

【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23年11月24日 (2011.11.24)

【公表番号】特表2010-540610(P2010-540610A)

【公表日】平成22年12月24日 (2010.12.24)

【年通号数】公開・登録公報2010-051

【出願番号】特願2010-527532(P2010-527532)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 451/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/14 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 451/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/14 C S P

C 0 7 D 403/12

A 6 1 K 31/506

C 0 7 D 413/14

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 451/04

C 0 7 D 403/14

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D 451/14

A 6 1 K 31/55

C 0 7 D 409/14

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成23年10月4日 (2011.10.4)

【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

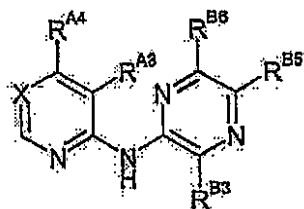
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

次式：

## 【化 1】



[ 式中、

-X=は-CR<sup>A5</sup>=であり；

-R<sup>A5</sup>は-Q<sup>A5</sup>であり；

-R<sup>A3</sup>は-Hであり；

-R<sup>A4</sup>は独立して-Q<sup>A4N</sup>または-O-Q<sup>A4O</sup>であり；

-R<sup>B3</sup>は-Hであり；

-R<sup>B5</sup>は-Q<sup>B5</sup>であり；

-Q<sup>B5</sup>は-CNであり；および

-R<sup>B6</sup>は-Hまたは-Q<sup>B6</sup>であり、

およびここで、

-Q<sup>A4N</sup>は独立して-Q<sup>A4N1</sup>または-Q<sup>A4N2</sup>であり；

-Q<sup>A4N1</sup>は独立して-NHR<sup>QN1</sup>または-NR<sup>QN1</sup><sub>2</sub>であり；

-Q<sup>A4N2</sup>は-NR<sup>QN2</sup>R<sup>QN3</sup>であり；

各-R<sup>QN1</sup>は独立して、

-R<sup>I1</sup>、-R<sup>I4</sup>、-R<sup>I6</sup>、-R<sup>I7</sup>、-R<sup>I8</sup>、-L<sup>I</sup>-R<sup>I4</sup>、-L<sup>I</sup>-R<sup>I6</sup>、-L<sup>I</sup>-R<sup>I7</sup>、または-L<sup>I</sup>-R<sup>I8</sup>であり；

ここで、

各-R<sup>I1</sup>は飽和脂肪族C<sub>1-6</sub>アルキルであり；

各-R<sup>I4</sup>は飽和C<sub>3-6</sub>シクロアルキルであり；

各-R<sup>I6</sup>は非芳香族C<sub>3-8</sub>ヘテロシクリルであり；

各-R<sup>I7</sup>はフェニルであり；

各-R<sup>I8</sup>はC<sub>5-6</sub>ヘテロアリールであり；

各-L<sup>I</sup>は飽和脂肪族C<sub>1-3</sub>アルキレンであり；

およびここで、

各C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、非芳香族C<sub>3-8</sub>ヘテロシクリル、フェニル、C<sub>5-6</sub>ヘテロアリール、およびC<sub>1-3</sub>アルキレンは、1以上の置換基-R<sup>I9</sup>により任意に置換され、

ここで、各-R<sup>I9</sup>は独立して、

-R<sup>L1</sup>、

-OH、-OR<sup>L1</sup>、

-NH<sub>2</sub>、-NHR<sup>L1</sup>、-NR<sup>L1</sup><sub>2</sub>、-NR<sup>L2</sup>R<sup>L3</sup>、

-C(=O)NH<sub>2</sub>、-C(=O)NHR<sup>L1</sup>、-C(=O)NR<sup>L1</sup><sub>2</sub>、または-C(=O)NR<sup>L2</sup>R<sup>L3</sup>であり；

ここで、

各-NR<sup>L2</sup>R<sup>L3</sup>は独立してピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、またはモルホリノであり、

そして任意に、C<sub>1-3</sub>アルキルおよび-CF<sub>3</sub>から選択される1以上の基により置換されており

；

各-R<sup>L1</sup>は独立して：

-R<sup>Z1</sup>、-R<sup>Z7</sup>、または-L<sup>Z</sup>-R<sup>Z7</sup>であり；

ここで、

各-R<sup>Z1</sup>は飽和脂肪族C<sub>1-6</sub>アルキルであり；

各-R<sup>Z7</sup>はフェニルであり；

各-L<sup>Z</sup>は飽和脂肪族C<sub>1-3</sub>アルキレンであり；

およびここで、

各C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>6-10</sub>カルボアリール、およびC<sub>1-3</sub>アルキレンは、1以上の置換基-R<sup>Z9</sup>により任意に置換され、

ここで各  $-R^{Z9}$  は独立して：

$-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、

$-R^{ZZ1}$ 、

$-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、

$-OH$ 、 $-L^{ZZ}-OH$ 、

$-OR^{ZZ1}$ 、 $-L^{ZZ}-OR^{ZZ1}$ 、

$-NH_2$ 、 $-NHR^{ZZ1}$ 、 $-NR^{ZZ1}_2$ 、 $-NR^{ZZ2}R^{ZZ3}$ 、

$-L^{ZZ}-NH_2$ 、 $-L^{ZZ}-NHR^{ZZ1}$ 、 $-L^{ZZ}-NR^{ZZ1}_2$ 、 $-L^{ZZ}-NR^{ZZ2}R^{ZZ3}$ 、

$-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR^{ZZ1}$ 、

$-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=O)NHR^{ZZ1}$ 、 $-C(=O)NR^{ZZ1}_2$ 、または  $-C(=O)NR^{ZZ2}R^{ZZ3}$  であり；

ここで、

各  $-R^{ZZ1}$  は独立して飽和脂肪族  $C_{1-4}$  アルキル、フェニル、またはベンジルであり；

各  $-L^{ZZ}$  は飽和脂肪族  $C_{1-5}$  アルキレンであり；そして

各  $-NR^{ZZ2}R^{ZZ3}$  は独立してピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、またはモルホリノであり、そして任意に、 $C_{1-3}$  アルキルおよび  $-CF_3$  から選択される1以上の基により置換されており；

およびここで、

$-NR^{QN2}R^{QN3}$  は独立してピペリジノ、ピペラジノ、またはモルホリノであり、そして1以上の置換基  $-R^{QNR}$  により任意に置換されており、

ここで、各  $-R^{QNR}$  は独立して：

$-R^{AA1}$ 、

$-NH_2$ 、 $-NHR^{AA1}$ 、 $-NR^{AA1}_2$ 、 $-NR^{AA2}R^{AA3}$ 、

$-L^{AA}-NH_2$ 、 $-L^{AA}-NHR^{AA1}$ 、 $-L^{AA}-NR^{AA1}_2$ 、または  $-L^{AA}-NR^{AA2}R^{AA3}$  であり；

ここで、

各  $-L^{AA}$  は飽和脂肪族  $C_{1-5}$  アルキレンであり；

各  $-NR^{AA2}R^{AA3}$  は独立してピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、またはモルホリノであり、そして任意に、 $C_{1-3}$  アルキルおよび  $-CF_3$  から選択される1以上の基により置換されており；

各  $-R^{AA1}$  は独立して  $-R^{BB1}$ 、 $-R^{BB7}$ 、または  $-L^{BB}-R^{BB7}$  であり；

ここで、

各  $-R^{BB1}$  は飽和脂肪族  $C_{1-6}$  アルキルであり；

各  $-R^{BB7}$  はフェニルであり；

各  $-L^{BB}$  は飽和脂肪族  $C_{1-3}$  アルキレンであり；

および、ここで、

各  $C_{1-6}$  アルキル、フェニルおよび  $C_{1-3}$  アルキレンは、1以上の置換基  $-R^{BB9}$  により任意に置換され；

ここで各  $-R^{BB9}$  は独立して：

$-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、

$-R^{CC1}$ 、

$-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、

$-OH$ 、 $-L^{CC}-OH$ 、

$-OR^{CC1}$ 、 $-L^{CC}-OR^{CC1}$ 、

$-NH_2$ 、 $-NHR^{CC1}$ 、 $-NR^{CC1}_2$ 、 $-NR^{CC2}R^{CC3}$ 、

$-L^{CC}-NH_2$ 、 $-L^{CC}-NHR^{CC1}$ 、 $-L^{CC}-NR^{CC1}_2$ 、 $-L^{CC}-NR^{CC2}R^{CC3}$ 、

$-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR^{CC1}$ 、

$-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=O)NHR^{CC1}$ 、 $-C(=O)NR^{CC1}_2$ 、または  $-C(=O)NR^{CC2}R^{CC3}$  であり；

ここで、

各  $-R^{CC1}$  は独立して飽和脂肪族  $C_{1-4}$  アルキル、フェニル、またはベンジルであり；

各  $-L^{CC}$  は飽和脂肪族  $C_{1-5}$  アルキレンであり；および

各  $-NR^{CC2}R^{CC3}$  は独立してピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、またはモルホリノであり

、そして任意に、 $C_{1-3}$ アルキルおよび $-CF_3$ から選択される1以上の基により置換されてお

り；

およびここで、

$-Q^{A40}$ は独立して $-R^{C1}$ であり、ここで $-R^{C1}$ は独立して、

$-R^{D1}$ 、 $-R^{D6}$ 、 $-R^{D7}$ 、 $-R^{D8}$ 、 $-L^D-R^{D6}$ 、 $-L^D-R^{D7}$ 、または $-L^D-R^{D8}$ であり；

ここで、

各 $-R^{D1}$ は飽和脂肪族 $C_{1-6}$ アルキルであり；

各 $-R^{D6}$ は非芳香族 $C_{3-8}$ ヘテロシクリルであり；

各 $-R^{D7}$ はフェニルであり；

各 $-R^{D8}$ は $C_{5-6}$ ヘテロアリールであり；

各 $-L^D$ は飽和脂肪族 $C_{1-3}$ アルキレンであり；

および、ここで、

各 $C_{1-6}$ アルキル、非芳香族 $C_{3-8}$ ヘテロシクリル、フェニル、 $C_{6-10}$ カルボアリール、 $C_{5-6}$ ヘテロアリール、および $C_{1-3}$ アルキレンは、1以上の置換基 $-R^{D9}$ により任意に置換され、  
ここで、各 $-R^{D9}$ は独立して：

$-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、

$-R^{E1}$ 、

$-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、

$-OH$ 、 $-L^E-OH$ 、 $-O-L^E-OH$ 、

$-OR^{E1}$ 、 $-L^E-OR^{E1}$ 、 $-O-L^E-OR^{E1}$ 、

$-NH_2$ 、 $-NHR^{E1}$ 、 $-NR^{E1}_2$ 、 $-NR^{E2}R^{E3}$ 、

$-L^E-NH_2$ 、 $-L^E-NHR^{E1}$ 、 $-L^E-NR^{E1}_2$ 、 $-L^E-NR^{E2}R^{E3}$ 、

$-O-L^E-NH_2$ 、 $-O-L^E-NHR^{E1}$ 、 $-O-L^E-NR^{E1}_2$ 、 $-O-L^E-NR^{E2}R^{E3}$ 、

$-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR^{E1}$ 、

$-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=O)NHR^{E1}$ 、 $-C(=O)NR^{E1}_2$ 、または $-C(=O)NR^{E2}R^{E3}$ であり；

ここで、

各 $-R^{E1}$ は独立して飽和脂肪族 $C_{1-4}$ アルキル、フェニル、またはベンジルであり；

各 $-L^E$ は飽和脂肪族 $C_{1-5}$ アルキレンであり；および

各 $-NR^{E2}R^{E3}$ は独立してピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、またはモルホリノであり、  
そして任意に、 $C_{1-3}$ アルキルおよび $-CF_3$ から選択される1以上の基により置換されており

；

およびここで、

$-Q^{A5}$ は独立して、

$-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、

$-R^{J1}$ 、

$-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、

$-OH$ 、 $-L^J-OH$ 、 $-O-L^J-OH$ 、

$-OR^{J1}$ 、 $-L^J-OR^{J1}$ 、 $-O-L^J-OR^{J1}$ 、

$-CN$ 、

$-NH_2$ 、 $-NHR^{J1}$ 、 $-NR^{J1}_2$ 、 $-NR^{J2}R^{J3}$ 、

$-L^J-NH_2$ 、 $-L^J-NHR^{J1}$ 、 $-L^J-NR^{J1}_2$ 、 $-L^J-NR^{J2}R^{J3}$ 、

$-O-L^J-NH_2$ 、 $-O-L^J-NHR^{J1}$ 、 $-O-L^J-NR^{J1}_2$ 、 $-O-L^J-NR^{J2}R^{J3}$ 、

$-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR^{J1}$ 、

$-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=O)NHR^{J1}$ 、 $-C(=O)NR^{J1}_2$ 、 $-C(=O)NR^{J2}R^{J3}$ 、

