

【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31年3月7日(2019.3.7)

【公表番号】特表2018-507191(P2018-507191A)

【公表日】平成30年3月15日(2018.3.15)

【年通号数】公開・登録公報2018-010

【出願番号】特願2017-539592(P2017-539592)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

A 6 1 K 38/06 (2006.01)

A 6 1 K 38/12 (2006.01)

A 6 1 K 38/44 (2006.01)

A 6 1 K 39/00 (2006.01)

A 6 1 K 39/395 (2006.01)

A 6 1 K 31/365 (2006.01)

A 6 1 K 31/395 (2006.01)

A 6 1 K 31/4045 (2006.01)

A 6 1 K 31/407 (2006.01)

A 6 1 K 31/4196 (2006.01)

A 6 1 K 31/436 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 31/44 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/4545 (2006.01)

A 6 1 K 31/4743 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/513 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/565 (2006.01)

A 6 1 K 31/69 (2006.01)

A 6 1 K 31/704 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/145 (2006.01)

C 0 7 D 249/08 (2006.01)

C 0 7 D 239/553 (2006.01)

C 0 7 D 239/94 (2006.01)

C 0 7 D 225/06 (2006.01)

C 0 7 D 307/88 (2006.01)

C 0 7 D 475/04 (2006.01)

C 0 7 D 491/044 (2006.01)

C 0 7 D 491/08 (2006.01)

C 0 7 D 213/81 (2006.01)

C 0 7 D 273/08 (2006.01)

C 0 7 H 15/252 (2006.01)

C 0 7 H 17/04 (2006.01)
 C 0 7 D 401/04 (2006.01)
 C 0 7 D 403/06 (2006.01)
 C 0 7 D 493/04 (2006.01)
 C 0 7 D 493/22 (2006.01)
 C 0 7 D 498/18 (2006.01)
 C 0 7 J 31/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z
 C 0 7 D 519/00 3 0 1
 A 6 1 K 38/06
 A 6 1 K 38/12
 A 6 1 K 38/44
 A 6 1 K 39/00 H
 A 6 1 K 39/395 N
 A 6 1 K 31/365
 A 6 1 K 31/395
 A 6 1 K 31/4045
 A 6 1 K 31/407
 A 6 1 K 31/4196
 A 6 1 K 31/436
 A 6 1 K 31/437
 A 6 1 K 31/44
 A 6 1 K 31/444
 A 6 1 K 31/4545
 A 6 1 K 31/4743
 A 6 1 K 31/506
 A 6 1 K 31/513
 A 6 1 K 31/517
 A 6 1 K 31/519
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 K 31/565
 A 6 1 K 31/69
 A 6 1 K 31/704
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 K 31/145
 C 0 7 D 249/08 5 3 0
 C 0 7 D 239/553 C S P A
 C 0 7 D 239/94
 C 0 7 D 225/06
 C 0 7 D 307/88
 C 0 7 D 475/04
 C 0 7 D 491/044
 C 0 7 D 491/08
 C 0 7 D 213/81
 C 0 7 D 273/08
 C 0 7 H 15/252
 C 0 7 H 17/04

C 0 7 D 401/04
 C 0 7 D 403/06
 C 0 7 D 493/04 1 1 1
 C 0 7 D 493/22
 C 0 7 D 498/18
 C 0 7 J 31/00

【手続補正書】

【提出日】平成31年1月23日(2019.1.23)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

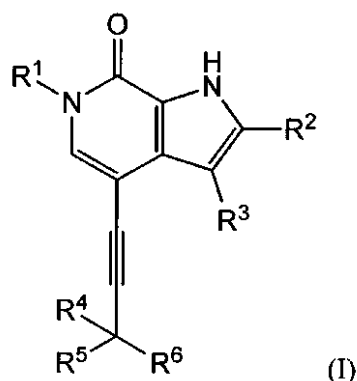
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1 7 6】



(式中、

R^1 は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、カルボシクリル、またはヘテロシクリルであり、前記 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル（前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R^2 は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、カルボシクリル、またはヘテロシクリルであり、前記 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル（前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R^3 は、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $-N(R^b)_2$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、または 5 ~ 6 員ヘテロアリール環であり、前記 $C_1 \sim 6$ アルキルおよび 5 ~ 6 員ヘテロアリール環は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-OR^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)$

- S (O) - R^b、- N (R^b) - C (O) - N (R^b)₂、および - N (R^b) - S (O)₂ - R^b からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され、任意の C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R^f、オキソ、ハロ、- NO₂、- N (R^b)₂、- C N、- C (O) - N (R^b)₂、- S (O) - N (R^b)₂、- S (O)₂ - N (R^b)₂、- O - R^b、- S - R^b、- O - C (O) - R^b、- C (O) - R^b、- C (O) - O - R^b、- S (O) - R^b、- S (O)₂ - R^b、- N (R^b) - C (O) - R^b、- N (R^b) - S (O) - R^b、- N (R^b) - C (O) - N (R^b)₂、および - N (R^b) - S (O)₂ - R^b からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R^a は、水素、C₁ ~ 10 アルキル、C₂ ~ 10 アルケニル、C₂ ~ 10 アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から選択され、任意の C₁ ~ 10 アルキル、C₂ ~ 10 アルケニル、C₂ ~ 10 アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R^d、オキソ、ハロ、- NO₂、- N (R^b)₂、- C N、- C (O) - N (R^b)₂、- S (O) - N (R^b)₂、- S (O)₂ - N (R^b)₂、- O - R^b、- S - R^b、- O - C (O) - R^b、- C (O) - R^b、- C (O) - O - R^b、- S (O) - R^b、- S (O)₂ - R^b、- N (R^b) - C (O) - R^b、- N (R^b) - S (O) - R^b、- N (R^b) - C (O) - N (R^b)₂、および - N (R^b) - S (O)₂ - R^b からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

各々の R^b は、水素、C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₁ ~ 6 アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々の C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₁ ~ 6 アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R^c、オキソ、ハロ、- NO₂、- N (R^c)₂、- C N、- C (O) - N (R^c)₂、- S (O) - N (R^c)₂、- S (O)₂ - N (R^c)₂、- O - R^c、- S - R^c、- O - C (O) - R^c、- C (O) - R^c、- C (O) - O R^c、- S (O) - R^c、- S (O)₂ - R^c、- N (R^c) - C (O) - R^c、- N (R^c) - S (O) - R^c、- N (R^c) - C (O) - N (R^c)₂、および - N (R^c) - S (O)₂ - R^c からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2 つの R^b が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、および C₁ ~ 3 アルキル（前記 C₁ ~ 3 アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

各々の R^c は、水素、C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々の C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、C₁ ~ 6 アルコキシ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、および C₁ ~ C₆ アルキル（前記 C₁ ~ C₆ アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2 つの R^c が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、および C₁ ~ 3 アルキル（前記 C₁ ~ 3 アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

各々の R^d は、C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₁ ~ 6 アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々の C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₁ ~ 6 アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R^e、オキソ、ハロ、- NO₂、- N (R^e)₂、- C N、- C (O) - N (R^e)₂、- S (O) - N (R^e)₂、- S (O)₂ - N (R^e)₂、- O - R^e、- S - R^e、- O - C (O) - R^e、- C (O)

- R^e、- C(O) - OR^c、- S(O) - R^c、- S(O)₂ - R^c、- N(R^c) - C(O) - R^c、- N(R^c) - S(O) - R^c、- N(R^c) - C(O) - N(R^c)₂、および - N(R^e) - S(O)₂ - R^e からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され、

各々の R^e は、水素、C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₁ ~ 6 アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々の C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₁ ~ 6 アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、C₁ ~ 6 アルコキシ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、および C₁ ~ C₆ アルキル（前記 C₁ ~ C₆ アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2 つの R^e が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、および C₁ ~ 3 アルキル（前記 C₁ ~ 3 アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

各々の R^f は、C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₁ ~ 6 アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々の C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₁ ~ 6 アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、C₁ ~ 6 アルコキシ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、および C₁ ~ C₆ アルキル（前記 C₁ ~ C₆ アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R⁴ は存在しないか、H、ヒドロキシ、または C₁ ~ 6 アルキル（前記 C₁ ~ 6 アルキルは、ハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）であり；

R⁵ は、H またはハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C₁ ~ 6 アルキルであり；R⁶ は、C₁ ~ 6 アルキル、カルボシクリル、またはヘテロシクリルであり、前記 C₁ ~ 6 アルキル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、1 つまたは複数の R^g で任意選択的に置換され；または、R⁵ および R⁶ が、それらが結合する炭素とともに、カルボシクリルまたはヘテロシクリルを形成し、前記カルボシクリルおよびヘテロシクリルは、1 つまたは複数の R^g で任意選択的に置換され；

各々の R^g は、C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリル、R^k、ハロ、オキソ (= O)、- NO₂、- N(R^h)₂、- CN、- C(O) - N(R^h)₂、- S(O) - N(R^h)₂、- S(O)₂ - N(R^h)₂、- O - R^h、- S - R^h、- O - C(O) - R^h、- C(O) - R^h、- C(O) - OR^h、- S(O) - R^h、- S(O)₂ - R^h、- N(R^h) - C(O) - R^h、- N(R^h) - S(O) - R^h、- N(R^h) - C(O) - N(R^h)₂、および - N(R^h) - S(O)₂ - R^h からなる群から独立して選択され；

各々の R^h は、水素、C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₁ ~ 6 アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々の C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₁ ~ 6 アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、C₁ ~ 6 アルコキシ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、および C₁ ~ C₆ アルキル（前記 C₁ ~ C₆ アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2 つの R^h が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、および C₁ ~ 3 アルキル（前記 C₁ ~ 3 アルキルは、オキソ

およびハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し;

各々の R^k は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、前記 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^h)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^h)_2$ 、 $-S(O)-N(R^h)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^h)_2$ 、 $-O-R^h$ 、 $-S-R^h$ 、 $-O-C(O)-R^h$ 、 $-C(O)-R^h$ 、 $-C(O)-OR^h$ 、 $-S(O)-R^h$ 、 $-S(O)_2-R^h$ 、 $-N(R^h)-C(O)-R^h$ 、 $-N(R^h)-S(O)-R^h$ 、 $-N(R^h)-C(O)-N(R^h)_2$ 、および $-N(R^h)-S(O)_2-R^h$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で置換される) の化合物またはその塩。

【請求項 2】

R^1 は、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル (前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルである、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 3】

R^1 はメチルである、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 4】

R^2 は、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル (前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルである、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 5】

R^2 はメチルである、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 6】

R^3 は H である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 7】

R^3 は、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり、任意のカルボシクリル、およびヘテロシクリルは、 R^f 、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-O-R^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 8】

R^3 は $-N(R^b)_2$ である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 9】

R^3 は $-C(=O)R^a$ である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 10】

R^3 は $-C(=O)OR^a$ である、請求項 1～5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

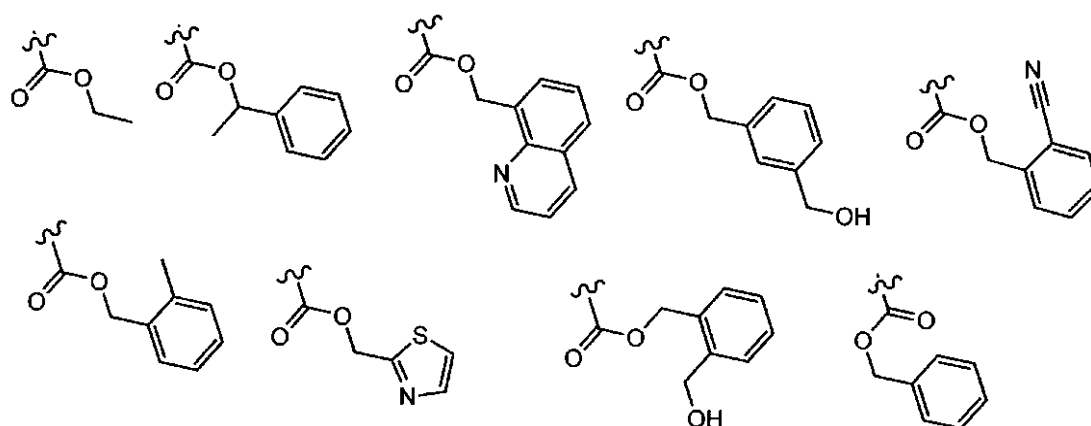
【請求項 11】

R^3 は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された 5～6 員ヘテロアリール環であり、任意の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、 R^f 、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-O-R^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項 1～5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

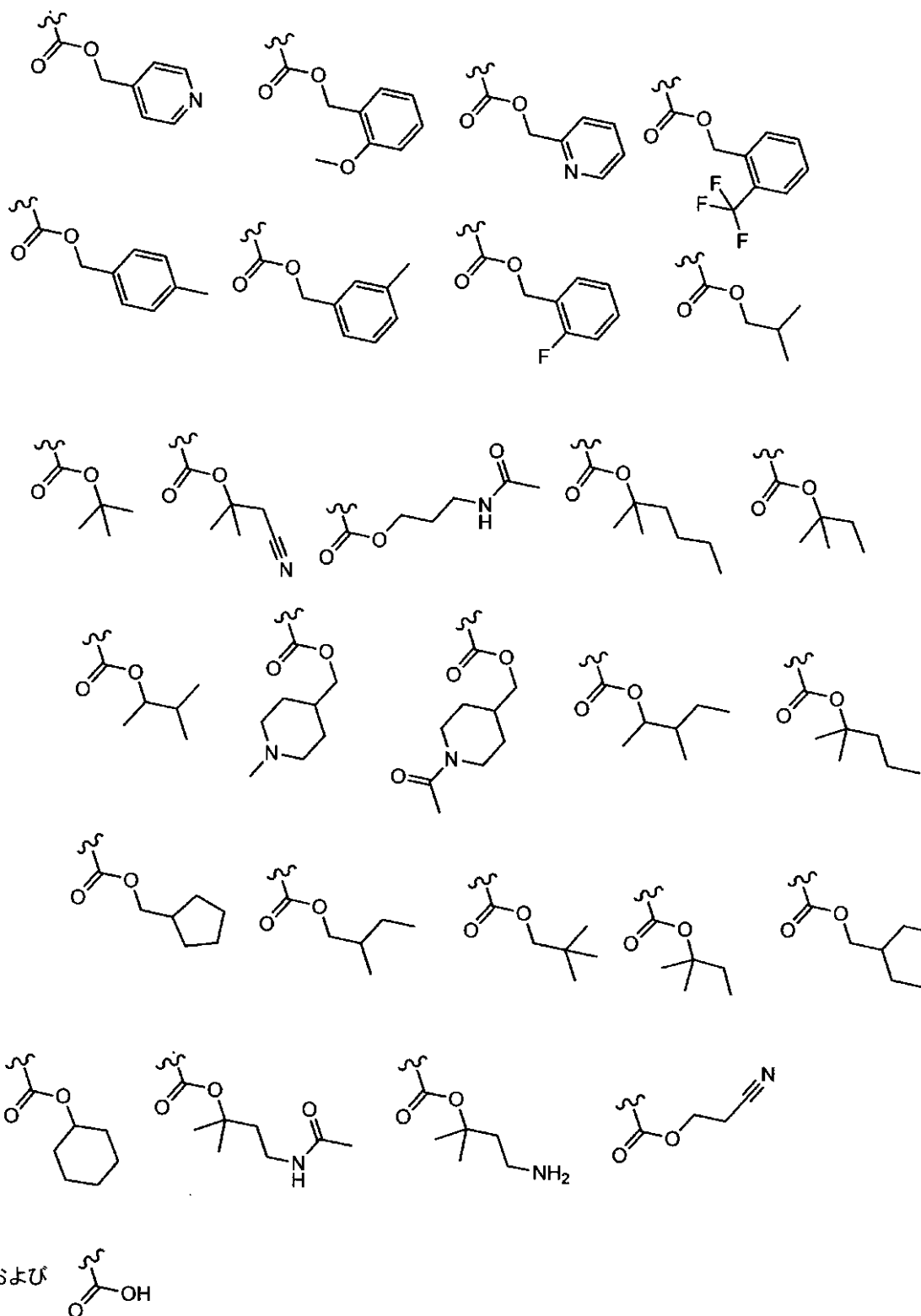
【請求項 12】

R^3 は、

【化 177】



【化 1 7 8】

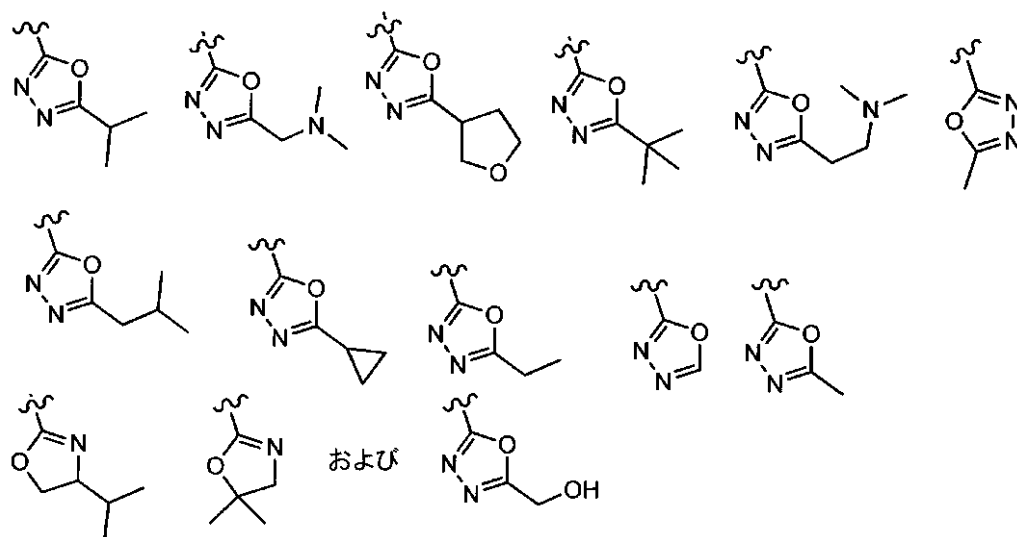


からなる群から選択される、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 1 3】

R³ は、

【化 1 7 9】

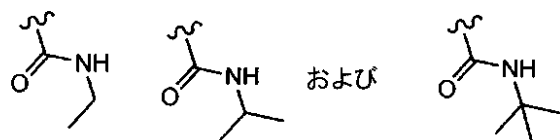


からなる群から選択される、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 1 4】

R³ は、

【化 1 8 0】

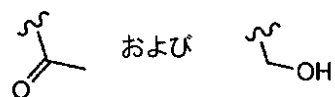


からなる群から選択される、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 1 5】

R³ は、

【化 1 8 1】

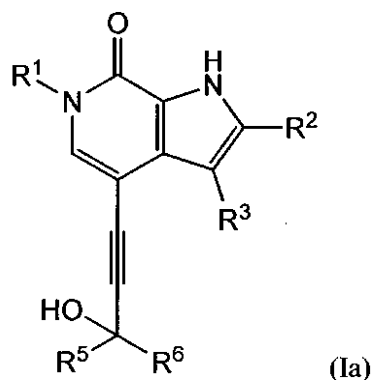


からなる群から選択される、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 1 6】

式 (I a) :

【化 1 8 2】



の化合物である、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 1 7】

R⁴ は H である、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 1 8】

R⁴ はヒドロキシルである、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 1 9】

R⁴ は、ハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C₁ ~ 6 アルキルである、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 2 0】

R⁵ は H である、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 2 1】

R⁵ は、ハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C₁ ~ 6 アルキルである、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 2 2】

R⁶ は、1 つまたは複数の R⁸ で任意選択的に置換された C₁ ~ 6 アルキルである、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 2 3】

R⁶ は、1 つまたは複数の R⁸ で任意選択的に置換されたカルボシクリルである、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 2 4】

R⁶ は、1 つまたは複数の R⁸ で任意選択的に置換されたヘテロシクリルである、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 2 5】

R⁶ は、オキソおよび - N (R^h)₂ で置換されて - C (O) - N (R^h)₂ 基を形成した C₁ アルキルである、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 2 6】

R⁵ および R⁶ が、それらが結合する炭素とともに、1 つまたは複数の R⁸ で任意選択的に置換されたカルボシクリルを形成する、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 2 7】

R⁵ および R⁶ が、それらが結合する炭素とともに、1 つまたは複数の R⁸ で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成する、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 2 8】

R⁴ は存在せず；R⁵ および R⁶ が、それらが結合する炭素とともに、1 つまたは複数の

R⁸ で任意選択的に置換され、式 (I) の残部と芳香環の原子で連結したアリール環を形成する、請求項 1 ~ 15 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

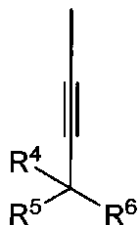
【請求項 29】

R⁴ は存在せず；R⁵ および R⁶ が、それらが結合する炭素とともに、1 つまたは複数の R⁸ で任意選択的に置換され、式 (I) の残部と芳香環の原子で連結したヘテロシクリルを形成する、請求項 1 ~ 15 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 30】

