

【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27年9月10日(2015.9.10)

【公表番号】特表2014-520887(P2014-520887A)

【公表日】平成26年8月25日(2014.8.25)

【年通号数】公開・登録公報2014-045

【出願番号】特願2014-521730(P2014-521730)

【国際特許分類】

C 07 D 217/24	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 37/06	(2006.01)
A 61 K 31/519	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)
A 61 K 31/4725	(2006.01)
C 07 D 487/04	(2006.01)
A 61 K 31/5025	(2006.01)
A 61 K 31/53	(2006.01)
C 07 D 513/04	(2006.01)
C 07 D 403/12	(2006.01)
C 07 D 519/00	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 K 31/517	(2006.01)
C 07 D 401/12	(2006.01)
C 07 D 475/00	(2006.01)
C 07 D 417/12	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)

【F I】

C 07 D 217/24	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 35/00	
A 61 P 29/00	
A 61 P 37/06	
A 61 K 31/519	
C 07 D 471/04	1 1 8 Z
C 07 D 471/04	1 1 4 Z
A 61 K 31/4725	
C 07 D 487/04	1 4 2
C 07 D 487/04	1 4 4
A 61 K 31/5025	
A 61 K 31/53	
C 07 D 487/04	1 4 1
C 07 D 513/04	3 5 1
C 07 D 403/12	C S P
C 07 D 519/00	3 0 1
C 07 D 519/00	3 1 1
A 61 K 31/5377	
A 61 K 31/517	

C 0 7 D 401/12  
 C 0 7 D 487/04 1 4 7  
 C 0 7 D 475/00  
 C 0 7 D 417/12  
 C 0 7 D 401/14

## 【手続補正書】

【提出日】平成27年7月17日(2015.7.17)

## 【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

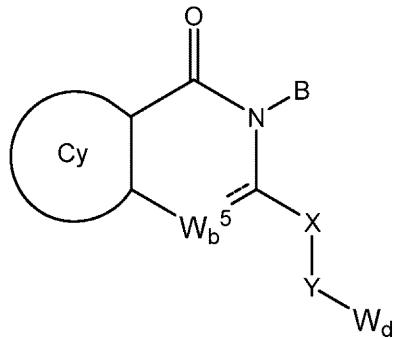
## 【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式(I)の化合物、又はそのエナンチオマー、エナンチオマーの混合物、もしくは2以上のジアステレオマーの混合物、或いはその医薬として許容し得るその形態：

## 【化1】



式(I)

(式中、

Cyは、0～1回出現するR<sup>3</sup>及び0～3回出現するR<sup>5</sup>で置換されたアリール又はヘテロアリールであり；

W<sub>b</sub><sup>5</sup>は、CR<sup>8</sup>、CHR<sup>8</sup>、又はNであり；

R<sup>8</sup>は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、又はニトロであり；

Bは、その各々が0～4回出現するR<sup>2</sup>で置換されている、水素、アルキル、アミノ、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、又はヘテロアリールであり；

各々のR<sup>2</sup>は、独立に、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、ホスフェート、尿素、又はカルボネートであり；

Xは、非存在であるか、又は-(CH(R<sup>9</sup>))<sub>z</sub>-であり；

Yは、非存在、-O-、-S-、-S(=O)-、-S(=O)<sub>2</sub>-、-N(R<sup>9</sup>)-、-C(=O)-(CHR<sup>9</sup>)<sub>z</sub>-、-C(=O)-、-N(R<sup>9</sup>)-C(=O)-NH-、又は-N(R<sup>9</sup>)-C(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>-であり；

各々のzは、独立に、1、2、3、又は4の整数であり；

ここで、W<sub>b</sub><sup>5</sup>がNであるとき、X又はYのうちの1以下が非存在であり；

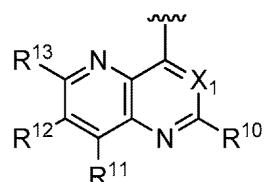
$R^3$ は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、フルオロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシリル、アシリルオキシ、スルフィニル、スルホニル、スルホキシド、スルホン、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヘテロアリール、アリール、ヒドロキシル、又はニトロであり；ここで、上記の置換基の各々は、0、1、2、又は3個の $R^{17}$ で置換されることができ；

各々の $R^5$ は、独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシリル、アシリルオキシ、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、又はニトロであり；

各々の $R^9$ は、独立に、水素、アルキル、シクロアルキル、又はヘテロアルキルであり；かつ

$W_d$ は、

【化2】



であり、

ここで、 $X_1$ は、N又は $CR^{14}$ であり；

ここで、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、及び $R^{17}$ は、独立に、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、アミド、アミノ、アシリル、アシリルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、オキソ、又は $NR'R''$ であり、ここで、 $R'$ 及び $R''$ は、窒素と一緒に、環状部分を形成する)。

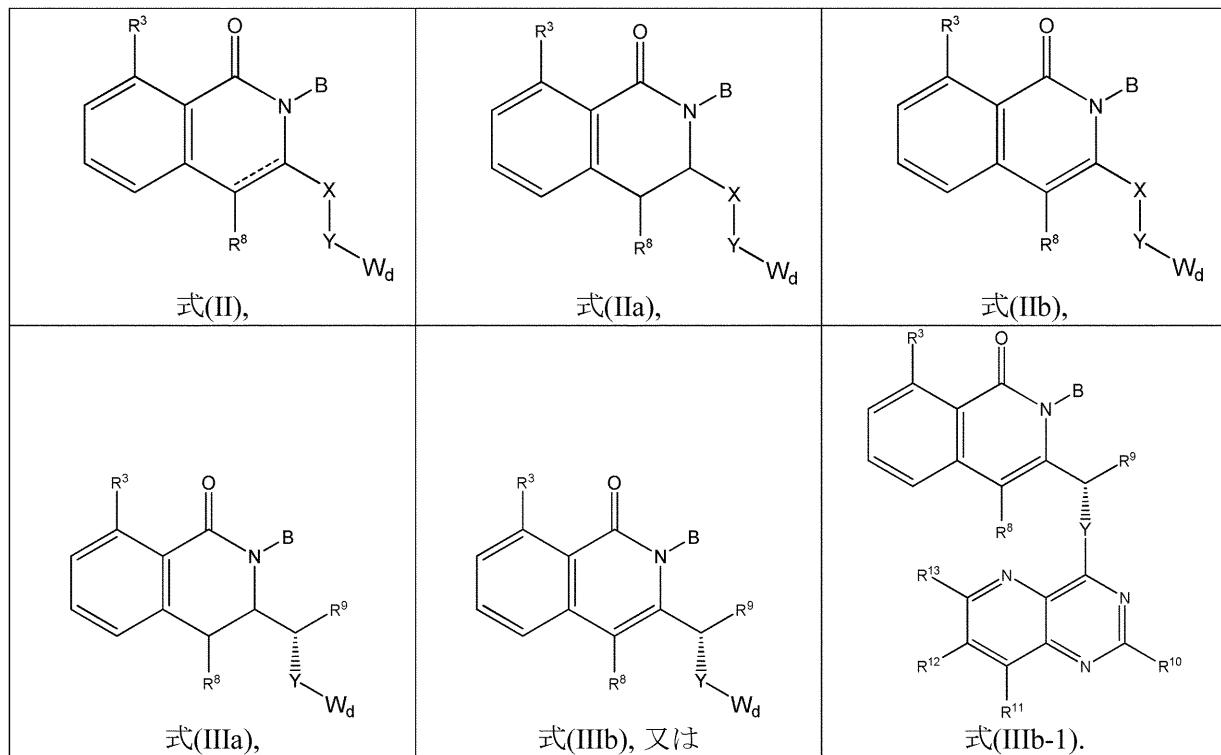
【請求項2】

Cyが、1回出現する $R^3$ 及び0回出現する $R^5$ で置換されたフェニルである、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

