

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】令和7年3月5日(2025.3.5)

【国際公開番号】WO2022/192598

【公表番号】特表2024-509962(P2024-509962A)

【公表日】令和6年3月5日(2024.3.5)

【年通号数】公開公報(特許)2024-041

【出願番号】特願2023-555557(P2023-555557)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 1 7 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 7 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 5 / 1 7 (2 0 2 5 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 1 7 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 7 2 5 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 1 7 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 3 3 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 7 0 9 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 3 7 5 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 9 / 3 9 5 (2 0 0 6 . 0 1)

10

20

【 F I 】

C 0 7 D 4 1 7 / 0 4 C S P

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 P 3 7 / 0 4

A 6 1 K 3 5 / 1 7

A 6 1 K 3 1 / 5 1 7

A 6 1 K 3 1 / 4 7 2 5

C 0 7 D 4 1 7 / 1 4

A 6 1 K 3 1 / 4 3 3

A 6 1 K 3 1 / 4 7 0 9

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 1 2

A 6 1 K 3 1 / 4 3 7 5

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7

A 6 1 K 3 9 / 3 9 5 N

30

【手続補正書】

【提出日】令和7年2月25日(2025.2.25)

40

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

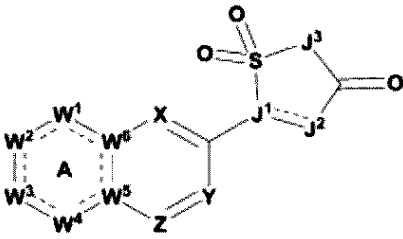
【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I-3)の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物：

50

【化 8 8 1】



式 (1-3)

10

(式中、

W^1 は、N、 $N(R^1)$ 、 $C(R^1)$ 、 $C(R^1)(R^{1a})$ 、 $C(O)$ 、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 、 $S(O)(NR^1)$ 、 $S(O)(R^1)$ 、または $P(O)(R^1)$ であり、
 W^2 は、N、 $N(R^2)$ 、 $C(R^2)$ 、 $C(R^2)(R^{2a})$ 、 $C(O)$ 、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 、 $S(O)(NR^2)$ 、 $S(O)(R^2)$ 、または $P(O)(R^2)$ であり、
 W^3 は、N、 $N(R^3)$ 、 $C(R^3)$ 、 $C(R^3)(R^{3a})$ 、 $C(O)$ 、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 、 $S(O)(NR^3)$ 、 $S(O)(R^3)$ 、または $P(O)(R^3)$ であり、
 W^4 は、N、 $N(R^4)$ 、 $C(R^4)$ 、 $C(R^4)(R^{4a})$ 、 $C(O)$ 、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 、 $S(O)(NR^4)$ 、 $S(O)(R^4)$ 、または $P(O)(R^4)$ であり、
 W^5 は、N または C であり、
 W^6 は、N または C であり、ここで、 W^1 、 W^2 、 W^3 、 W^4 、 W^5 、及び W^6 のうちの少なくとも1つは、N、 $N(R^1)$ 、 $N(R^2)$ 、 $N(R^3)$ 、または $N(R^4)$ であり、

20

X は、N または $C(R^5)$ であり、

Y は、N または $C(R^6)$ であり、

Z は、N または $C(R^7)$ であり、

J^1 は、N、C、または $C(R^8)$ であり、

J^2 は、N、 $N(R^9)$ 、 $C(R^9)$ 、 $C(R^9)(R^{9a})$ 、または $C(O)$ であり、

J^3 は、 $N(R^{10})$ であり、

30

R^1 及び R^{1a} は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、もしくは3つの R^{20a} で任意選択により置換され、または R^1 及び R^{1a} は、結合して、 C_{3-6} シクロアルキルもしくは C_{2-9} ヘテロシクロアルキルを形成し、ここで、前記 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{2-9} ヘテロシクロアルキルは、1、2、もしくは3つの R^{20a} で任意選択により置換され、

40

R^2 及び R^{2a} は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)$

50

$N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリーール、及び C_{1-9} ヘテロアリーールは、1、2、もしくは3つの R^{20b} で任意選択により置換され、または R^2 及び R^{2a} は、結合して、 C_{3-6} シクロアルキルもしくは C_{2-9} ヘテロシクロアルキルを形成し、ここで、前記 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{2-9} ヘテロシクロアルキルは、1、2、もしくは3つの R^{20b} で任意選択により置換され、 R^3 及び R^{3a} は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリーール、 C_{1-9} ヘテロアリーール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリーール、及び C_{1-9} ヘテロアリーールは、1、2、もしくは3つの R^{20c} で任意選択により置換され、または R^3 及び R^{3a} は、結合して、 C_{3-6} シクロアルキルもしくは C_{2-9} ヘテロシクロアルキルを形成し、ここで、前記 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{2-9} ヘテロシクロアルキルは、1、2、もしくは3つの R^{20c} で任意選択により置換され、 R^4 及び R^{4a} は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリーール、 C_{1-9} ヘテロアリーール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリーール、及び C_{1-9} ヘテロアリーールは、1、2、もしくは3つの R^{20d} で任意選択により置換され、または R^4 及び R^{4a} は、結合して、 C_{3-6} シクロアルキルもしくは C_{2-9} ヘテロシクロアルキルを形成し、ここで、前記 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{2-9} ヘテロシクロアルキルは、1、2、もしくは3つの R^{20d} で任意選択により置換され、 R^5 は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリーール、 C_{1-9} ヘテロアリーール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$

、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20e} で任意選択により置換され、

R^6 は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{16}$ 、 $-N(R^{12})(R^{16})$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20f} で任意選択により置換され、

R^7 は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20g} で任意選択により置換され、

R^8 は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20h} で任意選択により置換され、

R^9 及び R^{9a} は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$

10

20

30

40

50

、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、もしくは3つの R^{20i} で任意選択により置換され、または R^9 及び R^{9a} は、結合して、 C_{3-6} シクロアルキルもしくは C_{2-9} ヘテロシクロアルキルを形成し、ここで、前記 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{2-9} ヘテロシクロアルキルは、1、2、もしくは3つの R^{20i} で任意選択により置換され、 R^{10} 及び R^{10a} は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 $-R^{16}$ 、 $-OR^{16}$ 、 $-N(R^{12})(R^{16})$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、もしくは3つの R^{20j} で任意選択により置換され、または R^{10} 及び R^{10a} は、結合して、 C_{3-6} シクロアルキルもしくは C_{2-9} ヘテロシクロアルキルを形成し、ここで、前記 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{2-9} ヘテロシクロアルキルは、1、2、もしくは3つの R^{20j} で任意選択により置換され、各 R^{12} は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20k} で任意選択により置換され、各 R^{13} は、水素、 C_{1-6} アルキル、及び C_{1-6} ハロアルキルから独立して選択され、または R^{12} 及び R^{13} は、それらが結合している窒素と一緒に、1、2、もしくは3つの R^{20k} で任意選択により置換された C_{2-9} ヘテロシクロアルキル環を形成し、各 R^{14} は、水素、 C_{1-6} アルキル、及び C_{1-6} ハロアルキルから独立して選択され、各 R^{15} は、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} ヘテロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} ヘテロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20k} で任意選択により置換され、各 R^{16} は、 $-C_{1-6}$ アルキレン- $OP(O)(OR^{16a})(OR^{16b})$ 及び $-P(O)(OR^{16a})(OR^{16b})$ から独立して選択され、ここで、前記 C_{1-6} アルキレ

10

20

30

40

50

ンは、1、2、または3つの R^{201} で任意選択により置換され、

各 R^{16a} 及び R^{16b} は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20m} で任意選択により置換され、

各 R^{20a} 、 R^{20b} 、 R^{20c} 、 R^{20d} 、 R^{20e} 、 R^{20f} 、 R^{20g} 、 R^{20h} 、 R^{20i} 、 R^{20j} 、 R^{20k} 、 R^{20l} 、及び R^{20m} は、オキソ、 $-CN$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 C_{1-6} ヘテロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{21}$ 、 $-SR^{21}$ 、 $-N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-C(O)OR^{22}$ 、 $-C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-OC(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-N(R^{24})C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-N(R^{24})C(O)OR^{22}$ 、 $-N(R^{24})C(O)R^{25}$ 、 $-N(R^{24})S(O)_2R^{25}$ 、 $-C(O)R^{25}$ 、 $-S(O)_2R^{25}$ 、 $-S(O)_2N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-OCH_2C(O)OR^{22}$ 、

及び $-OC(O)R^{25}$ からそれぞれ独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 C_{1-6} ヘテロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、

及び C_{1-9} ヘテロアリールは、ハロゲン、オキソ、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 $-OR^{21}$ 、 $-SR^{21}$ 、 $-N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-C(O)OR^{22}$ 、 $-C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-OC(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-N(R^{24})C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-N(R^{24})C(O)OR^{25}$ 、 $-N(R^{24})C(O)R^{25}$ 、 $-N(R^{24})S(O)_2R^{25}$ 、 $-C(O)R^{25}$ 、 $-S(O)_2R^{25}$ 、 $-S(O)_2N(R^{22})(R^{23})$ 、及び $-OC(O)R^{25}$ から独立して選択される1、2、または3つの基で任意選択により置換され、

各 R^{21} は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから独立して選択され、

各 R^{22} は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから独立して選択され、

各 R^{23} は、H及び C_{1-6} アルキルから独立して選択され、

各 R^{24} は、H及び C_{1-6} アルキルから独立して選択され、

各 R^{25} は、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} ヘテロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから選択され、

【化882】

は、全ての原子価が満たされるような単結合または二重結合を示し、ただし、
環A

10

20

30

40

50

【化 8 8 3】

のうちの少なくとも2つは、二重結合である)。

【請求項2】

Xが、C(R⁵)である、請求項1に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項3】

Yが、C(R⁶)である、請求項2に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。 10

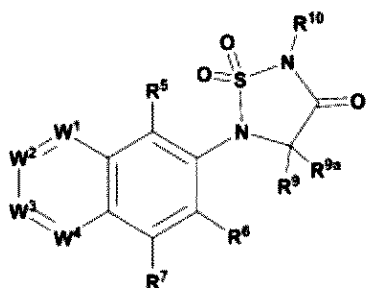
【請求項4】

Zが、C(R⁷)である、請求項3に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項5】

式(Ia-3)の構造を有する、請求項1に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物：

【化 8 8 5】



式(Ia-3)。

20

【請求項6】

W¹がNであり、W²がC(R²)であり、W³がC(R³)であり、W⁴がC(R⁴)である、請求項5に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。 30

【請求項7】

R²が水素であり、R³が水素であり、R⁴が水素である、請求項6に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項8】

R⁵が、水素及びハロゲンから選択される、請求項5に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項9】

R⁶が、-OHである、請求項5に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。 40

【請求項10】

R⁷が、水素である、請求項5に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

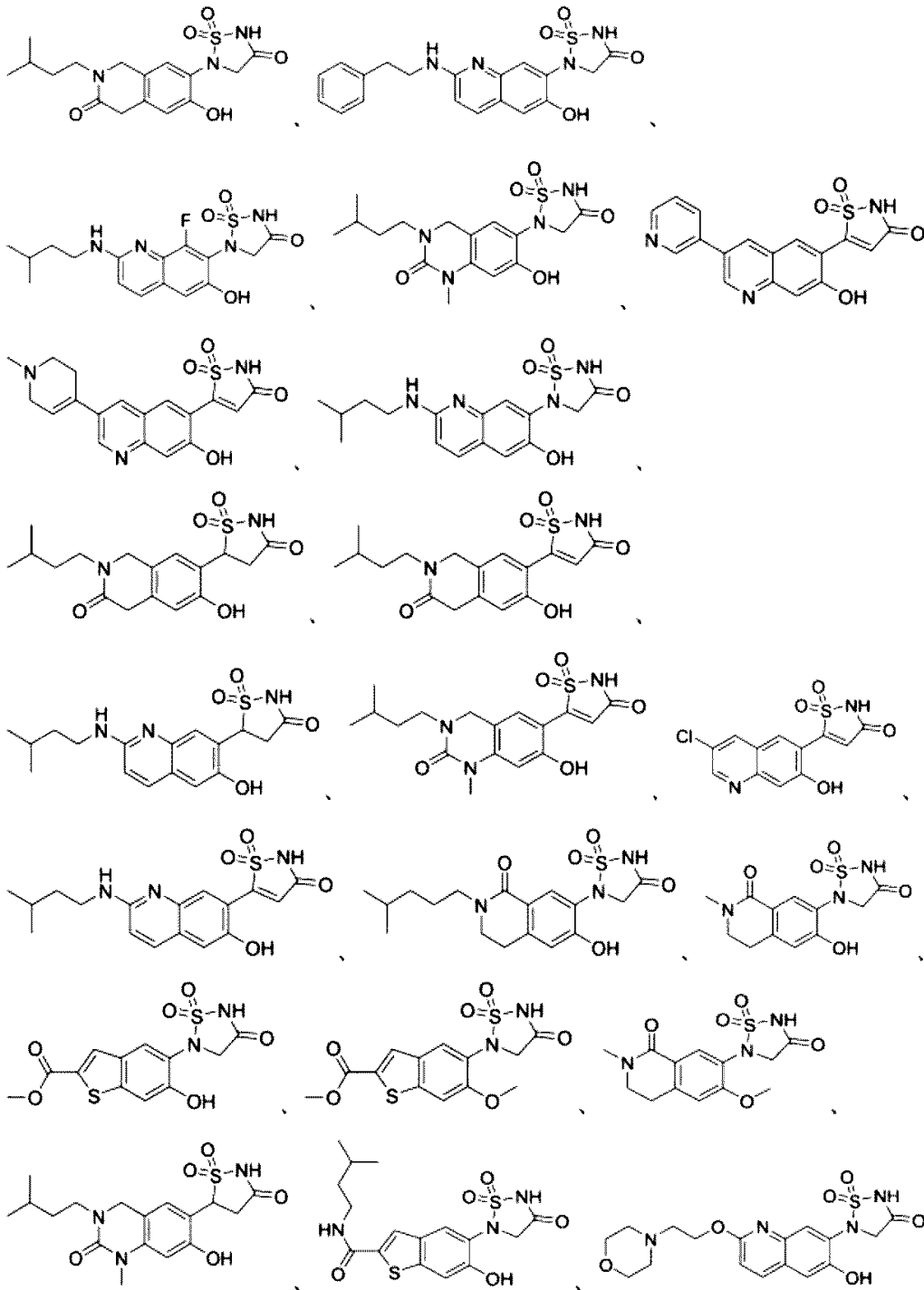
【請求項11】

R⁹が水素であり、R^{9a}が水素であり、R¹⁰が水素である、請求項5に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項12】

R²が、-OR¹²であり、
R¹²が、C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、-CH₂-C₃₋₆シクロアルキ 50

【化 8 9 8 - 1】



10

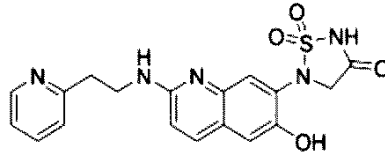
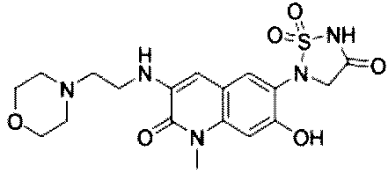
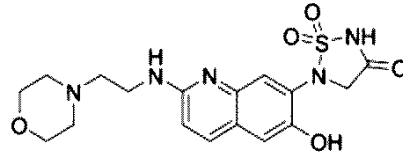
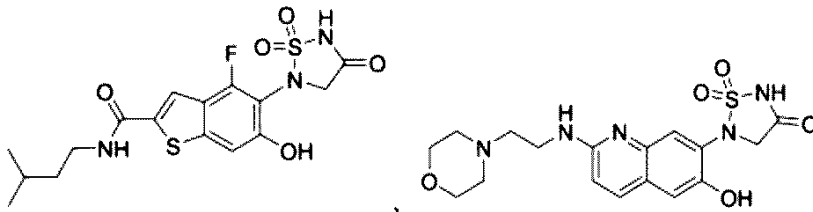
20

30

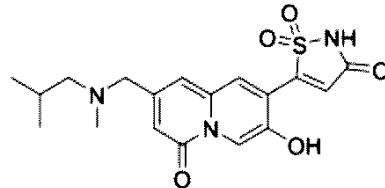
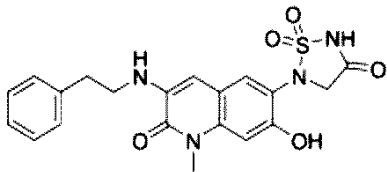
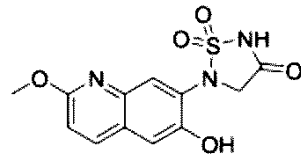
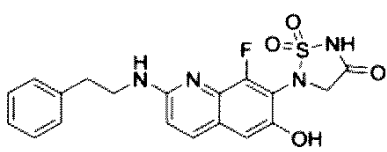
40

50

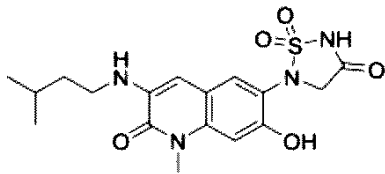
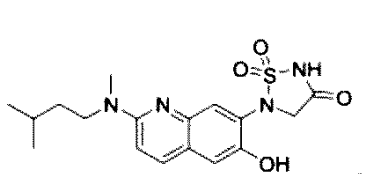
【化 8 9 8 - 2】



