つのフルオロで置換されている)、 $-C_{1-6}$ アルキレン- CO_2H 、 $-C_{1-6}$ アルキレン- CO_2C_{1-6} アルキル、テトラゾリル、 $-SO_2C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHCH_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CONHC_{1-6}$ アルキル、および $-CON(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ から独立して選択される1、2、または3つの置換基で必要に応じて置換されている]で置換されており、

前記 R^5 ヘテロアリール環が、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル(アルキルは1~5つのフルオロで置換されている)、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル(アルキルは1~5つのフルオロで置換されている)、ハロ、 CN 、 $-NH_2$ 、およびヒドロキシから独立して選択される1または2つの置換基でさらに必要に応じて置換されている、請求項124または125に記載の化合物。

(請求項136)

R^5 がN、O、またはSから独立して選択される1~3個のヘテロ原子を有する5~10員のヘテロアリール C_{1-6} アルキルであり、ヘテロアリール環がハロ C_{1-6} アルコキシまたはハロ C_{1-6} アルキルで置換されており、前記 R^5 ヘテロアリール環が、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル(アルキルは1~5つのフルオロで置換されている)、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル(アルキルは1~5つのフルオロで置換されている)、ハロ、 CN 、 $-NH_2$ 、およびヒドロキシから独立して選択される1または2つの置換基でさらに必要に応じて置換されている、請求項124または125に記載の化合物。

(請求項137)

R^5 がN、O、またはSから独立して選択される1~3個のヘテロ原子を有する5~10員のヘテロアリール C_{1-6} アルキルであり、ヘテロアリール環が $-CO_2H$ で置換されており、前記 R^5 ヘテロアリール環が、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ アルキル(アルキルは1~5つのフルオロで置換されている)、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル(アルキルは1~5つのフルオロで置換されている)、ハロ、 CN 、 $-NH_2$ 、およびヒドロキシから独立して選択される1または2つの置換基でさらに必要に応じて置換されている、請求項124または125に記載の化合物。

(請求項138)

R^5 がN、O、またはSから独立して選択される1~3個のヘテロ原子を有する5~1

0 員のヘテロアリール $C_1 \sim 6$ アルキルであり、ヘテロアリール環が $-CO_2C_1 \sim 6$ アルキルで置換されており、前記 R^5 ヘテロアリール環が、 $-C_1 \sim 6$ アルキル、 $-C_1 \sim 6$ アルキル（アルキルは 1 ～ 5 つのフルオロで置換されている）、 $-O-C_1 \sim 6$ アルキル、 $-OC_1 \sim 6$ アルキル（アルキルは 1 ～ 5 つのフルオロで置換されている）、ハロ、 CN 、 $-NH_2$ 、およびヒドロキシから独立して選択される 1 または 2 つの置換基でさらに必要に応じて置換されている、請求項 124 または 125 に記載の化合物。

（請求項 139）

R^5 が N 、 O 、または S から独立して選択される 1 ～ 3 個のヘテロ原子を有する 5 ～ 10 員のヘテロアリール $C_1 \sim 6$ アルキルであり、ヘテロアリール環がテトラゾリルで置換されており、前記 R^5 ヘテロアリール環が、 $-C_1 \sim 6$ アルキル、 $-C_1 \sim 6$ アルキル（アルキルは 1 ～ 5 つのフルオロで置換されている）、 $-O-C_1 \sim 6$ アルキル、 $-OC_1 \sim 6$ アルキル（アルキルは 1 ～ 5 つのフルオロで置換されている）、ハロ、 CN 、 $-NH_2$ 、およびヒドロキシから独立して選択される 1 または 2 つの置換基でさらに必要に応じて置換されている、請求項 124 または 125 に記載の化合物。

（請求項 140）

前記 R^5 の 5 ～ 10 員のヘテロアリール環が、チエニル、フラニル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、ピリジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、オキサゾリル、オキサジアゾリル（oxadiazolylo）、イソオキサゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾオキサゾリル、インドリル、キノリニル、またはイソキノリニル、およびベンゾチエニルから選択される、請求項 124 から 139 のいずれか一項に記載の化合物。

（請求項 141）

Het が式 (iii) の基である、請求項 124 から 139 のいずれか一項に記載の化合物。

（請求項 142）

R^s が水素である、請求項 124 から 141 のいずれか一項に記載の化合物。

（請求項 143）

R^w および R^d が水素である、請求項 124 から 142 のいずれか一項に記載の化合物。

（請求項 144）

R^u が水素、ハロ、シアノ、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{20}$ 、 $-NHCOR^{20}$ 、 $-NR^{20}$ 、 R^{21} 、 $-R^{20}$ 、 $-SR^{20}$ 、または $-OR^{20}$ であり、 R^{20} および R^{21} が独立して、必要に応じて置換されている $C_1 \sim 6$ アルキル、必要に応じて置換されているカルボシクリル、必要に応じて置換されているカルボシクリル $C_1 \sim 6$ アルキル、必要に応じて置換されているヘテロシクリル、必要に応じて置換されているヘテロシクリル $C_1 \sim 6$ アルキル、必要に応じて置換されているアリール、必要に応じて置換されているアリール $C_1 \sim 6$ アルキル、必要に応じて置換されているヘテロアリール、もしくは必要に応じて置換されているヘテロアリール $C_1 \sim 6$ アルキルであるか、または R^{20} および R^{21} が、これらが結合している窒素と一緒に、必要に応じて置換されている窒素含有ヘテロシクリルを形成し、

R^v が、水素、ハロ、ハロ $C_1 \sim 6$ アルキル、シアノ、 $-R^{24}$ 、 $-SR^{24}$ 、 $-OR^{24}$ 、または $-SO_2R^{24}$ であり、

R^{24} が、必要に応じて置換されている $C_1 \sim 6$ アルキル、 $-C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $-C_2 \sim C_6$ アルキニル、必要に応じて置換されているカルボシクリル、必要に応じて置換されているカルボシクリル $C_1 \sim 6$ アルキル、必要に応じて置換されているヘテロシクリル、必要に応じて置換されているヘテロシクリル $C_1 \sim 6$ アルキル、必要に応じて置換されているアリール、必要に応じて置換されているアリール $C_1 \sim 6$ アルキル、必要に応じて置換されているヘテロアリール、または必要に応じて置換されているヘテロアリール $C_1 \sim 6$ アルキルである、請求項 124 から 143 のいずれか一項に記載の化合物。

（請求項 145）

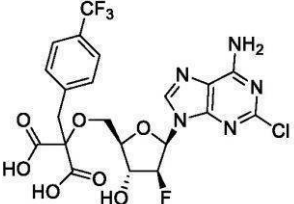

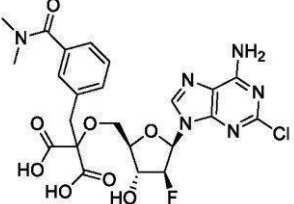
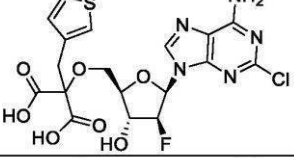
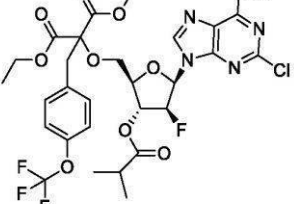
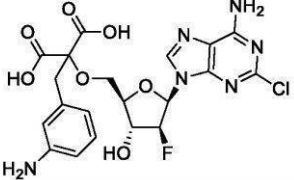
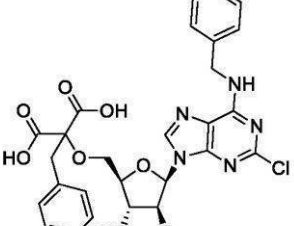
R^u が -NH₂、-NHR²⁰、または -NR²⁰R²¹ であり、R²⁰ および R²¹ が独立して、必要に応じて置換されている C₁ ~ 6 アルキル、必要に応じて置換されているカルボシクリル、必要に応じて置換されているカルボシクリル C₁ ~ 6 アルキル、必要に応じて置換されているヘテロシクリル、必要に応じて置換されているヘテロシクリル C₁ ~ 6 アルキル、必要に応じて置換されているアリール、必要に応じて置換されているアリール C₁ ~ 6 アルキル、必要に応じて置換されているヘテロアリール、もしくは必要に応じて置換されているヘテロアリール C₁ ~ 6 アルキルであるか、または R²⁰ および R²¹ が、これらが結合している窒素と一緒に、必要に応じて置換されている窒素含有ヘテロシクリルを形成する、請求項 1 2 4 から 1 4 4 のいずれか一項に記載の化合物。
(請求項 1 4 6)

