

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】令和3年9月30日(2021.9.30)

【公表番号】特表2020-531432(P2020-531432A)

【公表日】令和2年11月5日(2020.11.5)

【年通号数】公開・登録公報2020-045

【出願番号】特願2020-508455(P2020-508455)

【国際特許分類】

C 07 D	513/14	(2006.01)
A 61 K	31/5025	(2006.01)
A 61 K	31/506	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	3/04	(2006.01)
A 61 P	3/10	(2006.01)
A 61 P	13/12	(2006.01)
A 61 P	9/10	(2006.01)
A 61 P	13/08	(2006.01)
A 61 P	37/06	(2006.01)

【F I】

C 07 D	513/14	C S P
A 61 K	31/5025	
A 61 K	31/506	
A 61 P	43/00	1 1 1
A 61 P	35/00	
A 61 P	3/04	
A 61 P	3/10	
A 61 P	13/12	
A 61 P	9/10	
A 61 P	13/08	
A 61 P	37/06	

【手続補正書】

【提出日】令和3年8月13日(2021.8.13)

【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

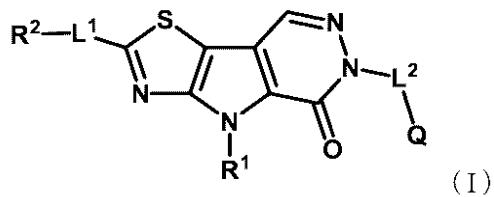
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

ピルビン酸キナーゼM2(PKM2)活性の調節を必要とする対象においてそれを調節する方法における使用のための組成物であって、式(I)の化合物またはその薬学的に許容される塩を含み、

【化145】



式中、Qは、水素、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、または任意で置換されたヘテロアリールであり、

$R^1$ は、水素、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたハロアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、 $-OR^{01}$ 、 $-C(=O)R^{c1}$ 、または窒素保護基であり、

$L^1$ は、結合、任意で置換されたアルキレン、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S-CH_2-$ 、 $-S(=O)CH_2-$ 、 $-S(=O)_2CH_2-$ 、 $-NR^{3}-$ 、 $-NR^{3}C(=O)-$ 、 $-C(=O)NR^{3}-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-C(=O)O-$ 、 $-NR^{3}C(=O)O-$ 、 $-OC(=O)NR^{3}-$ 、 $-NR^{3}C(=O)NR^{3}-$ 、 $-OC(R^4)_2-$ 、 $-C(R^4)_2O-$ 、 $-NR^{3}C(R^4)_2-$ 、 $-C(R^4)_2NR^{3}-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2O-$ 、 $-OS(=O)_2-$ 、 $-S(=O)O-$ 、 $-OS(=O)-$ 、 $-S(=O)_2NR^{3}-$ 、 $-NR^{3}S(=O)-$ 、 $-NR^{3}S(=O)_2O-$ 、 $-OS(=O)NR^{3}-$ 、または $-S(=O)(=NR^{3})-$ であり、 $R^2$ への結合点が左側にあり、

$L^2$ は、結合、任意で置換されたアルキレン、 $-C(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、または $-S(=O)-$ であり、Qへの結合点が右側にあり、

$R^2$ は、水素、ハロゲン、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルコキシ、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、もしくは任意で置換されたヘテロアリールであるか、あるいは、 $L^1$ が $-NR^{3}-$ 、 $-NR^{3}C(=O)-$ 、 $-NR^{3}C(=O)O-$ 、 $-NR^{3}C(R^4)_2-$ 、 $-NR^{3}S(=O)_2-$ 、 $-NR^{3}S(=O)-$ 、 $-NR^{3}C(=O)NR^{3}-$ 、 $-OC(R^4)_2-$ 、 $-OS(=O)_2-$ 、 $-OS(=O)NR^{3}-$ 、 $-OS(=O)NR^{3}-$ 、もしくは $-S(=O)-$ である場合、窒素保護基であるか、 $L^1$ が $-O-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)NR^{3}-$ 、 $-OC(R^4)_2-$ 、 $-OS(=O)_2-$ 、 $-OS(=O)NR^{3}-$ 、もしくは $-OS(=O)-$ である場合、酸素保護基であるか、または $L^1$ が $-S-$ である場合、硫黄保護基であり、

$R^3$ の各例は独立して、水素、 $-OR^{02}$ 、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、または窒素保護基であり、

$R^{01}$ および $R^{02}$ の各例は独立して、水素、任意で置換されたアルキル、または酸素保護基であり、

$R^{c1}$ の各例は独立して、任意で置換されたアルキル、または $-N(R^{c1})_2$ であり、式中、 $R^{c1}$ の各例が独立して、水素、 $-C_{1-6}$ アルキル、または窒素保護基であり、

$R^4$ の各例は独立して、水素、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、または任意で置換されたヘテロアリールである、組成物。

**【請求項 2】**

血漿グルコースのレベルの調節を必要とする対象においてそれを調節する方法における使用のための組成物であって、式(I)の化合物またはその薬学的に許容される塩を含み、式(I)が、請求項1に定義されるとおりである、組成物。

**【請求項 3】**

P KM 2 の機能に関連する疾患もしくは障害に罹患しているか、または罹患する可能性の高い対象において細胞増殖を阻害する方法における使用のための組成物であって、式(I)の化合物またはその薬学的に許容される塩を含み、式(I)が、請求項1に定義されるとおりである、組成物。

**【請求項 4】**

P KM 2 の異常活性に関連する疾患の治療を必要とする対象においてそれを治療する方法における使用のための組成物であって、式(I)の化合物またはその薬学的に許容される塩を含み、式(I)が、請求項1に定義されるとおりである、組成物。

**【請求項 5】**

前記疾患が、増殖性疾患である、請求項4に記載の組成物。

**【請求項 6】**

前記疾患が、癌、肥満、糖尿病性疾患（例えば、糖尿病性腎症（DN））、アテローム性動脈硬化症、再狭窄、冠動脈疾患（CAD）、ブルーム症候群（BS）、良性前立腺過形成（BPH）、または自己免疫疾患である、請求項4に記載の組成物。

**【請求項 7】**

高血糖の治療を必要とする対象においてそれを治療する方法における使用のための組成物であって、式(I)の化合物またはその薬学的に許容される塩を含み、式(I)が、請求項1に定義されるとおりである、組成物。

**【請求項 8】**

糖尿病性疾患の治療を必要とする対象においてそれを治療する方法における使用のための組成物であって、式(I)の化合物またはその薬学的に許容される塩を含み、式(I)が、請求項1に定義されるとおりである、組成物。

**【請求項 9】**

前記糖尿病性疾患が、糖尿病性腎症である、請求項8に記載の組成物。

**【請求項 10】**

前記方法が、P KM 2 の調節から利益を得るであろう対象を特定することをさらに含む、請求項1～9のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項 11】**

前記調節が、活性化である、請求項1に記載の組成物。

**【請求項 12】**

Qは、水素、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、任意で置換されたC<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>シクロアルキル、任意で置換された3～14員ヘテロシクリル、任意で置換された6～14員アリール、または任意で置換された5～14員ヘテロアリールであり、

R<sup>1</sup>は、水素、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、任意で置換された-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、任意で置換された-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル、任意で置換されたC<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>シクロアルキル、任意で置換された3～14員ヘテロシクリル、任意で置換された6～12員アリール、-OR<sup>0.1</sup>、-C(=O)R<sup>c.1</sup>、または窒素保護基であり、

L<sup>1</sup>は、結合、任意で置換されたC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン、-O-、-S-、-S-CH<sub>2</sub>-、-S(=O)CH<sub>2</sub>-、-S(=O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-NR<sup>3</sup>-、-NR<sup>3</sup>C(=O)-、-C(=O)NR<sup>3</sup>-、-C(=O)O-、-NR<sup>3</sup>C(=O)O-、-OC(=O)NR<sup>3</sup>-、-NR<sup>3</sup>C(=O)NR<sup>3</sup>-、-OC(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>-、-C(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>O-、-NR<sup>3</sup>C(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>-、-C(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NR<sup>3</sup>-、-S(=O)<sub>2</sub>-、-S(=O)-、-S(=O)<sub>2</sub>O-、-OS(=O)<sub>2</sub>-、-S(=O)O-、-OS(=O)-、-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>3</sup>-、-NR<sup>3</sup>S(=O)<sub>2</sub>

-、 - S ( = O ) N R <sup>3</sup> -、 - N R <sup>3</sup> S ( = O ) -、 - N R <sup>3</sup> S ( = O ) <sub>2</sub> O -、 - O S ( = O ) <sub>2</sub> N R <sup>3</sup> -、 - N R <sup>3</sup> S ( = O ) O -、 - O S ( = O ) N R <sup>3</sup> -、 または - S ( = O ) ( = N R <sup>3</sup> ) - であり、 R <sup>2</sup> への結合点が左側にあり、

L <sup>2</sup> は、結合、任意で置換された C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキレン、 - C ( = O ) -、 - S ( = O ) <sub>2</sub> -、 または - S ( = O ) - であり、 Q への結合点が右側にあり、

R <sup>2</sup> は、水素、ハロゲン、任意で置換された - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、任意で置換された - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルコキシ、任意で置換された - C <sub>3</sub> - C <sub>1</sub> <sub>2</sub> シクロアルキル、任意で置換された 3 ~ 14 員ヘテロシクリル、任意で置換された - C <sub>6</sub> - C <sub>1</sub> <sub>2</sub> アリール、もしくは任意で置換された 3 ~ 14 員ヘテロアリールであるか、あるいは、L <sup>1</sup> が - N R <sup>3</sup> -、 - N R <sup>3</sup> C ( = O ) -、 - N R <sup>3</sup> C ( = O ) O -、 - N R <sup>3</sup> C ( R <sup>4</sup> ) <sub>2</sub> -、 - N R <sup>3</sup> S ( = O ) <sub>2</sub> -、 - N R <sup>3</sup> S ( = O ) -、 - N R <sup>3</sup> C ( = O ) N R <sup>3</sup> -、 - N R <sup>3</sup> S ( = O ) <sub>2</sub> O -、 または - N R <sup>3</sup> S ( = O ) O - である場合、窒素保護基であるか、L <sup>1</sup> が - O -、 - O C ( = O ) -、 - O C ( = O ) N R <sup>3</sup> -、 - O C ( R <sup>4</sup> ) <sub>2</sub> -、 - O S ( = O ) -、 - O S ( = O ) <sub>2</sub> N R <sup>3</sup> -、 - O S ( = O ) N R <sup>3</sup> -、 または - O S ( = O ) - である場合、酸素保護基であるか、または L <sup>1</sup> が - S - である場合、硫黄保護基であり、

R <sup>3</sup> の各例は独立して、水素、 - O R <sup>0</sup> <sup>2</sup> 、任意で置換された - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、任意で置換された - C <sub>2</sub> - C <sub>6</sub> アルケニル、任意で置換された - C <sub>2</sub> - C <sub>6</sub> アルキニル、任意で置換された C <sub>3</sub> - C <sub>1</sub> <sub>2</sub> シクロアルキル、任意で置換された C <sub>3</sub> - C <sub>1</sub> <sub>2</sub> ヘテロシクリル、任意で置換された C <sub>6</sub> - C <sub>1</sub> <sub>2</sub> アリール、任意で置換された C <sub>5</sub> - C <sub>1</sub> <sub>2</sub> ヘテロアリール、または窒素保護基であり、

R <sup>0</sup> <sup>1</sup> および R <sup>0</sup> <sup>2</sup> の各例は独立して、水素、任意で置換された - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、または酸素保護基であり、

R <sup>c</sup> <sup>1</sup> の各例は独立して、任意で置換された - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、または - N ( R <sup>c</sup> <sup>n</sup> ) <sub>2</sub> であり、式中、R <sup>c</sup> <sup>n</sup> の各例が独立して、水素、 - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、または窒素保護基であり、

R <sup>4</sup> の各例は独立して、水素、任意で置換された - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、任意で置換された - C <sub>2</sub> - C <sub>6</sub> アルケニル、任意で置換された - C <sub>2</sub> - C <sub>6</sub> アルキニル、任意で置換された C <sub>3</sub> - C <sub>1</sub> <sub>2</sub> シクロアルキル、任意で置換された 3 ~ 14 員ヘテロシクリル、任意で置換された C <sub>6</sub> - C <sub>1</sub> <sub>2</sub> アリール、または任意で置換された 5 ~ 14 員ヘテロアリールである、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の組成物。

### 【請求項 13】

Q は、 C <sub>6</sub> - C <sub>1</sub> <sub>2</sub> アリール、5 ~ 6 員单環式ヘテロアリール、または 8 ~ 12 員二環式ヘテロアリールであり、それらの各々が、0 ~ 3 回出現する R <sup>c</sup> で置換され、

R <sup>1</sup> は、水素、 - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、 - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> ハロアルキル、 C <sub>3</sub> - C <sub>7</sub> 单環式シクロアルキルおよび 3 ~ 14 員ヘテロシクリル、 - O R <sup>0</sup> <sup>1</sup> 、 - C ( = O ) R <sup>c</sup> <sup>1</sup> 、または窒素保護基から選択され、式中、アルキル、シクロアルキル、またはヘテロシクリルの各々が、0 ~ 3 回出現する R <sup>d</sup> で置換され、

R <sup>2</sup> は、水素、ハロゲン、 - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、 - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルコキシ、 C <sub>3</sub> - C <sub>7</sub> 单環式シクロアルキル、 C <sub>6</sub> - C <sub>1</sub> <sub>2</sub> 二環式シクロアルキル、3 ~ 14 員ヘテロシクリル、 C <sub>6</sub> - C <sub>1</sub> <sub>2</sub> アリール、5 ~ 6 員单環式ヘテロアリール、8 ~ 12 員二環式ヘテロアリールから選択され、式中、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、およびヘテロアリールの各々が、0 ~ 3 回出現する R <sup>e</sup> で置換されるか、あるいは、L <sup>1</sup> が - N R <sup>3</sup> -、 - N R <sup>3</sup> C ( = O ) -、 - N R <sup>3</sup> C ( = O ) O -、 - N R <sup>3</sup> C ( R <sup>4</sup> ) <sub>2</sub> -、 - N R <sup>3</sup> S ( = O ) <sub>2</sub> -、 - N R <sup>3</sup> S ( = O ) -、 - N R <sup>3</sup> C ( = O ) N R <sup>3</sup> -、 - N R <sup>3</sup> S ( = O ) <sub>2</sub> O -、 または - N R <sup>3</sup> S ( = O ) O - である場合、窒素保護基であるか、L <sup>1</sup> が - O -、 - O C ( = O ) -、 - O C ( = O ) N R <sup>3</sup> -、 - O C ( R <sup>4</sup> ) <sub>2</sub> -、 - O S ( = O ) -、 - O S ( = O ) <sub>2</sub> -、 - O S ( = O ) <sub>2</sub> N R <sup>3</sup> -、 - O S ( = O ) N R <sup>3</sup> -、 または - O S ( = O ) - である場合、酸素保護基であるか、または L <sup>1</sup> が - S - である場合、硫黄保護基であり、

R<sub>3</sub>は、水素、-OR<sub>2</sub>、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>単環式シクロアルキル、C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>二環式シクロアルキル、3~14員ヘテロシクリル、C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>アリール、5~6員単環式ヘテロアリール、および8~12員二環式ヘテロアリールから選択され、式中、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールの各々が、0~3回出現するR<sub>f</sub>で置換され、

