

【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 07D 209/44	(2006.01)
C 07D 401/06	(2006.01)
C 07D 217/06	(2006.01)
C 07D 417/06	(2006.01)
C 07D 413/06	(2006.01)
C 07D 405/06	(2006.01)
C 07D 413/12	(2006.01)
C 07D 401/12	(2006.01)
C 07D 417/14	(2006.01)
C 07D 417/04	(2006.01)
C 07D 403/06	(2006.01)
C 07D 223/16	(2006.01)
C 07D 217/04	(2006.01)
C 07D 413/14	(2006.01)
C 07D 409/06	(2006.01)
A 61K 31/4725	(2006.01)
A 61K 31/472	(2006.01)
A 61K 31/4035	(2006.01)
A 61K 31/55	(2006.01)
A 61P 43/00	(2006.01)
A 61P 35/00	(2006.01)
A 61P 35/02	(2006.01)
A 61P 37/08	(2006.01)
A 61P 29/00	(2006.01)
A 61P 19/02	(2006.01)
A 61P 37/06	(2006.01)
A 61P 7/02	(2006.01)
A 61P 9/12	(2006.01)
A 61P 9/00	(2006.01)
A 61P 9/04	(2006.01)

【F I】

C 07D 209/44	C S P
C 07D 401/06	
C 07D 217/06	
C 07D 417/06	
C 07D 413/06	
C 07D 405/06	
C 07D 413/12	
C 07D 401/12	
C 07D 417/14	
C 07D 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

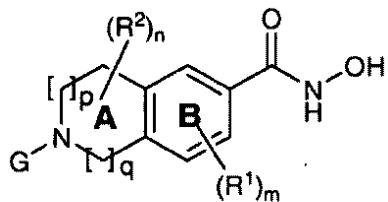
【補正の内容】

【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 ありかつ q は 3 もしくは 4 であるか、または p は 1 ありかつ q は 2 もしくは 3 であるか、または p は 2 ありかつ q は 1 もしくは 2 であり；
 G は - R³、- V₁ - R³、- V₁ - L₁ - R³、- L₁ - V₂ - R³、- L₁ - R³
 、または - L₁ - V₂ - L₂ - R³ 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 $C_{1 \sim 3}$ 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 $C_{1 \sim 6}$ 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 $C_{1 \sim 4}$ 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 $C_{1 \sim 4}$ 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、 $C_{1 \sim 3}$ アルキル、 $C_{1 \sim 3}$ ハロアルキル、 $-O-C_{1 \sim 3}$ アルキル、 $-O-C_{1 \sim 3}$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-NHC(O)C_{1 \sim 3}$ アルキル、 $-NHC(O)NHC_{1 \sim 3}$ アルキル、または $NHS(O)_2C_{1 \sim 3}$ 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、 $C_{1 \sim 3}$ アルキル、 $C_{1 \sim 3}$ ハロアルキル、 $-O-C_{1 \sim 3}$ アルキル、 $-O-C_{1 \sim 3}$ ハロアルキル、 $-NHC(O)C_{1 \sim 3}$ アルキル、 $-NHC(O)NHC_{1 \sim 3}$ アルキル、または $NHS(O)_2C_{1 \sim 3}$ アルキルであり；

m は 0 ~ 2 であり；

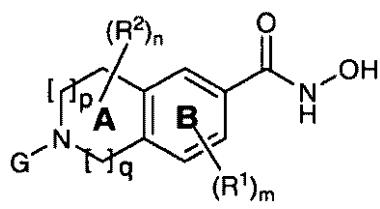
n は 0 ~ 4 である、

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 ありかつ q は 3 もしくは 4 であるか、または p は 1 ありかつ q は 2 もしくは 3 であるか、または p は 2 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 $C_{1 \sim 3}$ アルキレン鎖であり、ここで、1 個の炭素原子が $-C$

$R^A = CR^A$ - で置き換えられてもよく；

L_2 は非置換または置換 $C_{2 \sim 3}$ アルキレン鎖であり、ここで、1個の炭素原子が - C $R^A = CR^A$ - 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 - 、 - 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 $C_{1 \sim 6}$ 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 $C_{1 \sim 4}$ 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 $C_{1 \sim 4}$ 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；

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；

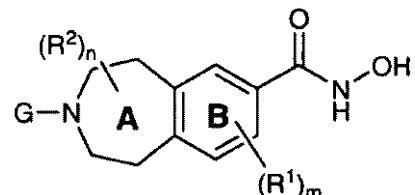
n は 0 ~ 2 である、

化合物。

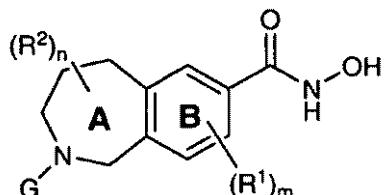
【請求項 4】

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

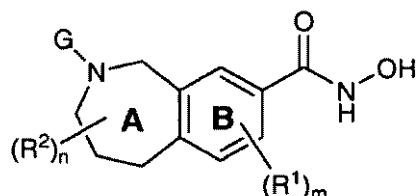
【化177】



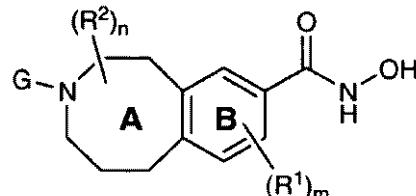
(II-C)



(II-D)

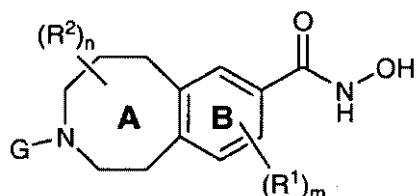


(II-E)



(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になって、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、 $C_{1~4}$ 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。

【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；

R³ 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、- NHCO(O)C_{1 ~ 6} アルキル、- NHCO_{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、- NHCO(O)NHC_{1 ~ 6} アルキル、- NHCO(O)N(C_{1 ~ 6} アルキル)₂、または - NHSCO₂C_{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、- NHCO(O)C_{1 ~ 6} アルキル、- NHCO_{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、- NHCO(O)NHC_{1 ~ 6} アルキル、- NHCO(O)N(C_{1 ~ 6} アルキル)₂、または - NHSCO₂C_{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；