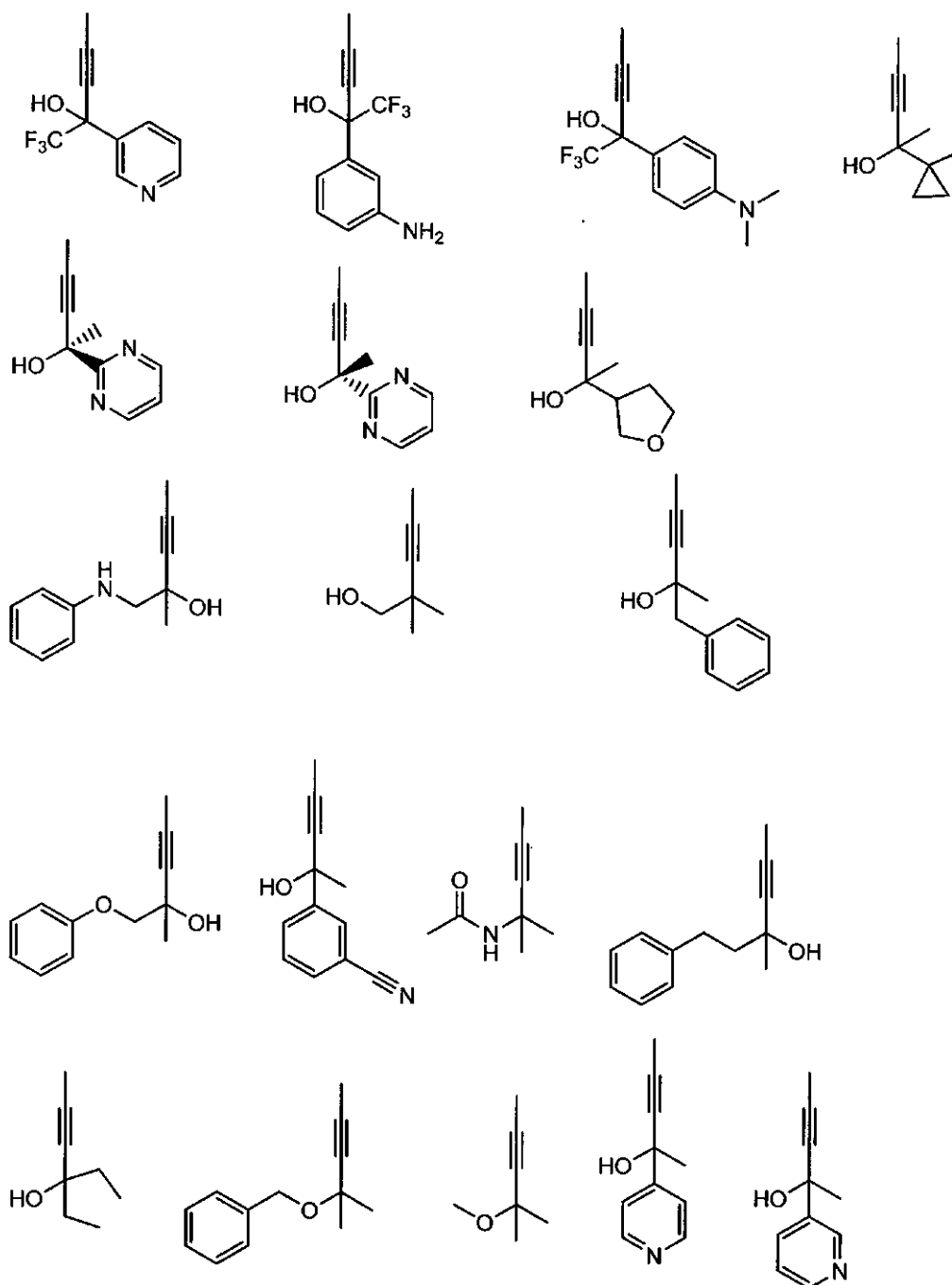
以下の基：

【化 183】

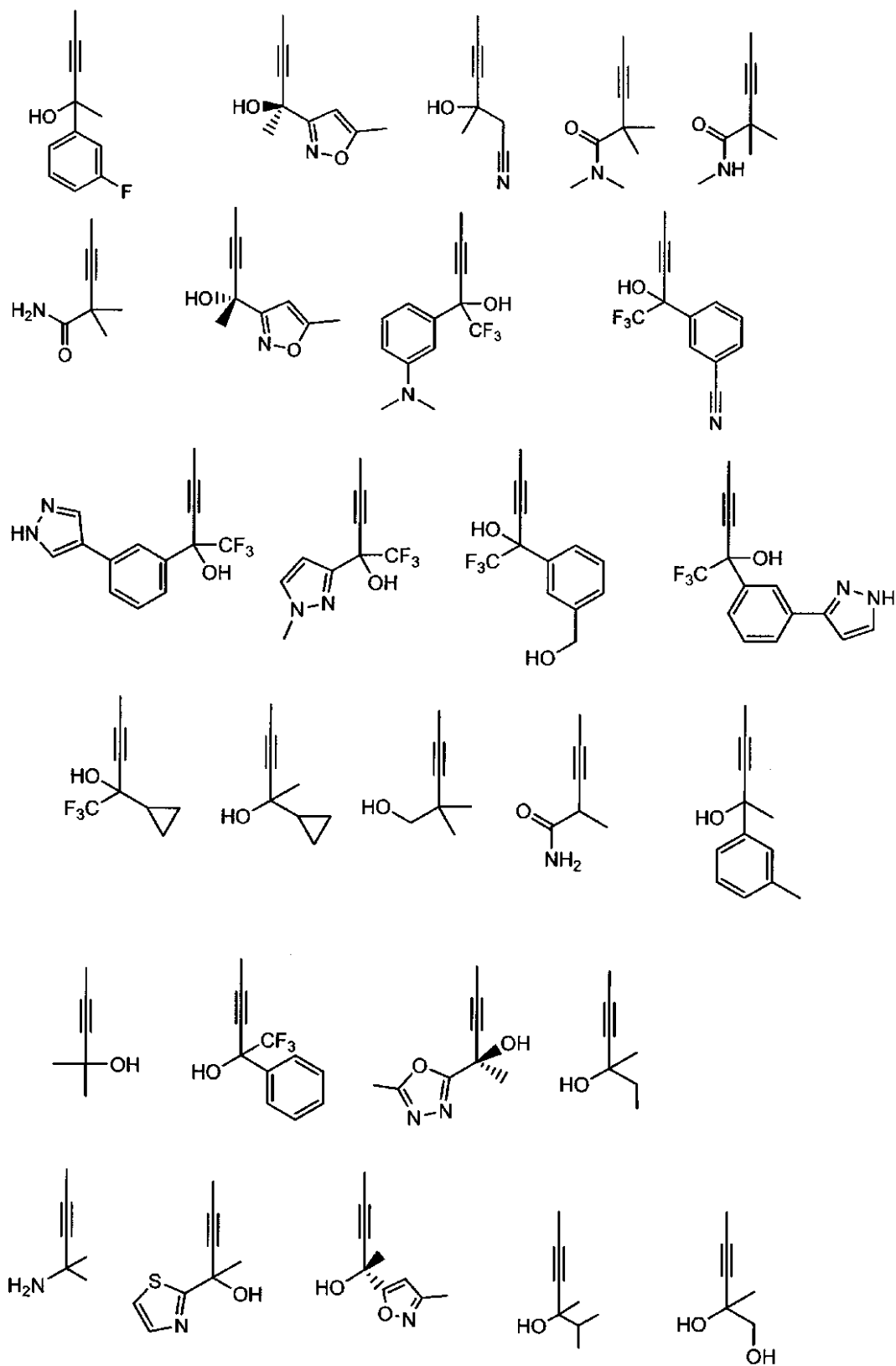


は、

【化 1 8 4】

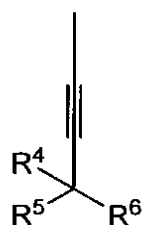


【化 1 8 5】



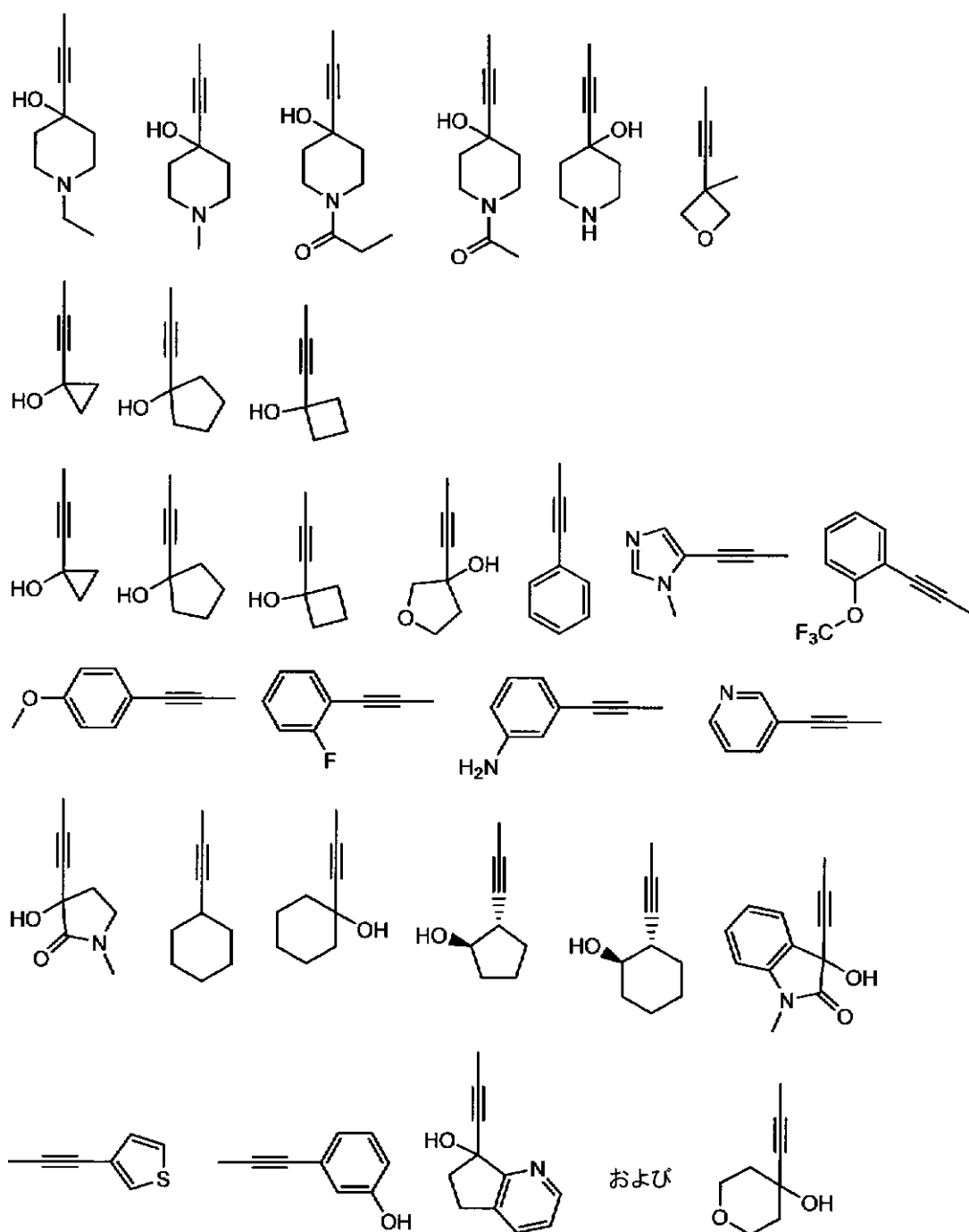
Chemical structures of 13 compounds are shown, including various alkyne derivatives, alcohols, and amides.

【化 1 8 7】



は、

【化 1 8 8】



からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 3 2】

R^1 は、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル（前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^2 は、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル（前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^3 は、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$

、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり、任意のカルボシクリル、およびヘテロシクリルは、 R^f 、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-O-R^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1に記載の化合物またはその塩。

【請求項33】

R^1 は、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル（前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^2 は、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル（前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^3 は $-N(R^b)_2$ である、請求項1に記載の化合物またはその塩。

【請求項34】

R^1 は、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル（前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^2 は、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル（前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^3 は $-C(=O)OR^a$ である、請求項1に記載の化合物またはその塩。

【請求項35】

R^1 は、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル（前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^2 は、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル（前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

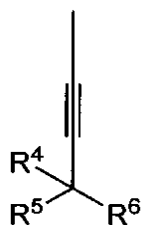
R^3 は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された5～6員ヘテロアリール環であり、任意の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim$

₆ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、 R^f 、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-O-R^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 36】

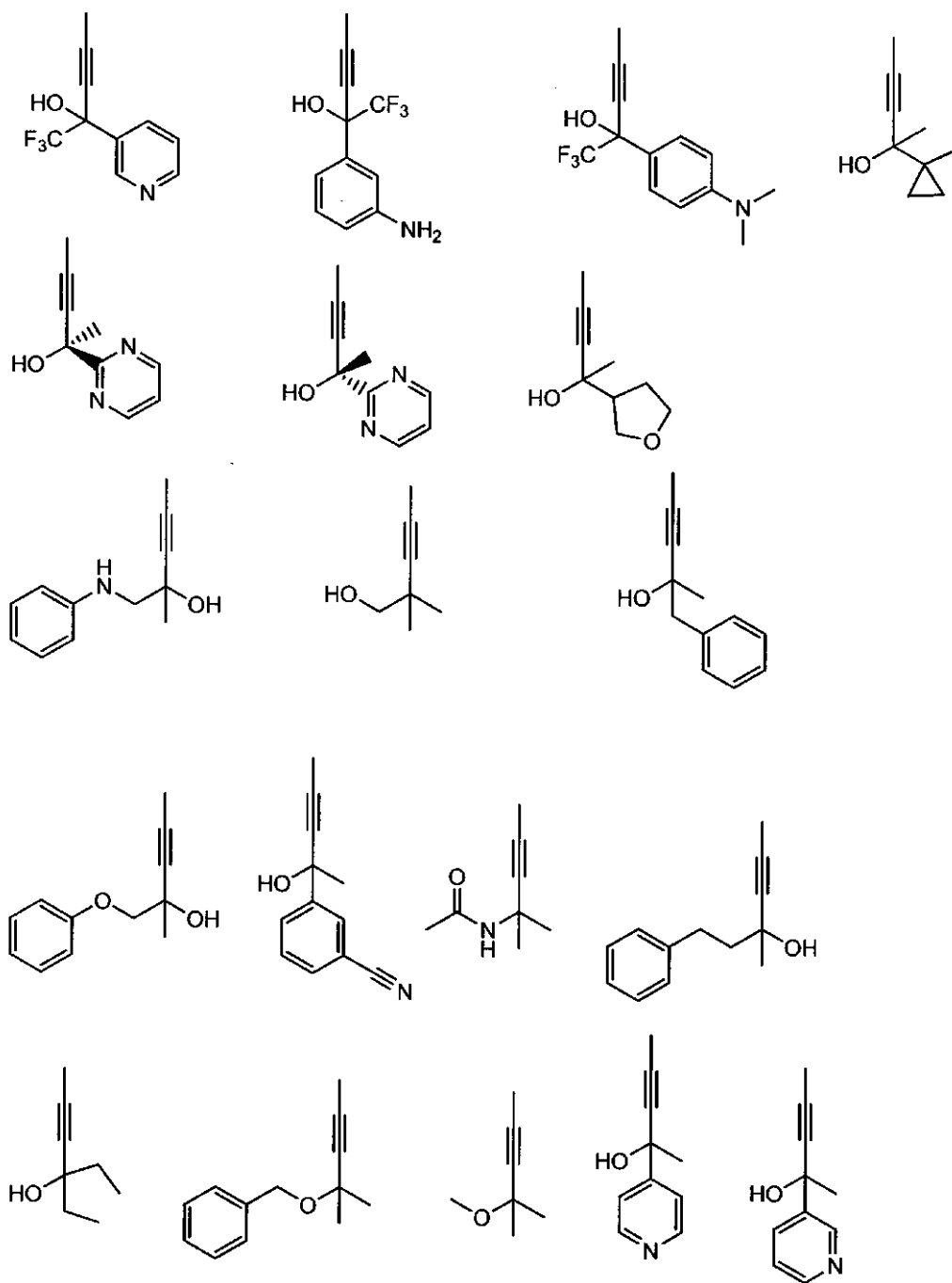
以下の基：

【化 189】

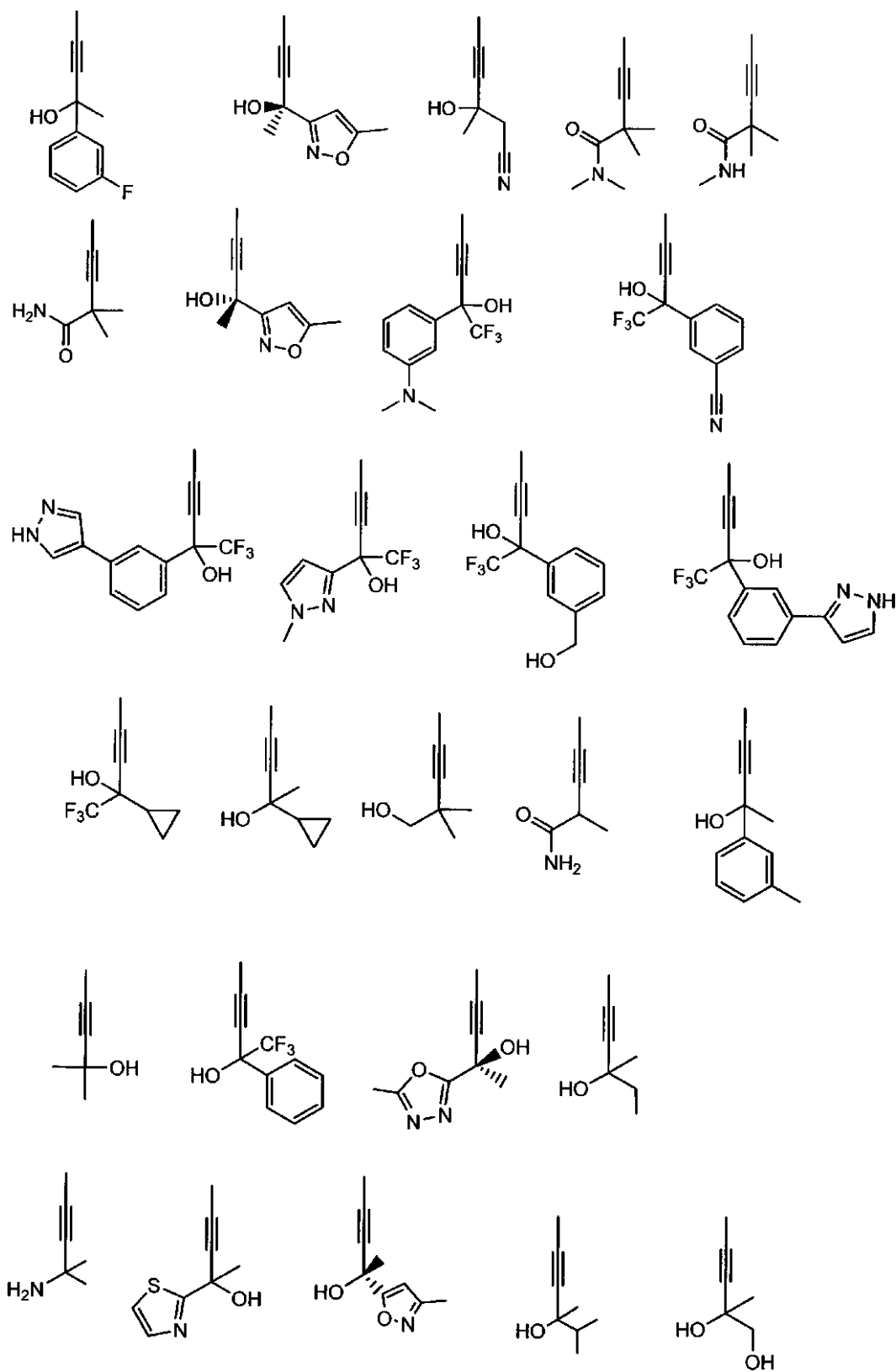


が、

【化 190】



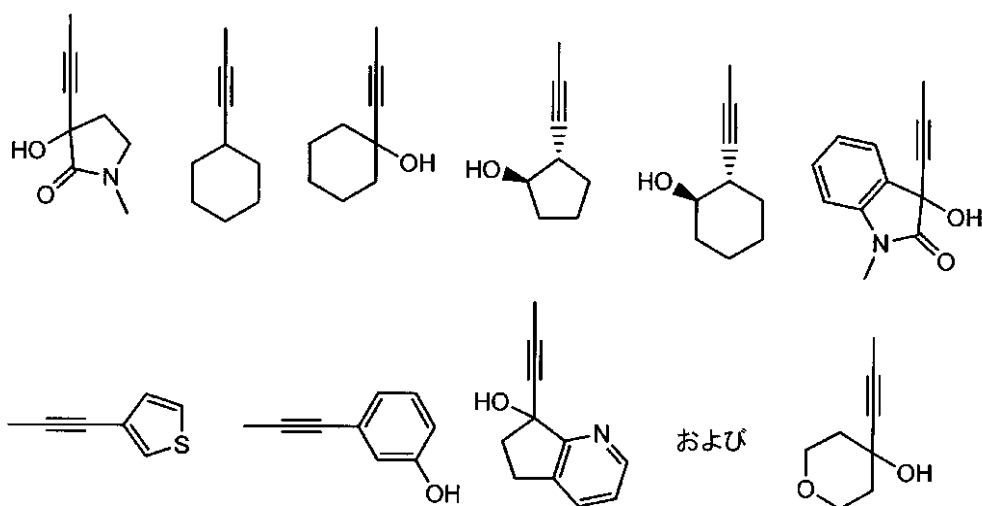
【化 1 9 1】



This figure displays 100 chemical structures of alkyne derivatives, arranged in five rows of twenty. The structures are diverse, featuring various functional groups and ring systems. Key features include:

- Row 1:** A pyrrolidine ring with an alkyne and a hydroxyl group; a phenol derivative with an alkyne; a tert-butyl group with an alkyne; a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; a propargyl alcohol derivative; and a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group.
- Row 2:** A benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; and a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group.
- Row 3:** A benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; and a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group.
- Row 4:** A benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; and a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group.
- Row 5:** A benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group; and a benzene ring with an alkyne and a hydroxyl group.

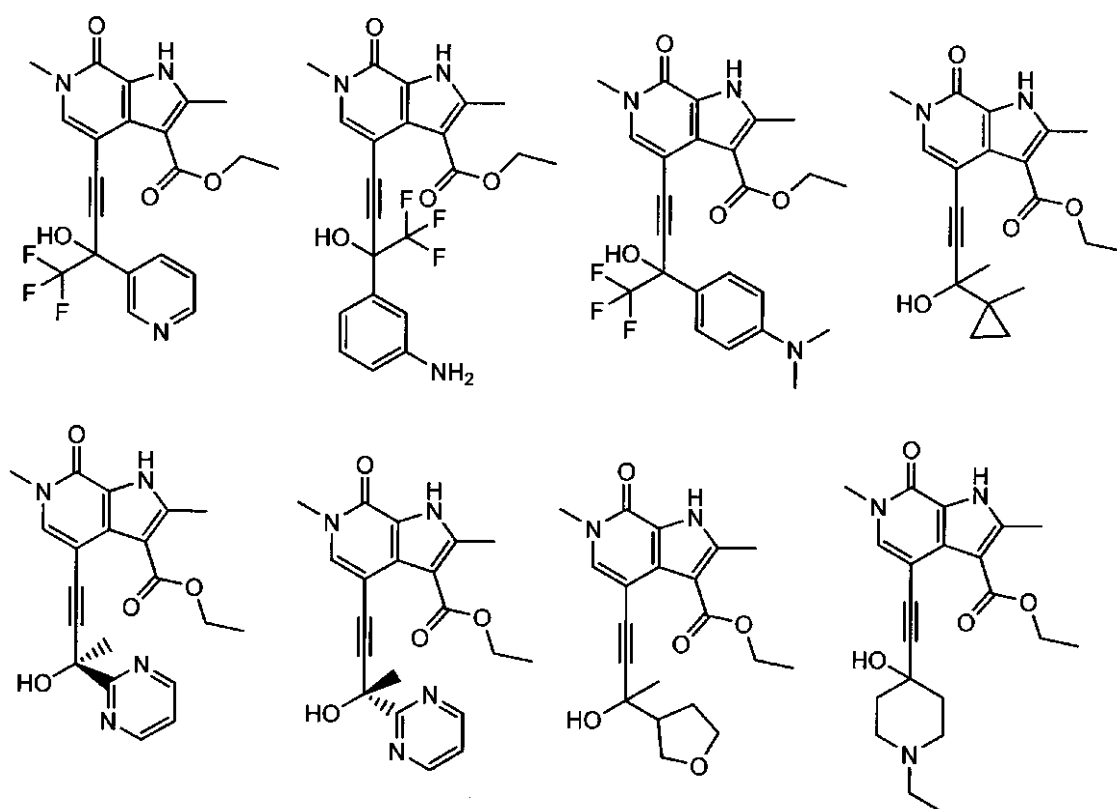
【化 1 9 3】



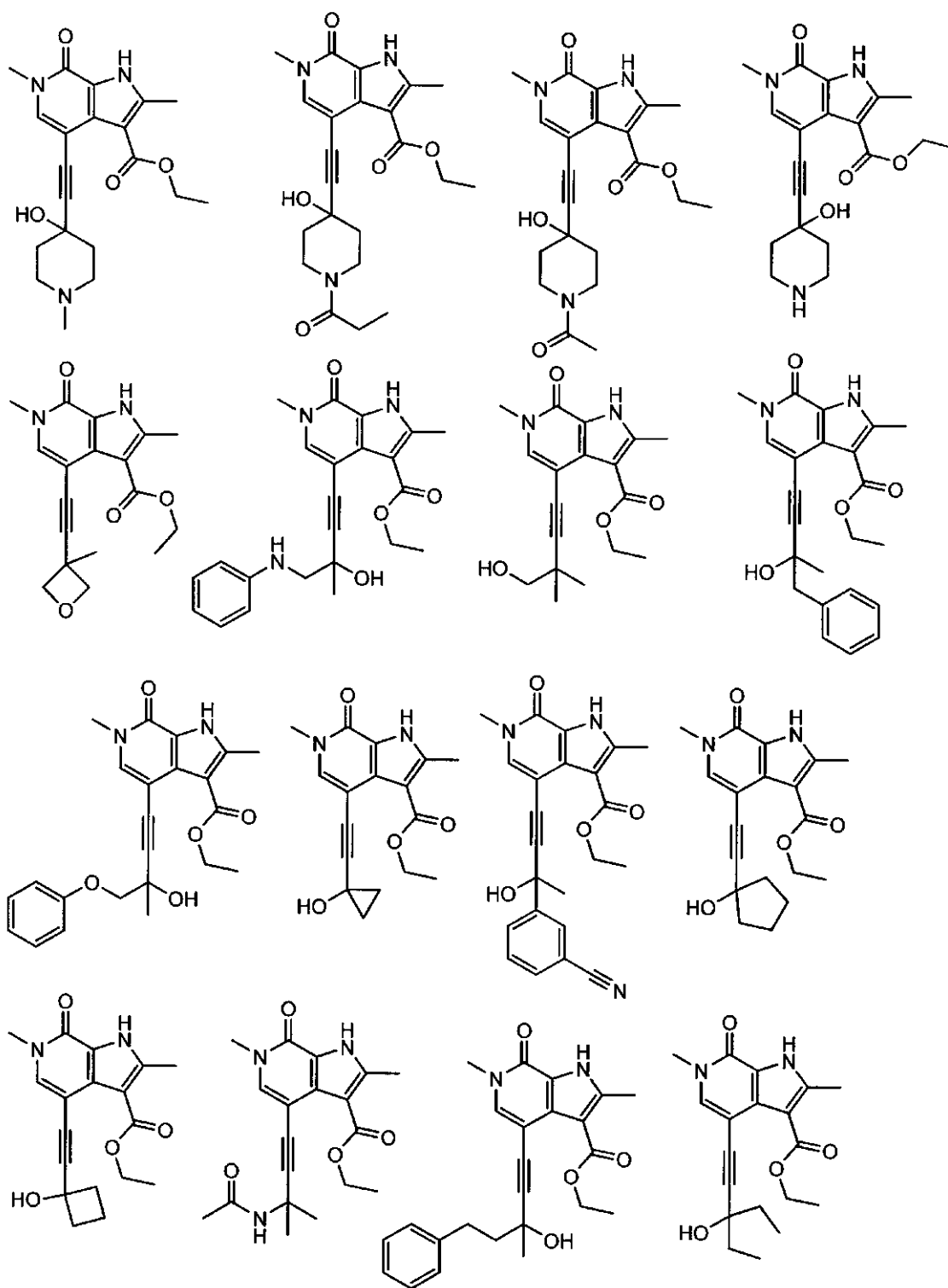
からなる群から選択される、請求項 3 2 ~ 3 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 3 7】