R^u が NH₂ であり、R^v がクロロである、請求項 1 2 4 から 1 4 5 のいずれか一項に記載の化合物。
(請求項 1 4 7)

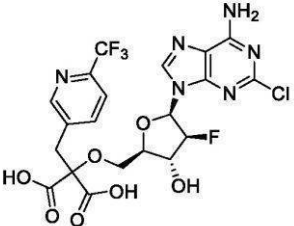
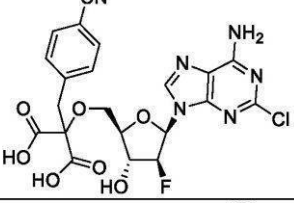
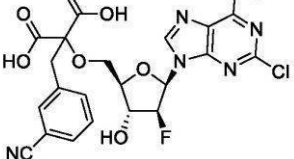
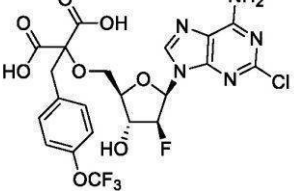
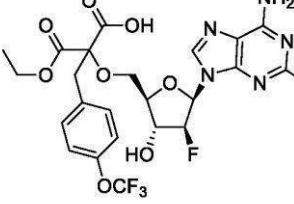
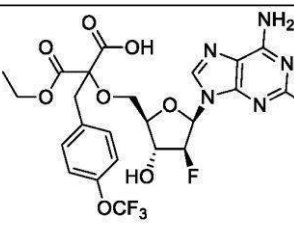
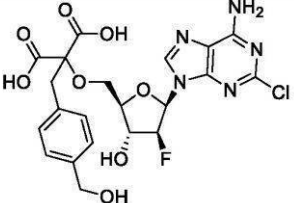
【表 7 - 1】

化合物 番号	化合物	名称
6		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-ベンジルマロン酸
7		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-カルボキシベンジル)-マロン酸
8		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-((6-クロロピリジン-3-イル)メチル)マロン酸
10		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>R</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-ベンジルマロン酸
12		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-(2-カルボキシエチル)ベンジル)マロン酸
13		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(3-フェノキシベンジル)マロン酸
15		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(3-(トリフルオロメキシ)ベンジル)マロン酸
16		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(3-(トリフルオロメチル)ベンジル)マロン酸
17		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(ナフタレン-2-イルメチル)マロン酸

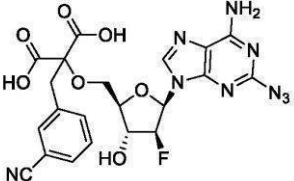
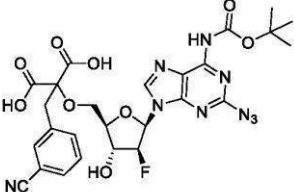
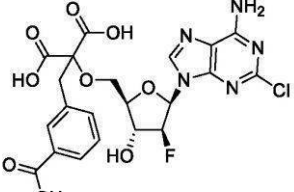
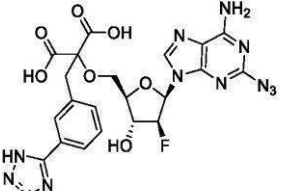
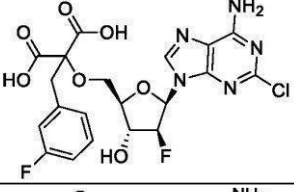
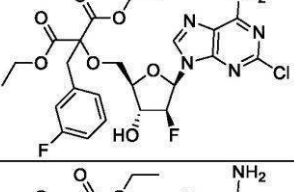
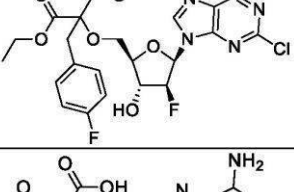
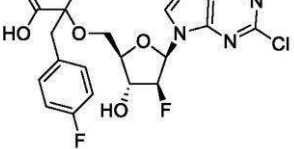
【表 7 - 2】

化合物 番号	化合物	名称
20		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-(トリフルオロメチル)ベンジル)マロン酸
21		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-(メチルスルホニル)ベンジル)マロン酸
22		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(3-(ジメチルカルバモイル)ベンジル)マロン酸
23		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(チオフェン-3-イルメチル)マロン酸
25		ジエチル 2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-(イソブチリルオキシ)テトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-(トリフルオロメチル)ベンジル)マロネート
27		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(3-アミノベンジル)マロン酸
28		2-ベンジル-2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-(ベンジルアミノ)-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)マロン酸

【表 7 - 3】

化合物番号	化合物	名称
32		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-((6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)メチル)マロン酸
34		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-シアノベンジル)マロン酸
35		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(3-シアノベンジル)マロン酸
36		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-(トリフルオロメキシ)ベンジル)マロン酸
37	 異性体 1	2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-3-エトキシ-3-オキソ-2-(4-(トリフルオロメキシ)ベンジル)プロパン酸
38	 異性体 2	2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-3-エトキシ-3-オキソ-2-(4-(トリフルオロメキシ)ベンジル)プロパン酸
39		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-(ヒドロキシメチル)ベンジル)マロン酸

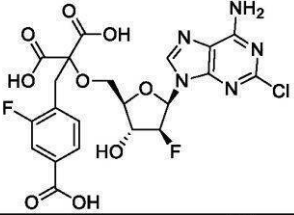
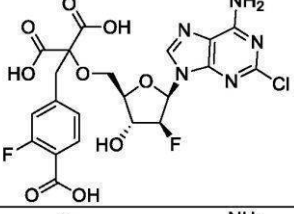
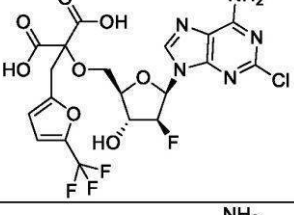
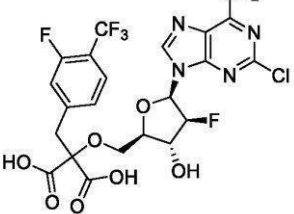
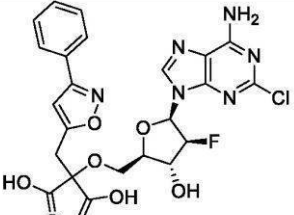
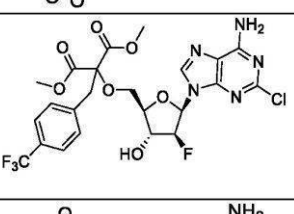
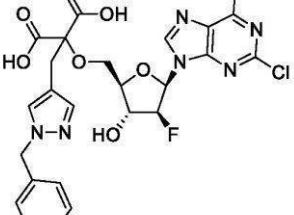
【表 7 - 4】

化合物番号	化合物	名称
40		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-アジド-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(3-シアノベンジル)マロン酸
41		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(2-アジド-6-((tert-ブトキシカルボニル)アミノ)-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(3-シアノベンジル)マロン酸
42		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(3-カルボキシベンジル)-マロン酸
43		2-(3-(1H-テトラゾール-5-イル)ベンジル)-2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-アジド-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)マロン酸
44		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(3-フルオロベンジル)マロン酸
45		ジエチル 2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(3-フルオロベンジル)マロネート
46		ジエチル 2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-フルオロベンジル)マロネート
47		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-フルオロベンジル)マロン酸

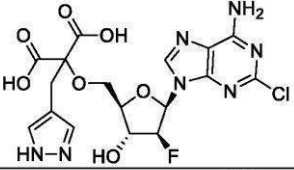
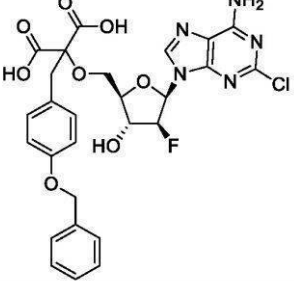
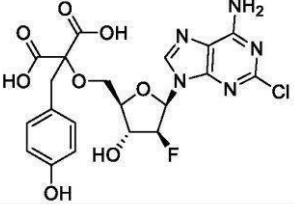
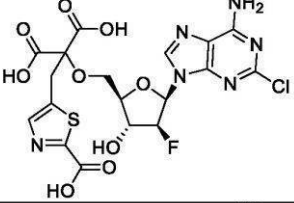
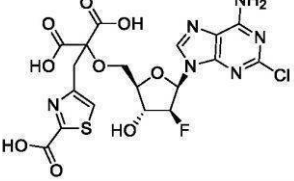