R³ 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；

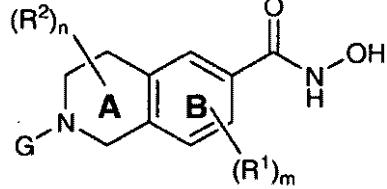
存在する R^{5a} の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、C_{1 ~ 4} アルキル、C_{1 ~ 6} フルオロアルキル、- O - C_{1 ~ 6} アルキル、- O - C_{1 ~ 6} フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、- NHCO(O)C_{1 ~ 6} アルキル、- NHCO_{1 ~ 6} アルキル、- N(C_{1 ~ 6} アルキル)₂、- C(O)NHC_{1 ~ 6} アルキル、- C(O)N(C_{1 ~ 6} アルキル)₂、- NHCO(O)NHC_{1 ~ 6} アルキル、- NHCO(O)N(C_{1 ~ 6} アルキル)₂、または - NHSCO₂C_{1 ~ 6} アルキルである、

化合物。

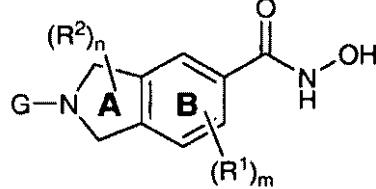
【請求項 9】

化学式 (II-A) または (II-B) の化合物：

【化 178】



または



(II-A)

(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 - R³、 - V₁ - R³、 - V₁ - L₁ - R³、 - L₁ - V₂ - R³、 - L₁ - R³ 、または - L₁ - V₂ - L₂ - R³ であり；

L₁ および L₂ は、各々独立して、非置換もしくは置換 C₁ ~ 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く；

V₁ は - S (O)₂ - であり；

V₂ は - C (O) - 、 - C (S) - 、 - N (R^{4a}) - 、 - C (O) - N (R^{4a}) - 、 - N (R^{4a}) - C (O) - 、 - SO₂ - N (R^{4a}) - 、 - N (R^{4a}) - SO₂ - 、 - 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}) - SO₂ - N (R^{4a}) - であり；

R³ は非置換もしくは置換 C₁ ~ 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 C₁ ~ 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 C₁ ~ 4 脂肪族基であり；

B 環は m 個存在する R¹ で任意にさらに置換され；

存在する R¹ の各々は、独立して、ハロ、C₁ ~ 3 アルキル、C₁ ~ 3 ハロアルキル、- O - C₁ ~ 3 アルキル、- O - C₁ ~ 3 ハロアルキル、- CN、- NH C (O) C₁ ~ 3 アルキル、- NH C (O) NH C₁ ~ 3 アルキル、または N H S (O)₂ C₁ ~ 3 アルキルであり；

A 環は、n 個存在する R² で任意にさらに置換され；

存在する R² の各々は、独立して、ハロ、C₁ ~ 3 アルキル、C₁ ~ 3 ハロアルキル、- O - C₁ ~ 3 アルキル、- O - C₁ ~ 3 ハロアルキル、- NH C (O) C₁ ~ 3 アルキル、- NH C (O) NH C₁ ~ 3 アルキル、または N H S (O)₂ C₁ ~ 3 アルキルであり；

m は 0 ~ 2 であり；

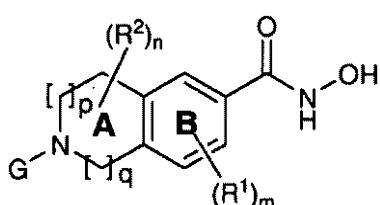
n は 0 ~ 4 である、

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

G は - R³、 - V₁ - R³、 - V₁ - L₁ - R³、 - L₁ - V₁ - R³、 - L₂ - V₂ - R³、 - V₁ - L₁ - V₂ - R³、 または - L₁ - R³ であり；

L₁ 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く；

L₂ 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 - C R^A = C R^A - で置き換えられてもよく；

V₁ は - C (S) - または - S (O)₂ - であり；

V₂ は - C (O) - 、 - C (S) - 、 - N (R^{4a}) - 、 - C (O) - N (R^{4a}) - 、 - N (R^{4a}) - C (O) - 、 - SO₂ - N (R^{4a}) - 、 - N (R^{4a}) - SO₂ - 、 - 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}) - SO₂ - N (R^{4a}) - であり；

R³ 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 R¹ で任意にさらに置換され；

存在する R¹ 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 R² で任意にさらに置換され；

存在する R² 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。

【請求項 1 1】

請求項 1 0 に記載の化合物であって、ここで：

G は - R³、 - V₁ - R³、 または - L₁ - R³ であり；かつ

V₁ は - S (O)₂ - であり；

R¹ 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 R² 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 1 2】

請求項 1 0 に記載の化合物であって、ここで：

R³ は、置換される場合、独立して存在する 1~4 個の - R⁵ で置換され、ここで、R⁵ は - R^{5a}、 - R^{5d}、 - L₃ - R^{5d}、 または - V₃ - L₃ - 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、- NO₂、- 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 (R⁵

^e) SO_2R^5 ^c 、 - $\text{N}(\text{R}^5$ ^e) $\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$ ^b 、 - $\text{N}(\text{R}^5$ ^e) $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5$ ^b) ₂ 、もしくは $\text{N}(\text{R}^5$ ^e) $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^5$ ^b) ₂ であるか、または R^5 ^d ^d 、ハロゲン、 - CN 、 - NO_2 、 - $\text{N}(\text{R}^5$ ^b) ₂ 、 - OR^5 ^b 、 - SR^5 ^c 、 - $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^5$ ^c 、 - $\text{S}(\text{O})\text{R}^5$ ^c 、 - $\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ ^b 、 - $\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$ ^b 、 - $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5$ ^b) ₂ 、 - $\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^5$ ^b) ₂ 、 - $\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5$ ^b) ₂ 、 - $\text{N}(\text{R}^5$ ^e) $\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ ^b 、 - $\text{N}(\text{R}^5$ ^e) SO_2R^5 ^c 、 - $\text{N}(\text{R}^5$ ^e) $\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$ ^b 、 - $\text{N}(\text{R}^5$ ^e) $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5$ ^b) ₂ 、もしくは - $\text{N}(\text{R}^5$ ^e) $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^5$ ^b) ₂ で置換された $\text{C}_{1 \sim 4}$ 脂肪族であり；