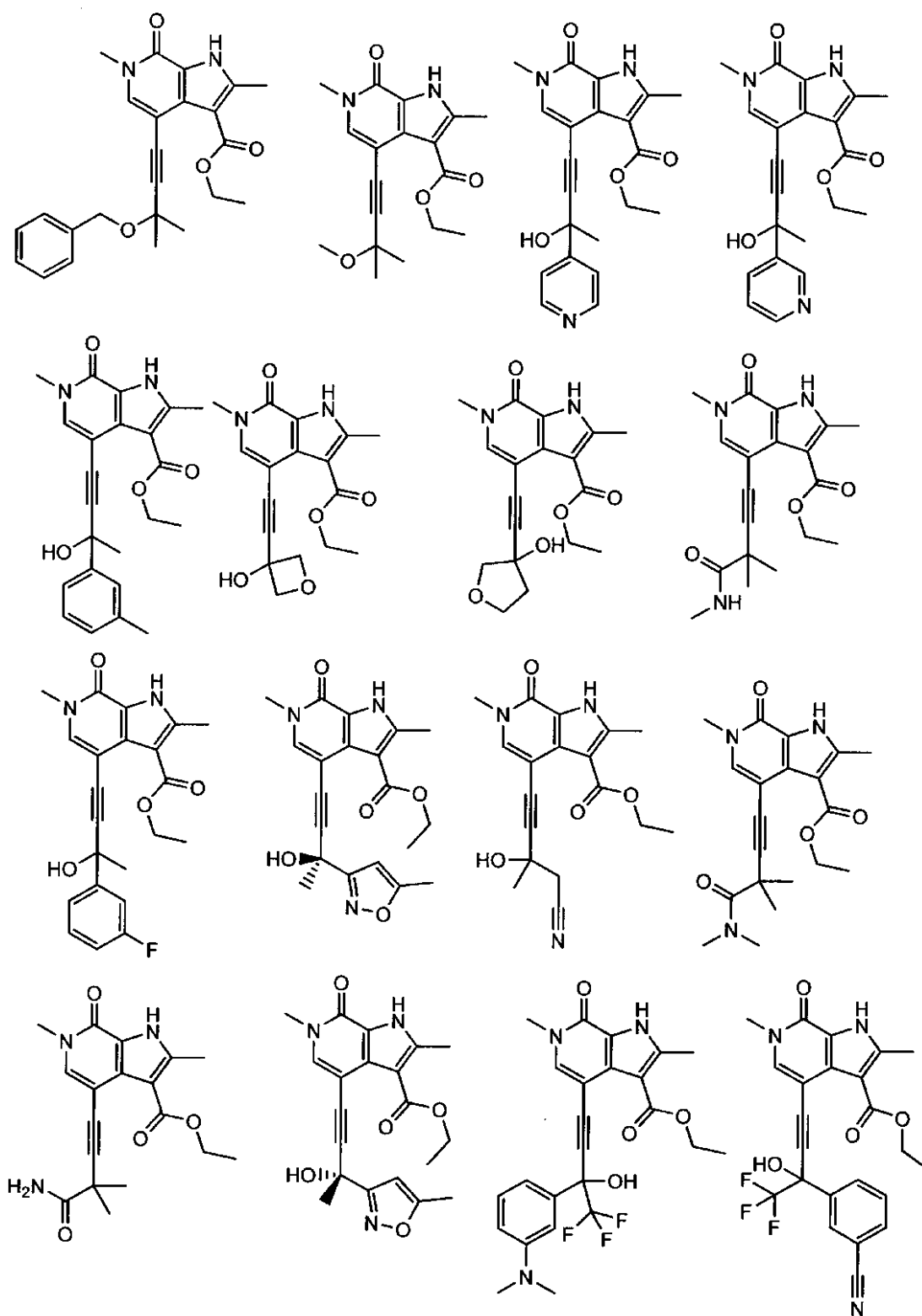
【化 1 9 4】



【化 1 9 5】

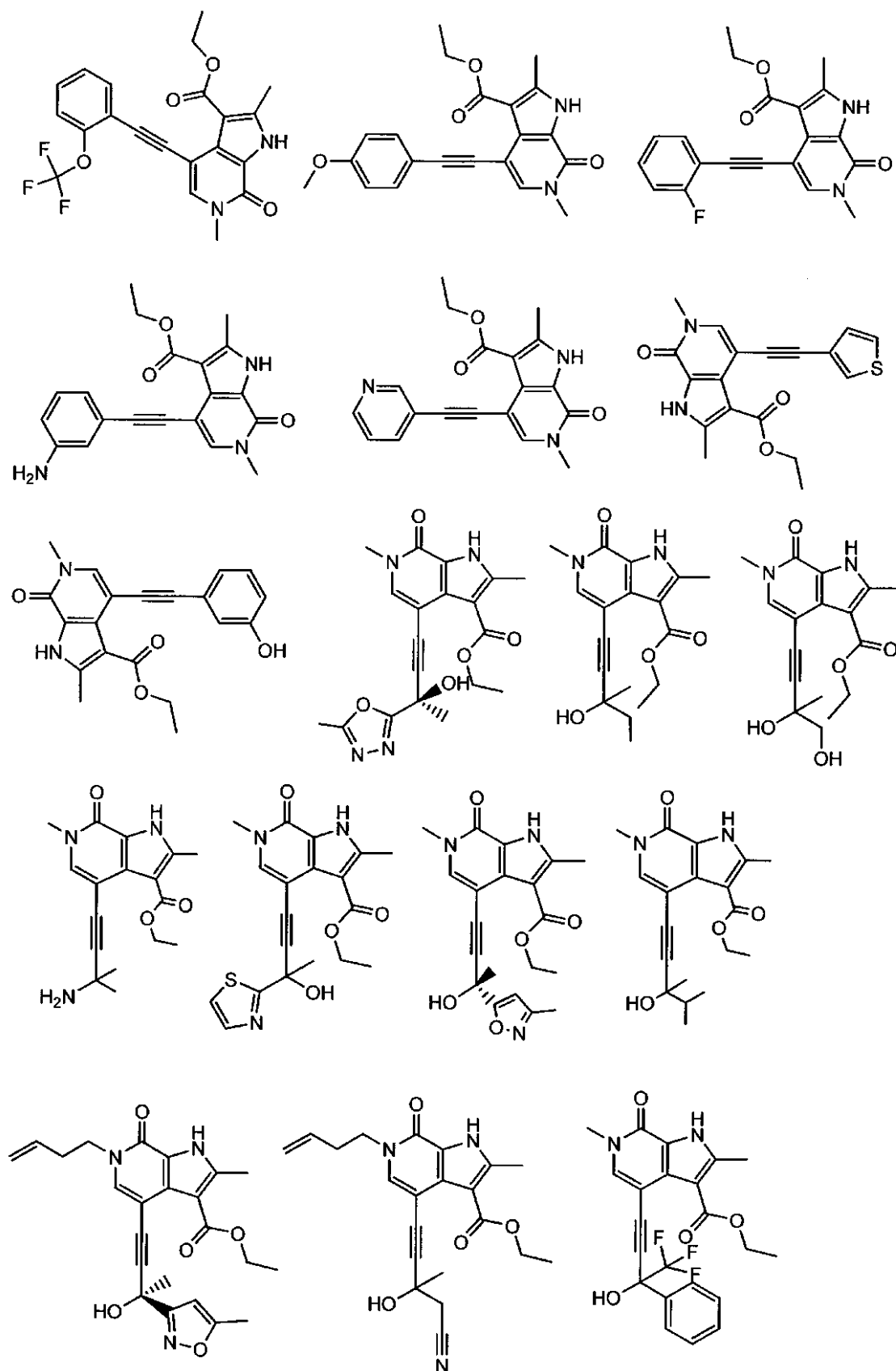


【化 196】

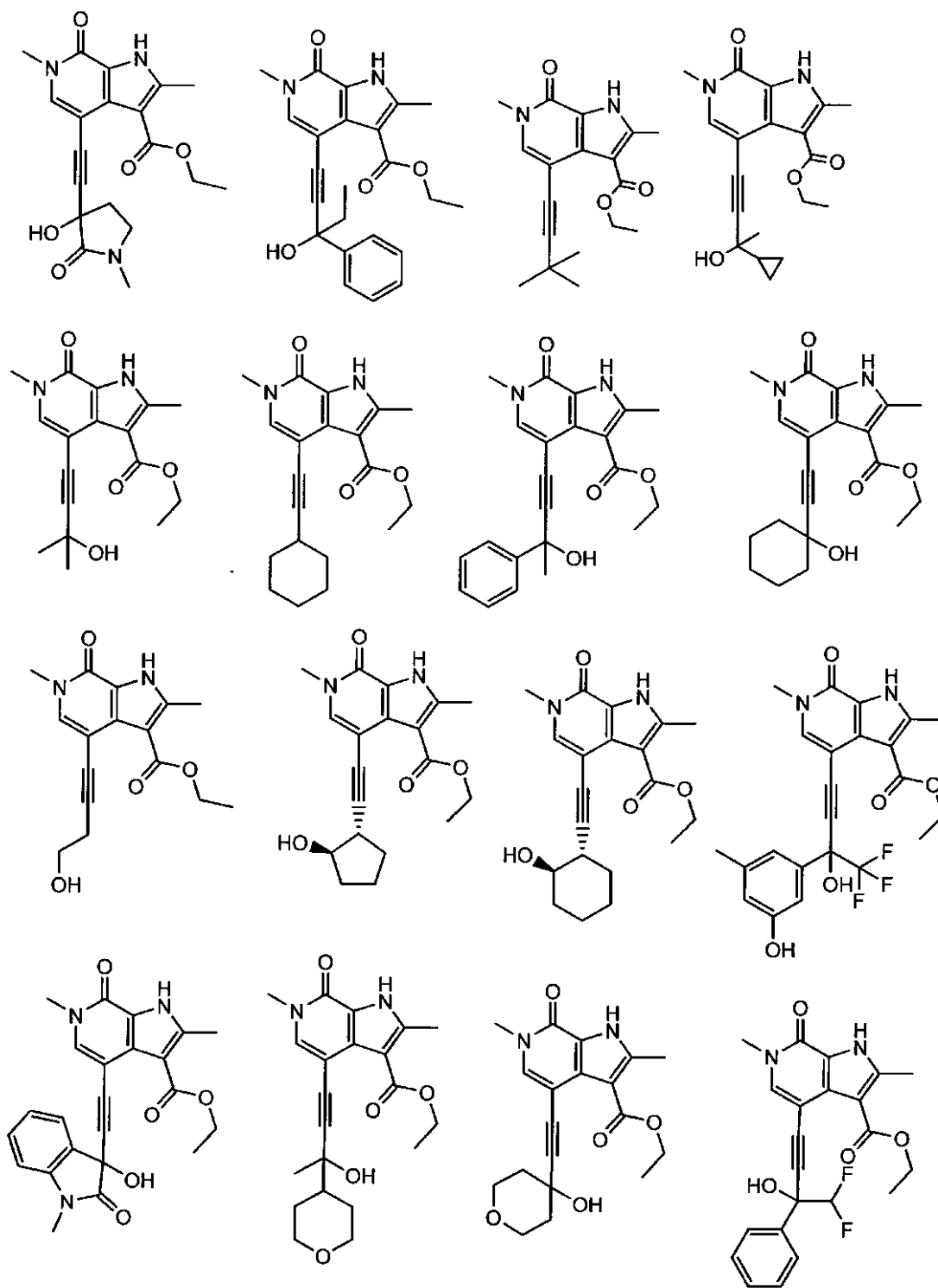


[illegible]

【化 1 9 8】



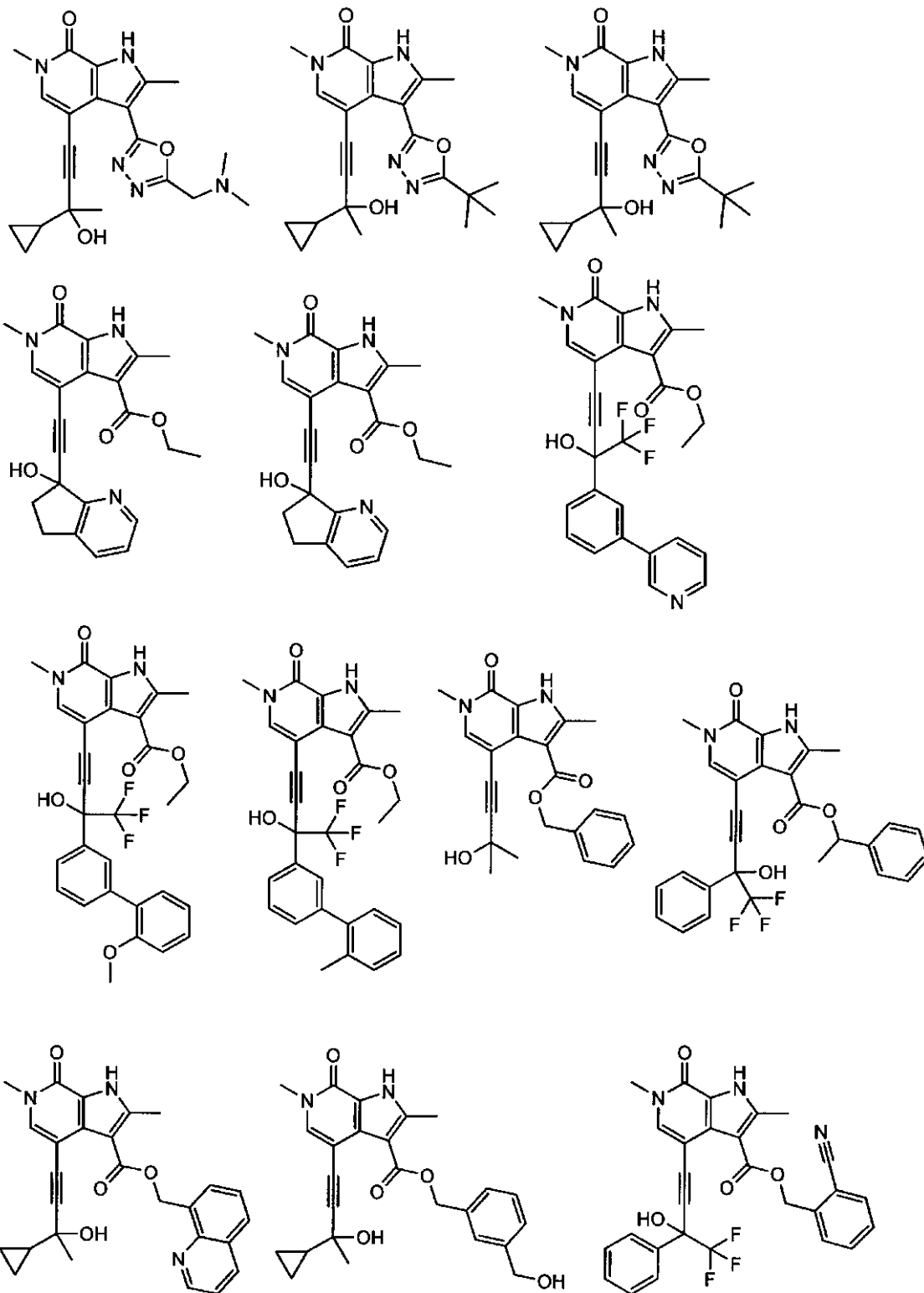
【化 1 9 9】



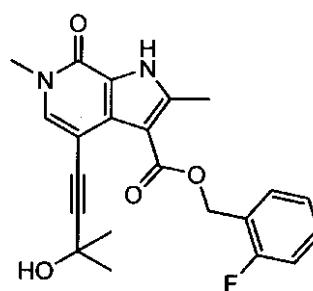
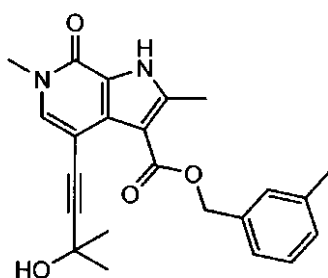
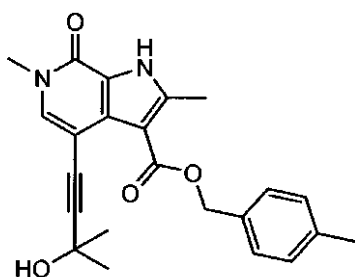
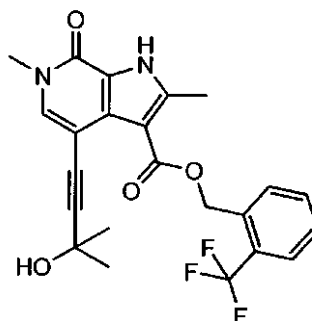
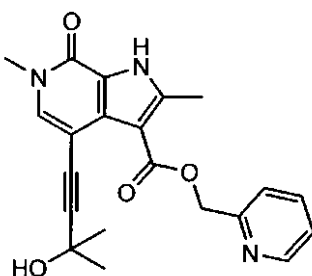
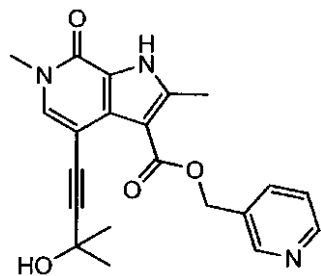
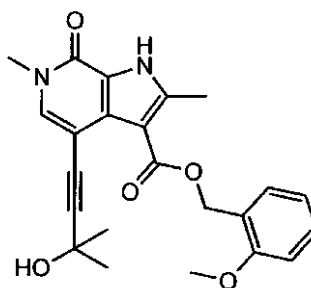
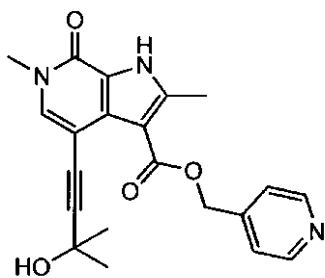
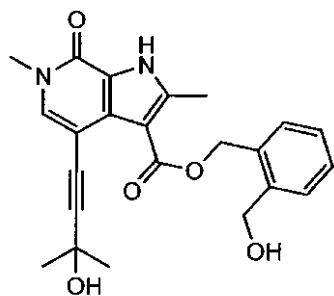
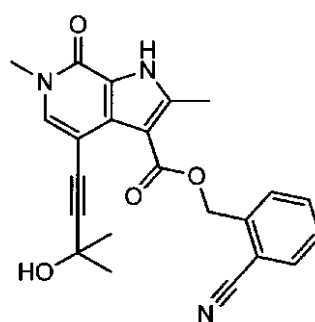
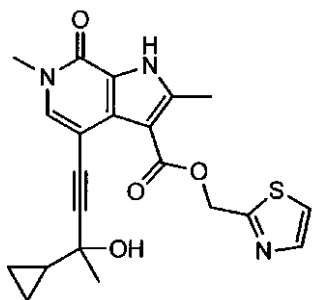
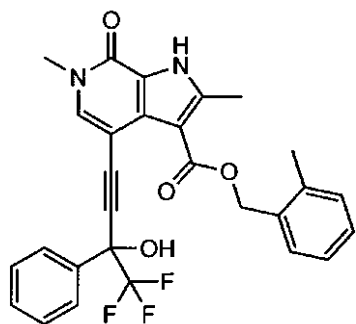
Chemical structures of 12 compounds (1-12) featuring a 6-methyl-2-methyl-1H-indolizino[1,2-b]pyridine-3-carboxylate core with various substituents at the 3-position:

- 1: 3-(4-phenoxyphenyl)-2,2,2-trifluoro-1-hydroxyprop-1-yn-1-yl
- 2: 3-(2,2,2-trifluoro-1-hydroxy-1-phenylethyl)prop-1-yn-1-yl
- 3: 3-(2,2,2-trifluoro-1-hydroxy-1-phenylethyl)prop-1-yn-1-yl
- 4: 3-(2,2,2-trifluoro-1-hydroxy-1-phenylethyl)prop-1-yn-1-yl
- 5: 3-(2,2,2-trifluoro-1-hydroxy-1-phenylethyl)prop-1-yn-1-yl
- 6: 3-(2,2,2-trifluoro-1-hydroxy-1-phenylethyl)prop-1-yn-1-yl
- 7: 3-(2,2,2-trifluoro-1-hydroxy-1-phenylethyl)prop-1-yn-1-yl
- 8: 3-(2,2,2-trifluoro-1-hydroxy-1-phenylethyl)prop-1-yn-1-yl
- 9: 3-(2,2,2-trifluoro-1-hydroxy-1-phenylethyl)prop-1-yn-1-yl
- 10: 3-(2,2,2-trifluoro-1-hydroxy-1-phenylethyl)prop-1-yn-1-yl
- 11: 3-(2,2,2-trifluoro-1-hydroxy-1-phenylethyl)prop-1-yn-1-yl
- 12: 3-(2,2,2-trifluoro-1-hydroxy-1-phenylethyl)prop-1-yn-1-yl

