

【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3月10日(2011.3.10)

【公表番号】特表2009-526761(P2009-526761A)

【公表日】平成21年7月23日(2009.7.23)

【年通号数】公開・登録公報2009-029

【出願番号】特願2008-552481(P2008-552481)

【国際特許分類】

C 07 D 495/04	(2006.01)
C 07 D 519/00	(2006.01)
A 61 K 31/4365	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 K 31/4545	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
A 61 K 31/541	(2006.01)
A 61 K 31/444	(2006.01)
A 61 K 31/497	(2006.01)
A 61 K 31/501	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
A 61 K 31/439	(2006.01)
A 61 K 45/00	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 3/10	(2006.01)
A 61 P 1/16	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 31/12	(2006.01)
A 61 P 37/06	(2006.01)
A 61 P 9/08	(2006.01)
A 61 P 17/06	(2006.01)
A 61 P 37/08	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 5/00	(2006.01)
A 61 P 31/18	(2006.01)
A 61 P 37/04	(2006.01)
A 61 P 19/00	(2006.01)
A 61 P 31/00	(2006.01)
A 61 P 7/02	(2006.01)
A 61 P 35/02	(2006.01)
A 61 P 25/02	(2006.01)
A 61 P 25/06	(2006.01)

【F I】

C 07 D 495/04	1 0 5 A
C 07 D 495/04	C S P
C 07 D 519/00	3 0 1
A 61 K 31/4365	

A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	31/4545	
A 6 1 K	31/496	
A 6 1 K	31/541	
A 6 1 K	31/444	
A 6 1 K	31/497	
A 6 1 K	31/501	
A 6 1 K	31/506	
A 6 1 K	31/439	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	31/12	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	9/08	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	5/00	
A 6 1 P	31/18	
A 6 1 P	37/04	
A 6 1 P	19/00	
A 6 1 P	31/00	
A 6 1 P	43/00	1 0 5
A 6 1 P	7/02	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	43/00	
A 6 1 P	25/02	1 0 1
A 6 1 P	25/06	

【手続補正書】

【提出日】平成22年1月15日(2010.1.15)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

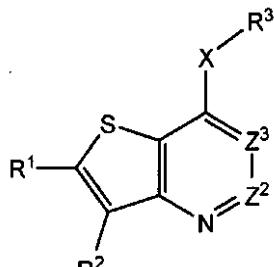
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I :

【化1】

**I**

およびその医薬的に許容し得る塩から選択される化合物：

(式中、

Xは、O、SまたはNR^{1 0}であり；Z²およびZ³は、独立して、CR⁴およびNから選択され、ここで、Z²およびZ³の1個のみがNであり；R¹は、H、C₁-C₁₂アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル、-C(=O)NR^{1 0}R^{1 1}、-(CR^{1 4}R^{1 5})_tNR^{1 0}R^{1 1}、-NR^{1 0}C(=Y)R^{1 1}、-NR^{1 0}C(=Y)OR^{1 1}、-NR^{1 2}C(=Y)NR^{1 0}R^{1 1}またはNR^{1 2}SO₂NR^{1 0}R^{1 1}、またはR¹は、単環式または二環式C₃-C₁₂炭素環、C₂-C₂₀ヘテロ環、C₆-C₂₀アリールまたはC₁-C₂₀ヘテロアリールであり、ここで、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリールおよびヘテロアリールは、場合によって、F、Cl、Br、I、CN、CF₃、オキソ、OR^{1 0}、SR^{1 0}、-C(=Y)R^{1 0}、-C(=Y)OR^{1 0}、-C(=Y)NR^{1 0}R^{1 1}、-(CR^{1 4}R^{1 5})_n-NR^{1 0}R^{1 1}、-NR^{1 0}C(=Y)R^{1 3}、-NR^{1 0}C(=Y)OR^{1 1}、-NR^{1 2}C(=Y)NR^{1 0}R^{1 1}、-NR^{1 2}SO₂R^{1 0}、-OC(=Y)R^{1 0}、-OC(=Y)OR^{1 0}、-OC(=Y)NR^{1 0}R^{1 1}、-OS(O)₂(OR^{1 0})、-OP(=Y)(OR^{1 0})、-OP(OR^{1 0})(OR^{1 1})、-S(O)R^{1 0}、-S(O)₂R^{1 0}、-S(O)₂NR^{1 0}R^{1 1}、-S(O)(OR^{1 0})、-S(O)₂(OR^{1 0})、-SC(=Y)R^{1 0}、-SC(=Y)OR^{1 0}、-SC(=Y)NR^{1 0}R^{1 1}、C₁-C₁₂アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル、C₃-C₁₂シクロアルキル、C₂-C₂₀ヘテロ環、C₆-C₂₀アリールおよびC₁-C₂₀ヘテロアリール、-(CR^{1 4}R^{1 5})_n-NR^{1 2}C(=O)(CR^{1 4}R^{1 5})_mNR^{1 0}R^{1 1}、および-C(=O)(CR^{1 4}R^{1 5})_nNR^{1 0}R^{1 1}から独立して選択される1個以上の基で置換され；R²およびR⁴は、独立して、H、F、Cl、Br、I、CF₃、CN、-C(=Y)R^{1 0}、-C(=Y)OR^{1 0}、-C(=Y)NR^{1 0}R^{1 1}、-NR^{1 0}R^{1 1}、-NR^{1 0}C(=Y)R^{1 1}、-NR^{1 0}C(=Y)OR^{1 1}、-NR^{1 2}C(=Y)NR^{1 0}R^{1 1}、-NR^{1 2}SO₂NR^{1 0}R^{1 1}、-OR^{1 0}、-OC(=Y)R^{1 0}、-OC(=Y)OR^{1 0}、-OC(=Y)NR^{1 0}R^{1 1}、-C(=O)NR^{1 2}(CR^{1 4}R^{1 5})_tNR^{1 0}R^{1 1}、-OP(=Y)(OR^{1 0})(OR^{1 1})、-OP(OR^{1 0})(OR^{1 1})、-SR^{1 0}、-S(O)R^{1 0}、-S(O)₂R^{1 0}、-S(O)₂NR^{1 0}R^{1 1}、-SC(=Y)R^{1 0}、-SC(=Y)OR^{1 0}、C₁-C₁₂アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル、C₃-C₁₂炭素環、C₂-C₂₀ヘテロ環、C₆-C₂₀アリールまたはC₁-C₂₀ヘテロアリールであり、ここで、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリール、およびヘテロアリールは、場合によって、F、Cl、Br、I、OR^{1 0}およびNR^{1 0}R^{1 1}から独立して選択される1個以上の基で置換され；R³は、単環式または二環式C₃-C₁₂炭素環、C₂-C₂₀ヘテロ環、C₆-C₂₀