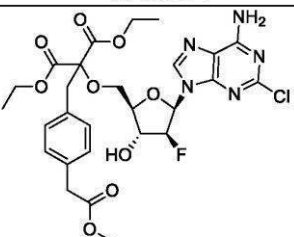
【表 7 - 5】

化合物番号	化合物	名称
48		ジエチル 2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-(トリフルオロメキシ)ベンジル)マロネート
49		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(3-メキシベンジル)マロン酸
50		2-((1H-テトラゾール-5-イル)メチル)-2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)マロン酸
51		2-(((2S,3S,4R,5R)-3-アミノ-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-ベンジルマロン酸
53		2-(3-(1H-テトラゾール-5-イル)ベンジル)-2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)マロン酸
54		2-(4-(1H-テトラゾール-5-イル)ベンジル)-2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)マロン酸
55		2-(((2R,3S,4R,5R)-4-アミノ-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-ベンジルマロン酸
56		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(3-ヒドロキシベンジル)マロン酸

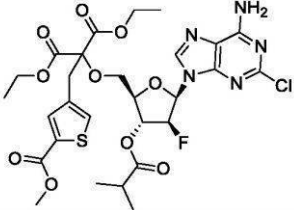
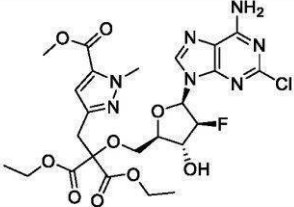
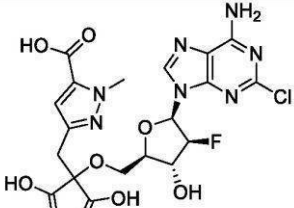
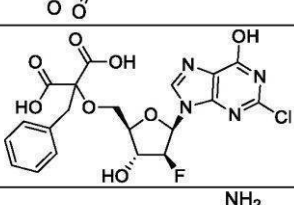
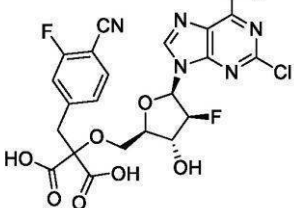
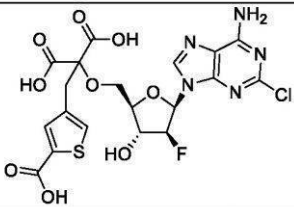
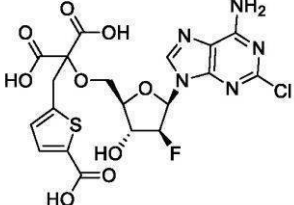
【表 7 - 6】

化合物 番号	化合物	名称
57		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-カルボキシ-2-フルオロベンジル)マロン酸
58		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-カルボキシ-3-フルオロベンジル)マロン酸
59		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-((5-(トリフルオロメチル)-フラン-2-イル)メチル)マロン酸
60		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(3-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)ベンジル)マロン酸
61		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-((3-フェニルイソキサゾール-5-イル)メチル)マロン酸
62		ジメチル 2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-(トリフルオロメチル)ベンジル)マロネート
63		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-((1-ベンジル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)マロン酸

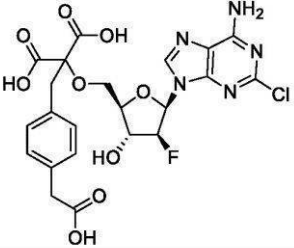
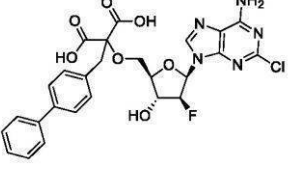
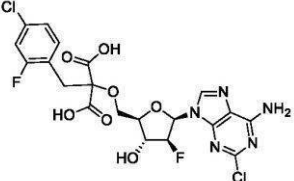
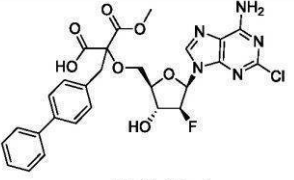
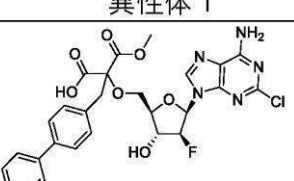

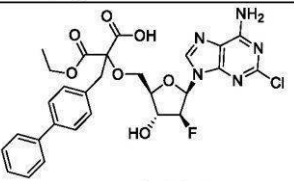
【表 7 - 7】

化合物 番号	化合物	名称
64		2-((1H-ピラゾール-4-イル)メチル)-2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)マロン酸
65		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-(ベンジルオキシ)ベンジル)マロン酸
66		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-ヒドロキシベンジル)マロン酸
67		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-((2-カルボキシチアゾール-5-イル)メチル)マロン酸
68		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-((2-カルボキシチアゾール-4-イル)メチル)マロン酸
69	 異性体 1	2-([1,1'-ビフェニル]-4-イルメチル)-2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-3-エトキシ-3-オキソプロパン酸
70		ジエチル 2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-(2-メトキシ-2-オキソエチル)ベンジル)マロネート

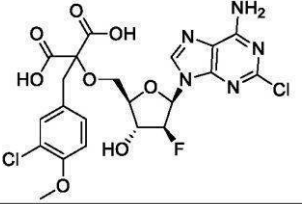
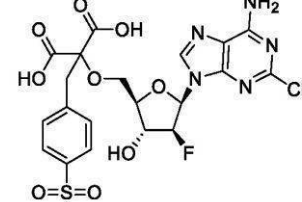
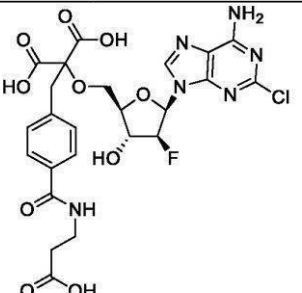
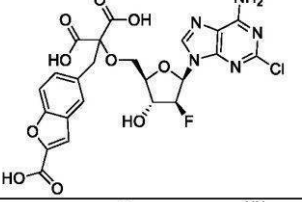
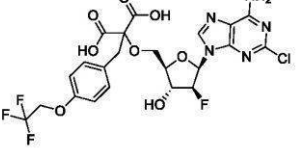
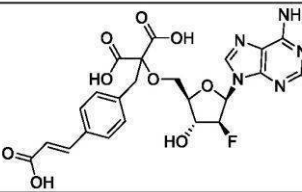
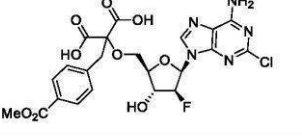
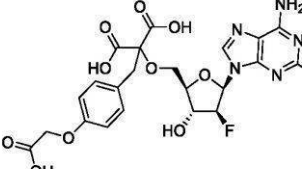
【表 7 - 8】

化合物 番号	化合物	名称
71		ジエチル 2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-(イソブチリルオキシ)テトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(((5-(メキシカルボニル)チオフェン-3-イル)メチル)マロネート
72		ジエチル 2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(((5-(メキシカルボニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)メチル)マロネート
73		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(((5-カルボキシ-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)メチル)マロン酸
74		2-ベンジル-2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(2-クロロ-6-ヒドロキシ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)マロン酸
75		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-シアノ-3-フルオロベンジル)マロン酸
76		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(((5-カルボキシチオフェン-3-イル)メチル)マロン酸
77		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(((5-カルボキシチオフェン-2-イル)メチル)マロン酸