存在する R^5 ^b の各々は、独立して、水素であるか、または $\text{C}_{1 \sim 6}$ 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^5 ^b が、それらが結合している窒素と一緒にになって、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^5 ^c の各々は、独立して、 $\text{C}_{1 \sim 6}$ 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^5 ^d 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^5 ^d ^d 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^5 ^e の各々は、独立して、水素または任意に置換された $\text{C}_{1 \sim 6}$ 脂肪族基であり；

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

L_3 は任意に置換された $\text{C}_{1 \sim 3}$ 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 1 3】

請求項 1 2 に記載の化合物であって、ここで：

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

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

$\text{R}^{6'}$ は水素、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ 脂肪族、 $\text{C}_{3 \sim 6}$ 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 $\text{R}^{6'}$ は、一緒にになって、 $\text{C}_{3 \sim 6}$ 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 1 4】

請求項 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 $- NHS(O)_2C_{1~6}$ 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、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 1 5】

p が 1 ありかつ q が 1 である、請求項 1 4 に記載の化合物。

【請求項 1 6】

請求項 1 3 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、 $- N(C_{1~6} \text{ アルキル})_2$

~₆ アルキル)~₂、-C(=O)NHC₁~₆ アルキル、-C(=O)N(C₁~₆ アルキル)~₂、-NHC(=O)NHC₁~₆ アルキル、-NHC(=O)N(C₁~₆ アルキル)~₂、または-NHS(=O)~₂C₁~₆ アルキルである、化合物。

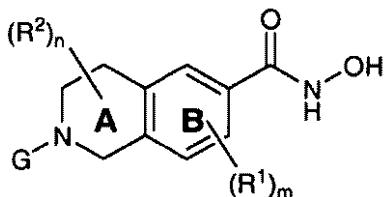
【請求項 17】

p が 1 でありかつ q が 1 である、請求項 16 に記載の化合物。

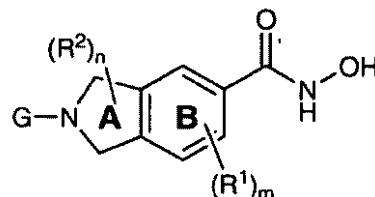
【請求項 18】

化学式 (II-A) または (II-B) の化合物：

【化 180】



または



(II-A)

(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(R⁶)(R⁶')-R³、-C(=O)-[C(R⁶)(R⁶')]_u-R³ 、または -C(=O)-NH-[C(R⁶)(R⁶')]_u-R³ であり；

R⁶ は水素、C₁~₄ 脂肪族、C₃~₆ 脂環式、もしくは 6~10 員アリールであり；

R⁶' は水素、C₁~₄ 脂肪族、C₃~₆ 脂環式、もしくは 6~10 員アリールであるか；または

R⁶ および R⁶' は、一緒にになって、C₃~₆ 脂環式基を形成し；

ここで、存在する R⁶ の少なくとも 1 個は R⁶'' であり；

R⁶'' は C₁~₄ 脂肪族、C₃~₆ 脂環式、または 6~10 員アリールであり；

R³ は -R³^d であり；

R³^d は非置換もしくは置換 C₁~₆ 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、R³^d は、置換される場合、独立して存在する 0~2 個の -R⁵^a で置換され；

存在する R⁵^a の各々は、独立して、ハロゲン、C₁~₃ 脂肪族、-CN、-NO₂、-N(R⁵^b)₂、-OR⁵^b、-SR⁵^c、-S(O)₂R⁵^c、-S(O)R⁵^c、-C(=O)R⁵^b、-C(=O)OR⁵^b、-C(=O)N(R⁵^b)₂、-S(O)₂N(R⁵^b)₂、-OC(O)N(R⁵^b)₂、-N(R⁵^e)C(=O)R⁵^b、-N(R⁵^e)SO₂R⁵^c、-N(R⁵^e)C(=O)OR⁵^b、-N(R⁵^e)C(=O)N(R⁵^b)₂ もしくは -N(R⁵^e)SO₂N(R⁵^b)₂ であるか、または R⁵^d、ハロゲン、-CN、-NO₂、-N(R⁵^b)₂、-OR⁵^b、-SR⁵^c、-S(O)₂R⁵^c、-S(O)R⁵^c、-C(=O)R⁵^b、-C(=O)OR⁵^b、-C(=O)N(R⁵^b)₂、-S(O)₂N(R⁵^b)₂、-OC(O)N(R⁵^b)₂、-N(R⁵^e)C(=O)R⁵^b、-N(R⁵^e)SO₂R⁵^c、-N(R⁵^e)C(=O)OR⁵^b、-N(R⁵^e)C(=O)N(R⁵^b)₂ もしくは -N(R⁵^e)SO₂N(R⁵^b)₂ で置換された C₁~₄ 脂肪族であり；

存在する R⁵^b の各々は、独立して、水素であるか、または C₁~₆ 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^5 b は、これらが結合している窒素原子と一緒にになって、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^5 c 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^5 d d 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^5 e 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、-NHCO_{1 ~ 3} アルキル、-NHCO_{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、-NHCO_{1 ~ 3} アルキル、-NHCO_{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；

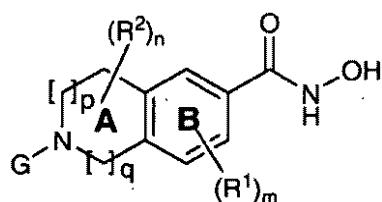
n は 0 ~ 4 である、

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

G は -C(O)-[C(R⁶')(R⁶')]zz-R³g、-C(O)-N(R⁴a)-[C(R⁶')(R⁶')]zz-R³g'、-C(O)-O-[C(R⁶')(R⁶')]zz-R³g'、-C(O)-C(R⁶')(R⁶')]yy-V_{2a}-R³g、-C(O)-N(R⁴a)-[C(R⁶')(R⁶')]yy-V_{2a}-R³g、-C(O)-O-[C(R⁶')(R⁶')]yy-V_{2a}-R³g または -C(O)-O-[C(R⁶')(R⁶')]yy-V_{2a}-R³g であり；

R⁶ 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；

R⁶' 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 $C_{3 \sim 6}$ 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 $C_{1 \sim 4}$ 脂肪族、 $C_{3 \sim 6}$ 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 $C_{1 \sim 6}$ 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 $C_{1 \sim 4}$ 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；

z は 1 ~ 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 20】

請求項 19 に記載の化合物であって、ここで：

G は - $C(O)$ - [$C(R^6)(R^{6'})$] z_z - R^{3g} 、- $C(O)NH$ - [$C(R^6)(R^{6'})$] z_z - $R^{3g'}$ 、または - $C(O)$ - [$C(R^6)(R^{6'})$] y_y - V_{2a} - 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。

