

【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 07D 401/14	(2006.01)
C 07D 403/12	(2006.01)
A 61K 31/506	(2006.01)
C 07D 413/14	(2006.01)
A 61K 31/5377	(2006.01)
C 07D 451/04	(2006.01)
C 07D 403/14	(2006.01)
C 07D 405/14	(2006.01)
C 07D 417/14	(2006.01)
C 07D 451/14	(2006.01)
A 61K 31/55	(2006.01)
C 07D 409/14	(2006.01)
A 61P 35/00	(2006.01)
A 61P 43/00	(2006.01)

【F I】

C 07D 401/14	C S P
C 07D 403/12	
A 61K 31/506	
C 07D 413/14	
A 61K 31/5377	
C 07D 451/04	
C 07D 403/14	
C 07D 405/14	
C 07D 417/14	
C 07D 451/14	
A 61K 31/55	
C 07D 409/14	
A 61P 35/00	
A 61P 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

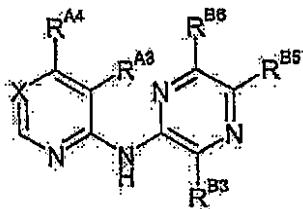
【補正の内容】

【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>11</sup>、-R<sup>14</sup>、-R<sup>16</sup>、-R<sup>17</sup>、-R<sup>18</sup>、-L<sup>1</sup>-R<sup>14</sup>、-L<sup>1</sup>-R<sup>16</sup>、-L<sup>1</sup>-R<sup>17</sup>、または-L<sup>1</sup>-R<sup>18</sup>であり；  
ここで、

各-R<sup>11</sup>は飽和脂肪族C<sub>1-6</sub>アルキルであり；

各-R<sup>14</sup>は飽和C<sub>3-6</sub>シクロアルキルであり；

各-R<sup>16</sup>は非芳香族C<sub>3-8</sub>ヘテロシクリルであり；

各-R<sup>17</sup>はフェニルであり；

各-R<sup>18</sup>はC<sub>5-6</sub>ヘテロアリールであり；

各-L<sup>1</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>19</sup>により任意に置換され、  
ここで、各-R<sup>19</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<sup>Z9</sup>は独立して：

-F、-Cl、-Br、-I、

-R<sup>ZZ1</sup>、

-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、

-OH、-L<sup>ZZ</sup>-OH、

-OR<sup>ZZ1</sup>、-L<sup>ZZ</sup>-OR<sup>ZZ1</sup>、

-NH<sub>2</sub>、-NHR<sup>ZZ1</sup>、-NR<sup>ZZ1</sup><sub>2</sub>、-NR<sup>ZZ2</sup>R<sup>ZZ3</sup>、

-L<sup>ZZ</sup>-NH<sub>2</sub>、-L<sup>ZZ</sup>-NHR<sup>ZZ1</sup>、-L<sup>ZZ</sup>-NR<sup>ZZ1</sup><sub>2</sub>、-L<sup>ZZ</sup>-NR<sup>ZZ2</sup>R<sup>ZZ3</sup>、

-C(=O)OH、-C(=O)OR<sup>ZZ1</sup>、

-C(=O)NH<sub>2</sub>、-C(=O)NHR<sup>ZZ1</sup>、-C(=O)NR<sup>ZZ1</sup><sub>2</sub>、または-C(=O)NR<sup>ZZ2</sup>R<sup>ZZ3</sup>であり；

ここで、

各-R<sup>ZZ1</sup>は独立して飽和脂肪族C<sub>1-4</sub>アルキル、フェニル、またはベンジルであり；

各-L<sup>ZZ</sup>-は飽和脂肪族C<sub>1-5</sub>アルキレンであり；そして

各-NR<sup>ZZ2</sup>R<sup>ZZ3</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；

およびここで、

-NR<sup>Q<sub>N</sub>2</sup>R<sup>Q<sub>N</sub>3</sup>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<sup>Q<sub>N</sub>R</sup>により任意に置換されており、

ここで、各-R<sup>Q<sub>N</sub>R</sup>は独立して：

-R<sup>AA1</sup>、

-NH<sub>2</sub>、-NHR<sup>AA1</sup>、-NR<sup>AA1</sup><sub>2</sub>、-NR<sup>AA2</sup>R<sup>AA3</sup>、

-L<sup>AA</sup>-NH<sub>2</sub>、-L<sup>AA</sup>-NHR<sup>AA1</sup>、-L<sup>AA</sup>-NR<sup>AA1</sup><sub>2</sub>、または-L<sup>AA</sup>-NR<sup>AA2</sup>R<sup>AA3</sup>であり；

ここで、

各-L<sup>AA</sup>-は飽和脂肪族C<sub>1-5</sub>アルキレンであり；

各-NR<sup>AA2</sup>R<sup>AA3</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>AA1</sup>は独立して-R<sup>BB1</sup>、-R<sup>BB7</sup>、または-L<sup>BB</sup>-R<sup>BB7</sup>であり；

ここで、

各-R<sup>BB1</sup>は飽和脂肪族C<sub>1-6</sub>アルキルであり；

各-R<sup>BB7</sup>はフェニルであり；

各-L<sup>BB</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、フェニルおよびC<sub>1-3</sub>アルキレンは、1以上の置換基-R<sup>BB9</sup>により任意に置換され；

ここで各-R<sup>BB9</sup>は独立して：

-F、-Cl、-Br、-I、

-R<sup>CC1</sup>、

-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、

-OH、-L<sup>CC</sup>-OH、

-OR<sup>CC1</sup>、-L<sup>CC</sup>-OR<sup>CC1</sup>、

-NH<sub>2</sub>、-NHR<sup>CC1</sup>、-NR<sup>CC1</sup><sub>2</sub>、-NR<sup>CC2</sup>R<sup>CC3</sup>、

-L<sup>CC</sup>-NH<sub>2</sub>、-L<sup>CC</sup>-NHR<sup>CC1</sup>、-L<sup>CC</sup>-NR<sup>CC1</sup><sub>2</sub>、-L<sup>CC</sup>-NR<sup>CC2</sup>R<sup>CC3</sup>、

-C(=O)OH、-C(=O)OR<sup>CC1</sup>、

-C(=O)NH<sub>2</sub>、-C(=O)NHR<sup>CC1</sup>、-C(=O)NR<sup>CC1</sup><sub>2</sub>、または-C(=O)NR<sup>CC2</sup>R<sup>CC3</sup>であり；

ここで、

各-R<sup>CC1</sup>は独立して飽和脂肪族C<sub>1-4</sub>アルキル、フェニル、またはベンジルであり；

各-L<sup>CC</sup>-は飽和脂肪族C<sub>1-5</sub>アルキレンであり；および

各-NR<sup>CC2</sup>R<sup>CC3</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、 $C_{1-3}$ 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<sup>J1</sup>は独立して、

-R<sup>K1</sup>、-R<sup>K2</sup>、-R<sup>K3</sup>、-R<sup>K4</sup>、-R<sup>K5</sup>、-R<sup>K6</sup>、-R<sup>K7</sup>、-R<sup>K8</sup>、-L<sup>K</sup>-R<sup>K4</sup>、-L<sup>K</sup>-R<sup>K5</sup>、-L<sup>K</sup>-R<sup>K6</sup>、-L<sup>K</sup>-R<sup>K7</sup>、または-L<sup>K</sup>-R<sup>K8</sup>であり；

ここで、

各-R<sup>K1</sup>は飽和脂肪族C<sub>1-6</sub>アルキルであり；

各-R<sup>K2</sup>は脂肪族C<sub>2-6</sub>アルケニルであり；

各-R<sup>K3</sup>は脂肪族C<sub>2-6</sub>アルキニルであり；

各-R<sup>K4</sup>は飽和C<sub>3-6</sub>シクロアルキルであり；

各-R<sup>K5</sup>はC<sub>3-6</sub>シクロアルケニルであり；

各-R<sup>K6</sup>は非芳香族C<sub>3-8</sub>ヘテロシクリルであり；

各-R<sup>K7</sup>はフェニルであり；

各-R<sup>K8</sup>はC<sub>5-6</sub>ヘテロアリールであり；

各-L<sup>K</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>2-6</sub>アルケニル、C<sub>2-6</sub>アルキニル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、C<sub>3-6</sub>シクロアルケニル、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>K9</sup>により任意に置換され、

ここで各-R<sup>K9</sup>は独立して、

-F、-Cl、-Br、-I、

-R<sup>M1</sup>、

-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、

-OH、-L<sup>M</sup>-OH、

-OR<sup>M1</sup>、-L<sup>M</sup>-OR<sup>M1</sup>、-O-L<sup>M</sup>-OR<sup>M1</sup>、

-NH<sub>2</sub>、-NHR<sup>M1</sup>、-NR<sup>M1</sup><sub>2</sub>、-NR<sup>M2</sup>R<sup>M3</sup>、

-L<sup>M</sup>-NH<sub>2</sub>、-L<sup>M</sup>-NHR<sup>M1</sup>、-L<sup>M</sup>-NR<sup>M1</sup><sub>2</sub>、-L<sup>M</sup>-NR<sup>M2</sup>R<sup>M3</sup>、

-C(=O)OH、-C(=O)OR<sup>M1</sup>、

-C(=O)NH<sub>2</sub>、-C(=O)NHR<sup>M1</sup>、-C(=O)NR<sup>M1</sup><sub>2</sub>、または-C(=O)NR<sup>M2</sup>R<sup>M3</sup>であり；

ここで、

各-R<sup>M1</sup>は独立して飽和脂肪族C<sub>1-4</sub>アルキル、フェニル、またはベンジルであり；

各-L<sup>M</sup>-は飽和脂肪族C<sub>1-5</sub>アルキレンであり；および

各-NR<sup>M2</sup>R<sup>M3</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

;

およびここで、

-Q<sup>B6</sup>は独立して、

-R<sup>W1</sup>、

-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、

-OH、-L<sup>W</sup>-OH、-O-L<sup>W</sup>-OH、

-OR<sup>W1</sup>、-L<sup>W</sup>-OR<sup>W1</sup>、-O-L<sup>W</sup>-OR<sup>W1</sup>、

-CN、

-NH<sub>2</sub>、-NHR<sup>W1</sup>、-NR<sup>W1</sup><sub>2</sub>、-NR<sup>W2</sup>R<sup>W3</sup>、

-L<sup>W</sup>-NH<sub>2</sub>、-L<sup>W</sup>-NHR<sup>W1</sup>、-L<sup>W</sup>-NR<sup>W1</sup><sub>2</sub>、-L<sup>W</sup>-NR<sup>W2</sup>R<sup>W3</sup>、

-O-L<sup>W</sup>-NH<sub>2</sub>、-O-L<sup>W</sup>-NHR<sup>W1</sup>、-O-L<sup>W</sup>-NR<sup>W1</sup><sub>2</sub>、または-O-L<sup>W</sup>-NR<sup>W2</sup>R<sup>W3</sup>であり；

ここで、

各-L<sup>W</sup>-は飽和脂肪族C<sub>1-5</sub>アルキレンであり；

各-NR<sup>W2</sup>R<sup>W3</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>W1</sup>は独立して、

-R<sup>X1</sup>、-R<sup>X4</sup>、-R<sup>X6</sup>、-R<sup>X7</sup>、-R<sup>X8</sup>、-L<sup>X</sup>-R<sup>X4</sup>、-L<sup>X</sup>-R<sup>X6</sup>、-L<sup>X</sup>-R<sup>X7</sup>、または-L<sup>X</sup>-R<sup>X8</sup>であり；  
ここで、

各-R<sup>X1</sup>は飽和脂肪族C<sub>1-6</sub>アルキルであり；

各-R<sup>X4</sup>は飽和C<sub>3-6</sub>シクロアルキルであり；

各-R<sup>X6</sup>は非芳香族C<sub>3-8</sub>ヘテロシクリルであり；

各-R<sup>X7</sup>はC<sub>6-10</sub>カルボアリールであり；

各-R<sup>X8</sup>はC<sub>5-10</sub>ヘテロアリールであり；

各-L<sup>X</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、C<sub>6-10</sub>カルボアリール、C<sub>5-10</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>X9</sup>により任意に置換され、

