

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成25年8月8日 (2013.8.8)

【公表番号】特表2012-530703(P2012-530703A)

【公表日】平成24年12月6日 (2012.12.6)

【年通号数】公開・登録公報2012-051

【出願番号】特願2012-516072(P2012-516072)

【国際特許分類】

C 0 7 D 209/44 (2006.01)

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

C 0 7 D 217/06 (2006.01)

C 0 7 D 417/06 (2006.01)

C 0 7 D 413/06 (2006.01)

C 0 7 D 405/06 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

C 0 7 D 223/16 (2006.01)

C 0 7 D 217/04 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 409/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

A 6 1 K 31/472 (2006.01)

A 6 1 K 31/4035 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 209/44 C S P

C 0 7 D 401/06

C 0 7 D 217/06

C 0 7 D 417/06

C 0 7 D 413/06

C 0 7 D 405/06

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D 417/04

C 0 7 D 403/06  
 C 0 7 D 223/16 B  
 C 0 7 D 223/16 Z  
 C 0 7 D 217/04  
 C 0 7 D 413/14  
 C 0 7 D 409/06  
 A 6 1 K 31/4725  
 A 6 1 K 31/472  
 A 6 1 K 31/4035  
 A 6 1 K 31/55  
 A 6 1 P 43/00 1 0 5  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 35/02  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1  
 A 6 1 P 37/08  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 29/00 1 0 1  
 A 6 1 P 19/02  
 A 6 1 P 37/06  
 A 6 1 P 7/02  
 A 6 1 P 9/12  
 A 6 1 P 9/00  
 A 6 1 P 9/04

## 【手続補正書】

【提出日】平成25年6月19日(2013.6.19)

## 【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

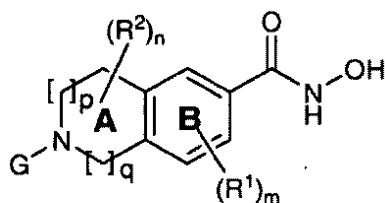
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

化学式(I)の化合物：

【化175】



(I)

またはその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで：

pは0でありかつqは3もしくは4であるか、またはpは1でありかつqは2もしくは3であるか、またはpは2でありかつqは1もしくは2であり；

Gは $-R^3$ 、 $-V_1-R^3$ 、 $-V_1-L_1-R^3$ 、 $-L_1-V_2-R^3$ 、 $-L_1-R^3$ 、または $-L_1-V_2-L_2-R^3$ であり；

$L_1$  および  $L_2$  は各々独立して非置換もしくは置換  $C_{1-3}$  アルキレン鎖であり、ここで、1 個の炭素原子が  $-CR^A = CR^A -$  で置き換えられてもよく；

$V_1$  は  $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-$ 、 $-C(O)-O-$ 、または  $-S(O)_2-$  であり；

$V_2$  は  $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-N(R^{4a})-$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-$ 、 $-N(R^{4a})-C(O)-$ 、 $-SO_2-N(R^{4a})-$ 、 $-N(R^{4a})-SO_2-$ 、 $-C(O)-O-$ 、 $-O-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-N(R^{4a})-C(O)-N(R^{4a})-$ 、 $-N(R^{4a})-C(O)-O-$ 、 $-O-C(O)-N(R^{4a})-$ 、または  $-N(R^{4a})-SO_2-N(R^{4a})-$  であり；

$R^3$  は非置換もしくは置換  $C_{1-6}$  脂肪族、または非置換もしくは置換 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

存在する  $R^A$  の各々は、独立して、水素、ハロ、または任意に置換された  $C_{1-4}$  脂肪族基であり；

存在する  $R^{4a}$  の各々は、独立して、水素、または任意に置換された  $C_{1-4}$  脂肪族基であり；

B 環は  $m$  個存在する  $R^1$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^1$  の各々は、独立して、ハロ、 $C_{1-3}$  アルキル、 $C_{1-3}$  ハロアルキル、 $-O-C_{1-3}$  アルキル、 $-O-C_{1-3}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-NHC(O)C_{1-3}$  アルキル、 $-NHC(O)NHC_{1-3}$  アルキル、または  $NHS(O)_2C_{1-3}$  アルキルであり；

A 環は  $n$  個存在する  $R^2$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、ハロ、 $C_{1-3}$  アルキル、 $C_{1-3}$  ハロアルキル、 $-O-C_{1-3}$  アルキル、 $-O-C_{1-3}$  ハロアルキル、 $-NHC(O)C_{1-3}$  アルキル、 $-NHC(O)NHC_{1-3}$  アルキル、または  $NHS(O)_2C_{1-3}$  アルキルであり；

$m$  は 0 ~ 2 であり；

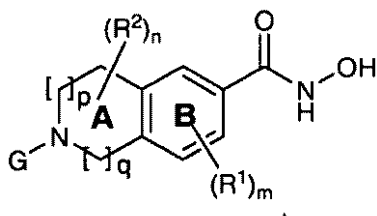
$n$  は 0 ~ 4 である、

化合物またはその薬学的に受容可能な塩。

#### 【請求項 2】

化学式 (I) の化合物：

#### 【化 176】



#### (I)

またはその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで：

$p$  は 0 でありかつ  $q$  は 3 もしくは 4 であるか、または  $p$  は 1 でありかつ  $q$  は 2 もしくは 3 であるか、または  $p$  は 2 でありかつ  $q$  は 1 もしくは 2 であり；

$G$  は  $-R^3$ 、 $-V_1-R^3$ 、 $-V_1-L_1-R^3$ 、 $-L_1-V_1-R^3$ 、 $-L_2-V_2-R^3$ 、 $-V_1-L_1-V_2-R^3$ 、または  $-L_1-R^3$  であり；

$L_1$  は非置換または置換  $C_{1-3}$  アルキレン鎖であり、ここで、1 個の炭素原子が  $-C$

$R^A = CR^A -$  で置き換えられてもよく；

$L_2$  は非置換または置換  $C_{2-3}$  アルキレン鎖であり、ここで、1 個の炭素原子が  $-CR^A = CR^A -$  で置き換えられてもよく；

$V_1$  は  $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-$ 、 $-C(O)-O-$ 、または  $-S(O)_2-$  であり；

$V_2$  は  $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-N(R^{4a})-$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-$ 、 $-N(R^{4a})-C(O)-$ 、 $-SO_2-N(R^{4a})-$ 、 $-N(R^{4a})-SO_2-$ 、 $-C(O)-O-$ 、 $-O-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-N(R^{4a})-C(O)-N(R^{4a})-$ 、 $-N(R^{4a})-C(O)-O-$ 、 $-O-C(O)-N(R^{4a})-$ 、または  $-N(R^{4a})-SO_2-N(R^{4a})-$  であり；

$R^3$  は非置換もしくは置換  $C_{1-6}$  脂肪族、または非置換もしくは置換 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

存在する  $R^A$  の各々は、独立して、水素、フルオロ、または非置換もしくは置換  $C_{1-4}$  脂肪族であり；

存在する  $R^{4a}$  の各々は、独立して、水素、または非置換もしくは置換  $C_{1-4}$  脂肪族であり；

B 環は m 個存在する  $R^1$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^1$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $-O-C_{1-4}$  アルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$  アルキル、または  $C_{1-4}$  フルオロアルキルであり；

A 環は n 個存在する  $R^2$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、 $C_{1-4}$  アルキル、または  $C_{1-4}$  フルオロアルキルであり；

m は 0 ~ 2 であり；

n は 0 ~ 4 である、

化合物またはその薬学的に受容可能な塩。

#### 【請求項 3】

請求項 2 に記載の化合物であって、ここで：

$V_1$  は  $-C(O)-$ 、 $-C(O)-NH-$ 、または  $-S(O)_2-$  であり；

$V_2$  は  $-NH-$  または  $-O-$  であり；

$R^1$  はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであり；

m は 0 ~ 1 であり；

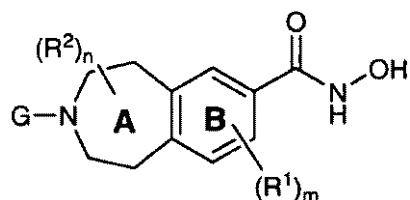
n は 0 ~ 2 である、

化合物。

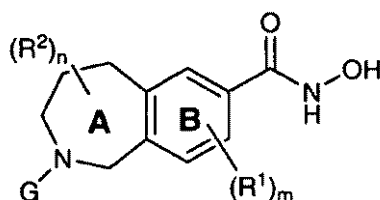
#### 【請求項 4】

化学式 (II - C) ~ (II - G) によって表される請求項 2 に記載の化合物

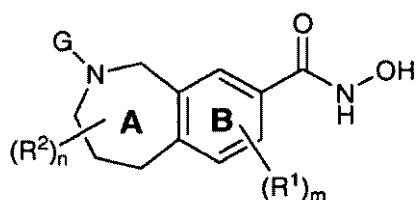
## 【化 177】



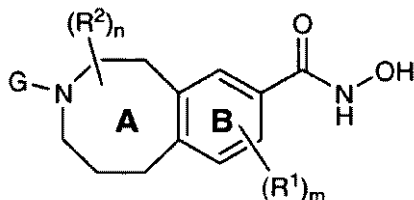
(II-C)



(II-D)

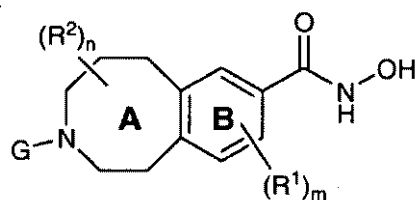


(II-E)



(II-F)

または



(II-G)

°

## 【請求項 5】

請求項 2 に記載の化合物であって、ここで：

$R^3$  は、置換されるとき、独立して存在する 1 ~ 4 個の  $-R^5$  で置換され、ここで、 $R^5$  は  $-R^{5a}$ 、 $-R^{5d}$ 、 $-L_3-R^{5d}$ 、または  $-V_3-L_3-R^{5d}$  であり；

存在する  $R^{5a}$  の各々は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim 3$  脂肪族、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{5b})_2$ 、 $-OR^{5b}$ 、 $-SR^{5c}$ 、 $-S(O)_2R^{5c}$ 、 $-S(O)R^{5c}$ 、 $-C(O)R^{5b}$ 、 $-C(O)OR^{5b}$ 、 $-C(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{5b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-N(R^{5e})C(O)R^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})SO_2R^{5c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5b})_2$ 、もしくは  $-N(R^{5e})SO_2N(R^{5b})_2$  であるか、または  $R^{5d}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{5b})_2$ 、 $-OR^{5b}$ 、 $-SR^{5c}$ 、 $-S(O)_2R^{5c}$ 、 $-S(O)R^{5c}$ 、 $-C(O)R^{5b}$ 、 $-C(O)OR^{5b}$ 、 $-C(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{5b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-N(R^{5e})C(O)R^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})SO_2R^{5c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5b})_2$ 、もしくは  $-N(R^{5e})SO_2N(R^{5b})_2$  で置換された  $C_1 \sim 4$  脂肪族であり；

存在する  $R^{5b}$  の各々は、独立して、水素であるか、または  $C_1 \sim 6$  脂肪族、もしくは 3 ~ 10 員脂環式、もしくは窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、もしくは 6 ~ 10 員アリアル、もしくは窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリアルから選択される任意に置換された基であるか；あるいは同じ窒素原子上に存在する 2 個の  $R^{5b}$  が、それらが結合している窒素原子と一緒に、窒素、酸素および硫黄から選択される 0 ~ 1 個のさらなるヘテロ原子を有する任意に置換された 4 ~ 7 員

ヘテロシクリル環を形成でき；

存在する  $R^{5c}$  の各々は、独立して、 $C_1 \sim 6$  脂肪族、または 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5d}$  の各々は、6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5dd}$  の各々は、6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5e}$  の各々は、独立して、水素または任意に置換された  $C_1 \sim 6$  脂肪族基であり；

存在する  $V_3$  の各々は、独立して、 $-N(R^{5e})$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{5e})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{5e})-$ 、 $-OC(O)N(R^{5e})-$ 、 $-N(R^{5e})C(O)-$ 、 $-N(R^{5e})SO_2-$ 、 $-N(R^{5e})C(O)O-$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5e})-$ 、 $-N(R^{5e})SO_2N(R^{5e})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または  $-C(O)N(R^{5e})O-$  であり；

$L_3$  は任意に置換された  $C_1 \sim 3$  アルキレン鎖であり、ここで、1 個の炭素原子が  $-C(R^A) = C(R^A)-$  で置き換えられてもよい、

化合物。

#### 【請求項 6】

請求項 5 に記載の化合物であって、ここで：

$G$  は  $-[C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$ 、 $-C(O) - [C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$ 、 $-C(O) - NH - [C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$ 、 $-S(O)_2 - [C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$ 、 $-[C(R^6)(R^{6'})]_y - V_{2a} - R^3$ 、または  $-C(O) - C(R^6)(R^{6'}) - V_{2a} - R^3$  であり、

$R^6$  は水素、 $C_1 \sim 4$  脂肪族、 $C_3 \sim 6$  脂環式、もしくは 6 ~ 10 員アリールであり；

$R^{6'}$  は水素、 $C_1 \sim 4$  脂肪族、 $C_3 \sim 6$  脂環式、もしくは 6 ~ 10 員アリールであるか；または

$R^6$  および  $R^{6'}$  は、一緒になって、 $C_3 \sim 6$  脂環式基を形成し；

$V_{2a}$  は  $-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-N(R^{4a})-$ 、または  $-C(O)N(R^{4a})-$  であり；

$V_{2a'}$  は  $-O-$ 、 $-S-$ 、または  $-N(R^{4a})-$  であり；

$R^1$  はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであり；

$m$  は 0 ~ 1 であり；

$n$  は 0 ~ 2 であり；

$y$  は 2 ~ 3 であり；

$z$  は 0 ~ 3 である、

化合物。

#### 【請求項 7】

請求項 6 に記載の化合物であって、ここで：

$G$  は  $-[C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$ 、 $-C(O) - [C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$ 、または  $-S(O)_2 - [C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$  であり；

$m$  は 0 であり；

$n$  は 0 であり ;

$z$  は 0 ~ 1 であり ;

$R^3$  は  $-R^{3a}$  であり ;

$R^{3a}$  は非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり ; ここで、 $R^{3a}$  は、置換される場合には、0 ~ 1 個存在する  $-R^{5a}$  および 1 個存在する  $-R^{5d}$  で置換され ;