【請求項 21】

請求項 19 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、 $C_{1 \sim 3}$ 脂肪族、- CN 、- NO_2 、- $N(R^{5b})_2$ 、- OR^{5b} 、- SR^{5c} 、- $S(O)_2R^{5c}$ 、- $S(O)R^{5c}$ 、- $C(O)R^{5b}$ 、- $C(O)OR^{5b}$ 、- $C(O)N(R^{5b})_2$ 、- $S(O)_2N(R^{5b})_2$ 、- $OC(O)N(R^{5b})_2$ 、- $N(R^{5e})C(O)R^{5b}$ 、- $N(R^{5e})$

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

存在する R^5 b の各々は、 独立して、 水素であるか、 または $\text{C}_{1 \sim 6}$ 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^5 b は、 これらが結合している窒素原子と一緒にになって、 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^5 c の各々は、 独立して、 $\text{C}_{1 \sim 6}$ 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^5 d 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^5 d d 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^5 e の各々は、 独立して、 水素または任意に置換された $\text{C}_{1 \sim 6}$ 脂肪族基であり；

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

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

【請求項 2 2】

請求項 2 1 に記載の化合物であって、 ここで：

G は - $\text{C}(\text{O})$ - [$\text{C}(\text{R}^6)$ ($\text{R}^{6'}$)] $_{z \ z}$ - $\text{R}^{3 \ g}$ 、 - $\text{C}(\text{O})$ - NH - [$\text{C}(\text{R}^6)$ ($\text{R}^{6'}$)] $_{z \ z}$ - $\text{R}^{3 \ g'}$ 、 - $\text{C}(\text{O})$ - [$\text{C}(\text{R}^6)$ ($\text{R}^{6'}$)] $_{y \ y}$ - $\text{V}_{2 \ a}$ - $\text{R}^{3 \ g}$ 、 または - $\text{C}(\text{O})$ - $\text{C}(\text{R}^6)$ ($\text{R}^{6'}$) - $\text{V}_{2 \ a}$ 、 - $\text{R}^{3 \ g}$ であり；

R^6 は水素もしくは $\text{C}_{1 \sim 4}$ 脂肪族であり；

$\text{R}^{6'}$ は水素もしくは $\text{C}_{1 \sim 4}$ 脂肪族であるか； または

R^6 および $\text{R}^{6'}$ は、 一緒にになって、 $\text{C}_{3 \sim 6}$ 脂環式基を形成し；

$\text{R}^{6'}$ は $\text{C}_{1 \sim 4}$ 脂肪族であり；

$\text{V}_{2 \ a}$ は - O - または - NH - であり；

$\text{V}_{2 \ a'}$ 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 2 3】

請求項 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。

【請求項 2 4】

p が 1 ありかつ q が 1 である、請求項 2 3 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

請求項 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 ~ 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。

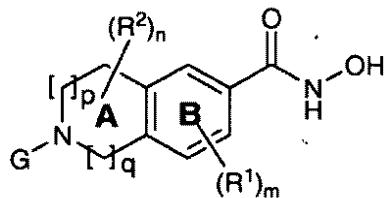
【請求項 2 6】

p が 1 ありかつ q が 1 である、請求項 2 5 に記載の化合物。

【請求項 2 7】

化学式 (I) の化合物：

【化182】



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

$R^{3\ e}$ 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；

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

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

存在する $R^{4\ a}$ 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；

$z\ z$ 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28】

請求項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。

【請求項29】

請求項27に記載の化合物であって、ここで：

$R^{3\ e}$ は、置換される場合、0～1個存在する- $R^{5\ a}$ および0～1個存在する- $R^{5\ d}$ 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 $C_{1~6}$ アルキル、-N($C_{1~6}$ アルキル) $_2$ 、-C(O)NHC $C_{1~6}$ アルキル、-C(O)N($C_{1~6}$ アルキル) $_2$ 、-NHC(O)NHC $C_{1~6}$ アルキル、-NHC(O)N($C_{1~6}$ アルキル) $_2$ 、または-NHS(O) $C_{1~6}$ アルキルであり；

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；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 $C_{1~6}$ アルキル、-N($C_{1~6}$ アルキル) $_2$ 、-C(O)NHC $C_{1~6}$ アルキル、-C(O)N($C_{1~6}$ アルキル) $_2$ 、-NHC(O)NHC $C_{1~6}$ アルキル、-NHC(O)N($C_{1~6}$ アルキル) $_2$ 、または-NHS(O) $C_{1~6}$ 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、ブリニル、ブテリジニル、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；

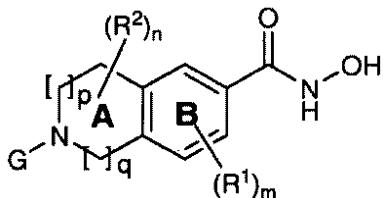
p は 1 であり；

q は 1 である、化合物。

【請求項 32】

化学式 (I) の化合物：

【化183】



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

G は $-C(O)-(CH_2)_{z-2}-R^{3f}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-(CH_2)_z$
 $-R^{3f}$ 、 $-C(O)-O-(CH_2)_{z-2}-R^{3f}$ 、 $-C(O)-CH_2-V_{2a}$ 、
 $-R^{3f}$ 、 $-C(O)-(CH_2)_{y-2}-V_{2a}-R^{3f}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-(CH_2)_{y-2}-V_{2a}-R^{3f}$ 、または $-C(O)-O-(CH_2)_{y-2}-V_{2a}-R^{3f}$ 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^{5a} で置換され；

存在する R^{5a} 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、 $-N(C_{1-6}$ 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、 $-OH$ 、 $-O(C_{1-6}$ アルキル)、 $-CN$ 、 $-N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、 $-NH(C_{1-6}$ アルキル)、 $-C(O)(C_{1-6}$ アルキル)、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_{1-6}$ アルキル)、 $-C(O)NH_2$ 、または $-C(O)NH(C_{1-6}$ 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、 $-N(C_{1-6}$ 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；

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、C₁～₄アルキル、またはC₁～₄フルオロアルキルであり；