式(I)の化合物が、式(II)、(IIa)、(IIb)、(IIIa)、(IIIb)又は(IIIb-1)の構造：

## 【化3】



を有する、請求項2記載の化合物。

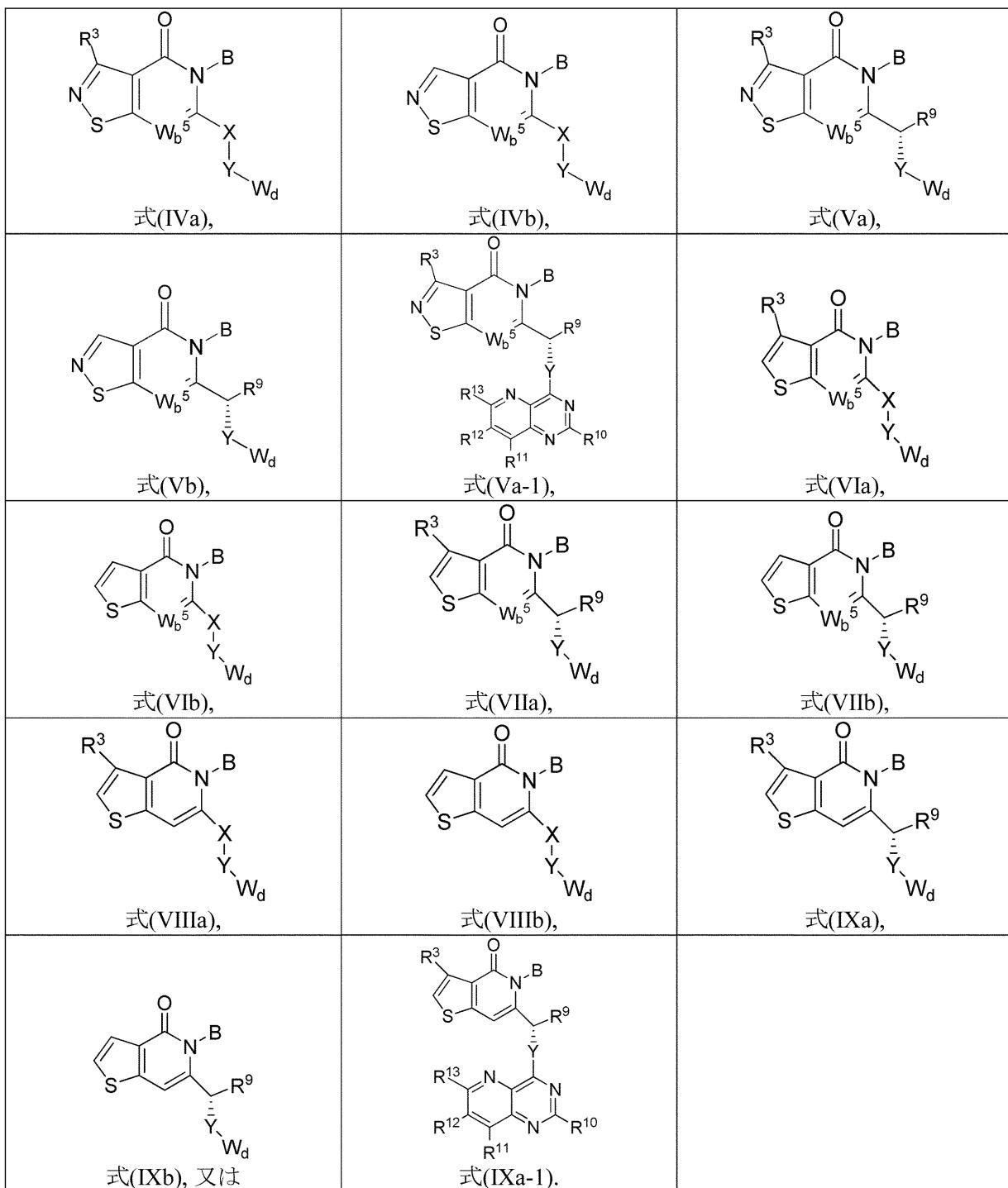
## 【請求項4】

Cyが、0～1回出現するR<sup>3</sup>及び0～3回出現するR<sup>5</sup>で置換された5員ヘテロアリールである、請求項1記載の化合物。

## 【請求項5】

式(I)の化合物が、式(IVa)、(IVb)、(Va)、(Vb)、(Va-1)、(VIa)、(VIb)、(VIIa)、(VIIb)、(VIIIa)、(VIIIb)、(IXa)、(IXb)又は(IXa-1)の構造：

## 【化4】



を有する、請求項4記載の化合物。

## 【請求項6】

$R^3$ が、アルキル、シクロアルキル、ハロ、アリール、及びヘテロアリールから選択される、請求項1~5のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項7】

$R^3$ が、メチル、クロロ、及びピラゾロから選択される、請求項1~6のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項8】

Bが、非置換フェニルである、請求項1~7のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項9】

Yが、非存在、-O-、-NH(R<sup>9</sup>)-、又は-S(=O)<sub>2</sub>-である、請求項1～8のいずれか一項記載の化合物。

**【請求項10】**

X-Yが、-CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)-、(S)-CH(CH<sub>3</sub>)-NH-又は(R)-CH(CH<sub>3</sub>)-NH-である、請求項1～9のいずれか一項記載の化合物。

**【請求項11】**

X<sub>1</sub>がNである、請求項1～10のいずれか一項記載の化合物。

**【請求項12】**

R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、及びR<sup>13</sup>が、独立に、水素、アミノ、及びクロロから選択される、請求項1～11のいずれか一項記載の化合物。

**【請求項13】**

R<sup>10</sup>が、アミノ及びクロロから選択される、請求項1～12のいずれか一項記載の化合物。

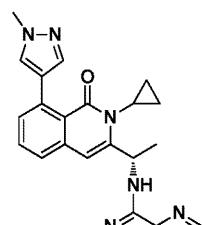
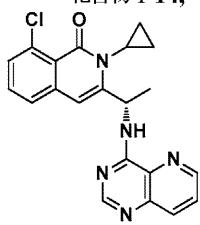
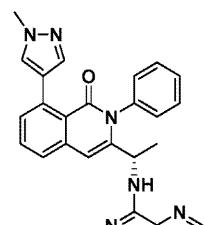
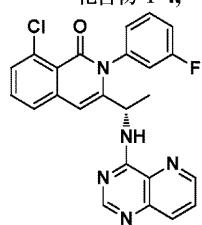
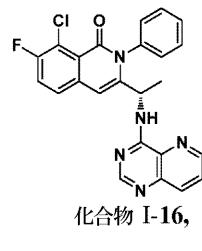
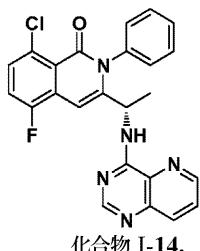
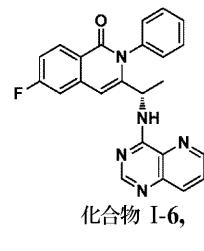
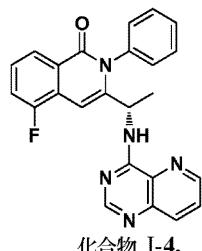
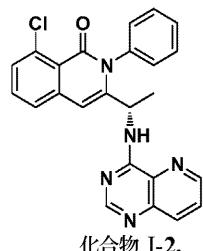
**【請求項14】**

