

【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22年9月9日(2010.9.9)

【公表番号】特表2010-500352(P2010-500352A)

【公表日】平成22年1月7日(2010.1.7)

【年通号数】公開・登録公報2010-001

【出願番号】特願2009-523802(P2009-523802)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 471/04 1 2 1

C 0 7 D 471/04 C S P

A 6 1 K 31/55

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成22年7月26日(2010.7.26)

【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

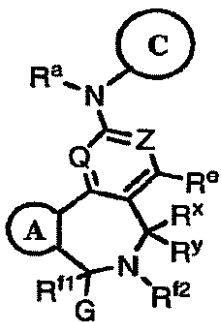
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化44】



(I)

の化合物、またはそれらの薬学的に受容可能な塩であって、式(I)において、

R<sup>f1</sup>は、水素であるか、またはR<sup>f1</sup>およびR<sup>f2</sup>は、一緒になって、結合を形成し

；

R<sup>f2</sup>は、水素であるか、またはR<sup>f2</sup>は、R<sup>f1</sup>もしくはR<sup>x</sup>のいずれかと共に、結合を形成し；

R<sup>x</sup>およびR<sup>y</sup>の各々は、独立して、水素、フルオロ、もしくは必要に応じて置換されたC<sub>1</sub>~6脂肪族であるか；またはR<sup>x</sup>およびR<sup>y</sup>は、それらが結合する炭素原子と一緒に、必要に応じて置換された3員~6員脂環式環を形成するか；またはR<sup>x</sup>およびR<sup>f2</sup>は、一緒になって、結合を形成し；

Q および Z のうちの一方は、 $-N-$  であり、そして他方は、 $-CH-$  であり；

G は、 $R^{f1}$  が水素であるとき、水素、必要に応じて置換された脂肪族または環 B であり；そして G は、 $R^{f1}$  および  $R^{f2}$  が一緒になって結合を形成するとき、水素、 $-OR^5$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-SR^5$ 、必要に応じて置換された脂肪族、または環 B であり；

環 A は、置換または非置換の 5 員または 6 員のアリール環、ヘテロアリール環、脂環式環またはヘテロシクリル環であり；

環 B は、置換または非置換のアリール環、ヘテロアリール環、ヘテロシクリル環または脂環式環であり；

環 C は、置換または非置換のアリール環、ヘテロアリール環、ヘテロシクリル環または脂環式環であり；

$R^a$  は、水素、 $-C(O)R^1$ 、 $-CO_2R^1$ 、 $-SO_2R^1$ 、または  $C_{1-3}$  脂肪族であり、該  $C_{1-3}$  脂肪族は、0 個 ~ 2 個の置換基を有し、該置換基は、独立して、 $R^3$  または  $R^7$  から選択され；

$R^e$  は、水素、 $-OR^5$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-SR^5$ 、 $-NR^4C(O)R^5$ 、 $-NR^4C(O)N(R^4)_2$ 、 $-NR^4CO_2R^6$ 、 $-N(R^4)SO_2R^6$ 、 $-N(R^4)SO_2N(R^4)_2$ 、または  $C_{1-3}$  脂肪族であり、該  $C_{1-3}$  脂肪族は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^7$  で置換されており；

$R^1$  は、 $C_{1-6}$  脂肪族、あるいは必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロアリール基またはヘテロシクリル基であり；

各  $R^3$  は、独立して、 $-H$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_{1-3}$  アルキル)、 $-CN$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-C(O)(C_{1-3}$  アルキル)、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_{1-3}$  アルキル)、 $-C(O)NH_2$ 、および  $-C(O)NH(C_{1-3}$  アルキル) からなる群より選択され；

各  $R^4$  は、独立して、水素または必要に応じて置換された脂肪族基、アリール基、ヘテロアリール基もしくはヘテロシクリル基であるか；あるいは同じ窒素原子上の 2 個の  $R^4$  は、該窒素原子と一緒に、必要に応じて置換された 5 員 ~ 6 員ヘテロアリール環または 4 員 ~ 8 員ヘテロシクリル環を形成し、該環は、該窒素原子に加えて、0 個 ~ 2 個の環ヘテロ原子を有し、該環ヘテロ原子は、N、O および S から選択され；

各  $R^5$  は、独立して、水素、あるいは必要に応じて置換された脂肪族基、アリール基、ヘテロアリール基またはヘテロシクリル基であり；

各  $R^6$  は、独立して、必要に応じて置換された脂肪族基またはアリール基であり；そして

各  $R^7$  は、独立して、必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロシクリル基またはヘテロアリール基である、

化合物。

#### 【請求項 2】

請求項 1 に記載の化合物であって、

$R^x$  および  $R^y$  の各々は、独立して、水素、フルオロ、もしくは  $C_{1-6}$  脂肪族から選択され、該  $C_{1-6}$  脂肪族は、必要に応じて、1 個もしくは 2 個の  $R^3$  で置換されているか；または  $R^x$  および  $R^y$  は、それらが結合する炭素原子と一緒に、必要に応じて置換された 3 員 ~ 6 員脂環式環を形成し；

$R^e$  は、水素、 $-OH$ 、 $-NHR^4$ 、 $-SH$ 、または  $C_{1-3}$  脂肪族であり、該  $C_{1-3}$  脂肪族は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^7$  で置換されており；

$R^{f1}$  および  $R^{f2}$  は、一緒になって、結合を形成し；

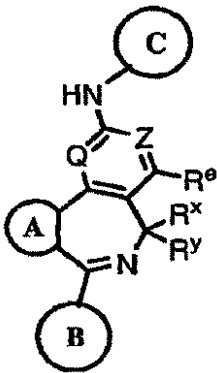
G は、 $-H$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-O(C_{1-3}$  アルキル)、 $-NH(C_{1-3}$  アルキル)、 $-N(C_{1-3}$  アルキル) $_2$ 、 $C_{1-3}$  アルキル、 $C_{1-3}$  フルオロアルキル、 $-O-L^1-R^7$ 、 $-N(C_{1-3}$  アルキル) $-L^1-R^7$ 、または  $-L^1-R^7$  であり；そして

$L^1$  は、共有結合または  $C_{1-3}$  アルキレンである、化合物。

【請求項 3】

式 (II) :

【化 45】



(II)

またはそれらの薬学的に受容可能な塩を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

環 A が、フラノ、ジヒドロフラノ、チエノ、ジヒドロチエノ、シクロペンテノ、シクロヘキセノ、2H-ピロロ、ピロロ、ピロリノ、ピロリジノ、オキサゾロ、チアゾロ、イミダゾロ、イミダゾリノ、イミダゾリジノ、ピラゾロ、ピラゾリノ、ピラゾリジノ、イソオキサゾロ、イソチアゾロ、オキサジアゾロ、トリアゾロ、チアジアゾロ、2H-ピラノ、4H-ピラノ、ベンゾ、ピリジノ、ペペリジノ、ジオキサノ、モルホリノ、ジチアノ、チオモルホリノ、ピリダジノ、ピリミジノ、ピラジノ、ペペラジノおよびトリアジノからなる群より選択される置換環または非置換環である、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

環 A が、フラノ、チエノ、ピロロ、オキサゾロ、チアゾロ、イミダゾロ、ピラゾロ、イソオキサゾロ、イソチアゾロ、トリアゾロ、ベンゾ、ピリジノ、ピリダジノ、ピリミジノおよびピラジノからなる群より選択される置換環または非置換環である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

請求項 5 に記載の化合物であって、

環 A 内の各置換可能な飽和環炭素原子は、非置換であるか、または = O、= S、= C (R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、= N - N (R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、= N - OR<sup>5</sup>、= N - NHC (O) R<sup>5</sup>、= N - NHC O<sub>2</sub> R<sup>6</sup>、= N - NHSO<sub>2</sub> R<sup>6</sup>、= N - R<sup>5</sup> もしくは - R<sup>b</sup> で置換されており；

環 A 内の各置換可能な不飽和環炭素原子は、非置換であるか、または - R<sup>b</sup> で置換されており；

環 A 内の置換可能な環窒素原子は、非置換であるか、または - R<sup>9b</sup> で置換されており；

環 A 内の 1 個の環窒素原子は、必要に応じて、酸化されており；

各 R<sup>b</sup> は、独立して、- H、- NO<sub>2</sub>、- CN、- C (R<sup>5</sup>) = C (R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、- C (R<sup>5</sup>) = C (R<sup>5</sup>) (R<sup>10</sup>)、- C - C - R<sup>5</sup>、- C - C - R<sup>10</sup>、- OR<sup>5</sup>、- S R<sup>6</sup>、- S (O) R<sup>6</sup>、- SO<sub>2</sub> R<sup>6</sup>、- SO<sub>2</sub> N (R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、- N (R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、- NR<sup>4</sup> C (O) R<sup>5</sup>、- NR<sup>4</sup> C (O) N (R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、- NR<sup>4</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>6</sup>、- O - CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>、- OC (O) N (R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、- O - C (O) R<sup>5</sup>、- CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>、- C (O) - C (O) R<sup>5</sup>、- C (O) R<sup>5</sup>、- C (O) N (R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、- C (= NR<sup>4</sup>) - N (R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、- C (= NR<sup>4</sup>) - OR<sup>5</sup>、- N (R<sup>4</sup>) - N (R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、- N (R<sup>4</sup>) C (= NR<sup>4</sup>) - N (R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、- N (R<sup>4</sup>) SO<sub>2</sub> R<sup>6</sup>、- N (R<sup>4</sup>) SO<sub>2</sub> N (R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、- P (O) (R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、- P (O) (OR<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、必要に応じて置換された脂肪族、または必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロシクリル基もしくはヘテロアリール基であり；あるいは 2 個の隣接する R<sup>b</sup> は、介在する環原子と一緒に、必要に応じて置換された縮合 4 員 ~ 8 員芳香族環または非芳香族環を形成し、該芳香族環は、0 個 ~ 3 個の環ヘテ

口原子を有し、該環ヘテロ原子は、O、NおよびSからなる群より選択され；

各R<sup>3</sup>は、独立して、-八口、-OH、-O(C<sub>1-3</sub>アルキル)、-CN、-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-C(O)(C<sub>1-3</sub>アルキル)、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>(C<sub>1-3</sub>アルキル)、-C(O)NH<sub>2</sub>、および-C(O)NH(C<sub>1-3</sub>アルキル)からなる群より選択され；

各R<sup>4</sup>は、独立して、水素、あるいは、必要に応じて置換された脂肪族基、アリール基、ヘテロアリール基またはヘテロシクリル基であるか；または同じ窒素原子上の2個のR<sup>4</sup>は、該窒素原子と一緒にあって、必要に応じて置換された5員～6員ヘテロアリールまたは4員～8員ヘテロシクリルを形成し、該ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは、該窒素原子に加えて、0個～2個の環ヘテロ原子を有し、該環ヘテロ原子は、N、OおよびSから選択され；

各R<sup>5</sup>は、独立して、水素、あるいは必要に応じて置換された脂肪族基、アリール基、ヘテロアリール基またはヘテロシクリル基であり；

各R<sup>6</sup>は、独立して、必要に応じて置換された脂肪族基またはアリール基であり；

各R<sup>7</sup>は、独立して、必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロシクリル基またはヘテロアリール基であり；

各R<sup>9b</sup>は、独立して、-C(O)R<sup>5</sup>、-C(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、またはC<sub>1-4</sub>脂肪族であり、該C<sub>1-4</sub>脂肪族は、必要に応じて、R<sup>3</sup>またはR<sup>7</sup>で置換されており；そして

各R<sup>10</sup>は、独立して、-CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>または-C(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>である、化合物。

#### 【請求項7】

請求項6に記載の化合物であって、

各R<sup>b</sup>は、独立して、C<sub>1-6</sub>脂肪族、C<sub>1-6</sub>フルオロ脂肪族、-R<sup>2b</sup>、-R<sup>7b</sup>、-T<sup>1</sup>-R<sup>2b</sup>、および-T<sup>1</sup>-R<sup>7b</sup>からなる群より選択されるか；または2個の隣接するR<sup>b</sup>は、介在する環原子と一緒にあって、必要に応じて置換された縮合4員～8員芳香族環または非芳香族環を形成し、該環は、0個～3個の環ヘテロ原子を有し、該環ヘテロ原子は、O、NおよびSからなる群より選択され；

T<sup>1</sup>は、C<sub>1-6</sub>アルキレン鎖であり、該C<sub>1-6</sub>アルキレン鎖は、必要に応じて、R<sup>3</sup>またはR<sup>3b</sup>で置換されており、ここで、T<sup>1</sup>またはその一部は、必要に応じて、3員～7員環の部分形成し；

各R<sup>3b</sup>は、独立して、C<sub>1-3</sub>脂肪族であり、該C<sub>1-3</sub>脂肪族は、必要に応じて、R<sup>3</sup>またはR<sup>7</sup>で置換されているか、または同じ炭素原子上の2個の置換基R<sup>3b</sup>は、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、3員～6員炭素環式環を形成し；

各R<sup>2b</sup>は、独立して、-八口、-NO<sub>2</sub>、-CN、-C(R<sup>5</sup>)=C(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-C(R<sup>5</sup>)=C(R<sup>5</sup>)(R<sup>10</sup>)、-C-C-R<sup>5</sup>、-C-C-R<sup>10</sup>、-OR<sup>5</sup>、-SR<sup>6</sup>、-S(O)R<sup>6</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>4</sup>C(O)R<sup>5</sup>、-NR<sup>4</sup>C(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>4</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、-O-CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、-OC(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-O-C(O)R<sup>5</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、-C(O)-C(O)R<sup>5</sup>、-C(O)R<sup>5</sup>、-C(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-C(=NR<sup>4</sup>)-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-C(=NR<sup>4</sup>)-OR<sup>5</sup>、-N(R<sup>4</sup>)-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>4</sup>)C(=NR<sup>4</sup>)-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>4</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、-N(R<sup>4</sup>)SO<sub>2</sub>N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-P(O)(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、または-P(O)(OR<sup>5</sup>)<sub>2</sub>であり；そして

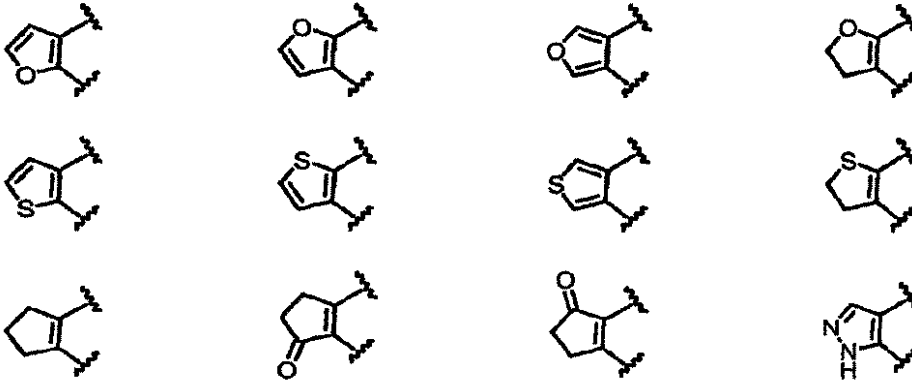
各R<sup>7b</sup>は、独立して、必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロアリール基またはヘテロシクリル基である、