A環はn個存在するR²で任意にさらに置換され；

存在するR²の各々は、独立して、フルオロ、C₁～₄アルキル、またはC₁～₄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33】

請求項32に記載の化合物であって、ここで：

R¹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R²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34】

請求項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)-CH₂-R^{3f}、-C(=O)-N(R^{4a})-CH₂-R^{3f}、または-C(=O)-O-CH₂-R^{3f}である、

化合物。

【請求項35】

請求項32に記載の化合物であって、ここで：

存在するR^{5a}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)CH₃、-NHC(=O)-シクロプロピル、-C(=O)NHCCH₃、-NHC(=O)NHCCH₃、-NHS(=O)₂CH₃、-NHCCH₃、-N(CH₃)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36】

請求項32に記載の化合物であって、ここで：

pは1であり；かつ

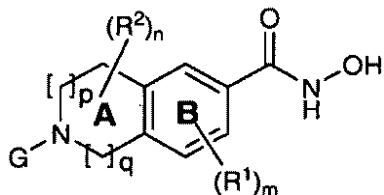
qは1である、

化合物。

【請求項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 ありかつ q は 1 であるか、または p は 1 ありかつ q は 1 であり；

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

$R^{3\ h}$ 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 $3\sim 6$ 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 $1\sim 2$ 個のヘテロ原子を有する非置換もしくは置換 $4\sim 6$ 員ヘテロシクリル、または非置換もしくは置換 $6\sim 10$ 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 $1\sim 2$ 個のヘテロ原子を有する置換 $5\sim 10$ 員ヘテロアリールであり；ここで、 $R^{3\ h}$ は、置換される場合、 $0\sim 2$ 個存在する $R^{5\ a\ a\ a}$ で置換され；

存在する $R^{5\ a\ a\ a}$ 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；

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

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

存在する $R^{4\ a}$ 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；

$z\ z$ は $0\sim 3$ であり；

$y\ y$ は $2\sim 3$ であり；

m は $0\sim 2$ であり；

n は $0\sim 4$ 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 3 8】

請求項 3 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 1 ありかつ n は 0 であるか、または m は 0 ありかつ n は 1 であるか、または m は 0 ありかつ n は 2 であるか、または m は 1 ありかつ n は 2 である、化合物。

【請求項 3 9】

請求項 3 7 に記載の化合物であって、ここで：

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

【請求項 4 0】

請求項 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。

【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

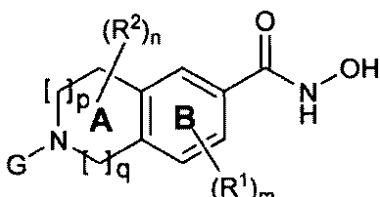
【補正対象項目名】0 0 2 7

【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 $-C(O)-(CH_2)_{z-z}-R^{3h}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-(CH_2)_z-z-R^{3h}$ 、 $-C(O)-O-(CH_2)_{z-z}-R^{3h}$ 、 $-C(O)-CH_2-V_{2a}$ 、 $-R^{3h}$ 、 $-C(O)-(CH_2)_{y-y}-V_{2a}-R^{3h}$ 、 $-C(O)-N(R^{4a})-(CH_2)_{y-y}-V_{2a}-R^{3h}$ 、または $-C(O)-O-(CH_2)_{y-y}-V_{2a}-R^{3h}$ 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 $R^{5a a a}$ で置換され；

存在する $R^{5a a a}$ 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；

$z-z$ 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；

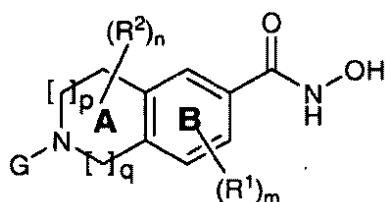
m と n の合計は少なくとも 1 でなければならない。

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；

G は - R³、 - V₁ - R³、 - V₁ - L₁ - R³、 - L₁ - V₂ - R³、 - L₁ - R³、または - L₁ - V₂ - L₂ - R³ であり；

L₁ および L₂ は各々独立して非置換もしくは置換 C₁ ~ 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く；

V₁ は - C (O) - 、 - C (S) - 、 - C (O) - N (R^{4a}) - 、 - C (O) - O - 、または - S (O)₂ - であり；

V₂ は - C (O) - 、 - C (S) - 、 - N (R^{4a}) - 、 - C (O) - N (R^{4a}) - 、 - N (R^{4a}) - C (O) - 、 - SO₂ - N (R^{4a}) - 、 - N (R^{4a}) - SO₂ - 、 - 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}) - SO₂ - N (R^{4a}) - であり；

R³ は非置換もしくは置換 C₁ ~ 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 C₁ ~ 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 C₁ ~ ₄ 脂肪族基であり；

B 環は m 個存在する R¹ で任意にさらに置換され；

存在する R¹ の各々は、独立して、ハロ、C₁ ~ ₃ アルキル、C₁ ~ ₃ ハロアルキル、- O - C₁ ~ ₃ アルキル、- O - C₁ ~ ₃ ハロアルキル、- CN、- NH C (O) C₁ ~ ₃ アルキル、- NH C (O) NH C₁ ~ ₃ アルキル、または N H S (O)₂ C₁ ~ ₃ アルキルであり；

A 環は n 個存在する R² で任意にさらに置換され；

存在する R² の各々は、独立して、ハロ、C₁ ~ ₃ アルキル、C₁ ~ ₃ ハロアルキル、- O - C₁ ~ ₃ アルキル、- O - C₁ ~ ₃ ハロアルキル、- NH C (O) C₁ ~ ₃ アルキル、- NH C (O) NH C₁ ~ ₃ アルキル、または N H S (O)₂ C₁ ~ ₃ アルキルであり；

m は 0 ~ 2 であり；

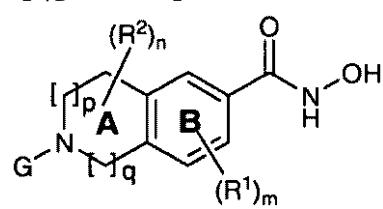
n は 0 ~ 4 である、

化合物またはその薬学的に受容可能な塩。

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

G は - R³、 - V₁ - R³、 - V₁ - L₁ - R³、 - L₁ - V₁ - R³、 - L₂ - V₂ - R³、 - V₁ - L₁ - V₂ - R³、 または - L₁ - R³ であり；

