

【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29年3月23日(2017.3.23)

【公表番号】特表2016-514100(P2016-514100A)

【公表日】平成28年5月19日(2016.5.19)

【年通号数】公開・登録公報2016-030

【出願番号】特願2015-559015(P2015-559015)

【国際特許分類】

C 0 7 C	49/84	(2006.01)
C 0 7 D	319/18	(2006.01)
C 0 7 D	327/06	(2006.01)
C 0 7 D	311/58	(2006.01)
C 0 7 D	317/54	(2006.01)
C 0 7 D	405/06	(2006.01)
C 0 7 D	307/79	(2006.01)
C 0 7 D	263/56	(2006.01)
C 0 7 D	333/54	(2006.01)
C 0 7 D	409/06	(2006.01)
C 0 7 D	407/06	(2006.01)
C 0 7 D	213/50	(2006.01)
C 0 7 D	333/22	(2006.01)
C 0 7 D	209/08	(2006.01)
C 0 7 D	401/06	(2006.01)
C 0 7 D	235/06	(2006.01)
C 0 7 D	209/12	(2006.01)
C 0 7 D	231/56	(2006.01)
C 0 7 D	239/26	(2006.01)
C 0 7 D	237/08	(2006.01)
A 6 1 K	31/357	(2006.01)
A 6 1 K	31/39	(2006.01)
A 6 1 K	31/353	(2006.01)
A 6 1 K	31/36	(2006.01)
A 6 1 K	31/343	(2006.01)
A 6 1 K	31/423	(2006.01)
A 6 1 K	31/381	(2006.01)
A 6 1 K	31/506	(2006.01)
A 6 1 K	31/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/4402	(2006.01)
A 6 1 K	31/443	(2006.01)
A 6 1 K	31/404	(2006.01)
A 6 1 K	31/4439	(2006.01)
A 6 1 K	31/4184	(2006.01)
A 6 1 K	31/416	(2006.01)
A 6 1 K	31/4433	(2006.01)
A 6 1 K	31/4406	(2006.01)
A 6 1 K	31/4409	(2006.01)
A 6 1 K	31/501	(2006.01)
A 6 1 K	31/505	(2006.01)
A 6 1 K	31/50	(2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)
 A 6 1 K 9/107 (2006.01)
 A 6 1 L 29/00 (2006.01)
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)
 A 6 1 P 27/02 (2006.01)
 A 6 1 P 19/10 (2006.01)
 A 6 1 P 19/02 (2006.01)
 A 6 1 P 19/00 (2006.01)
 A 6 1 P 1/02 (2006.01)
 A 6 1 P 27/16 (2006.01)
 A 6 1 P 17/02 (2006.01)
 A 6 1 P 1/04 (2006.01)
 A 6 1 P 17/00 (2006.01)
 A 6 1 P 25/16 (2006.01)
 A 6 1 P 9/10 (2006.01)
 A 6 1 P 25/08 (2006.01)
 A 6 1 P 25/28 (2006.01)
 A 6 1 P 25/24 (2006.01)
 A 6 1 P 25/18 (2006.01)
 A 6 1 P 17/14 (2006.01)
 A 6 1 P 7/06 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)
 C 0 7 C 49/83 (2006.01)
 C 0 7 C 221/00 (2006.01)
 C 0 7 C 49/792 (2006.01)
 C 0 7 C 49/813 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 49/84 C S P D
 C 0 7 D 319/18
 C 0 7 D 327/06
 C 0 7 D 311/58
 C 0 7 D 317/54
 C 0 7 D 405/06
 C 0 7 D 307/79
 C 0 7 D 263/56
 C 0 7 D 333/54
 C 0 7 D 409/06
 C 0 7 D 407/06
 C 0 7 D 213/50
 C 0 7 D 333/22
 C 0 7 D 209/08
 C 0 7 D 401/06
 C 0 7 D 235/06
 C 0 7 D 209/12
 C 0 7 D 231/56 B
 C 0 7 D 231/56 Z
 C 0 7 D 239/26
 C 0 7 D 237/08
 A 6 1 K 31/357
 A 6 1 K 31/39

A 6 1 K	31/353	
A 6 1 K	31/36	
A 6 1 K	31/343	
A 6 1 K	31/423	
A 6 1 K	31/381	
A 6 1 K	31/506	
A 6 1 K	31/12	
A 6 1 K	31/4402	
A 6 1 K	31/443	
A 6 1 K	31/404	
A 6 1 K	31/4439	
A 6 1 K	31/4184	
A 6 1 K	31/416	
A 6 1 K	31/4433	
A 6 1 K	31/4406	
A 6 1 K	31/4409	
A 6 1 K	31/501	
A 6 1 K	31/505	
A 6 1 K	31/50	
A 6 1 K	9/06	
A 6 1 K	9/107	
A 6 1 L	29/00	Z
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	19/00	
A 6 1 P	1/02	
A 6 1 P	27/16	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	25/08	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/24	
A 6 1 P	25/18	
A 6 1 P	17/14	
A 6 1 P	7/06	
A 6 1 P	43/00	1 0 5
A 6 1 P	43/00	1 1 1
C 0 7 C	49/84	C
C 0 7 C	49/83	Z
C 0 7 C	221/00	
C 0 7 C	49/84	E
C 0 7 C	49/792	
C 0 7 C	49/813	

【提出日】平成29年2月20日(2017.2.20)

【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

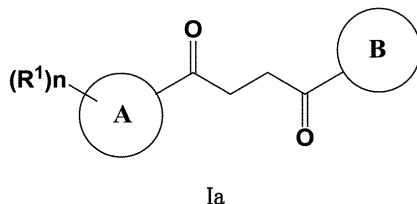
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

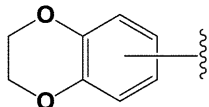
式Iaの化合物：



、または薬学的に許容されるその塩：

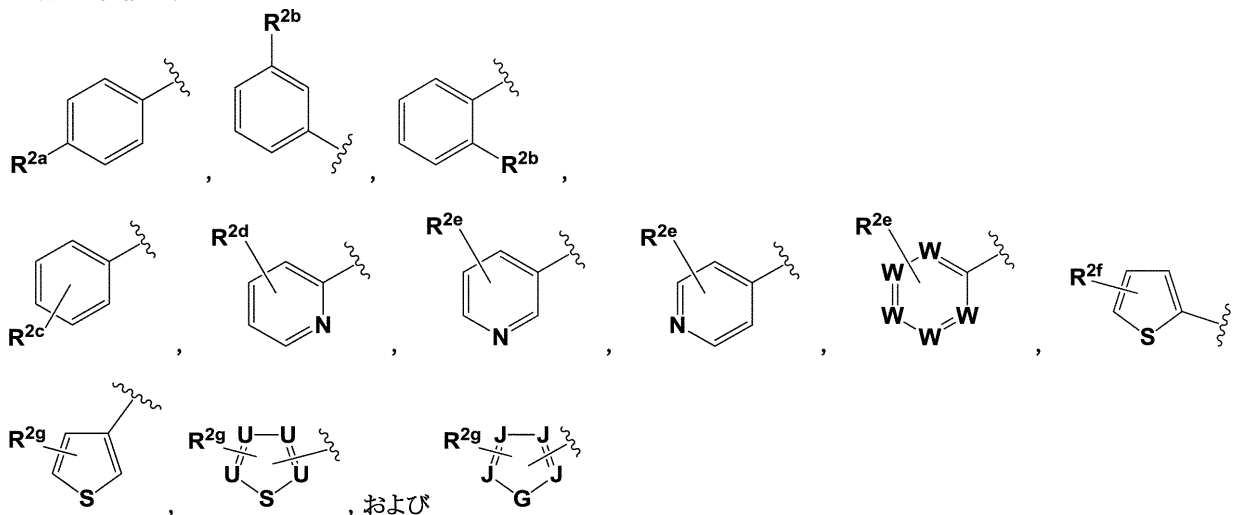
式中、

A環が



であり；

B環が下記式：



からなる群より選択され；

各 R^1 が、A環に結合した置換基であり、出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{2a} が非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、Cl、Br、I、-OR^{3a}、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{2b} が非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR^{3a}、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{2c} が2～5個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{2d} が1～4個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{2e} が1～4個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{3b})_2$ 、 $-C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^3$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{2f} が1～3個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{3b})_2$ 、 $-C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^3$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{2g} が1～3個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{3b})_2$ 、 $-C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^3$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^3 が独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、 $-C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{3a} が独立して非置換- $C_2 \sim 6$ アルキル、 $-C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{3b} が独立してHおよび非置換- $C_1 \sim 3$ アルキルからなる群より選択され；

各WがNまたはCであり、ここで少なくとも2つのWはNであり；

各UがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのUはNであり、少なくとも1つのUはCであり；

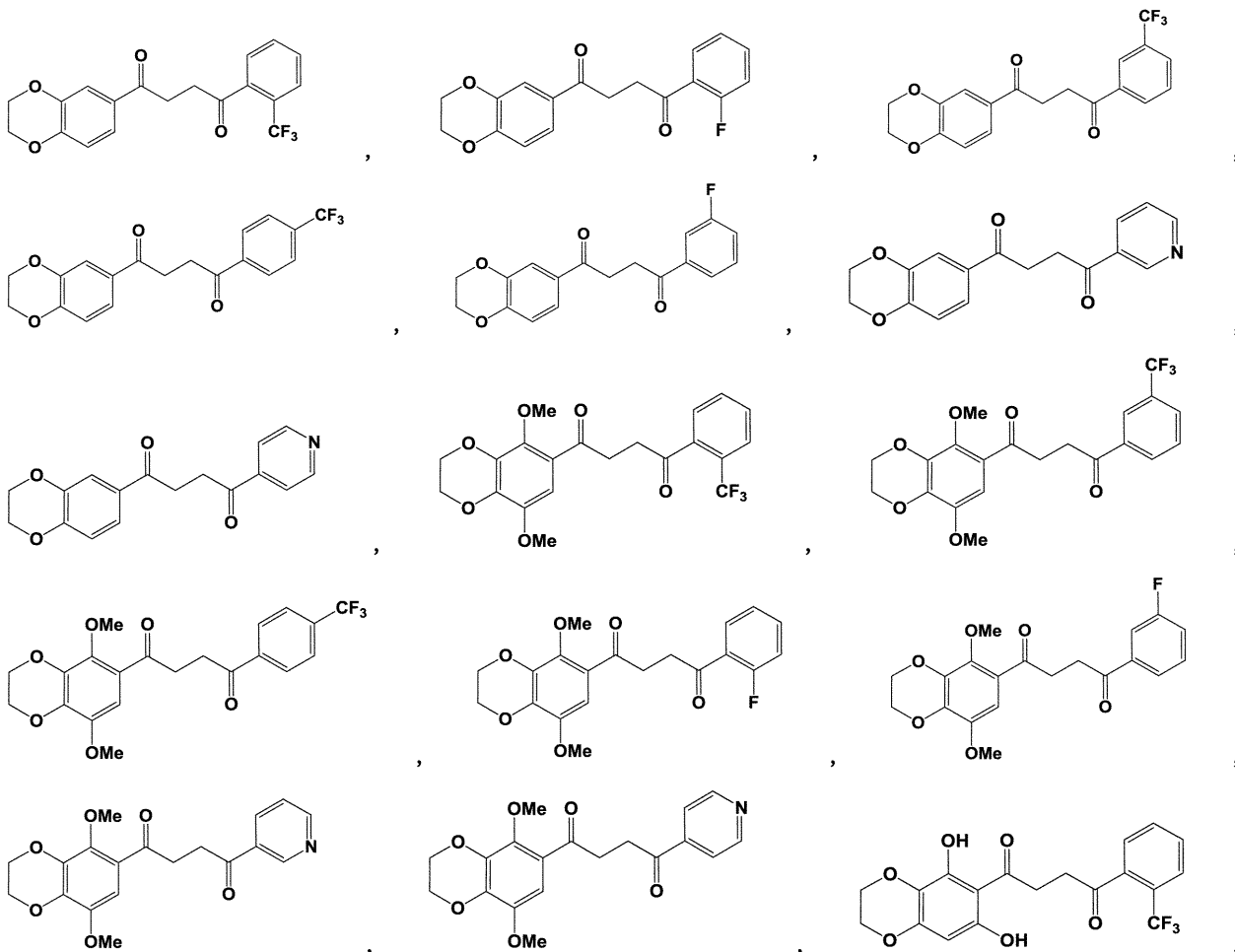
GがNHまたはOであり；

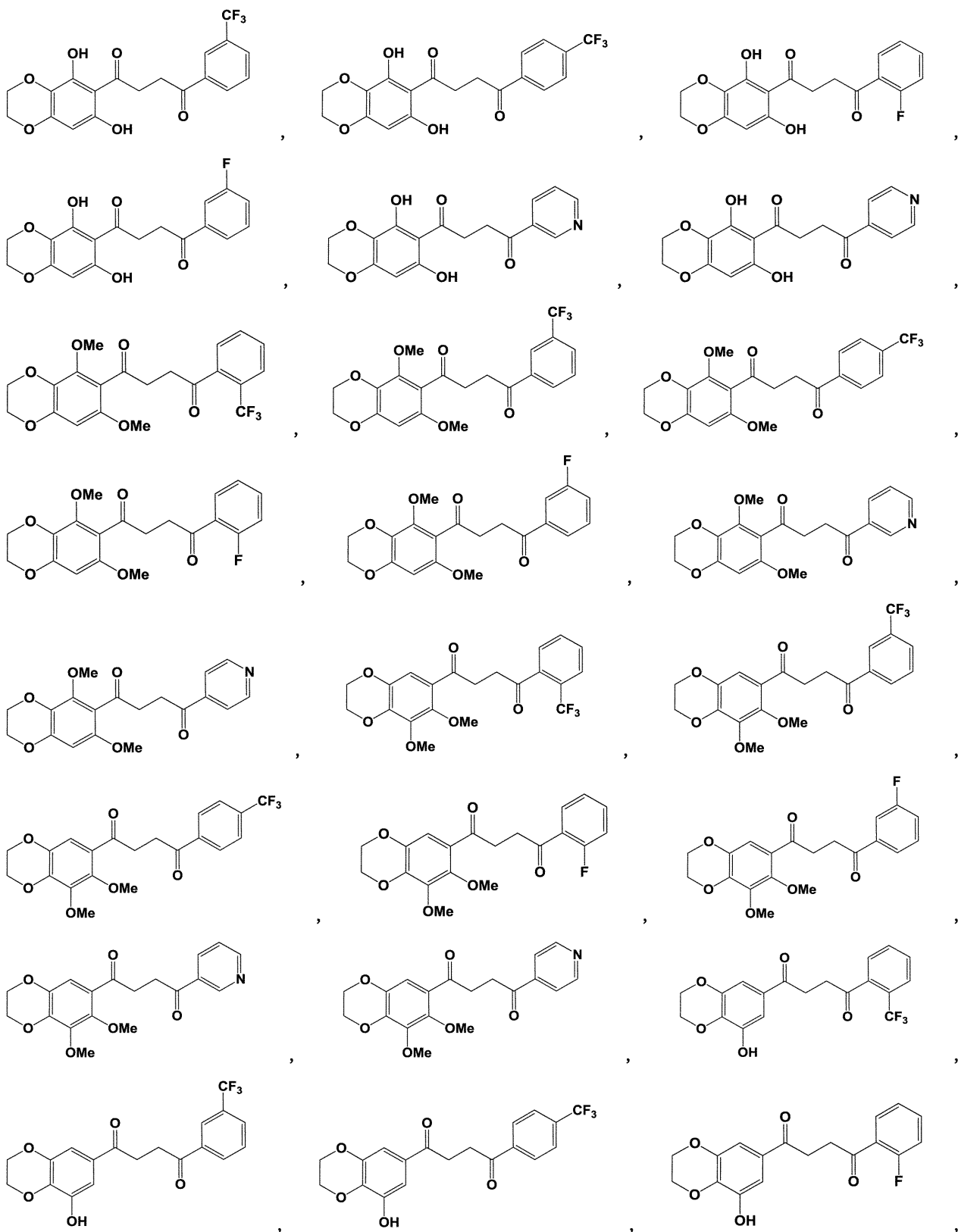
各JがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのJはCであり；

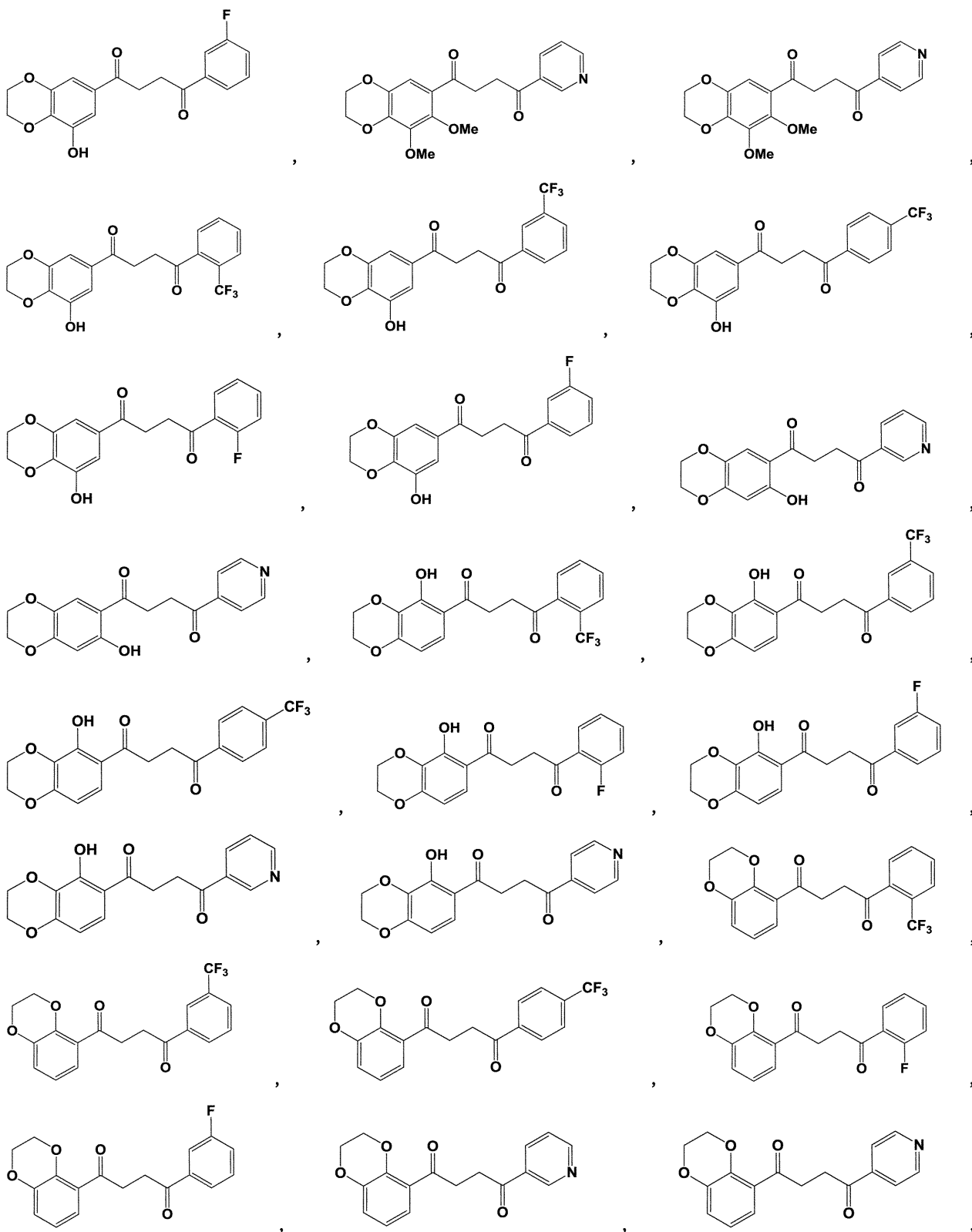
nが1～7の整数である。

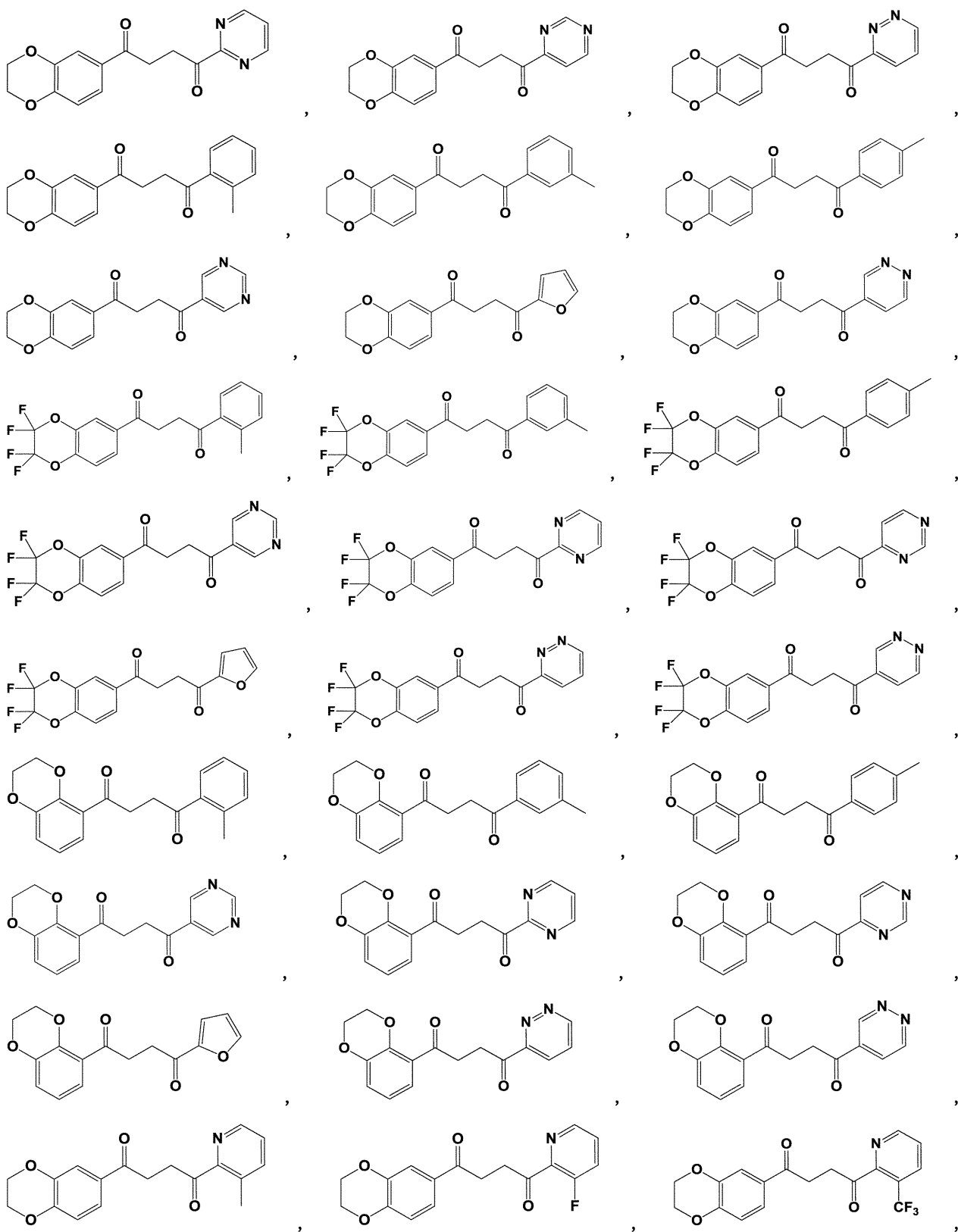
【請求項2】

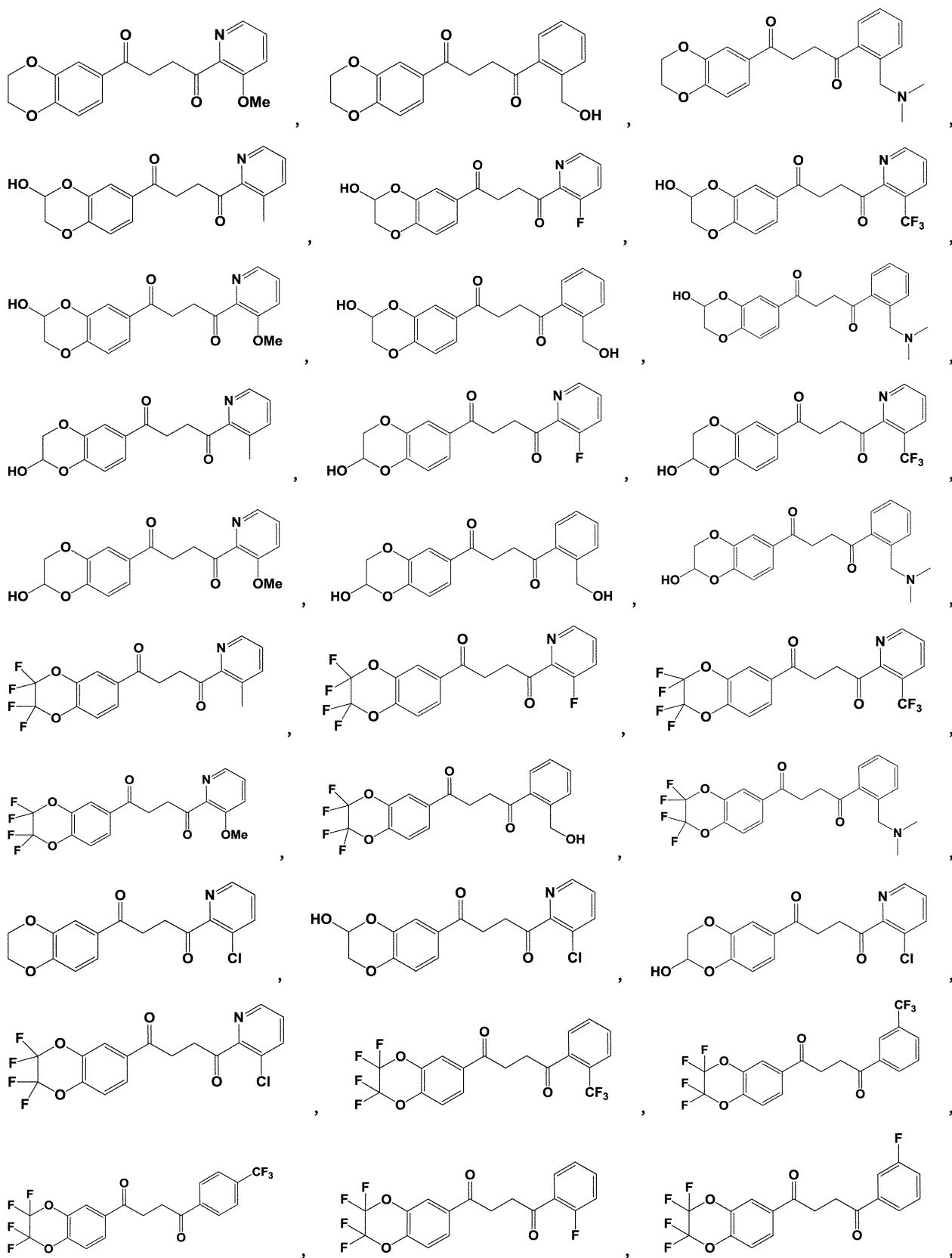
式Iaの化合物が下記式：

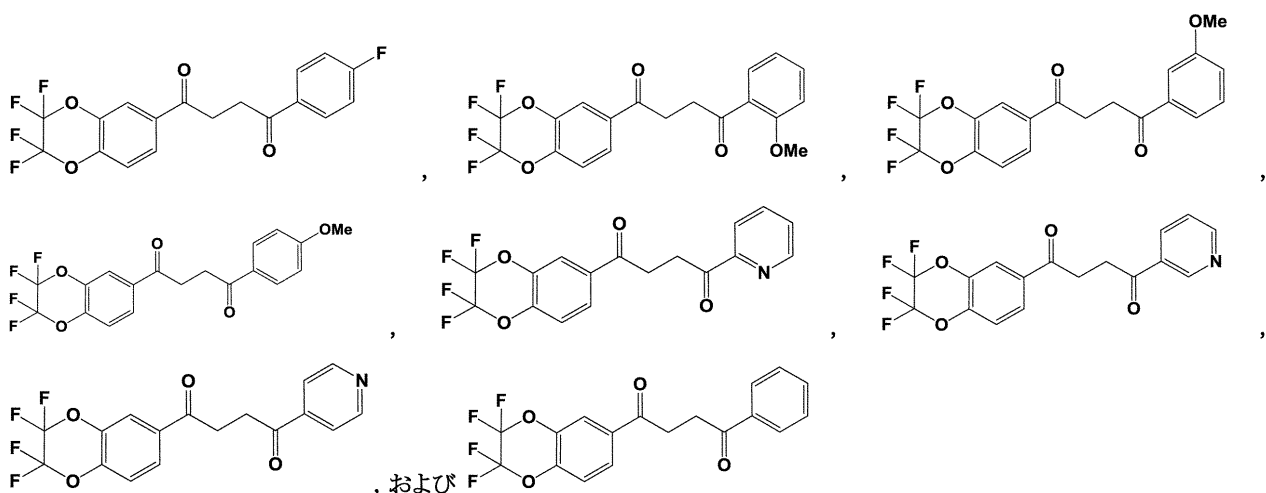








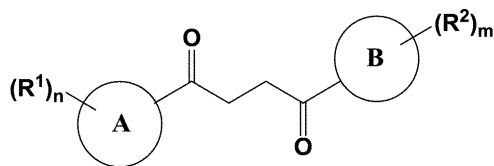




または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

式Ibの化合物：

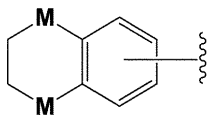


Ib

、または薬学的に許容されるその塩：

式中、

A環が



であり；

B環がフェニルおよび5～6員ヘテロアリールからなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^1 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^2 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^3 が独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各 R^{3b} が独立してHおよび非置換- $C_1 \sim 3$ アルキルからなる群より選択され；

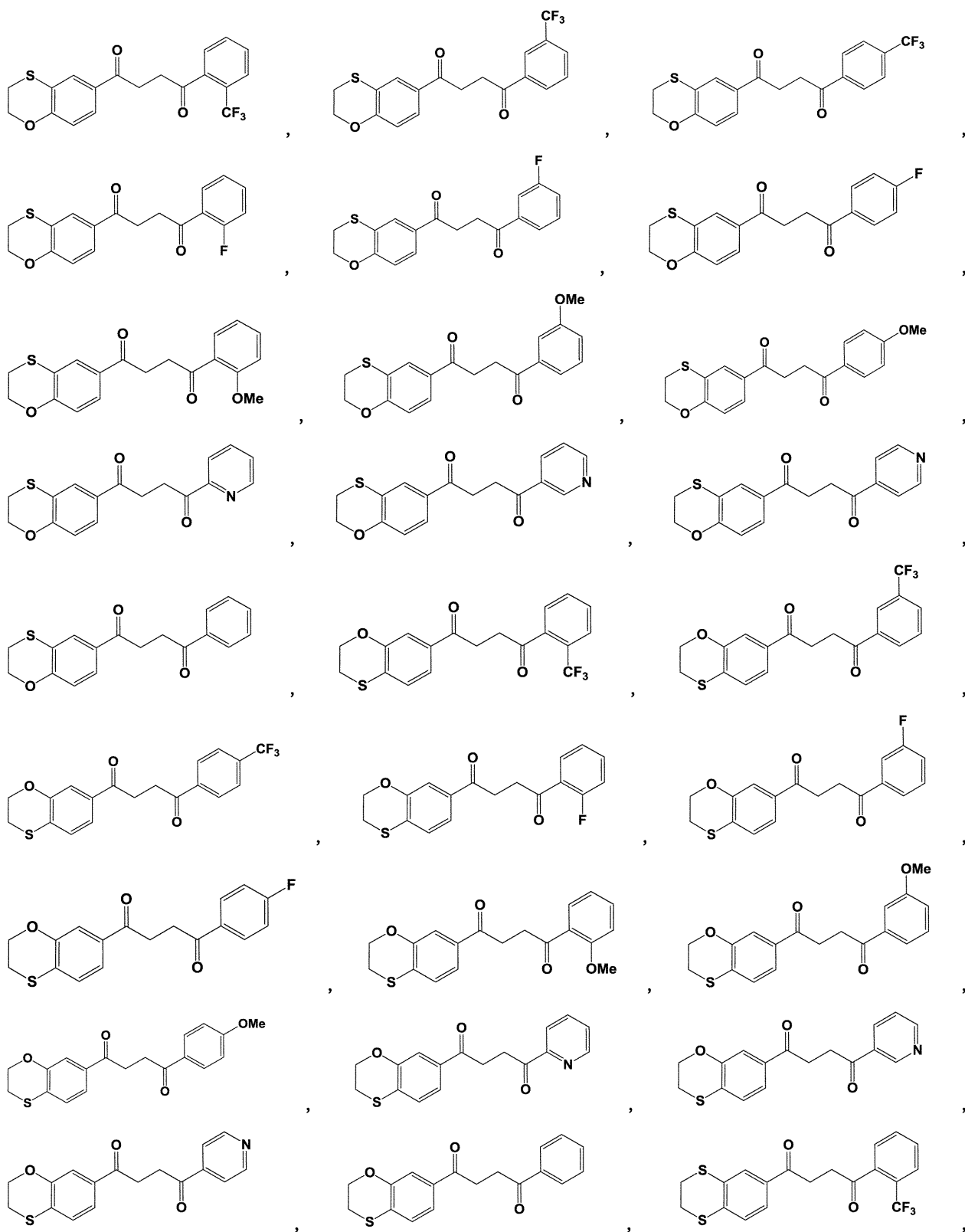
各Mが独立してN、C、S、およびOからなる群より選択され、ここで両方のMはOであることはなく、両方のMはCであることはなく；

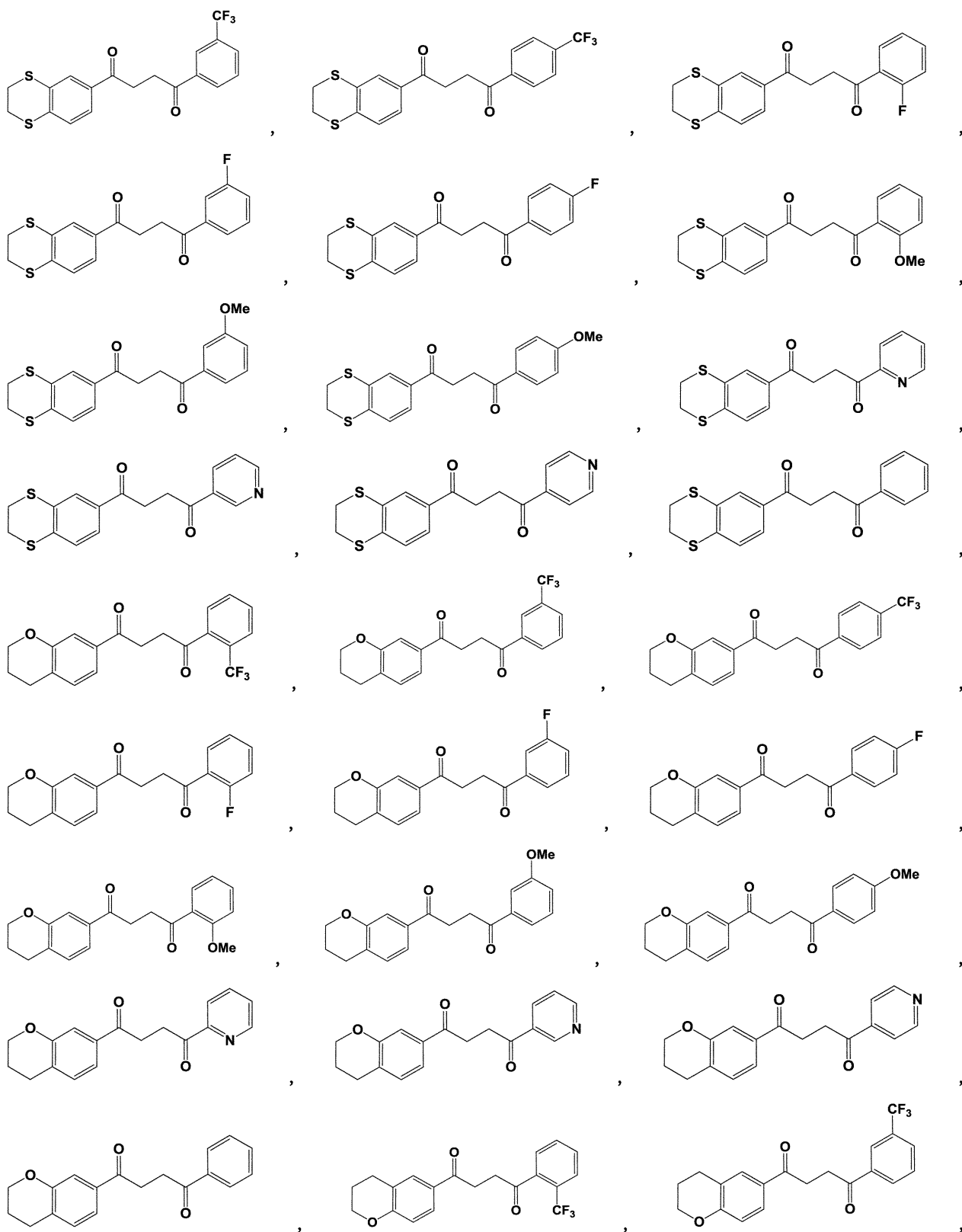
mが1～5の整数であり；

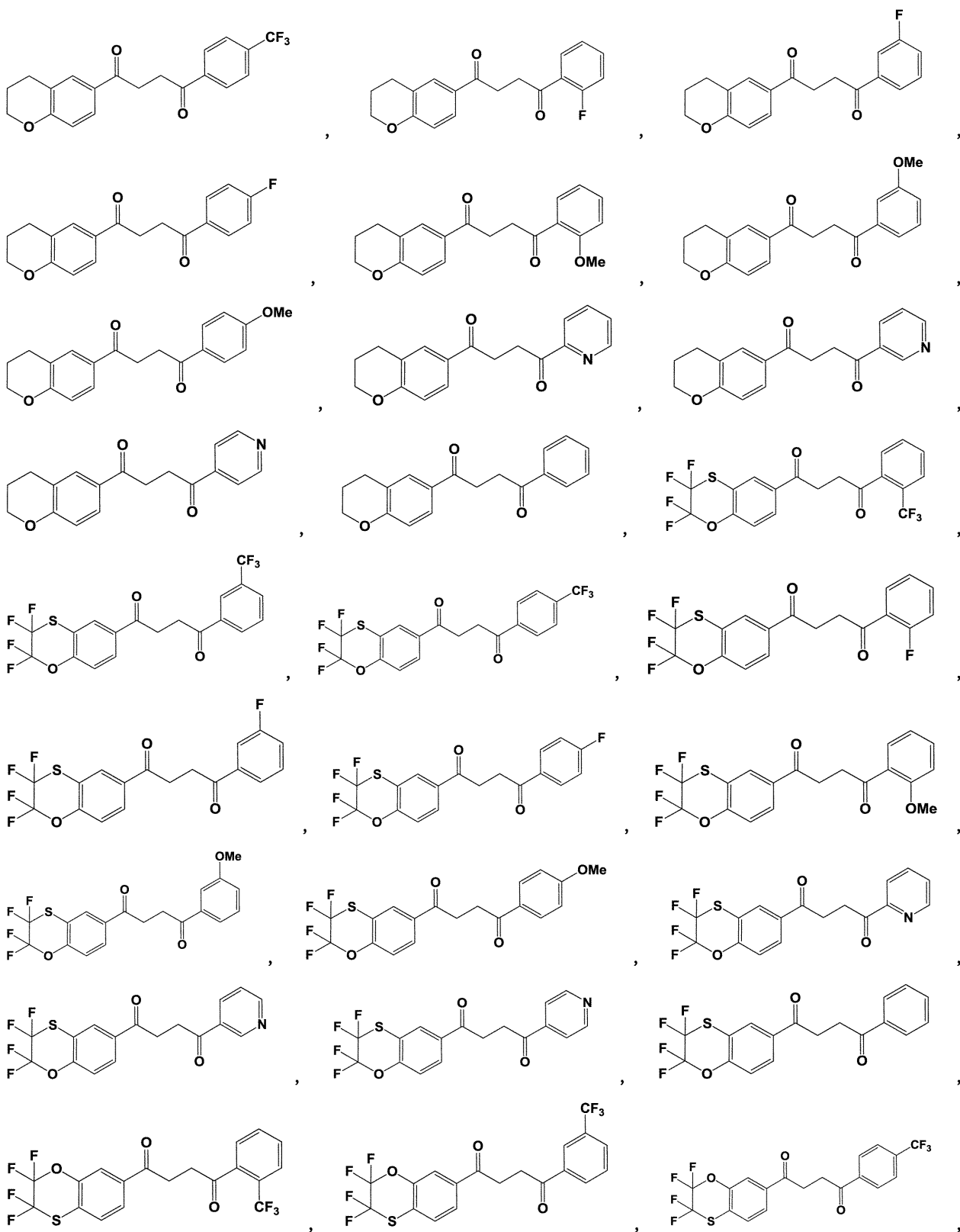
nが1～10の整数である。

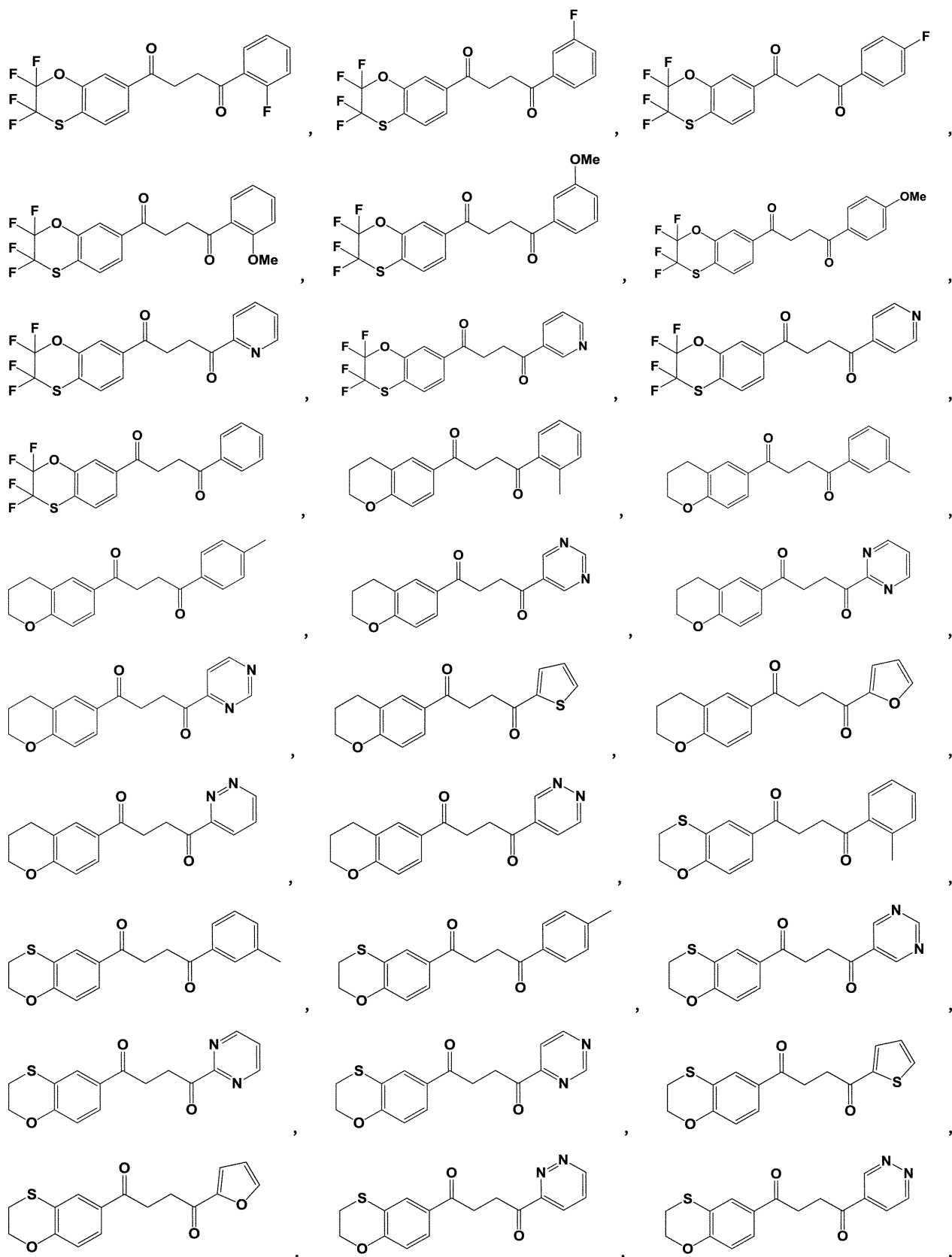
【請求項4】

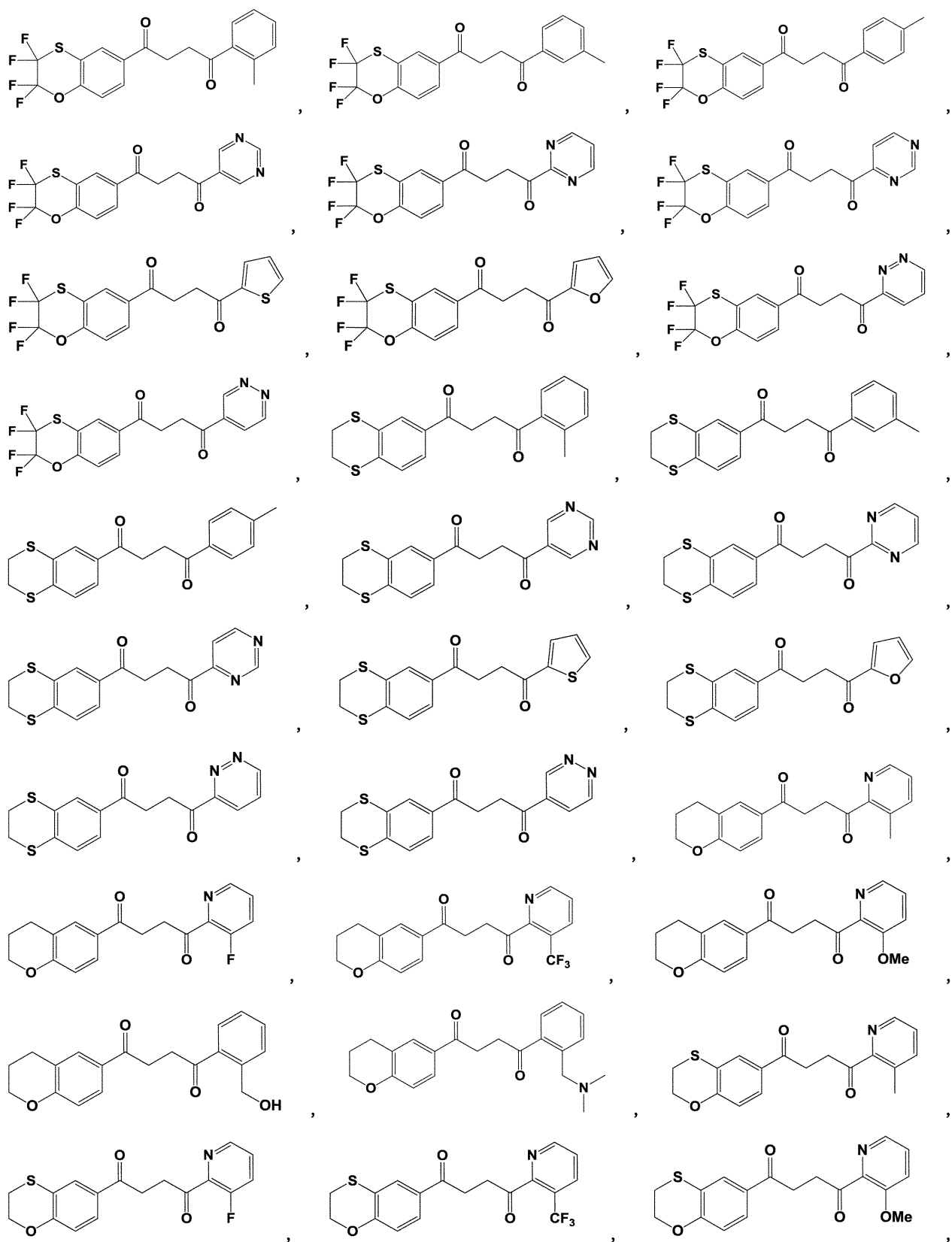
式Ibの化合物が下記式：

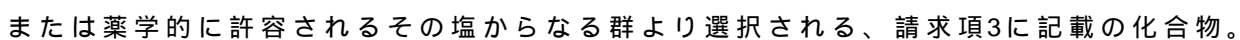












式 1c の化合物：



式中、

であり；

B環がフェニルおよび5~6員ヘテロアリールからなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各R¹が出現するごとに独立してH、非置換-C₁～₆アルキル、-C₁～₃ハロアルキル、ハロゲン化合物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^2 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{3b})_2$ 、 $-C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^3$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^3 が独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、 $-C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{3b} が独立してHおよび非置換- $C_1 \sim 3$ アルキルからなる群より選択され；