$-NHC(=O)R^{J1}$ 、 $-NR^{J1}C(=O)R^{J1}$ 、 $-NHS(=O)_2R^{J1}$ 、 $-NR^{J1}S(=O)_2R^{J1}$ 、または

$-C(=O)R^{J1}$ であり；

ここで、

各 $-L^J$ は飽和脂肪族 $C_{1-5}$ アルキレンであり；

各 $-NR^{J2}R^{J3}$ は独立してピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、またはモルホリノであり、  
そして任意に、 $C_{1-3}$ アルキルおよび $-CF_3$ から選択される1以上の基により置換されており

;

各  $-R^{J1}$  は独立して、

$-R^{K1}$ 、 $-R^{K2}$ 、 $-R^{K3}$ 、 $-R^{K4}$ 、 $-R^{K5}$ 、 $-R^{K6}$ 、 $-R^{K7}$ 、 $-R^{K8}$ 、 $-L^K-R^{K4}$ 、 $-L^K-R^{K5}$ 、 $-L^K-R^{K6}$ 、 $-L^K-R^{K7}$ 、または  $-L^K-R^{K8}$  であり；

ここで、

各  $-R^{K1}$  は飽和脂肪族  $C_{1-6}$  アルキルであり；

各  $-R^{K2}$  は脂肪族  $C_{2-6}$  アルケニルであり；

各  $-R^{K3}$  は脂肪族  $C_{2-6}$  アルキニルであり；

各  $-R^{K4}$  は飽和  $C_{3-6}$  シクロアルキルであり；

各  $-R^{K5}$  は  $C_{3-6}$  シクロアルケニルであり；

各  $-R^{K6}$  は非芳香族  $C_{3-8}$  ヘテロシクリルであり；

各  $-R^{K7}$  はフェニルであり；

各  $-R^{K8}$  は  $C_{5-6}$  ヘテロアリールであり；

各  $-L^K$  は飽和脂肪族  $C_{1-3}$  アルキレンであり；

および、ここで

各  $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルケニル、非芳香族  $C_{3-8}$  ヘテロシクリル、フェニル、 $C_{5-6}$  ヘテロアリール、および  $C_{1-3}$  アルキレンは、1以上の置換基  $-R^{K9}$  により任意に置換され、

ここで各  $-R^{K9}$  は独立して、

$-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、

$-R^{M1}$ 、

$-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、

$-OH$ 、 $-L^M-OH$ 、

$-OR^{M1}$ 、 $-L^M-OR^{M1}$ 、 $-O-L^M-OR^{M1}$ 、

$-NH_2$ 、 $-NHR^{M1}$ 、 $-NR^{M1}_2$ 、 $-NR^{M2}R^{M3}$ 、

$-L^M-NH_2$ 、 $-L^M-NHR^{M1}$ 、 $-L^M-NR^{M1}_2$ 、 $-L^M-NR^{M2}R^{M3}$ 、

$-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR^{M1}$ 、

$-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=O)NHR^{M1}$ 、 $-C(=O)NR^{M1}_2$ 、または  $-C(=O)NR^{M2}R^{M3}$  であり；

ここで、

各  $-R^{M1}$  は独立して飽和脂肪族  $C_{1-4}$  アルキル、フェニル、またはベンジルであり；

各  $-L^M$  は飽和脂肪族  $C_{1-5}$  アルキレンであり；および

各  $-NR^{M2}R^{M3}$  は独立してピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、またはモルホリノであり、

そして任意に、 $C_{1-3}$  アルキルおよび  $-CF_3$  から選択される1以上の基により置換されており

;

およびここで、

$-Q^{B6}$  は独立して、

$-R^{W1}$ 、

$-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、

$-OH$ 、 $-L^W-OH$ 、 $-O-L^W-OH$ 、

$-OR^{W1}$ 、 $-L^W-OR^{W1}$ 、 $-O-L^W-OR^{W1}$ 、

$-CN$ 、

$-NH_2$ 、 $-NHR^{W1}$ 、 $-NR^{W1}_2$ 、 $-NR^{W2}R^{W3}$ 、

$-L^W-NH_2$ 、 $-L^W-NHR^{W1}$ 、 $-L^W-NR^{W1}_2$ 、 $-L^W-NR^{W2}R^{W3}$ 、

$-O-L^W-NH_2$ 、 $-O-L^W-NHR^{W1}$ 、 $-O-L^W-NR^{W1}_2$ 、または  $-O-L^W-NR^{W2}R^{W3}$  であり；

ここで、

各  $-L^W$  は飽和脂肪族  $C_{1-5}$  アルキレンであり；

各  $-NR^{W2}R^{W3}$  は独立してピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、またはモルホリノであり、

そして任意に、 $C_{1-3}$  アルキルおよび  $-CF_3$  から選択される1以上の基により置換されており

;

各  $-R^{W1}$  は独立して、

$-R^{X1}$ 、 $-R^{X4}$ 、 $-R^{X6}$ 、 $-R^{X7}$ 、 $-R^{X8}$ 、 $-L^X-R^{X4}$ 、 $-L^X-R^{X6}$ 、 $-L^X-R^{X7}$ 、または $-L^X-R^{X8}$ であり；  
ここで、

各 $-R^{X1}$ は飽和脂肪族 $C_{1-6}$ アルキルであり；

各 $-R^{X4}$ は飽和 $C_{3-6}$ シクロアルキルであり；

各 $-R^{X6}$ は非芳香族 $C_{3-8}$ ヘテロシクリルであり；

各 $-R^{X7}$ は $C_{6-10}$ カルボアリールであり；

各 $-R^{X8}$ は $C_{5-10}$ ヘテロアリールであり；

各 $-L^X$ は飽和脂肪族 $C_{1-3}$ アルキレンであり；

およびここで、

各 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、非芳香族 $C_{3-8}$ ヘテロシクリル、 $C_{6-10}$ カルボアリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、および $C_{1-3}$ アルキレンは、1以上の置換基 $-R^{X9}$ により任意に置換され、

ここで各 $-R^{X9}$ は独立して、

$-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、

$-R^{Y1}$ 、

$-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、

$-OH$ 、 $-L^Y-OH$ 、

$-OR^{Y1}$ 、 $-L^Y-OR^{Y1}$ 、

$-NH_2$ 、 $-NHR^{Y1}$ 、 $-NR^{Y1}_2$ 、 $-NR^{Y2}R^{Y3}$ 、

$-L^Y-NH_2$ 、 $-L^Y-NHR^{Y1}$ 、 $-L^Y-NR^{Y1}_2$ 、 $-L^Y-NR^{Y2}R^{Y3}$ 、

$-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR^{Y1}$ 、

$-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=O)NHR^{Y1}$ 、 $-C(=O)NR^{Y1}_2$ 、または $-C(=O)NR^{Y2}R^{Y3}$ であり；

ここで、

各 $-R^{Y1}$ は独立して飽和脂肪族 $C_{1-4}$ アルキル、フェニル、またはベンジルであり；

各 $-L^Y$ は飽和脂肪族 $C_{1-5}$ アルキレンであり；および

各 $-NR^{Y2}R^{Y3}$ は独立してピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、またはモルホリノであり、  
そして任意に、 $C_{1-3}$ アルキルおよび $-CF_3$ から選択される1以上の基により置換されている  
]

の化合物から選択される化合物、ならびにその製薬上許容される塩、および溶媒和物。

【請求項2】

$-R^{A4}$ が $-Q^{A4N}$ である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

$-R^{A4}$ が $-O-Q^{A4O}$ である、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

$-R^{B6}$ が $-H$ である、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項5】

$-R^{B6}$ が $-Q^{B6}$ である、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項6】

$-Q^{A4N}$ は、もし存在すれば、 $-Q^{A4N1}$ である、請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項7】

$-Q^{A4N1}$ は独立して $-NHR^{QN1}$ または $-NR^{QN1}_2$ である、請求項6に記載の化合物。

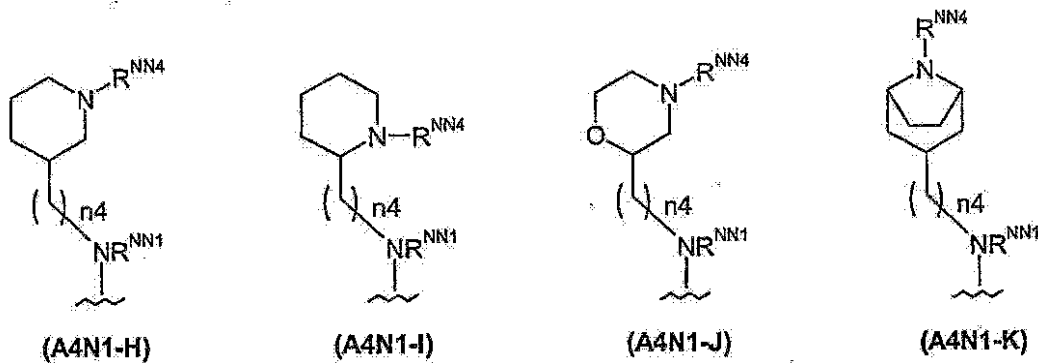
【請求項8】

各 $-R^{QN1}$ は $-R^{I1}$ であり；各 $-R^{I1}$ は飽和脂肪族 $C_{1-5}$ アルキルである、請求項7に記載の化合物。

【請求項9】

$-Q^{A4N1}$ は、独立して次式：

## 【化 2】



[ 式中、 $n_4$ は独立して1または2であり；

$R^{NN1}$ は独立して-Hまたは飽和脂肪族 $C_{1-4}$ アルキルであり；および

$R^{NN4}$ は独立して-H、飽和脂肪族 $C_{1-4}$ アルキル、フェニル、またはベンジルである ]

からなる基より選択される、請求項6に記載の化合物。

## 【請求項 1 0】

$-Q^{A4N1}$ は、式(A4N1-J)の基である、請求項9に記載の化合物。

## 【請求項 1 1】

$n_4$ は、1であり； $R^{NN1}$ は-Hまたは-Meであり；および $R^{NN4}$ は-Hまたは-Meである、請求項9または10に記載の化合物。

## 【請求項 1 2】

$-Q^{A5}$ は、独立して、

-F、-Cl、-Br、-I、

$-R^{J1}$ 、

$-NH_2$ 、 $-NHR^{J1}$ 、 $-NR^{J1}_2$ 、 $-NR^{J2}R^{J3}$ 、

$-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR^{J1}$

$-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=O)NHR^{J1}$ 、 $-C(=O)NR^{J1}_2$ 、 $-C(=O)NR^{J2}R^{J3}$ 、

$-NHC(=O)R^{J1}$ 、 $-NR^{J1}C(=O)R^{J1}$ 、

$-NHS(=O)_2R^{J1}$ 、または $-NR^{J1}S(=O)_2R^{J1}$ である、請求項1～11のいずれか1項に記載の化合物

。

## 【請求項 1 3】

$-Q^{A5}$ は、独立して、-F、-Cl、-Br、-I、または $-R^{J1}$ である、請求項1～11のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項 1 4】

$-Q^{A5}$ は、 $-R^{J1}$ である、請求項1～11のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項 1 5】

各 $-R^{J1}$ は、もし存在すれば、独立して、 $-R^{K1}$ 、 $-R^{K4}$ 、 $-R^{K6}$ 、 $-R^{K7}$ 、 $-R^{K8}$ 、

$-L^K-R^{K4}$ 、 $-L^K-R^{K6}$ 、 $-L^K-R^{K7}$ 、または $-L^K-R^{K8}$ である、請求項1～14のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項 1 6】

各 $-R^{J1}$ は、もし存在すれば、 $-R^{K8}$ である、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物。

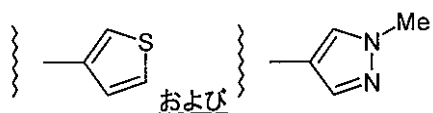
## 【請求項 1 7】

各 $-R^{K8}$ は、もし存在すれば、独立してチエニルまたはピラゾリルであり、そして任意に置換されている、請求項1～16のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項 1 8】