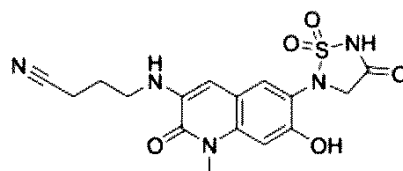
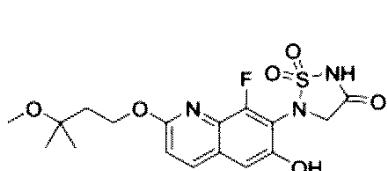
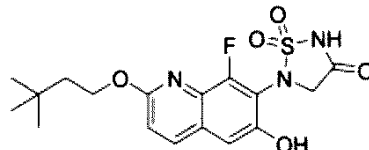
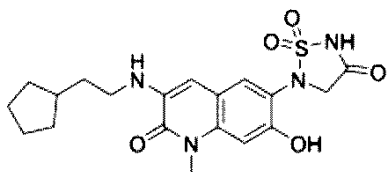
10



20



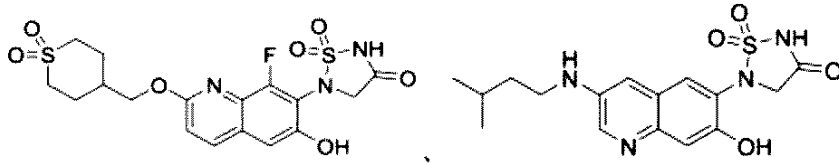
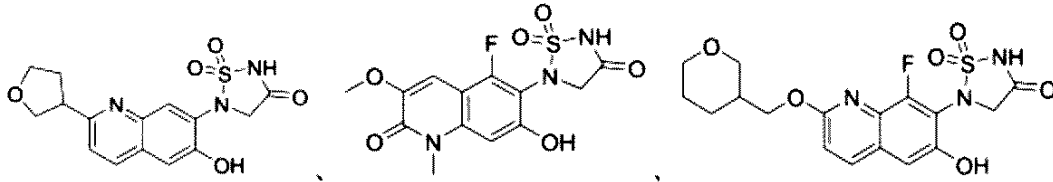
30



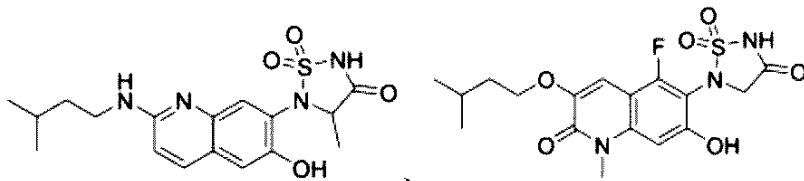
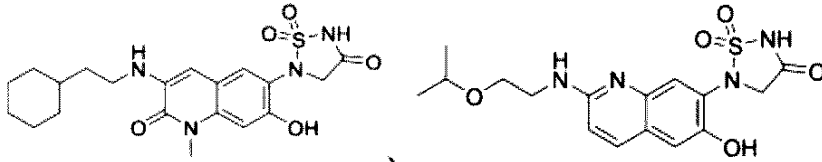
40

50

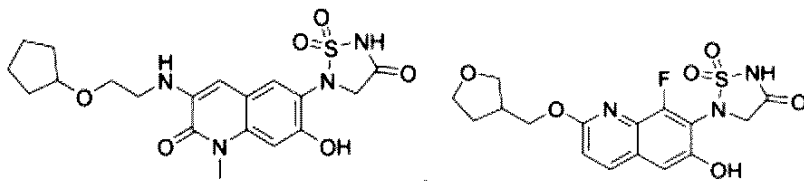
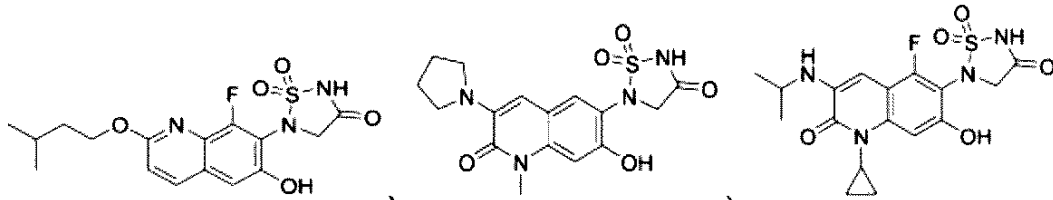
【化 8 9 8 - 3】



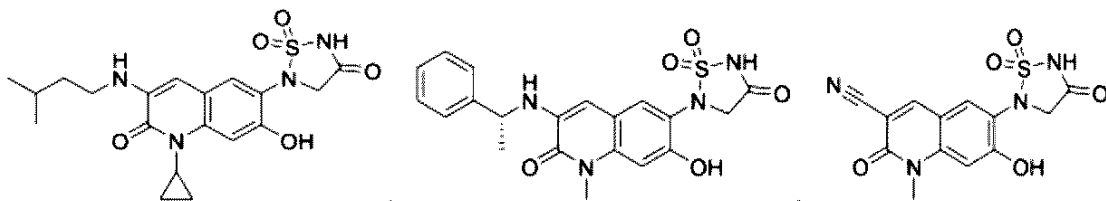
10



20



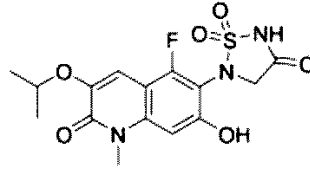
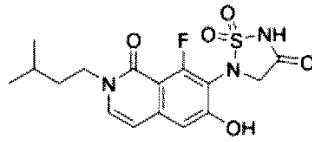
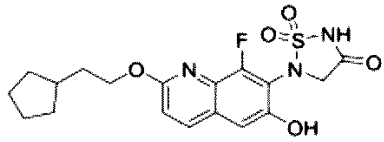
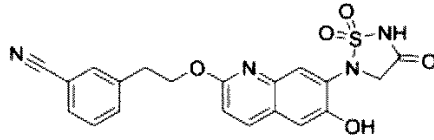
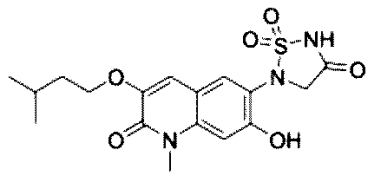
30



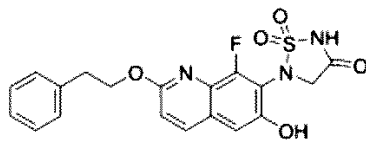
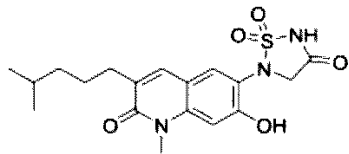
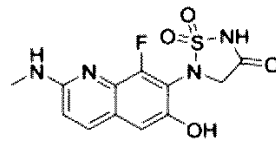
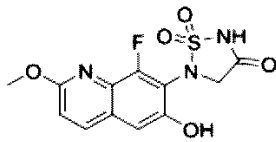
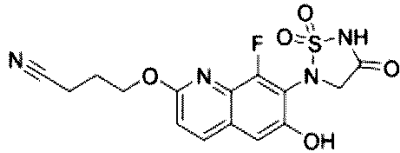
40

50

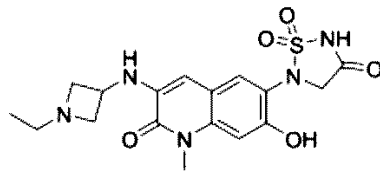
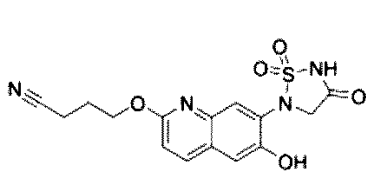
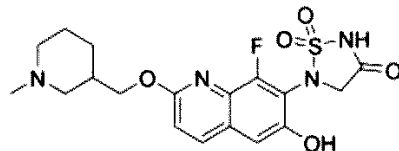
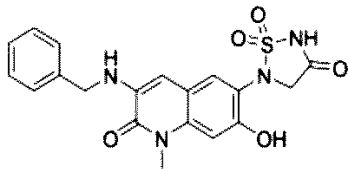
【化 8 9 8 - 4】



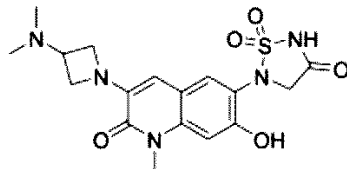
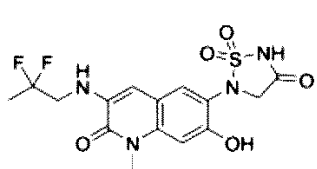
10



20



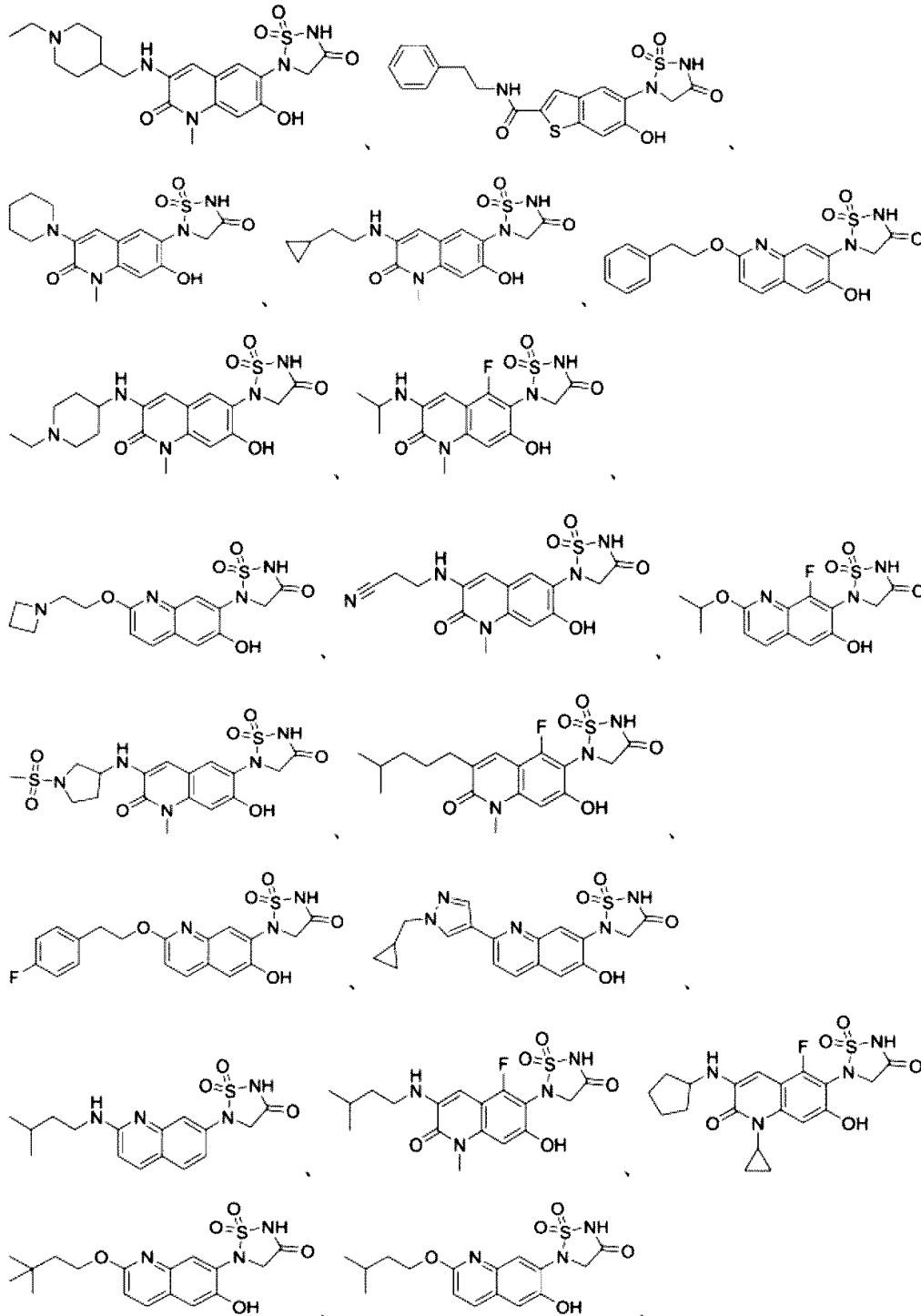
30



40

50

【化 8 9 8 - 5】



10

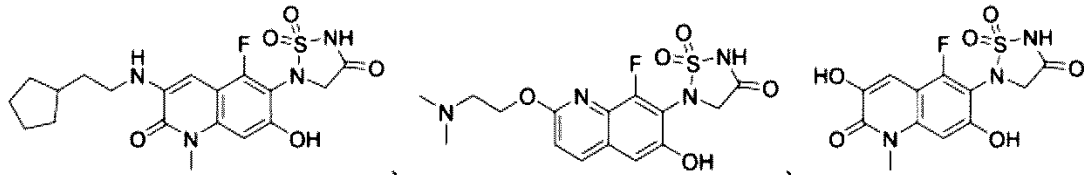
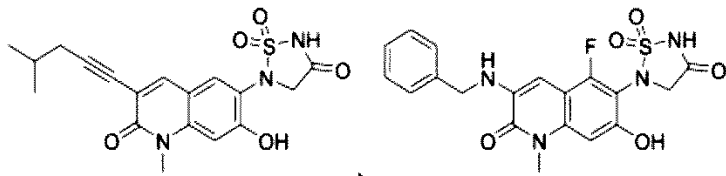
20

30

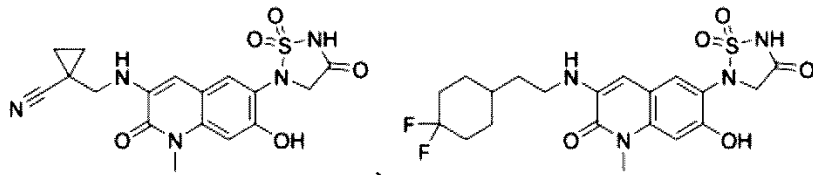
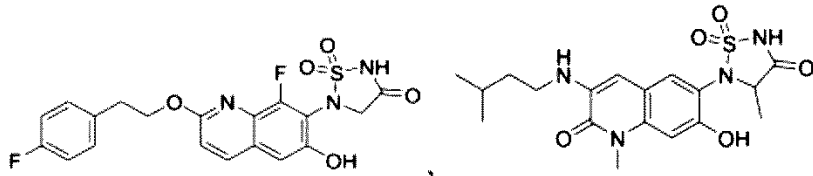
40

50

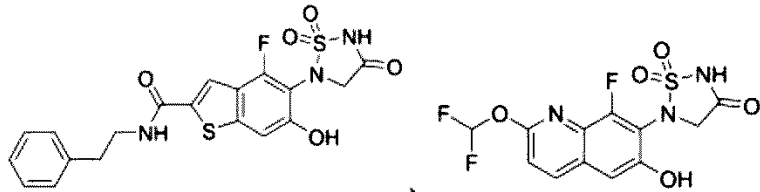
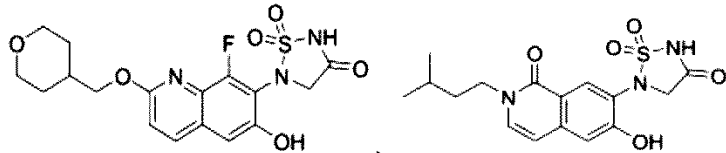
【化 8 9 8 - 6】



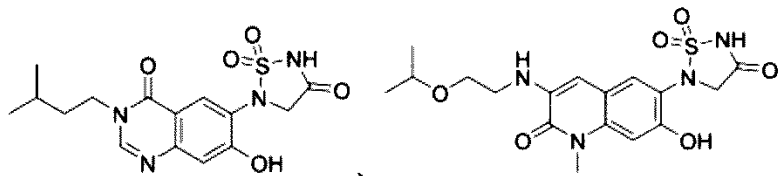
10



20



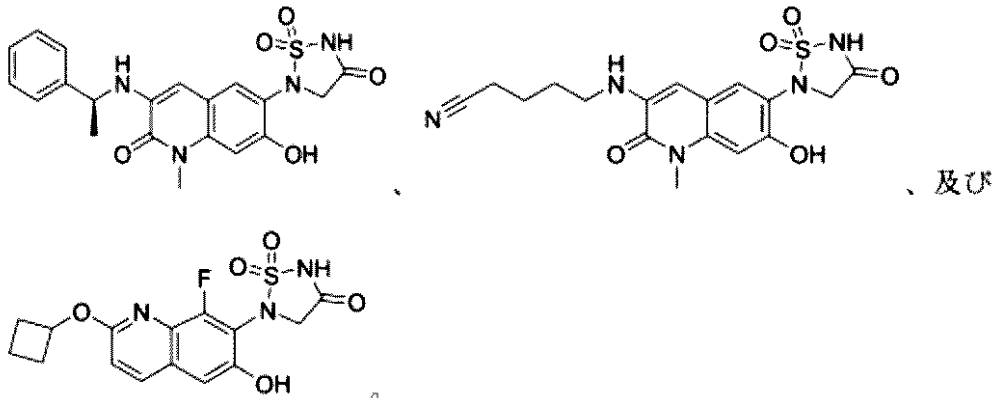
30



40

50

【化 8 9 8 - 7】



10

【請求項 19】

請求項 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物と、薬学的に許容される賦形剤とを含む、医薬組成物。

