

【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 0 7 D 217/24 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/5025 (2006.01)

A 6 1 K 31/53 (2006.01)

C 0 7 D 513/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 475/00 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 217/24

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 K 31/519

C 0 7 D 471/04 1 1 8 Z

C 0 7 D 471/04 1 1 4 Z

A 6 1 K 31/4725

C 0 7 D 487/04 1 4 2

C 0 7 D 487/04 1 4 4

A 6 1 K 31/5025

A 6 1 K 31/53

C 0 7 D 487/04 1 4 1

C 0 7 D 513/04 3 5 1

C 0 7 D 403/12 C S P

C 0 7 D 519/00 3 0 1

C 0 7 D 519/00 3 1 1

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 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

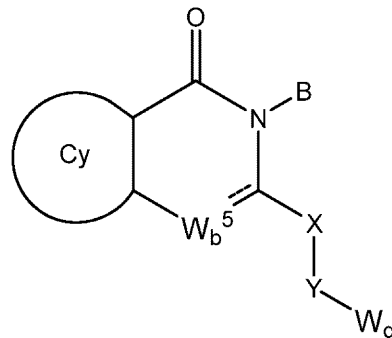
【補正の内容】

【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R³及び0～3回出現するR⁵で置換されたアリール又はヘテロアリールであり；

W_b⁵は、CR⁸、CHR⁸、又はNであり；

R⁸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R²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R²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(R⁹))_z-であり；

Yは、非存在、-O-、-S-、-S(=O)-、-S(=O)₂-、-N(R⁹)-、-C(=O)-(CHR⁹)_z-、-C(=O)-、-N(R⁹)-C(=O)NH-、又は-N(R⁹)C(R⁹)₂-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_b⁵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；

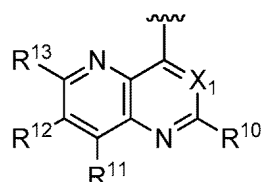
R^3 は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、フルオロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、スルフィニル、スルホニル、スルホキシド、スルホン、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヘテロアリール、アリール、ヒドロキシル、又はニトロであり；ここで、上記の置換基の各々は、0、1、2、又は3個の R^{17} で置換されることができ；

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^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)。

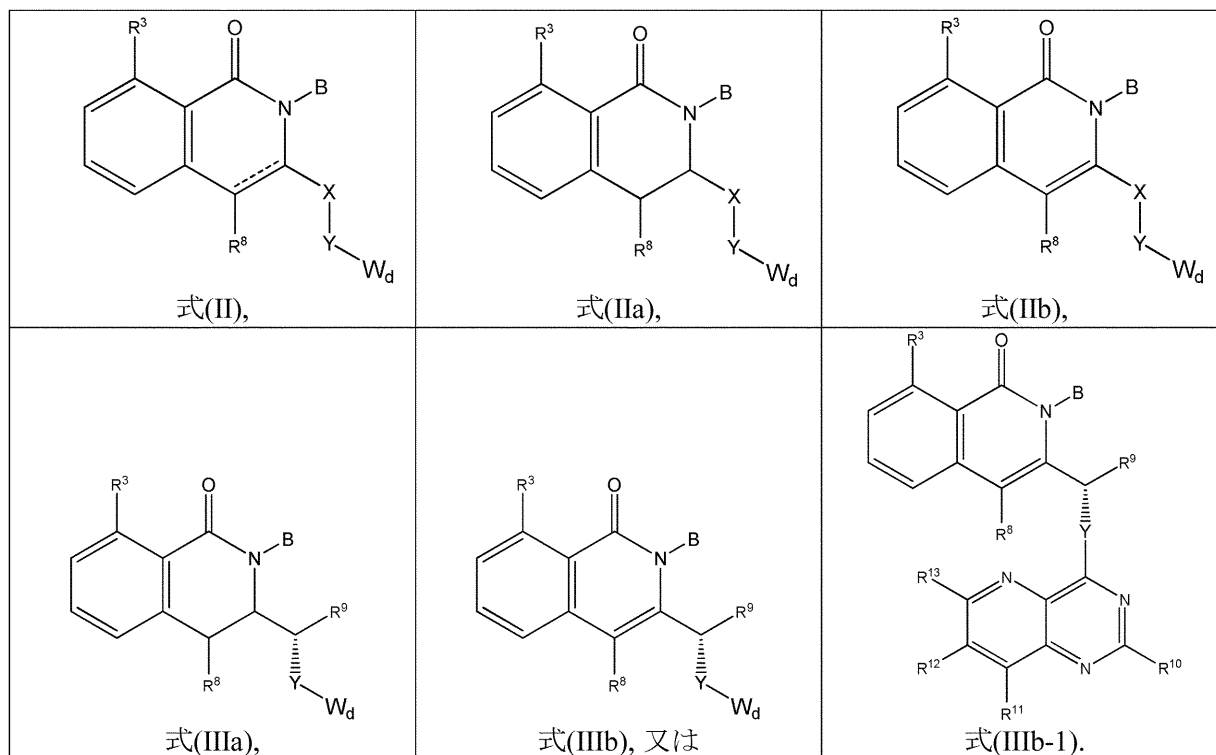
【請求項 2】

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R³及び0～3回出現するR⁵で置換された5員ヘテロアリアルである、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)、(VI Ib)、(VIIIa)、(VIIIb)、(IXa)、(IXb)又は(IXa-1)の構造：

【化 4】

<p>式(IVa),</p>	<p>式(IVb),</p>	<p>式(Va),</p>
<p>式(Vb),</p>	<p>式(Va-1),</p>	<p>式(VIa),</p>
<p>式(VIb),</p>	<p>式(VIIa),</p>	<p>式(VIIb),</p>
<p>式(VIIIa),</p>	<p>式(VIIIb),</p>	<p>式(IXa),</p>
<p>式(IXb), 又は</p>	<p>式(IXa-1).</p>	

を有する、請求項4記載の化合物。

【請求項 6】

R³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】

R³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(R⁹)-、又は-S(=O)₂-である、請求項1～8のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 1 0】

X-Yが、-CH₂-N(CH₃)-、(S)-CH(CH₃)-NH-又は(R)-CH(CH₃)-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 1 1】