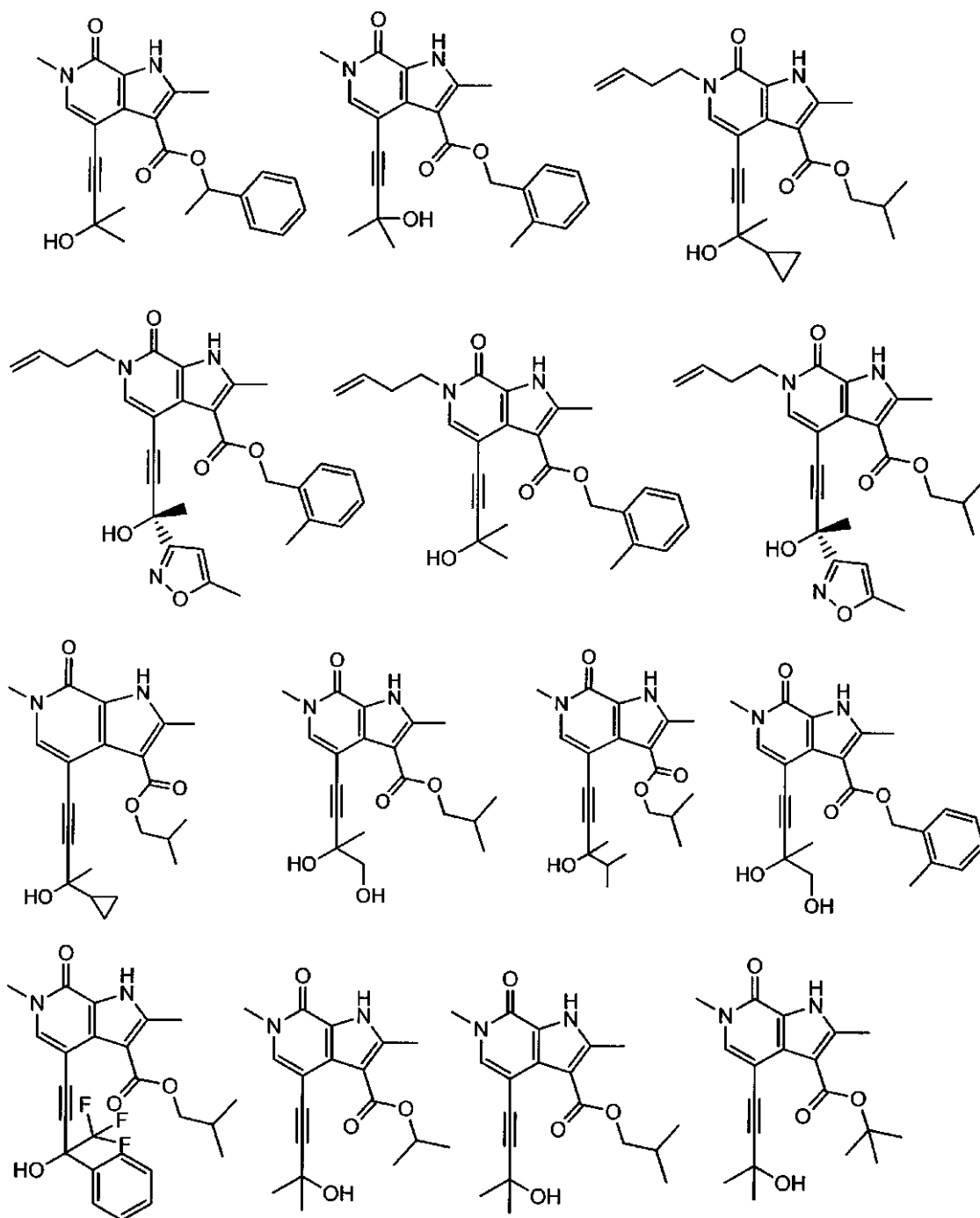
【化 2 0 1】



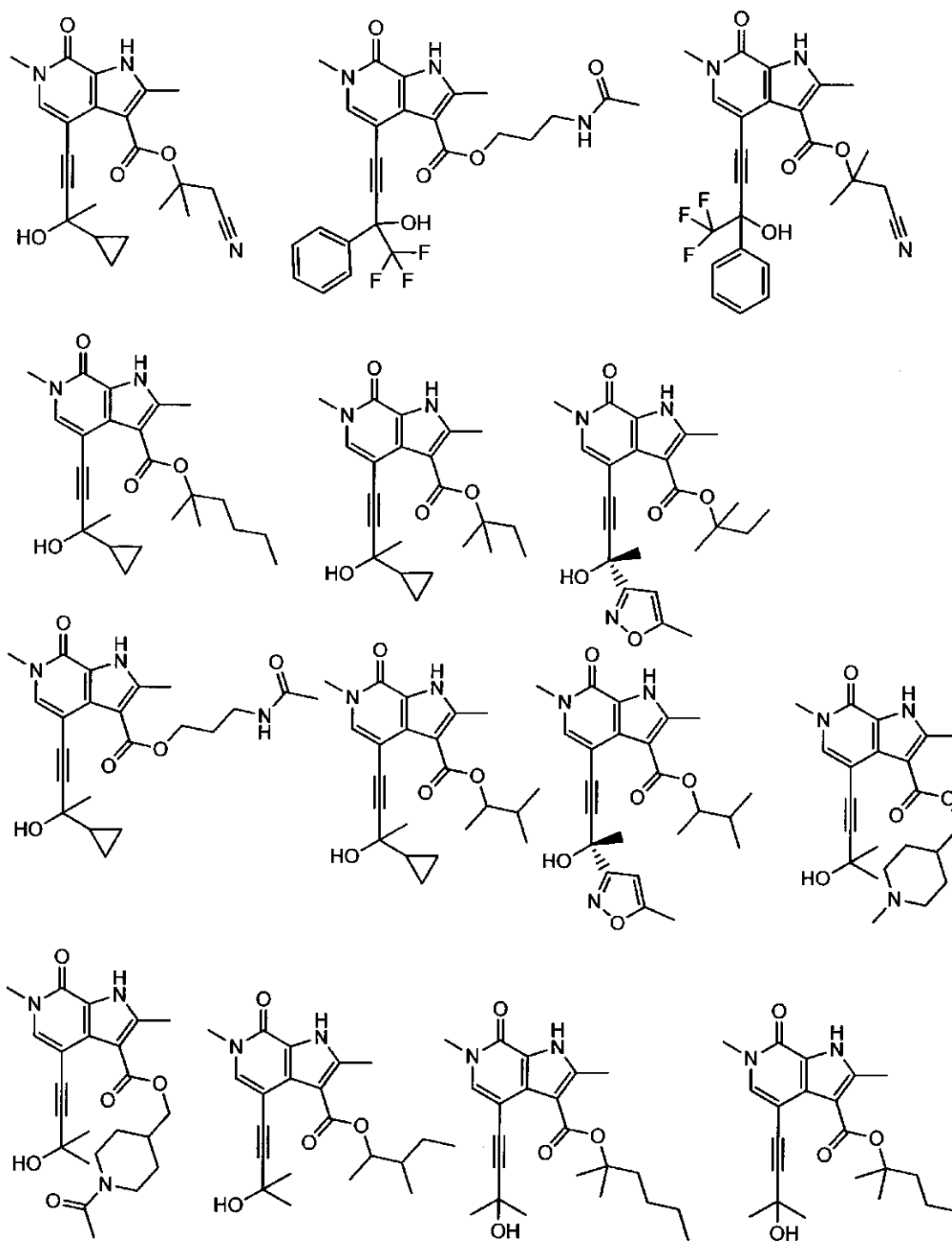
【化 2 0 2】



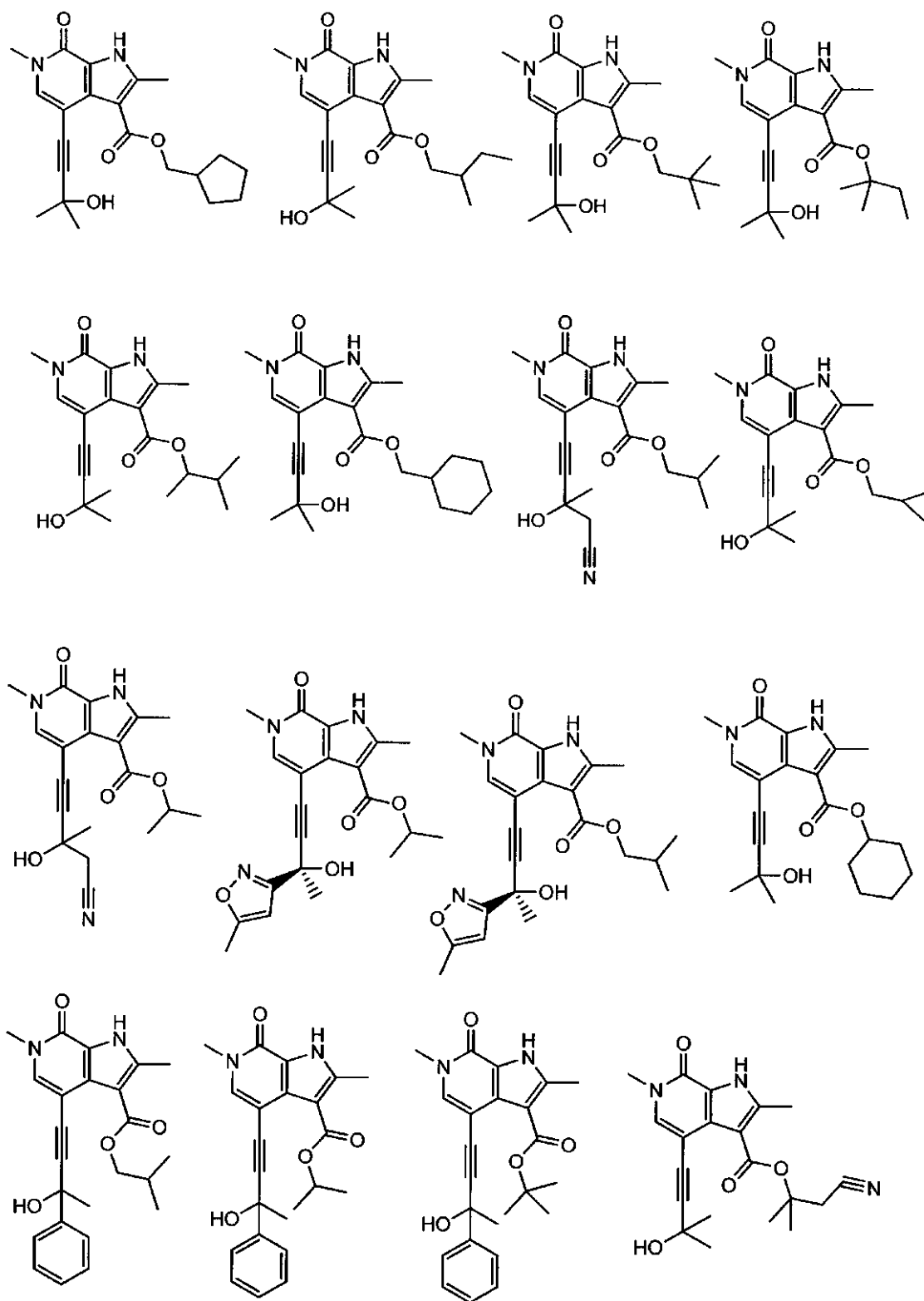
【化 2 0 3】



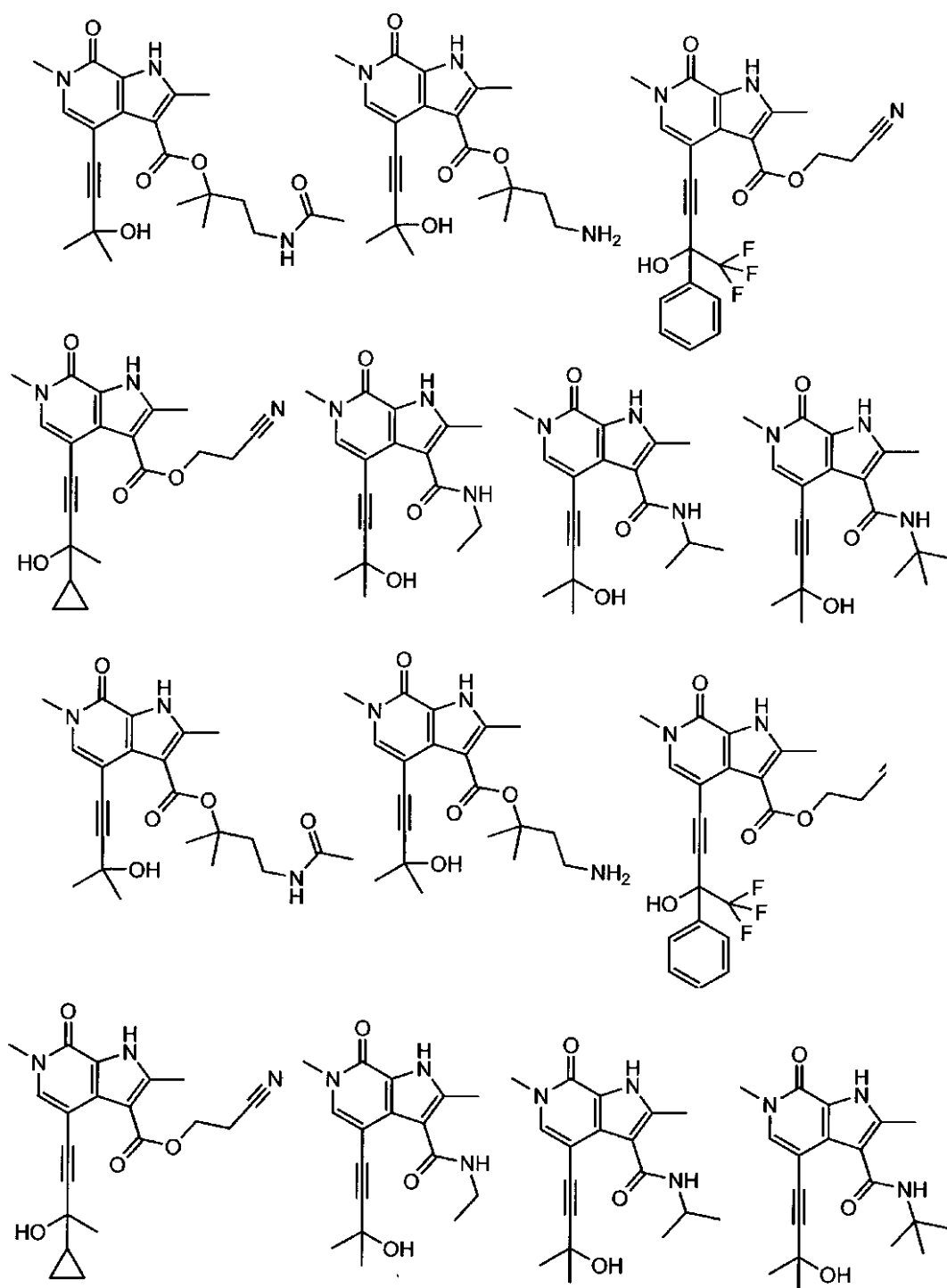
【化 2 0 4】



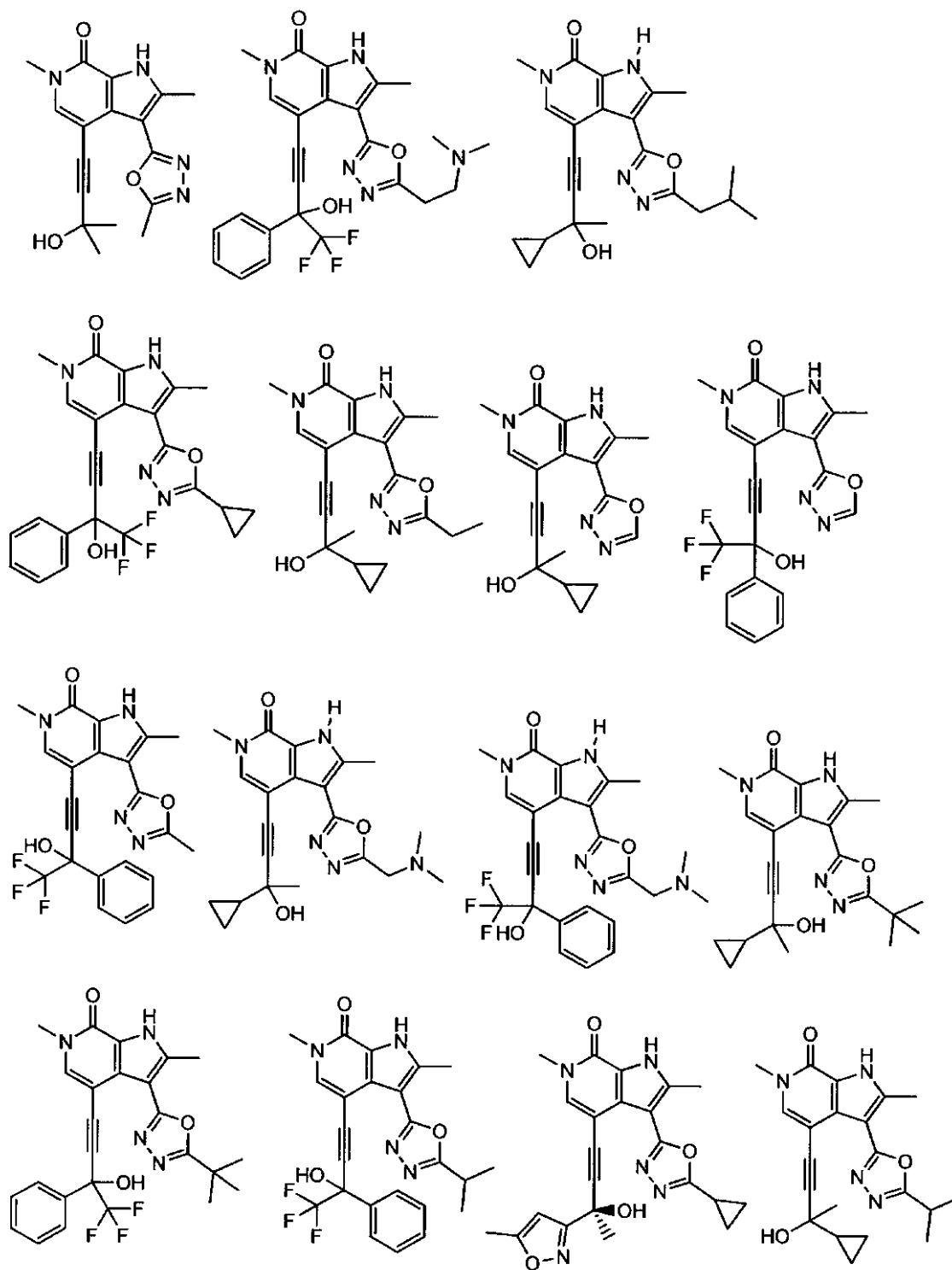
【化 2 0 5】



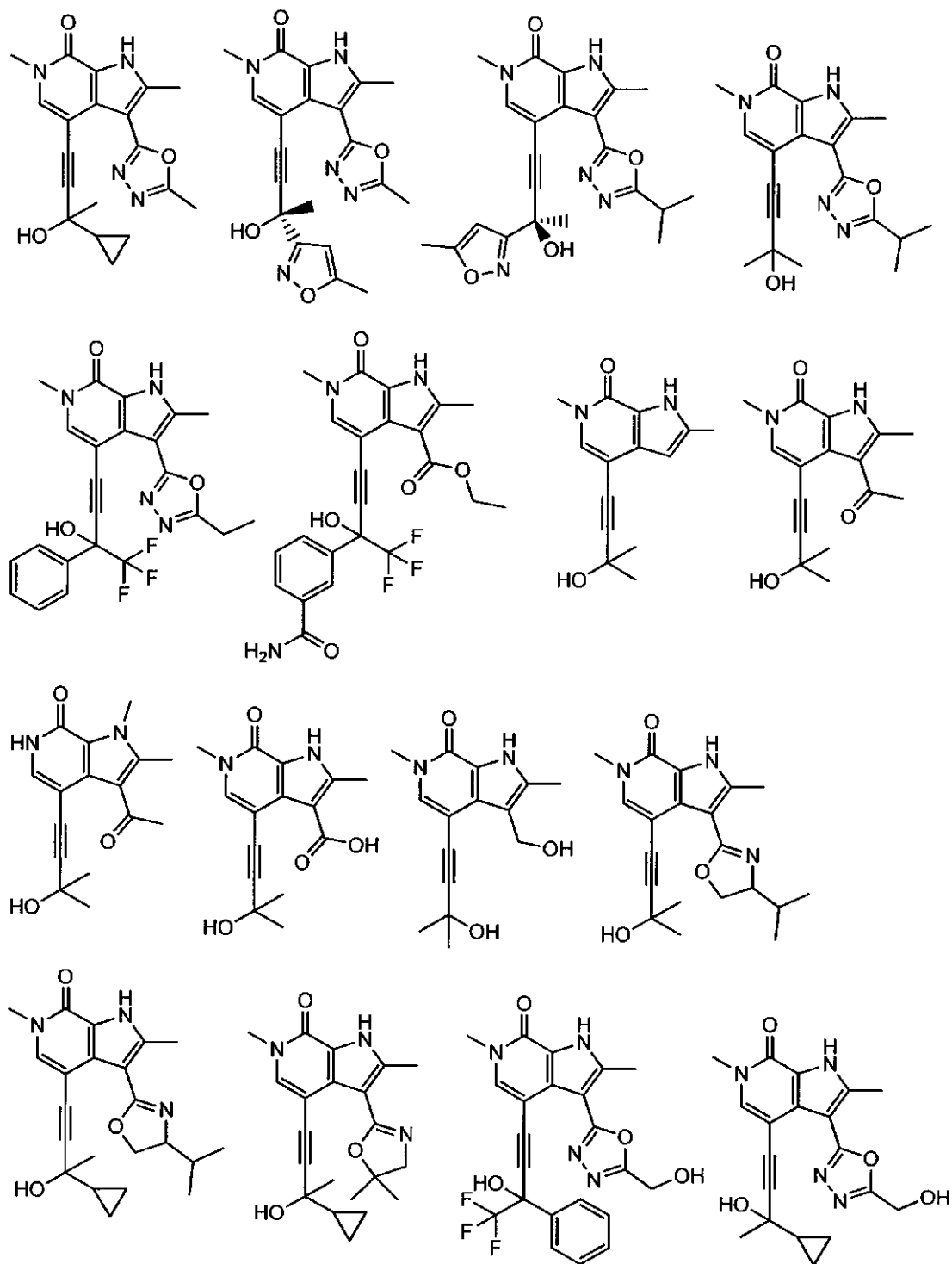
【化 2 0 6】



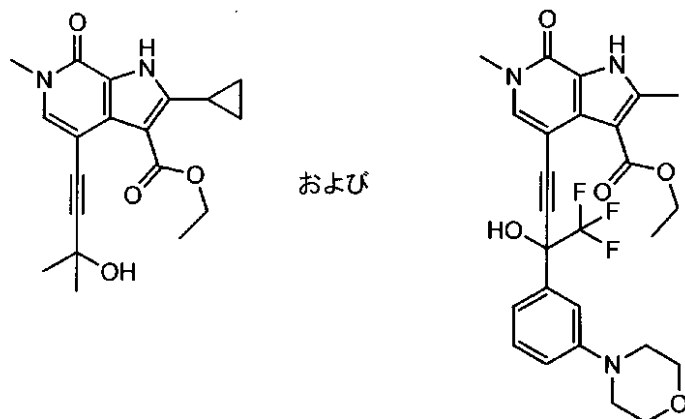
【化 2 0 7】



【化 2 0 8】



【化 2 0 9】



からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 38】

請求項 1 ～ 37 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容され得る塩および薬学的に許容され得るアジュバント、担体、またはビヒクルを含む組成物。

【請求項 39】

さらなる治療剤をさらに含む、請求項 38 に記載の組成物。

【請求項 40】

前記さらなる治療剤が化学療法剤である、請求項 39 に記載の組成物。

【請求項 41】

動物における T A F 1 媒介障害を処置するための、請求項 1 ～ 37 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその塩を含む、組成物。

【請求項 42】

前記障害が癌である、請求項 41 に記載の組成物。

【請求項 43】

前記癌が、聴神経腫、急性白血病、急性リンパ球性白血病、急性骨髄球性白血病、急性 T 細胞白血病、基底細胞癌腫、胆管癌腫、膀胱癌、脳癌、乳癌、気管支原性癌腫、子宮頸癌、軟骨肉腫、脊索腫、絨毛癌腫、慢性白血病、慢性リンパ球性白血病、慢性骨髄球性白血病、慢性骨髄性白血病、結腸癌、結腸直腸癌、頭蓋咽頭腫、嚢胞腺癌腫、びまん性大細胞型 B 細胞リンパ腫、増殖異常性変化、胎児性癌腫、子宮内膜癌、内皮肉腫、上衣腫、上皮癌腫、赤白血病、食道癌、エストロゲン - 受容体陽性乳癌、本態性血小板血症、ユーイング腫瘍、線維肉腫、濾胞性リンパ腫、生殖細胞精巣癌、神経膠腫、膠芽腫、神経膠肉腫、重鎖病、頭頸部癌、血管芽細胞腫、ヘパトーム、肝細胞癌、ホルモン非感受性前立腺癌、平滑筋肉腫、白血病、脂肪肉腫、肺癌、リンパ管内皮肉腫、リンパ管肉腫、リンパ芽球性白血病、リンパ腫、T 細胞または B 細胞起源のリンパ系悪性疾患、髄様癌腫、髄芽腫、黒色腫、髄膜腫、中皮腫、多発性骨髄腫、骨髄性白血病、骨髄腫、粘液肉腫、神経芽細胞腫、N U T ミッドラインカルシノーマ (N M C)、非小細胞肺癌、乏突起膠腫、口腔癌、骨原性肉腫、卵巣癌、膵臓癌、乳頭腺癌腫、乳頭状癌腫、松果体腫、真性赤血球増加症、前立腺癌、直腸癌、腎細胞癌腫、網膜芽細胞腫、横紋筋肉腫、肉腫、脂腺癌腫、セミノーマ、皮膚癌、小細胞性肺癌腫、固形腫瘍 (癌腫および肉腫)、小細胞肺癌、胃癌、扁平上皮癌腫、滑膜腫、汗腺癌腫、甲状腺癌、ワルデンシュトレームマクログロブリン血症、精巣腫瘍、子宮癌、およびウィルムス腫瘍から選択される、請求項 42 に記載の組成物。

【請求項 44】

前記障害が癌であり、前記癌が肺癌、乳癌、膵臓癌、結腸直腸癌、および黒色腫から選択される、請求項 42 に記載の組成物。

【請求項 45】

医薬療法における使用のための、請求項 1 ~ 37 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその塩を含む組成物。

【請求項 46】

T A F 1 媒介障害の予防的処置または治療的処置のための、請求項 1 ~ 37 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその塩を含む組成物。

【請求項 47】

動物における T A F 1 媒介障害を処置するための医薬を調製するための、請求項 1 ~ 37 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその塩の使用。

【請求項 48】

T A F 1 の阻害を必要とする動物において T A F 1 を阻害するための、請求項 1 ~ 37 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその塩を含む、組成物。

【請求項 49】

T A F 1 を阻害するための、請求項 1 ~ 37 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその塩を含む組成物。

【請求項 50】

T A F 1 の阻害を必要とする動物において T A F 1 を阻害するための医薬を調製するための、請求項 1 ~ 37 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその塩の使用。

【請求項 51】

動物における癌を処置するための、T A F 1 のインヒビターを含む、組成物。

【請求項 52】

前記癌が、聴神経腫、急性白血病、急性リンパ球性白血病、急性骨髄球性白血病、急性 T 細胞白血病、基底細胞癌腫、胆管癌腫、膀胱癌、脳癌、乳癌、気管支原性癌腫、子宮頸癌、軟骨肉腫、脊索腫、絨毛癌腫、慢性白血病、慢性リンパ球性白血病、慢性骨髄球性白血病、慢性骨髄性白血病、結腸癌、結腸直腸癌、頭蓋咽頭腫、嚢胞腺癌腫、びまん性大細胞型 B 細胞リンパ腫、増殖異常性変化、胎児性癌腫、子宮内膜癌、内皮肉腫、上衣腫、上皮癌腫、赤白血病、食道癌、エストロゲン - 受容体陽性乳癌、本態性血小板血症、ユーイング腫瘍、線維肉腫、濾胞性リンパ腫、生殖細胞精巢癌、神経膠腫、膠芽腫、神経膠肉腫、重鎖病、頭頸部癌、血管芽細胞腫、ヘパトーム、肝細胞癌、ホルモン非感受性前立腺癌、平滑筋肉腫、白血病、脂肪肉腫、肺癌、リンパ管内皮肉腫、リンパ管肉腫、リンパ芽球性白血病、リンパ腫、T 細胞または B 細胞起源のリンパ系悪性疾患、髄様癌腫、髄芽腫、黒色腫、髄膜腫、中皮腫、多発性骨髄腫、骨髄性白血病、骨髄腫、粘液肉腫、神経芽細胞腫、N U T ミッドラインカルシノーマ (N M C)、非小細胞肺癌、乏突起膠腫、口腔癌、骨原性肉腫、卵巣癌、膵臓癌、乳頭腺癌腫、乳頭状癌腫、松果体腫、真性赤血球増加症、前立腺癌、直腸癌、腎細胞癌腫、網膜芽細胞腫、横紋筋肉腫、肉腫、脂腺癌腫、セミノーマ、皮膚癌、小細胞性肺癌腫、固形腫瘍 (癌腫および肉腫)、小細胞肺癌、胃癌、扁平上皮癌腫、滑膜腫、汗腺癌腫、甲状腺癌、ワルデンシュトレームマクログロブリン血症、精巣腫瘍、子宮癌、およびウィルムス腫瘍から選択される、請求項 51 に記載の組成物。

【請求項 53】

前記 T A F 1 のインヒビターが T A F 1 に特異的に結合して T A F 1 プロモドメインの活性を阻害する、請求項 51 ~ 52 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 54】

医薬療法における使用のための、T A F 1 のインヒビターを含む組成物。

【請求項 55】

癌の予防的処置または治療的処置のための、T A F 1 のインヒビターを含む組成物。

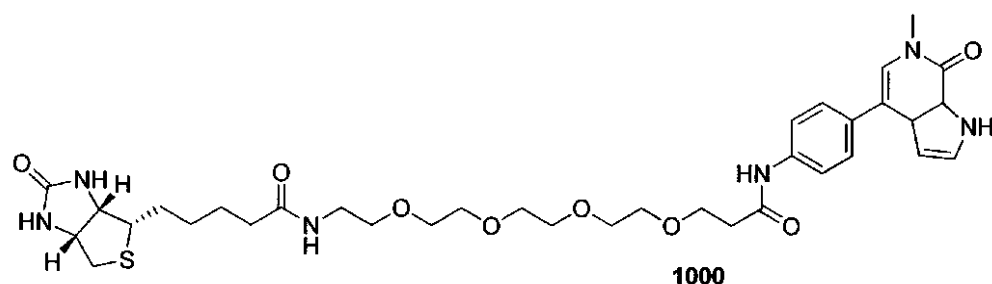
【請求項 56】

動物における癌を処置するための医薬を調製するための、T A F 1 のインヒビターの使用。

【請求項 57】

化合物：

【化 2 1 0】



またはその塩。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 3 1 4

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 3 1 4】

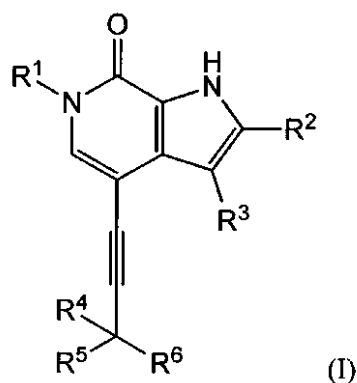
多数の実施形態を記載しているが、これらの実施例を、本明細書中に記載の化合物および方法を利用する他の実施形態を得るために変更することができる。したがって、本発明の範囲を、例で示した特定の実施形態ではなく添付の特許請求の範囲によって定義すべきである。

本発明の実施形態の例として、以下の項目が挙げられる。

(項目 1)

式 (I) :

【化 1 7 6】



(式中、

R^1 は、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、カルボシクリル、またはヘテロシクリルであり、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、ハロ、シアノ、 C_{1-3} アルコキシ、および C_{3-8} カルボシクリル (前記 C_{3-8} カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R^2 は、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、カルボシクリル

ル、またはヘテロシクリルであり、前記 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル（前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R^3 は、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $-N(R^b)_2$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)O$ R^a 、または 5 ～ 6 員ヘテロアリール環であり、前記 $C_1 \sim 6$ アルキルおよび 5 ～ 6 員ヘテロアリール環は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され、任意の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、 R^f 、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-O-R^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R^a は、水素、 $C_1 \sim 10$ アルキル、 $C_2 \sim 10$ アルケニル、 $C_2 \sim 10$ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から選択され、任意の $C_1 \sim 10$ アルキル、 $C_2 \sim 10$ アルケニル、 $C_2 \sim 10$ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、 R^d 、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-O-R^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