【請求項 20】

免疫を増強することを、それを必要とする対象に対して行うための薬剤の製造における、請求項 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物の使用であって、

20

- (a) PTPN2 の発現または活性を示している前記対象を選択することと、
- (b) PTPN2 の発現または活性を下方制御することを含む、前記使用。

【請求項 21】

がんを治療することを、それを必要とする対象に対して細胞療法と併用して行うための薬剤の製造における、請求項 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物の使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】1413

30

【補正方法】変更

【補正の内容】

【1413】

本開示の好ましい実施形態について、本明細書に示し、説明してきたが、かかる実施形態は、例として提供されるにすぎないことは、当業者にとって明らかであろう。当業者であれば、本開示を逸脱することなく、多くの変形形態、変更、及び置換を思いつくであろう。本発明を実施する際には、本明細書に記載される本開示の実施形態に対する様々な代替が採用され得ることを理解されたい。以下の特許請求の範囲は、本発明の範囲を定義するものであり、その特許請求の範囲内の方法及び構造ならびにその等価物が包含されることが意図される。

40

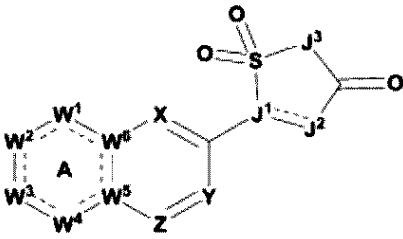
本発明は、例えば、以下の項目を提供する。

(項目 1)

式 (I - 3) の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物；

50

【化 8 8 1】



式 (1-3)

10

(式中、

W¹は、N、N(R¹)、C(R¹)、C(R¹)(R^{1a})、C(O)、S(O)、S(O)₂、S(O)(NR¹)、S(O)(R¹)、またはP(O)(R¹)であり、
W²は、N、N(R²)、C(R²)、C(R²)(R^{2a})、C(O)、S(O)、S(O)₂、S(O)(NR²)、S(O)(R²)、またはP(O)(R²)であり、
W³は、N、N(R³)、C(R³)、C(R³)(R^{3a})、C(O)、S(O)、S(O)₂、S(O)(NR³)、S(O)(R³)、またはP(O)(R³)であり、
W⁴は、N、N(R⁴)、C(R⁴)、C(R⁴)(R^{4a})、C(O)、S(O)、S(O)₂、S(O)(NR⁴)、S(O)(R⁴)、またはP(O)(R⁴)であり、
W⁵は、NまたはCであり、

20

W⁶は、NまたはCであり、ここで、W¹、W²、W³、W⁴、W⁵、及びW⁶のうち少なくとも1つは、N、N(R¹)、N(R²)、N(R³)、またはN(R⁴)であり、

Xは、NまたはC(R⁵)であり、

Yは、NまたはC(R⁶)であり、

Zは、NまたはC(R⁷)であり、

J¹は、N、C、またはC(R⁸)であり、

J²は、N、N(R⁹)、C(R⁹)、C(R⁹)(R^{9a})、またはC(O)であり、

J³は、N(R¹⁰)であり、

30

R¹及びR^{1a}は、水素、ハロゲン、-CN、C₁-6アルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₃-6シクロアルキル、C₂-9ヘテロシクロアルキル、C₆-10アリール、C₁-9ヘテロアリール、-OR¹²、-SR¹²、-N(R¹²)(R¹³)、-C(O)OR¹²、-OC(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)OR¹²、-N(R¹⁴)S(O)₂R¹⁵、-C(O)R¹⁵、-S(O)R¹⁵、-OC(O)R¹⁵、-C(O)N(R¹²)(R¹³)、-C(O)C(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)R¹⁵、-S(O)₂R¹⁵、-S(O)₂N(R¹²)(R¹³)、-S(=O)(=NH)N(R¹²)(R¹³)、-CH₂C(O)N(R¹²)(R¹³)、-CH₂N(R¹⁴)C(O)R¹⁵、-CH₂S(O)₂R¹⁵、及び-CH₂S(O)₂N(R¹²)(R¹³)から独立して選択され、ここで、C₁-6アルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₃-6シクロアルキル、C₂-9ヘテロシクロアルキル、C₆-10アリール、及びC₁-9ヘテロアリールは、1、2、もしくは3つのR^{20a}で任意選択により置換され、またはR¹及びR^{1a}は、結合して、C₃-6シクロアルキルもしくはC₂-9ヘテロシクロアルキルを形成し、ここで、前記C₃-6シクロアルキル及びC₂-9ヘテロシクロアルキルは、1、2、もしくは3つのR^{20a}で任意選択により置換され、

40

R²及びR^{2a}は、水素、ハロゲン、-CN、C₁-6アルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₃-6シクロアルキル、C₂-9ヘテロシクロアルキル、C₆-10アリール、C₁-9ヘテロアリール、-OR¹²、-SR¹²、-N(R¹²)(R¹³)、-C(O)OR¹²、-OC(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)

50

$N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-N(R^{1.4})C(O)OR^{1.2}$ 、 $-N(R^{1.4})S(O)_2R^{1.5}$ 、 $-C(O)R^{1.5}$ 、 $-S(O)R^{1.5}$ 、 $-OC(O)R^{1.5}$ 、 $-C(O)N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-N(R^{1.4})C(O)R^{1.5}$ 、 $-S(O)_2R^{1.5}$ 、 $-S(O)_2N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-CH_2N(R^{1.4})C(O)R^{1.5}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{1.5}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{1.2})(R^{1.3})$ から独立して選択され、ここで、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、 C_2-6 アルキニル、 C_3-6 シクロアルキル、 C_2-9 ヘテロシクロアルキル、 C_6-10 アリール、及び C_1-9 ヘテロアリールは、1、2、もしくは3つの $R^{2.0b}$ で任意選択により置換され、または R^2 及び $R^{2.a}$ は、結合して、 C_3-6 シクロアルキルもしくは C_2-9 ヘテロシクロアルキルを形成し、ここで、前記 C_3-6 シクロアルキル及び C_2-9 ヘテロシクロアルキルは、1、2、もしくは3つの $R^{2.0b}$ で任意選択により置換され、 R^3 及び $R^{3.a}$ は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、 C_2-6 アルキニル、 C_3-6 シクロアルキル、 C_2-9 ヘテロシクロアルキル、 C_6-10 アリール、 C_1-9 ヘテロアリール、 $-OR^{1.2}$ 、 $-SR^{1.2}$ 、 $-N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-C(O)OR^{1.2}$ 、 $-OC(O)N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-N(R^{1.4})C(O)N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-N(R^{1.4})C(O)OR^{1.2}$ 、 $-N(R^{1.4})S(O)_2R^{1.5}$ 、 $-C(O)R^{1.5}$ 、 $-S(O)R^{1.5}$ 、 $-OC(O)R^{1.5}$ 、 $-C(O)N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-N(R^{1.4})C(O)R^{1.5}$ 、 $-S(O)_2R^{1.5}$ 、 $-S(O)_2N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-CH_2N(R^{1.4})C(O)R^{1.5}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{1.5}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{1.2})(R^{1.3})$ から独立して選択され、ここで、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、 C_2-6 アルキニル、 C_3-6 シクロアルキル、 C_2-9 ヘテロシクロアルキル、 C_6-10 アリール、及び C_1-9 ヘテロアリールは、1、2、もしくは3つの $R^{2.0c}$ で任意選択により置換され、または R^3 及び $R^{3.a}$ は、結合して、 C_3-6 シクロアルキルもしくは C_2-9 ヘテロシクロアルキルを形成し、ここで、前記 C_3-6 シクロアルキル及び C_2-9 ヘテロシクロアルキルは、1、2、もしくは3つの $R^{2.0c}$ で任意選択により置換され、 R^4 及び $R^{4.a}$ は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、 C_2-6 アルキニル、 C_3-6 シクロアルキル、 C_2-9 ヘテロシクロアルキル、 C_6-10 アリール、 C_1-9 ヘテロアリール、 $-OR^{1.2}$ 、 $-SR^{1.2}$ 、 $-N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-C(O)OR^{1.2}$ 、 $-OC(O)N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-N(R^{1.4})C(O)N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-N(R^{1.4})C(O)OR^{1.2}$ 、 $-N(R^{1.4})S(O)_2R^{1.5}$ 、 $-C(O)R^{1.5}$ 、 $-S(O)R^{1.5}$ 、 $-OC(O)R^{1.5}$ 、 $-C(O)N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-N(R^{1.4})C(O)R^{1.5}$ 、 $-S(O)_2R^{1.5}$ 、 $-S(O)_2N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-CH_2N(R^{1.4})C(O)R^{1.5}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{1.5}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{1.2})(R^{1.3})$ から独立して選択され、ここで、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、 C_2-6 アルキニル、 C_3-6 シクロアルキル、 C_2-9 ヘテロシクロアルキル、 C_6-10 アリール、及び C_1-9 ヘテロアリールは、1、2、もしくは3つの $R^{2.0d}$ で任意選択により置換され、または R^4 及び $R^{4.a}$ は、結合して、 C_3-6 シクロアルキルもしくは C_2-9 ヘテロシクロアルキルを形成し、ここで、前記 C_3-6 シクロアルキル及び C_2-9 ヘテロシクロアルキルは、1、2、もしくは3つの $R^{2.0d}$ で任意選択により置換され、 R^5 は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、 C_2-6 アルキニル、 C_3-6 シクロアルキル、 C_2-9 ヘテロシクロアルキル、 C_6-10 アリール、 C_1-9 ヘテロアリール、 $-OR^{1.2}$ 、 $-SR^{1.2}$ 、 $-N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-C(O)OR^{1.2}$ 、 $-OC(O)N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-N(R^{1.4})C(O)N(R^{1.2})(R^{1.3})$ 、 $-N(R^{1.4})C(O)OR^{1.2}$ 、 $-N(R^{1.4})S(O)_2R^{1.5}$ 、 $-C(O)R^{1.5}$ 、 $-S(O)R^{1.5}$ 、 $-OC(O)R^{1.5}$ 、 $-C(O)N(R^{1.2})(R^{1.3})$

10

20

30

40

50

$-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$, $-N(R^{14})C(O)R^{15}$, $-S(O)_2R^{15}$, $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$, $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$, $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$, $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$, $-CH_2S(O)_2R^{15}$, 及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20e} で任意選択により置換され、

R^6 は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{16}$ 、 $-N(R^{12})(R^{16})$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、

2、または3つの R^{20f} で任意選択により置換され、

R^7 は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20g} で任意選択により置換され、

R^8 は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20h} で任意選択により置換され、

R^9 及び R^{9a} は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$

10

20

30

40

50

$\text{C}(\text{O})\text{OR}^{1.2}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{1.2})(\text{R}^{1.3})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{1.4})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{1.2})(\text{R}^{1.3})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{1.4})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{1.2}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{1.4})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{1.5}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{1.5}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{1.5}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{1.5}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{1.2})(\text{R}^{1.3})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{1.2})(\text{R}^{1.3})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{1.4})\text{C}(\text{O})\text{R}^{1.5}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{1.5}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{1.2})(\text{R}^{1.3})$ 、 $-\text{S}(=\text{O})(=\text{NH})\text{N}(\text{R}^{1.2})(\text{R}^{1.3})$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{1.2})(\text{R}^{1.3})$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{1.4})\text{C}(\text{O})\text{R}^{1.5}$ 、 $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{1.5}$ 、及び $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{1.2})(\text{R}^{1.3})$ から独立して選択され、ここで、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、 C_2-6 アルキニル、 C_3-6 シクロアルキル、 C_2-9 ヘテロシクロアルキル、 C_6-10 アリール、及び C_1-9 ヘテロアリールは、1、2、もしくは3つの $\text{R}^{2.0.i}$ で任意選択により置換され、または R^9 及び $\text{R}^{9.a}$ は、結合して、 C_3-6 シクロアルキルもしくは C_2-9 ヘテロシクロアルキルを形成し、ここで、前記 C_3-6 シクロアルキル及び C_2-9 ヘテロシクロアルキルは、1、2、もしくは3つの $\text{R}^{2.0.i}$ で任意選択により置換され、 $\text{R}^{1.0}$ 及び $\text{R}^{1.0.a}$ は、水素、ハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、 C_2-6 アルキニル、 C_3-6 シクロアルキル、 C_2-9 ヘテロシクロアルキル、 C_6-10 アリール、 C_1-9 ヘテロアリール、 $-\text{R}^{1.6}$ 、 $-\text{OR}^{1.6}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{1.2})(\text{R}^{1.6})$ 、 $-\text{OR}^{1.2}$ 、 $-\text{SR}^{1.2}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{1.2})(\text{R}^{1.3})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{1.2}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{1.2})(\text{R}^{1.3})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{1.4})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{1.2})(\text{R}^{1.3})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{1.4})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{1.2}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{1.4})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{1.5}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{1.5}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{1.5}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{1.5}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{1.2})(\text{R}^{1.3})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{1.2})(\text{R}^{1.3})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{1.4})\text{C}(\text{O})\text{R}^{1.5}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{1.5}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{1.2})(\text{R}^{1.3})$ 、 $-\text{S}(=\text{O})(=\text{NH})\text{N}(\text{R}^{1.2})(\text{R}^{1.3})$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{1.2})(\text{R}^{1.3})$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{1.4})\text{C}(\text{O})\text{R}^{1.5}$ 、 $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{1.5}$ 、及び $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{1.2})(\text{R}^{1.3})$ から独立して選択され、ここで、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、 C_2-6 アルキニル、 C_3-6 シクロアルキル、 C_2-9 ヘテロシクロアルキル、 C_6-10 アリール、及び C_1-9 ヘテロアリールは、1、2、もしくは3つの $\text{R}^{2.0.j}$ で任意選択により置換され、または $\text{R}^{1.0}$ 及び $\text{R}^{1.0.a}$ は、結合して、 C_3-6 シクロアルキルもしくは C_2-9 ヘテロシクロアルキルを形成し、ここで、前記 C_3-6 シクロアルキル及び C_2-9 ヘテロシクロアルキルは、1、2、もしくは3つの $\text{R}^{2.0.j}$ で任意選択により置換され、各 $\text{R}^{1.2}$ は、水素、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、 C_2-6 アルキニル、 C_3-6 シクロアルキル、 $-\text{CH}_2-\text{C}_3-6$ シクロアルキル、 C_2-9 ヘテロシクロアルキル、 $-\text{CH}_2-\text{C}_2-9$ ヘテロシクロアルキル、 C_6-10 アリール、 $-\text{CH}_2-\text{C}_6-10$ アリール、及び C_1-9 ヘテロアリールから独立して選択され、ここで、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、 C_2-6 アルキニル、 C_3-6 シクロアルキル、 $-\text{CH}_2-\text{C}_3-6$ シクロアルキル、 C_2-9 ヘテロシクロアルキル、 $-\text{CH}_2-\text{C}_2-9$ ヘテロシクロアルキル、 C_6-10 アリール、 $-\text{CH}_2-\text{C}_6-10$ アリール、及び C_1-9 ヘテロアリールは、1、2、または3つの $\text{R}^{2.0.k}$ で任意選択により置換され、各 $\text{R}^{1.3}$ は、水素、 C_1-6 アルキル、及び C_1-6 ハロアルキルから独立して選択され、または $\text{R}^{1.2}$ 及び $\text{R}^{1.3}$ は、それらが結合している窒素と一緒に、1、2、もしくは3つの $\text{R}^{2.0.k}$ で任意選択により置換された C_2-9 ヘテロシクロアルキル環を形成し、各 $\text{R}^{1.4}$ は、水素、 C_1-6 アルキル、及び C_1-6 ハロアルキルから独立して選択され、各 $\text{R}^{1.5}$ は、独立して選択される C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、 C_2-6 アルキニル、 C_3-6 シクロアルキル、 C_1-6 ヘテロアルキル、 C_2-9 ヘテロシクロアルキル、 C_6-10 アリール、及び C_1-9 ヘテロアリールであり、ここで、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、 C_2-6 アルキニル、 C_3-6 シクロアルキル、 C_1-6 ヘテロアルキル、 C_2-9 ヘテロシクロアルキル、 C_6-10 アリール、及び C_1-9 ヘテロアリールは、1、2、または3つの $\text{R}^{2.0.k}$ で任意選択により置換され、各 $\text{R}^{1.6}$ は、 $-\text{C}_1-6$ アルキレン- $\text{OP}(\text{O})(\text{OR}^{1.6.a})(\text{OR}^{1.6.b})$ 及び $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{1.6.a})(\text{OR}^{1.6.b})$ から独立して選択され、ここで、前記 C_1-6 アルキレ

10

20

30

40

50

ンは、1、2、または3つの R^{201} で任意選択により置換され、

各 R^{16a} 及び R^{16b} は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20m} で任意選択により置換され、

各 R^{20a} 、 R^{20b} 、 R^{20c} 、 R^{20d} 、 R^{20e} 、 R^{20f} 、 R^{20g} 、 R^{20h} 、 R^{20i} 、 R^{20j} 、 R^{20k} 、 R^{20l} 、及び R^{20m} は、オキソ、 $-CN$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 C_{1-6} ヘテロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{21}$ 、 $-SR^{21}$ 、 $-N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-C(O)OR^{22}$ 、 $-C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-OC(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-N(R^{24})C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-N(R^{24})C(O)OR^{22}$ 、 $-N(R^{24})C(O)R^{25}$ 、 $-N(R^{24})S(O)_2R^{25}$ 、 $-C(O)R^{25}$ 、 $-S(O)_2R^{25}$ 、 $-S(O)_2N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-OCH_2C(O)OR^{22}$ 、

