

【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23年7月28日(2011.7.28)

【公表番号】特表2010-514686(P2010-514686A)

【公表日】平成22年5月6日(2010.5.6)

【年通号数】公開・登録公報2010-018

【出願番号】特願2009-543183(P2009-543183)

【国際特許分類】

C 07 D 417/14 (2006.01)  
 A 61 K 31/444 (2006.01)  
 A 61 K 31/4545 (2006.01)  
 C 07 D 495/04 (2006.01)  
 A 61 K 31/506 (2006.01)  
 A 61 K 45/00 (2006.01)  
 A 61 P 43/00 (2006.01)  
 A 61 P 35/00 (2006.01)  
 A 61 P 25/28 (2006.01)

【F I】

C 07 D 417/14 C S P  
 A 61 K 31/444  
 A 61 K 31/4545  
 C 07 D 495/04 105 A  
 A 61 K 31/506  
 A 61 K 45/00  
 A 61 P 43/00 111  
 A 61 P 35/00  
 A 61 P 25/28

【手続補正書】

【提出日】平成22年7月15日(2010.7.15)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

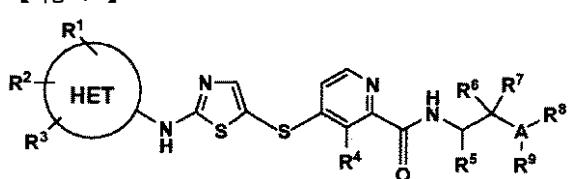
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

【化1】



【式中、

H E Tは、ヘテロアリール、またはヘテロシクリル基であり；

Aは、アリール、またはヘテロアリール基であり；

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は独立して、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、シクロアルキル、置換シクロアルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アル

コキシ、置換アルコキシ、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルカノイル、置換アルカノイル、アミノ、置換アミノ、アミノアルキル、置換アミノアルキル、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、アミド、置換アミド、カルバメート、ウレイド、シアノ、スルホンアミド、置換スルホンアミド、アルキルスルホン、ニトロ、チオ、チオアルキル、アルキルチオ、二置換アミノ、アルキルスルホニル、アルキルスルフィニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、カルバモイル、置換カルバモイル、アルケニル、置換アルケニル、アルキニル、置換アルキニル、またはアルキルカルボニルであり；あるいは

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、一緒になって、適宜置換される炭素環またはヘテロ環を形成し；

R<sup>4</sup> は水素、アルキル、置換アルキル、ヒドロキシ、シアノ、またはハロゲンであり；

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> は独立して、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、オキソ、アリールオキシ、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルカノイル、置換アルカノイル、アルカノイルオキシ、アミノ、アミノアルキル、置換アミノアルキル、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、二置換アミノ、アミド、置換アミド、カルバメート、置換カルバメート、ウレイド、シアノ、スルホンアミド、置換スルホンアミド、アルキルスルホン、ヘテロシクロアルキル、置換ヘテロシクロアルキル、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ニトロ、チオ、チオアルキル、アルキルチオ、アルキルスルホニル、アルキルスルフィニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、カルバモイル、アルケニル、置換アルケニル、アルキニル、置換アルキニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、アリールヘテロアリール、アリールアルコキシカルボニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アリールオキシアリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロシクリル、アルキルカルボニル、置換ヘテロアルキル、ヘテロアルケニル、置換ヘテロアルケニル、ヘテロアルキニル、置換ヘテロアルキニル、アリールアルキニル、アリールアミノ、アリールアルキルアミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ、アリールアルカノイルアミノ、アリールチオ、アリールアルキルチオ、アリールスルホニル、アリールアルキルスルホニル、アルキルスルホニル、アリールカルボニルアミノ、またはアルキルアミノカルボニルであり；