化合物。

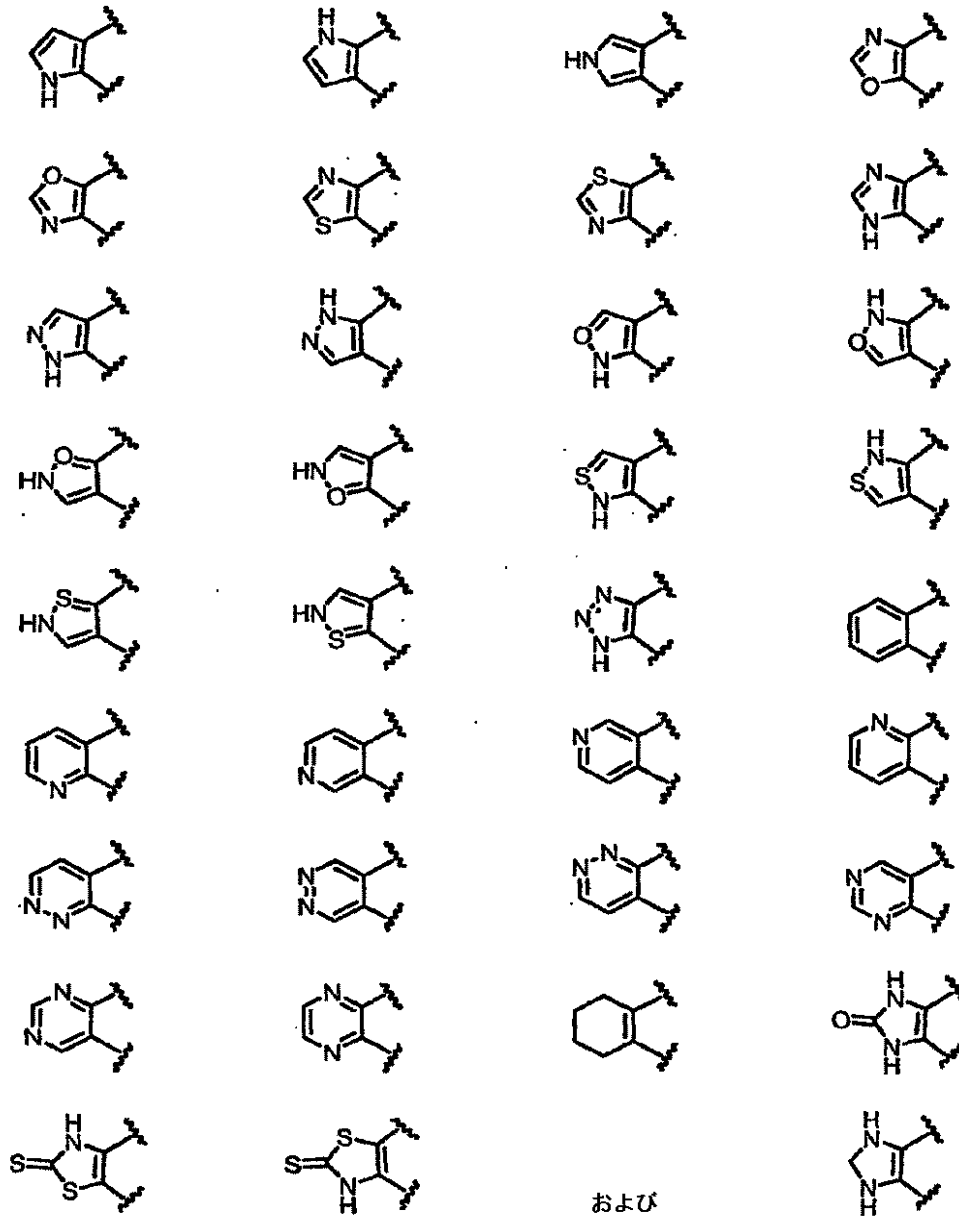
#### 【請求項8】

環Aが、

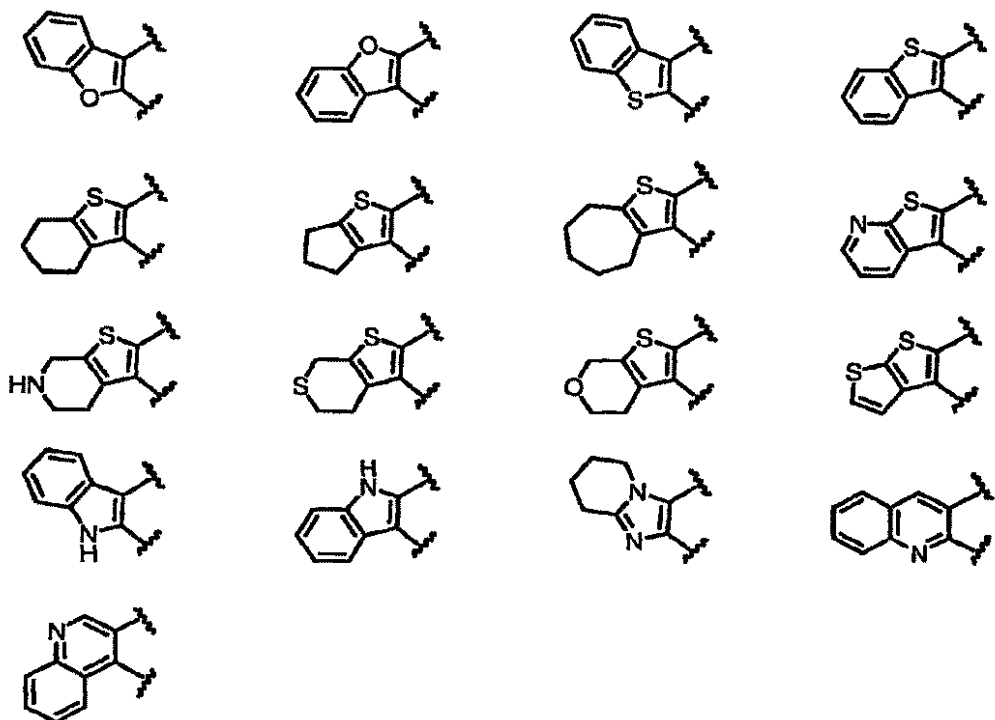
## 【化 4 6】



## 【化 4 7】



## 【化 4 8】



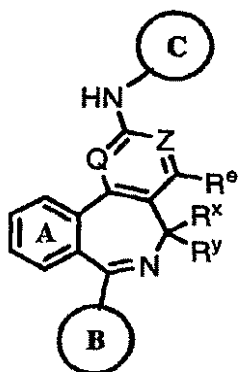
および

からなる群より選択され、これらの基のいずれかは、必要に応じて、任意の置換可能な環炭素原子および任意の置換可能な環窒素原子上で、置換されている、請求項 8 に記載の化合物。

## 【請求項 10】

式 (III)

## 【化 4 9】



## (III)

またはそれらの薬学的に受容可能な塩を有し、式 (III) において、環 A は、0 個 ~ 3 個の  $R^b$  で置換されている、請求項 8 に記載の化合物。

## 【請求項 11】

請求項 10 に記載の化合物であって、

環 B は、単環式または二環式のアリール環、ヘテロアリール環、ヘテロシクリル環または脂環式環であり；

環 B 内の各置換可能な飽和環炭素原子は、非置換であるか、または  $=O$ 、 $=S$ 、 $=C(R^5)_2$  もしくは  $R^c$  で置換されており；

環 B 内の各置換可能な不飽和環炭素原子は、非置換であるか、または  $R^c$  で置換されており；

環 B 内の各置換可能な環窒素原子は、非置換であるか、または  $R^{9c}$  で置換されており；

;

各  $R^c$  は、独立して、 $C_{1-6}$  脂肪族、 $R^{2c}$ 、 $R^{7c}$ 、 $-T^1-R^{2c}$ 、および  $-T^1-R^{7c}$  からなる群より選択され；

$T^1$  は、 $C_{1-6}$  アルキレン鎖であり、該  $C_{1-6}$  アルキレン鎖は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^{3b}$  で置換されており、ここで、 $T^1$  またはその一部は、必要に応じて、3員～7員環の部分形成し；

$R^{2c}$  は、 $-$  八口、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(R^5) = C(R^5)_2$ 、 $-C(R^5) = C(R^5)(R^{10})$ 、 $-C-C-R^5$ 、 $-C-C-R^{10}$ 、 $-OR^5$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)R^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-NR^4C(O)R^5$ 、 $-NR^4C(O)N(R^4)_2$ 、 $-NR^4CO_2R^6$ 、 $-O-CO_2R^5$ 、 $-OC(O)N(R^4)_2$ 、 $-O-C(O)R^5$ 、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)-C(O)R^5$ 、 $-C(O)R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)-OR^5$ 、 $-N(R^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)SO_2R^6$ 、 $-N(R^4)SO_2N(R^4)_2$ 、 $-P(O)(R^5)_2$ 、または  $-P(O)(OR^5)_2$  であり；

各  $R^{7c}$  は、独立して、必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロシクリル基またはヘテロアリール基であり；

各  $R^{9c}$  は、独立して、 $-C(O)R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-CO_2R^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、または  $C_{1-4}$  脂肪族であり、該  $C_{1-4}$  脂肪族は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^7$  で置換されており；そして

環  $C$  は、単環式または二環式のアリール環、ヘテロアリール環、ヘテロシクリル環または脂環式環であり；

環  $C$  内の各置換可能な飽和環炭素原子は、非置換であるか、または  $=O$ 、 $=S$ 、 $=C(R^5)_2$  または  $R^d$  で置換されており；

環  $C$  内の各置換可能な不飽和環炭素原子は、非置換であるか、または  $R^d$  で置換されており；

環  $C$  内の各置換可能な環窒素原子は、非置換であるか、または  $R^{9d}$  で置換されており；

各  $R^d$  は、独立して、 $C_{1-6}$  脂肪族、 $R^{2d}$ 、 $R^{7d}$ 、 $-T^2-R^{2d}$ 、 $-T^2-R^{7d}$ 、 $-V-T^3-R^{2d}$ 、および  $-V-T^3-R^{7d}$  からなる群より選択され；

$T^2$  は、 $C_{1-6}$  アルキレン鎖であり、該  $C_{1-6}$  アルキレン鎖は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^{3b}$  で置換されており、ここで、該アルキレン鎖は、必要に応じて、 $-C(R^5) = C(R^5)-$ 、 $-C-C-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-SO_2N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)C(O)-$ 、 $-NR^4C(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)CO_2-$ 、 $-C(O)N(R^4)-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OC(O)-$ 、 $-OC(O)O-$ 、 $-OC(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)-N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)SO_2-$ 、または  $-SO_2N(R^4)-$  で中断されており、ここで、 $T^2$  またはその一部は、必要に応じて、3員～7員環の部分形成し；

$T^3$  は、 $C_{1-6}$  アルキレン鎖であり、該  $C_{1-6}$  アルキレン鎖は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^{3b}$  で置換されており、ここで、該アルキレン鎖は、必要に応じて、 $-C(R^5) = C(R^5)-$ 、 $-C-C-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-SO_2N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)C(O)-$ 、 $-NR^4C(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)CO_2-$ 、 $-C(O)N(R^4)-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OC(O)-$ 、 $-OC(O)O-$ 、 $-OC(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)-N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)SO_2-$ 、または  $-SO_2N(R^4)-$  で中断されており、ここで、 $T^3$  またはその一部は、必要に応じて、3員～7員環の部分形成し；

$V$  は、 $-C(R^5) = C(R^5)-$ 、 $-C-C-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-SO_2N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)C(O)-$ 、 $-NR^4C(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)CO_2-$ 、 $-C(O)N(R^4)-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OC(O)-$ 、 $-OC(O)O-$ 、 $-OC(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)-N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)SO_2-$ 、または  $-SO_2N(R^4)-$  で中断されており、ここで、 $T^3$  またはその一部は、必要に応じて、3員～7員環の部分形成し；

) -、 - C ( O ) - C ( O ) -、 - C O<sub>2</sub> -、 - O C ( O ) -、 - O C ( O ) O -、 - O C ( O ) N ( R<sup>4</sup> ) -、 - C ( N R<sup>4</sup> ) = N -、 - C ( O R<sup>5</sup> ) = N -、 - N ( R<sup>4</sup> ) - N ( R<sup>4</sup> ) -、 - N ( R<sup>4</sup> ) - S O<sub>2</sub> -、 - N ( R<sup>4</sup> ) S O<sub>2</sub> N ( R<sup>4</sup> ) -、 - P ( O ) ( R<sup>5</sup> ) -、 - P ( O ) ( O R<sup>5</sup> ) - O -、 - P ( O ) - O -、または - P ( O ) ( N R<sup>5</sup> ) - N ( R<sup>5</sup> ) - であり；

R<sup>2 d</sup> は、 - 八口、 - N O<sub>2</sub>、 - C N、 - C ( R<sup>5</sup> ) = C ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub>、 - C ( R<sup>5</sup> ) = C ( R<sup>5</sup> ) ( R<sup>1 0</sup> )、 - C C - R<sup>5</sup>、 - C C - R<sup>1 0</sup>、 - O R<sup>5</sup>、 - S R<sup>6</sup>、 - S ( O ) R<sup>6</sup>、 - S O<sub>2</sub> R<sup>6</sup>、 - S O<sub>3</sub> R<sup>5</sup>、 - S O<sub>2</sub> N ( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>、 - N ( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>、 - N R<sup>4</sup> C ( O ) R<sup>5</sup>、 - N R<sup>4</sup> C ( O ) N ( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>、 - N R<sup>4</sup> C O<sub>2</sub> R<sup>6</sup>、 - O - C O<sub>2</sub> R<sup>5</sup>、 - O C ( O ) N ( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>、 - O - C ( O ) R<sup>5</sup>、 - C O<sub>2</sub> R<sup>5</sup>、 - C ( O ) - C ( O ) R<sup>5</sup>、 - C ( O ) R<sup>5</sup>、 - C ( O ) N ( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>、 - C ( O ) N ( R<sup>4</sup> ) C ( = N R<sup>4</sup> ) - N ( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>、 - N ( R<sup>4</sup> ) C ( = N R<sup>4</sup> ) - N ( R<sup>4</sup> ) - C ( O ) R<sup>5</sup>、 - C ( = N R<sup>4</sup> ) - N ( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>、 - C ( = N R<sup>4</sup> ) - O R<sup>5</sup>、 - N ( R<sup>4</sup> ) - N ( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>、 - N ( R<sup>4</sup> ) C ( = N R<sup>4</sup> ) - N ( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>、 - N ( R<sup>4</sup> ) S O<sub>2</sub> R<sup>6</sup>、 - N ( R<sup>4</sup> ) S O<sub>2</sub> N ( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>、 - P ( O ) ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub>、または - P ( O ) ( O R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> であり；

各 R<sup>7 d</sup> は、独立して、必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロシクリル基またはヘテロアリール基であり；そして

各 R<sup>9 d</sup> は、独立して、 - C ( O ) R<sup>5</sup>、 - C ( O ) N ( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>、 - C O<sub>2</sub> R<sup>6</sup>、 - S O<sub>2</sub> R<sup>6</sup>、 - S O<sub>2</sub> N ( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>、または C<sub>1 - 4</sub> 脂肪族であり、該 C<sub>1 - 4</sub> 脂肪族は、必要に応じて、R<sup>3</sup> または R<sup>7</sup> で置換されている、化合物。

【請求項 1 2】

環 B が、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、チアジアゾリル、フェニル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、トリアジニル、インドリジニル、インドリル、イソインドリル、インダゾリル、ベンゾ [ b ] フラニル、ベンゾ [ b ] チエニル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、プリニル、キノリル、イソキノリル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、およびプテリジニルからなる群より選択される置換または非置換の単環式または二環式のアリール環またはヘテロアリール環である、請求項 1 1 に記載の化合物。

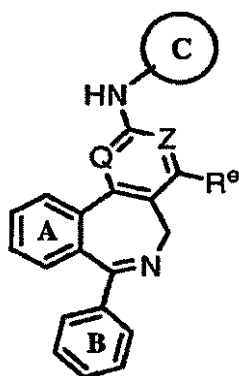
【請求項 1 3】

環 B が、置換または非置換のフェニル環またはピリジル環である、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

式 ( I V ) :

【化 5 0】



(IV)

を有し、式 ( I V ) において、

環 A は、0 個 ~ 2 個の独立して選択された R<sup>b</sup> で置換されており；そして

環 B は、0 個 ~ 2 個の独立して選択された  $R^c$  で置換されている、請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 15】

以下の特徴：

(a) 各  $R^b$  は、独立して、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $R^{2b}$ 、 $R^{7b}$ 、 $-T^1-R^{2b}$ 、および  $-T^1-R^{7b}$  からなる群より選択され、ここで、 $T^1$  は、 $C_{1-3}$  アルキレン鎖であり、該  $C_{1-3}$  アルキレン鎖は、必要に応じて、フルオロで置換されており、そして各  $R^{2b}$  は、独立して、- 八口、 $-NO_2$ 、 $-C(R^5)=C(R^5)_2$ 、 $-C-C-R^5$ 、 $-C-C-R^5$ 、 $-OR^5$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-CO_2R^5$ 、および  $-C(O)N(R^4)$  からなる群より選択されること；

(b) 各  $R^c$  は、独立して、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $R^{2c}$ 、 $R^{7c}$ 、 $-T^1-R^{2c}$ 、および  $-T^1-R^{7c}$  からなる群より選択され、ここで、 $T^1$  は、 $C_{1-3}$  アルキレン鎖であり、該  $C_{1-3}$  アルキレン鎖は、必要に応じて、フルオロで置換されており、そして各  $R^{2c}$  は、独立して、- 八口、 $-NO_2$ 、 $-C(R^5)=C(R^5)_2$ 、 $-C-C-R^5$ 、 $-OR^5$ 、および  $-N(R^4)_2$  からなる群より選択されること；ならびに

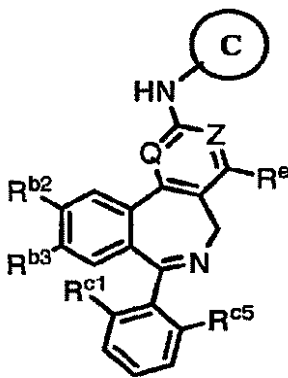
(c)  $R^e$  は、水素であること、

の少なくとも 1 つにより特徴付けられる、請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 16】

式 (V)：

【化 51】



(V)

を有し、式 (V) において、

$R^{b2}$  および  $R^{b3}$  の各々は、独立して、水素または  $R^b$  であり；

$R^b$  は、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $C_{1-3}$  フルオロ脂肪族、および  $R^{2b}$  からなる群より選択され；

$R^{2b}$  は、- 八口、 $-NO_2$ 、 $-C(R^5)=C(R^5)_2$ 、 $-C-C-R^5$ 、 $-OR^5$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$  からなる群より選択され；

$R^{c1}$  および  $R^{c5}$  の各々は、独立して、水素または  $R^c$  であり；

$R^c$  は、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $C_{1-3}$  フルオロ脂肪族、および  $R^{2c}$  からなる群より選択され；そして