及び $-OC(O)R^{25}$ からそれぞれ独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 C_{1-6} ヘテロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、ハロゲン、オキソ、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 $-OR^{21}$ 、 $-SR^{21}$ 、 $-N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-C(O)OR^{22}$ 、 $-C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-OC(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-N(R^{24})C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-N(R^{24})C(O)OR^{25}$ 、 $-N(R^{24})C(O)R^{25}$ 、 $-N(R^{24})S(O)_2R^{25}$ 、 $-C(O)R^{25}$ 、 $-S(O)_2R^{25}$ 、 $-S(O)_2N(R^{22})(R^{23})$ 、及び $-OC(O)R^{25}$ から独立して選択される1、2、または3つの基で任意選択により置換され、

各 R^{21} は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから独立して選択され、

各 R^{22} は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから独立して選択され、

各 R^{23} は、H 及び C_{1-6} アルキルから独立して選択され、

各 R^{24} は、H 及び C_{1-6} アルキルから独立して選択され、

各 R^{25} は、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} ヘテロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから選択され、

【化882】

は、全ての原子価が満たされるような単結合または二重結合を示し、ただし、

環A

10

20

30

40

50

【化 8 8 3】

のうちの少なくとも2つは、二重結合である)。

(項目2)

Xが、 $C(R^5)$ である、項目1に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目3)

Yが、 $C(R^6)$ である、項目1または項目2に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

10

(項目4)

Zが、 $C(R^7)$ である、項目1~3のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目5)

J^1 が、Nであり、 J^2 が、 $C(R^9)(R^{9a})$ である、項目1~4のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目6)

J^1 が、 $C(R^8)$ であり、 J^2 が、 $C(R^9)(R^{9a})$ である、項目1~4のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

20

(項目7)

J^2 が、 CH_2 である、項目1~6のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目8)

J^1 が、Cであり、 J^2 が、 $C(R^9)$ である、項目1~4のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目9)

J^2 が、 $C(H)$ である、項目8に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目10)

J^3 が、 $N(H)$ である、項目1~9のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

30

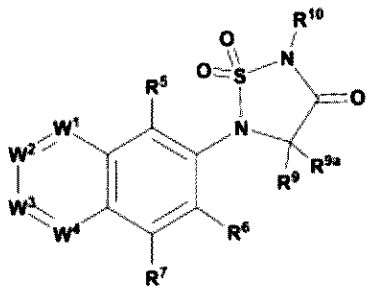
(項目11)

式(Ia-3)、(Ib-3)、または(Ic-3)の構造を有する、項目1~10のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物：

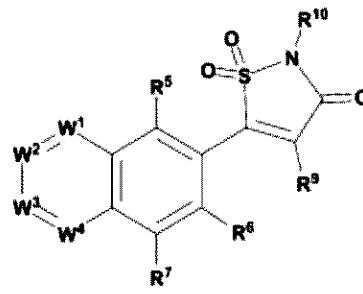
40

50

【化 8 8 4】

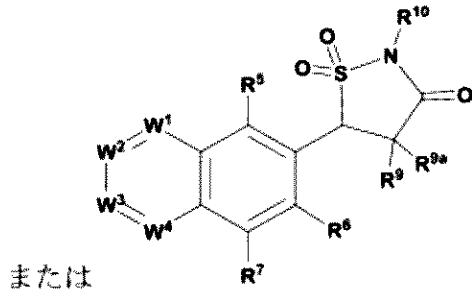


式 (I a - 3) ;



式 (I b - 3) ;

10



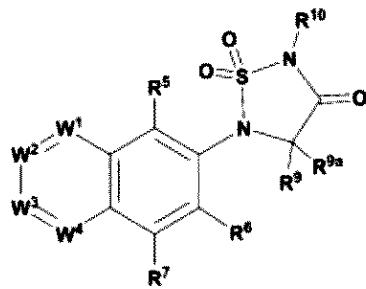
式 (I c - 3) 。

(項目 1 2)

20

式 (I a - 3) の構造を有する、項目 1 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物：

【化 8 8 5】



式 (I a - 3) 。

30

(項目 1 3)

W¹がNであり、W²がC (R²) であり、W³がC (R³) であり、W⁴がC (R⁴) である、項目 1 1 ~ 1 2 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目 1 4)

R²が水素であり、R³が水素であり、R⁴が水素である、項目 1 1 ~ 1 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

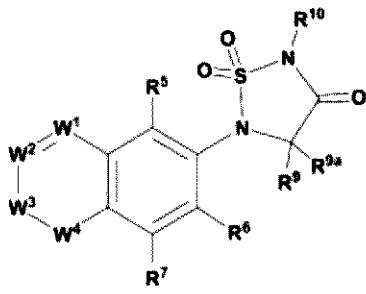
40

(項目 1 5)

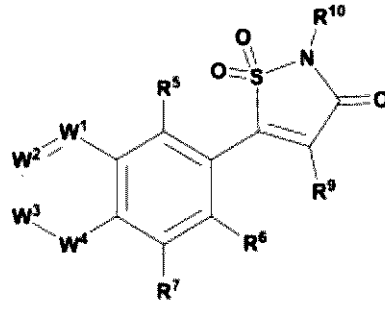
式 (I g - 3) 、 (I h - 3) 、または (I i - 3) の構造を有する、項目 1 ~ 1 0 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物：

50

【化 8 8 6】

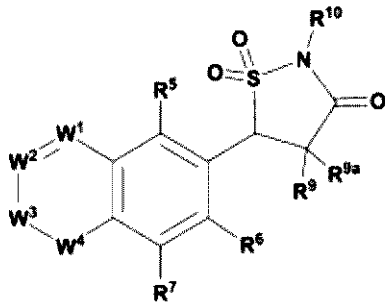


式 (I g - 3) ;



式 (I h - 3) ;

10



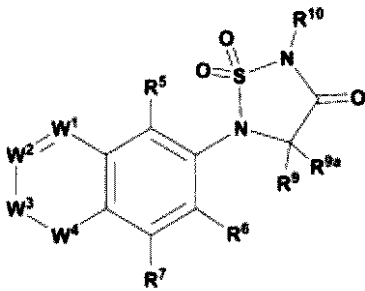
式 (I i - 3) 。

20

(項目 1 6)

式 (I g - 3) の構造を有する、項目 1 5 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物；

【化 8 8 7】



式 (I g - 3) 。

30

(項目 1 7)

W¹がC(R¹)であり、W²がC(R²)である、項目 1 4 ~ 1 5 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目 1 8)

R¹が水素であり、R²が水素である、項目 1 7 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

40

(項目 1 9)

W³がC(O)であり、W⁴がN(R⁴)である、項目 1 4 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目 2 0)

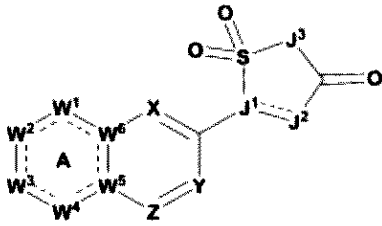
R⁴がメチルである、項目 1 4 ~ 1 9 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目 2 1)

式 (I I I - 3) の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物；

50

【化 8 8 8】



式 (III-3)

10

(式中、

W¹は、N、N(R¹)、C(R¹)、C(R¹)(R^{1a})、C(O)、S(O)、S(O)₂、S(O)(NR¹)、S(O)(R¹)、またはP(O)(R¹)であり、
 W²は、N、N(R²)、C(R²)、C(R²)(R^{2a})、C(O)、S(O)、S(O)₂、S(O)(NR²)、S(O)(R²)、またはP(O)(R²)であり、
 W³は、N、N(R³)、C(R³)、C(R³)(R^{3a})、C(O)、S(O)、S(O)₂、S(O)(NR³)、S(O)(R³)、またはP(O)(R³)であり、
 W⁴は、N、N(R⁴)、C(R⁴)、C(R⁴)(R^{4a})、C(O)、S(O)、S(O)₂、S(O)(NR⁴)、S(O)(R⁴)、またはP(O)(R⁴)であり、
 W⁵は、NまたはCであり、

20

W⁶は、NまたはCであり、ここで、

i) W¹、W²、W³、W⁴、W⁵、及びW⁶のうちの少なくとも1つは、N、N(R¹)、N(R²)、N(R³)、N(R⁴)、またはOであり、
 ii) W¹、W²、W³、及びW⁴のうちの少なくとも1つは、C(O)、S(O)、S(O)₂、S(O)(NR¹)、S(O)(R¹)、P(O)(R¹)、S(O)(NR²)、S(O)(R²)、P(O)(R²)、S(O)(NR³)、S(O)(R³)、P(O)(R³)、S(O)(NR⁴)、S(O)(R⁴)、またはP(O)(R⁴)であり、

Xは、NまたはC(R⁵)であり、Yは、NまたはC(R⁶)であり、Zは、NまたはC(R⁷)であり、J¹は、N、C、またはC(R⁸)であり、J²は、N、N(R⁹)、C(R⁹)、C(R⁹)(R^{9a})、またはC(O)であり、J³は、N(R¹⁰)またはC(R¹⁰)(R^{10a})であり、

R¹及びR^{1a}は、水素、ハロゲン、-CN、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₂₋₉ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₀アリール、C₁₋₉ヘテロアリール、-OR¹²、-SR¹²、-N(R¹²)(R¹³)、-C(O)OR¹²、-OC(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)OR¹²、-N(R¹⁴)S(O)₂R¹⁵、-C(O)R¹⁵、-S(O)R¹⁵、-OC(O)R¹⁵、-C(O)N(R¹²)(R¹³)、-C(O)C(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)R¹⁵、-S(O)₂R¹⁵、-S(O)₂N(R¹²)(R¹³)、-S(=O)(=NH)N(R¹²)(R¹³)、-CH₂C(O)N(R¹²)(R¹³)、-CH₂N(R¹⁴)C(O)R¹⁵、-CH₂S(O)₂R¹⁵、及び-CH₂S(O)₂N(R¹²)(R¹³)から独立して選択され、ここで、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₂₋₉ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₀アリール、及びC₁₋₉ヘテロアリールは、1、2、もしくは3つのR^{20a}で任意選択により置換され、またはR¹及びR^{1a}は、結合して、C₃₋₆シクロアルキルもしくはC₂₋₉ヘテロシクロアルキルを形成し、ここで、前記C₃₋₆シクロアルキル及びC₂₋₉ヘテロシクロアルキルは、1、2、もしくは3つのR^{20a}で任意選択により置換され、

30

40

50

R^2 及び R^{2a} は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、
 C_2-6 アルキニル、 C_3-6 シクロアルキル、 C_2-9 ヘテロシクロアルキル、 C_6-10 アリー
 C_1-9 ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)$
 $N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})$
 (R^{13}) 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)$
 $N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から独立して選択され、ここで、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、 C_2-6
 C_1-9 ヘテロアリールは、1、2、もしくは3つの R^{20b} で任意選択により置換され、または R^2 及び R^{2a} は、結合して、 C_3-6 シクロアルキルもしくは C_2-9
 C_3-6 シクロアルキルを形成し、ここで、前記 C_3-6 シクロアルキル及び C_2-9 ヘテ
 C_1-9 ヘテロアリールは、1、2、もしくは3つの R^{20b} で任意選択により置換され、
 R^3 及び R^{3a} は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、
 C_2-6 アルキニル、 C_3-6 シクロアルキル、 C_2-9 ヘテロシクロアルキル、 C_6-10 アリー
 C_1-9 ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)$
 $N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})$
 (R^{13}) 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)$
 $N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から独立して選択され、ここで、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、 C_2-6
 C_1-9 ヘテロアリールは、1、2、もしくは3つの R^{20c} で任意選択により置換され、または R^3 及び R^{3a} は、結合して、 C_3-6 シクロアルキルもしくは C_2-9
 C_3-6 シクロアルキルを形成し、ここで、前記 C_3-6 シクロアルキル及び C_2-9 ヘテ
 C_1-9 ヘテロアリールは、1、2、もしくは3つの R^{20c} で任意選択により置換され、
 R^4 及び R^{4a} は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、
 C_2-6 アルキニル、 C_3-6 シクロアルキル、 C_2-9 ヘテロシクロアルキル、 C_6-10 アリー
 C_1-9 ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)$
 $N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})$
 (R^{13}) 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)$
 $N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から独立して選択され、ここで、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、 C_2-6
 C_1-9 ヘテロアリールは、1、2、もしくは3つの R^{20d} で任意選択により置換され、または R^4 及び R^{4a} は、結合して、 C_3-6 シクロアルキルもしくは C_2-9
 C_3-6 シクロアルキルを形成し、ここで、前記 C_3-6 シクロアルキル及び C_2-9 ヘテ
 R^5 は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、 C_2-6 アル
 C_1-9 ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)$
 $N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})$
 (R^{13}) 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)$
 $N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から独立して選択され、ここで、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル、 C_2-6
 C_1-9 ヘテロアリールは、1、2、もしくは3つの R^{20d} で任意選択により置換され、

10

20

30

40

50

C₁-9ヘテロアリール、-OR¹²、-SR¹²、-N(R¹²)(R¹³)、-C(O)OR¹²、-OC(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)OR¹²、-N(R¹⁴)S(O)₂R¹⁵、-C(O)R¹⁵、-S(O)R¹⁵、-OC(O)R¹⁵、-C(O)N(R¹²)(R¹³)、-C(O)C(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)R¹⁵、-S(O)₂R¹⁵、-S(O)₂N(R¹²)(R¹³)、-S(=O)(=NH)N(R¹²)(R¹³)、-CH₂C(O)N(R¹²)(R¹³)、-CH₂N(R¹⁴)C(O)R¹⁵、-CH₂S(O)₂R¹⁵、及び-CH₂S(O)₂N(R¹²)(R¹³)から選択され、ここで、C₁-6アルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₃-6シクロアルキル、C₂-9ヘテロシクロアルキル、C₆-10アリール、及びC₁-9ヘテロアリールは、1、2、または3つのR^{20e}で任意選択により置換され、

10

R⁶は、水素、ハロゲン、-CN、C₁-6アルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₃-6シクロアルキル、C₂-9ヘテロシクロアルキル、C₆-10アリール、C₁-9ヘテロアリール、-OR¹⁶、-N(R¹²)(R¹⁶)、-OR¹²、-SR¹²、-N(R¹²)(R¹³)、-C(O)OR¹²、-OC(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)OR¹²、-N(R¹⁴)S(O)₂R¹⁵、-C(O)R¹⁵、-S(O)R¹⁵、-OC(O)R¹⁵、-C(O)N(R¹²)(R¹³)、-C(O)C(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)R¹⁵、-S(O)₂R¹⁵、-S(O)₂N(R¹²)(R¹³)、-S(=O)(=NH)N(R¹²)(R¹³)、-CH₂C(O)N(R¹²)(R¹³)、-CH₂N(R¹⁴)C(O)R¹⁵、-CH₂S(O)₂R¹⁵、及び-CH₂S(O)₂N(R¹²)(R¹³)から選択され、ここで、C₁-6アルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₃-6シクロアルキル、C₂-9ヘテロシクロアルキル、C₆-10アリール、及びC₁-9ヘテロアリールは、1、

20

2、または3つのR^{20f}で任意選択により置換され、

R⁷は、水素、ハロゲン、-CN、C₁-6アルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₃-6シクロアルキル、C₂-9ヘテロシクロアルキル、C₆-10アリール、C₁-9ヘテロアリール、-OR¹²、-SR¹²、-N(R¹²)(R¹³)、-C(O)OR¹²、-OC(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)OR¹²、-N(R¹⁴)S(O)₂R¹⁵、-C(O)R¹⁵、-S(O)R¹⁵、-OC(O)R¹⁵、-C(O)N(R¹²)(R¹³)、-C(O)C(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)R¹⁵、-S(O)₂R¹⁵、-S(O)₂N(R¹²)(R¹³)、-S(=O)(=NH)N(R¹²)(R¹³)、-CH₂C(O)N(R¹²)(R¹³)、-CH₂N(R¹⁴)C(O)R¹⁵、-CH₂S(O)₂R¹⁵、及び-CH₂S(O)₂N(R¹²)(R¹³)から選択され、ここで、C₁-6アルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₃-6シクロアルキル、C₂-9ヘテロシクロアルキル、C₆-10アリール、及びC₁-9ヘテロアリールは、1、2、または3つのR^{20g}で任意選択により置換され、

30

R⁸は、水素、ハロゲン、-CN、C₁-6アルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₃-6シクロアルキル、C₂-9ヘテロシクロアルキル、C₆-10アリール、C₁-9ヘテロアリール、-OR¹²、-SR¹²、-N(R¹²)(R¹³)、-C(O)OR¹²、-OC(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)OR¹²、-N(R¹⁴)S(O)₂R¹⁵、-C(O)R¹⁵、-S(O)R¹⁵、-OC(O)R¹⁵、-C(O)N(R¹²)(R¹³)、-C(O)C(O)N(R¹²)(R¹³)、-N(R¹⁴)C(O)R¹⁵、-S(O)₂R¹⁵、-S(O)₂N(R¹²)(R¹³)、-S(=O)(=NH)N(R¹²)(R¹³)、-CH₂C(O)N(R¹²)(R¹³)、-CH₂N(R¹⁴)C(O)R¹⁵、-CH₂S(O)₂R¹⁵、及び-CH₂S(O)₂N(R¹²)(R¹³)から選択され、ここで、C₁-6アルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₃-6シクロアルキル、C₂-9ヘテロシクロアルキル、C₆-10アリール、及びC₁-9ヘテ