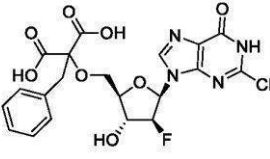
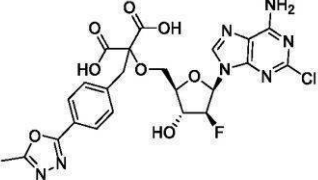
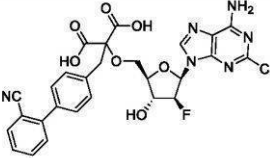
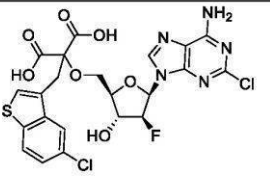
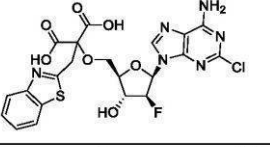
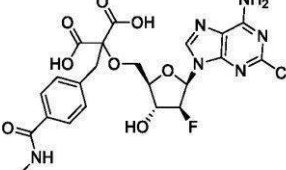
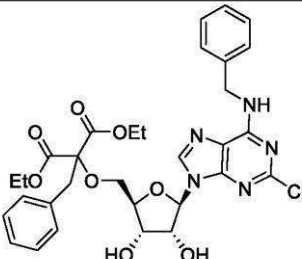
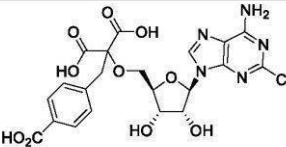
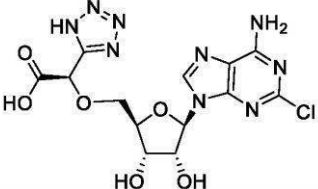
【表 7 - 9】

化合物 番号	化合物	名称
78		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-(カルボキシメチル)ベンジル)マロン酸
79		2-([1,1'-ビフェニル]-4-イルメチル)-2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)マロン酸
80		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-クロロ-2-フルオロベンジル)マロン酸
81	 異性体 1	2-([1,1'-ビフェニル]-4-イルメチル)-2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-3-メキシ-3-オキソプロパン酸
82	 異性体 2	2-([1,1'-ビフェニル]-4-イルメチル)-2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-3-メキシ-3-オキソプロパン酸
83		2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-((3-カルボキシイソオキサゾール-5-イル)メチル)マロン酸
84	 異性体 2	2-([1,1'-ビフェニル]-4-イルメチル)-2-(((2R,3R,4S,5R)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9H-プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-3-エトキシ-3-オキソプロパン酸

【表 7 - 10】

化合物番号	化合物	名称
85		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(3-クロロ-4-メキシベンジル)マロン酸
86		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-スルファモイルベンジル)マロン酸
87		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-((2-カルボキシエチル)カルバモイル)ベンジル)マロン酸
88		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-((2-カルボキシベンゾフラン-5-イル)メチル)マロン酸
89		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ベンジル)マロン酸
90		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-((<i>E</i>)-2-カルボキシビニル)ベンジル)マロン酸
91		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-(メキシカルボニル)ベンジル)マロン酸
92		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-(カルボキシメキシ)ベンジル)マロン酸

【表 7 - 1 1】

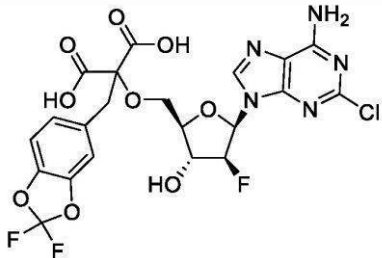
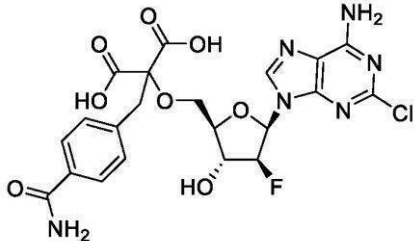
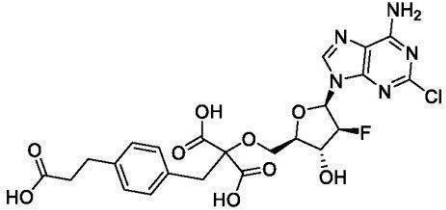
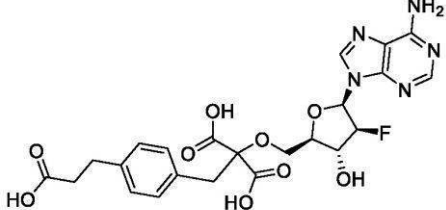
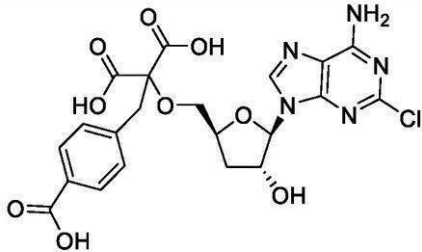
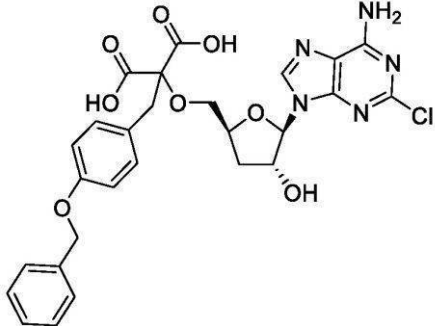
化合物 番号	化合物	名称
93		2-ベンジル-2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(2-クロロ-6-オキソ-1 <i>H</i> -プリン-9(6 <i>H</i>)-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)マロン酸
94		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-(5-メチル-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)ベンジル)マロン酸
95		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-((2'-シアノ-[1,1'-ビフェニル]-4-イル)-メチル)マロン酸
96		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-((5-クロロベンゾ[<i>b</i>]チオフェン-3-イル)メチル)-マロン酸
97		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(ベンゾ[<i>d</i>]チアゾール-2-イルメチル)マロン酸
98		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>R</i> ,4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-(メチルカルバモイル)ベンジル)マロン酸
99		ジエチル 2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>S</i> ,4 <i>R</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-3,4-ジヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-ベンジルマロネート
100		2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>S</i> ,4 <i>R</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-3,4-ジヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(4-カルボキシベンジル)マロン酸
101		5-2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>S</i> ,4 <i>R</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-3,4-ジヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(1 <i>H</i> -テトラゾール-5-イル)酢酸

【表 7 - 1 2】

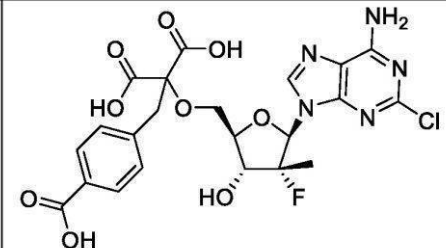
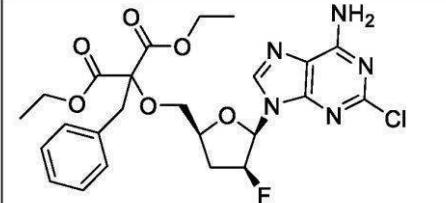
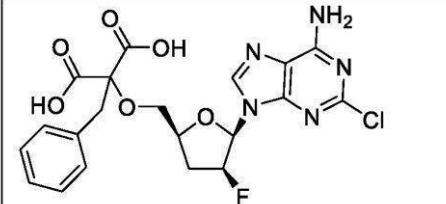
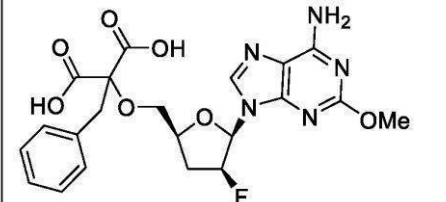
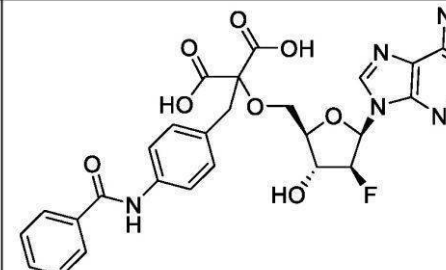
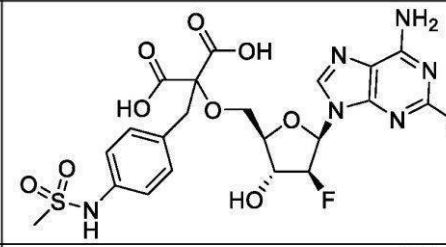
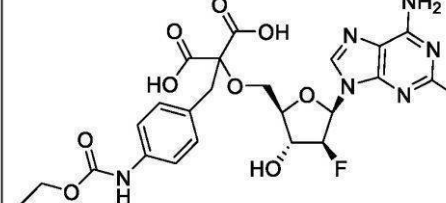
化合物番号	化合物	名称
102		(<i>R</i>)-2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>S</i> ,4 <i>R</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-3,4-ジヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-2-(1 <i>H</i> -テトラゾール-5-イル)酢酸
103		(<i>S</i>)-2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>S</i> ,4 <i>R</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-3,4-ジヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-3-フェニル-2-(1 <i>H</i> -テトラゾール-5-イル)プロパン酸
104		(<i>R</i>)-2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>S</i> ,4 <i>R</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-クロロ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-3,4-ジヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-3-フェニル-2-(1 <i>H</i> -テトラゾール-5-イル)プロパン酸
105		(<i>S</i>)-2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>S</i> ,4 <i>R</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-メキシ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-3,4-ジヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-3-フェニル-2-(1 <i>H</i> -テトラゾール-5-イル)プロパン酸
106		(<i>R</i>)-2-(((2 <i>R</i> ,3 <i>S</i> ,4 <i>R</i> ,5 <i>R</i>)-5-(6-アミノ-2-メキシ-9 <i>H</i> -プリン-9-イル)-3,4-ジヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メキシ)-3-フェニル-2-(1 <i>H</i> -テトラゾール-5-イル)プロパン酸