各 $-R^{K8}$ は、もし存在すれば、独立して次式：

## 【化 3】



から選択される、請求項1～16のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項 19】

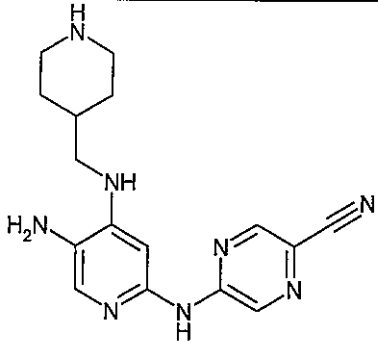
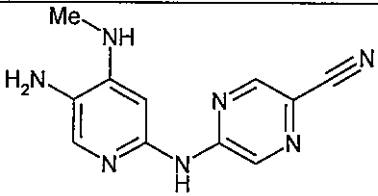
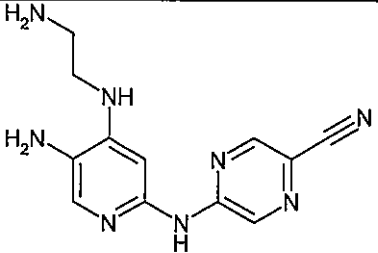
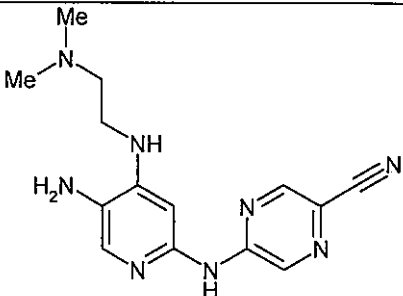
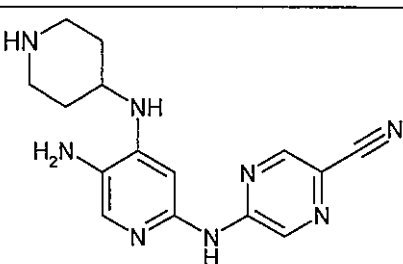
各- $R^{W1}$ は、もし存在すれば、 $-R^{X1}$ であり；および各- $R^{X1}$ は、もし存在すれば、飽和脂肪族 $C_{1-3}$ アルキルである、請求項1～18のいずれか1項に記載の化合物。

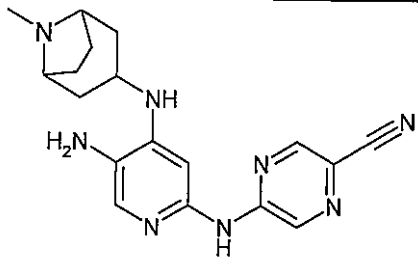
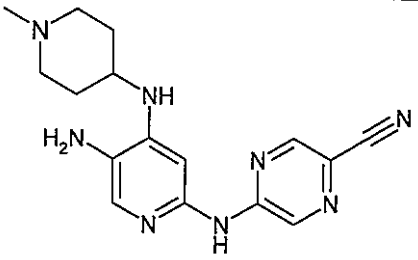
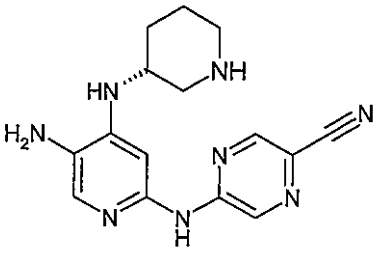
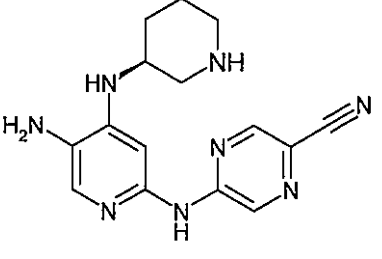
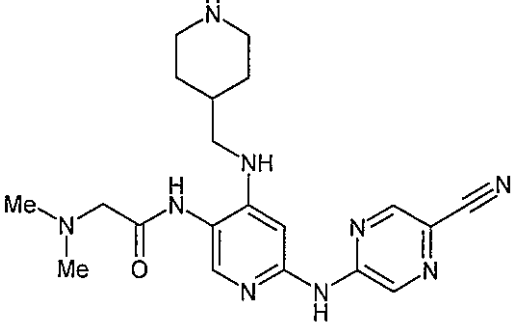
## 【請求項 20】

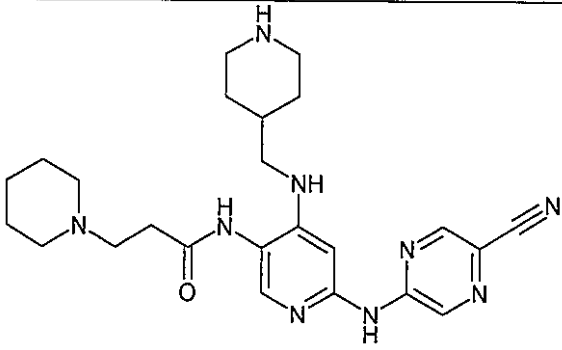
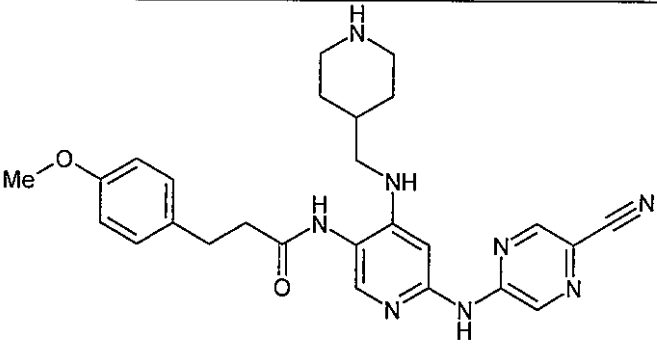
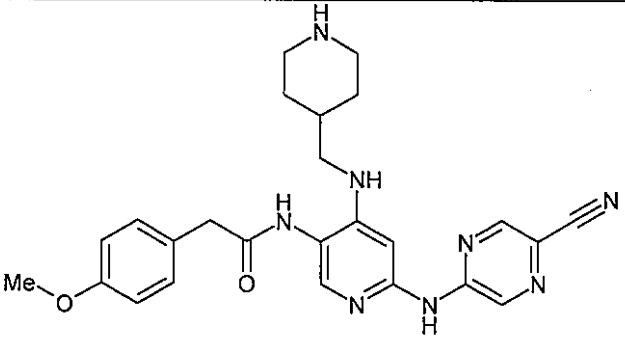
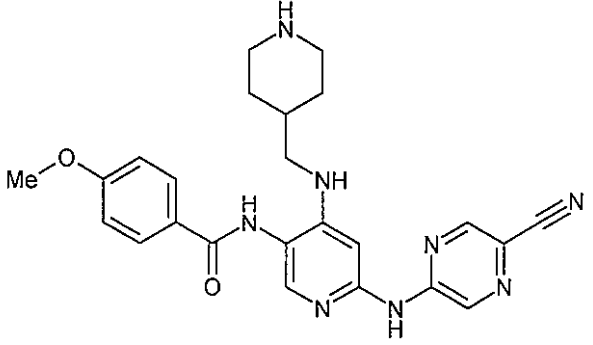
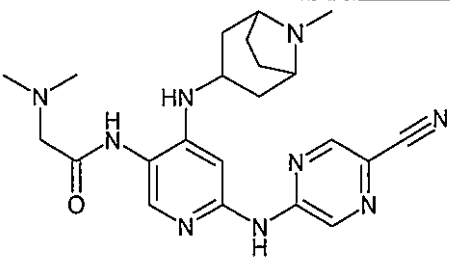
以下の化合物から選択される、請求項1に記載の化合物、ならびにその製薬上許容される塩、および溶媒和物：

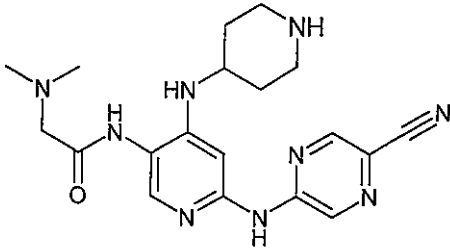
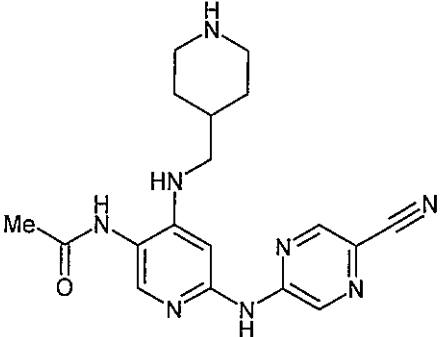
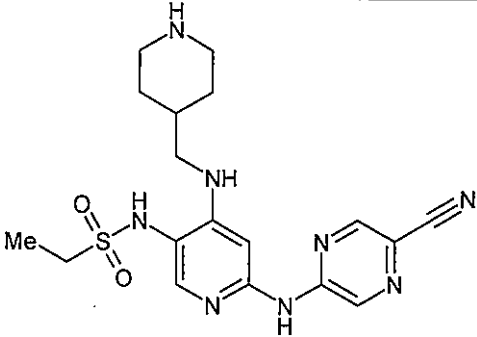
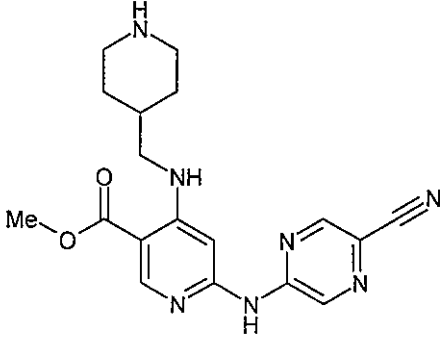
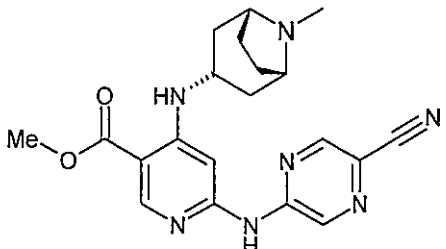


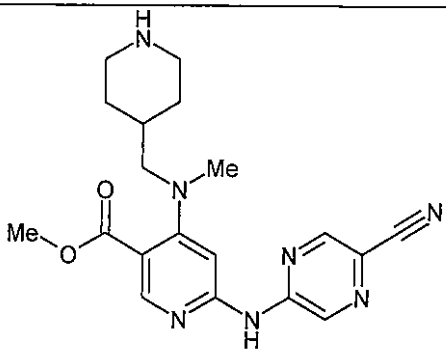
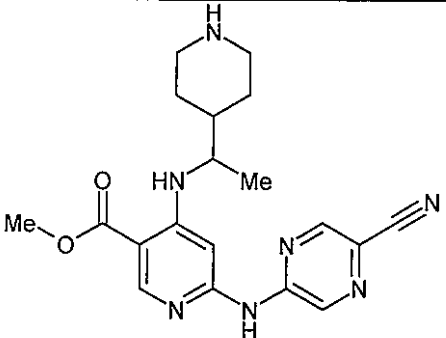
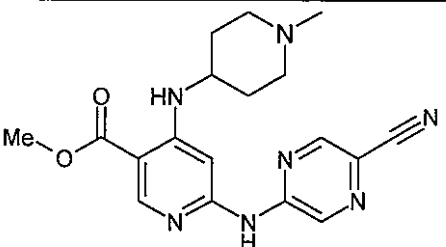
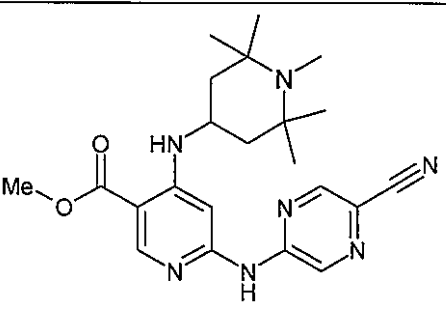
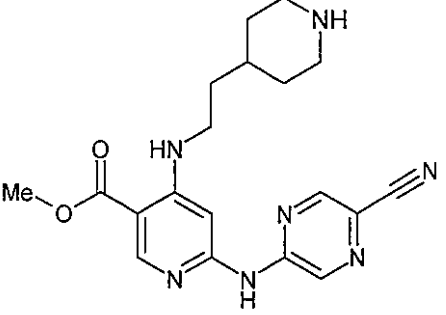
## 【化 4】