40

50

口アリアルは、1、2、または3つの R^{20h} で任意選択により置換され、
 R^9 及び R^{9a} は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、
 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、
 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、
 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、
 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、
 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、もしくは3つの R^{20i} で任意選択により置換され、または R^9 及び R^{9a} は、結合して、 C_{3-6} シクロアルキルもしくは C_{2-9} ヘテロシクロアルキルを形成し、ここで、前記 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{2-9} ヘテロシクロアルキルは、1、2、もしくは3つの R^{20i} で任意選択により置換され、
 R^{10} 及び R^{10a} は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 $-R^{16}$ 、 $-OR^{16}$ 、 $-N(R^{12})(R^{16})$ 、
 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、
 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、
 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、
 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、
 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、
 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、もしくは3つの R^{20j} で任意選択により置換され、または R^{10} 及び R^{10a} は、結合して、 C_{3-6} シクロアルキルもしくは C_{2-9} ヘテロシクロアルキルを形成し、ここで、前記 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{2-9} ヘテロシクロアルキルは、1、2、もしくは3つの R^{20j} で任意選択により置換され、
 各 R^{12} は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20k} で任意選択により置換され、
 各 R^{13} は、水素、 C_{1-6} アルキル、及び C_{1-6} ハロアルキルから独立して選択され、または R^{12} 及び R^{13} は、それらが結合している窒素と一緒に、1、2、もしくは3つの R^{20k} で任意選択により置換された C_{2-9} ヘテロシクロアルキル環を形成し、
 各 R^{14} は、水素、 C_{1-6} アルキル、及び C_{1-6} ハロアルキルから独立して選択され、
 各 R^{15} は、独立して選択される C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} ヘテロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールであり、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} ヘテロアル

キル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20k} で任意選択により置換され、

各 R^{16} は、 $-C_{1-6}$ アルキレン-OP(O)(OR^{16a})(OR^{16b})及び-P(O)(OR^{16a})(OR^{16b})から独立して選択され、ここで、前記 C_{1-6} アルキレンは、1、2、または3つの R^{20l} で任意選択により置換され、

各 R^{16a} 及び R^{16b} は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20m} で任意選択により置換され、

各 R^{20a} 、 R^{20b} 、 R^{20c} 、 R^{20d} 、 R^{20e} 、 R^{20f} 、 R^{20g} 、 R^{20h} 、 R^{20i} 、 R^{20j} 、 R^{20k} 、 R^{20l} 、及び R^{20m} は、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 C_{1-6} ヘテロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{21}$ 、 $-SR^{21}$ 、 $-N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-C(O)OR^{22}$ 、 $-C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-OC(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-N(R^{24})C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-N(R^{24})C(O)OR^{22}$ 、 $-N(R^{24})C(O)R^{25}$ 、 $-N(R^{24})S(O)_2R^{25}$ 、 $-C(O)R^{25}$ 、 $-S(O)_2R^{25}$ 、 $-S(O)_2N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-OCH_2C(O)OR^{22}$ 、及び $-OC(O)R^{25}$ からそれぞれ独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 C_{1-6} ヘテロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、ハロゲン、オキソ、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 $-OR^{21}$ 、 $-SR^{21}$ 、 $-N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-C(O)OR^{22}$ 、 $-C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-OC(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-N(R^{24})C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-N(R^{24})C(O)OR^{25}$ 、 $-N(R^{24})C(O)R^{25}$ 、 $-N(R^{24})S(O)_2R^{25}$ 、 $-C(O)R^{25}$ 、 $-S(O)_2R^{25}$ 、 $-S(O)_2N(R^{22})(R^{23})$ 、及び $-OC(O)R^{25}$ から独立して選択される1、2、または3つの基で任意選択により置換され、

各 R^{21} は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから独立して選択され、

各 R^{22} は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから独立して選択され、

各 R^{23} は、H及び C_{1-6} アルキルから独立して選択され、

各 R^{24} は、H及び C_{1-6} アルキルから独立して選択され、

各 R^{25} は、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} ヘテロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから選択され、

【化889】

10

20

30

40

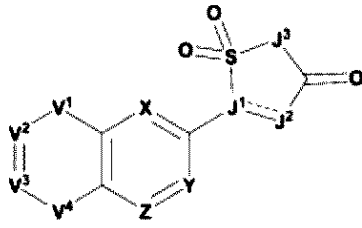
50

は、全ての原子価が満たされるような単結合または二重結合を示す)。

(項目 2 2)

式 (I I - 3) の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物：

【化 8 9 0】



式 (I I - 3)

10

(式中、

V^1 は、結合またはSであり、

V^4 は、結合またはSであり、ここで、 V^1 が結合である場合、 V^4 はSであり、 V^1 がSである場合、 V^4 は結合であり、

V^2 は、NまたはC (R^2)であり、

V^3 は、NまたはC (R^3)であり、

Xは、NまたはC (R^5)であり、

Yは、NまたはC (R^6)であり、

Zは、NまたはC (R^7)であり、

J^1 は、N、C、またはC (R^8)であり、

J^2 は、N、N (R^9)、C (R^9)、C (R^9) (R^{9a})、またはC (O)であり、

J^3 は、N (R^{10})またはC (R^{10}) (R^{10a})であり、

R^2 及び R^{2a} は、水素、ハロゲン、-CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、

C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、

C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、

$-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、

$-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})$

(R^{13}) 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20b} で任意選択により置換され、

R^3 及び R^{3a} は、水素、ハロゲン、-CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、

C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、

C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})$

(R^{13}) 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6}

C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20b} で任意選択により置換され、

R^3 及び R^{3a} は、水素、ハロゲン、-CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、

C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、

C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})$

(R^{13}) 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6}

C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20b} で任意選択により置換され、

R^3 及び R^{3a} は、水素、ハロゲン、-CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、

C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、

C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})$

(R^{13}) 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6}

C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20b} で任意選択により置換され、

R^3 及び R^{3a} は、水素、ハロゲン、-CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、

C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、

C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})$

(R^{13}) 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6}

C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20b} で任意選択により置換され、

R^3 及び R^{3a} は、水素、ハロゲン、-CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、

C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、

C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})$

(R^{13}) 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6}

20

30

40

50

アルキニル、 $C_3 - 6$ シクロアルキル、 $C_2 - 9$ ヘテロシクロアルキル、 $C_6 - 10$ アリーール、及び $C_1 - 9$ ヘテロアリーールは、1、2、または3つの R^{20c} で任意選択により置換され、

R^5 は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $C_1 - 6$ アルキル、 $C_2 - 6$ アルケニル、 $C_2 - 6$ アルキニル、 $C_3 - 6$ シクロアルキル、 $C_2 - 9$ ヘテロシクロアルキル、 $C_6 - 10$ アリーール、 $C_1 - 9$ ヘテロアリーール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から選択され、ここで、 $C_1 - 6$ アルキル、 $C_2 - 6$ アルケニル、 $C_2 - 6$ アルキニル、 $C_3 - 6$ シクロアルキル、 $C_2 - 9$ ヘテロシクロアルキル、 $C_6 - 10$ アリーール、及び $C_1 - 9$ ヘテロアリーールは、1、2、または3つの R^{20e} で任意選択により置換され、

R^6 は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $C_1 - 6$ アルキル、 $C_2 - 6$ アルケニル、 $C_2 - 6$ アルキニル、 $C_3 - 6$ シクロアルキル、 $C_2 - 9$ ヘテロシクロアルキル、 $C_6 - 10$ アリーール、 $C_1 - 9$ ヘテロアリーール、 $-OR^{16}$ 、 $-N(R^{12})(R^{16})$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から選択され、ここで、 $C_1 - 6$ アルキル、 $C_2 - 6$ アルケニル、 $C_2 - 6$ アルキニル、 $C_3 - 6$ シクロアルキル、 $C_2 - 9$ ヘテロシクロアルキル、 $C_6 - 10$ アリーール、及び $C_1 - 9$ ヘテロアリーールは、1、

2、または3つの R^{20f} で任意選択により置換され、

R^7 は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $C_1 - 6$ アルキル、 $C_2 - 6$ アルケニル、 $C_2 - 6$ アルキニル、 $C_3 - 6$ シクロアルキル、 $C_2 - 9$ ヘテロシクロアルキル、 $C_6 - 10$ アリーール、 $C_1 - 9$ ヘテロアリーール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-S(=O)(=NH)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-CH_2N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-CH_2S(O)_2R^{15}$ 、及び $-CH_2S(O)_2N(R^{12})(R^{13})$ から選択され、ここで、 $C_1 - 6$ アルキル、 $C_2 - 6$ アルケニル、 $C_2 - 6$ アルキニル、 $C_3 - 6$ シクロアルキル、 $C_2 - 9$ ヘテロシクロアルキル、 $C_6 - 10$ アリーール、及び $C_1 - 9$ ヘテロアリーールは、1、2、または3つの R^{20g} で任意選択により置換され、

R^8 は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $C_1 - 6$ アルキル、 $C_2 - 6$ アルケニル、 $C_2 - 6$ アルキニル、 $C_3 - 6$ シクロアルキル、 $C_2 - 9$ ヘテロシクロアルキル、 $C_6 - 10$ アリーール、 $C_1 - 9$ ヘテロアリーール、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{12}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_2R^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-OC(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-S(O)$

キル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの $R^{2.0k}$ で任意選択により置換され、

各 $R^{1.6}$ は、 $-C_{1-6}$ アルキレン-OP(O)(OR^{1.6a})(OR^{1.6b})及び-P(O)(OR^{1.6a})(OR^{1.6b})から独立して選択され、ここで、前記 C_{1-6} アルキレンは、1、2、または3つの $R^{2.0l}$ で任意選択により置換され、

各 $R^{1.6a}$ 及び $R^{1.6b}$ は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの $R^{2.0m}$ で任意選択により置換され、

各 $R^{2.0a}$ 、 $R^{2.0b}$ 、 $R^{2.0c}$ 、 $R^{2.0d}$ 、 $R^{2.0e}$ 、 $R^{2.0f}$ 、 $R^{2.0g}$ 、 $R^{2.0h}$ 、 $R^{2.0i}$ 、 $R^{2.0j}$ 、 $R^{2.0k}$ 、 $R^{2.0l}$ 、及び $R^{2.0m}$ は、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 C_{1-6} ヘテロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{2.1}$ 、 $-SR^{2.1}$ 、 $-N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-C(O)OR^{2.2}$ 、 $-C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-OC(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-N(R^{2.4})C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-N(R^{2.4})C(O)OR^{2.2}$ 、 $-N(R^{2.4})C(O)R^{2.5}$ 、 $-N(R^{2.4})S(O)_2R^{2.5}$ 、 $-C(O)R^{2.5}$ 、 $-S(O)_2R^{2.5}$ 、 $-S(O)_2N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-OCH_2C(O)OR^{2.2}$ 、及び $-OC(O)R^{2.5}$ からそれぞれ独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 C_{1-6} ヘテロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、ハロゲン、オキソ、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 $-OR^{2.1}$ 、 $-SR^{2.1}$ 、 $-N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-C(O)OR^{2.2}$ 、 $-C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-OC(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-N(R^{2.4})C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-N(R^{2.4})C(O)OR^{2.5}$ 、 $-N(R^{2.4})C(O)R^{2.5}$ 、 $-N(R^{2.4})S(O)_2R^{2.5}$ 、 $-C(O)R^{2.5}$ 、 $-S(O)_2R^{2.5}$ 、 $-S(O)_2N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、及び $-OC(O)R^{2.5}$ から独立して選択される1、2、または3つの基で任意選択により置換され、

各 $R^{2.1}$ は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから独立して選択され、

各 $R^{2.2}$ は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから独立して選択され、

各 $R^{2.3}$ は、H及び C_{1-6} アルキルから独立して選択され、

各 $R^{2.4}$ は、H及び C_{1-6} アルキルから独立して選択され、

各 $R^{2.5}$ は、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} ヘテロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから選択される)。

(項目23)

R^5 が、水素及びハロゲンから選択される、項目1~22のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

10

20

30

40

50

(項目 2 4)

R⁶が、-OHである、項目 1 ~ 2 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目 2 5)

R⁷が、水素である、項目 1 ~ 2 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目 2 6)

R⁹が水素であり、R^{9a}が水素であり、R¹⁰が水素である、項目 1 ~ 2 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目 2 7)

R²が、-OR¹²であり、R¹²が、C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、-CH₂-C₃₋₆シクロアルキル、C₂₋₉ヘテロシクロアルキル、及び-CH₂-C₂₋₉ヘテロシクロアルキルから独立して選択され、ここで、C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、-CH₂-C₃₋₆シクロアルキル、C₂₋₉ヘテロシクロアルキル、及び-CH₂-C₂₋₉ヘテロシクロアルキルは、1、2、または3つのR^{20k}で任意選択により置換される、請求項 1 ~ 2 6 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目 2 8)

R^{20k}が、オキソ、-CN、ハロゲン、-CN、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、-CH₂-C₃₋₆シクロアルキル、C₁₋₆ヘテロアルキル、C₂₋₉ヘテロシクロアルキル、-CH₂-C₂₋₉ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₀アリール、-CH₂-C₆₋₁₀アリール、C₁₋₉ヘテロアリール、-CH₂-C₁₋₉ヘテロアリール、-OR²¹、-SR²¹、-N(R²²)(R²³)、-C(O)OR²²、-C(O)N(R²²)(R²³)、-C(O)C(O)N(R²²)(R²³)、-OC(O)N(R²²)(R²³)、-N(R²⁴)C(O)N(R²²)(R²³)、-N(R²⁴)C(O)OR²²、-N(R²⁴)C(O)R²⁵、-N(R²⁴)S(O)₂R²⁵、-C(O)R²⁵、-S(O)₂R²⁵、-S(O)₂N(R²²)(R²³)、-OCH₂C(O)OR²²、及び-O C(O)R²⁵から独立して選択され、ここで、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、-CH₂-C₃₋₆シクロアルキル、C₁₋₆ヘテロアルキル、C₂₋₉ヘテロシクロアルキル、-CH₂-C₂₋₉ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₀アリール、-CH₂-C₆₋₁₀アリール、C₁₋₉ヘテロアリール、及び-CH₂-C₁₋₉ヘテロアリールは、ハロゲン、オキソ、-CN、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルコキシ、-OR²¹、-SR²¹、-N(R²²)(R²³)、-C(O)OR²²、-C(O)N(R²²)(R²³)、-C(O)C(O)N(R²²)(R²³)、-OC(O)N(R²²)(R²³)、-N(R²⁴)C(O)N(R²²)(R²³)、-N(R²⁴)C(O)OR²²、-N(R²⁴)C(O)R²⁵、-N(R²⁴)S(O)₂R²⁵、-C(O)R²⁵、-S(O)₂R²⁵、-S(O)₂N(R²²)(R²³)、及び-O C(O)R²⁵から独立して選択される 1、2、または 3 つの基で任意選択により置換される、項目 2 7 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目 2 9)

R²が、

10

20

30

40

50

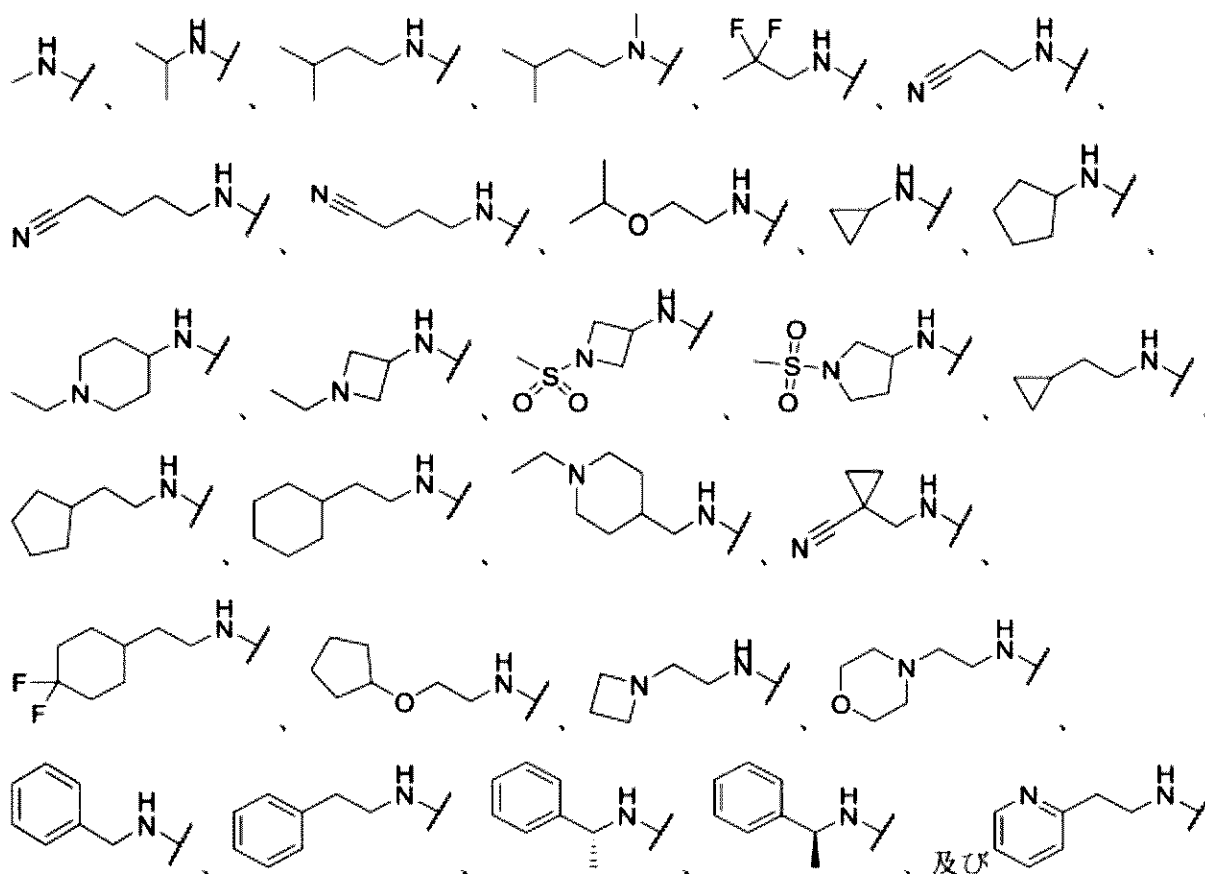
立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ シクロアルキル、 C_{1-6} ヘテロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 $-CH_2-C_{2-9}$ ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 $-CH_2-C_{6-10}$ アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、及び $-CH_2-C_{1-9}$ ヘテロアリールは、ハロゲン、オキソ、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 $-OR^{2.1}$ 、 $-SR^{2.1}$ 、 $-N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-C(O)OR^{2.2}$ 、 $-C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-OC(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-N(R^{2.4})C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-N(R^{2.4})C(O)OR^{2.5}$ 、 $-N(R^{2.4})C(O)R^{2.5}$ 、 $-N(R^{2.4})S(O)_2R^{2.5}$ 、 $-C(O)R^{2.5}$ 、 $-S(O)_2R^{2.5}$ 、 $-S(O)_2N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、及び $-OC(O)R^{2.5}$ から独立して選択される1、2、または3つの基で任意選択により置換される、項目30に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