R<sub>4</sub>は、水素、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>単環式シクロアルキル、および3~14員ヘテロシクリルから選択され、式中、アルキル、シクロアルキル、またはヘテロシクリルの各々が、0~1回出現するR<sub>g</sub>で置換され、

L<sup>1</sup>は、結合、0~3回出現するR<sup>h</sup>で置換されるアルキレン、-O-、-S-、-S-C(H<sub>2</sub>)-、-S(=O)CH<sub>2</sub>-、-S(=O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-NR<sup>3</sup>-、-NR<sup>3</sup>C(=O)-、-C(=O)O-、-NR<sup>3</sup>C(=O)O-、-OC(=O)NR<sup>3</sup>-、-NR<sup>3</sup>C(=O)NR<sup>3</sup>-、-OC(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>-、-C(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>O-、-NR<sup>3</sup>C(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>-、-C(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NR<sup>3</sup>-、-S(=O)<sub>2</sub>-、-S(=O)-、-S(=O)<sub>2</sub>O-、-OS(=O)<sub>2</sub>-、-S(=O)O-、-OS(=O)-、-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>3</sup>-、-NR<sup>3</sup>S(=O)-、-NR<sup>3</sup>S(=O)<sub>2</sub>O-、-OS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>3</sup>-、-NR<sup>3</sup>S(=O)O-、-OS(=O)NR<sup>3</sup>-、または-S(=O)(=NR<sup>3</sup>)-であり、R<sup>2</sup>への結合点が左側にあり、

L<sup>2</sup>は、結合、0~3回出現するR<sup>h</sup>で置換されるアルキレン、-C(=O)-、-S(=O)<sub>2</sub>-、または-S(=O)-であり、Qへの結合点が右側にあり、

各R<sup>c</sup>は独立して、ハロ、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ヒドロキシアルキル、-OH、-OC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アミノアルキル、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-C(=O)OC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-C(=O)OH、-C(=O)C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-C(=O)NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-C(=O)N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-NHC(=O)NH<sub>2</sub>、-NHC(=O)NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-NH(C=O)N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-NHC(=O)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)C(=O)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-NHS(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>、-CN、および-N<sub>2</sub>から選択されるか、または、同一もしくは隣接する炭素原子に結合したR<sup>c</sup>の2つの例が、それらが結合する炭素原子と一緒にになって、シクロアルキルもしくはヘテロシクリルC(=O)OHを形成し、

各R<sup>d</sup>は独立して、ハロ、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-OH、-OC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-NH<sub>2</sub>、および-CNから選択され、

各R<sup>e</sup>は独立して、ハロ、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ヒドロキシアルキル、-OH、-OC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アミノアルキル、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-C(=O)OC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-C(=O)OH、-C(=O)C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-C(=O)NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-C(=O)N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-NHC(=O)NH<sub>2</sub>、-NHC(=O)NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-NH(C=O)N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-NHC(=O)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)C(=O)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-NHS(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>、-CN、および-N<sub>2</sub>から選択されるか、または、同一もしくは隣接する炭素原子に結合したR<sup>e</sup>の2つの例が、それらが結合する炭素原子と一緒にになって、シクロアルキルもしくはヘテロシクリルを形成し、

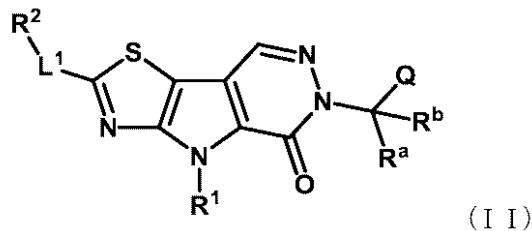
各R<sup>f</sup>は独立して、ハロ、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ、-OH、-NH<sub>2</sub>、-CN、および-N<sub>2</sub>から選択され、

各 R<sup>g</sup> は独立して、ハロ、 - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、 - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ハロアルキル、 - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ、 - OH、 NH<sub>2</sub>、 - CN、 および NO<sub>2</sub> から選択され、  
 各 R<sup>h</sup> は独立して、ハロ、 - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、 - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ハロアルキル、 - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ヒドロキシアルキル、 - OH、 - OC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、 - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アミノアルキル、 - NH(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル)、 - N(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル)<sub>2</sub>、 - C(=O)OC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、 - C(=O)OH、 - C(=O)C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、 - C(=O)NH<sub>2</sub>、 - C(=O)NH(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル)、 - C(=O)N(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル)<sub>2</sub>、 - NHCO(=O)NH<sub>2</sub>、 - NHCO(=O)NH(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル)、 - NH(C=O)N(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル)<sub>2</sub>、 - NHCO(=O)(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル)、 - S(=O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、 - S(=O)<sub>2</sub>NH(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル)<sub>2</sub>、 - NHSC(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル)、 - NH<sub>2</sub>、 - CN、 および - NO<sub>2</sub>、 S(=O)<sub>2</sub>アリール、 S(=O)<sub>2</sub>ヘテロアリールおよび =NOH から選択されるか、または、同一もしくは隣接する炭素原子に結合した R<sup>h</sup> の 2 つの例が、それらが結合する炭素原子と一緒にになって、シクロアルキルもしくはヘテロシクリルを形成する、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の組成物。

## 【請求項 14】

前記化合物が、式(I I)の化合物：

## 【化 146】



またはその薬学的に許容される塩であり、式中、

R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> はそれぞれ独立して、水素、ハロゲン、 - CN、 - NO<sub>2</sub>、 - N<sub>3</sub>、 任意で置換されたアルキル、 - OR<sup>o</sup><sup>3</sup>、 - N(R<sup>n</sup><sup>1</sup>)<sub>2</sub>、 - C(=O)N(R<sup>n</sup><sup>1</sup>)<sub>2</sub>、 もしくは - C(=O)R<sup>c</sup><sup>2</sup> であるか、または R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> が、炭素原子と一緒にになって、任意で置換されたシクロアルキルもしくは任意で置換されたヘテロシクリルを形成することができ、

R<sup>n</sup><sup>1</sup> の各例は独立して、水素、任意で置換された - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、または窒素保護基であり、

R<sup>o</sup><sup>3</sup> の各例は独立して、水素、任意で置換された - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、または酸素保護基であり、

R<sup>c</sup><sup>2</sup> の各例が独立して、任意で置換された - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルである、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の組成物。

## 【請求項 15】

L<sup>1</sup> が、結合、任意で置換された - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキレン、 - C(=O) - 、 - S(=O) - 、 - S(=O)<sub>2</sub> - 、 - NR<sup>3</sup>C(=O) - 、 または - C(=O)NR<sup>3</sup> - である、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の組成物。

## 【請求項 16】

L<sup>1</sup> が、R<sup>j</sup> および R<sup>k</sup> で置換された C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキレンであり、  
 式中、R<sup>j</sup> および R<sup>k</sup> の各例は独立して、H、ハロゲン、 - CN、 - OR<sup>o</sup><sup>7</sup>、 - N(R<sup>n</sup><sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - N(R<sup>n</sup><sup>5</sup>)C(=O)R<sup>c</sup><sup>5</sup>、 - C(=O)N(R<sup>n</sup><sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - C(=O)R<sup>c</sup><sup>5</sup>、 - C(=O)OR<sup>o</sup><sup>7</sup>、 - SR<sup>j</sup><sup>s</sup>、 - S(=O)<sub>2</sub>R<sup>j</sup><sup>s</sup>、 もしくは - S(=O)R<sup>j</sup><sup>s</sup>、 任意で置換された - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルから選択されるか、または R<sup>j</sup> および R<sup>k</sup> が、炭素原子と一緒にになって、C=O、C=N R<sup>j</sup><sup>n</sup>、 任意で置換された C<sub>3</sub>

- C<sub>6</sub> 単環式シクロアルキル環、もしくは任意で置換された C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> 単環式ヘテロシクリル環を形成することができ、

R<sup>n</sup><sup>5</sup> および R<sup>j</sup><sup>n</sup> の各例は独立して、水素、任意で置換された - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、- OR<sup>o</sup><sup>8</sup>、または窒素保護基であり、

R<sup>o</sup><sup>7</sup> の各例は独立して、水素、任意で置換された - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、または酸素保護基であり、

R<sup>c</sup><sup>5</sup> の各例は独立して、任意で置換された - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルであり、

R<sup>j</sup><sup>s</sup> の各例が独立して、任意で置換された - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、任意で置換された C<sub>6</sub> - C<sub>1</sub><sub>2</sub> アリール、任意で置換されたヘテロアリール、または硫黄保護基である、請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の組成物。

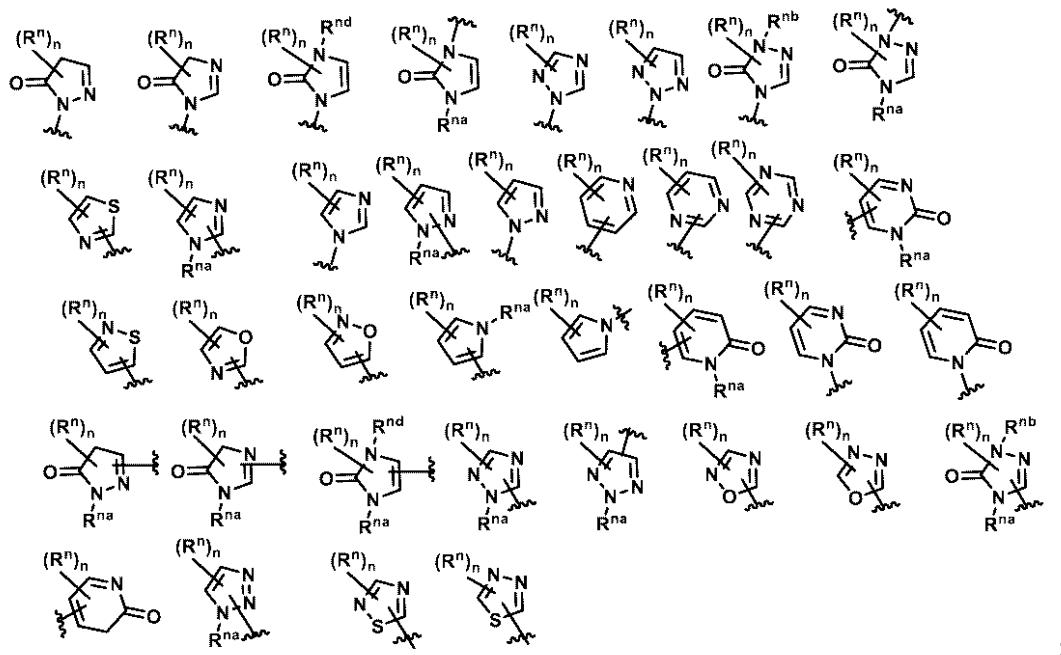
### 【請求項 17】

Q が、任意で置換された 5 ~ 6 員単環式ヘテロアリールである、請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の組成物。

### 【請求項 18】

Q が、以下の式のうちの 1 つであり、

### 【化 147】



式中、

R<sup>n</sup> の各例は独立して、水素、ハロゲン、- CN、- NO<sub>2</sub>、- N<sub>3</sub>、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたヘテロアリール、- OR<sup>o</sup><sup>4</sup>、- SR<sup>s</sup><sup>1</sup>、- N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)<sub>2</sub>、

- C(=O)N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)<sub>2</sub>、- N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)C(=O)R<sup>c</sup><sup>3</sup>、- C(=O)R<sup>c</sup><sup>3</sup>、- C(=O)OR<sup>o</sup><sup>4</sup>、- OC(=O)R<sup>c</sup><sup>3</sup>、- S(=O)R<sup>s</sup><sup>1</sup>、- S(=O)<sub>2</sub>R<sup>s</sup><sup>1</sup>、- S(=O)OR<sup>o</sup><sup>4</sup>、- OS(=O)R<sup>c</sup><sup>3</sup>、- S(=O)<sub>2</sub>OR<sup>o</sup><sup>4</sup>、- OS(=O)<sub>2</sub>R<sup>c</sup><sup>3</sup>、- S(=O)N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)<sub>2</sub>、- S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)<sub>2</sub>、- N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)S(=O)R<sup>s</sup><sup>1</sup>、- N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)S(=O)<sub>2</sub>R<sup>s</sup><sup>1</sup>、- N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)C(=O)OR<sup>o</sup><sup>4</sup>、- OC(=O)N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)<sub>2</sub>、- N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)C(=O)N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)<sub>2</sub>、- N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)S(=O)N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)<sub>2</sub>、- N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)S(=O)OR<sup>o</sup><sup>4</sup>、- N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)S(=O)<sub>2</sub>OR<sup>o</sup><sup>4</sup>、- OS(=O)N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)<sub>2</sub>、もしくは - OS(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)<sub>2</sub> であるか、または、同一もしくは

隣接する炭素原子に結合した  $R^n$  の 2 つの例が、それらが結合する炭素原子と一緒にになって、任意で置換されたシクロアルキルもしくはヘテロシクロアルキルを形成し、  
 $R^{n^2}$  の各例は独立して、水素、任意で置換された -  $C_1 - C_6$  アルキル、または窒素保護基であり、  
 $R^{n^4}$  の各例は独立して、水素、任意で置換された -  $C_1 - C_6$  アルキル、または酸素保護基であり、

$R^{n^3}$  の各例は独立して、任意で置換された -  $C_1 - C_6$  アルキルであり、

$R^{n^1}$  の各例は独立して、任意で置換された -  $C_1 - C_6$  アルキルまたは硫黄保護基であり、

$n$  は、結合価が許す限り、0、1、2、または3であり、

$R^{n^a}$ 、 $R^{n^b}$ 、および  $R^{n^d}$  の各々が独立して、水素、任意で置換された -  $C_1 - C_6$  アルキル、または窒素保護基である、請求項 1 ~ 17 のいずれか一項に記載の組成物。