X₁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 1 2】

R¹⁰、R¹¹、R¹²、及びR¹³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 1 3】

R¹⁰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。

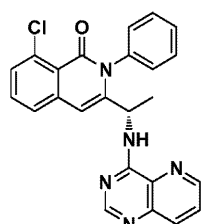
【請求項 1 4】

R⁸が水素である、請求項1～13のいずれか一項記載の化合物。

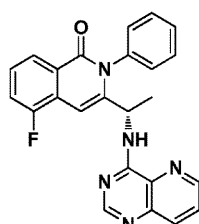
【請求項 1 5】

以下のもの：

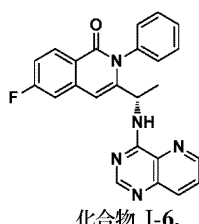
【化 5】



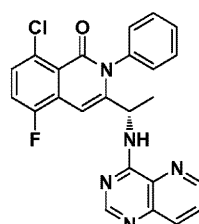
化合物 I-2,



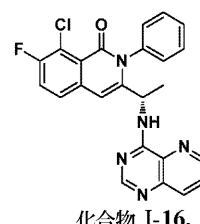
化合物 I-4,



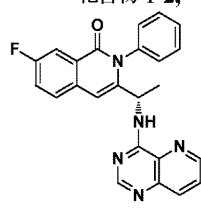
化合物 I-6,



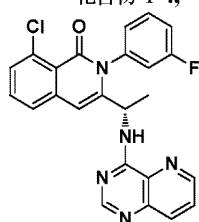
化合物 I-14,



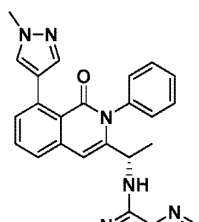
化合物 I-16,



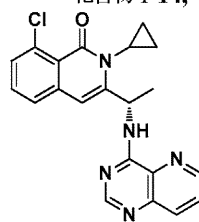
化合物 I-18,



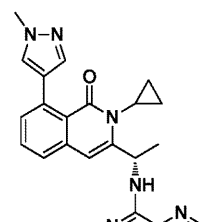
化合物 I-20,



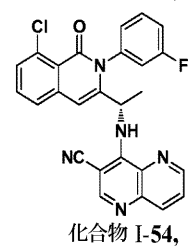
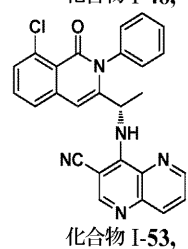
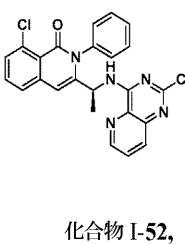
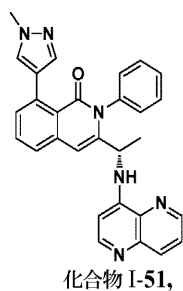
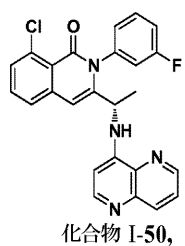
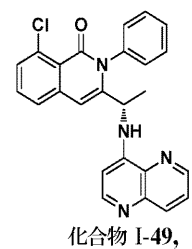
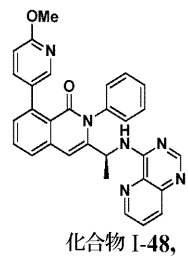
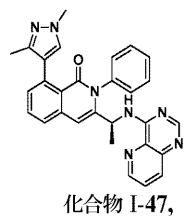
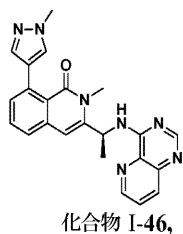
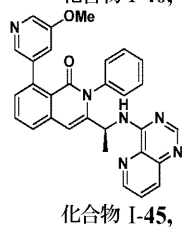
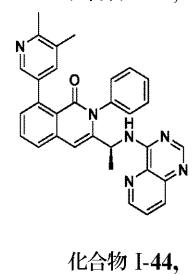
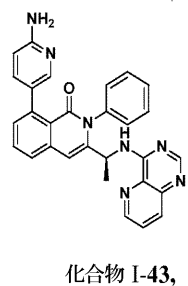
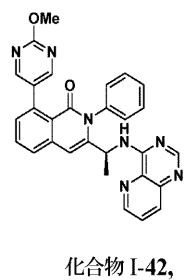
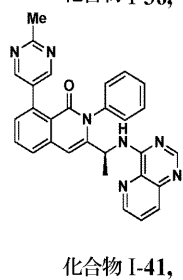
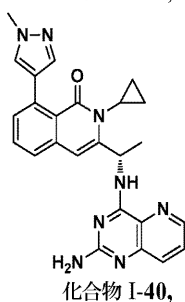
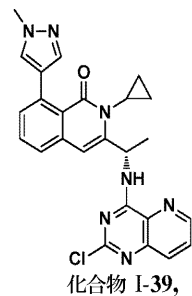
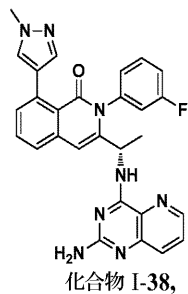
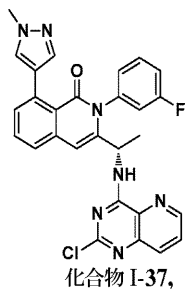
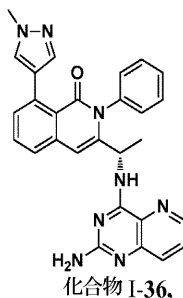
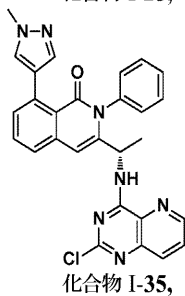
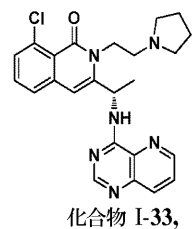
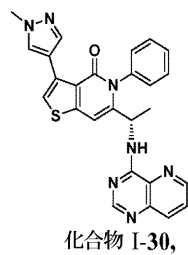
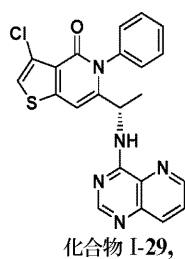
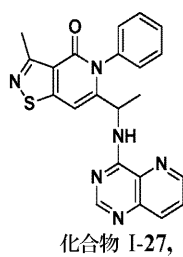
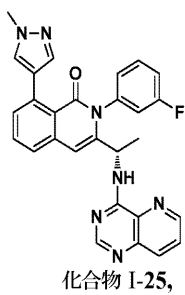
化合物 I-21,