ここで各-R<sup>X9</sup>は独立して、

-F、-Cl、-Br、-I、

-R<sup>Y1</sup>、

-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、

-OH、-L<sup>Y</sup>-OH、

-OR<sup>Y1</sup>、-L<sup>Y</sup>-OR<sup>Y1</sup>、

-NH<sub>2</sub>、-NHR<sup>Y1</sup>、-NR<sup>Y1</sup><sub>2</sub>、-NR<sup>Y2</sup>R<sup>Y3</sup>、

-L<sup>Y</sup>-NH<sub>2</sub>、-L<sup>Y</sup>-NHR<sup>Y1</sup>、-L<sup>Y</sup>-NR<sup>Y1</sup><sub>2</sub>、-L<sup>Y</sup>-NR<sup>Y2</sup>R<sup>Y3</sup>、

-C(=O)OH、-C(=O)OR<sup>Y1</sup>、

-C(=O)NH<sub>2</sub>、-C(=O)NHR<sup>Y1</sup>、-C(=O)NR<sup>Y1</sup><sub>2</sub>、または-C(=O)NR<sup>Y2</sup>R<sup>Y3</sup>であり；

ここで、

各-R<sup>Y1</sup>は独立して飽和脂肪族C<sub>1-4</sub>アルキル、フェニル、またはベンジルであり；

各-L<sup>Y</sup>は飽和脂肪族C<sub>1-5</sub>アルキレンであり；および

各-NR<sup>Y2</sup>R<sup>Y3</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<sup>A4</sup>が-Q<sup>A4N</sup>である、請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項3】

-R<sup>A4</sup>が-O-Q<sup>A4O</sup>である、請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項4】

-R<sup>B6</sup>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<sup>B6</sup>が-Q<sup>B6</sup>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<sup>A4N</sup>は、もし存在すれば、-Q<sup>A4N1</sup>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<sup>A4N1</sup>は独立して-NHR<sup>QN1</sup>または-NR<sup>QN1</sup><sub>2</sub>である、請求項6に記載の化合物。

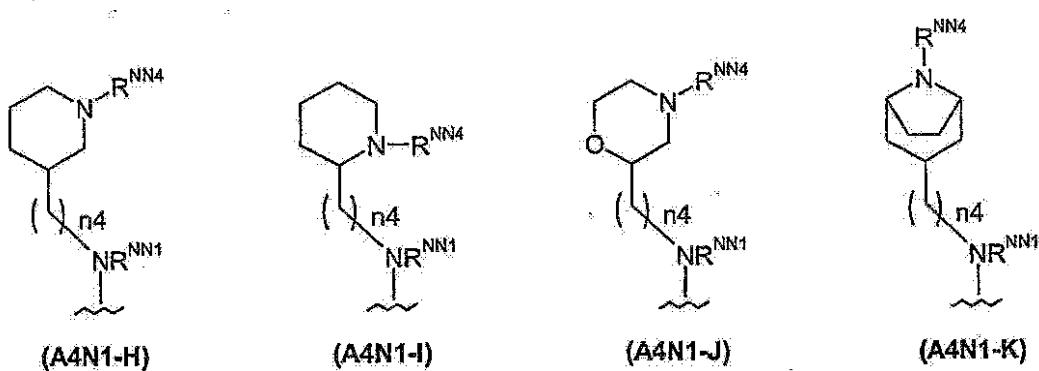
#### 【請求項8】

各-R<sup>QN1</sup>は-R<sup>I1</sup>であり；各-R<sup>I1</sup>は飽和脂肪族C<sub>1-5</sub>アルキルである、請求項7に記載の化合物。

#### 【請求項9】

-Q<sup>A4N1</sup>は、独立して次式：

【化 2】



[式中、n4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 10】

-Q<sup>A4N1</sup>は、式(A4N1-J)の基である、請求項9に記載の化合物。

### 【請求項 11】

$n_4$ は、1であり； $R^{NN_1}$ は-Hまたは-Meであり；および $R^{NN_4}$ 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、  
 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、  
 $-R^{J1}$ 、  
 $-NH_2$ 、 $-NHR^{J1}$ 、 $-NR^{J1}R^{J2}$ 、 $-NR^{J2}R^{J3}$ 、  
 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR^{J1}$   
 $-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=O)NHR^{J1}$ 、 $-C(=O)NR^{J1}R^{J2}$ 、 $-C(=O)NR^{J2}R^{J3}$ 、  
 $-NHC(=O)R^{J1}$ 、 $-NR^{J1}C(=O)R^{J1}$ 、  
 $-NHS(=O)_2R^{J1}$ 、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

• 5 精选题 1-3

請求項13】  $-C^A_5$ 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

に記載の化吉物  
【讀本類 14】

〔請求項 4〕  $\text{O}^{\text{A}5}$  は  $\text{P}^{\text{J}1}$  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 15】

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 16】

各-B<sup>J</sup><sub>1</sub>は、もし存在すれば、-B<sup>K</sup><sub>8</sub>である。請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物。

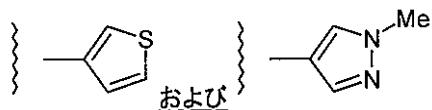
### 【請求項 17】

各  $-R^K$  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 18】

各  $-R^{K_8}$  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。

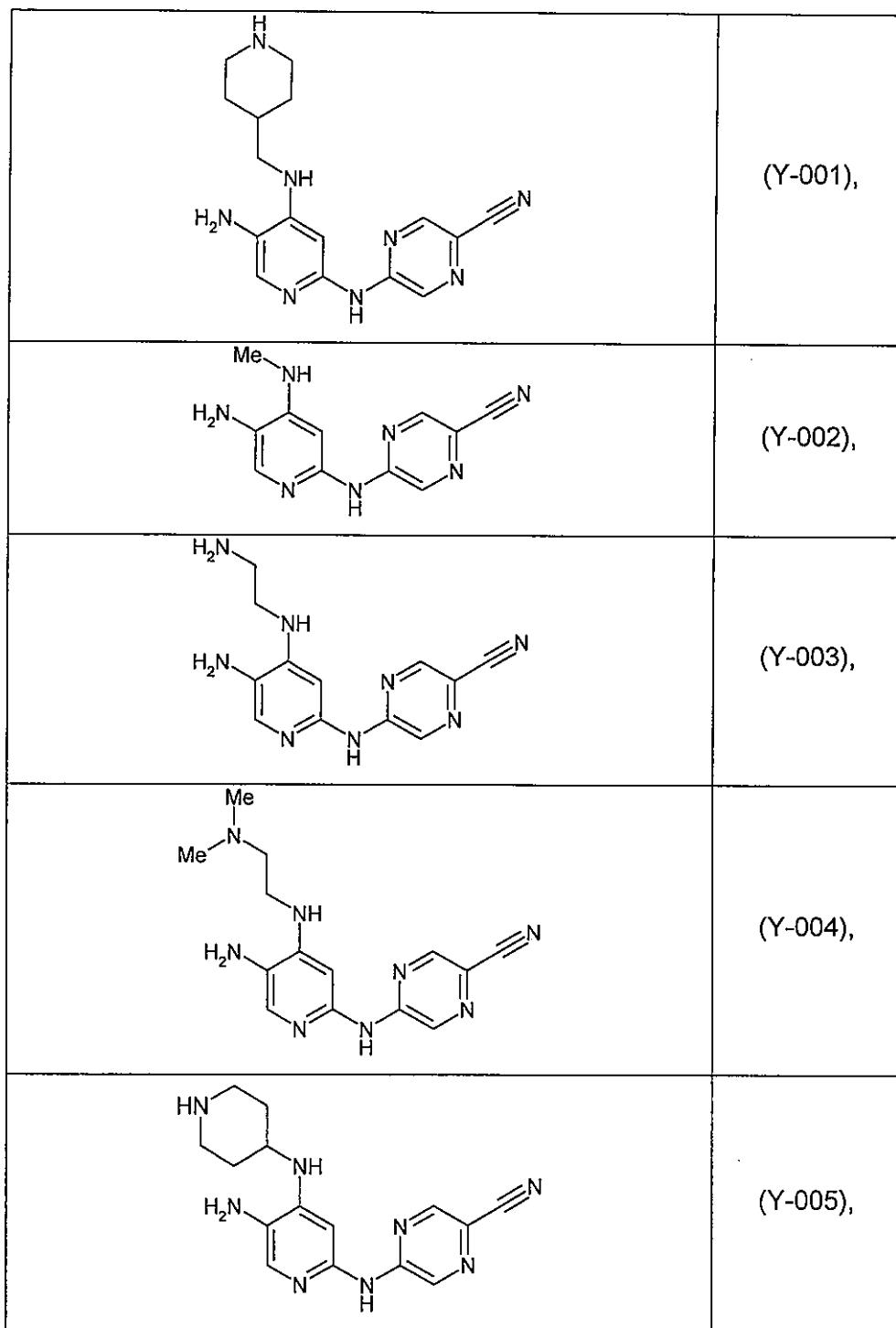
## 【請求項19】

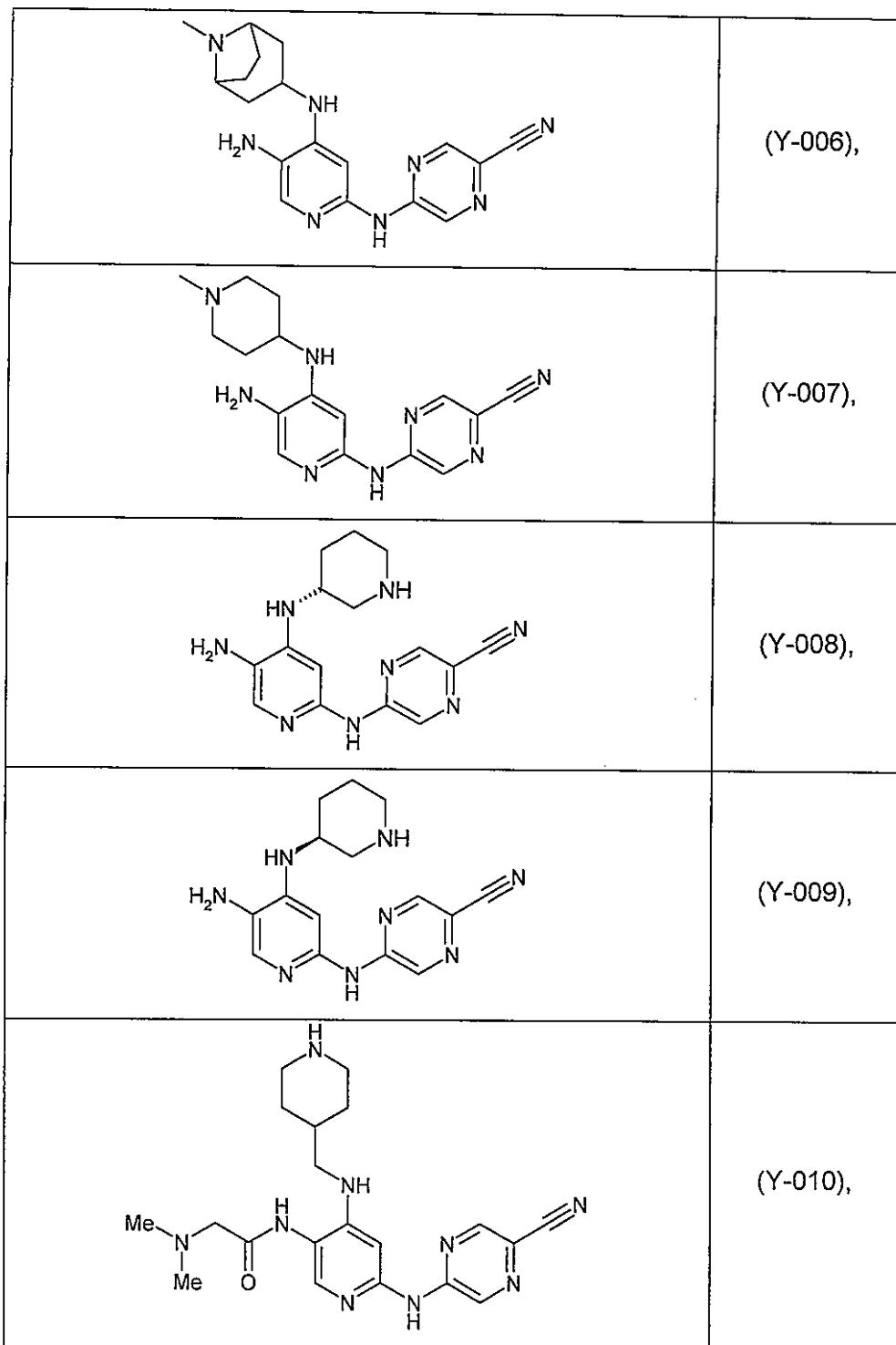
各-R<sup>W1</sup>は、もし存在すれば、-R<sup>X1</sup>であり；および各-R<sup>X1</sup>は、もし存在すれば、飽和脂肪族C<sub>1</sub>～3アルキルである、請求項1～18のいずれか1項に記載の化合物。