10

(項目32)

R^2 が、

【化892】



20

30

40

から選択される、項目1~26のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目33)

R^2 が、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールから選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの $R^{2.0b}$ で任意選択により置換される、項目1~26のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

50

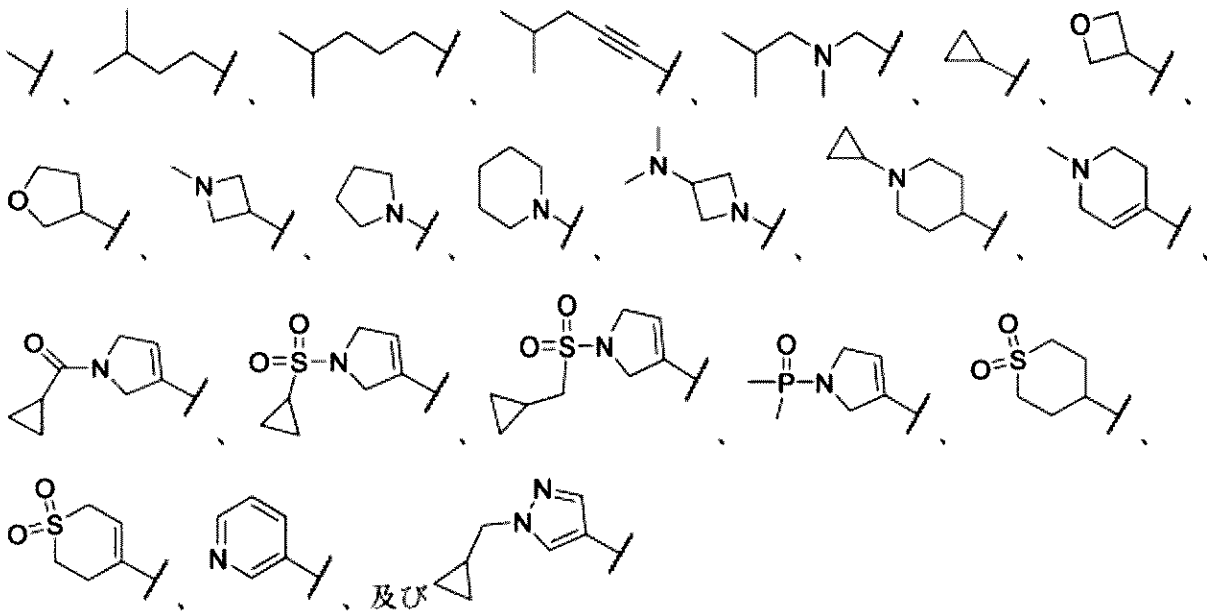
(項目 3 4)

各 R^{20b} が、オキソ、 $-CN$ 、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 $-N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-C(O)R^{25}$ 、 $-S(O)_2R^{25}$ 、及び $-P(O)(R^{25})_2$ から独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル及び C_{3-6} シクロアルキルは、ハロゲン、オキソ、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 $-OR^{21}$ 、 $-SR^{21}$ 、 $-N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-C(O)OR^{22}$ 、 $-C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-OC(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-N(R^{24})C(O)N(R^{22})(R^{23})$ 、 $-N(R^{24})C(O)OR^{25}$ 、 $-N(R^{24})C(O)R^{25}$ 、 $-N(R^{24})S(O)_2R^{25}$ 、 $-C(O)R^{25}$ 、 $-S(O)_2R^{25}$ 、 $-S(O)_2N(R^{22})(R^{23})$ 、及び $-OC(O)R^{25}$ から独立して選択される。1、2、または3つの基で任意選択により置換される、項目 3 3 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

10

(項目 3 5)

R^2 が、
【化 8 9 3】



20

30

から選択される、項目 1 ~ 2 6 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目 3 6)

R^2 が、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{1-9} ヘテロアリール、 $-OR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ から選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル、及び C_{1-9} ヘテロアリールは、1、2、または3つの R^{20b} で任意選択により置換される、項目 1 ~ 2 6 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

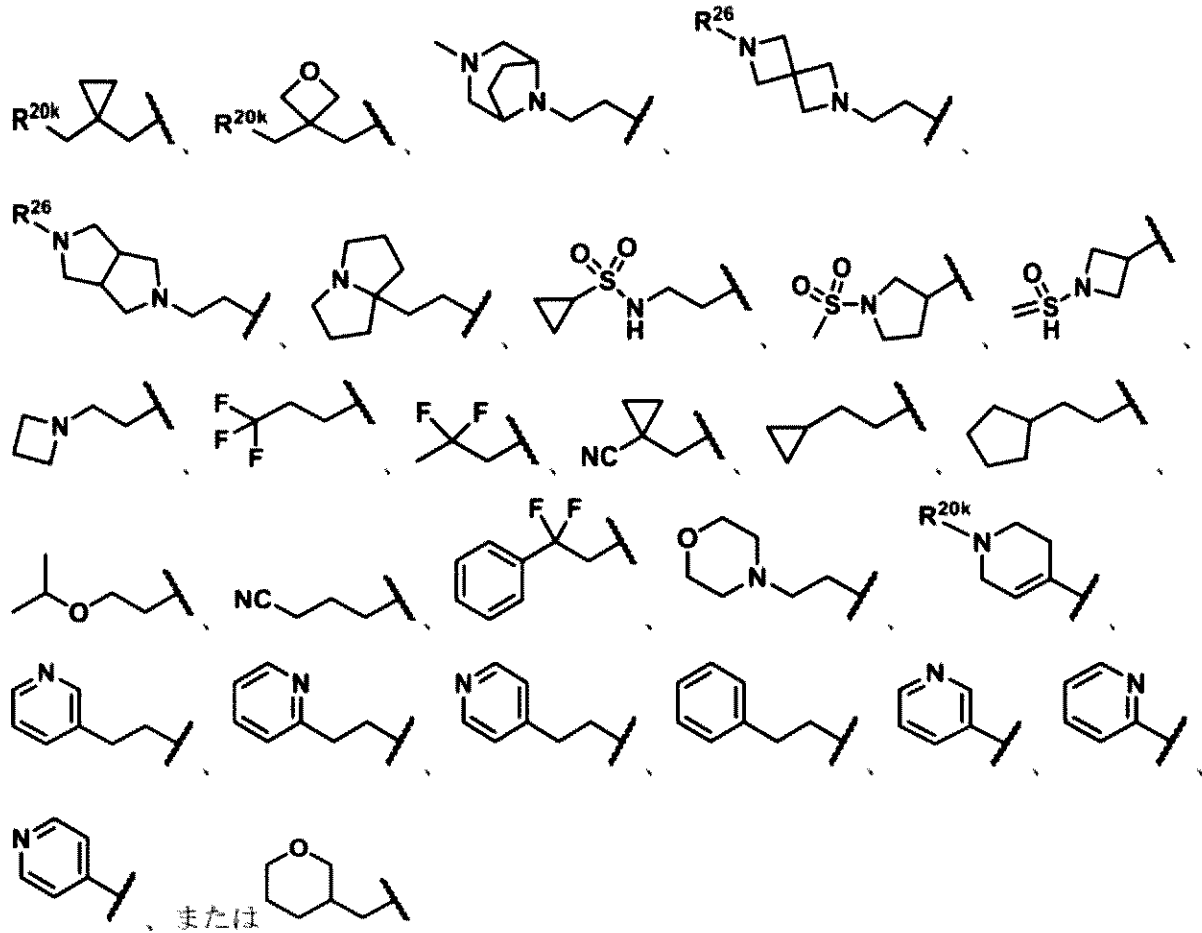
40

(項目 3 7)

R^2 が、 $-OR^{12}$ 、 $-N(R^{12})(R^{13})$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{12})(R^{13})$ から選択され、 R^{13} が、水素であり、 R^{12} 及び R^{15} が、独立して、

50

【化 8 9 4】



10

20

であり、

R^{2.6}が、ハロゲン、オキシ、-CN、C₁-6アルキル、C₁-6ハロアルキル、C₁-6アルコキシ、C₁-6ハロアルコキシ、-OR^{2.1}、-SR^{2.1}、-N(R^{2.2})(R^{2.3})、-C(O)OR^{2.2}、-C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})、-C(O)C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})、-OC(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})、-N(R^{2.4})C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})、-N(R^{2.4})C(O)OR^{2.5}、-N(R^{2.4})C(O)R^{2.5}、-N(R^{2.4})S(O)₂R^{2.5}、-C(O)R^{2.5}、-S(O)₂R^{2.5}、-S(O)₂N(R^{2.2})(R^{2.3})、及び-OC(O)R^{2.5}から独立して選択される
 項目 1 ~ 26 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

30

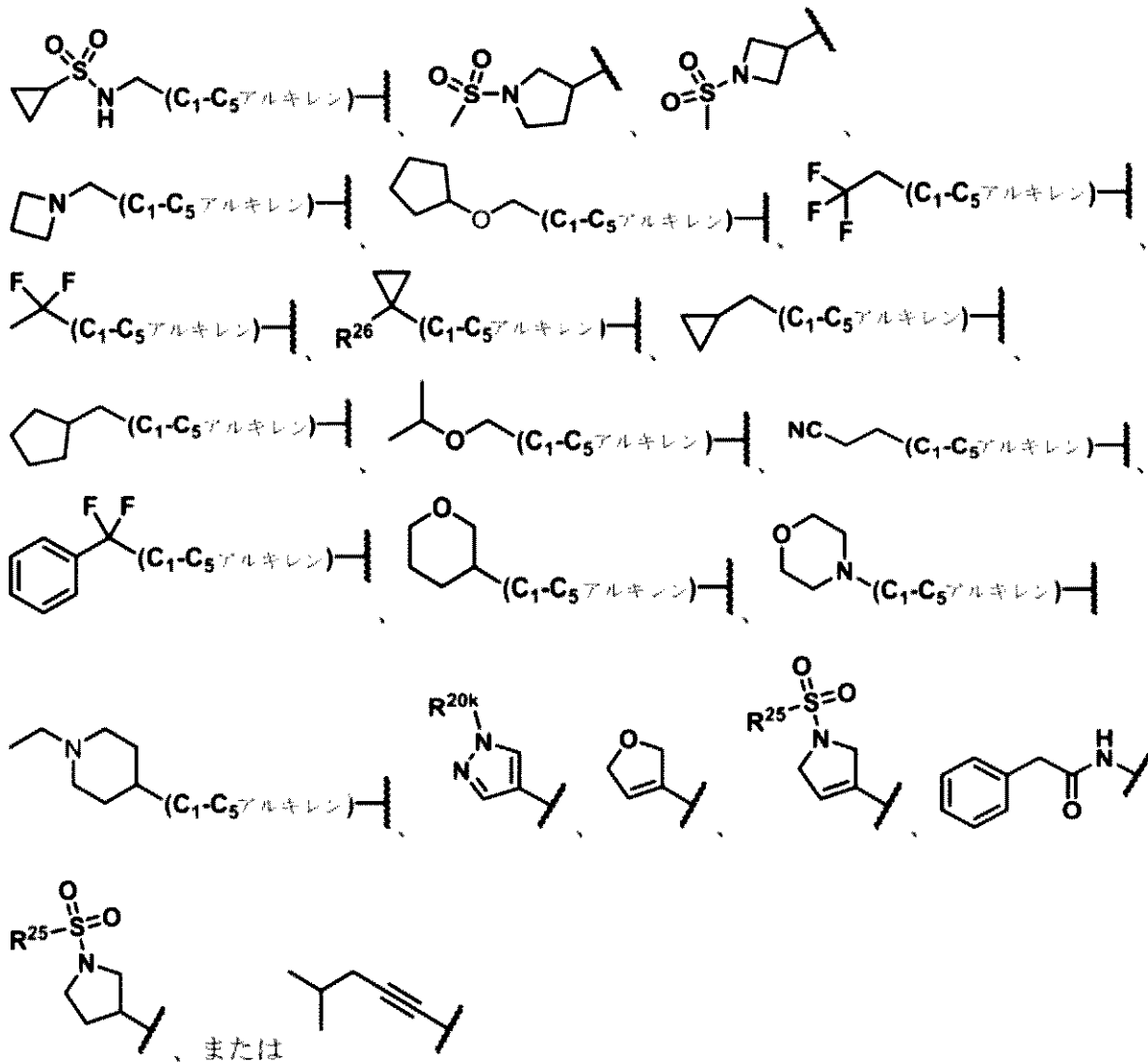
(項目 38)

R²が、-OR^{1.2}、-N(R^{1.2})(R^{1.3})、-C(O)R^{1.5}、-C(O)N(R^{1.2})(R^{1.3})から選択され、
R^{1.3}が、水素であり、
R^{1.2}及びR^{1.5}が、独立して、

40

50

【化 8 9 5】



10

20

30

であり、

R^{2.6}が、ハロゲン、オキソ、-CN、C₁-6アルキル、C₁-6ハロアルキル、C₁-6アルコキシ、C₁-6ハロアルコキシ、-OR^{2.1}、-SR^{2.1}、-N(R^{2.2})(R^{2.3})、-C(O)OR^{2.2}、-C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})、-C(O)C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})、-OC(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})、-N(R^{2.4})C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})、-N(R^{2.4})C(O)OR^{2.5}、-N(R^{2.4})C(O)R^{2.5}、-N(R^{2.4})S(O)₂R^{2.5}、-C(O)R^{2.5}、-S(O)₂R^{2.5}、-S(O)₂N(R^{2.2})(R^{2.3})、及び-OC(O)R^{2.5}から独立して選択される

項目1~26のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

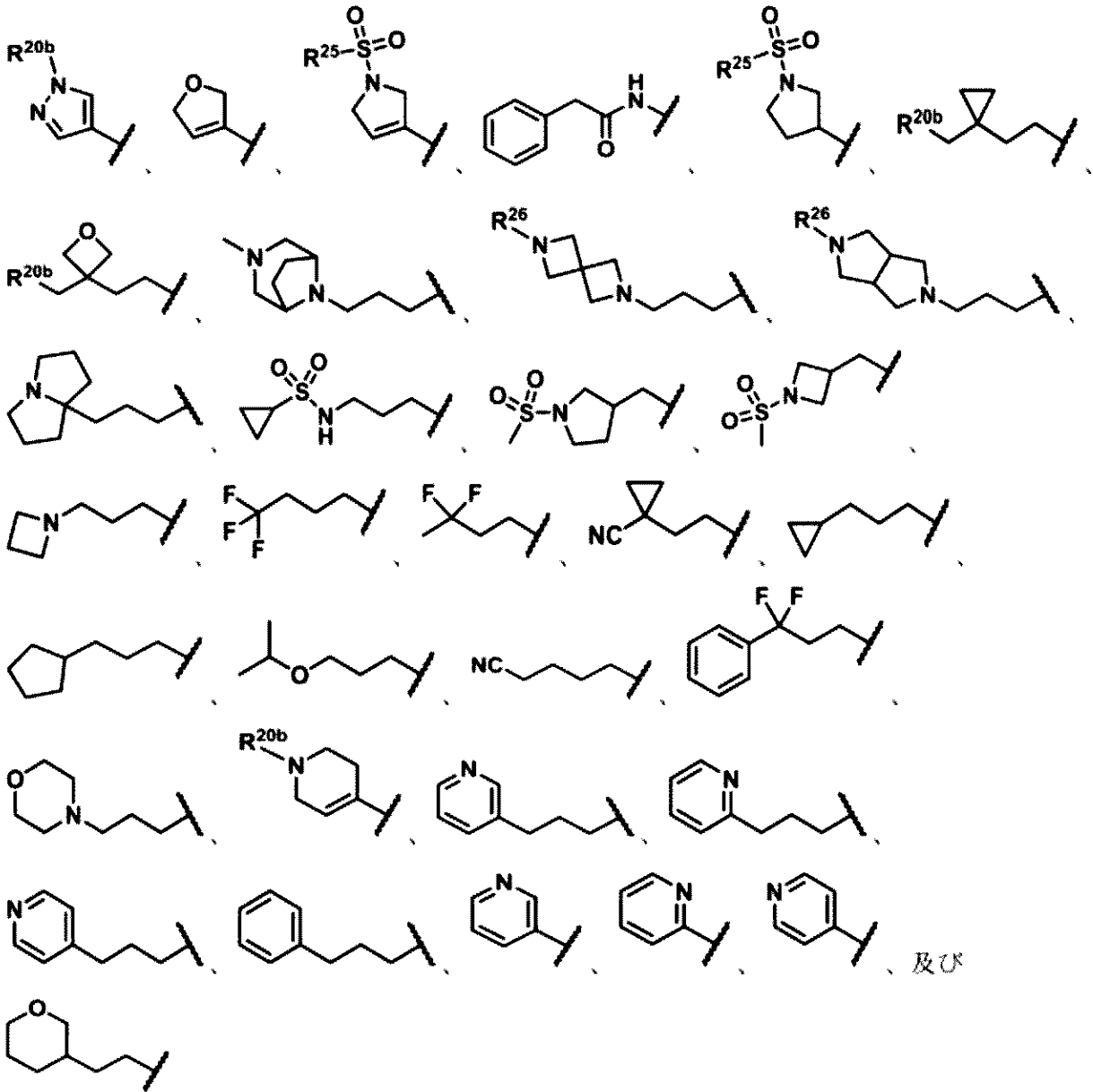
(項目39)