各々の R^b は、水素、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、 R^c 、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^c)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^c)_2$ 、 $-S(O)-N(R^c)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^c)_2$ 、 $-O-R^c$ 、 $-S-R^c$ 、 $-O-C(O)-R^c$ 、 $-C(O)-R^c$ 、 $-C(O)-OR^c$ 、 $-S(O)-R^c$ 、 $-S(O)_2-R^c$ 、 $-N(R^c)-C(O)-R^c$ 、 $-N(R^c)-S(O)-R^c$ 、 $-N(R^c)-C(O)-N(R^c)_2$ 、および $-N(R^c)-S(O)_2-R^c$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2 つの R^b が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、および $C_1 \sim 3$ アルキル（前記 $C_1 \sim 3$ アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

各々の R^c は、水素、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、および $C_1 \sim 6$ アルキル（前記 $C_1 \sim 6$ アルキルは、オキソ

およびハ口からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され; または、2 つの R^c が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハ口、および C_{1-3} アルキル (前記 C_{1-3} アルキルは、オキソおよびハ口からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し;

各々の R^d は、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、 R^e 、オキソ、ハ口、 $-NO_2$ 、 $-N(R^e)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^e)_2$ 、 $-S(O)-N(R^e)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^e)_2$ 、 $-O-R^e$ 、 $-S-R^e$ 、 $-O-C(O)-R^e$ 、 $-C(O)-R^e$ 、 $-C(O)-OR^c$ 、 $-S(O)-R^c$ 、 $-S(O)_2-R^c$ 、 $-N(R^c)-C(O)-R^c$ 、 $-N(R^c)-S(O)-R^c$ 、 $-N(R^c)-C(O)-N(R^c)_2$ 、および $-N(R^e)-S(O)_2-R^e$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され、

各々の R^e は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハ口、アミノ、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルコキシ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、および C_{1-6} アルキル (前記 C_{1-6} アルキルは、オキソおよびハ口からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され; または、2 つの R^e が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハ口、および C_{1-3} アルキル (前記 C_{1-3} アルキルは、オキソおよびハ口からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し;

各々の R^f は、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハ口、アミノ、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルコキシ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、および C_{1-6} アルキル (前記 C_{1-6} アルキルは、オキソおよびハ口からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され;

R^4 は存在しないか、H、ヒドロキシ、または C_{1-6} アルキル (前記 C_{1-6} アルキルは、ハ口からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) であり;

R^5 は、H またはハ口からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-6} アルキルであり; R^6 は、 C_{1-6} アルキル、カルボシクリル、またはヘテロシクリルであり、前記 C_{1-6} アルキル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、1 つまたは複数の R^8 で任意選択的に置換され; または、 R^5 および R^6 が、それらが結合する炭素とともに、カルボシクリルまたはヘテロシクリルを形成し、前記カルボシクリルおよびヘテロシクリルは、1 つまたは複数の R^8 で任意選択的に置換され;

各々の R^8 は、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリル、 R^k 、ハ口、オキソ (=O)、 $-NO_2$ 、 $-N(R^h)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^h)_2$ 、 $-S(O)-N(R^h)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^h)_2$ 、 $-O-R^h$ 、 $-S-R^h$ 、 $-O-C(O)-R^h$ 、 $-C(O)-R^h$ 、

- C (O) - O R ^h、 - S (O) - R ^h、 - S (O) ₂ - R ^h、 - N (R ^h) - C (O) - R ^h、 - N (R ^h) - S (O) - R ^h、 - N (R ^h) - C (O) - N (R ^h) ₂、および - N (R ^h) - S (O) ₂ - R ^h からなる群から独立して選択され；

各々の R ^h は、水素、C ₁ ~ C ₆ アルキル、C ₂ ~ C ₆ アルケニル、C ₂ ~ C ₆ アルキニル、C ₁ ~ C ₆ アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々の C ₁ ~ C ₆ アルキル、C ₂ ~ C ₆ アルケニル、C ₂ ~ C ₆ アルキニル、C ₁ ~ C ₆ アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、C ₁ ~ C ₆ アルコキシ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、および C ₁ ~ C ₆ アルキル（前記 C ₁ ~ C ₆ アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2 つの R ^h が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、および C ₁ ~ C ₃ アルキル（前記 C ₁ ~ C ₃ アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

各々の R ^k は、C ₁ ~ C ₆ アルキル、C ₂ ~ C ₆ アルケニル、C ₂ ~ C ₆ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、前記 C ₁ ~ C ₆ アルキル、C ₂ ~ C ₆ アルケニル、C ₂ ~ C ₆ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、ハロ、- NO ₂、- N (R ^h) ₂、- CN、- C (O) - N (R ^h) ₂、- S (O) - N (R ^h) ₂、- S (O) ₂ - N (R ^h) ₂、- O - R ^h、- S - R ^h、- O - C (O) - R ^h、- C (O) - R ^h、- C (O) - O R ^h、- S (O) - R ^h、- S (O) ₂ - R ^h、- N (R ^h) - C (O) - R ^h、- N (R ^h) - S (O) - R ^h、- N (R ^h) - C (O) - N (R ^h) ₂、および - N (R ^h) - S (O) ₂ - R ^h からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で置換される）の化合物またはその塩。

（項目 2）

R ¹ は、ハロ、シアノ、C ₁ ~ C ₃ アルコキシ、および C ₃ ~ C ₈ カルボシクリル（前記 C ₃ ~ C ₈ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C ₁ ~ C ₆ アルキルである、項目 1 に記載の化合物。

（項目 3）

R ¹ はメチルである、項目 1 に記載の化合物。

（項目 4）

R ² は、ハロ、シアノ、C ₁ ~ C ₃ アルコキシ、および C ₃ ~ C ₈ カルボシクリル（前記 C ₃ ~ C ₈ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C ₁ ~ C ₆ アルキルである、項目 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

（項目 5）

R ² はメチルである、項目 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

（項目 6）

R ³ は H である、項目 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

（項目 7）

R ³ は、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、- NO ₂、- N (R ^b) ₂、- CN、- C (O) - N (R ^b) ₂、- S (O) - N (R ^b) ₂、- S (O) ₂ - N (R ^b) ₂、- O - R ^b、- S - R ^b、- O - C (O) - R ^b、- C (O) - R ^b、- C (O) - O R ^b、- S (O) - R ^b、- S (O) ₂ - R ^b、- N (R ^b) - C (O) - R ^b、- N (R ^b) - S (O) - R ^b、- N (R ^b) - C (O) - N (R ^b) ₂、および - N (R ^b) - S (O) ₂ - R ^b からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C ₁ ~ C ₆ アルキルであり、任意のカルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R ^f、オキソ、ハロ、- NO ₂、- N (R ^b) ₂、- CN、- C (O) - N (R ^b) ₂、- S (O) - N (R ^b) ₂、- S (O) ₂ - N (R ^b) ₂、- O - R ^b、- S -

R^b 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-O-R^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目1～5のいずれか1項に記載の化合物。

(項目8)

R^3 は $-N(R^b)_2$ である、項目1～5のいずれか1項に記載の化合物。

(項目9)

R^3 は $-C(=O)R^a$ である、項目1～5のいずれか1項に記載の化合物。

(項目10)

R^3 は $-C(=O)OR^a$ である、項目1～5のいずれか1項に記載の化合物。

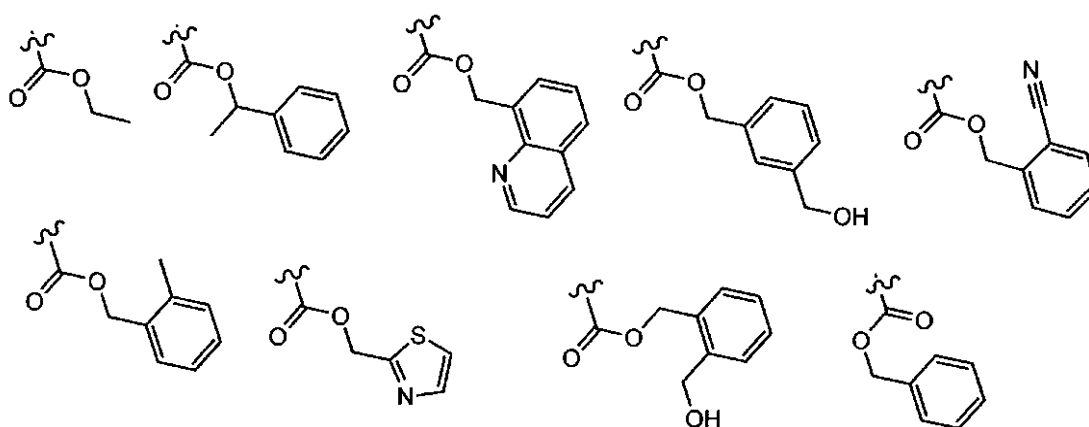
(項目11)

R^3 は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された5～6員ヘテロアリール環であり、任意の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、 R^f 、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-O-R^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目1～5のいずれか1項に記載の化合物。

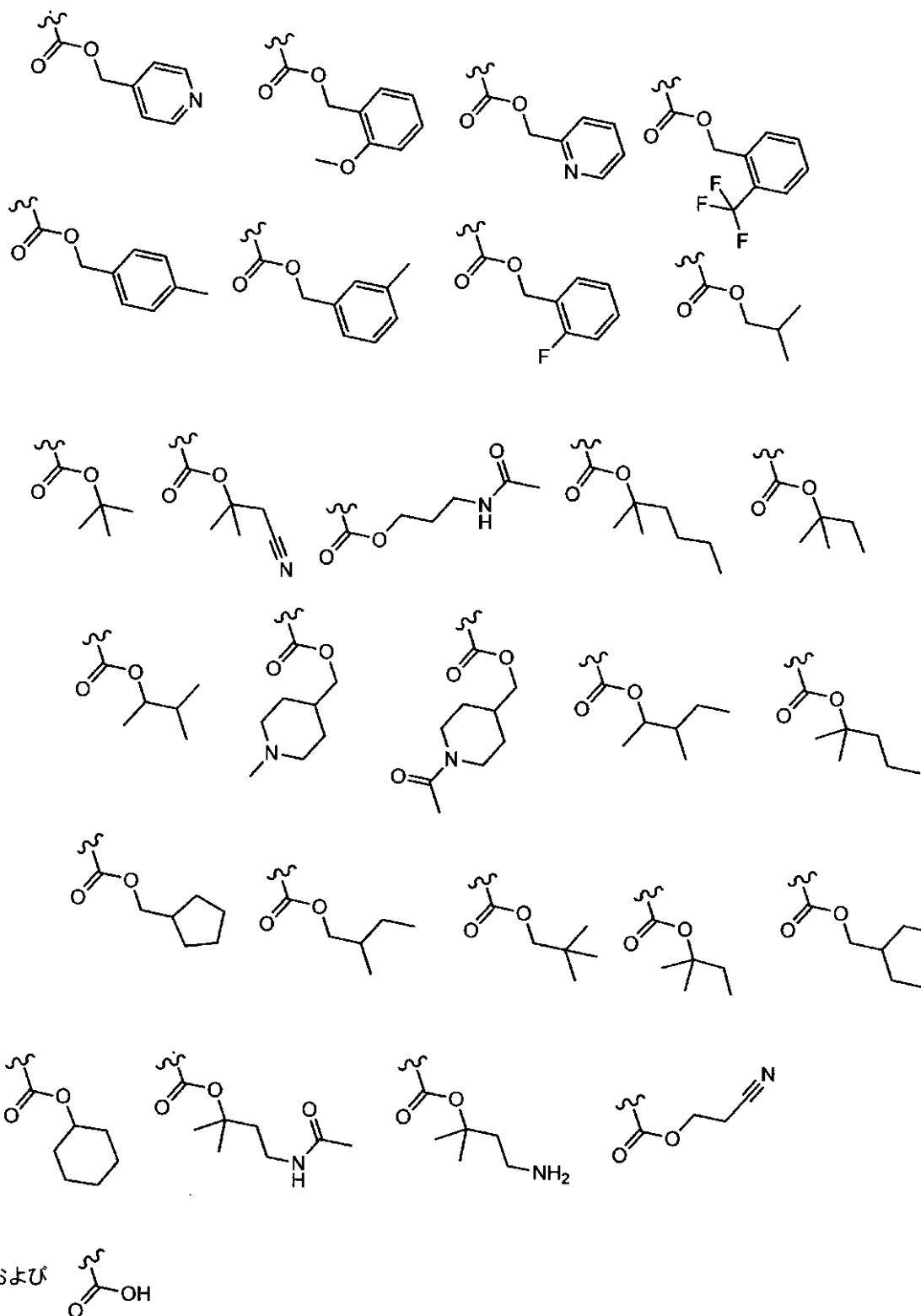
(項目12)

R^3 は、

【化177】



【化 1 7 8】

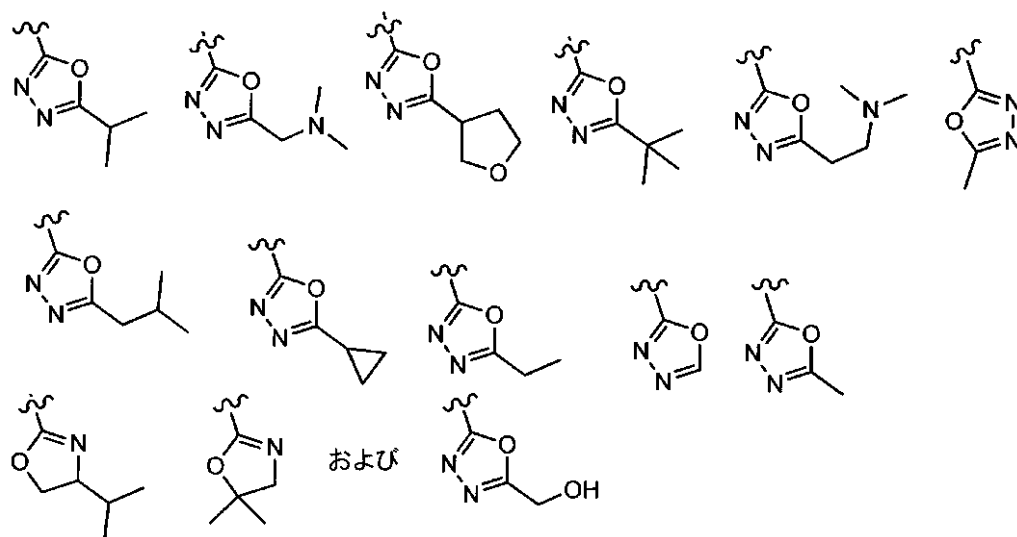


からなる群から選択される、項目 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 3)

R³ は、

【化 1 7 9】

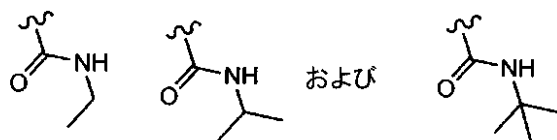


からなる群から選択される、項目 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 4)

R³ は、

【化 1 8 0】

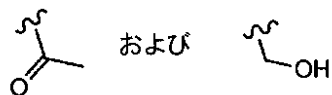


からなる群から選択される、項目 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 5)

R³ は、

【化 1 8 1】

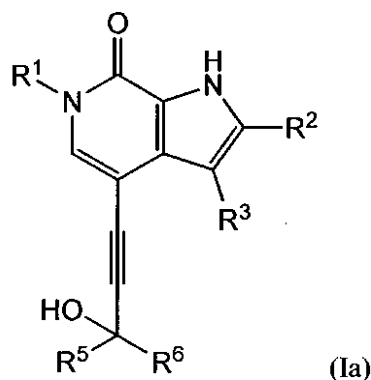


からなる群から選択される、項目 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 6)

式 (I a) :

【化 1 8 2】



の化合物である、項目 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

(項目 1 7)

R^4 は H である、項目 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 8)

R^4 はヒドロキシルである、項目 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 9)

R^4 は、ハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-6} アルキルである、項目 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 0)

R^5 は H である、項目 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 1)

R^5 は、ハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-6} アルキルである、項目 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 2)

R^6 は、1 つまたは複数の R^8 で任意選択的に置換された C_{1-6} アルキルである、項目 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 3)

R^6 は、1 つまたは複数の R^8 で任意選択的に置換されたカルボシクリルである、項目 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 4)

R^6 は、1 つまたは複数の R^8 で任意選択的に置換されたヘテロシクリルである、項目 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 5)

R^6 は、オキソおよび $-N(R^h)_2$ で置換されて $-C(O)-N(R^h)_2$ 基を形成した C_1 アルキルである、項目 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 6)

R^5 および R^6 が、それらが結合する炭素とともに、1 つまたは複数の R^8 で任意選択的に置換されたカルボシクリルを形成する、項目 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 7)

R^5 および R^6 が、それらが結合する炭素とともに、1 つまたは複数の R^8 で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成する、項目 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 8)

R^4 は存在せず； R^5 および R^6 が、それらが結合する炭素とともに、1 つまたは複数の R^8 で任意選択的に置換され、式 (I) の残部と芳香環の原子で連結したアリール環を形成する、項目 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 9)

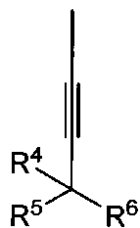
R^4 は存在せず； R^5 および R^6 が、それらが結合する炭素とともに、1 つまたは複数の

R⁸ で任意選択的に置換され、式 (I) の残部と芳香環の原子で連結したヘテロシクリルを形成する、項目 1 ~ 15 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 3 0)

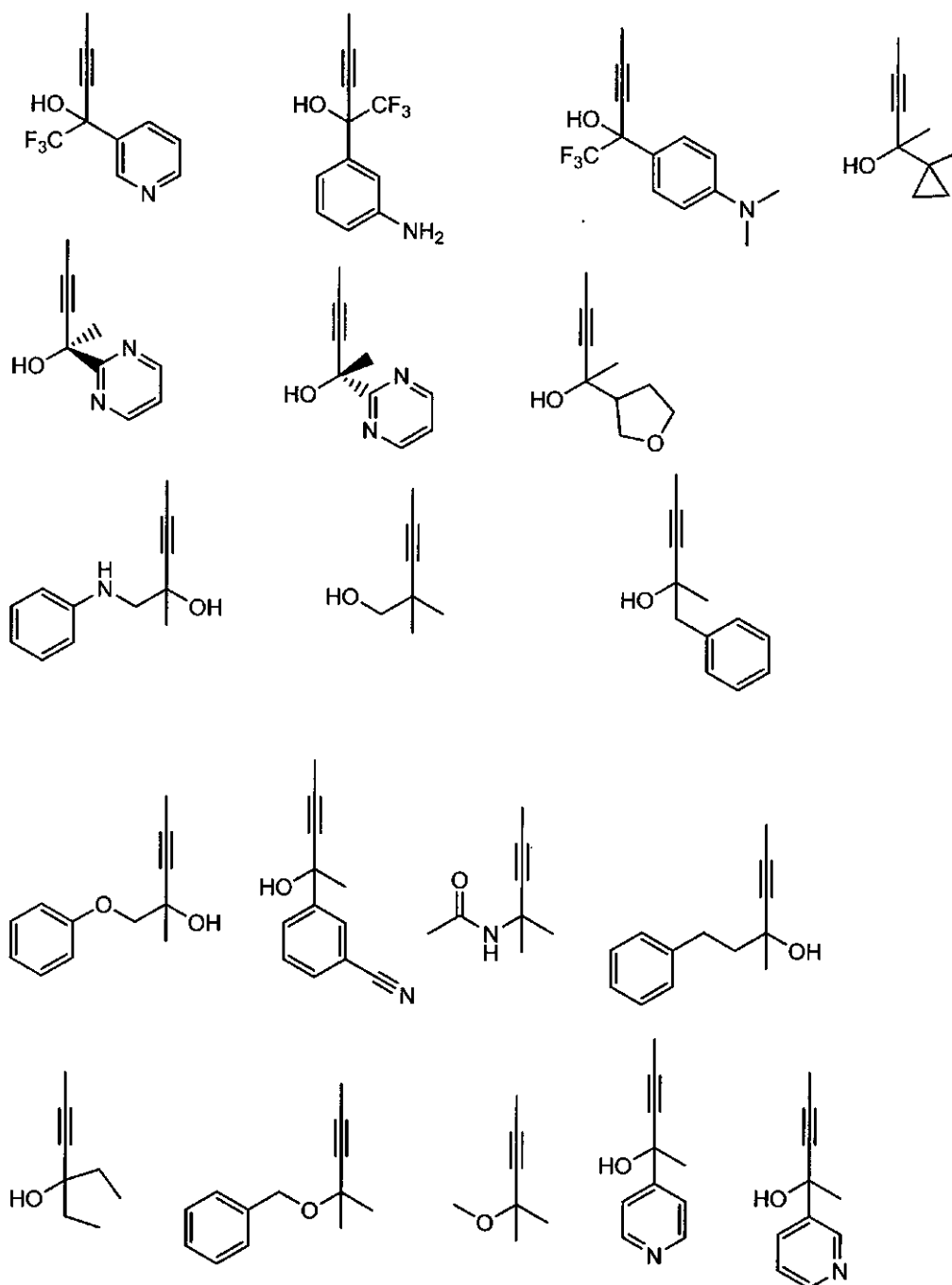
以下の基：

【化 1 8 3】

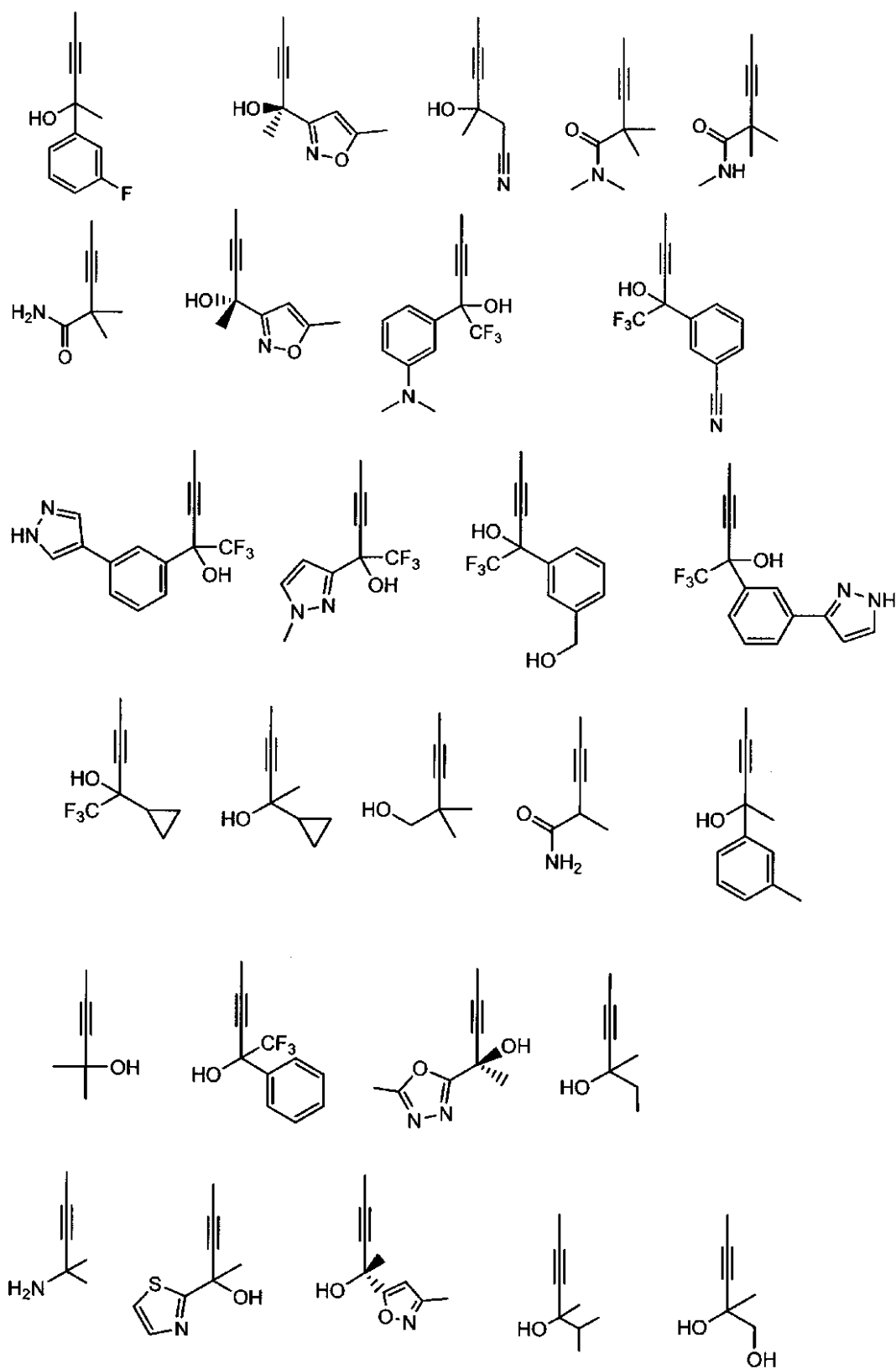


は、

【化 1 8 4】

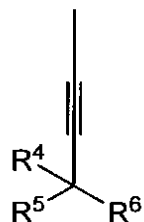


【化 1 8 5】



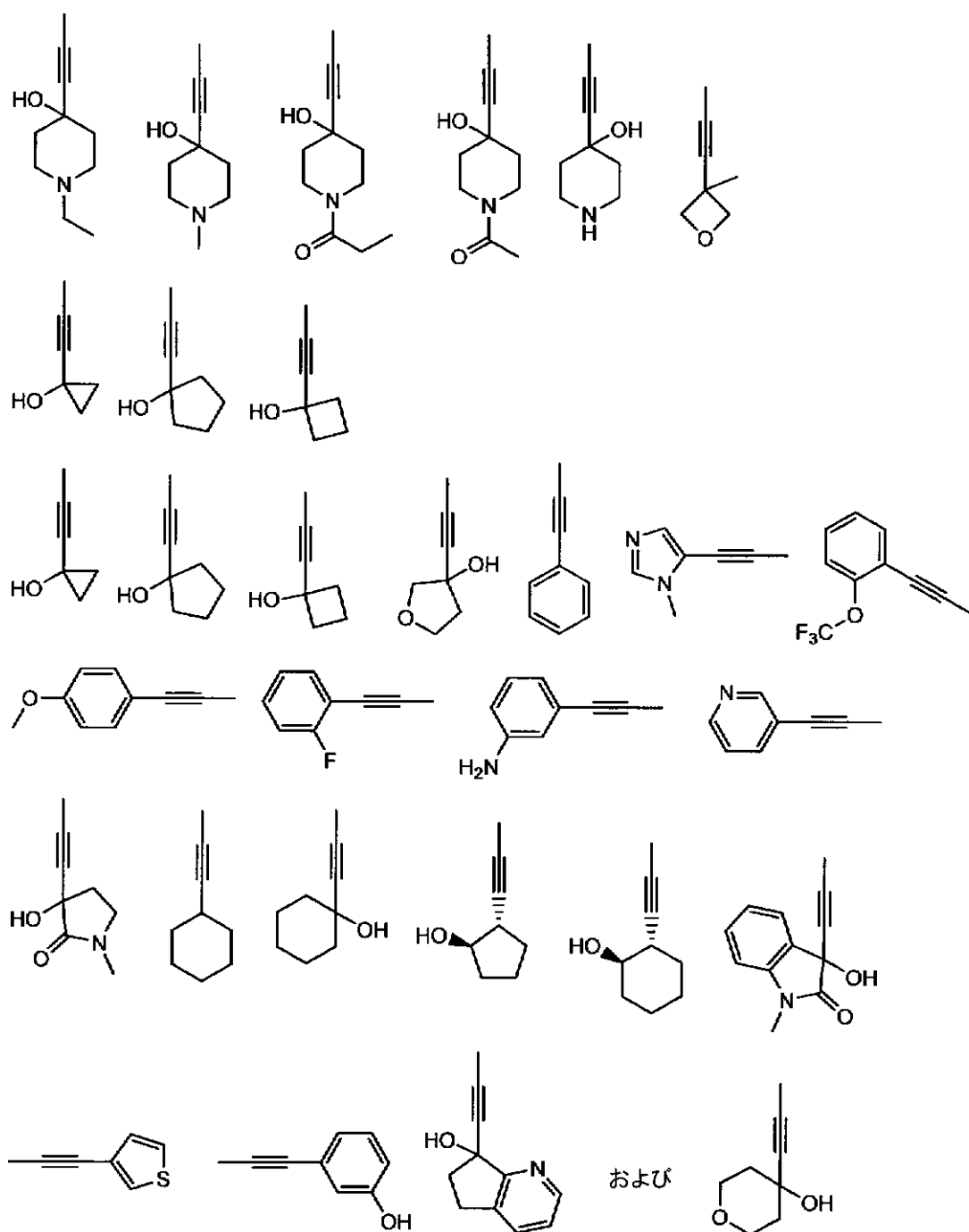
Chemical structures of 13 compounds are shown, including various alcohols, esters, and substituted benzenes, many featuring ethynyl and trifluoromethyl groups.