$R^{5a}$  はクロロ、フルオロ、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $-O-C_{1-6}$  アルキル、 $-O-C_{1-6}$  フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $-NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、 $-NHC_{1-6}$  アルキル、 $-N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $-C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-C(O)N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $-NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-NHC(O)N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、または  $-NHS(O)_2C_{1-6}$  アルキルであり ;

$R^{5d}$  は非置換であるかまたは 1 ~ 2 個存在する  $-R^{7a}$  で置換され ;

存在する  $R^{7a}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、ブロモ、ヨード、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $-O-C_{1-6}$  アルキル、 $-O-C_{1-6}$  フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $-NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、 $-NHC_{1-6}$  アルキル、 $-N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $-C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-C(O)N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $-NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-NHC(O)N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、または  $-NHS(O)_2C_{1-6}$  アルキルである、化合物。

#### 【請求項 8】

請求項 6 に記載の化合物であって、ここで :

$m$  は 0 であり ;

$n$  は 0 であり ;

$R^3$  は  $-R^{3d}$  であり ;

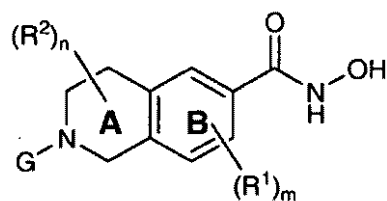
$R^{3d}$  は非置換もしくは置換  $C_{1-6}$  脂肪族、または非置換もしくは置換 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり ; ここで、 $R^{3d}$  は、置換される場合には、1 ~ 2 個存在する  $-R^{5a}$  で置換され ;

存在する  $R^{5a}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $-O-C_{1-6}$  アルキル、 $-O-C_{1-6}$  フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $-NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、 $-NHC_{1-6}$  アルキル、 $-N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $-C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-C(O)N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $-NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-NHC(O)N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、または  $-NHS(O)_2C_{1-6}$  アルキルである、化合物。

#### 【請求項 9】

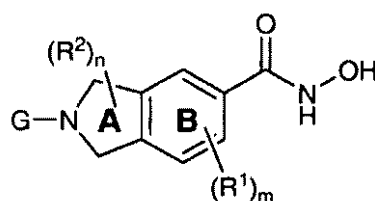
化学式 (II-A) または (II-B) の化合物 :

#### 【化 178】



(II-A)

または



(II-B)

またはその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで：

G は  $-R^3$ 、 $-V_1-R^3$ 、 $-V_1-L_1-R^3$ 、 $-L_1-V_2-R^3$ 、 $-L_1-R^3$ 、  
または  $-L_1-V_2-L_2-R^3$  であり；

$L_1$  および  $L_2$  は、各々独立して、非置換もしくは置換  $C_{1-3}$  アルキレン鎖であり、  
ここで、1 個の炭素原子が  $-CR^A=CR^A-$  で置き換えられてもよく；

$V_1$  は  $-S(O)_2-$  であり；

$V_2$  は  $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-N(R^{4a})-$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-$ 、  
 $-N(R^{4a})-C(O)-$ 、 $-SO_2-N(R^{4a})-$ 、 $-N(R^{4a})-SO_2-$ 、  
 $-C(O)-O-$ 、 $-O-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、  
 $-N(R^{4a})-C(O)-N(R^{4a})-$ 、 $-N(R^{4a})-C(O)-O-$ 、  
 $O-C(O)-N(R^{4a})-$ 、または  $-N(R^{4a})-SO_2-N(R^{4a})-$  であり；

$R^3$  は非置換もしくは置換  $C_{1-6}$  脂肪族、または非置換もしくは置換 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

存在する  $R^A$  の各々は、独立して、水素、ハロ、または任意に置換された  $C_{1-4}$  脂肪族基であり；

存在する  $R^{4a}$  の各々は、独立して、水素、または任意に置換された  $C_{1-4}$  脂肪族基であり；

B 環は m 個存在する  $R^1$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^1$  の各々は、独立して、ハロ、 $C_{1-3}$  アルキル、 $C_{1-3}$  ハロアルキル、  
 $-O-C_{1-3}$  アルキル、 $-O-C_{1-3}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-NHC(O)C_{1-3}$  アルキル、  
 $-NHC(O)NHC_{1-3}$  アルキル、または  $NHS(O)_2C_{1-3}$  アルキルであり；

A 環は、n 個存在する  $R^2$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、ハロ、 $C_{1-3}$  アルキル、 $C_{1-3}$  ハロアルキル、  
 $-O-C_{1-3}$  アルキル、 $-O-C_{1-3}$  ハロアルキル、 $-NHC(O)C_{1-3}$  アルキル、  
 $-NHC(O)NHC_{1-3}$  アルキル、または  $NHS(O)_2C_{1-3}$  アルキルであり；

m は 0 ~ 2 であり；

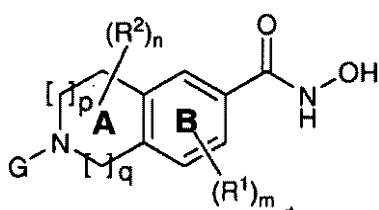
n は 0 ~ 4 である、

化合物。

【請求項 10】

化学式 (I) の化合物：

【化 179】



(I)

またはその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで：

p は 0 でありかつ q は 1 であるか、または p は 1 でありかつ q は 1 であり；

G は - R<sup>3</sup>、- V<sub>1</sub> - R<sup>3</sup>、- V<sub>1</sub> - L<sub>1</sub> - R<sup>3</sup>、- L<sub>1</sub> - V<sub>1</sub> - R<sup>3</sup>、- L<sub>2</sub> - V<sub>2</sub> - R<sup>3</sup>、- V<sub>1</sub> - L<sub>1</sub> - V<sub>2</sub> - R<sup>3</sup>、または - L<sub>1</sub> - R<sup>3</sup> であり；

L<sub>1</sub> は任意に置換された C<sub>1</sub> ~ 3 アルキレン鎖であり、ここで、1 個の炭素原子が - C R<sup>A</sup> = C R<sup>A</sup> - で置き換えられてもよく；

L<sub>2</sub> は任意に置換された C<sub>2</sub> ~ 3 アルキレン鎖であり、ここで、1 個の炭素原子が - C R<sup>A</sup> = C R<sup>A</sup> - で置き換えられてもよく；

V<sub>1</sub> は - C ( S ) - または - S ( O )<sub>2</sub> - であり；

V<sub>2</sub> は - C ( O ) - 、 - C ( S ) - 、 - N ( R<sup>4 a</sup> ) - 、 - C ( O ) - N ( R<sup>4 a</sup> ) - 、 - N ( R<sup>4 a</sup> ) - C ( O ) - 、 - S O<sub>2</sub> - N ( R<sup>4 a</sup> ) - 、 - N ( R<sup>4 a</sup> ) - S O<sub>2</sub> - 、 - C ( O ) - O - 、 - O - C ( O ) - 、 - O - 、 - S - 、 - S ( O ) - 、 - S ( O )<sub>2</sub> - 、 - N ( R<sup>4 a</sup> ) - C ( O ) - N ( R<sup>4 a</sup> ) - 、 - N ( R<sup>4 a</sup> ) - C ( O ) - O - 、 - O - C ( O ) - N ( R<sup>4 a</sup> ) - 、または - N ( R<sup>4 a</sup> ) - S O<sub>2</sub> - N ( R<sup>4 a</sup> ) - であり；

R<sup>3</sup> は非置換もしくは置換 C<sub>1</sub> ~ 6 脂肪族、または非置換もしくは置換 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

存在する R<sup>A</sup> の各々は、独立して、水素、フルオロ、または非置換もしくは置換 C<sub>1</sub> ~ 4 脂肪族であり；

存在する R<sup>4 a</sup> の各々は、独立して、水素、または非置換もしくは置換 C<sub>1</sub> ~ 4 脂肪族であり；

B 環は m 個存在する R<sup>1</sup> で任意にさらに置換され；

存在する R<sup>1</sup> の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、- O - C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、または C<sub>1</sub> ~ 4 フルオロアルキルであり；

A 環は n 個存在する R<sup>2</sup> で任意にさらに置換され；

存在する R<sup>2</sup> の各々は、独立して、フルオロ、C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、または C<sub>1</sub> ~ 4 フルオロアルキルであり；

m は 0 ~ 2 であり；

n は 0 ~ 4 である、

化合物。

#### 【請求項 11】

請求項 10 に記載の化合物であって、ここで：

G は - R<sup>3</sup>、- V<sub>1</sub> - R<sup>3</sup>、または - L<sub>1</sub> - R<sup>3</sup> であり；かつ

V<sub>1</sub> は - S ( O )<sub>2</sub> - であり；

R<sup>1</sup> はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する R<sup>2</sup> の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであり；

m は 0 ~ 1 であり；

n は 0 ~ 2 である、

化合物。

#### 【請求項 12】

請求項 10 に記載の化合物であって、ここで：

R<sup>3</sup> は、置換される場合、独立して存在する 1 ~ 4 個の - R<sup>5</sup> で置換され、ここで、R<sup>5</sup> は - R<sup>5 a</sup>、- R<sup>5 d</sup>、- L<sub>3</sub> - R<sup>5 d</sup>、または - V<sub>3</sub> - L<sub>3</sub> - R<sup>5 d</sup> であり；

存在する R<sup>5 a</sup> の各々は、独立して、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ 3 脂肪族、- C N、- N O<sub>2</sub>、- N ( R<sup>5 b</sup> )<sub>2</sub>、- O R<sup>5 b</sup>、- S R<sup>5 c</sup>、- S ( O )<sub>2</sub> R<sup>5 c</sup>、- S ( O ) R<sup>5 c</sup>、- C ( O ) R<sup>5 b</sup>、- C ( O ) O R<sup>5 b</sup>、- C ( O ) N ( R<sup>5 b</sup> )<sub>2</sub>、- S ( O )<sub>2</sub> N ( R<sup>5 b</sup> )<sub>2</sub>、- O C ( O ) N ( R<sup>5 b</sup> )<sub>2</sub>、- N ( R<sup>5 e</sup> ) C ( O ) R<sup>5 b</sup>、- N ( R<sup>5</sup>

$e$ )  $SO_2 R^{5c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5b})_2$ 、もしくは  $N(R^{5e})SO_2 N(R^{5b})_2$  であるか、または  $R^{5dd}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{5b})_2$ 、 $-OR^{5b}$ 、 $-SR^{5c}$ 、 $-S(O)_2 R^{5c}$ 、 $-S(O)R^{5c}$ 、 $-C(O)R^{5b}$ 、 $-C(O)OR^{5b}$ 、 $-C(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-S(O)_2 N(R^{5b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-N(R^{5e})C(O)R^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})SO_2 R^{5c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5b})_2$ 、もしくは  $-N(R^{5e})SO_2 N(R^{5b})_2$  で置換された  $C_1 \sim 4$  脂肪族であり；

存在する  $R^{5b}$  の各々は、独立して、水素であるか、または  $C_1 \sim 6$  脂肪族、もしくは 3 ~ 10 員脂環式、もしくは窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、もしくは 6 ~ 10 員アリール、もしくは窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であるか；あるいは同じ窒素原子上に存在する 2 個の  $R^{5b}$  が、それらが結合している窒素と一緒に、窒素、酸素および硫黄から選択される 0 ~ 1 個のさらなるヘテロ原子を有する任意に置換された 4 ~ 7 員ヘテロシクリル環を形成でき；

存在する  $R^{5c}$  の各々は、独立して、 $C_1 \sim 6$  脂肪族、または 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5d}$  の各々は、6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5dd}$  の各々は、6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5e}$  の各々は、独立して、水素または任意に置換された  $C_1 \sim 6$  脂肪族基であり；

存在する  $V_3$  の各々は、独立して、 $-N(R^{5e})$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{5e})-$ 、 $-S(O)_2 N(R^{5e})-$ 、 $-OC(O)N(R^{5e})-$ 、 $-N(R^{5e})C(O)-$ 、 $-N(R^{5e})SO_2-$ 、 $-N(R^{5e})C(O)O-$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5e})-$ 、 $-N(R^{5e})SO_2 N(R^{5e})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または  $-C(O)N(R^{5e})O-$  であり；

$L_3$  は任意に置換された  $C_1 \sim 3$  アルキレン鎖であり、ここで、1 個の炭素原子が  $-CR^A = CR^A-$  で置き換えられてもよい、化合物。

### 【請求項 13】

請求項 12 に記載の化合物であって、ここで：

$G$  は  $-[C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$ 、 $-[C(R^6)(R^{6'})]_y - V_{2a} - R^3$ 、 $-S(O)_2 - [C(R^6)(R^{6'})]_y - V_{2a} - R^3$ 、 $-S(O)_2 - C(R^6)(R^{6'}) - V_{2a} - R^3$ 、または  $-S(O)_2 - [C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$  であり；

$R^6$  は水素、 $C_1 \sim 4$  脂肪族、 $C_3 \sim 6$  脂環式、もしくは 6 ~ 10 員アリールであり；

$R^{6'}$  は水素、 $C_1 \sim 4$  脂肪族、 $C_3 \sim 6$  脂環式、もしくは 6 ~ 10 員アリールであるか；または

$R^6$  および  $R^{6'}$  は、一緒になって、 $C_3 \sim 6$  脂環式基を形成し；

$V_{2a}$  は  $-O-$  または  $-NH-$  であり；

$R^1$  はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメ

トキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであり；

$m$  は 0 ~ 1 であり；

$n$  は 0 ~ 2 であり；

$y$  は 2 ~ 3 であり；

$z$  は 0 ~ 3 である、

化合物。

【請求項 14】

請求項 13 に記載の化合物であって、ここで：

$G$  は  $- [C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$  または  $- S(O)_2 - [C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$  であり；

$m$  は 0 であり；

$n$  は 0 であり；

$z$  は 0 ~ 1 であり；

$R^3$  は  $- R^{3a}$  であり；

$R^{3a}$  は非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；ここで、 $R^{3a}$  は、置換される場合、0 ~ 1 個存在する  $- R^{5a}$  および 1 個存在する  $- R^{5d}$  で置換され；

存在する  $R^{5a}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $- O - C_{1-6}$  アルキル、 $- O - C_{1-6}$  フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $- NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、 $- NHC_{1-6}$  アルキル、 $- N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $- C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $- C(O)N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $- NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $- NHC(O)N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、または  $- NHS(O)_2C_{1-6}$  アルキルであり；

$R^{5d}$  は非置換であるかまたは 1 ~ 2 個存在する  $- R^{7a}$  で置換され；

存在する  $R^{7a}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、ブromo、ヨード、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $- O - C_{1-6}$  アルキル、 $- O - C_{1-6}$  フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $- NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、 $- NHC_{1-6}$  アルキル、 $- N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $- C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $- C(O)N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $- NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $- NHC(O)N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、または  $- NHS(O)_2C_{1-6}$  アルキルである、化合物。