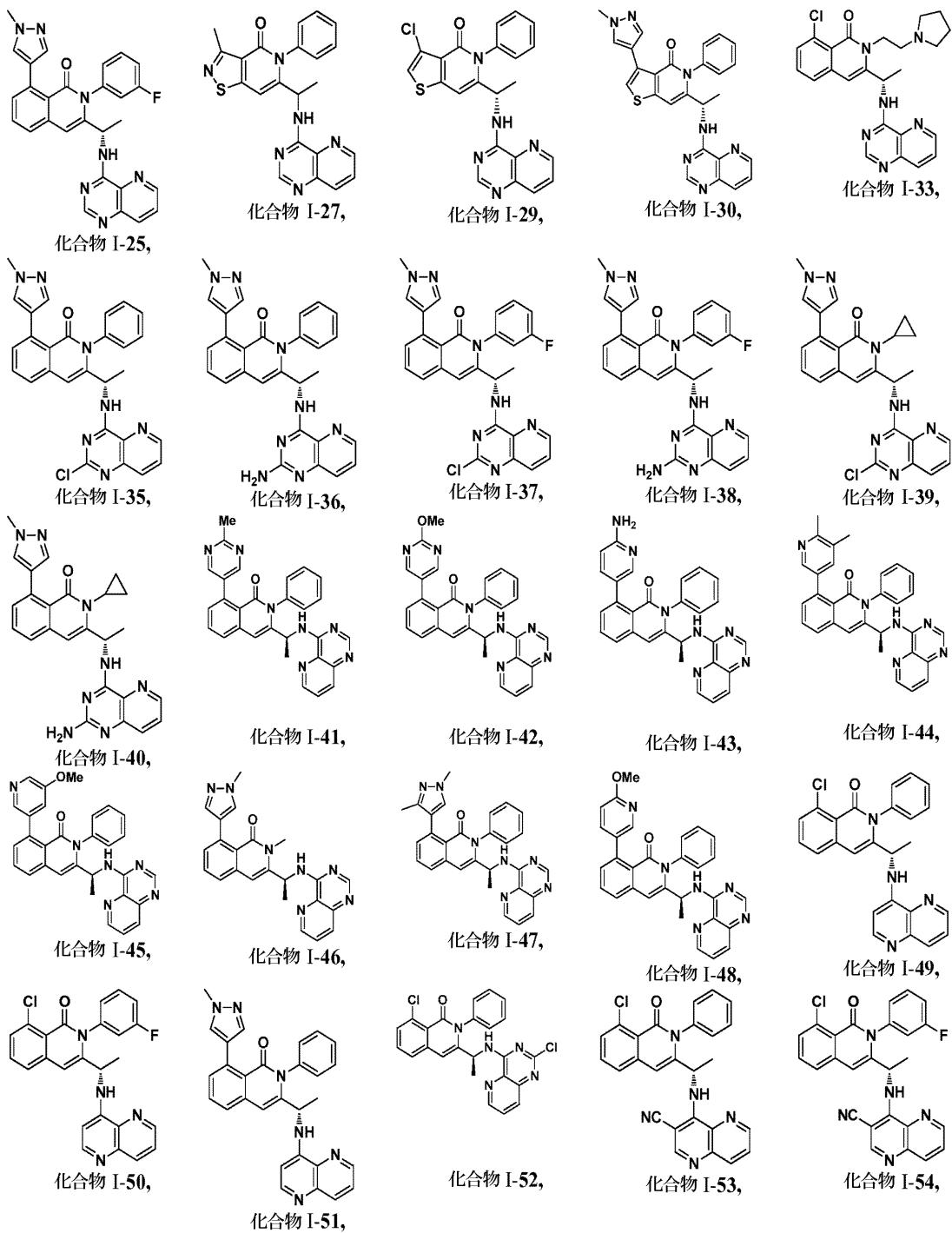
R<sup>8</sup>が水素である、請求項1～13のいずれか一項記載の化合物。