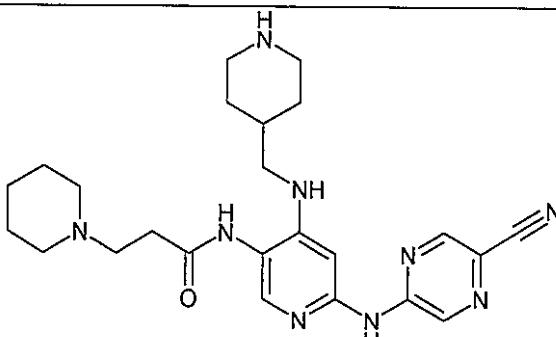
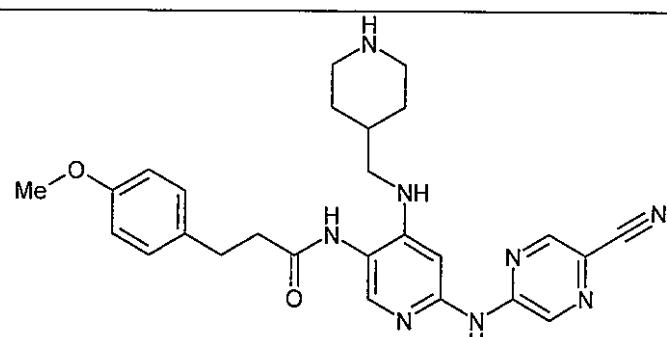
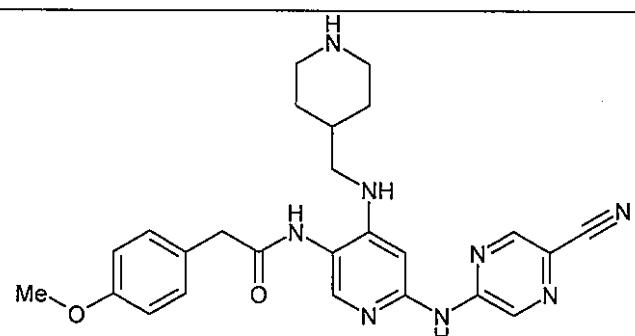
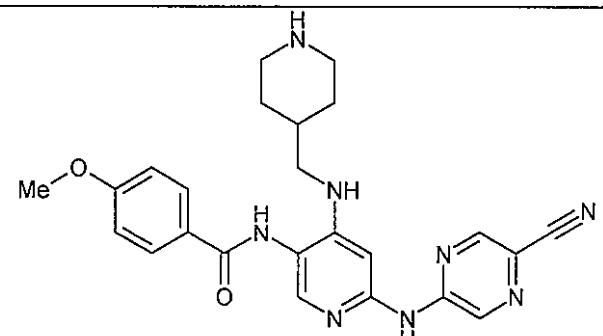
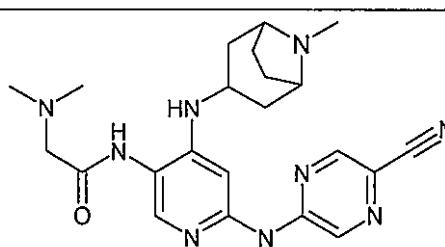
## 【請求項20】

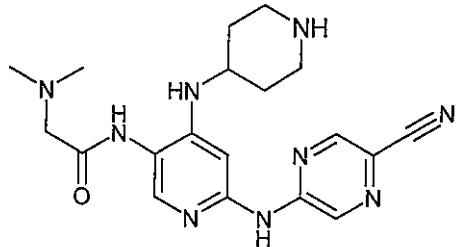
以下の化合物から選択される、請求項1に記載の化合物、ならびにその製薬上許容される塩、および溶媒和物：

【化 4】

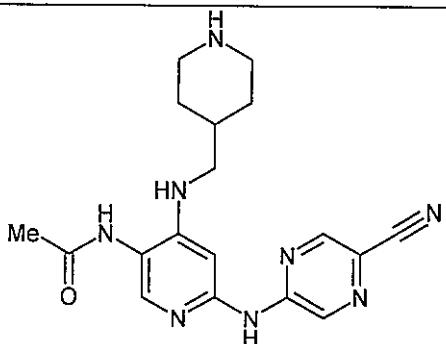




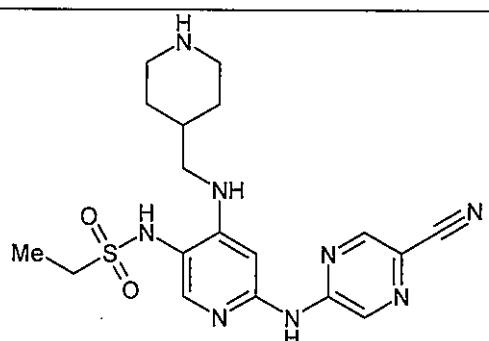
	(Y-011),
	(Y-012),
	(Y-013),
	(Y-014),
	(Y-015),



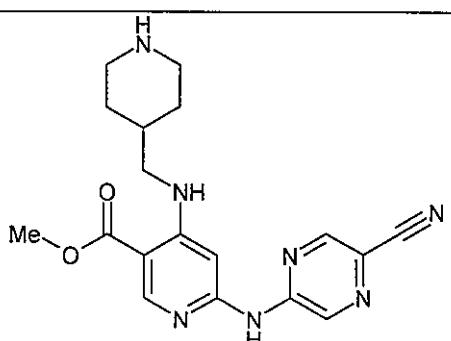
(Y-016),



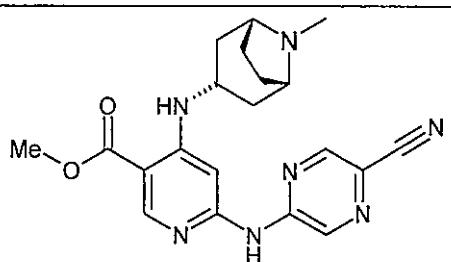
(Y-017),



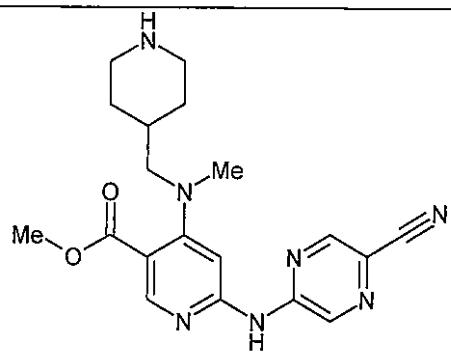
(Y-018),



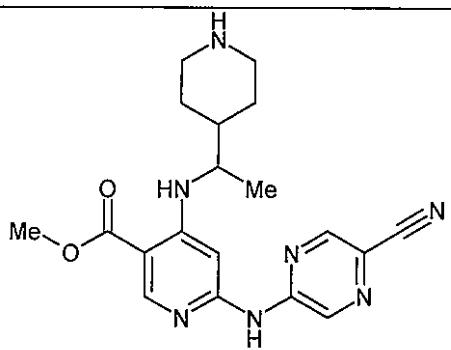
(Y-019),



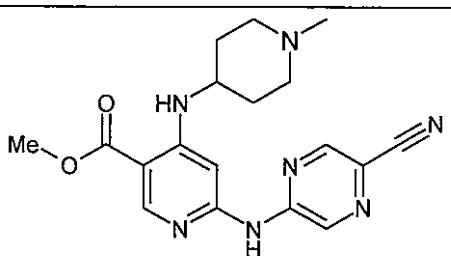
(Y-020),



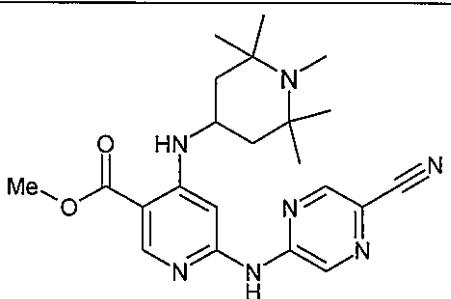
(Y-021),



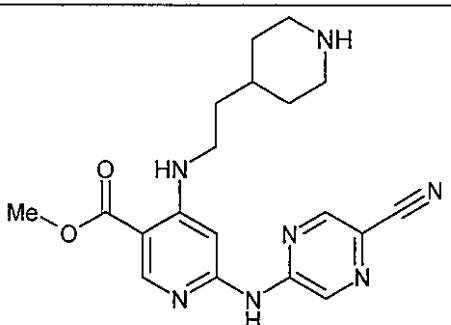
(Y-022),



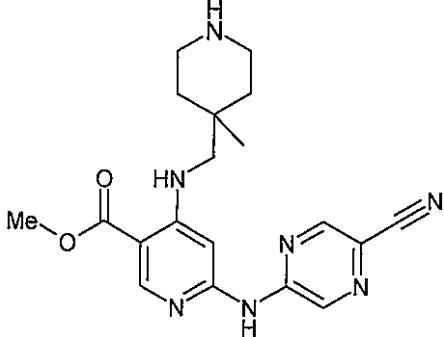
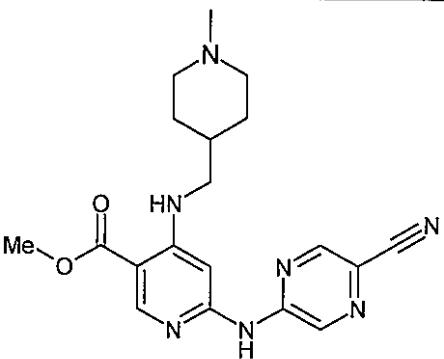
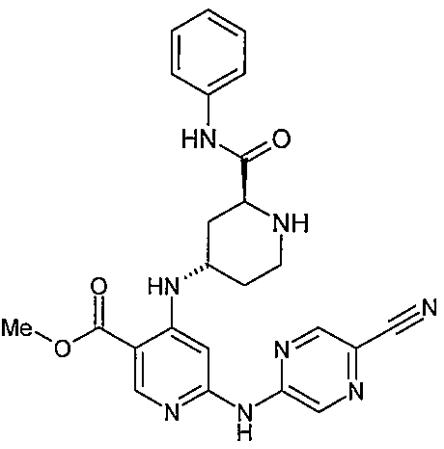
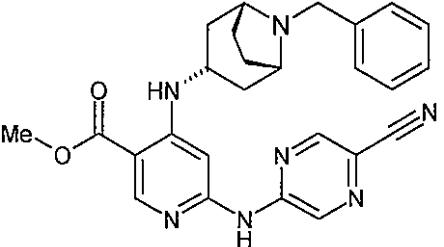
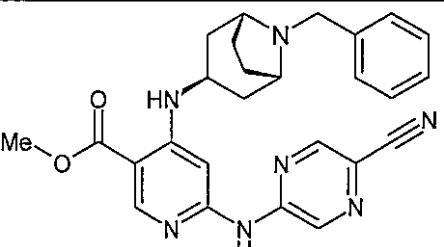
(Y-023),