【請求項 15】

$p$  が 1 でありかつ  $q$  が 1 である、請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 16】

請求項 13 に記載の化合物であって、ここで：

$m$  は 0 であり；

$n$  は 0 であり；

$R^3$  は  $- R^{3d}$  であり；

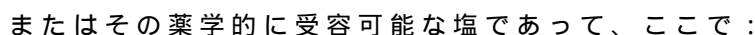
$R^{3d}$  は非置換もしくは置換  $C_{1-6}$  脂肪族、または非置換もしくは置換 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；ここで、 $R^{3d}$  は、置換される場合、独立して存在する 0 ~ 2 個の  $- R^{5a}$  で置換され；

存在する  $R^{5a}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $- O - C_{1-6}$  アルキル、 $- O - C_{1-6}$  フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $- NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、 $- NHC_{1-6}$  アルキル、 $- N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $- C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $- C(O)N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $- NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $- NHC(O)N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、または  $- NHS(O)_2C_{1-6}$  アルキルである、化合物。

【請求項 17】

【請求項 18】

【化 1 8 0】



か；または

ここで、存在する  $R^6$  の少なくとも 1 個は  $R^{6^*}$  であり；

R<sup>6</sup> は C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> 脂肪族、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> 脂環式、または 6 ~ 10 員アリールであり；

$$R^3 \text{ は } -R^3 \text{ d であり;} \\$$

R<sup>3d</sup> は非置換もしくは置換 C<sub>1</sub> ~<sub>6</sub> 脂肪族、または非置換もしくは置換 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；ここで、R<sup>3d</sup> は、置換される場合、独立して存在する 0 ~ 2 個の - R<sup>5a</sup> で置換され；

存在する  $R^{5a}$  の各々は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim 3$  脂肪族、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{5b})_2$ 、 $-OR^{5b}$ 、 $-SR^{5c}$ 、 $-S(O)_2R^{5c}$ 、 $-S(O)R^{5c}$ 、 $-C(O)R^{5b}$ 、 $-C(O)OR^{5b}$ 、 $-C(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{5b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-N(R^{5e})C(O)R^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})SO_2R^{5c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5b})_2$  もしくは  $-N(R^{5e})SO_2N(R^{5b})_2$  であるか、または  $R^{5d}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{5b})_2$ 、 $-OR^{5b}$ 、 $-SR^{5c}$ 、 $-S(O)_2R^{5c}$ 、 $-S(O)R^{5c}$ 、 $-C(O)R^{5b}$ 、 $-C(O)OR^{5b}$ 、 $-C(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{5b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-N(R^{5e})C(O)R^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})SO_2R^{5c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5b})_2$  もしくは  $-N(R^{5e})SO_2N(R^{5b})_2$  で置換された  $C_1 \sim 4$  脂肪族であり；

存在する R<sup>5b</sup> の各々は、独立して、水素であるか、または C<sub>1</sub> ~ 6 脂肪族、もしくは 3 ~ 10 員脂環式、もしくは窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、もしくは 6 ~ 10 員アリール、もしくは窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であるか；あるいは同じ窒素原子上に存

在する 2 個の  $R^{5b}$  は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄から選択される 0 ~ 1 個のさらなるヘテロ原子を有する任意に置換された 4 ~ 7 員ヘテロシクリル環を形成し；

存在する  $R^{5c}$  の各々は、独立して、 $C_{1-6}$  脂肪族、または 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5d}$  の各々は、6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5e}$  の各々は、独立して、水素または任意に置換された  $C_{1-6}$  脂肪族基であり；

u は 1 ~ 2 であり；

B 環は m 個存在する  $R^1$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^1$  の各々は、独立して、ハロ、 $C_{1-3}$  アルキル、 $C_{1-3}$  ハロアルキル、 $-O-C_{1-3}$  アルキル、 $-O-C_{1-3}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-NHC(O)C_{1-3}$  アルキル、 $-NHC(O)NHC_{1-3}$  アルキル、または  $NHS(O)_2C_{1-3}$  アルキルであり；

A 環は n 個存在する  $R^2$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、ハロ、 $C_{1-3}$  アルキル、 $C_{1-3}$  ハロアルキル、 $-O-C_{1-3}$  アルキル、 $-O-C_{1-3}$  ハロアルキル、 $-NHC(O)C_{1-3}$  アルキル、 $-NHC(O)NHC_{1-3}$  アルキル、または  $NHS(O)_2C_{1-3}$  アルキルであり；

m は 0 ~ 2 であり；

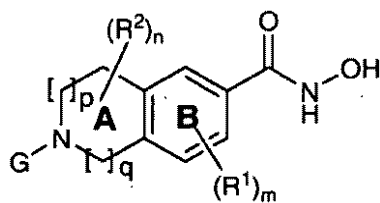
n は 0 ~ 4 である、

化合物。

【請求項 19】

化学式 (I) の化合物：

【化 181】



(I)

またはその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで：

p は 0 でありかつ q は 1 であるか、または p は 1 でありかつ q は 1 であり；

G は  $-C(O)-[C(R^6)(R^{6'})]_{zz}-R^{3g}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-[C(R^6)(R^{6'})]_{zz}-R^{3g}$ 、 $-C(O)-O-[C(R^6)(R^{6'})]_{zz}-R^{3g}$ 、 $-C(O)-C(R^6)(R^{6'})-V_{2a}-R^{3g}$ 、 $-C(O)-[C(R^6)(R^{6'})]_{yy}-V_{2a}-R^{3g}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-[C(R^6)(R^{6'})]_{yy}-V_{2a}-R^{3g}$ 、または  $-C(O)-O-[C(R^6)(R^{6'})]_{yy}-V_{2a}-R^{3g}$  であり；

$R^6$  は水素、 $C_{1-4}$  脂肪族、 $C_{3-6}$  脂環式、もしくは 6 ~ 10 員アリールであり；

$R^{6'}$  は水素、 $C_{1-4}$  脂肪族、 $C_{3-6}$  脂環式、もしくは 6 ~ 10 員アリールである

存在する R<sup>5a</sup> の各々は、独立して、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~<sub>3</sub> 脂肪族、-CN、-NO<sub>2</sub>、  
-N(R<sup>5b</sup>)<sub>2</sub>、-OR<sup>5b</sup>、-SR<sup>5c</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>5c</sup>、-S(O)R<sup>5c</sup>、  
-C(O)R<sup>5b</sup>、-C(O)OR<sup>5b</sup>、-C(O)N(R<sup>5b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>5b</sup>)<sub>2</sub>、  
-OC(O)N(R<sup>5b</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>5e</sup>)C(O)R<sup>5b</sup>、-N(R<sup>5</sup>

$e$ )  $SO_2 R^{5c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5b})_2$ 、もしくは $-N(R^{5e})SO_2 N(R^{5b})_2$ であるか、または $R^{5dd}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{5b})_2$ 、 $-OR^{5b}$ 、 $-SR^{5c}$ 、 $-S(O)_2 R^{5c}$ 、 $-S(O)R^{5c}$ 、 $-C(O)R^{5b}$ 、 $-C(O)OR^{5b}$ 、 $-C(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-S(O)_2 N(R^{5b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-N(R^{5e})C(O)R^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})SO_2 R^{5c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5b})_2$ もしくは $-N(R^{5e})SO_2 N(R^{5b})_2$ で置換された $C_1 \sim 4$ 脂肪族であり；

存在する $R^{5b}$ の各々は、独立して、水素であるか、または $C_1 \sim 6$ 脂肪族、もしくは3～10員脂環式、もしくは窒素、酸素および硫黄から独立して選択される1～4個のヘテロ原子を有する4～10員ヘテロシクリル、もしくは6～10員アリール、もしくは窒素、酸素および硫黄から独立して選択される1～5個のヘテロ原子を有する5～10員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であるか；あるいは同じ窒素原子上に存在する2個の $R^{5b}$ は、これらが結合している窒素原子と一緒に、窒素、酸素および硫黄から選択される0～1個のさらなるヘテロ原子を有する任意に置換された4～7員ヘテロシクリル環を形成でき；

存在する $R^{5c}$ の各々は、独立して、 $C_1 \sim 6$ 脂肪族、または3～10員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される1～4個のヘテロ原子を有する4～10員ヘテロシクリル、または6～10員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される1～5個のヘテロ原子を有する5～10員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する $R^{5d}$ の各々は、6～10員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される1～5個のヘテロ原子を有する5～10員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する $R^{5dd}$ の各々は、6～10員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される1～5個のヘテロ原子を有する5～10員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する $R^{5e}$ の各々は、独立して、水素または任意に置換された $C_1 \sim 6$ 脂肪族基であり；

存在する $V_3$ の各々は、独立して、 $-N(R^{5e})$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{5e})-$ 、 $-S(O)_2 N(R^{5e})-$ 、 $-OC(O)N(R^{5e})-$ 、 $-N(R^{5e})C(O)-$ 、 $-N(R^{5e})SO_2-$ 、 $-N(R^{5e})C(O)O-$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5e})-$ 、 $-N(R^{5e})SO_2 N(R^{5e})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{5e})-O-$ であり；

$L_3$ は、任意に置換された $C_1 \sim 3$ アルキレン鎖であり、ここで、1個の炭素原子は $-CR^A = CR^A-$ で置き換えられてもよい、化合物。

## 【請求項22】

請求項21に記載の化合物であって、ここで：

$G$ は $-C(O)-[C(R^6)(R^{6'})]_{zz}-R^{3g}$ 、 $-C(O)-NH-[C(R^6)(R^{6'})]_{zz}-R^{3g'}$ 、 $-C(O)-[C(R^6)(R^{6'})]_{yy}-V_{2a}-R^{3g}$ 、または $-C(O)-C(R^6)(R^{6'})-V_{2a}-R^{3g}$ であり；

$R^6$ は水素もしくは $C_1 \sim 4$ 脂肪族であり；

$R^{6'}$ は水素もしくは $C_1 \sim 4$ 脂肪族であるか；または

$R^6$ および $R^{6'}$ は、一緒になって、 $C_3 \sim 6$ 脂環式基を形成し；

$R^{6''}$ は $C_1 \sim 4$ 脂肪族であり；

$V_{2a}$ は $-O-$ または $-NH-$ であり；

$V_{2a'}$ は $-O-$ または $-NH-$ であり；

$R^1$ はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメ

トキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであり；

$m$  は 0 ~ 1 であり；

$n$  は 0 ~ 2 である、

化合物。

【請求項 23】

請求項 22 に記載の化合物であって、ここで：

$G$  は  $-C(O)-C(R^6)(R^{6'})-R^{3g}$  であり；

$m$  は 0 であり；

$n$  は 0 であり；

$R^{3g}$  は、置換される場合、0 ~ 1 個存在する  $-R^{5a}$  および 1 個存在する  $-R^{5d}$  で置換され；

$R^{5a}$  はクロロ、フルオロ、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $-O-C_{1-6}$  アルキル、 $-O-C_{1-6}$  フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $-NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、 $-NHC_{1-6}$  アルキル、 $-N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、 $-C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-C(O)N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、 $-NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-NHC(O)N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、または  $-NHS(O)_2C_{1-6}$  アルキルであり；

$R^{5d}$  は非置換もしくは 1 ~ 2 個存在する  $-R^{7a}$  で置換され；

存在する  $R^{7a}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、ブromo、ヨード、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $-O-C_{1-6}$  アルキル、 $-O-C_{1-6}$  フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $-NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、 $-NHC_{1-6}$  アルキル、 $-N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、 $-C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-C(O)N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、 $-NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-NHC(O)N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、または  $-NHS(O)_2C_{1-6}$  アルキルである、

化合物。

【請求項 24】

$p$  が 1 でありかつ  $q$  が 1 である、請求項 23 に記載の化合物。

【請求項 25】

請求項 22 に記載の化合物であって、ここで：

$G$  は  $-C(O)-C(R^6)(R^{6'})-R^{3g}$  であり；

$m$  は 0 であり；

$n$  は 0 であり；

$R^{3g}$  は、置換される場合、0 ~ 2 個存在する  $-R^{5a}$  で置換され；

存在する  $R^{5a}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $-O-C_{1-6}$  アルキル、 $-O-C_{1-6}$  フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $-NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、 $-NHC_{1-6}$  アルキル、 $-N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、 $-C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-C(O)N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、 $-NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-NHC(O)N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、または  $-NHS(O)_2C_{1-6}$  アルキルである、

化合物。

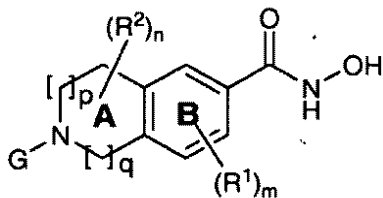
【請求項 26】

$p$  が 1 でありかつ  $q$  が 1 である、請求項 25 に記載の化合物。

【請求項 27】

化学式 (I) の化合物：

## 【化 1 8 2】



(I)

またはその薬学的に受容可能な塩であって、ここで：

p は 0 でありかつ q は 1 であるか、または p は 1 でありかつ q は 1 であり；

G は  $-C(O)-(CH_2)_z-z-R^{3e}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-(CH_2)_z-z-R^{3e}$ 、 $-C(O)-O-(CH_2)_z-z-R^{3e}$ 、 $-C(O)-CH_2-V_{2a}$ 、 $-R^{3e}$ 、 $-C(O)-(CH_2)_y-y-V_{2a}-R^{3e}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-(CH_2)_y-y-V_{2a}-R^{3e}$ 、または  $-C(O)-O-(CH_2)_y-y-V_{2a}-R^{3e}$  であり、

$R^{3e}$  は非置換もしくは置換 7 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 7 ~ 10 員ヘテロシクリル、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 3 ~ 5 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

$V_{2a}$  は  $-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-N(R^{4a})-$ 、または  $-C(O)N(R^{4a})-$  であり；

$V_{2a}$  は  $-O-$ 、 $-S-$ 、または  $-N(R^{4a})-$  であり；

存在する  $R^{4a}$  の各々は、独立して、水素、または非置換もしくは置換  $C_{1-4}$  脂肪族であり；

B 環は m 個存在する  $R^1$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^1$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $-O-C_{1-4}$  アルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$  アルキル、または  $C_{1-4}$  フルオロアルキルであり；