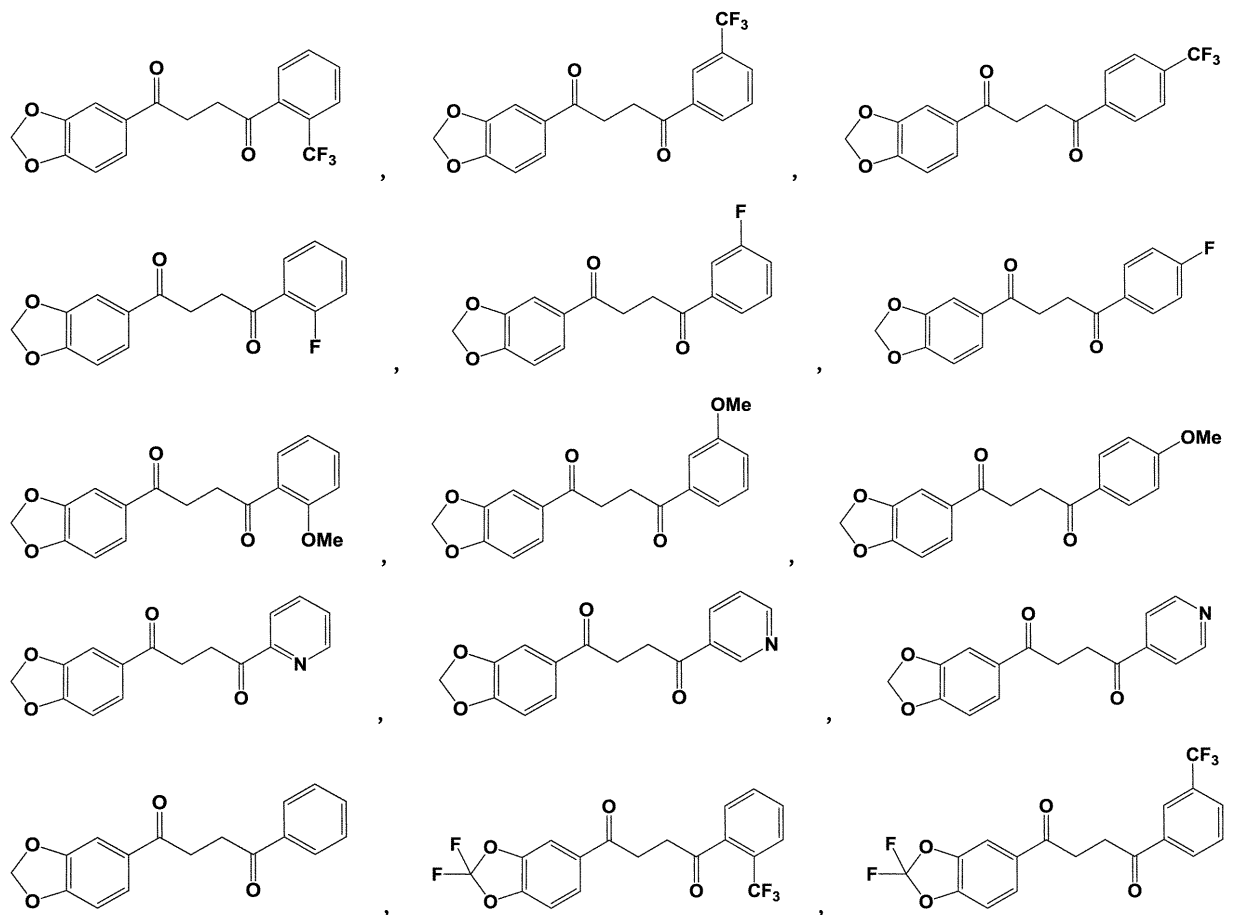
各Mが独立してN、C、S、およびOからなる群より選択され、ここで一方のMがCである場合、他方のMはN、S、およびOからなる群より選択され；

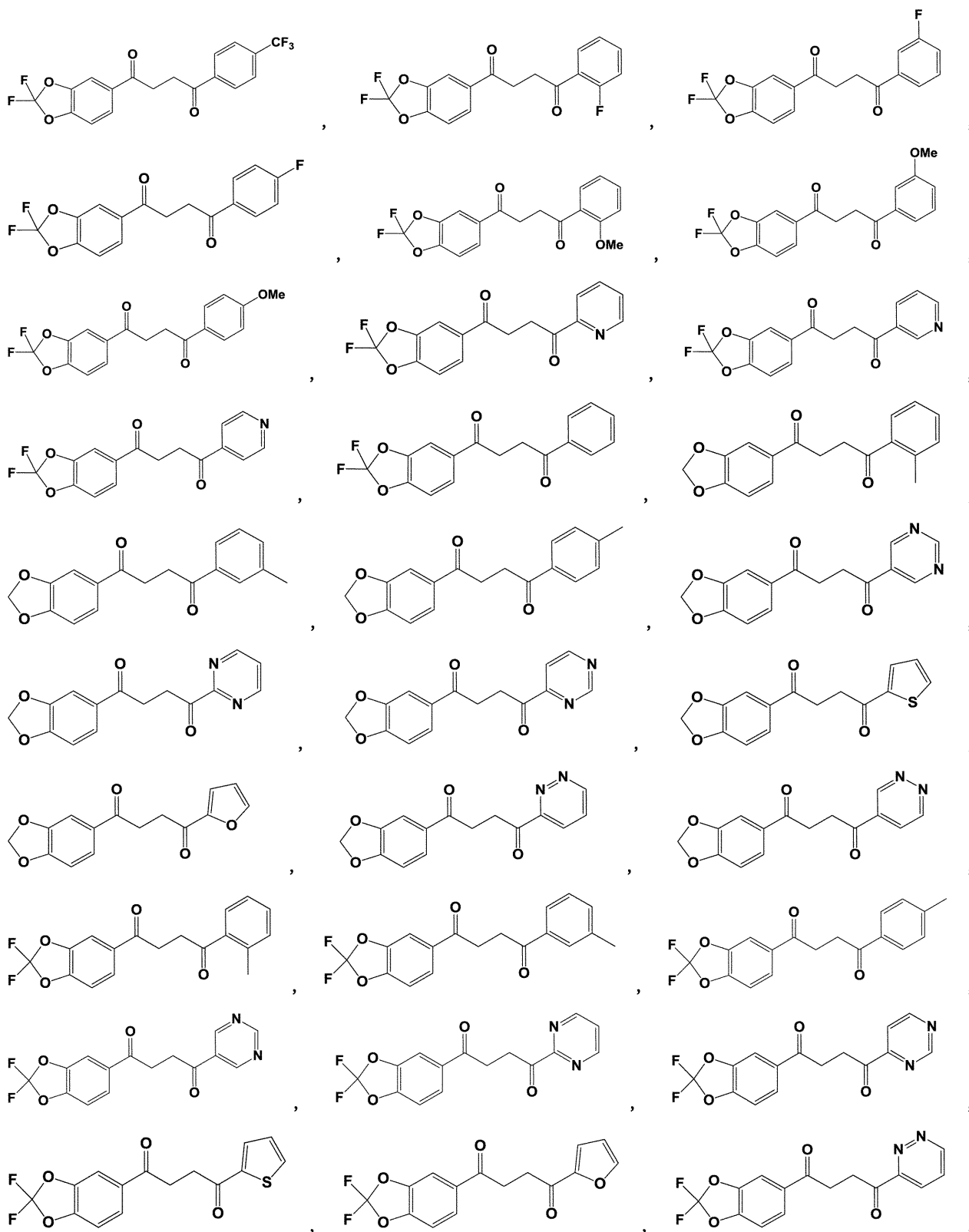
mが1～5の整数であり；

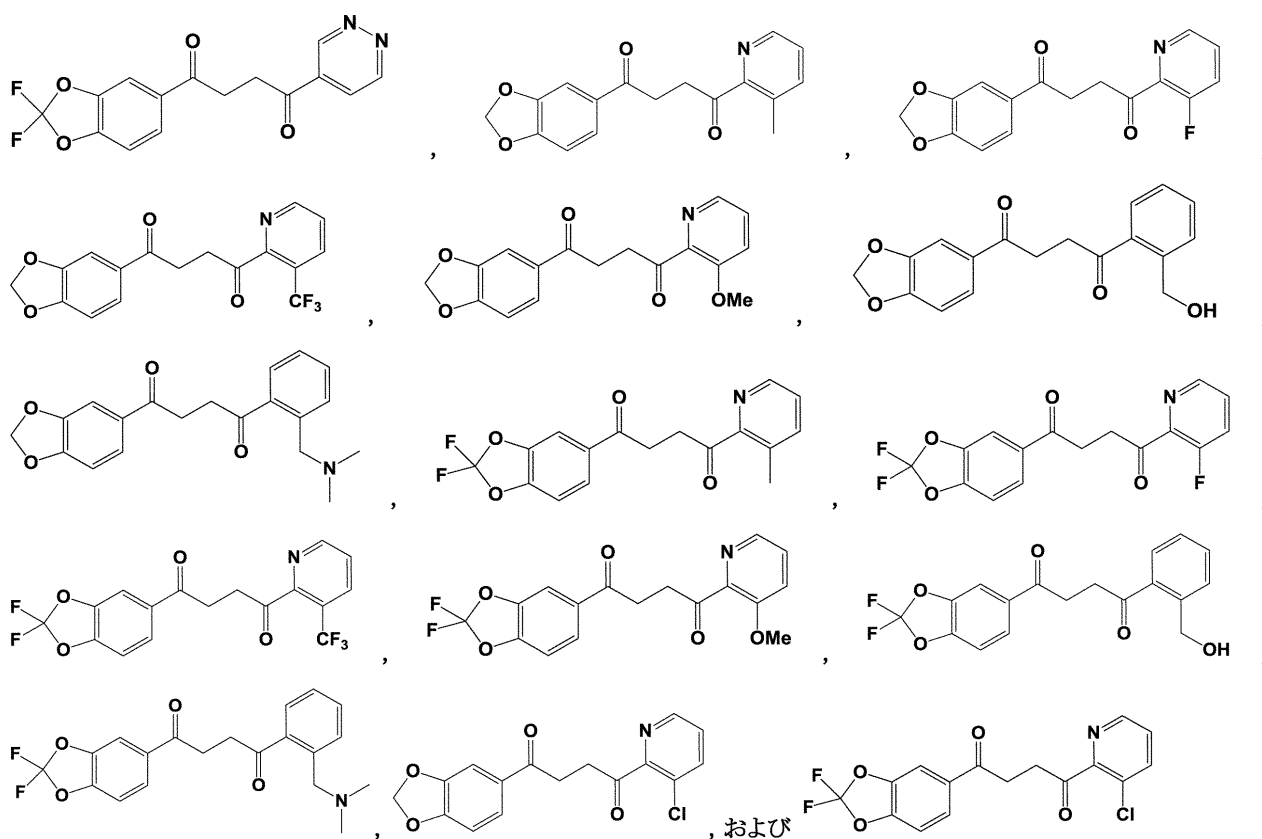
nが1～10の整数である。

【請求項6】

式Icの化合物が下記式：



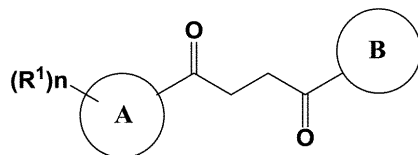




または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

式Idの化合物：

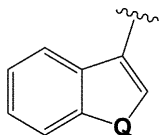


Id

、または薬学的に許容されるその塩：

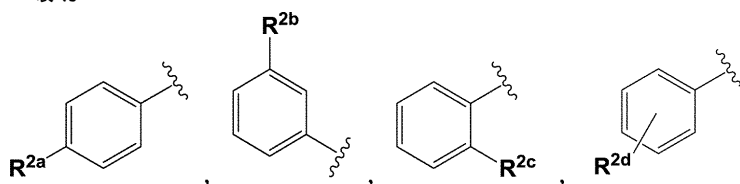
式中、

A環が



であり；

B環が



、および5～6員ヘテロアールR^{2e}からなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各R¹が出現するごとに独立してH、非置換-C₁～₆アルキル、-C₁～₃ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{2a}がH、非置換-C₁～₆アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、-C₁～₃ハロアルキル、Cl、Br、I

、 $-\text{OR}^{3a}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{2b} がH、非置換 $-\text{C}_2 \sim 6$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{3b})_2$ 、 $-\text{C}_1 \sim 3$ ハロアルキル、F、I、 $-\text{OR}^3$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{2c} がH、非置換 $-\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{3b})_2$ 、 $-\text{C}_1 \sim 3$ ハロアルキル、F、Br、I、 $-\text{OR}^3$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{2d} が2～5個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換 $-\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{3b})_2$ 、 $-\text{C}_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-\text{OR}^3$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{2e} が1～3個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換 $-\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{3b})_2$ 、 $-\text{C}_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-\text{OR}^3$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^3 が独立してH、非置換 $-\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $-\text{C}_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{3a} が独立してH、非置換 $-\text{C}_2 \sim 6$ アルキル、 $-\text{C}_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

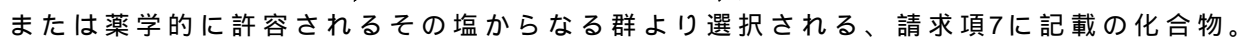
各 R^{3b} が独立してHおよび非置換 $-\text{C}_1 \sim 3$ アルキルからなる群より選択され；

QがSまたはNHであり；

nが1～5の整数である。

【請求項 8】

式Idの化合物が下記式：

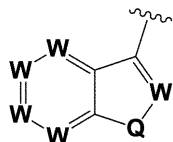


式 1e の化合物：



式中、

A環が



であり；

B環がフェニルおよび5～6員ヘテロアリールからなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^1 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^2 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^3 が独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各 R^{3b} が独立してHおよび非置換- $C_1 \sim 3$ アルキルからなる群より選択され；

各WがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのWはNであり；

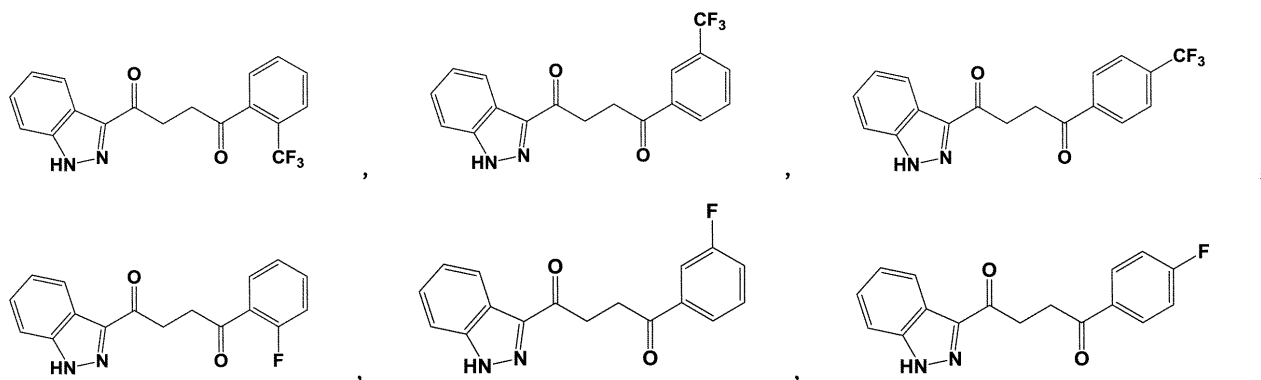
QがSまたはNHであり；

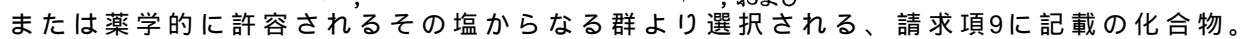
mが1～5の整数であり；

nが1～4の整数である。

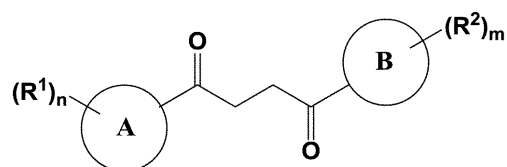
【請求項10】

式Ieの化合物が下記式：



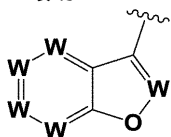


式 1 f の化合物：



If

A環が



であり；

B環がフェニルおよび5～6員ヘテロアリールからなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^1 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^2 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^3 が独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各 R^{3b} が独立してHおよび非置換- $C_1 \sim 3$ アルキルからなる群より選択され；

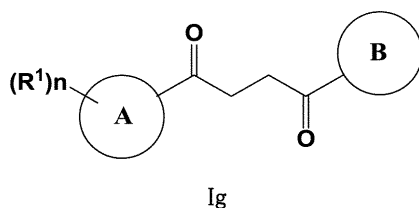
各WがNまたはCであり；

mが1～5の整数であり；

nが1～5の整数である。

【請求項 1 2】

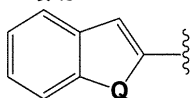
式Igの化合物：



、または薬学的に許容されるその塩：

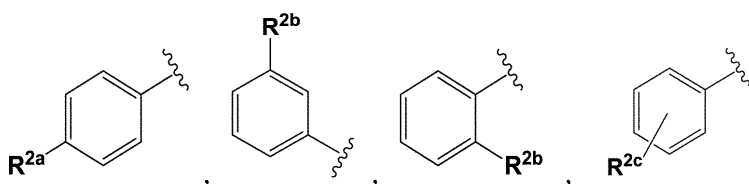
式中、

A環が



であり；

B環が



、および5～6員ヘテロアリール R^{2d} からなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^1 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{2a} が非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、F、I、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{2b} が非置換- $C_2 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{2c} が2～5個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{2d} が1～3個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^3 が独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

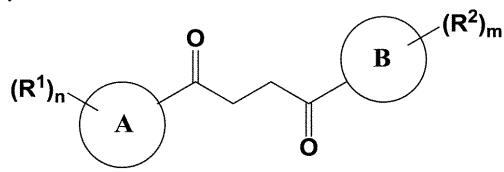
各 R^{3b} が独立してHおよび非置換- $C_1 \sim 3$ アルキルからなる群より選択され；

QがO、S、およびNHからなる群より選択され；

nが1～5の整数である。

【請求項 1 3】

式Ihの化合物：

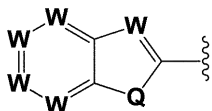


Ih

、または薬学的に許容されるその塩：

式中、

A環が



であり；

B環がフェニルおよび5～6員ヘテロアリールからなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^1 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^2 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^3 が独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各 R^{3b} が独立してHおよび非置換- $C_1 \sim 3$ アルキルからなる群より選択され；

各WがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのWはNであり；

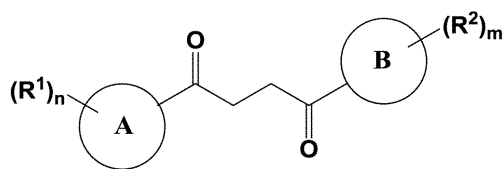
QがO、S、およびNHからなる群より選択され；

mが1～5の整数であり；

nが1～4の整数である。

【請求項 1 4】

式Iiの化合物：

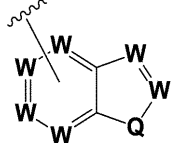


Ii

、または薬学的に許容されるその塩：

式中、

A環が



であり、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

B環がフェニルおよび5～6員ヘテロアリールからなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^1 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲ

ン化物、 $-OR^3$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^2 が出現するごとに独立してH、非置換 $-C_1 \sim 6$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{3b})_2$ 、 $-C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^3$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^3 が独立してH、非置換 $-C_1 \sim 6$ アルキル、 $-C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{3b} が独立してHおよび非置換 $-C_1 \sim 3$ アルキルからなる群より選択され；

各WがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのWはCであり；

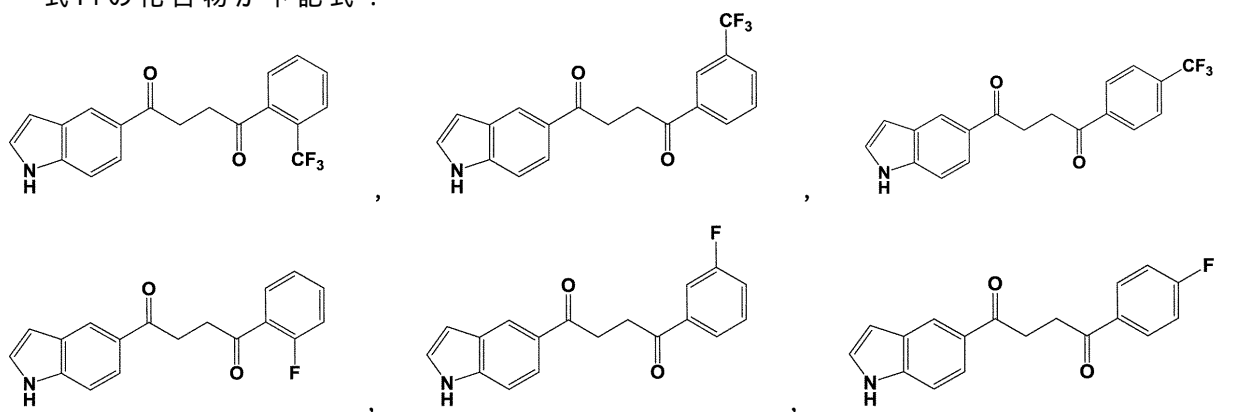
QがO、S、およびNからなる群より選択され；

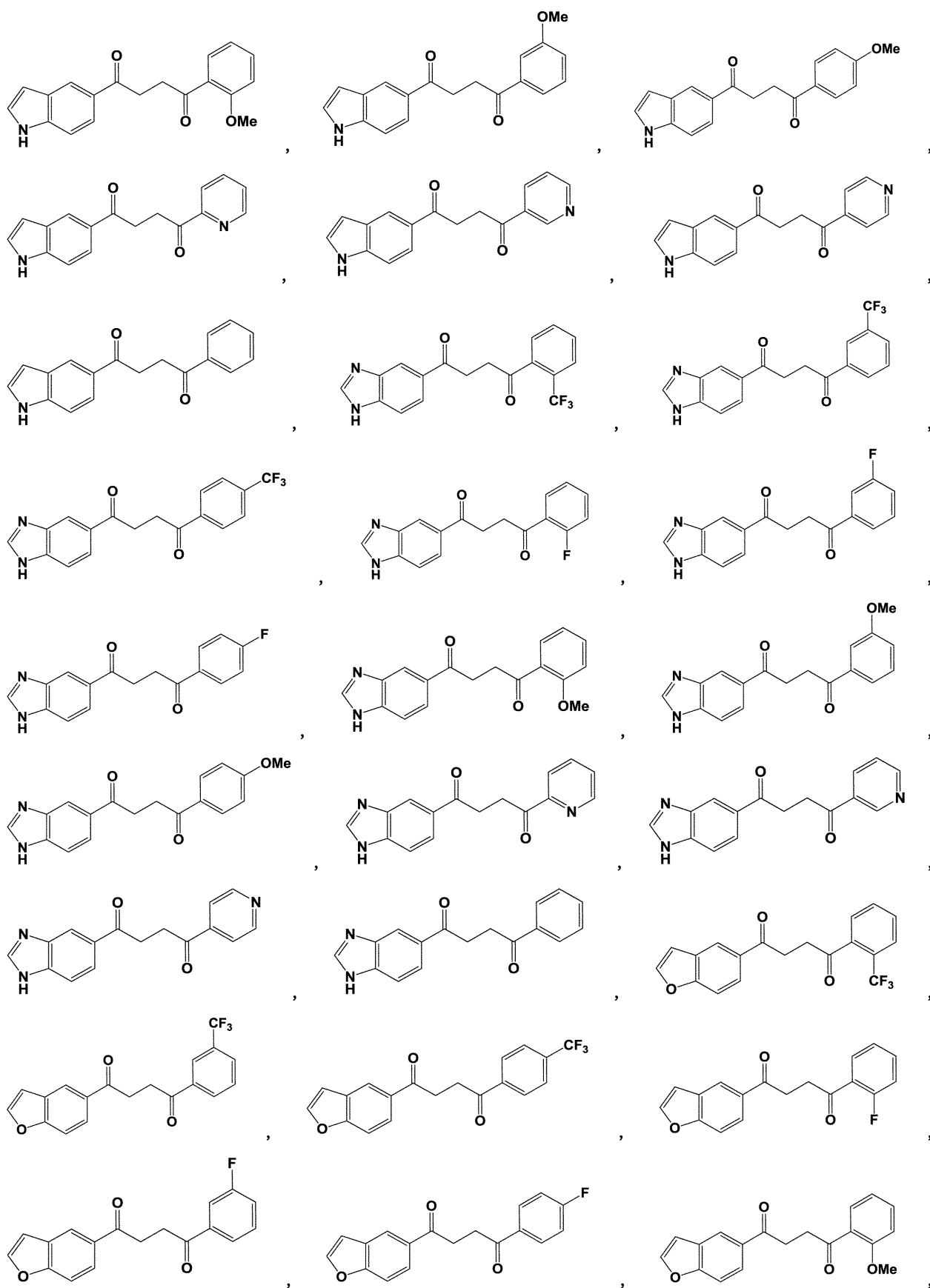
mが1～5の整数であり；

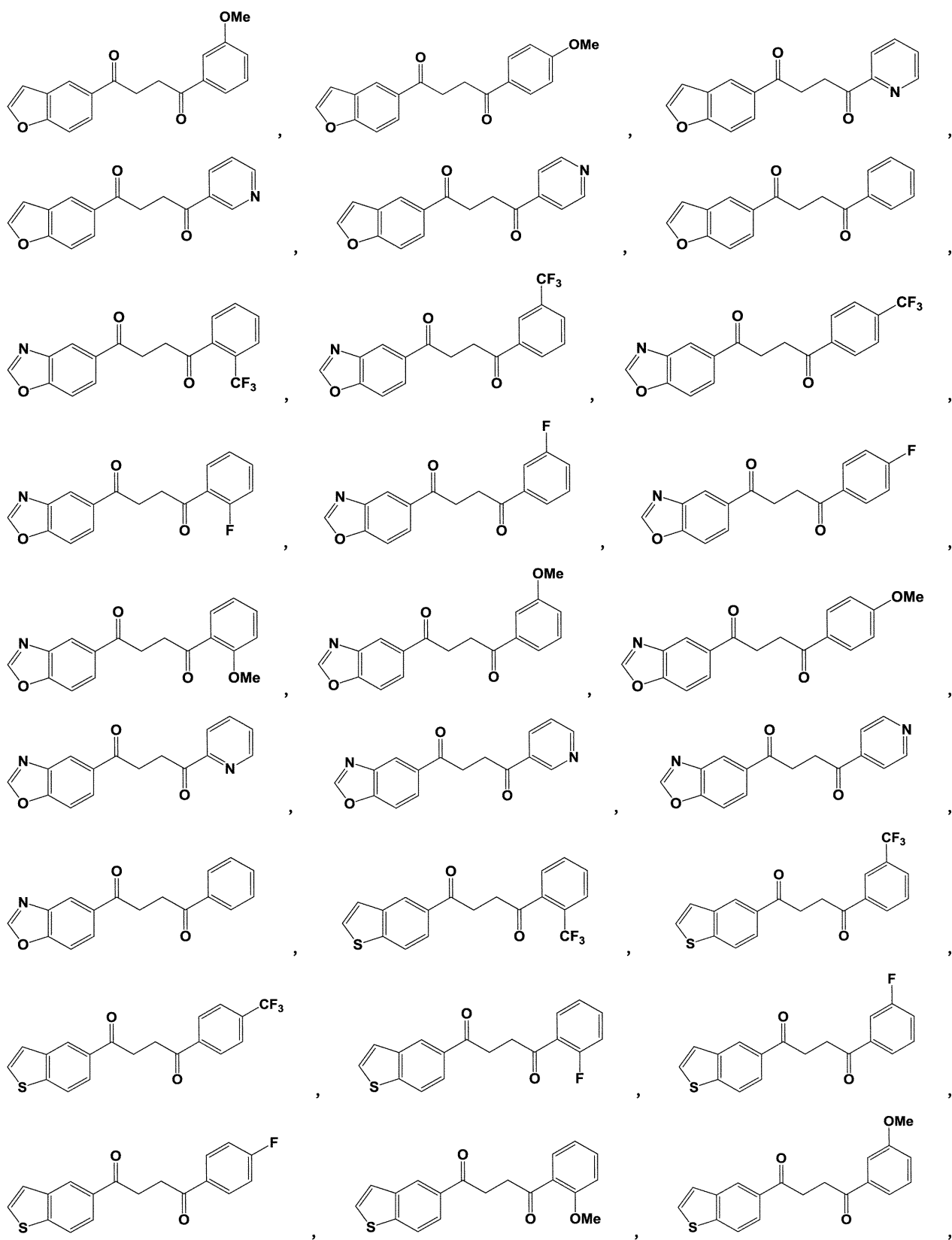
nが1～7の整数である。

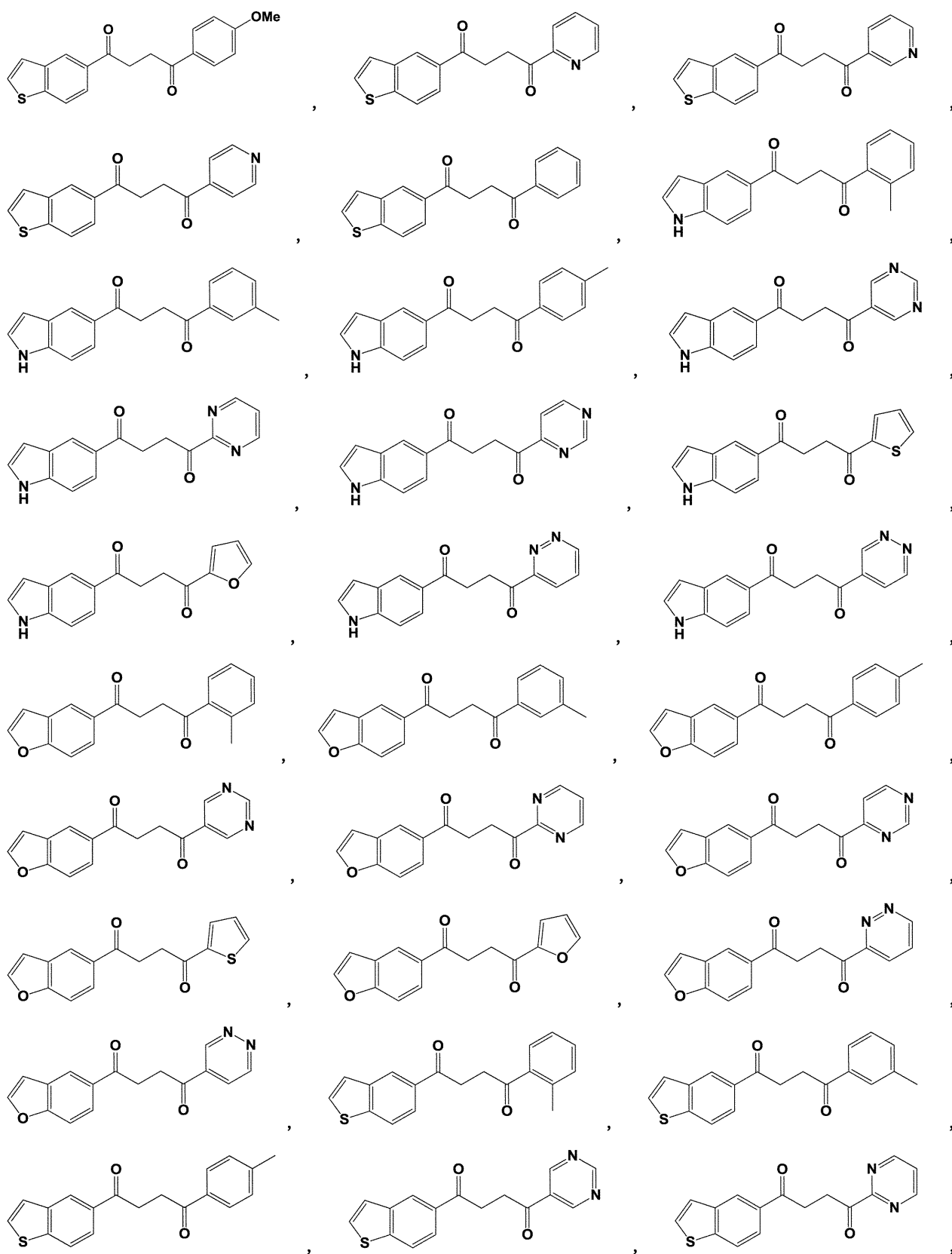
【請求項15】

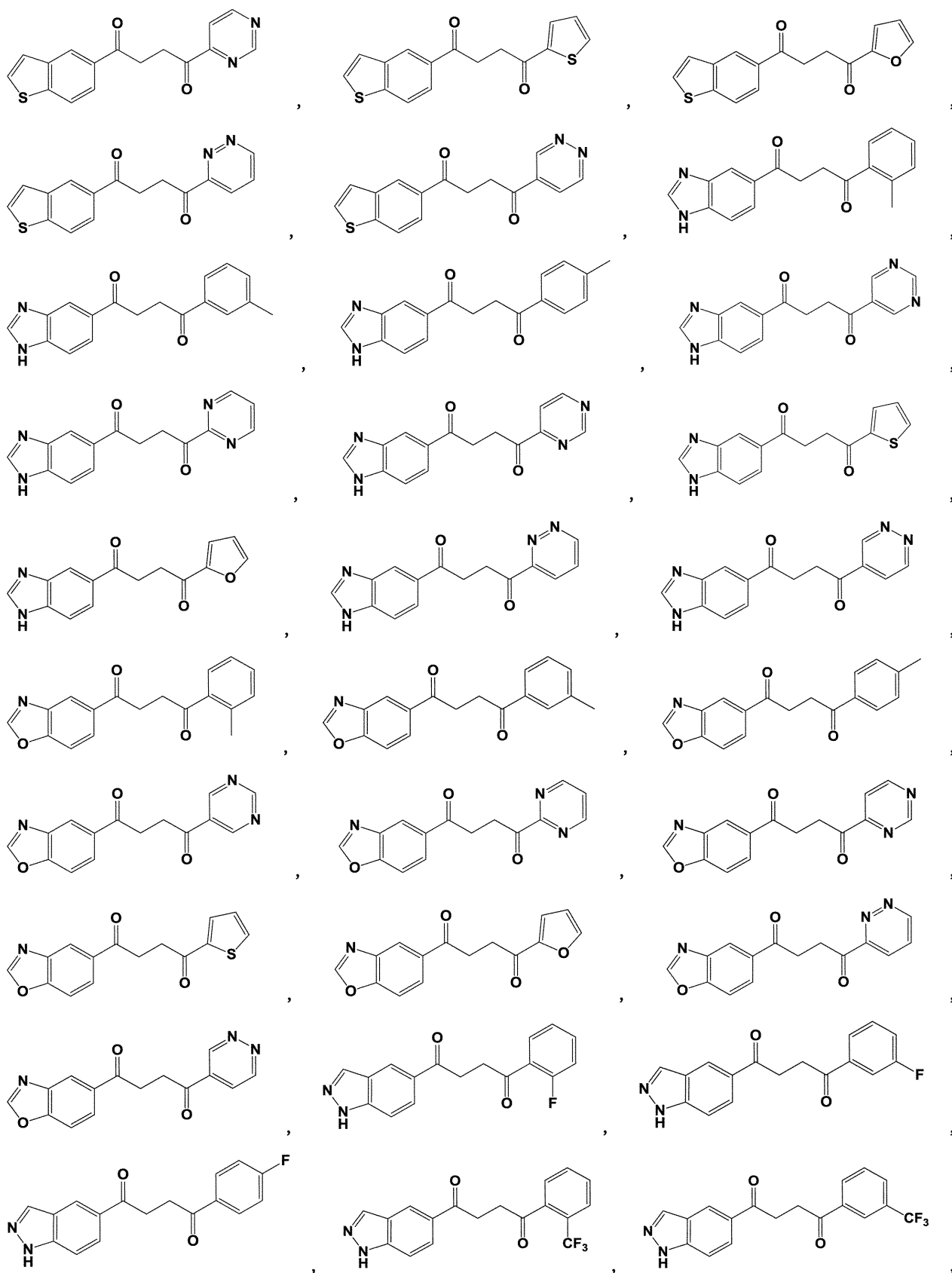
式Iiの化合物が下記式：

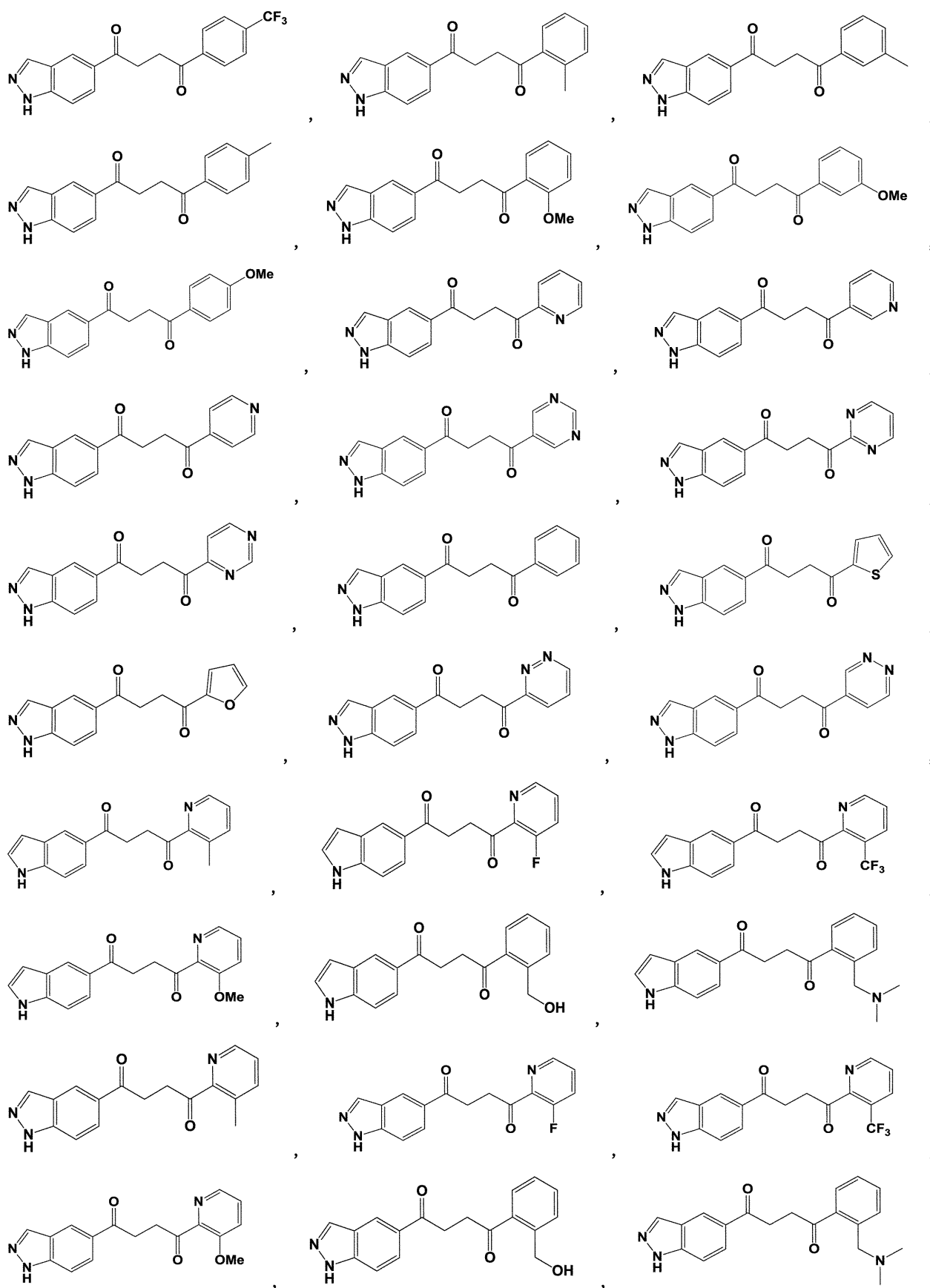


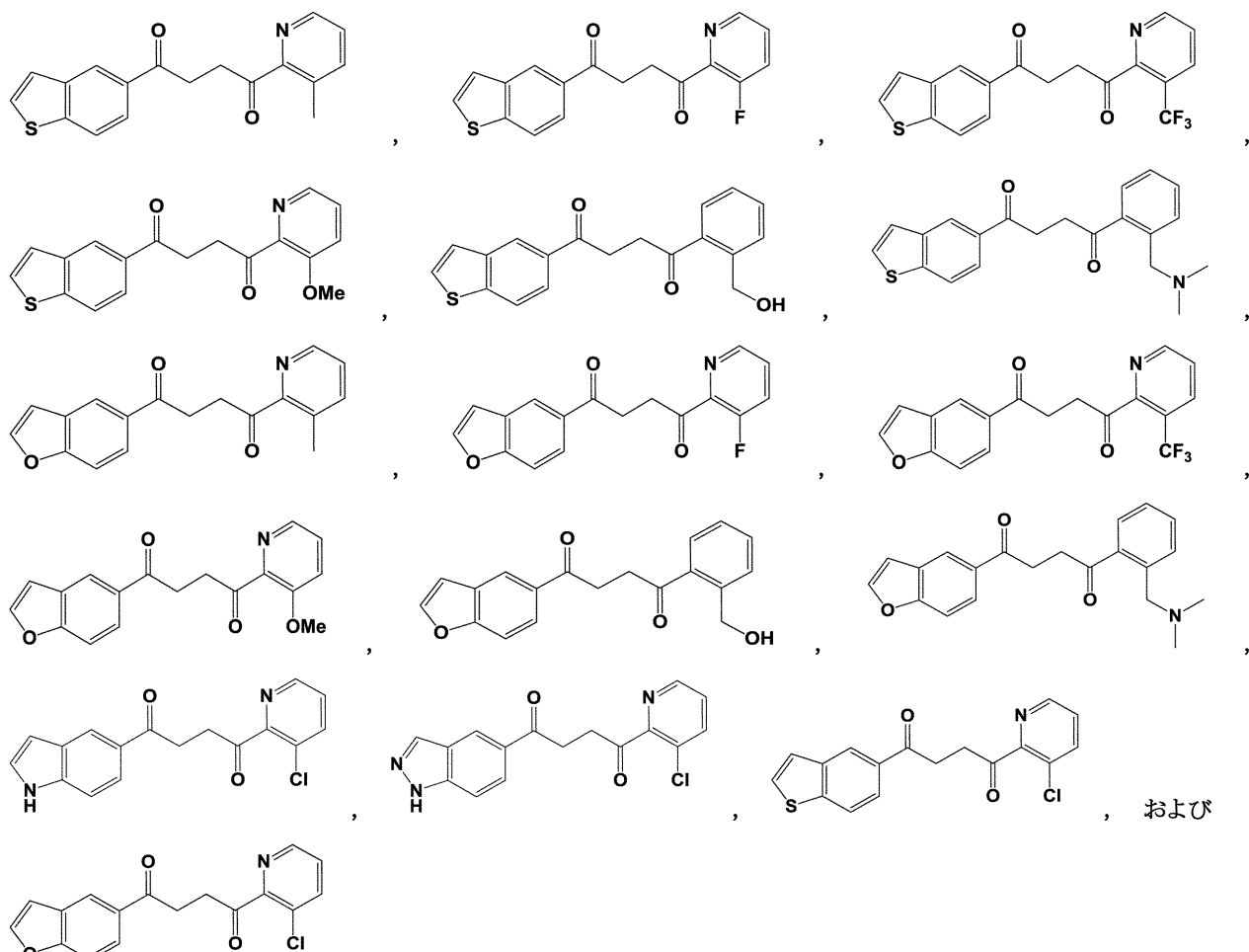










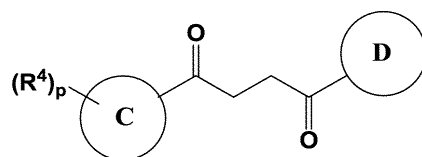


, および

または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、請求項14に記載の化合物。

【請求項16】

式IIaの化合物：

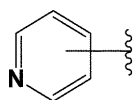


IIa

、または薬学的に許容されるその塩：

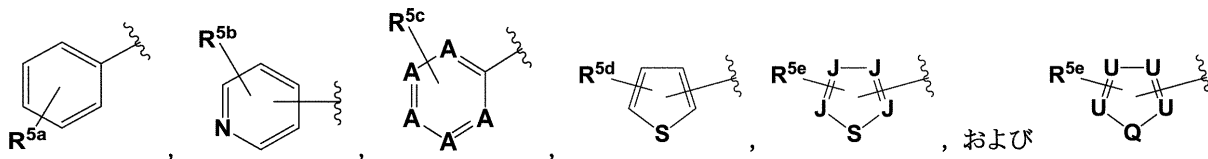
式中、

C環が



であり；

D環が下記式：



, および

からなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^4 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{5a} が1～5個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-

CH_2OH 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{6b})_2$ 、 $-\text{C}_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-\text{OR}^{6a}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5b} が1～4個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換 $-\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{6b})_2$ 、 $-\text{C}_1 \sim 3$ ハロアルキル、F、I、 $-\text{OR}^{6a}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5c} が1～3個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換 $-\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{6b})_2$ 、 $-\text{C}_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-\text{OR}^6$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5d} が1～2個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換 $-\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{6b})_2$ 、 $-\text{C}_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-\text{OR}^6$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5e} が1～3個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換 $-\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{6b})_2$ 、 $-\text{C}_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-\text{OR}^6$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^6 が独立してH、非置換 $-\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $-\text{C}_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{6a} が独立してH、非置換 $-\text{C}_2 \sim 6$ アルキル、 $-\text{C}_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{6b} が独立してHおよび非置換 $-\text{C}_1 \sim 3$ アルキルからなる群より選択され；

各AがNまたはCであり、ここで少なくとも2つのAはNであり；

各JがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのJはNであり、少なくとも1つのJはCであり；

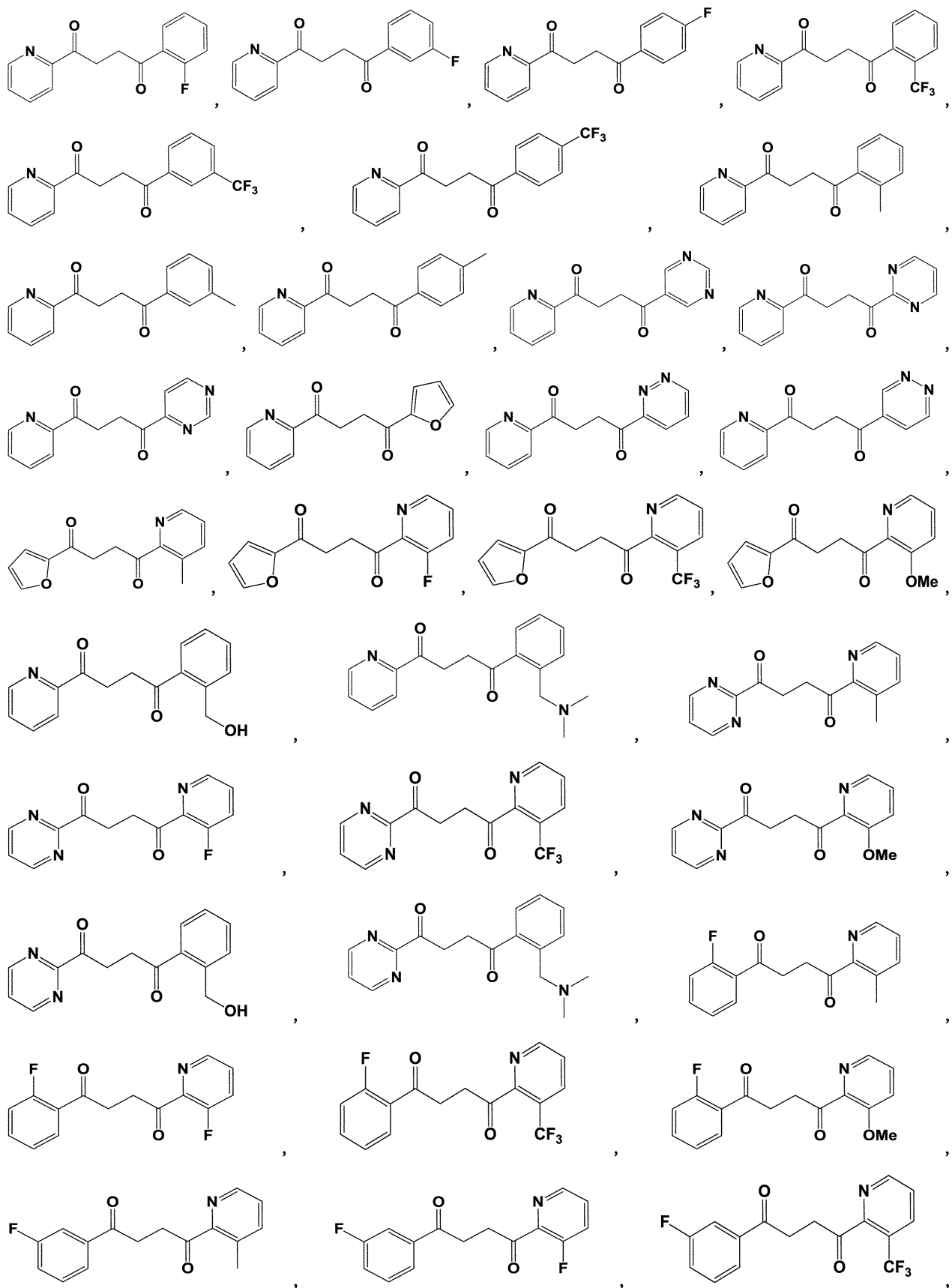
各UがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのUはCであり；

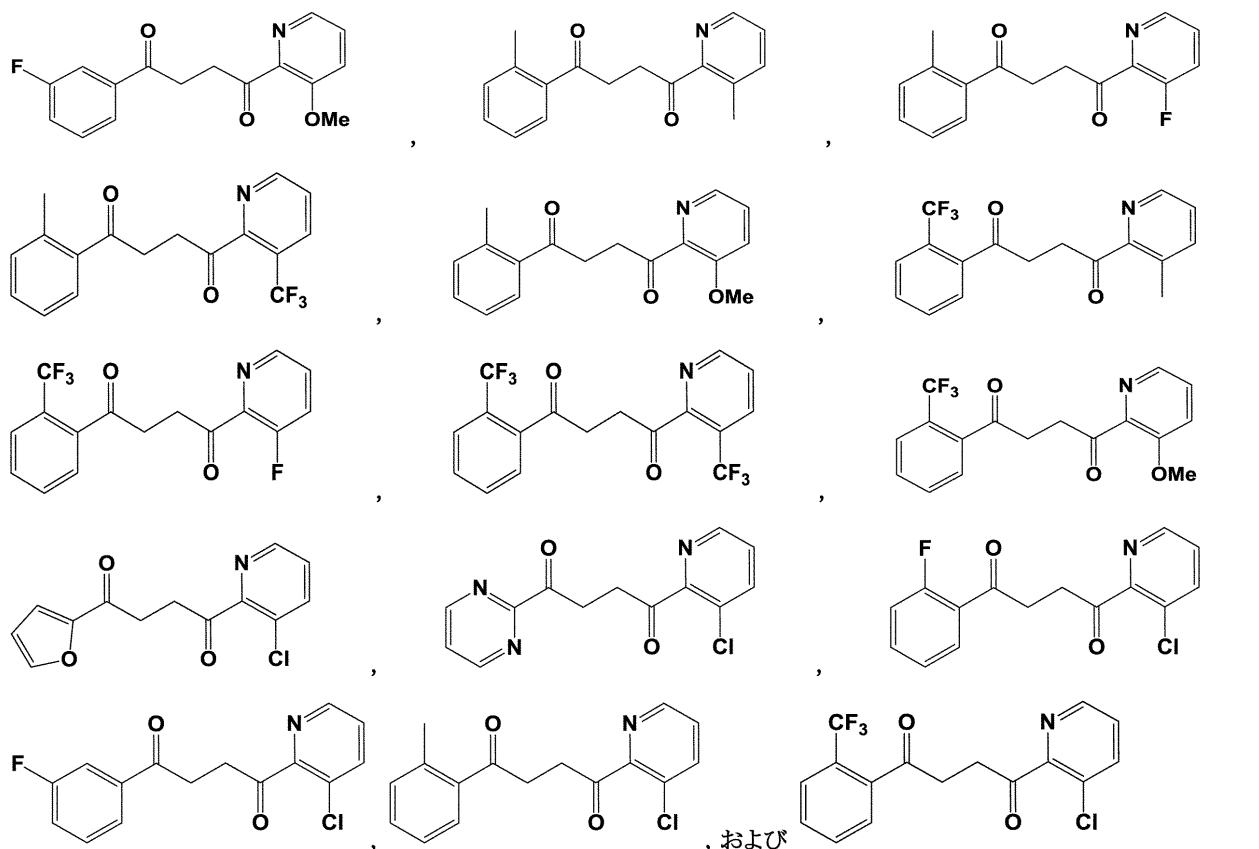
QがOまたはNであり；

pが1～4の整数である。

【請求項 17】

式IIaの化合物が下記式：

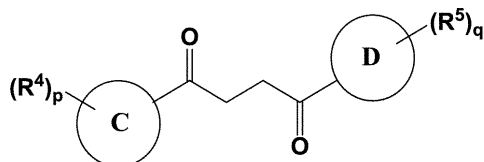




または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、請求項16に記載の化合物。

【請求項18】

式IIbの化合物：

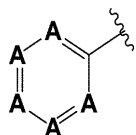


IIb

、または薬学的に許容されるその塩：

式中、

C環が



であり；

D環がフェニルおよび5～6員ヘテロアリールからなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^4 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR^{6a}、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^5 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^6 が独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各 R^{6a} が独立して非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各 R^{6b} が独立してHおよび非置換- $C_1 \sim 3$ アルキルからなる群より選択され；