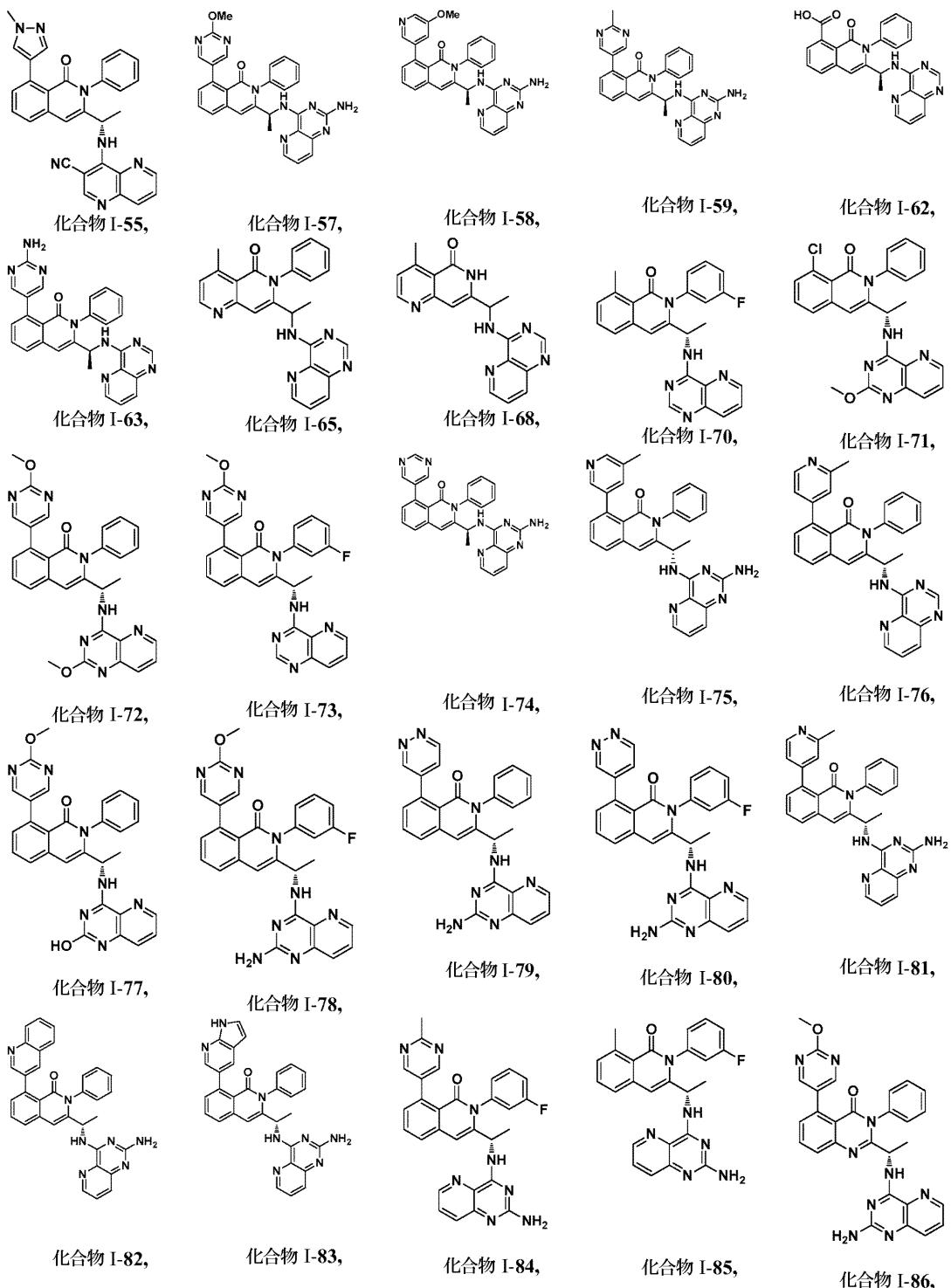
**【請求項15】**

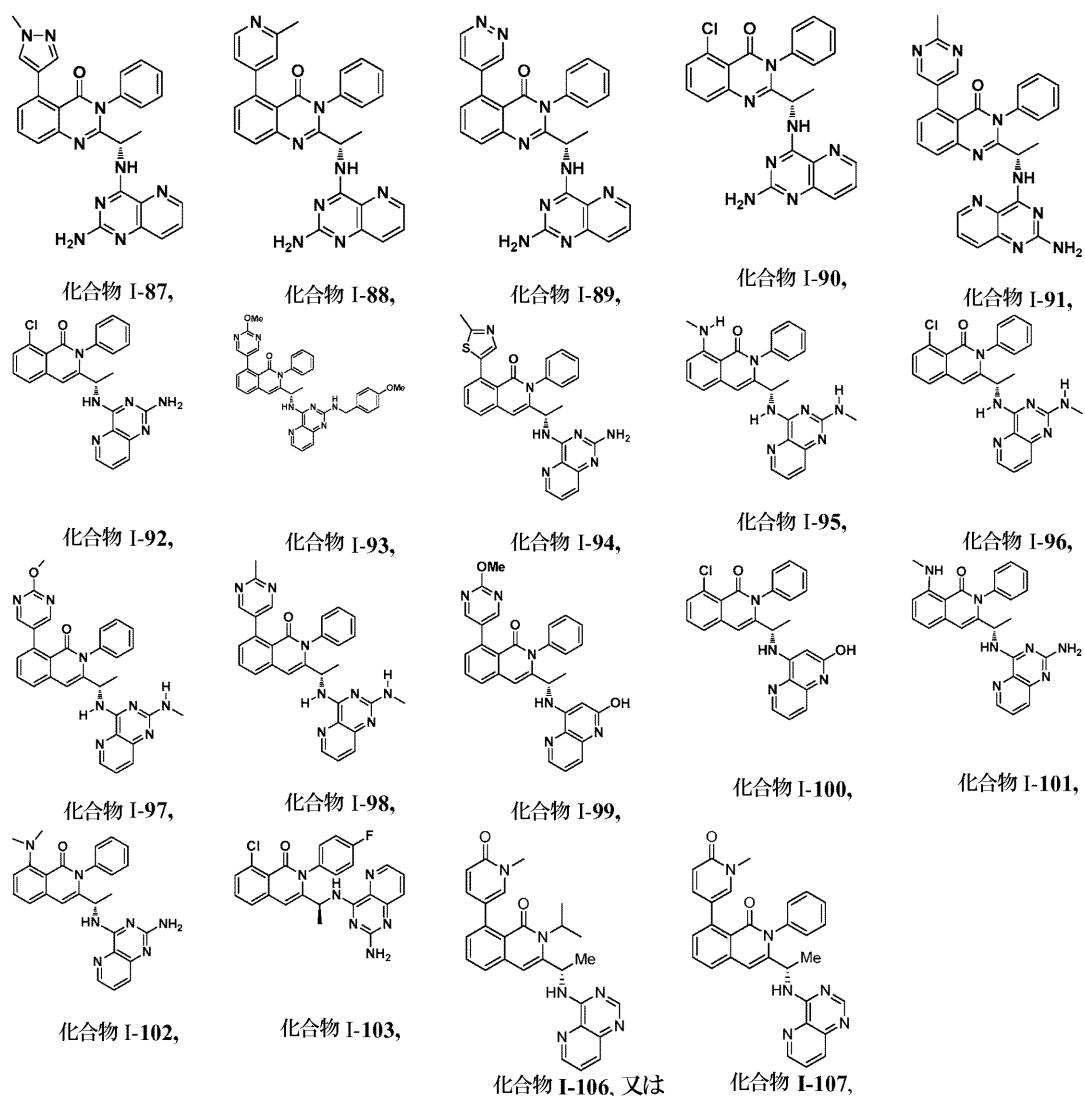
以下のもの：

**【化5】**







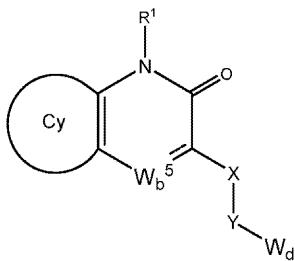


又はその医薬として許容し得る形態である、請求項1記載の化合物。

**【請求項 1 6】**

式(XI)の化合物、又はそのエナンチオマー、エナンチオマーの混合物、もしくは2以上のジアステレオマーの混合物、或いはその医薬として許容し得るその形態：

**【化 6】**



式 (XI),

(式中：

$W_b^5$  は、N、 $CHR^8$ 、又は $CR^8$ であり；

$R^8$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシリル、アシリルオキシ、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシリル、又はニトロであり；

Cyは、0～1回出現するR<sup>3</sup>及び0～3回出現するR<sup>5</sup>で置換されたアリール又はヘテロアリールであり；

R<sup>1</sup>は-(L)-R<sup>1'</sup>であり；

Lは、結合、-S-、-N(R<sup>15</sup>)-、-C(R<sup>15</sup>)<sub>2</sub>-、-C(=O)-、又は-O-であり；

R<sup>1'</sup>は、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、置換窒素、又はNR'R''であり、ここで、R'及びR''は、窒素と一緒に、環状部分を形成し；

各々のR<sup>15</sup>は、独立に、水素、アルキル、シクロアルキル、又はヘテロアルキルであり；

R<sup>3</sup>は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、フルオロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヘテロアリール、アリール、ヒドロキシル、又はニトロであり；ここで、上記の置換基の各々は、0、1、2、又は3個のR<sup>17</sup>で置換されることができ；

各々のR<sup>5</sup>は、独立に、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、又はNR'R''であり、ここで、R'及びR''は、窒素と一緒に、環状部分を形成し；

Xは、非存在又は-(CH(R<sup>16</sup>))<sub>z</sub>-であり；

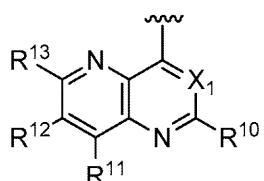
Yは、非存在、-O-、-S-、-S(=O)-、-S(=O)<sub>2</sub>-、-N(R<sup>16</sup>)-、-C(=O)-(CHR<sup>16</sup>)<sub>z</sub>-、-C(=O)-、-N(R<sup>16</sup>)-C(=O)-、-N(R<sup>16</sup>)-C(=O)NH-、-N(R<sup>16</sup>)C(R<sup>16</sup>)<sub>2</sub>-、又は-C(=O)-N(R<sup>16</sup>)-(CHR<sup>16</sup>)<sub>z</sub>-であり；

各々のzは、1、2、3、又は4の整数であり；

各々のR<sup>16</sup>は、独立に、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアルキル、アリール、ハロ、又はヘテロアリールであり；かつ

W<sub>d</sub>は、

### 【化7】



であり、

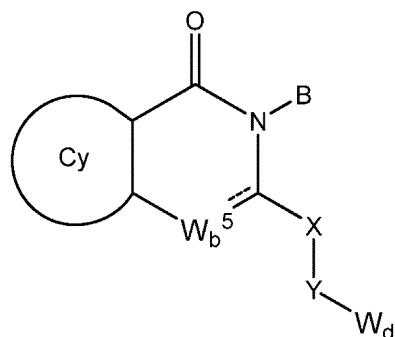
ここで、X<sub>1</sub>は、N又はCR<sup>14</sup>であり；

ここで、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、及びR<sup>17</sup>は、独立に、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、オキソ、又はNR'R''であり、ここで、R'及びR''は、窒素と一緒に、環状部分を形成する)。

### 【請求項17】

式(XII)の化合物、又はそのエナンチオマー、エナンチオマーの混合物、もしくは2以上のジアステレオマーの混合物、或いはその医薬として許容し得るその形態：

【化8】



(式中、

Cyは、0～1回出現するR<sup>3</sup>及び0～3回出現するR<sup>5</sup>で置換されたアリール又はヘテロアリールであり；

W<sub>b</sub><sup>5</sup>は、CR<sup>8</sup>、CHR<sup>8</sup>、又はNであり、

R<sup>8</sup>は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、又はニトロであり；

Bは、その各々が0～4個のR<sup>2</sup>で置換されている、水素、アルキル、アミノ、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、又はヘテロアリールであり；

R<sup>2</sup>は、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、ホスフェート、尿素、又はカルボネートであり；

Xは、非存在であるか、又は-(CH(R<sup>9</sup>))<sub>z</sub>-であり；

Yは、非存在、-O-、-S-、-S(=O)-、-S(=O)<sub>2</sub>-、-N(R<sup>9</sup>)-、-C(=O)-(CHR<sup>9</sup>)<sub>z</sub>-、-C(=O)-、-N(R<sup>9</sup>)-C(=O)NH-、又は-N(R<sup>9</sup>)C(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>-であり；

各々のzは、独立に、1、2、3、又は4の整数であり；

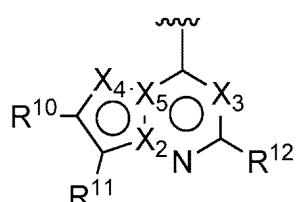
R<sup>3</sup>は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、スルフィニル、スルホニル、スルホキシド、スルホン、スルホンアミド、ハロ、シアノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシル、又はニトロであり；ここで、上記の置換基の各々は、0、1、2、又は3個のR<sup>17</sup>で置換することができ；

各々のR<sup>5</sup>は、独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、又はニトロであり；

各々のR<sup>9</sup>は、独立に、水素、アルキル、シクロアルキル、又はヘテロアルキルであり；かつ

W<sub>d</sub>は、

【化9】



であり、

ここで、 $X_5$ 及び $X_2$ のうちの1つはNであり、かつ $X_5$ 及び $X_2$ のうちの1つはCであり； $X_3$ 及び $X_4$ は、各々独立に、CR<sup>13</sup>又はNであり； $X_2$ と $X_3$ の両方ともがNであるというわけではなく；かつ各々のR<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、及びR<sup>17</sup>は、独立に、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、アミド、アミノ、アシリル、アシリルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホニアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、オキソ、又はNR' R''であり、ここで、R'及びR''は、窒素と一緒に、環状部分を形成する)。