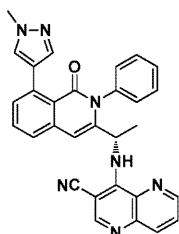


化合物 I-23,

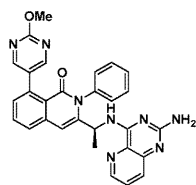


化合物 I-24,

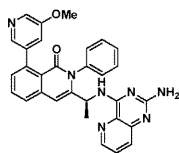




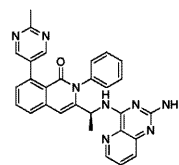
化合物 I-55,



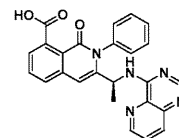
化合物 I-57,



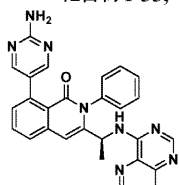
化合物 I-58,



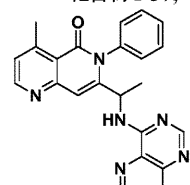
化合物 I-59,



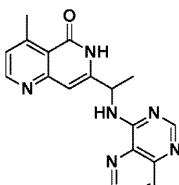
化合物 I-62,



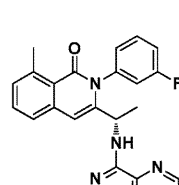
化合物 I-63,



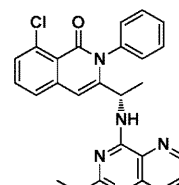
化合物 I-65,



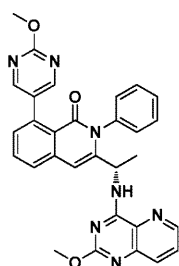
化合物 I-68,



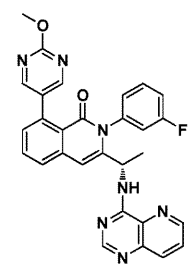
化合物 I-70,



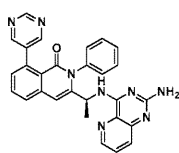
化合物 I-71,



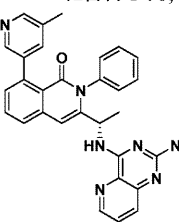
化合物 I-72,



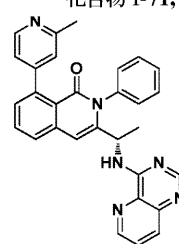
化合物 I-73,



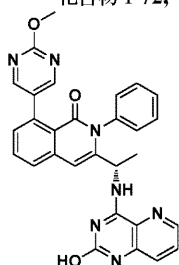
化合物 I-74,



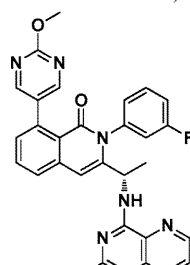
化合物 I-75,



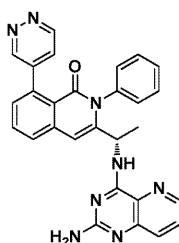
化合物 I-76,



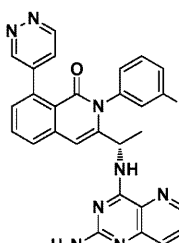
化合物 I-77,



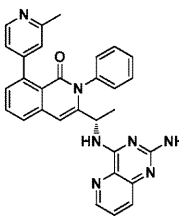
化合物 I-78,



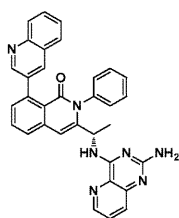
化合物 I-79,



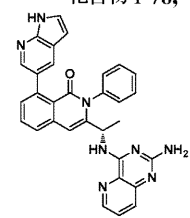
化合物 I-80,



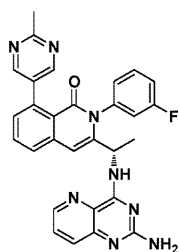
化合物 I-81,



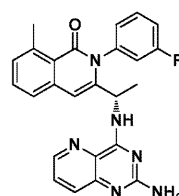
化合物 I-82,



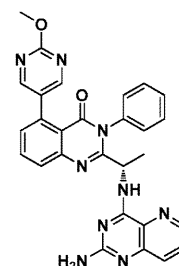
化合物 I-83,



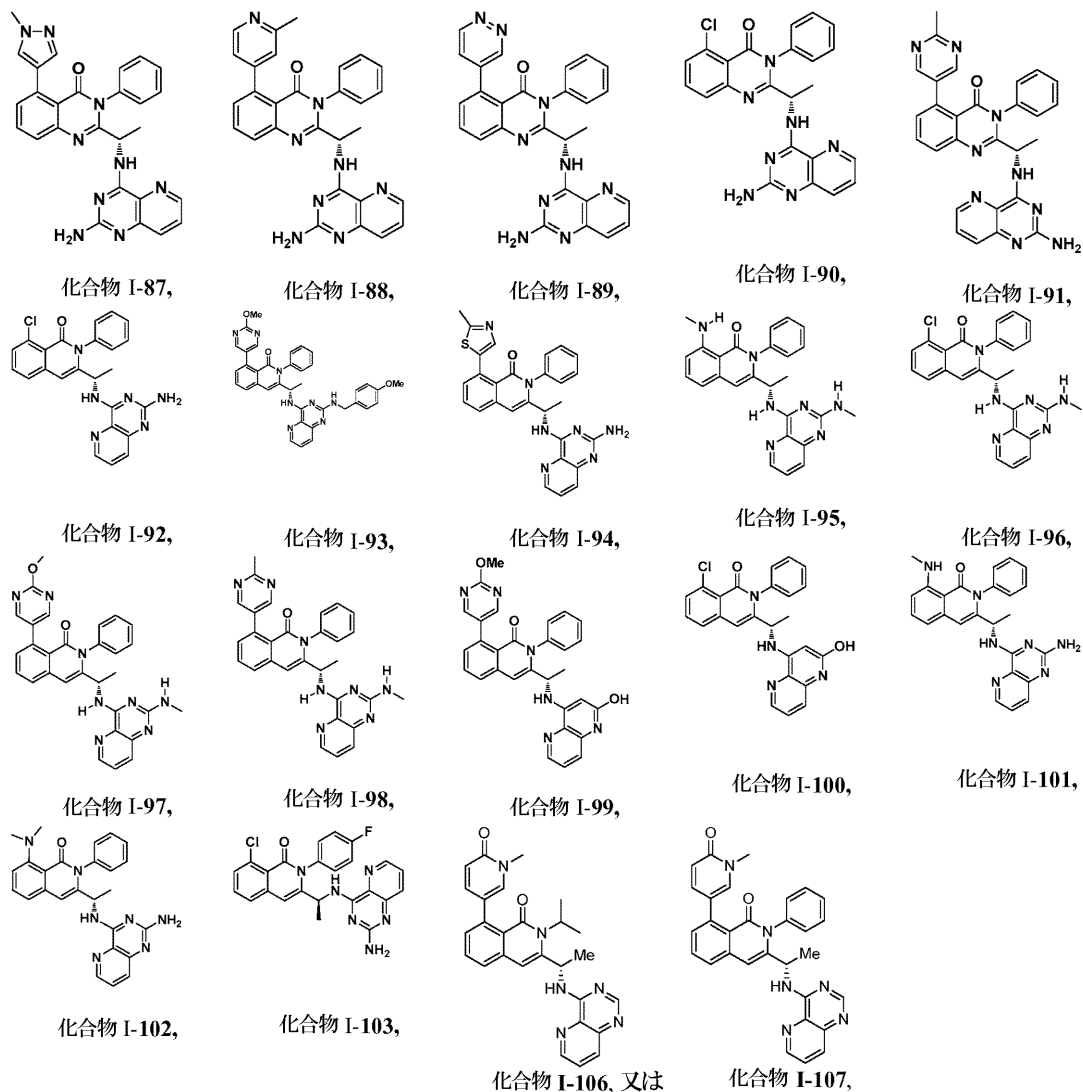
化合物 I-84,



化合物 I-85,



化合物 I-86,

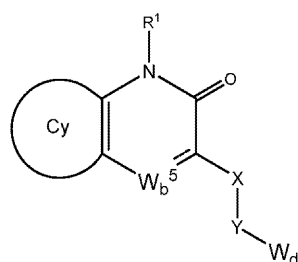


又はその医薬として許容し得る形態である、請求項1記載の化合物。

【請求項 16】

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^3 及び0～3回出現する R^5 で置換されたアリール又はヘテロアリールであり；

R^1 は $-(L)-R^{1'}$ であり；

Lは、結合、 $-S-$ 、 $-N(R^{15})-$ 、 $-C(R^{15})_2-$ 、 $-C(=O)-$ 、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^{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；