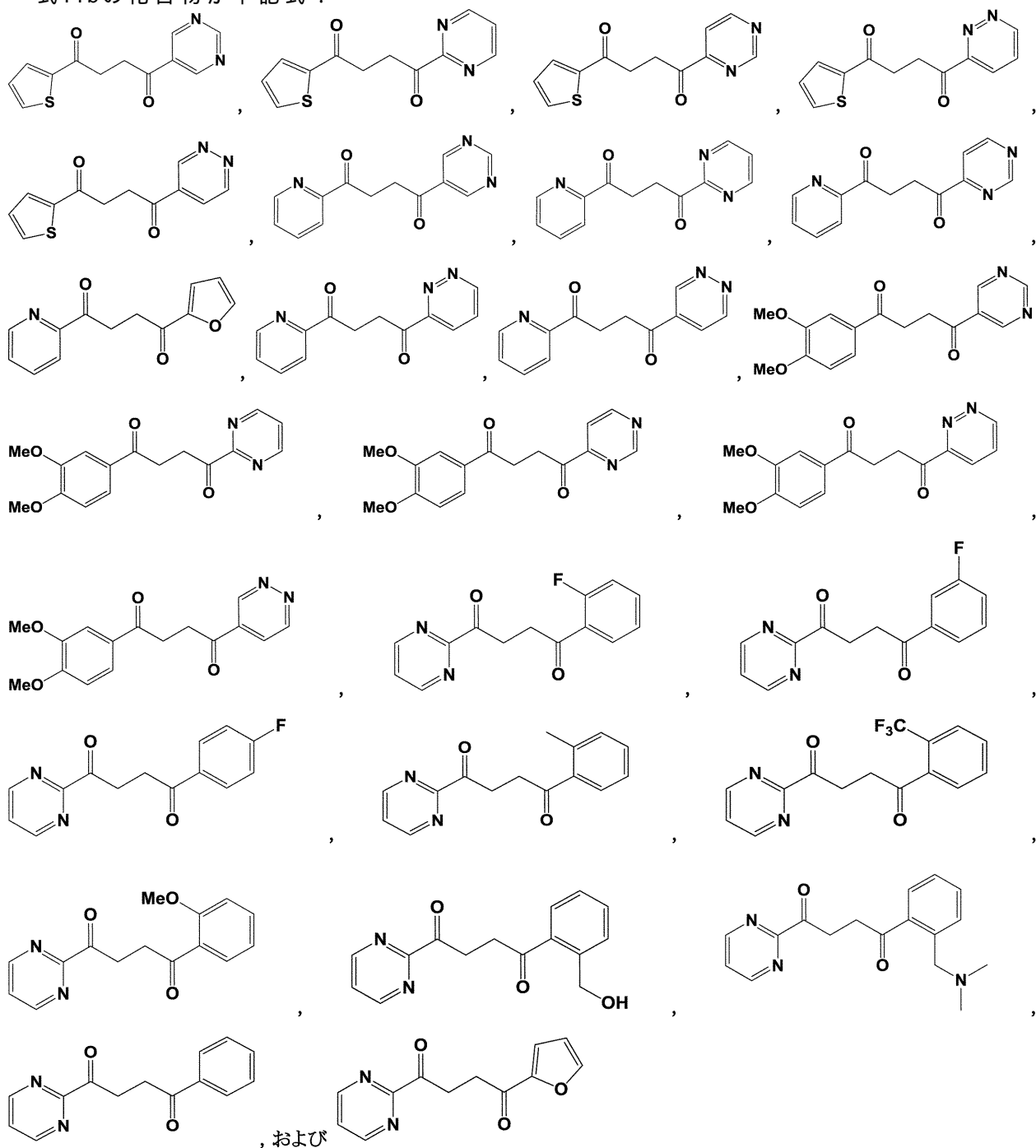
各AがNまたはCであり、ここで少なくとも2つのAはNであり；

pが1～3の整数であり；

qが1～5の整数である。

【請求項 19】

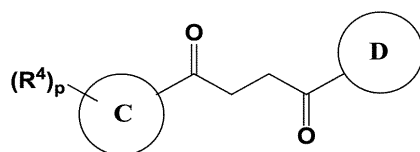
式IIbの化合物が下記式：



または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、請求項18に記載の化合物。

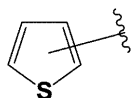
【請求項 20】

式IIcの化合物：



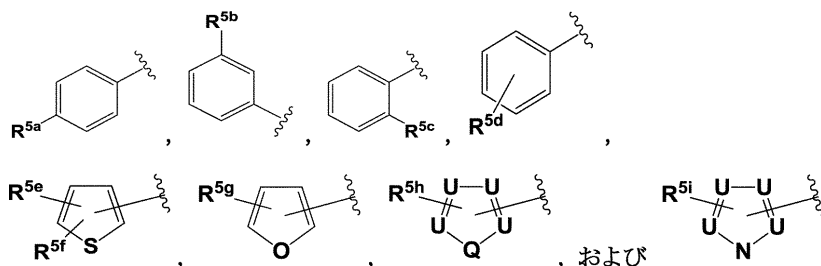
、または薬学的に許容されるその塩：

式中、
C環が



であり；

D環が下記式：



からなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^4 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{5a} が非置換- $C_2 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- $C_2 \sim 3$ ハロアルキル、ヨウ化物、-OR^{6a}、およびCNからなる群より選択され；

R^{5b} が非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- $C_2 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR^{6a}、およびCNからなる群より選択され；

R^{5c} が非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、F、Br、I、-OR^{6a}、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{5d} が2～5個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR^{6a}、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{5e} が1個の置換基であり、非置換- $C_2 \sim 5$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、F、I、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{5f} が1～2個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、F、Br、I、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{5g} が1～3個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{5h} が1～2個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{5i} が1～4個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^6 が独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各 R^{6a} が独立して非置換- $C_2 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各 R^{6b} が独立してHおよび非置換- $C_1 \sim 3$ アルキルからなる群より選択され；

各JがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのJはCであり；

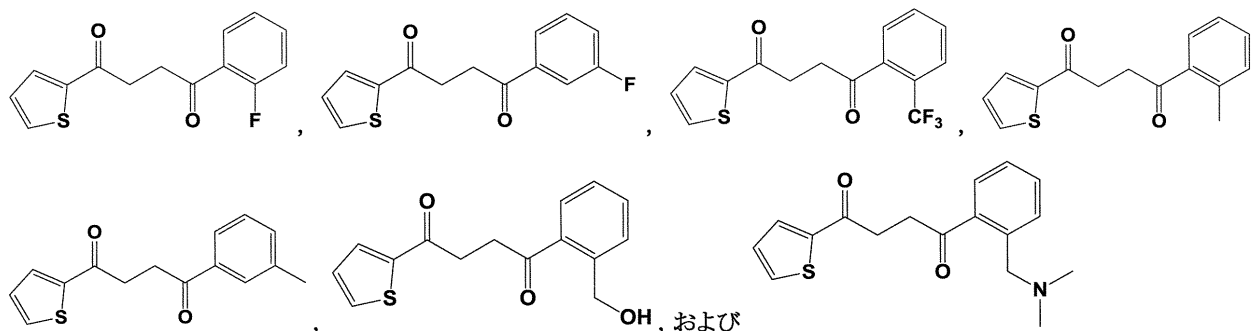
QがSまたはOであり；

各UがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのUはNであり、少なくとも1つのUはCであり；

pが1～3の整数である。

【請求項 2 1】

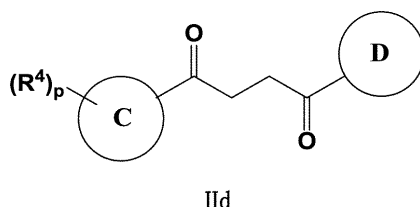
式IIcの化合物が下記式：



または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、請求項20に記載の化合物。

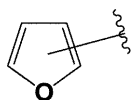
【請求項22】

式IIIdの化合物：



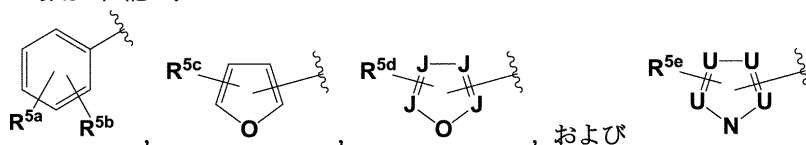
、または薬学的に許容されるその塩：

式中、
C環が



であり；

D環が下記式：



からなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^4 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{5a} が1個の置換基であり、非置換- $C_2 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR^{6a}、およびCNからなる群より選択され；

R^{5b} が1～4個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR^{6a}、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{5c} が1～3個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換- $C_2 \sim 5$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{5d} が1～2個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{5e} が1～4個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^6 が独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各 R^{6a} が独立して非置換- $C_2 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{6b} が独立してHおよび非置換- $C_1 \sim 3$ アルキルからなる群より選択され；

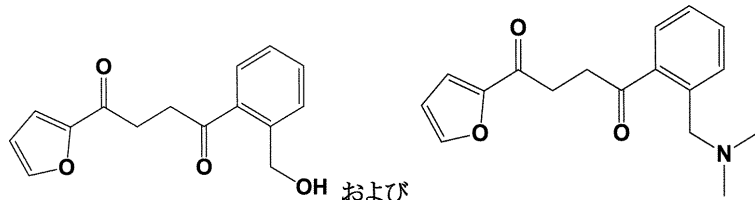
各JがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのJはNであり、少なくとも1つのJはCであり；
QがSまたはOであり；

各UがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのUはCであり；

pが1～3の整数である。

【請求項 2 3】

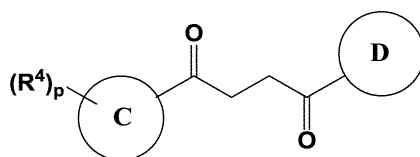
式IIdの化合物が下記式：



または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、請求項22に記載の化合物。

【請求項 2 4】

式Ileの化合物：

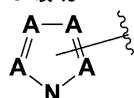


Ile

、または薬学的に許容されるその塩：

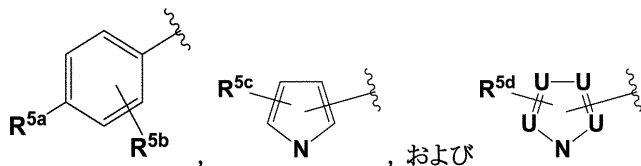
式中、

C環が



であり、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

D環が下記式：



からなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^4 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、- OR^6 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5a} がH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- CH_2OH 、- $CH_2N(R^{6b})_2$ 、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、F、Br、I、- OR^6 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5b} が1～4個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- CH_2OH 、- $CH_2N(R^{6b})_2$ 、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、- OR^6 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5c} が1～4個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換- $C_2 \sim 5$ アルキル、- CH_2OH 、- $CH_2N(R^{6b})_2$ 、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、- OR^6 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5d} が1～2個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- $C_2 \sim 6$ アルキル、- CH_2OH 、- $CH_2N(R^{6b})_2$ 、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、- OR^{6a} 、 CF_3 、およびCNか

らなる群より選択され；

各 R^6 が独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{6a} が独立して非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

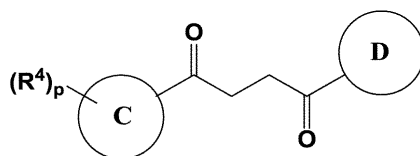
各 R^{6b} が独立してHおよび非置換- $C_1 \sim 3$ アルキルからなる群より選択され；

各AがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのAはCであり；

各UがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのUはNであり、少なくとも1つのUはCであり；
pが1～4の整数である。

【請求項 25】

式II fの化合物：

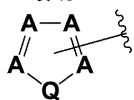


II f

、または薬学的に許容されるその塩：

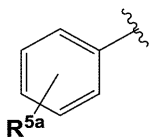
式中、

C環が



であり、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

D環が



および5員ヘテロアリール R^{5b} からなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^4 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、- OR^6 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5a} が1～5個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- CH_2OH 、- $CH_2N(R^{6b})_2$ 、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、- OR^{6a} 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5b} が1～4個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- CH_2OH 、- $CH_2N(R^{6b})_2$ 、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、- OR^6 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^6 が独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{6a} が独立して非置換- $C_2 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{6b} が独立してHおよび非置換- $C_1 \sim 3$ アルキルからなる群より選択され；

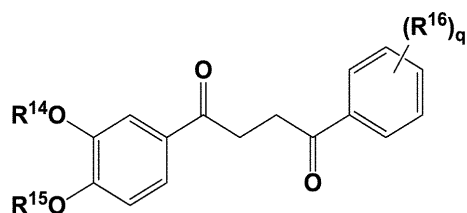
各AがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのAはNであり、少なくとも1つのAはCであり；

QがSまたはOであり；

pが1～4の整数である。

【請求項 26】

式IIIdの化合物：



IIIId

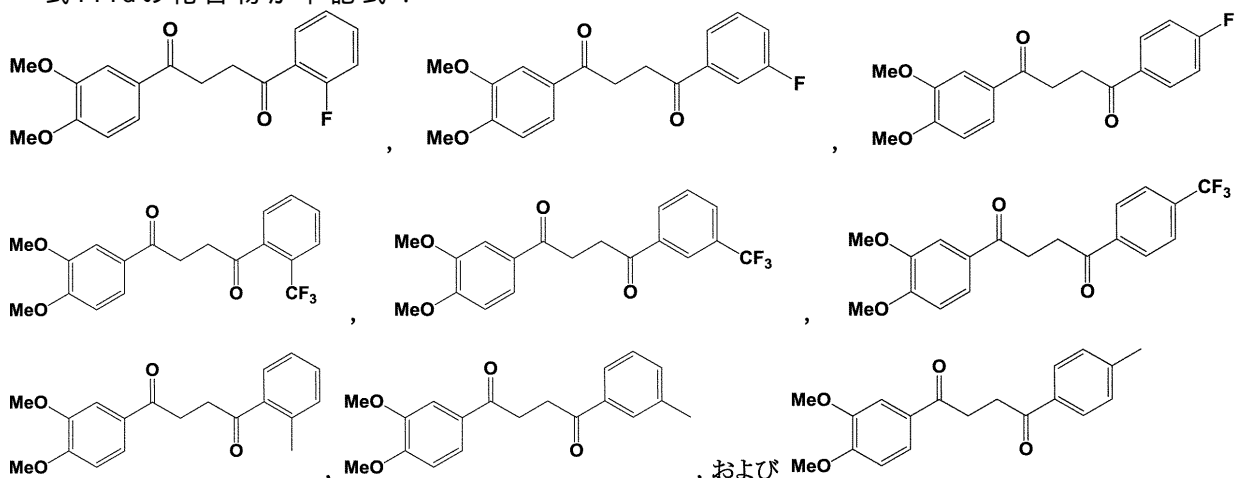
、または薬学的に許容されるその塩：

式中、

R^{14} が非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；
 R^{15} が非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；
 各 R^{16} が出現するごとに独立して非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- CH_2OH 、- $CH_2N(R^{17b})_2$ 、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、- OR^{17a} 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；
 各 R^{17a} が独立して非置換- $C_3 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；
 各 R^{17b} が独立してHおよび非置換- $C_1 \sim 3$ アルキルからなる群より選択され；
 q が1～5の整数である。

【請求項 27】

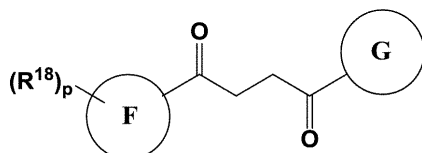
式IIIIdの化合物が下記式：



または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、請求項26に記載の化合物。

【請求項 28】

式IVの化合物：

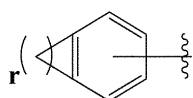


IV

、または薬学的に許容されるその塩：

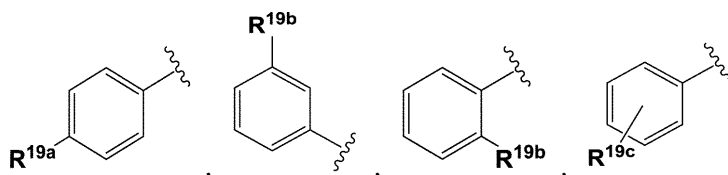
式中、

F環が



であり；

G環が



、および5～6員ヘテロアリール R^{19d} からなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^{18} が出現するごとに独立してH、 $-C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^{20}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{19a} がH、非置換 $-C_2 \sim 6$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{21})_2$ 、 $-C_1 \sim 3$ ハロアルキル、F、Br、I、 $-OR^{20}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^{19b} が出現するごとに独立してH、非置換 $-C_2 \sim 6$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{21})_2$ 、 $-C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^{20}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{19c} が2～5個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{21})_2$ 、 $-C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^{20}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{19d} が1～4個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{21})_2$ 、 $-C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^{20}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^{20} が独立してH、非置換 $-C_3 \sim 6$ アルキル、 $-C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

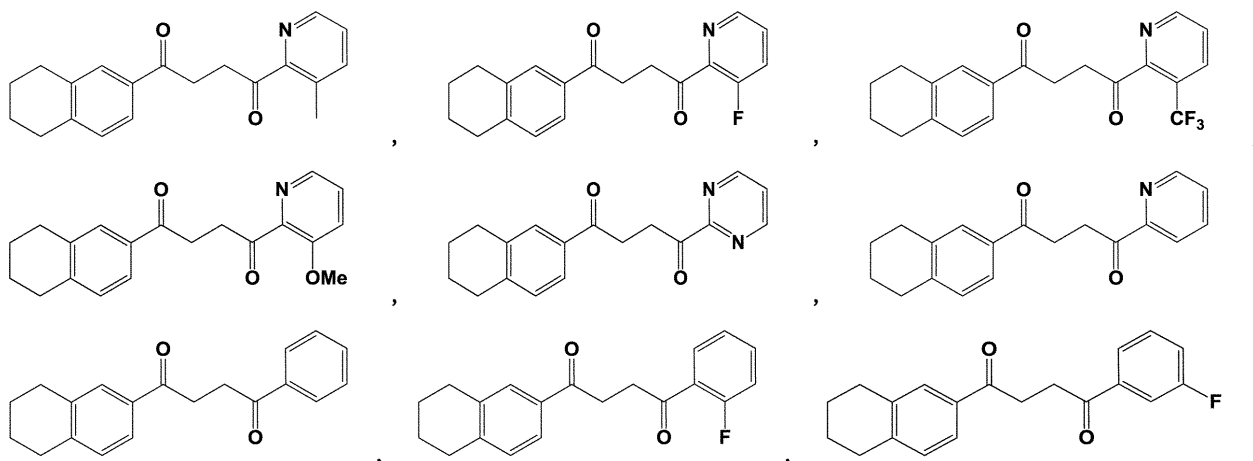
各 R^{21} が独立してHおよび非置換 $-C_1 \sim 3$ アルキルからなる群より選択され；

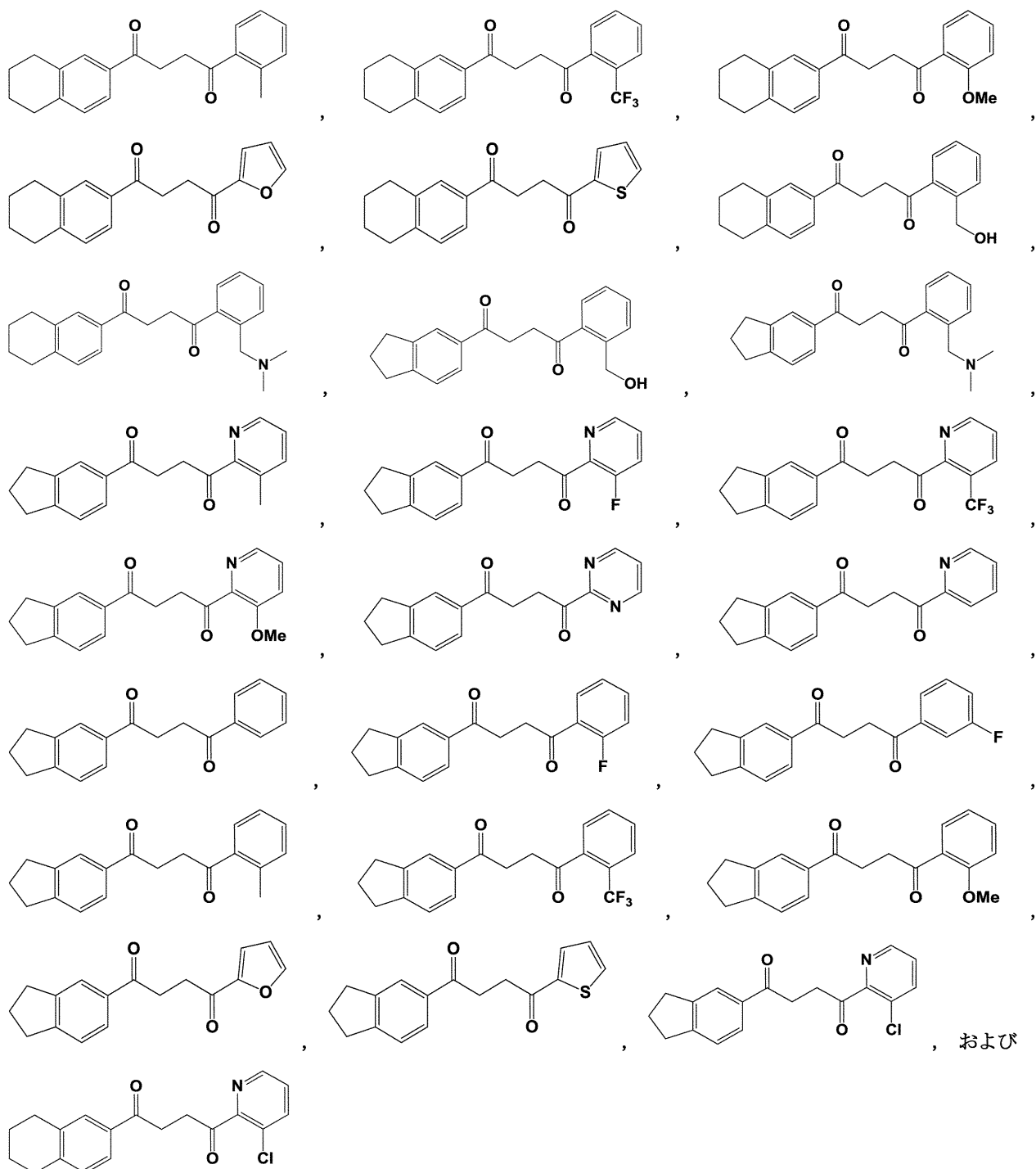
pが1～13の整数であり；

rが1～5の整数である。

【請求項29】

式IVの化合物が下記式：





または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、請求項28に記載の化合物。

【請求項30】

治療有効量の請求項1～29のいずれか一項に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩と、薬学的に許容される賦形剤とを含む、薬学的組成物。

【請求項31】

患者における、神経変性疾患、眼疾患、骨粗鬆症、骨関節症、骨形成不全症、骨欠損、骨折、歯周病、耳硬化症、創傷治癒、口腔粘膜炎症、胃腸粘膜炎症、頭蓋顔面欠損、および腫瘍退縮性骨疾患からなる群より選択される障害または疾患を処置するための、請求項1～29のいずれか一項に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩を含む、薬学的組成物。

【請求項32】

障害または疾患が神経変性疾患であり、該神経変性疾患がパーキンソン病、脳卒中、脊髄損傷、虚血性脳疾患、てんかん、アルツハイマー病、認知症、うつ病、双極性障害、ま

たは統合失調症より選択される、請求項31に記載の薬学的組成物。

【請求項33】

障害または疾患が眼疾患であり、該眼疾患が滲出型加齢黄斑変性症、萎縮型加齢黄斑変性症、地図状萎縮、糖尿病性網膜症、糖尿病黄斑浮腫、網膜剥離、網膜変性症、網膜静脈閉塞症、未熟児網膜症、網膜色素変性症、網膜症、レーバー先天黒内障、および緑内障より選択される、請求項31に記載の薬学的組成物。

【請求項34】

障害または疾患が、骨粗鬆症、骨関節症、骨形成不全症、骨欠損、骨折、歯周病、耳硬化症、創傷治癒、口腔粘膜炎症、胃腸粘膜炎症、頭蓋顔面欠損、または腫瘍退縮性骨疾患からなる群より選択される、請求項31に記載の薬学的組成物。

【請求項35】

患者における幹細胞の分化および増殖に関連する障害または疾患を処置するための、請求項1～29のいずれか一項に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩を含む薬学的組成物であって、該障害または疾患が、脱毛、造血関連疾患、組織再生関連疾患、ならびに、発生異常、幹細胞分化異常、および細胞増殖異常に関連する他の疾患からなる群より選択される、薬学的組成物。

【請求項36】

患者がヒトである、請求項31または35に記載の薬学的組成物。

【請求項37】

化合物がWnt経路中の1つまたは複数のタンパク質を活性化する、請求項31または35に記載の薬学的組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0039

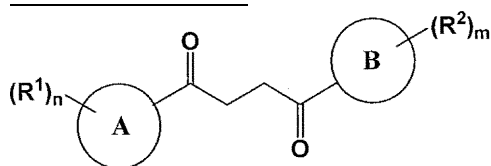
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0039】

[本発明1001]

式Iの化合物：



I

、または薬学的に許容されるその塩：

式中、

A環が7～12員ヘテロアリールであり、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

B環がフェニルおよび5～6員ヘテロアリールからなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

R¹が、A環に結合した置換基であり、出現するごとに独立してH、非置換-C₁～₆アルキル、-C₁～₃ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R²が、B環に結合した置換基であり、出現するごとに独立してH、非置換-C₁～₆アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R³ᵇ)₂、-C₁～₃ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

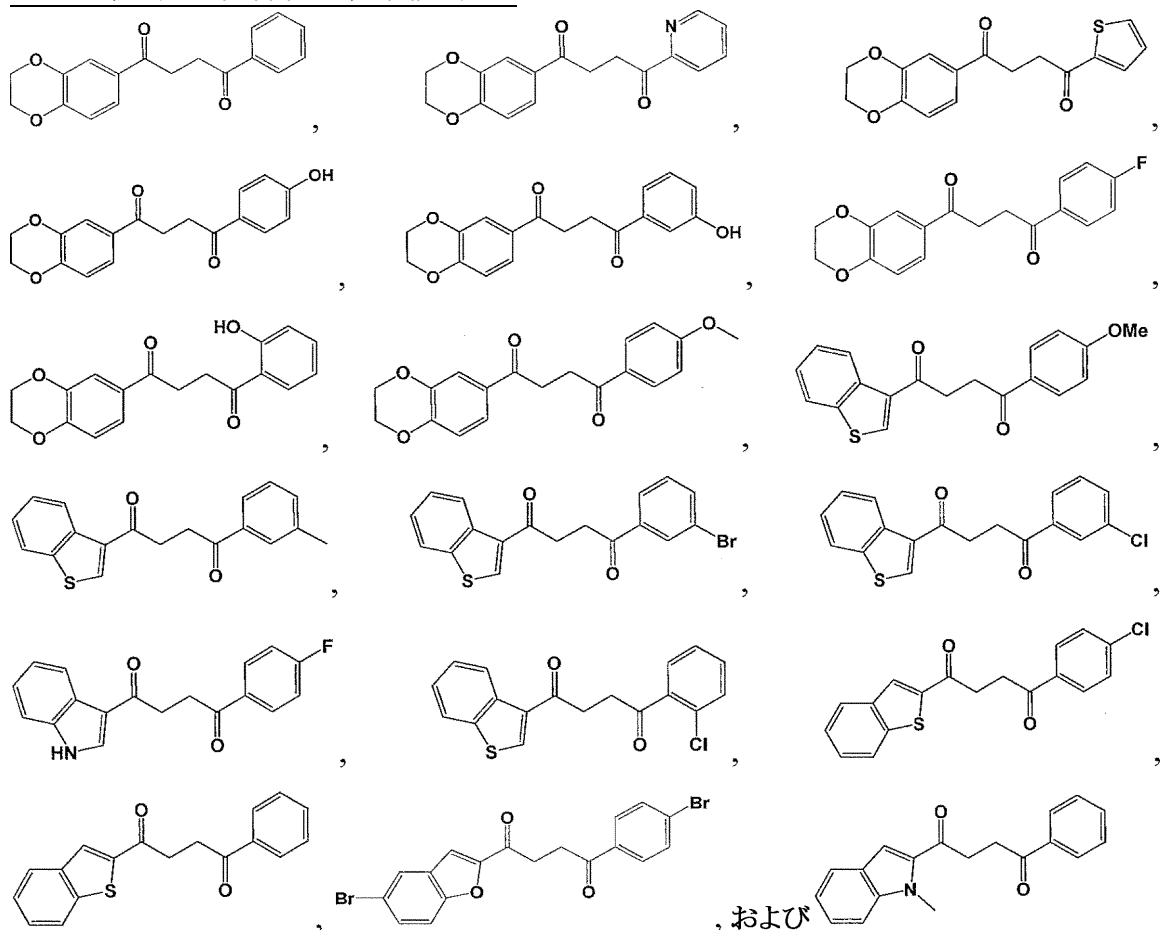
各R³が独立してH、非置換-C₁～₆アルキル、-C₁～₃ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各R³ᵇが独立してHおよび非置換-C₁～₃アルキルからなる群より選択され；

各nが1～10の整数であり；

各mが1～5の整数であるが、

ただし、式Iの化合物は、下記式：



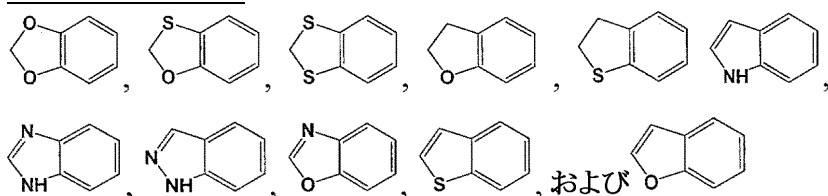
からなる群より選択される化合物ではない。

[本発明1002]

A環が、N、O、およびSからなる群より選択される1～3個のヘテロ原子を含有する9員二環式ヘテロアリール環である、本発明1001の化合物。

[本発明1003]

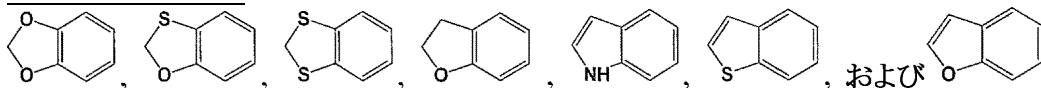
A環が下記式：



からなる群より選択される、本発明1001～1002のいずれかの化合物。

[本発明1004]

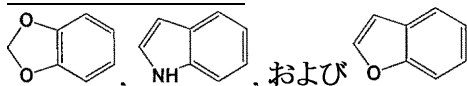
A環が下記式：



からなる群より選択される、本発明1001～1003のいずれかの化合物。

[本発明1005]

A環が下記式：



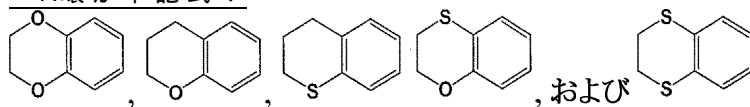
からなる群より選択される、本発明1001～1004のいずれかの化合物。

[本発明1006]

A環が、N、O、およびSからなる群より選択される1~3個のヘテロ原子を含有する10員二環式ヘテロアリール環である、本発明1001~1005のいずれかの化合物。

[本発明1007]

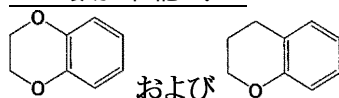
A環が下記式：



からなる群より選択される、本発明1001~1006のいずれかの化合物。

[本発明1008]

A環が下記式：



からなる群より選択される、本発明1001~1007のいずれかの化合物。

[本発明1009]

R^1 がH、F、Cl、Me、OMe、OH、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；nが1または2である、本発明1001~1008のいずれかの化合物。

[本発明1010]

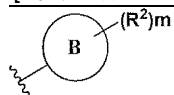
R^1 がHである、本発明1001~1009のいずれかの化合物。

[本発明1011]

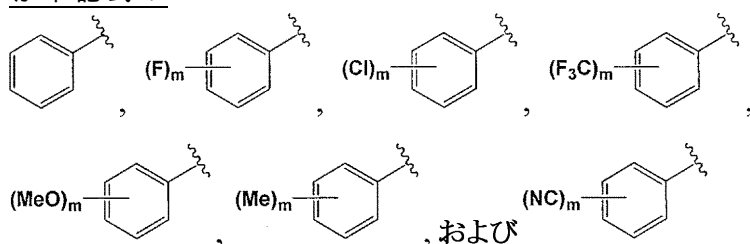
R^1 がFであり；nが1である、本発明1001~1010のいずれかの化合物。

[本発明1012]

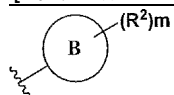
B環がフェニルである、本発明1001~1011のいずれかの化合物。

[本発明1013]

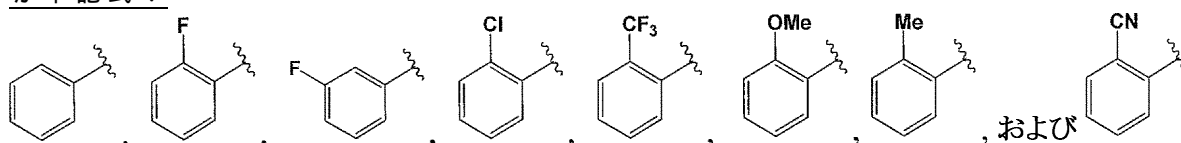
が下記式：



からなる群より選択され；mが1または2である、本発明1001~1012のいずれかの化合物。

[本発明1014]

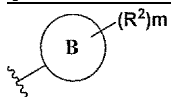
が下記式：



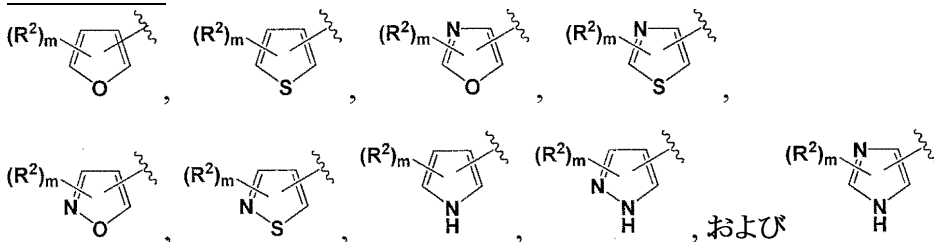
からなる群より選択される、本発明1001~1013のいずれかの化合物。

[本発明1015]

B環が、N、O、およびSからなる群より選択される1~3個のヘテロ原子を含有する5員ヘテロアリールである、本発明1001~1014のいずれかの化合物。

[本 発 明 1016]

が下記式：



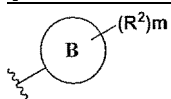
からなる群より選択され； m が1または2である、本発明1001～1015のいずれかの化合物。

[本 発 明 1017]

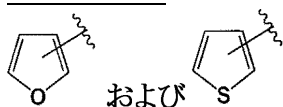
R^2 がHである、本発明1001～1016のいずれかの化合物。

[本 発 明 1018]

R^2 がFであり； m が1である、本発明1001～1017のいずれかの化合物。

[本 発 明 1019]

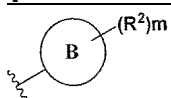
が下記式：



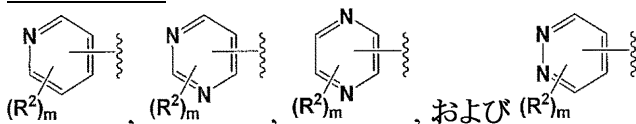
からなる群より選択され； R^2 がHである、本発明1001～1018のいずれかの化合物。

[本 発 明 1020]

B環が、1～2個の窒素原子を含有する6員ヘテロアリールである、本発明1001～1019のいずれかの化合物。

[本 発 明 1021]

が下記式：



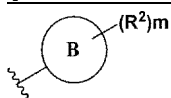
からなる群より選択され； m が1または2である、本発明1001～1020のいずれかの化合物。

[本 発 明 1022]

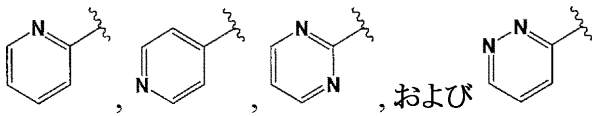
R^2 がHである、本発明1001～1021のいずれかの化合物。

[本 発 明 1023]

R^2 がFであり； m が1である、本発明1001～1022のいずれかの化合物。

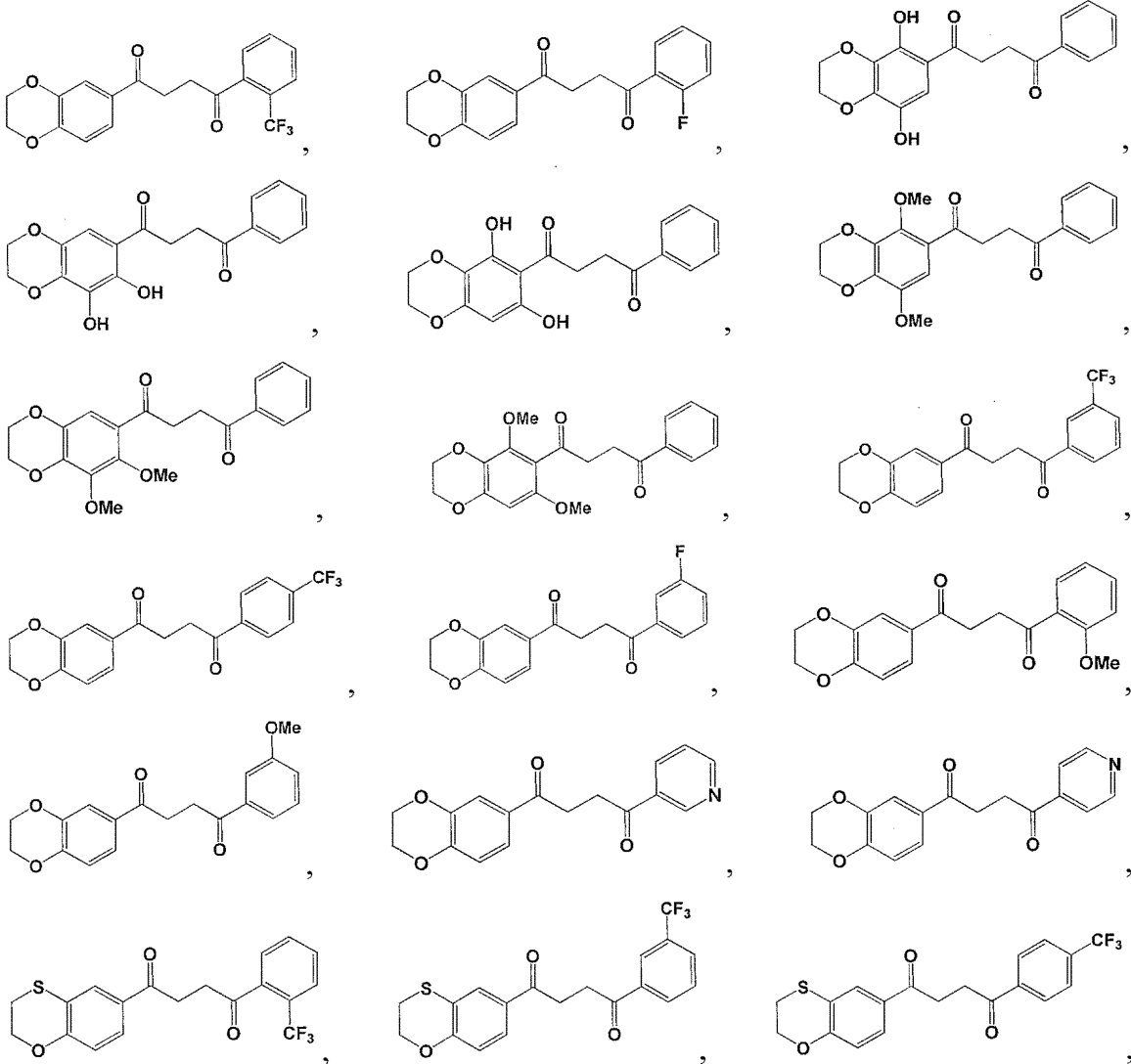
[本 発 明 1024]

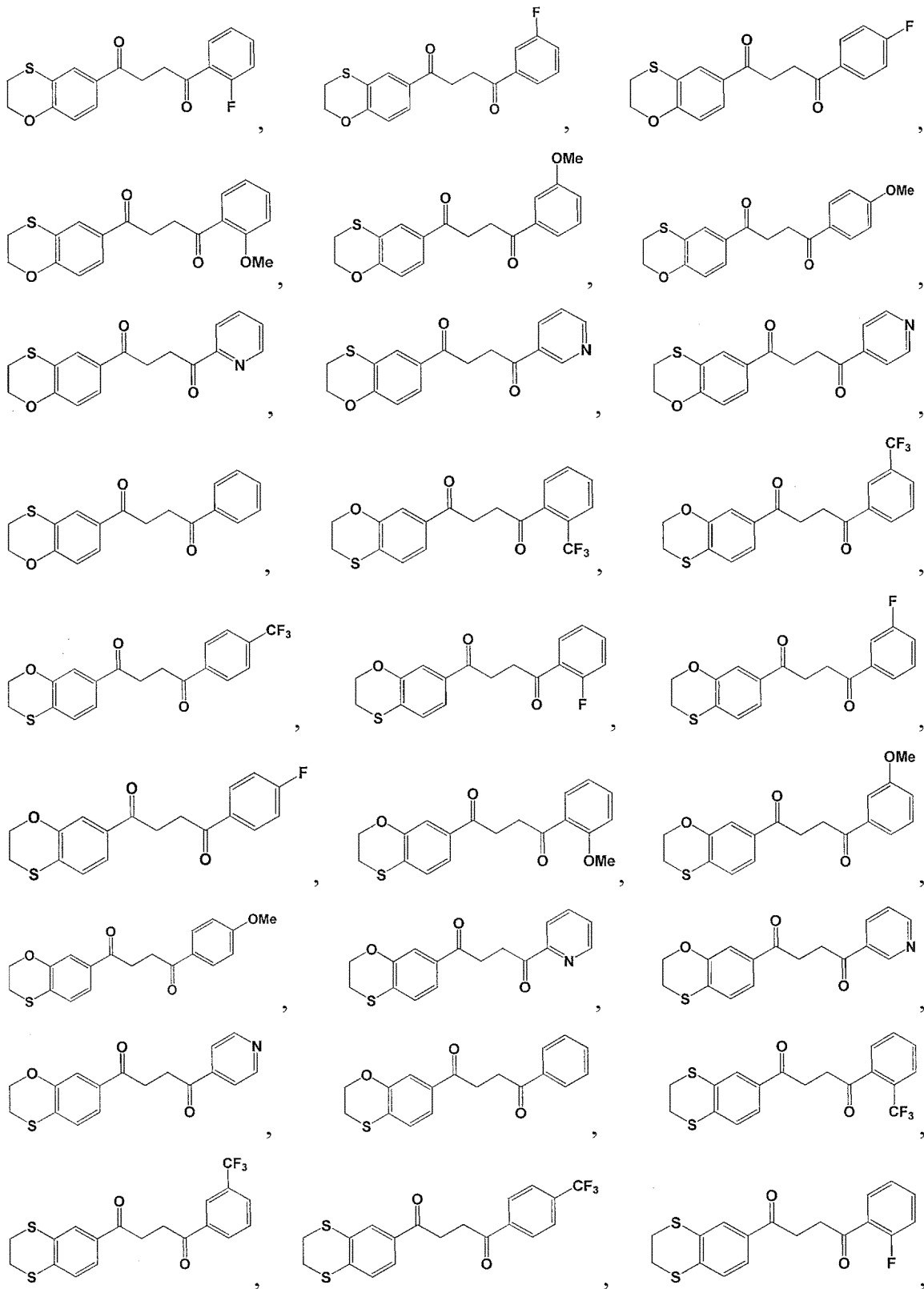
が下記式：

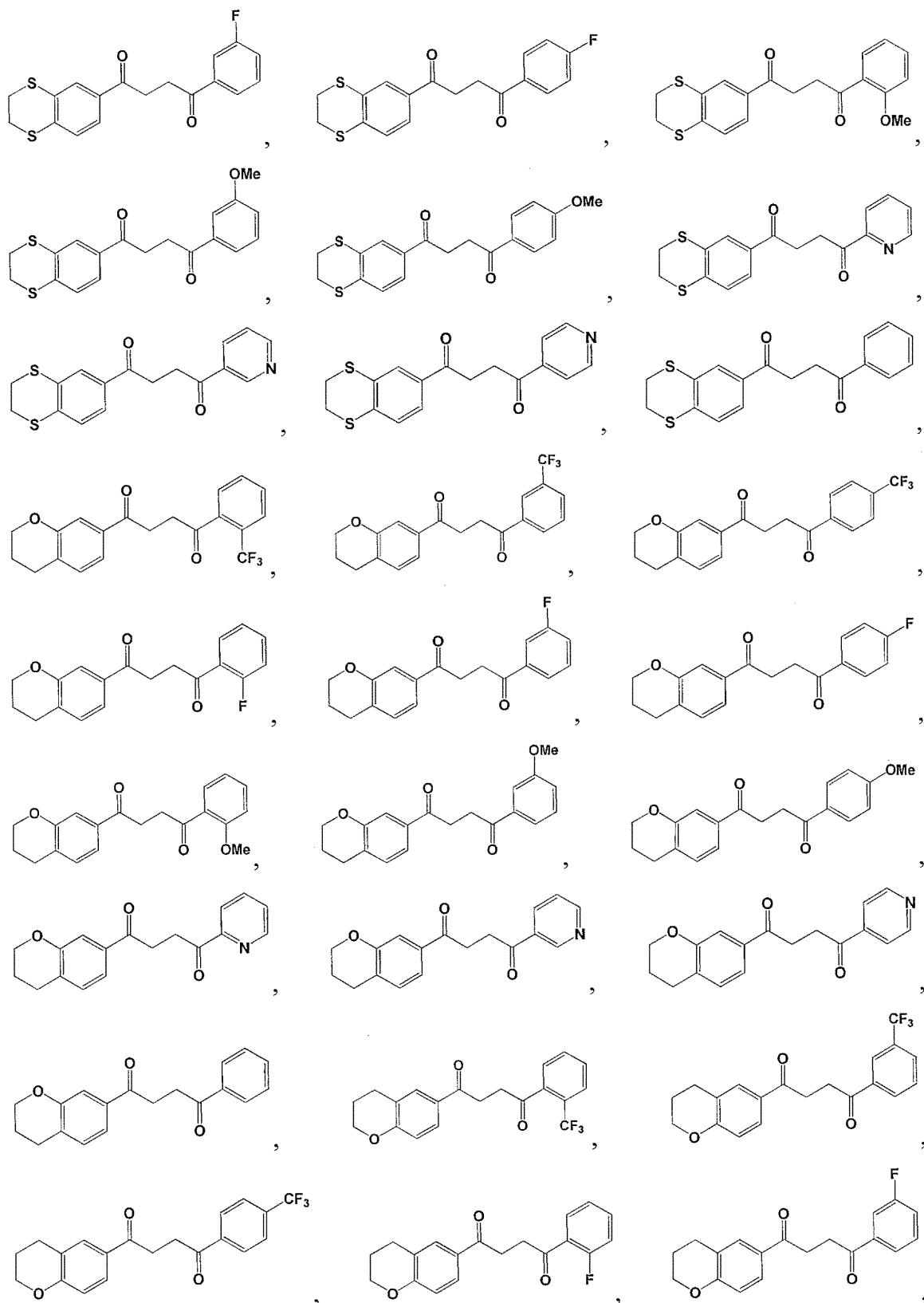


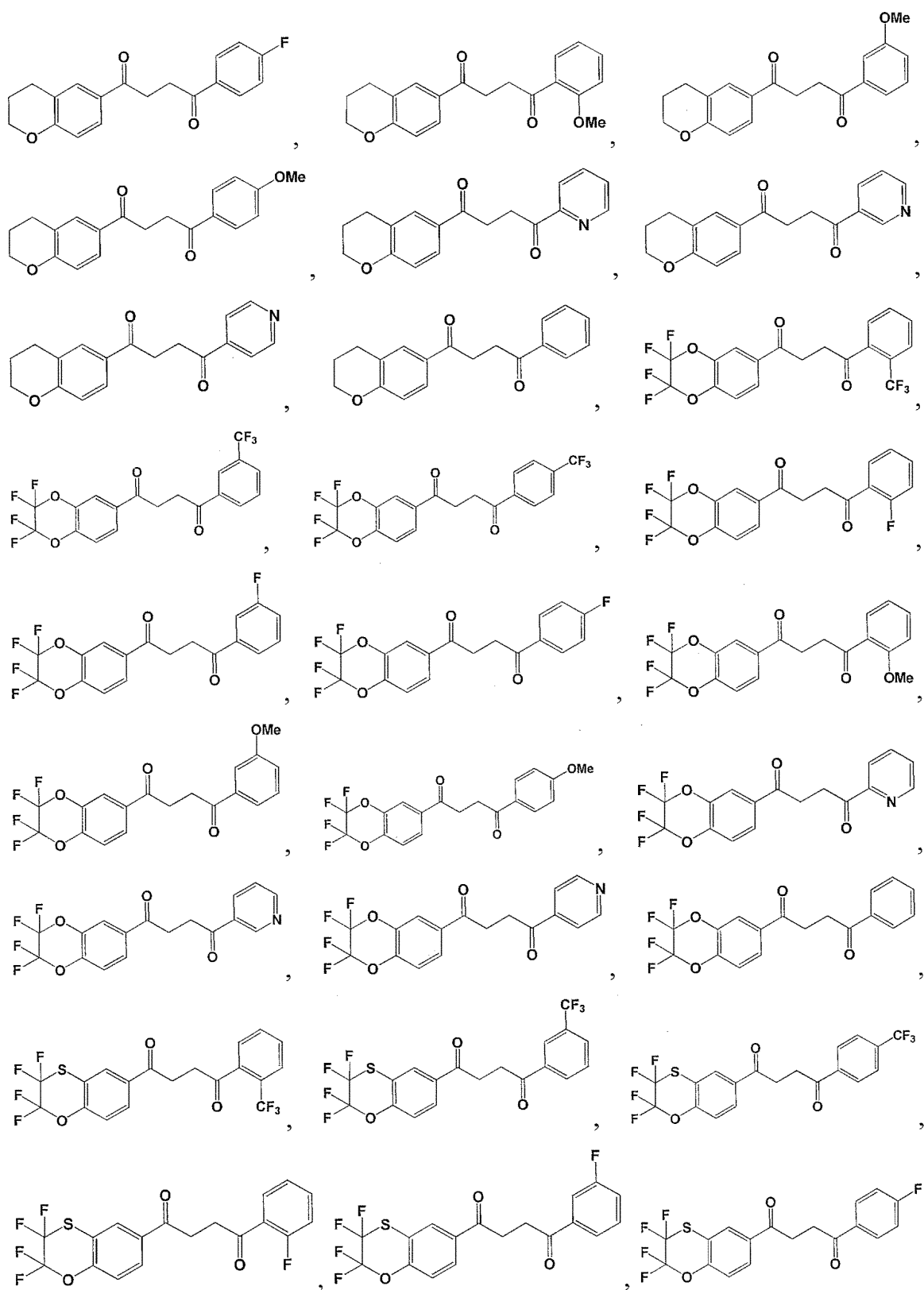
[本発明1025]