$R^{2c}$  は、- 八口、 $-NO_2$ 、 $-C(R^5)=C(R^5)_2$ 、 $-C-C-R^5$ 、 $-OR^5$ 、および  $-N(R^4)_2$  からなる群より選択される、

請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 17】

請求項 16 に記載の化合物であって、

$R^e$  は、水素であり；

$R^{b2}$  および  $R^{b3}$  の各々は、独立して、水素、- 八口、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $C_{1-3}$  フルオロ脂肪族、および  $-OR^5$  からなる群より選択され、ここで、 $R^5$  は、水素または  $C_{1-3}$  脂肪族であり；そして

$R^{c1}$  および  $R^{c5}$  の各々は、独立して、水素、- 八口、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $C_{1-3}$  フ

ルオ口脂肪族、および -OR<sup>5</sup> からなる群より選択され、ここで、R<sup>5</sup> は、水素または C<sub>1-3</sub> 脂肪族である、化合物。

【請求項 18】

R<sup>b3</sup> および R<sup>c1</sup> の各々が、独立して、-ハロ、C<sub>1-3</sub> 脂肪族、C<sub>1-3</sub> フルオ口脂肪族、および -OR<sup>5</sup> からなる群より選択され、ここで、R<sup>5</sup> が、水素または C<sub>1-3</sub> 脂肪族である、請求項 17 に記載の化合物。

【請求項 19】

R<sup>b3</sup> および R<sup>c1</sup> の各々が、独立して、クロ口、フルオ口、プロモ、メチル、トリフルオ口メチル、またはメトキシである、請求項 18 に記載の化合物。

【請求項 20】

請求項 10 に記載の化合物であって、ここで：

環 C は、単環式または二環式のアリール環、ヘテロアリール環、ヘテロシクリル環または炭素環式環であり、該環は、0 個～2 個の独立して選択された置換基 R<sup>d</sup> と、0 個～2 個の独立して選択された R<sup>2d</sup> または C<sub>1-6</sub> 脂肪族基とで置換されており；

各 R<sup>d</sup> は、独立して、C<sub>1-3</sub> 脂肪族、R<sup>2d</sup>、R<sup>7d</sup>、-T<sup>2</sup>-R<sup>2d</sup>、-T<sup>2</sup>-R<sup>7d</sup>、-V-T<sup>3</sup>-R<sup>2d</sup>、および -V-T<sup>3</sup>-R<sup>7d</sup> からなる群より選択され；

V は、-C(R<sup>5</sup>)=C(R<sup>5</sup>)-、-C C-、-O-、-N(R<sup>4</sup>)-、-C(O)- または -C(O)N(R<sup>4</sup>)- であり；

T<sup>2</sup> は、C<sub>1-6</sub> アルキレン鎖であり、ここで、T<sup>2</sup> は、必要に応じて、1 個または 2 個の置換基で置換されており、該置換基は、独立して、-ハロ、-C<sub>1-3</sub> 脂肪族、-OH、および -O(C<sub>1-3</sub> アルキル) からなる群より選択されるか、または同じ炭素原子上の 2 個の置換基は、それらが結合する炭素原子と一緒に、3 員～6 員炭素環式環を形成し、ここで、T<sup>2</sup> は、必要に応じて、-C(R<sup>5</sup>)=C(R<sup>5</sup>)-、-C C-、-O-、-C(O)-、-C(O)N(R<sup>4</sup>)-、-N(R<sup>4</sup>)C(O)- または -N(R<sup>4</sup>)- で中断されており；そして

T<sup>3</sup> は、C<sub>1-4</sub> アルキレン鎖であり、ここで、T<sup>3</sup> は、必要に応じて、1 個または 2 個の置換基で置換されており、該置換基は、独立して、-ハロ、-C<sub>1-3</sub> 脂肪族、-OH、および -O(C<sub>1-3</sub> アルキル) からなる群より選択されるか、または同じ炭素原子上の 2 個の置換基は、それらが結合する炭素原子と一緒に、3 員～6 員炭素環式環を形成し、ここで、T<sup>3</sup> は、必要に応じて、-C(R<sup>5</sup>)=C(R<sup>5</sup>)-、-C C-、-O-、-C(O)-、-C(O)N(R<sup>4</sup>)-、-N(R<sup>4</sup>)C(O)- または -N(R<sup>4</sup>)- で中断されており；

R<sup>2d</sup> は、-ハロ、-NO<sub>2</sub>、-CN、-C(R<sup>5</sup>)=C(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-C C-R<sup>5</sup>、-OR<sup>5</sup>、-SR<sup>6</sup>、-S(O)R<sup>6</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、-SO<sub>3</sub>R<sup>5</sup>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>4</sup>C(O)R<sup>5</sup>、-NR<sup>4</sup>C(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>4</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、-O-CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、-OC(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-O-C(O)R<sup>5</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、-C(O)-C(O)R<sup>5</sup>、-C(O)R<sup>5</sup>、-C(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-C(O)N(R<sup>4</sup>)C(=NR<sup>4</sup>)-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>4</sup>)C(=NR<sup>4</sup>)-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-C(=NR<sup>4</sup>)-OR<sup>5</sup>、-N(R<sup>4</sup>)-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>4</sup>)C(=NR<sup>4</sup>)-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>4</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、-N(R<sup>4</sup>)SO<sub>2</sub>N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-P(O)(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-P(O)(OR<sup>5</sup>)<sub>2</sub> であり；そして

各 R<sup>7d</sup> は、独立して、必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロシクリル基またはヘテロアリール基である、化合物。

【請求項 21】

環 C が、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、チアゾリル、オキサゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、およびフタルイミジルからなる群より選択される置換環または非置換

環である、請求項 20 に記載の化合物。

【請求項 22】

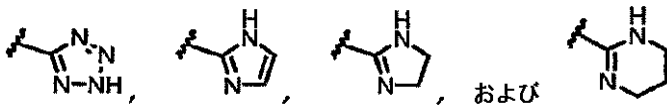
請求項 21 に記載の化合物であって、

各  $R^d$  は、独立して、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $R^{2d}$ 、 $R^{7d}$ 、 $-T^2-R^{2d}$ 、 $-T^2-R^{7d}$ 、 $-V-T^3-R^{2d}$ 、および  $-V-T^3-R^{7d}$  からなる群より選択され；そして  
各  $R^{2d}$  は、独立して、 $-$  八口、 $-OR^5$ 、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)N(R^4)_2$ 、 $-C(O)N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)-C(O)R^5$ 、および  $-NR^4C(O)R^5$  からなる群より選択される、  
化合物。

【請求項 23】

環 C が、少なくとも 1 個の  $R^{7d}$  で置換されており、 $R^{7d}$  が、

【化 52】



からなる群より選択され、これらの基のいずれかは、必要に応じて、任意の置換可能な環炭素および環窒素原子上で、置換されている、請求項 22 に記載の化合物。

【請求項 24】

環 C が、少なくとも 1 個の  $-T^2-R^{2d}$  または  $-T^2-R^{7d}$  で置換されている、請求項 22 に記載の化合物であって、

$T^2$  は、 $C_{1-6}$  アルキレン鎖であり、ここで、 $T^2$  は、必要に応じて、1 個または 2 個の置換基  $R^{3b}$  で置換されており、該置換基  $R^{3b}$  は、独立して、 $-$  八口、 $-C_{1-3}$  脂肪族、 $-OH$ 、および  $-O(C_{1-3}$  脂肪族) からなる群より選択されるか、または同じ炭素原子上の 2 個の置換基  $R^{3b}$  は、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、3 員～6 員炭素環式環を形成し、ここで、 $T^2$  は、必要に応じて、 $-C(R^5)=C(R^5)-$ 、 $-C-C-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-N(R^4)C(O)R^5-$ 、 $-N(R^4)C(O)-$  または  $-N(R^4)-$  で中断されており；そして

$R^{2d}$  は、 $-$  八口、 $-OR^5$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(O)-$ 、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、 $-C(O)N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、および  $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)-C(O)R^5$  からなる群より選択される、  
化合物。

【請求項 25】

環 C が、1 個の  $-T^2-R^{2d}$  または  $-T^2-R^{7d}$  と、必要に応じて、1 個の他の置換基とで置換されており、該他の置換基が、水素、 $-$  八口、 $C_{1-3}$  脂肪族、および  $-OR^5$  からなる群より選択され、ここで、 $R^5$  が、水素または  $C_{1-3}$  脂肪族である、請求項 24 に記載の化合物。

【請求項 26】

環 C が、少なくとも 1 個の  $-V-T^3-R^{2d}$  または  $-V-T^3-R^{7d}$  で置換されている、請求項 22 に記載の化合物であって、

$V$  は、 $-N(R^4)-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)N(R^4)-$ 、 $-C(O)-$ 、または  $-CC-$  であり；

$T^3$  は、 $C_{1-4}$  アルキレン鎖であり、該  $C_{1-4}$  アルキレン鎖は、必要に応じて、1 個または 2 個の置換基  $R^{3b}$  で置換されており、該置換基  $R^{3b}$  は、独立して、 $-$  八口、 $-C_{1-3}$  脂肪族、 $-OH$ 、および  $-O(C_{1-3}$  脂肪族) からなる群より選択されるか、または同じ炭素原子上の 2 個の置換基  $R^{3b}$  は、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、3 員～6 員炭素環式環を形成し；そして

$R^{2d}$  は、 $-$  八口、 $-OR^5$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-NR^4C(O)R^5$ 、 $-CO_2R^5$

、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、および $-SO_2N(R^4)_2$ からなる群より選択される、化合物。

【請求項 27】

環 C が、1 個の $-V-T^3-R^{2d}$ または $-V-T^3-R^{7d}$ と、必要に応じて、1 個の他の置換基とで置換されており、該他の置換基が、水素、 $-H$ 、 $C_{1-3}$  脂肪族、および $-OR^5$ からなる群より選択され、ここで、 $R^5$ が、水素または $C_{1-3}$  脂肪族である、請求項 26 に記載の化合物。

【請求項 28】

請求項 27 に記載の化合物であって、

V は、 $-C(O)N(R^4)-$ であり；

$T^3$  は、 $C_{2-4}$  アルキレン鎖であり；

$R^{2d}$  は、 $-N(R^4)_2$ であり、ここで、各  $R^4$  は、独立して、水素または $C_{1-3}$  脂肪族であるか、または $-N(R^4)_2$ は、必要に応じて置換された 5 員～6 員ヘテロアリール環または 4 員～8 員ヘテロシクリル環であり、該環は、該窒素に加えて、0 個～2 個の環ヘテロ原子を有し、該環ヘテロ原子は、N、O および S から選択され；そして

$R^{7d}$  は、必要に応じて置換された 4 員～8 員ヘテロシクリルまたは必要に応じて置換された 5 員～6 員ヘテロアリールである、化合物。

【請求項 29】

請求項 28 に記載の化合物であって、ここで：

$R^{2d}$  は、 $-N(R^4)_2$ であり、そして $-N(R^4)_2$ は、必要に応じて置換されたヘテロシクリルであり、該ヘテロシクリルは、ペリジニル、ペラジニル、モルホリニル、ピロリジニルおよびアゼチジニルからなる群より選択され；そして

$R^{7d}$  は、必要に応じて置換されたヘテロアリールであり、該ヘテロアリールは、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピロリル、オキサゾリル、イミダゾリルおよびピラゾリルからなる群より選択される、化合物。

【請求項 30】

環 C が、1 個または 2 個の置換基で置換されており、該置換基が、独立して、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $-H$ 、 $-OR^5$ 、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)N(R^4)_2$ 、 $-C(O)N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)-C(O)R^5$ 、および $-NR^4C(O)R^5$ からなる群より選択される、請求項 22 に記載の化合物。

【請求項 31】

環 C が、少なくとも 1 個の置換基で置換されており、該置換基が、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)N(R^4)_2$ 、 $-C(O)N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)-C(O)R^5$ 、および $-NR^4C(O)R^5$ からなる群より選択される、請求項 30 に記載の化合物。

【請求項 32】

環 C が、少なくとも 1 個の $-CO_2R^5$ で置換されており、ここで、 $R^5$ が、水素または $C_{1-6}$  脂肪族である、請求項 30 に記載の化合物。

【請求項 33】

請求項 30 に記載の化合物であって、

環 C は、少なくとも 1 個の $-C(O)-N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)N(R^4)_2$ 、または $-NR^4C(O)R^5$ で置換されており；

ここで、

$-N(R^4)_2$  は、必要に応じて置換された 4 員～8 員ヘテロシクリル環であり、該環は、該窒素原子に加えて、0 個～2 個の環ヘテロ原子を有し、該環ヘテロ原子は、N、O および S から選択され；そして

$R^5$  は、4 員～8 員窒素含有ヘテロシクリル環である、

化合物。

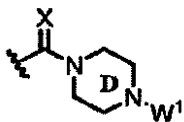
【請求項 3 4】

環 C が、少なくとも 1 個の  $-C(O)N(R^4)_2$  または  $-C(=NR^4)N(R^4)_2$  で置換されており、そして  $-N(R^4)_2$  が、必要に応じて置換されたヘテロシクリルであり、該ヘテロシクリルが、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ピロリジニルおよびアゼチジニルからなる群より選択される、請求項 3 3 に記載の化合物。

【請求項 3 5】

環 C が、次式：

【化 5 3】



を有する少なくとも 1 個の置換基で置換されており、

環 D は、必要に応じて、1 個または 2 個の環炭素原子上で置換されており；

X は、O または NH であり；

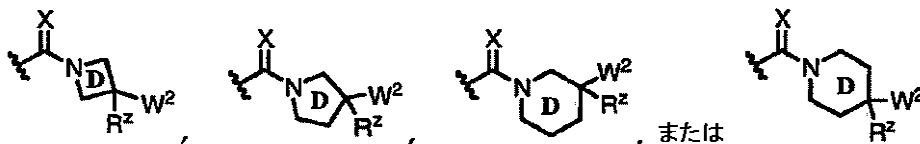
$W^1$  は、水素、 $-C(O)R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-CO_2R^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、あるいは必要に応じて置換された脂肪族基、アリアル基、ヘテロアリアル基またはヘテロシクリル基である、

請求項 3 4 に記載の化合物。

【請求項 3 6】

環 C が、次式：

【化 5 4】



を有する少なくとも 1 個の置換基で置換されており、

環 D は、必要に応じて、1 個または 2 個の置換可能な環炭素原子上で置換されており；

X は、O または NH であり；

$W^2$  は、 $R^n$  または  $-T^6-R^n$  であり；

$T^6$  は、 $C_{1-3}$  アルキレン鎖であり、該  $C_{1-3}$  アルキレン鎖は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^3^b$  で置換されており；そして

$R^n$  は、 $-N(R^4)_2$  または  $-C(O)N(R^4)_2$  であり；そして

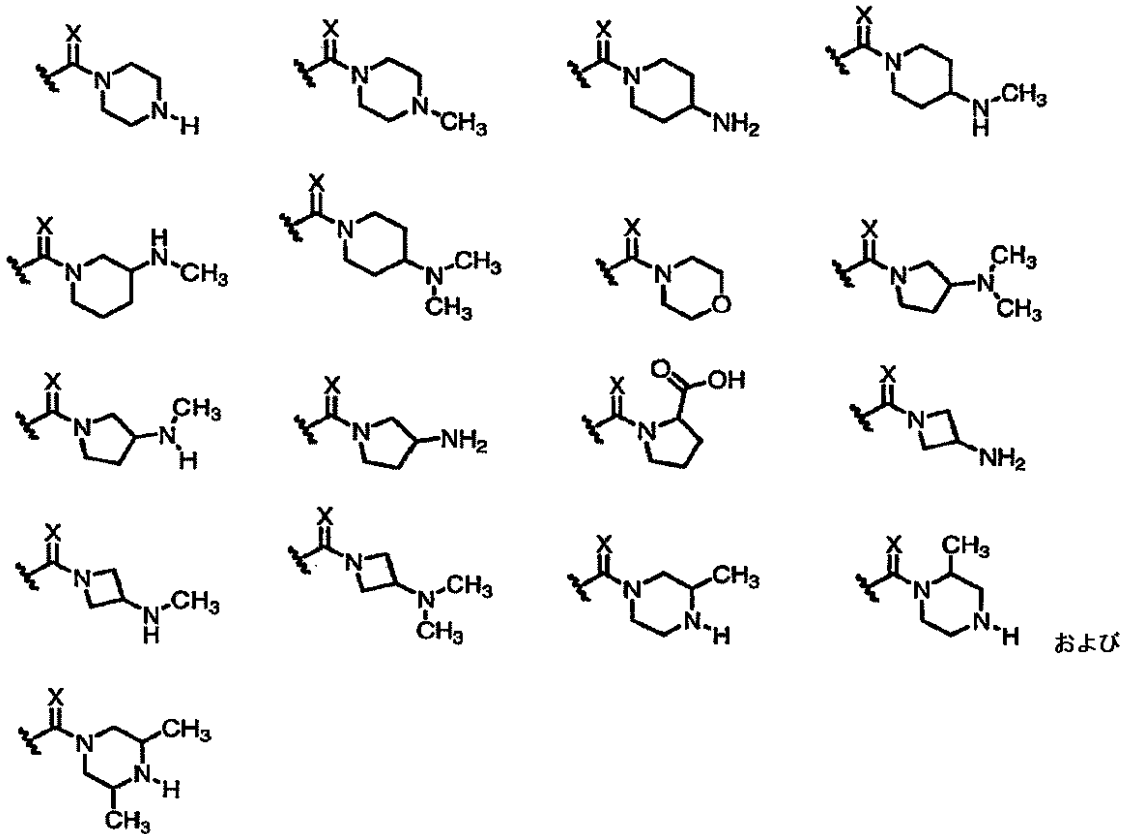
$R^2$  は、水素、 $-CO_2R^5$ 、 $C(O)N(R^4)_2$ 、 $-C(O)R^5$ 、または  $C_{1-3}$  脂肪族であり、該  $C_{1-3}$  脂肪族は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^7$  で置換されているか；または  $R^2$  および  $W^2$  は、それらが結合する炭素原子と一緒に、4 員 ~ 7 員の脂環式環またはヘテロシクリル環を形成する、