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^{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、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 $-(CH(R^{16}))_z-$ であり；

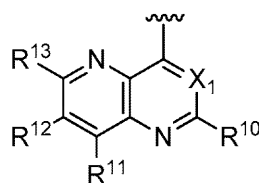
Yは、非存在、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、 $-N(R^{16})-$ 、 $-C(=O)-(CHR^{16})_z-$ 、 $-C(=O)-N(R^{16})-C(=O)-$ 、 $-N(R^{16})-C(=O)NH-$ 、 $-N(R^{16})C(R^{16})_2-$ 、又は $-C(=O)-N(R^{16})-(CHR^{16})_z-$ であり；

各々のzは、1、2、3、又は4の整数であり；

各々の R^{16} 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_d は、

【化7】



であり、

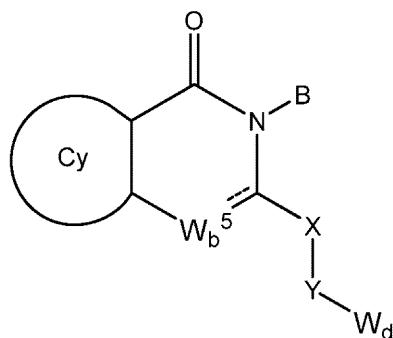
ここで、 X_1 は、N又は CR^{14} であり；

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 (XII)

(式中、

Cyは、0～1回出現するR³及び0～3回出現するR⁵で置換されたアリール又はヘテロアリールであり；

W_h^5 は、 CR^8 、 CHR^8 、又は N であり、

R⁸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R²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；

R²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 $-(\text{CH}(\text{R}^9))_z-$ であり；

Yは、非存在、-O-、-S-、-S(=O)-、-S(=O)₂-、-N(R⁹)-、-C(=O)-(CHR⁹)₂-、-C(=O)-、-N(R⁹)-C(=O)NH-、又は-N(R⁹)C(R⁹)₂-であり；

各々の z は、独立に、1、2、3、又は4の整数であり；

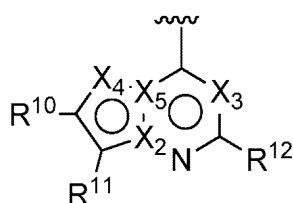
R³は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、スルフィニル、スルホニル、スルホキシド、スルホン、スルホンアミド、ハロ、シアノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシル、又はニトロであり；ここで、上記の置換基の各々は、0、1、2、又は3個のR¹⁷で置換されることができ；

各々のR⁵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R⁹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 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^{13} 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^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、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)。