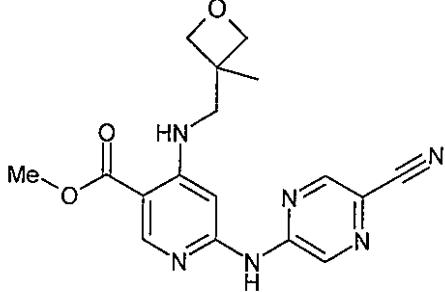
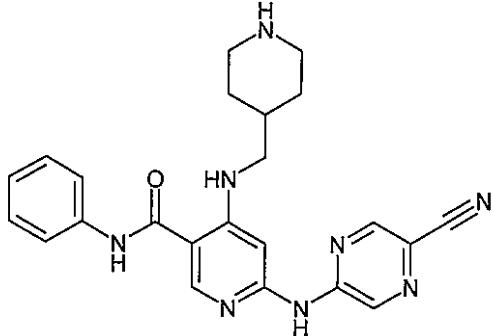
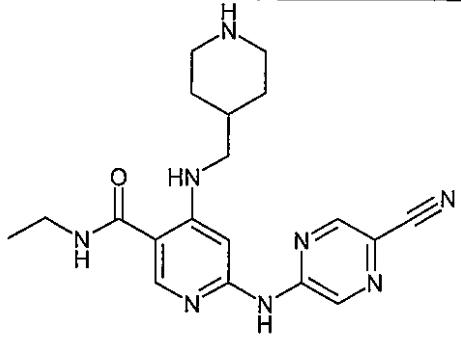
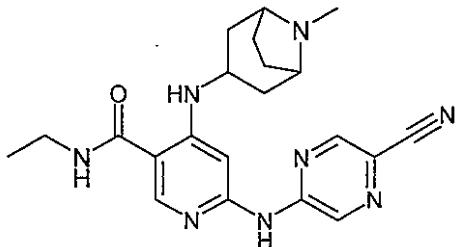
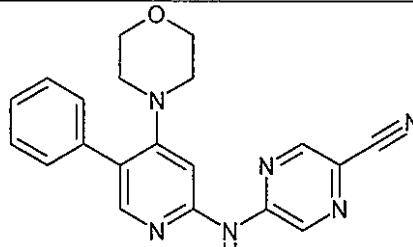


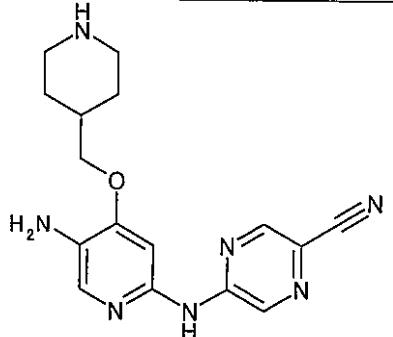
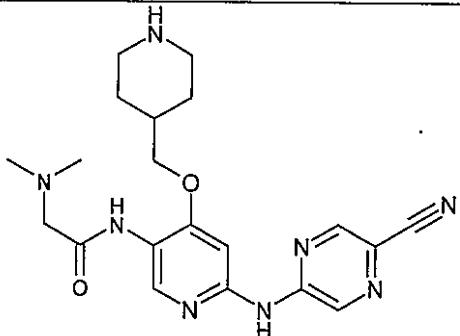
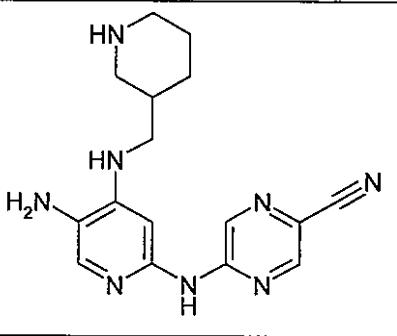
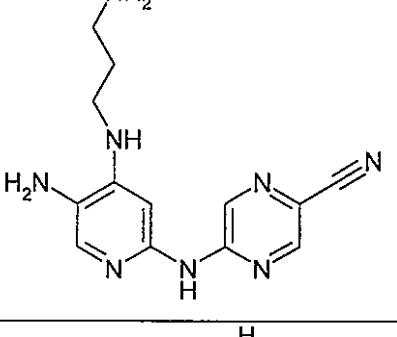
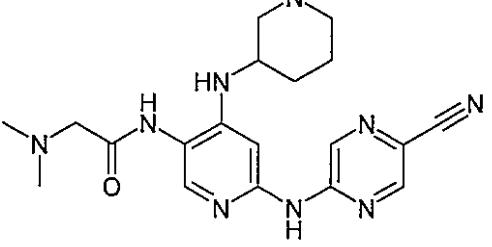
(Y-024),

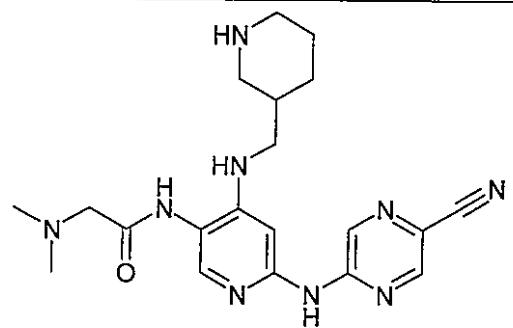


(Y-025),

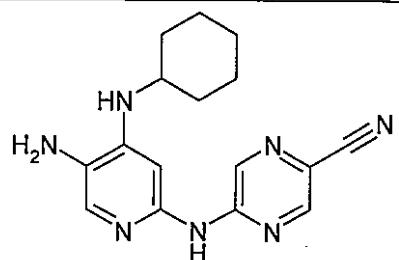
	(Y-026),
	(Y-027),
	(Y-028),
	(Y-029),
	(Y-030),

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

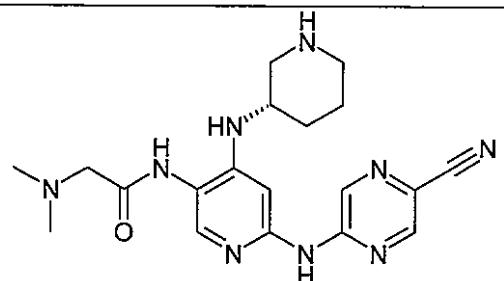
	(Y-038),
	(Y-039),
	(Y-041),
	(Y-042),
	(Y-043),



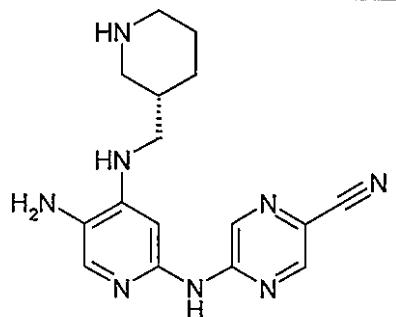
(Y-044),



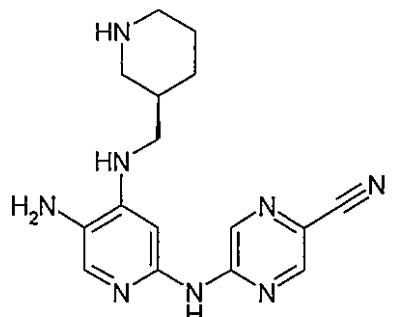
(Y-045),



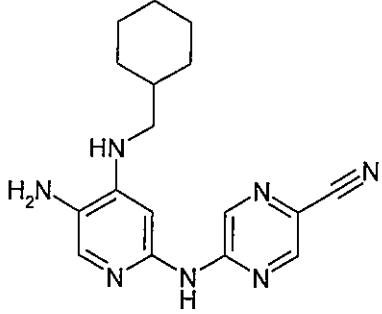
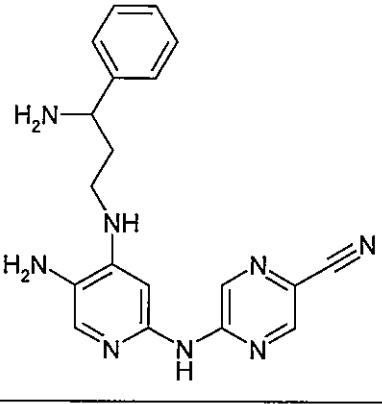
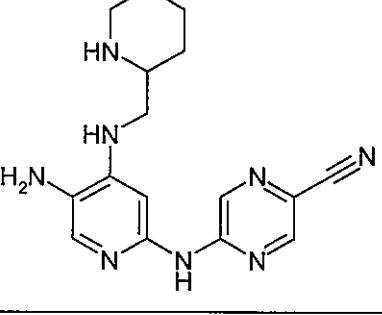
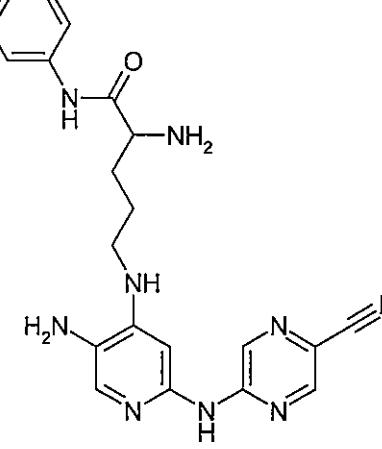
(Y-046),