L₁ 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 = C R^A - で置き換えられてもよく；

L₂ 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 - C R^A = C R^A - で置き換えられてもよく；

V₁ は - C(O) - 、 - C(S) - 、 - C(O) - N(R^{4a}) - 、 - C(O) - O - 、 または - S(O)₂ - であり；

V₂ は - C(O) - 、 - C(S) - 、 - N(R^{4a}) - 、 - C(O) - N(R^{4a}) - 、 - N(R^{4a}) - C(O) - 、 - SO₂ - N(R^{4a}) - 、 - N(R^{4a}) - SO₂ - 、 - 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}) - SO₂ - N(R^{4a}) - であり；

R³ 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 R¹ で任意にさらに置換され；

存在する R¹ 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 R² で任意にさらに置換され；

存在する R² 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：

V₁ は - C(O) - 、 - C(O) - NH - 、 または - S(O)₂ - であり；

V₂ は - NH - または - O - であり；

R¹ 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 R² 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；

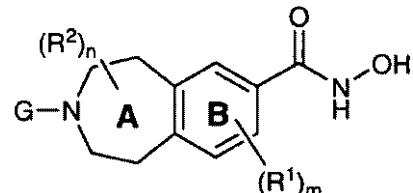
n は 0~2 である、

化合物。

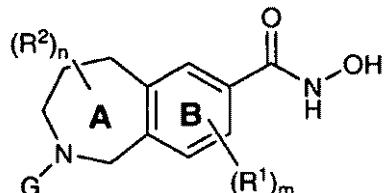
(項目 4)

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

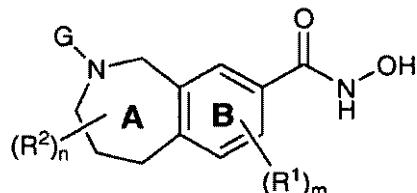
【化177】



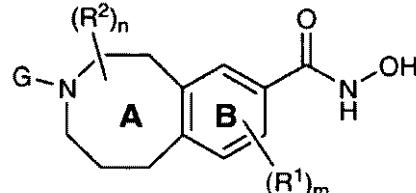
(II-C)



(II-D)

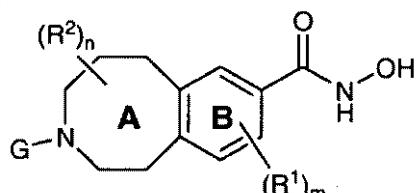


(II-E)



(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、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{5b})_2$ 、 $-OR^{5b}$ 、 $-SR^{5c}$ 、 $-S(O)_2R^{5c}$ 、 $-S(O)R^{5c}$ 、 $-C(O)R^{5b}$ 、 $-C(O)OR^{5b}$ 、 $-C(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{5b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-N(R^{5e})C(O)R^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)SO_2R^{5c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5b})_2$ 、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になって、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 個の炭素原子が $-C(R^A = C R^A -)$ 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；

R³ は - R³^a であり；

R³^a 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、R³^a は、置換される場合には、0 ~ 1 個存在する - R⁵^a および 1 個存在する - R⁵^d で置換され；

R⁵^a 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；

R⁵^d は非置換であるかまたは 1 ~ 2 個存在する - R⁷^a で置換され；

存在する R⁷^a 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 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；

R³ は - R³^d であり；

R³^d 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、R³^d は、置換される場合には、1 ~ 2 個存在する - R⁵^a で置換され；

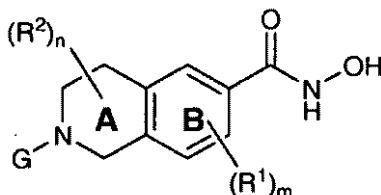
存在する R⁵^a の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、C_{1 ~ 4} アルキル、C_{1 ~ 6} フルオロアルキル、-O-C_{1 ~ 6} アルキル、-O-C_{1 ~ 6} フルオロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、-NHC(O)C_{1 ~ 6} アルキル、-NHC_{1 ~ 6} アルキル、-N(C_{1 ~ 6} アルキル)₂、-C(O)NHC_{1 ~ 6} アルキル、-C(O)N(C_{1 ~ 6} アルキル)₂、-NHC(O)NHC_{1 ~ 6} アルキル、-NHC(O)N(C_{1 ~ 6} アルキル)₂、または -NHS(O)₂C_{1 ~ 6} アルキルである、

化合物。

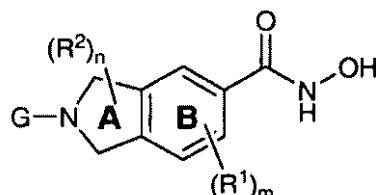
(項目 9)

化学式 (II-A) または (II-B) の化合物：

【化178】



または



(II-A)

(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；

L₁ および L₂ 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；

V₁ は $-S(O)_2-$ であり；

V₂ 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；

R³ 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 R¹ で任意にさらに置換され；

存在する R¹ 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 R² で任意にさらに置換され；

存在する R² 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；

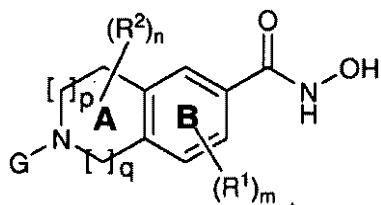
n は 0 ~ 4 である、

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 - R³、- V₁ - R³、- V₁ - L₁ - R³、- L₁ - V₁ - R³、- L₂ - V₂ - R³、- V₁ - L₁ - V₂ - R³、または - L₁ - R³ であり；

L₁ 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く；

L₂ 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 - C_R^A = C_R^A - で置き換えられてもよく；

V₁ は - C(S) - または - S(O)₂ - であり；

V₂ は - C(O) - 、- C(S) - 、- N(R^{4a}) - 、- C(O) - N(R^{4a}) - 、- N(R^{4a}) - C(O) - 、- SO₂ - N(R^{4a}) - 、- N(R^{4a}) - SO₂ - 、- 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}) - SO₂ - N(R^{4a}) - であり；

R³ 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 R¹ で任意にさらに置換され；

存在する R¹ 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 R² で任意にさらに置換され；

存在する R² 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 - R³、- V₁ - R³、または - L₁ - R³ であり；かつ