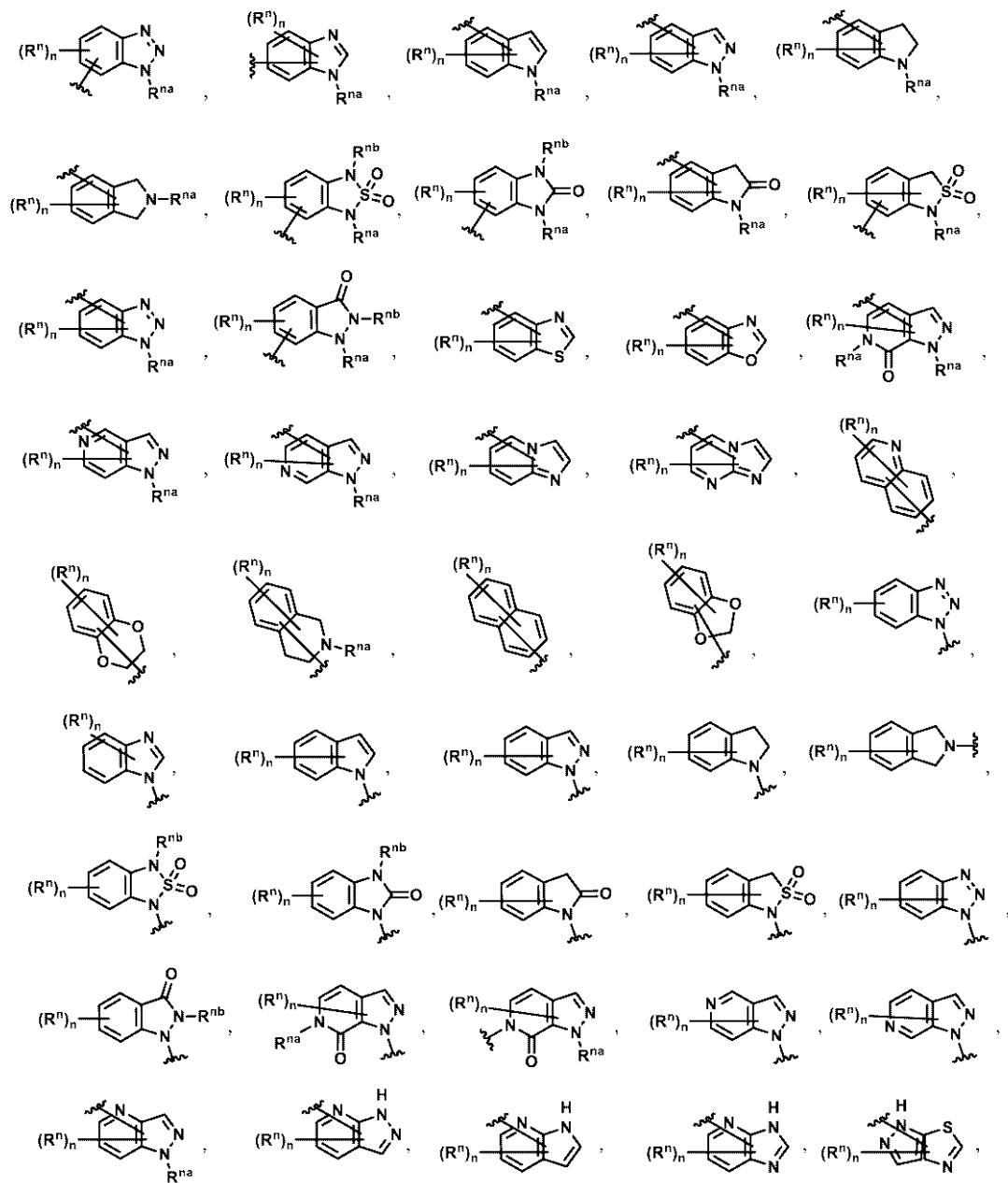
【請求項 19】

$Q$  が、任意で置換された 8 ~ 12 員二環式ヘテロアリール、または任意で置換された 8 ~ 12 員二環式ヘテロシクリルである、請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の組成物。

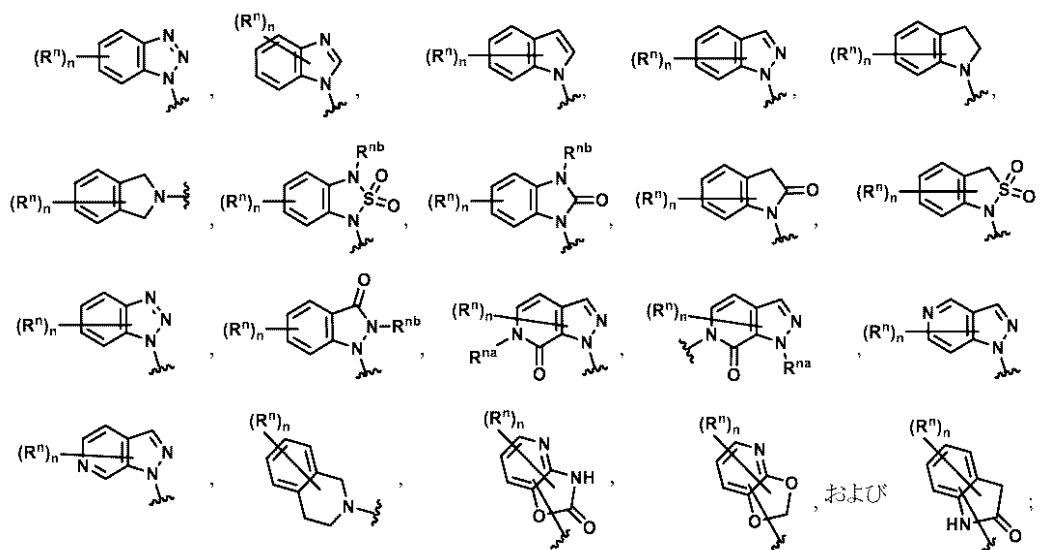
【請求項 20】

$Q$  が、以下の式のうちの 1 つであり、

【化 1 4 8】



## 【化149】



式中、 $R^n$  の各例は独立して、水素、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたヘテロアリール、-OR<sup>o</sup><sup>4</sup>、-SR<sup>s</sup><sup>1</sup>、-N(R<sup>n</sup>)<sub>2</sub>、-C(=O)N(R<sup>n</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>n</sup>)C(=O)R<sup>c</sup><sup>3</sup>、-C(=O)R<sup>c</sup><sup>3</sup>、-C(=O)OR<sup>o</sup><sup>4</sup>、-OC(=O)R<sup>c</sup><sup>3</sup>、-S(=O)R<sup>s</sup><sup>1</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>R<sup>s</sup><sup>1</sup>、-S(=O)OR<sup>o</sup><sup>4</sup>、-OS(=O)R<sup>c</sup><sup>3</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>OR<sup>o</sup><sup>4</sup>、-OS(=O)<sub>2</sub>R<sup>c</sup><sup>3</sup>、-S(=O)N(R<sup>n</sup>)<sub>2</sub>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>n</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>n</sup>)S(=O)R<sup>s</sup><sup>1</sup>、-N(R<sup>n</sup>)<sub>2</sub>S(=O)<sub>2</sub>R<sup>s</sup><sup>1</sup>、-N(R<sup>n</sup>)C(=O)OR<sup>o</sup><sup>4</sup>、-OC(=O)N(R<sup>n</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>n</sup>)C(=O)N(R<sup>n</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>n</sup>)S(=O)N(R<sup>n</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>n</sup>)<sub>2</sub>S(=O)OR<sup>o</sup><sup>4</sup>、-N(R<sup>n</sup>)<sub>2</sub>S(=O)<sub>2</sub>OR<sup>o</sup><sup>4</sup>、-OS(=O)N(R<sup>n</sup>)<sub>2</sub>、-OS(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>n</sup>)<sub>2</sub>から選択されるか、または、同一もしくは隣接する炭素原子に結合した $R^n$ の2つの例が、それらが結合する原子と一緒にになって、任意で置換されたシクロアルキルもしくはヘテロシクロアルキルを形成し、

$R^{n\alpha}$  および  $R^{nb}$  の各例は独立して、水素、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、または窒素保護基であり、

$R^{n\beta}$  の各例は独立して、水素、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、または窒素保護基であり、

$R^o$ <sup>4</sup> の各例は独立して、水素、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、または酸素保護基であり、

$R^c$ <sup>3</sup> の各例は独立して、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルであり、

$R^s$ <sup>1</sup> の各例が独立して、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、または硫黄保護基であり、

$n$  が、結合価が許す限り、0、1、2、または3である、請求項1～16および19のいずれか一項に記載の組成物。

## 【請求項21】

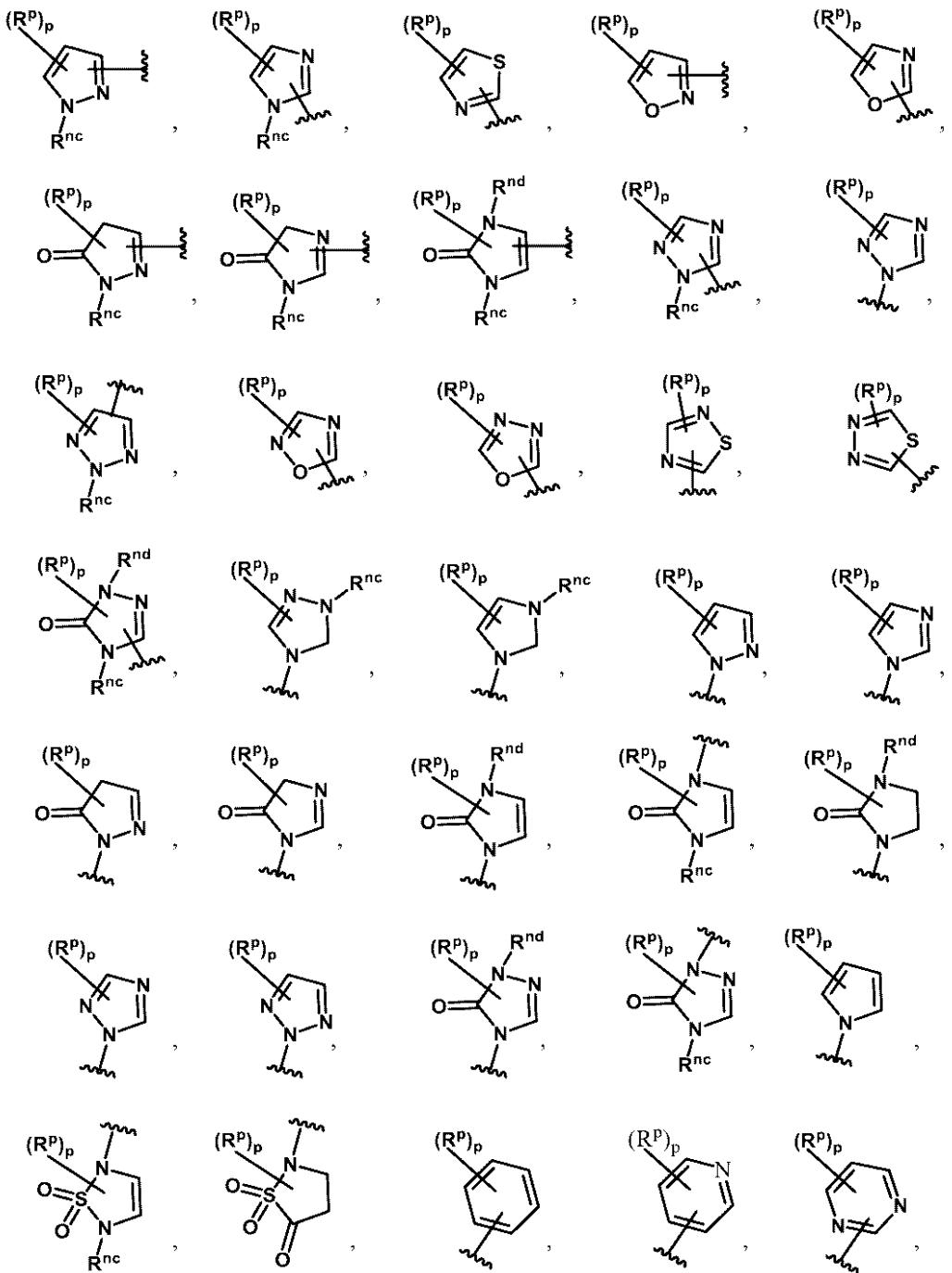
$R^2$  が、水素、ヒドロキシリル、ハロゲン、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシリル、フェニル、ナフタレニル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、5員ヘテロアリール、6員ヘテロアリール、8員二環式ヘテロアリール、9員二環式ヘテロアリールから選択され、式中、アルキル、アルケニル、フェニル、およびヘテロアリールの各々が、0～3回出現する $R^e$ で置換される、請求項1～20のいずれか一項に記載

の組成物。

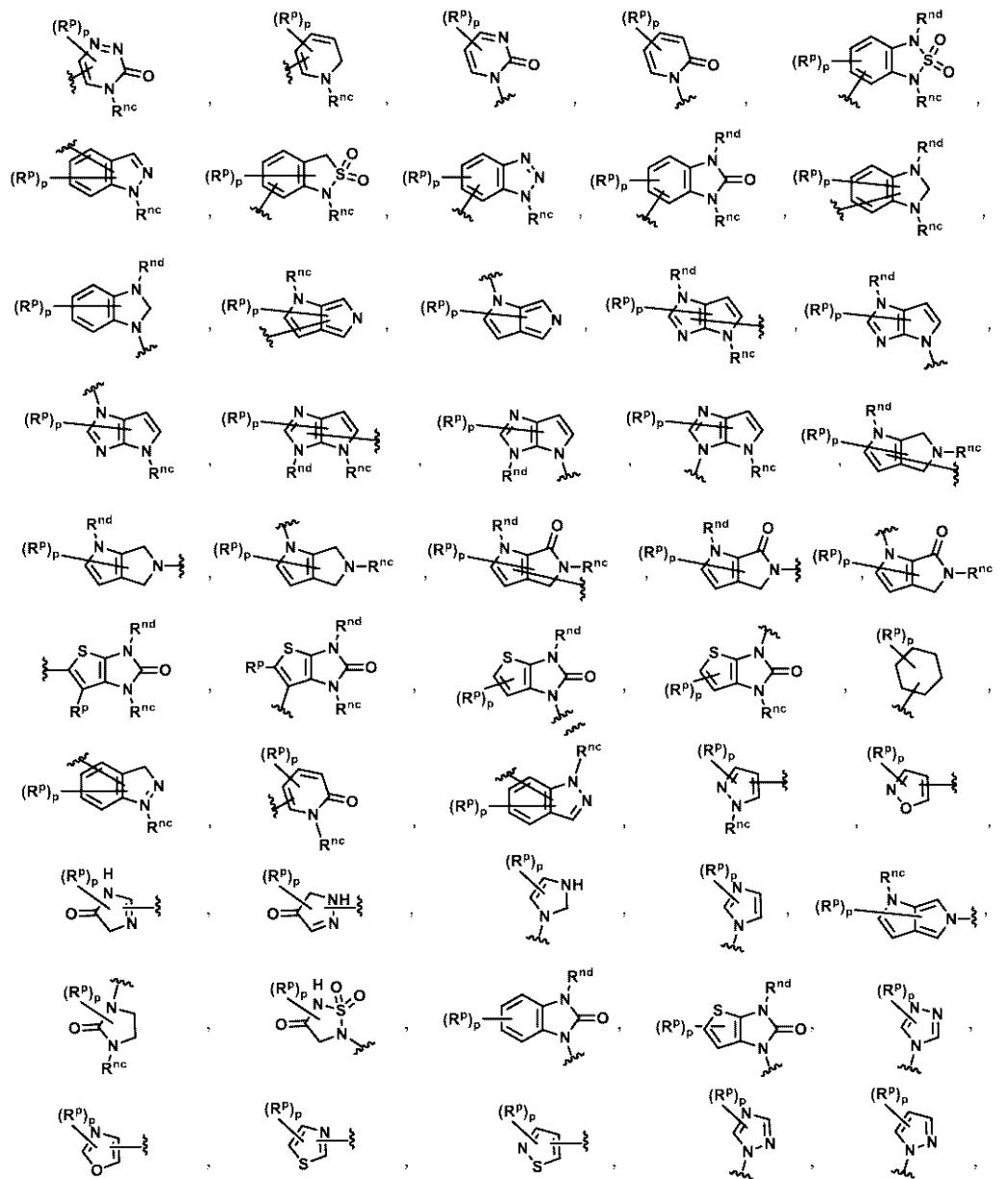
【請求項 22】

$R^2$  が、以下の式のうちの 1 つであり、

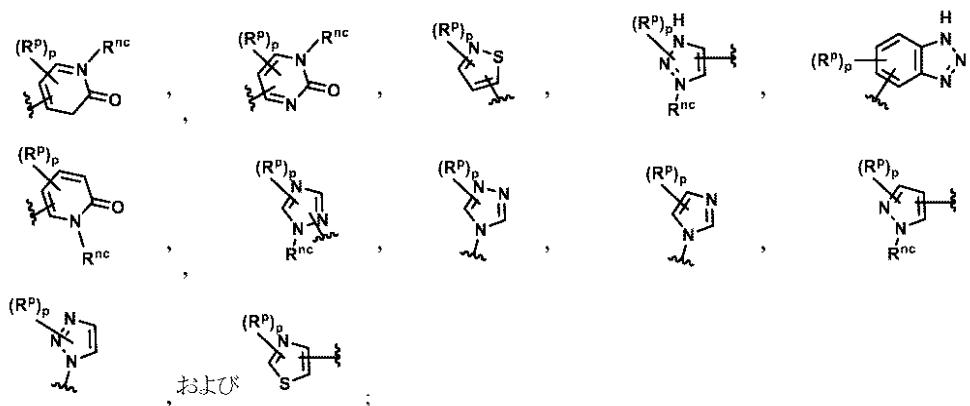
【化 150】



【化 1 5 1】



【化 1 5 2】



式中、 $R^P$  の各例が独立して、水素、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、任意で置