化合物番号	化合物
108	
109	

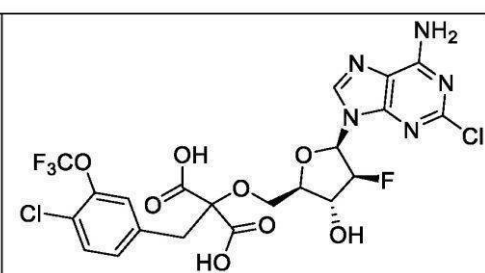
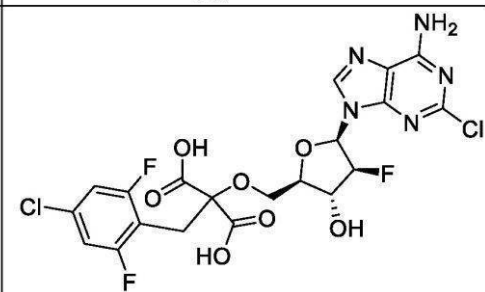
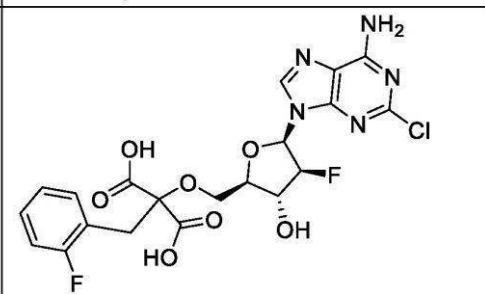
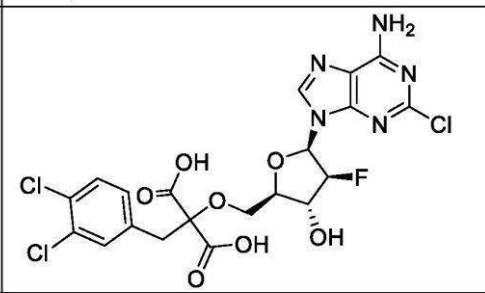
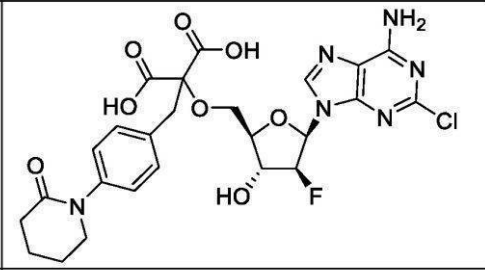
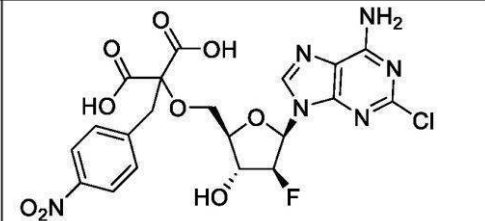
【表 7 - 1 3】

110	
111	
113	
114	
115	
116	

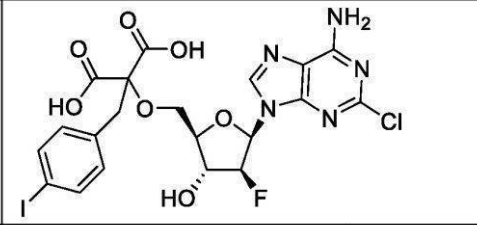
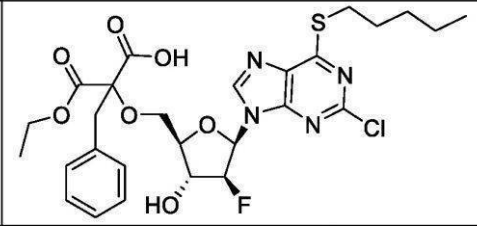
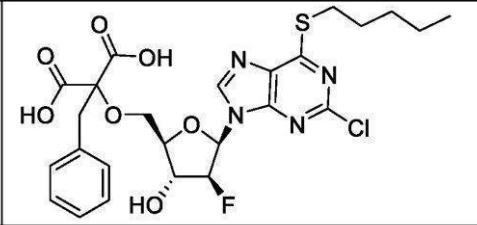
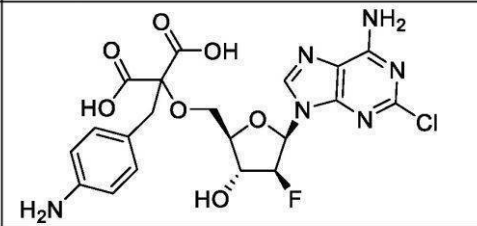
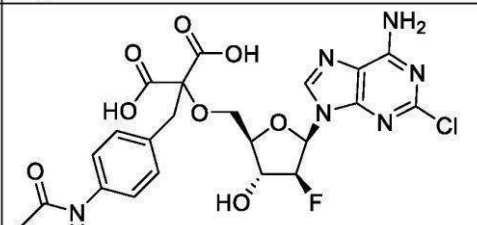
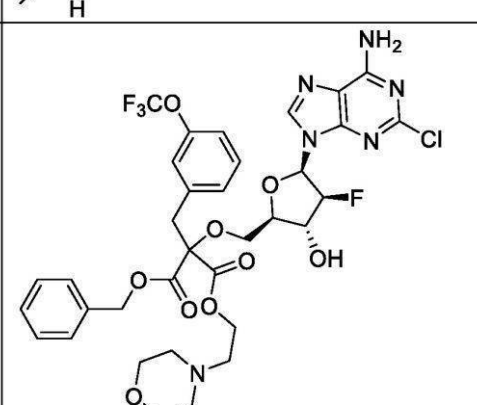
【表 7 - 1 4】

117	
118	
119	
120	
122	
123	
124	

【表 7 - 1 5】

125	
126	
127	
128	
129	
130	

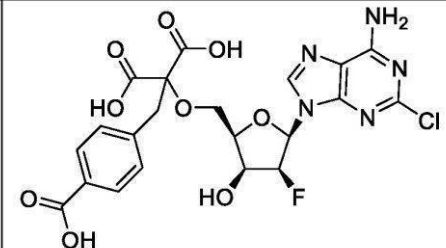
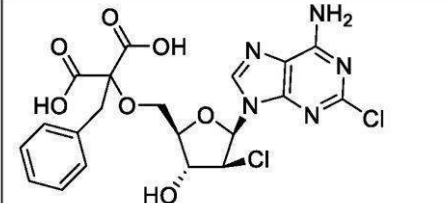
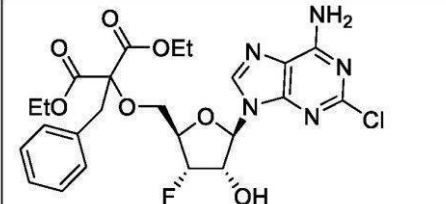
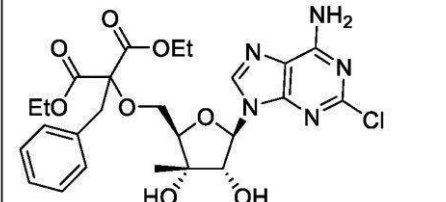
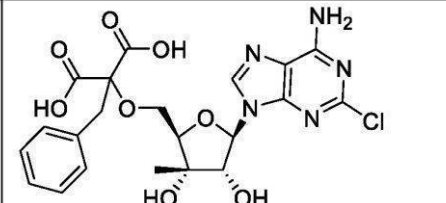
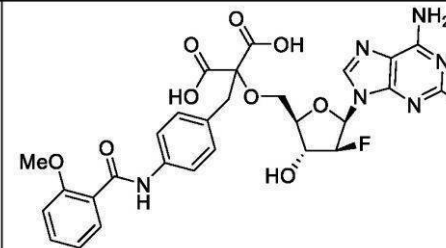
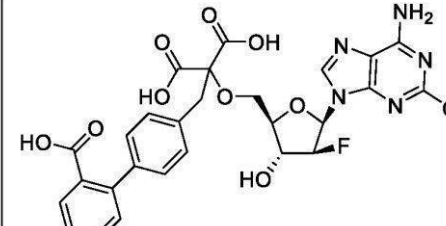
【表 7 - 1 6】