アリール、または $C_1 - C_{20}$ ヘテロアリールであり、ここで、前記炭素環、ヘテロ環、アリールおよびヘテロアリールは、場合によって、F、C1、Br、I、CN、CF₃、OR¹⁰、SR¹⁰、-C(=Y)R¹⁰、-C(=Y)OR¹⁰、-C(=Y)NR¹⁰R¹¹、-NR¹⁰R¹¹、-NR¹⁰C(=Y)R¹³、-NR¹⁰C(=Y)OR¹¹、-NR¹²C(=Y)NR¹⁰R¹¹、-NR¹²C(=O)C(=O)R¹⁰R¹¹、-NR¹²C(=O)C(=O)NR¹⁰R¹¹、-NR¹²C(=O)C(=O)OR^a、-NR¹²SO₂R¹⁰、-NR¹²C(=Y¹)(CR¹⁴R¹⁵)_nC(=Y²)NR¹⁰R¹¹、-NR¹²C(=Y¹)NR¹⁰C(=Y²)(CR¹⁴R¹⁵)_nC(=Y²)(CR¹⁴R¹⁵)_mR¹⁰、-OC(=Y)R¹⁰、-OC(=Y)OR¹⁰、-OC(=Y)NR¹⁰R¹¹、-OS(O)₂(OR¹⁰)、-OP(=Y)(OR¹⁰)(OR¹¹)、-OP(OR¹⁰)(OR¹¹)、-S(O)R¹⁰、-S(O)₂R¹⁰、-S(O)₂NR¹⁰R¹¹、-S(O)(OR¹⁰)、-S(O)₂(OR¹⁰)、-SC(=Y)R¹⁰、-SC(=Y)OR¹⁰、-SC(=Y)NR¹⁰R¹¹、C₁-C₁₂アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル、C₃-C₁₂シクロアルキル、C₂-C₂₀ヘテロ環、C₆-C₂₀アリールおよびC₁-C₂₀ヘテロアリールから独立して選択される1個以上の基で置換され、ここで前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロ環、アリールおよびヘテロアリールは、場合によって、F、C1、Br、I、OH、C₁-C₁₂アルキル、オキソ、NR¹⁰R¹¹、-C(=Y)NR¹⁰R¹¹および(CR¹⁴R¹⁵)_n-アリールから独立して選択される1個以上の基で置換され；

R¹⁰、R¹¹およびR¹²は、独立して、H、OR^a、C₁-C₁₂アルキル、C₂-C₈アルケニルまたはC₂-C₈アルキニル、または単環式または二環式C₃-C₁₂炭素環、C₂-C₂₀ヘテロ環、C₆-C₂₀アリール、またはC₁-C₂₀ヘテロアリールであり、ここで、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリールおよびヘテロアリールは、場合によって、F、C1、Br、I、SO₂R^c、CN、OR^a、NR^aR^b、C(=O)NR^aR^b、CR^aC(=O)R^b、C₁-C₁₂アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル、C₃-C₂₀炭素環、C₆-C₂₀アリールおよびC₁-C₂₀ヘテロアリールから独立して選択される1個以上の基で置換され；または

R¹⁰およびR¹¹は、これらが結合する窒素と一緒にになって、場合によって、飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和のC₃-C₂₀ヘテロシクロ環であって、場合によってN、OまたはSから選択される追加の環原子を1個以上含む環を形成し、ここで、前記ヘテロシクロ環は、場合によって、オキソ、OR^a、NR^aR^b、CF₃、F、C1、Br、I、SO₂R^a、C(=O)R^a、NR¹⁰C(=Y)R¹¹、C(=Y)NR¹⁰R¹¹、C₁-C₁₂アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル、C₃-C₁₂シクロアルキル、C₂-C₂₀ヘテロ環、C₆-C₂₀アリールおよびC₁-C₂₀ヘテロアリールから独立して選択される1個以上の基で置換され；

R¹³は、H、C₁-C₁₂アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル、(CR¹⁴R¹⁵)_nシクロアルキル、(CR¹⁴R¹⁵)_n-ヘテロ環、(CR¹⁴R¹⁵)_n-アリール、(CR¹⁴R¹⁵)_n-ヘテロアリール、(CR¹⁴R¹⁵)_n-O-(CR¹⁴R¹⁵)_m-アリール、(CR¹⁴R¹⁵)_n-OR¹⁰、(CR¹⁴R¹⁵)_n-NR¹⁰R¹¹、(CR¹⁴R¹⁵)_n-NR¹⁰C(=O)R¹¹、または(CR¹⁴R¹⁵)_n-NR¹⁰(SO₂Me)-R¹¹であり、ここで、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキルおよびヘテロアリール部分は、場合によって、F、C1、Br、I、オキソ、SO₂R^c、CN、OR^a、C(=O)R^a、C(=O)OR^a、NR^aR^b、NR^aC(=O)R^b、C₁-C₁₂アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル、C₃-C₁₂シクロアルキル、C₂-C₂₀ヘテロ環、C₆-C₂₀アリールおよびC₁-C₂₀ヘテロアリールから独立して選択される1個以上の基で置換され；