請求項 3 4 に記載の化合物。

【請求項 3 7】

環 C 上の少なくとも 1 個の置換基が、

## 【化 5 5】

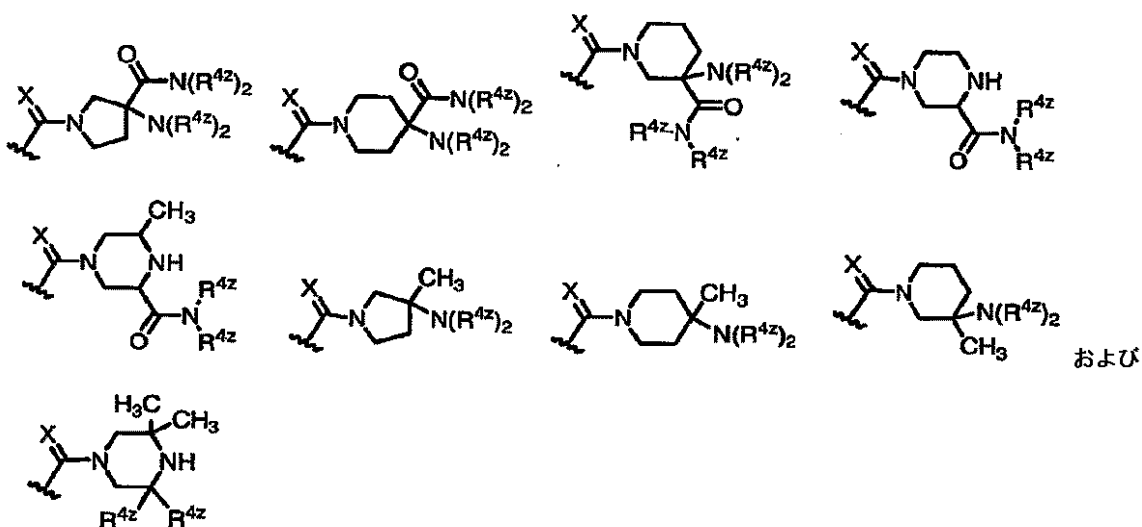


からなる群より選択され、ここで、Xは、OまたはNHである、請求項34に記載の化合物。

## 【請求項38】

環C上の少なくとも1個の置換基が、

## 【化 5 6】

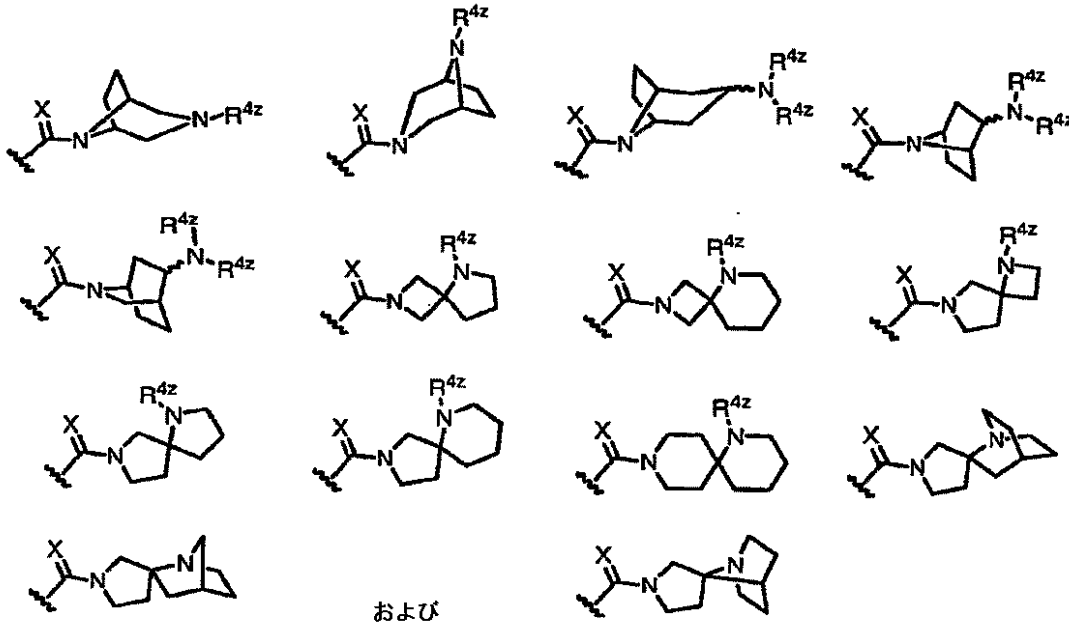


からなる群より選択され、ここで、Xは、OまたはNHであり、そして各R<sup>42</sup>は、独立して、水素または-CH<sub>3</sub>である、請求項34に記載の化合物。

## 【請求項39】

環Cが、

## 【化57】



からなる群より選択される基で置換されており、ここで、Xは、OまたはNHであり、そして各  $R^{4z}$  は、独立して、水素または  $-CH_3$  である、請求項33に記載の化合物。

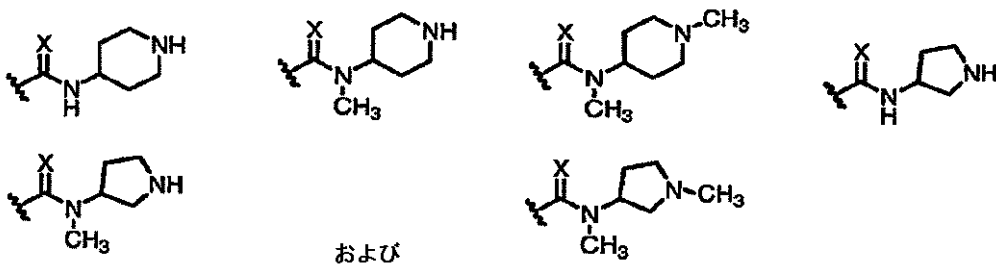
## 【請求項40】

環Cが、少なくとも1個の  $-C(O)N(R^4)_2$  または  $-C(=NH)N(R^4)_2$  で置換されており、ここで、一方の  $R^4$  が、水素または  $C_{1-3}$  アルキルであり、そして他方の  $R^4$  が、必要に応じて置換されたヘテロシクリルまたはヘテロシクリルアルキルである、請求項34に記載の化合物。

## 【請求項41】

環Cが、

## 【化58】

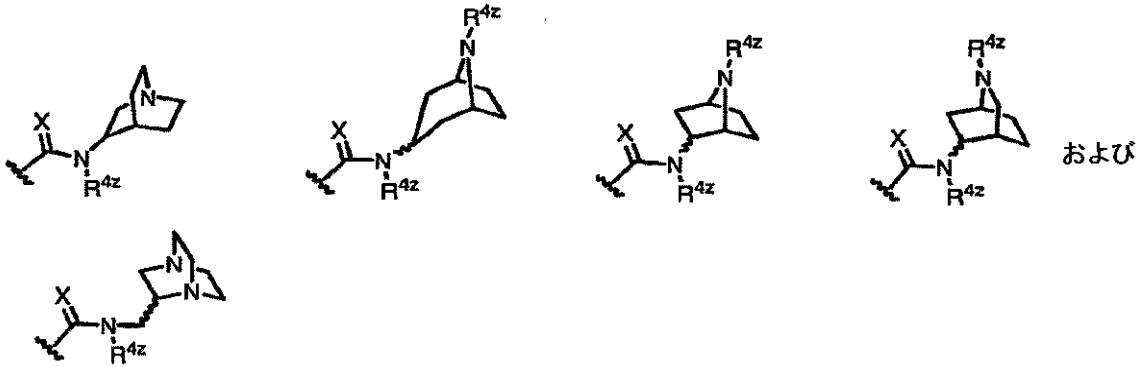


からなる群より選択される少なくとも1個の置換基で置換されており、ここで、Xは、OまたはNHである、請求項40に記載の化合物。

## 【請求項42】

環Cが、

## 【化59】

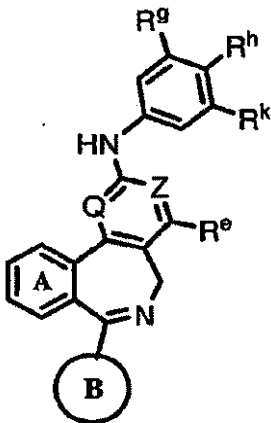


からなる群より選択される少なくとも1個の置換基で置換されており、ここで、Xは、OまたはNHであり、そして各R<sup>4z</sup>は、独立して、HまたはCH<sub>3</sub>である、請求項40に記載の化合物。

## 【請求項43】

式(VI)：

## 【化60】



## (VI)

を有し、式(VI)において、

R<sup>g</sup>は、水素、C<sub>1</sub>~6脂肪族、およびR<sup>2d</sup>からなる群より選択され；

R<sup>h</sup>およびR<sup>k</sup>の各々は、独立して、水素またはR<sup>d</sup>であり；

各R<sup>d</sup>は、独立して、C<sub>1</sub>~3脂肪族、R<sup>2d</sup>、R<sup>7d</sup>、-T<sup>2</sup>-R<sup>2d</sup>、-T<sup>2</sup>-R<sup>7d</sup>、-V-T<sup>3</sup>-R<sup>2d</sup>、および-V-T<sup>3</sup>-R<sup>7d</sup>からなる群より選択され；そして

各R<sup>2d</sup>は、独立して、-八口、-OR<sup>5</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、-C(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-C(=NR<sup>4</sup>)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-C(O)N(R<sup>4</sup>)C(=NR<sup>4</sup>)-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>4</sup>)C(=NR<sup>4</sup>)-N(R<sup>4</sup>)-C(O)R<sup>5</sup>、および-NR<sup>4</sup>C(O)R<sup>5</sup>からなる群より選択される、

請求項10に記載の化合物。

## 【請求項44】

R<sup>g</sup>が、水素であり；

R<sup>h</sup>が、-CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、-C(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-C(=NR<sup>4</sup>)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、または-N(R<sup>4</sup>)C(O)R<sup>5</sup>であり；そして

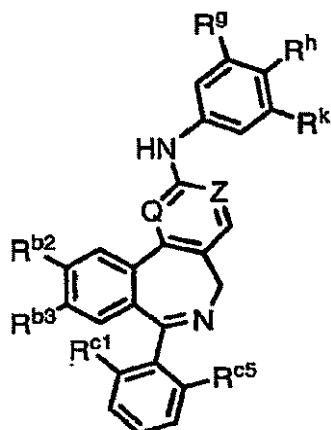
R<sup>k</sup>が、水素、八口、C<sub>1</sub>~3脂肪族、または-OR<sup>5</sup>である、

請求項43に記載の化合物。

## 【請求項45】

式(VII)：

【化 6 1】



(VII)

を有する、請求項 4 3 に記載の化合物であって、

$R^e$  は、水素であり；

$R^{b2}$  および  $R^{b3}$  の各々は、独立して、水素、- 八口、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $C_{1-3}$  フルオロ脂肪族、および  $-OR^5$  からなる群より選択され、ここで、 $R^5$  は、水素または  $C_{1-3}$  脂肪族であり；

$R^{c1}$  および  $R^{c5}$  の各々は、独立して、水素、- 八口、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $C_{1-3}$  フルオロ脂肪族、および  $-OR^5$  からなる群より選択され、ここで、 $R^5$  は、水素または  $C_{1-3}$  脂肪族であり；

$R^g$  は、水素、 $C_{1-6}$  脂肪族、および  $R^{2d}$  からなる群より選択され；そして

$R^h$  および  $R^k$  の各々は、独立して、水素または  $R^d$  である、

化合物。

【請求項 4 6】

$R^g$ 、 $R^h$  および  $R^k$  の各々が、独立して、水素、 $C_{1-3}$  脂肪族、- 八口、 $-OR^5$ 、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)N(R^4)_2$ 、 $-C(O)N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)-C(O)R^5$ 、および  $-N(R^4)C(O)R^5$  からなる群より選択される、請求項 4 5 に記載の化合物。

【請求項 4 7】

$R^h$  および  $R^k$  の少なくとも 1 個が、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)N(R^4)_2$ 、 $-C(O)N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)C(O)R^5$ 、および  $-N(R^4)C(O)R^5$  からなる群より選択される、請求項 4 6 に記載の化合物。

【請求項 4 8】

$R^e$ 、 $R^{b2}$ 、および  $R^g$  は、それぞれ、水素であり；

$R^{b3}$  および  $R^{c1}$  は、それぞれ独立して、- 八口、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $C_{1-3}$  フルオロ脂肪族、および  $-OR^5$  からなる群より選択され、ここで、 $R^5$  は、水素または  $C_{1-3}$  脂肪族であり；

$R^{c5}$  は、水素、- 八口、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $C_{1-3}$  フルオロ脂肪族、および  $-OR^5$  からなる群より選択され、ここで、 $R^5$  は、水素または  $C_{1-3}$  脂肪族であり；そして

$R^h$  は、 $-CO_2H$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)N(R^4)_2$ 、 $-C(O)N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、または  $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)-C(O)R^5$  であり、ここで、 $R^5$  は、必要に応じて置換された 4 員～8 員窒素含有ヘテロシクリル環であり、そして  $-N(R^4)_2$  は、必要に応じて置換された 4 員～8 員ヘテロシクリル環であり、該環は、該窒素原子に加えて、0 個～2 個のヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子は、N、O および S から選択され；そして

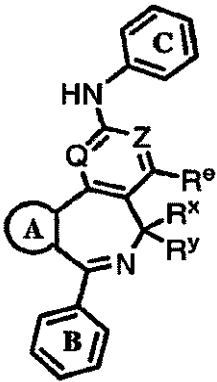
$R^k$  は、水素、八口、 $C_{1-3}$  脂肪族、または  $-OR^5$  である、

請求項 4 5 に記載の化合物。

【請求項 49】

式 (VIII) :

【化 62】



(VIII)

を有する、請求項 3 に記載の化合物、またはそれらの薬学的に受容可能な塩であって、式 (VIII) において、

環 B は、0 個 ~ 2 個の独立して選択された  $R^c$  と、0 個 ~ 3 個の独立して選択された  $R^{2c}$  または  $C_{1-6}$  脂肪族基とで置換されており；

各  $R^c$  は、独立して、 $C_{1-6}$  脂肪族、 $R^{2c}$ 、 $R^{7c}$ 、 $-T^1-R^{2c}$ 、および  $-T^1-R^{7c}$  からなる群より選択され；

$T^1$  は、 $C_{1-6}$  アルキレン鎖であり、該  $C_{1-6}$  アルキレン鎖は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^{3b}$  で置換されており、ここで、 $T^1$  またはその一部は、必要に応じて、3 員 ~ 7 員環の部分形成し；

$R^{2c}$  は、 $-$  八口、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(R^5)=C(R^5)_2$ 、 $-C(R^5)=C(R^5)(R^{10})$ 、 $-C-C-R^5$ 、 $-C-C-R^{10}$ 、 $-OR^5$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)R^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-NR^4C(O)R^5$ 、 $-NR^4C(O)N(R^4)_2$ 、 $-NR^4CO_2R^6$ 、 $-O-CO_2R^5$ 、 $-OC(O)N(R^4)_2$ 、 $-O-C(O)R^5$ 、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)-C(O)R^5$ 、 $-C(O)R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)-OR^5$ 、 $-N(R^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)SO_2R^6$ 、 $-N(R^4)SO_2N(R^4)_2$ 、 $-P(O)(R^5)_2$ 、または  $-P(O)(OR^5)_2$  であり；

各  $R^{7c}$  は、独立して、必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロシクリル基またはヘテロアリール基であり；

環 C は、0 個 ~ 2 個の独立して選択された  $R^d$  と、0 個 ~ 3 個の独立して選択された  $R^{2d}$  または  $C_{1-6}$  脂肪族基とで置換されており；

各  $R^d$  は、独立して、 $C_{1-6}$  脂肪族、 $R^{2d}$ 、 $R^{7d}$ 、 $-T^2-R^{2d}$ 、 $-T^2-R^{7d}$ 、 $-V-T^3-R^{2d}$ 、および  $-V-T^3-R^{7d}$  からなる群より選択され；