A 環は n 個存在する  $R^2$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、 $C_{1-4}$  アルキル、または  $C_{1-4}$  フルオロアルキルであり；

z z は 0 ~ 3 であり；

y y は 2 ~ 3 であり；

m は 0 ~ 2 であり；

n は 0 ~ 4 である、

化合物。

## 【請求項 2 8】

請求項 2 7 に記載の化合物であって、ここで：

$R^1$  はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであり；

m は 0 ~ 1 であり；

n は 0 ~ 2 である、

化合物。

## 【請求項 2 9】

請求項 2 7 に記載の化合物であって、ここで：

$R^{3e}$  は、置換される場合、0 ~ 1 個存在する  $-R^{5a}$  および 0 ~ 1 個存在する  $-R^{5d}$  で置換され；

存在する  $R^{5a}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $-O-C_{1-6}$  アルキル、 $-O-C_{1-6}$  フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $-NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、 $-NHC_{1-6}$  アルキル、 $-N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、 $-C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-C(O)N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、 $-NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-NHC(O)N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、または  $-NHS(O)_2C_{1-6}$  アルキルであり；

存在する  $R^{5d}$  の各々は、6～10員アリアル、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される1～5個のヘテロ原子を有する5～10員ヘテロアリアルから選択される任意に置換された基であり；ここで、 $R^{5d}$  は、置換される場合、1～2個存在する  $-R^{7a}$  で置換され；

存在する  $R^{7a}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、ブロモ、ヨード、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $-O-C_{1-6}$  アルキル、 $-O-C_{1-6}$  フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $-NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、 $-NHC_{1-6}$  アルキル、 $-N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、 $-C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-C(O)N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、 $-NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-NHC(O)N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、または  $-NHS(O)_2C_{1-6}$  アルキルである、化合物。

#### 【請求項30】

請求項29に記載の化合物であって、ここで：

$G$  は  $-C(O)-R^{3e}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-R^{3e}$ 、 $-C(O)-O-R^{3e}$ 、 $-C(O)-CH_2-R^{3e}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-CH_2-R^{3e}$ 、または  $-C(O)-O-CH_2-R^{3e}$  であり；

$R^{3e}$  はトリアゾリル、チアジアゾリル、オキサジアゾリル、ベンゾチアジアゾリル、2, 3-4H-フロ[3, 2-b]ピロリル、ピラゾロピリミジニル、プリニル、プテリジニル、キヌクリジニル、ジアゼピニル、デカヒドロキノリニル、オキサゼピニル、チアゼピニル、オキサゼピニル、チアゼピニル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロヘプテニル、シクロオクテニル、ビシクロヘプタニル、ビシクロオクタニル、キヌクリジニル、またはアダマンチルである、化合物。

#### 【請求項31】

請求項29に記載の化合物であって、ここで：

$R^1$  はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであり；

$m$  は0～1であり；

$n$  は0～2であり；

$p$  は1であり；

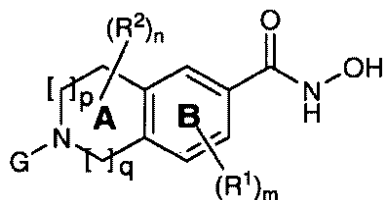
$q$  は1である、

化合物。

#### 【請求項32】

化学式(I)の化合物：

## 【化 1 8 3】



(I)

またはその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで：

p は 0 でありかつ q は 1 であるか、または p は 1 でありかつ q は 1 であり；

G は  $-C(O)-(CH_2)_z-z-R^{3f}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-(CH_2)_z-z-R^{3f}$ 、 $-C(O)-O-(CH_2)_z-z-R^{3f}$ 、 $-C(O)-CH_2-V_{2a}-R^{3f}$ 、 $-C(O)-(CH_2)_y-y-V_{2a}-R^{3f}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-(CH_2)_y-y-V_{2a}-R^{3f}$ 、または  $-C(O)-O-(CH_2)_y-y-V_{2a}-R^{3f}$  であり；

$R^{3f}$  は置換  $C_{1-6}$  脂肪族、または置換 3 ~ 6 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する置換 4 ~ 6 員ヘテロシクリル、または置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；ここで、 $R^{3f}$  は独立して存在する 1 ~ 2 個の  $R^{5aa}$  で置換され；

存在する  $R^{5aa}$  の各々は、独立して、シアノ、ヒドロキシ、1 ~ 2 個存在する  $R^7$  または  $R^8$  で置換された  $C_{1-6}$  脂肪族、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $-O-C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $-NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、 $-NHC(O)C_{3-6}$  シクロアルキル、 $-C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-NHS(O)_2C_{1-6}$  アルキル、 $-NHC_{1-6}$  アルキル、 $-N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、または 1 ~ 2 個存在する  $-R^{7a}$  で置換されたフェニルであり；

存在する  $R^7$  の各々は、独立して、窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

存在する  $R^8$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $-OH$ 、 $-O(C_{1-6} \text{ アルキル})$ 、 $-CN$ 、 $-N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $-NH(C_{1-6} \text{ アルキル})$ 、 $-C(O)(C_{1-6} \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_{1-6} \text{ アルキル})$ 、 $-C(O)NH_2$ 、または  $-C(O)NH(C_{1-6} \text{ アルキル})$  であり；

存在する  $R^{7a}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、ブロモ、ヨード、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $-O-C_{1-6}$  アルキル、 $-O-C_{1-6}$  フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $-NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、 $-NHC_{1-6}$  アルキル、 $-N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $-C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-C(O)N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $-NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-NHC(O)N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、または  $-NHS(O)_2C_{1-6}$  アルキルであり；

$V_{2a}$  は  $-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-N(R^{4a})-$ 、または  $-C(O)N(R^{4a})-$  であり；

$V_{2a}$  は  $-O-$ 、 $-S-$ 、または  $-N(R^{4a})-$  であり；

存在する  $R^{4a}$  の各々は、独立して、水素、または非置換もしくは置換  $C_{1-4}$  脂肪族であり；

B 環は m 個存在する  $R^1$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^1$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $-O-C_{1-4}$  アルキル、シア

ノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 4$  アルキル、または  $C_1 \sim 4$  フルオロアルキルであり；

A 環は  $n$  個存在する  $R^2$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、 $C_1 \sim 4$  アルキル、または  $C_1 \sim 4$  フルオロアルキルであり；

$z$  は 0 ~ 3 であり；

$y$  は 2 ~ 3 であり；

$m$  は 0 ~ 2 であり；

$n$  は 0 ~ 4 である、

化合物。

【請求項 3 3】

請求項 3 2 に記載の化合物であって、ここで：

$R^1$  はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであり；

$m$  は 0 ~ 1 であり；

$n$  は 0 ~ 2 である、

化合物。

【請求項 3 4】

請求項 3 2 に記載の化合物であって、ここで：

$G$  は  $-C(O)-R^{3f}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-R^{3f}$ 、 $-C(O)-O-R^{3f}$ 、 $-C(O)-CH_2-R^{3f}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-CH_2-R^{3f}$ 、または  $-C(O)-O-CH_2-R^{3f}$  である、

化合物。

【請求項 3 5】

請求項 3 2 に記載の化合物であって、ここで：

存在する  $R^{5aa}$  の各々は、独立して、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $-NHC(O)CH_3$ 、 $-NHC(O)$ -シクロプロピル、 $-C(O)NHCH_3$ 、 $-NHC(O)NHCH_3$ 、 $-NHS(O)_2CH_3$ 、 $-NHCH_3$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、4-メトキシフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、または 3-メトキシフェニルである、

化合物。

【請求項 3 6】

請求項 3 2 に記載の化合物であって、ここで：

$p$  は 1 であり；かつ

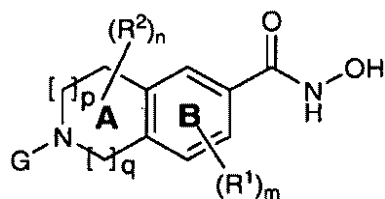
$q$  は 1 である、

化合物。

【請求項 3 7】

化学式 (I) の化合物：

【化 1 8 4】



(I)

またはその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで：

p は 0 でありかつ q は 1 であるか、または p は 1 でありかつ q は 1 であり；

G は  $-C(O)-(CH_2)_{zz}-R^{3h}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-(CH_2)_z$   
 $-R^{3h}$ 、 $-C(O)-O-(CH_2)_{zz}-R^{3h}$ 、 $-C(O)-CH_2-V_{2a}$ 、  
 $-R^{3h}$ 、 $-C(O)-(CH_2)_{yy}-V_{2a}-R^{3h}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-$   
 $(CH_2)_{yy}-V_{2a}-R^{3h}$ 、または  $-C(O)-O-(CH_2)_{yy}-V_{2a}-R^{3h}$  であり；

$R^{3h}$  は非置換もしくは置換  $C_1 \sim 6$  脂肪族、または非置換もしくは置換 3 ~ 6 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 4 ~ 6 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；ここで、 $R^{3h}$  は、置換される場合、0 ~ 2 個存在する  $R^{5aaa}$  で置換され；

存在する  $R^{5aaa}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $-O-C_1 \sim 6$  アルキル、またはフェニルであり；

$V_{2a}$  は  $-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-N(R^{4a})-$ 、または  $-C(O)N(R^{4a})-$  であり；

$V_{2a}$  は  $-O-$ 、 $-S-$ 、または  $-N(R^{4a})-$  であり；

存在する  $R^{4a}$  の各々は、独立して、水素、または非置換もしくは置換  $C_1 \sim 4$  脂肪族であり；

B 環は m 個存在する  $R^1$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^1$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $-O-C_1 \sim 4$  アルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 4$  アルキル、または  $C_1 \sim 4$  フルオロアルキルであり；

A 環は n 個存在する  $R^2$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、 $C_1 \sim 4$  アルキル、または  $C_1 \sim 4$  フルオロアルキルであり；

zz は 0 ~ 3 であり；

yy は 2 ~ 3 であり；

m は 0 ~ 2 であり；

n は 0 ~ 4 であり；

m と n の合計は少なくとも 1 でなければならない、

化合物。

#### 【請求項 38】

請求項 37 に記載の化合物であって、ここで：

$R^1$  はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであり；

m は 1 でありかつ n は 0 であるか、または m は 0 でありかつ n は 1 であるか、または m は 0 でありかつ n は 2 であるか、または m は 1 でありかつ n は 2 である、

化合物。

#### 【請求項 39】

請求項 37 に記載の化合物であって、ここで：

G は  $-C(O)-R^{3h}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-R^{3h}$ 、 $-C(O)-O-R^{3h}$ 、  
 $-C(O)-CH_2-R^{3h}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-CH_2-R^{3h}$ 、または  
 $-C(O)-O-CH_2-R^{3h}$  である、

化合物。

#### 【請求項 40】

請求項 37 に記載の化合物であって、ここで：

p は 1 であり；かつ

q は 1 である、  
化合物。

【請求項 4 1】

請求項 1 ~ 4 0 のいずれか 1 項に記載の化合物および薬学的に受容可能なキャリアを含む薬学的組成物。

【請求項 4 2】

治療有効量の請求項 1 ~ 4 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩を包含する、患者における増殖性障害を治療するための組成物。

【請求項 4 3】

前記増殖性障害が乳がん、肺がん、卵巣がん、多発性骨髄腫、急性骨髄性白血病、または急性リンパ芽球性白血病である、請求項 4 2 に記載の組成物。

【請求項 4 4】

活性成分としての請求項 1 ~ 4 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩、および薬学的に受容可能なキャリアを含む、治療が必要な患者における増殖性障害の治療のための薬学的組成物。

【請求項 4 5】

前記増殖性障害が乳がん、肺がん、卵巣がん、多発性骨髄腫、急性骨髄性白血病、または急性リンパ芽球性白血病である、請求項 4 4 に記載の薬学的組成物。

【請求項 4 6】

増殖性障害の治療のための薬学的組成物の調製のための請求項 1 ~ 4 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩の使用。

【請求項 4 7】

前記増殖性障害が乳がん、肺がん、卵巣がん、多発性骨髄腫、急性骨髄性白血病、または急性リンパ芽球性白血病である、請求項 4 6 に記載の使用。

【請求項 4 8】

増殖性障害を治療するための医薬の製造における請求項 1 ~ 4 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩の使用。

【請求項 4 9】

前記増殖性障害が乳がん、肺がん、卵巣がん、多発性骨髄腫、急性骨髄性白血病、または急性リンパ芽球性白血病である、請求項 4 8 に記載の使用。

【請求項 5 0】

患者における H D A C 6 活性を阻害するための組成物であって、該患者における H D A C 6 活性を阻害するのに有効な量の請求項 1 ~ 4 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩を含む、組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

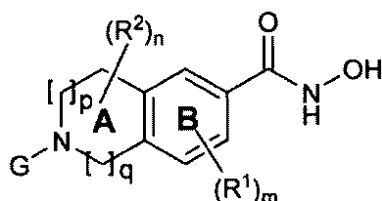
【補正対象項目名】0 0 2 7

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 2 7】

【化 9】



(I)

によって表される化合物またはその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで：

p は 0 でありかつ q は 1 であるか、または p は 1 でありかつ q は 1 であり；

G は  $-C(O)-(CH_2)_{zz}-R^{3h}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-(CH_2)_z$ 、 $-R^{3h}$ 、 $-C(O)-O-(CH_2)_{zz}-R^{3h}$ 、 $-C(O)-CH_2-V_{2a}$ 、 $-R^{3h}$ 、 $-C(O)-(CH_2)_{yy}-V_{2a}-R^{3h}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-(CH_2)_{yy}-V_{2a}-R^{3h}$ 、または  $-C(O)-O-(CH_2)_{yy}-V_{2a}-R^{3h}$  であり；

$R^{3h}$  は非置換もしくは置換  $C_{1-6}$  脂肪族、または非置換もしくは置換 3～6 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1～2 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 4～6 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 6～10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1～2 個のヘテロ原子を有する置換 5～10 員ヘテロアリールであり；ここで、 $R^{3h}$  は、置換される場合、0～2 個存在する  $R^{5aaa}$  で置換され；

存在する  $R^{5aaa}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $C_{1-4}$  アルキル、 $-O-C_{1-6}$  アルキル、またはフェニルであり；

$V_{2a}$  は  $-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-N(R^{4a})-$ 、または  $-C(O)N(R^{4a})-$  であり；

$V_{2a}$  は  $-O-$ 、 $-S-$ 、または  $-N(R^{4a})-$  であり；

存在する  $R^{4a}$  の各々は、独立して、水素、または非置換もしくは置換  $C_{1-4}$  脂肪族であり；

B 環は m 個存在する  $R^1$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^1$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $-O-C_{1-4}$  アルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$  アルキル、または  $C_{1-4}$  フルオロアルキルであり；