【化 1 8 7】



は、

【化 1 8 8】



からなる群から選択される、項目 1 に記載の化合物。

(項目 3 2)

R^1 は、ハロ、シアノ、 C_{1-3} アルコキシ、および C_{3-8} カルボシクリル (前記 C_{3-8} カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-6} アルキルであり；

R^2 は、ハロ、シアノ、 C_{1-3} アルコキシ、および C_{3-8} カルボシクリル (前記 C_{3-8} カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-6} アルキルであり；

R^3 は、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり、任意のカルボシクリル、およびヘテロシクリルは、 R^f 、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-O-R^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目 1 に記載の化合物またはその塩。

(項目 33)

R^1 は、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル (前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^2 は、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル (前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^3 は $-N(R^b)_2$ である、項目 1 に記載の化合物またはその塩。

(項目 34)

R^1 は、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル (前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^2 は、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル (前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^3 は $-C(=O)OR^a$ である、項目 1 に記載の化合物またはその塩。

(項目 35)

R^1 は、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル (前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

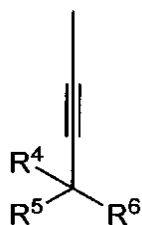
R^2 は、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、および $C_3 \sim 8$ カルボシクリル (前記 $C_3 \sim 8$ カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される) からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^3 は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された 5

~ 6 員ヘテロアリール環であり、任意の $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{2 \sim 6}$ アルケニル、 $C_{2 \sim 6}$ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、 R^f 、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-O-R^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目 1 に記載の化合物またはその塩。
 (項目 3 6)

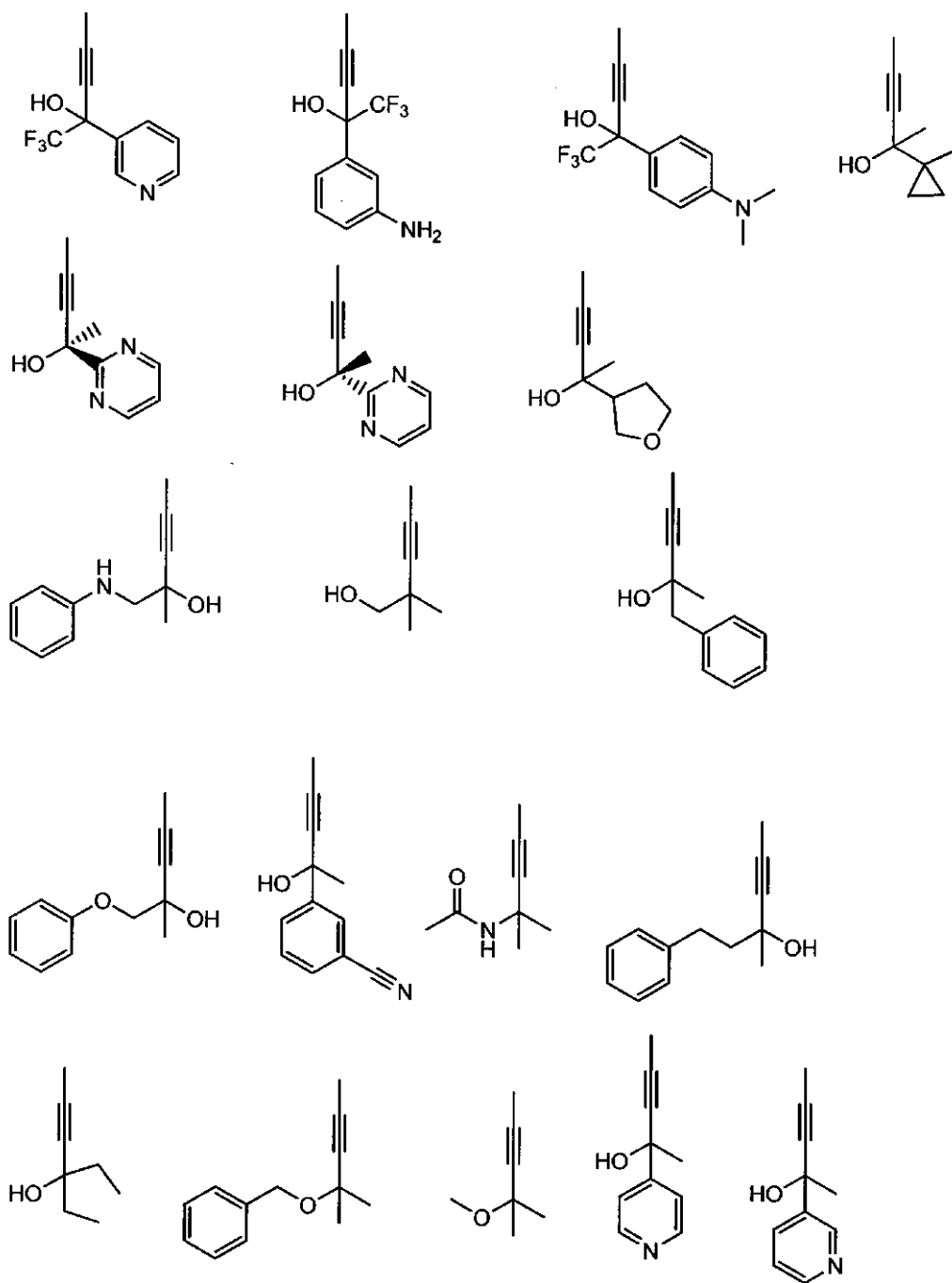
以下の基：

【化 1 8 9】

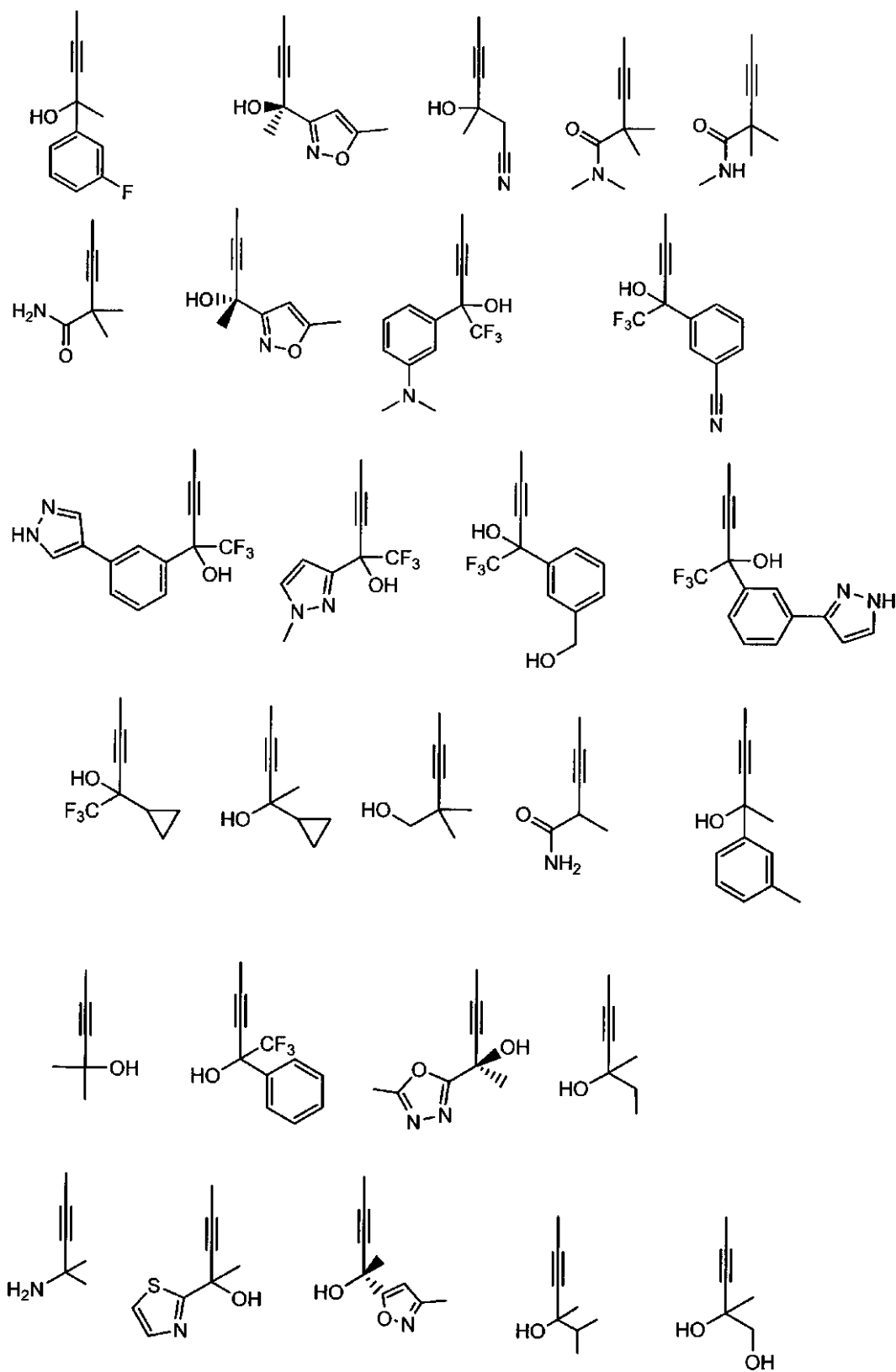


が、

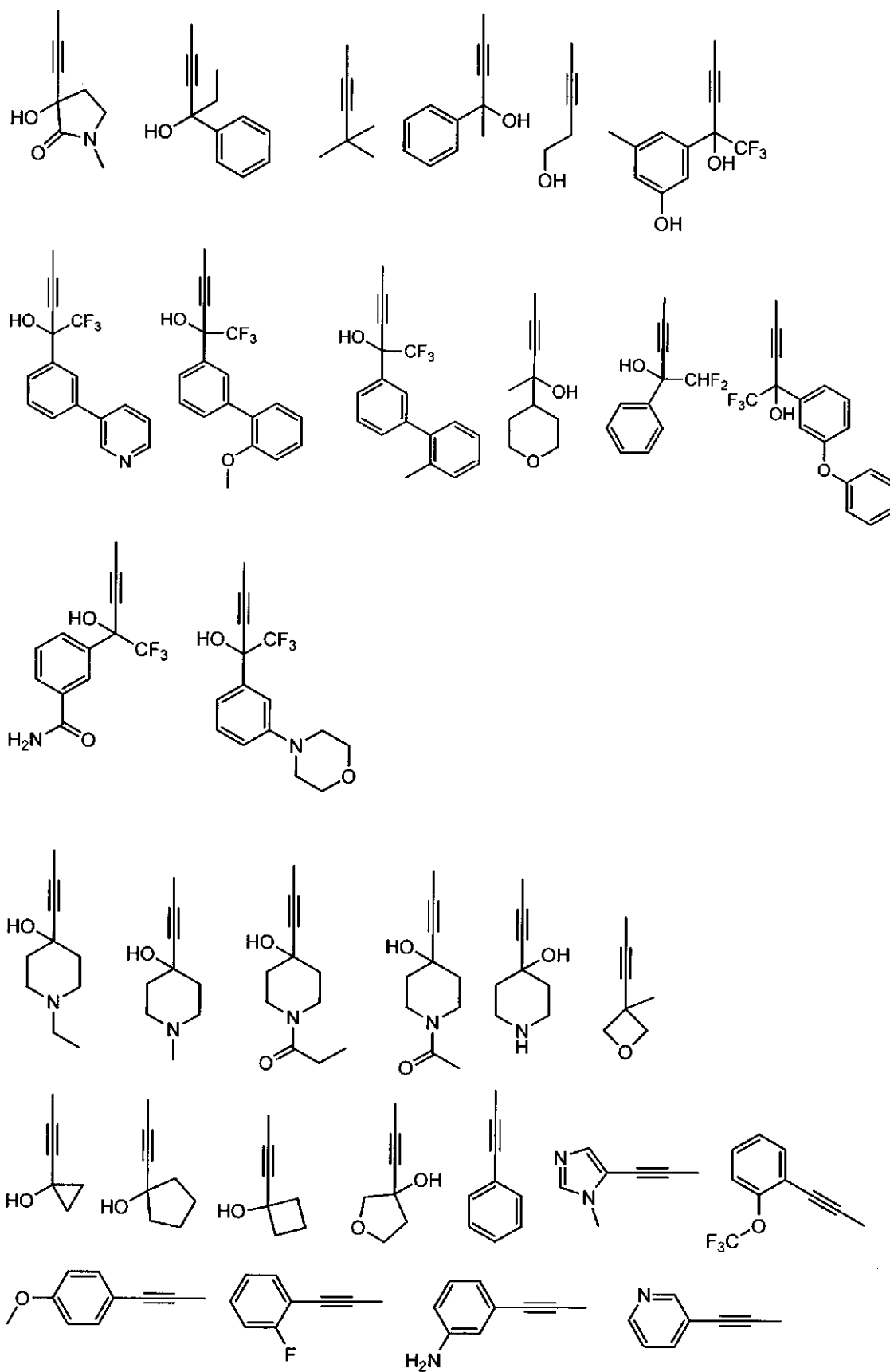
【化 1 9 0】



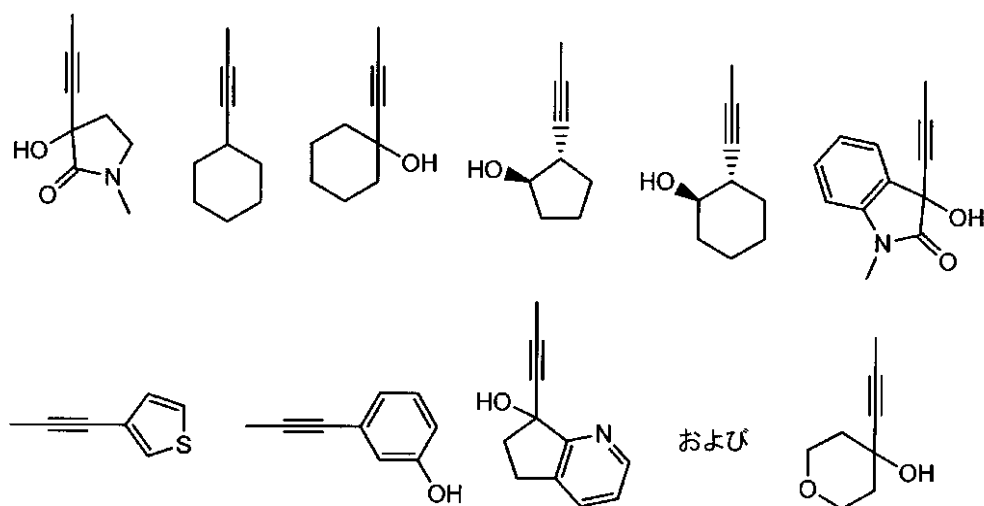
【化 1 9 1】



【化 1 9 2】



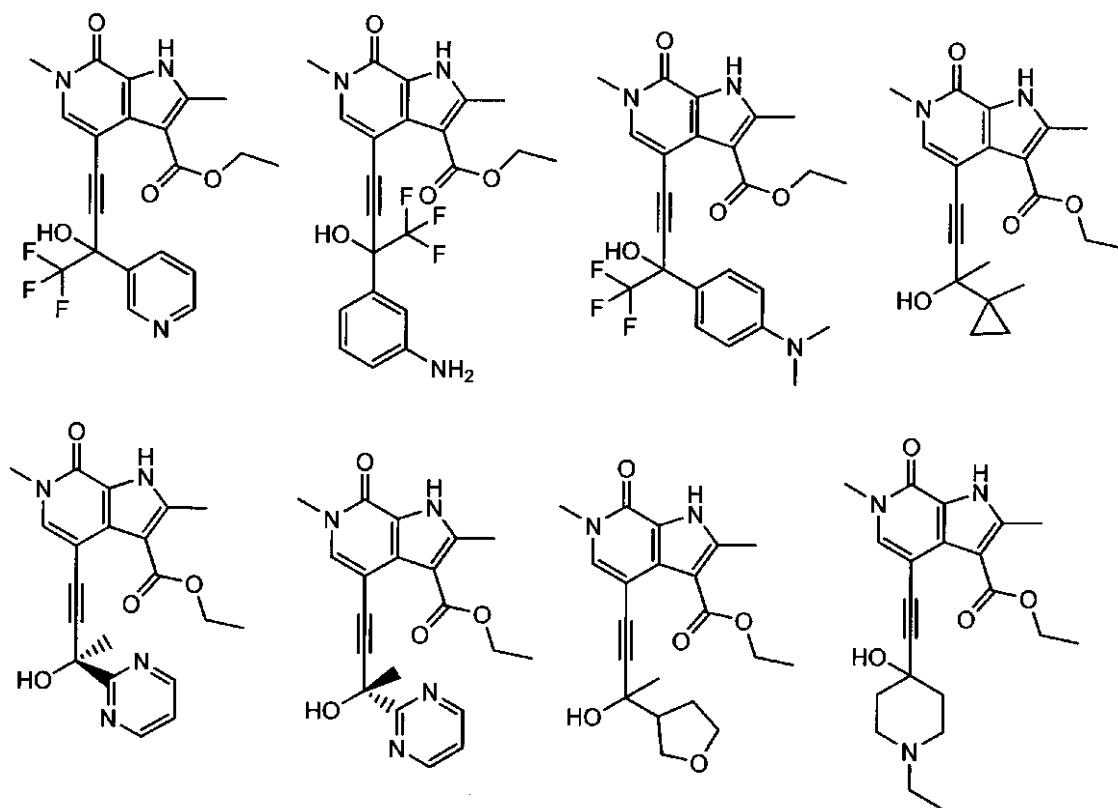
【化 1 9 3】



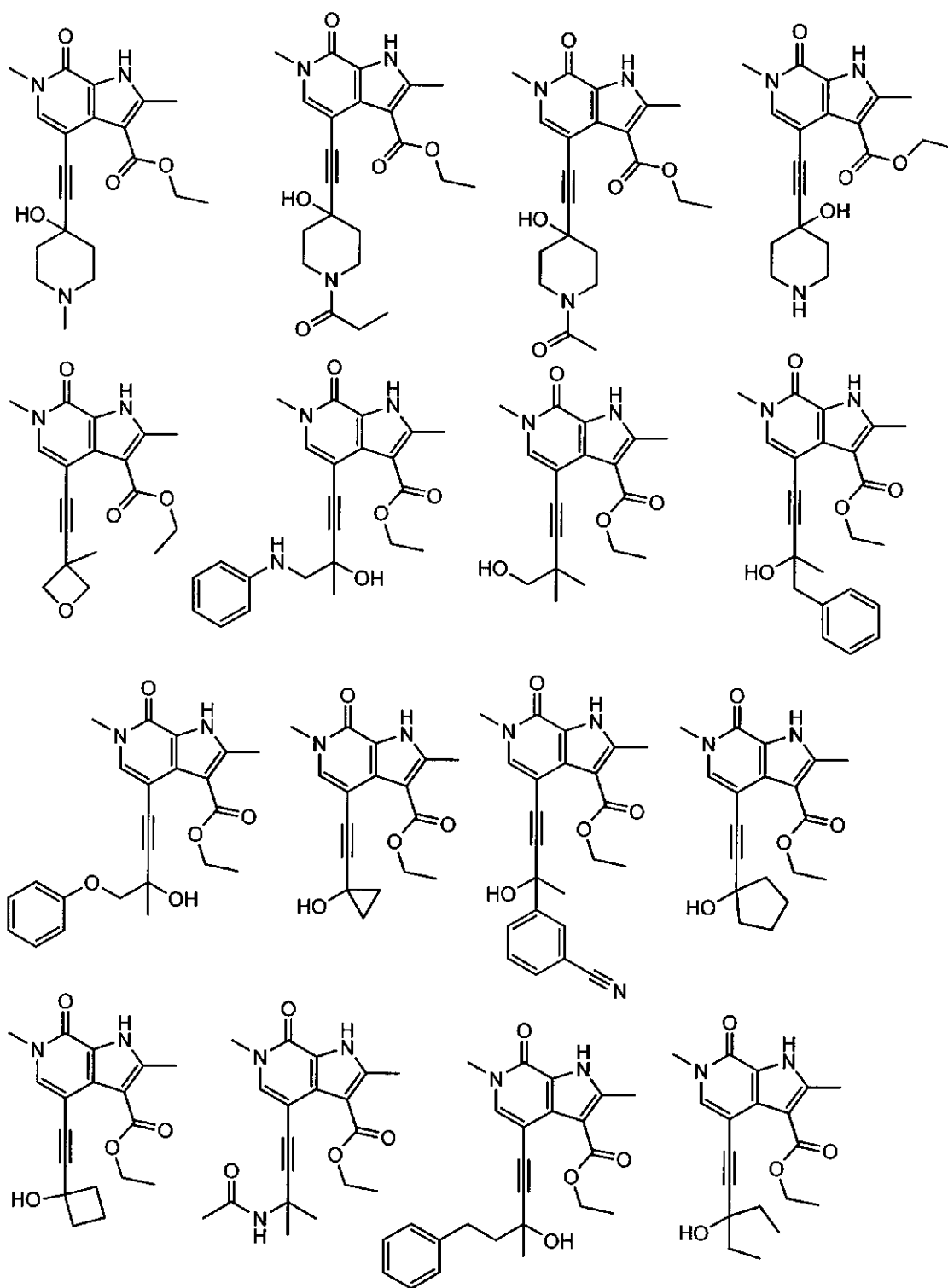
からなる群から選択される、項目 3 2 ~ 3 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 3 7)