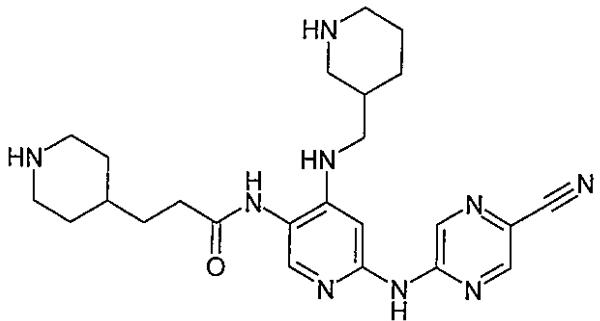


(Y-047),

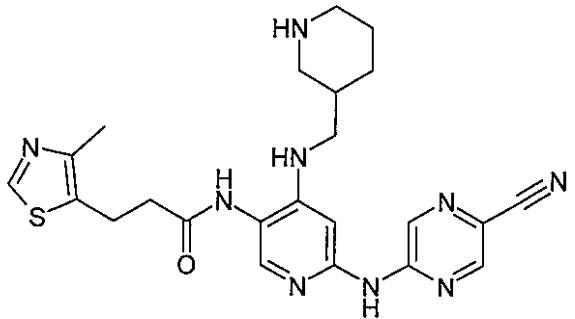


(Y-048),

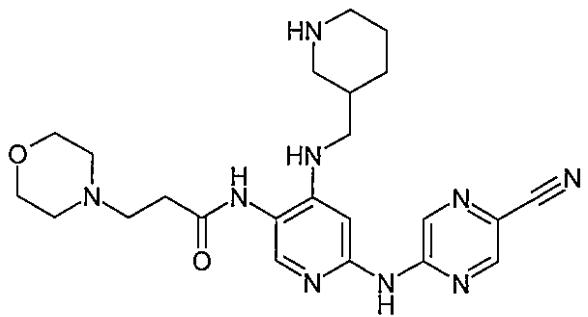
	(Y-049),
	(Y-050),
	(Y-051),
	(Y-052),



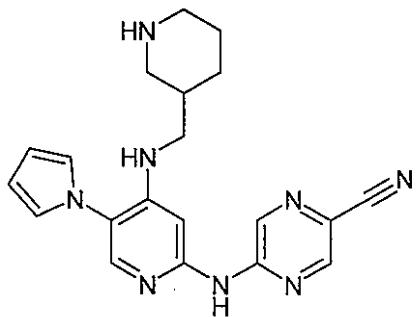
(Y-053),



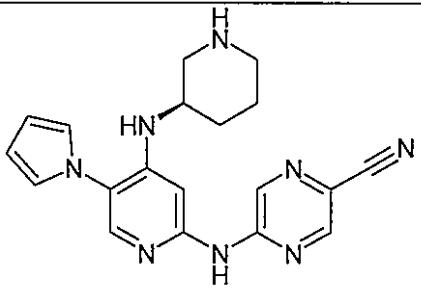
(Y-054),



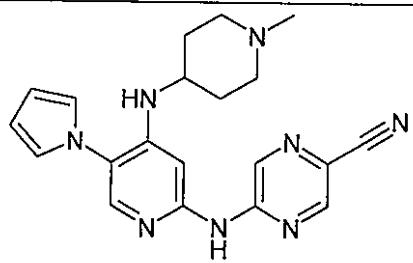
(Y-055),



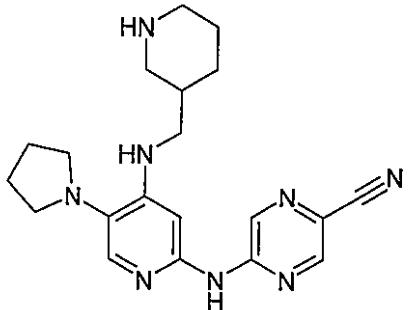
(Y-056),



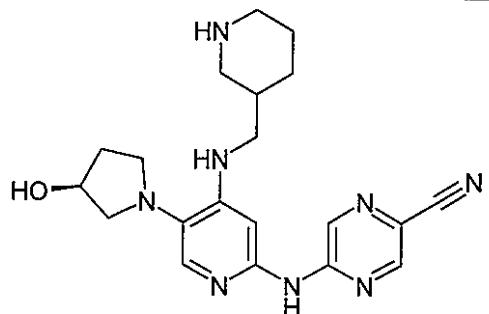
(Y-057),



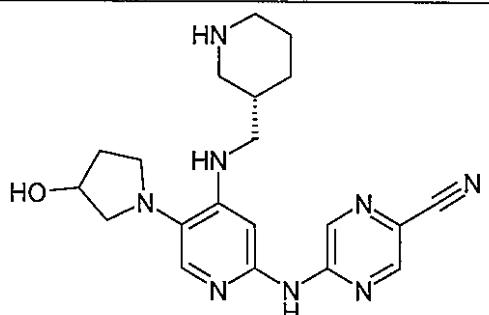
(Y-058),



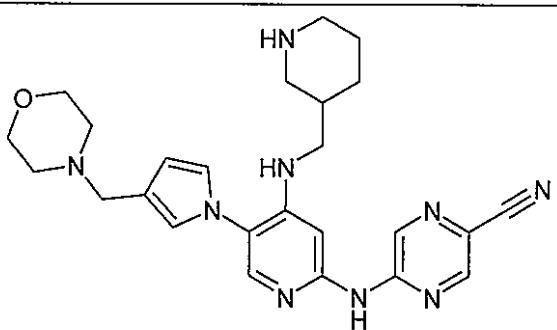
(Y-059),



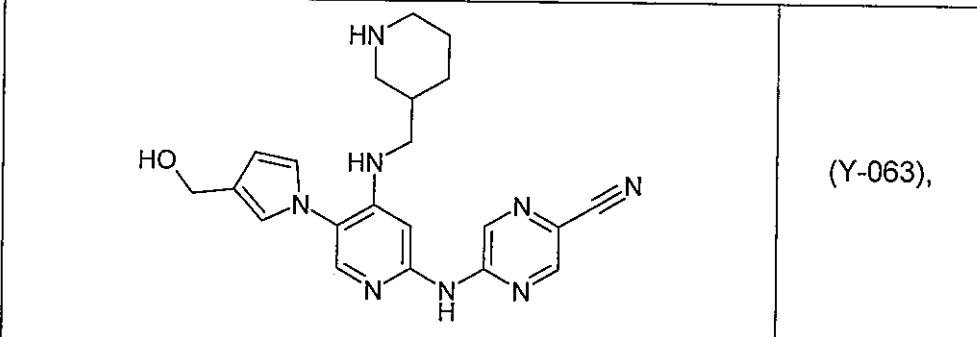
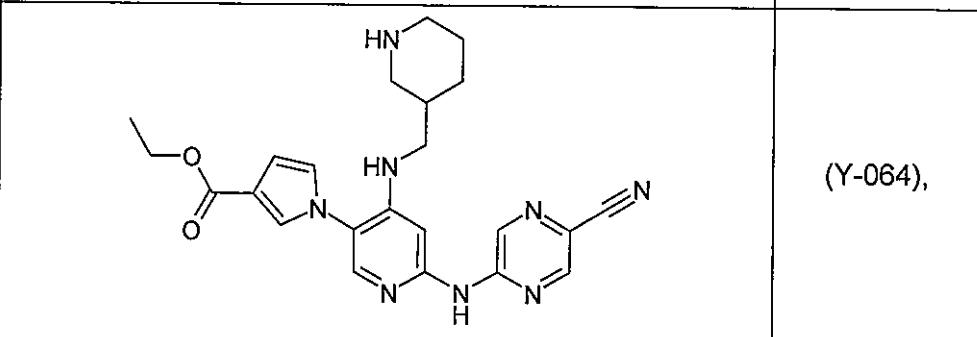
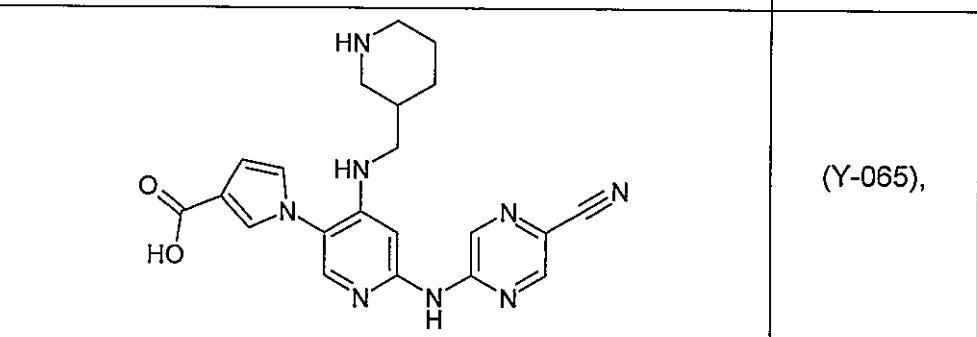
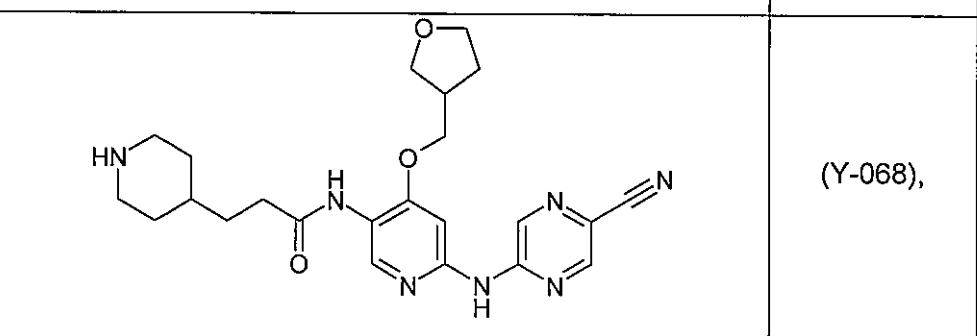
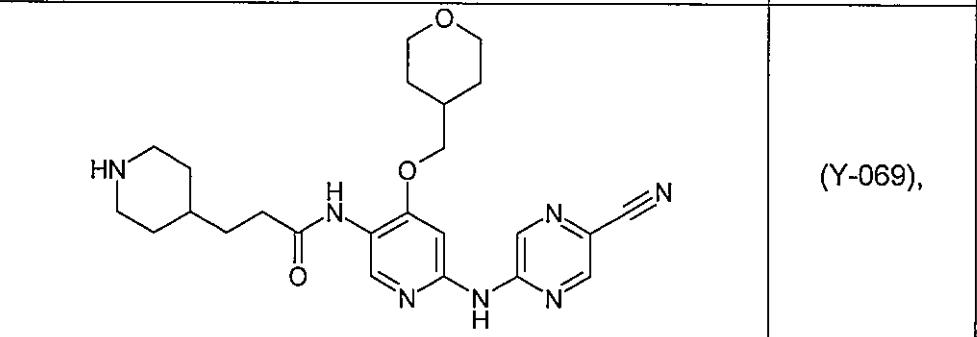
(Y-060),



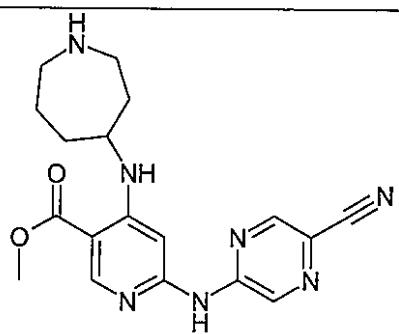
(Y-061),



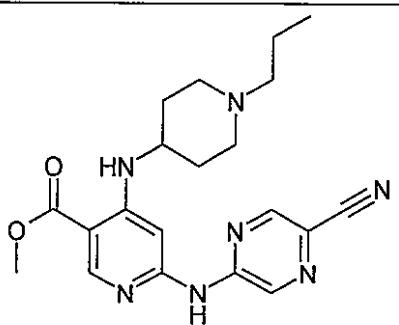
(Y-062),

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

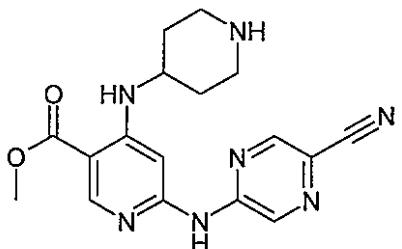
	(Y-070),
	(Y-071),
	(Y-072),
	(Y-073),
	(Y-075),



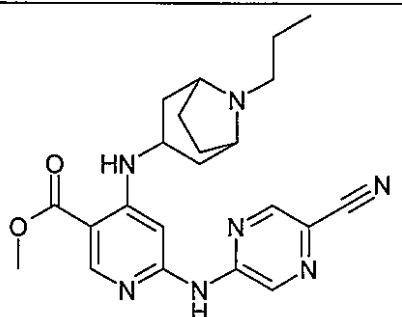
(Y-076),



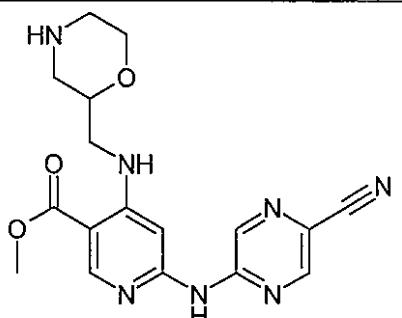
(Y-077),



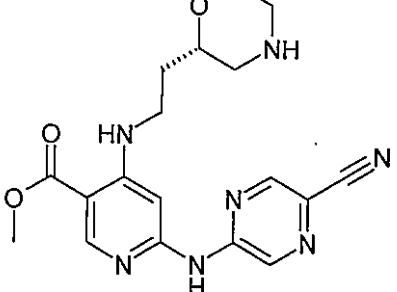
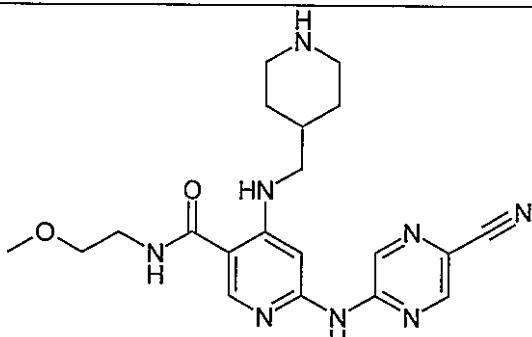
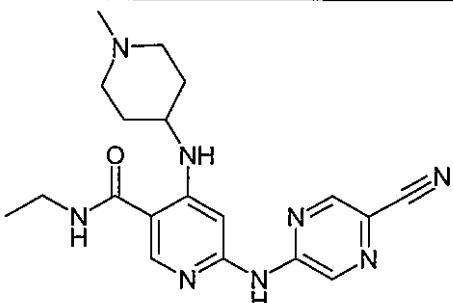
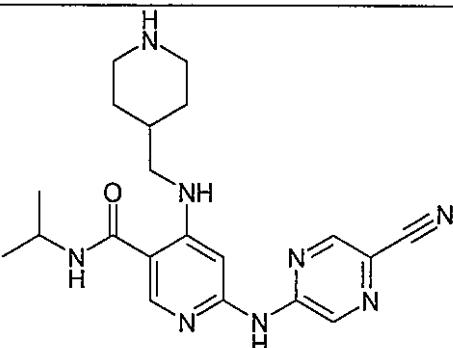
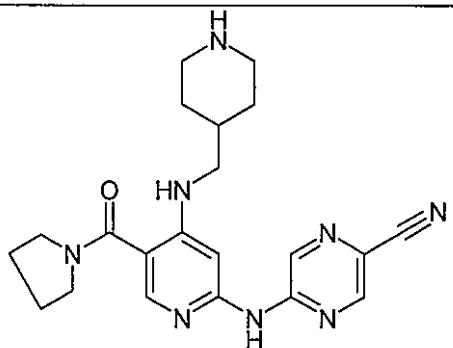
(Y-078),