換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたヘテロアリール、 $-OR^{\circ 6}$ 、 $-SR^{s 2}$ 、 $-N(R^{n 3})_2$ 、 $-C(=O)N(R^{n 3})_2$ 、 $-N(R^{n 3})C(=O)R^{c 4}$ 、 $-C(=O)R^{c 4}$ 、 $-C(=O)OR^{\circ 6}$ 、 $-OC(=O)R^{c 4}$ 、 $-S(=O)R^{s 2}$ 、 $-S(=O)_2R^s$ 、 $-S(=O)OR^{\circ 6}$ 、 $-OS(=O)R^{c 4}$ 、 $-S(=O)_2OR^{\circ 6}$ 、 $-OS(=O)_2R^{c 4}$ 、 $-S(=O)N(R^{n 3})_2$ 、 $-S(=O)_2N(R^{n 3})_2$ 、 $-N(R^{n 3})S(=O)R^{s 2}$ 、 $-N(R^{n 3})S(=O)_2R^s$ 、 $-N(R^{n 3})C(=O)OR^{\circ 6}$ 、 $-OC(=O)N(R^{n 3})_2$ 、 $-N(R^{n 3})C(=O)N(R^{n 3})_2$ 、 $-N(R^{n 3})S(=O)N(R^{n 3})_2$ 、 $-N(R^{n 3})S(=O)_2N(R^{n 3})_2$ 、 $-N(R^{n 3})S(=O)OR^{\circ 6}$ 、 $-N(R^{n 3})S(=O)_2OR^{\circ 6}$ 、 $-OS(=O)N(R^{n 3})_2$ 、 $-OS(=O)_2N(R^{n 3})_2$ から選択されるか、または、同一もしくは隣接する炭素原子に結合した $R^p$ の2つの例が、それらが結合する原子と一緒にになって、任意で置換されたシクロアルキルもしくはヘテロシクロアルキルを形成し、

$R^{n 3}$ 、 $R^{n c}$ 、および $R^{n d}$ の各例は独立して、水素、任意で置換された $-C_1-C_6$ アルキル、または窒素保護基であり、

$R^{\circ 6}$ の各例は独立して、水素、任意で置換された $-C_1-C_6$ アルキル、または酸素保護基であり、

$R^{c 4}$ の各例は独立して、任意で置換された $-C_1-C_6$ アルキルであり、

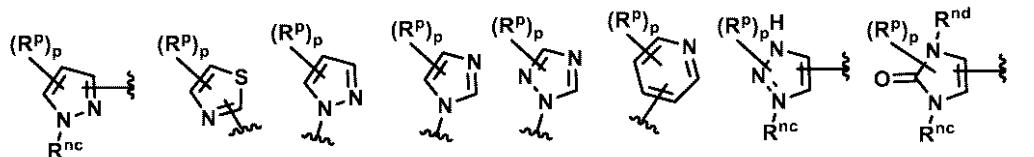
$R^{s 2}$ の各例が独立して、任意で置換された $-C_1-C_6$ アルキル、または硫黄保護基であり、

$p$ が、結合価が許す限り、0、1、2、または3である、請求項1～21のいずれか一項に記載の組成物。

### 【請求項23】

$R^2$ が、以下のうちの1つから選択される、請求項1～22のいずれか一項に記載の組成物

### 【化153】



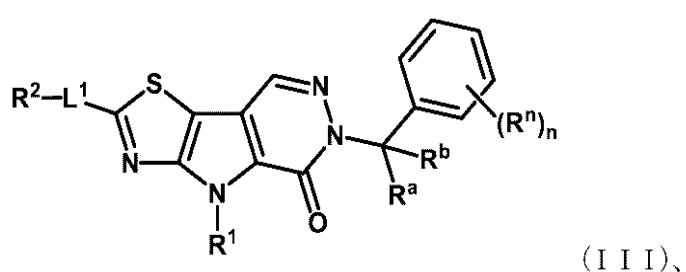
### 【請求項24】

$R^p$ の各例が独立して、水素、ハロゲン、任意で置換された $C_{1-4}$ アルキル、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ 、 $-OR^{\circ 4}$ 、 $-N(R^{n 2})_2$ 、 $-C(=O)N(R^{n 2})_2$ 、 $-C(=O)R^{c 3}$ 、または $-C(=O)OR^{\circ 4}$ である、請求項22および23のいずれか一項に記載の組成物。

### 【請求項25】

前記化合物が、式(I II I)の化合物：

### 【化154】

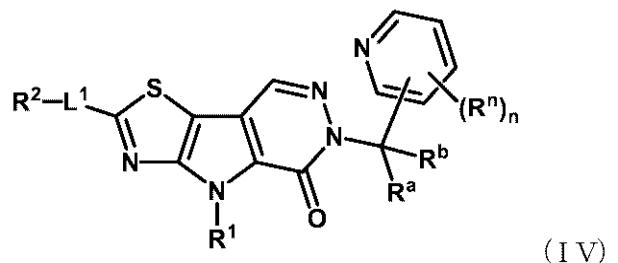


またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が請求項14に定義されるとおりであり、R<sup>n</sup>およびnが請求項18または請求項20に定義されるとおりである、請求項1～16および21～24のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項26】**

前記化合物が、式(IV)の化合物：

**【化155】**

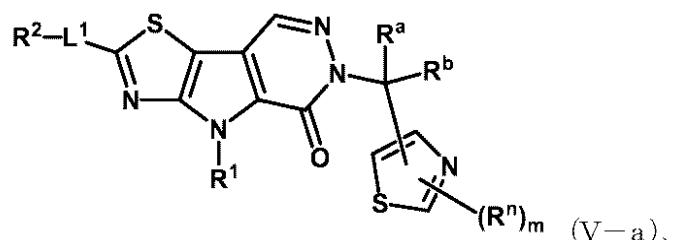


またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が請求項14に定義されるとおりであり、R<sup>n</sup>およびnが請求項18または請求項20に定義されるとおりである、請求項1～18および21～24のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項27】**

前記化合物が、式(V-a)の化合物：

**【化156】**

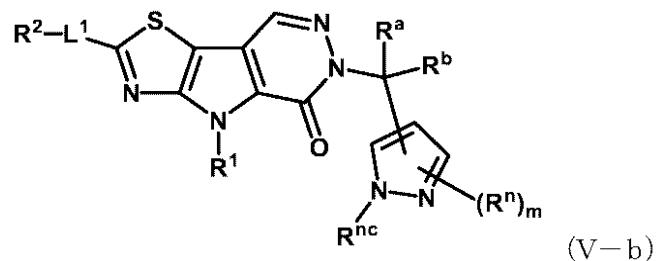


またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が請求項14に定義されるとおりであり、R<sup>n</sup>が請求項18または請求項20に定義されるとおりであり、mが0、1、または2である、請求項1～18および21～24のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項28】**

前記化合物が、式(V-b)の化合物：

**【化157】**



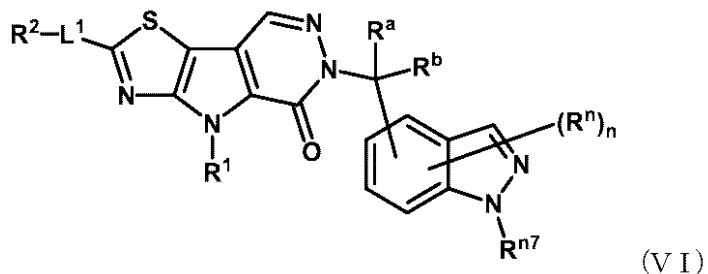
またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が請求項14に定義されるとおりであり、R<sup>n</sup>が請求項18または請求項20に定義されるとおりであり、mが0、1、または2であり、R<sup>n</sup><sup>c</sup>が独立して、水素、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、または窒素保護基である、請求項1～18および21～24のいずれか一項に記載

の組成物。

【請求項 29】

前記化合物が、式(ⅤⅠ)の化合物：

【化158】

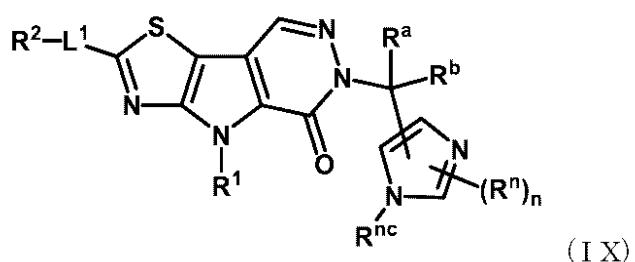


またはその薬学的に許容される塩であり、式中、 $R^a$  および  $R^b$  が請求項14に定義されるとおりであり、 $R^n$  および  $n$  が請求項18または請求項20に定義されるとおりであり、 $R^{n7}$  が水素、任意で置換された- $C_1-C_6$ アルキル、または窒素保護基である、請求項1～16および19～24のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項30】

前記化合物が、式(IX)の化合物：

【化159】

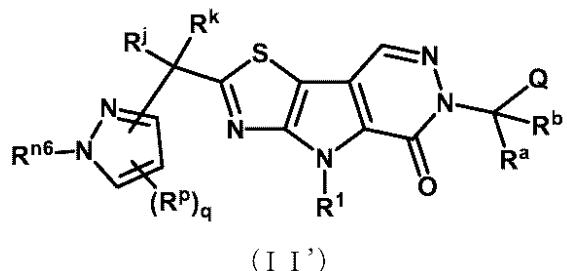


またはその薬学的に許容される塩であり、式中、 $R^a$  および  $R^b$  が請求項14に定義されるとおりであり、 $R^n$  および  $n$  が請求項18または請求項20に定義されるとおりであり、 $R^{nC}$  が独立して、水素、任意で置換された- $C_1-C_6$ アルキル、または窒素保護基である、請求項1～18および21～24のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項31】

前記化合物が、以下の構造式によって表されるか、

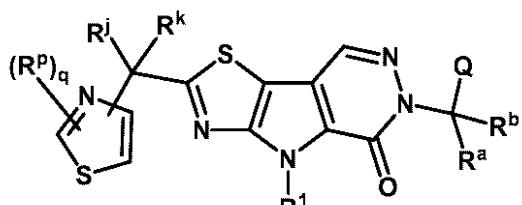
【化160】



またはその薬学的に許容される塩であり、式中、 $R^a$  および  $R^b$  が請求項14に定義されるとおりであり、 $R^j$  および  $R^k$  が請求項16に定義されるとおりであり、 $R^p$  が請求項22に定義されるとおりであり、 $q$  が0、1、2、または3である、請求項1～30のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項32】

前記化合物が、以下の構造式によって表されるか、  
【化161】



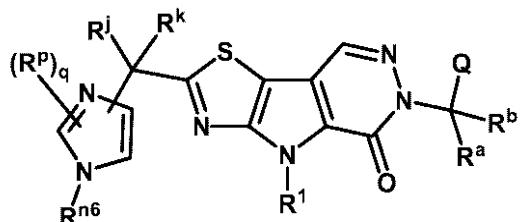
(III')

またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が請求項14に定義されるとおりであり、R<sup>j</sup>およびR<sup>k</sup>が請求項16に定義されるとおりであり、R<sup>p</sup>が請求項22に定義されるとおりであり、qが0、1、2、または3である、請求項1～30のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項33】

前記化合物が、以下の構造式によって表されるか、

【化162】



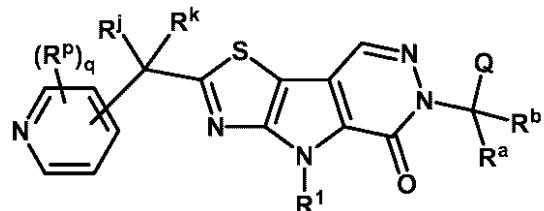
(IV')

またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が請求項14に定義されるとおりであり、R<sup>j</sup>およびR<sup>k</sup>が請求項16に定義されるとおりであり、R<sup>p</sup>が請求項22に定義されるとおりであり、qが0、1、2、または3であり、R<sup>n6</sup>が水素、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、または窒素保護基である、請求項1～30のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項34】

前記化合物が、以下の構造式によって表されるか、

【化163】



(V')

またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が請求項14に定義されるとおりであり、R<sup>j</sup>およびR<sup>k</sup>が請求項16に定義されるとおりであり、R<sup>p</sup>が請求項22に定義されるとおりであり、qが0、1、2、または3である、請求項1～30のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項35】

R<sup>n-a</sup>が、水素または-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルである、請求項20～34のいずれか一項に

記載の組成物。

【請求項 3 6】

$R^n$  の各例が独立して、水素、ハロゲン、任意で置換された  $C_{1-4}$  アルキル、-C N、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、-OR<sup>o</sup><sup>4</sup>、-N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)<sub>2</sub>、-C(=O)N(R<sup>n</sup><sup>2</sup>)<sub>2</sub>、-C(=O)R<sup>c</sup><sup>3</sup>、または-C(=O)OR<sup>o</sup><sup>4</sup> である、請求項 18~35 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 3 7】

$R^1$  が、水素または-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキルである、請求項 1~36 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 3 8】

$R^j$  および  $R^k$  がそれぞれ独立して、水素、ハロゲン、-OR<sup>o</sup><sup>7</sup>、または-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> アルキルである、請求項 16~37 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 3 9】

$R^a$  および  $R^b$  が、それぞれ水素である、請求項 14~38 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 4 0】

q が、0 または 1 である、請求項 31~39 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 4 1】

n が、0 または 1 である、請求項 18~40 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 4 2】

前記化合物が、表 1 から選択される、請求項 1~41 のいずれか一項に記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0297

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0297】

実施例 11. PKM2 アッセイ

手順：

PKM2 酵素ストック溶液を希釈して、1.11 倍濃縮反応ミックス (ADP なし) を調製した。最初に 1 μL の試験化合物をウェルに添加し、続いて 40 μL の 1.11 倍濃縮反応ミックス (ADP なし) を添加して、室温 (25) で 60 分間インキュベートした。反応を、10 μl の ADP (最終濃度 0.4 mM) を用いて開始して、最終反応ミックスを 1 倍濃縮にし、反応の進行を、室温で波長 340 nm の吸光度の変化として測定した。

試験化合物の調製：試験化合物を、DMSO 中 50 倍の最終濃度で調製した。1~3 の希釈を 11 ポイントで行った（例えば、50 μL の 5000 μM の化合物を、100 μL の 100% の DMSO に添加して 1667 μM 得、50 μL のこれを、100 μL の DMSO に添加して 556 μM 得た、等）。化合物を、1~50 の希釈 (50 μL 中 1 μL) としてアッセイに添加し、11 ポイントで 3 倍減少する最高濃度 100 μM を得た。

反応ミックス：1 倍濃縮反応緩衝液中、PKM2 (5 ng / ウェル、0.1 μg / ml)、ADP (0.4 mM)、PEP (0.11 mM)、NADH (180 μM)、LDH (0.005 U / μl、Sigma # L3888)、1 mM の DTT、0.03% の BSA