R^{1-4} および R^{1-5} は、独立して、H、 C_1-C_{1-2} アルキルまたは($CR^{1-4}R^{1-5}$)_t-アリールであり、または

R^{1-4} および R^{1-5} は、これらが結合する原子と一緒にになって、飽和または部分的に不飽和の C_3-C_{1-2} 炭素環を形成し；または

R^{1-0} および R^{1-5} は、これらが結合する原子と一緒にになって、飽和または部分的に不飽和の C_1-C_{2-0} ヘテロシクロ環であって、場合によって、F、Cl、Br、I、OR^a、 C_1-C_{1-2} アルキル、 C_2-C_8 アルケニル、 C_2-C_8 アルキニル、 C_3-C_{1-2} シクロアルキル、 C_2-C_{2-0} ヘテロ環、 C_6-C_{2-0} アリールおよび C_1-C_{2-0} ヘテロアリールから独立して選択される1個以上の基で置換される環を形成し、ここで、前記アルキルおよびアリールは、場合によって、F、Cl、Br および I から独立して選択される1個以上の基で置換され、または

R^{1-4} は存在せず、かつ R^{1-0} および R^{1-5} は、これらが結合する原子と一緒にになって、1個以上のヘテロ原子を有する C_1-C_{2-0} ヘテロアリール環を形成し；

R^a および R^b は、独立して、H、 C_1-C_{1-2} アルキル、 C_2-C_8 アルケニル、 C_2-C_8 アルキニル、 C_3-C_{1-2} 炭素環、 C_2-C_{2-0} ヘテロ環、 C_6-C_{2-0} アリールまたは C_1-C_{2-0} ヘテロアリールであり、ここで、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリールおよびヘテロアリールは、場合によって、1個以上のアルキルまたはハロゲン基で置換され；

R^c は、 C_1-C_{1-2} アルキルまたは C_6-C_{2-0} アリールであり、ここで、前記アルキルおよびアリールは、場合によって、F、Cl、Br、I、OR^a および $C(=O)NR^a$ R^b から独立して選択される1個以上の基で置換され；

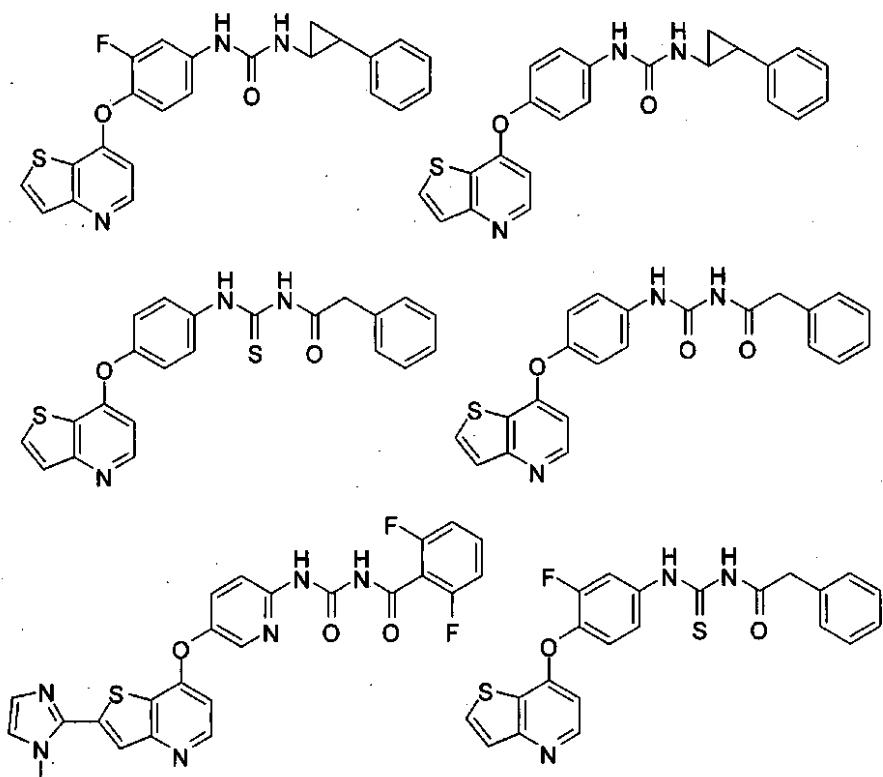
Y、 Y^1 および Y^2 は、独立して、O または S であり；

t は、1、2、3、4、5 または 6 であり；そして

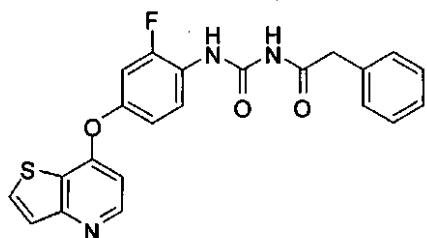
n および m は、独立して、0、1、2、3、4、5 または 6 であり；

ただし、式 I の化合物は、

【化2】



および



から選択される化合物ではない。)