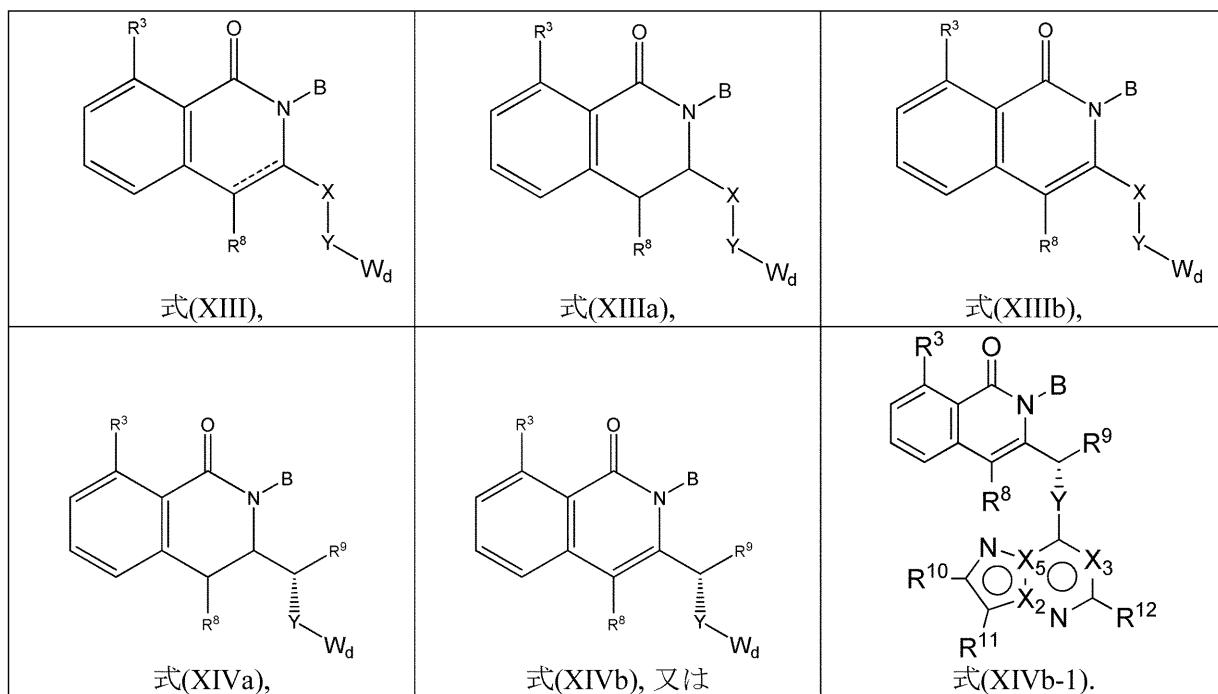
【請求項18】

Cyが、1回出現するR<sup>3</sup>及び0回出現するR<sup>5</sup>で置換されたフェニルである、請求項17記載の化合物。

【請求項19】

式(XIII)の化合物が、式(XIII)、(XIIIa)、(XIIIb)、(XIVa)、(XIVb)又は(XIVb-1)の構造：

【化10】



を有する、請求項18記載の化合物。

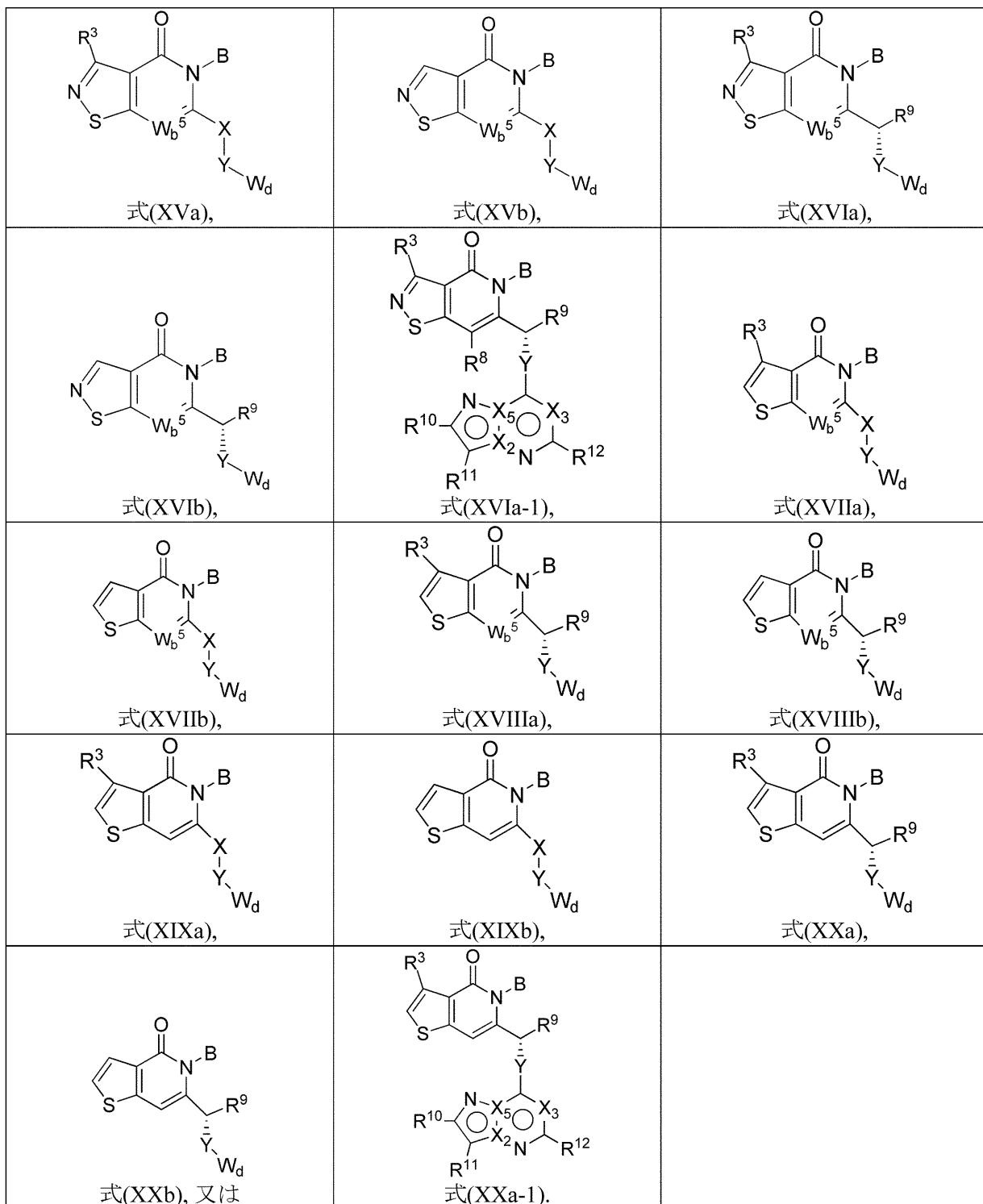
【請求項20】

Cyが、0～1回出現するR<sup>3</sup>及び0～3回出現するR<sup>5</sup>で置換された5員ヘテロアリールである、請求項17記載の化合物。

【請求項21】

式(XIII)の化合物が、式(XVa)、(XVb)、(XVIa)、(XVIb)、(XVIa-1)、(XVIIa)、(XVIIb)、(XVIIIa)、(XVIIIb)、(XIXa)、(XIXb)、(XXa)、(XXb)又は(XXa-1)の構造：

## 【化11】



を有する、請求項20記載の化合物。

## 【請求項22】

R<sup>3</sup>が、水素、アルキル、シクロアルキル、ハロ、アリール、及びヘテロアリールから選択される、請求項17～21のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項23】

R<sup>3</sup>が、メチル、クロロ、及びピラゾロから選択される、請求項17～22のいずれか一項記載の化合物。

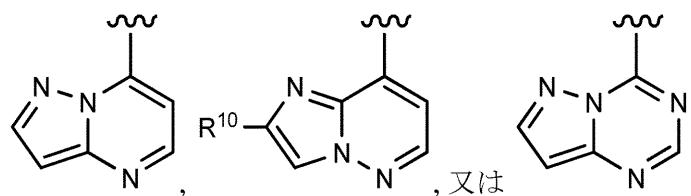
## 【請求項24】

Bが非置換フェニルである、請求項17～23のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 2 5】

W<sub>d</sub>が、

## 【化 1 2】



である、請求項17～24のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 2 6】

Yが、非存在、-O-、-NH(R<sup>9</sup>)-、又は-S(=O)<sub>2</sub>-である、請求項17～25のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 2 7】

X-Yが、-CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)-、(S)-CH(CH<sub>3</sub>)-NH-、又は(R)-CH(CH<sub>3</sub>)-NH-である、請求項17～26のいずれか一項記載の化合物。