R²が、

40

50

【化 8 9 6】



10

20

30

から選択され、

$R^{2.6}$ が、ハロゲン、オキソ、 $-CN$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 $-OR^{2.1}$ 、 $-SR^{2.1}$ 、 $-N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-C(O)OR^{2.2}$ 、 $-C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-C(O)C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-OC(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-N(R^{2.4})C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、 $-N(R^{2.4})C(O)OR^{2.5}$ 、 $-N(R^{2.4})C(O)R^{2.5}$ 、 $-N(R^{2.4})S(O)_2R^{2.5}$ 、 $-C(O)R^{2.5}$ 、 $-S(O)_2R^{2.5}$ 、 $-S(O)_2N(R^{2.2})(R^{2.3})$ 、及び $-OC(O)R^{2.5}$ から独立して選択される、項目 1 ~ 26 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

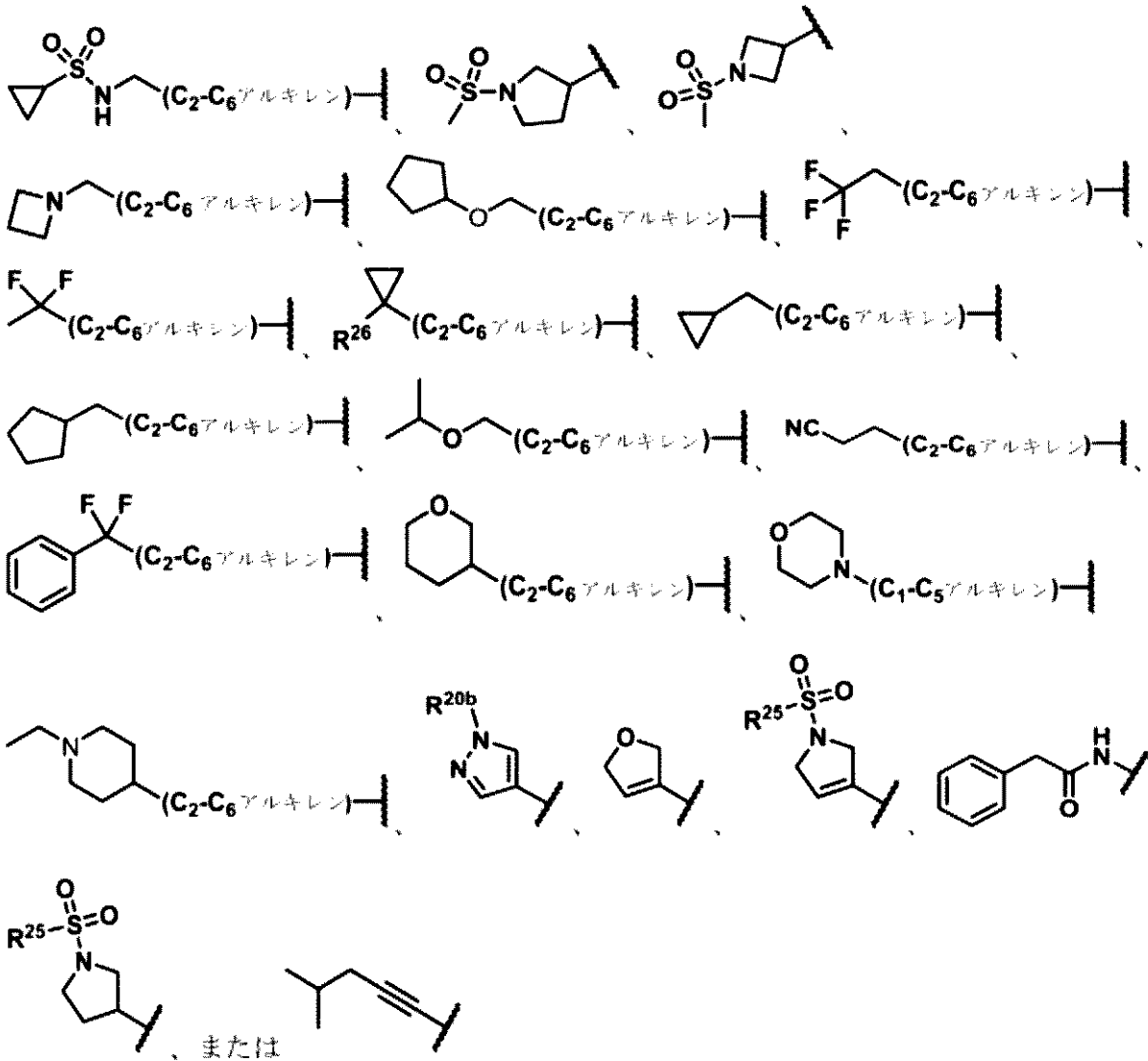
40

(項目 40)

 R^2 が、独立して、

50

【化 8 9 7】



10

20

30

であり、

R^{2.6}が、ハロゲン、オキソ、-CN、C₁-6アルキル、C₁-6ハロアルキル、C₁-6アルコキシ、C₁-6ハロアルコキシ、-OR^{2.1}、-SR^{2.1}、-N(R^{2.2})(R^{2.3})、-C(O)OR^{2.2}、-C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})、-C(O)C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})、-OC(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})、-N(R^{2.4})C(O)N(R^{2.2})(R^{2.3})、-N(R^{2.4})C(O)OR^{2.5}、-N(R^{2.4})C(O)R^{2.5}、-N(R^{2.4})S(O)₂R^{2.5}、-C(O)R^{2.5}、-S(O)₂R^{2.5}、-S(O)₂N(R^{2.2})(R^{2.3})、及び-OC(O)R^{2.5}から独立して選択される

項目1~2.6のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

40

(項目4.1)

R³が、水素、ハロゲン、-CN、C₁-6アルキル、C₃-6シクロアルキル、C₂-9ヘテロシクロアルキル、-OR^{1.2}、-SR^{1.2}、及び-N(R^{1.2})(R^{1.3})から選択され、ここで、C₁-6アルキル、C₃-6シクロアルキル、及びC₂-9ヘテロシクロアルキルは、1、2、または3つのR^{2.0c}で任意選択により置換される、項目1~2.6のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目4.2)

R³が、水素、ハロゲン、-CN、C₁-6アルキル、C₃-6シクロアルキル、及び-

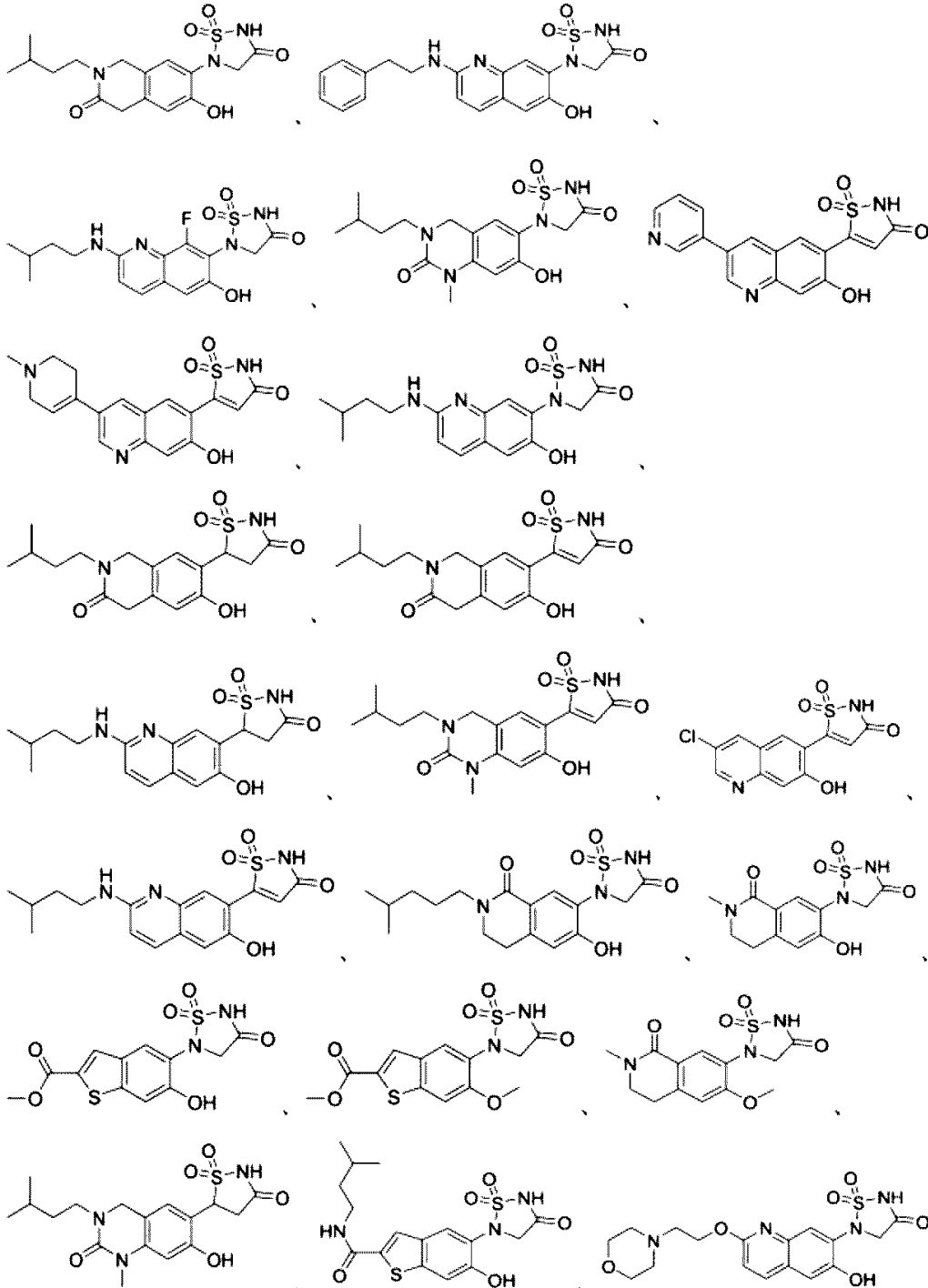
50

OR^{1,2}から選択され、ここで、C₁₋₆アルキル及びC₃₋₆シクロアルキルは、1、2、または3つのR^{2,0,c}で任意選択により置換される、項目1~2.6のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

(項目4.3)

以下から選択される、化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物：

【化898-1】



10

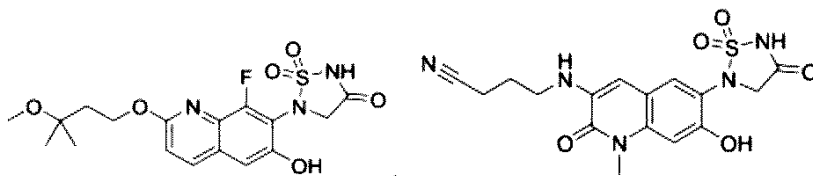
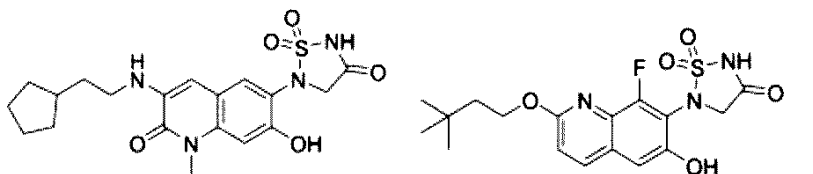
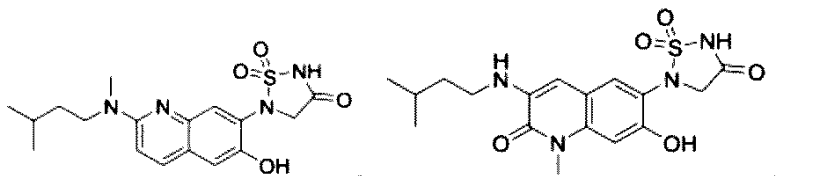
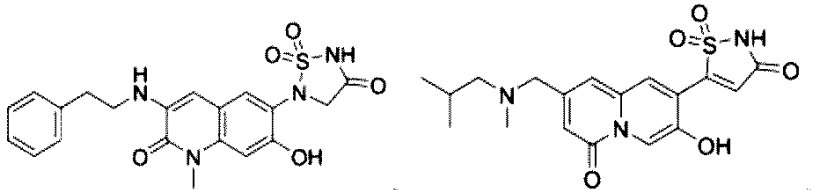
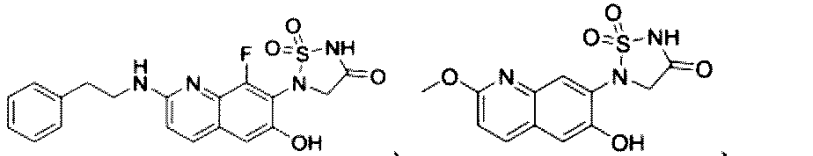
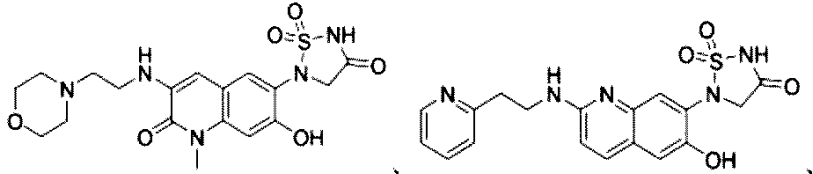
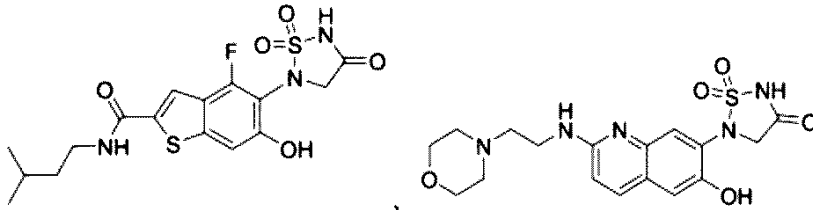
20

30

40

50

【化 8 9 8 - 2】



10

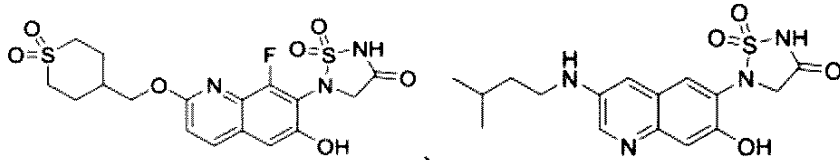
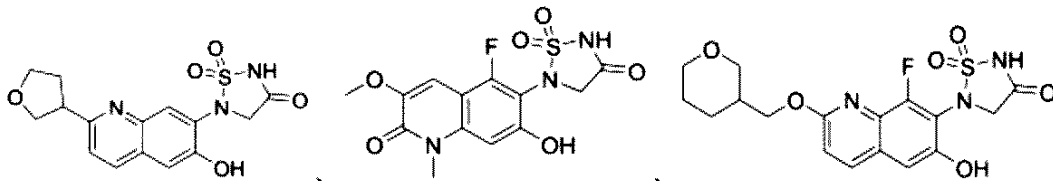
20

30

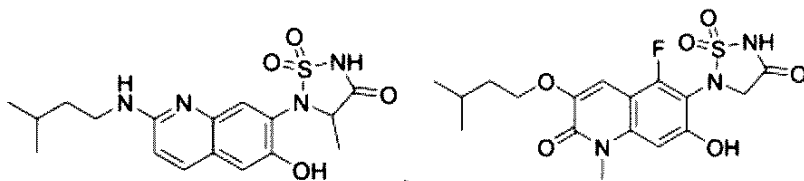
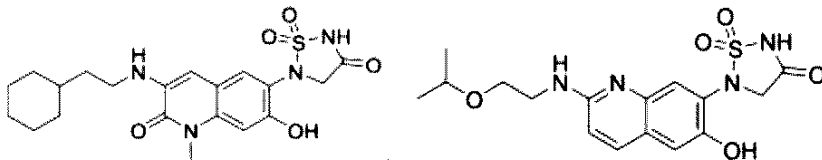
40