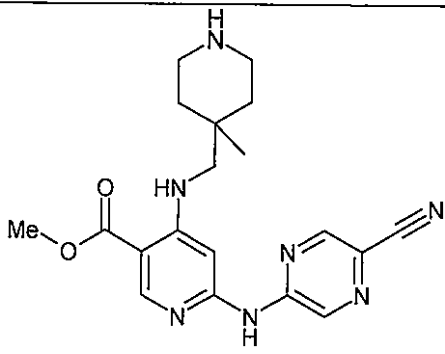
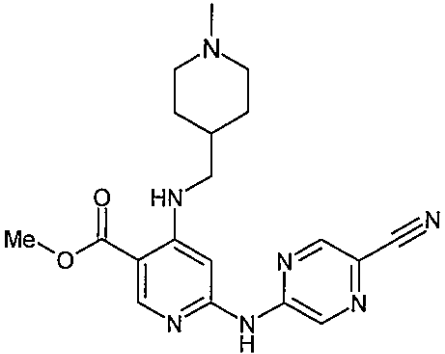
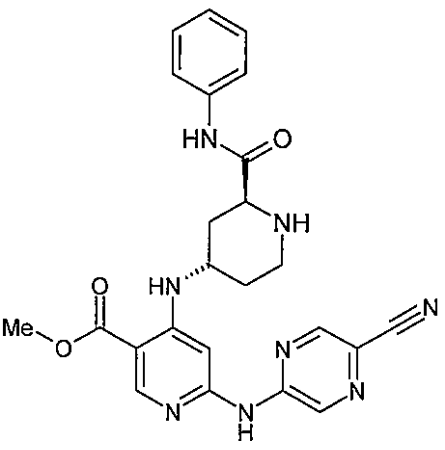
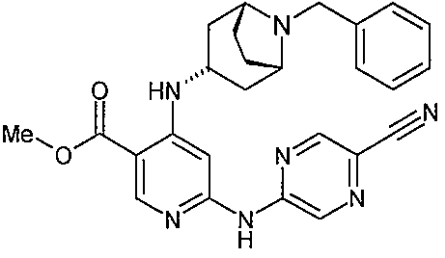
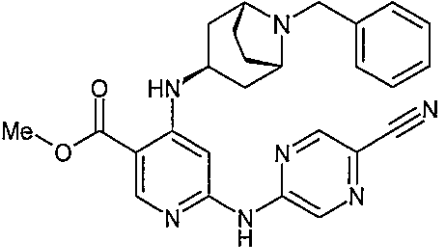
	(Y-001),
	(Y-002),
	(Y-003),
	(Y-004),
	(Y-005),

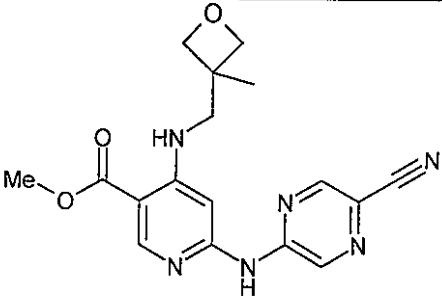
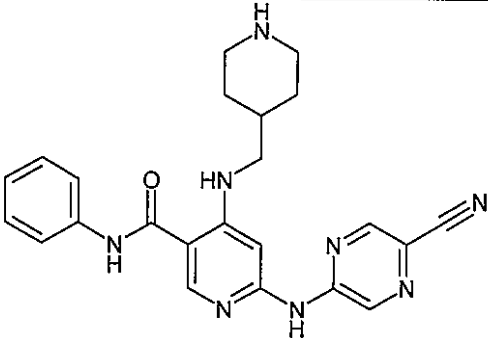
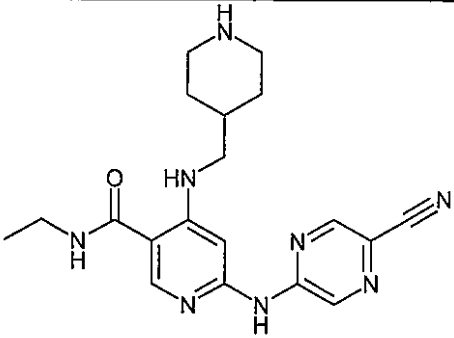
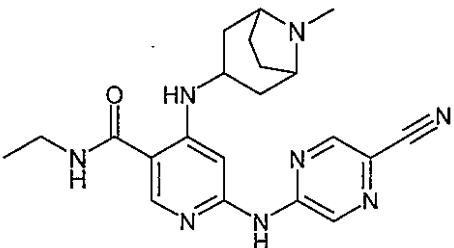
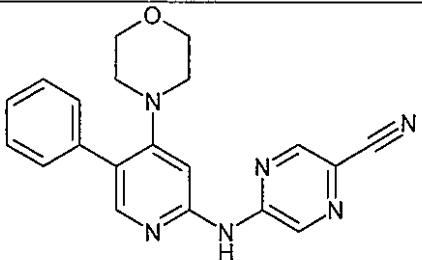
	(Y-006),
	(Y-007),
	(Y-008),
	(Y-009),
	(Y-010),

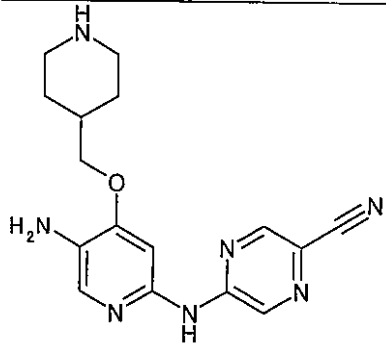
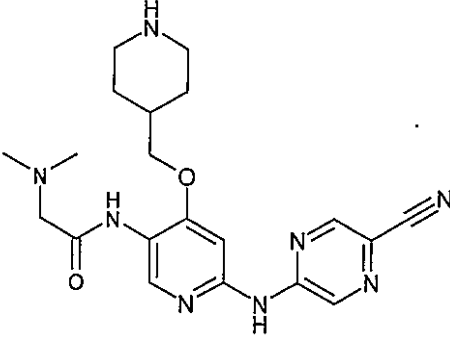
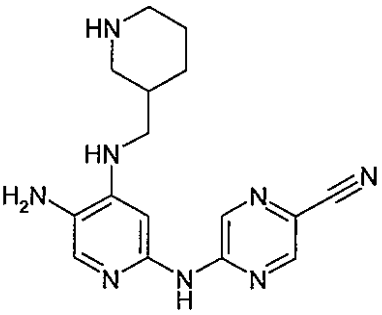
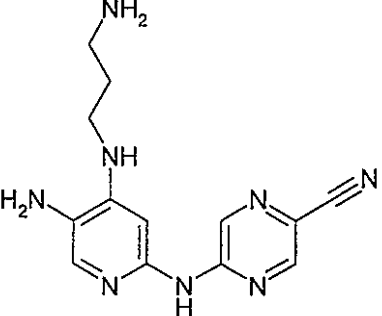
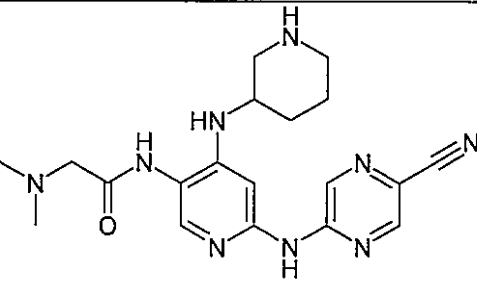
	(Y-011),
	(Y-012),
	(Y-013),
	(Y-014),
	(Y-015),

	(Y-016),
	(Y-017),
	(Y-018),
	(Y-019),
	(Y-020),

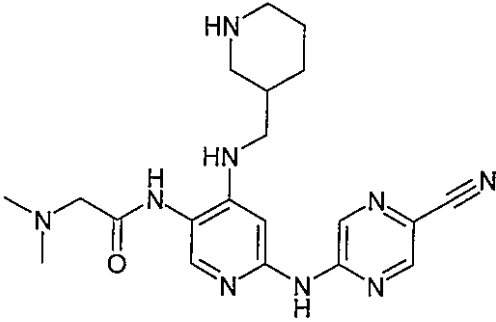
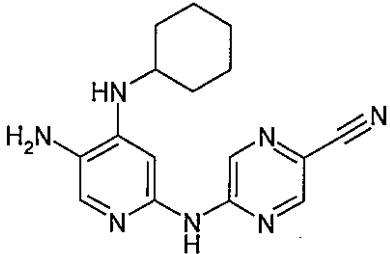
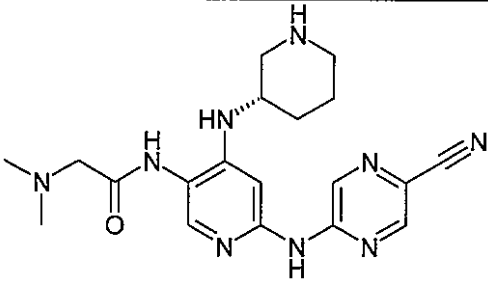
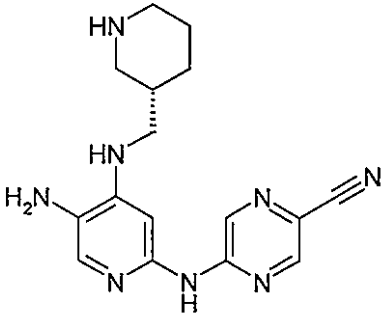
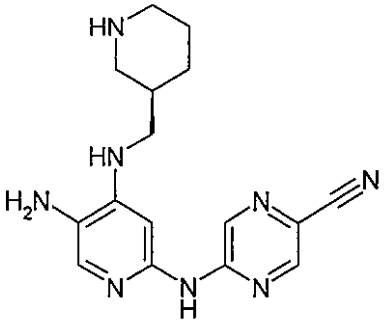
	(Y-021),
	(Y-022),
	(Y-023),
	(Y-024),
	(Y-025),

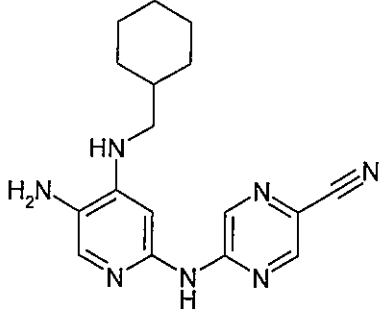
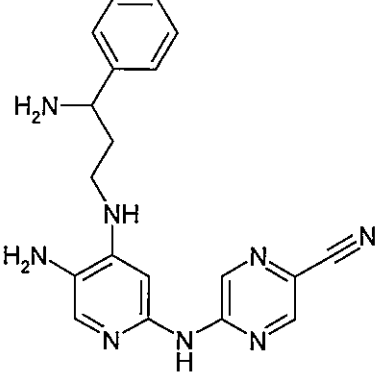
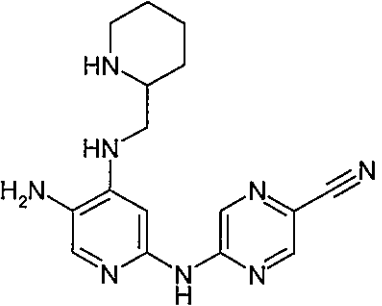
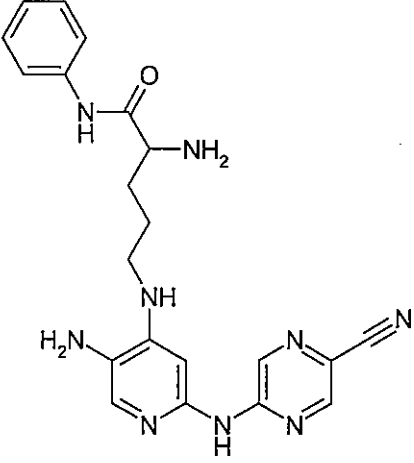
	(Y-026),
	(Y-027),
	(Y-028),
	(Y-029),
	(Y-030),