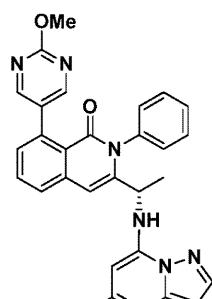
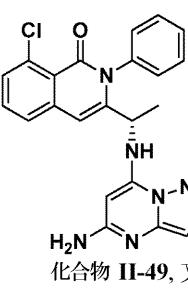
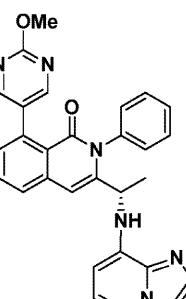
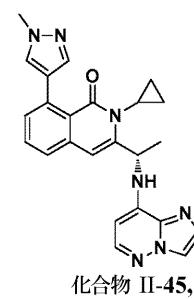
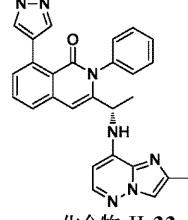
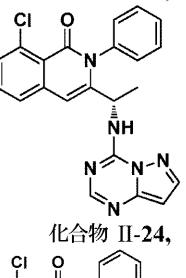
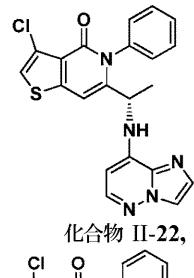
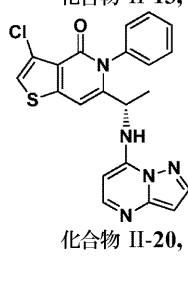
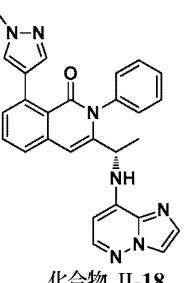
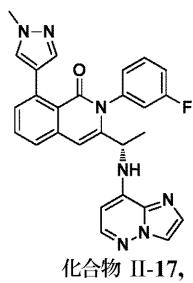
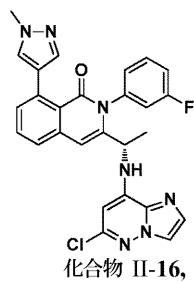
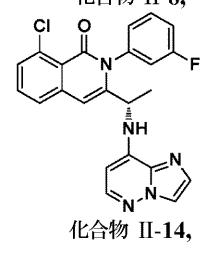
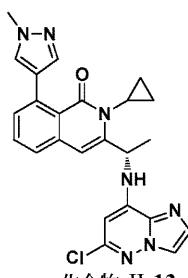
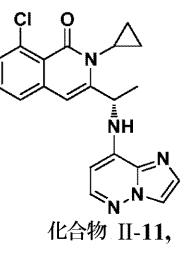
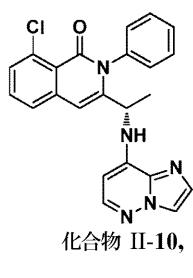
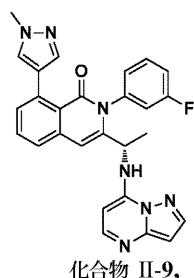
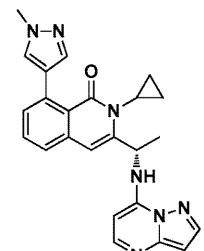
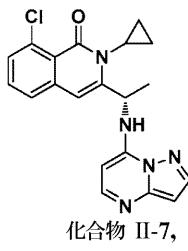
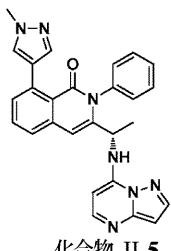
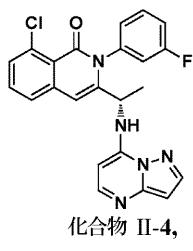
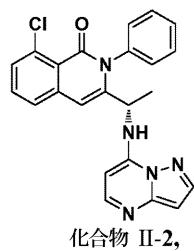
## 【請求項 2 8】

R<sup>8</sup>が水素である、請求項17～27のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 2 9】

以下のもの：

## 【化13】

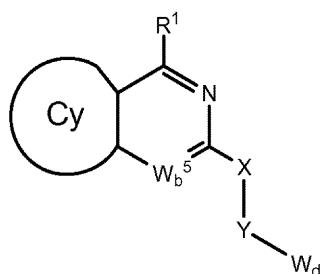


又はその医薬として許容し得る形態である、請求項17記載の化合物。

## 【請求項 30】

式(XXIII)の化合物、又はそのエナンチオマー、エナンチオマーの混合物、もしくは2以上のジアステレオマーの混合物、或いはその医薬として許容し得るその形態：

## 【化14】



式(XXIII)

(式中、

$W_b^5$ は、N又はCR<sup>8</sup>であり；

R<sup>8</sup>は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシリル、アシリルオキシ、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、又はニトロであり；

Cyは、0～1回出現するR<sup>3</sup>及び0～3回出現するR<sup>5</sup>で置換されたアリール又はヘテロアリー  
ルであり；

R<sup>1</sup>は-(L)-R<sup>1'</sup>であり；

Lは、結合、-S-、-N(R<sup>16</sup>)-、-C(R<sup>15</sup>)<sub>2</sub>-、-C(=O)-、又は-O-であり；

R<sup>1'</sup>は、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリー  
ル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、アミド、ア  
ミノ、アシリル、アシリルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、  
ヒドロキシ、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、置換窒素、又はNR'R''であり  
、ここで、R'及びR''は、窒素と一緒に、環状部分を形成し；

R<sup>3</sup>は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ハロアル  
キル、ヘテロアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシリル、アシリルオキシ、スルフ  
ィニル、スルホニル、スルホキシド、スルホン、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヘテロ  
アリール、アリール、ヒドロキシル、又はニトロであり；ここで、上記の置換基の各々は  
、0、1、2、又は3個のR<sup>17</sup>で置換することができ；

各々のR<sup>5</sup>は、独立に、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアル  
キル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリ  
ールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、アミド、アミノ、アシリル、ア  
シリルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ  
、ホスフェート、尿素、カルボネート、又はNR'R''であり、ここで、R'及びR''は、窒素  
と一緒に、環状部分を形成し；

Xは、非存在であるか、又は-(CH(R<sup>14</sup>))<sub>z</sub>であり；

Yは、非存在、-O-、-S-、-S(=O)-、-S(=O)<sub>2</sub>-、-N(R<sup>9</sup>)-、-C(=O)-(CHR<sup>14</sup>)<sub>z</sub>-、-C(=O)-、  
-N(R<sup>9</sup>)-C(=O)-、-N(R<sup>9</sup>)-C(=O)NH-、-N(R<sup>9</sup>)C(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>-、又は-C(=O)-(CHR<sup>14</sup>)<sub>z</sub>-であり；

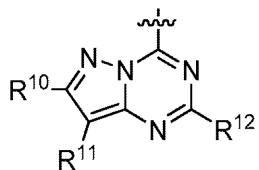
各々のzは、1、2、3、又は4の整数であり；

各々のR<sup>9</sup>及びR<sup>16</sup>は、独立に、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘ  
テロアルキル、アリール、又はヘテロアリールであり；

各々のR<sup>14</sup>及びR<sup>15</sup>は、独立に、水素、アルキル、アリール、ヘテロアリール、又はハロ  
であり；かつ

W<sub>d</sub>は、

## 【化15】



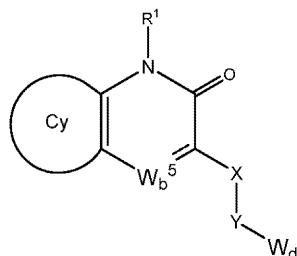
であり、

ここで、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、及びR<sup>17</sup>は、独立に、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、オキソ、又はNR'R''であり、ここで、R'及びR''は、窒素と一緒に、環状部分を形成する)。

## 【請求項31】

式(XXII)の化合物、又はそのエナンチオマー、エナンチオマーの混合物、もしくは2以上のジアステレオマーの混合物、或いはその医薬として許容し得るその形態:

## 【化16】



式(XXII),

(式中:

W<sub>b</sub><sup>5</sup>は、N、CHR<sup>8</sup>、又はCR<sup>8</sup>であり;

R<sup>8</sup>は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、又はニトロであり;

Cyは、0~1回出現するR<sup>3</sup>及び0~3回出現するR<sup>5</sup>で置換されたアリール又はヘテロアリールであり;

R<sup>1</sup>は-(L)-R<sup>1'</sup>であり;

Lは、結合、-S-、-N(R<sup>15</sup>)-、-C(R<sup>15</sup>)<sub>2</sub>-、-C(=O)-、又は-O-であり;

R<sup>1'</sup>は、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、置換窒素、又はNR'R''であり、ここで、R'及びR''は、窒素と一緒に、環状部分を形成し;

各々のR<sup>15</sup>は、独立に、水素、アルキル、シクロアルキル、又はヘテロアルキルであり;