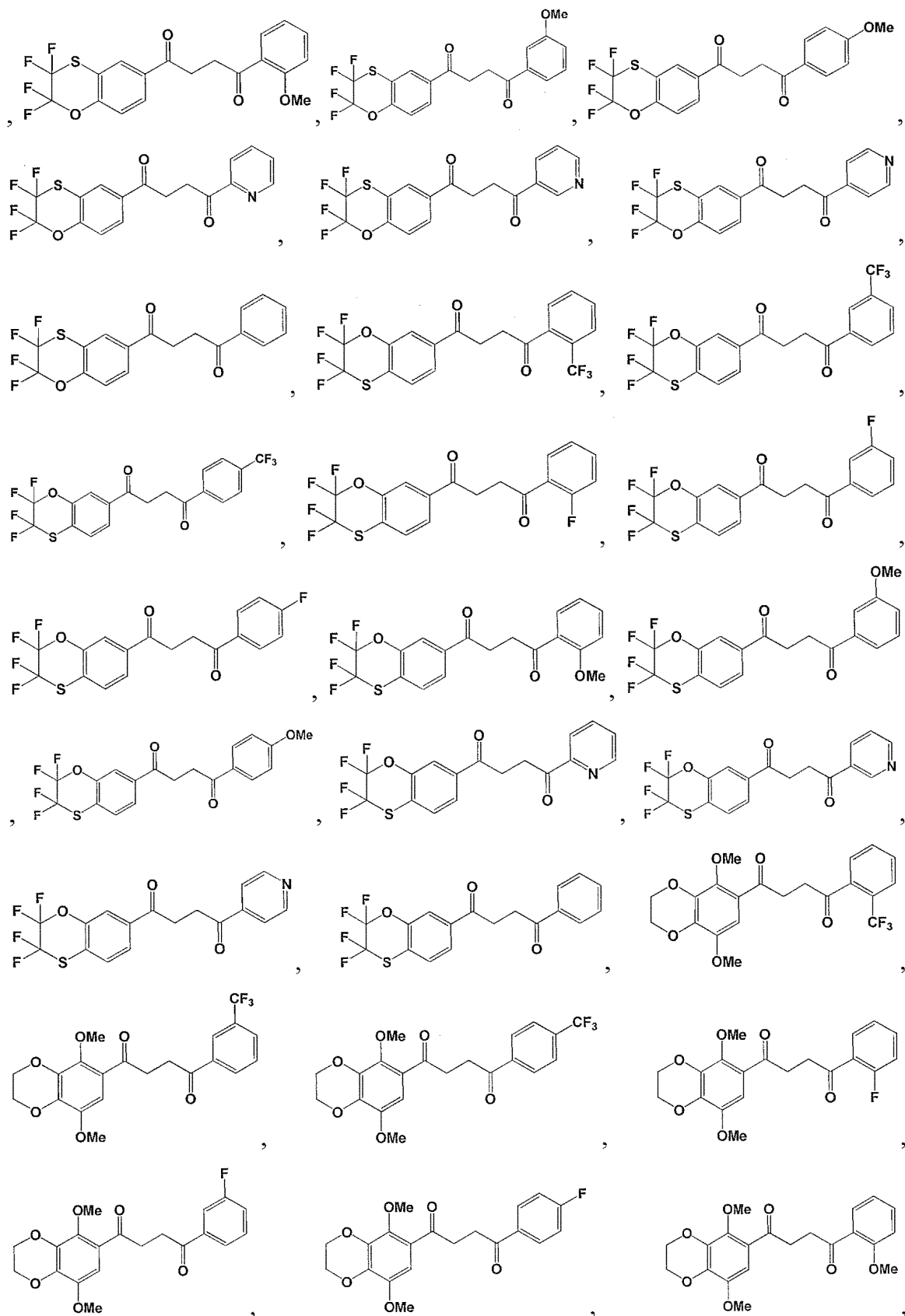
式Iの化合物が下記式：

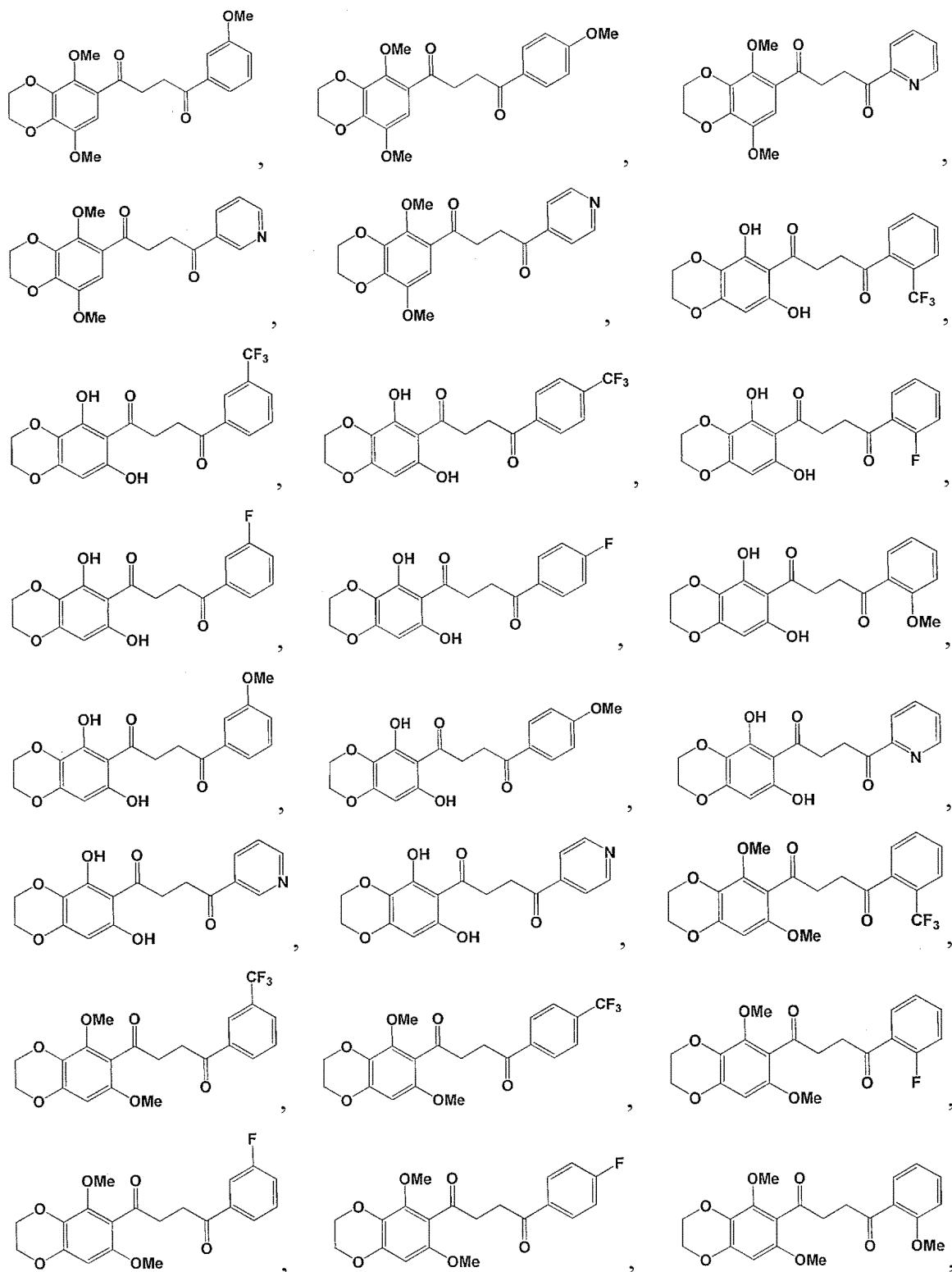


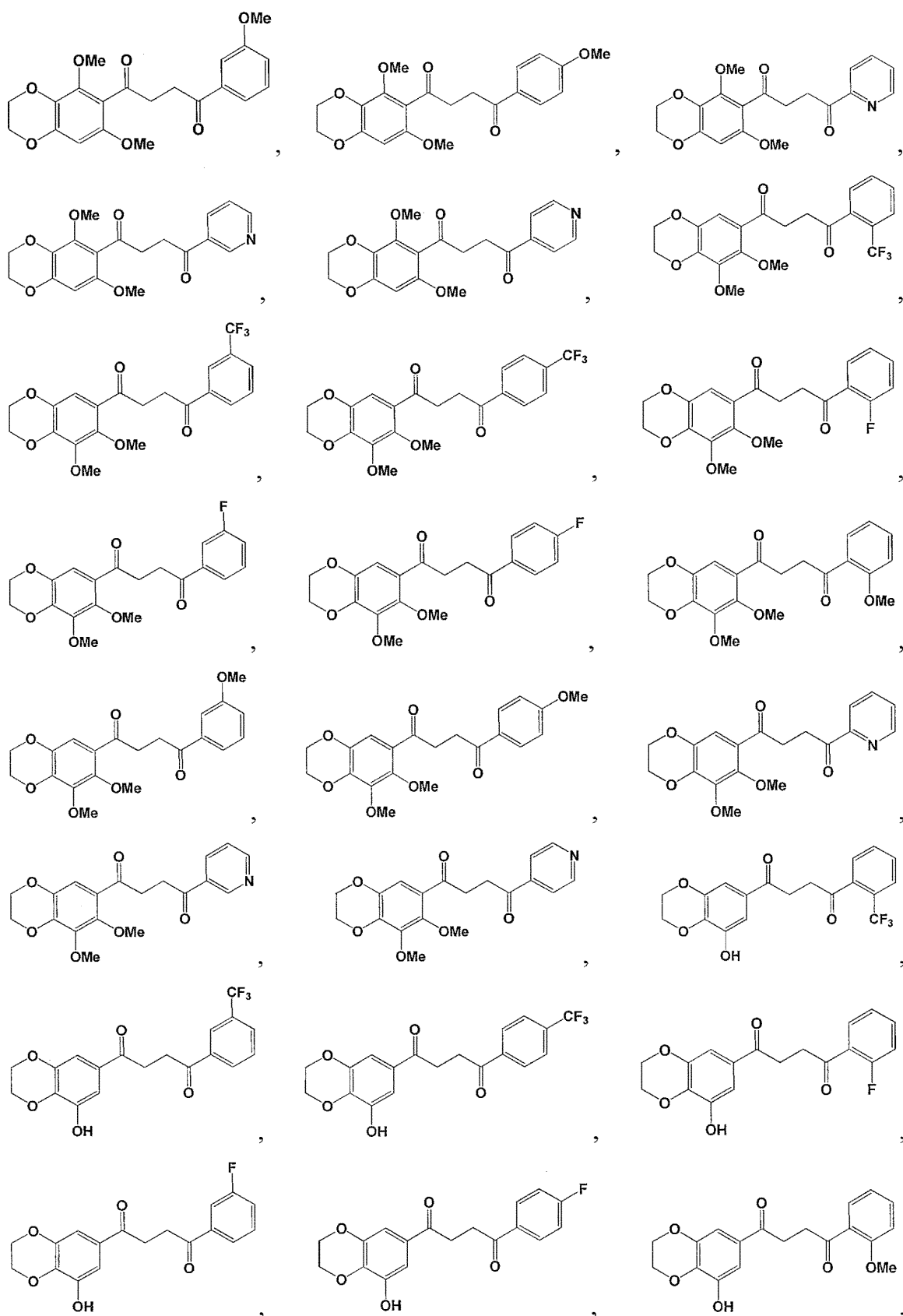


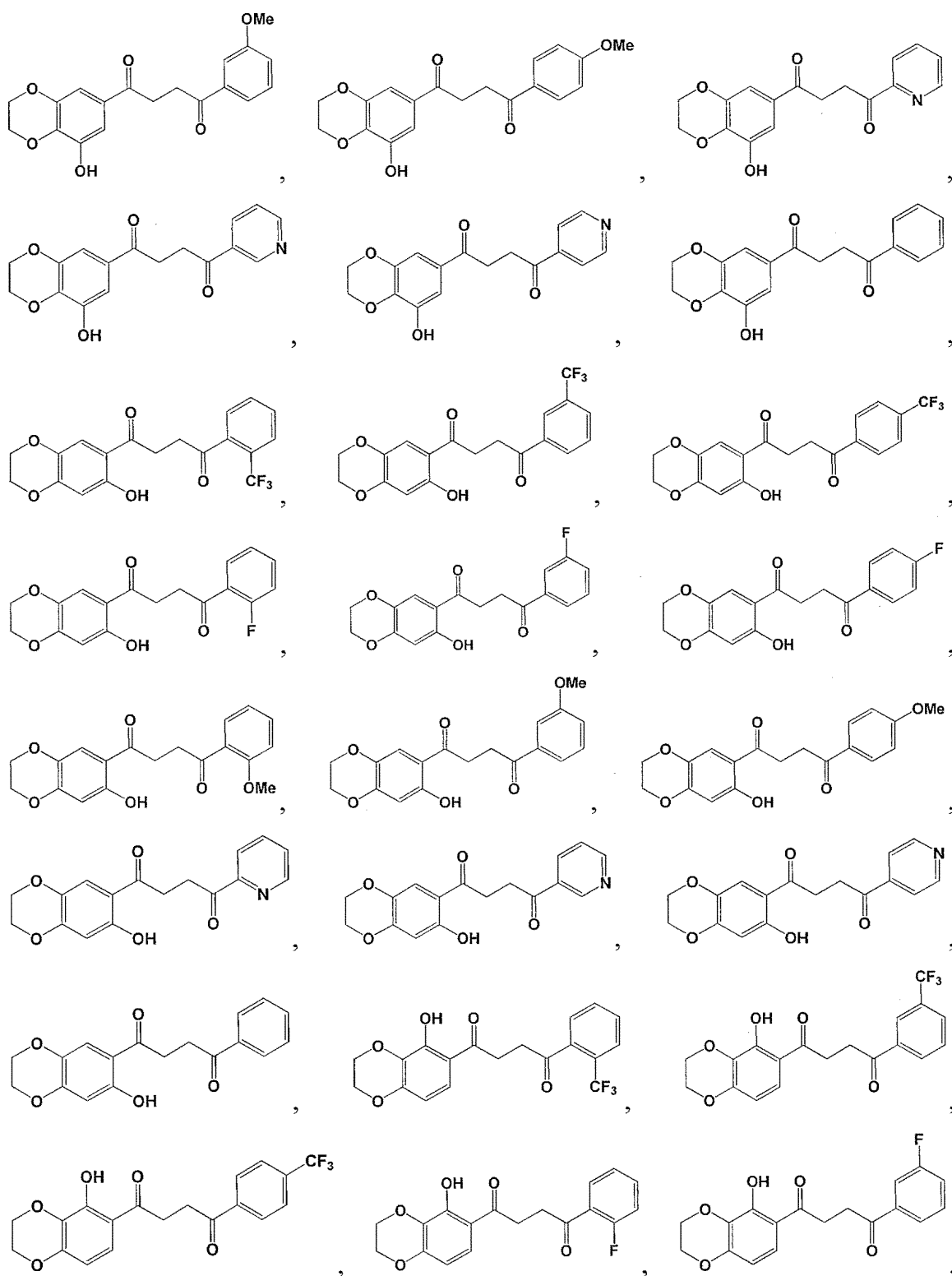


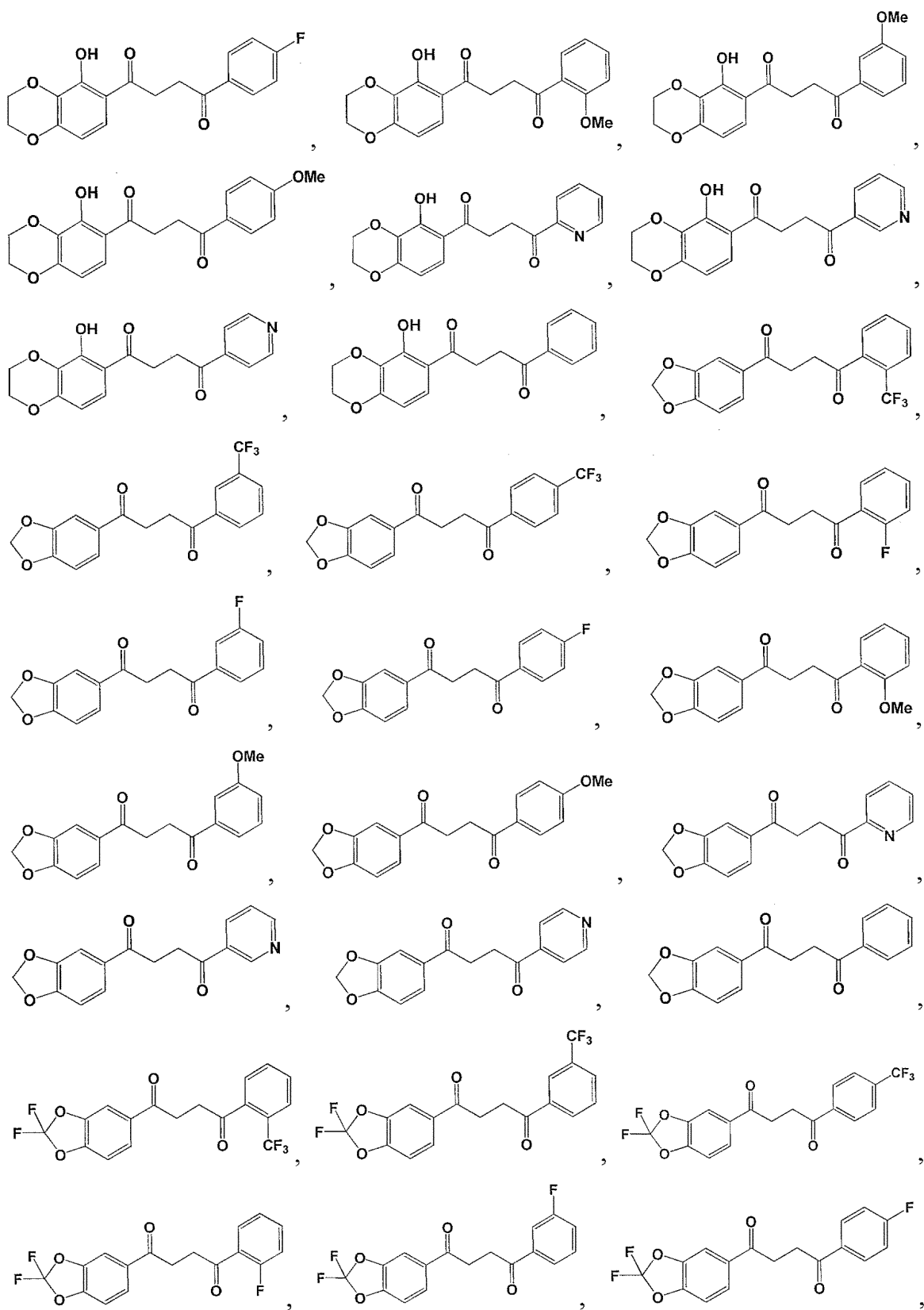


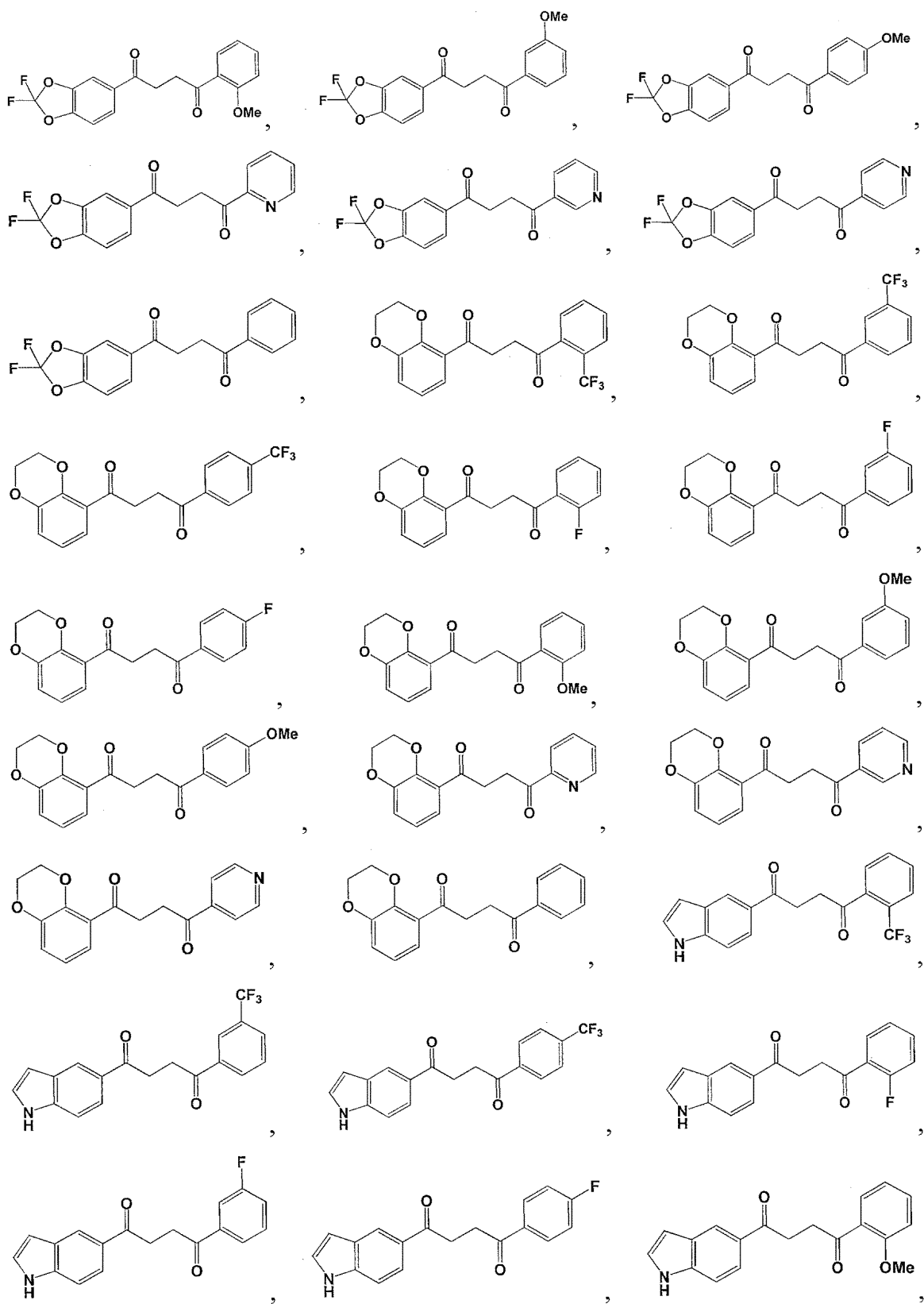


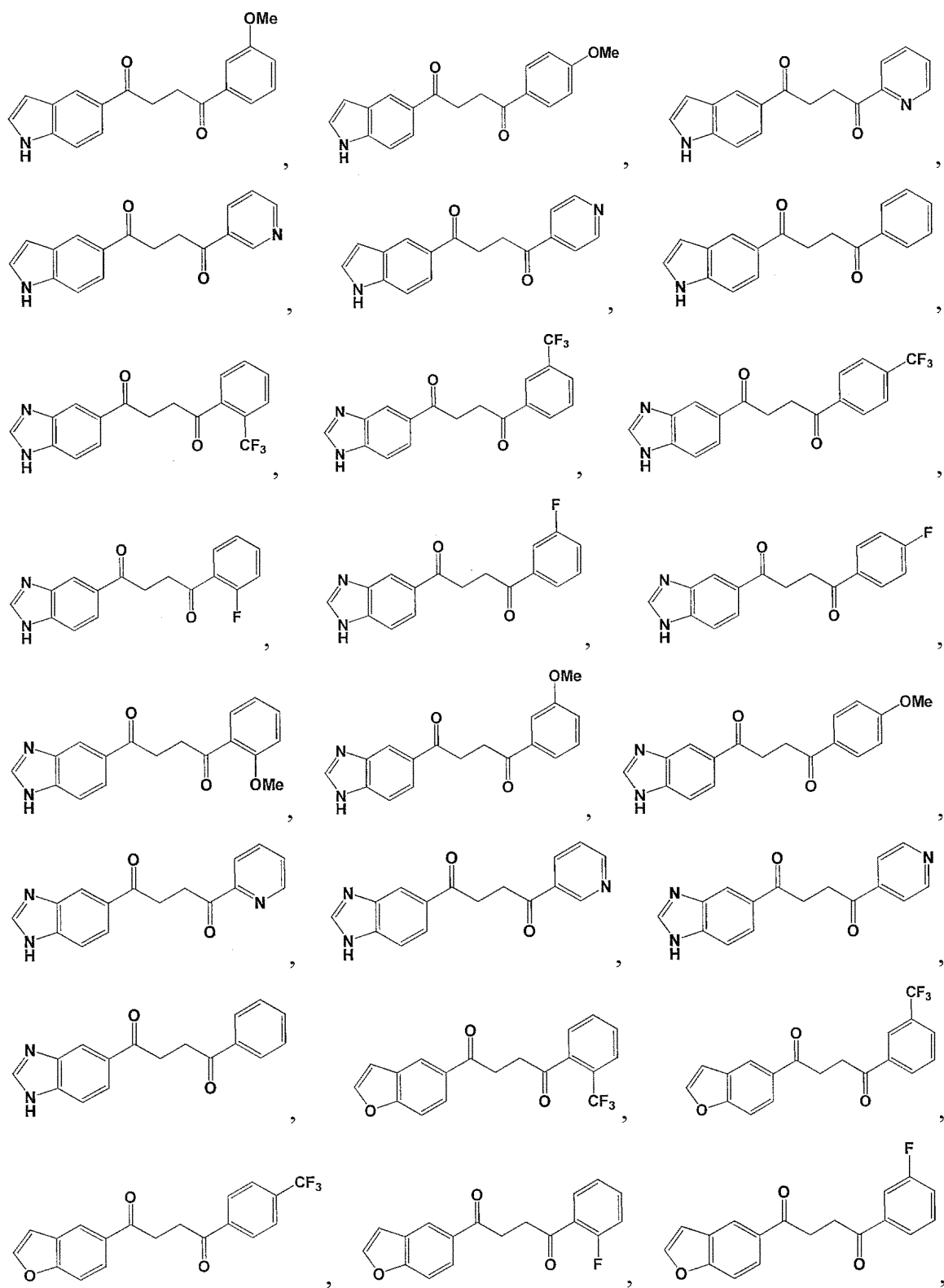


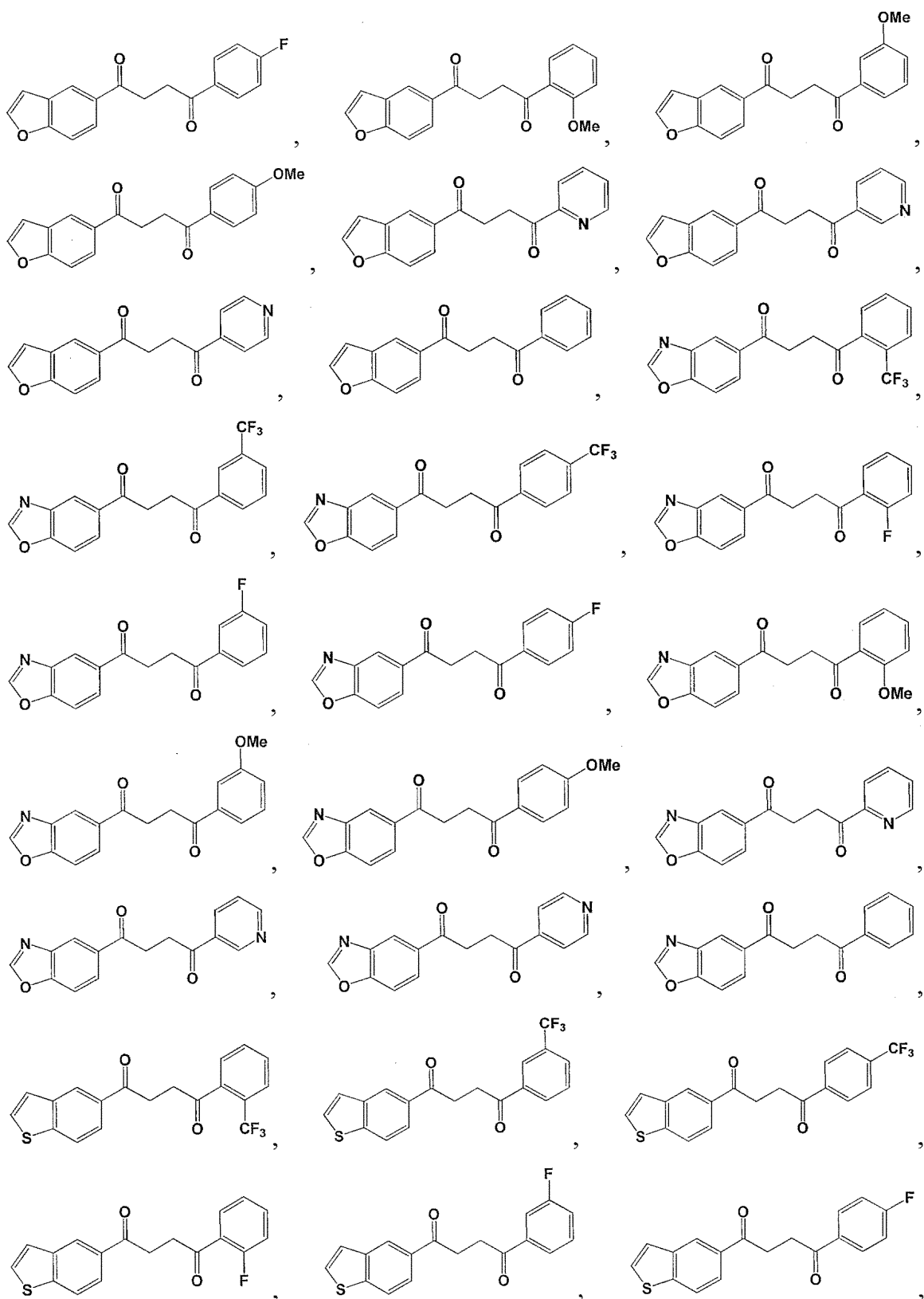


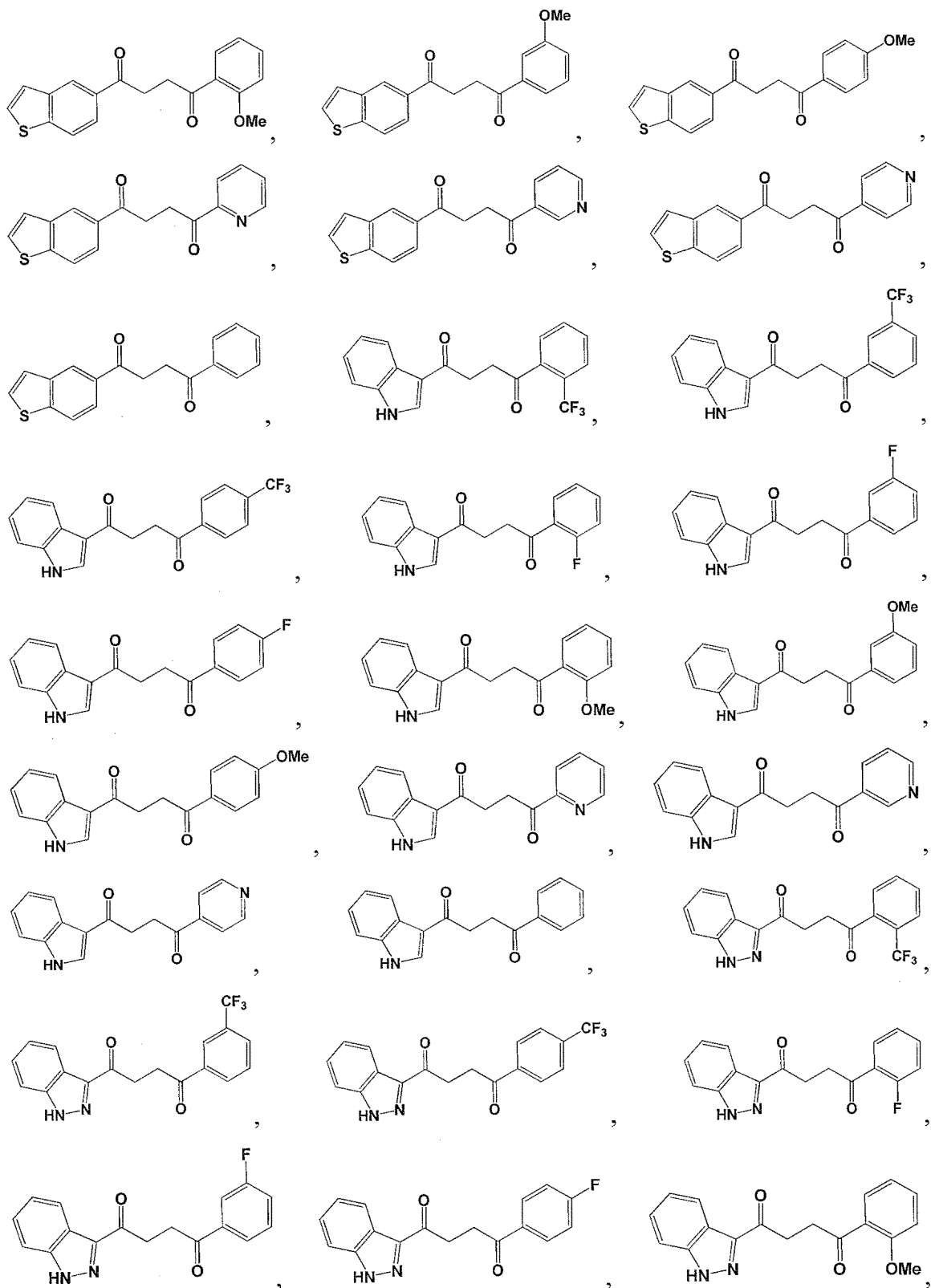


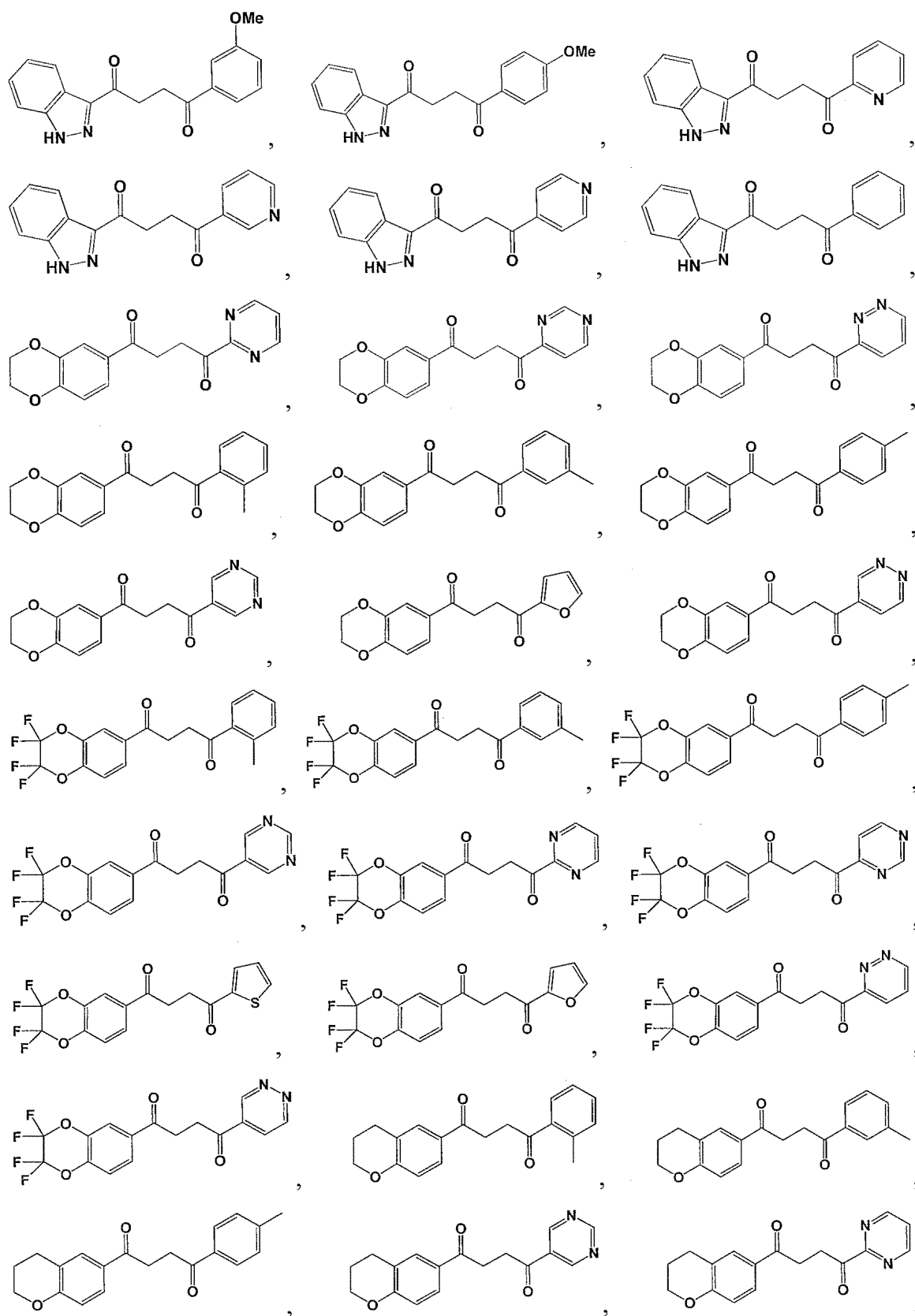


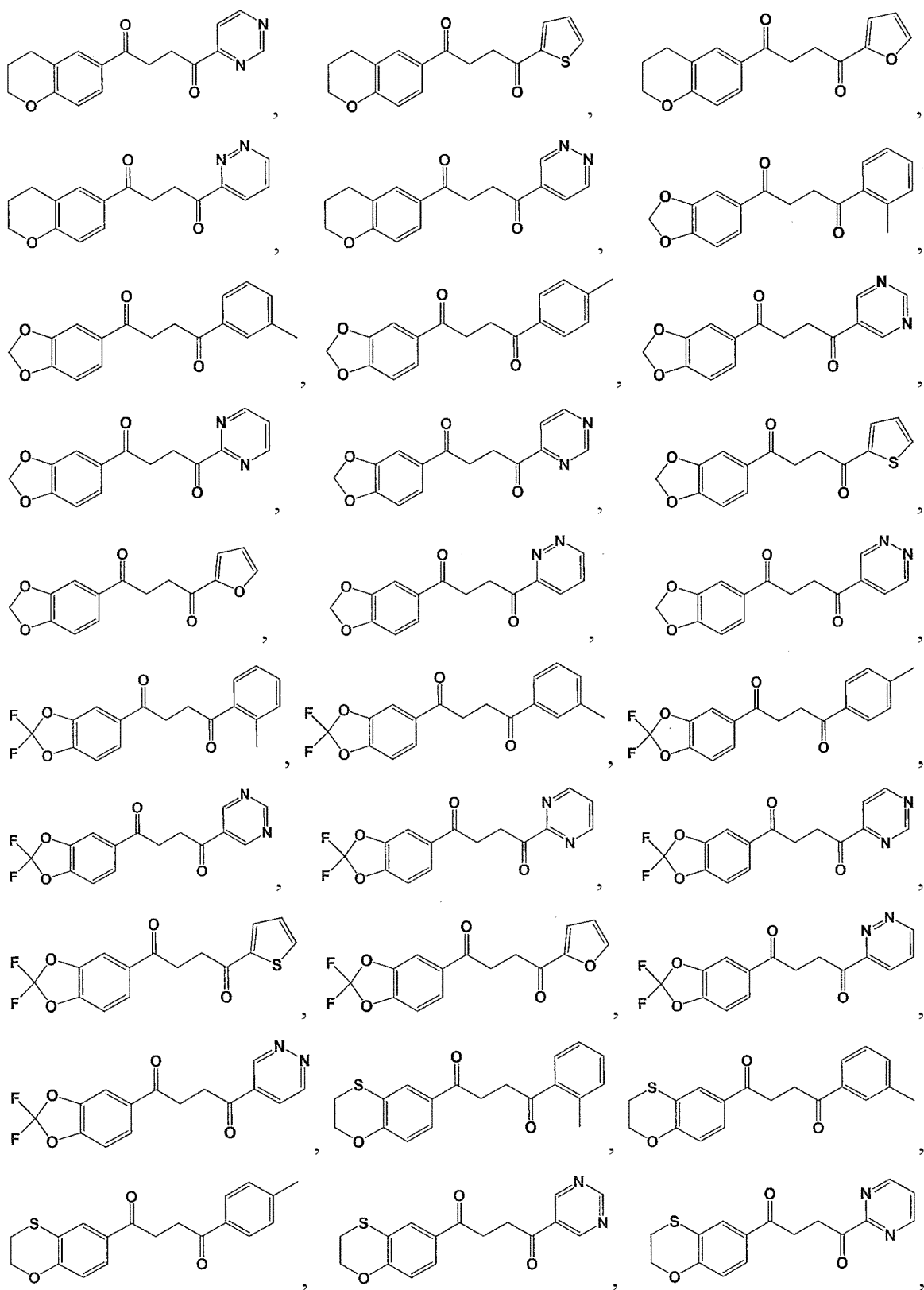


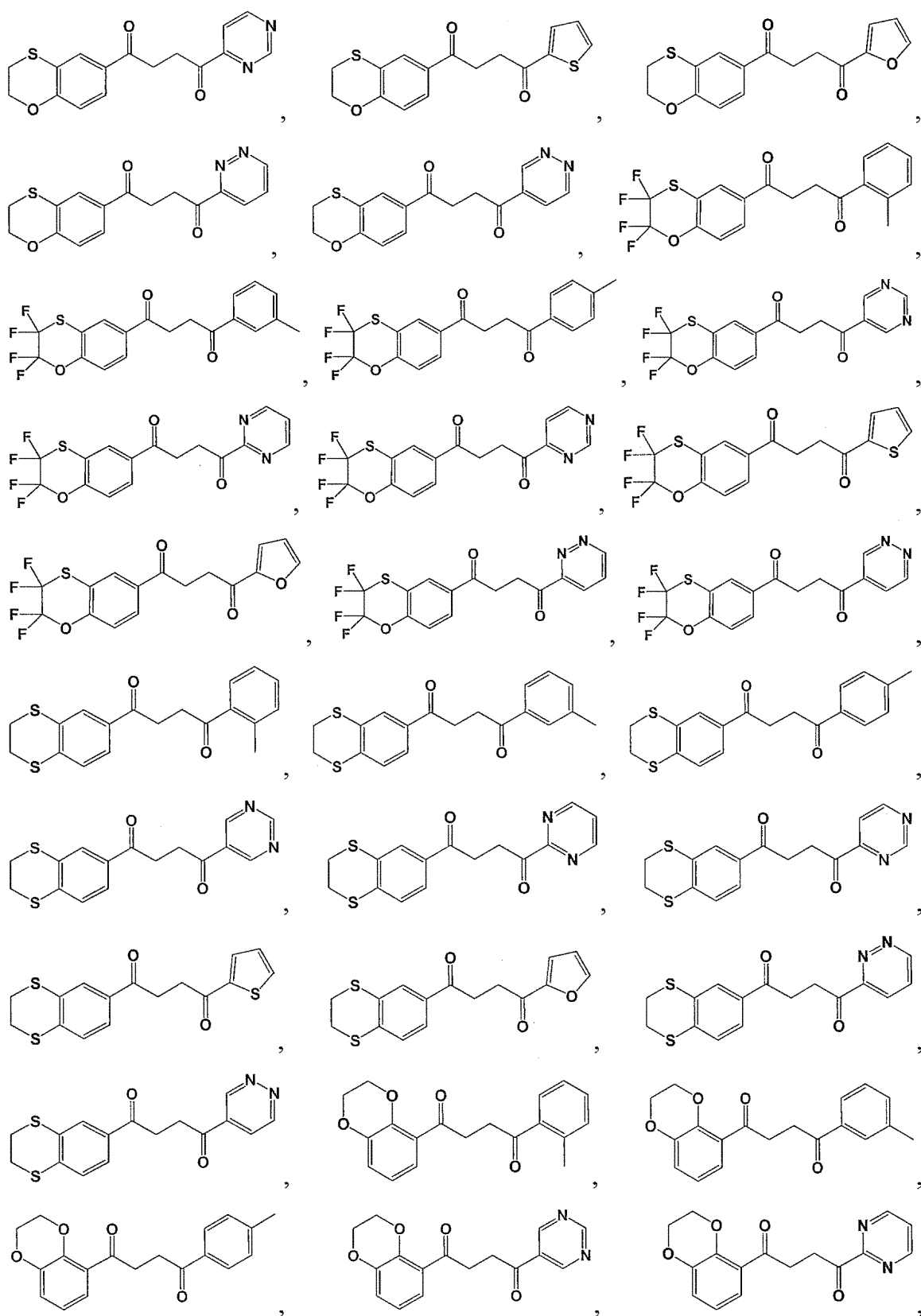


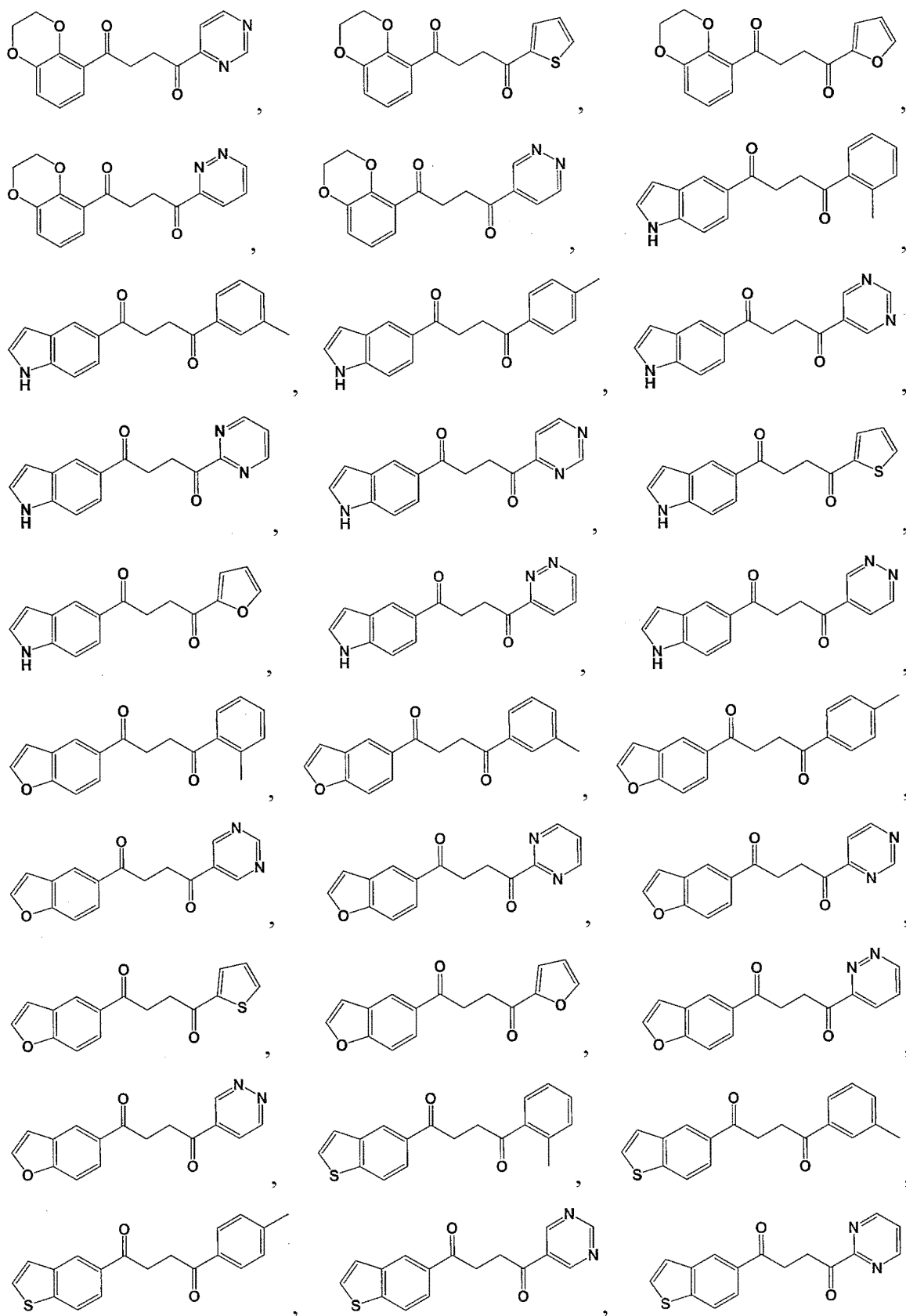


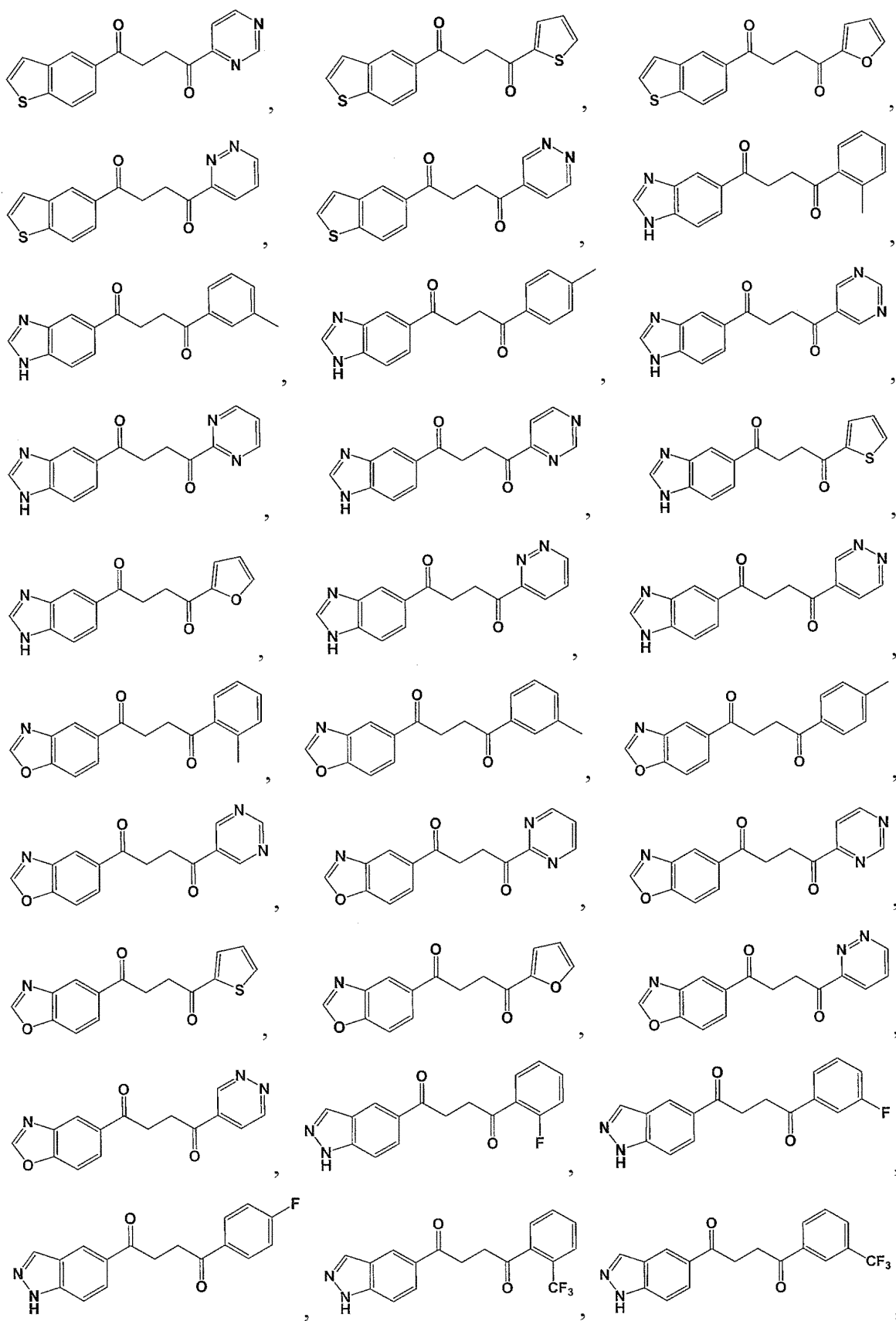


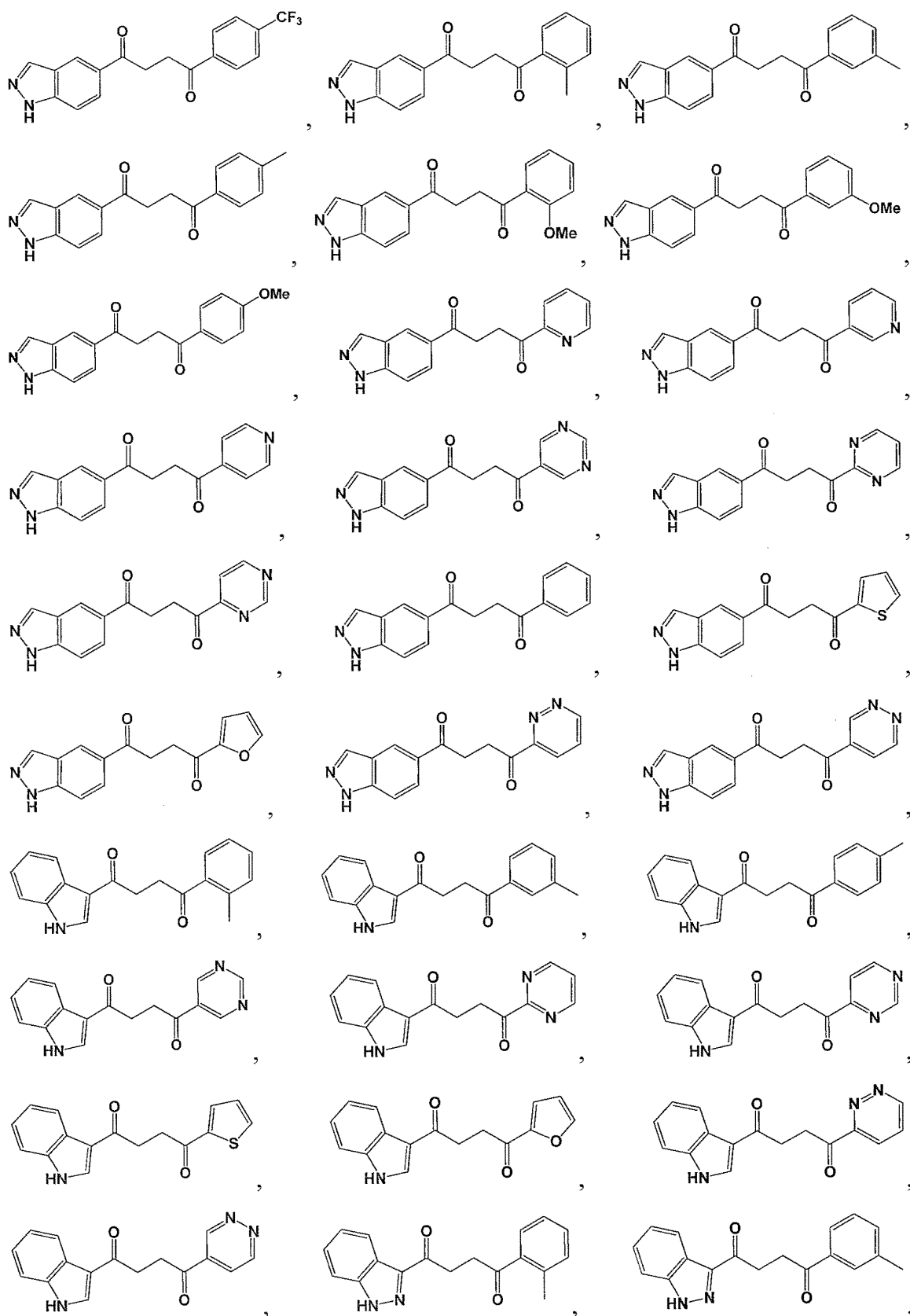


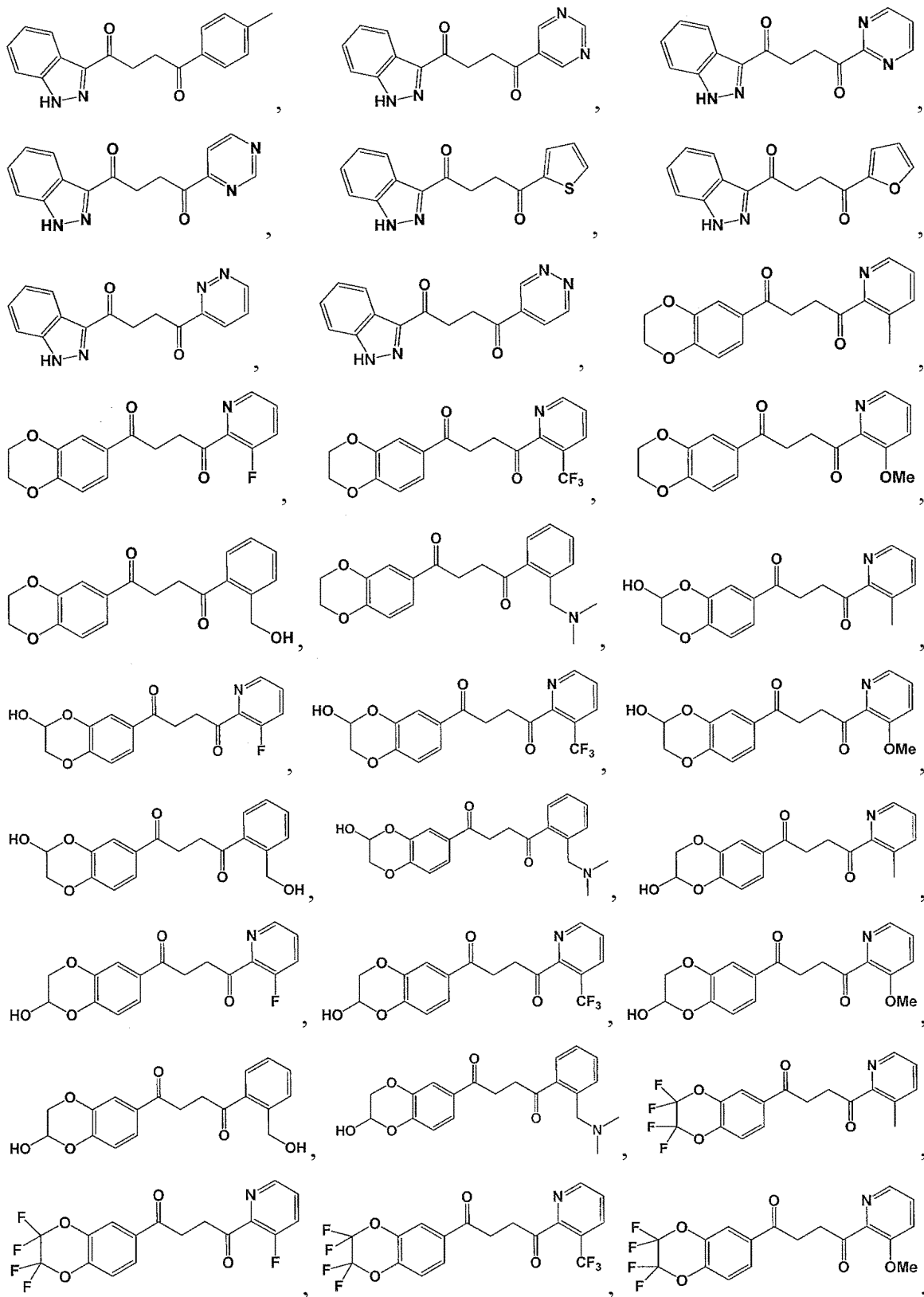


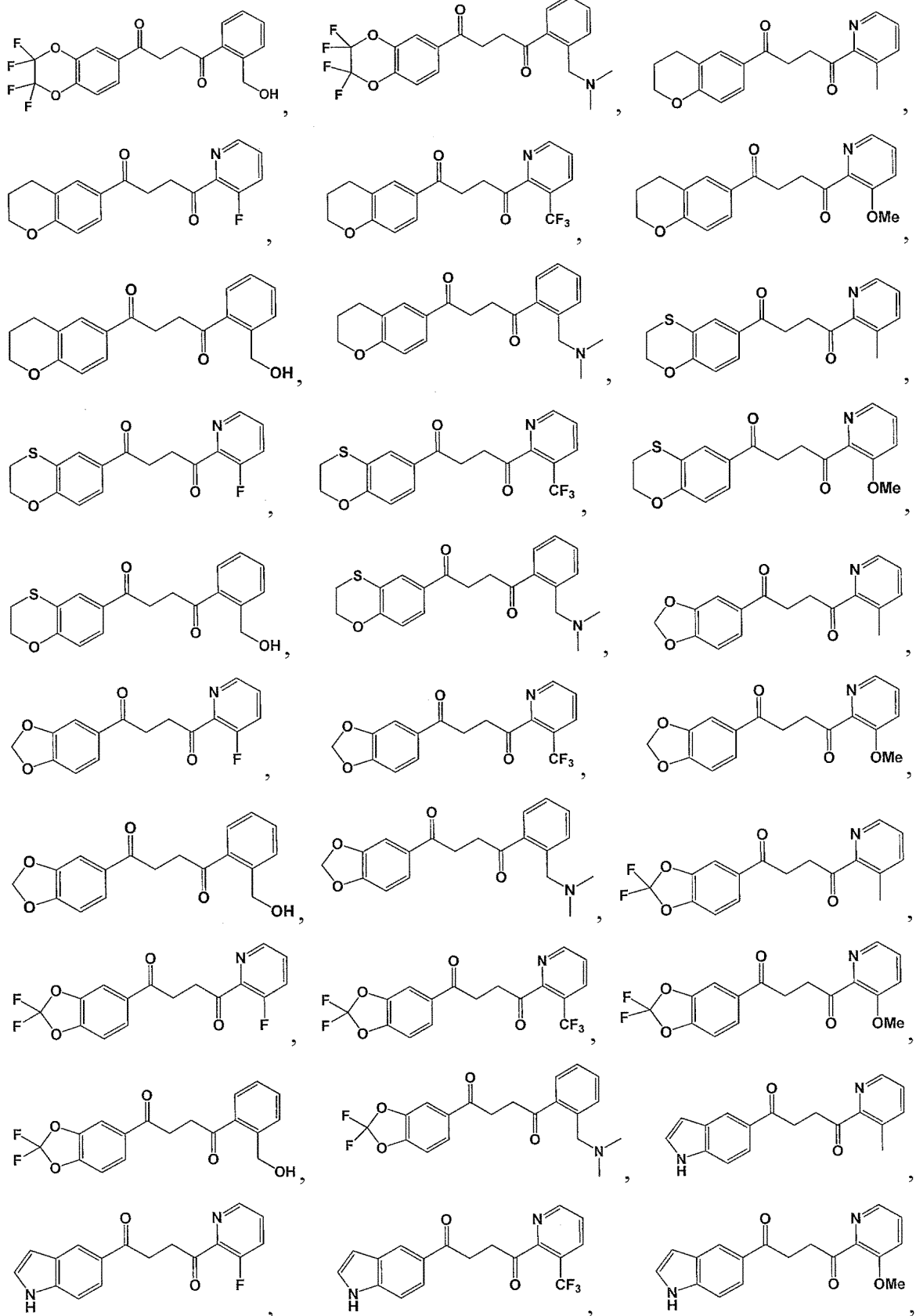


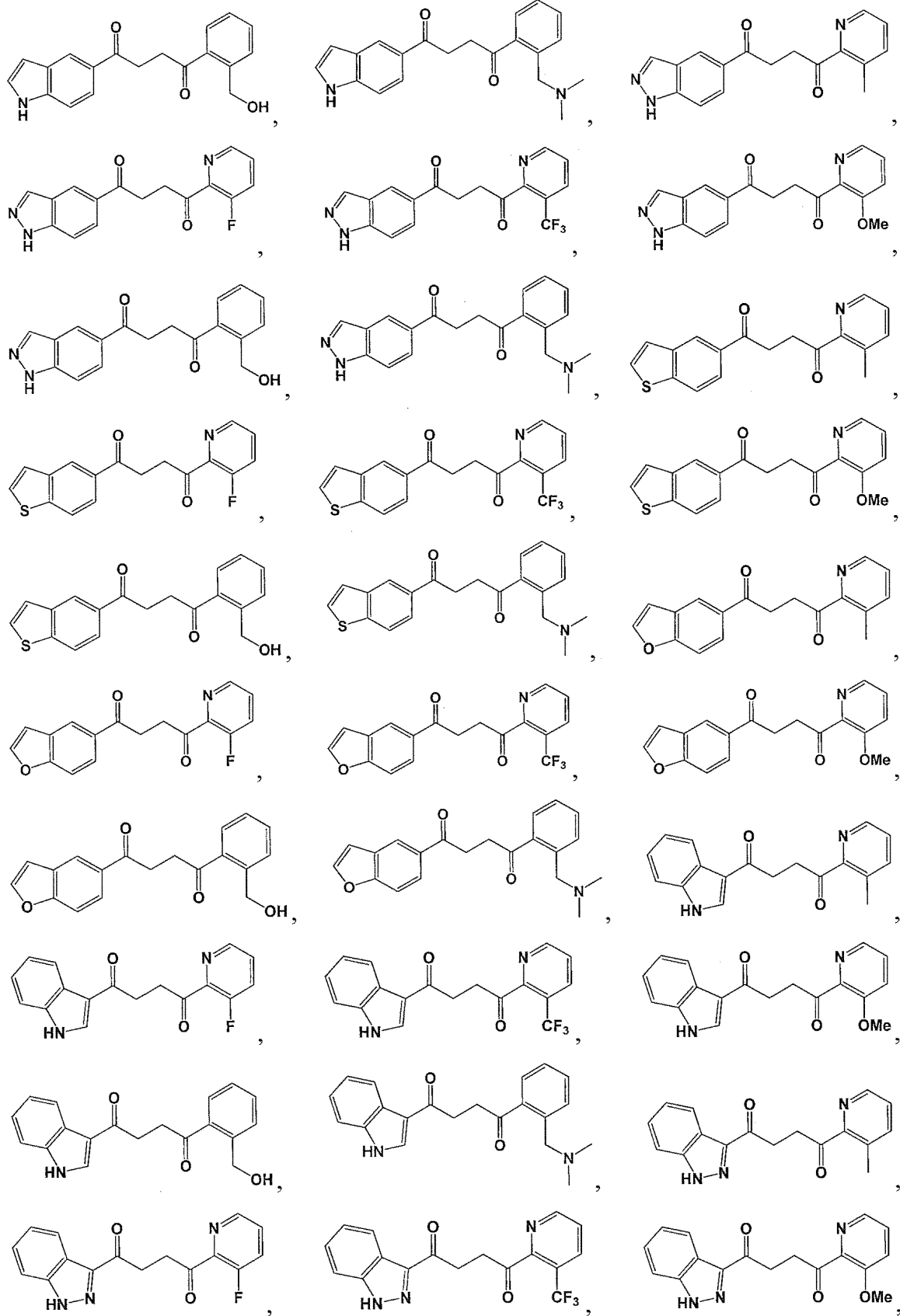


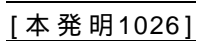




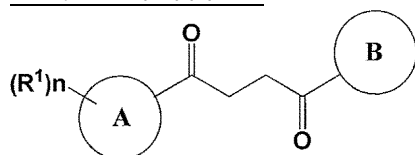








式 Ia の化合物 :

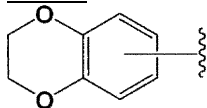


Ia

、または薬学的に許容されるその塩 :

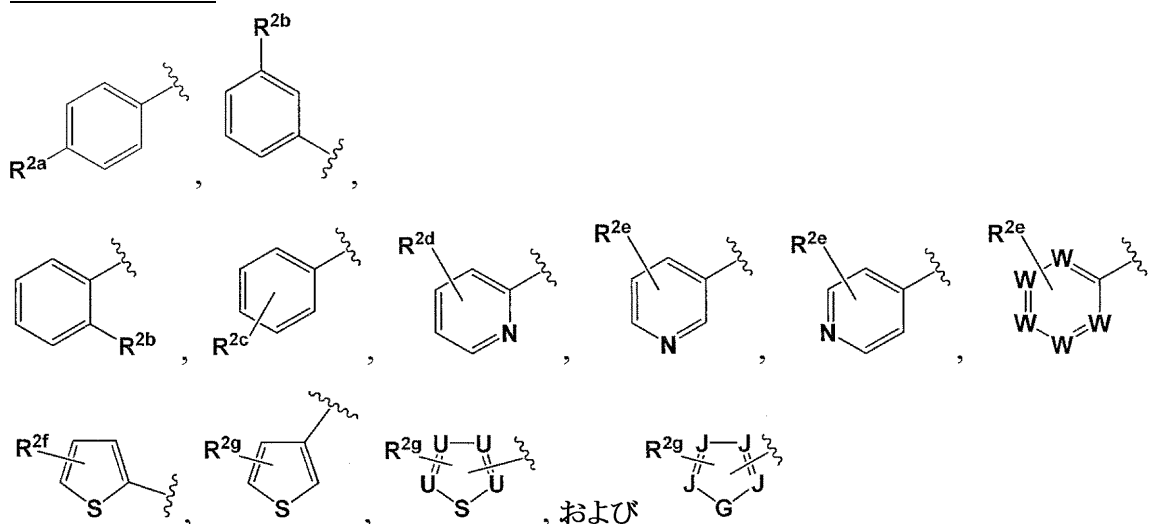
式中、

A環が



であり ;

B環が下記式 :



からなる群より選択され ;

各 R¹ が、A環に結合した置換基であり、出現することに独立して H、非置換-C₁~₆アルキル、-C₁~₃ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され ;

R²ᵃ が非置換-C₁~₆アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R³ᵇ)₂、-C₁~₃ハロアルキル、Cl、Br、I、-OR³ᵃ、CF₃、およびCNからなる群より選択され ;

R²ᵇ が非置換-C₁~₆アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R³ᵇ)₂、-C₁~₃ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³ᵃ、CF₃、およびCNからなる群より選択され ;

R²ᶜ が2~5個の置換基であり、出現することにそれぞれ独立して非置換-C₁~₆アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R³ᵇ)₂、-C₁~₃ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され ;

R²ᵈ が1~4個の置換基であり、出現することにそれぞれ独立して非置換-C₁~₆アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R³ᵇ)₂、-C₁~₃ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され ;

R²ᵉ が1~4個の置換基であり、出現することにそれぞれ独立して H、非置換-C₁~₆アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R³ᵇ)₂、-C₁~₃ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され ;