反応緩衝液：100 mM の KCl、50 mM のトリス pH 7.5、5 mM の MgCl<sub>2</sub>。いくつかの実施形態のいくつかの態様について説明することにより、当業者には様々な変更、修正、および改善が容易に思い浮かぶであろうことが理解されるべきである。そのような変更、修正、および改善は、本開示の一部であることが意図され、本発明の趣旨およ

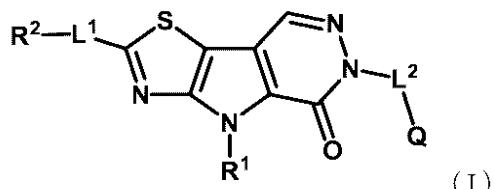
び範囲内であることが意図されている。したがって、前述の説明および図面は、例証としてのみである。

一実施形態において、例えば、以下の項目が提供される。

(項目1)

ピルビン酸キナーゼM2(PKM2)活性の調節を必要とする対象においてそれを調節する方法であって、有効量の式(I)の化合物またはその薬学的に許容される塩を投与することを含み、

【化145】



式中、Qは、水素、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、または任意で置換されたヘテロアリールであり、

R<sup>1</sup>は、水素、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたハロアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、-OR<sup>0.1</sup>、-C(=O)R<sup>c.1</sup>、または窒素保護基であり、

L<sup>1</sup>は、結合、任意で置換されたアルキレン、-O-、-S-、-S-CH<sub>2</sub>-、-S(=O)CH<sub>2</sub>-、-S(=O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-NR<sup>3</sup>-、-NR<sup>3</sup>C(=O)-、-C(=O)NR<sup>3</sup>-、-OC(=O)-、-C(=O)O-、-NR<sup>3</sup>C(=O)O-、-OC(=O)NR<sup>3</sup>-、-NR<sup>3</sup>C(=O)NR<sup>3</sup>-、-OC(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>-、-C(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>O-、-NR<sup>3</sup>C(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>-、-C(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NR<sup>3</sup>-、-S(=O)<sub>2</sub>-、-S(=O)<sub>2</sub>O-、-OS(=O)<sub>2</sub>-、-S(=O)O-、-OS(=O)<sub>2</sub>-、-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>3</sup>-、-NR<sup>3</sup>S(=O)-、-NR<sup>3</sup>S(=O)<sub>2</sub>O-、-OS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>3</sup>-、または-S(=O)(=NR<sup>3</sup>)-であり、R<sup>2</sup>への結合点が左側にあり、

L<sup>2</sup>は、結合、任意で置換されたアルキレン、-C(=O)-、-S(=O)<sub>2</sub>-、または-S(=O)-であり、Qへの結合点が右側にあり、

R<sup>2</sup>は、水素、ハロゲン、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルコキシ、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、もしくは任意で置換されたヘテロアリールであるか、あるいは、L<sup>1</sup>が-NR<sup>3</sup>-、-NR<sup>3</sup>C(=O)-、-NR<sup>3</sup>C(=O)O-、-NR<sup>3</sup>C(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>-、-NR<sup>3</sup>S(=O)<sub>2</sub>-、-NR<sup>3</sup>S(=O)-、-NR<sup>3</sup>C(=O)NR<sup>3</sup>-、-NR<sup>3</sup>S(=O)<sub>2</sub>O-、もしくは-NR<sup>3</sup>S(=O)O-である場合、窒素保護基であるか、L<sup>1</sup>が-O-、-OC(=O)-、-OC(=O)NR<sup>3</sup>-、-OC(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>-、-OS(=O)<sub>2</sub>-、-OS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>3</sup>-、-OS(=O)NR<sup>3</sup>-、もしくは-OS(=O)-である場合、酸素保護基であるか、またはL<sup>1</sup>が-S-である場合、硫黄保護基であり、

R<sup>3</sup>の各例は独立して、水素、-OR<sup>0.2</sup>、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロアリール、または窒素保護基であり、

R<sup>0.1</sup>およびR<sup>0.2</sup>の各例は独立して、水素、任意で置換されたアルキル、または酸素保護基であり、

$R^c_1$  の各例は独立して、任意で置換されたアルキル、または  $-N(R^c^n)_2$  であり、式中、 $R^c^n$  の各例が独立して、水素、 $-C_{1-6}$  アルキル、または窒素保護基であり、

$R^4$  の各例は独立して、水素、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、または任意で置換されたヘテロアリールである。

(項目2)

血漿グルコースのレベルの調節を必要とする対象においてそれを調節する方法であって、有効量の式(I)の化合物またはその薬学的に許容される塩を投与することを含み、式(I)が、項目1に定義されるとおりである、方法。

(項目3)

PKM2の機能に関連する疾患もしくは障害に罹患しているか、または罹患する可能性の高い対象において細胞増殖を阻害する方法であって、有効量の式(I)の化合物またはその薬学的に許容される塩を投与することを含み、式(I)が、項目1に定義されるとおりである、方法。

(項目4)

PKM2の異常活性に関連する疾患の治療を必要とする対象においてそれを治療する方法であって、有効量の式(I)の化合物またはその薬学的に許容される塩を投与することを含み、式(I)が、項目1に定義されるとおりである、方法。

(項目5)

前記疾患が、増殖性疾患である、項目4に記載の方法。

(項目6)

前記疾患が、癌、肥満、糖尿病性疾患(例えば、糖尿病性腎症(DN))、アテローム性動脈硬化症、再狭窄、冠動脈疾患(CAD)、ブルーム症候群(BS)、良性前立腺過形成(BPH)、または自己免疫疾患である、項目4に記載の方法。

(項目7)

高血糖の治療を必要とする対象においてそれを治療する方法であって、有効量の式(I)の化合物またはその薬学的に許容される塩を投与することを含み、式(I)が、項目1に定義されるとおりである、方法。

(項目8)

糖尿病性疾患の治療を必要とする対象においてそれを治療する方法であって、有効量の式(I)の化合物またはその薬学的に許容される塩を投与することを含み、式(I)が、項目1に定義されるとおりである、方法。

(項目9)

前記糖尿病性疾患が、糖尿病性腎症である、項目8に記載の方法。

(項目10)

PKM2の調節から利益を得るであろう対象を特定することをさらに含む、項目1~9のいずれか一項に記載の方法。

(項目11)

前記調節が、活性化である、項目1に記載の方法。

(項目12)

Qは、水素、任意で置換された $-C_{1-C_6}$  アルキル、任意で置換された $C_{3-C_{12}}$  シクロアルキル、任意で置換された3~14員ヘテロシクリル、任意で置換された6~14員アリール、または任意で置換された5~14員ヘテロアリールであり、

$R^1$ は、水素、任意で置換された $-C_{1-C_6}$  アルキル、任意で置換された $-C_{1-C_6}$  ハロアルキル、任意で置換された $-C_{2-C_6}$  アルケニル、任意で置換された $-C_{2-C_6}$  アルキニル、任意で置換された $C_{3-C_{12}}$  シクロアルキル、任意で置換された3~14員ヘテロシクリル、任意で置換された6~12員アリール、 $-OR^{1-}$ 、 $-C(=O)R^c_1$ 、または窒素保護基であり、

$L^1$  は、結合、任意で置換された  $C_{1-6}$  アルキレン、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S-CH_2-$ 、 $-S(=O)CH_2-$ 、 $-S(=O)_2CH_2-$ 、 $-NR^3-$ 、 $-NR^3C(=O)-$ 、 $-C(=O)NR^3-$ 、 $-C(=O)NR^3C(=O)-$ 、 $-NR^3C(=O)O-$ 、 $-OC(R^4)_2-$ 、 $-C(R^4)_2O-$ 、 $-NR^3C(R^4)_2-$ 、 $-C(R^4)_2NR^3-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、 $-S(=O)_2O-$ 、 $-OS(=O)_2-$ 、 $-S(=O)_2O-$ 、 $-OS(=O)_2-$ 、 $-S(=O)_2NR^3-$ 、 $-NR^3S(=O)_2-$ 、 $-NR^3S(=O)_2O-$ 、 $-OS(=O)NR^3-$ 、または $-S(=O)(=NR^3)-$  であり、 $R^2$ への結合点が左側にあり、

$L^2$  は、結合、任意で置換された  $C_{1-C_6}$  アルキレン、 $-C(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、または $-S(=O)-$  であり、 $Q$ への結合点が右側にあり、

$R^2$  は、水素、ハロゲン、任意で置換された  $-C_{1-C_6}$  アルキル、任意で置換された  $-C_{1-C_6}$  アルコキシ、任意で置換された  $-C_{3-14}$  員ヘテロシクリル、任意で置換された  $-C_6-C_{1-2}$  アリール、もしくは任意で置換された  $3-14$  員ヘテロアリールであるか、あるいは、 $L^1$  が $-NR^3-$ 、 $-NR^3C(=O)-$ 、 $-NR^3C(=O)O-$ 、 $-NR^3C(R^4)_2-$ 、 $-NR^3S(=O)_2-$ 、 $-NR^3S(=O)_2O-$ 、 $-NR^3S(=O)O-$  である場合、窒素保護基であるか、 $L^1$  が $-O-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)NR^3-$ 、 $-OC(R^4)_2-$ 、 $-OS(=O)_2-$ 、 $-OS(=O)_2NR^3-$ 、 $-OS(=O)NR^3-$ 、もしくは $-OS(=O)-$  である場合、酸素保護基であるか、または $L^1$  が $-S-$  である場合、硫黄保護基であり、

$R^3$  の各例は独立して、水素、 $-OR^{0-2}$ 、任意で置換された  $-C_{1-C_6}$  アルキル、任意で置換された  $-C_{2-C_6}$  アルケニル、任意で置換された  $-C_{2-C_6}$  アルキニル、任意で置換された  $C_{3-C_{1-2}}$  シクロアルキル、任意で置換された  $C_{3-C_{1-2}}$  ヘテロシクリル、任意で置換された  $C_6-C_{1-2}$  アリール、任意で置換された  $C_5-C_{1-2}$  ヘテロアリール、または窒素保護基であり、

$R^{0-1}$  および  $R^{0-2}$  の各例は独立して、水素、任意で置換された  $-C_{1-C_6}$  アルキル、または酸素保護基であり、

$R^{c-1}$  の各例は独立して、任意で置換された  $-C_{1-C_6}$  アルキル、または $-N(R^{c-n})_2$  であり、式中、 $R^{c-n}$  の各例が独立して、水素、 $-C_{1-C_6}$  アルキル、または窒素保護基であり、

$R^4$  の各例は独立して、水素、任意で置換された  $-C_{1-C_6}$  アルキル、任意で置換された  $-C_{2-C_6}$  アルケニル、任意で置換された  $-C_{2-C_6}$  アルキニル、任意で置換された  $C_{3-C_{1-2}}$  シクロアルキル、任意で置換された  $3-14$  員ヘテロシクリル、任意で置換された  $C_6-C_{1-2}$  アリール、または任意で置換された  $5-14$  員ヘテロアリールである、請求項 1-11 のいずれか一項に記載の方法。

(項目 13)

$Q$  は、 $C_6-C_{1-2}$  アリール、 $5-6$  員単環式ヘテロアリール、または $8-12$  員二環式ヘテロアリールであり、それらの各々が、 $0-3$  回出現する  $R^c$  で置換され、

$R^1$  は、水素、 $-C_{1-C_6}$  アルキル、 $-C_{1-C_6}$  ハロアルキル、 $C_3-C_7$  単環式シクロアルキルおよび  $3-14$  員ヘテロシクリル、 $-OR^{0-1}$ 、 $-C(=O)R^{c-1}$ 、または窒素保護基から選択され、式中、アルキル、シクロアルキル、またはヘテロシクリルの各々が、 $0-3$  回出現する  $R^d$  で置換され、

$R^2$  は、水素、ハロゲン、 $-C_{1-C_6}$  アルキル、 $-C_{1-C_6}$  アルコキシ、 $C_3-C_7$  単環式シクロアルキル、 $C_6-C_{1-2}$  二環式シクロアルキル、 $3-14$  員ヘテロシクリル、 $C_6-C_{1-2}$  アリール、 $5-6$  員単環式ヘテロアリール、 $8-12$  員二環式ヘテロアリールから選択され、式中、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、およびヘテロアリールの各々が、 $0-3$  回出現する  $R^e$  で置換されるか、あるいは、 $L^1$  が

- N R <sup>3</sup> - 、 - N R <sup>3</sup> C ( = O ) - 、 - N R <sup>3</sup> C ( = O ) O - 、 - N R <sup>3</sup> C ( R <sup>4</sup> ) <sub>2</sub> -  
 - N R <sup>3</sup> S ( = O ) <sub>2</sub> - 、 - N R <sup>3</sup> S ( = O ) - 、 - N R <sup>3</sup> C ( = O ) N R <sup>3</sup> - 、 - N  
 R <sup>3</sup> S ( = O ) <sub>2</sub> O - 、 もしくは - N R <sup>3</sup> S ( = O ) O - である場合、窒素保護基である  
 か、 L <sup>1</sup> が - O - 、 - O C ( = O ) - 、 - O C ( = O ) N R <sup>3</sup> - 、 - O C ( R <sup>4</sup> ) <sub>2</sub> - 、  
 - O S ( = O ) - 、 - O S ( = O ) <sub>2</sub> - 、 - O S ( = O ) <sub>2</sub> N R <sup>3</sup> - 、 - O S ( = O ) N  
 R <sup>3</sup> - 、 もしくは - O S ( = O ) - である場合、酸素保護基であるか、または L <sup>1</sup> が - S  
 - である場合、硫黄保護基であり、

R <sup>3</sup> は、水素、 - O R o 2 、 - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、 C <sub>3</sub> - C <sub>7</sub> 単環式シクロアルキル  
 、 C <sub>6</sub> - C <sub>1</sub> 2 二環式シクロアルキル、 3 ~ 1 4 員ヘテロシクリル、 C <sub>6</sub> - C <sub>1</sub> 2 アリー  
 ル、 5 ~ 6 員単環式ヘテロアリール、および 8 ~ 1 2 員二環式ヘテロアリールから選択さ  
 れ、式中、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、およびヘテロ  
 アリールの各々が、 0 ~ 3 回出現する R <sup>f</sup> で置換され、

R <sup>4</sup> は、水素、 - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、 C <sub>3</sub> - C <sub>7</sub> 単環式シクロアルキル、および 3 ~  
 1 4 員ヘテロシクリルから選択され、式中、アルキル、シクロアルキル、またはヘテロシ  
 クリルの各々が、 0 ~ 1 回出現する R <sup>g</sup> で置換され、