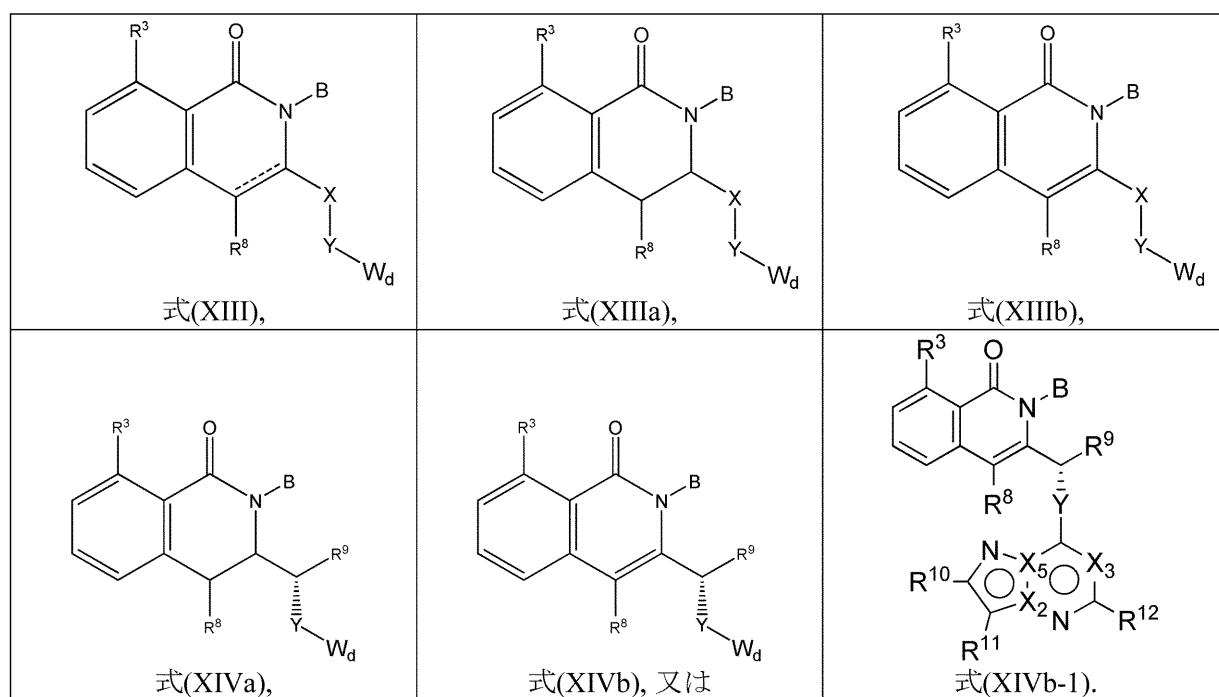
【請求項 18】

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17記載の化合物。

【請求項 19】

式(XII)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。

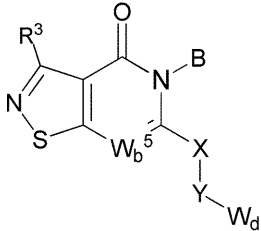
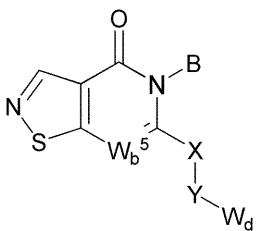
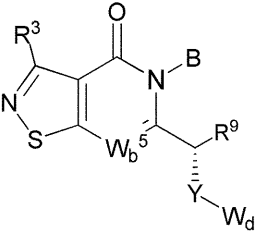
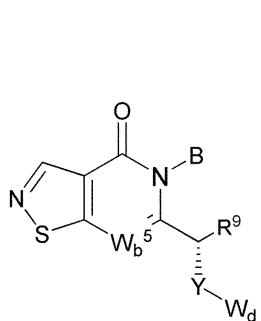
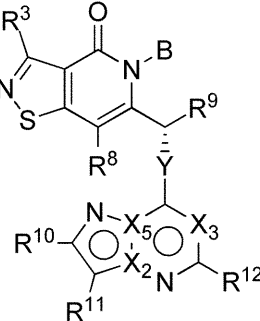
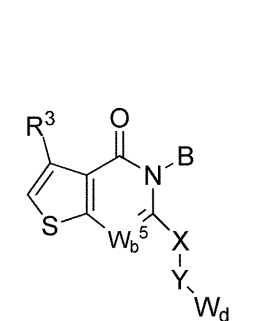
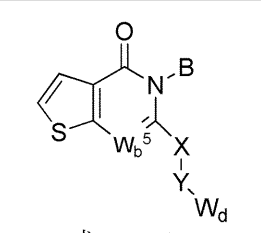
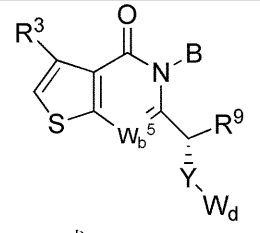
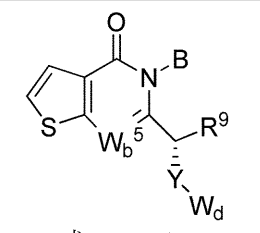
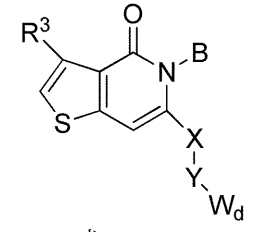
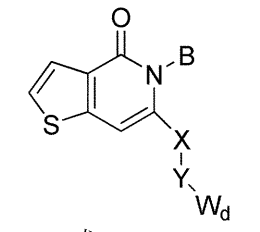
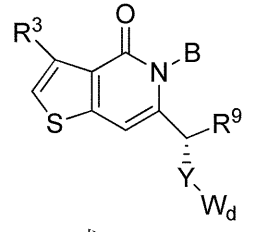
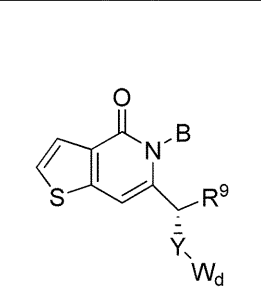
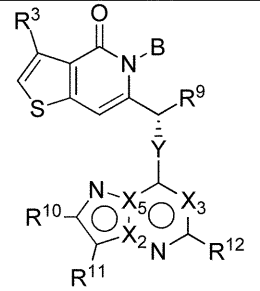
【請求項 20】

Cyが、0～1回出現する R^3 及び0～3回出現する R^5 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(XII)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 1 1】

 <p>式(XVa),</p>	 <p>式(XVb),</p>	 <p>式(XVIa),</p>
 <p>式(XVIb),</p>	 <p>式(XVIa-1),</p>	 <p>式(XVIIa),</p>
 <p>式(XVIIb),</p>	 <p>式(XVIIIa),</p>	 <p>式(XVIIIb),</p>
 <p>式(XIXa),</p>	 <p>式(XIXb),</p>	 <p>式(XXa),</p>
 <p>式(XXb), 又は</p>	 <p>式(XXa-1).</p>	

を有する、請求項20記載の化合物。

【請求項 2 2】

R³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 2 3】

R³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。

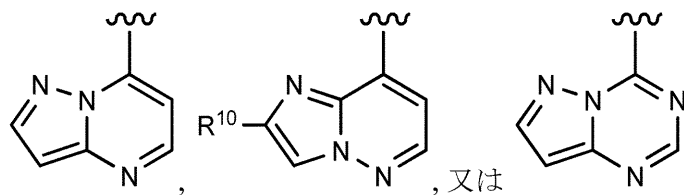
【請求項 2 4】

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 25】

W_d が、

【化 12】



である、請求項17～24のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 26】

Y が、非存在、 $-O-$ 、 $-NH(R^9)-$ 、又は $-S(=O)_2-$ である、請求項17～25のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 27】

$X-Y$ が、 $-CH_2-N(CH_3)-$ 、 $(S)-CH(CH_3)-NH-$ 、又は $(R)-CH(CH_3)-NH-$ である、請求項17～26のいずれか一項記載の化合物。