【請求項2】

R³は、単環式または二環式C₃-C₁₂炭素環、C₂-C₂₀ヘテロ環、C₆-C₂₀アリールまたはC₁-C₂₀ヘテロアリールであり、ここで、前記炭素環、ヘテロ環、アリールおよびヘテロアリールは、場合によって、F、Cl、Br、I、CN、CF₃、OR¹⁰、SR¹⁰、-C(=Y)R¹⁰、-C(=Y)OR¹⁰、-C(=Y)NR¹⁰、R¹¹、-NR¹⁰R¹¹、-NR¹⁰C(=Y)R¹³、-NR¹⁰C(=Y)OR¹¹、-NR¹²C(=Y)NR¹⁰R¹¹、-NR¹²C(=O)C(=O)R¹⁰R¹¹、-NR¹²C(=O)C(=O)OR^a、-NR¹²SO₂R¹⁰、-NR¹²C(=Y¹)(CR¹⁴R¹⁵)_nC(=Y²)NR¹⁰R¹¹、-NR¹²C(=Y¹)(CR¹⁴R¹⁵)_nC(=Y²)(CR¹⁴R¹⁵)_mR¹⁰、-OC(=Y)R¹⁰、-OC(=Y)OR¹⁰、-OC(=Y)NR¹⁰R¹¹、-OS(O)₂(OR¹⁰)、-OP(=Y)(OR¹⁰)(OR¹¹)、-OP(OR¹⁰)(OR¹¹)、-S(O)R¹⁰、-S(O)₂R¹⁰、-S(O)₂NR¹⁰R¹¹、-S(O)(OR¹⁰)、-S(O)₂(OR¹⁰)、-SC(=Y)R¹⁰、-SC(=Y)OR¹⁰、-SC(=Y)NR¹⁰R¹¹、C₁-C₁₂アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル、C₃-C₁₂シクロアルキル、C₂-C₂₀ヘテロ環、C₆-C₂₀アリールおよびC₁-C₂₀ヘテロアリールから独立して選択される1個以上の基で置換され、ここで前記

アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロ環、アリールおよびヘテロアリールは、場合によって、F、Cl、Br、I、OH、C₁-C₁₂アルキル、NR¹R¹¹および(CR¹⁻⁴R¹⁻⁵)_n-アリールから独立して選択される1個以上の基で置換され；

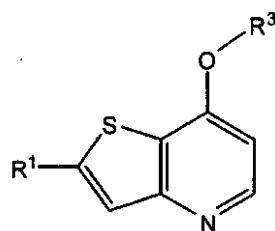
R¹⁰、R¹¹およびR¹²は、独立して、H、C₁-C₁₂アルキル、C₂-C₈アルケニルまたはC₂-C₈アルキニル、単環式または二環式C₃-C₁₂炭素環、C₂-C₂₀ヘテロ環、C₆-C₂₀アリール、あるいはC₁-C₂₀ヘテロアリールであり、ここで、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリールおよびヘテロアリールは、場合によって、F、Cl、Br、I、SO₂R^c、CN、OR^a、NR^aR^b、C(=O)NR^aR^b、CR^aC(=O)R^b、C₁-C₁₂アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル、C₆-C₂₀アリール、およびC₁-C₂₀ヘテロアリールから独立して選択される1個以上の基で置換され；

R^aおよびR^bは、独立して、H、C₁-C₁₂アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル、C₃-C₁₂炭素環、C₂-C₂₀ヘテロ環、C₆-C₂₀アリール、またはC₁-C₂₀ヘテロアリールであり、ここで、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリールおよびヘテロアリールは、場合によって、1個以上のアルキル基で置換される請求項1記載の化合物。

【請求項3】

式Iが、式Ib：

【化3】



Ib

およびその医薬的に許容し得る塩から選択される請求項1または2記載の化合物：

(式中、

R¹は、H、C₁-C₁₂アルキル、C₂-C₈アルケニル、-C(=O)NR¹⁰R¹¹、または

R¹は、単環式または二環式C₃-C₁₂炭素環、C₂-C₂₀ヘテロ環、C₆-C₂₀アリール、またはC₁-C₂₀ヘテロアリールであり、ここで、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリールおよびヘテロアリールは、場合によって、オキソ、-C(=Y)R¹⁰、-C(=Y)OR¹⁰、-C(=Y)NR¹⁰R¹¹、-(CR¹⁻⁴R¹⁻⁵)_n-NR¹⁰R¹¹、-NR¹⁰C(=Y)R¹³、C₁-C₁₂アルキル、C₂-C₂₀ヘテロ環、およびC₁-C₂₀ヘテロアリールから独立して選択される1個以上の基で置換され；かつ

R³は、C₆-C₂₀アリールまたはC₁-C₂₀ヘテロアリールであり、ここで、前記アリールおよびヘテロアリールは、場合によって、F、Cl、-NR¹⁰R¹¹、-NR¹⁰C(=Y)R¹³、-NR¹⁰C(=Y)OR¹¹、-NR¹⁰C(=Y)NR¹⁰R¹¹、-NR¹⁰C(=O)C(=O)NR¹⁰R¹¹、-NR¹⁰C(=O)C(=O)OR^a、-NR¹⁰SO₂R¹⁰、-NR¹⁰C(=Y¹)(CR¹⁻⁴R¹⁻⁵)_nC(=Y²)NR¹⁰R¹¹、-NR¹⁰C(=Y¹)NR¹⁰C(=Y²)(CR¹⁻⁴R¹⁻⁵)_nR¹¹、-NR¹⁰C(=Y¹)(CR¹⁻⁴R¹⁻⁵)_nC(=Y²)(CR¹⁻⁴R¹⁻⁵)_mR¹⁰、C₁-C₁₂アルキル、C₂-C₂₀ヘテロ環およびC₁-C₂₀ヘテロアリールから独立して選択される1個以上の基で置換され、ここで前記アルキル、ヘテロ環およびヘテロアリールは、場合によって、F、Cl、Br、I、OH、C₁-C₂アルキル、オキソ、NR¹⁰R¹¹、-C(=Y)NR¹⁰R¹¹および(CR¹⁻⁴R¹⁻⁵)_n-

R^{1-5})_n - アリールから独立して選択される 1 個以上の基で置換される。)