	(Y-031),
	(Y-032),
	(Y-033),
	(Y-034),
	(Y-035),

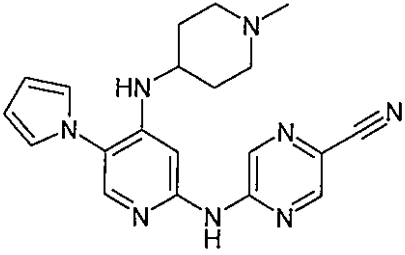
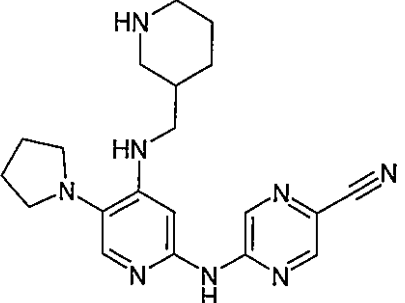
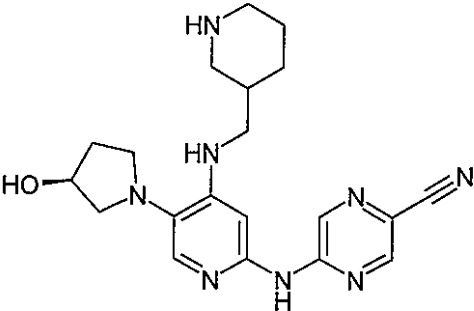
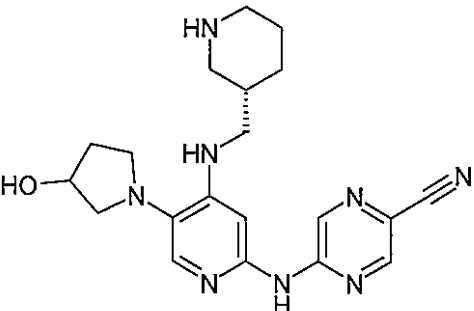
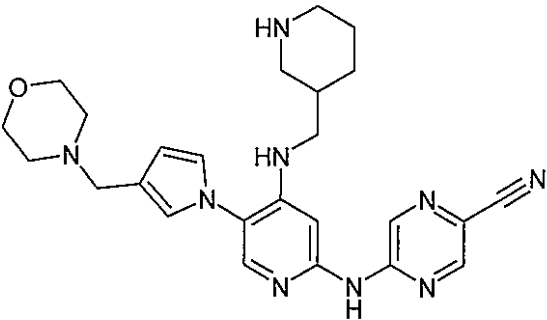
	(Y-038),
	(Y-039),
	(Y-041),
	(Y-042),
	(Y-043),

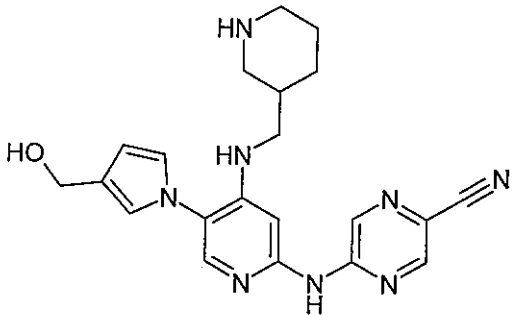
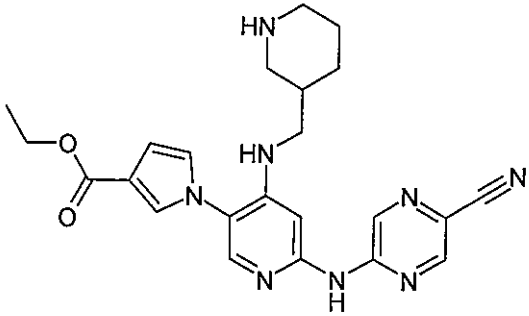
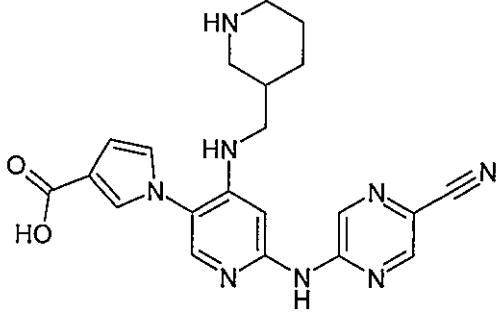
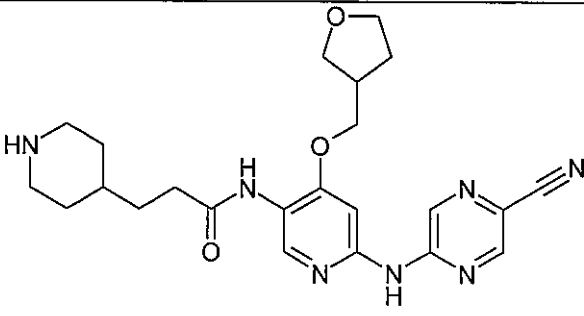
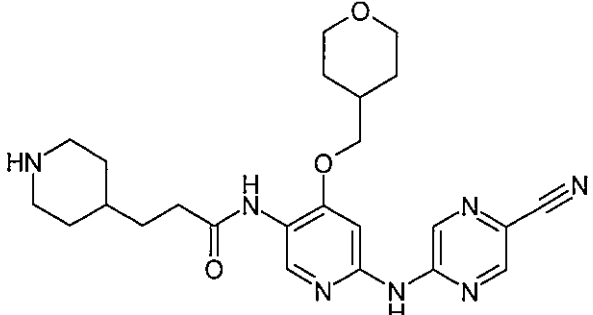


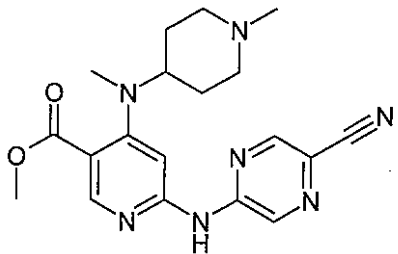
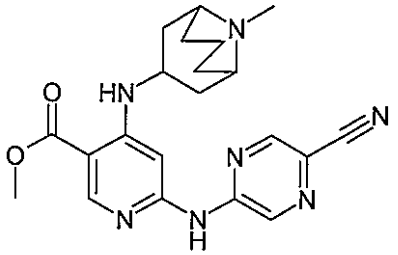
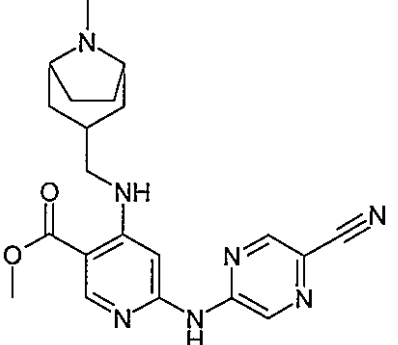
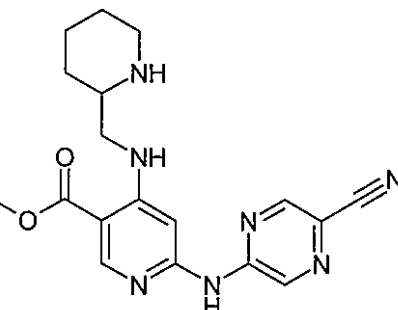
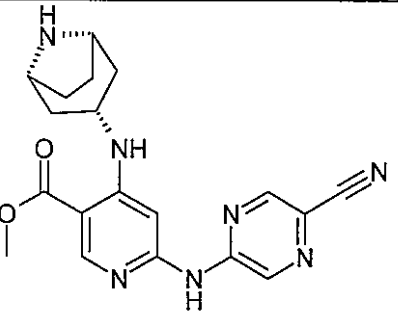
	(Y-044),
	(Y-045),
	(Y-046),
	(Y-047),
	(Y-048),

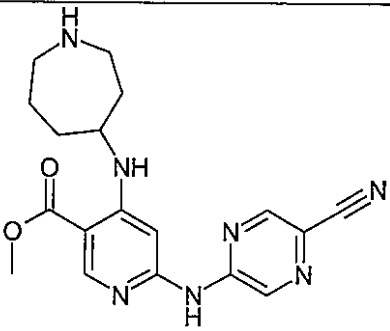
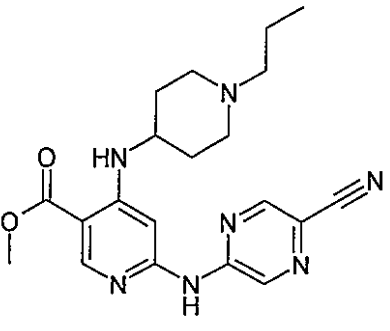
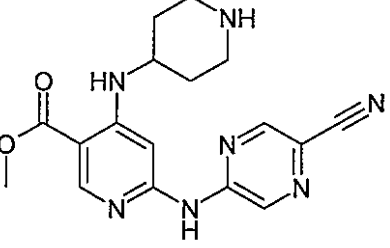
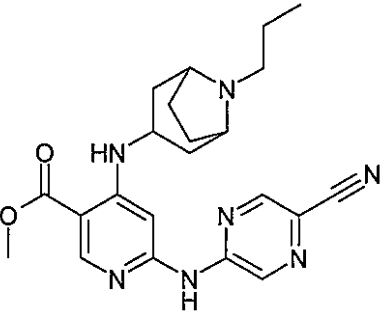
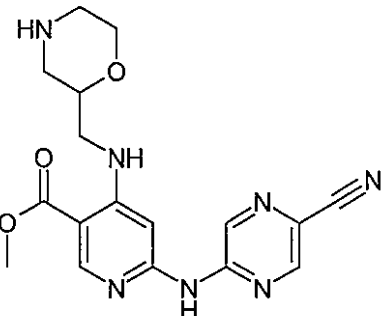
	(Y-049),
	(Y-050),
	(Y-051),
	(Y-052),

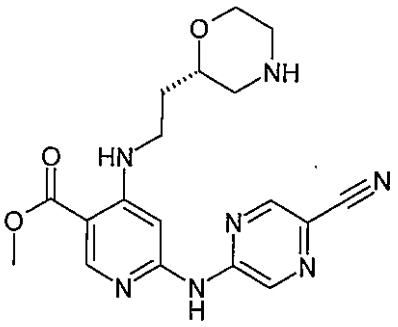
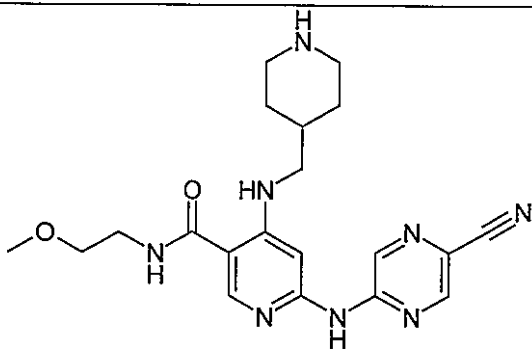
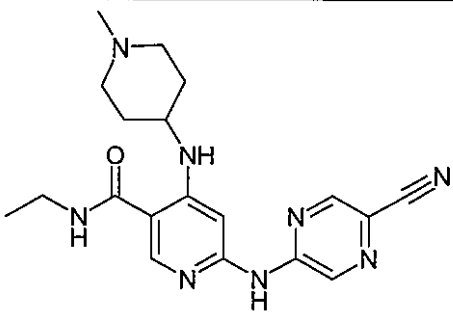
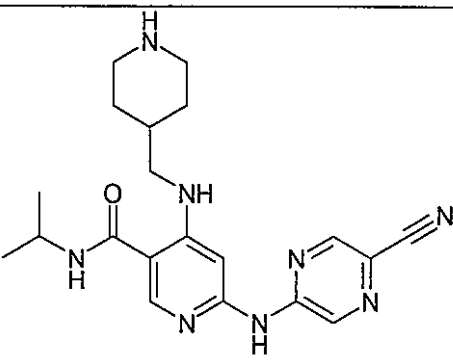
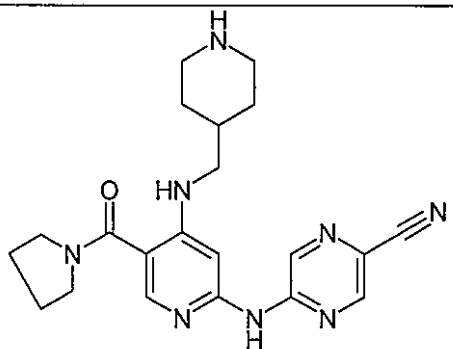
	(Y-053),
	(Y-054),
	(Y-055),
	(Y-056),
	(Y-057),