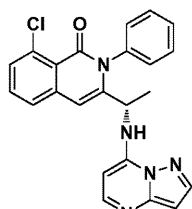
【請求項 28】

R^8 が水素である、請求項17～27のいずれか一項記載の化合物。

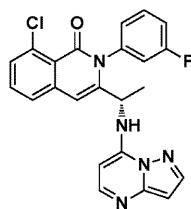
【請求項 29】

以下のもの：

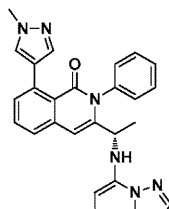
【化 1 3】



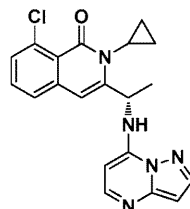
化合物 II-2,



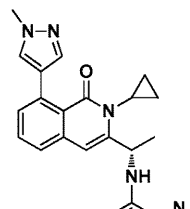
化合物 II-4,



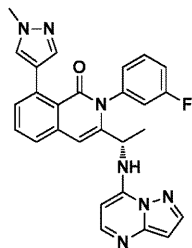
化合物 II-5,



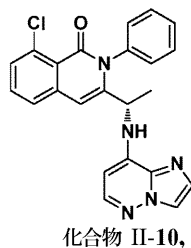
化合物 II-7,



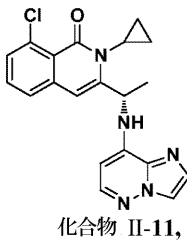
化合物 II-8,



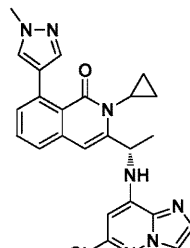
化合物 II-9,



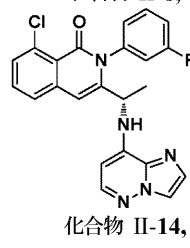
化合物 II-10,



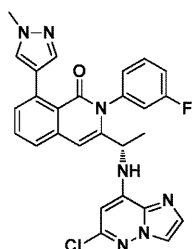
化合物 II-11,



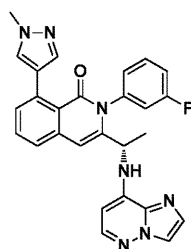
化合物 II-13,



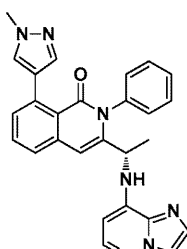
化合物 II-14,



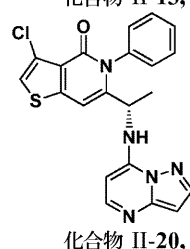
化合物 II-16,



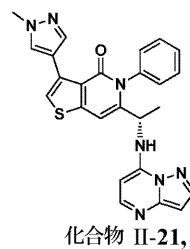
化合物 II-17,



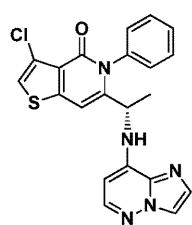
化合物 II-18,



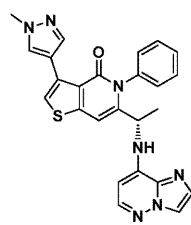
化合物 II-20,



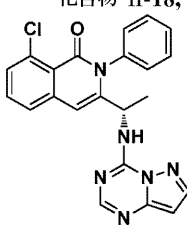
化合物 II-21,



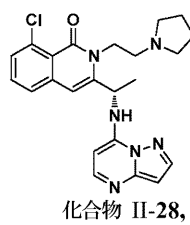
化合物 II-22,



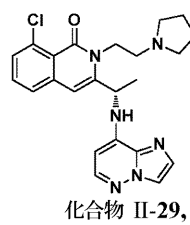
化合物 II-23,



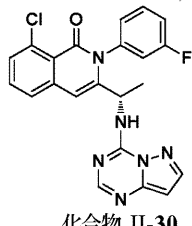
化合物 II-24,



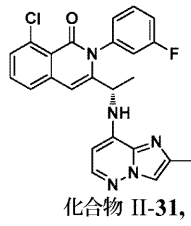
化合物 II-28,



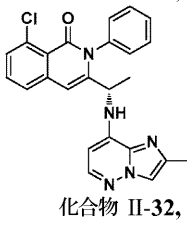
化合物 II-29,



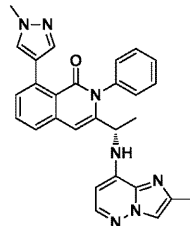
化合物 II-30,



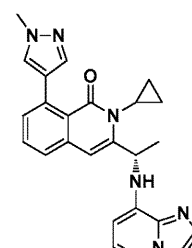
化合物 II-31,



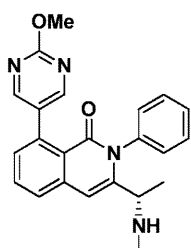
化合物 II-32,



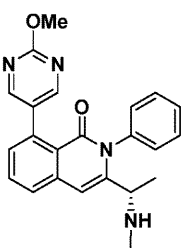
化合物 II-33,



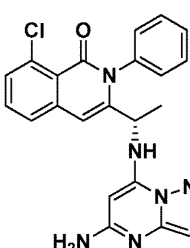
化合物 II-45,



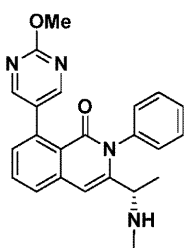
化合物 II-47,



化合物 II-48,



化合物 II-49, 又は



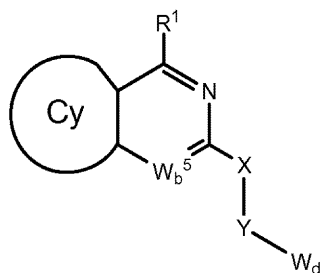
化合物 II-50,

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^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^3 及び0～3回出現する R^5 で置換されたアリール又はヘテロアリールであり；

R^1 は $-(L)-R^{1'}$ であり；

Lは、結合、 $-S-$ 、 $-N(R^{16})-$ 、 $-C(R^{15})_2-$ 、 $-C(=O)-$ 、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、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；

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、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^{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、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、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 $-(CH(R^{14}))_z$ であり；

Yは、非存在、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、 $-N(R^9)-$ 、 $-C(=O)-(CHR^{14})_z-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-N(R^9)-C(=O)-$ 、 $-N(R^9)-C(=O)NH-$ 、 $-N(R^9)C(R^{14})_2-$ 、又は $-C(=O)-(CHR^{14})_z-$ であり；

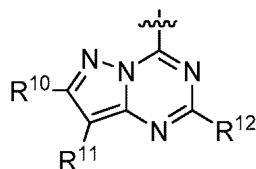
各々のzは、1、2、3、又は4の整数であり；

各々の R^9 及び R^{16} 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^{14} 及び R^{15} 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_d は、