【請求項 4】

R^1 は、場合によって置換されたアルキニルである請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

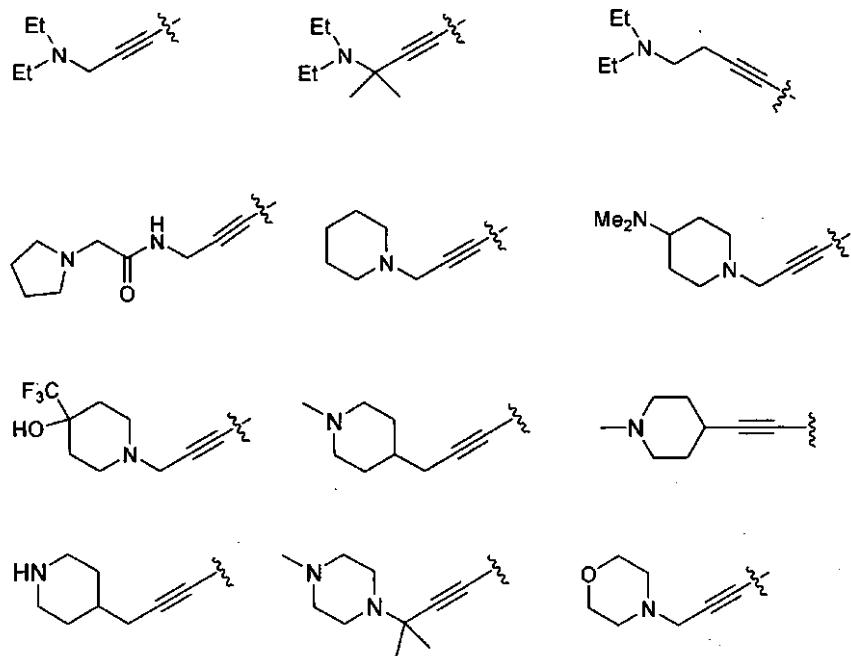
【請求項 5】

R^1 は、 $-C(CR^{1-4}R^{1-5})_nNR^{1-2}C(=O)(CR^{1-4}R^{1-5})_mNR^{1-0}R^{1-1}$ 、 $-C(CR^{1-4}R^{1-5})_n-NR^{1-0}R^{1-1}$ または、場合によって C_5-C_8 ヘテロ環で置換されたアルキニルである請求項 4 記載の化合物。

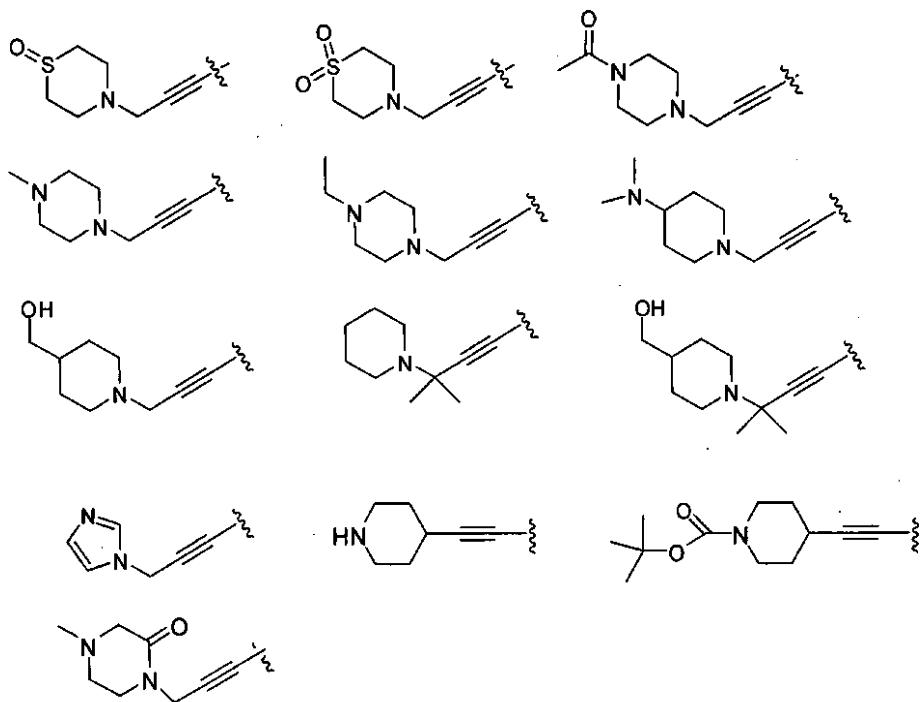
【請求項 6】

R^1 は、構造式：

【化 4】



【化5】



(式中、波線は、チオフェン環の2位炭素への結合を示す)から選択される請求項5記載の化合物。

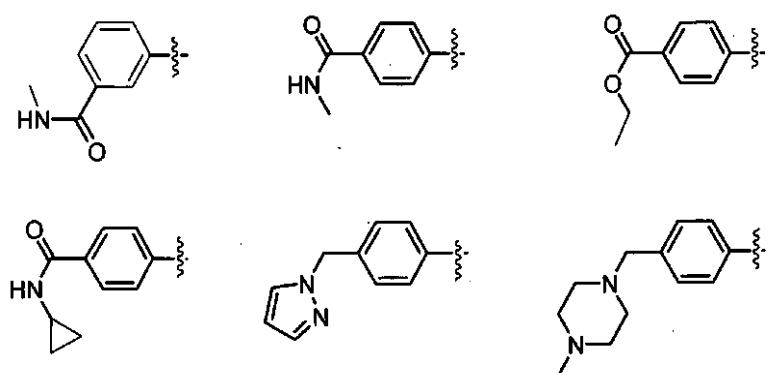
【請求項7】

R¹は、場合によって置換されたアリールまたはヘテロアリールである請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物。