R<sup>3</sup>は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、スルフィニル、スルホニル、スルホキシド、スルホン、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヘテロアリール、アリール、ヒドロキシル、又はニトロであり;ここで、上記の置換基の各々は、0、1、2、又は3個のR<sup>17</sup>で置換されることができ;

各々のR<sup>5</sup>は、独立に、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリー

ルアルキル、アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、アミド、アミノ、アシリル、アシリルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、又はNR'R''であり、ここで、R'及びR''は、窒素と一緒に、環状部分を形成し；

Xは、-(CH(R<sup>9</sup>))<sub>z</sub>であり；

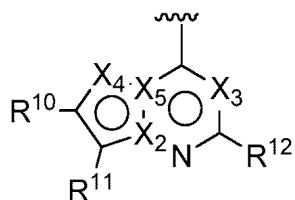
Yは、非存在、-O-、-S-、-S(=O)-、-S(=O)<sub>2</sub>-、-N(R<sup>9</sup>)-、-C(=O)-(CHR<sup>9</sup>)<sub>z</sub>-、-C(=O)-、-N(R<sup>9</sup>)-C(=O)-、-N(R<sup>9</sup>)-C(=O)NH-、-N(R<sup>9</sup>)C(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>-、又は-C(=O)-N(R<sup>9</sup>)-(CHR<sup>9</sup>)<sub>z</sub>-であり；

各々のzは、1、2、3、又は4の整数であり；

各々のR<sup>9</sup>は、独立に、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアルキル、アリール、ハロ、又はヘテロアリールであり；かつ

W<sub>d</sub>は、

【化17】



であり、

ここで、X<sub>5</sub>及びX<sub>2</sub>のうちの1つはNであり、かつX<sub>5</sub>及びX<sub>2</sub>のうちの1つはCであり；

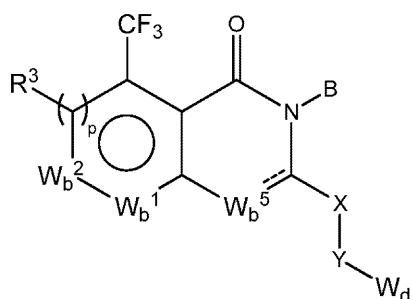
ここで、X<sub>3</sub>及びX<sub>4</sub>は、各々独立に、CR<sup>13</sup>及びNから選択され；かつ

各々のR<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、及びR<sup>17</sup>は、独立に、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、アミド、アミノ、アシリル、アシリルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、又はNR'R''であり、ここで、R'及びR''は、窒素と一緒に、環状部分を形成する)。

【請求項32】

式(XXV)の化合物、又はそのエナンチオマー、エナンチオマーの混合物、もしくは2以上のジアステレオマーの混合物、或いはその医薬として許容し得るその形態：

【化18】



式(XXV)

(式中、

W<sub>b</sub><sup>1</sup>及びW<sub>b</sub><sup>2</sup>は、各々独立に、CR<sup>3</sup>、S、O、N、又はNR<sup>13</sup>であり、ここで、W<sub>b</sub><sup>1</sup>及びW<sub>b</sub><sup>2</sup>のうちの少なくとも1つは、CR<sup>3</sup>、N、又はNR<sup>13</sup>であり；

pは、0、1、2、又は3であり；

W<sub>b</sub><sup>5</sup>は、CR<sup>8</sup>、CHR<sup>8</sup>、又はNであり；

R<sup>8</sup>は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシリル、アシリルオキシ、スルホンアミド、ハロ、シアノ、

ヒドロキシル、又はニトロであり；

Bは、その各々が0～4回出現するR<sup>2</sup>で置換されている、水素、アルキル、アミノ、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、又はヘテロアリールであり；

Xは、非存在であるか、又は-(CH(R<sup>9</sup>))<sub>z</sub>-であり；

Yは、非存在、-O-、-S-、-S(=O)-、-S(=O)<sub>2</sub>-、-N(R<sup>9</sup>)-、-C(=O)-(CHR<sup>9</sup>)<sub>z</sub>-、-C(=O)-、-N(R<sup>9</sup>)-C(=O)NH-、又は-N(R<sup>9</sup>)C(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>-であり；

各々のzは、独立に、1、2、3、又は4の整数であり；

ここで、W<sub>b</sub><sup>5</sup>がNであるとき、X又はYのうちの1以下が非存在であり；

各々のR<sup>2</sup>は、独立に、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、スルホニアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、ホスフェート、尿素、又はカルボネートであり；

各々のR<sup>3</sup>は、独立に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、フルオロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、スルフィニル、スルホニル、スルホキシド、スルホン、スルホニアミド、ハロ、シアノ、ヘテロアリール、アリール、ヒドロキシル、又はニトロであり；

各々のR<sup>9</sup>は、独立に、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、又はヘテロアルキルであり；

W<sub>d</sub>は、1以上のR<sup>b</sup>、R<sup>11</sup>、又はR<sup>12</sup>で任意に置換されている、ヘテロシクリル、アリール、シクロアルキル、又はヘテロアリールであり；

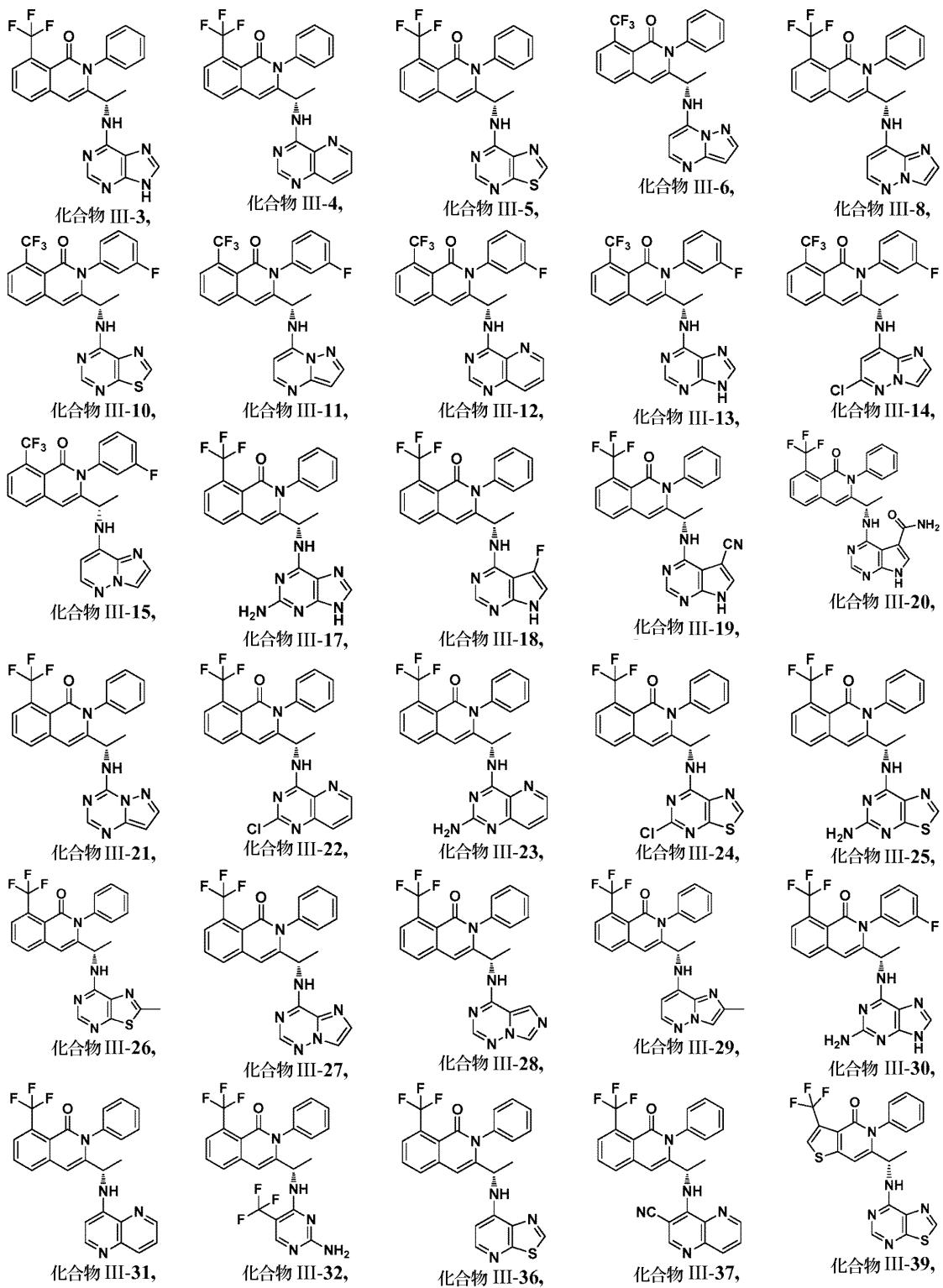
ここで、各々のR<sup>b</sup>は、独立に、水素、ハロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アミノ、ヘテロアルキル、又はヘテロシクリルであり；かつ