R²ᶠ が1~3個の置換基であり、出現することにそれぞれ独立して非置換-C₁~₆アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R³ᵇ)₂、-C₁~₃ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され ;

R²ᵍ が1~3個の置換基であり、出現することにそれぞれ独立して H、非置換-C₁~₆アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R³ᵇ)₂、-C₁~₃ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNから

なる群より選択され；

各 R^3 が独立してH、非置換 $-C_{1\sim 6}$ アルキル、 $-C_{1\sim 3}$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{3a} が独立して非置換 $-C_{2\sim 6}$ アルキル、 $-C_{1\sim 3}$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{3b} が独立してHおよび非置換 $-C_{1\sim 3}$ アルキルからなる群より選択され；

各WがNまたはCであり、ここで少なくとも2つのWはNであり；

各UがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのUはNであり、少なくとも1つのUはCであり；

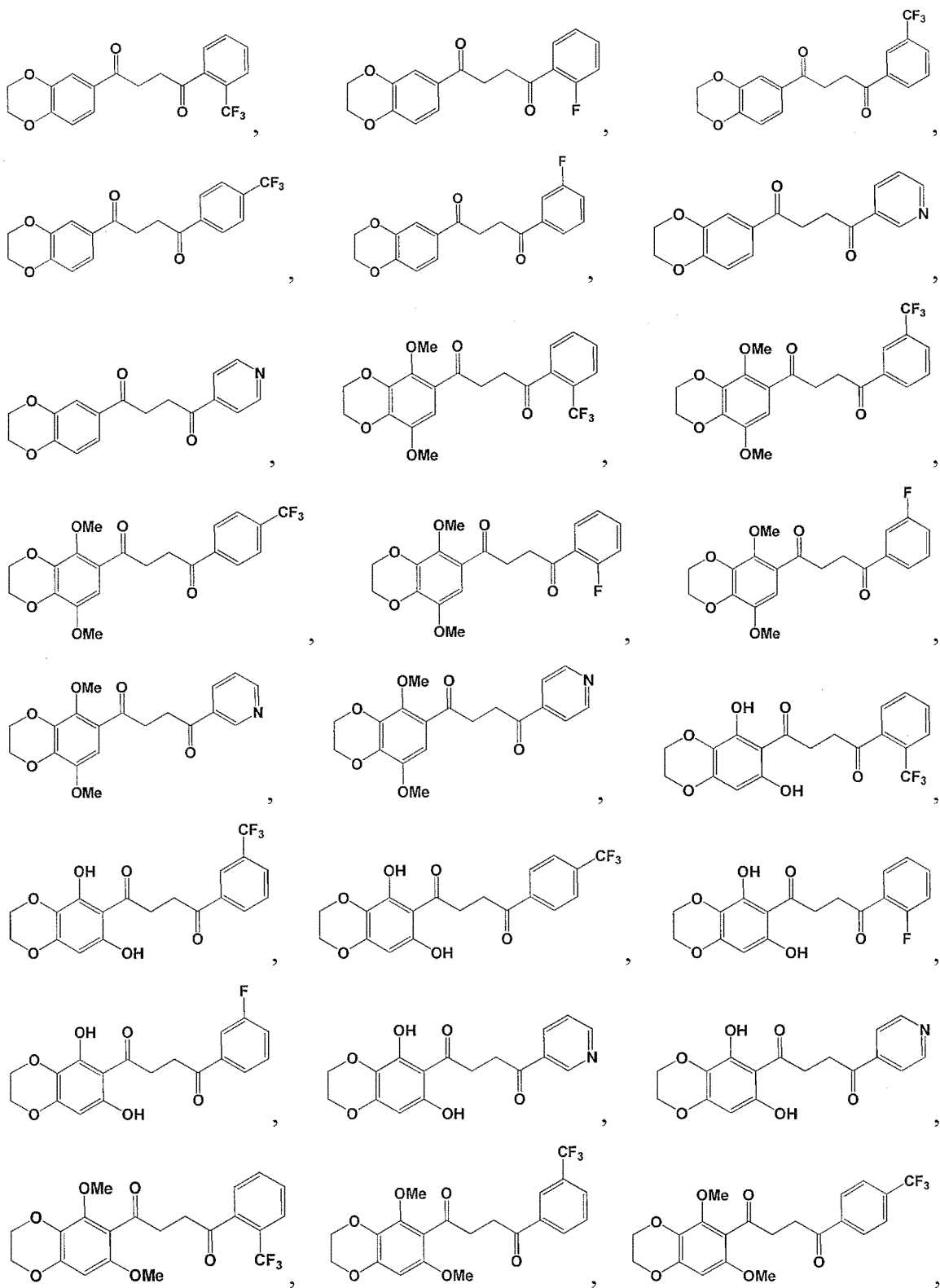
GがNHまたはOであり；

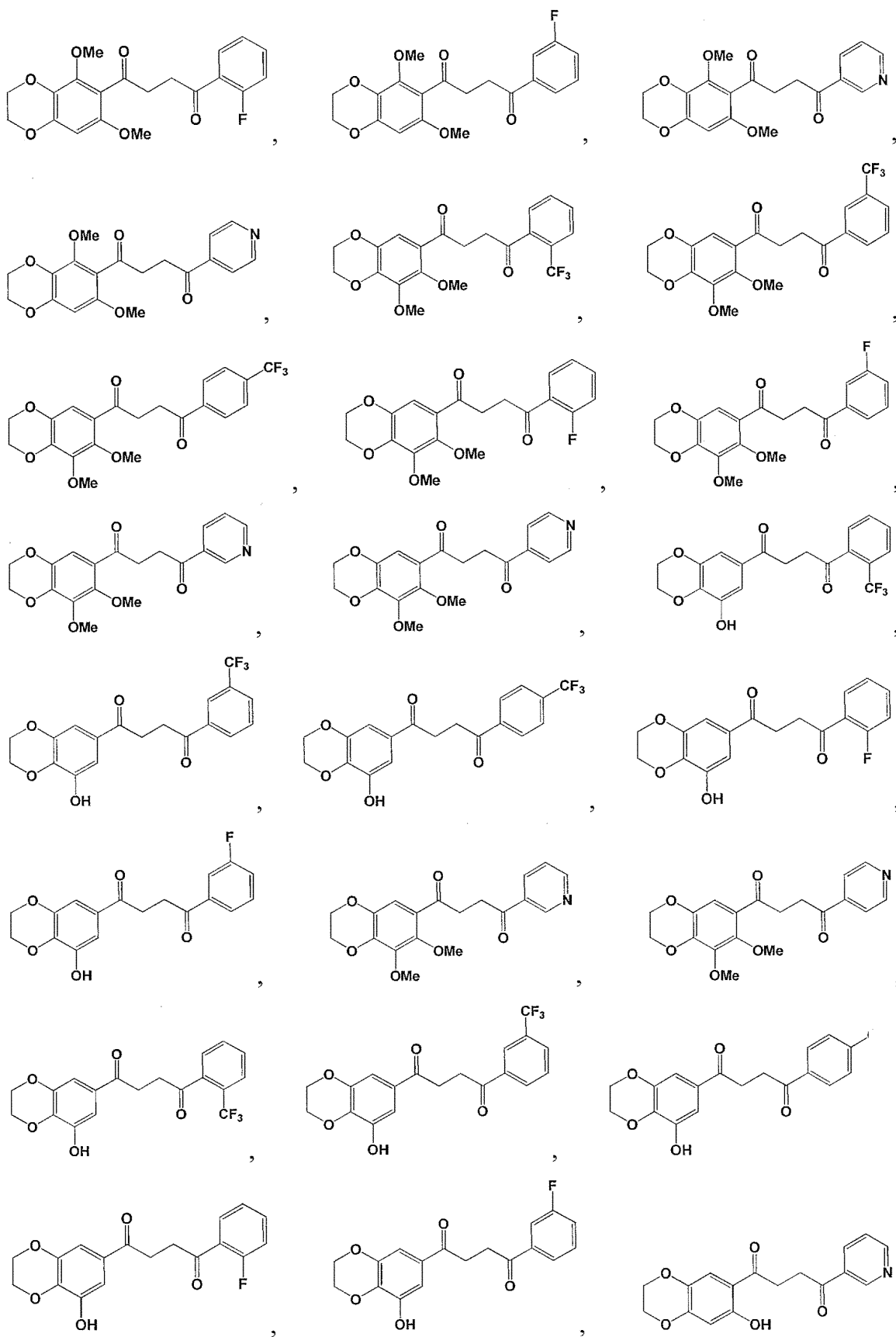
各JがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのJはCであり；

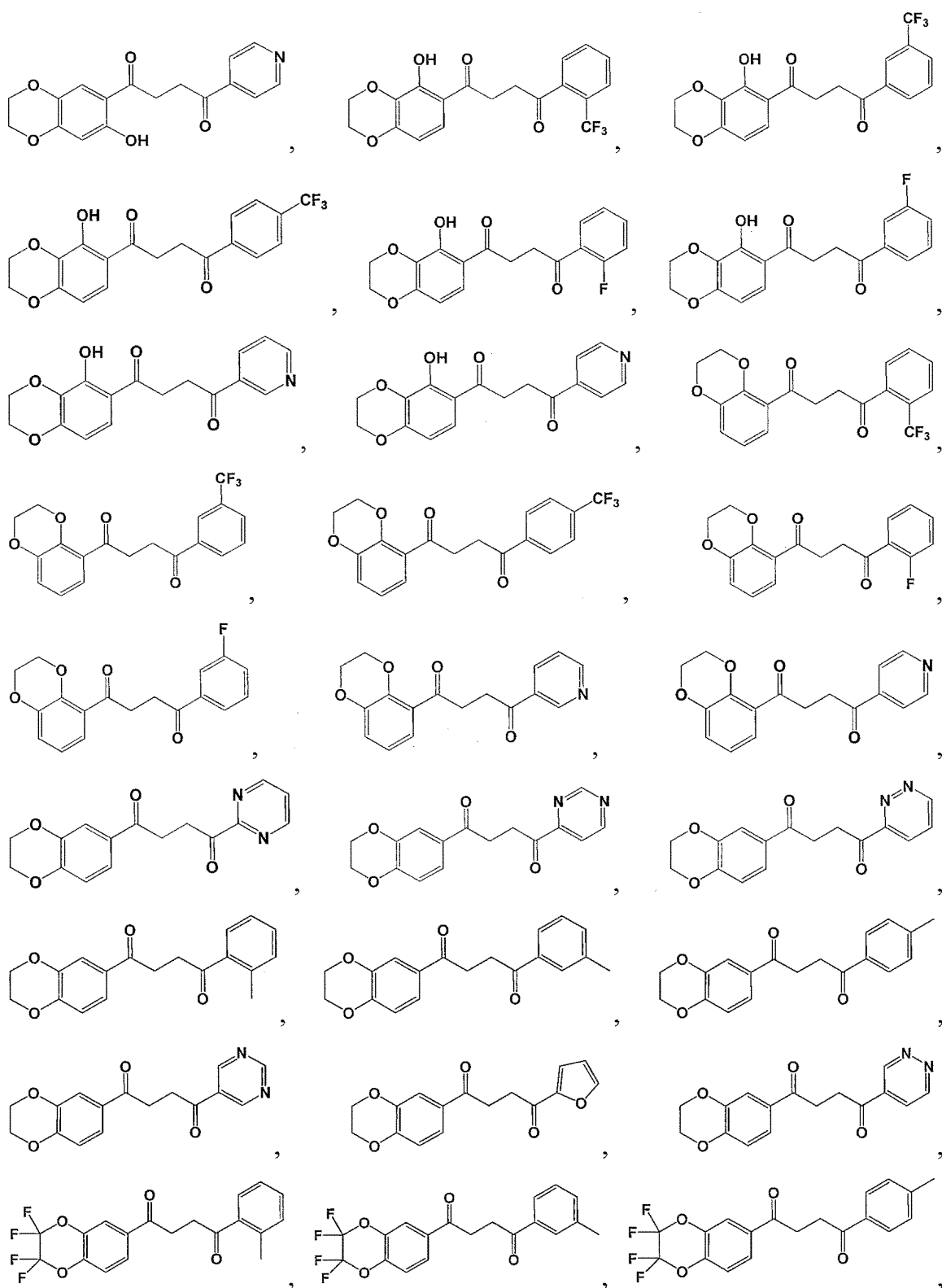
nが1～7の整数である。

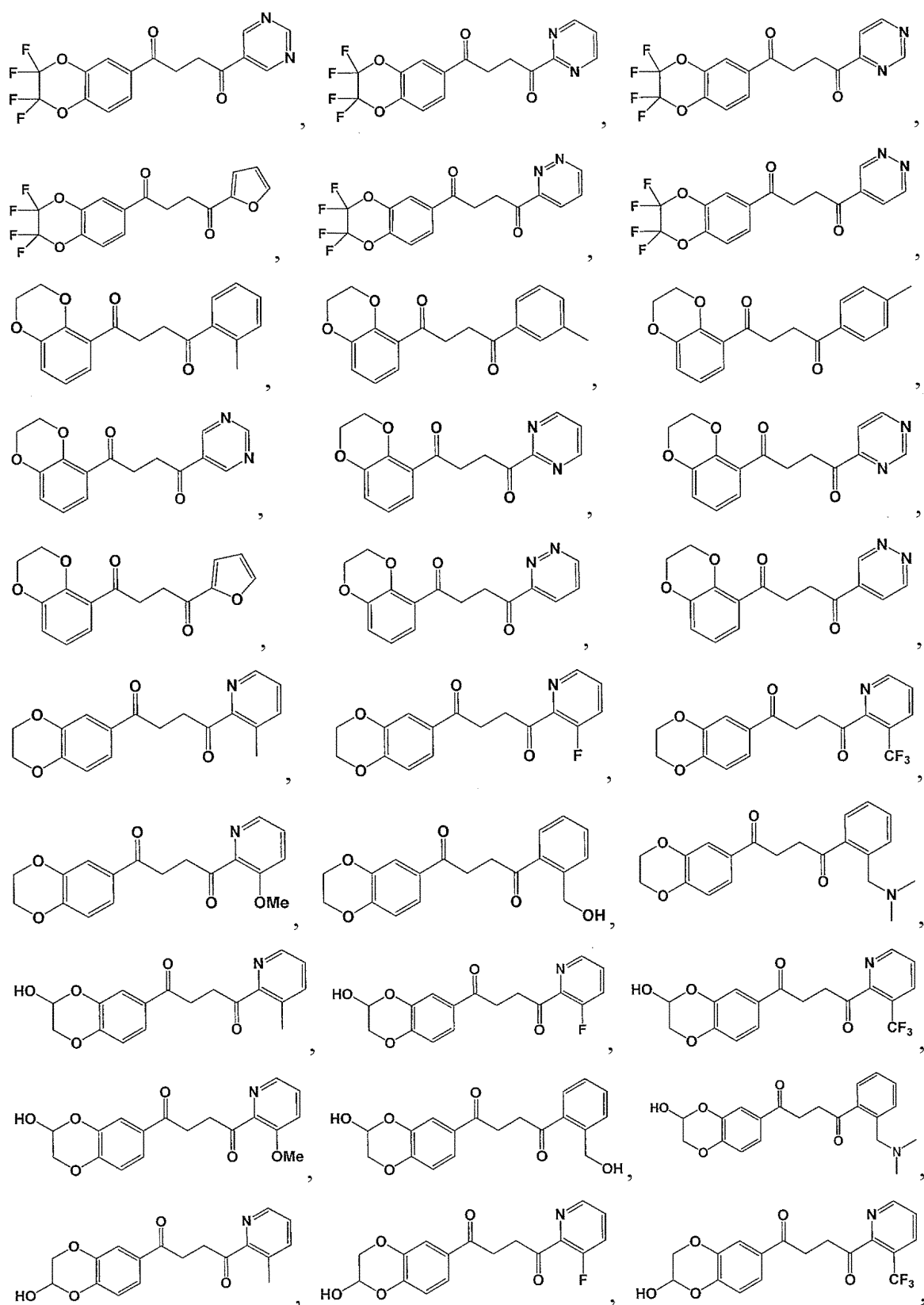
[本発明1027]

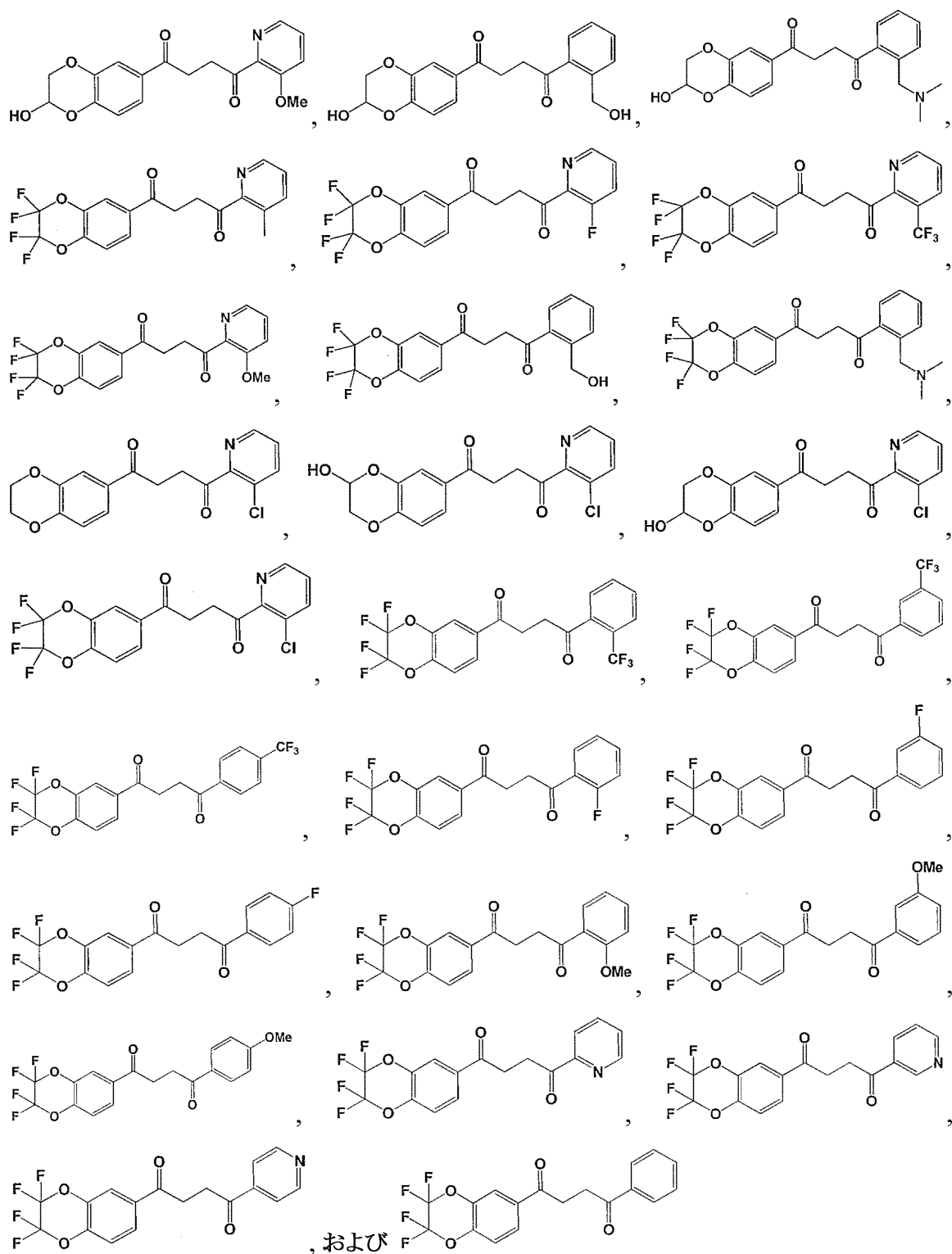
式Iaの化合物が下記式：







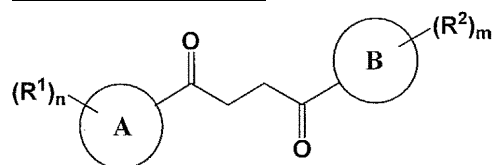




または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、本発明1026の化合物。

[本発明1028]

式Ibの化合物：

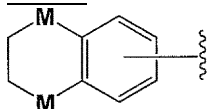


Ib

、または薬学的に許容されるその塩：

式中、

A環が



であり；

B環がフェニルおよび5～6員ヘテロアリールからなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^1 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、- $C_{1\sim3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^2 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- $C_{1\sim3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^3 が独立してH、非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、- $C_{1\sim3}$ ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各 R^{3b} が独立してHおよび非置換- $C_{1\sim3}$ アルキルからなる群より選択され；

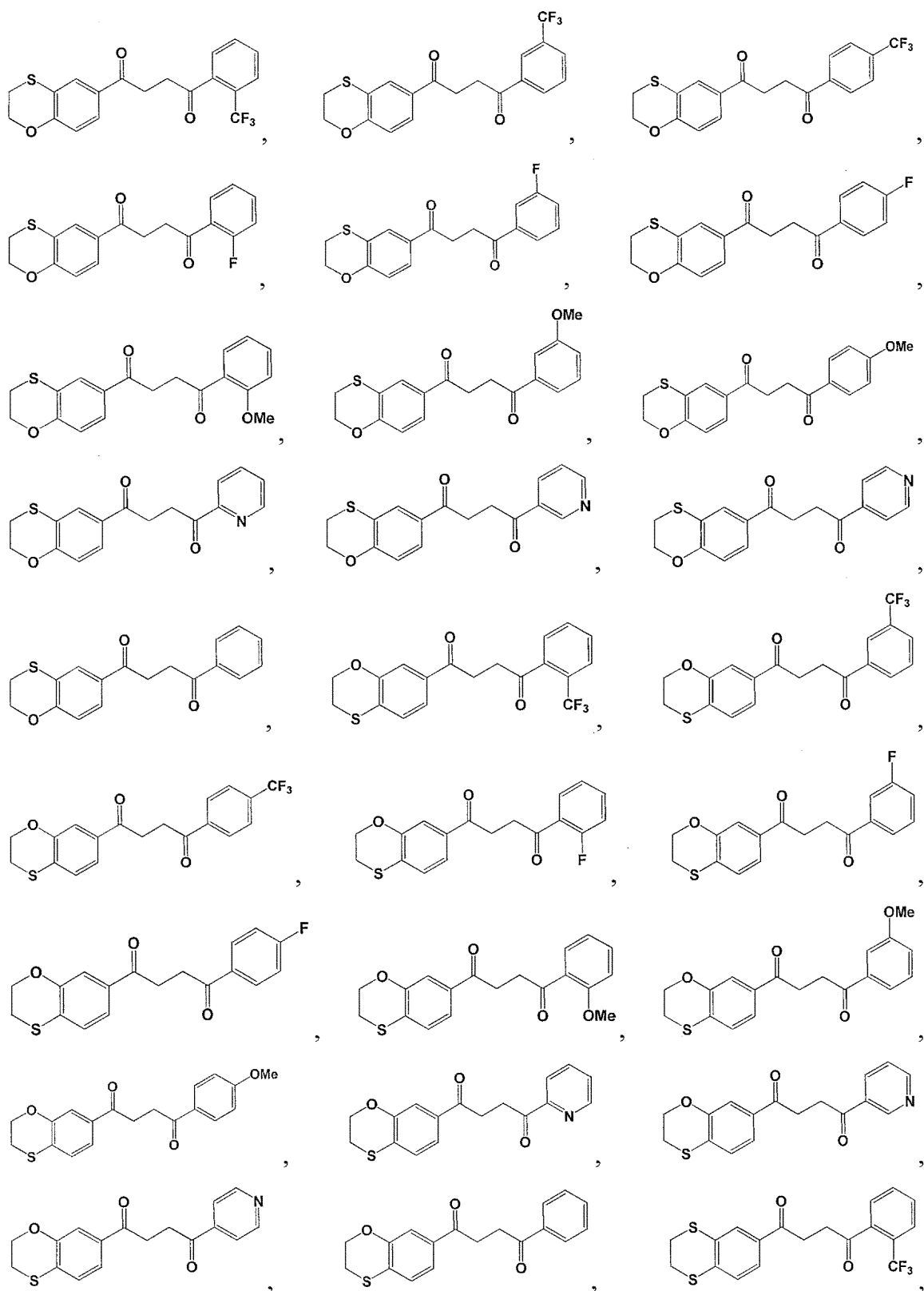
各Mが独立してN、C、S、およびOからなる群より選択され、ここで両方のMはOであることはなく、両方のMはCであることはなく；