131	
133	
134	
135	
136	
138	

【表 7 - 1 7】

139	
140	
141	
142	
143	
144	

【表 7 - 1 8】

145	
146	
147	
148	
149	
150	
151	

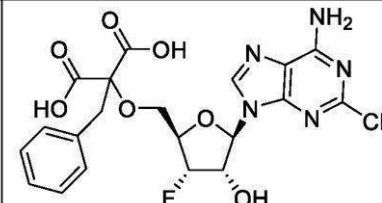
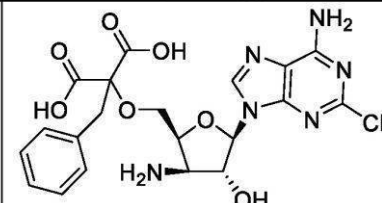
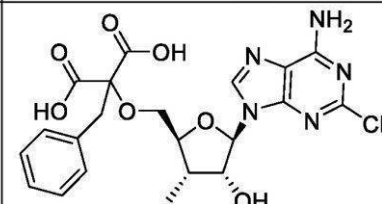
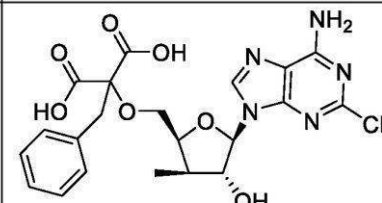
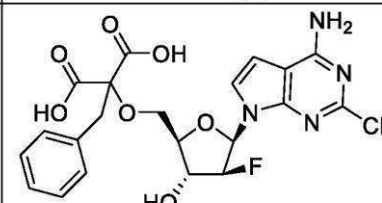
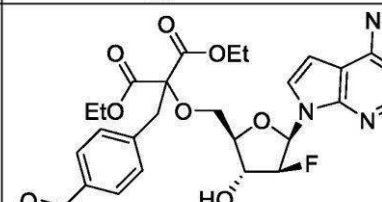
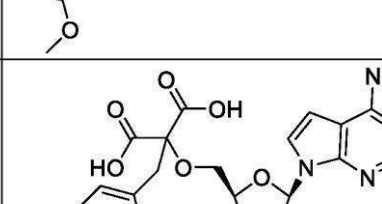
【表 7 - 1 9】

152	
153	
154	
155	
156	
157	

【表 7 - 20】

158	
159	
160	
161	
162	
163	
164	

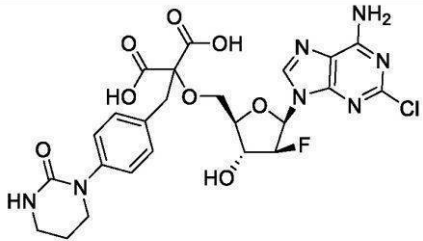
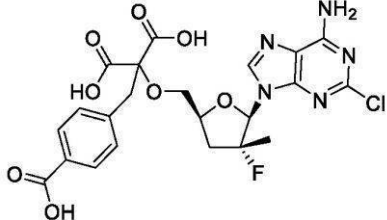
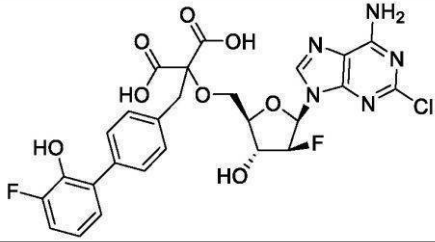
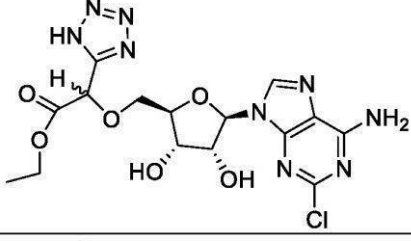
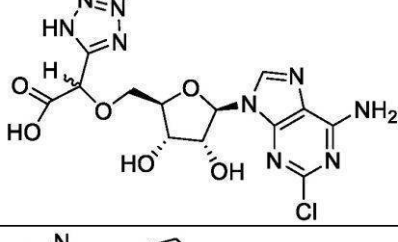
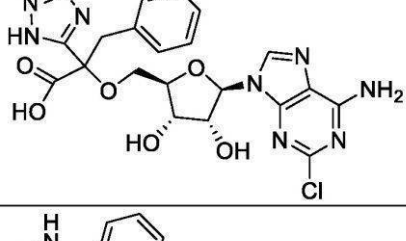
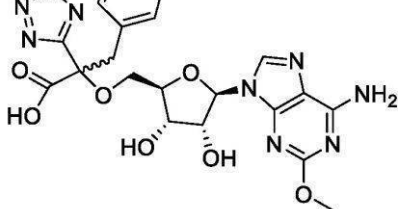
【表 7 - 2 1】

165	
166	
167	
168	
169	
170	
171	

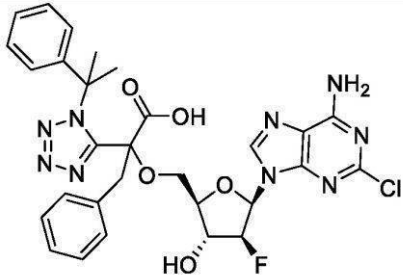
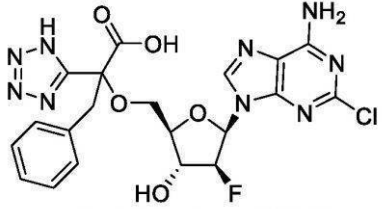
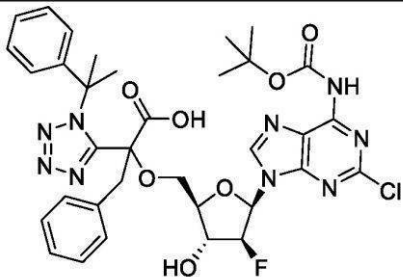
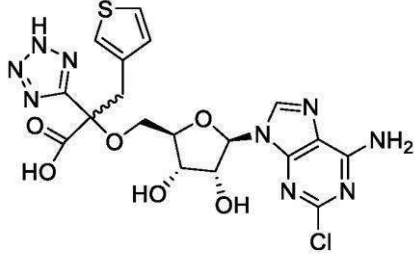
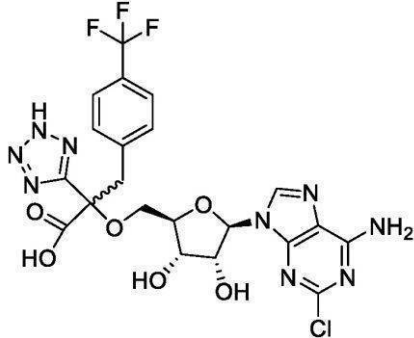
【表 7 - 2 2】