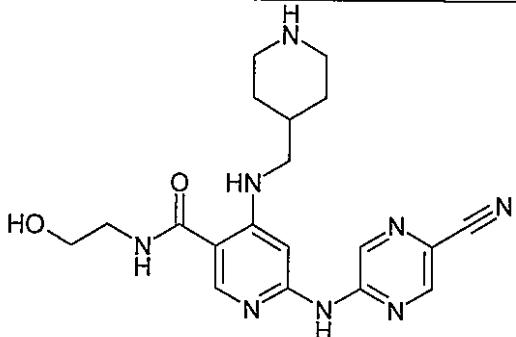
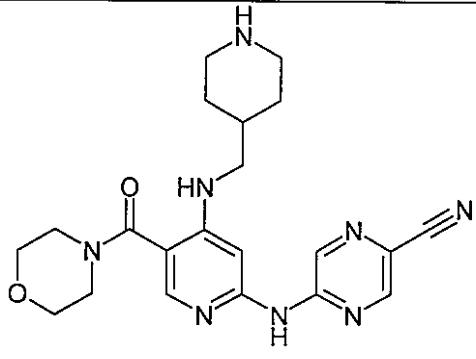
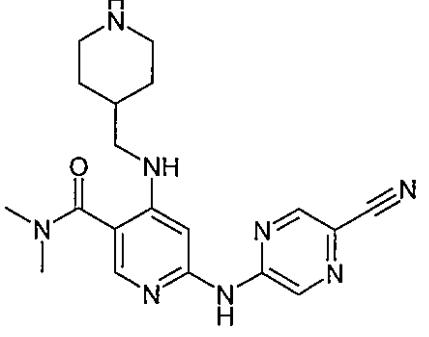
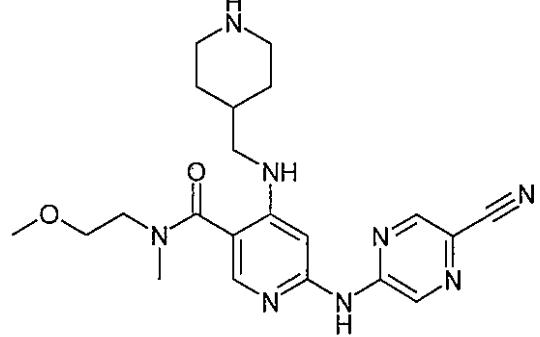


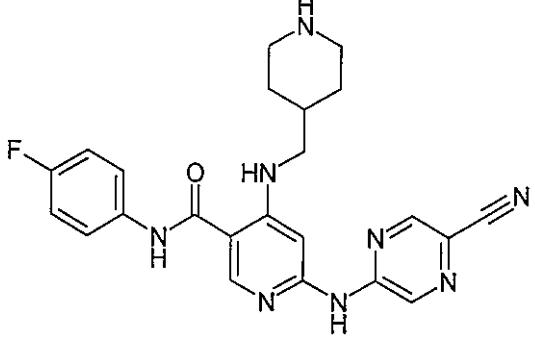
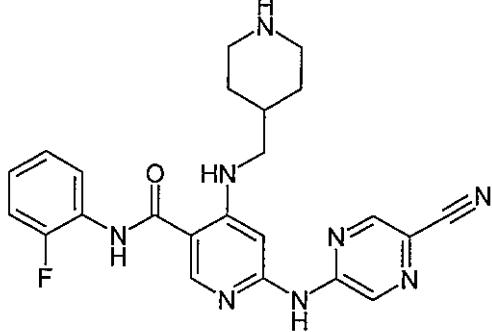
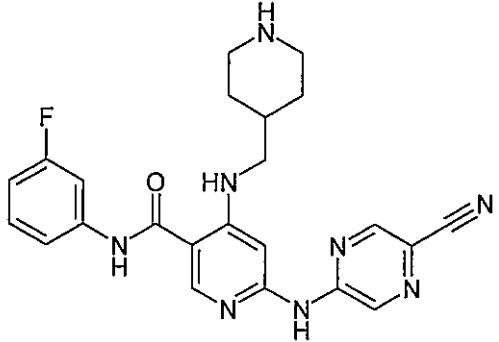
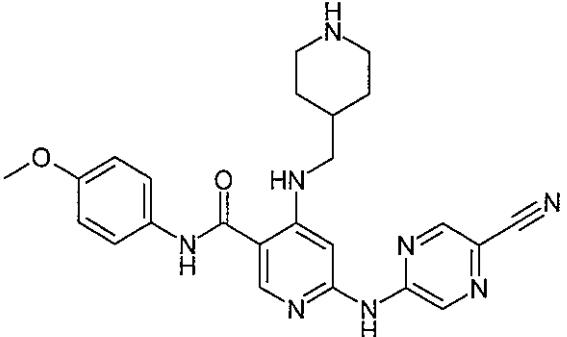
(Y-079),

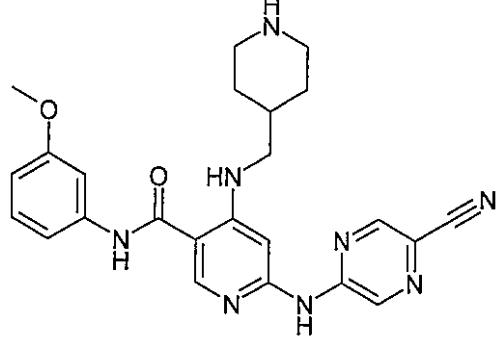
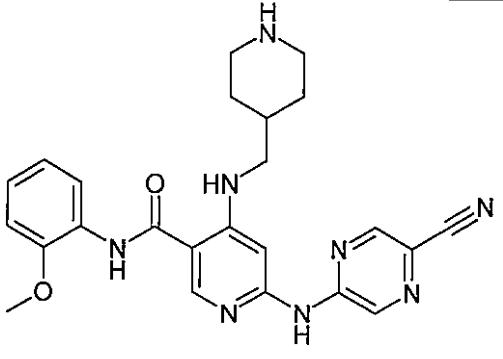
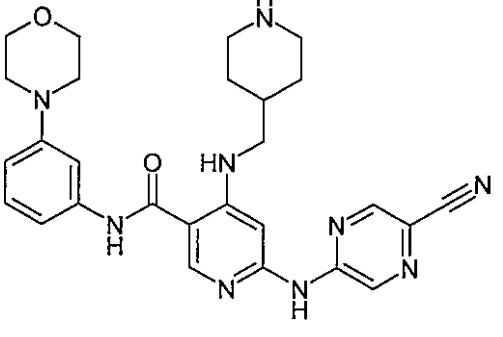
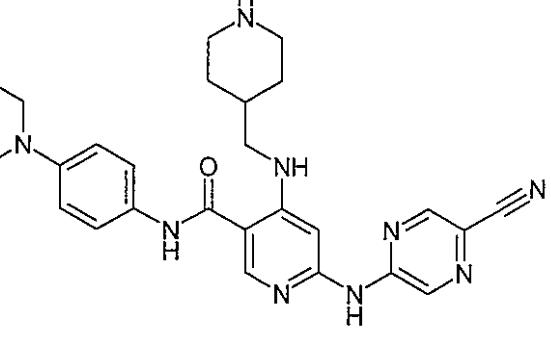


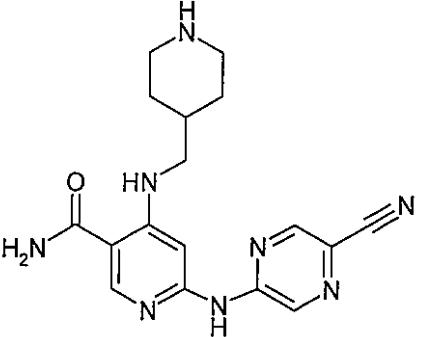
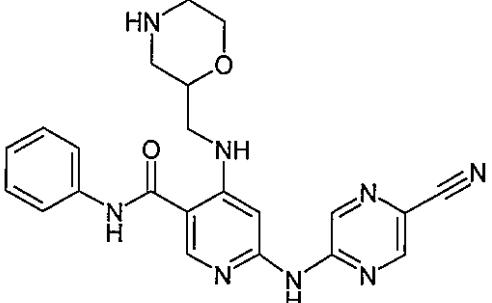
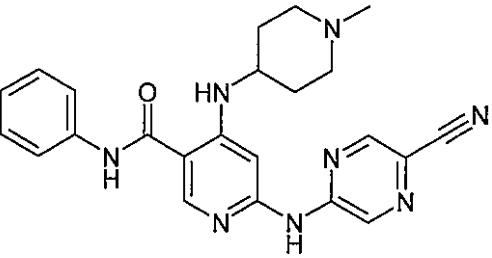
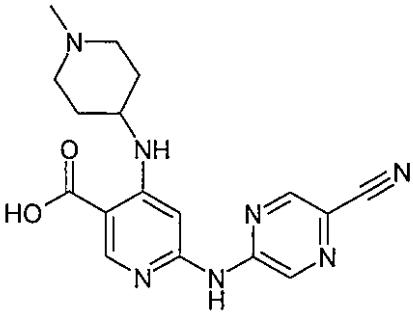
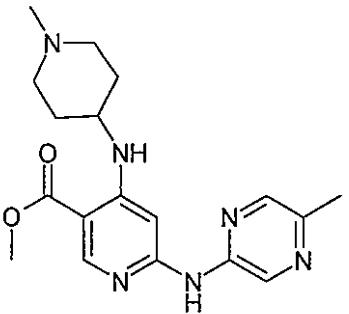
(Y-081),

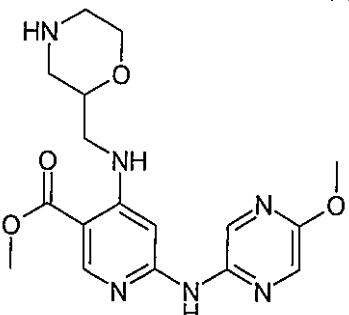
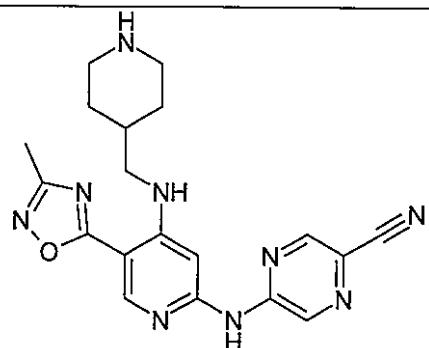
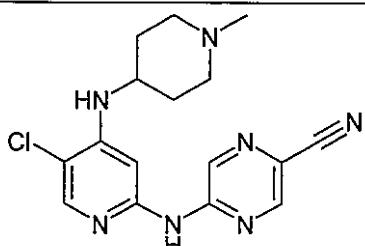
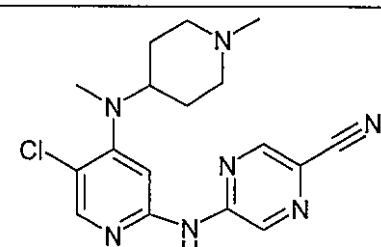
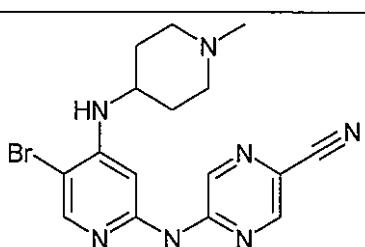
	(Y-082),
	(Y-084),
	(Y-085),
	(Y-086),
	(Y-087),