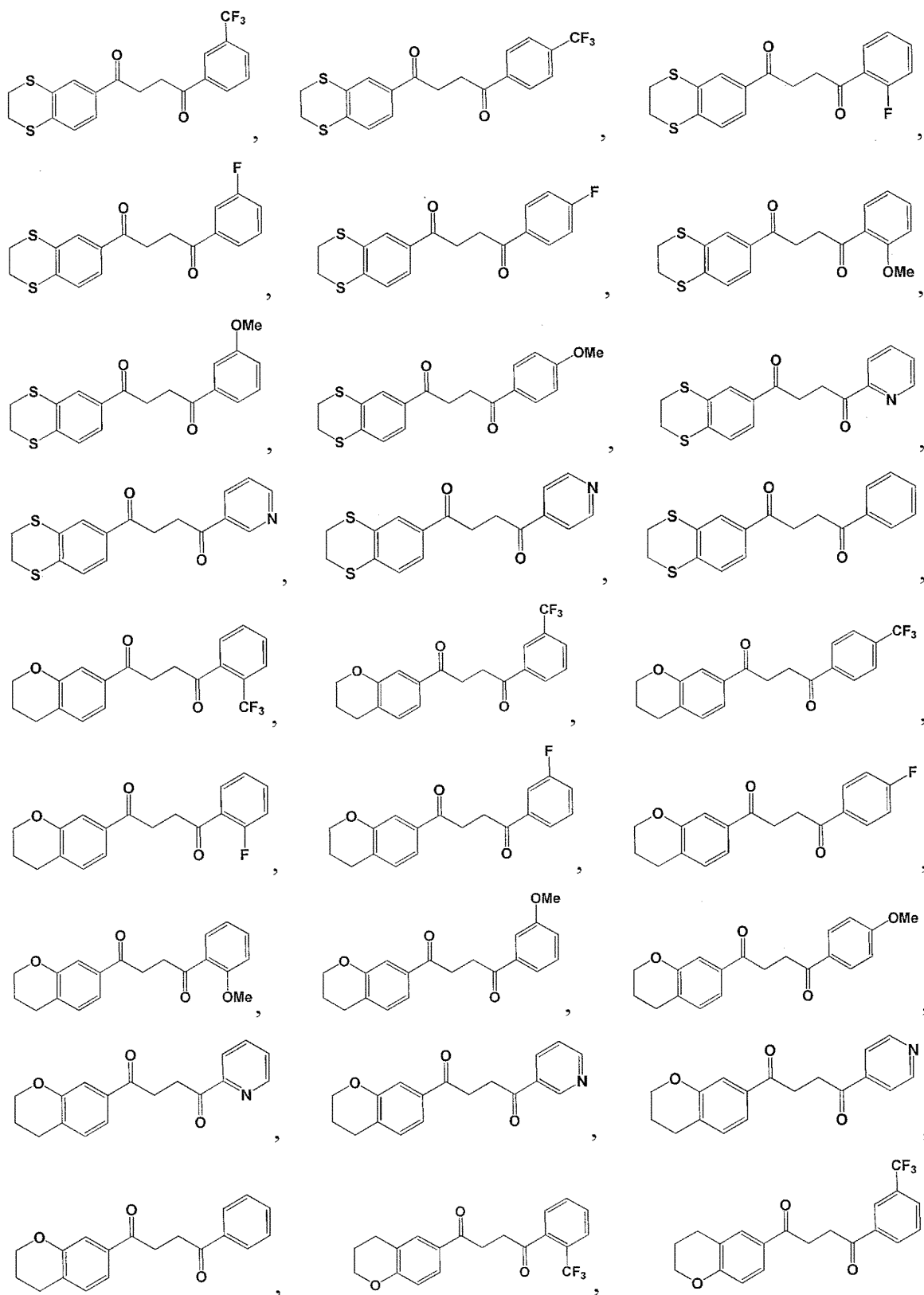
mが1～5の整数であり；

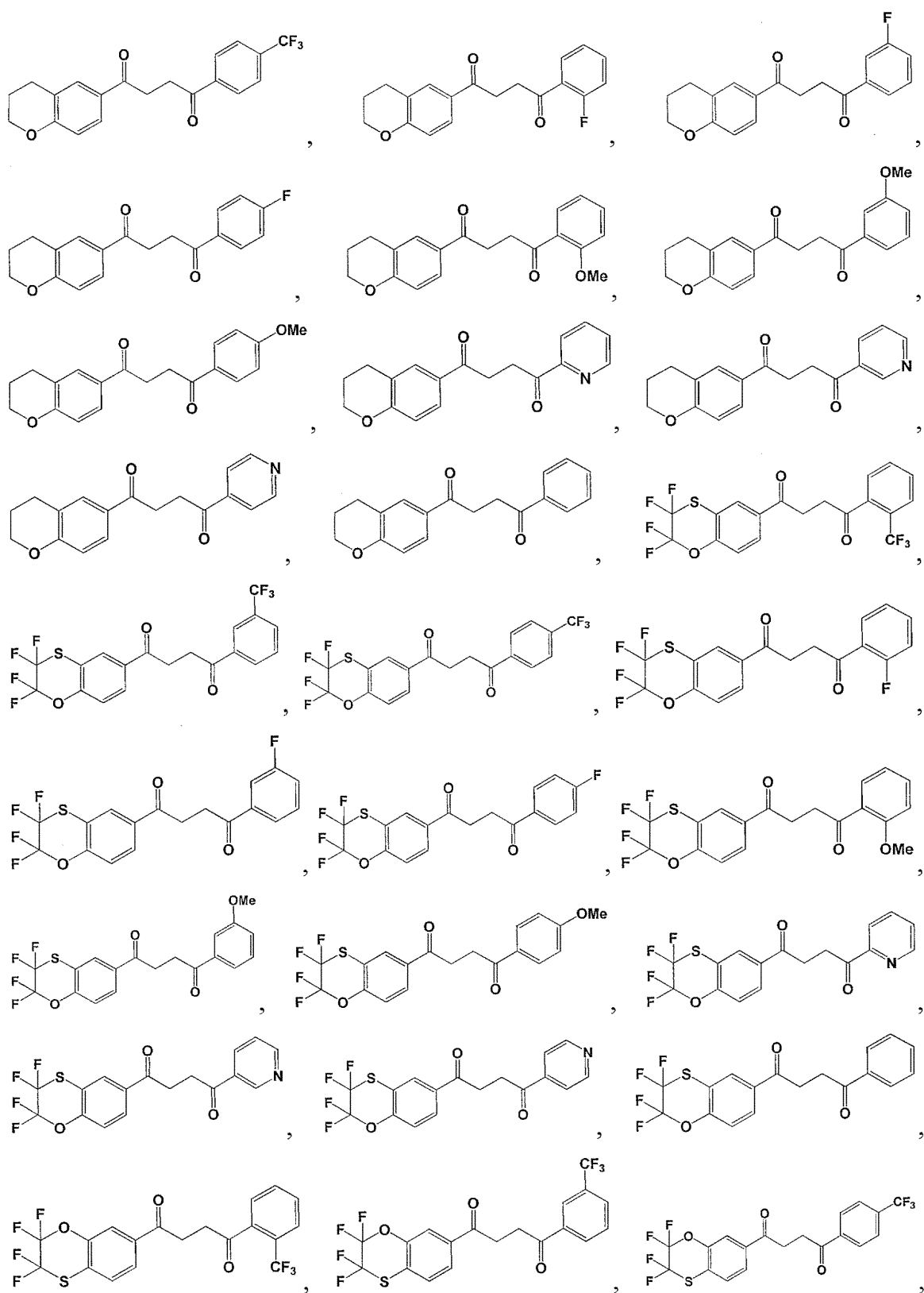
nが1～10の整数である。

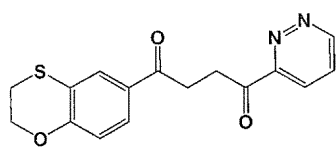
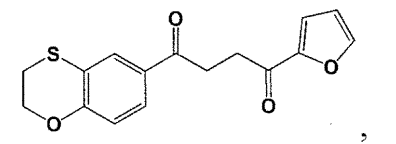
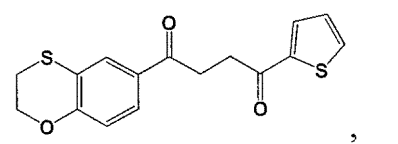
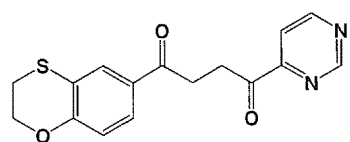
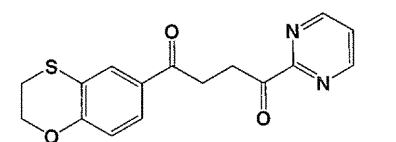
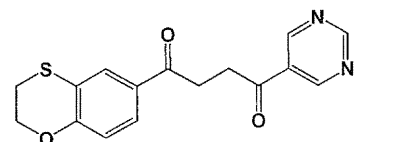
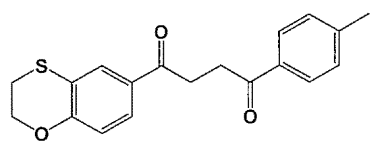
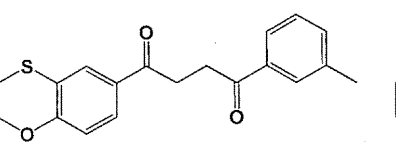
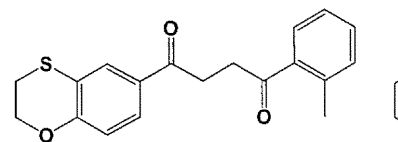
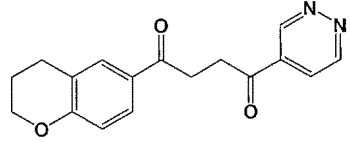
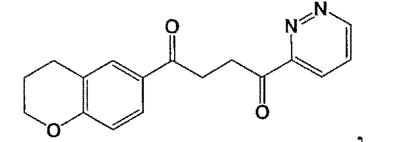
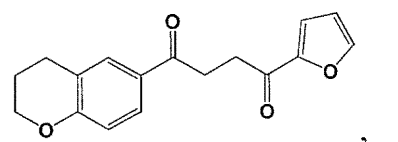
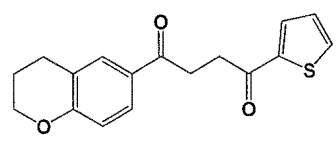
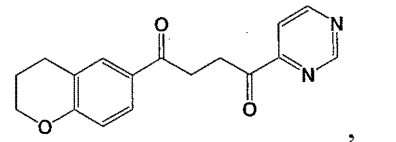
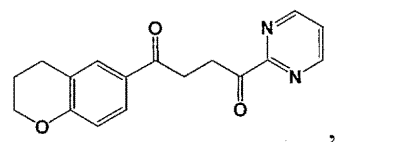
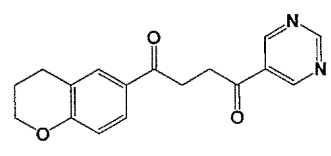
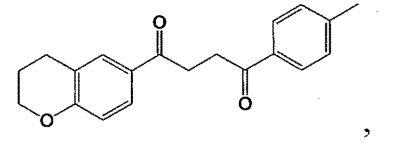
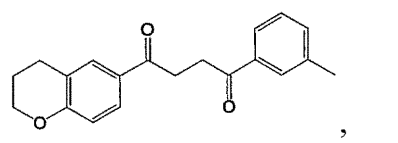
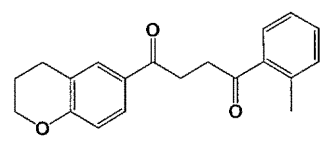
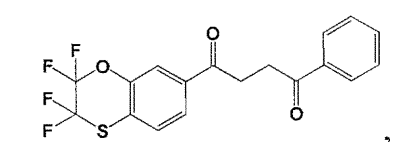
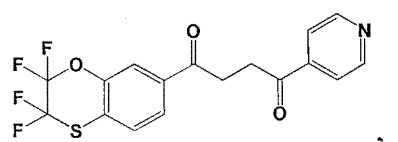
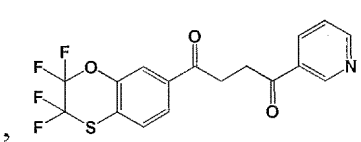
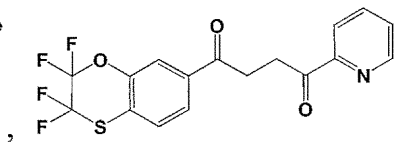
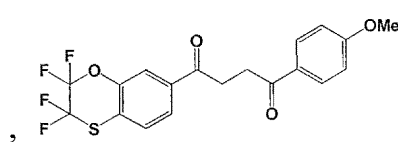
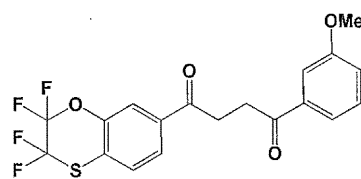
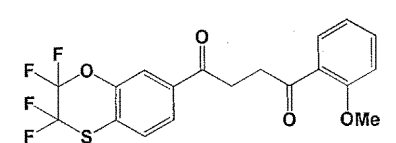
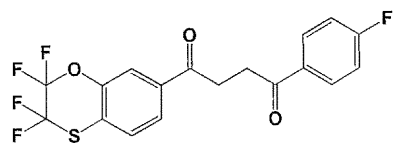
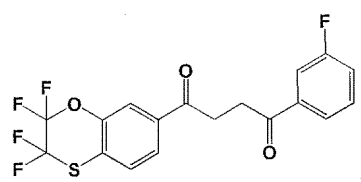
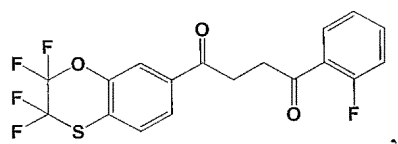
[本発明1029]

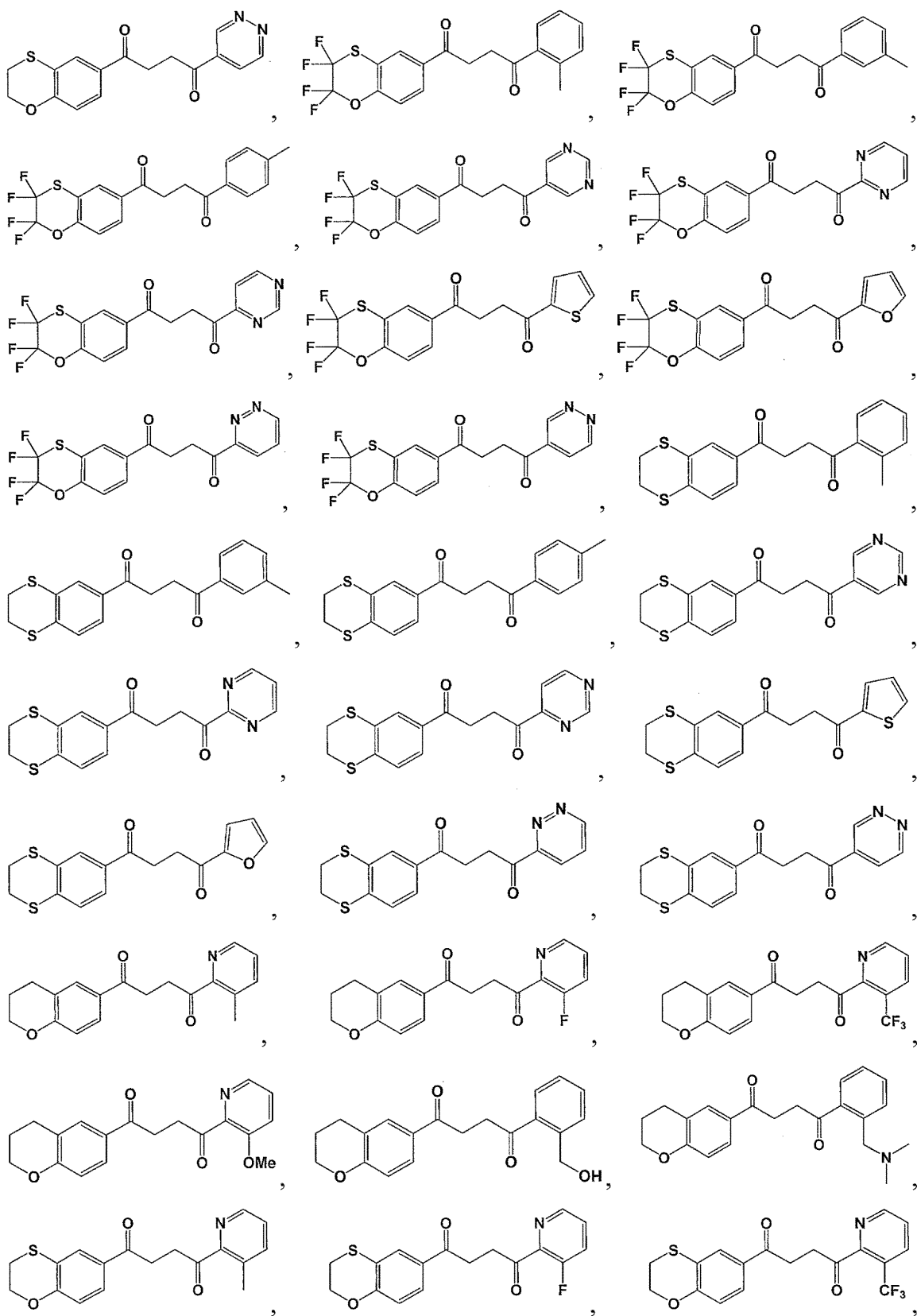
式Ibの化合物が下記式：

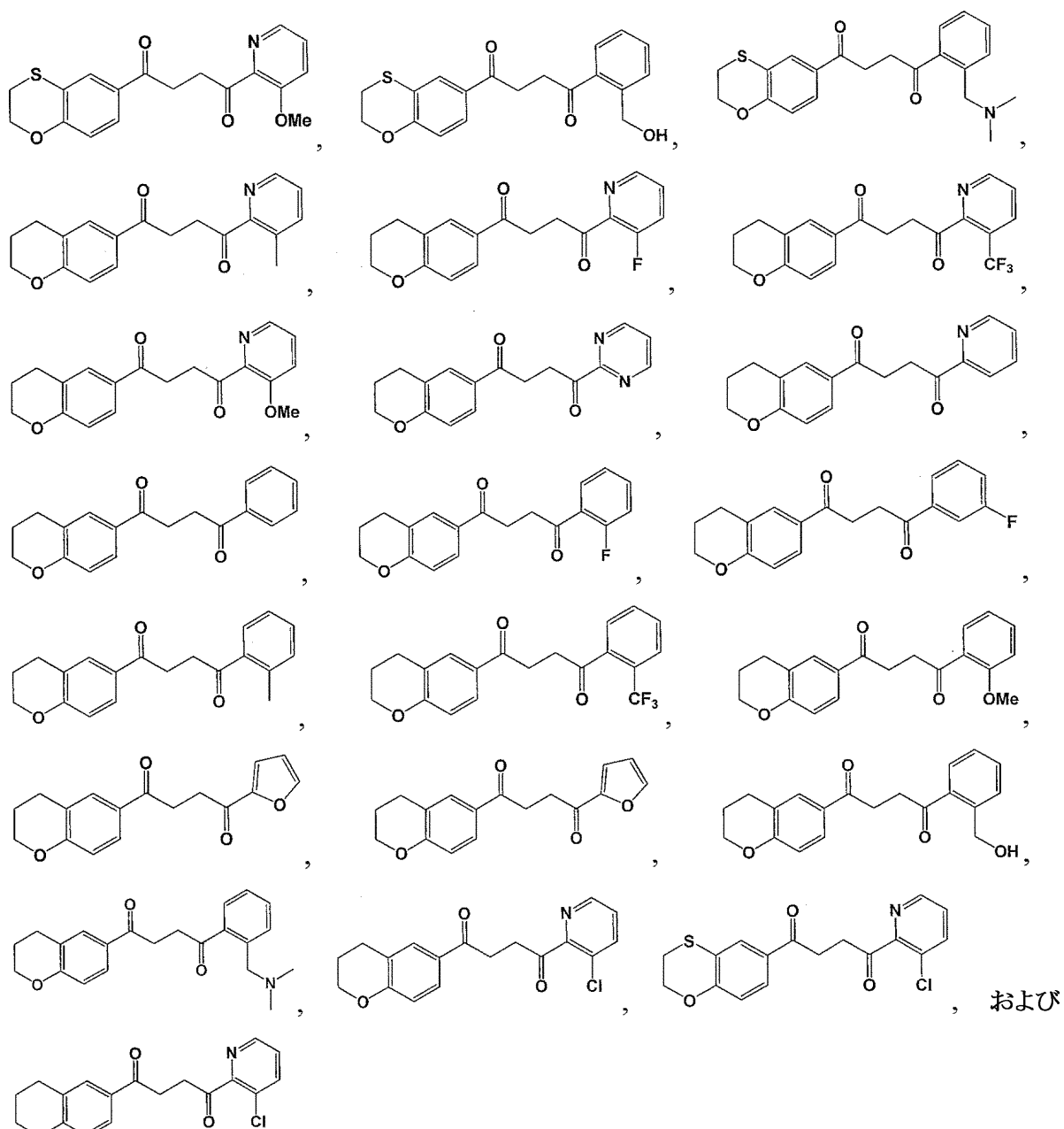








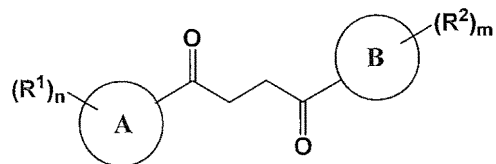




または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、本発明1028の化合物。

[本発明1030]

式Icの化合物：

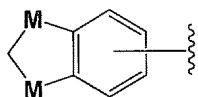


Ic

、または薬学的に許容されるその塩：

式中、

A環が



であり；

B環がフェニルおよび5～6員ヘテロアリールからなる群より選択され、ここで環上の炭素

原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^1 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、- $C_{1\sim3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^2 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- $C_{1\sim3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^3 が独立してH、非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、- $C_{1\sim3}$ ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各 R^{3b} が独立してHおよび非置換- $C_{1\sim3}$ アルキルからなる群より選択され；

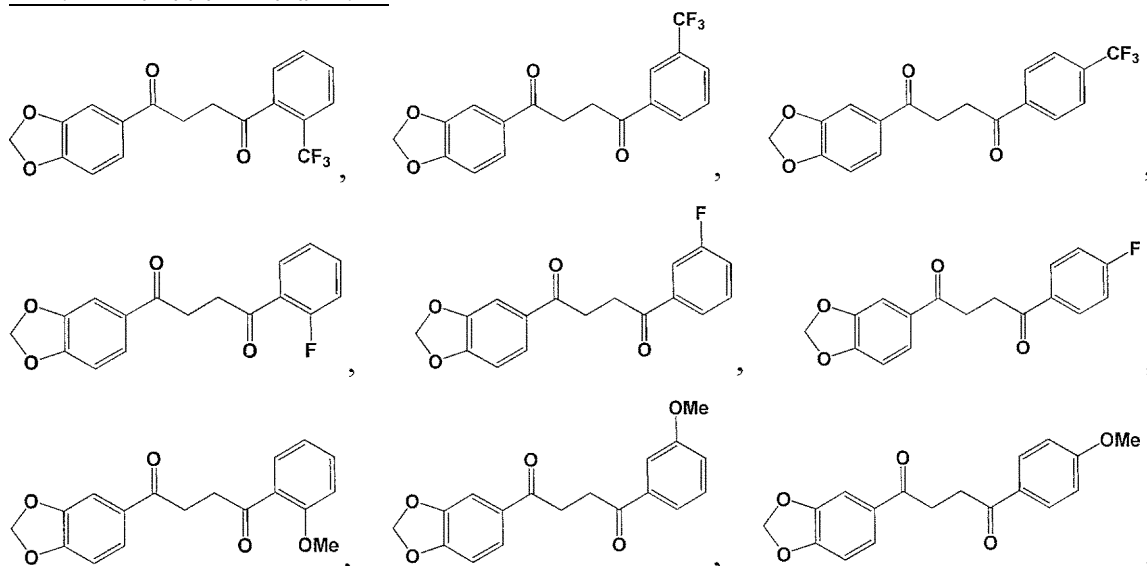
各Mが独立してN、C、S、およびOからなる群より選択され、ここで一方のMがCである場合、他方のMはN、S、およびOからなる群より選択され；

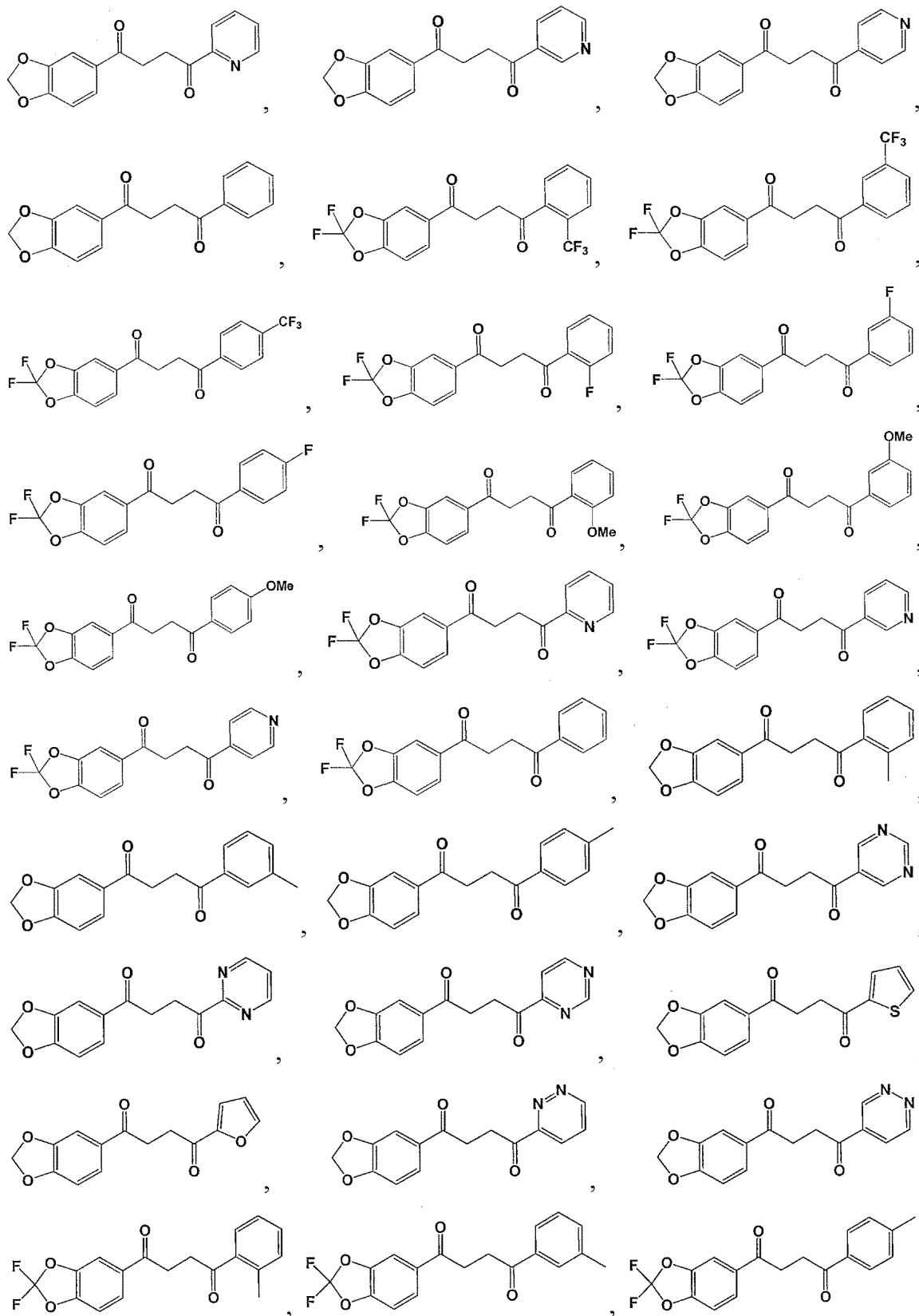
mが1～5の整数であり；

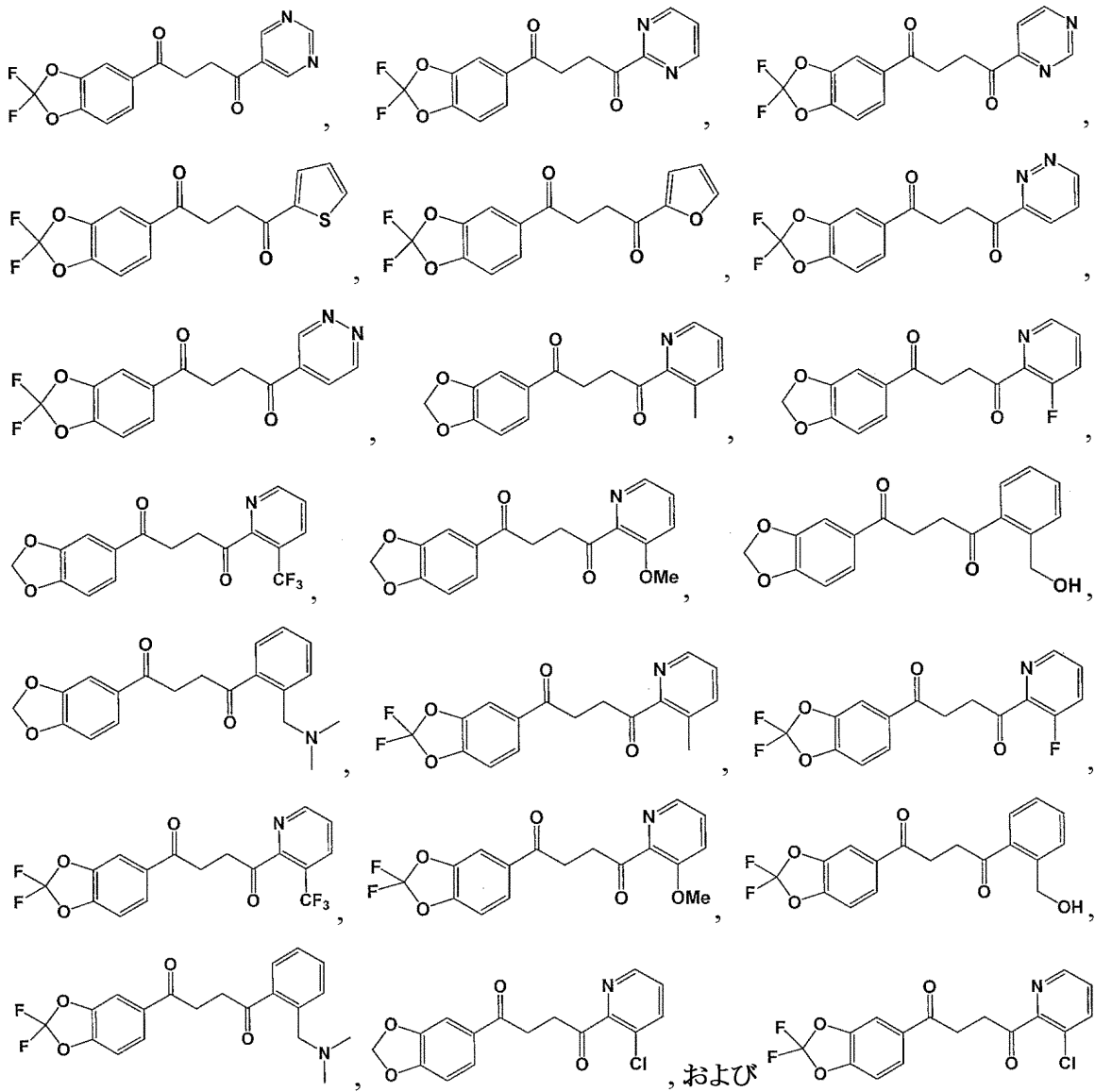
nが1～10の整数である。

[本発明1031]

式Icの化合物が下記式：



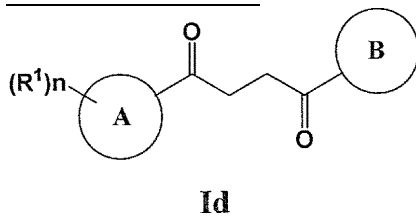




または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、本発明1030の化合物。

[本発明1032]

式Idの化合物：

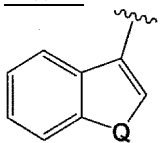


Id

、または薬学的に許容されるその塩：

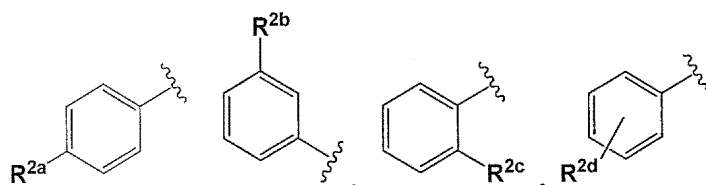
式中、

A環が



であり；

B環が



、および5～6員ヘテロアリール R^{2e} からなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^1 が出現するごとに独立してH、非置換- C_{1-6} アルキル、- C_{1-3} ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{2a} がH、非置換- C_{1-6} アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- C_{1-3} ハロアルキル、Cl、Br、I、-OR^{3a}、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{2b} がH、非置換- C_{2-6} アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- C_{1-3} ハロアルキル、F、I、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{2c} がH、非置換- C_{1-6} アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- C_{1-3} ハロアルキル、F、Br、I、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{2d} が2～5個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- C_{1-6} アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- C_{1-3} ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{2e} が1～3個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- C_{1-6} アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- C_{1-3} ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^3 が独立してH、非置換- C_{1-6} アルキル、- C_{1-3} ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各 R^{3a} が独立してH、非置換- C_{2-6} アルキル、- C_{1-3} ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

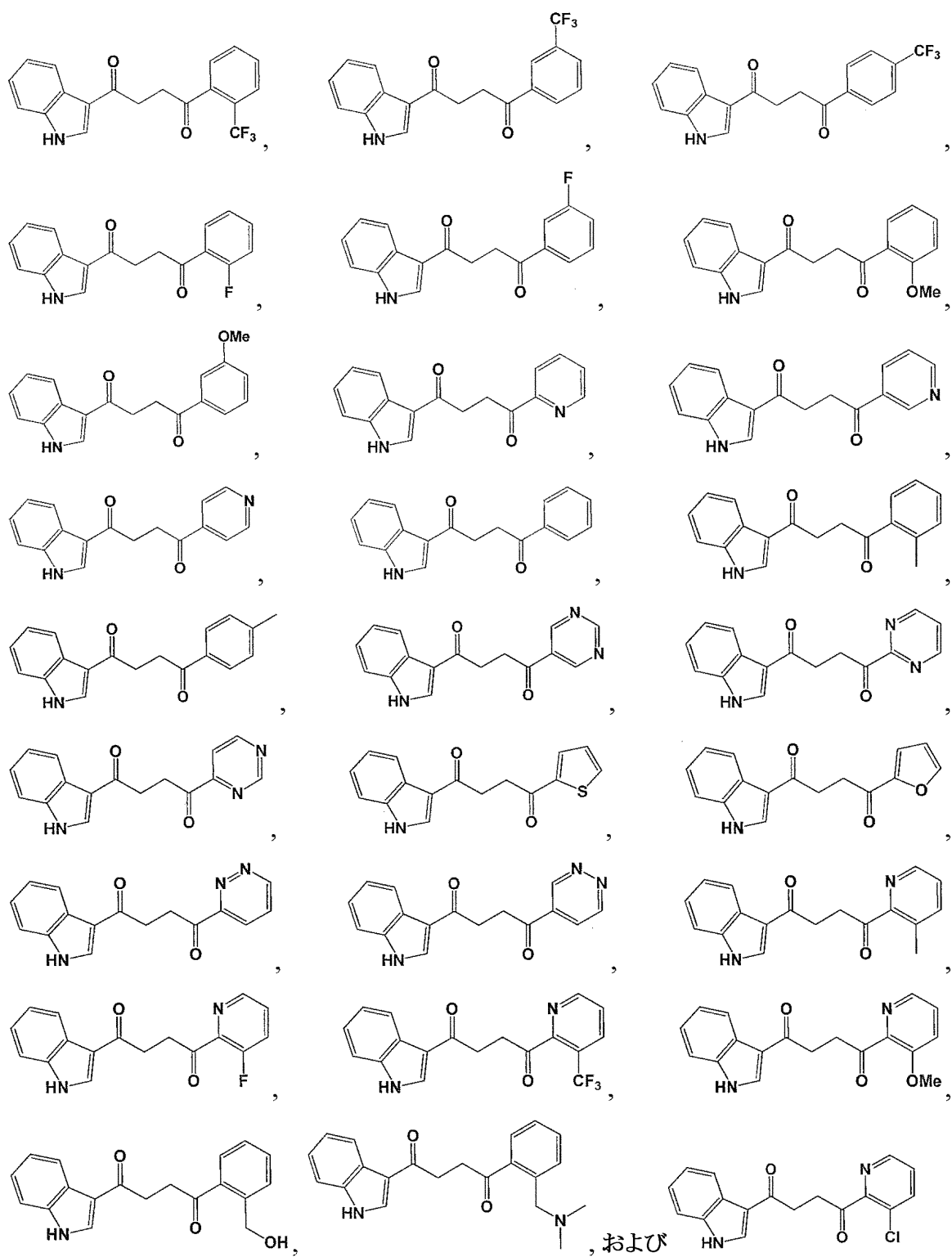
各 R^{3b} が独立してHおよび非置換- C_{1-3} アルキルからなる群より選択され；

QがSまたはNHであり；

nが1～5の整数である。

[本発明1033]

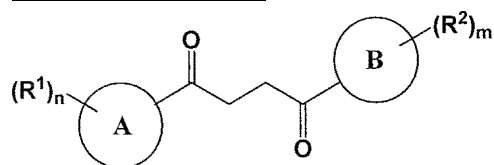
式Idの化合物が下記式：



または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、本発明1032の化合物。

[本発明1034]

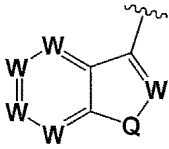
式Ieの化合物：



Ie

、または薬学的に許容されるその塩：

式中、
A環が



であり；

B環がフェニルおよび5～6員ヘテロアリールからなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^1 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、- $C_{1\sim3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^2 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- $C_{1\sim3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^3 が独立してH、非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、- $C_{1\sim3}$ ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各 R^{3b} が独立してHおよび非置換- $C_{1\sim3}$ アルキルからなる群より選択され；

各WがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのWはNであり；

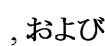
QがSまたはNHであり；

mが1～5の整数であり；

nが1～4の整数である。

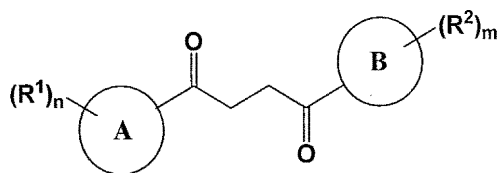
[本発明1035]

式Ieの化合物が下記式：



[本 発 明 1036]

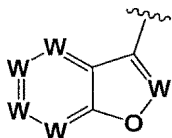
式 1 f の化合物：

**If**

、または薬学的に許容されるその塩：

式中、

A環が



であり；

B環がフェニルおよび5～6員ヘテロアリールからなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各R¹が出現するごとに独立してH、非置換-C₁～₆アルキル、-C₁～₃ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各R²が出現するごとに独立してH、非置換-C₁～₆アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、-C₁～₃ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各R³が独立してH、非置換-C₁～₆アルキル、-C₁～₃ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各R^{3b}が独立してHおよび非置換-C₁～₃アルキルからなる群より選択され；

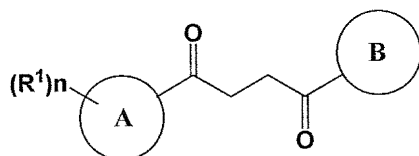
各WがNまたはCであり；

mが1～5の整数であり；

nが1～5の整数である。

[本発明1037]

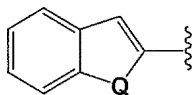
式Igの化合物：

**Ig**

、または薬学的に許容されるその塩：

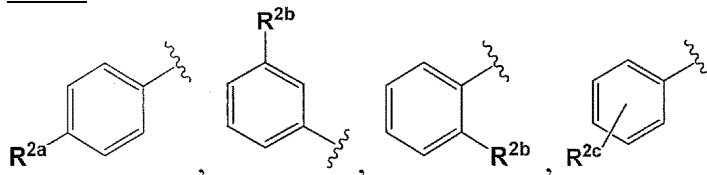
式中、

A環が



であり；

B環が



、および5～6員ヘテロアリールR^{2d}からなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各R¹が出現するごとに独立してH、非置換-C₁～₆アルキル、-C₁～₃ハロアルキル、ハロゲ

ン化物、 $-OR^3$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{2a} が非置換 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{3b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、F、I、 $-OR^3$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{2b} が非置換 $-C_{2-6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{3b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^3$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{2c} が2～5個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{3b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^3$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{2d} が1～3個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{3b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^3$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^3 が独立してH、非置換 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

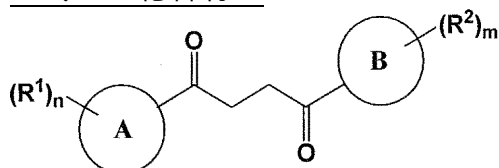
各 R^{3b} が独立してHおよび非置換 $-C_{1-3}$ アルキルからなる群より選択され；

QがO、S、およびNHからなる群より選択され；

nが1～5の整数である。

[本発明1038]

式Ihの化合物：

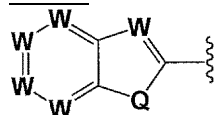


Ih

、または薬学的に許容されるその塩：

式中、

A環が



であり；

B環がフェニルおよび5～6員ヘテロアリールからなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^1 が出現するごとに独立してH、非置換 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^3$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^2 が出現するごとに独立してH、非置換 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{3b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^3$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^3 が独立してH、非置換 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{3b} が独立してHおよび非置換 $-C_{1-3}$ アルキルからなる群より選択され；

各WがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのWはNであり；

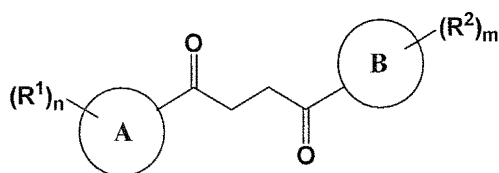
QがO、S、およびNHからなる群より選択され；

mが1～5の整数であり；

nが1～4の整数である。

[本発明1039]

式Iiの化合物：

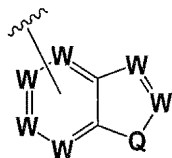


Ii

、または薬学的に許容されるその塩：

式中、

A環が



であり、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

B環がフェニルおよび5～6員ヘテロアリールからなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^1 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、- $C_{1\sim3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^2 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{3b})₂、- $C_{1\sim3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^3 が独立してH、非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、- $C_{1\sim3}$ ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各 R^{3b} が独立してHおよび非置換- $C_{1\sim3}$ アルキルからなる群より選択され；

各WがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのWはCであり；

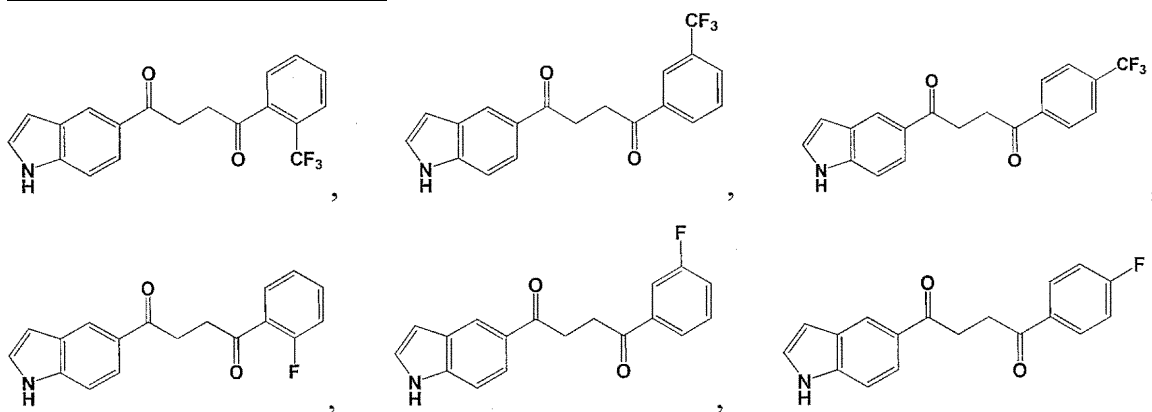
QがO、S、およびNからなる群より選択され；

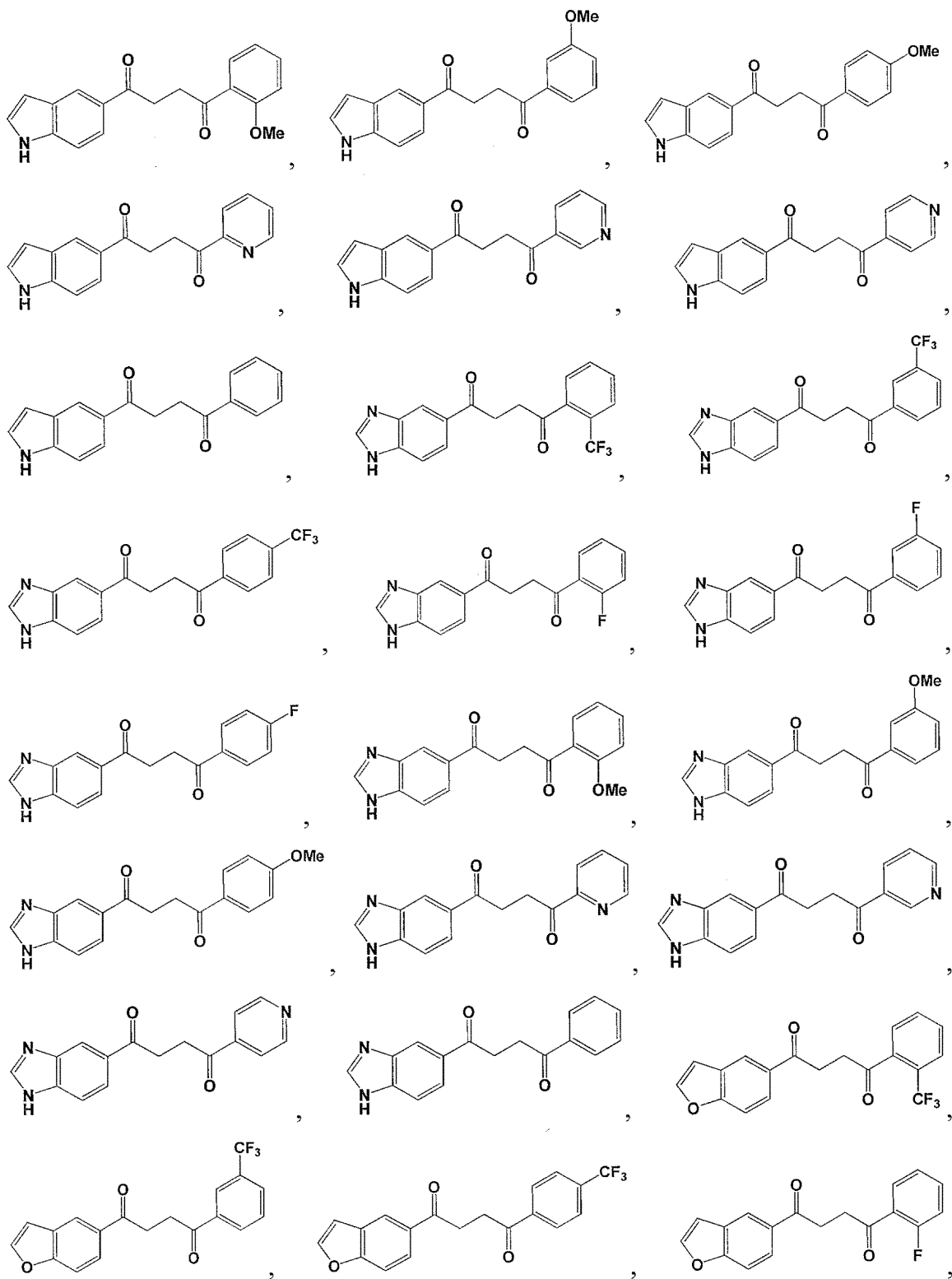
mが1～5の整数であり；

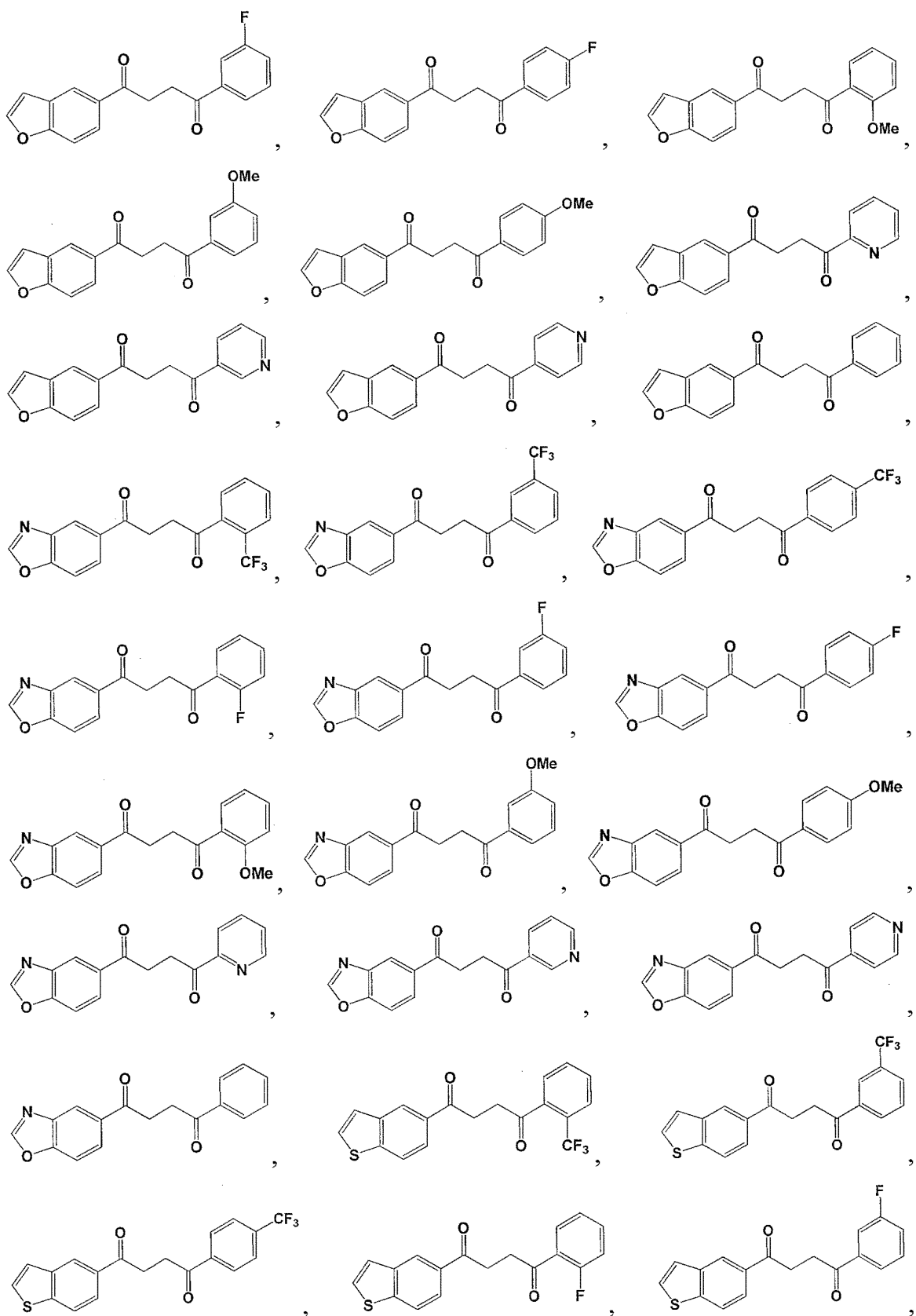
nが1～7の整数である。

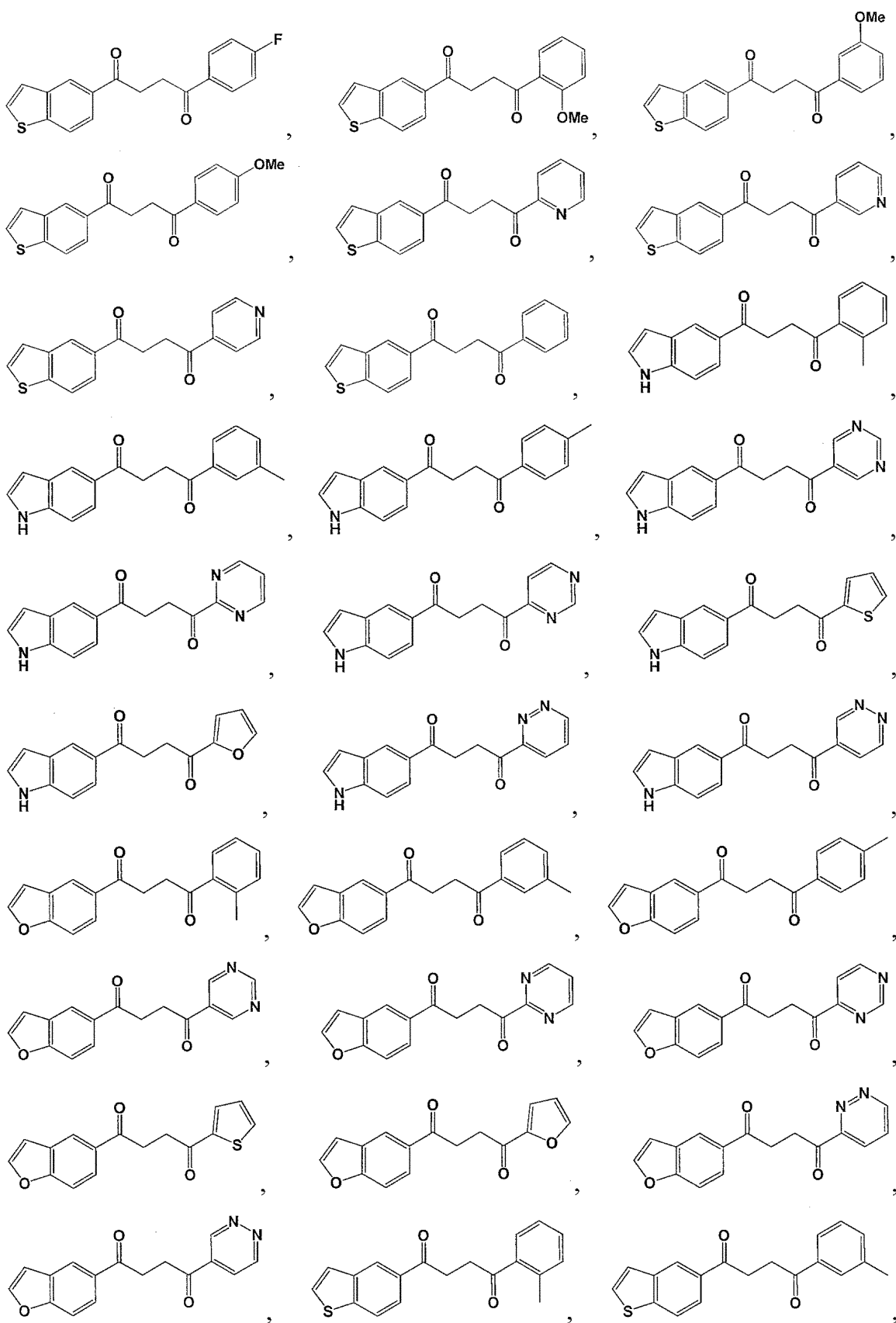
[本発明1040]