V₁ は - S(O)₂ - であり；

R¹ 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、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{5b})_2$ 、 $-OR^{5b}$ 、 $-SR^{5c}$ 、 $-S(O)_2R^{5c}$ 、 $-S(O)R^{5c}$ 、 $-C(O)R^{5b}$ 、 $-C(O)OR^{5b}$ 、 $-C(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{5b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-N(R^{5e})C(O)R^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})SO_2R^{5c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)OR^{5b}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{5b})_2$ 、 $-N(R^{5e})SO_2N(R^{5b})_2$ 、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になって、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^{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；

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13)

項目12に記載の化合物であって、ここで：

Gは - [C (R⁶) (R^{6'})]_z - R³、 - [C (R⁶) (R^{6'})]_y - V_{2a} - R³、 - S (O)₂ - [C (R⁶) (R^{6'})]_y - V_{2a} - R³、 - S (O)₂ - C (R⁶) (R^{6'}) - V_{2a} - R³、または - S (O)₂ - [C (R⁶) (R^{6'})]_z - R³であり；

R⁶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

R⁶およびR^{6'}は、一緒にになって、C_{3~6}脂環式基を形成し；

V_{2a}は-O-または-NH-であり；

R¹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R²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14)

項目13に記載の化合物であって、ここで：

Gは - [C (R⁶) (R^{6'})]_z - R³ または - S (O)₂ - [C (R⁶) (R^{6'})]_z - R³ であり；

mは0であり；

nは0であり；

zは0~1であり；

R³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}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}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15)

pが1でありかつqが1である、項目14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；

R³ は - R³_d であり；

R³_d 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、R³_d は、置換される場合、独立して存在する 0～2 個の - R⁵_a で置換され；

存在する R⁵_a 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、- NH C(O) C_{1～6} アルキル、- NH C_{1～6} アルキル、- N(C_{1～6} アルキル)₂、- C(O) NH C_{1～6} アルキル、- C(O) N(C_{1～6} アルキル)₂、- NH C(O) NH C_{1～6} アルキル、- NH C(O) N(C_{1～6} アルキル)₂、または - NH S(O) C_{1～6} アルキルである、

化合物。

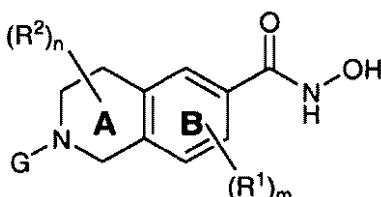
(項目 17)

p が 1 ありかつ q が 1 である、項目 16 に記載の化合物。

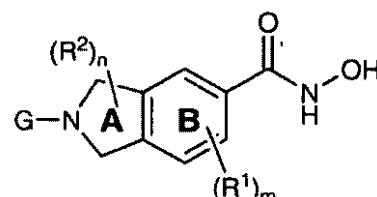
(項目 18)

化学式 (II-A) または (II-B) の化合物：

【化 180】



または



(II-A)

(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(R⁶)(R^{6'}) - R³、- C(O) - [C(R⁶)(R^{6'})]_u - R³ 、または - C(O) - NH - [C(R⁶)(R^{6'})]_u - R³ であり；

R⁶ 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

R⁶ 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 R⁶ 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；

R³ は - R³_d であり；

R³_d 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、R³_d は、置換される場合、独立して存在する 0～2 個の - R⁵_a で置換され；

存在する R⁵_a の各々は、独立して、ハロゲン、C_{1～3} 脂肪族、- CN、- NO₂、- N(R⁵_b)₂、- OR⁵_b、- SR⁵_c、- S(O)₂R⁵_c、- S(O)R⁵_c、

$-C(O)R^5b$ 、 $-C(O)OR^5b$ 、 $-C(O)N(R^5b)_2$ 、 $-S(O)_2N(R^5b)_2$ 、 $-OC(O)N(R^5b)_2$ 、 $-N(R^5e)C(O)R^5b$ 、 $-N(R^5e)SO_2R^5c$ 、 $-N(R^5e)C(O)OR^5b$ 、 $-N(R^5e)C(O)N(R^5b)_2$ もしくは $-N(R^5e)SO_2N(R^5b)_2$ であるか、または $R^{5d}d$ 、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になって、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 $R^{5d}d$ 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；

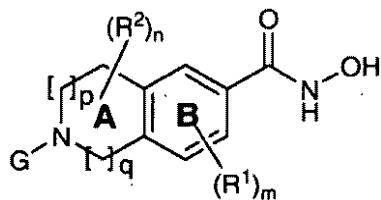
n は0~4である、

化合物。

(項目19)

化学式(I)の化合物：

【化181】



(I)

またはその薬学的に受容可能な塩であつて、

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；

$z z$ は 1 ~ 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。

(項目20)

項目19に記載の化合物であって、ここで：

G は $-C(O)-[C(R^6)(R^{6'})]_{z,z}-R^3g$ 、 $-C(O)-NH-[C(R^6)(R^{6'})]_{y,y}-V_{2a}-R^3g$ 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21)

項目19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になって、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})SO₂-、-N(R^{5e})C(O)O-、-N(R^{5e})C(O)N(R^{5e})-、-N(R^{5e})SO₂N(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。

(項目22)

項目21に記載の化合物であって、ここで：

Gは-C(O)-[C(R⁶)(R^{6'})]_{zz}-R^{3g}、-C(O)-NH-[C(R⁶)(R^{6'})]_{yy}-V_{2a}-R^{3g}、または-C(O)-C(R⁶)(R^{6'})-V_{2a}-R^{3g}であり；

R⁶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

R⁶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；

R¹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 R² 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23)

項目22に記載の化合物であって、ここで：

Gは-C(O)-C(R⁶)(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、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、 $C_{1 \sim 6}$ 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、-NH₂ C(O)C_{1~6} アルキル、-NH₂C_{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、-NH₂C(O)NHC_{1~6} アルキル、-NH₂C(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、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{1 \sim 6}$ 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、-NH₂ C(O)C_{1~6} アルキル、-NH₂C_{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、-NH₂C(O)NHC_{1~6} アルキル、-NH₂C(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24)

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 ⁶) (R ⁶ ') - R ³ g であり；

m は 0 であり；

n は 0 であり；

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

存在する R ⁵ a 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 - NH₂ C _{1 ~ 6} アルキルである、