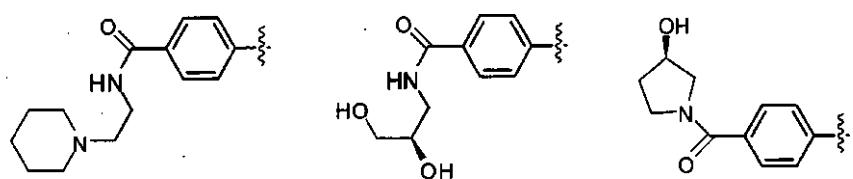
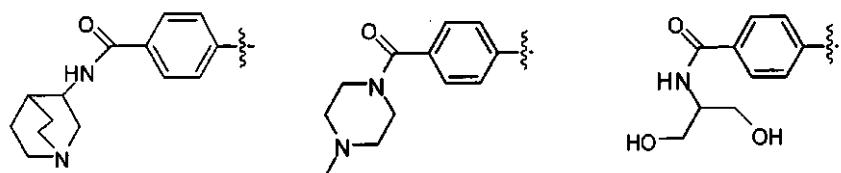
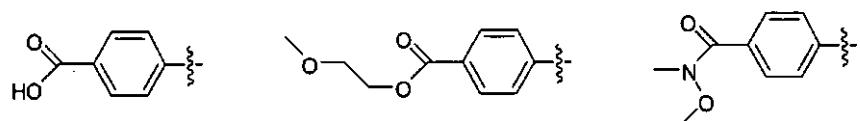
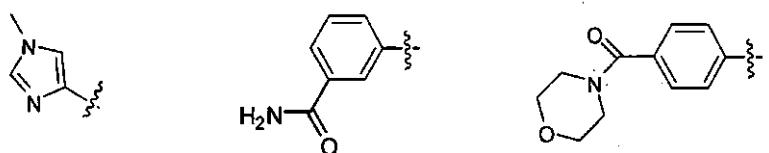
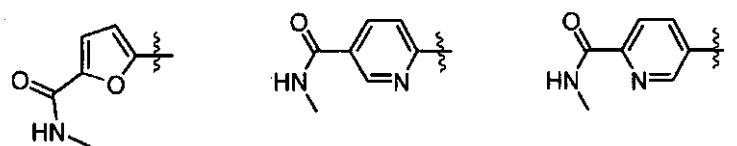
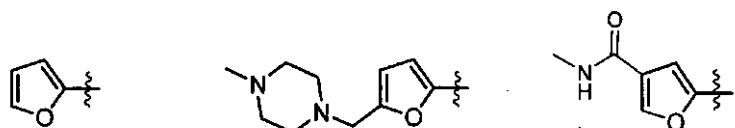
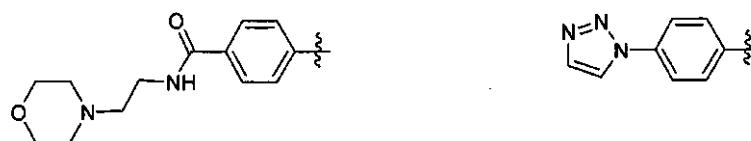
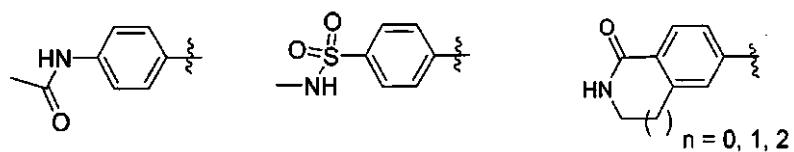
【請求項8】

R¹は、構造式：

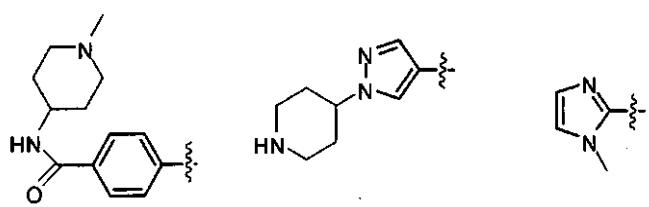
【化6】



【化 7】



【化 8】



(式中、波線は、チオフェン環の2位炭素への結合点を示す)から選択される請求項7記載の化合物。

【請求項9】

R¹は、(a)フェニルであって、場合によってハロゲン、C₁-C₆アルキル、SO₂NH(C₁-C₆アルキル)、ヘテロアリールまたはCH₂-ヘテロアリール(ここで、ヘテロアリールは、2または3個の環窒素原子を有する5または6員環であって、場合によってC₁-C₆アルキルで置換されている)で置換され、CH₂-het Cyc(ここで、het Cycは、NおよびOから独立して選択される1~2個の環へテロ原子を有する5または6員環であって、場合によって、C₁-C₆アルキルで置換されている)、NR^hC(=O)Rⁱ、C(=O)R^h、C(=O)NR^hRⁱまたはNR^hRⁱ(ここで、R^hおよびRⁱは、独立して、H、OH、O(C₁-C₆アルキル)、C₁-C₆アルキル、C₃-C₆炭素環、または5~8員ヘテロ環(ここで、前記O(C₁-C₆アルキル)、アルキル、炭素環またはヘテロ環は、場合によって、OH、OCH₃、C₁-C₆アルキルおよび5または6員ヘテロ環から選択される1個以上の基で置換されている))であり；(b)6、7または8員アザ環状環に縮合するフェニル基であって、場合によって、オキソで置換され；または(c)NおよびOから選択される1または2個の環へテロ原子を有する5または6員ヘテロアリールであって、場合によって、C₁-C₆アルキルで置換されたヘテロアリール、C(=O)NR^hRⁱ(ここで、R^hおよびRⁱは、独立して、H、C₁-C₆アルキルまたはC₃-C₆炭素環である)、het CycまたはCH₂-het Cyc(ここで、het Cycは、場合によって、C₁-C₆アルキルで置換されている5または6員アザ環である)である請求項7記載の化合物。