R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は独立して、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、アルキリデン、置換アルキリデン、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、アルコキシアルコキシアルキルハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、オキソ、アリールオキシ、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルカノイル、置換アルカノイル、アルカノイルオキシ、アミノ、アミノアルキル、置換アミノアルキル、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、二置換アミノ、アミド、置換アミド、カルバメート、置換カルバメート、ウレイド、シアノ、スルホンアミド、置換スルホンアミド、アルキルスルホン、ヘテロシクロアルキル、置換ヘテロシクロアルキル、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ニトロ、チオ、チオアルキル、アルキルチオ、アルキルスルホニル、アルキルスルフィニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、カルバモイル、アルケニル、置換アルケニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、アリールヘテロアリール、アリールアルコキシカルボニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アリールオキシアリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロシクリル、アルキルカルボニル、置換ヘテロアルキル、ヘテロアルケニル、置換ヘテロアルケニル、ヘテロアルキニル、置換ヘテロアルキニル、アリールアミノ、アリールアルキルアミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ、アリールアルカノイルアミノ、アリールチオ、アリールアルキルチオ、アリールスルホニル、アリールアルキルスルホニル、アルキルスルホニル、アリールカルボニルアミノ、またはアルキル

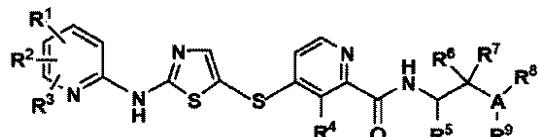
アミノカルボニルであり、あるいは

R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は、それらが結合している原子とともに、一緒になって適宜置換される炭素二環、または複素二環を形成する]

によって表される式 I の化合物、またはその医薬的に許容される塩、もしくは立体異性体。

【請求項 2】

【化 2】



(II)

[式中、

A は、アリール、またはヘテロアリール基であり；

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は独立して、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、シクロアルキル、置換シクロアルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルカノイル、置換アルカノイル、アミノ、置換アミノ、アミノアルキル、置換アミノアルキル、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、アミド、置換アミド、カルバメート、ウレイド、シアノ、スルホンアミド、置換スルホンアミド、アルキルスルホン、ニトロ、チオ、チオアルキル、アルキルチオ、二置換アミノ、アルキルスルホニル、アルキルスルフィニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、カルバモイル、置換カルバモイル、アルケニル、置換アルケニル、アルキニル、置換アルキニル、またはアルキルカルボニルであり；あるいは

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、一緒になって、適宜置換される炭素環またはヘテロ環を形成し；

R<sup>4</sup> は水素、アルキル、置換アルキル、ヒドロキシ、シアノ、またはハロゲンであり；

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> は独立して、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、オキソ、アリールオキシ、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルカノイル、置換アルカノイル、アルカノイルオキシ、アミノ、アミノアルキル、置換アミノアルキル、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、二置換アミノ、アミド、置換アミド、カルバメート、置換カルバメート、ウレイド、シアノ、スルホンアミド、置換スルホンアミド、アルキルスルホン、ヘテロシクロアルキル、置換ヘテロシクロアルキル、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ニトロ、チオ、チオアルキル、アルキルチオ、アルキルスルホニル、アルキルスルフィニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、カルバモイル、アルケニル、置換アルキニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、アリールヘテロアリール、アリールアルコキシカルボニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アリールオキシアリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロシクリル、アルキルカルボニル、置換ヘテロアルキル、ヘテロアルケニル、置換ヘテロアルケニル、アリールアミノ、アリールアルキルアミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ、アリールアルカノイルアミノ、アリールチオ、アリールアルキルチオ、アリールスルホニル、アリールアルキルスルホニル、アルキルスルホニル、アリールカルボニルアミノ、またはアルキルアミノカルボニルであり；

R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は独立して、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、アルキリデン、置換アルキリデン、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、アルコキシアルコキシアルキルハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ

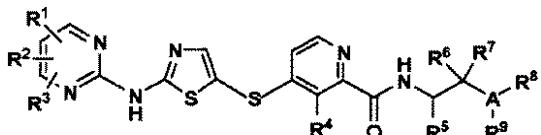
、オキソ、アリールオキシ、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルカノイル、置換アルカノイル、アルカノイルオキシ、アミノ、アミノアルキル、置換アミノアルキル、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、二置換アミノ、アミド、置換アミド、カルバメート、置換カルバメート、ウレイド、シアノ、スルホンアミド、置換スルホンアミド、アルキルスルホン、ヘテロシクロアルキル、置換ヘテロシクロアルキル、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ニトロ、チオ、チオアルキル、アルキルチオ、アルキルスルホニル、アルキルスルフィニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、カルバモイル、アルケニル、置換アルケニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、アリールヘテロアリール、アリールアルコキシカルボニル、アリールオキシアリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロシクリル、アルキルカルボニル、置換ヘテロアルキル、ヘテロアルケニル、置換ヘテロアルケニル、ヘテロアルキニル、置換ヘテロアルキニル、アリールアミノ、アリールアルキルアミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ、アリールアルカノイルアミノ、アリールチオ、アリールアルキルチオ、アリールスルホニル、アリールアルキルスルホニル、アルキルスルホニル、アリールカルボニルアミノ、またはアルキルアミノカルボニルであり、あるいは

R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は、それらが結合している原子とともに、一緒になって適宜置換される炭素二環、または複素二環を形成する]

によって表される式 II である請求項 1 の化合物、またはその医薬的に許容される塩、もしくは立体異性体。

【請求項 3】

【化 3】



(III)

[式中、

A は、アリール、またはヘテロアリール基であり；

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は独立して、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、シクロアルキル、置換シクロアルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルカノイル、置換アルカノイル、アミノ、置換アミノ、アミノアルキル、置換アミノアルキル、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、アミド、置換アミド、カルバメート、ウレイド、シアノ、スルホンアミド、置換スルホンアミド、アルキルスルホン、ニトロ、チオ、チオアルキル、アルキルチオ、二置換アミノ、アルキルスルホニル、アルキルスルフィニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、カルバモイル、置換カルバモイル、アルケニル、置換アルケニル、アルキニル、置換アルキニル、またはアルキルカルボニルであり；あるいは

R<sup>4</sup> および R<sup>5</sup> は、一緒になって、適宜置換される炭素環またはヘテロ環を形成し；

R<sup>6</sup> は水素、アルキル、置換アルキル、ヒドロキシ、シアノ、またはハロゲンであり；

R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は独立して、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、オキソ、アリールオキシ、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルカノイル、置換アルカノイル、アルカノイルオキシ、アミノ、アミノアルキル、置換アミノアルキル、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、二置換アミノ、アミド、置換アミド、カルバメート、置換カルバメート、ウレイド、シアノ、スルホンアミド、置換スルホンアミド、アルキルスルホン、ヘテロシクロアルキル、置換ヘテロシク

ロアルキル、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ニトロ、チオ、チオアルキル、アルキルチオ、アルキルスルホニル、アルキルスルフィニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、カルバモイル、アルケニル、置換アルキニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、アリールヘテロアリール、アリールアルコキシカルボニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アリールオキシアリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロシクリル、アルキルカルボニル、置換ヘテロアルキル、ヘテロアルケニル、置換ヘテロアルケニル、ヘテロアルキニル、置換ヘテロアルキニル、アリールアミノ、アリールアルキルアミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ、アリールアルカノイルアミノ、アリールチオ、アリールアルキルチオ、アリールスルホニル、アリールアルキルスルホニル、アルキルスルホニル、アリールカルボニルアミノ、またはアルキルアミノカルボニルであり；

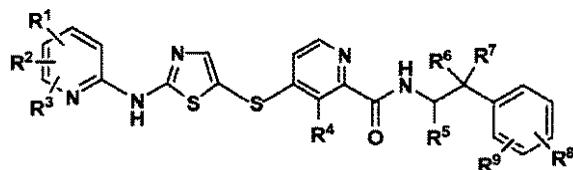
R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は独立して、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、アルキリデン、置換アルキリデン、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、アルコキシアルコキシアルキルハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、オキソ、アリールオキシ、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルカノイル、置換アルカノイル、アルカノイルオキシ、アミノ、アミノアルキル、置換アミノアルキル、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ニ置換アミノ、アミド、置換アミド、カルバメート、置換カルバメート、ウレイド、シアノ、スルホンアミド、置換スルホンアミド、アルキルスルホン、ヘテロシクロアルキル、置換ヘテロシクロアルキル、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ニトロ、チオ、チオアルキル、アルキルチオ、アルキルスルホニル、アルキルスルフィニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、カルバモイル、アルケニル、置換アルケニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、アリールヘテロアリール、アリールアルコキシカルボニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アリールオキシアリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロシクリル、アルキルカルボニル、置換ヘテロアルキル、ヘテロアルケニル、置換ヘテロアルケニル、ヘテロアルキニル、置換ヘテロアルキニル、アリールアミノ、アリールアルキルアミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ、アリールアルカノイルアミノ、アリールチオ、アリールアルキルチオ、アリールスルホニル、アリールアルキルスルホニル、アルキルスルホニル、アリールカルボニルアミノ、またはアルキルアミノカルボニルであり、あるいは