化合物。

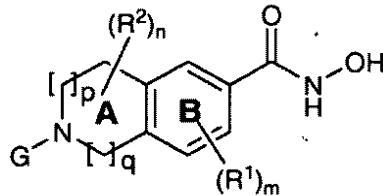
(項目 2 6)

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) - (C H ₂) _{z z} - R ³ e 、 - C (O) - N (R ⁴ a) - (C H ₂) _z - R ³ e 、 - C (O) - O - (C H ₂) _{z z} - R ³ e 、 - C (O) - C H ₂ - V _{2 a} - R ³ e 、 - C (O) - (C H ₂) _{y y} - V _{2 a} - R ³ e 、 - C (O) - N (R ⁴ a) - (C H ₂) _{y y} - V _{2 a} - R ³ e 、または - C (O) - O - (C H ₂) _{y y} - V _{2 a} - R ³ e であり、

R ³ e 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 _{2 a} は - C (O) - 、 - O - 、 - S - 、 - N (R ⁴ a) - 、または - C (O) N (R ⁴ a) - であり；

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

存在する R ⁴ a 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。

(項目 28)

項目 27 に記載の化合物であって、ここで：

R¹ 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 R² 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 ~ 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 - NH₂ (O)C_{1 ~ 6} アルキルであり；

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；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 - NH₂ (O)C_{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) - CH₂ - R^{3e}、- C(O) - N(R^{4a}) - CH₂ - R^{3e}、または - C(O) - O - CH₂ - 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 - 4 H - フロ [3, 2 - b] ピロリル、ピラゾロピリミジニル、ブリニル、ブテリジニル、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：

R¹ 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 R² 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；

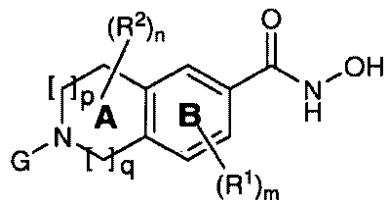
q は 1 である、

化合物。

(項目 32)

化学式 (I) の化合物：

【化183】



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

G は - C (O) - (CH₂)_{2~2} - R^{3 f}、- C (O) - N (R^{4 a}) - (CH₂)_{2~2} - R^{3 f}、- C (O) - O - (CH₂)_{2~2} - R^{3 f}、- C (O) - CH₂ - V_{2 a}、- R^{3 f}、- C (O) - (CH₂)_{2~2} - V_{2 a} - R^{3 f}、- C (O) - N (R^{4 a}) - (CH₂)_{2~2} - V_{2 a} - R^{3 f}、または - C (O) - O - (CH₂)_{2~2} - V_{2 a} - R^{3 f} であり；

R^{3 f} 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^{3 f} は独立して存在する 1~2 個の R^{5 a a} で置換され；

存在する R^{5 a a} の各々は、独立して、シアノ、ヒドロキシ、1~2 個存在する R⁷ または R⁸ 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)₂ C_{1~6} アルキル、- NHC_{1~6} アルキル、- N (C_{1~6} アルキル)₂、または 1~2 個存在する - R^{7 a} で置換されたフェニルであり；

存在する R⁷ 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 R⁸ の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、- OH、- O (C_{1~6} アルキル)、- CN、- N (C_{1~6} アルキル)₂、- NH (C_{1~6} アルキル)、- C (O) (C_{1~6} アルキル)、- CO₂H、- CO₂ (C_{1~6} アルキル)、- C (O) NH₂、または - C (O) NH (C_{1~6} アルキル) であり；

存在する R^{7 a} 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 $-NHS(O)_2C_{1-6}$ アルキルであり；

V_{2a} は $-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-N(R^{4a})-$ 、または $-C(O)N(R^{4a})-$ 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 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^{5a} 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、 $-NHC(O)CH_3$ 、 $-NHC(O)-$ シクロプロビル、 $-C(O)NHCCH_3$ 、 $-NHC(O)NHCCH_3$ 、 $-NHS(O)_2CH_3$ 、 $-NHCCH_3$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、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

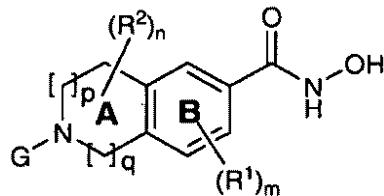
q は1である、

化合物。

(項目37)

化学式 (I) の化合物 :

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

G は - C (O) - (C H₂)_z - R^{3h}、- C (O) - N (R^{4a}) - (C H₂)_z - R^{3h}、- C (O) - O - (C H₂)_z - R^{3h}、- C (O) - C H₂ - V_{2a} - R^{3h}、- C (O) - (C H₂)_y - V_{2a} - R^{3h}、- C (O) - N (R^{4a}) - (C H₂)_y - V_{2a} - R^{3h}、または - C (O) - O - (C H₂)_y - V_{2a} - R^{3h} であり；

R^{3h} は非置換もしくは置換 C₁ ~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^{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、C₁ ~₄ アルキル、- O - C₁ ~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 C₁ ~₄ 脂肪族であり；

B 環は m 個存在する R¹ で任意にさらに置換され；

存在する R¹ の各々は、独立して、クロロ、フルオロ、- O - C₁ ~₄ アルキル、シアノ、ヒドロキシ、C₁ ~₄ アルキル、または C₁ ~₄ フルオロアルキルであり；

A 環は n 個存在する R² で任意にさらに置換され；

存在する R² の各々は、独立して、フルオロ、C₁ ~₄ アルキル、または C₁ ~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：

R¹ 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 R² 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39)

項目37に記載の化合物であって、ここで：

Gは-C(O)-R³h、-C(O)-N(R⁴a)-R³h、-C(O)-O-R³h、-C(O)-C₂H-R³h、-C(O)-N(R⁴a)-C₂H-R³h、または-C(O)-O-C₂H-R³hである、化合物。

(項目40)

項目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。

(項目41)

項目1～40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42)

治療有効量の項目1～40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43)

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42に記載の方法。

(項目44)

治療の必要がある患者において増殖性障害を治療する際に使用するための項目1～40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45)

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44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46)

活性成分としての項目1～40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47)

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46に記載の薬学的組成物。

(項目48)

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1～40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49)

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48に記載の使用。

(項目50)

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1～40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51)

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50に記載の使用。

(項目52)

増殖性障害を治療するための医薬の製造における項目1～40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53)

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、または急性リンパ球性白血病である、項目52に記載の使用。

(項目54)

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1～40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。