L <sup>1</sup> は、結合、 0 ~ 3 回出現する R <sup>h</sup> で置換されるアルキレン、 - O - 、 - S - 、 - S  
 - C H <sub>2</sub> - 、 - S ( = O ) C H <sub>2</sub> - 、 - S ( = O ) <sub>2</sub> C H <sub>2</sub> - 、 - N R <sup>3</sup> - 、 - N R <sup>3</sup>  
 C ( = O ) - 、 - C ( = O ) N R <sup>3</sup> - 、 - C ( = O ) - 、 - O C ( = O ) - 、 - C ( =  
 O ) O - 、 - N R <sup>3</sup> C ( = O ) O - 、 - O C ( = O ) N R <sup>3</sup> - 、 - N R <sup>3</sup> C ( = O ) N R  
<sup>3</sup> - 、 - O C ( R <sup>4</sup> ) <sub>2</sub> - 、 - C ( R <sup>4</sup> ) <sub>2</sub> O - 、 - N R <sup>3</sup> C ( R <sup>4</sup> ) <sub>2</sub> - 、 - C ( R <sup>4</sup>  
 ) <sub>2</sub> N R <sup>3</sup> - 、 - S ( = O ) <sub>2</sub> - 、 - S ( = O ) - 、 - S ( = O ) <sub>2</sub> O - 、 - O S ( = O  
 ) <sub>2</sub> - 、 - S ( = O ) O - 、 - O S ( = O ) - 、 - S ( = O ) <sub>2</sub> N R <sup>3</sup> - 、 - N R <sup>3</sup> S ( = O )  
<sub>2</sub> - 、 - S ( = O ) N R <sup>3</sup> - 、 - N R <sup>3</sup> S ( = O ) - 、 - N R <sup>3</sup> S ( = O ) <sub>2</sub> O -  
 、 - O S ( = O ) <sub>2</sub> N R <sup>3</sup> - 、 - N R <sup>3</sup> S ( = O ) O - 、 - O S ( = O ) N R <sup>3</sup> - 、 または  
 - S ( = O ) ( = N R <sup>3</sup> ) - であり、 R <sup>2</sup> への結合点が左側にあり、

L <sup>2</sup> は、結合、 0 ~ 3 回出現する R <sup>h</sup> で置換されるアルキレン、 - C ( = O ) - 、 - S  
 ( = O ) <sub>2</sub> - 、 または - S ( = O ) - であり、 Q への結合点が右側にあり、

各 R <sup>c</sup> は独立して、ハロ、 - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、 - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> ハロアルキル、 - C <sub>1</sub>  
 - C <sub>6</sub> ヒドロキシアルキル、 - O H 、 - O C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、 - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アミノアル  
 キル、 - N H ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル) 、 - N ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル) <sub>2</sub> 、 - C ( = O ) O  
 C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、 - C ( = O ) O H 、 - C ( = O ) C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、 - C ( = O )  
 ) N H <sub>2</sub> 、 - C ( = O ) N H ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル) 、 - C ( = O ) N ( C ) <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> ア  
 ルキル ) <sub>2</sub> 、 - N H C ( = O ) N H <sub>2</sub> 、 - N H C ( = O ) N H ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル)  
 、 - N H ( C = O ) N ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル) <sub>2</sub> 、 - N H C ( = O ) ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキ  
 ル) 、 - N ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル) C ( = O ) ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル) 、 - S ( = O ) <sub>2</sub>  
 N H <sub>2</sub> 、 - S ( = O ) <sub>2</sub> N H ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル) 、 - S ( = O ) <sub>2</sub> N ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> ア  
 ルキル) <sub>2</sub> 、 - N H S ( = O ) <sub>2</sub> ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル) 、 - N H <sub>2</sub> 、 - C N 、 および  
 - N O <sub>2</sub> から選択されるか、または、同一もしくは隣接する炭素原子に結合した R <sup>c</sup> の 2 つ  
 の例が、それらが結合する炭素原子と一緒にになって、シクロアルキルもしくはヘテロシ  
 クリル C ( = O ) O H を形成し、

各 R <sup>d</sup> は独立して、ハロ、 - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、 - O H 、 - O C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、  
 - N H <sub>2</sub> 、 および - C N から選択され、

各 R <sup>e</sup> は独立して、ハロ、 - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、 - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> ハロアルキル、 - C <sub>1</sub>  
 - C <sub>6</sub> ヒドロキシアルキル、 - O H 、 - O C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、 - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アミノアル  
 キル、 - N H ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル) 、 - N ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル) <sub>2</sub> 、 - C ( = O ) O  
 C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、 - C ( = O ) O H 、 - C ( = O ) C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、 - C ( = O )  
 ) N H <sub>2</sub> 、 - C ( = O ) N H ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル) 、 - C ( = O ) N ( C ) <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> ア  
 ルキル ) <sub>2</sub> 、 - N H C ( = O ) N H <sub>2</sub> 、 - N H C ( = O ) N H ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル)  
 、 - N H ( C = O ) N ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル) <sub>2</sub> 、 - N H C ( = O ) ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキ  
 ル) 、 - N ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル) C ( = O ) ( C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル) 、 - S ( = O ) <sub>2</sub>

NH<sub>2</sub>、-S(=O)<sub>2</sub>NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>S(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>、-CN、および-NO<sub>2</sub>から選択されるか、または、同一もしくは隣接する炭素原子に結合したR<sup>e</sup>の2つの例が、それらが結合する炭素原子と一緒にになって、シクロアルキルもしくはヘテロシクリルを形成し、

各R<sup>f</sup>は独立して、ハロ、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ、-OH、-NH<sub>2</sub>、-CN、および-NO<sub>2</sub>から選択され、

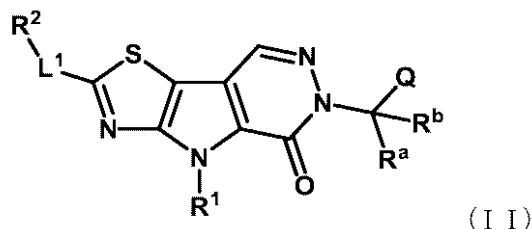
各R<sup>g</sup>は独立して、ハロ、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ、-OH、NH<sub>2</sub>、-CN、およびNO<sub>2</sub>から選択され、

各R<sup>h</sup>は独立して、ハロ、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ヒドロキシアルキル、-OH、-OC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アミノアルキル、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)2、-C(=O)O<sub>C</sub><sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-C(=O)OH、-C(=O)C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-C(=O)NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-C(=O)N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)2、-NHCO(=O)NH<sub>2</sub>、-NHCO(=O)NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-NH(C=O)N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)2、-NHCO(=O)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-S(=O)<sub>2</sub>NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)2、-NH<sub>2</sub>、-CN、および-NO<sub>2</sub>、S(=O)<sub>2</sub>アリール、S(=O)<sub>2</sub>ヘテロアリールおよび=NOHから選択されるか、または、同一もしくは隣接する炭素原子に結合したR<sup>h</sup>の2つの例が、それらが結合する炭素原子と一緒にになって、シクロアルキルもしくはヘテロシクリルを形成する、請求項1~12のいずれか一項に記載の方法。

(項目14)

前記化合物が、式(I I)の化合物：

【化146】



またはその薬学的に許容される塩であり、式中、

R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>はそれぞれ独立して、水素、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、任意で置換されたアルキル、-OR<sup>o</sup><sup>3</sup>、-N(R<sup>n</sup><sup>1</sup>)<sub>2</sub>、-C(=O)N(R)<sup>n</sup><sup>1</sup>)<sub>2</sub>、もしくは-C(=O)R<sup>c</sup><sup>2</sup>であるか、またはR<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が、炭素原子と一緒にになって、任意で置換されたシクロアルキルもしくは任意で置換されたヘテロシクリルを形成することができ、

R<sup>n</sup><sup>1</sup>の各例は独立して、水素、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、または窒素保護基であり、

R<sup>o</sup><sup>3</sup>の各例は独立して、水素、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、または酸素保護基であり、

R<sup>c</sup><sup>2</sup>の各例が独立して、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルである、項目1~13のいずれか一項に記載の方法。

(項目15)

L<sup>1</sup>が、結合、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン、-C(=O)-、-S(=O)-、-S(=O)<sub>2</sub>-、-NR<sup>3</sup>C(=O)-、または-C(=O)NR<sup>3</sup>-である、項目1~14のいずれか一項に記載の方法。

## (項目16)

$L^1$  が、 $R^j$  および  $R^k$  で置換された  $C_{1-6}$  アルキレンであり、

式中、 $R^j$  および  $R^k$  の各例は独立して、H、ハロゲン、-CN、-OR<sup>o</sup><sub>7</sub>、-N(R<sup>n</sup><sub>5</sub>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>n</sup><sub>5</sub>)C(=O)R<sup>c</sup><sub>5</sub>、-C(=O)N(R<sup>n</sup><sub>5</sub>)<sub>2</sub>、-C(=O)R<sup>c</sup><sub>5</sub>、-C(=O)OR<sup>o</sup><sub>7</sub>、-SR<sup>j</sup><sub>s</sub>、-S(=O)<sub>2</sub>R<sup>j</sup><sub>s</sub>、もしくは-S(=O)R<sup>j</sup><sub>s</sub>、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキルから選択されるか、または  $R^j$  および  $R^k$  が、炭素原子と一緒にになって、C=O、C=N R<sup>j</sup><sub>n</sub>、任意で置換された C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 単環式シクロアルキル環、もしくは任意で置換された C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 単環式ヘテロシクリル環を形成することができ、

$R^n$ <sub>5</sub> および  $R^j$ <sub>n</sub> の各例は独立して、水素、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキル、-OR<sup>o</sup><sub>8</sub>、または窒素保護基であり、

$R^o$ <sub>7</sub> の各例は独立して、水素、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキル、または酸素保護基であり、

$R^c$ <sub>5</sub> の各例は独立して、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキルであり、

$R^j$ <sub>s</sub> の各例が独立して、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキル、任意で置換された C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub> アリール、任意で置換されたヘテロアリール、または硫黄保護基である、項目1~15のいずれか一項に記載の方法。

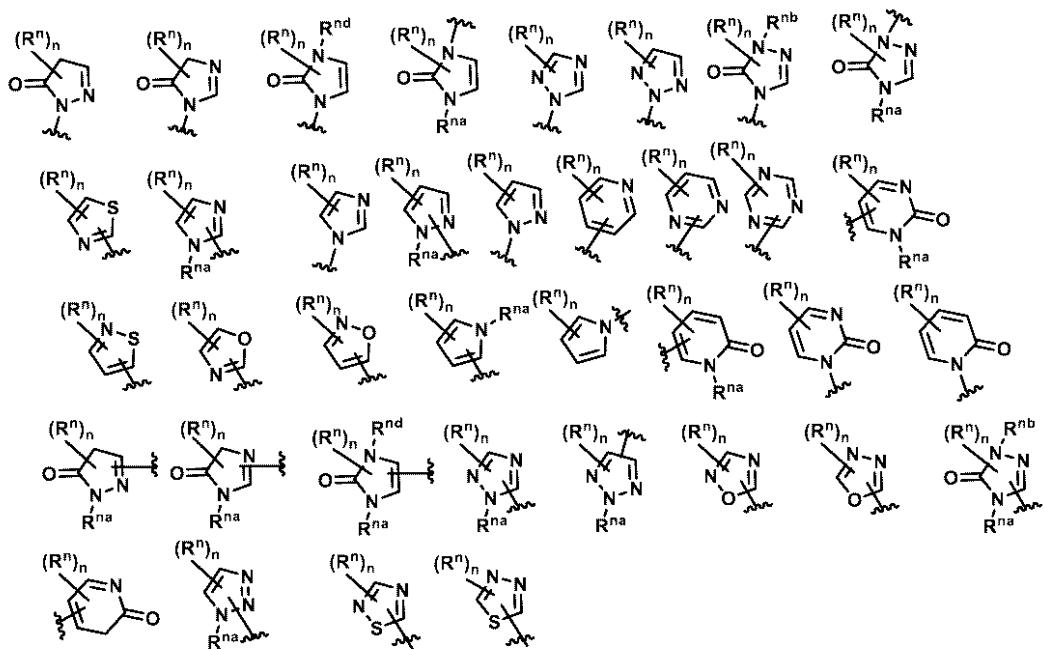
## (項目17)

Qが、任意で置換された5~6員单環式ヘテロアリールである、項目1~16のいずれか一項に記載の方法。

## (項目18)

Qが、以下の式のうちの1つであり、

## 【化147】



## 式中、

$R^n$  の各例は独立して、水素、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたヘテロアリール、-OR<sup>o</sup><sub>4</sub>、-SR<sup>s</sup><sub>1</sub>、-N(R<sup>n</sup><sub>2</sub>)<sub>2</sub>、-C(=O)N(R<sup>n</sup><sub>2</sub>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>n</sup><sub>2</sub>)C(=O)R<sup>c</sup><sub>3</sub>、-C(=O)R<sup>c</sup><sub>3</sub>、-C(=O)OR<sup>o</sup><sub>4</sub>、-OC(=O)R<sup>c</sup><sub>3</sub>、-S(=O)R<sup>s</sup><sub>1</sub>、-S(=O)<sub>2</sub>、R<sup>s</sup><sub>1</sub>、-S(=O)OR<sup>o</sup><sub>4</sub>、-OS(=O)R<sup>c</sup><sub>3</sub>、-S(=O)<sub>2</sub>OR<sup>o</sup><sub>4</sub>、-O

S (=O) <sub>2</sub> R <sup>c</sup> <sup>3</sup>、 - S (=O) N (R <sup>n</sup> <sup>2</sup>) <sub>2</sub>、  
- S (=O) <sub>2</sub> N (R <sup>n</sup> <sup>2</sup>) <sub>2</sub>、 - N (R <sup>n</sup> <sup>2</sup>) S (=O) R <sup>s</sup> <sup>1</sup>、 - N (R <sup>n</sup> <sup>2</sup>) S (=O) <sub>2</sub> R <sup>s</sup> <sup>1</sup>、 - N (R <sup>n</sup> <sup>2</sup>) C (=O) OR <sup>o</sup> <sup>4</sup>、  
- OC (=O) N (R <sup>n</sup> <sup>2</sup>) <sub>2</sub>、 - N (R <sup>n</sup> <sup>2</sup>) C (=O) N (R <sup>n</sup> <sup>2</sup>) <sub>2</sub>、 - N (R <sup>n</sup> <sup>2</sup>) S (=O) N (R <sup>n</sup> <sup>2</sup>) <sub>2</sub>、 - N (R <sup>n</sup> <sup>2</sup>) S (=O) OR <sup>o</sup> <sup>4</sup>、 - N (R <sup>n</sup> <sup>2</sup>) S (=O) <sub>2</sub> OR <sup>o</sup> <sup>4</sup>、 - OS (=O) <sub>2</sub> N (R <sup>n</sup> <sup>2</sup>) <sub>2</sub>、 もしくは - OS (=O) <sub>2</sub> N (R <sup>n</sup> <sup>2</sup>) <sub>2</sub> であるか、または、同一もしくは隣接する炭素原子に結合した R <sup>n</sup> の 2 つの例が、それらが結合する炭素原子と一緒にになって、任意で置換されたシクロアルキルもしくはヘテロシクロアルキルを形成し、  
R <sup>n</sup> <sup>2</sup> の各例は独立して、水素、任意で置換された - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、または窒素保護基であり、

R <sup>o</sup> <sup>4</sup> の各例は独立して、水素、任意で置換された - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、または酸素保護基であり、

R <sup>c</sup> <sup>3</sup> の各例は独立して、任意で置換された - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキルであり、

R <sup>s</sup> <sup>1</sup> の各例は独立して、任意で置換された - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキルまたは硫黄保護基であり、

n は、結合価が許す限り、0、1、2、または3 であり、

R <sup>n</sup> <sup>a</sup>、R <sup>n</sup> <sup>b</sup>、および R <sup>n</sup> <sup>d</sup> の各々が独立して、水素、任意で置換された - C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> アルキル、または窒素保護基である、項目 1 ~ 17 のいずれか一項に記載の方法。