	(Y-058),
	(Y-059),
	(Y-060),
	(Y-061),
	(Y-062),

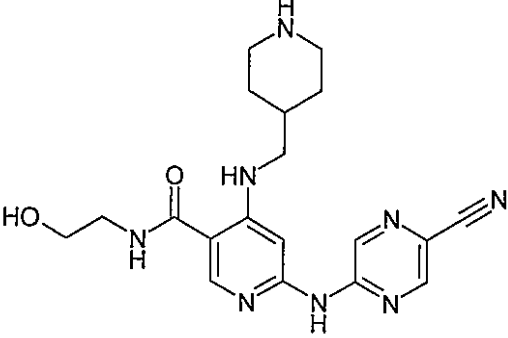
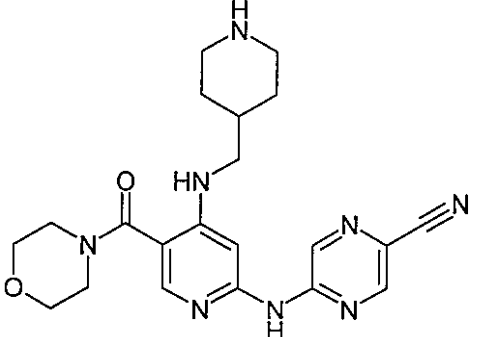
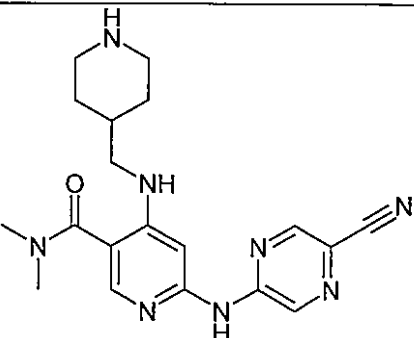
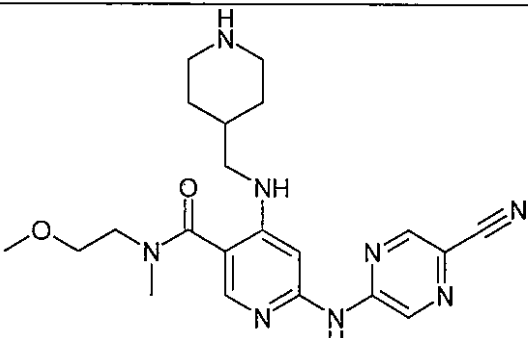
	(Y-063),
	(Y-064),
	(Y-065),
	(Y-068),
	(Y-069),

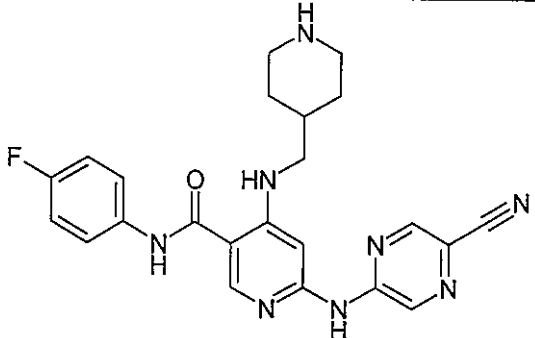
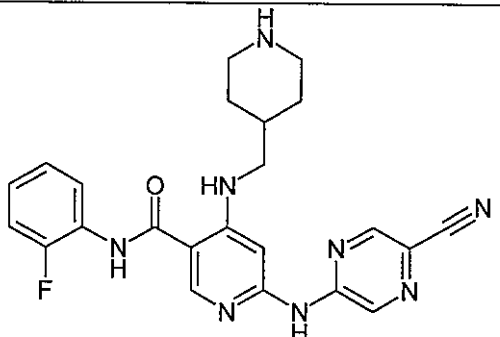
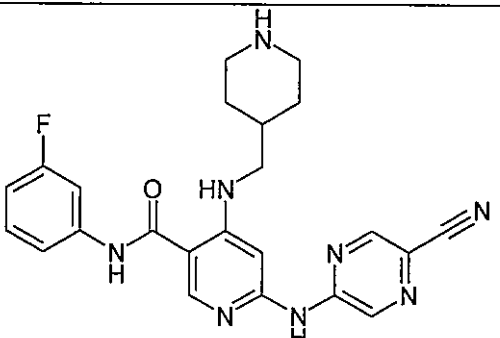
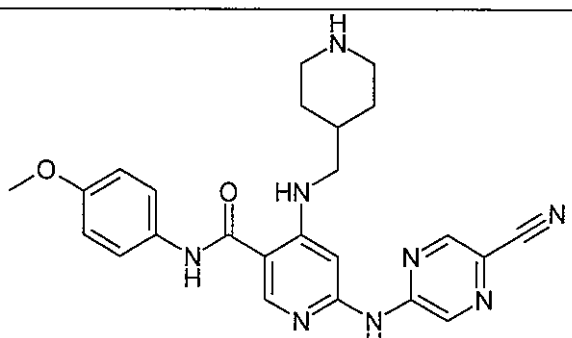
	(Y-070),
	(Y-071),
	(Y-072),
	(Y-073),
	(Y-075),

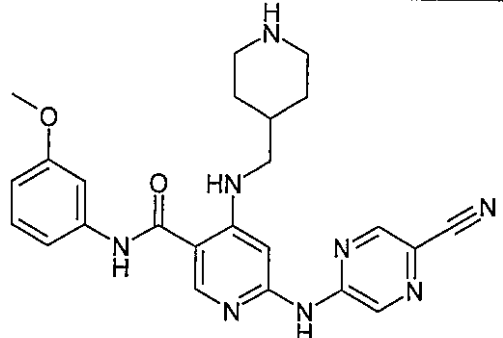
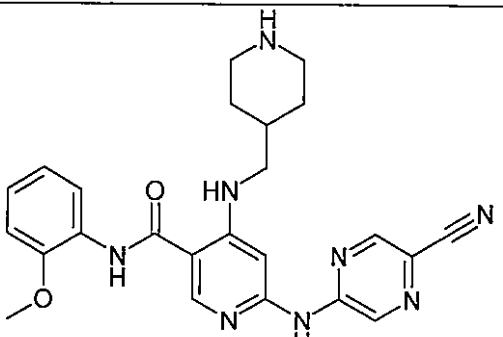
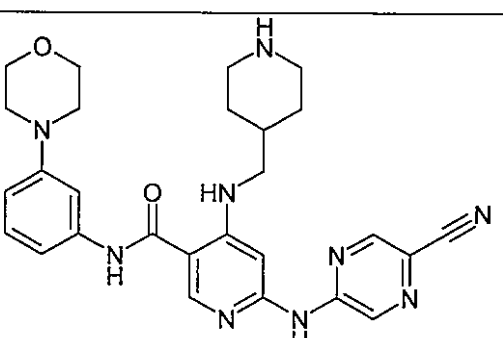
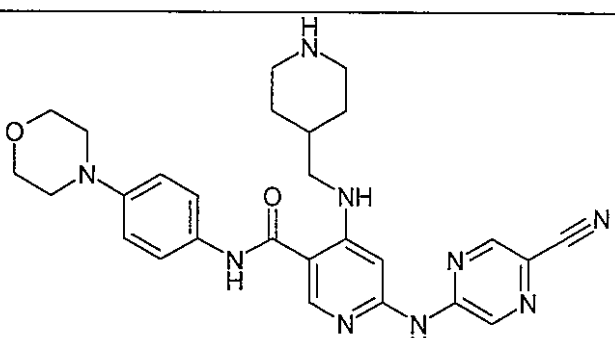
	(Y-076),
	(Y-077),
	(Y-078),
	(Y-079),
	(Y-081),

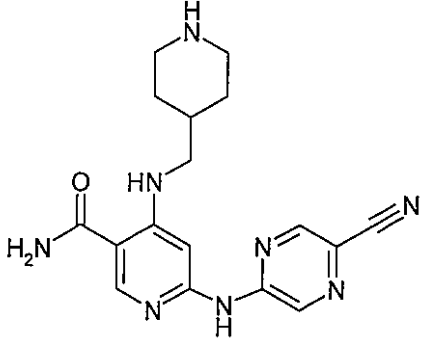
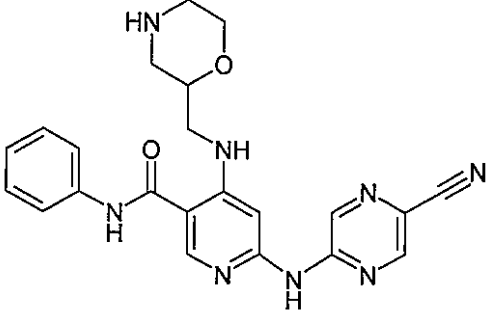
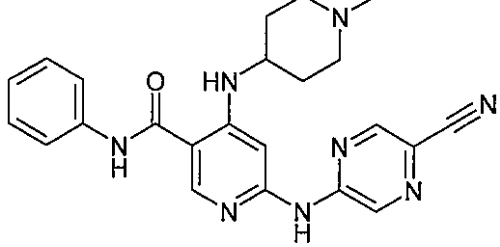
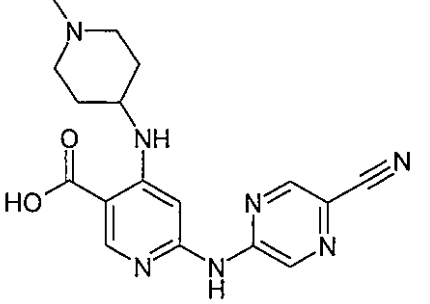
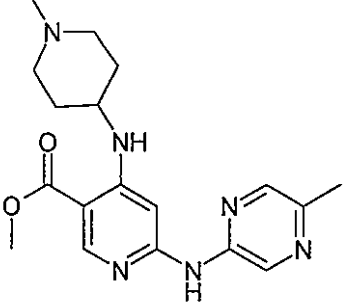
	(Y-082),
	(Y-084),
	(Y-085),
	(Y-086),
	(Y-087),

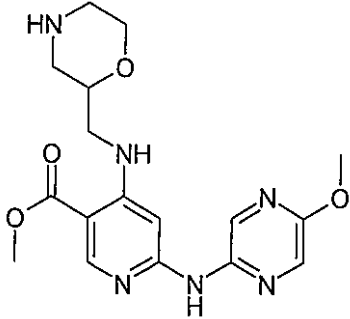
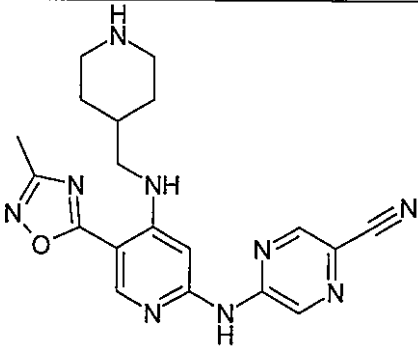
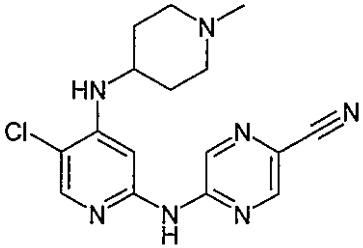
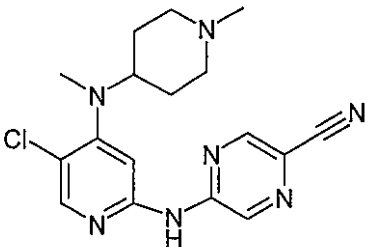
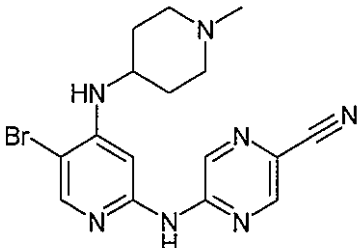