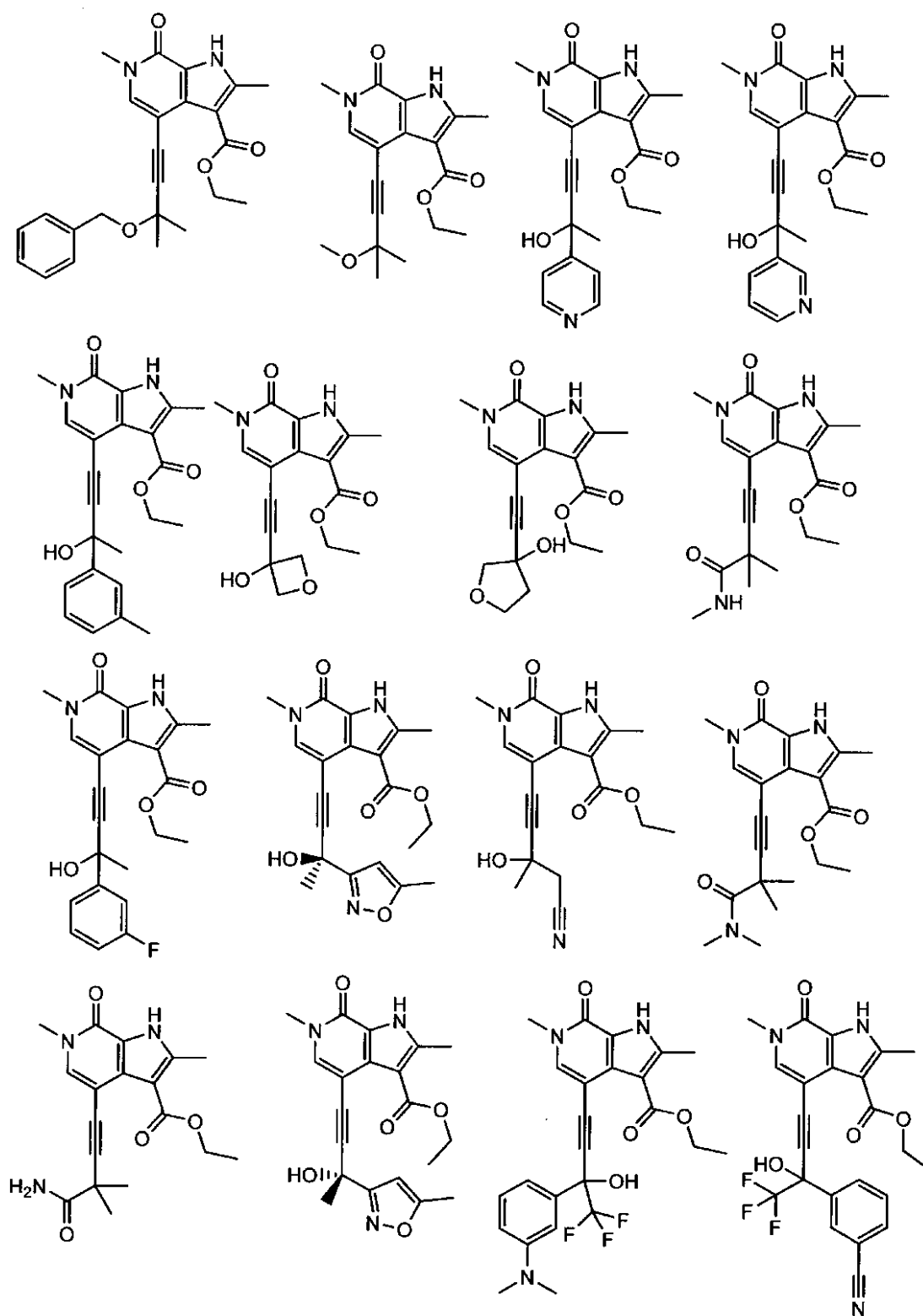
【化 1 9 4】



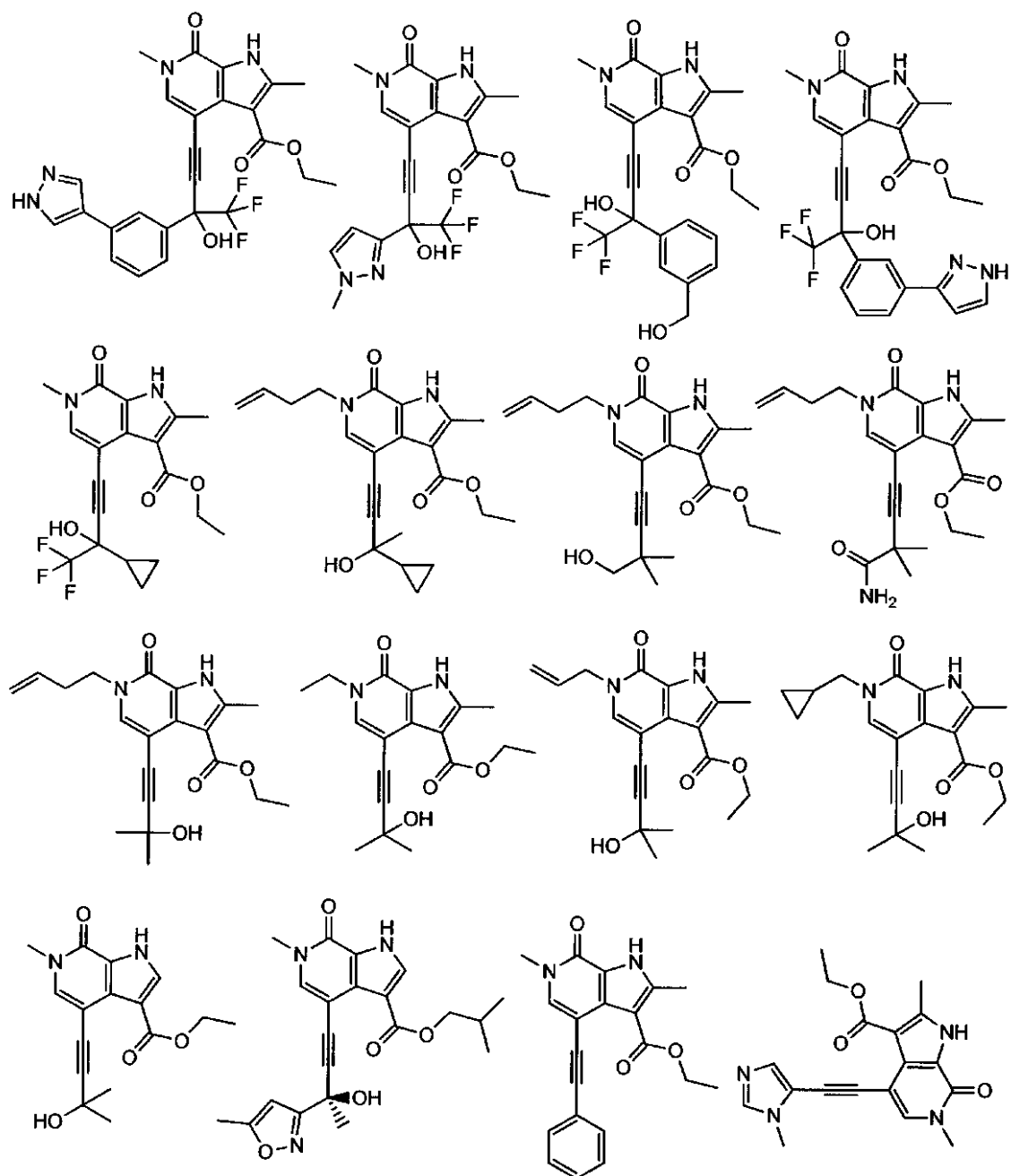
【化 1 9 5】



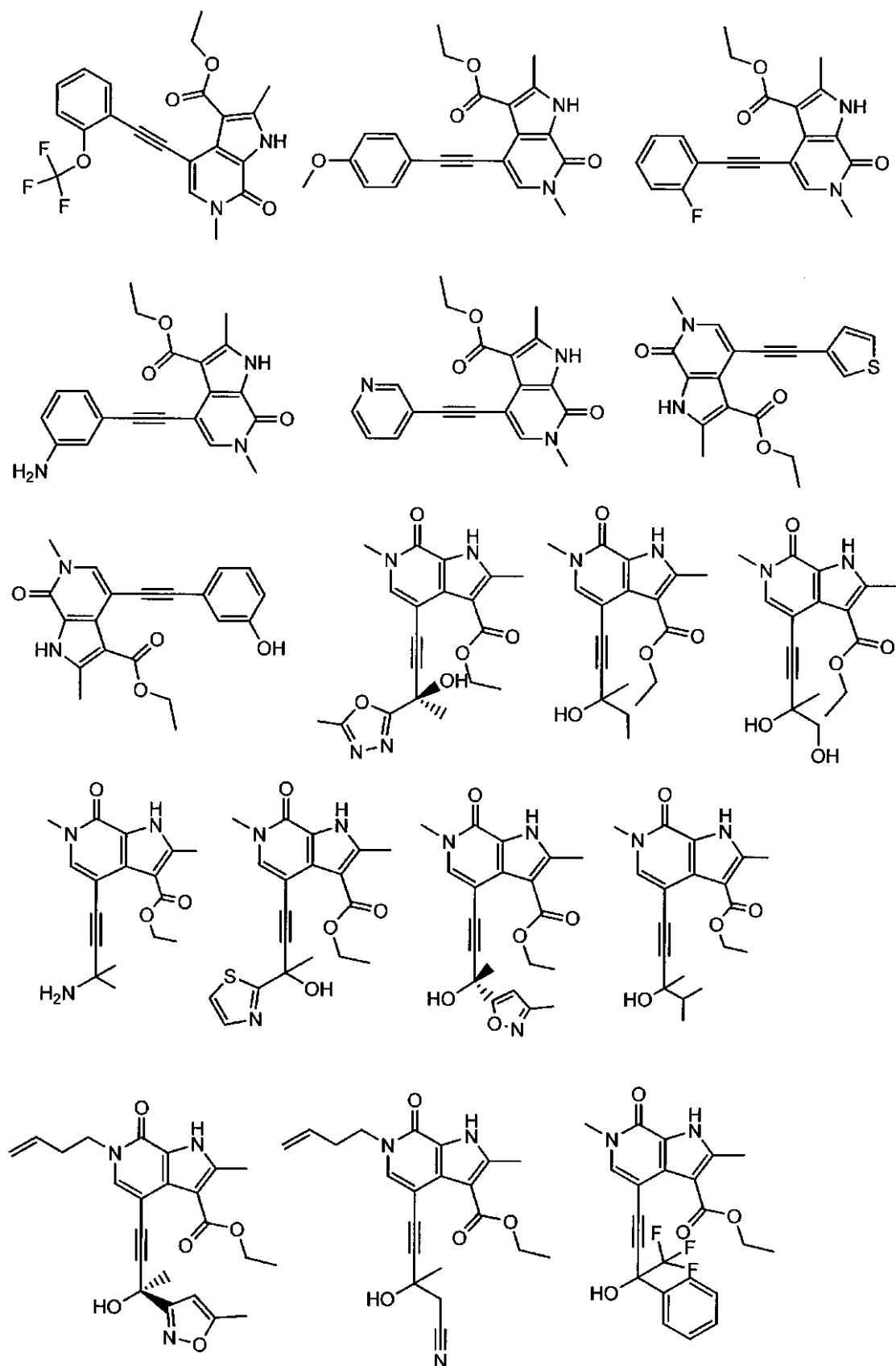
【化 1 9 6】



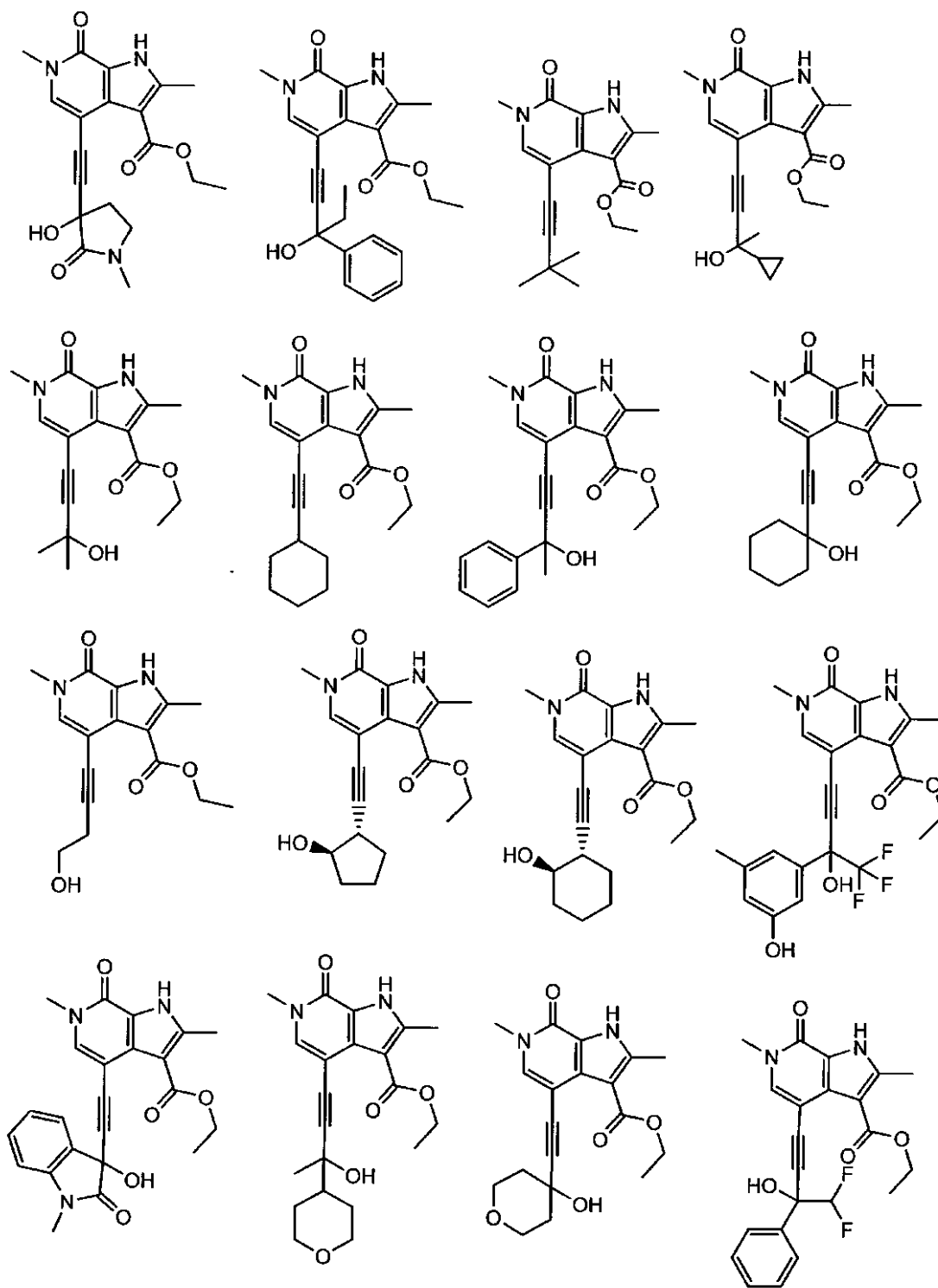
【化 1 9 7】



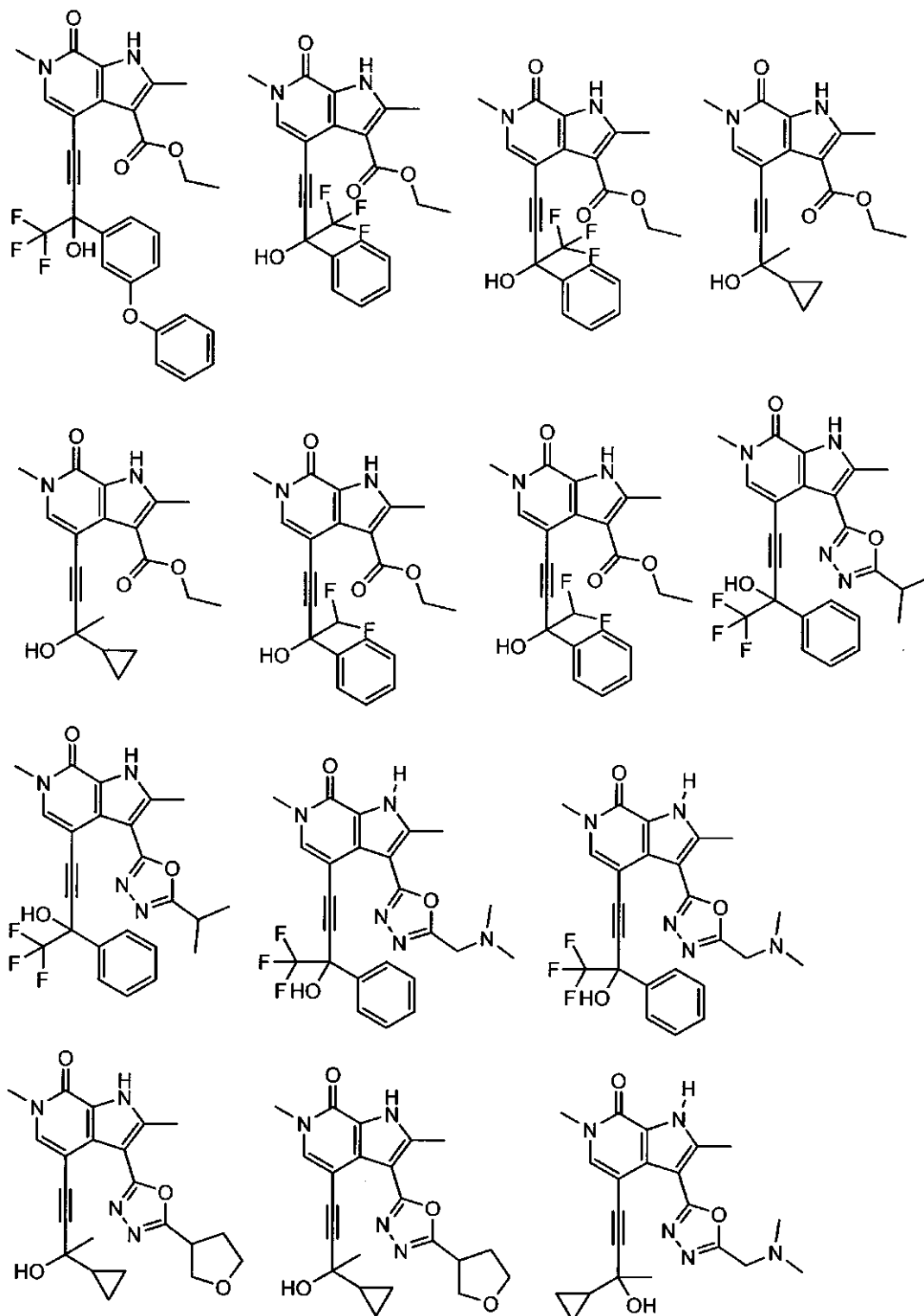
【化 1 9 8】



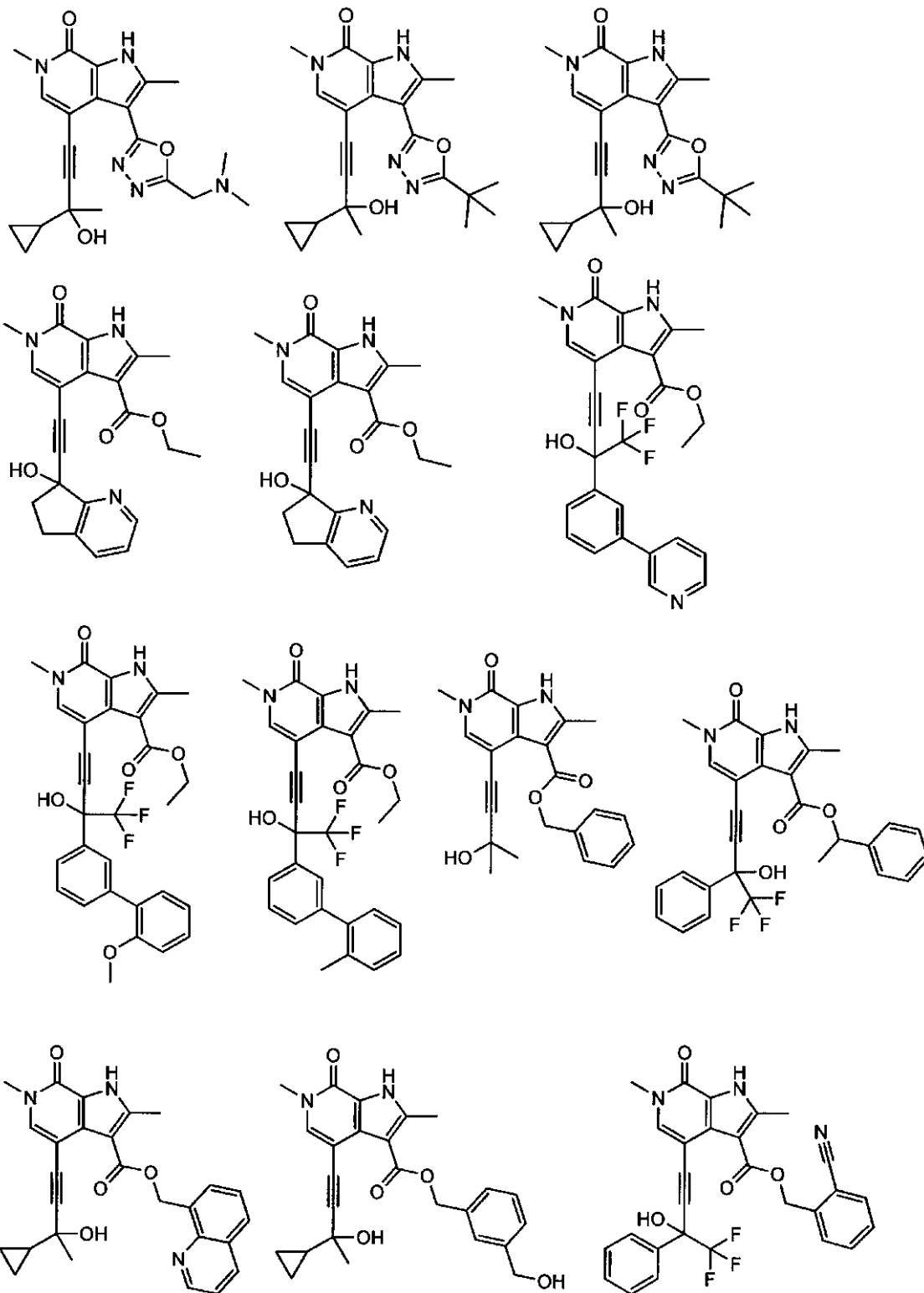
【化 1 9 9】



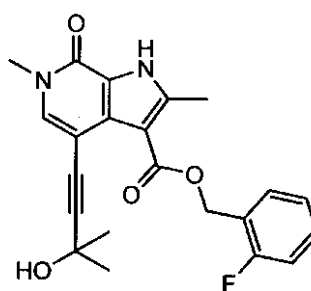
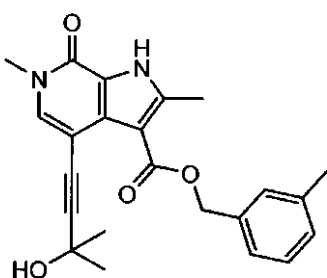
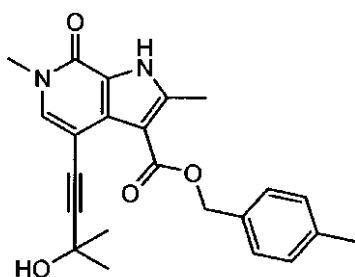
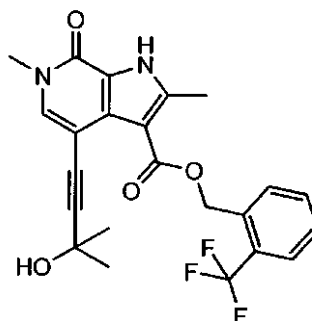
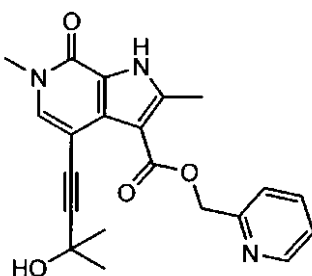
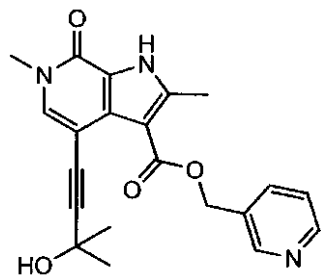
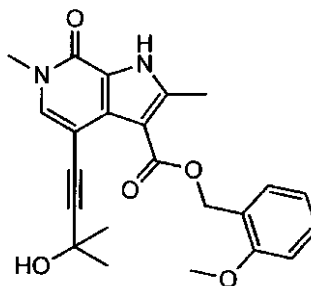
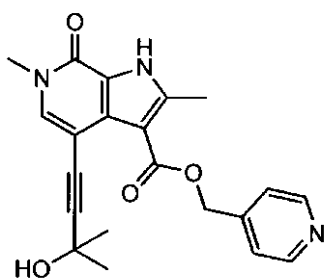
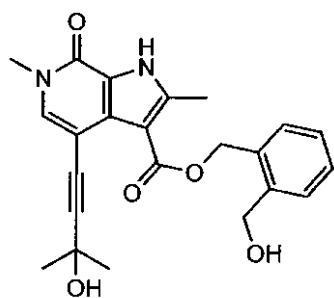
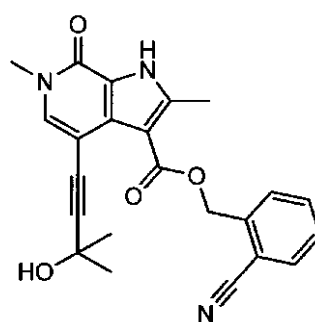
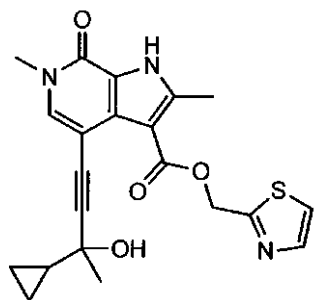
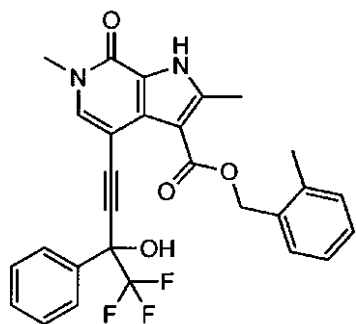
【化 2 0 0】