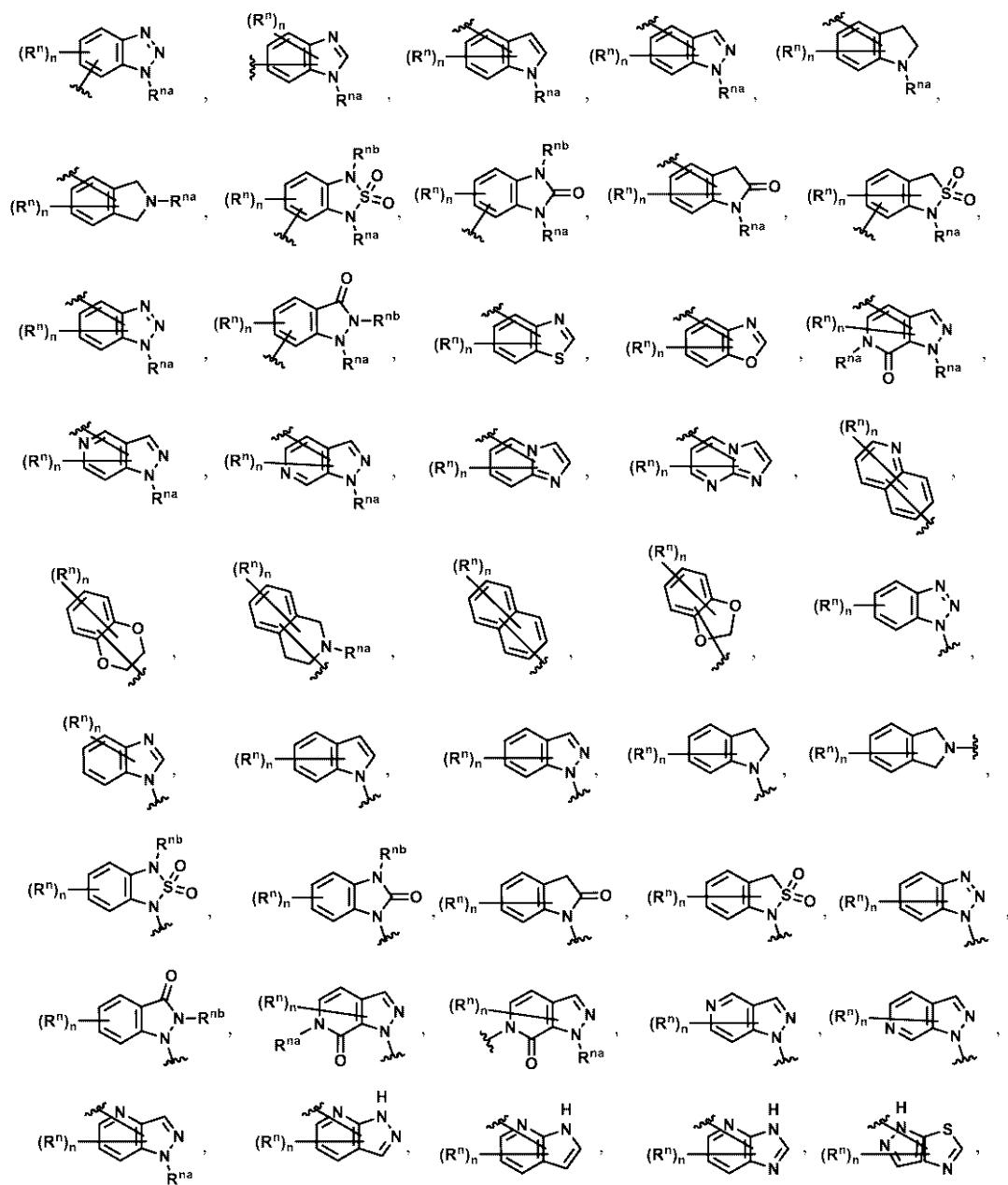
(項目 19)

Q が、任意で置換された 8 ~ 12 員二環式ヘテロアリール、または任意で置換された 8 ~ 12 員二環式ヘテロシクリルである、項目 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の方法。

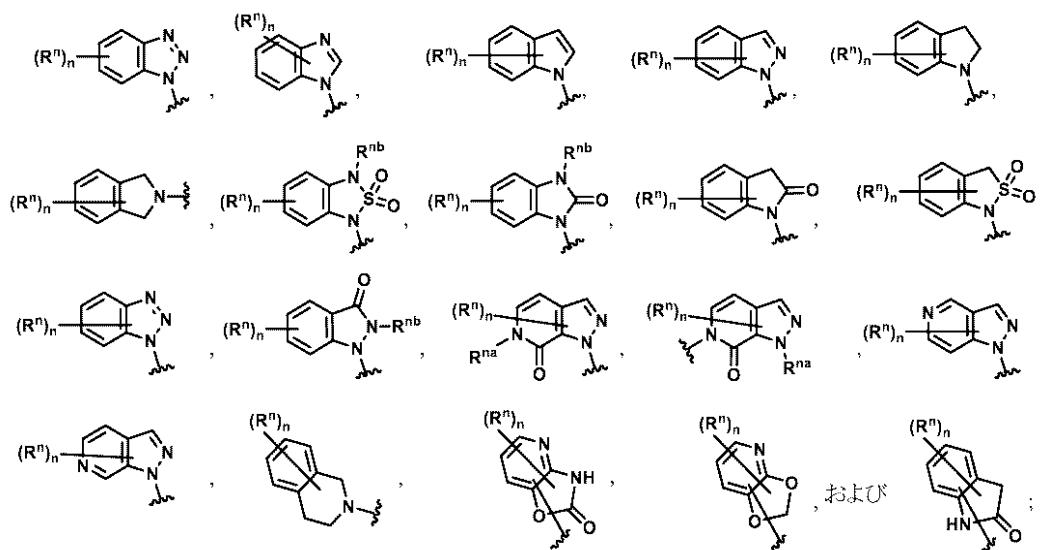
(項目 20)

Q が、以下の式のうちの 1 つであり、

【化 1 4 8】



## 【化149】



式中、 $R^n$  の各例は独立して、水素、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、任意で置換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロシリル、任意で置換されたヘテロアリール、-OR<sup>o4</sup>、-SR<sup>s1</sup>、-N(R<sup>n2</sup>)<sub>2</sub>、-C(=O)N(R<sup>n2</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>n2</sup>)C(=O)R<sup>c3</sup>、-C(=O)R<sup>c3</sup>、-C(=O)OR<sup>o4</sup>、-OC(=O)R<sup>c3</sup>、-S(=O)R<sup>s1</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>R<sup>s1</sup>、-S(=O)OR<sup>o4</sup>、-OS(=O)R<sup>c3</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>OR<sup>o4</sup>、-OS(=O)<sub>2</sub>R<sup>c3</sup>、-S(=O)N(R<sup>n2</sup>)<sub>2</sub>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>n2</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>n2</sup>)S(=O)R<sup>s1</sup>、-N(R<sup>n2</sup>)S(=O)<sub>2</sub>R<sup>s1</sup>、-N(R<sup>n2</sup>)C(=O)N(R<sup>n2</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>n2</sup>)S(=O)N(R<sup>n2</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>n2</sup>)S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>n2</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>n2</sup>)S(=O)OR<sup>o4</sup>、-OS(=O)N(R<sup>n2</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>n2</sup>)C(=O)N(R<sup>n2</sup>)<sub>2</sub>から選択されるか、または、同一もしくは隣接する炭素原子に結合した  $R^n$  の 2 つの例が、それらが結合する原子と一緒にになって、任意で置換されたシクロアルキルもしくはヘテロシクロアルキルを形成し

$R^{n\alpha}$  および  $R^{nb}$  の各例は独立して、水素、任意で置換された -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキル、または窒素保護基であり、

$R^{n2}$  の各例は独立して、水素、任意で置換された -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキル、または窒素保護基であり、

$R^o4$  の各例は独立して、水素、任意で置換された -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキル、または酸素保護基であり、

$R^c3$  の各例は独立して、任意で置換された -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキルであり、

$R^s1$  の各例が独立して、任意で置換された -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキル、または硫黄保護基であり、

$n$  が、結合価が許す限り、0、1、2、または3である、項目1~16および19のいずれか一項に記載の方法。

(項目21)

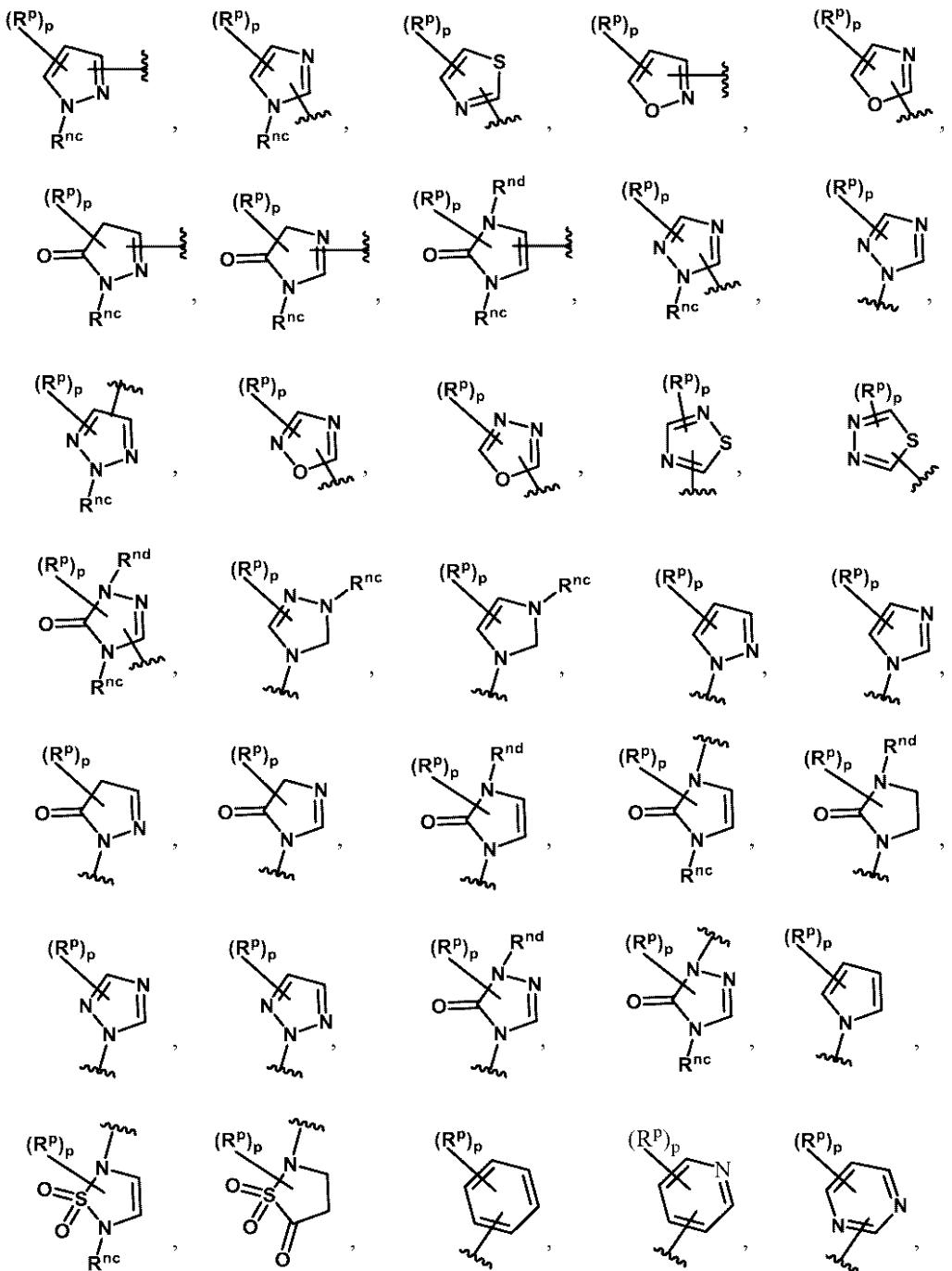
$R^2$  が、水素、ヒドロキシル、ハロゲン、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキル、-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルケニル、-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルコキシル、フェニル、ナフタレンイル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> シクロアルキル、5員ヘテロアリール、6員ヘテロアリール、8員二環式ヘテロアリール、9員二環式ヘテロアリールから選択され、式中、アルキル、アルケニル、フェニル、およびヘテロアリールの各々が、0~3回出現する  $R^e$  で置換される、項目1~20のいずれか一項に記載の

方法。

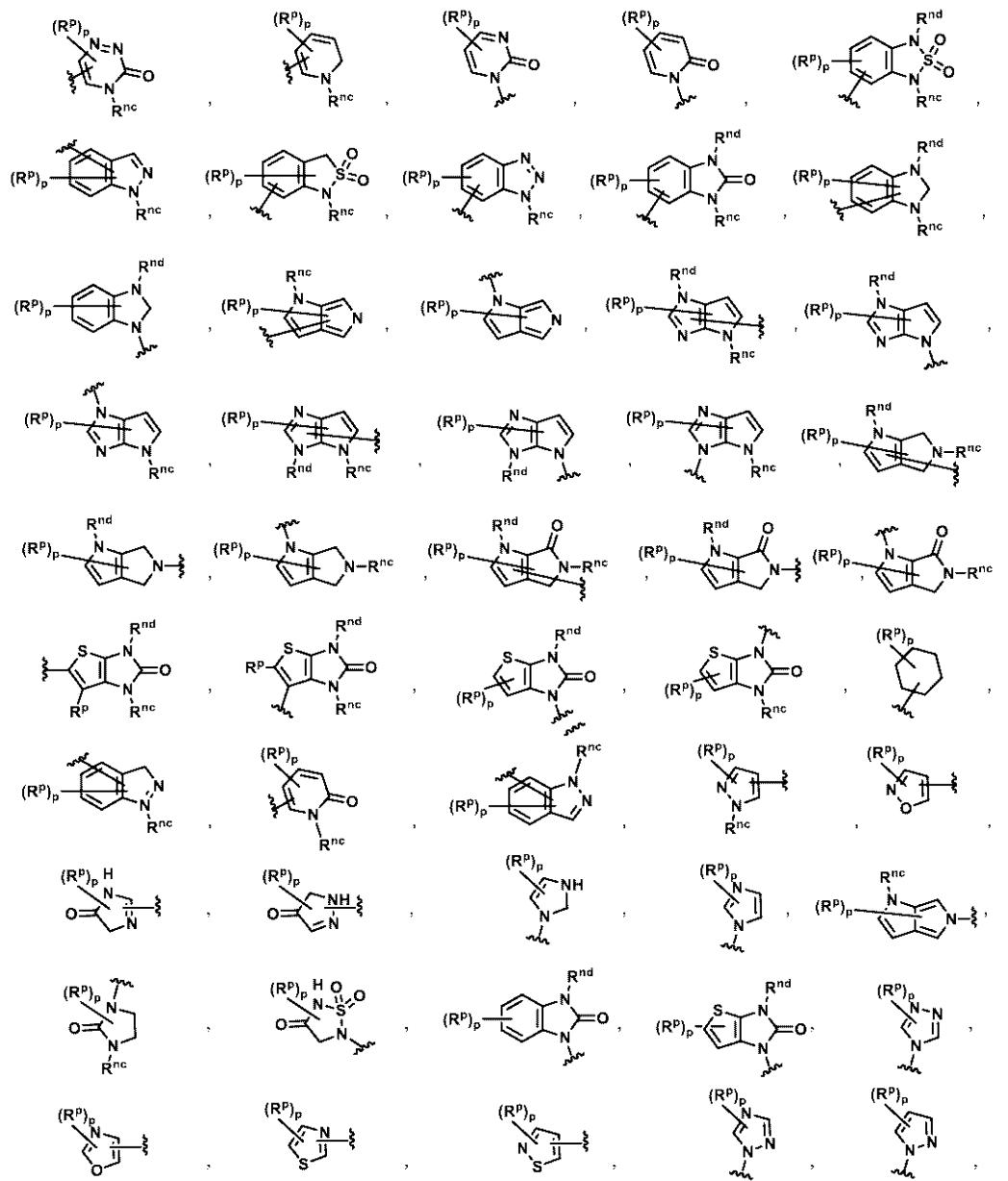
(項目 22)