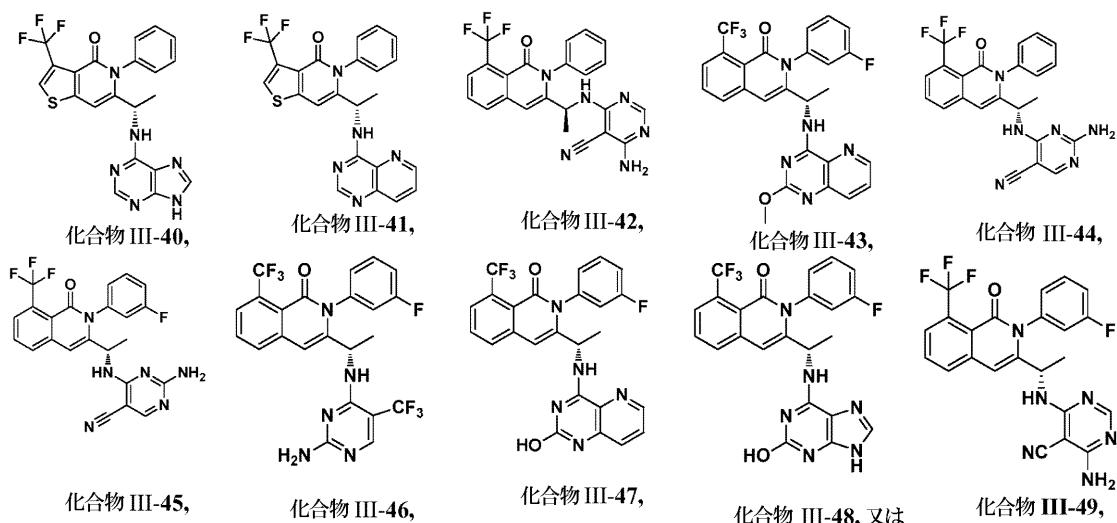
各々のR<sup>11</sup>及びR<sup>12</sup>は、独立に、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホニアミド、ハロ、ハロアルキル、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボン酸、カルボネート、オキソ、又はNR'R''であり、ここで、R'及びR''は、窒素と一緒に、環状部分を形成する)。

### 【請求項 3 3】

以下のもの：

【化 1 9】



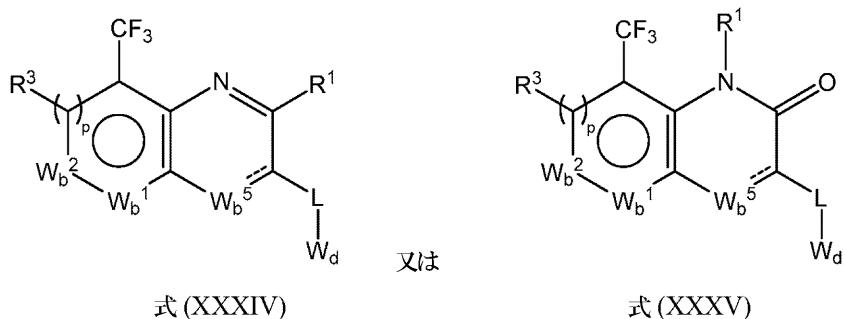


又はその医薬として許容し得る形態である、請求項32記載の化合物。

**【請求項34】**

式(XXXIV)もしくは(XXXV)の化合物、又はそのエナンチオマー、エナンチオマーの混合物、もしくは2以上のジアステレオマーの混合物、或いはその医薬として許容し得るその形態：

**【化20】**



(式中：

$W_b^1$ 及び $W_b^2$ は、各々独立に、 $CR^3$ 、S、O、N、又は $NR^{13}$ であり、ここで、 $W_b^1$ 及び $W_b^2$ のうちの少なくとも1つは、 $CR^3$ 、N、又は $NR^{13}$ であり；

pは、0、1、2、又は3であり；

$W_b^5$ は、 $CR^8$ 、 $CHR^8$ 、又はNであり；

$R^8$ は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシリル、アシリルオキシ、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、又はニトロであり；

$R^1$ は $-(L)-R^{1'}$ であり；

Lは、結合、-S-、-N( $R^{15}$ )-、-C(=O)-、又は-O-であり；

$R^{1'}$ は、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、アミド、アミノ、アシリル、アシリルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、置換窒素、又は $NR'R''$ であり、ここで、 $R'$ 及び $R''$ は、窒素と一緒に、環状部分を形成し；

各々の $R^{15}$ は、独立に、水素、アルキル、シクロアルキル、又はヘテロアルキルであり；

Xは、非存在であるか、又は $-(CH(R^{16}))_z$ であり；

Yは、非存在、-O-、-S-、-S(=O)-、-S(=O)<sub>2</sub>-、-N(R<sup>16</sup>)-、-C(=O)-(CHR<sup>16</sup>)<sub>z</sub>-、-C(=O)-、-N(R<sup>16</sup>)-C(=O)-、-N(R<sup>16</sup>)-C(=O)NH-、-N(R<sup>16</sup>)C(R<sup>16</sup>)<sub>2</sub>-、又は-C(=O)-N(R<sup>16</sup>)-(CHR<sup>16</sup>)<sub>z</sub>-であり；

各々のzは、1、2、3、又は4の整数であり；

各々のR<sup>3</sup>は、独立に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、フルオロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、スルフィニル、スルホニル、スルホキシド、スルホン、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヘテロアリール、アリール、ヒドロキシル、又はニトロであり；

各々のR<sup>13</sup>は、独立に、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、又はヘテロアルキルであり；

各々のR<sup>16</sup>は、独立に、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアルキル、アリール、ハロ、又はヘテロアリールであり；

W<sub>d</sub>は、1以上のR<sup>b</sup>、R<sup>11</sup>、又はR<sup>12</sup>で任意に置換されている、ヘテロシクリル、アリール、シクロアルキル、又はヘテロアリールであり；

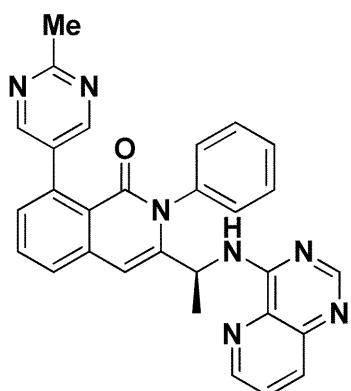
ここで、各々のR<sup>b</sup>は、独立に、水素、ハロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アミノ、ヘテロアルキル、又はヘテロシクリルであり；かつ

各々のR<sup>11</sup>及びR<sup>12</sup>は、独立に、水素、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、ハロアルキル、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボン酸、カルボネート、オキソ、又はNR'R''であり、ここで、R'及びR''は、窒素と一緒に、環状部分を形成する)。

### 【請求項 3 5】

以下のもの：

### 【化 2 1】



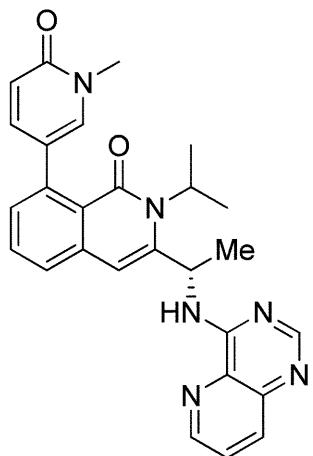
化合物 I-41,

又はその医薬として許容し得る形態である、請求項1記載の化合物。

### 【請求項 3 6】

以下のもの：

【化22】



化合物 I-106,

又はその医薬として許容し得る形態である、請求項1記載の化合物。

【請求項37】

請求項1～36のいずれか一項記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項38】

対象におけるPI3K媒介性障害を治療するための医薬組成物であって、治療的有効量の請求項1～36のいずれか一項記載の化合物を含む、前記医薬組成物。

【請求項39】

前記障害が、癌、炎症性疾患、又は自己免疫疾患である、請求項38記載の医薬組成物。

【請求項40】

前記癌が、白血病又はリンパ腫である、請求項39記載の医薬組成物。