【化 1 5】



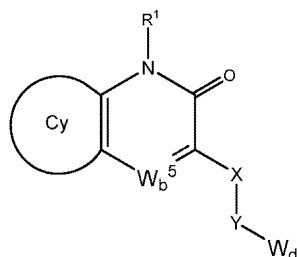
であり、

ここで、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、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 $NR^{1'}$ であり、ここで、 $R^{1'}$ 及び $R^{1'}$ は、窒素と一緒に、環状部分を形成する)。

【請求項 3 1】

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 1 6】



式(XXII),

(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^3 及び0～3回出現する R^5 で置換されたアリール又はヘテロアリールであり；

R^1 は $-(L)-R^{1'}$ であり；

Lは、結合、 $-S-$ 、 $-N(R^{15})-$ 、 $-C(R^{15})_2-$ 、 $-C(=O)-$ 、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 $NR^{1'}$ であり、ここで、 $R^{1'}$ 及び $R^{1'}$ 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；

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、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^{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、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、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、又は $\text{NR}^1\text{R}^{1'}$ であり、ここで、 R^1 及び $\text{R}^{1'}$ は、窒素と一緒に、環状部分を形成し；

X は、 $-(\text{CH}(\text{R}^9))_z$ であり；

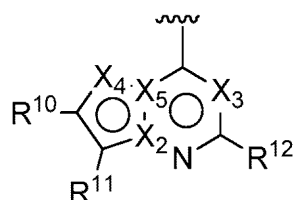
Y は、非存在、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{S}(=\text{O})-$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^9)-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-(\text{CHR}^9)_z-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^9)-\text{C}(=\text{O})-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^9)-\text{C}(=\text{O})\text{NH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^9)\text{C}(\text{R}^9)_2-$ 、又は $-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{R}^9)-(\text{CHR}^9)_z-$ であり；

各々の z は、1、2、3、又は4の整数であり；

各々の R^9 は、独立に、水素、アルキル、シクロアルキル、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_d は、

【化 1 7】



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；

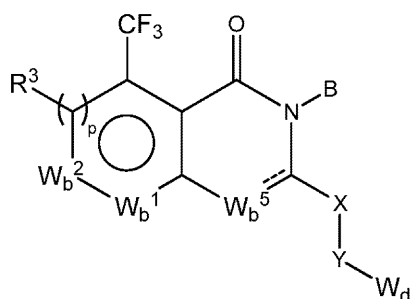
ここで、 X_3 及び X_4 は、各々独立に、 CR^{13} 及び N から選択され；かつ

各々の R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、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 $\text{NR}^1\text{R}^{1'}$ であり、ここで、 R^1 及び $\text{R}^{1'}$ は、窒素と一緒に、環状部分を形成する)。

【請求項 3 2】

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 1 8】



式(XXV)

(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^2 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 $-(CH(R^9))_z-$ であり；

Yは、非存在、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、 $-N(R^9)-$ 、 $-C(=O)-(CHR^9)_z-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-N(R^9)-C(=O)NH-$ 、又は $-N(R^9)C(R^9)_2-$ 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_b^5 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^2 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；

各々の R^3 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^9 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_d は、1以上の R^b 、 R^{11} 、又は R^{12} 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；

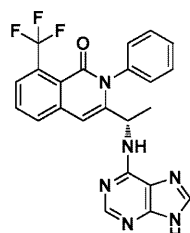
ここで、各々の R^b は、独立に、水素、ハロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アミノ、ヘテロアルキル、又はヘテロシクリルであり；かつ