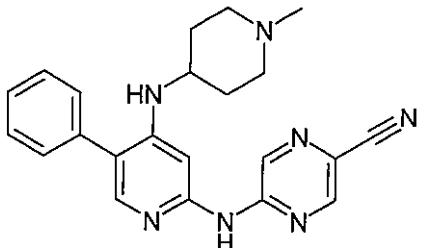
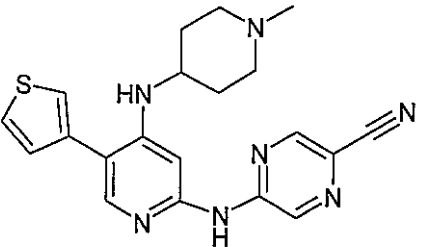
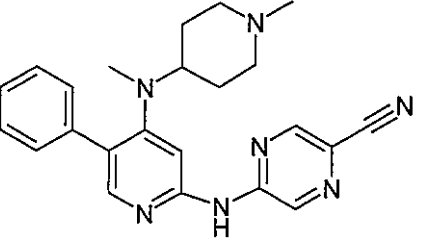
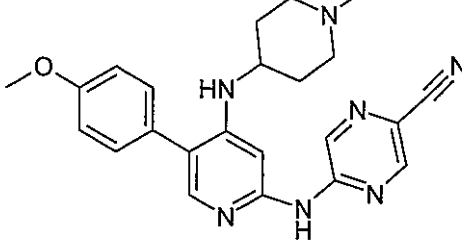
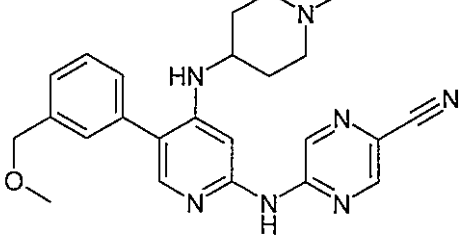
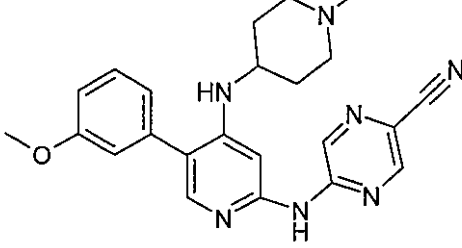
	(Y-088),
	(Y-089),
	(Y-090),
	(Y-091),

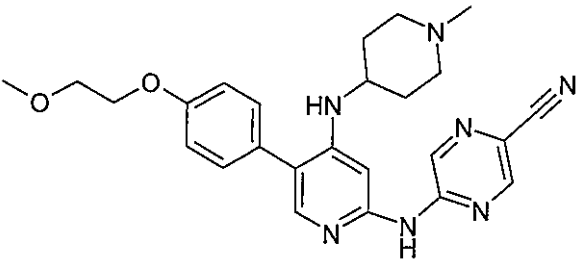
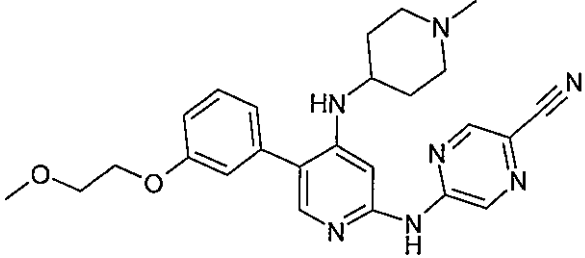
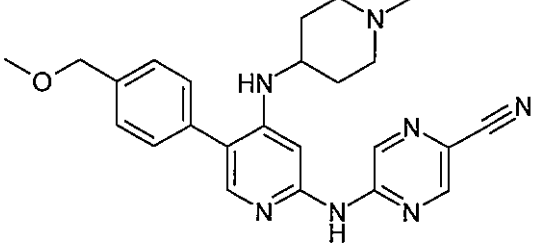
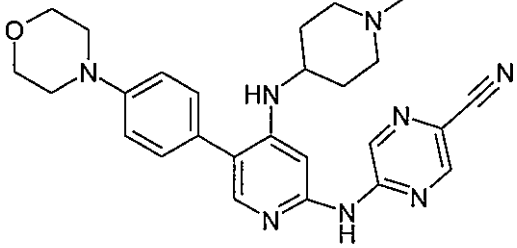
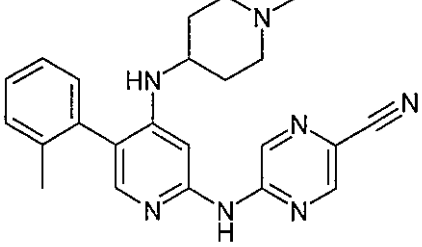
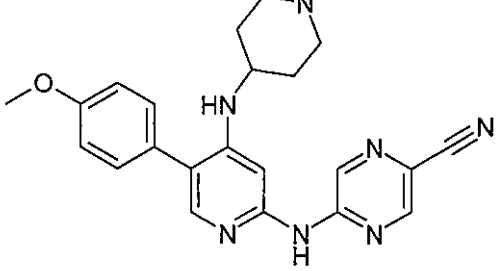
	(Y-092),
	(Y-093),
	(Y-094),
	(Y-095),

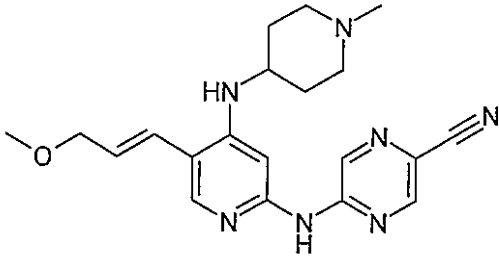
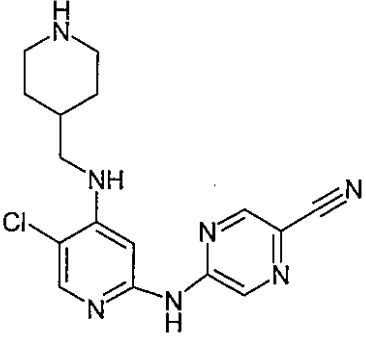
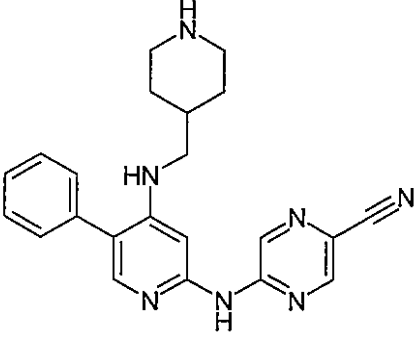
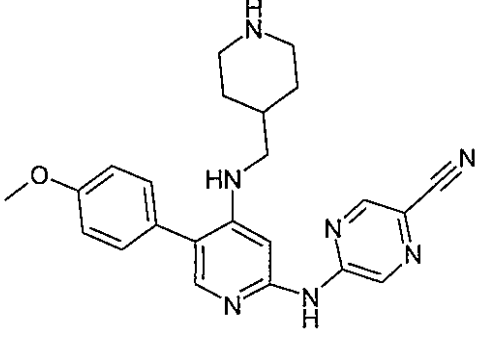
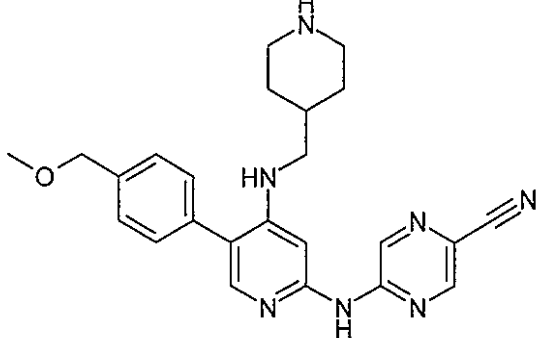
	(Y-096),
	(Y-097),
	(Y-099),
	(Y-100),

	(Y-101),
	(Y-102),
	(Y-103),
	(Y-104),
	(Y-105),

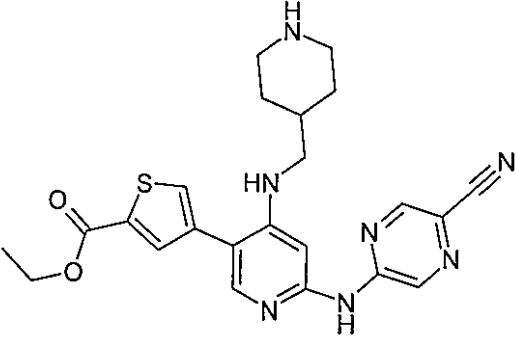
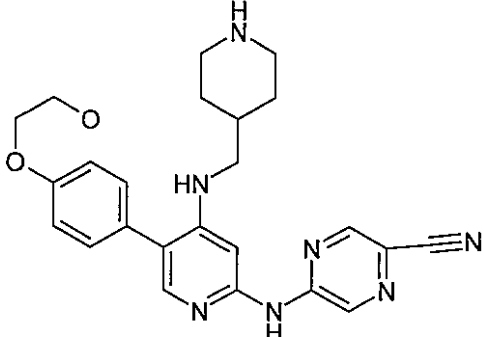
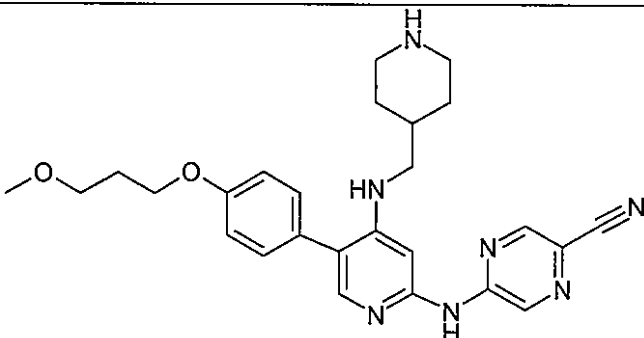
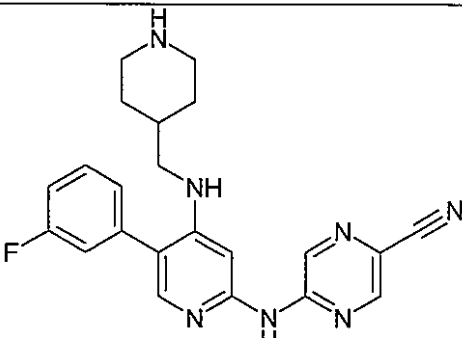
	(Y-106),
	(Y-107),
	(Y-108),
	(Y-109),
	(Y-110),

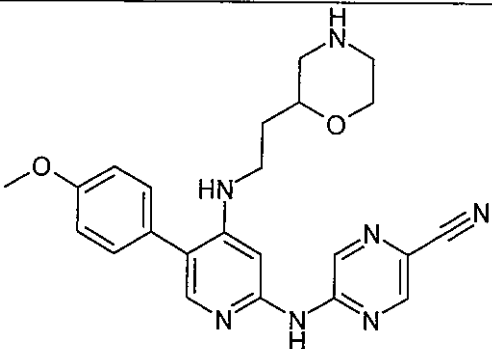
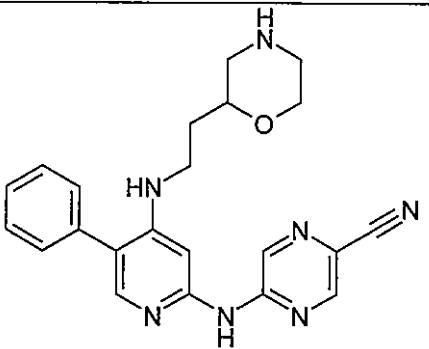
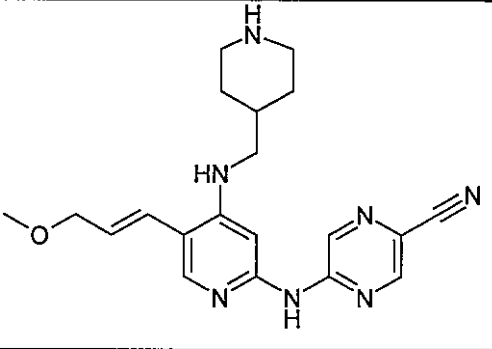
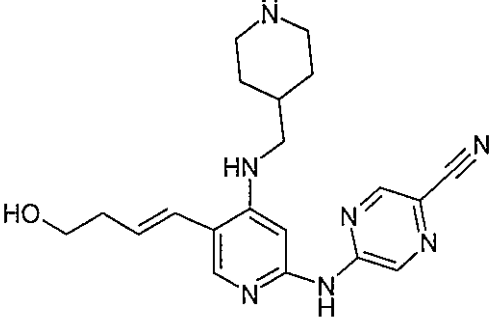
	(Y-111),
	(Y-112),
	(Y-113),
	(Y-114),
	(Y-115),
	(Y-116),