$T^2$  は、 $C_{1-6}$  アルキレン鎖であり、該  $C_{1-6}$  アルキレン鎖は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^{3b}$  で置換されており、ここで、該アルキレン鎖は、必要に応じて、 $-C(R^5)=C(R^5)-$ 、 $-C-C-$ 、 $-O-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-SO_2N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)C(O)-$ 、 $-NR^4C(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)CO_2-$ 、 $-C(O)N(R^4)-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OC(O)-$ 、 $-OC(O)O-$ 、 $-OC(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)-N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)SO_2-$ 、または  $-SO_2N(R^4)-$  で中断されており、ここで、 $T^2$  またはその一部は、必要に応じて、3 員 ~ 7 員環の部分形成し；

$T^3$  は、 $C_{1-6}$  アルキレン鎖であり、該  $C_{1-6}$  アルキレン鎖は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^{3b}$  で置換されており、ここで、該アルキレン鎖は、必要に応じて、 $-C(R^5)=C(R^5)-$ 、 $-C-C-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-$

$SO_2N(R^4)$  -、 $-N(R^4)$  -、 $-N(R^4)C(O)$  -、 $-NR^4C(O)N(R^4)$  -、 $-N(R^4)CO_2$  -、 $-C(O)N(R^4)$  -、 $-C(O)$  -、 $-C(O)-C(O)$  -、 $-CO_2$  -、 $-OC(O)$  -、 $-OC(O)O$  -、 $-OC(O)N(R^4)$  -、 $-N(R^4)-N(R^4)$  -、 $-N(R^4)SO_2$  -、または $-SO_2N(R^4)$  -で中断されており、ここで、 $T^3$  またはその一部は、必要に応じて、3員～7員環の部分を形成し；

Vは、 $-C(R^5) = C(R^5)$  -、 $-C$  -  $C$  -、 $-O$  -、 $-S$  -、 $-S(O)$  -、 $-S(O)_2$  -、 $-SO_2N(R^4)$  -、 $-N(R^4)$  -、 $-N(R^4)C(O)$  -、 $-NR^4C(O)N(R^4)$  -、 $-N(R^4)CO_2$  -、 $-C(O)N(R^4)$  -、 $-C(O)$  -、 $-C(O)-C(O)$  -、 $-CO_2$  -、 $-OC(O)$  -、 $-OC(O)O$  -、 $-OC(O)N(R^4)$  -、 $-C(NR^4) = N$  -、 $-C(OR^5) = N$  -、 $-N(R^4)-N(R^4)$  -、 $-N(R^4)-SO_2$  -、 $-N(R^4)SO_2N(R^4)$  -、 $-P(O)(R^5)$  -、 $-P(O)(OR^5)-O$  -、 $-P(O)-O$  -、または $-P(O)(NR^5)-N(R^5)$  -であり；

$R^{2d}$ は、 $-$ 八口、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(R^5) = C(R^5)_2$ 、 $-C(R^5) = C(R^5)(R^{10})$ 、 $-C$  -  $C$  -  $R^5$ 、 $-C$  -  $C$  -  $R^{10}$ 、 $-OR^5$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)R^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-SO_3R^5$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-NR^4C(O)R^5$ 、 $-NR^4C(O)N(R^4)_2$ 、 $-NR^4CO_2R^6$ 、 $-O-CO_2R^5$ 、 $-OC(O)N(R^4)_2$ 、 $-O-C(O)R^5$ 、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)-C(O)R^5$ 、 $-C(O)R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-C(O)N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)-C(O)R^5$ 、 $-C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)-OR^5$ 、 $-N(R^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)SO_2R^6$ 、 $-N(R^4)SO_2N(R^4)_2$ 、 $-P(O)(R^5)_2$ 、または $-P(O)(OR^5)_2$ であり；

各 $R^{7d}$ は、独立して、必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロシクリル基またはヘテロアリール基であり；

各 $R^{3b}$ は、独立して、 $C_{1-3}$ 脂肪族であり、該 $C_{1-3}$ 脂肪族は、必要に応じて、 $R^3$ または $R^7$ で置換されているか、または同じ炭素原子上の2個の置換基 $R^{3b}$ は、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、3員～6員炭素環式環を形成し；そして

各 $R^{10}$ は、独立して、 $-CO_2R^5$ または $-C(O)N(R^4)_2$ である、化合物。

【請求項50】

請求項1に記載の化合物と薬学的に受容可能なキャリアとを含有する、薬学的組成物。

【請求項51】

細胞におけるAuroraキナーゼ活性を阻害するための組成物であって、請求項1に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項52】

Auroraキナーゼ媒介障害の処置を必要とする患者においてAuroraキナーゼ媒介障害を処置するための組成物であって、治療有効量の請求項1に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項53】

前記Auroraキナーゼ媒介障害が、癌である、請求項52に記載の組成物。

【請求項54】

前記癌が、結腸直腸癌、卵巣癌、乳癌、胃癌、前立腺癌、および膵臓癌からなる群から選択される、請求項53に記載の組成物。

【請求項55】

前記癌が、乳癌、結腸直腸癌、および膵臓癌からなる群から選択される、請求項54に記載の組成物。

【手続補正2】

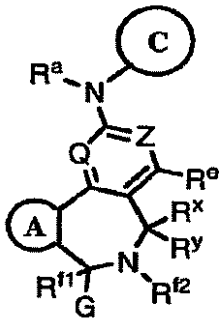
【補正対象書類名】明細書  
 【補正対象項目名】0006  
 【補正方法】変更  
 【補正の内容】  
 【0006】

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目1)

式(I)：

【化44】



(I)

の化合物、またはそれらの薬学的に受容可能な塩であって、式(I)において、

$R^{f1}$  は、水素であるか、または  $R^{f1}$  および  $R^{f2}$  は、一緒になって、結合を形成し

；  
 $R^{f2}$  は、水素であるか、または  $R^{f2}$  は、 $R^{f1}$  もしくは  $R^x$  のいずれかと共に、結合を形成し；

$R^x$  および  $R^y$  の各々は、独立して、水素、フルオロ、もしくは必要に応じて置換された  $C_{1-6}$  脂肪族であるか；または  $R^x$  および  $R^y$  は、それらが結合する炭素原子と一緒に、必要に応じて置換された 3員～6員脂環式環を形成するか；または  $R^x$  および  $R^{f2}$  は、一緒になって、結合を形成し；

G は、 $R^{f1}$  が水素であるとき、水素、必要に応じて置換された脂肪族または環 B であり；そして G は、 $R^{f1}$  および  $R^{f2}$  が一緒になって結合を形成するとき、水素、 $-OR^5$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-SR^5$ 、必要に応じて置換された脂肪族、または環 B であり；

環 A は、置換または非置換の 5員または 6員のアリール環、ヘテロアリール環、脂環式環またはヘテロシクリル環であり；

環 B は、置換または非置換のアリール環、ヘテロアリール環、ヘテロシクリル環または脂環式環であり；

環 C は、置換または非置換のアリール環、ヘテロアリール環、ヘテロシクリル環または脂環式環であり；

$R^a$  は、水素、 $-C(O)R^1$ 、 $-CO_2R^1$ 、 $-SO_2R^1$ 、または  $C_{1-3}$  脂肪族であり、該  $C_{1-3}$  脂肪族は、0個～2個の置換基を有し、該置換基は、独立して、 $R^3$  または  $R^7$  から選択され；

$R^e$  は、水素、 $-OR^5$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-SR^5$ 、 $-NR^4C(O)R^5$ 、 $-NR^4C(O)N(R^4)_2$ 、 $-NR^4CO_2R^6$ 、 $-N(R^4)SO_2R^6$ 、 $-N(R^4)SO_2N(R^4)_2$ 、または  $C_{1-3}$  脂肪族であり、該  $C_{1-3}$  脂肪族は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^7$  で置換されており；

$R^1$  は、 $C_{1-6}$  脂肪族、あるいは必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロアリール基またはヘテロシクリル基であり；

各  $R^3$  は、独立して、 $-H$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_{1-3}$  アルキル)、 $-CN$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-C(O)(C_{1-3}$  アルキル)、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_{1-3}$  アルキル)、 $-C(O)NH_2$ 、および  $-C(O)NH(C_{1-3}$  アルキル) からなる群より選択さ

れ；

各  $R^4$  は、独立して、水素または必要に応じて置換された脂肪族基、アリール基、ヘテロアリール基もしくはヘテロシクリル基であるか；あるいは同じ窒素原子上の 2 個の  $R^4$  は、該窒素原子と一緒に、必要に応じて置換された 5 員～6 員ヘテロアリール環または 4 員～8 員ヘテロシクリル環を形成し、該環は、該窒素原子に加えて、0 個～2 個の環ヘテロ原子を有し、該環ヘテロ原子は、N、O および S から選択され；

各  $R^5$  は、独立して、水素、あるいは必要に応じて置換された脂肪族基、アリール基、ヘテロアリール基またはヘテロシクリル基であり；

各  $R^6$  は、独立して、必要に応じて置換された脂肪族基またはアリール基であり；そして

各  $R^7$  は、独立して、必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロシクリル基またはヘテロアリール基である、

化合物。

(項目 2)

項目 1 に記載の化合物であって、

$R^x$  および  $R^y$  の各々は、独立して、水素、フルオロ、もしくは  $C_{1-6}$  脂肪族から選択され、該  $C_{1-6}$  脂肪族は、必要に応じて、1 個もしくは 2 個の  $R^3$  で置換されているか；または  $R^x$  および  $R^y$  は、それらが結合する炭素原子と一緒に、必要に応じて置換された 3 員～6 員脂環式環を形成し；

$R^e$  は、水素、-OH、-NHR<sup>4</sup>、-SH、または  $C_{1-3}$  脂肪族であり、該  $C_{1-3}$  脂肪族は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^7$  で置換されており；

$R^{f1}$  および  $R^{f2}$  は、一緒に、結合を形成し；

G は、-H、-OH、-NH<sub>2</sub>、-O( $C_{1-3}$ アルキル)、-NH( $C_{1-3}$ アルキル)、-N( $C_{1-3}$ アルキル)<sub>2</sub>、 $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{1-3}$ フルオロアルキル、-O-L<sup>1</sup>-R<sup>7</sup>、-N( $C_{1-3}$ アルキル)-L<sup>1</sup>-R<sup>7</sup>、または -L<sup>1</sup>-R<sup>7</sup> であり；

そして

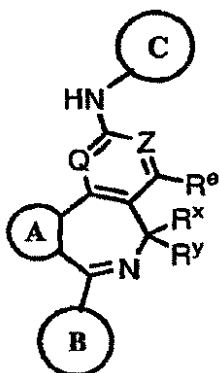
L<sup>1</sup> は、共有結合または  $C_{1-3}$  アルキレンである、

化合物。

(項目 3)

式 (II)：

【化 45】



(II)

またはそれらの薬学的に受容可能な塩を有する、項目 1 に記載の化合物。

(項目 4)

環 A が、フラノ、ジヒドロフラノ、チエノ、ジヒドロチエノ、シクロペンテノ、シクロヘキセノ、2H-ピロロ、ピロロ、ピロリノ、ピロリジノ、オキサゾロ、チアゾロ、イミダゾロ、イミダゾリノ、イミダゾリジノ、ピラゾロ、ピラゾリノ、ピラゾリジノ、イソオキサゾロ、イソチアゾロ、オキサジアゾロ、トリアゾロ、チアジアゾロ、2H-ピラノ、4H-ピラノ、ベンゾ、ピリジノ、ピペリジノ、ジオキサノ、モルホリノ、ジチアノ、チオ

モルホリノ、ピリダジノ、ピリミジノ、ピラジノ、ピペラジノおよびトリアジノからなる群より選択される置換環または非置換環である、項目3に記載の化合物。

(項目5)

環Aが、フラノ、チエノ、ピロロ、オキサゾロ、チアゾロ、イミダゾロ、ピラゾロ、イソオキサゾロ、イソチアゾロ、トリアゾロ、ベンゾ、ピリジノ、ピリダジノ、ピリミジノおよびピラジノからなる群より選択される置換環または非置換環である、項目4に記載の化合物。

(項目6)

項目5に記載の化合物であって、

環A内の各置換可能な飽和環炭素原子は、非置換であるか、または $=O$ 、 $=S$ 、 $=C(R^5)_2$ 、 $=N-N(R^4)_2$ 、 $=N-OR^5$ 、 $=N-NHC(O)R^5$ 、 $=N-NHCOR^6$ 、 $=N-NHSO_2R^6$ 、 $=N-R^5$ もしくは $-R^b$ で置換されており；

環A内の各置換可能な不飽和環炭素原子は、非置換であるか、または $-R^b$ で置換されており；

環A内の置換可能な窒素原子は、非置換であるか、または $-R^9$ で置換されており；

環A内の1個の窒素原子は、必要に応じて、酸化されており；

各 $R^b$ は、独立して、 $-H$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(R^5)=C(R^5)_2$ 、 $-C(R^5)=C(R^5)(R^{10})$ 、 $-C-C-R^5$ 、 $-C-C-R^{10}$ 、 $-OR^5$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)R^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-NR^4C(O)R^5$ 、 $-NR^4C(O)N(R^4)_2$ 、 $-NR^4CO_2R^6$ 、 $-O-CO_2R^5$ 、 $-OC(O)N(R^4)_2$ 、 $-O-C(O)R^5$ 、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)-C(O)R^5$ 、 $-C(O)R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)-OR^5$ 、 $-N(R^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)SO_2R^6$ 、 $-N(R^4)SO_2N(R^4)_2$ 、 $-P(O)(R^5)_2$ 、 $-P(O)(OR^5)_2$ 、必要に応じて置換された脂肪族、または必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロシクリル基もしくはヘテロアリール基であり；あるいは2個の隣接する $R^b$ は、介在する環原子と一緒に、必要に応じて置換された縮合4員～8員芳香族環または非芳香族環を形成し、該芳香族環は、0個～3個の環ヘテロ原子を有し、該環ヘテロ原子は、 $O$ 、 $N$ および $S$ からなる群より選択され；

各 $R^3$ は、独立して、 $-H$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_{1-3}アルキル)$ 、 $-CN$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-C(O)(C_{1-3}アルキル)$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_{1-3}アルキル)$ 、 $-C(O)NH_2$ 、および $-C(O)NH(C_{1-3}アルキル)$ からなる群より選択され；

各 $R^4$ は、独立して、水素、あるいは、必要に応じて置換された脂肪族基、アリール基、ヘテロアリール基またはヘテロシクリル基であるか；または同じ窒素原子上の2個の $R^4$ は、該窒素原子と一緒に、必要に応じて置換された5員～6員ヘテロアリールまたは4員～8員ヘテロシクリルを形成し、該ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは、該窒素原子に加えて、0個～2個の環ヘテロ原子を有し、該環ヘテロ原子は、 $N$ 、 $O$ および $S$ から選択され；

各 $R^5$ は、独立して、水素、あるいは必要に応じて置換された脂肪族基、アリール基、ヘテロアリール基またはヘテロシクリル基であり；

各 $R^6$ は、独立して、必要に応じて置換された脂肪族基またはアリール基であり；

各 $R^7$ は、独立して、必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロシクリル基またはヘテロアリール基であり；

各 $R^9$ は、独立して、 $-C(O)R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-CO_2R^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、または $C_{1-4}$ 脂肪族であり、該 $C_{1-4}$ 脂肪族は、必要に応じて、 $R^3$ または $R^7$ で置換されており；そして

各 $R^{10}$ は、独立して、 $-CO_2R^5$ または $-C(O)N(R^4)_2$ である、化合物。

## (項目7)

項目6に記載の化合物であって、

各  $R^b$  は、独立して、 $C_{1-6}$  脂肪族、 $C_{1-6}$  フルオロ脂肪族、 $-R^{2b}$ 、 $-R^{7b}$ 、 $-T^1-R^{2b}$ 、および  $-T^1-R^{7b}$  からなる群より選択されるか；または2個の隣接する  $R^b$  は、介在する環原子と一緒にあって、必要に応じて置換された縮合4員～8員芳香族環または非芳香族環を形成し、該環は、0個～3個の環ヘテロ原子を有し、該環ヘテロ原子は、O、NおよびSからなる群より選択され；

$T^1$  は、 $C_{1-6}$  アルキレン鎖であり、該  $C_{1-6}$  アルキレン鎖は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^{3b}$  で置換されており、ここで、 $T^1$  またはその一部は、必要に応じて、3員～7員環の部分形成し；

各  $R^{3b}$  は、独立して、 $C_{1-3}$  脂肪族であり、該  $C_{1-3}$  脂肪族は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^7$  で置換されているか、または同じ炭素原子上の2個の置換基  $R^{3b}$  は、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、3員～6員炭素環式環を形成し；

各  $R^{2b}$  は、独立して、 $-H$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(R^5)=C(R^5)_2$ 、 $-C(R^5)=C(R^5)(R^{10})$ 、 $-C-C-R^5$ 、 $-C-C-R^{10}$ 、 $-OR^5$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)R^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-NR^4C(O)R^5$ 、 $-NR^4C(O)N(R^4)_2$ 、 $-NR^4CO_2R^6$ 、 $-O-CO_2R^5$ 、 $-OC(O)N(R^4)_2$ 、 $-O-C(O)R^5$ 、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)-C(O)R^5$ 、 $-C(O)R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)-OR^5$ 、 $-N(R^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)SO_2R^6$ 、 $-N(R^4)SO_2N(R^4)_2$ 、 $-P(O)(R^5)_2$ 、または  $-P(O)(OR^5)_2$  であり；そして