172	
173	
174	
175	
176	
177	
178	

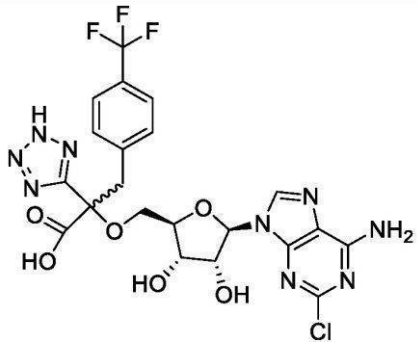
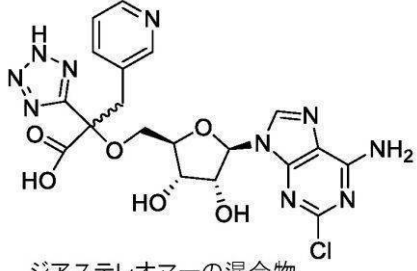
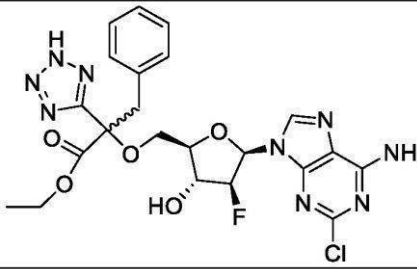
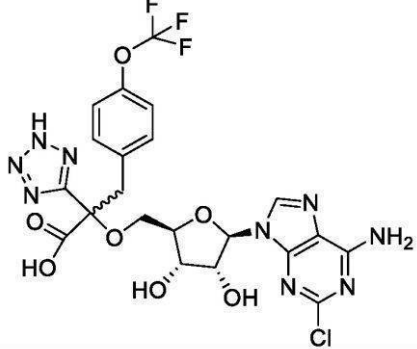
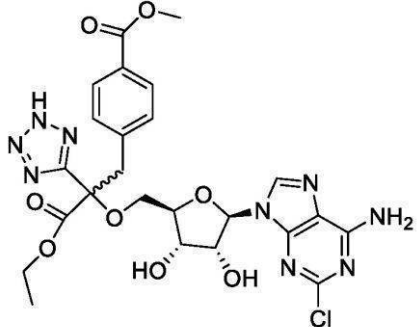
【表 7 - 2 3】

179	
180	
181	
182	
183	
184	
185	

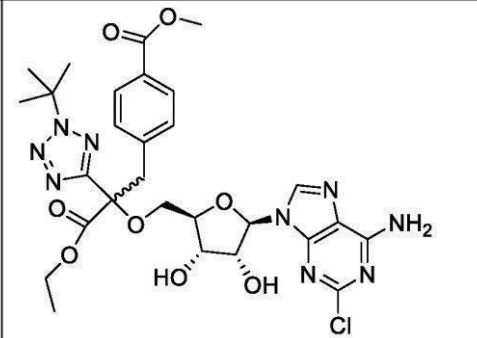
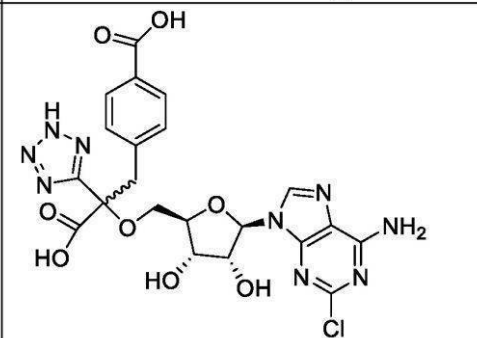
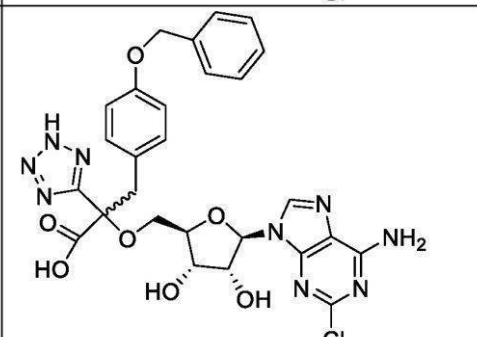
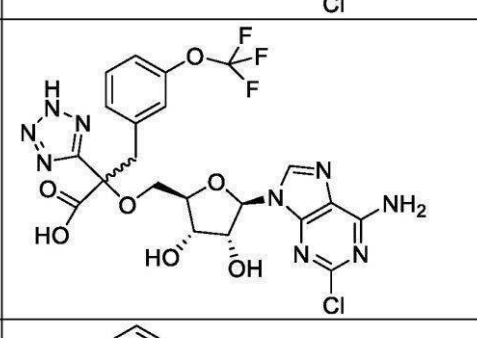
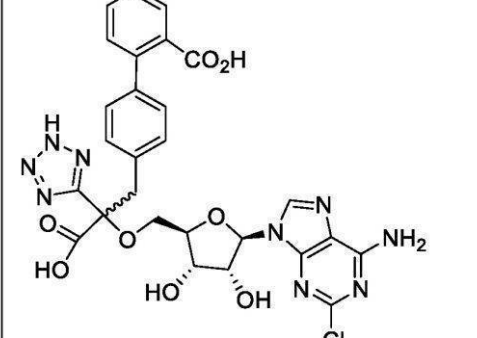
【表 7 - 2 4】

186	 <p>ジアステレオマーの混合物</p>
187	 <p>ジアステレオマーの混合物</p>
188	 <p>ジアステレオマーの混合物</p>
189	 <p>ジアステレオマーの混合物</p>
190	 <p>ジアステレオマーの混合物</p>

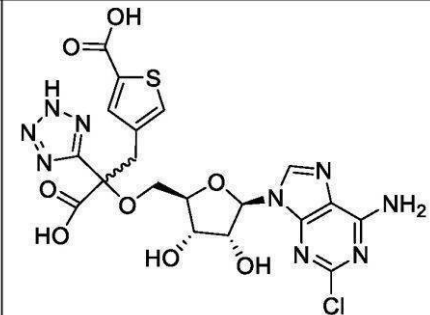
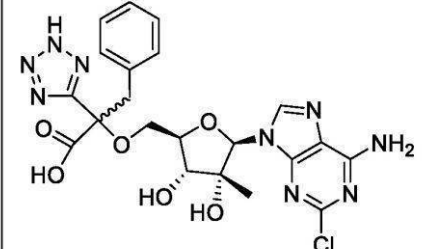
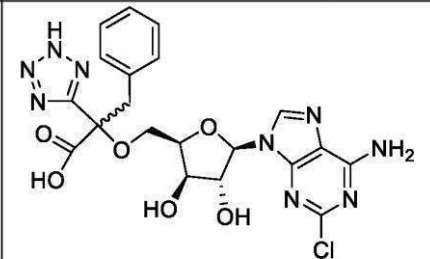
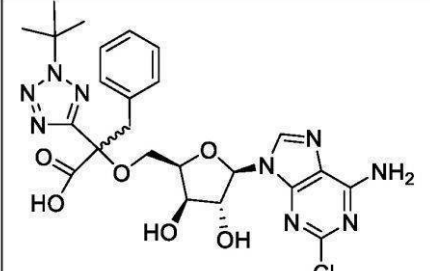
【表 7 - 2 5】

191	
192	 ジアステレオマーの混合物
193	
194	
195	

【表 7 - 2 6】

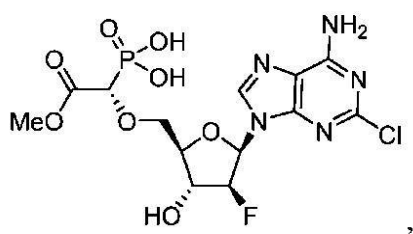
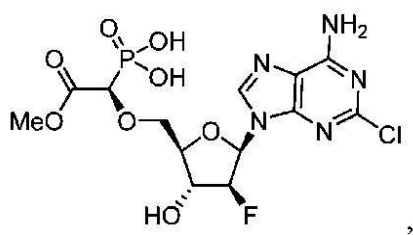
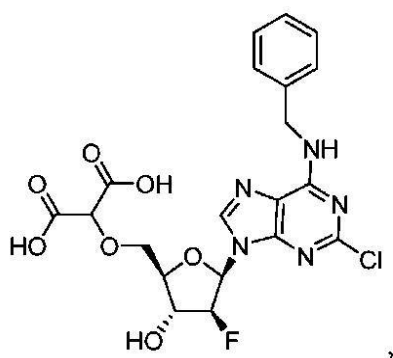
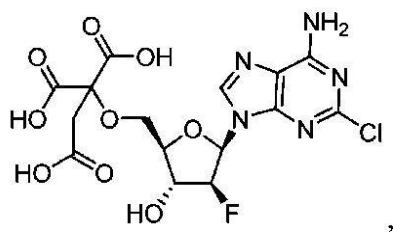
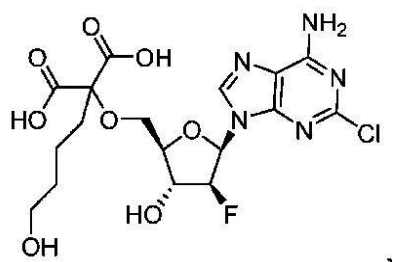
196	
197	
198	
199	
200	