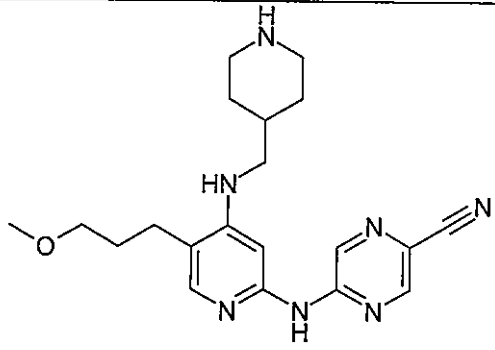
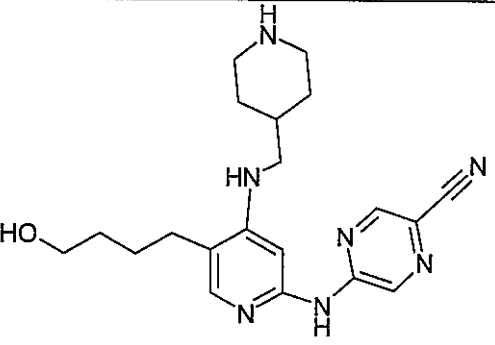
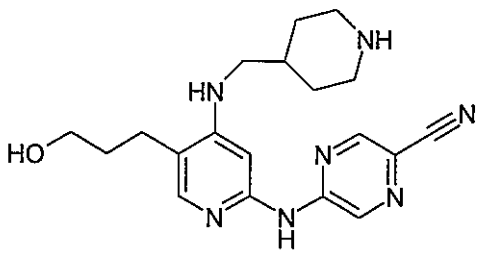
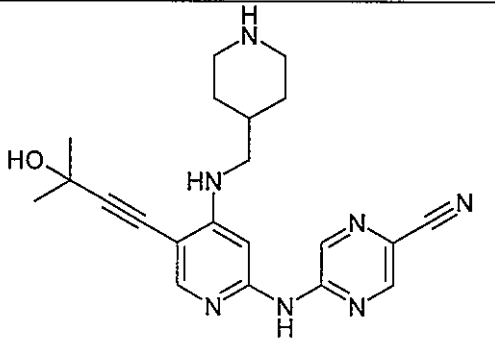
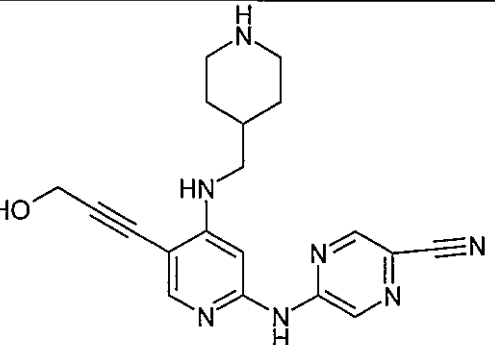
	(Y-117),
	(Y-118),
	(Y-119),
	(Y-120),
	(Y-121),
	(Y-122),

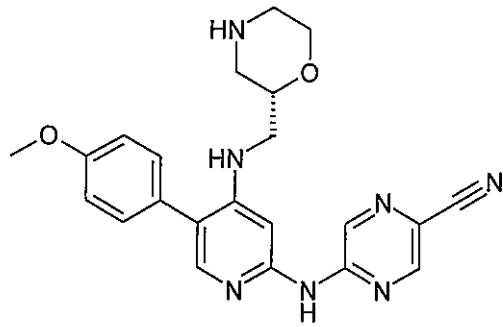
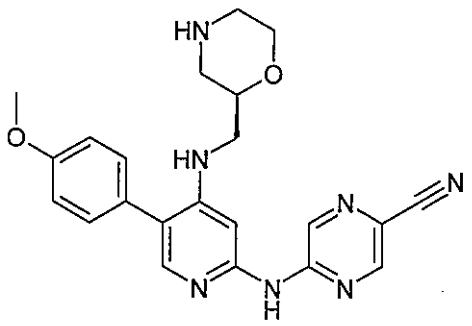
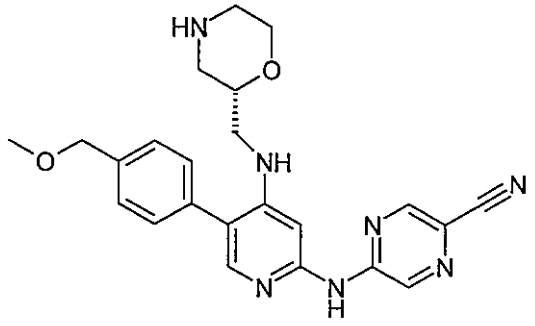
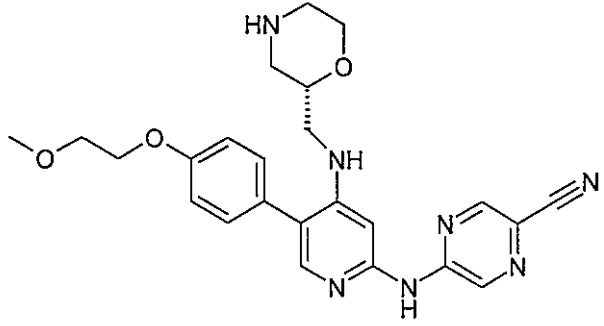
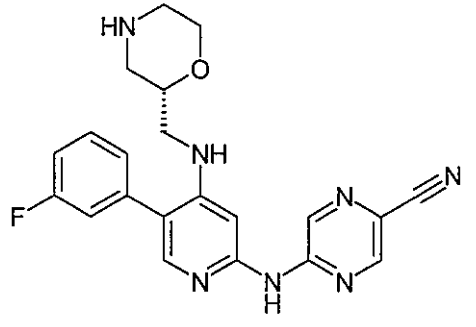
	(Y-123),
	(Y-124),
	(Y-125),
	(Y-126),
	(Y-127),

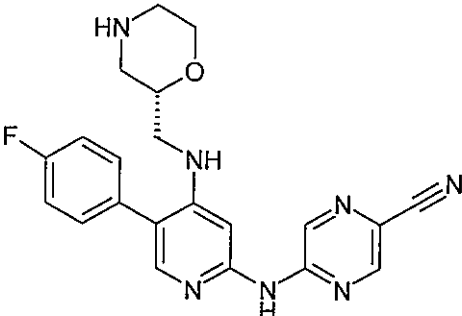
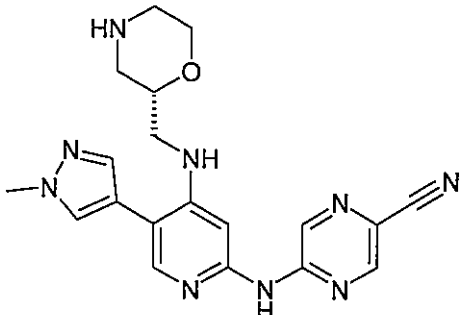
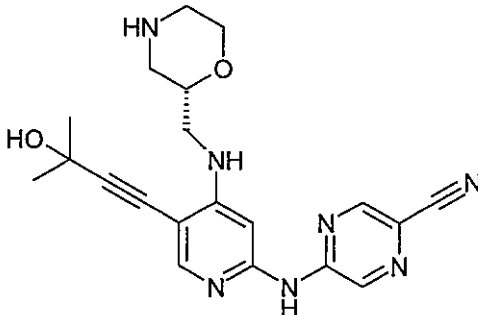
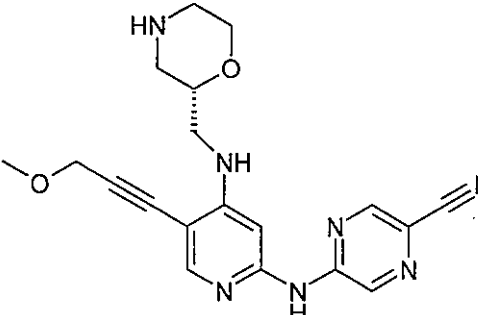
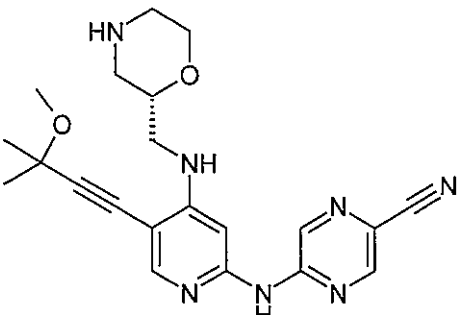


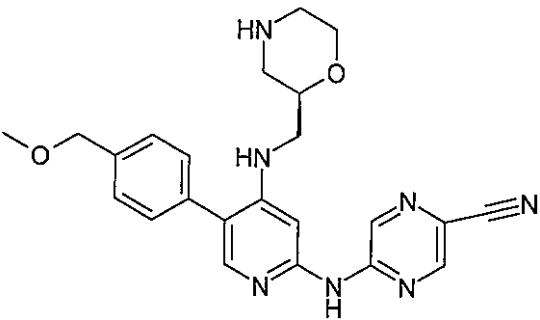
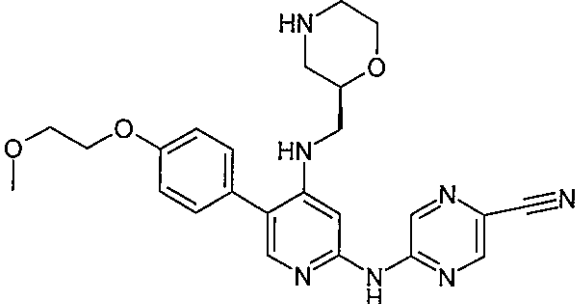
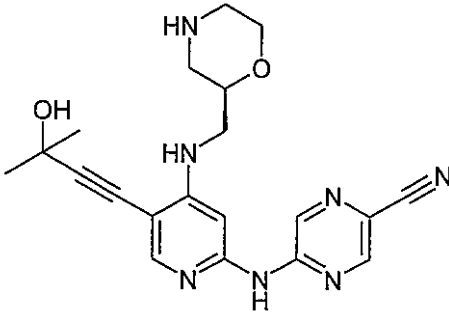
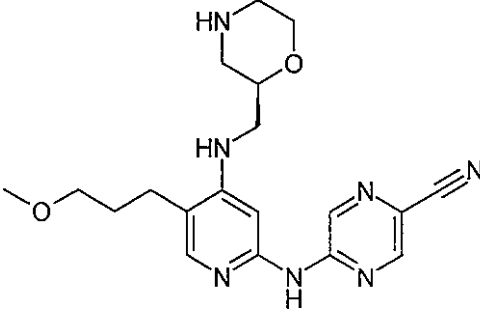
	(Y-128),
	(Y-129),
	(Y-133),
	(Y-135),

	(Y-137),
	(Y-138),
	(Y-139),
	(Y-140),

	(Y-141),
	(Y-142),
	(Y-143),
	(Y-144),
	(Y-145),

	(Y-146),
	(Y-147),
	(Y-148),
	(Y-149),
	(Y-150),

	(Y-151),
	(Y-152),
	(Y-153),
	(Y-154),
	(Y-155),

	(Y-156),
	(Y-157),
	(Y-158), and
	(Y-159).

。

## 【請求項 2 1】

請求項1～20のいずれか1項に記載の化合物、および製薬上許容される担体または希釈剤を含む医薬組成物。

## 【請求項 2 2】

療法でヒトまたは動物の身体を治療する方法に使用する、請求項1～20のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項 2 3】

CHK1が介在する疾患または症状；CHK1キナーゼ機能の阻害により改善される疾患または症状；増殖症状；癌；p53癌；あるいは肺癌、乳癌、卵巣癌、結腸直腸癌、黒色腫、または神経膠腫の治療に使用する、請求項1～20のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項 2 4】

治療がさらに、(a)DNAトポイソメラーゼIまたはIIインヒビター；(b)DNA傷害剤；(c)代

謝拮抗薬またはTSインヒビター；(d)微小管を標的化した薬剤；および(e)電離放射線から選択される、1以上の他の作用物質による治療を含むものである、請求項23に記載の化合物。

【請求項 25】

CHK1が介在する疾患または症状；CHK1キナーゼ機能の阻害により改善される疾患または症状；増殖症状；癌；p53癌；あるいは肺癌、乳癌、卵巣癌、結腸直腸癌、黒色腫、または神経膠腫を治療するための医薬品の製造における、請求項1～20のいずれか1項に記載の化合物の使用。

【請求項 26】

治療がさらに、(a)DNAトポイソメラーゼIまたはIIインヒビター；(b)DNA傷害剤；(c)代謝拮抗薬またはTSインヒビター；(d)微小管を標的化した薬剤；および(e)電離放射線から選択される、1以上の他の作用物質による治療を含むものである、請求項25に記載の使用

。