A 環は n 個存在する  $R^2$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、 $C_{1-4}$  アルキル、または  $C_{1-4}$  フルオロアルキルであり；

zz は 0～3 であり；

yy は 2～3 であり；

m は 0～2 であり；

n は 0～4 であり；

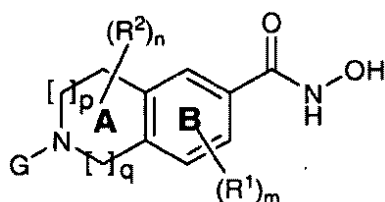
m と n の合計は少なくとも 1 でなければならない。

例えば、本発明は以下の項目を提供する。

(項目 1)

化学式 (I) の化合物：

【化 175】



(I)

またはその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで：

p は 0 でありかつ q は 3 もしくは 4 であるか、または p は 1 でありかつ q は 2 もしくは 3 であるか、または p は 2 でありかつ q は 1 もしくは 2 であり；

p は 0 でありかつ q は 3 もしくは 4 であるか、または p は 1 でありかつ q は 2 もしくは 3 であるか、または p は 2 でありかつ q は 1 もしくは 2 であり；

$G$  は  $-R^3$ 、 $-V_1-R^3$ 、 $-V_1-L_1-R^3$ 、 $-L_1-V_1-R^3$ 、 $-L_2-V_2-R^3$ 、 $-V_1-L_1-V_2-R^3$ 、または  $-L_1-R^3$  であり；

$L_1$  は非置換または置換  $C_{1-3}$  アルキレン鎖であり、ここで、1 個の炭素原子が  $-CR^A = CR^A-$  で置き換えられてもよく；

$L_2$  は非置換または置換  $C_{2-3}$  アルキレン鎖であり、ここで、1 個の炭素原子が  $-CR^A = CR^A-$  で置き換えられてもよく；

$V_1$  は  $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-$ 、 $-C(O)-O-$ 、または  $-S(O)_2-$  であり；

$V_2$  は  $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-N(R^{4a})-$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-$ 、 $-N(R^{4a})-C(O)-$ 、 $-SO_2-N(R^{4a})-$ 、 $-N(R^{4a})-SO_2-$ 、 $-C(O)-O-$ 、 $-O-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-N(R^{4a})-C(O)-N(R^{4a})-$ 、 $-N(R^{4a})-C(O)-O-$ 、 $-O-C(O)-N(R^{4a})-$ 、または  $-N(R^{4a})-SO_2-N(R^{4a})-$  であり；

$R^3$  は非置換もしくは置換  $C_{1-6}$  脂肪族、または非置換もしくは置換 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

存在する  $R^A$  の各々は、独立して、水素、フルオロ、または非置換もしくは置換  $C_{1-4}$  脂肪族であり；

存在する  $R^{4a}$  の各々は、独立して、水素、または非置換もしくは置換  $C_{1-4}$  脂肪族であり；

$B$  環は  $m$  個存在する  $R^1$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^1$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $-O-C_{1-4}$  アルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$  アルキル、または  $C_{1-4}$  フルオロアルキルであり；

$A$  環は  $n$  個存在する  $R^2$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、 $C_{1-4}$  アルキル、または  $C_{1-4}$  フルオロアルキルであり；

$m$  は 0 ~ 2 であり；

$n$  は 0 ~ 4 である、

化合物またはその薬学的に受容可能な塩。

(項目 3)

項目 2 に記載の化合物であって、ここで：

$V_1$  は  $-C(O)-$ 、 $-C(O)-NH-$ 、または  $-S(O)_2-$  であり；

$V_2$  は  $-NH-$  または  $-O-$  であり；

$R^1$  はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであり；

$m$  は 0 ~ 1 であり；

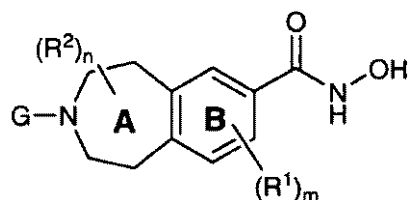
$n$  は 0 ~ 2 である、

化合物。

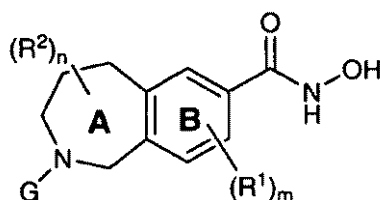
(項目 4)

化学式  $(II-C) \sim (II-G)$  によって表される項目 2 に記載の化合物。

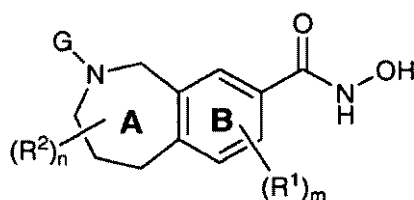
## 【化 1 7 7】



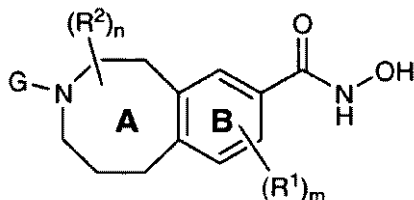
(II-C)



(II-D)

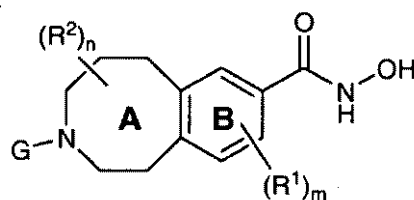


(II-E)



(II-F)

または



(II-G)

## (項目 5)

項目 2 に記載の化合物であって、ここで：

$R^3$  は、置換されるとき、独立して存在する 1 ~ 4 個の  $-R^5$  で置換され、ここで、 $R^5$  は  $-R^{5a}$ 、 $-R^{5d}$ 、 $-L_3-R^{5d}$ 、または  $-V_3-L_3-R^{5d}$  であり；

存在する  $R^{5a}$  の各々は、独立して、ハロゲン、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{5b})_2$ 、 $-OR^{5b}$ 、 $-SR^{5c}$ 、 $-S(O)_2R^{5c}$ 、 $-S(O)R^{5c}$ 、 $-C(O)R^{5b}$ 、 $-C(O)OR^{5b}$ 、 $-C(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{5b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-N(R^{5e})C(O)R^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})SO_2R^{5c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5b})_2$ 、もしくは  $-N(R^{5e})SO_2N(R^{5b})_2$  であるか、または  $R^{5d}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{5b})_2$ 、 $-OR^{5b}$ 、 $-SR^{5c}$ 、 $-S(O)_2R^{5c}$ 、 $-S(O)R^{5c}$ 、 $-C(O)R^{5b}$ 、 $-C(O)OR^{5b}$ 、 $-C(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{5b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-N(R^{5e})C(O)R^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})SO_2R^{5c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5b})_2$ 、もしくは  $-N(R^{5e})SO_2N(R^{5b})_2$  で置換された  $C_{1-4}$  脂肪族であり；

存在する  $R^{5b}$  の各々は、独立して、水素であるか、または  $C_{1-6}$  脂肪族、もしくは 3 ~ 10 員脂環式、もしくは窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、もしくは 6 ~ 10 員アリール、もしくは窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であるか；あるいは同じ窒素原子上に存在する 2 個の  $R^{5b}$  が、それらが結合している窒素原子と一緒に、窒素、酸素および硫黄から選択される 0 ~ 1 個のさらなるヘテロ原子を有する任意に置換された 4 ~ 7 員

ヘテロシクリル環を形成でき；

存在する  $R^{5c}$  の各々は、独立して、 $C_{1-6}$  脂肪族、または 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5d}$  の各々は、6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5dd}$  の各々は、6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5e}$  の各々は、独立して、水素または任意に置換された  $C_{1-6}$  脂肪族基であり；

存在する  $V_3$  の各々は、独立して、 $-N(R^{5e})$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{5e})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{5e})-$ 、 $-OC(O)N(R^{5e})-$ 、 $-N(R^{5e})C(O)-$ 、 $-N(R^{5e})SO_2-$ 、 $-N(R^{5e})C(O)O-$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5e})-$ 、 $-N(R^{5e})SO_2N(R^{5e})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または  $-C(O)N(R^{5e})O-$  であり；

$L_3$  は任意に置換された  $C_{1-3}$  アルキレン鎖であり、ここで、1 個の炭素原子が  $-CR^A = CR^A-$  で置き換えられてもよい、

化合物。

(項目 6)

項目 5 に記載の化合物であって、ここで：

$G$  は  $-[C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$ 、 $-C(O) - [C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$ 、 $-C(O) - NH - [C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$ 、 $-S(O)_2 - [C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$ 、 $-[C(R^6)(R^{6'})]_y - V_{2a} - R^3$ 、または  $-C(O) - C(R^6)(R^{6'}) - V_{2a} - R^3$  であり、

$R^6$  は水素、 $C_{1-4}$  脂肪族、 $C_{3-6}$  脂環式、もしくは 6 ~ 10 員アリールであり；

$R^{6'}$  は水素、 $C_{1-4}$  脂肪族、 $C_{3-6}$  脂環式、もしくは 6 ~ 10 員アリールであるか；または

$R^6$  および  $R^{6'}$  は、一緒になって、 $C_{3-6}$  脂環式基を形成し；

$V_{2a}$  は  $-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-N(R^{4a})-$ 、または  $-C(O)N(R^{4a})-$  であり；

$V_{2a}$  は  $-O-$ 、 $-S-$ 、または  $-N(R^{4a})-$  であり；

$R^1$  はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであり；

$m$  は 0 ~ 1 であり；

$n$  は 0 ~ 2 であり；

$y$  は 2 ~ 3 であり；

$z$  は 0 ~ 3 である、

化合物。

(項目 7)

項目 6 に記載の化合物であって、ここで：

$G$  は  $-[C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$ 、 $-C(O) - [C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$ 、または  $-S(O)_2 - [C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$  であり；

$m$  は 0 であり；

n は 0 であり；

z は 0 ～ 1 であり；

R<sup>3</sup> は - R<sup>3 a</sup> であり；

R<sup>3 a</sup> は非置換もしくは置換 6 ～ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ～ 10 員ヘテロアリールであり；ここで、R<sup>3 a</sup> は、置換される場合には、0 ～ 1 個存在する - R<sup>5 a</sup> および 1 個存在する - R<sup>5 d</sup> で置換され；

R<sup>5 a</sup> はクロロ、フルオロ、C<sub>1</sub> ～ 4 アルキル、C<sub>1</sub> ～ 6 フルオロアルキル、- O - C<sub>1</sub> ～ 6 アルキル、- O - C<sub>1</sub> ～ 6 フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、- NHC(O)C<sub>1</sub> ～ 6 アルキル、- NHC<sub>1</sub> ～ 6 アルキル、- N(C<sub>1</sub> ～ 6 アルキル)<sub>2</sub>、- C(O)NHC<sub>1</sub> ～ 6 アルキル、- C(O)N(C<sub>1</sub> ～ 6 アルキル)<sub>2</sub>、- NHC(O)NHC<sub>1</sub> ～ 6 アルキル、- NHC(O)N(C<sub>1</sub> ～ 6 アルキル)<sub>2</sub>、または - NHS(O)<sub>2</sub>C<sub>1</sub> ～ 6 アルキルであり；

R<sup>5 d</sup> は非置換であるかまたは 1 ～ 2 個存在する - R<sup>7 a</sup> で置換され；

存在する R<sup>7 a</sup> の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、プロモ、ヨード、C<sub>1</sub> ～ 6 アルキル、C<sub>1</sub> ～ 6 フルオロアルキル、- O - C<sub>1</sub> ～ 6 アルキル、- O - C<sub>1</sub> ～ 6 フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、- NHC(O)C<sub>1</sub> ～ 6 アルキル、- NHC<sub>1</sub> ～ 6 アルキル、- N(C<sub>1</sub> ～ 6 アルキル)<sub>2</sub>、- C(O)NHC<sub>1</sub> ～ 6 アルキル、- C(O)N(C<sub>1</sub> ～ 6 アルキル)<sub>2</sub>、- NHC(O)NHC<sub>1</sub> ～ 6 アルキル、- NHC(O)N(C<sub>1</sub> ～ 6 アルキル)<sub>2</sub>、または - NHS(O)<sub>2</sub>C<sub>1</sub> ～ 6 アルキルである、化合物。

(項目 8)

項目 6 に記載の化合物であって、ここで：

m は 0 であり；

n は 0 であり；

R<sup>3</sup> は - R<sup>3 d</sup> であり；

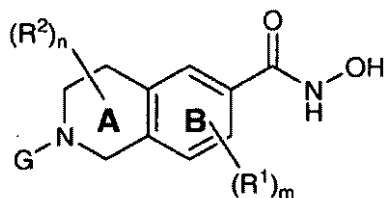
R<sup>3 d</sup> は非置換もしくは置換 C<sub>1</sub> ～ 6 脂肪族、または非置換もしくは置換 3 ～ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ～ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 4 ～ 10 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 6 ～ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ～ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ～ 10 員ヘテロアリールであり；ここで、R<sup>3 d</sup> は、置換される場合には、1 ～ 2 個存在する - R<sup>5 a</sup> で置換され；

存在する R<sup>5 a</sup> の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、C<sub>1</sub> ～ 4 アルキル、C<sub>1</sub> ～ 6 フルオロアルキル、- O - C<sub>1</sub> ～ 6 アルキル、- O - C<sub>1</sub> ～ 6 フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、- NHC(O)C<sub>1</sub> ～ 6 アルキル、- NHC<sub>1</sub> ～ 6 アルキル、- N(C<sub>1</sub> ～ 6 アルキル)<sub>2</sub>、- C(O)NHC<sub>1</sub> ～ 6 アルキル、- C(O)N(C<sub>1</sub> ～ 6 アルキル)<sub>2</sub>、- NHC(O)NHC<sub>1</sub> ～ 6 アルキル、- NHC(O)N(C<sub>1</sub> ～ 6 アルキル)<sub>2</sub>、または - NHS(O)<sub>2</sub>C<sub>1</sub> ～ 6 アルキルである、化合物。

(項目 9)

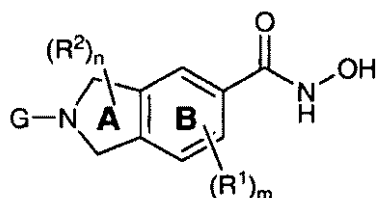
化学式 (II - A) または (II - B) の化合物：

【化 178】



(II-A)

または



(II-B)

またはその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで：

G は  $-R^3$ 、 $-V_1-R^3$ 、 $-V_1-L_1-R^3$ 、 $-L_1-V_2-R^3$ 、 $-L_1-R^3$ 、  
または  $-L_1-V_2-L_2-R^3$  であり；