各々の R^{11} 及び R^{12} 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)。

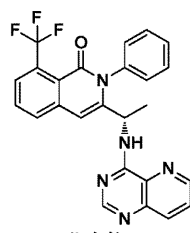
【請求項 33】

以下のもの：

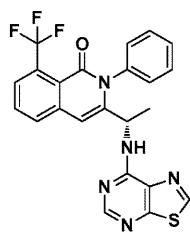
【化 19】



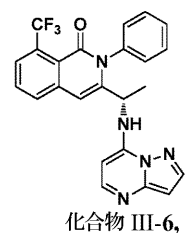
化合物 III-3,



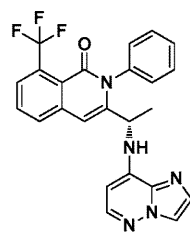
化合物 III-4,



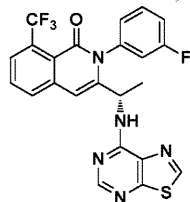
化合物 III-5,



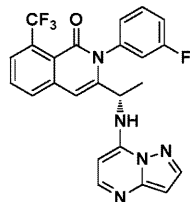
化合物 III-6,



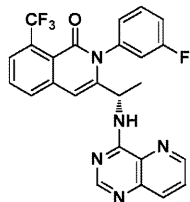
化合物 III-8,



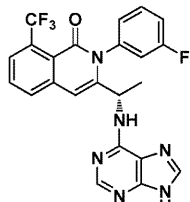
化合物 III-10,



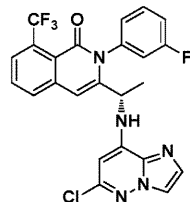
化合物 III-11,



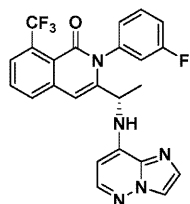
化合物 III-12,



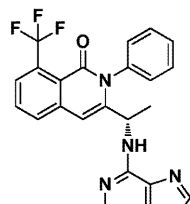
化合物 III-13,



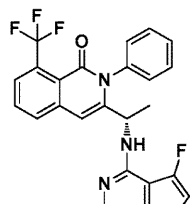
化合物 III-14,



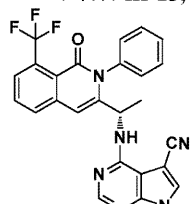
化合物 III-15,



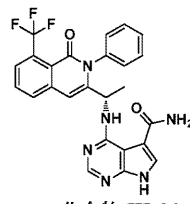
化合物 III-17,



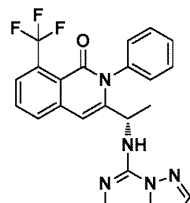
化合物 III-18,



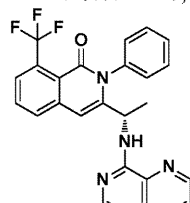
化合物 III-19,



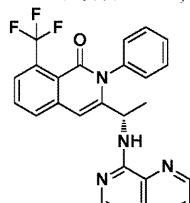
化合物 III-20,



化合物 III-21,



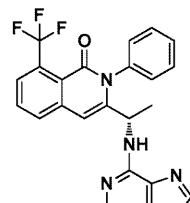
化合物 III-22,



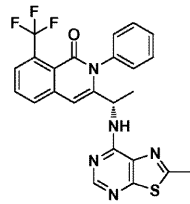
化合物 III-23,



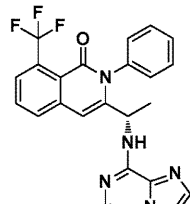
化合物 III-24,



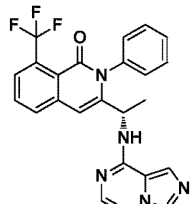
化合物 III-25,



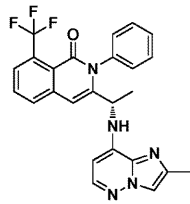
化合物 III-26,



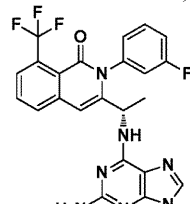
化合物 III-27,



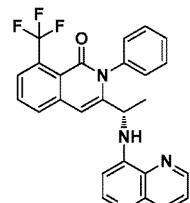
化合物 III-28,



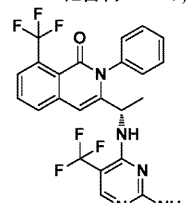
化合物 III-29,



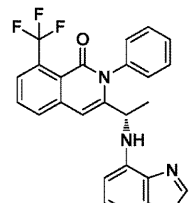
化合物 III-30,



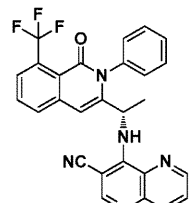
化合物 III-31,



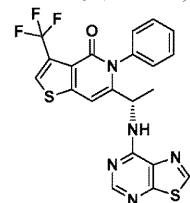
化合物 III-32,



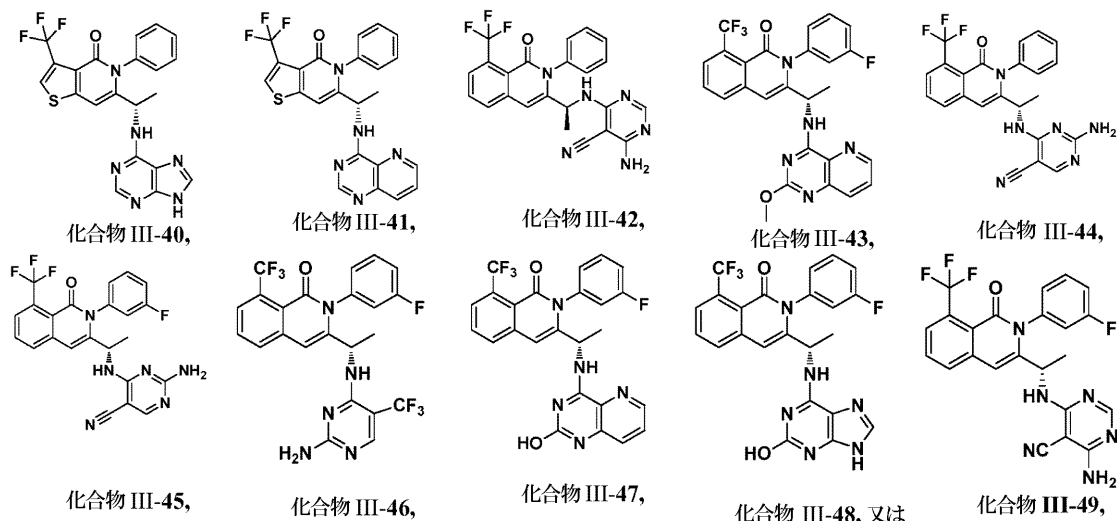
化合物 III-36,



化合物 III-37,



化合物 III-39,

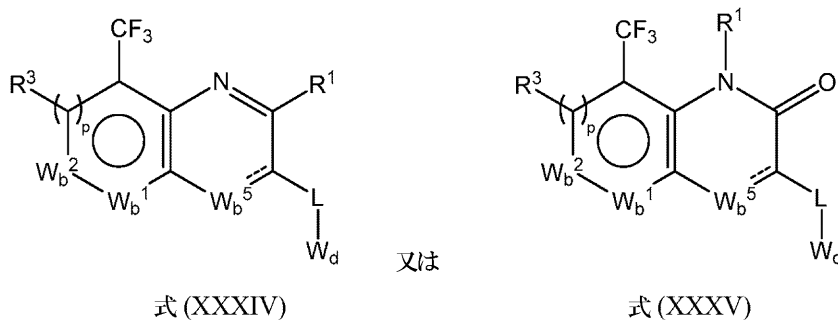


又はその医薬として許容し得る形態である、請求項32記載の化合物。

【請求項 3 4】

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 2 0】



(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；

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^{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)₂-、-N(R¹⁶)-、-C(=O)-(CHR¹⁶)_z-、-C(=O)-、-N(R¹⁶)-C(=O)-、-N(R¹⁶)-C(=O)NH-、-N(R¹⁶)C(R¹⁶)₂-、又は-C(=O)-N(R¹⁶)-(CHR¹⁶)_z-であり；

各々のzは、1、2、3、又は4の整数であり；

各々のR³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R¹³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R¹⁶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_dは、1以上のR^b、R¹¹、又はR¹²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；

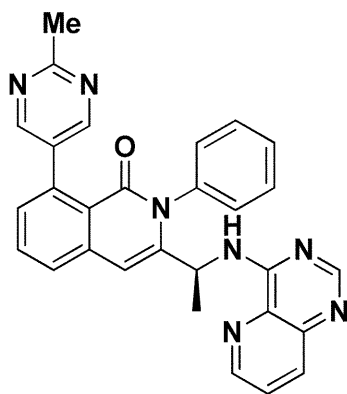
ここで、各々のR^bは、独立に、水素、ハロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アミノ、ヘテロアルキル、又はヘテロシクリルであり；かつ

各々のR¹¹及びR¹²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】



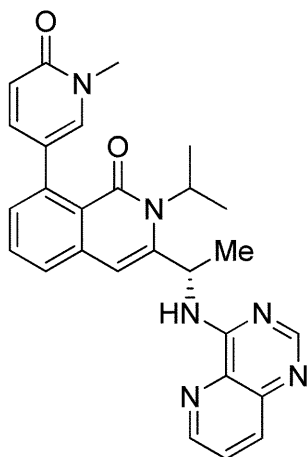
化合物 I-41,

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 2 2】



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。