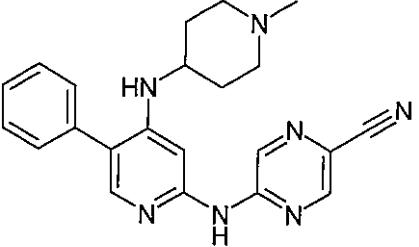
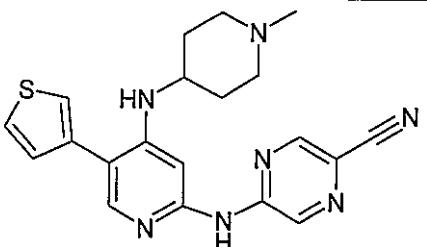
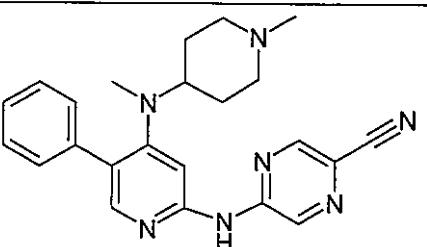
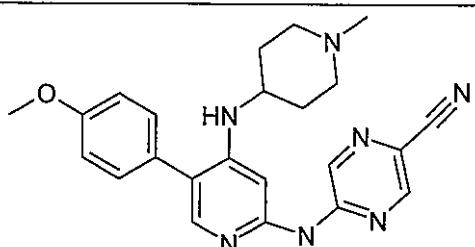
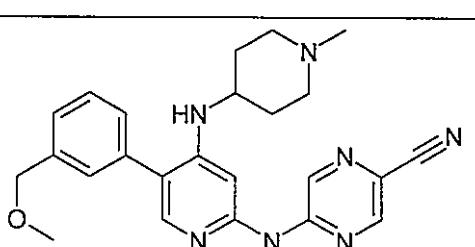
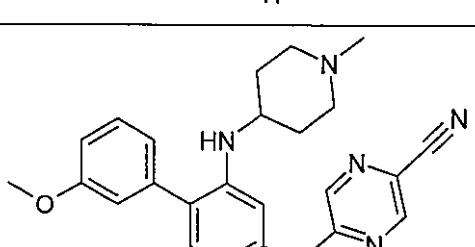
	(Y-088),
	(Y-089),
	(Y-090),
	(Y-091),

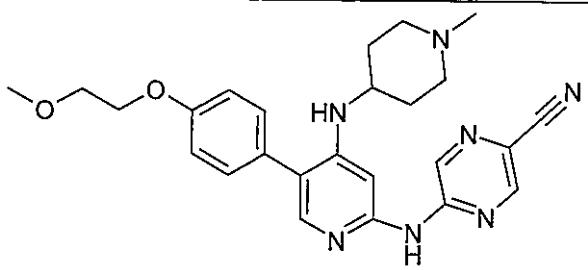
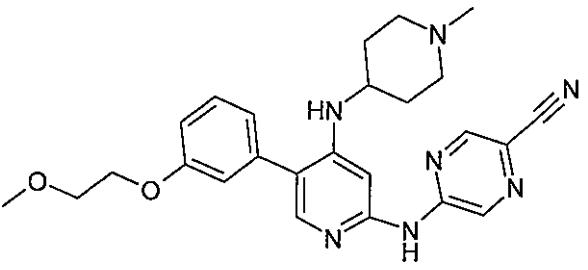
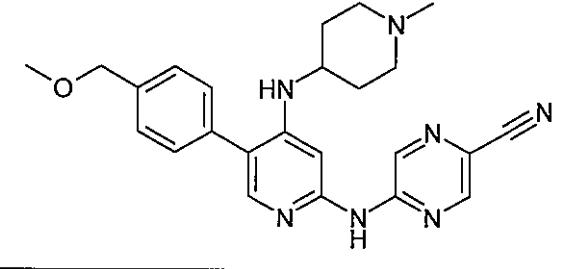
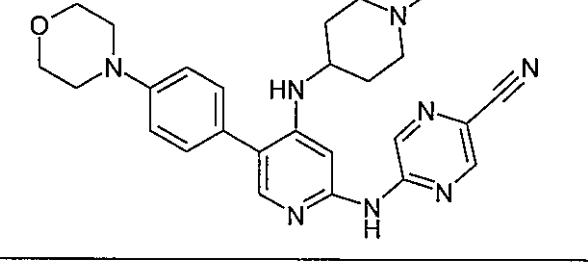
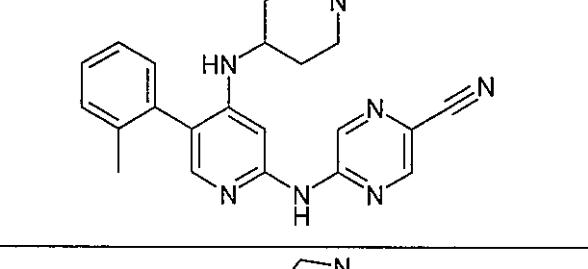
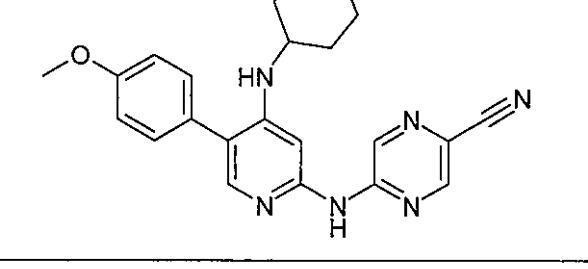
	(Y-092),
	(Y-093),
	(Y-094),
	(Y-095),

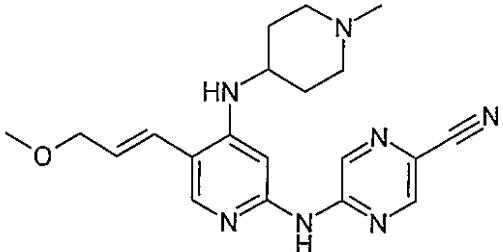
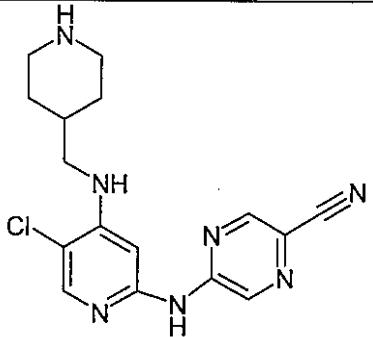
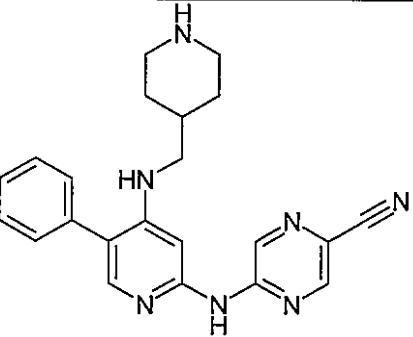
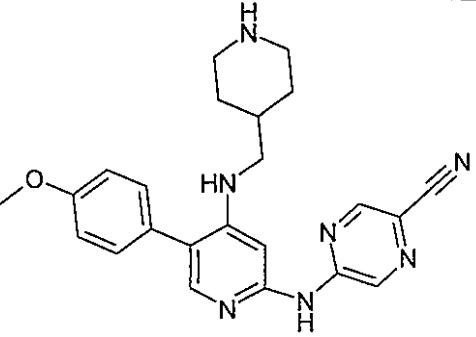
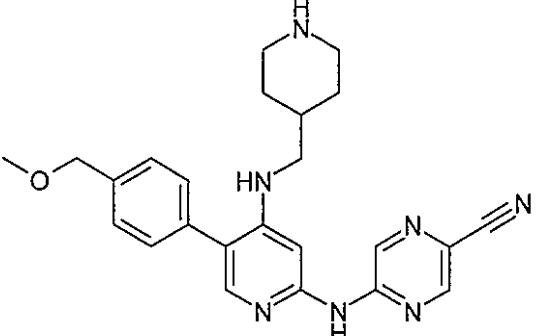
	(Y-096),
	(Y-097),
	(Y-099),
	(Y-100),

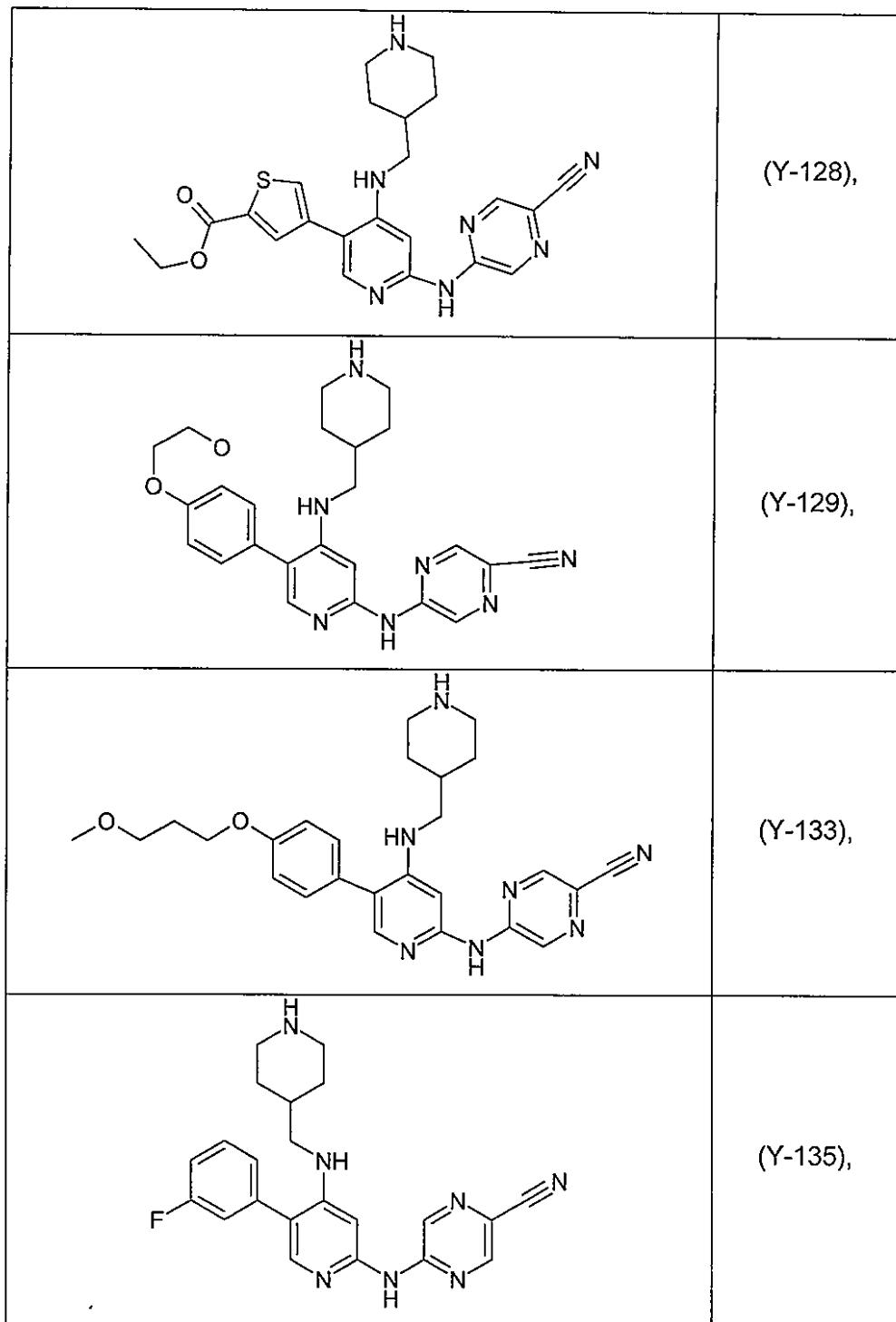
	(Y-101),
	(Y-102),
	(Y-103),
	(Y-104),
	(Y-105),