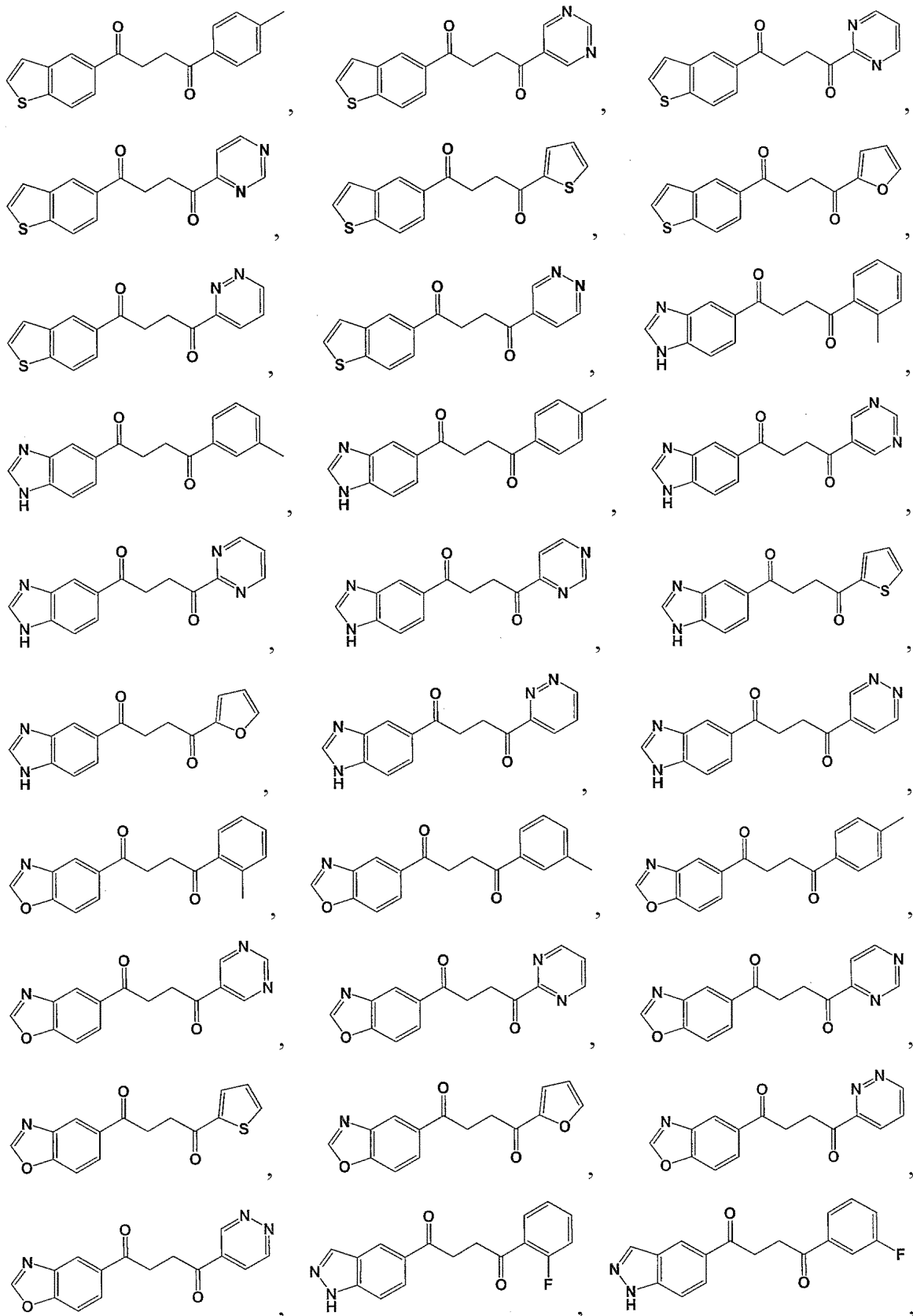
式Iiの化合物が下記式：

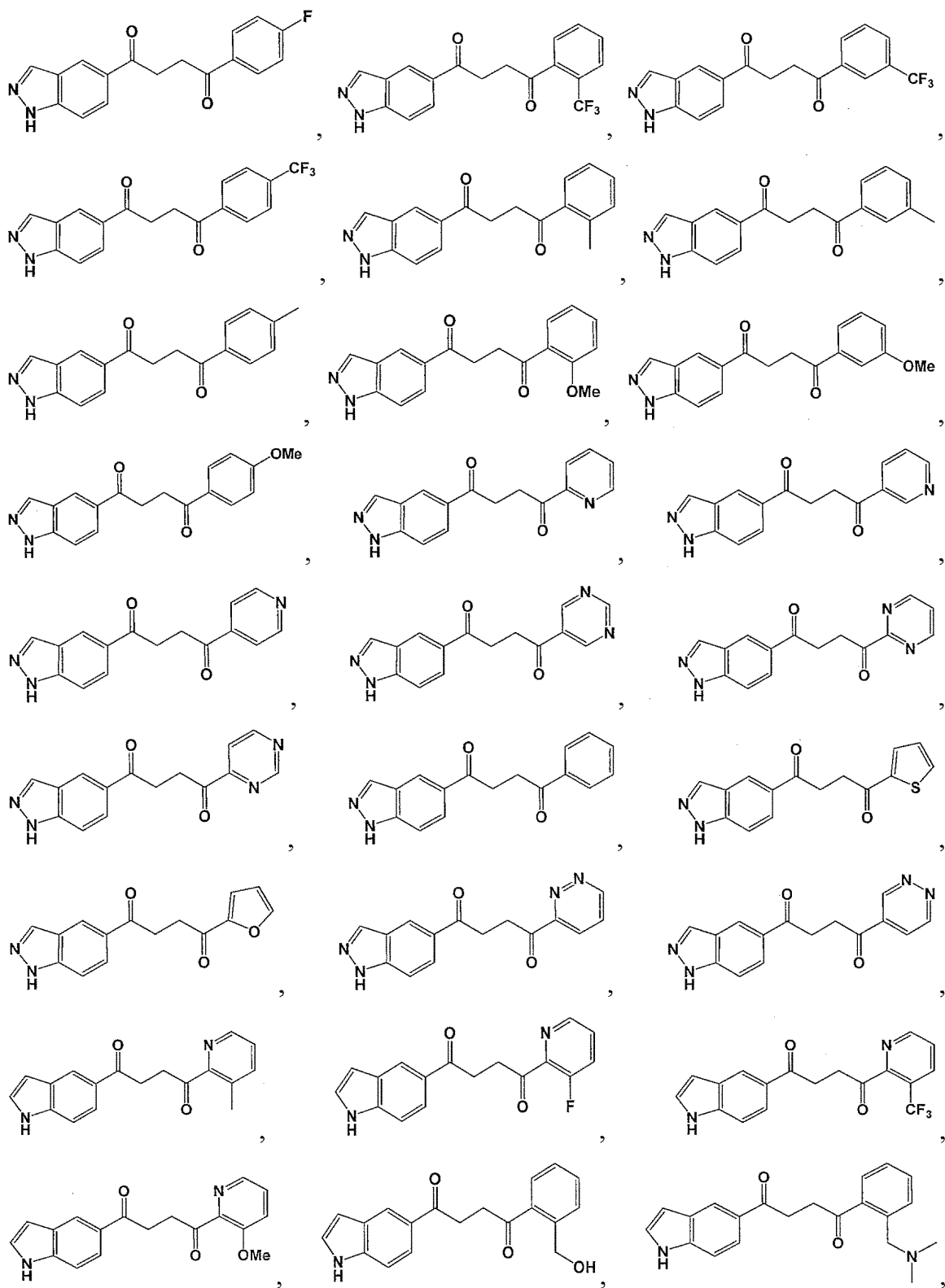


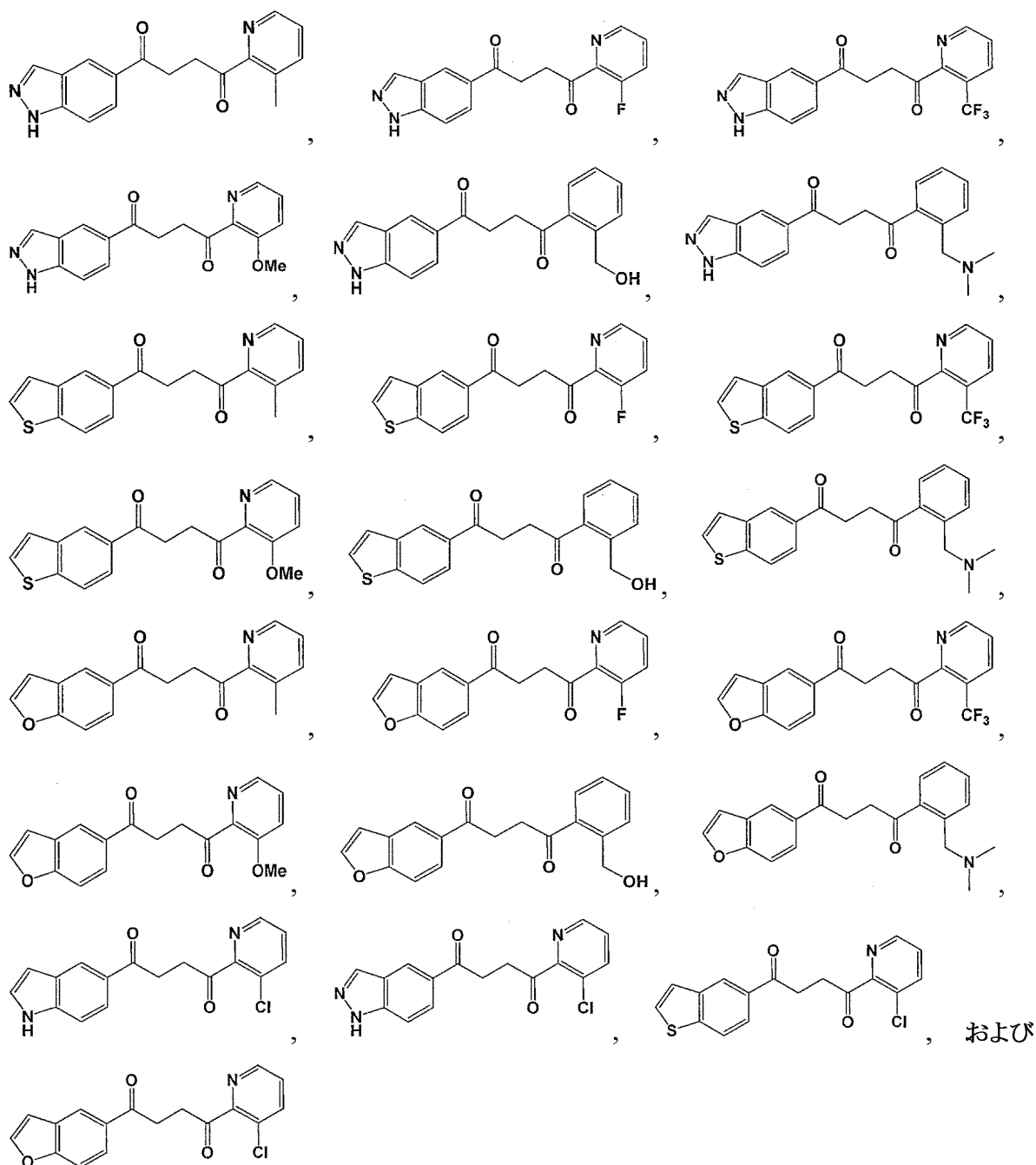








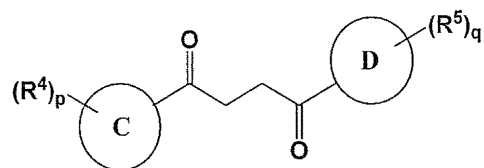




または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、本発明1039の化合物。

[本発明1041]

式IIの化合物：



II

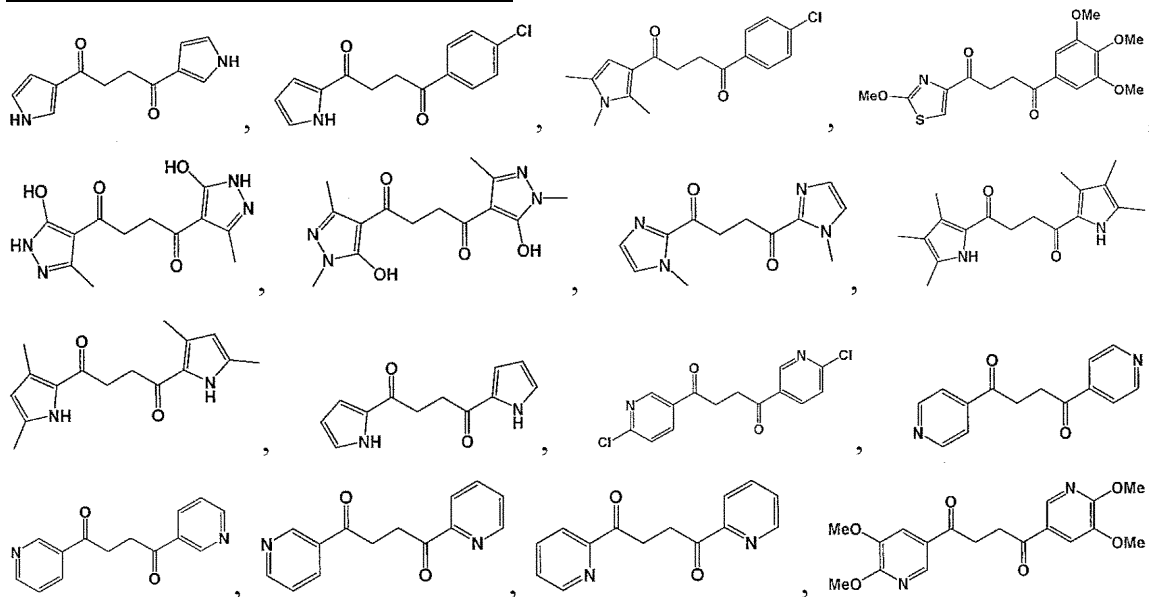
、または薬学的に許容されるその塩：

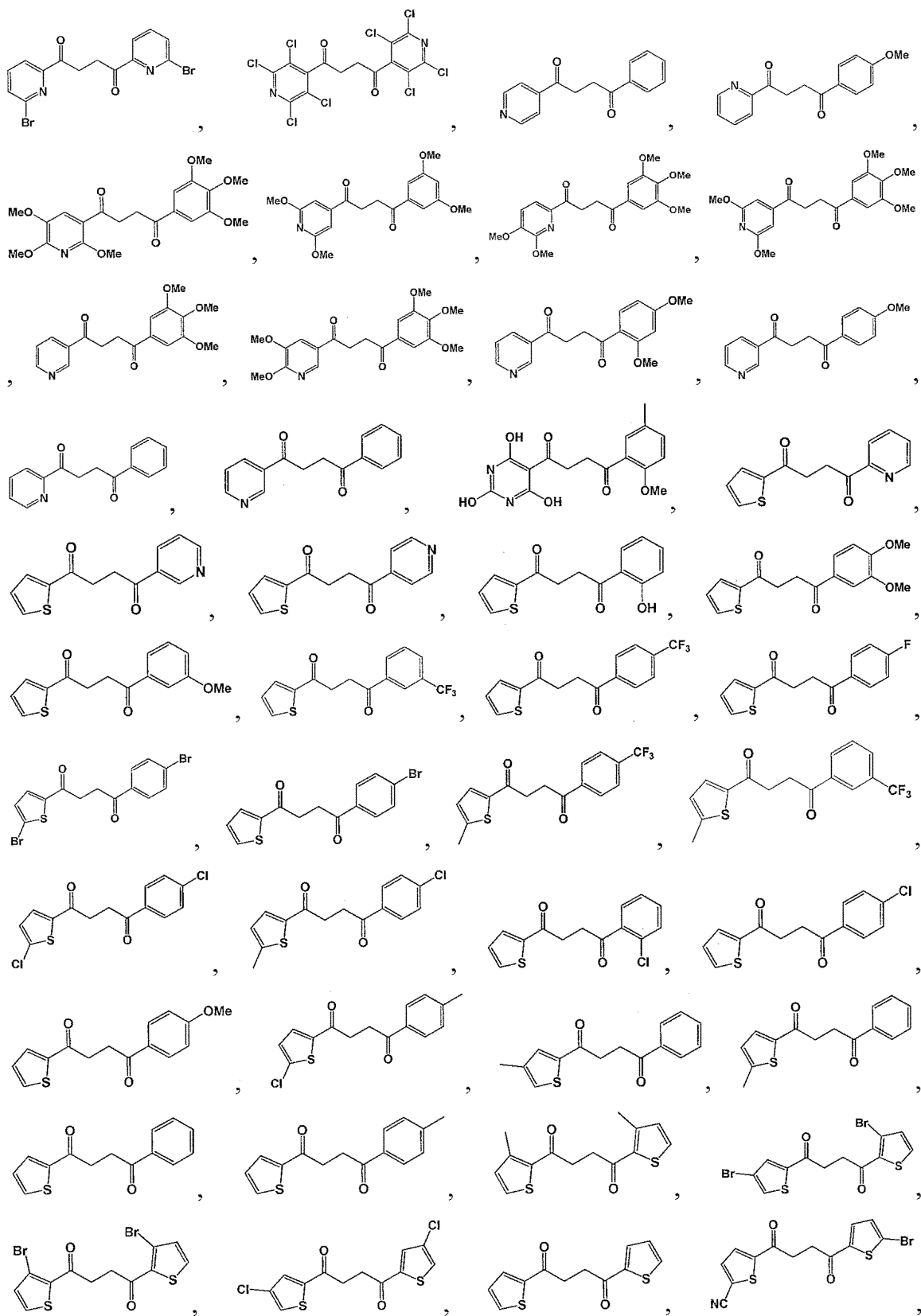
式中、

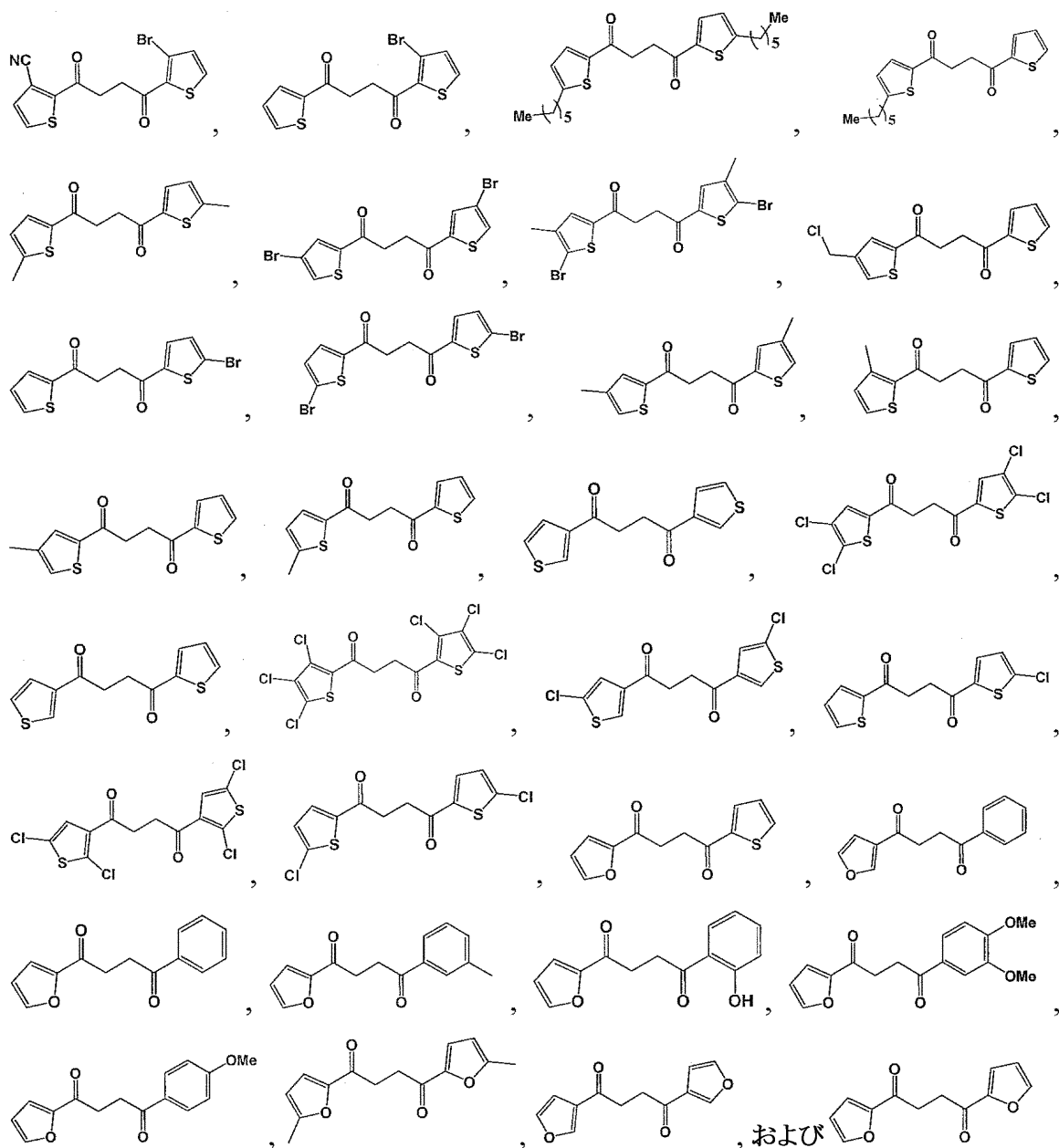
C環が5～6員ヘテロアリールであり、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

D環がフェニルおよび5～6員ヘテロアリールからなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

ただし、式IIの化合物は、下記式：





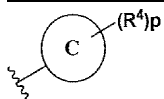


からなる群より選択される化合物ではない。

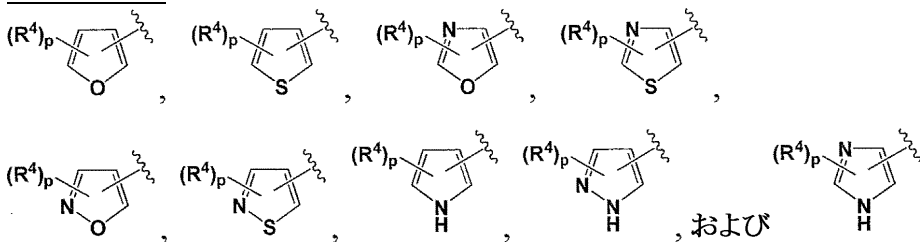
[本発明1042]

C環が、N、O、およびSからなる群より選択される1～3個のヘテロ原子を含有する5員ヘテロアリール環である、本発明1041の化合物。

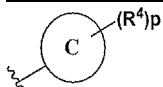
[本発明1043]



が下記式：



からなる群より選択され、pが1または2である、本発明1041～1042のいずれかの化合物。

[本発明1044]

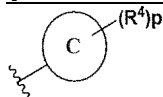
が



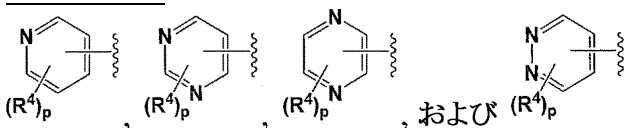
である、本発明1041～1043のいずれかの化合物。

[本発明1045]

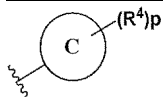
C環が、1～2個の窒素を含有する6員ヘテロアリール環である、本発明1041～1044のいずれかの化合物。

[本発明1046]

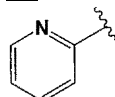
が下記式：



からなる群より選択され；pが1または2である、本発明1041～1045のいずれかの化合物。

[本発明1047]

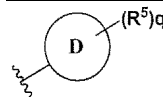
が



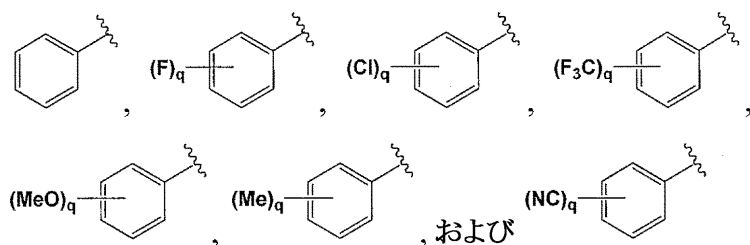
である、本発明1041～1046のいずれかの化合物。

[本発明1048] R^4 がH、F、Cl、Me、OMe、OH、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；pが1または2である、本発明1041～1047のいずれかの化合物。[本発明1049] R^4 がHである、本発明1041～1048のいずれかの化合物。[本発明1050] R^4 がFであり；pが1である、本発明1041～1049のいずれかの化合物。[本発明1051]

D環がフェニルである、本発明1041～1050のいずれかの化合物。

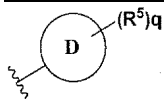
[本発明1052]

が下記式：

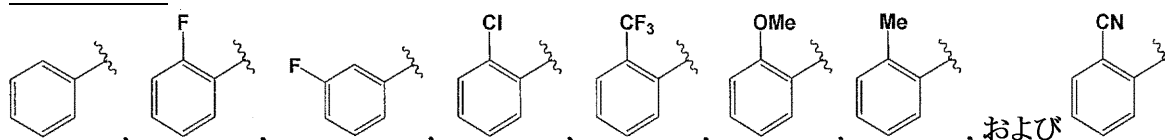


からなる群より選択され; qが1または2である、本発明1041～1051のいずれかの化合物。

[本発明1053]



が下記式：

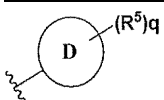


からなる群より選択される、本発明1041～1052のいずれかの化合物。

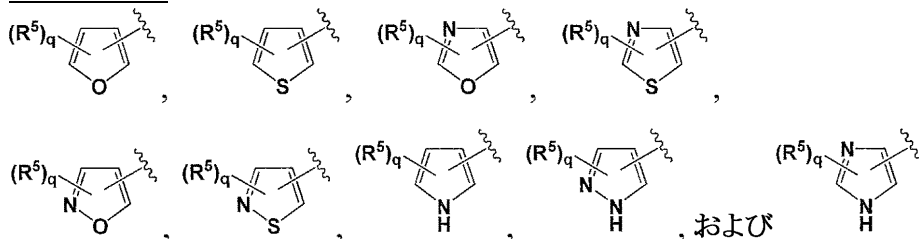
[本発明1054]

D環が、N、O、およびSからなる群より選択される1～3個のヘテロ原子を含有する5員ヘテロアリールである、本発明1041～1053のいずれかの化合物。

[本発明1055]



が下記式：



からなる群より選択され; qが1または2である、本発明1041～1054のいずれかの化合物。

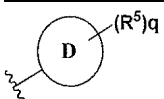
[本発明1056]

R⁵がHである、本発明1041～1055のいずれかの化合物。

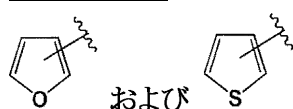
[本発明1057]

R⁵がFであり; qが1である、本発明1041～1056のいずれかの化合物。

[本発明1058]



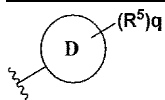
が下記式：



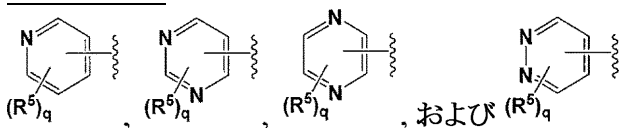
からなる群より選択される、本発明1041～1057のいずれかの化合物。

[本発明1059]

B環が、1～2個の窒素原子を含有する6員ヘテロアリールである、本発明1041～1058のいずれかの化合物。

[本発明1060]

が下記式：



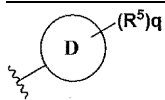
からなる群より選択され；qが1または2である、本発明1041～1059のいずれかの化合物。

[本発明1061]

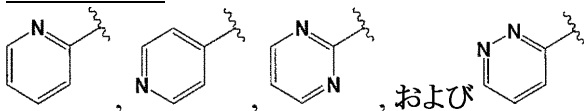
R⁵がHである、本発明1041～1060のいずれかの化合物。

[本発明1062]

R⁵がFであり；qが1である、本発明1041～1061のいずれかの化合物。

[本発明1063]

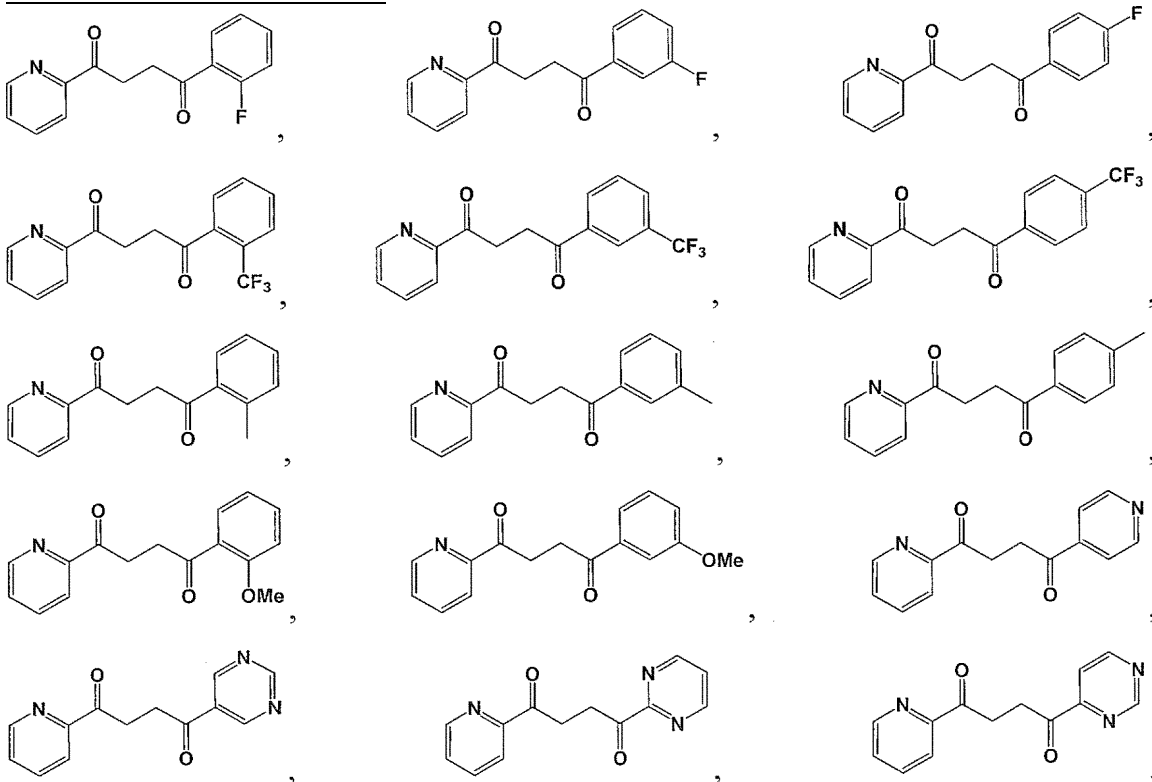
が下記式：

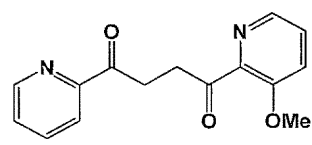
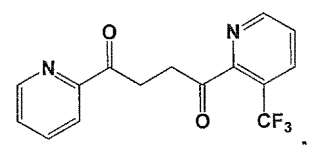
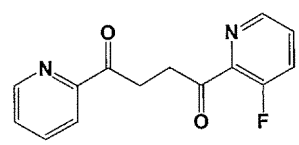
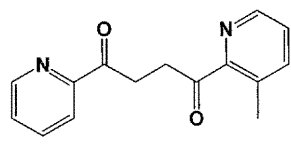
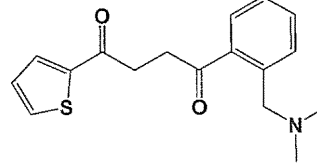
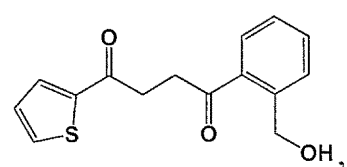
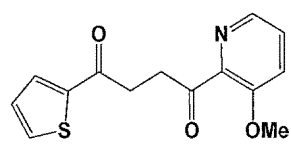
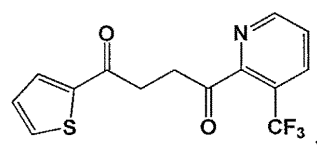
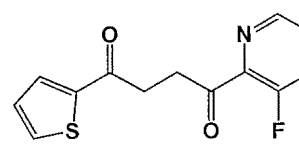
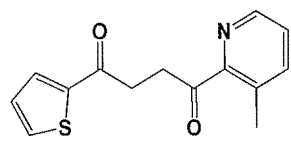
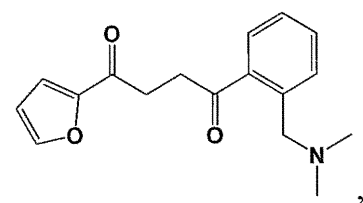
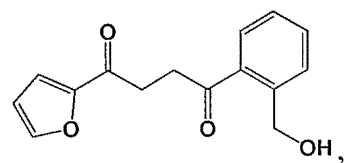
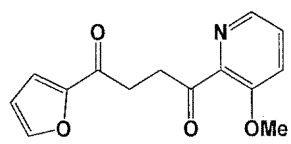
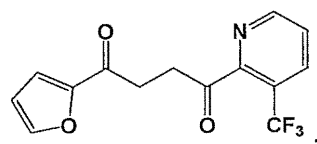
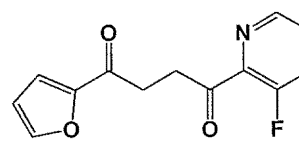
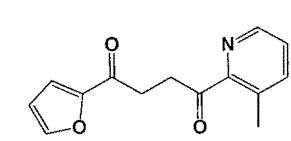
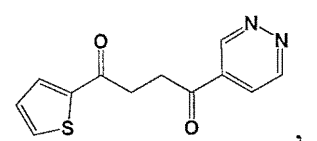
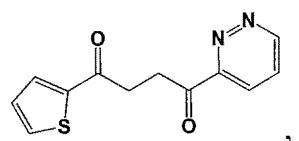
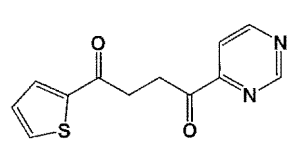
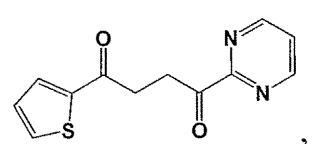
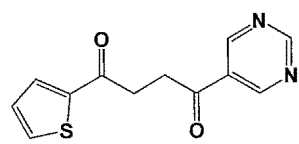
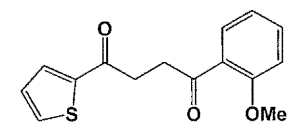
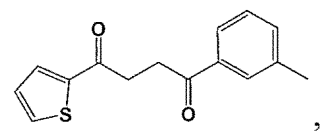
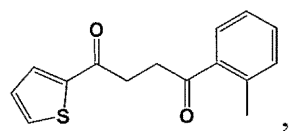
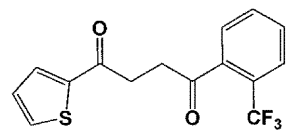
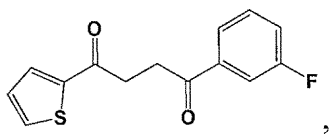
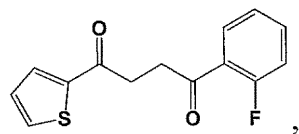
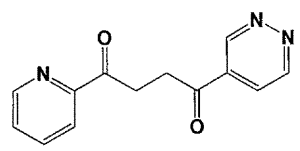
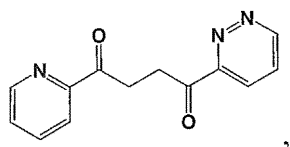
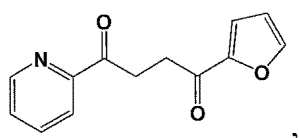


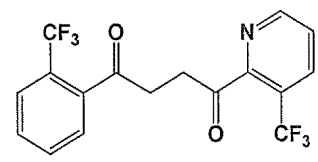
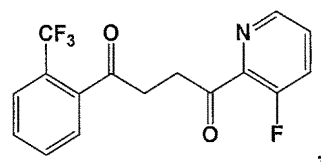
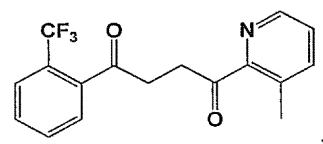
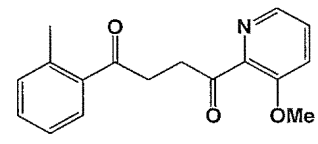
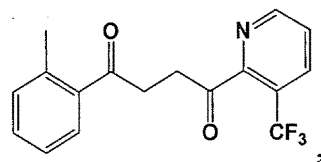
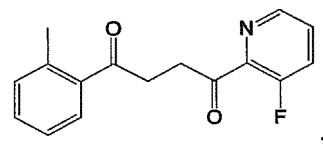
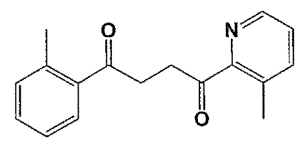
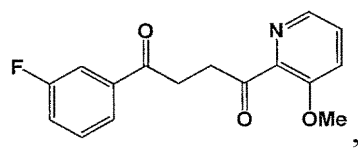
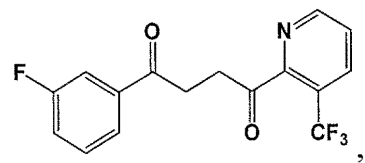
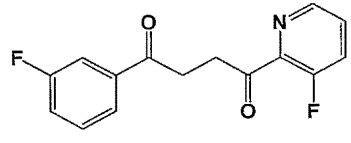
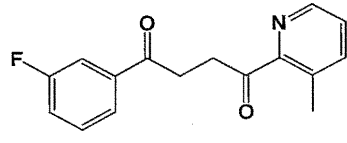
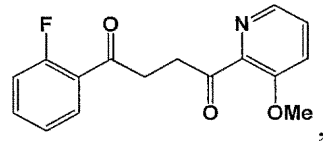
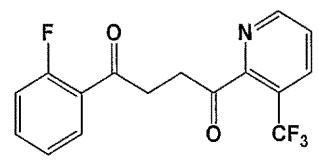
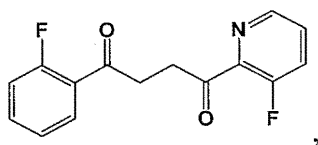
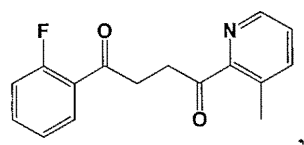
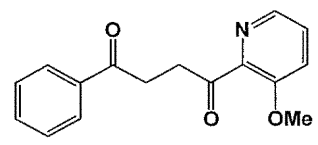
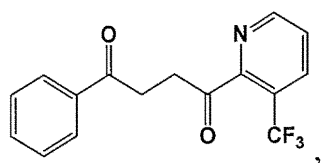
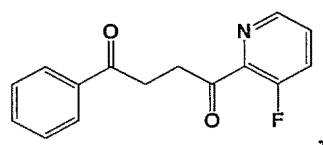
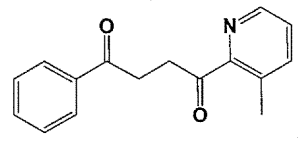
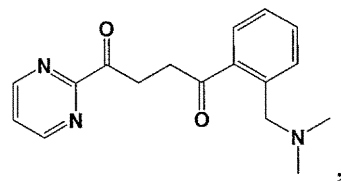
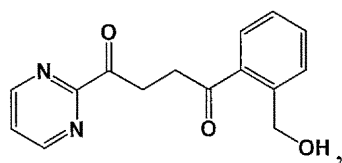
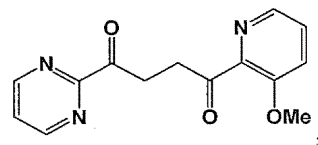
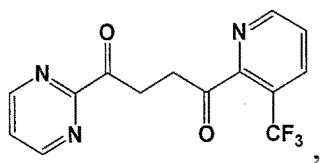
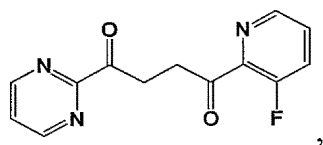
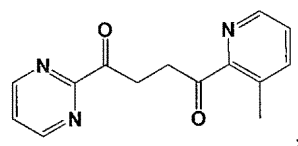
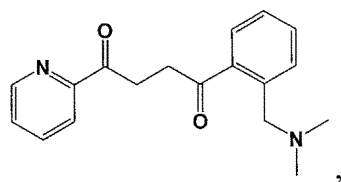
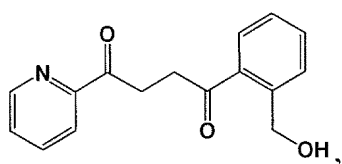
からなる群より選択され；R⁵がHである、本発明1041～1062のいずれかの化合物。

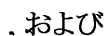
[本発明1064]

式IIの化合物が下記式：





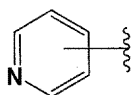




[本 発 明 1065]

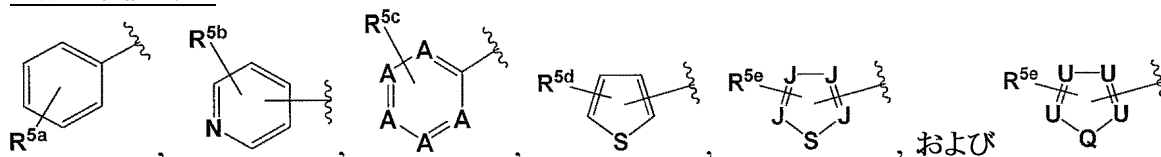
、または薬学的に許容されるその塩：

C環が



であり；

D環が下記式：



からなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^4 が出現するごとに独立してH、非置換 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^6$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5a} が1～5個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{6b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^{6a}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5b} が1～4個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{6b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、F、I、 $-OR^{6a}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5c} が1～3個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{6b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^6$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5d} が1～2個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{6b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^6$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5e} が1～3個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{6b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^6$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^6 が独立してH、非置換 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{6a} が独立してH、非置換 $-C_{2-6}$ アルキル、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{6b} が独立してHおよび非置換 $-C_{1-3}$ アルキルからなる群より選択され；

各AがNまたはCであり、ここで少なくとも2つのAはNであり；

各JがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのJはNであり、少なくとも1つのJはCであり；

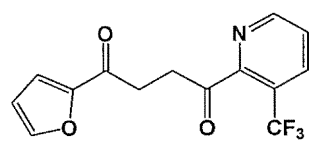
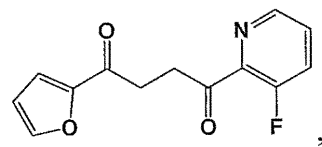
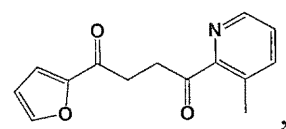
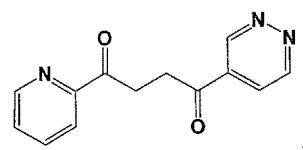
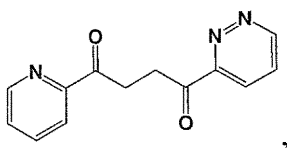
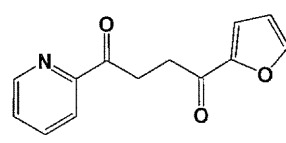
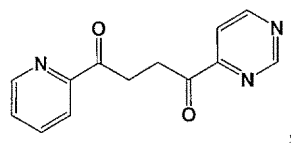
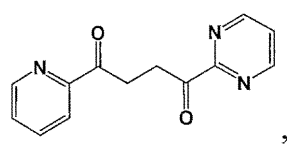
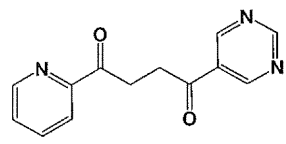
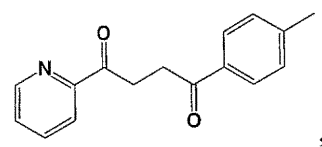
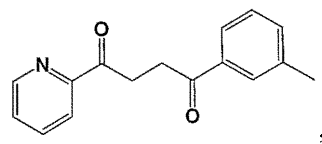
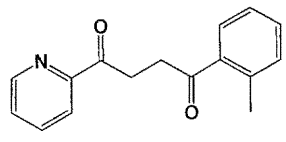
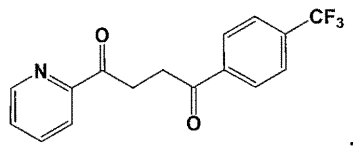
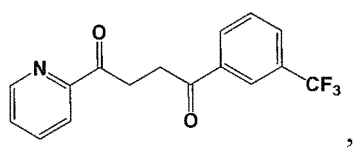
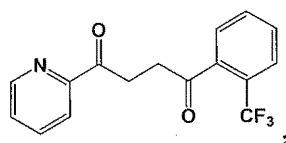
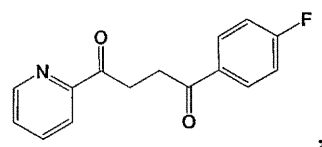
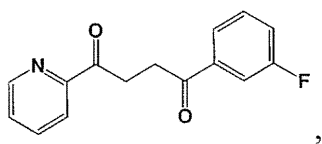
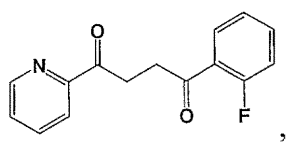
各UがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのUはCであり；

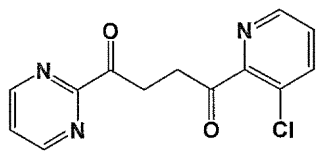
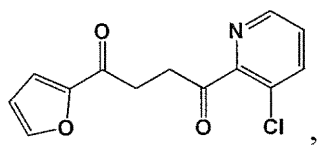
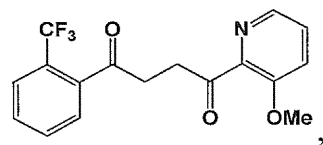
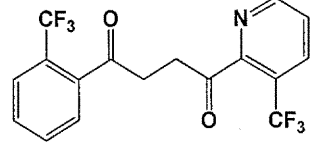
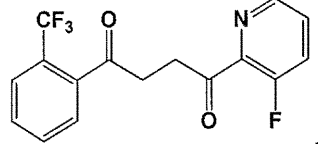
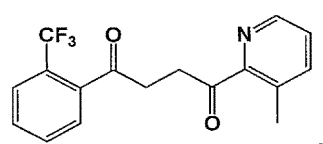
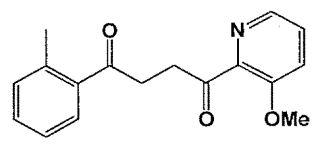
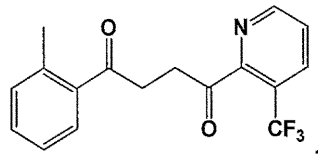
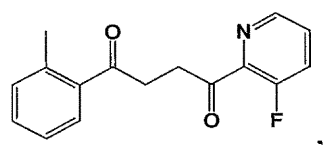
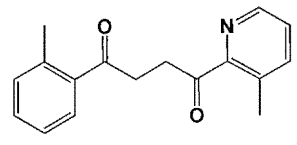
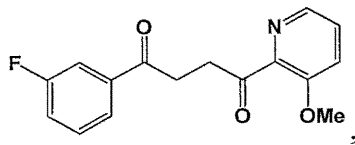
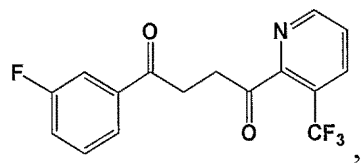
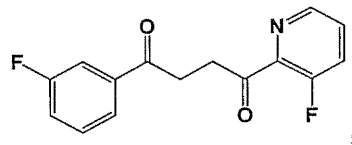
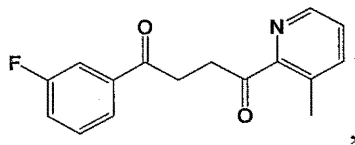
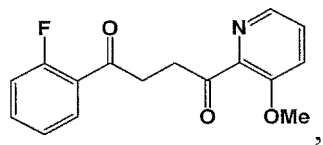
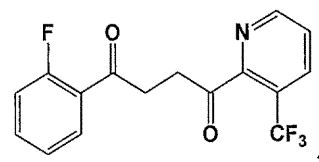
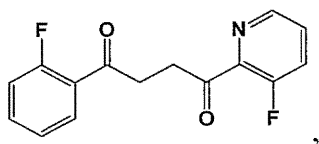
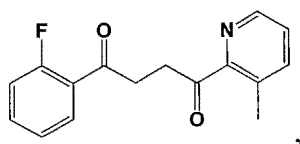
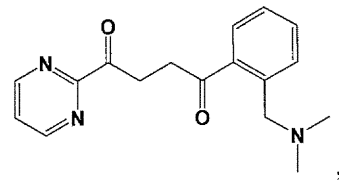
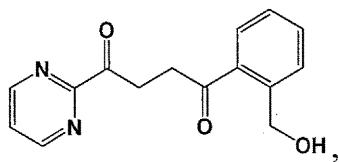
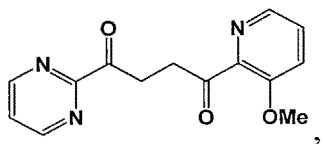
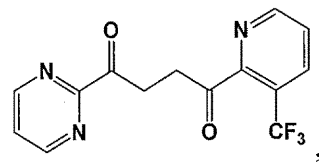
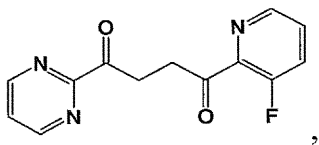
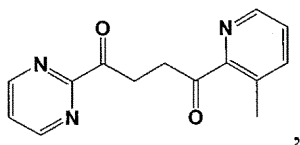
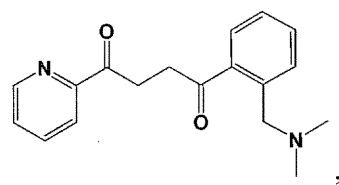
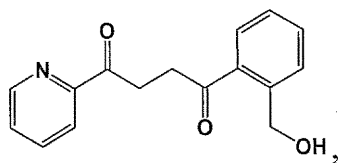
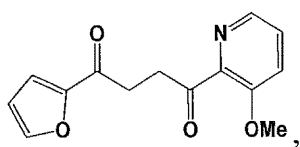
QがOまたはNであり；