50

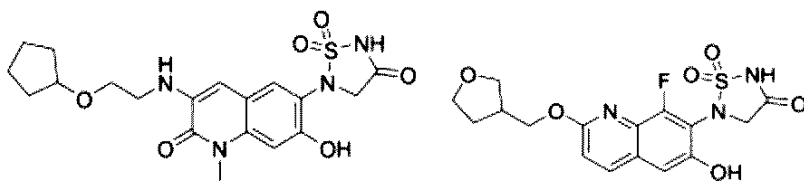
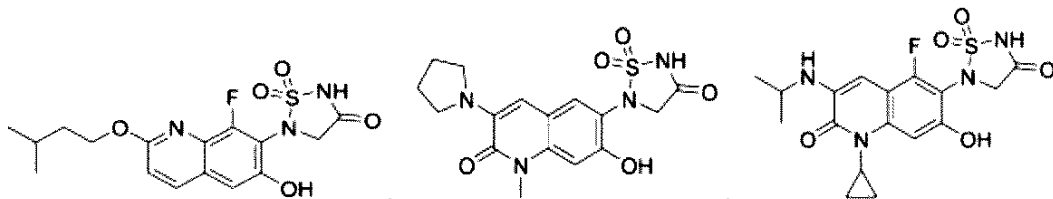
【化 8 9 8 - 3】



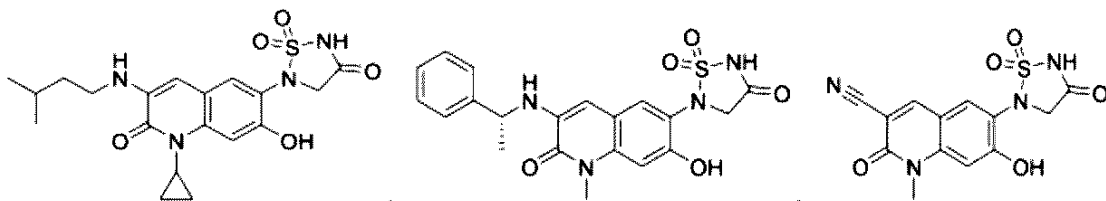
10



20



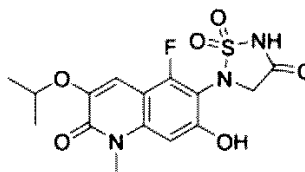
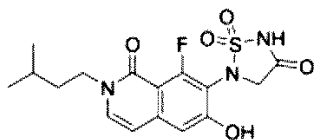
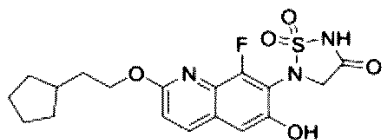
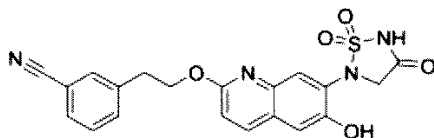
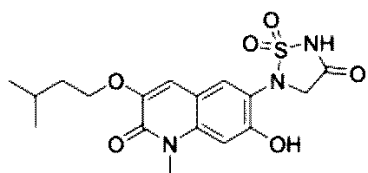
30



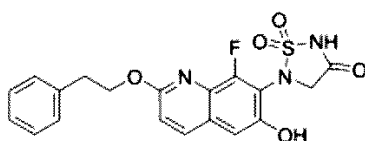
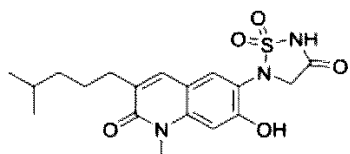
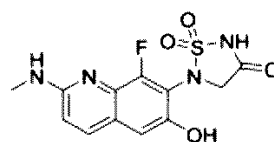
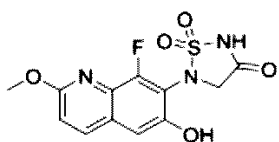
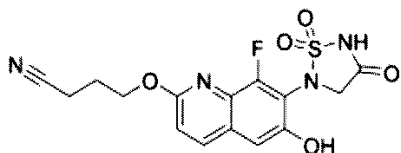
40

50

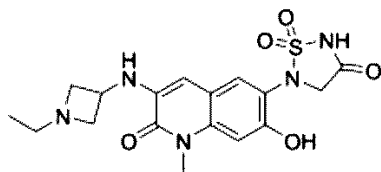
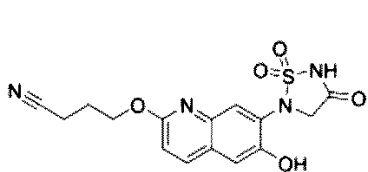
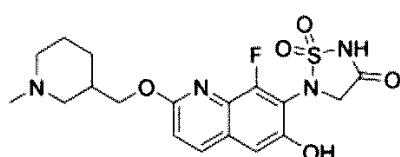
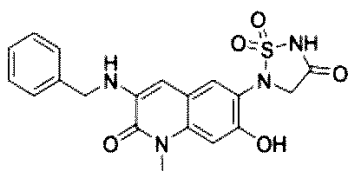
【化 8 9 8 - 4】



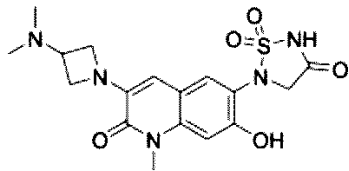
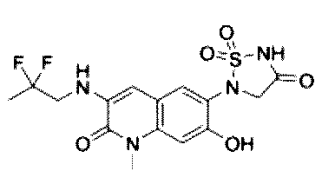
10



20



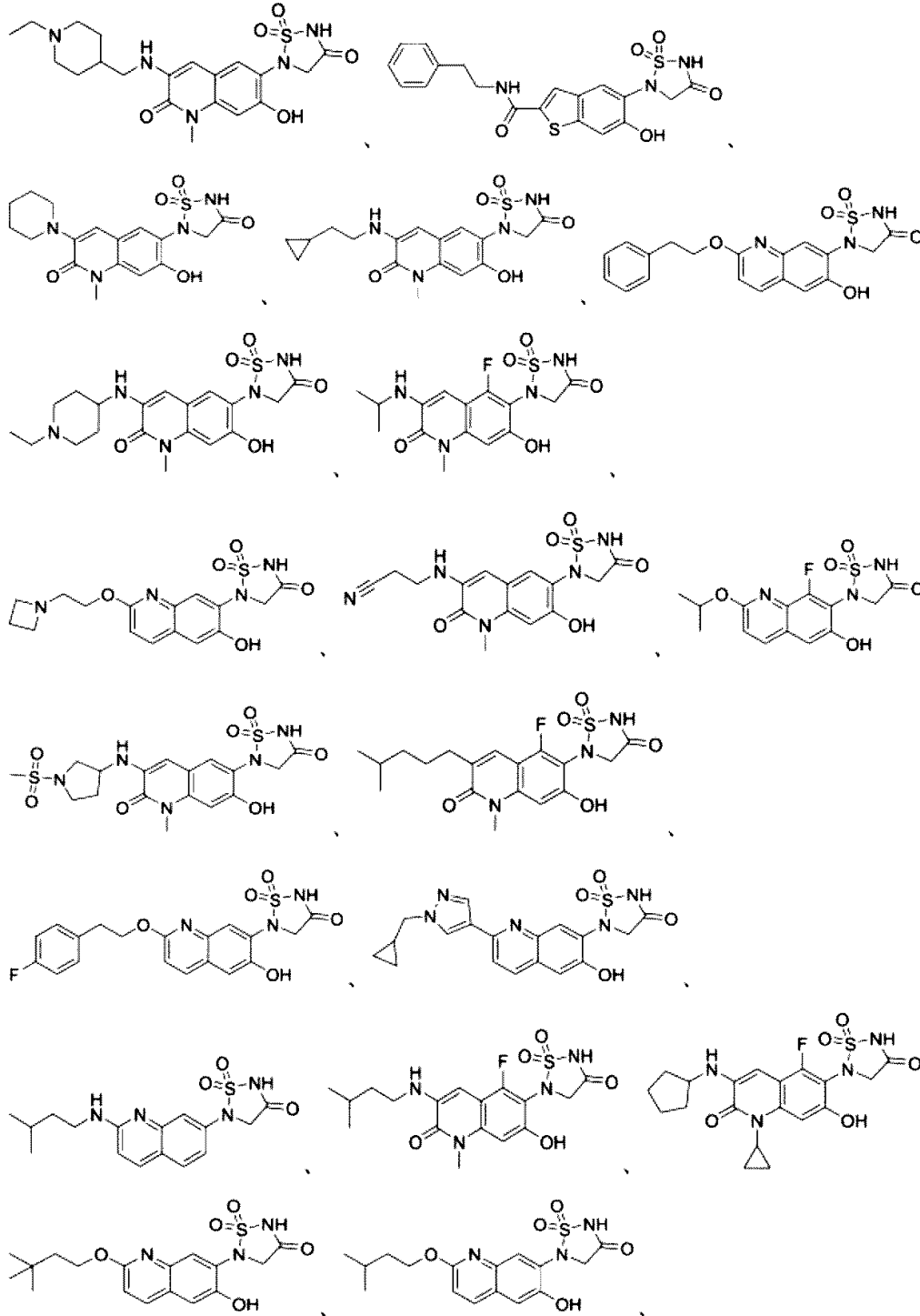
30



40

50

【化 8 9 8 - 5】



10

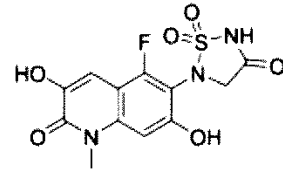
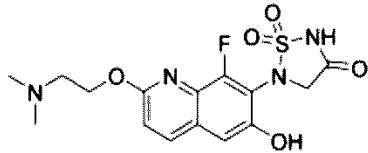
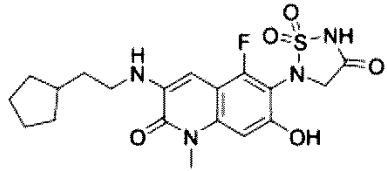
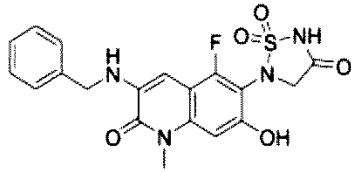
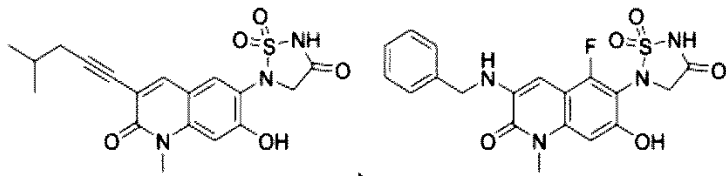
20

30

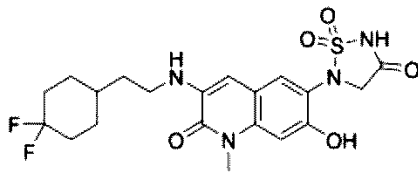
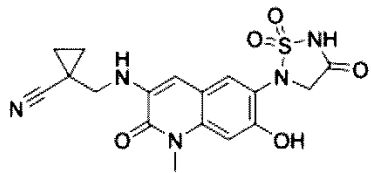
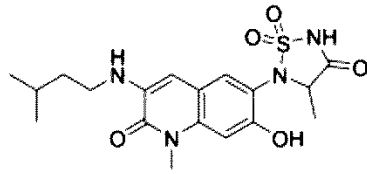
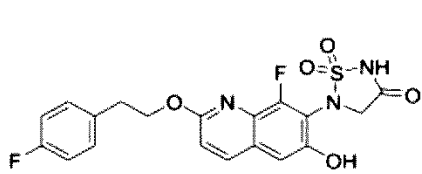
40

50

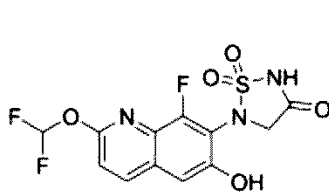
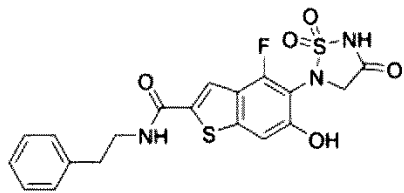
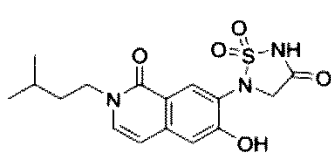
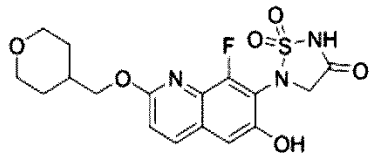
【化 8 9 8 - 6】



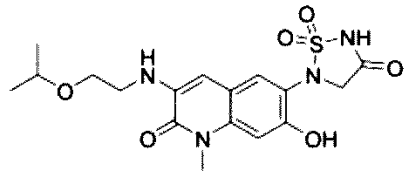
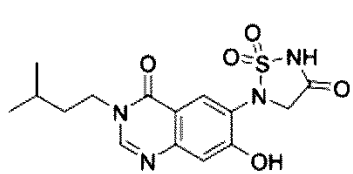
10



20



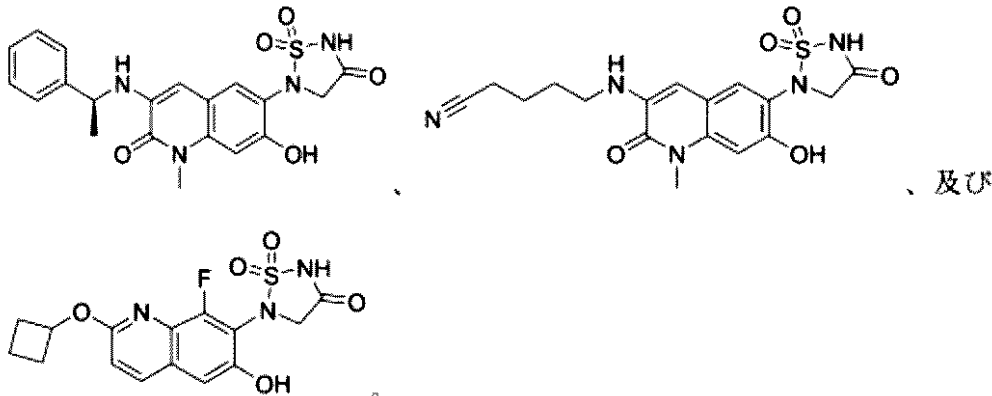
30



40

50

【化 8 9 8 - 7】



10

(項目 4 4)

項目 1 ~ 4 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物と、薬学的に許容される賦形剤とを含む、医薬組成物。

(項目 4 5)

がんを治療することを、それを必要とする対象において行う方法であって、前記対象に、治療上有効な量の項目 1 ~ 4 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物を投与することを、前記方法。

20

(項目 4 6)

細胞の免疫を増強する方法であって、

(a) 前記細胞を項目 1 ~ 4 3 のいずれか 1 項に記載の化合物と接触させ、それにより、前記細胞の免疫を増強することを含み、

前記細胞は、(i) T 細胞受容体融合タンパク質 (T F P) をコードするキメラ T 細胞受容体配列及び / または (i i) キメラ抗原受容体 (C A R) をコードする C A R 配列を含み、T F P 及び C A R のそれぞれは、抗原に対する特異的結合を示す、前記方法。

(項目 4 7)

細胞の免疫を増強する方法であって、

(a) 前記細胞を項目 1 ~ 4 3 のいずれか 1 項に記載の化合物と接触させることと、

(b) 前記細胞に、(i) T 細胞受容体融合タンパク質 (T F P) をコードするキメラ T 細胞受容体配列及び / または (i i) キメラ抗原受容体 (C A R) をコードする C A R 配列を導入することであって、T F P 及び C A R のそれぞれは、抗原に対する特異的結合を示す、前記導入することを含み、それにより、前記細胞の免疫を増強する、前記方法。

30

(項目 4 8)

前記細胞が、リンパ系細胞である、項目 4 6 ~ 4 7 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 4 9)

前記細胞を投与することを、それを必要とする対象に行うことを更に含む、項目 4 6 ~ 4 8 のいずれか 1 項に記載の方法。

40

(項目 5 0)

前記細胞を前記投与する前、それと同時に、またはその後、項目 1 ~ 4 3 のいずれか 1 項に記載の化合物を前記対象に投与することを更に含む、項目 4 9 に記載の方法。

(項目 5 1)

項目 1 ~ 4 3 のいずれか 1 項に記載の化合物を投与する前に、前記対象の細胞は、P T P N 2 の発現または活性を示している、項目 5 0 に記載の方法。

(項目 5 2)

免疫を増強することを、それを必要とする対象に対して行う方法であって、

(a) P T P N 2 の発現または活性を示している前記対象を選択することと、

(b) 項目 1 ~ 4 3 のいずれか 1 項に記載の化合物を前記対象の細胞に導入することによ

50

って P T P N 2 の発現または活性を下方制御することとを含み、それにより、前記対象の免疫を増強する、前記方法。

(項目 5 3)

免疫を増強することを、それを必要とする対象に対して行う方法であって、リンパ系細胞を前記対象に投与することと、

10

20

30

40

50