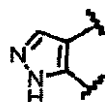
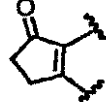
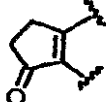
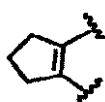
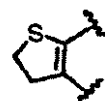
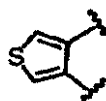
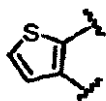
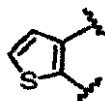
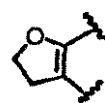
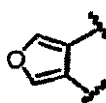
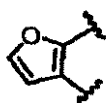
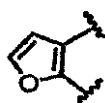
各  $R^{7b}$  は、独立して、必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロアリール基またはヘテロシクリル基である、

化合物。

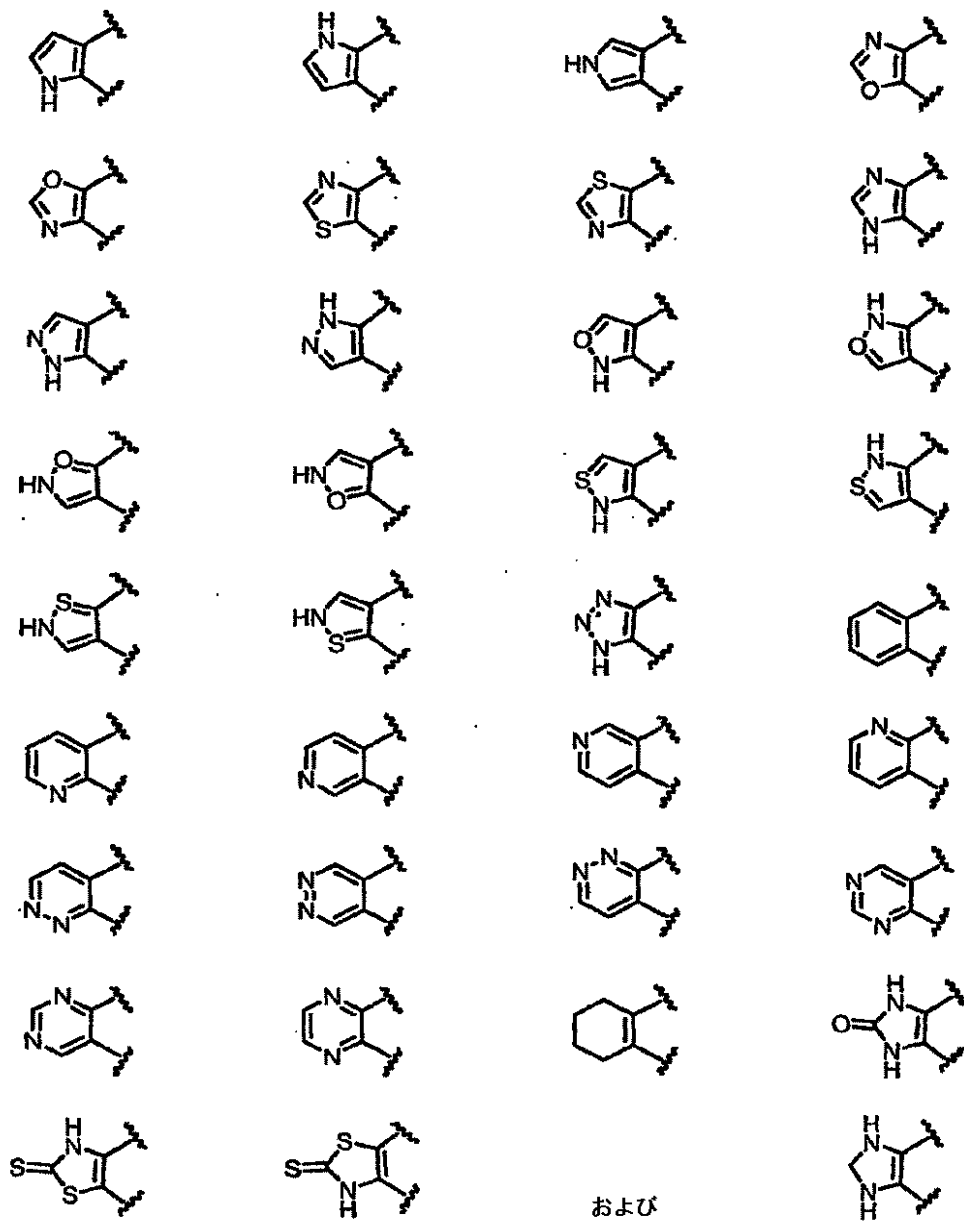
## (項目8)

環Aが、

【化46】



【化 4 7】



からなる群より選択され、これらの基のいずれかは、必要に応じて、任意の置換可能な環炭素原子および任意の置換可能な環窒素原子上で、置換されている、項目 7 に記載の化合物。

( 項目 9 )

環 A が、



環 B 内の各置換可能な環窒素原子は、非置換であるか、または  $R^{9c}$  で置換されており

;

各  $R^c$  は、独立して、 $C_{1-6}$  脂肪族、 $R^{2c}$ 、 $R^{7c}$ 、 $-T^1-R^{2c}$ 、および  $-T^1-R^{7c}$  からなる群より選択され;

$T^1$  は、 $C_{1-6}$  アルキレン鎖であり、該  $C_{1-6}$  アルキレン鎖は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^{3b}$  で置換されており、ここで、 $T^1$  またはその一部は、必要に応じて、3員~7員環の部分形成し;

$R^{2c}$  は、 $-$  八口、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(R^5)=C(R^5)_2$ 、 $-C(R^5)=C(R^5)(R^{10})$ 、 $-C-C-R^5$ 、 $-C-C-R^{10}$ 、 $-OR^5$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)R^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-NR^4C(O)R^5$ 、 $-NR^4C(O)N(R^4)_2$ 、 $-NR^4CO_2R^6$ 、 $-O-CO_2R^5$ 、 $-OC(O)N(R^4)_2$ 、 $-O-C(O)R^5$ 、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)-C(O)R^5$ 、 $-C(O)R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)-OR^5$ 、 $-N(R^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)SO_2R^6$ 、 $-N(R^4)SO_2N(R^4)_2$ 、 $-P(O)(R^5)_2$ 、または  $-P(O)(OR^5)_2$  であり;

各  $R^{7c}$  は、独立して、必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロシクリル基またはヘテロアリール基であり;

各  $R^{9c}$  は、独立して、 $-C(O)R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-CO_2R^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、または  $C_{1-4}$  脂肪族であり、該  $C_{1-4}$  脂肪族は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^7$  で置換されており;そして

環 C は、単環式または二環式のアリール環、ヘテロアリール環、ヘテロシクリル環または脂環式環であり;

環 C 内の各置換可能な飽和環炭素原子は、非置換であるか、または  $=O$ 、 $=S$ 、 $=C(R^5)_2$  または  $R^d$  で置換されており;

環 C 内の各置換可能な不飽和環炭素原子は、非置換であるか、または  $R^d$  で置換されており;

環 C 内の各置換可能な環窒素原子は、非置換であるか、または  $R^{9d}$  で置換されており

;

各  $R^d$  は、独立して、 $C_{1-6}$  脂肪族、 $R^{2d}$ 、 $R^{7d}$ 、 $-T^2-R^{2d}$ 、 $-T^2-R^{7d}$ 、 $-V-T^3-R^{2d}$ 、および  $-V-T^3-R^{7d}$  からなる群より選択され;

$T^2$  は、 $C_{1-6}$  アルキレン鎖であり、該  $C_{1-6}$  アルキレン鎖は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^{3b}$  で置換されており、ここで、該アルキレン鎖は、必要に応じて、 $-C(R^5)=C(R^5)-$ 、 $-C-C-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-SO_2N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)C(O)-$ 、 $-NR^4C(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)CO_2-$ 、 $-C(O)N(R^4)-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OC(O)-$ 、 $-OC(O)O-$ 、 $-OC(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)-N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)SO_2-$ 、または  $-SO_2N(R^4)-$  で中断されており、ここで、 $T^2$  またはその一部は、必要に応じて、3員~7員環の部分形成し;

$T^3$  は、 $C_{1-6}$  アルキレン鎖であり、該  $C_{1-6}$  アルキレン鎖は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^{3b}$  で置換されており、ここで、該アルキレン鎖は、必要に応じて、 $-C(R^5)=C(R^5)-$ 、 $-C-C-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-SO_2N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)C(O)-$ 、 $-NR^4C(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)CO_2-$ 、 $-C(O)N(R^4)-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OC(O)-$ 、 $-OC(O)O-$ 、 $-OC(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)-N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)SO_2-$ 、または  $-SO_2N(R^4)-$  で中断されており、ここで、 $T^3$  またはその一部は、必要に応じて、3員~7員環の部分形成し;

$V$  は、 $-C(R^5)=C(R^5)-$ 、 $-C-C-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-$

S(O)<sub>2</sub> -、 -SO<sub>2</sub>N(R<sup>4</sup>) -、 -N(R<sup>4</sup>) -、 -N(R<sup>4</sup>)C(O) -、 -NR<sup>4</sup>C(O)N(R<sup>4</sup>) -、 -N(R<sup>4</sup>)CO<sub>2</sub> -、 -C(O)N(R<sup>4</sup>) -、 -C(O) -、 -C(O) - C(O) -、 -CO<sub>2</sub> -、 -OC(O) -、 -OC(O)O -、 -OC(O)N(R<sup>4</sup>) -、 -C(NR<sup>4</sup>) = N -、 -C(OR<sup>5</sup>) = N -、 -N(R<sup>4</sup>) - N(R<sup>4</sup>) -、 -N(R<sup>4</sup>) - SO<sub>2</sub> -、 -N(R<sup>4</sup>)SO<sub>2</sub>N(R<sup>4</sup>) -、 -P(O)(R<sup>5</sup>) -、 -P(O)(OR<sup>5</sup>) - O -、 -P(O) - O -、または -P(O)(NR<sup>5</sup>) - N(R<sup>5</sup>) -であり；

R<sup>2d</sup>は、 -H、 -NO<sub>2</sub>、 -CN、 -C(R<sup>5</sup>) = C(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 -C(R<sup>5</sup>) = C(R<sup>5</sup>)(R<sup>10</sup>)、 -C - C - R<sup>5</sup>、 -C - C - R<sup>10</sup>、 -OR<sup>5</sup>、 -SR<sup>6</sup>、 -S(O)R<sup>6</sup>、 -SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、 -SO<sub>3</sub>R<sup>5</sup>、 -SO<sub>2</sub>N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、 -N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、 -NR<sup>4</sup>C(O)R<sup>5</sup>、 -NR<sup>4</sup>C(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、 -NR<sup>4</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、 -O - CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、 -OC(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、 -O - C(O)R<sup>5</sup>、 -CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、 -C(O) - C(O)R<sup>5</sup>、 -C(O)R<sup>5</sup>、 -C(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、 -C(O)N(R<sup>4</sup>)C(=NR<sup>4</sup>) - N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、 -N(R<sup>4</sup>)C(=NR<sup>4</sup>) - N(R<sup>4</sup>) - C(O)R<sup>5</sup>、 -C(=NR<sup>4</sup>) - N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、 -C(=NR<sup>4</sup>) - OR<sup>5</sup>、 -N(R<sup>4</sup>) - N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、 -N(R<sup>4</sup>)C(=NR<sup>4</sup>) - N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、 -N(R<sup>4</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、 -N(R<sup>4</sup>)SO<sub>2</sub>N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、 -P(O)(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、または -P(O)(OR<sup>5</sup>)<sub>2</sub>であり；

各R<sup>7d</sup>は、独立して、必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロシクリル基またはヘテロアリール基であり；そして

各R<sup>9d</sup>は、独立して、 -C(O)R<sup>5</sup>、 -C(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、 -CO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、 -SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、 -SO<sub>2</sub>N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、またはC<sub>1-4</sub>脂肪族であり、該C<sub>1-4</sub>脂肪族は、必要に応じて、R<sup>3</sup>またはR<sup>7</sup>で置換されている、

化合物。

(項目12)

環Bが、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、チアジアゾリル、フェニル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、トリアジニル、インドリジニル、インドリル、イソインドリル、インダゾリル、ベンゾ[b]フラニル、ベンゾ[b]チエニル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、プリニル、キノリル、イソキノリル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、およびプテリジニルからなる群より選択される置換または非置換の単環式または二環式のアリール環またはヘテロアリール環である、項目11に記載の化合物。

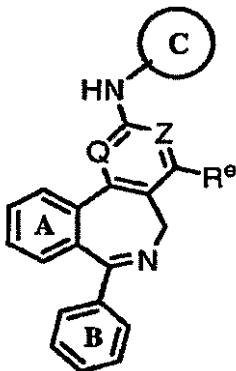
(項目13)

環Bが、置換または非置換のフェニル環またはピリジル環である、項目12に記載の化合物。

(項目14)

式(IV)：

【化50】



(IV)

を有し、式 (IV) において、

環 A は、0 個 ~ 2 個の独立して選択された  $R^b$  で置換されており；そして

環 B は、0 個 ~ 2 個の独立して選択された  $R^c$  で置換されている、項目 13 に記載の化合物。

(項目 15)

以下の特徴：

(a) 各  $R^b$  は、独立して、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $R^{2b}$ 、 $R^{7b}$ 、 $-T^1-R^{2b}$ 、および  $-T^1-R^{7b}$  からなる群より選択され、ここで、 $T^1$  は、 $C_{1-3}$  アルキレン鎖であり、該  $C_{1-3}$  アルキレン鎖は、必要に応じて、フルオロで置換されており、そして各  $R^{2b}$  は、独立して、 $-H$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(R^5)=C(R^5)_2$ 、 $-C-C-R^5$ 、 $-C-C-R^5$ 、 $-OR^5$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-CO_2R^5$ 、および  $-C(O)N(R^4)$  からなる群より選択されること；

(b) 各  $R^c$  は、独立して、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $R^{2c}$ 、 $R^{7c}$ 、 $-T^1-R^{2c}$ 、および  $-T^1-R^{7c}$  からなる群より選択され、ここで、 $T^1$  は、 $C_{1-3}$  アルキレン鎖であり、該  $C_{1-3}$  アルキレン鎖は、必要に応じて、フルオロで置換されており、そして各  $R^{2c}$  は、独立して、 $-H$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(R^5)=C(R^5)_2$ 、 $-C-C-R^5$ 、 $-OR^5$ 、および  $-N(R^4)_2$  からなる群より選択されること；ならびに

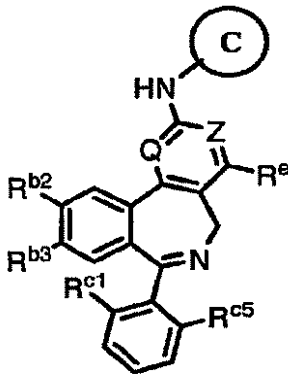
(c)  $R^e$  は、水素であること、

の少なくとも 1 つにより特徴付けられる、項目 14 に記載の化合物。

(項目 16)

式 (V)：

【化 51】



(V)

を有し、式 (V) において、

$R^{b2}$  および  $R^{b3}$  の各々は、独立して、水素または  $R^b$  であり；

$R^b$  は、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $C_{1-3}$  フルオロ脂肪族、および  $R^{2b}$  からなる群より選択され；

$R^{2b}$  は、 $-H$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(R^5)=C(R^5)_2$ 、 $-C-C-R^5$ 、 $-OR^5$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$  からなる群より選択され；

$R^{c1}$  および  $R^{c5}$  の各々は、独立して、水素または  $R^c$  であり；

$R^c$  は、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $C_{1-3}$  フルオロ脂肪族、および  $R^{2c}$  からなる群より選択され；そして

$R^{2c}$  は、 $-H$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(R^5)=C(R^5)_2$ 、 $-C-C-R^5$ 、 $-OR^5$ 、および  $-N(R^4)_2$  からなる群より選択される、

項目 15 に記載の化合物。

(項目 17)

項目 16 に記載の化合物であって、

$R^e$  は、水素であり；

$R^{b2}$  および  $R^{b3}$  の各々は、独立して、水素、-ハロ、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $C_{1-3}$  フルオロ脂肪族、および  $-OR^5$  からなる群より選択され、ここで、 $R^5$  は、水素または  $C_{1-3}$  脂肪族であり；そして

$R^{c1}$  および  $R^{c5}$  の各々は、独立して、水素、-ハロ、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $C_{1-3}$  フルオロ脂肪族、および  $-OR^5$  からなる群より選択され、ここで、 $R^5$  は、水素または  $C_{1-3}$  脂肪族である、

化合物。

(項目18)

$R^{b3}$  および  $R^{c1}$  の各々が、独立して、-ハロ、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $C_{1-3}$  フルオロ脂肪族、および  $-OR^5$  からなる群より選択され、ここで、 $R^5$  が、水素または  $C_{1-3}$  脂肪族である、項目17に記載の化合物。