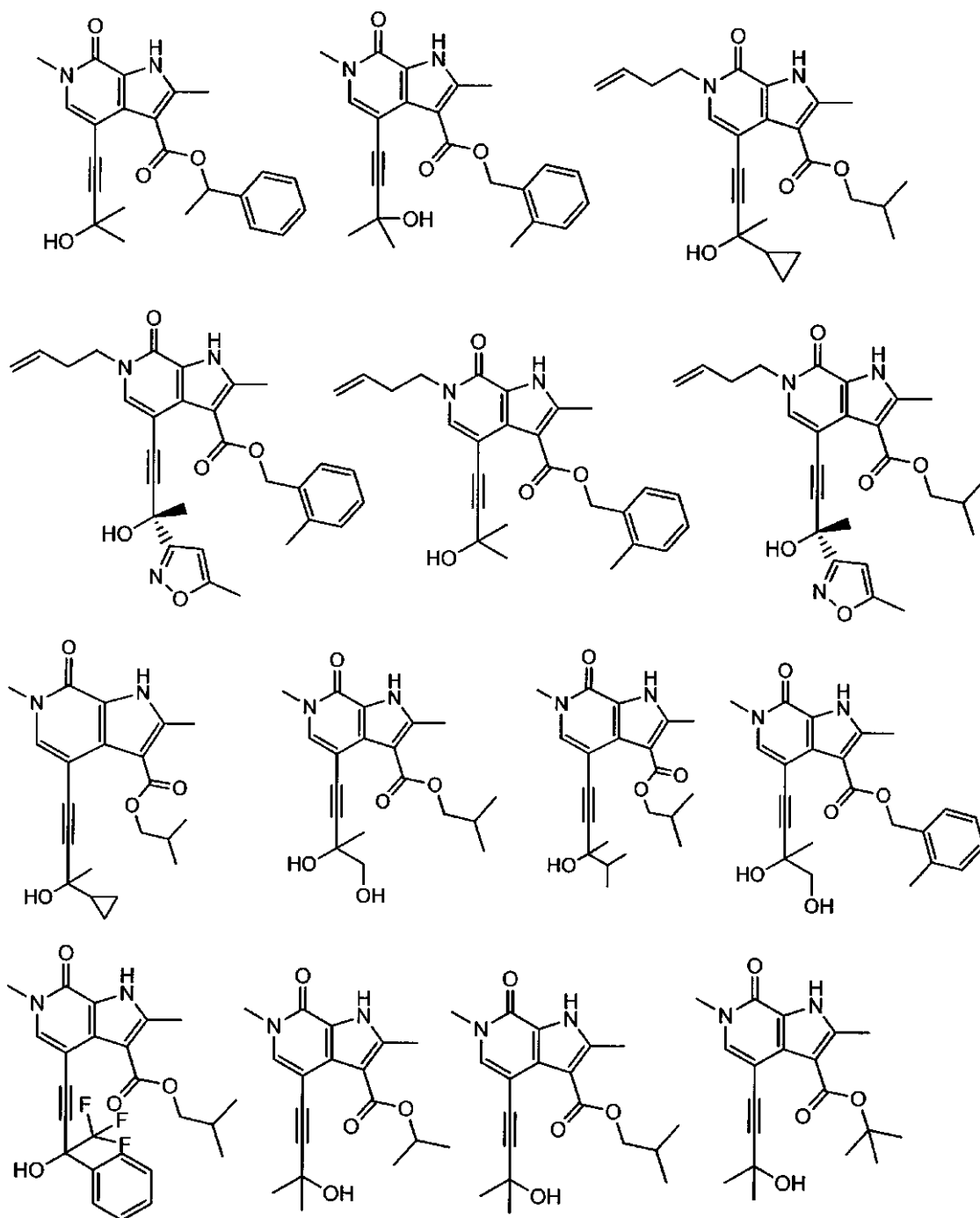
【化 201】



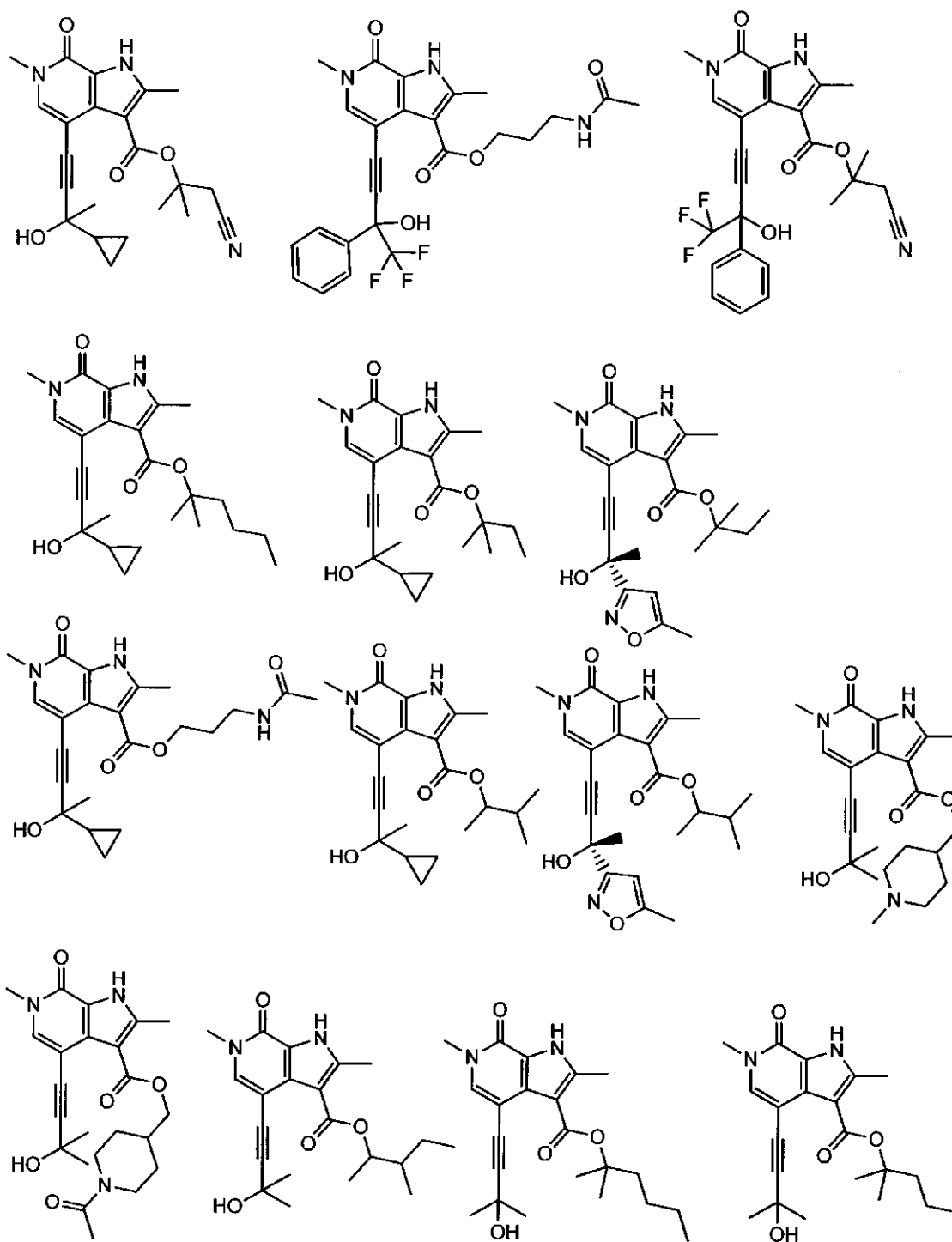
【化 2 0 2】



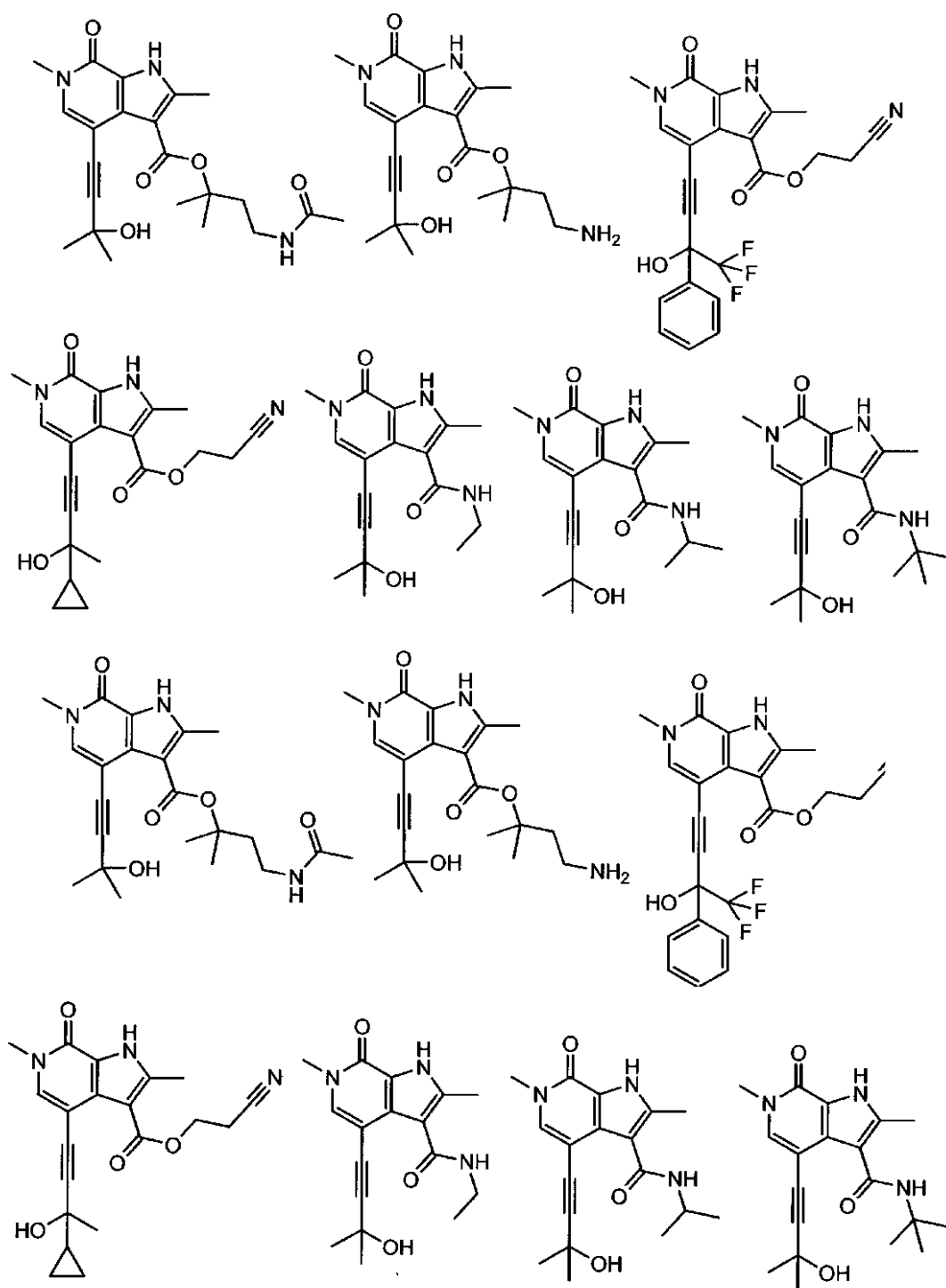
【化 2 0 3】



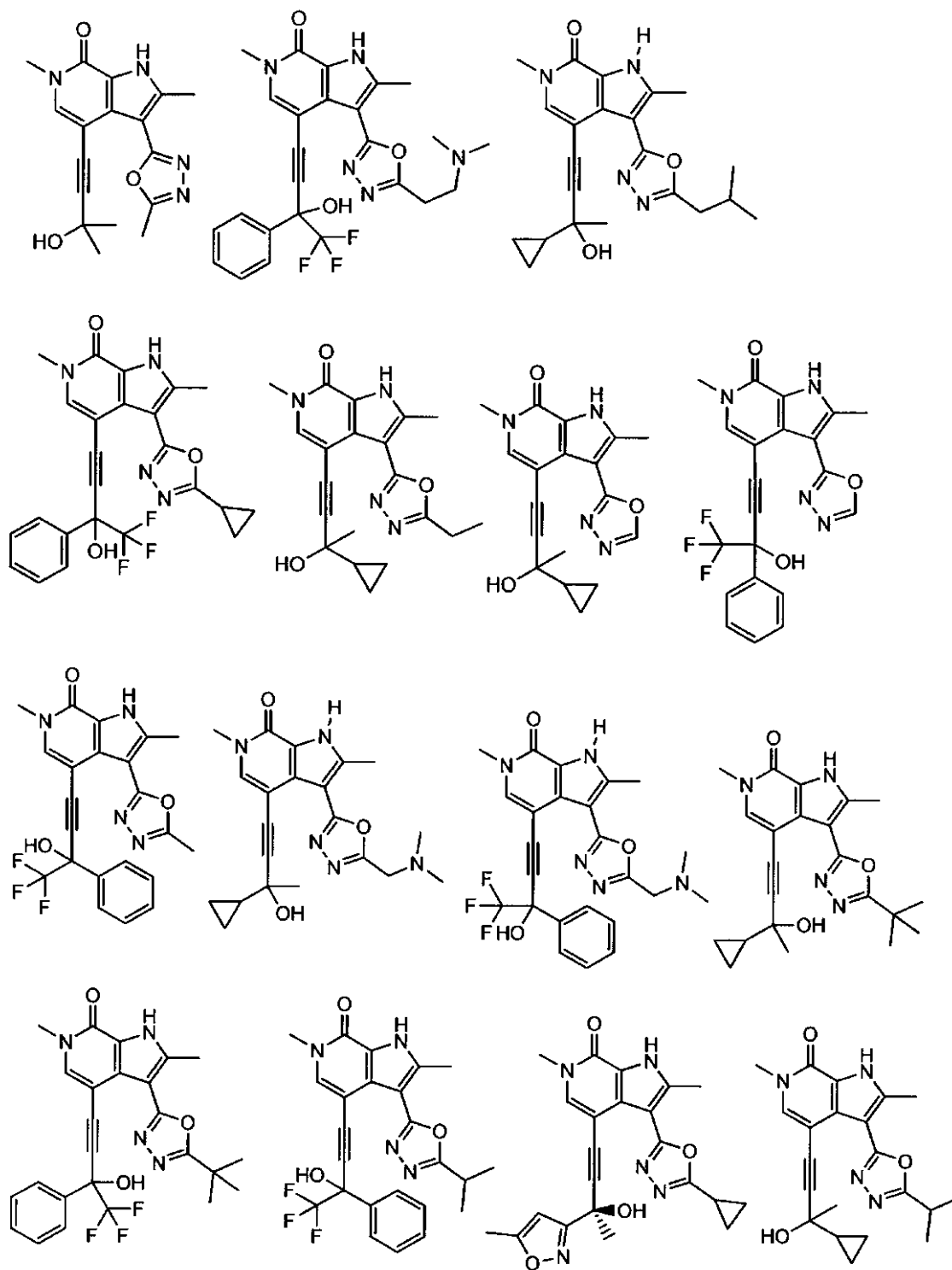
【化 2 0 4】



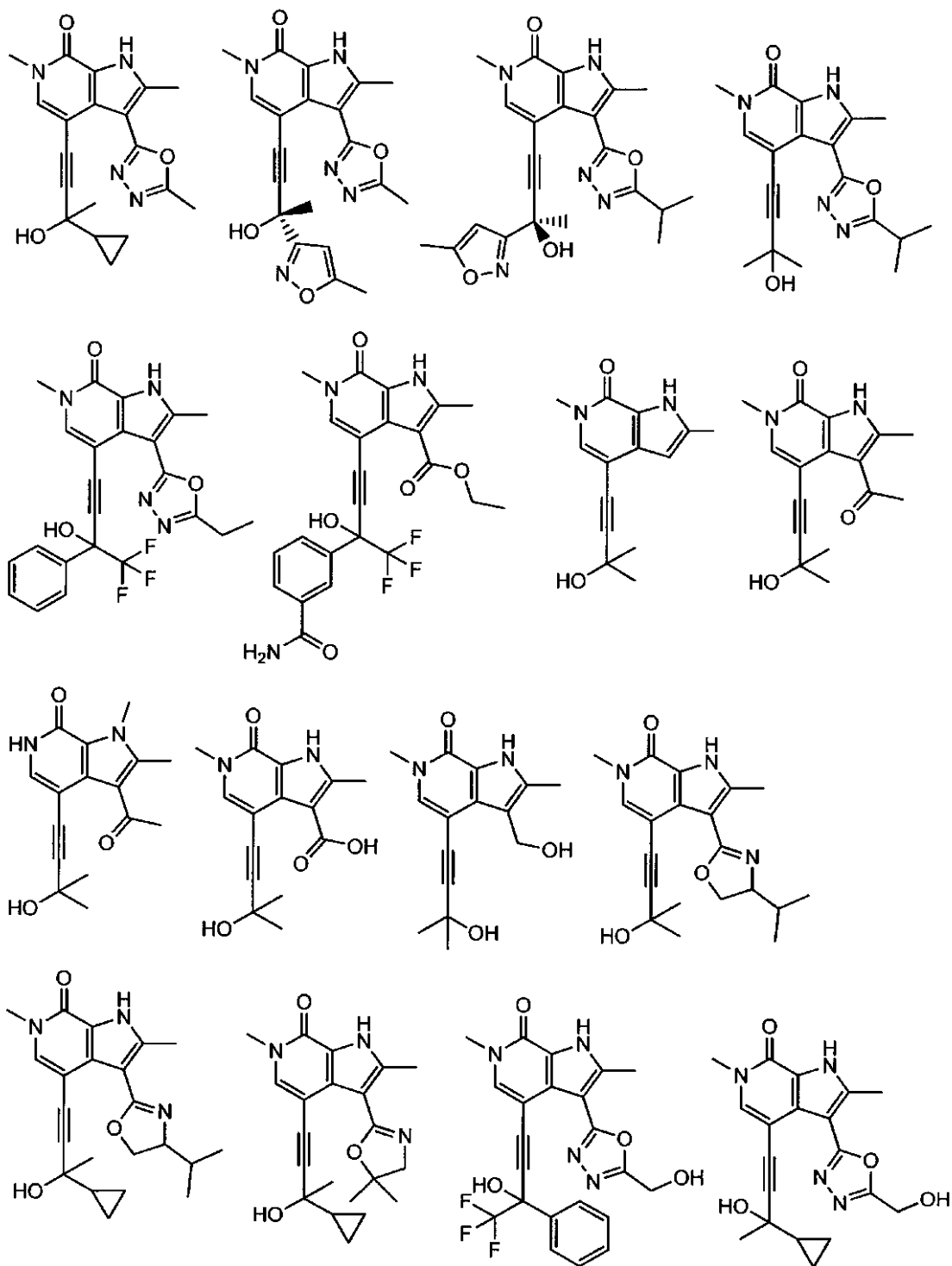
【化 2 0 6】



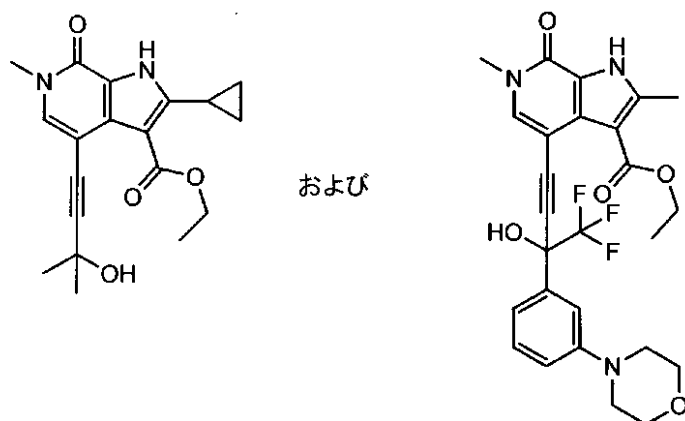
【化 2 0 7】



【化 208】



【化 2 0 9】



ならびにその塩からなる群から選択される、項目 1 に記載の化合物。

(項目 3 8)

項目 1 ~ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容され得る塩および薬学的に許容され得るアジュバント、担体、またはビヒクルを含む組成物。

(項目 3 9)

さらなる治療剤をさらに含む、項目 3 8 に記載の組成物。

(項目 4 0)

前記さらなる治療剤が化学療法剤である、項目 3 9 に記載の組成物。

(項目 4 1)

動物における T A F 1 媒介障害を処置する方法であって、項目 1 ~ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を前記動物に投与することを含む、方法。

(項目 4 2)

前記障害が癌である、項目 4 1 に記載の方法。

(項目 4 3)

前記癌が、聴神経腫、急性白血病、急性リンパ球性白血病、急性骨髄球性白血病、急性 T 細胞白血病、基底細胞癌腫、胆管癌腫、膀胱癌、脳癌、乳癌、気管支原性癌腫、子宮頸癌、軟骨肉腫、脊索腫、絨毛癌腫、慢性白血病、慢性リンパ球性白血病、慢性骨髄球性白血病、慢性骨髄性白血病、結腸癌、結腸直腸癌、頭蓋咽頭腫、嚢胞腺癌腫、びまん性大細胞型 B 細胞リンパ腫、増殖異常性変化、胎児性癌腫、子宮内膜癌、内皮肉腫、上衣腫、上皮癌腫、赤白血病、食道癌、エストロゲン - 受容体陽性乳癌、本態性血小板血症、ユーイング腫瘍、線維肉腫、濾胞性リンパ腫、生殖細胞精巢癌、神経膠腫、膠芽腫、神経膠肉腫、重鎖病、頭頸部癌、血管芽細胞腫、ヘパトーム、肝細胞癌、ホルモン非感受性前立腺癌、平滑筋肉腫、白血病、脂肪肉腫、肺癌、リンパ管内皮肉腫、リンパ管肉腫、リンパ芽球性白血病、リンパ腫、T 細胞または B 細胞起源のリンパ系悪性疾患、髄様癌腫、髄芽腫、黒色腫、髄膜腫、中皮腫、多発性骨髄腫、骨髄性白血病、骨髄腫、粘液肉腫、神経芽細胞腫、N U T ミッドラインカルシノーマ (N M C)、非小細胞肺癌、乏突起膠腫、口腔癌、骨原性肉腫、卵巣癌、膵臓癌、乳頭腺癌腫、乳頭状癌腫、松果体腫、真性赤血球増加症、前立腺癌、直腸癌、腎細胞癌腫、網膜芽細胞腫、横紋筋肉腫、肉腫、脂腺癌腫、セミノーマ、皮膚癌、小細胞性肺癌腫、固形腫瘍 (癌腫および肉腫)、小細胞肺癌、胃癌、扁平上皮癌腫、滑膜腫、汗腺癌腫、甲状腺癌、ワルデンシュトレーママクログロブリン血症、精巣腫瘍、子宮癌、およびウィルムス腫瘍から選択される、項目 4 2 に記載の方法。

(項目 4 4)

前記障害が癌であり、前記癌が肺癌、乳癌、膵臓癌、結腸直腸癌、および黒色腫から選択

される、項目 4 2 に記載の方法。

(項目 4 5)

医薬療法における使用のための、項目 1 ～ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

(項目 4 6)

T A F 1 媒介障害の予防的処置または治療的処置のための、項目 1 ～ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

(項目 4 7)

動物における T A F 1 媒介障害を処置するための医薬を調製するための、項目 1 ～ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

(項目 4 8)

T A F 1 の阻害を必要とする動物において T A F 1 を阻害する方法であって、項目 1 ～ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を前記動物に投与することを含む、方法。

(項目 4 9)

T A F 1 を阻害するための、項目 1 ～ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

(項目 5 0)

T A F 1 の阻害を必要とする動物において T A F 1 を阻害するための医薬を調製するための、項目 1 ～ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

(項目 5 1)

動物における癌を処置する方法であって、有効量の T A F 1 のインヒビターを前記動物に投与することを含む、方法。

(項目 5 2)

前記癌が、聴神経腫、急性白血病、急性リンパ球性白血病、急性骨髄球性白血病、急性 T 細胞白血病、基底細胞癌腫、胆管癌腫、膀胱癌、脳癌、乳癌、気管支原性癌腫、子宮頸癌、軟骨肉腫、脊索腫、絨毛癌腫、慢性白血病、慢性リンパ球性白血病、慢性骨髄球性白血病、慢性骨髄性白血病、結腸癌、結腸直腸癌、頭蓋咽頭腫、嚢胞腺癌腫、びまん性大細胞型 B 細胞リンパ腫、増殖異常性変化、胎児性癌腫、子宮内膜癌、内皮肉腫、上衣腫、上皮癌腫、赤白血病、食道癌、エストロゲン - 受容体陽性乳癌、本態性血小板血症、ユーイング腫瘍、線維肉腫、濾胞性リンパ腫、生殖細胞精巢癌、神経膠腫、膠芽腫、神経膠肉腫、重鎖病、頭頸部癌、血管芽細胞腫、ヘパトーム、肝細胞癌、ホルモン非感受性前立腺癌、平滑筋肉腫、白血病、脂肪肉腫、肺癌、リンパ管内皮肉腫、リンパ管肉腫、リンパ芽球性白血病、リンパ腫、T 細胞または B 細胞起源のリンパ系悪性疾患、髓様癌腫、髓芽腫、黒色腫、髓膜腫、中皮腫、多発性骨髄腫、骨髄性白血病、骨髄腫、粘液肉腫、神経芽細胞腫、N U T ミッドラインカルシノーマ (N M C)、非小細胞肺癌、乏突起膠腫、口腔癌、骨原性肉腫、卵巣癌、脾臓癌、乳頭腺癌腫、乳頭状癌腫、松果体腫、真性赤血球増加症、前立腺癌、直腸癌、腎細胞癌腫、網膜芽細胞腫、横紋筋肉腫、肉腫、脂腺癌腫、セミノーマ、皮膚癌、小細胞性肺癌腫、固形腫瘍 (癌腫および肉腫)、小細胞肺癌、胃癌、扁平上皮癌腫、滑膜腫、汗腺癌腫、甲状腺癌、ワルデンシュトレームマクログロブリン血症、精巣腫瘍、子宮癌、およびウィルムス腫瘍から選択される、項目 5 1 に記載の方法。

(項目 5 3)

前記 T A F 1 のインヒビターが T A F 1 に特異的に結合して T A F 1 プロモドメインの活性を阻害する、項目 5 1 ～ 5 2 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 5 4)

医薬療法における使用のための、T A F 1 のインヒビター。

(項目 5 5)

癌の予防的処置または治療的処置のための、T A F 1 のインヒビター。

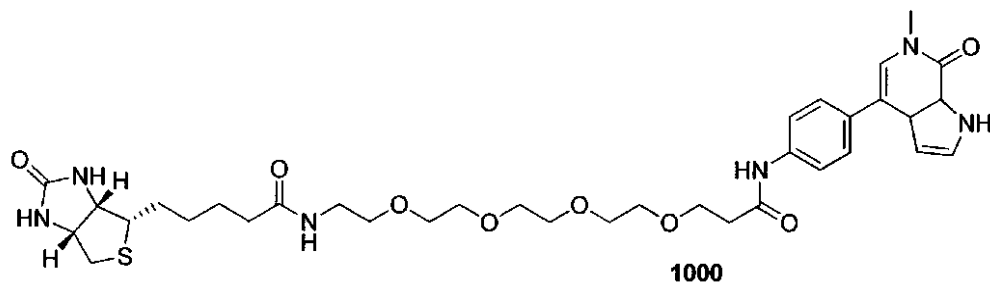
(項目 5 6)

動物における癌を処置するための医薬を調製するための、T A F 1 のインヒビターの使用

。
(項 目 5 7)

化合物：

【 化 2 1 0 】



またはその塩。