$L_1$  および  $L_2$  は、各々独立して、非置換もしくは置換  $C_{1-3}$  アルキレン鎖であり、  
ここで、1 個の炭素原子が  $-CR^A=CR^A-$  で置き換えられてもよく；

$V_1$  は  $-S(O)_2-$  であり；

$V_2$  は  $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-N(R^{4a})-$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-$ 、  
 $-N(R^{4a})-C(O)-$ 、 $-SO_2-N(R^{4a})-$ 、 $-N(R^{4a})-SO_2-$ 、  
 $-C(O)-O-$ 、 $-O-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、  
 $-N(R^{4a})-C(O)-N(R^{4a})-$ 、 $-N(R^{4a})-C(O)-O-$ 、  
 $-O-C(O)-N(R^{4a})-$ 、または  $-N(R^{4a})-SO_2-N(R^{4a})-$  であり；

$R^3$  は非置換もしくは置換  $C_{1-6}$  脂肪族、または非置換もしくは置換 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

存在する  $R^A$  の各々は、独立して、水素、ハロ、または任意に置換された  $C_{1-4}$  脂肪族基であり；

存在する  $R^{4a}$  の各々は、独立して、水素、または任意に置換された  $C_{1-4}$  脂肪族基であり；

B 環は m 個存在する  $R^1$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^1$  の各々は、独立して、ハロ、 $C_{1-3}$  アルキル、 $C_{1-3}$  ハロアルキル、  
 $-O-C_{1-3}$  アルキル、 $-O-C_{1-3}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-NHC(O)C_{1-3}$  アルキル、  
 $-NHC(O)NHC_{1-3}$  アルキル、または  $NHS(O)_2C_{1-3}$  アルキルであり；

A 環は、n 個存在する  $R^2$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、ハロ、 $C_{1-3}$  アルキル、 $C_{1-3}$  ハロアルキル、  
 $-O-C_{1-3}$  アルキル、 $-O-C_{1-3}$  ハロアルキル、 $-NHC(O)C_{1-3}$  アルキル、  
 $-NHC(O)NHC_{1-3}$  アルキル、または  $NHS(O)_2C_{1-3}$  アルキルであり；

m は 0 ~ 2 であり；

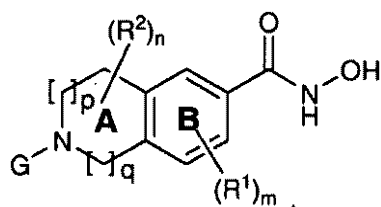
n は 0 ~ 4 である、

化合物。

(項目 10)

化学式 (I) の化合物：

【化 179】



(I)

またはその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで：

$p$  は 0 でありかつ  $q$  は 1 であるか、または  $p$  は 1 でありかつ  $q$  は 1 であり；

$G$  は  $-R^3$ 、 $-V_1-R^3$ 、 $-V_1-L_1-R^3$ 、 $-L_1-V_1-R^3$ 、 $-L_2-V_2-R^3$ 、 $-V_1-L_1-V_2-R^3$ 、または  $-L_1-R^3$  であり；

$L_1$  は任意に置換された  $C_{1-3}$  アルキレン鎖であり、ここで、1 個の炭素原子が  $-CR^A = CR^A-$  で置き換えられてもよく；

$L_2$  は任意に置換された  $C_{2-3}$  アルキレン鎖であり、ここで、1 個の炭素原子が  $-CR^A = CR^A-$  で置き換えられてもよく；

$V_1$  は  $-C(S)-$  または  $-S(O)_2-$  であり；

$V_2$  は  $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-N(R^{4a})-$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-$ 、 $-N(R^{4a})-C(O)-$ 、 $-SO_2-N(R^{4a})-$ 、 $-N(R^{4a})-SO_2-$ 、 $-C(O)-O-$ 、 $-O-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-N(R^{4a})-C(O)-N(R^{4a})-$ 、 $-N(R^{4a})-C(O)-O-$ 、 $-O-C(O)-N(R^{4a})-$ 、または  $-N(R^{4a})-SO_2-N(R^{4a})-$  であり；

$R^3$  は非置換もしくは置換  $C_{1-6}$  脂肪族、または非置換もしくは置換 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

存在する  $R^A$  の各々は、独立して、水素、フルオロ、または非置換もしくは置換  $C_{1-4}$  脂肪族であり；

存在する  $R^{4a}$  の各々は、独立して、水素、または非置換もしくは置換  $C_{1-4}$  脂肪族であり；

B 環は  $m$  個存在する  $R^1$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^1$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $-O-C_{1-4}$  アルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$  アルキル、または  $C_{1-4}$  フルオロアルキルであり；

A 環は  $n$  個存在する  $R^2$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、 $C_{1-4}$  アルキル、または  $C_{1-4}$  フルオロアルキルであり；

$m$  は 0 ~ 2 であり；

$n$  は 0 ~ 4 である、

化合物。

(項目 11)

項目 10 に記載の化合物であって、ここで：

$G$  は  $-R^3$ 、 $-V_1-R^3$ 、または  $-L_1-R^3$  であり；かつ

$V_1$  は  $-S(O)_2-$  であり；

$R^1$  はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメ

トキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであり；

$m$  は 0 ~ 1 であり；

$n$  は 0 ~ 2 である、

化合物。

(項目 12)

項目 10 に記載の化合物であって、ここで：

$R^3$  は、置換される場合、独立して存在する 1 ~ 4 個の  $-R^5$  で置換され、ここで、 $R^5$  は  $-R^{5a}$ 、 $-R^{5d}$ 、 $-L_3-R^{5d}$ 、または  $-V_3-L_3-R^{5d}$  であり；

存在する  $R^{5a}$  の各々は、独立して、ハロゲン、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{5b})_2$ 、 $-OR^{5b}$ 、 $-SR^{5c}$ 、 $-S(O)_2R^{5c}$ 、 $-S(O)R^{5c}$ 、 $-C(O)R^{5b}$ 、 $-C(O)OR^{5b}$ 、 $-C(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{5b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-N(R^{5e})C(O)R^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})SO_2R^{5c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5b})_2$ 、もしくは  $N(R^{5e})SO_2N(R^{5b})_2$  であるか、または  $R^{5d}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{5b})_2$ 、 $-OR^{5b}$ 、 $-SR^{5c}$ 、 $-S(O)_2R^{5c}$ 、 $-S(O)R^{5c}$ 、 $-C(O)R^{5b}$ 、 $-C(O)OR^{5b}$ 、 $-C(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{5b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-N(R^{5e})C(O)R^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})SO_2R^{5c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5b})_2$ 、もしくは  $-N(R^{5e})SO_2N(R^{5b})_2$  で置換された  $C_{1-4}$  脂肪族であり；

存在する  $R^{5b}$  の各々は、独立して、水素であるか、または  $C_{1-6}$  脂肪族、もしくは 3 ~ 10 員脂環式、もしくは窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、もしくは 6 ~ 10 員アリール、もしくは窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であるか；あるいは同じ窒素原子上に存在する 2 個の  $R^{5b}$  が、それらが結合している窒素と一緒に、窒素、酸素および硫黄から選択される 0 ~ 1 個のさらなるヘテロ原子を有する任意に置換された 4 ~ 7 員ヘテロシクリル環を形成でき；

存在する  $R^{5c}$  の各々は、独立して、 $C_{1-6}$  脂肪族、または 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5d}$  の各々は、6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5dd}$  の各々は、6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5e}$  の各々は、独立して、水素または任意に置換された  $C_{1-6}$  脂肪族基であり；

存在する  $V_3$  の各々は、独立して、 $-N(R^{5e})$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{5e})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{5e})-$ 、 $-OC(O)N(R^{5e})-$ 、 $-N(R^{5e})C(O)-$ 、 $-N(R^{5e})SO_2-$ 、 $-N(R^{5e})C(O)O-$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5e})-$ 、 $-N(R^{5e})SO_2N(R^{5e})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または  $-C(O)N(R^{5e})O-$  であり；

$L_3$  は任意に置換された  $C_{1-3}$  アルキレン鎖であり、ここで、1 個の炭素原子が  $-C$

$R^A = C R^A$  - で置き換えられてもよい、  
化合物。

(項目 1 3)

項目 1 2 に記載の化合物であって、ここで：

$G$  は  $- [C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$ 、 $- [C(R^6)(R^{6'})]_y - V_{2a} - R^3$ 、 $- S(O)_2 - [C(R^6)(R^{6'})]_y - V_{2a} - R^3$ 、 $- S(O)_2 - C(R^6)(R^{6'}) - V_{2a} - R^3$ 、または  $- S(O)_2 - [C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$  であり；

$R^6$  は水素、 $C_{1-4}$  脂肪族、 $C_{3-6}$  脂環式、もしくは 6 ~ 10 員アリールであり；

$R^{6'}$  は水素、 $C_{1-4}$  脂肪族、 $C_{3-6}$  脂環式、もしくは 6 ~ 10 員アリールであるか；または

$R^6$  および  $R^{6'}$  は、一緒になって、 $C_{3-6}$  脂環式基を形成し；

$V_{2a}$  は  $-O-$  または  $-NH-$  であり；

$R^1$  はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであり；

$m$  は 0 ~ 1 であり；

$n$  は 0 ~ 2 であり；

$y$  は 2 ~ 3 であり；

$z$  は 0 ~ 3 である、

化合物。

(項目 1 4)

項目 1 3 に記載の化合物であって、ここで：

$G$  は  $- [C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$  または  $- S(O)_2 - [C(R^6)(R^{6'})]_z - R^3$  であり；

$m$  は 0 であり；

$n$  は 0 であり；

$z$  は 0 ~ 1 であり；

$R^3$  は  $-R^{3a}$  であり；

$R^{3a}$  は非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；ここで、 $R^{3a}$  は、置換される場合、0 ~ 1 個存在する  $-R^{5a}$  および 1 個存在する  $-R^{5d}$  で置換され；

存在する  $R^{5a}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $-O-C_{1-6}$  アルキル、 $-O-C_{1-6}$  フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $-NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、 $-NHC_{1-6}$  アルキル、 $-N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $-C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-C(O)N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $-NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-NHC(O)N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、または  $-NHS(O)_2 C_{1-6}$  アルキルであり；

$R^{5d}$  は非置換であるかまたは 1 ~ 2 個存在する  $-R^{7a}$  で置換され；

存在する  $R^{7a}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、プロモ、ヨード、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $-O-C_{1-6}$  アルキル、 $-O-C_{1-6}$  フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $-NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、 $-NHC_{1-6}$  アルキル、 $-N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $-C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-C(O)N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $-NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-NHC(O)N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、または  $-NHS(O)_2 C_{1-6}$  アルキルである、

化合物。

(項目 1 5)

$p$  が 1 でありかつ  $q$  が 1 である、項目 1 4 に記載の化合物。

## (項目16)

項目13に記載の化合物であって、ここで：

mは0であり；

nは0であり；

$R^3$ は $-R^{3d}$ であり；

$R^{3d}$ は非置換もしくは置換 $C_{1-6}$ 脂肪族、または非置換もしくは置換3～10員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される1～4個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換4～10員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換6～10員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される1～5個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換5～10員ヘテロアリールであり；ここで、 $R^{3d}$ は、置換される場合、独立して存在する0～2個の $-R^{5a}$ で置換され；

存在する $R^{5a}$ の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-6}$ フルオロアルキル、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $-NHC(O)C_{1-6}$ アルキル、 $-NHC_{1-6}$ アルキル、 $-N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、 $-C(O)NHC_{1-6}$ アルキル、 $-C(O)N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、 $-NHC(O)NHC_{1-6}$ アルキル、 $-NHC(O)N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、または $-NHS(O)_2C_{1-6}$ アルキルである、

化合物。

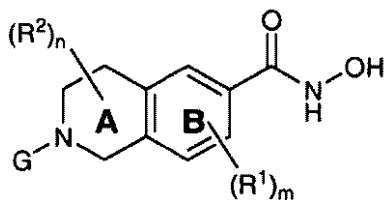
## (項目17)

pが1でありかつqが1である、項目16に記載の化合物。

## (項目18)

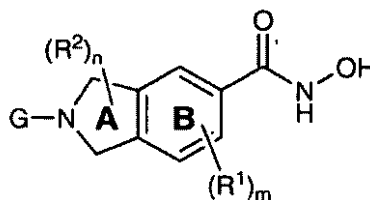
化学式(II-A)または(II-B)の化合物：

【化180】



(II-A)

または



(II-B)

またはその薬学的に受容可能な塩であって、ここで：

Gは $-C(R^6)(R^{6'})-R^3$ 、 $-C(O)-[C(R^6)(R^{6'})]_u-R^3$ 、または $-C(O)-NH-[C(R^6)(R^{6'})]_u-R^3$ であり；

$R^6$ は水素、 $C_{1-4}$ 脂肪族、 $C_{3-6}$ 脂環式、もしくは6～10員アリールであり；

$R^{6'}$ は水素、 $C_{1-4}$ 脂肪族、 $C_{3-6}$ 脂環式、もしくは6～10員アリールであるか；または

$R^6$ および $R^{6'}$ は、一緒になって、 $C_{3-6}$ 脂環式基を形成し；

ここで、存在する $R^6$ の少なくとも1個は $R^{6''}$ であり；

$R^{6''}$ は $C_{1-4}$ 脂肪族、 $C_{3-6}$ 脂環式、または6～10員アリールであり；

$R^3$ は $-R^{3d}$ であり；

$R^{3d}$ は非置換もしくは置換 $C_{1-6}$ 脂肪族、または非置換もしくは置換3～10員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される1～4個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換4～10員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換6～10員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される1～5個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換5～10員ヘテロアリールであり；ここで、 $R^{3d}$ は、置換される場合、独立して存在する0～2個の $-R^{5a}$ で置換され；

存在する $R^{5a}$ の各々は、独立して、ハロゲン、 $C_{1-3}$ 脂肪族、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{5b})_2$ 、 $-OR^{5b}$ 、 $-SR^{5c}$ 、 $-S(O)_2R^{5c}$ 、 $-S(O)R^{5c}$ 、