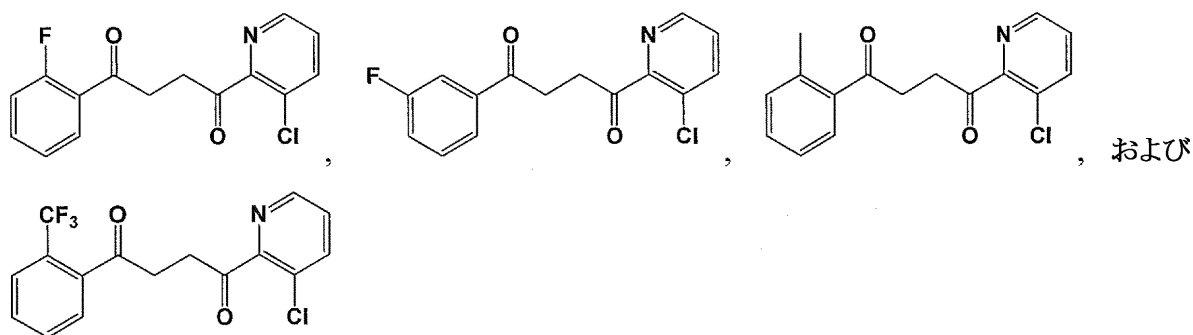
pが1～4の整数である。

[本発明1066]

式IIaの化合物が下記式：



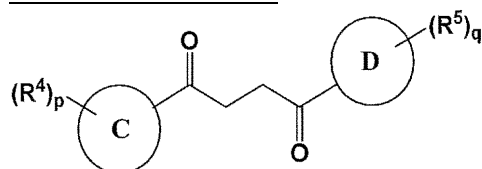




または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、本発明1065の化合物。

[本発明1067]

式IIbの化合物：

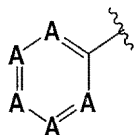


IIb

、または薬学的に許容されるその塩：

式中、

C環が



であり；

D環がフェニルおよび5～6員ヘテロアリールからなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^4 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、- $C_{1\sim3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR^{6a}、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^5 が出現するごとに独立してH、非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- $C_{1\sim3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各 R^6 が独立してH、非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、- $C_{1\sim3}$ ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各 R^{6a} が独立して非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、- $C_{1\sim3}$ ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各 R^{6b} が独立してHおよび非置換- $C_{1\sim3}$ アルキルからなる群より選択され；

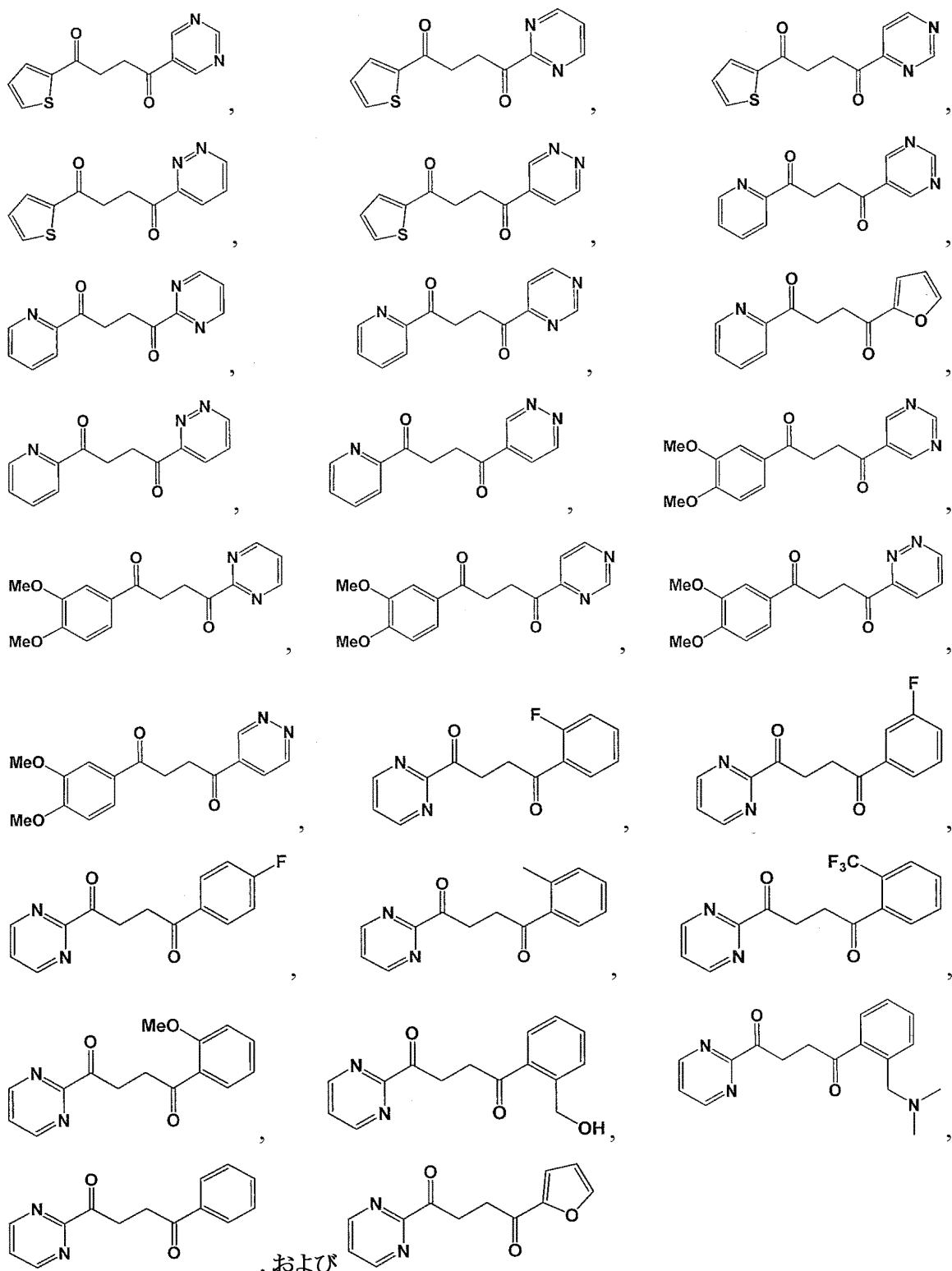
各AがNまたはCであり、ここで少なくとも2つのAはNであり；

pが1～3の整数であり；

qが1～5の整数である。

[本発明1068]

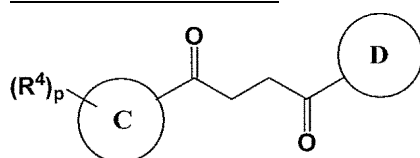
式IIbの化合物が下記式：



または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、本発明1067の化合物。

[本発明1069]

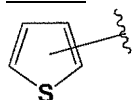
式IIcの化合物：



IIc

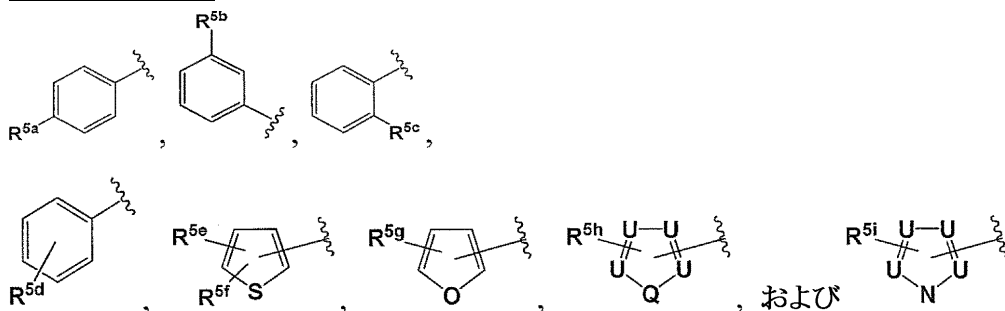
、または薬学的に許容されるその塩：

式中、
C環が



であり；

D環が下記式：



からなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^4 が出現するごとに独立してH、非置換- C_{1-6} アルキル、- C_{1-3} ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{5a}が非置換- C_{2-6} アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- C_{2-3} ハロアルキル、ヨウ化物、-OR^{6a}、およびCNからなる群より選択され；

R^{5b}が非置換- C_{1-6} アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- C_{2-3} ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR^{6a}、およびCNからなる群より選択され；

R^{5c}が非置換- C_{1-6} アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- C_{1-3} ハロアルキル、F、Br、I、-OR^{6a}、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{5d}が2～5個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換- C_{1-6} アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- C_{1-3} ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR^{6a}、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{5e}が1個の置換基であり、非置換- C_{2-5} アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- C_{1-3} ハロアルキル、F、I、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{5f}が1～2個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- C_{1-6} アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- C_{1-3} ハロアルキル、F、Br、I、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{5g}が1～3個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換- C_{1-6} アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- C_{1-3} ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R^{5h}が1～2個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- C_{1-6} アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- C_{1-3} ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R⁵ⁱが1～4個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- C_{1-6} アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{6b})₂、- C_{1-3} ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR⁶、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各R⁶が独立してH、非置換- C_{1-6} アルキル、- C_{1-3} ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各R^{6a}が独立して非置換- C_{2-6} アルキル、- C_{1-3} ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各R^{6b}が独立してHおよび非置換- C_{1-3} アルキルからなる群より選択され；

各JがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのJはCであり；

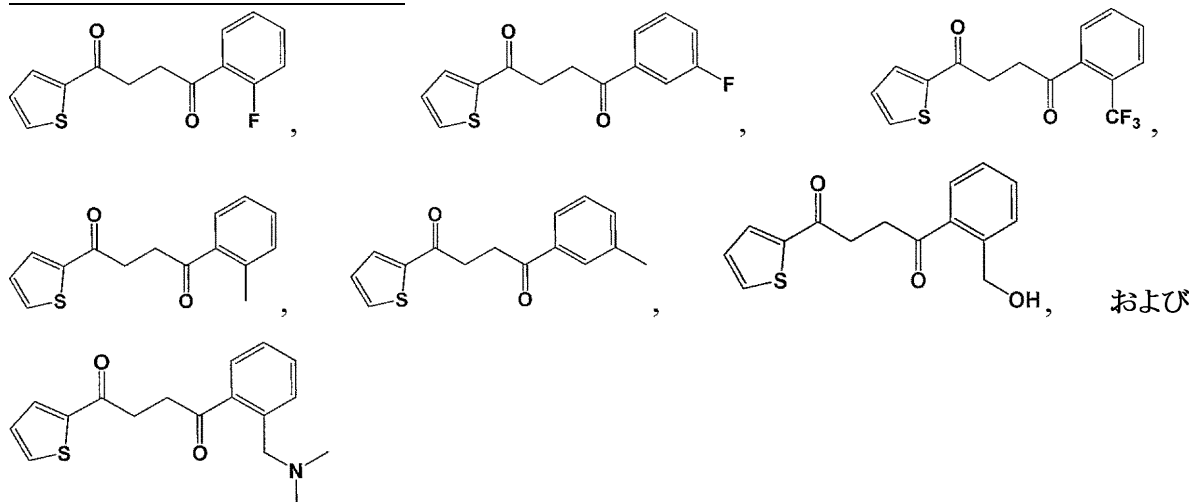
QがSまたはOであり；

各UがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのUはNであり、少なくとも1つのUはCであり；

pが1～3の整数である。

[本発明1070]

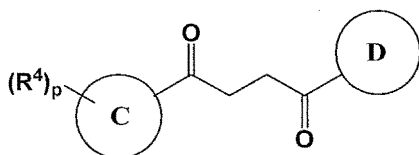
式IIcの化合物が下記式：



または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、本発明1069の化合物。

[本発明1071]

式II dの化合物：

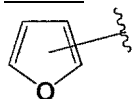


II d

、または薬学的に許容されるその塩：

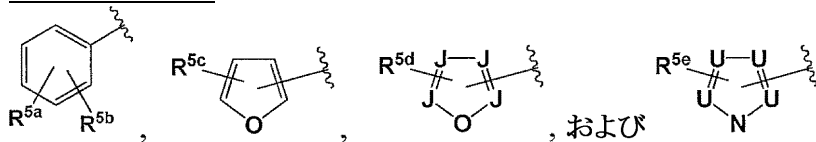
式中、

C環が



であり；

D環が下記式：



からなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^4 が出現するごとに独立してH、非置換 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^6$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され； R^{5a} が1個の置換基であり、非置換 $-C_{2-6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{6b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^{6a}$ 、およびCNからなる群より選択され； R^{5b} が1～4個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{6b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^{6a}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され； R^{5c} が1～3個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換 $-C_{2-5}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{6b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^6$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され； R^{5d} が1～2個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{6b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^6$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5e} が1～4個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- C_{1-6} アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{6b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^6$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^6 が独立してH、非置換- C_{1-6} アルキル、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{6a} が独立して非置換- C_{2-6} アルキル、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{6b} が独立してHおよび非置換- C_{1-3} アルキルからなる群より選択され；

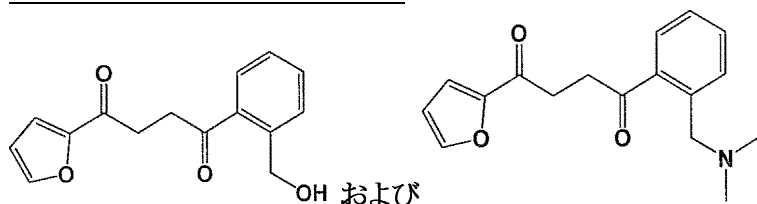
各JがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのJはNであり、少なくとも1つのJはCであり；
QがSまたはOであり；

各UがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのUはCであり；

pが1～3の整数である。

[本発明1072]

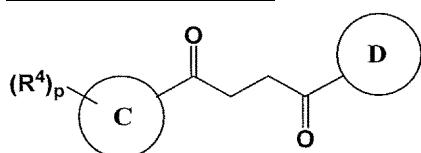
式II dの化合物が下記式：



または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、本発明1071の化合物。

[本発明1073]

式II eの化合物：

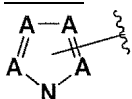


II e

、または薬学的に許容されるその塩：

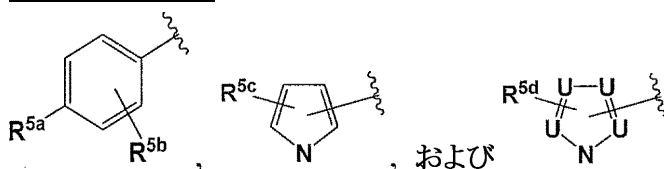
式中、

C環が



であり、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

D環が下記式：



からなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^4 が出現するごとに独立してH、非置換- C_{1-6} アルキル、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^6$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5a} がH、非置換- C_{1-6} アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{6b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、F、Br、I、 $-OR^6$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5b} が1～4個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- C_{1-6} アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{6b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^6$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5c} が1～4個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換- C_{2-5} アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{6b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^6$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5d} が1～2個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- C_{2-6} アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{6b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^{6a}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^6 が独立してH、非置換- C_{1-6} アルキル、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{6a} が独立して非置換- C_{1-6} アルキル、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{6b} が独立してHおよび非置換- C_{1-3} アルキルからなる群より選択され；

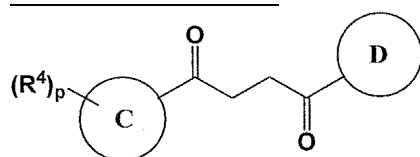
各AがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのAはCであり；

各UがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのUはNであり、少なくとも1つのUはCであり；

pが1～4の整数である。

[本発明1074]

式II fの化合物：

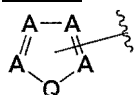


II f

、または薬学的に許容されるその塩：

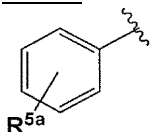
式中、

C環が



であり、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

D環が



および5員ヘテロアリール R^{5b} からなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^4 が出現するごとに独立してH、非置換- C_{1-6} アルキル、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^6$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5a} が1～5個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- C_{1-6} アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{6b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^{6a}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{5b} が1～4個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、非置換- C_{1-6} アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{6b})_2$ 、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^6$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^6 が独立してH、非置換- C_{1-6} アルキル、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{6a} が独立して非置換- C_{2-6} アルキル、 $-C_{1-3}$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{6b} が独立してHおよび非置換- C_{1-3} アルキルからなる群より選択され；

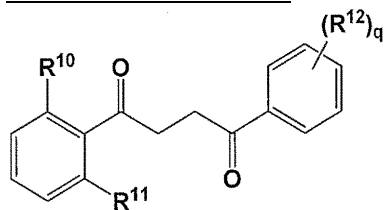
各AがNまたはCであり、ここで少なくとも1つのAはNであり、少なくとも1つのAはCであり；

QがSまたは0であり；

pが1～4の整数である。

[本発明1075]

式IIIaの化合物：



IIIa

、または薬学的に許容されるその塩：

式中、

R¹⁰がH、非置換-C₁～₆アルキル、-C₁～₃ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR¹³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

R¹¹が非置換-C₁～₆アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{13b})₂、-C₁～₃ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR¹³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

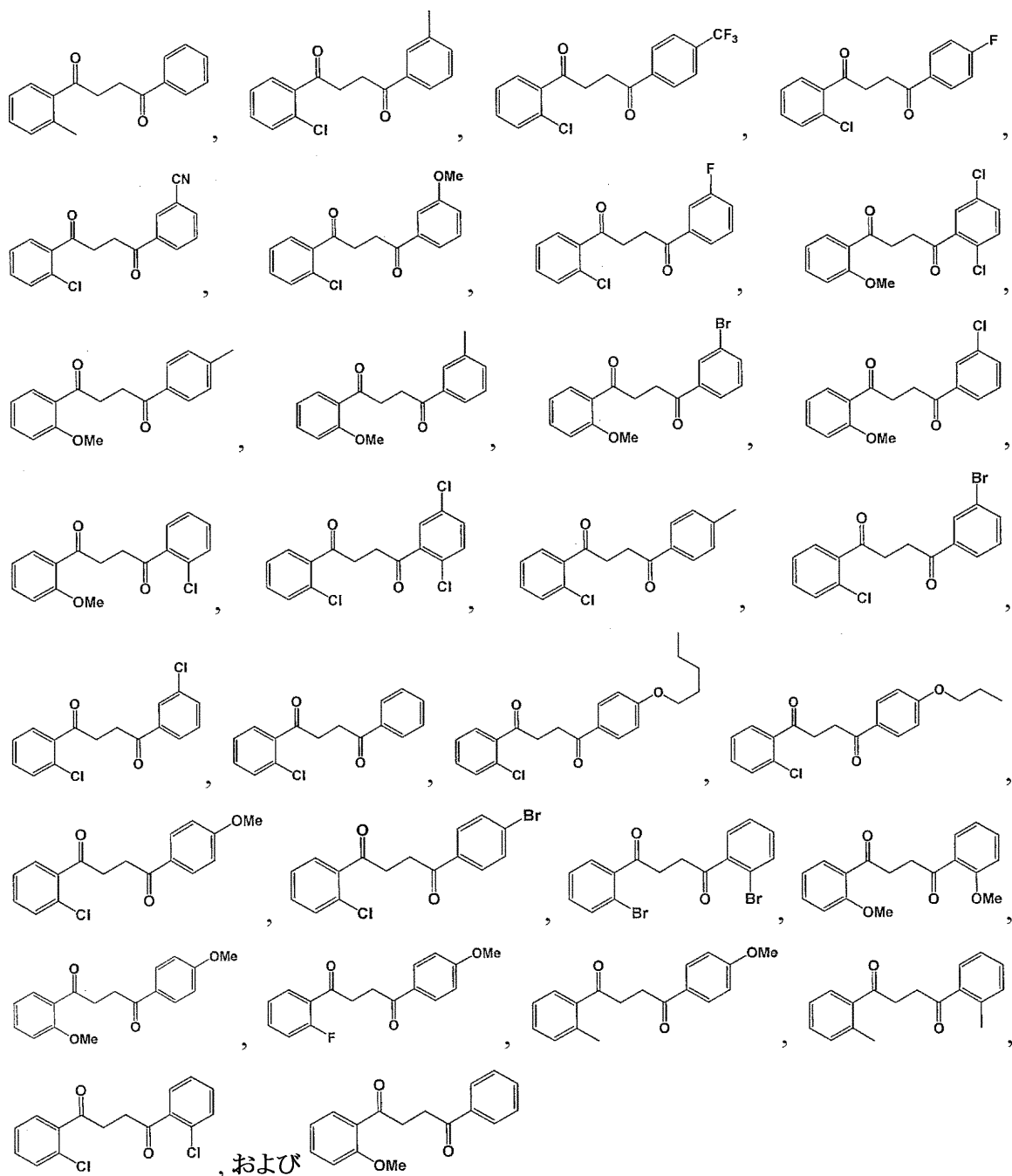
各R¹²が出現するごとに独立してH、非置換-C₁～₆アルキル、-CH₂OH、-CH₂N(R^{13b})₂、-C₁～₃ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR¹³、CF₃、およびCNからなる群より選択され；

各R¹³が独立して非置換-C₁～₆アルキル、-C₁～₃ハロアルキル、およびCF₃からなる群より選択され；

各R^{13b}が独立してHおよび非置換-C₁～₃アルキルからなる群より選択され；

qが1～5の整数であるが、

ただし、式IIIaの化合物は、下記式：



からなる群より選択される化合物ではない。

[本発明1076]

R^{10} がH、F、Cl、Me、OMe、 CF_3 、およびCNからなる群より選択される、本発明1075の化合物。

[本発明1077]

R^{11} がH、F、Cl、Me、OMe、 CF_3 、およびCNからなる群より選択される、本発明1075～1076のいずれかの化合物。

[本発明1078]

R^{10} がHであり； R^{11} がFである、本発明1075～1077のいずれかの化合物。

[本発明1079]

R^{10} がHであり； R^{11} が CF_3 である、本発明1075～1078のいずれかの化合物。

[本発明1080]

R^{10} がFであり； R^{11} がFである、本発明1075～1079のいずれかの化合物。

[本発明1081]

R^{10} がFであり； R^{11} が CF_3 である、本発明1075～1080のいずれかの化合物。

[本発明1082]

R^{12} がH、F、Cl、Me、OMe、 CF_3 、およびCNからなる群より選択される、本発明1075～1081のいずれかの化合物。

[本発明1083]

R^{12} がHである、本発明1075～1082のいずれかの化合物。

[本発明1084]

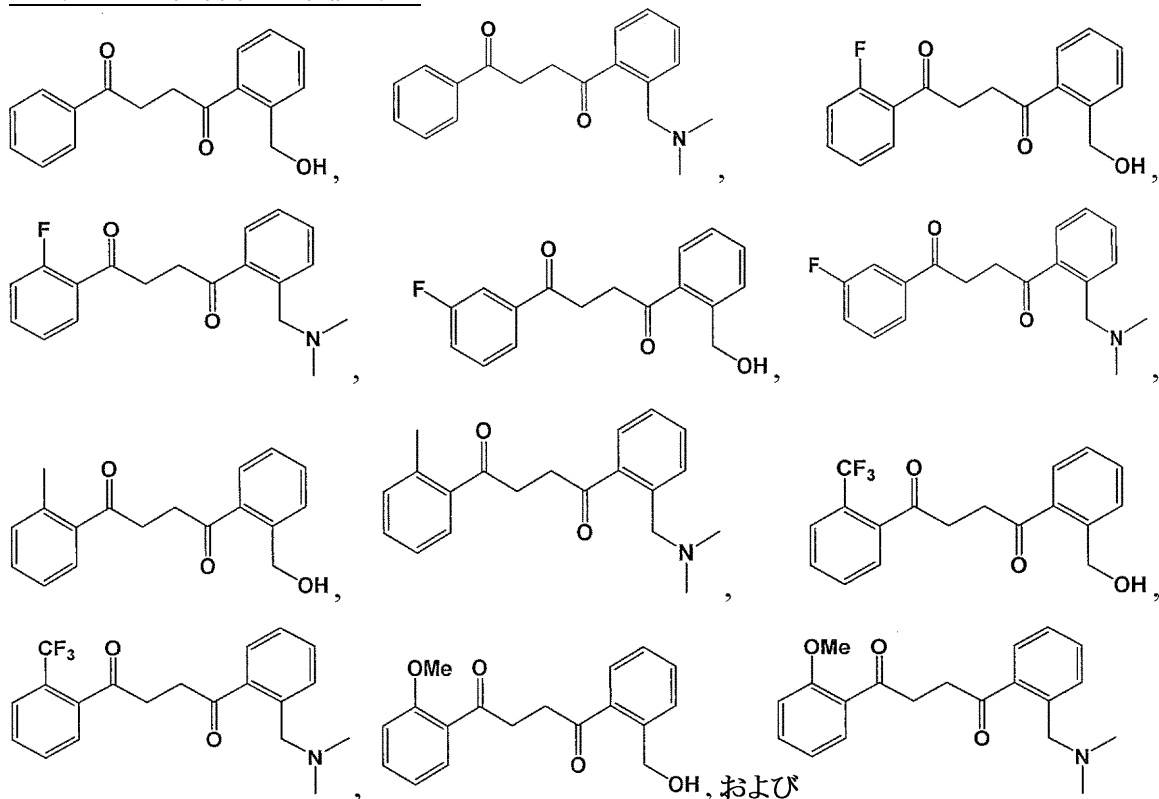
R^{12} がFまたはClであり；qが1である、本発明1075～1083のいずれかの化合物。

[本発明1085]

R^{12} が CF_3 であり；qが1である、本発明1075～1084のいずれかの化合物。

[本発明1086]

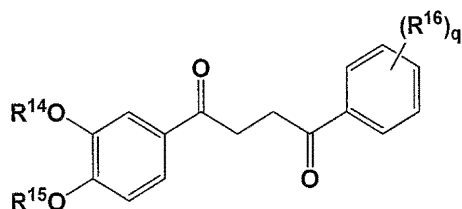
式IIIaの化合物が下記式：



または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、本発明1075～1085のいずれかの化合物。

[本発明1087]

式IIIbの化合物：

**IIIb**

、または薬学的に許容されるその塩：

式中、

R^{14} が非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

R^{15} が非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{16} が出現するごとに独立してH、非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- CH_2OH 、- $CH_2N(R^{17b})_2$ 、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、- OR^{17} 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

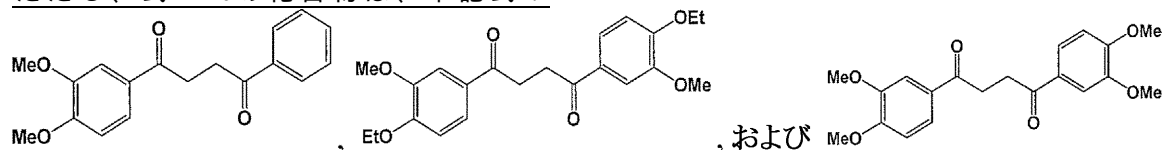
各 R^{17} が独立して非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より

選択され；

各 R^{17b} が独立してHおよび非置換- $C_{1\sim 3}$ アルキルからなる群より選択され；

qが1～5の整数であるが、

ただし、式IIIbの化合物は、下記式：



からなる群より選択される化合物ではない。

[本発明1088]

R^{14} が- $C_{1\sim 6}$ アルキルである、本発明1087の化合物。

[本発明1089]

R^{14} がMeである、本発明1087～1088のいずれかの化合物。

[本発明1090]

R^{15} が- $C_{1\sim 6}$ アルキルである、本発明1087～1089のいずれかの化合物。

[本発明1091]

R^{15} がMeである、本発明1087～1090のいずれかの化合物。

[本発明1092]

R^{16} がH、F、Cl、Me、OMe、 CF_3 、およびCNからなる群より選択される、本発明1087～1091のいずれかの化合物。

[本発明1093]

R^{16} がHである、本発明1087～1092のいずれかの化合物。

[本発明1094]

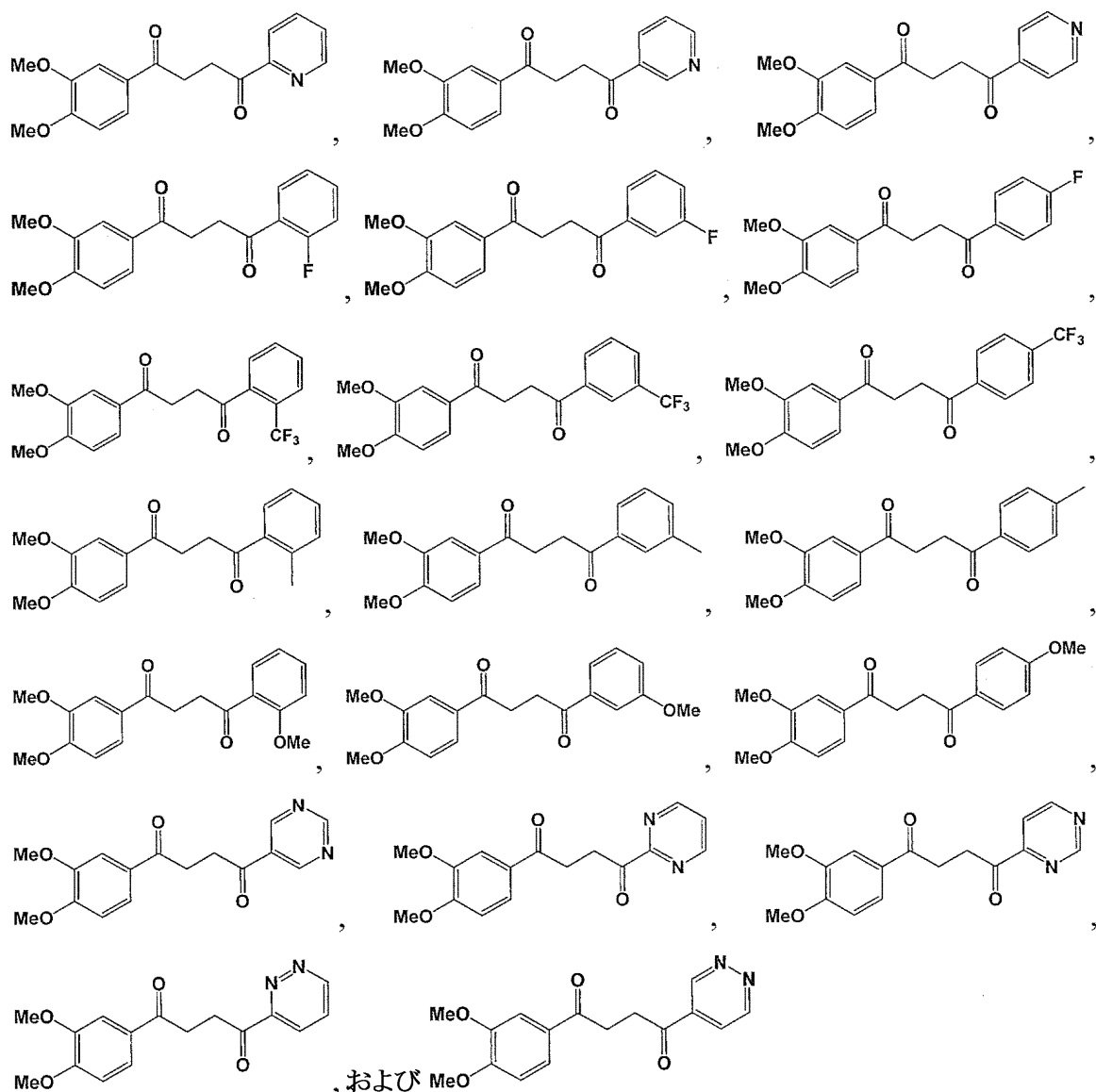
R^{16} がFまたはClであり；qが1である、本発明1087～1093のいずれかの化合物。

[本発明1095]

R^{16} が CF_3 であり；qが1である、本発明1087～1094のいずれかの化合物。

[本発明1096]

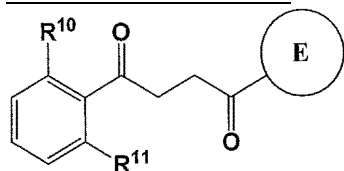
式IIIbの化合物が下記式：



または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、本発明1087～1095のいずれかの化合物。

[本発明1097]

式IIIcの化合物：

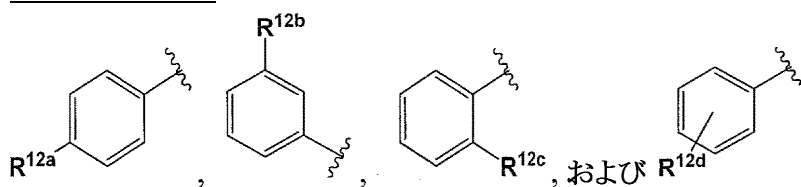


IIIc

、または薬学的に許容されるその塩：

式中、

E環が下記式：



からなる群より選択され；

R^{10} がH、非置換- C_{1-6} アルキル、- C_{1-3} ハロアルキル、ハロゲン化物、-OR¹³、CF₃、およ

びCNからなる群より選択され；

R^{11} が非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{13b})_2$ 、 $-C_{1\sim3}$ ハロアルキル、ハロゲン化合物、 $-OR^{13}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{12a} が非置換- $C_{2\sim6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{13b})_2$ 、 $-C_{2\sim3}$ ハロアルキル、Cl、I、 $-OEt$ 、およびCNからなる群より選択され；

R^{12b} が非置換- $C_{2\sim6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{13b})_2$ 、 $-C_{1\sim3}$ ハロアルキル、ヨウ化物、 $-OR^{13a}$ 、および CF_3 からなる群より選択され；

R^{12c} が非置換- $C_{2\sim6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{13b})_2$ 、 $-C_{1\sim3}$ ハロアルキル、F、I、 $-OR^{13a}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{12d} が2～5個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立して非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{13b})_2$ 、 $-C_{1\sim3}$ ハロアルキル、F、Br、I、 $-OR^{13}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^{13} が独立して非置換- $C_{1\sim6}$ アルキル、 $-C_{1\sim3}$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

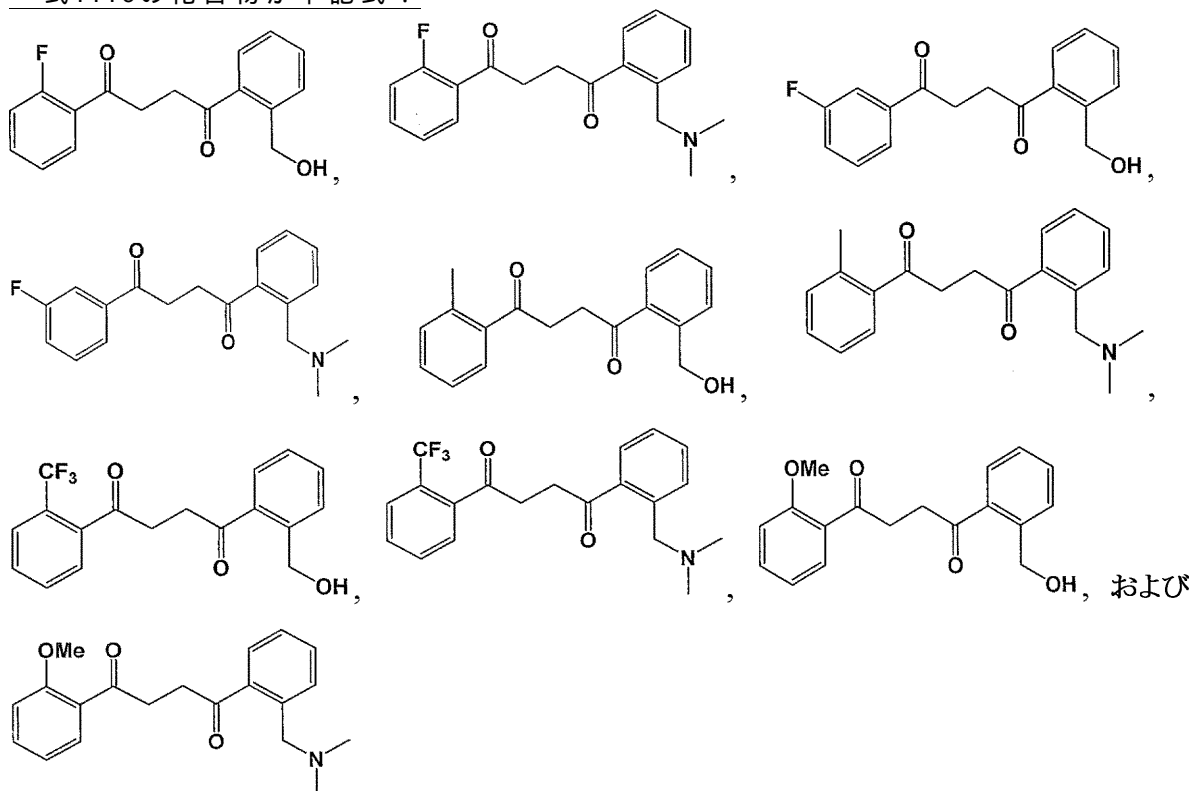
各 R^{13a} が独立して非置換- $C_{2\sim6}$ アルキル、 $-C_{1\sim3}$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{13b} が独立してHおよび非置換- $C_{1\sim3}$ アルキルからなる群より選択され；

qが1～5の整数である。

[本発明1098]

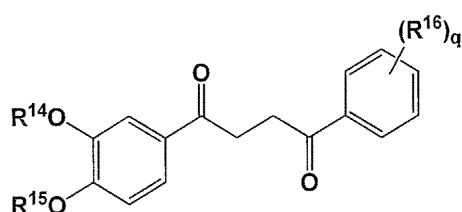
式IIIcの化合物が下記式：



または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、本発明1097の化合物。

[本発明1099]

式IIIdの化合物：



IIIId

、または薬学的に許容されるその塩：

式中、

R^{14} が非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

R^{15} が非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{16} が出現するごとに独立して非置換- $C_1 \sim 6$ アルキル、- CH_2OH 、- $CH_2N(R^{17b})_2$ 、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、ハロゲン化物、- OR^{17a} 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

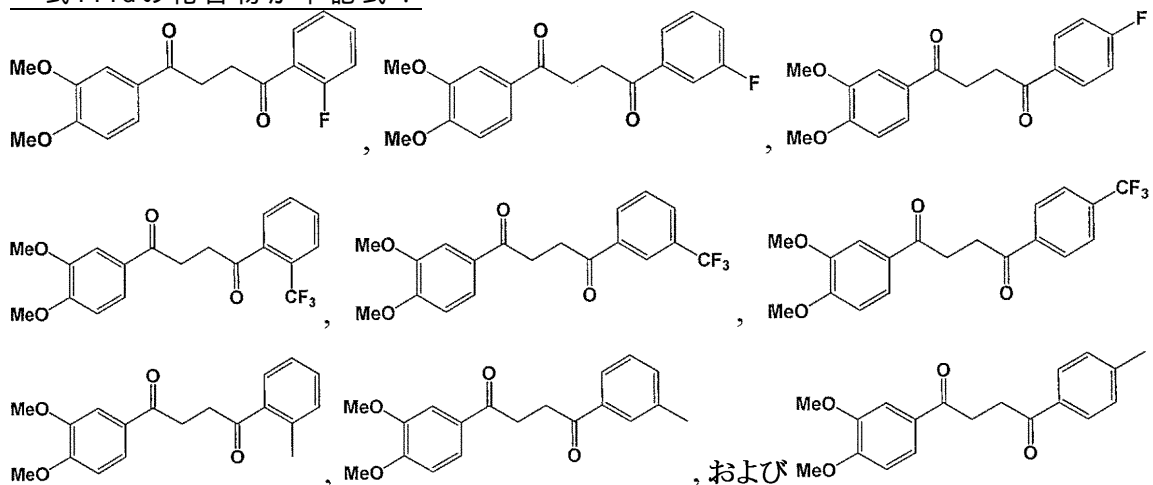
各 R^{17a} が独立して非置換- $C_3 \sim 6$ アルキル、- $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

各 R^{17b} が独立してHおよび非置換- $C_1 \sim 3$ アルキルからなる群より選択され；

qが1～5の整数である。

[本発明1100]

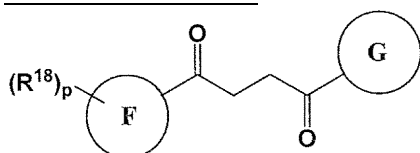
式IIIdの化合物が下記式：



または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、本発明1099の化合物。

[本発明1101]

式IVの化合物：

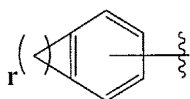


IV

、または薬学的に許容されるその塩：

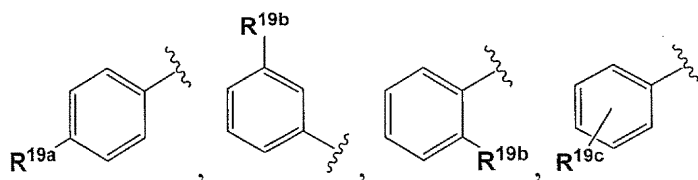
式中、

F環が



であり；

G環が



、および5～6員ヘテロアリール R^{19d} からなる群より選択され、ここで環上の炭素原子はカルボニル炭素に結合しており；

各 R^{18} が出現するごとに独立してH、 $-C_{1\sim 3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^{20}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{19a} がH、非置換 $-C_{2\sim 6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{21})_2$ 、 $-C_{1\sim 3}$ ハロアルキル、F、Br、I、 $-OR^{20}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^{19b} が出現するごとに独立してH、非置換 $-C_{2\sim 6}$ アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{21})_2$ 、 $-C_{1\sim 3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^{20}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{19c} が2～5個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{21})_2$ 、 $-C_{1\sim 3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^{20}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

R^{19d} が1～4個の置換基であり、出現するごとにそれぞれ独立してH、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2N(R^{21})_2$ 、 $-C_{1\sim 3}$ ハロアルキル、ハロゲン化物、 $-OR^{20}$ 、 CF_3 、およびCNからなる群より選択され；

各 R^{20} が独立してH、非置換 $-C_{3\sim 6}$ アルキル、 $-C_{1\sim 3}$ ハロアルキル、および CF_3 からなる群より選択され；

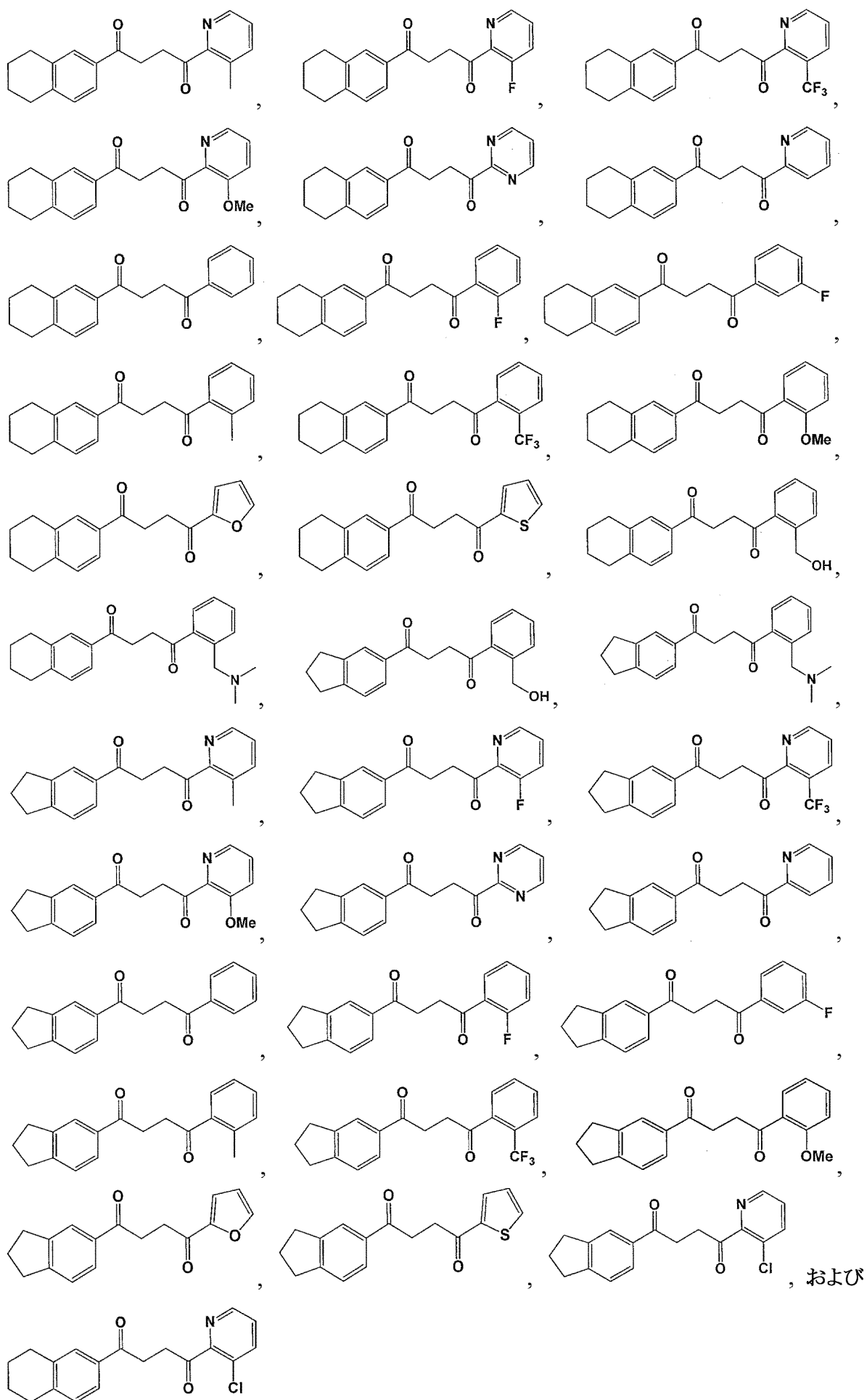
各 R^{21} が独立してHおよび非置換 $-C_{1\sim 3}$ アルキルからなる群より選択され；

pが1～13の整数であり；

rが1～5の整数である。

[本発明1102]

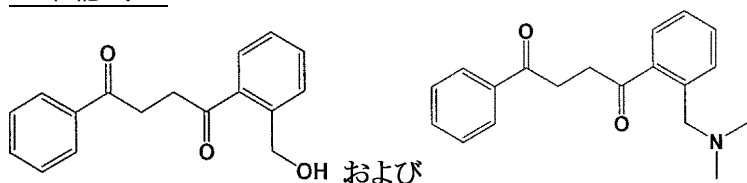
式IVの化合物が下記式：



または薬学的に許容されるその塩からなる群より選択される、本発明1101の化合物。

[本発明1103]

下記式：



からなる群より選択される化合物、または薬学的に許容されるその塩。

[本発明1104]

治療有効量の本発明1001～1103のいずれかの化合物または薬学的に許容されるその塩と、薬学的に許容される賦形剤とを含む、薬学的組成物。

[本発明1105]

医療機器用の化合物溶出コーティング中の成分である、本発明1104の薬学的組成物。

[本発明1106]

神経変性疾患、眼疾患、骨粗鬆症、骨関節症、骨形成不全症、骨欠損、骨折、歯周病、耳硬化症、創傷治癒、口腔粘膜炎症、胃腸粘膜炎症、頭蓋顔面欠損、および腫瘍退縮性骨疾患からなる群より選択される障害または疾患を処置する方法であって、治療有効量の本発明1001～1103のいずれかの化合物または薬学的に許容されるその塩を患者に投与する段階を含む、方法。

[本発明1107]

障害または疾患が神経変性疾患である、本発明1106の方法。

[本発明1108]

神経変性疾患がパーキンソン病、脳卒中、脊髄損傷、虚血性脳疾患、てんかん、アルツハイマー病、認知症、うつ病、双極性障害、または統合失調症である、本発明1106～1107のいずれかの方法。

[本発明1109]

障害または疾患が眼疾患である、本発明1106の方法。

[本発明1110]

眼疾患が滲出型加齢黄斑変性症、萎縮型加齢黄斑変性症、地図状萎縮、糖尿病性網膜症、糖尿病黄斑浮腫、網膜剥離、網膜変性症、網膜静脈閉塞症、未熟児網膜症、網膜色素変性症、網膜症、レーバー先天黒内障、および緑内障である、本発明1106および1109のいずれかの方法。

[本発明1111]

障害または疾患が骨粗鬆症、骨関節症、骨形成不全症、骨欠損、骨折、歯周病、耳硬化症、創傷治癒、口腔粘膜炎症、胃腸粘膜炎症、頭蓋顔面欠損、または腫瘍退縮性骨疾患である、本発明1106の方法。

[本発明1112]

幹細胞の分化および増殖に関連し、かつ脱毛、造血関連疾患、組織再生関連疾患、ならびに、発生異常、幹細胞分化異常、および細胞増殖異常に関連する他の疾患からなる群より選択される障害または障害または疾患を処置する方法であって、治療有効量の本発明1001～1103のいずれかの化合物または薬学的に許容されるその塩を患者に投与する段階を含む、方法。

[本発明1113]

患者が哺乳動物である、本発明1106または1112の方法。

[本発明1114]

哺乳動物がヒトである、本発明1113の方法。

[本発明1115]

化合物がWnt経路中の1つまたは複数のタンパク質を活性化する、本発明1106の方法。

[本発明1116]

化合物が、1つまたは複数のWntタンパク質によって誘導されるシグナル伝達を活性化する、本発明1115の方法。

[本発明1117]

1つまたは複数のWntタンパク質がWNT1、WNT2、WNT2B、WNT3、WNT3A、WNT4、WNT5A、WNT5B、WNT6、WNT7A、WNT7B、WNT8A、WNT8B、WNT9A、WNT9B、WNT10A、WNT10B、WNT11、およびWNT16からなる群より選択される、本発明1106および1115～1116のいずれかの方法。

[本発明1118]

本発明1001～1103のいずれかの化合物または薬学的に許容されるその塩を含む、化合物溶出コーティングまたは制御放出系。

[本発明1119]

本発明1001～1103のいずれかの化合物または薬学的に許容されるその塩を含む、医療機器。

[本発明1120]

本発明1001～1103のいずれかの化合物または薬学的に許容されるその塩を含む、インビボでの使用に好適な移植片、スポンジ、ポリマー、軟膏、クリーム、またはゲル組成物。

前述の一般的説明および以下の詳細な説明がいずれも例示的および説明的でしかなく、特許請求される本発明を制限するものではないということを理解すべきである。