R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は、それらが結合している原子とともに、一緒になって適宜置換される炭素二環、または複素二環を形成する]

によって表される式 I I I である請求項 1 の化合物、またはその医薬的に許容される塩、もしくは立体異性体。

【請求項 4】

【化 4】



(IV)

[式中、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は独立して、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、シクロアルキル、置換シクロアルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルカノイル、置

換アルカノイル、アミノ、置換アミノ、アミノアルキル、置換アミノアルキル、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、アミド、置換アミド、カルバメート、ウレイド、シアノ、ニトロ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、カルバモイル、置換カルバモイル、アルケニル、置換アルケニル、アルキニル、置換アルキニル、またはアルキルカルボニルであり；あるいは

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、一緒になって、適宜置換される炭素環またはヘテロ環を形成し；

R<sup>4</sup> は水素、アルキル、置換アルキル、ヒドロキシ、シアノ、またはハロゲンであり；

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> は独立して、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、オキソ、アリールオキシ、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルカノイル、置換アルカノイル、アルカノイルオキシ、アミノ、アミノアルキル、置換アミノアルキル、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、二置換アミノ、アミド、置換アミド、カルバメート、置換カルバメート、ウレイド、シアノ、ヘテロシクロアルキル、置換ヘテロシクロアルキル、シクロアルキル、置換シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ニトロ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、カルバモイル、アルケニル、置換アルキニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、アリールヘテロアリール、アリールアルコキシカルボニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アリールオキシアリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロシクリル、アルキルカルボニル、置換ヘテロアルキル、ヘテロアルケニル、置換ヘテロアルケニル、ヘテロアルキニル、置換ヘテロアルキニル、アリールアミノ、アリールアルキルアミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ、アリールアルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、またはアルキルアミノカルボニルであり；

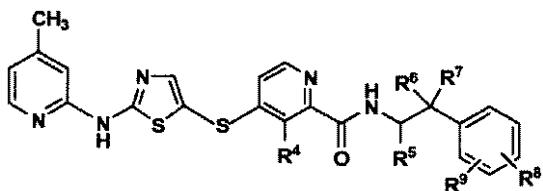
R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は独立して、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、アルコキシアルコキシアルキルハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、オキソ、アリールオキシ、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルカノイル、置換アルカノイル、アルカノイルオキシ、アミノ、アミノアルキル、置換アミノアルキル、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、二置換アミノ、アミド、置換アミド、カルバメート、置換カルバメート、ウレイド、シアノ、ヘテロシクロアルキル、置換ヘテロシクロアルキル、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ニトロ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、カルバモイル、アルケニル、置換アルケニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、アリールヘテロアリール、アリールアルコキシカルボニル、ヘテロアリールアルキル、アリールオキシアルキル、アリールオキシアリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロシクリル、アルキルカルボニル、置換ヘテロアルキル、ヘテロアルケニル、置換ヘテロアルケニル、アリールアミノ、アリールアルキルアミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ、アリールアルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、またはアルキルアミノカルボニルであり、あるいは

R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は、それらが結合している原子とともに、一緒になって適宜置換される炭素二環、または複素二環を形成する】

によって表される式 I V の化合物、またはその医薬的に許容される塩、もしくは立体異性体。

【請求項 5】

## 【化5】



(V)