$-C(O)R^{5b}$ 、 $-C(O)OR^{5b}$ 、 $-C(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{5b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-N(R^{5e})C(O)R^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})SO_2R^{5c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5b})_2$  もしくは  $-N(R^{5e})SO_2N(R^{5b})_2$  であるか、または  $R^{5dd}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{5b})_2$ 、 $-OR^{5b}$ 、 $-SR^{5c}$ 、 $-S(O)_2R^{5c}$ 、 $-S(O)R^{5c}$ 、 $-C(O)R^{5b}$ 、 $-C(O)OR^{5b}$ 、 $-C(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{5b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-N(R^{5e})C(O)R^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})SO_2R^{5c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5b})_2$  もしくは  $-N(R^{5e})SO_2N(R^{5b})_2$  で置換された  $C_{1-4}$  脂肪族であり；

存在する  $R^{5b}$  の各々は、独立して、水素であるか、または  $C_{1-6}$  脂肪族、もしくは 3 ~ 10 員脂環式、もしくは窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、もしくは 6 ~ 10 員アリール、もしくは窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であるか；あるいは同じ窒素原子上に存在する 2 個の  $R^{5b}$  は、これらが結合している窒素原子と一緒に、窒素、酸素および硫黄から選択される 0 ~ 1 個のさらなるヘテロ原子を有する任意に置換された 4 ~ 7 員ヘテロシクリル環を形成し；

存在する  $R^{5c}$  の各々は、独立して、 $C_{1-6}$  脂肪族、または 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5dd}$  の各々は、6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5e}$  の各々は、独立して、水素または任意に置換された  $C_{1-6}$  脂肪族基であり；

$u$  は 1 ~ 2 であり；

B 環は  $m$  個存在する  $R^1$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^1$  の各々は、独立して、ハロ、 $C_{1-3}$  アルキル、 $C_{1-3}$  ハロアルキル、 $-O-C_{1-3}$  アルキル、 $-O-C_{1-3}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-NHC(O)C_{1-3}$  アルキル、 $-NHC(O)NHC_{1-3}$  アルキル、または  $NHS(O)_2C_{1-3}$  アルキルであり；

A 環は  $n$  個存在する  $R^2$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、ハロ、 $C_{1-3}$  アルキル、 $C_{1-3}$  ハロアルキル、 $-O-C_{1-3}$  アルキル、 $-O-C_{1-3}$  ハロアルキル、 $-NHC(O)C_{1-3}$  アルキル、 $-NHC(O)NHC_{1-3}$  アルキル、または  $NHS(O)_2C_{1-3}$  アルキルであり；

$m$  は 0 ~ 2 であり；

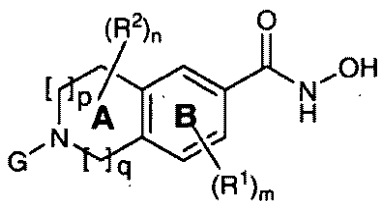
$n$  は 0 ~ 4 である、

化合物。

( 項目 19 )

化学式 ( I ) の化合物：

【化 1 8 1】



(I)

またはその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで：

p は 0 でありかつ q は 1 であるか、または p は 1 でありかつ q は 1 であり；

G は  $-C(O)-[C(R^6)(R^{6'})]_{zz}-R^{3g}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})$ 、 $-[C(R^6)(R^{6'})]_{zz}-R^{3g'}$ 、 $-C(O)-O-[C(R^6)(R^{6'})]_{zz}-R^{3g'}$ 、 $-C(O)-C(R^6)(R^{6'})-V_{2a}$ 、 $-R^{3g}$ 、 $-C(O)-[C(R^6)(R^{6'})]_{yy}-V_{2a}-R^{3g}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-[C(R^6)(R^{6'})]_{yy}-V_{2a}-R^{3g}$ 、または  $-C(O)-O-[C(R^6)(R^{6'})]_{yy}-V_{2a}-R^{3g}$  であり；

$R^6$  は水素、 $C_{1-4}$  脂肪族、 $C_{3-6}$  脂環式、もしくは 6 ~ 10 員アリールであり；

$R^{6'}$  は水素、 $C_{1-4}$  脂肪族、 $C_{3-6}$  脂環式、もしくは 6 ~ 10 員アリールであるか；または

$R^6$  および  $R^{6'}$  は一緒になって  $C_{3-6}$  脂環式基を形成し；

ここで、存在する  $R^6$  の少なくとも 1 個は  $R^{6''}$  であり；

$R^{6''}$  は  $C_{1-4}$  脂肪族、 $C_{3-6}$  脂環式、または 6 ~ 10 員アリールであり；

$V_{2a}$  は  $-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-N(R^{4a})-$ 、または  $-C(O)N(R^{4a})-$  であり；

$V_{2a}$  は  $-O-$ 、 $-S-$ 、または  $-N(R^{4a})-$  であり；

$R^{3g}$  は非置換もしくは置換  $C_{1-6}$  脂肪族、または非置換もしくは置換 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

$R^{3g'}$  は非置換もしくは置換 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

$R^{4a}$  は独立して、水素、または非置換もしくは置換  $C_{1-4}$  脂肪族であり；

B 環は m 個存在する  $R^1$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^1$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $-O-C_{1-4}$  アルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$  アルキル、または  $C_{1-4}$  フルオロアルキルであり；

A 環は n 個存在する  $R^2$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、 $C_{1-4}$  アルキル、または  $C_{1-4}$  フルオロアルキルであり；

zz は 1 ~ 3 であり；

yy は 2 ~ 3 であり；

m は 0 ~ 2 であり；

n は 0 ~ 4 である、

化合物。

(項目 2 0)

項目 1 9 に記載の化合物であって、ここで：

$G$  は  $-C(O)-[C(R^6)(R^{6'})]_{zz}-R^{3g}$ 、 $-C(O)-NH-[C(R^6)(R^{6'})]_{yy}-R^{3g}$ 、または  $-C(O)-[C(R^6)(R^{6'})]_{yy}-V_{za}-R^{3g}$  であり；

$R^1$  はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであり；

$m$  は 0 ~ 1 であり；

$n$  は 0 ~ 2 である、

化合物。

(項目 2 1)

項目 1 9 に記載の化合物であって、ここで：

$R^{3g}$  または  $R^{3g'}$  は、置換されるとき、独立して存在する 1 ~ 4 個の  $-R^5$  で置換され、ここで、 $R^5$  は  $-R^{5a}$ 、 $-R^{5d}$ 、 $-L_3-R^{5d}$ 、または  $-V_3-L_3-R^{5d}$  であり；

存在する  $R^{5a}$  の各々は、独立して、ハロゲン、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{5b})_2$ 、 $-OR^{5b}$ 、 $-SR^{5c}$ 、 $-S(O)_2R^{5c}$ 、 $-S(O)R^{5c}$ 、 $-C(O)R^{5b}$ 、 $-C(O)OR^{5b}$ 、 $-C(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{5b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-N(R^{5e})C(O)R^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})SO_2R^{5c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5b})_2$ 、もしくは  $-N(R^{5e})SO_2N(R^{5b})_2$  であるか、または  $R^{5dd}$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{5b})_2$ 、 $-OR^{5b}$ 、 $-SR^{5c}$ 、 $-S(O)_2R^{5c}$ 、 $-S(O)R^{5c}$ 、 $-C(O)R^{5b}$ 、 $-C(O)OR^{5b}$ 、 $-C(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{5b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-N(R^{5e})C(O)R^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})SO_2R^{5c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5b})_2$  もしくは  $-N(R^{5e})SO_2N(R^{5b})_2$  で置換された  $C_{1-4}$  脂肪族であり；

存在する  $R^{5b}$  の各々は、独立して、水素であるか、または  $C_{1-6}$  脂肪族、もしくは 3 ~ 10 員脂環式、もしくは窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、もしくは 6 ~ 10 員アリール、もしくは窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であるか；あるいは同じ窒素原子上に存在する 2 個の  $R^{5b}$  は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄から選択される 0 ~ 1 個のさらなるヘテロ原子を有する任意に置換された 4 ~ 7 員ヘテロシクリル環を形成でき；

存在する  $R^{5c}$  の各々は、独立して、 $C_{1-6}$  脂肪族、または 3 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5d}$  の各々は、6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5dd}$  の各々は、6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員ヘテロアリールから選択される任意に置換された基であり；

存在する  $R^{5e}$  の各々は、独立して、水素または任意に置換された  $C_{1-6}$  脂肪族基で

あり；

存在する  $V_3$  の各々は、独立して、 $-N(R^{5e})$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{5e})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{5e})-$ 、 $-OC(O)N(R^{5e})-$ 、 $-N(R^{5e})C(O)-$ 、 $-N(R^{5e})SO_2-$ 、 $-N(R^{5e})C(O)O-$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5e})-$ 、 $-N(R^{5e})SO_2N(R^{5e})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または  $-C(O)N(R^{5e})-O-$  であり；

$L_3$  は、任意に置換された  $C_{1-3}$  アルキレン鎖であり、ここで、1 個の炭素原子は  $-CR^A=CR^A-$  で置き換えられてもよい、

化合物。

(項目 2 2)

項目 2 1 に記載の化合物であって、ここで：

$G$  は  $-C(O)-[C(R^6)(R^{6'})]_{zz}-R^{3g}$ 、 $-C(O)-NH-[C(R^6)(R^{6'})]_{zz}-R^{3g'}$ 、 $-C(O)-[C(R^6)(R^{6'})]_{yy}-V_{2a}-R^{3g}$ 、または  $-C(O)-C(R^6)(R^{6'})-V_{2a}-R^{3g}$  であり；

$R^6$  は水素もしくは  $C_{1-4}$  脂肪族であり；

$R^{6'}$  は水素もしくは  $C_{1-4}$  脂肪族であるか；または

$R^6$  および  $R^{6'}$  は、一緒になって、 $C_{3-6}$  脂環式基を形成し；

$R^{6''}$  は  $C_{1-4}$  脂肪族であり；

$V_{2a}$  は  $-O-$  または  $-NH-$  であり；

$V_{2a'}$  は  $-O-$  または  $-NH-$  であり；

$R^1$  はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであり；

$m$  は 0 ~ 1 であり；

$n$  は 0 ~ 2 である、

化合物。

(項目 2 3)

項目 2 2 に記載の化合物であって、ここで：

$G$  は  $-C(O)-C(R^6)(R^{6'})-R^{3g}$  であり；

$m$  は 0 であり；

$n$  は 0 であり；

$R^{3g}$  は、置換される場合、0 ~ 1 個存在する  $-R^{5a}$  および 1 個存在する  $-R^{5d}$  で置換され；

$R^{5a}$  はクロロ、フルオロ、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $-O-C_{1-6}$  アルキル、 $-O-C_{1-6}$  フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $-NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、 $-NHC_{1-6}$  アルキル、 $-N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、 $-C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-C(O)N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、 $-NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-NHC(O)N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、または  $-NHS(O)_2C_{1-6}$  アルキルであり；

$R^{5d}$  は非置換もしくは 1 ~ 2 個存在する  $-R^{7a}$  で置換され；

存在する  $R^{7a}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、ブロモ、ヨード、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $-O-C_{1-6}$  アルキル、 $-O-C_{1-6}$  フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $-NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、 $-NHC_{1-6}$  アルキル、 $-N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、 $-C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-C(O)N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、 $-NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-NHC(O)N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、または  $-NHS(O)_2C_{1-6}$  アルキルである、

化合物。

(項目 2 4)

p が 1 でありかつ q が 1 である、項目 2 3 に記載の化合物。

( 項目 2 5 )

項目 2 2 に記載の化合物であって、ここで：

G は - C ( O ) - C ( R<sup>6</sup> ) ( R<sup>6'</sup> ) - R<sup>3 g</sup> であり；

m は 0 であり；

n は 0 であり；

R<sup>3 g</sup> は、置換される場合、0 ~ 2 個存在する - R<sup>5 a</sup> で置換され；

存在する R<sup>5 a</sup> の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、C<sub>1</sub> ~ 6 フルオロアルキル、- O - C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、- O - C<sub>1</sub> ~ 6 フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、- NHC ( O ) C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、- NHC<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、- N ( C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル )<sub>2</sub>、- C ( O ) NHC<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、- C ( O ) N ( C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル )<sub>2</sub>、- NHC ( O ) NHC<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、- NHC ( O ) N ( C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル )<sub>2</sub>、または - NHS ( O )<sub>2</sub> C<sub>1</sub> ~ 6 アルキルである、

化合物。

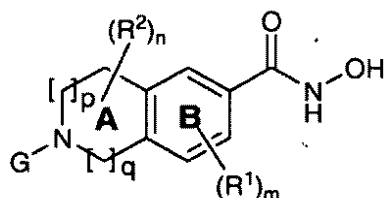
( 項目 2 6 )

p が 1 でありかつ q が 1 である、項目 2 5 に記載の化合物。

( 項目 2 7 )

化学式 ( I ) の化合物：

【化 1 8 2】



(I)

またはその薬学的に受容可能な塩であって、ここで：

p は 0 でありかつ q は 1 であるか、または p は 1 でありかつ q は 1 であり；

G は - C ( O ) - ( CH<sub>2</sub> )<sub>z z</sub> - R<sup>3 e</sup>、- C ( O ) - N ( R<sup>4 a</sup> ) - ( CH<sub>2</sub> )<sub>z z</sub> - R<sup>3 e</sup>、- C ( O ) - O - ( CH<sub>2</sub> )<sub>z z</sub> - R<sup>3 e</sup>、- C ( O ) - CH<sub>2</sub> - V<sub>2 a</sub>、- R<sup>3 e</sup>、- C ( O ) - ( CH<sub>2</sub> )<sub>y y</sub> - V<sub>2 a</sub> - R<sup>3 e</sup>、- C ( O ) - N ( R<sup>4 a</sup> ) - ( CH<sub>2</sub> )<sub>y y</sub> - V<sub>2 a</sub> - R<sup>3 e</sup>、または - C ( O ) - O - ( CH<sub>2</sub> )<sub>y y</sub> - V<sub>2 a</sub> - R<sup>3 e</sup> であり、

R<sup>3 e</sup> は非置換もしくは置換 7 ~ 10 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 7 ~ 10 員ヘテロシクリル、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 3 ~ 5 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

V<sub>2 a</sub> は - C ( O ) -、- O -、- S -、- N ( R<sup>4 a</sup> ) -、または - C ( O ) N ( R<sup>4 a</sup> ) - であり；

V<sub>2 a</sub> は - O -、- S -、または - N ( R<sup>4 a</sup> ) - であり；

存在する R<sup>4 a</sup> の各々は、独立して、水素、または非置換もしくは置換 C<sub>1</sub> ~ 4 脂肪族であり；

B 環は m 個存在する R<sup>1</sup> で任意にさらに置換され；

存在する R<sup>1</sup> の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、- O - C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、または C<sub>1</sub> ~ 4 フルオロアルキルであり；