(項目19)

$R^{b3}$  および  $R^{c1}$  の各々が、独立して、クロロ、フルオロ、プロモ、メチル、トリフルオロメチル、またはメトキシである、項目18に記載の化合物。

(項目20)

項目10に記載の化合物であって、ここで：

環Cは、単環式または二環式のアリール環、ヘテロアリール環、ヘテロシクリル環または炭素環式環であり、該環は、0個～2個の独立して選択された置換基  $R^d$  と、0個～2個の独立して選択された  $R^{2d}$  または  $C_{1-6}$  脂肪族基とで置換されており；

各  $R^d$  は、独立して、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $R^{2d}$ 、 $R^{7d}$ 、 $-T^2-R^{2d}$ 、 $-T^2-R^{7d}$ 、 $-V-T^3-R^{2d}$ 、および  $-V-T^3-R^{7d}$  からなる群より選択され；

Vは、 $-C(R^5)=C(R^5)-$ 、 $-C-C-$ 、 $-O-$ 、 $-N(R^4)-$ 、 $-C(O)-$  または  $-C(O)N(R^4)-$  であり；

$T^2$  は、 $C_{1-6}$  アルキレン鎖であり、ここで、 $T^2$  は、必要に応じて、1個または2個の置換基で置換されており、該置換基は、独立して、-ハロ、 $-C_{1-3}$  脂肪族、 $-OH$ 、および  $-O(C_{1-3}$  アルキル) からなる群より選択されるか、または同じ炭素原子上の2個の置換基は、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、3員～6員炭素環式環を形成し、ここで、 $T^2$  は、必要に応じて、 $-C(R^5)=C(R^5)-$ 、 $-C-C-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)C(O)-$  または  $-N(R^4)-$  で中断されており；そして

$T^3$  は、 $C_{1-4}$  アルキレン鎖であり、ここで、 $T^3$  は、必要に応じて、1個または2個の置換基で置換されており、該置換基は、独立して、-ハロ、 $-C_{1-3}$  脂肪族、 $-OH$ 、および  $-O(C_{1-3}$  アルキル) からなる群より選択されるか、または同じ炭素原子上の2個の置換基は、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、3員～6員炭素環式環を形成し、ここで、 $T^3$  は、必要に応じて、 $-C(R^5)=C(R^5)-$ 、 $-C-C-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)C(O)-$  または  $-N(R^4)-$  で中断されており；

$R^{2d}$  は、 $-ハロ$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(R^5)=C(R^5)_2$ 、 $-C-C-R^5$ 、 $-OR^5$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)R^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-SO_3R^5$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-NR^4C(O)R^5$ 、 $-NR^4C(O)N(R^4)_2$ 、 $-NR^4CO_2R^6$ 、 $-O-CO_2R^5$ 、 $-OC(O)N(R^4)_2$ 、 $-O-C(O)R^5$ 、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)-C(O)R^5$ 、 $-C(O)R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-C(O)N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)-C(O)R^5$ 、 $-C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)-OR^5$ 、 $-N(R^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)SO_2R^6$ 、 $-N(R^4)SO_2N(R^4)_2$ 、 $-P(O)(R^5)_2$ 、 $-P(O)(OR^5)_2$  であり；そして

各  $R^{7d}$  は、独立して、必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロシクリル基またはヘテロアリール基である、

化合物。

## (項目 2 1)

環 C が、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、チアゾリル、オキサゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、およびフタルイミジルからなる群より選択される置換環または非置換環である、項目 2 0 に記載の化合物。

## (項目 2 2)

項目 2 1 に記載の化合物であって、

各  $R^d$  は、独立して、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $R^{2d}$ 、 $R^{7d}$ 、 $-T^2-R^{2d}$ 、 $-T^2-R^{7d}$ 、 $-V-T^3-R^{2d}$ 、および  $-V-T^3-R^{7d}$  からなる群より選択され；そして

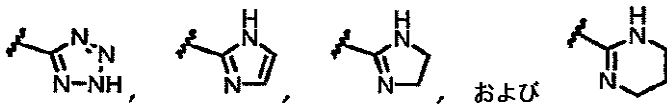
各  $R^{2d}$  は、独立して、 $-$  八口、 $-OR^5$ 、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)N(R^4)_2$ 、 $-C(O)N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)-C(O)R^5$ 、および  $-NR^4C(O)R^5$  からなる群より選択される、

化合物。

## (項目 2 3)

環 C が、少なくとも 1 個の  $R^{7d}$  で置換されており、 $R^{7d}$  が、

【化 5 2】



からなる群より選択され、これらの基のいずれかは、必要に応じて、任意の置換可能な環炭素および環窒素原子上で、置換されている、項目 2 2 に記載の化合物。

## (項目 2 4)

環 C が、少なくとも 1 個の  $-T^2-R^{2d}$  または  $-T^2-R^{7d}$  で置換されている、項目 2 2 に記載の化合物であって、

$T^2$  は、 $C_{1-6}$  アルキレン鎖であり、ここで、 $T^2$  は、必要に応じて、1 個または 2 個の置換基  $R^{3b}$  で置換されており、該置換基  $R^{3b}$  は、独立して、 $-$  八口、 $-C_{1-3}$  脂肪族、 $-OH$ 、および  $-O(C_{1-3}$  脂肪族) からなる群より選択されるか、または同じ炭素原子上の 2 個の置換基  $R^{3b}$  は、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、3 員 ~ 6 員炭素環式環を形成し、ここで、 $T^2$  は、必要に応じて、 $-C(R^5)=C(R^5)-$ 、 $-C-C-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-N(R^4)C(O)R^5-$ 、 $-N(R^4)C(O)-$  または  $-N(R^4)-$  で中断されており；そして

$R^{2d}$  は、 $-$  八口、 $-OR^5$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(O)-$ 、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、 $-C(O)N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、および  $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)-C(O)R^5$  からなる群より選択される、

化合物。

## (項目 2 5)

環 C が、1 個の  $-T^2-R^{2d}$  または  $-T^2-R^{7d}$  と、必要に応じて、1 個の他の置換基とで置換されており、該他の置換基が、水素、 $-$  八口、 $C_{1-3}$  脂肪族、および  $-OR^5$  からなる群より選択され、ここで、 $R^5$  が、水素または  $C_{1-3}$  脂肪族である、項目 2 4 に記載の化合物。

## (項目 2 6)

環 C が、少なくとも 1 個の  $-V-T^3-R^{2d}$  または  $-V-T^3-R^{7d}$  で置換されている、項目 2 2 に記載の化合物であって、

$V$  は、 $-N(R^4)-$ 、 $-O-$ 、 $-C(O)N(R^4)-$ 、 $-C(O)-$ 、または  $-C-C-$  であり；

$T^3$  は、 $C_{1-4}$  アルキレン鎖であり、該  $C_{1-4}$  アルキレン鎖は、必要に応じて、1

個または2個の置換基  $R^{3b}$  で置換されており、該置換基  $R^{3b}$  は、独立して、- 八口、  
 $-C_{1-3}$  脂肪族、- OH、および  $-O(C_{1-3}$  脂肪族) からなる群より選択されるか  
 、または同じ炭素原子上の2個の置換基  $R^{3b}$  は、それらが結合する炭素原子と一緒にな  
 って、3員~6員炭素環式環を形成し；そして

$R^{2d}$  は、- 八口、-  $OR^5$ 、-  $N(R^4)_2$ 、-  $NR^4C(O)R^5$ 、-  $CO_2R^5$   
 、-  $C(O)N(R^4)_2$ 、および  $-SO_2N(R^4)_2$  からなる群より選択される、  
 化合物。

(項目27)

環Cが、1個の  $-V-T^3-R^{2d}$  または  $-V-T^3-R^{7d}$  と、必要に応じて、1個の  
 他の置換基とで置換されており、該他の置換基が、水素、- 八口、 $C_{1-3}$  脂肪族、およ  
 び  $-OR^5$  からなる群より選択され、ここで、 $R^5$  が、水素または  $C_{1-3}$  脂肪族である  
 、項目26に記載の化合物。

(項目28)

項目27に記載の化合物であって、

Vは、 $-C(O)N(R^4)-$  であり；

$T^3$  は、 $C_{2-4}$  アルキレン鎖であり；

$R^{2d}$  は、 $-N(R^4)_2$  であり、ここで、各  $R^4$  は、独立して、水素または  $C_{1-3}$   
 脂肪族であるか、または  $-N(R^4)_2$  は、必要に応じて置換された5員~6員ヘテロア  
 リール環または4員~8員ヘテロシクリル環であり、該環は、該窒素に加えて、0個~2  
 個の環ヘテロ原子を有し、該環ヘテロ原子は、N、OおよびSから選択され；そして

$R^{7d}$  は、必要に応じて置換された4員~8員ヘテロシクリルまたは必要に応じて置換  
 された5員~6員ヘテロアリアルである、  
 化合物。

(項目29)

項目28に記載の化合物であって、ここで：

$R^{2d}$  は、 $-N(R^4)_2$  であり、そして  $-N(R^4)_2$  は、必要に応じて置換された  
 ヘテロシクリルであり、該ヘテロシクリルは、ペリジニル、ペラジニル、モルホリニ  
 ル、ピロリジニルおよびアゼチジニルからなる群より選択され；そして

$R^{7d}$  は、必要に応じて置換されたヘテロアリアルであり、該ヘテロアリアルは、ピリ  
 ジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピロリル、オキサゾリル、イミダゾリ  
 ルおよびピラゾリルからなる群より選択される、  
 化合物。

(項目30)

環Cが、1個または2個の置換基で置換されており、該置換基が、独立して、 $C_{1-3}$  脂  
 肪族、- 八口、-  $OR^5$ 、-  $CO_2R^5$ 、-  $C(O)N(R^4)_2$ 、-  $SO_2N(R^4)$   
 $_2$ 、-  $C(=NR^4)N(R^4)_2$ 、-  $C(O)N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)$   
 $_2$ 、-  $N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)-C(O)R^5$ 、および  $-NR^4C(O)$   
 $R^5$  からなる群より選択される、項目22に記載の化合物。

(項目31)

環Cが、少なくとも1個の置換基で置換されており、該置換基が、-  $CO_2R^5$ 、-  $C(O)$   
 $N(R^4)_2$ 、-  $C(=NR^4)N(R^4)_2$ 、-  $C(O)N(R^4)C(=NR^4)$   
 $-N(R^4)_2$ 、-  $N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)-C(O)R^5$ 、および  
 $-NR^4C(O)R^5$  からなる群より選択される、項目30に記載の化合物。

(項目32)

環Cが、少なくとも1個の  $-CO_2R^5$  で置換されており、ここで、 $R^5$  が、水素または  
 $C_{1-6}$  脂肪族である、項目30に記載の化合物。

(項目33)

項目30に記載の化合物であって、

環Cは、少なくとも1個の  $-C(O)-N(R^4)_2$ 、-  $C(=NR^4)N(R^4)_2$   
 、または  $-NR^4C(O)R^5$  で置換されており；

ここで、

- N ( R <sup>4</sup> ) <sub>2</sub> は、必要に応じて置換された 4 員 ~ 8 員ヘテロシクリル環であり、該環は、該窒素原子に加えて、0 個 ~ 2 個の環ヘテロ原子を有し、該環ヘテロ原子は、N、O および S から選択され；そして

R <sup>5</sup> は、4 員 ~ 8 員窒素含有ヘテロシクリル環である、化合物。

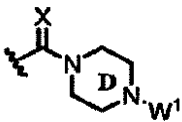
( 項目 3 4 )

環 C が、少なくとも 1 個の - C ( O ) N ( R <sup>4</sup> ) <sub>2</sub> または - C ( = N R <sup>4</sup> ) N ( R <sup>4</sup> ) <sub>2</sub> で置換されており、そして - N ( R <sup>4</sup> ) <sub>2</sub> が、必要に応じて置換されたヘテロシクリルであり、該ヘテロシクリルが、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ピロリジニルおよびアゼチジニルからなる群より選択される、項目 3 3 に記載の化合物。

( 項目 3 5 )

環 C が、次式：

【化 5 3】



を有する少なくとも 1 個の置換基で置換されており、

環 D は、必要に応じて、1 個または 2 個の環炭素原子上で置換されており；

X は、O または NH であり；

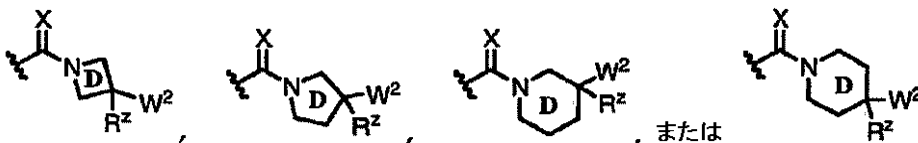
W <sup>1</sup> は、水素、- C ( O ) R <sup>5</sup>、- C ( O ) N ( R <sup>4</sup> ) <sub>2</sub>、- C O <sub>2</sub> R <sup>6</sup>、- S O <sub>2</sub> R <sup>6</sup>、- S O <sub>2</sub> N ( R <sup>4</sup> ) <sub>2</sub>、あるいは必要に応じて置換された脂肪族基、アリール基、ヘテロアリール基またはヘテロシクリル基である、

項目 3 4 に記載の化合物。

( 項目 3 6 )

環 C が、次式：

【化 5 4】



を有する少なくとも 1 個の置換基で置換されており、

環 D は、必要に応じて、1 個または 2 個の置換可能な環炭素原子上で置換されており；

X は、O または NH であり；

W <sup>2</sup> は、R <sup>n</sup> または - T <sup>6</sup> - R <sup>n</sup> であり；

T <sup>6</sup> は、C <sub>1</sub> ~ <sub>3</sub> アルキレン鎖であり、該 C <sub>1</sub> ~ <sub>3</sub> アルキレン鎖は、必要に応じて、R <sup>3</sup> または R <sup>3 b</sup> で置換されており；そして

R <sup>n</sup> は、- N ( R <sup>4</sup> ) <sub>2</sub> または - C ( O ) N ( R <sup>4</sup> ) <sub>2</sub> であり；そして

R <sup>2</sup> は、水素、- C O <sub>2</sub> R <sup>5</sup>、C ( O ) N ( R <sup>4</sup> ) <sub>2</sub>、- C ( O ) R <sup>5</sup>、または C <sub>1</sub> ~ <sub>3</sub> 脂肪族であり、該 C <sub>1</sub> ~ <sub>3</sub> 脂肪族は、必要に応じて、R <sup>3</sup> または R <sup>7</sup> で置換されているか；または R <sup>2</sup> および W <sup>2</sup> は、それらが結合する炭素原子と一緒に、4 員 ~ 7 員の脂環式環またはヘテロシクリル環を形成する、

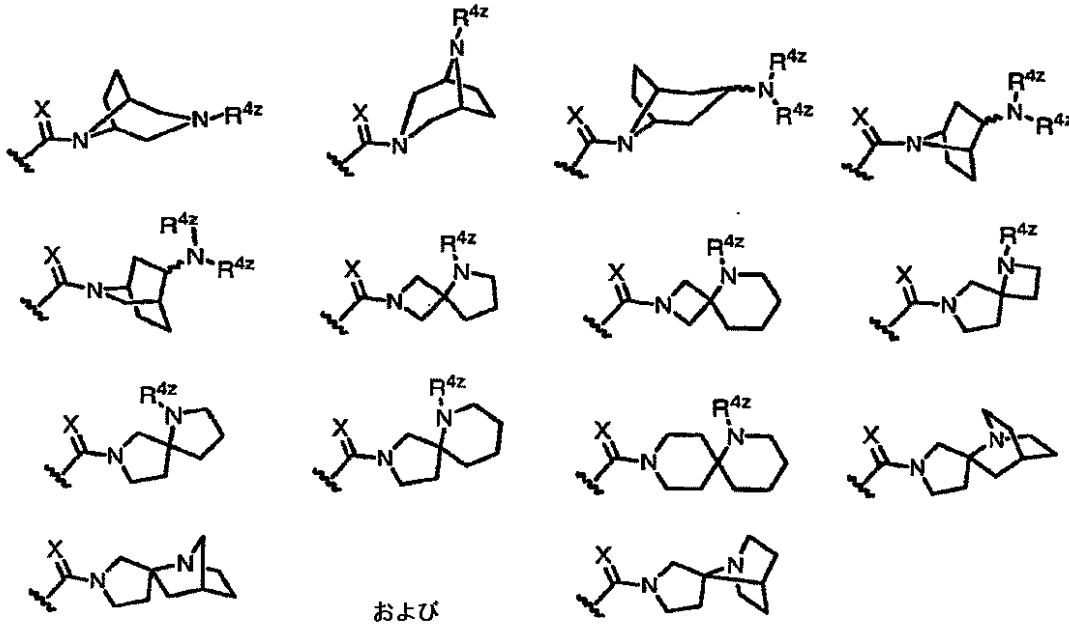
項目 3 4 に記載の化合物。

( 項目 3 7 )

環 C 上の少なくとも 1 個の置換基が、



## 【化 5 7】



からなる群より選択される基で置換されており、ここで、Xは、OまたはNHであり、そして各  $R^{4z}$  は、独立して、水素または  $-CH_3$  である、項目 3 3 に記載の化合物。