R<sup>2</sup> が、以下の式のうちの 1 つであり、

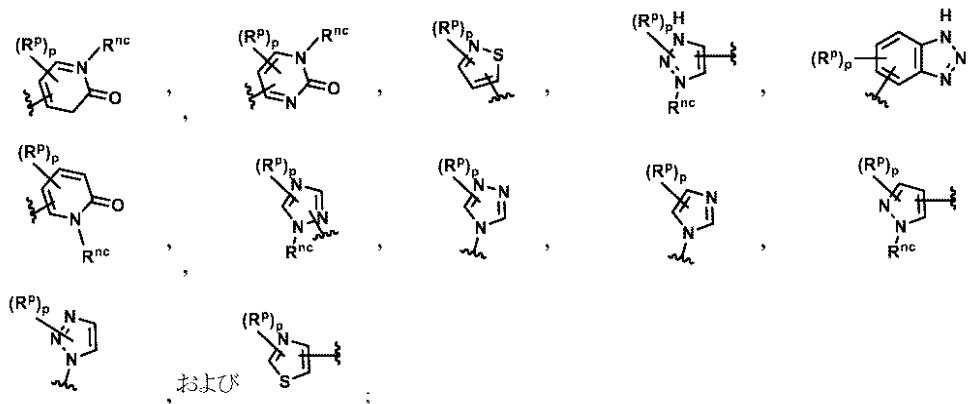
【化 150】



【化 1 5 1】



【化 1 5 2】



式中、 $R^P$  の各例が独立して、水素、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、任意で置

換されたアルキル、任意で置換されたアルケニル、任意で置換されたアルキニル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたアリール、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたヘテロアリール、 $-OR^{\circ 6}$ 、 $-SR^{s 2}$ 、 $-N(R^{n 3})_2$ 、 $-C(=O)N(R^{n 3})_2$ 、 $-C(=O)OR^{\circ 6}$ 、 $-OC(=O)R^{c 4}$ 、 $-C(=O)R^{c 4}$ 、 $-C(=O)OR^{\circ 6}$ 、 $-OS(=O)R^{c 4}$ 、 $-S(=O)R^{s 2}$ 、 $-S(=O)_2R^s$ 、 $-S(=O)OR^{\circ 6}$ 、 $-OS(=O)R^{c 4}$ 、 $-S(=O)_2OR^{\circ 6}$ 、 $-OS(=O)_2R^{c 4}$ 、 $-S(=O)N(R^{n 3})_2$ 、 $-S(=O)_2N(R^{n 3})_2$ 、 $-N(R^{n 3})S(=O)R^{s 2}$ 、 $-N(R^{n 3})S(=O)_2R^{s 2}$ 、 $-N(R^{n 3})C(=O)N(R^{n 3})$ 、 $-N(R^{n 3})S(=O)N(R^{n 3})_2$ 、 $-N(R^{n 3})S(=O)_2N(R^{n 3})_2$ 、 $-N(R^{n 3})S(=O)OR^{\circ 6}$ 、 $-N(R^{n 3})S(=O)_2OR^{\circ 6}$ 、 $-OS(=O)N(R^{n 3})_2$ 、 $-OS(=O)_2N(R^{n 3})_2$ から選択されるか、または、同一もしくは隣接する炭素原子に結合した  $R^p$  の 2 つの例が、それらが結合する原子と一緒にになって、任意で置換されたシクロアルキルもしくはヘテロシクロアルキルを形成し、

$R^{n 3}$ 、 $R^{n c}$ 、および  $R^{n d}$  の各例は独立して、水素、任意で置換された  $-C_1-C_6$  アルキル、または窒素保護基であり、

$R^{\circ 6}$  の各例は独立して、水素、任意で置換された  $-C_1-C_6$  アルキル、または酸素保護基であり、

$R^{c 4}$  の各例は独立して、任意で置換された  $-C_1-C_6$  アルキルであり、

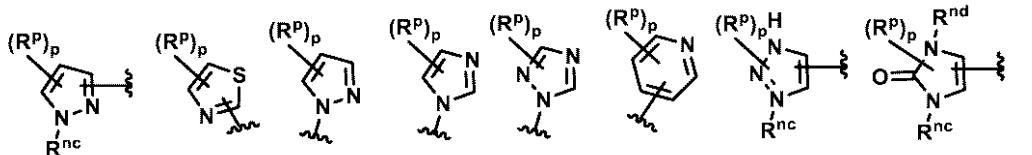
$R^{s 2}$  の各例が独立して、任意で置換された  $-C_1-C_6$  アルキル、または硫黄保護基であり、

$p$  が、結合価が許す限り、0、1、2、または3である、項目1～21のいずれか一項に記載の方法。

#### (項目23)

$R^2$  が、以下のうちの1つから選択される、項目1～22のいずれか一項に記載の化合物。

#### 【化153】



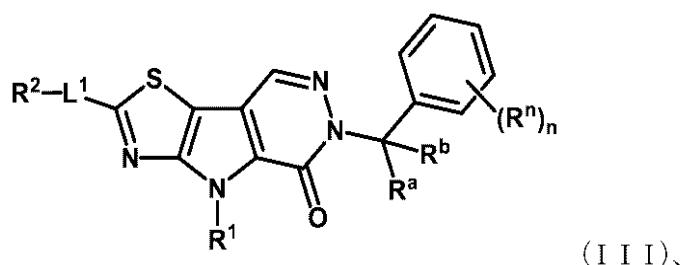
#### (項目24)

$R^p$  の各例が独立して、水素、ハロゲン、任意で置換された  $C_1-C_4$  アルキル、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N_3$ 、 $-OR^{\circ 4}$ 、 $-N(R^{n 2})_2$ 、 $-C(=O)N(R^{n 2})_2$ 、 $-C(=O)R^{c 3}$ 、または  $-C(=O)OR^{\circ 4}$  である、項目22および23のいずれか一項に記載の方法。

#### (項目25)

前記化合物が、式(III)の化合物：

#### 【化154】

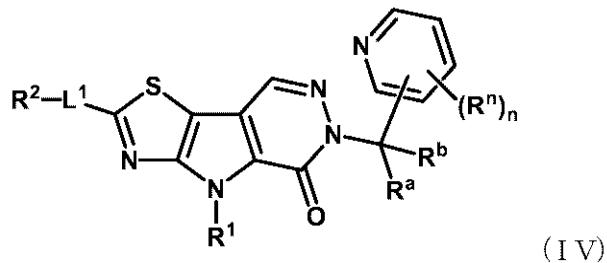


またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が項目1~4に定義されるとおりであり、R<sup>n</sup>およびnが項目1~8または項目2~0に定義されるとおりである、項目1~16および21~24のいずれか一項に記載の方法。

(項目26)

前記化合物が、式(IV)の化合物：

【化155】

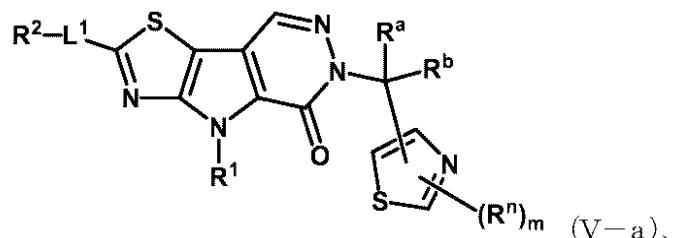


またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が項目1~4に定義されるとおりであり、R<sup>n</sup>およびnが項目1~8または項目2~0に定義されるとおりである、項目1~18および21~24のいずれか一項に記載の方法。

(項目27)

前記化合物が、式(V-a)の化合物：

【化156】

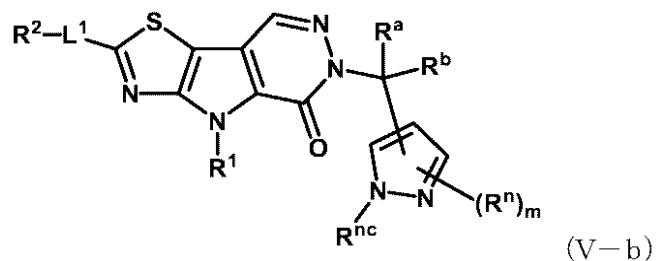


またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が項目1~4に定義されるとおりであり、R<sup>n</sup>が項目1~8または項目2~0に定義されるとおりであり、mが0、1、または2である、項目1~18および21~24のいずれか一項に記載の方法。

(項目28)

前記化合物が、式(V-b)の化合物：

【化157】

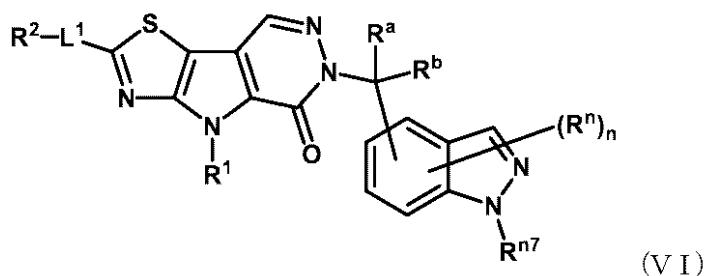


またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が項目1~4に定義されるとおりであり、R<sup>n</sup>が項目1~8または項目2~0に定義されるとおりであり、mが0、1、または2であり、R<sup>n</sup>cが独立して、水素、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、または窒素保護基である、項目1~18および21~24のいずれか一項に記載の方法。

(項目29)

前記化合物が、式(VI)の化合物：

【化158】

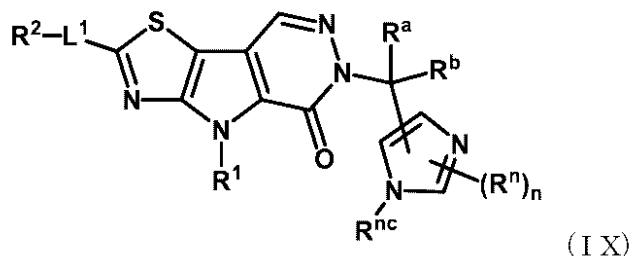


またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が項目14に定義されるとおりであり、R<sup>n</sup>およびnが項目18または項目20に定義されるとおりであり、R<sup>n7</sup>が水素、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、または窒素保護基である、項目1~16および19~24のいずれか一項に記載の方法。

(項目30)

前記化合物が、式(VII)の化合物：

【化159】

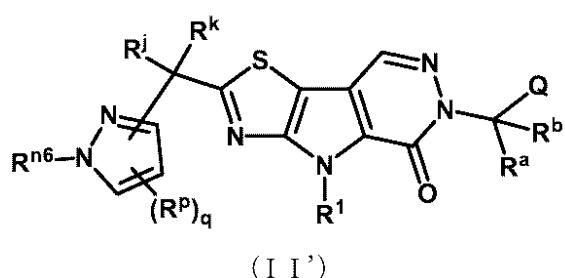


またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が項目14に定義されるとおりであり、R<sup>n</sup>およびnが項目18または項目20に定義されるとおりであり、R<sup>nc</sup>が独立して、水素、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、または窒素保護基である、項目1~18および21~24のいずれか一項に記載の方法。

(項目31)

前記化合物が、以下の構造式によって表されるか、

【化160】

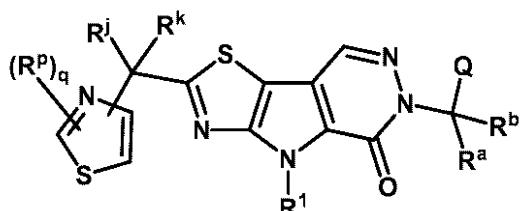


またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が項目14に定義されるとおりであり、R<sup>j</sup>およびR<sup>k</sup>が項目16に定義されるとおりであり、R<sup>p</sup>が項目22に定義されるとおりであり、qが0、1、2、または3である、項目1~30のいずれか一項に記載の方法。

(項目32)

前記化合物が、以下の構造式によって表されるか、

## 【化161】



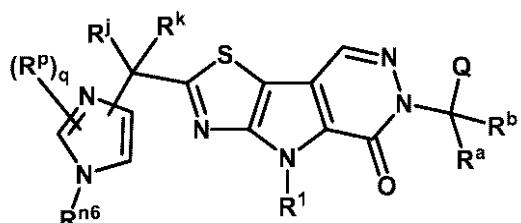
(III')

またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が項目14に定義されるとおりであり、R<sup>j</sup>およびR<sup>k</sup>が項目16に定義されるとおりであり、R<sup>P</sup>が項目22に定義されるとおりであり、qが0、1、2、または3である、項目1～30のいずれか一項に記載の方法。

(項目33)

前記化合物が、以下の構造式によって表されるか、

## 【化162】



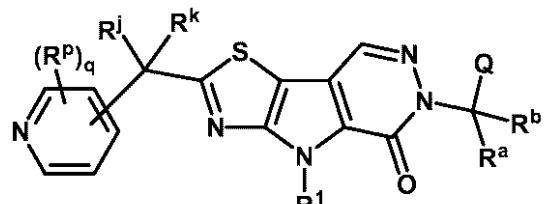
(IV')

またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が項目14に定義されるとおりであり、R<sup>j</sup>およびR<sup>k</sup>が項目16に定義されるとおりであり、R<sup>P</sup>が項目22に定義されるとおりであり、qが0、1、2、または3であり、R<sup>n6</sup>が水素、任意で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、または窒素保護基である、項目1～30のいずれか一項に記載の方法。

(項目34)

前記化合物が、以下の構造式によって表されるか、

## 【化163】



(V')

またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が項目14に定義されるとおりであり、R<sup>j</sup>およびR<sup>k</sup>が項目16に定義されるとおりであり、R<sup>P</sup>が項目22に定義されるとおりであり、qが0、1、2、または3である、項目1～30のいずれか一項に記載の方法。

(項目35)

R<sup>n6</sup>が、水素または-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルである、項目20～34のいずれか一項に記載の方法。

(項目36)

R<sup>n</sup> の各例が独立して、水素、ハロゲン、任意で置換された C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、- CN、- NO<sub>2</sub>、- N<sub>3</sub>、- OR<sup>o</sup><sub>4</sub>、- N(R<sup>n</sup><sub>2</sub>)<sub>2</sub>、- C(=O)N(R<sup>n</sup><sub>2</sub>)<sub>2</sub>、- C(=O)R<sup>c</sup><sub>3</sub>、または - C(=O)OR<sup>o</sup><sub>4</sub> である、項目18～35のいずれか一項に記載の方法。

(項目37)

R<sup>1</sup> が、水素または - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルである、項目1～36のいずれか一項に記載の方法。

(項目38)

R<sup>j</sup> および R<sup>k</sup> がそれぞれ独立して、水素、ハロゲン、- OR<sup>o</sup><sub>7</sub>、または - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルである、項目16～37のいずれか一項に記載の方法。

(項目39)

R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> が、それぞれ水素である、項目14～38のいずれか一項に記載の方法。

(項目40)

q が、0 または 1 である、項目31～39のいずれか一項に記載の方法。

(項目41)

n が、0 または 1 である、項目18～40のいずれか一項に記載の方法。

(項目42)

前記化合物が、表1から選択される、項目1～41のいずれか一項に記載の方法。