A 環は n 個存在する R<sup>2</sup> で任意にさらに置換され；

存在する R<sup>2</sup> の各々は、独立して、フルオロ、C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、または C<sub>1</sub> ~ 4 フル

オロアルキルであり；  
 $z$  は 0 ～ 3 であり；  
 $y$  は 2 ～ 3 であり；  
 $m$  は 0 ～ 2 であり；  
 $n$  は 0 ～ 4 である、

化合物。

(項目 28)

項目 27 に記載の化合物であって、ここで：

$R^1$  はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであり；

$m$  は 0 ～ 1 であり；  
 $n$  は 0 ～ 2 である、

化合物。

(項目 29)

項目 27 に記載の化合物であって、ここで：

$R^{3e}$  は、置換される場合、0 ～ 1 個存在する -  $R^{5a}$  および 0 ～ 1 個存在する -  $R^{5d}$  で置換され；

存在する  $R^{5a}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、-  $O - C_{1-6}$  アルキル、-  $O - C_{1-6}$  フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、-  $NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、-  $NHC_{1-6}$  アルキル、-  $N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、-  $C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、-  $C(O)N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、-  $NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、-  $NHC(O)N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、または -  $NHS(O)_2C_{1-6}$  アルキルであり；

存在する  $R^{5d}$  の各々は、6 ～ 10 員アリアル、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 個のヘテロ原子を有する 5 ～ 10 員ヘテロアリアルから選択される任意に置換された基であり；ここで、 $R^{5d}$  は、置換される場合、1 ～ 2 個存在する -  $R^{7a}$  で置換され；

存在する  $R^{7a}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、プロモ、ヨード、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、-  $O - C_{1-6}$  アルキル、-  $O - C_{1-6}$  フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、-  $NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、-  $NHC_{1-6}$  アルキル、-  $N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、-  $C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、-  $C(O)N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、-  $NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、-  $NHC(O)N(C_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、または -  $NHS(O)_2C_{1-6}$  アルキルである、

化合物。

(項目 30)

項目 29 に記載の化合物であって、ここで：

$G$  は -  $C(O) - R^{3e}$ 、-  $C(O) - N(R^{4a}) - R^{3e}$ 、-  $C(O) - O - R^{3e}$ 、-  $C(O) - CH_2 - R^{3e}$ 、-  $C(O) - N(R^{4a}) - CH_2 - R^{3e}$ 、または -  $C(O) - O - CH_2 - R^{3e}$  であり；

$R^{3e}$  はトリアゾリル、チアジアゾリル、オキサジアゾリル、ベンゾチアジアゾリル、2, 3-4H-フロ[3, 2-b]ピロリル、ピラゾロピリミジニル、プリニル、プテリジニル、キヌクリジニル、ジアゼピニル、デカヒドロキノリニル、オキサゼピニル、チアゼピニル、オキサゼピニル、チアゼピニル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロヘプテニル、シクロオクテニル、ビシクロヘプタニル、ビシクロオクタニル、キヌクリジニル、またはアダマンチルである、

化合物。

(項目 31)

項目 29 に記載の化合物であって、ここで：

$R^1$  はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであり；

$m$  は 0 ~ 1 であり；

$n$  は 0 ~ 2 であり；

$p$  は 1 であり；

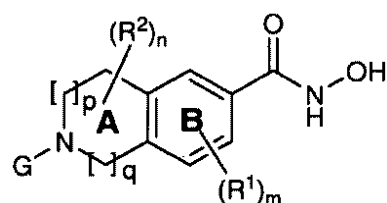
$q$  は 1 である、

化合物。

( 項目 3 2 )

化学式 ( I ) の化合物：

【化 1 8 3】



(I)

またはその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで：

$p$  は 0 でありかつ  $q$  は 1 であるか、または  $p$  は 1 でありかつ  $q$  は 1 であり；

$G$  は  $-C(O)-(CH_2)_{zz}-R^{3f}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-(CH_2)_z$ 、 $-R^{3f}$ 、 $-C(O)-O-(CH_2)_{zz}-R^{3f}$ 、 $-C(O)-CH_2-V_{2a}$ 、 $-R^{3f}$ 、 $-C(O)-(CH_2)_{yy}-V_{2a}-R^{3f}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-(CH_2)_{yy}-V_{2a}-R^{3f}$ 、または  $-C(O)-O-(CH_2)_{yy}-V_{2a}-R^{3f}$  であり；

$R^{3f}$  は置換  $C_{1-6}$  脂肪族、または置換 3 ~ 6 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する置換 4 ~ 6 員ヘテロシクリル、または置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；ここで、 $R^{3f}$  は独立して存在する 1 ~ 2 個の  $R^{5aa}$  で置換され；

存在する  $R^{5aa}$  の各々は、独立して、シアノ、ヒドロキシ、1 ~ 2 個存在する  $R^7$  または  $R^8$  で置換された  $C_{1-6}$  脂肪族、 $C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $-O-C_{1-6}$  フルオロアルキル、 $-NHC(O)C_{1-6}$  アルキル、 $-NHC(O)C_{3-6}$  シクロアルキル、 $-C(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-NHC(O)NHC_{1-6}$  アルキル、 $-NHS(O)_2C_{1-6}$  アルキル、 $-NHC_{1-6}$  アルキル、 $-N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、または 1 ~ 2 個存在する  $-R^{7a}$  で置換されたフェニルであり；

存在する  $R^7$  の各々は、独立して、窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 4 ~ 10 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

存在する  $R^8$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $-OH$ 、 $-O(C_{1-6} \text{ アルキル})$ 、 $-CN$ 、 $-N(C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $-NH(C_{1-6} \text{ アルキル})$ 、 $-C(O)(C_{1-6} \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_{1-6} \text{ アルキル})$ 、 $-C(O)NH_2$ 、または  $-C(O)NH(C_{1-6} \text{ アルキル})$  であり；

存在する  $R^{7a}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、プロモ、ヨード、 $C_{1-6}$  ア

ルキル、 $C_{1 \sim 6}$ フルオロアルキル、 $-O-C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $-O-C_{1 \sim 6}$ フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $-NHC(O)C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $-NHC_{1 \sim 6}$ アルキル、 $-N(C_{1 \sim 6}$ アルキル) $_2$ 、 $-C(O)NHC_{1 \sim 6}$ アルキル、 $-C(O)N(C_{1 \sim 6}$ アルキル) $_2$ 、 $-NHC(O)NHC_{1 \sim 6}$ アルキル、 $-NHC(O)N(C_{1 \sim 6}$ アルキル) $_2$ 、または $-NHS(O)_2C_{1 \sim 6}$ アルキルであり；

$V_{2a}$ は $-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-N(R^{4a})-$ 、または $-C(O)N(R^{4a})-$ であり；

$V_{2a}$ は $-O-$ 、 $-S-$ 、または $-N(R^{4a})-$ であり；

存在する $R^{4a}$ の各々は、独立して、水素、または非置換もしくは置換 $C_{1 \sim 4}$ 脂肪族であり；

B環はm個存在する $R^1$ で任意にさらに置換され；

存在する $R^1$ の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $-O-C_{1 \sim 4}$ アルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、または $C_{1 \sim 4}$ フルオロアルキルであり；

A環はn個存在する $R^2$ で任意にさらに置換され；

存在する $R^2$ の各々は、独立して、フルオロ、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、または $C_{1 \sim 4}$ フルオロアルキルであり；

zzは0～3であり；

yyは2～3であり；

mは0～2であり；

nは0～4である、

化合物。

(項目33)

項目32に記載の化合物であって、ここで；

$R^1$ はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する $R^2$ の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであり；

mは0～1であり；

nは0～2である、

化合物。

(項目34)

項目32に記載の化合物であって、ここで；

Gは $-C(O)-R^{3f}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-R^{3f}$ 、 $-C(O)-O-R^{3f}$ 、 $-C(O)-CH_2-R^{3f}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-CH_2-R^{3f}$ 、または $-C(O)-O-CH_2-R^{3f}$ である、

化合物。

(項目35)

項目32に記載の化合物であって、ここで；

存在する $R^{5aa}$ の各々は、独立して、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $-NHC(O)CH_3$ 、 $-NHC(O)-シクロプロピル$ 、 $-C(O)NHCH_3$ 、 $-NHC(O)NHCH_3$ 、 $-NHS(O)_2CH_3$ 、 $-NHCH_3$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、4-メトキシフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、または3-メトキシフェニルである、

化合物。

(項目36)

項目32に記載の化合物であって、ここで；

pは1であり；かつ

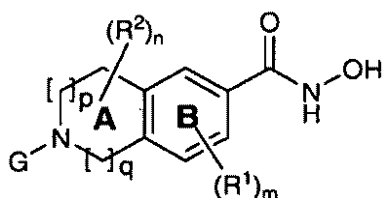
qは1である、

化合物。

(項目37)

化学式 (I) の化合物：

【化 184】



(I)

またはその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで：

p は 0 でありかつ q は 1 であるか、または p は 1 でありかつ q は 1 であり；

G は  $-C(O)-(CH_2)_{zz}-R^{3h}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-(CH_2)_z$ 、 $-R^{3h}$ 、 $-C(O)-O-(CH_2)_{zz}-R^{3h}$ 、 $-C(O)-CH_2-V_{2a}$ 、 $-R^{3h}$ 、 $-C(O)-(CH_2)_{yy}-V_{2a}-R^{3h}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-(CH_2)_{yy}-V_{2a}-R^{3h}$ 、または  $-C(O)-O-(CH_2)_{yy}-V_{2a}-R^{3h}$  であり；

$R^{3h}$  は非置換もしくは置換  $C_{1-6}$  脂肪族、または非置換もしくは置換 3 ~ 6 員脂環式、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 4 ~ 6 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 6 ~ 10 員アリール、または窒素、酸素および硫黄から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；ここで、 $R^{3h}$  は、置換される場合、0 ~ 2 個存在する  $R^{5aaa}$  で置換され；

存在する  $R^{5aaa}$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $C_{1-4}$  アルキル、 $-O-C_{1-6}$  アルキル、またはフェニルであり；

$V_{2a}$  は  $-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-N(R^{4a})-$ 、または  $-C(O)N(R^{4a})-$  であり；

$V_{2a}$  は  $-O-$ 、 $-S-$ 、または  $-N(R^{4a})-$  であり；

存在する  $R^{4a}$  の各々は、独立して、水素、または非置換もしくは置換  $C_{1-4}$  脂肪族であり；

B 環は m 個存在する  $R^1$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^1$  の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、 $-O-C_{1-4}$  アルキル、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$  アルキル、または  $C_{1-4}$  フルオロアルキルであり；

A 環は n 個存在する  $R^2$  で任意にさらに置換され；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、 $C_{1-4}$  アルキル、または  $C_{1-4}$  フルオロアルキルであり；

zz は 0 ~ 3 であり；

yy は 2 ~ 3 であり；

m は 0 ~ 2 であり；

n は 0 ~ 4 であり；

m と n の合計は少なくとも 1 でなければならない、

化合物。

(項目 38)

項目 37 に記載の化合物であって、ここで：

$R^1$  はクロロ、フルオロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、メチル、またはエチルであり；

存在する  $R^2$  の各々は、独立して、フルオロ、メチル、またはトリフルオロメチルであ

り；

m は 1 でありかつ n は 0 であるか、または m は 0 でありかつ n は 1 であるか、または m は 0 でありかつ n は 2 であるか、または m は 1 でありかつ n は 2 である、

化合物。

( 項目 3 9 )

項目 3 7 に記載の化合物であって、ここで：

G は  $-C(O)-R^{3h}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-R^{3h}$ 、 $-C(O)-O-R^{3h}$ 、 $-C(O)-CH_2-R^{3h}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-CH_2-R^{3h}$ 、または  $-C(O)-O-CH_2-R^{3h}$  である、

化合物。

( 項目 4 0 )

項目 3 7 に記載の化合物であって、ここで：

p は 1 であり；かつ

q は 1 である、

化合物。

( 項目 4 1 )

項目 1 ～ 4 0 のいずれか 1 項に記載の化合物および薬学的に受容可能なキャリアを含む薬学的組成物。

( 項目 4 2 )

治療有効量の項目 1 ～ 4 0 のいずれか 1 項に記載の化合物を患者に投与する工程を包含する、該患者における増殖性障害を治療する方法。

( 項目 4 3 )

前記増殖性障害が乳がん、肺がん、卵巣がん、多発性骨髄腫、急性骨髄性白血病、または急性リンパ芽球性白血病である、項目 4 2 に記載の方法。

( 項目 4 4 )

治療の必要がある患者において増殖性障害を治療するために使用するための項目 1 ～ 4 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩またはその薬学的組成物。

( 項目 4 5 )

前記増殖性障害が乳がん、肺がん、卵巣がん、多発性骨髄腫、急性骨髄性白血病、または急性リンパ芽球性白血病である、項目 4 4 に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩またはその薬学的組成物。

( 項目 4 6 )

活性成分としての項目 1 ～ 4 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩、および薬学的に受容可能なキャリアを含む、治療が必要な患者における増殖性障害の治療のための薬学的組成物。

( 項目 4 7 )

前記増殖性障害が乳がん、肺がん、卵巣がん、多発性骨髄腫、急性骨髄性白血病、または急性リンパ芽球性白血病である、項目 4 6 に記載の薬学的組成物。

( 項目 4 8 )

増殖性障害の治療のための薬学的組成物の調製のための項目 1 ～ 4 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩の使用。

( 項目 4 9 )

前記増殖性障害が乳がん、肺がん、卵巣がん、多発性骨髄腫、急性骨髄性白血病、または急性リンパ芽球性白血病である、項目 4 8 に記載の使用。

( 項目 5 0 )

治療が必要な患者における増殖性障害の治療のための、有効量の項目 1 ～ 4 0 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその薬学的に受容可能な塩またはその薬学的組成物の使用。

( 項目 5 1 )

前記増殖性障害が乳がん、肺がん、卵巣がん、多発性骨髄腫、急性骨髄性白血病、または急性リンパ芽球性白血病である、項目 5 0 に記載の使用。

( 項目 5 2 )

増殖性障害を治療するための医薬の製造における項目 1 ~ 4 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩の使用。

( 項目 5 3 )

前記増殖性障害が乳がん、肺がん、卵巣がん、多発性骨髄腫、急性骨髄性白血病、または急性リンパ芽球性白血病である、項目 5 2 に記載の使用。

( 項目 5 4 )

患者における H D A C 6 活性を阻害するのに有効な量の項目 1 ~ 4 0 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む薬学的組成物を投与する工程を包含する、該患者における H D A C 6 活性を阻害するための方法。