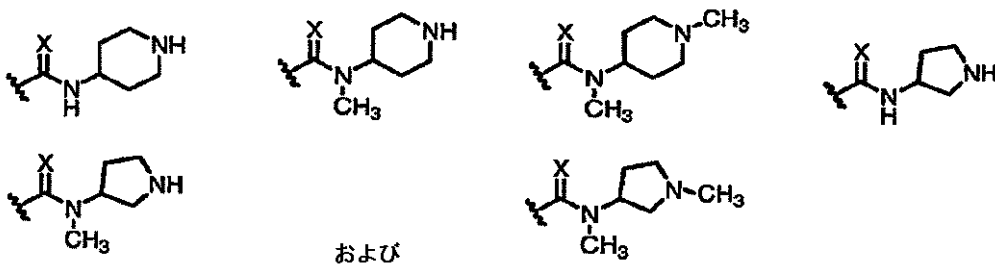
(項目 4 0)

環 C が、少なくとも 1 個の  $-C(O)N(R^4)_2$  または  $-C(=NH)N(R^4)_2$  で置換されており、ここで、一方の  $R^4$  が、水素または  $C_{1-3}$  アルキルであり、そして他方の  $R^4$  が、必要に応じて置換されたヘテロシクリルまたはヘテロシクリルアルキルである、項目 3 4 に記載の化合物。

(項目 4 1)

環 C が、

## 【化 5 8】

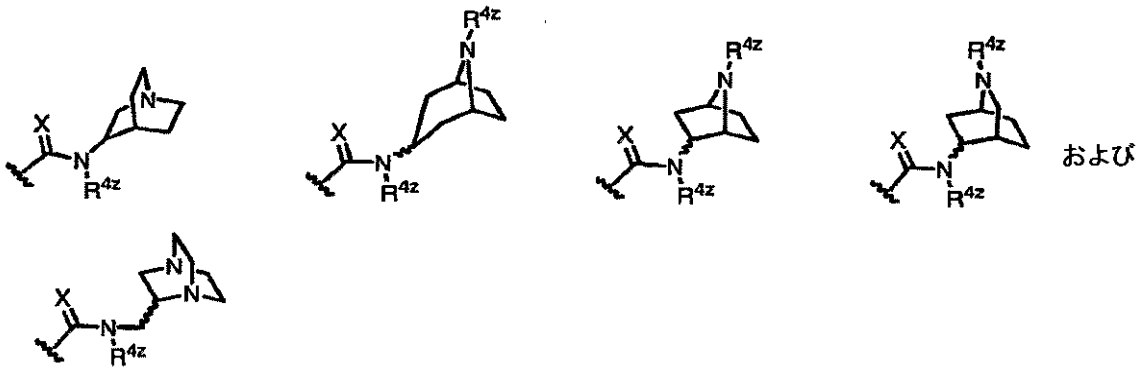


からなる群より選択される少なくとも 1 個の置換基で置換されており、ここで、Xは、OまたはNHである、項目 4 0 に記載の化合物。

(項目 4 2)

環 C が、

## 【化59】

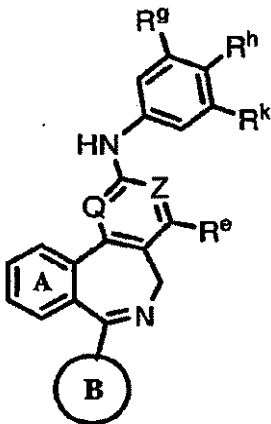


からなる群より選択される少なくとも1個の置換基で置換されており、ここで、Xは、OまたはNHであり、そして各 $R^{4z}$ は、独立して、Hまたは $CH_3$ である、項目40に記載の化合物。

(項目43)

式(VI)：

## 【化60】



(VI)

を有し、式(VI)において、

$R^g$ は、水素、 $C_{1-6}$ 脂肪族、および $R^{2d}$ からなる群より選択され；

$R^h$ および $R^k$ の各々は、独立して、水素または $R^d$ であり；

各 $R^d$ は、独立して、 $C_{1-3}$ 脂肪族、 $R^{2d}$ 、 $R^{7d}$ 、 $-T^2-R^{2d}$ 、 $-T^2-R^{7d}$ 、 $-V-T^3-R^{2d}$ 、および $-V-T^3-R^{7d}$ からなる群より選択され；そして

各 $R^{2d}$ は、独立して、 $-H$ 、 $-OR^5$ 、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)N(R^4)_2$ 、 $-C(O)N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)-C(O)R^5$ 、および $-NR^4C(O)R^5$ からなる群より選択される、

項目10に記載の化合物。

(項目44)

$R^g$ が、水素であり；

$R^h$ が、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)N(R^4)_2$ 、または $-N(R^4)C(O)R^5$ であり；そして

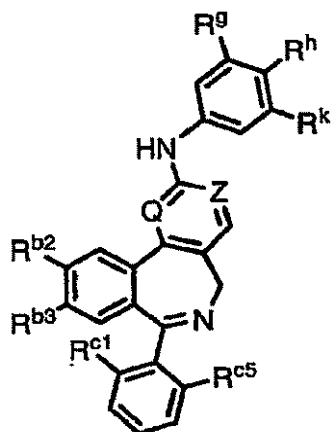
$R^k$ が、水素、 $H$ 、 $C_{1-3}$ 脂肪族、または $-OR^5$ である、

項目43に記載の化合物。

(項目45)

式(VII)：

【化 6 1】



(VII)

を有する、項目 4 3 に記載の化合物であって、

$R^e$  は、水素であり；

$R^{b2}$  および  $R^{b3}$  の各々は、独立して、水素、- 八口、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $C_{1-3}$  フルオロ脂肪族、および  $-OR^5$  からなる群より選択され、ここで、 $R^5$  は、水素または  $C_{1-3}$  脂肪族であり；

$R^{c1}$  および  $R^{c5}$  の各々は、独立して、水素、- 八口、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $C_{1-3}$  フルオロ脂肪族、および  $-OR^5$  からなる群より選択され、ここで、 $R^5$  は、水素または  $C_{1-3}$  脂肪族であり；

$R^g$  は、水素、 $C_{1-6}$  脂肪族、および  $R^{2d}$  からなる群より選択され；そして

$R^h$  および  $R^k$  の各々は、独立して、水素または  $R^d$  である、

化合物。

(項目 4 6)

$R^g$ 、 $R^h$  および  $R^k$  の各々が、独立して、水素、 $C_{1-3}$  脂肪族、- 八口、 $-OR^5$ 、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)N(R^4)_2$ 、 $-C(O)N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)-C(O)R^5$ 、および  $-N(R^4)C(O)R^5$  からなる群より選択される、項目 4 5 に記載の化合物。

(項目 4 7)

$R^h$  および  $R^k$  の少なくとも 1 個が、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)N(R^4)_2$ 、 $-C(O)N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)C(O)R^5$ 、および  $-N(R^4)C(O)R^5$  からなる群より選択される、項目 4 6 に記載の化合物。

(項目 4 8)

$R^e$ 、 $R^{b2}$ 、および  $R^g$  は、それぞれ、水素であり；

$R^{b3}$  および  $R^{c1}$  は、それぞれ独立して、- 八口、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $C_{1-3}$  フルオロ脂肪族、および  $-OR^5$  からなる群より選択され、ここで、 $R^5$  は、水素または  $C_{1-3}$  脂肪族であり；

$R^{c5}$  は、水素、- 八口、 $C_{1-3}$  脂肪族、 $C_{1-3}$  フルオロ脂肪族、および  $-OR^5$  からなる群より選択され、ここで、 $R^5$  は、水素または  $C_{1-3}$  脂肪族であり；そして

$R^h$  は、 $-CO_2H$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)N(R^4)_2$ 、 $-C(O)N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、または  $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)-C(O)R^5$  であり、ここで、 $R^5$  は、必要に応じて置換された 4 員～8 員窒素含有ヘテロシクリル環であり、そして  $-N(R^4)_2$  は、必要に応じて置換された 4 員～8 員ヘテロシクリル環であり、該環は、該窒素原子に加えて、0 個～2 個のヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子は、N、O および S から選択され；そして

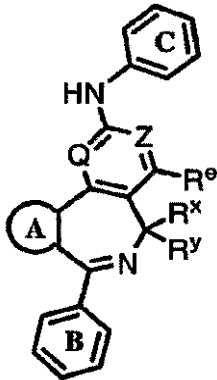
$R^k$  は、水素、八口、 $C_{1-3}$  脂肪族、または  $-OR^5$  である、

項目 4 5 に記載の化合物。

( 項目 4 9 )

式 ( V I I I ) :

【化 6 2】



(VIII)

を有する、項目 3 に記載の化合物、またはそれらの薬学的に受容可能な塩であって、式 ( V I I I ) において、

環 B は、0 個 ~ 2 個の独立して選択された R<sup>c</sup> と、0 個 ~ 3 個の独立して選択された R<sup>2c</sup> または C<sub>1-6</sub> 脂肪族基とで置換されており；

各 R<sup>c</sup> は、独立して、C<sub>1-6</sub> 脂肪族、R<sup>2c</sup>、R<sup>7c</sup>、-T<sup>1</sup>-R<sup>2c</sup>、および -T<sup>1</sup>-R<sup>7c</sup> からなる群より選択され；

T<sup>1</sup> は、C<sub>1-6</sub> アルキレン鎖であり、該 C<sub>1-6</sub> アルキレン鎖は、必要に応じて、R<sup>3</sup> または R<sup>3b</sup> で置換されており、ここで、T<sup>1</sup> またはその一部は、必要に応じて、3 員 ~ 7 員環の部分形成し；

R<sup>2c</sup> は、-H、-NO<sub>2</sub>、-CN、-C(R<sup>5</sup>)=C(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-C(R<sup>5</sup>)=C(R<sup>5</sup>)(R<sup>10</sup>)、-C-C-R<sup>5</sup>、-C-C-R<sup>10</sup>、-OR<sup>5</sup>、-SR<sup>6</sup>、-S(O)R<sup>6</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>4</sup>C(O)R<sup>5</sup>、-NR<sup>4</sup>C(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>4</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、-O-CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、-OC(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-O-C(O)R<sup>5</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、-C(O)-C(O)R<sup>5</sup>、-C(O)R<sup>5</sup>、-C(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-C(=NR<sup>4</sup>)-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-C(=NR<sup>4</sup>)-OR<sup>5</sup>、-N(R<sup>4</sup>)-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>4</sup>)C(=NR<sup>4</sup>)-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>4</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、-N(R<sup>4</sup>)SO<sub>2</sub>N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-P(O)(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、または -P(O)(OR<sup>5</sup>)<sub>2</sub> であり；

各 R<sup>7c</sup> は、独立して、必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロシクリル基またはヘテロアリール基であり；

環 C は、0 個 ~ 2 個の独立して選択された R<sup>d</sup> と、0 個 ~ 3 個の独立して選択された R<sup>2d</sup> または C<sub>1-6</sub> 脂肪族基とで置換されており；

各 R<sup>d</sup> は、独立して、C<sub>1-6</sub> 脂肪族、R<sup>2d</sup>、R<sup>7d</sup>、-T<sup>2</sup>-R<sup>2d</sup>、-T<sup>2</sup>-R<sup>7d</sup>、-V-T<sup>3</sup>-R<sup>2d</sup>、および -V-T<sup>3</sup>-R<sup>7d</sup> からなる群より選択され；

T<sup>2</sup> は、C<sub>1-6</sub> アルキレン鎖であり、該 C<sub>1-6</sub> アルキレン鎖は、必要に応じて、R<sup>3</sup> または R<sup>3b</sup> で置換されており、ここで、該アルキレン鎖は、必要に応じて、-C(R<sup>5</sup>)=C(R<sup>5</sup>)-、-C-C-、-O-、-O-、-S-、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>4</sup>)-、-N(R<sup>4</sup>)-、-N(R<sup>4</sup>)C(O)-、-NR<sup>4</sup>C(O)N(R<sup>4</sup>)-、-N(R<sup>4</sup>)CO<sub>2</sub>-、-C(O)N(R<sup>4</sup>)-、-C(O)-、-C(O)-C(O)-、-CO<sub>2</sub>-、-OC(O)-、-OC(O)O-、-OC(O)N(R<sup>4</sup>)-、-N(R<sup>4</sup>)-N(R<sup>4</sup>)-、-N(R<sup>4</sup>)SO<sub>2</sub>-、または -SO<sub>2</sub>N(R<sup>4</sup>)- で中断されており、ここで、T<sup>2</sup> またはその一部は、必要に応じて、3 員 ~ 7 員環の部分形成し；

T<sup>3</sup> は、C<sub>1-6</sub> アルキレン鎖であり、該 C<sub>1-6</sub> アルキレン鎖は、必要に応じて、R

<sup>3</sup> または  $R^3$  <sup>b</sup> で置換されており、ここで、該アルキレン鎖は、必要に応じて、 $-C(R^5) = C(R^5) -$ 、 $-C-C-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-SO_2$ 、 $N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)C(O)-$ 、 $-NR^4C(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)CO_2-$ 、 $-C(O)N(R^4)-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OC(O)-$ 、 $-OC(O)O-$ 、 $-OC(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)-N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)SO_2-$ 、または  $-SO_2N(R^4)-$  で中断されており、ここで、 $T^3$  またはその一部は、必要に応じて、3員～7員環の部分を形成し；

V は、 $-C(R^5) = C(R^5) -$ 、 $-C-C-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-SO_2$ 、 $N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)C(O)-$ 、 $-NR^4C(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)CO_2-$ 、 $-C(O)N(R^4)-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OC(O)-$ 、 $-OC(O)O-$ 、 $-OC(O)N(R^4)-$ 、 $-C(NR^4) = N-$ 、 $-C(OR^5) = N-$ 、 $-N(R^4)-N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)-SO_2-$ 、 $-N(R^4)SO_2N(R^4)-$ 、 $-P(O)(R^5)-$ 、 $-P(O)(OR^5)-O-$ 、 $-P(O)-O-$ 、または  $-P(O)(NR^5)-N(R^5)-$  であり；

$R^2$  <sup>d</sup> は、 $-$ 八口、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(R^5) = C(R^5)_2$ 、 $-C(R^5) = C(R^5)(R^{10})$ 、 $-C-C-R^5$ 、 $-C-C-R^{10}$ 、 $-OR^5$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)R^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-SO_3R^5$ 、 $-SO_2N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-NR^4C(O)R^5$ 、 $-NR^4C(O)N(R^4)_2$ 、 $-NR^4CO_2R^6$ 、 $-O-CO_2R^5$ 、 $-OC(O)N(R^4)_2$ 、 $-O-C(O)R^5$ 、 $-CO_2R^5$ 、 $-C(O)-C(O)R^5$ 、 $-C(O)R^5$ 、 $-C(O)N(R^4)_2$ 、 $-C(O)N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)-C(O)R^5$ 、 $-C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-C(=NR^4)-OR^5$ 、 $-N(R^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)C(=NR^4)-N(R^4)_2$ 、 $-N(R^4)SO_2R^6$ 、 $-N(R^4)SO_2N(R^4)_2$ 、 $-P(O)(R^5)_2$ 、または  $-P(O)(OR^5)_2$  であり；

各  $R^7$  <sup>d</sup> は、独立して、必要に応じて置換されたアリール基、ヘテロシクリル基またはヘテロアリール基であり；

各  $R^3$  <sup>b</sup> は、独立して、 $C_{1-3}$  脂肪族であり、該  $C_{1-3}$  脂肪族は、必要に応じて、 $R^3$  または  $R^7$  で置換されているか、または同じ炭素原子上の2個の置換基  $R^3$  <sup>b</sup> は、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、3員～6員炭素環式環を形成し；そして

各  $R^{10}$  は、独立して、 $-CO_2R^5$  または  $-C(O)N(R^4)_2$  である、

化合物。

(項目50)

項目1に記載の化合物と薬学的に受容可能なキャリアとを含有する、薬学的組成物。

(項目51)

細胞における Aurora キナーゼ活性を阻害する方法であって、Aurora キナーゼの阻害が望まれている細胞と、項目1に記載の化合物とを接触させる工程を包含する、方法。

(項目52)

Aurora キナーゼ媒介障害の処置を必要とする患者において Aurora キナーゼ媒介障害を処置する方法であって、該患者に、治療有効量の項目1に記載の化合物を投与する工程を包含する、方法。

(項目53)

前記 Aurora キナーゼ媒介障害が、癌である、項目52に記載の方法。

(項目54)

前記癌が、結腸直腸癌、卵巣癌、乳癌、胃癌、前立腺癌、および膵臓癌からなる群から選択される、項目53に記載の方法。

(項目55)

前記癌が、乳癌、結腸直腸癌、および膵臓癌からなる群から選択される、項目54に記載

の方法。

( 発明の説明 )

本発明は、A u r o r aキナーゼを阻害する化合物を提供する。これらの化合物は、インビトロまたはインビボでA u r o r aキナーゼを阻害するのに有用であり、特に、癌を含めた細胞増殖障害の処置に有用である。本発明のA u r o r aキナーゼインヒビターは、式( I ) :