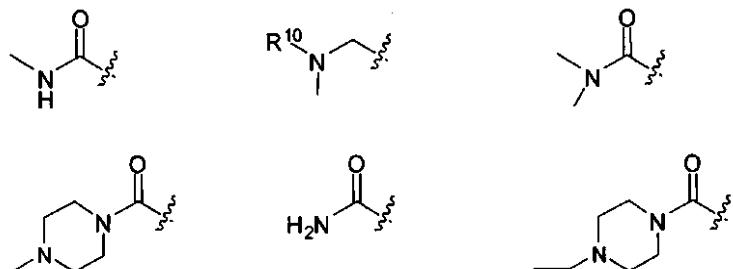
【請求項10】

R¹は、-C(=O)NR¹₀R¹₁または-(CR¹₄R¹₅)_tNR¹₀R¹₁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11】

R¹は、構造式：

【化9】



(式中、波線は、チオフェン環の2位炭素への結合点を示す)から選択される請求項10記載の化合物。

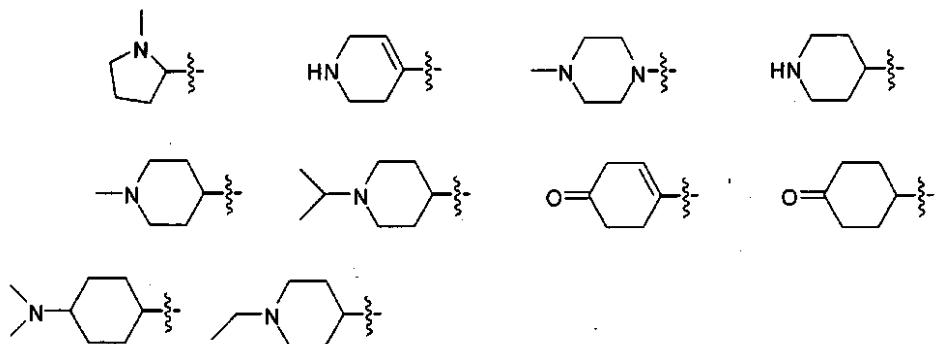
【請求項12】

R¹は、場合によって置換された炭素環またはヘテロ環である請求項1~3のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項13】

R¹は、構造式：

【化10】

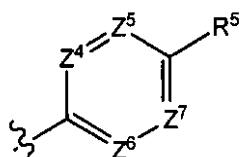


から選択される請求項12記載の化合物。

【請求項14】

R^3 が、構造式：

【化11】



(式中、波線は、Oへの結合点を示し；

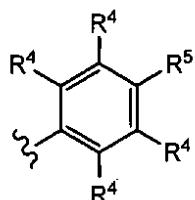
Z^4 、 Z^5 、 Z^6 および Z^7 は、独立して、CR⁴またはNであり、かつ0、1または2個のZ⁴、Z⁵、Z⁶およびZ⁷がNであるが、ここでZ⁴およびZ⁵またはZ⁶およびZ⁷がCR⁴である場合、Z⁴およびZ⁵またはZ⁶およびZ⁷は、場合によって、飽和、部分的に不飽和または完全に不飽和の炭素環またはヘテロシクロ環を形成し；

R^5 は、F、Cl、-NR¹₀R¹₁、-NR¹₀C(=Y)R¹₃、-NR¹₀C(=Y)OR¹₁、-NR¹₂C(=Y)NR¹₀R¹₁、-NR¹₂C(=O)C(=O)NR¹₀R¹₁、-NR¹₂C(=O)C(=O)OR^a、-NR¹₂SO₂R¹₀、-NR¹₂C(=Y¹)(CR¹₄R¹₅)_nC(=Y²)NR¹₀R¹₁、-NR¹₂C(=Y¹)(CR¹₄R¹₅)_nC(=Y²)(CR¹₄R¹₅)_mR¹₀、C₁-C₁₂アルキル、C₂-C₂₀ヘテロ環またはC₁-C₂₀ヘテロアリールであり、ここで前記アルキル、ヘテロ環およびヘテロアリールは、場合によって、F、Cl、Br、I、OH、C₁-C₁₂アルキル、オキソ、NR¹₀R¹₁、-C(=Y)NR¹₀R¹₁および(CR¹₄R¹₅)_n-アリールから独立して選択される1個以上の基で置換される)で表される請求項1~13のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項15】