[式中、

R<sup>4</sup> は水素、アルキル、置換アルキル、ヒドロキシ、シアノ、またはハロゲンであり；

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> は独立して、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、オキソ、アリールオキシ、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルカノイル、置換アルカノイル、アルカノイルオキシ、アミノ、アミノアルキル、置換アミノアルキル、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、二置換アミノ、アミド、置換アミド、カルバメート、置換カルバメート、ウレイド、シアノ、ヘテロシクロアルキル、置換ヘテロシクロアルキル、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ニトロ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、カルバモイル、アルケニル、置換アルキニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、アリールヘテロアリール、アリールアルコキシカルボニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アリールオキシアリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロシクリル、アルキルカルボニル、置換ヘテロアルキル、ヘテロアルケニル、置換ヘテロアルケニル、ヘテロアルキニル、置換ヘテロアルキニル、アリールアミノ、アリールアルキルアミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ、アリールアルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、またはアルキルアミノカルボニルであり；

R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は独立して、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、アルコキシアルコキシアルキルハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、オキソ、アリールオキシ、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルカノイル、置換アルカノイル、アルカノイルオキシ、アミノ、アミノアルキル、置換アミノアルキル、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、二置換アミノ、アミド、置換アミド、カルバメート、置換カルバメート、ウレイド、シアノ、ヘテロシクロアルキル、置換ヘテロシクロアルキル、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ニトロ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、カルバモイル、アルケニル、置換アルケニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、アリールヘテロアリール、アリールアルコキシカルボニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アリールオキシアリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロシクリル、アルキルカルボニル、置換ヘテロアルキル、ヘテロアルケニル、置換ヘテロアルケニル、ヘテロアルキニル、置換ヘテロアルキニル、アリールアミノ、アリールアルキルアミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ、アリールアルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、またはアルキルアミノカルボニルであり、あるいは

R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は、それらが結合している原子とともに、一緒にになって適宜置換される炭素二環、または複素二環を形成する]

によって表される式Vの化合物、またはその医薬的に許容される塩、もしくは立体異性体。

## 【請求項6】

医薬的に許容される担体、および請求項1から5の化合物の一またはそれ以上を含む医

薬組成物。

【請求項 7】

請求項 1 から 5 の化合物の一またはそれ以上を、医薬的に許容される担体、および他の抗癌剤または細胞毒性薬の一またはそれ以上と組み合わせて含む医薬組成物。

【請求項 8】

増殖性疾患の治療剤の製造における、請求項 1 から 5 のいずれかの化合物の使用。

【請求項 9】

該増殖性疾患が癌である、請求項 8 の使用。

【請求項 10】

該癌が前立腺癌、膀胱腺癌、乳癌、結腸癌、肺癌、卵巣癌、肺臓癌、甲状腺癌、神経芽細胞腫、膠芽細胞腫、髓芽腫、黒色腫、多発性骨髓腫、および急性骨髓性白血病(AML)である、請求項 9 の使用。

【請求項 11】

他の抗癌剤または細胞毒性薬の一またはそれ以上を、請求項 1 から 5 の化合物の一またはそれ以上と組み合わせて、治療が必要な温血動物に投与することをさらなる特徴とする、請求項 10 の使用。

【請求項 12】

アルツハイマー病の治療剤の製造における、請求項 1 から 5 のいずれかの化合物の使用。

【請求項 13】

治療が必要な哺乳類で受容体チロシンキナーゼ活性の調節のための、薬剤の製造における、請求項 1 から 5 のいずれかの化合物の使用。

【請求項 14】

治療が必要な哺乳類でIGF-1R関連疾患の治療剤の製造における、請求項 1 から 5 のいずれかの化合物の使用。

【請求項 15】

該IGF-1R関連疾患が、前立腺癌、膀胱腺癌、乳癌、結腸癌、肺癌、卵巣癌、肺臓癌、甲状腺癌、神経芽細胞腫、膠芽細胞腫、髓芽腫、黒色腫、多発性骨髓腫、および急性骨髓性白血病(AML)からなる群から選択される癌である、請求項 14 の使用。