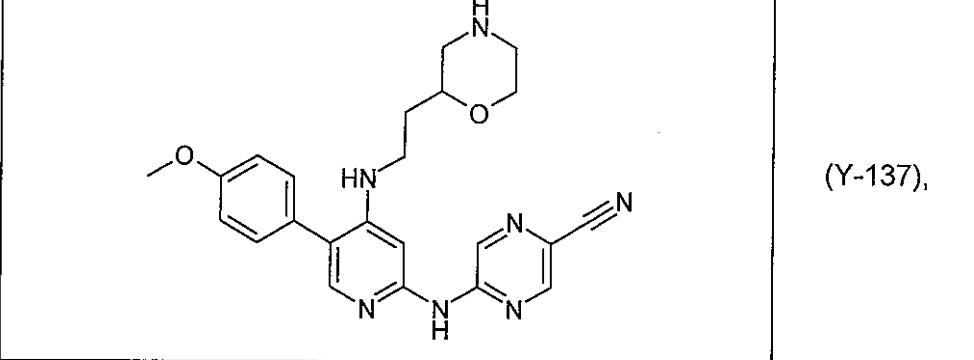
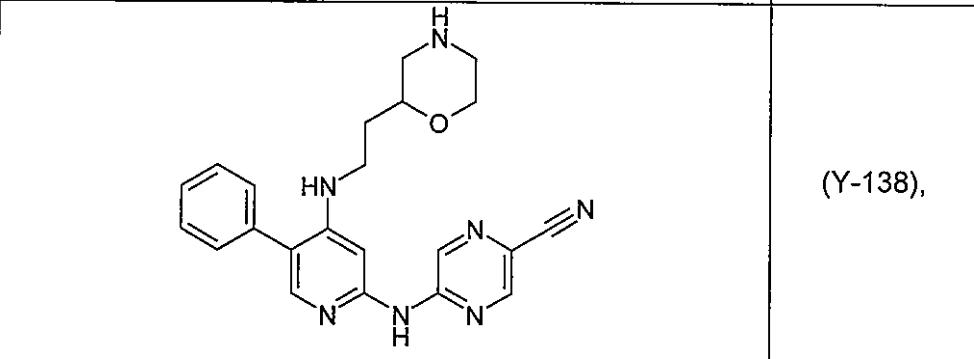
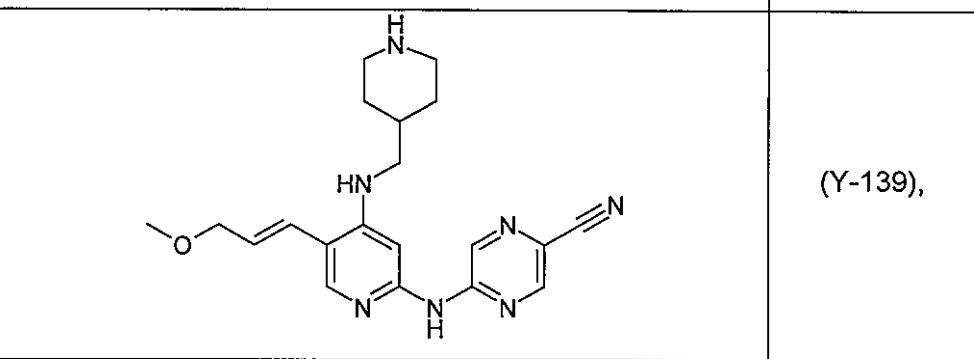
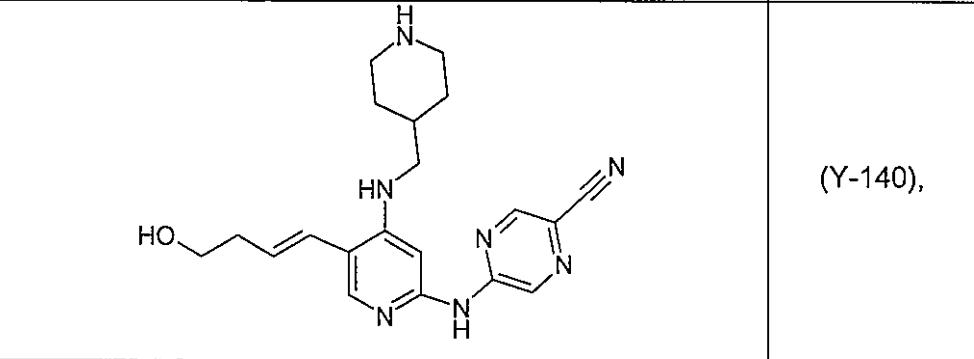
	(Y-106),
	(Y-107),
	(Y-108),
	(Y-109),
	(Y-110),

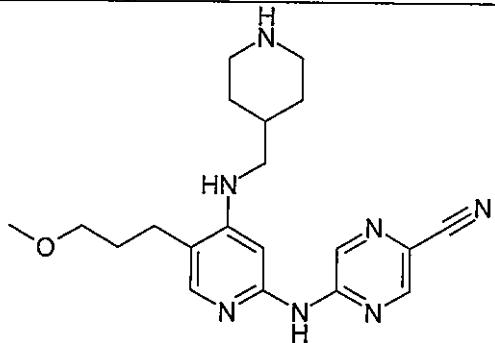
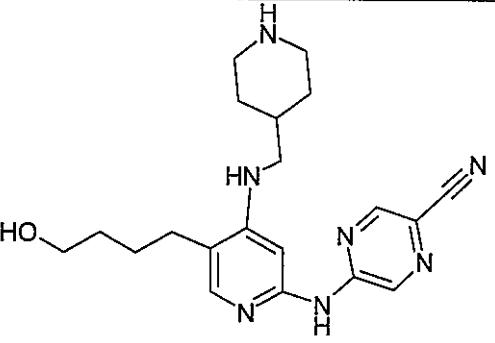
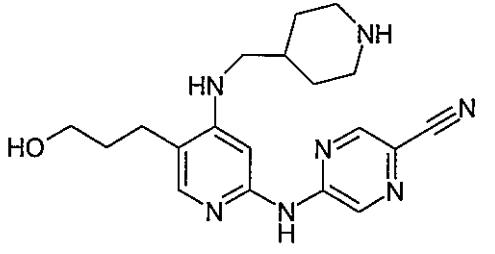
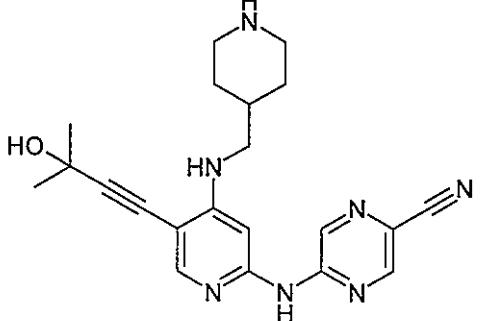
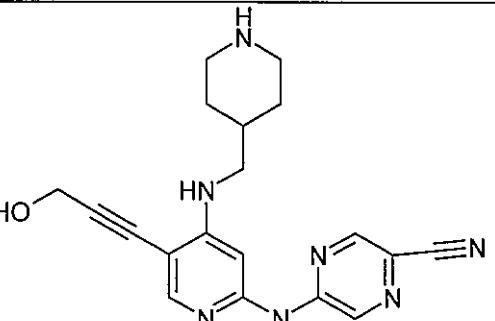
	(Y-111),
	(Y-112),
	(Y-113),
	(Y-114),
	(Y-115),
	(Y-116),

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

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

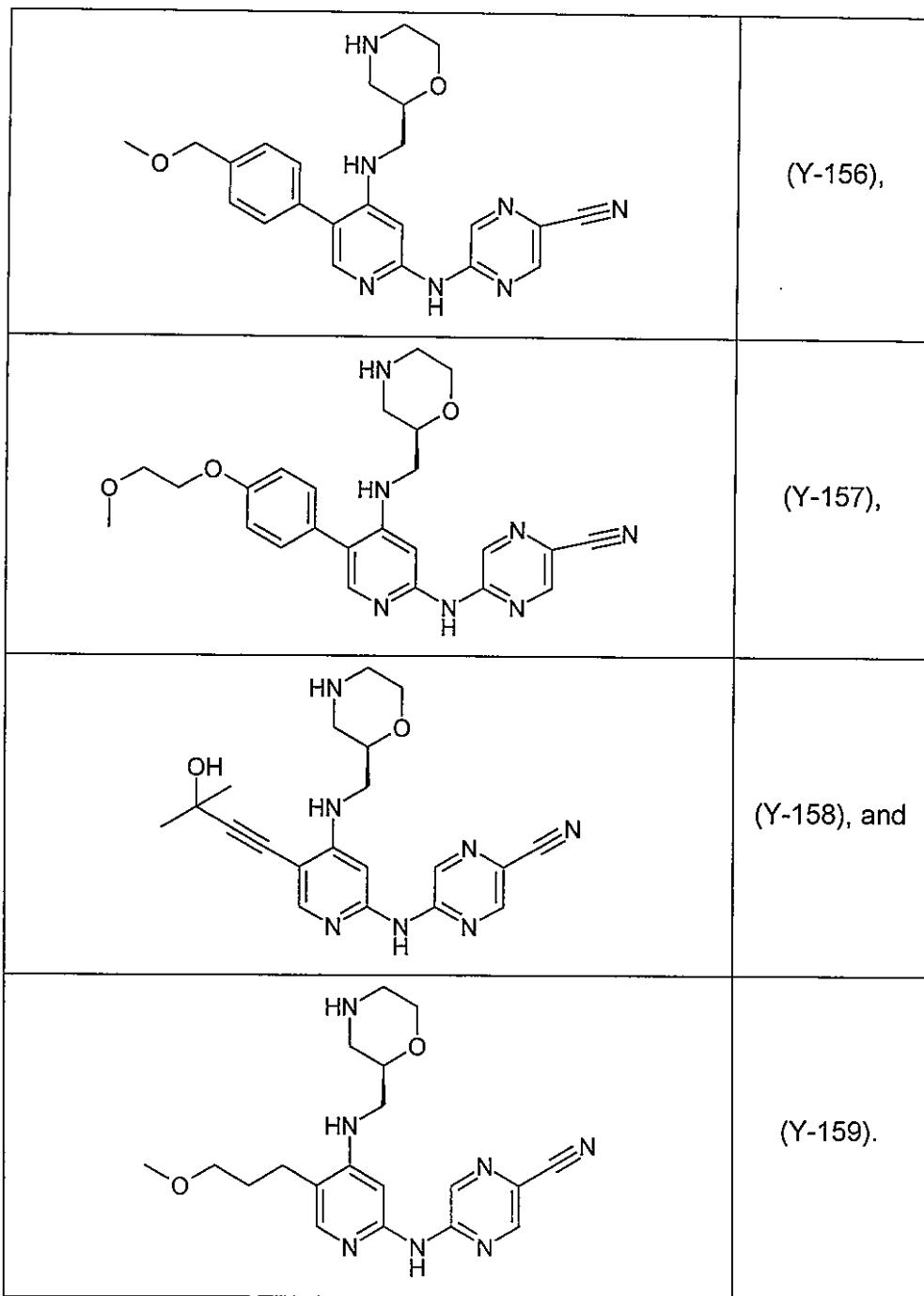


	(Y-137),
	(Y-138),
	(Y-139),
	(Y-140),

	(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),



。

## 【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、黑色腫、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。