【表 7 - 27】

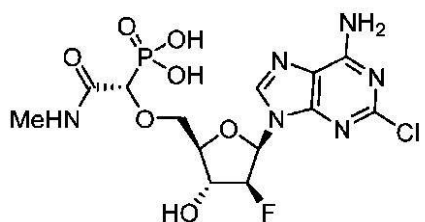
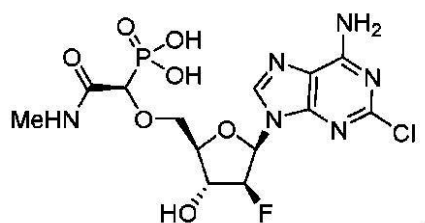
201	
202	
203	
204	

から選択される化合物またはその薬学的に許容される塩。
(請求項 1 4 8)

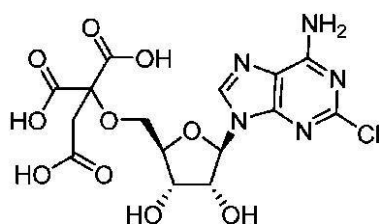
【化 2 4 3】



【化 2 4 4】



,および



から選択される化合物またはその薬学的に許容される塩。

(請求項 1 4 9)

請求項 1 から 1 4 8 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩と、1 種または複数種の薬学的に許容される賦形剤とを含む、薬学的組成物。

(請求項 1 5 0)

細胞において CD 7 3 を阻害する方法であって、前記細胞を、請求項 1 から 1 4 8 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物、またはその薬学的に許容される塩に接触させることを含む、方法。

(請求項 1 5 1)

前記細胞を接触させることが、それを必要とする対象において生じ、これによって、がん、脳および心臓の虚血性疾患、線維症、免疫および炎症性障害、炎症性腸運動障害、神経系、神経変性および CNS の障害および疾患、うつ病、パーキンソン病、ならびに睡眠障害から選択される疾患または障害を処置する、請求項 1 5 0 に記載の方法。

(請求項 1 5 2)

前記がんが、膀胱がん、骨がん、脳がん、乳がん、心臓がん、子宮頸がん、結腸がん、直腸結腸がん、食道がん、線維肉腫、胃のがん、消化器がん、頭頸部がん、カボジ肉腫、腎臓がん、白血病、肝がん、肺がん、リンパ腫、黒色腫、骨髄腫、卵巣がん、膵がん、陰茎がん、前立腺がん、精巣胚細胞性がん、胸腺腫および胸腺癌から選択される、請求項 1 5 1 に記載の方法。

(請求項 1 5 3)

前記がんが、乳がん、脳がん、結腸がん、線維肉腫、腎臓がん、肺がん、黒色腫、卵巣がん、および前立腺がんから選択される、請求項 1 5 1 または 1 5 2 に記載の方法。

(請求項 1 5 4)

前記がんが乳がんである、請求項 1 5 1 から 1 5 3 のいずれか一項に記載の方法。

(請求項 1 5 5)

1 種または複数種の追加の化学療法剤を共投与することをさらに含む、請求項 1 5 1 から 1 5 4 のいずれか一項に記載の方法。

(請求項 1 5 6)

前記 1 種または複数種の追加の化学療法剤が、1 - アミノ - 4 - フェニルアミノ - 9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - スルホネート (アシッドブルー 25)、1 - アミノ - 4 - [4 - ヒドロキシフェニル - アミノ] - 9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - スルホネート、1 - アミノ - 4 - [4 - アミノフェニルアミノ] - 9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - スルホネート、1 - アミノ - 4 - [1 - ナフチルアミノ] - 9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - スルホネート、1 - アミノ - 4 - [4 - フルオロ - 2 - カルボキシフェニルアミノ] - 9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - スルホネート、1 - アミノ - 4 - [2 - アントラセニルアミノ] - 9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - スルホネート、A B T - 263、アフアチニブジマレイン酸塩、アキシチニブ、アミノグルテチミド、アムサクリン、アナストロゾール、A P C P、アスパラギナーゼ、A Z D 5363、カルメットゲラン桿菌ワクチン (b c g)、ビカルタミド、ブレオマイシン、ボルテゾミブ、- メチレン - A D P (A O P C P)、ブセレリン、ブスルファン、カバジタキセル、カボザンチニブ、カンプトテシン、カベシタピン、カルボプラチン、カルフィルゾミブ、カルムスチン、セリチニブ、クロラムブシル、クロロキン、シスプラチン、クラドリピン、クロドロネート、コビメチニブ、コルヒチン、クリゾチニブ、シクロホスファミド、シプロテロン、シタラピン、ダカルバジン、ダクチノマイシン、ダウノルビシン、デメトキシビリジジン、デキサメタゾン、ジクロロアセテート、ジエネストロール、ジエチルスチルベストロール、ドセタキセル、ドキシソルビシン、エピルビシン、エリブリン、エルロチニブ、エストラジオール、エストラムスチン、エトボシド、エベロリムス、エキセメスタン、フィルグラスチム、フルダラビン、フルドロコルチゾン、フルオロウラシル、フルオキシメステロン、フルタミド、ゲフィチニブ、ゲムシタピン、ゲニステイン、ゴセレリン、G S K 1120212、ヒドロキシウレア、イダルビシン、イホスファミド、イマチニブ、インターフェロン、イリノテカン、イクサベピロン、レナリドミド、レトロゾール、ロイコボリン、ロイブロリド、レバミソール、ロムスチン、ロニダミン、メクロレタミン、メドロキシプロゲステロン、メゲストロール、メルファラン、メルカプトプリン、メスナ、メトホルミン、メトトレキサート、ミルテホシン、マイトマイシン、ミトタン、ミトキサントロン、M K - 2206、ムタマイシン、N - (4 - スルファモイルフェニルカルバモチオイル) ビバルアミド、N F 279、N F 449、ニルタミド、ノコダゾール、オクトレオチド、オラパリブ、オキサリプラチン、パクリタキセル、パミドロネート、バゾパニブ、ベメトレキセド、ペントスタチン、ペリホシン、P F - 04691502、プリカマイシン、ボマリドミド、ボルフイマー、P P A D S、プロカルバジン、ケルセチン、ラルチトレキセド、ラムシルマブ、反応性ブルー 2、リツキシマブ、ロロフィリン、ロミデプシン、ルカパリブ、セルメチニブ、シロリムス、2 , 4 - ジニトロベンゼンスルホン酸ナトリウム、ソラフェニブ、ストレプトゾシン、スニチニブ、スラミン、タラゾパリブ、タモキシフェン、テモゾロミド、テムシロリムス、テニボシド、テストステロン、サリドマイド、チオグアニン、チオテバ、二塩化チタノセン、トナボフィリン、トボテカン、トラメチニブ、トラスツズマブ、トレチノイン、ベリパリブ、ピンブラスチン、ピンクリスチン、ピンデシン、ビノレルビン、およびボリノスタット (S A H A) から選択される、他の実施形態では、本発明の化合物と共投与することができる化学療法剤として、A B T - 263、デキサメタゾン、5 - フルオロウラシル、P F - 04691502、ロミデプシン、およびボリノスタット (S A H A) が挙げられる、請求項 155 に記載の方法。

(請求項 157)

前記 1 種または複数種の追加の化学療法剤が、1 - アミノ - 4 - フェニルアミノ - 9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - スルホネート (アシッドブルー 25)、1 - アミノ - 4 - [4 - ヒドロキシフェニル - アミノ] - 9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - スルホネート、1 - アミノ - 4 - [4 - アミノフェニルアミノ] - 9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - スルホネート、1 - アミノ - 4 - [1 - ナフチルアミノ] - 9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒ

ドロアントラセン - 2 - スルホネート、1 - アミノ - 4 - [4 - フルオロ - 2 - カルボキシフェニルアミノ] - 9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - スルホネート、1 - アミノ - 4 - [2 - アントラセニルアミノ] - 9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - スルホネート、APCP、 - メチレン - ADP (AOPCP)、カベシタビン、クラドリビン、シタラビン、フルダラビン、ドキソルビシン、ゲムシタビン、N - (4 - スルファモイルフェニルカルバモチオイル) ピバルアミド、NF 279、NF 449、PPADS、ケルセチン、反応性ブルー 2、ロロフィリン 2、4 - ジニトロベンゼンスルホン酸ナトリウム、スマリン、およびトナボフィリンから選択される、請求項 155 に記載の方法。

(請求項 158)

前記追加の化学療法剤がイムノオンコロジー薬剤である、請求項 155 に記載の方法。