R^3 は、構造式：

【化12】

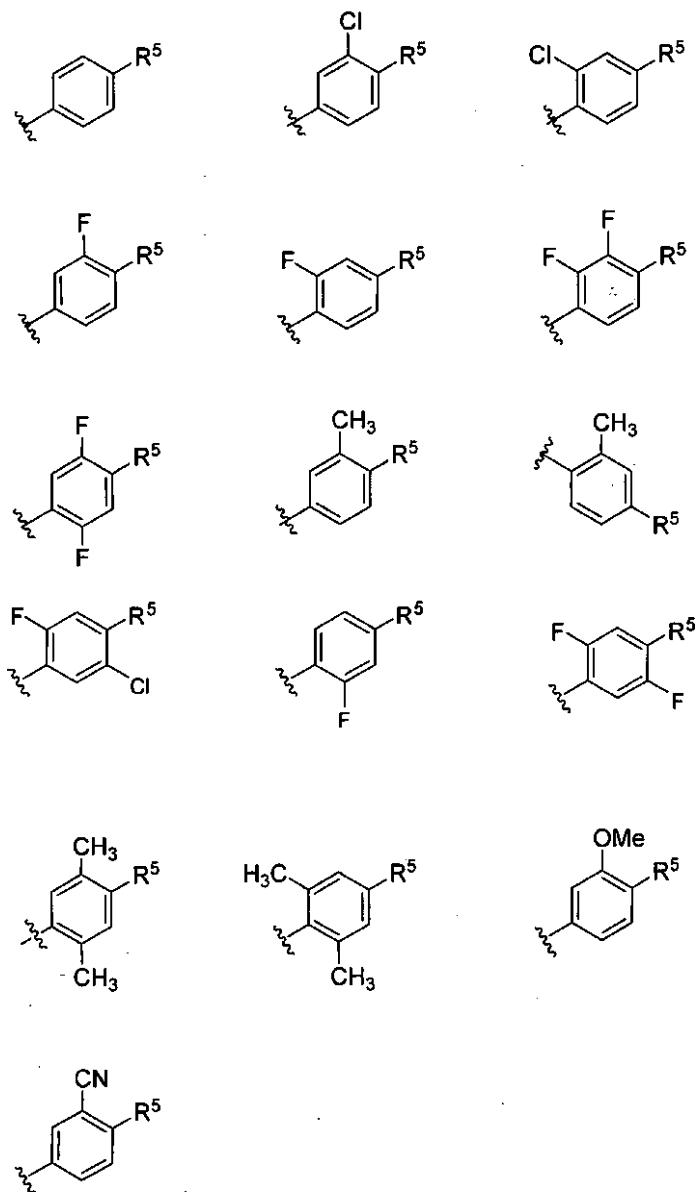


(式中、波線は、Xへの結合を示し、各R⁴は、他のものとは独立している)で表される請求項14記載の化合物。

【請求項16】

R^3 は、構造式：

【化13】

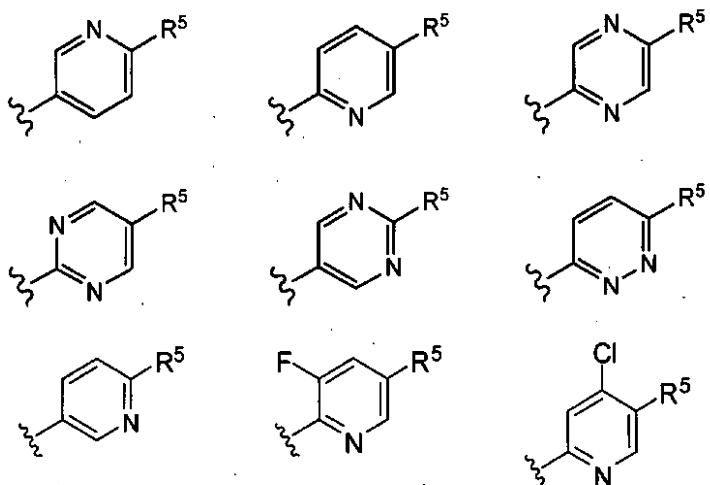


から選択される請求項15記載の化合物。

【請求項17】

R^3 は、構造式：

【化14】

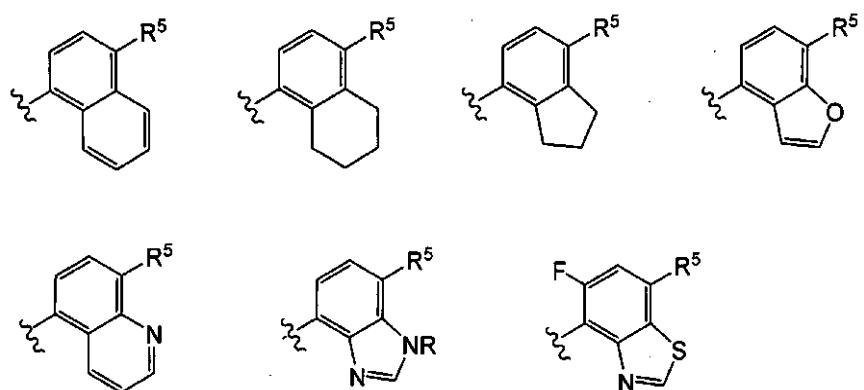


(式中、波線は、Xへの結合点を示す)から選択される請求項14記載の化合物。

【請求項18】

R³は、構造式：

【化15】

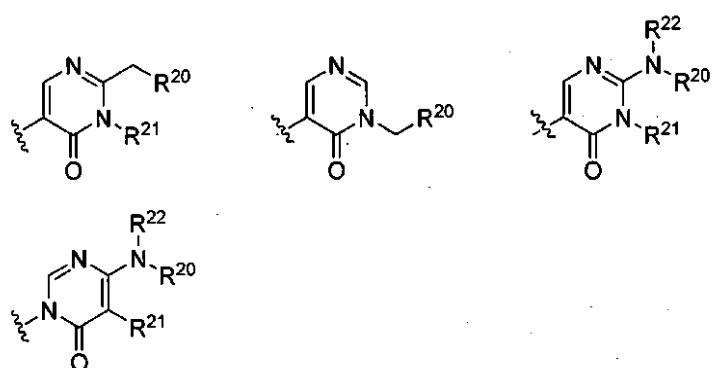


から選択される請求項1～13のいずれか1項に記載の化合物。

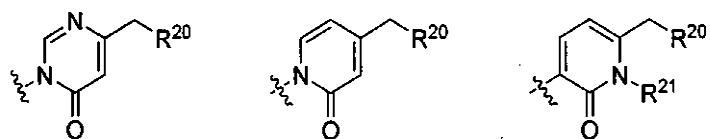
【請求項19】

Z⁴、Z⁵、Z⁶およびZ⁷がそれぞれCR⁴であり、かつR¹がH、アルキルまたは-C(=O)NR¹₀R¹₁である場合、R⁵は、F、Cl、-NR¹₀R¹₁、-NR¹₀C(=O)R¹₃、C₁-C₁₂アルキル、または構造式：

【化16】



【化17】

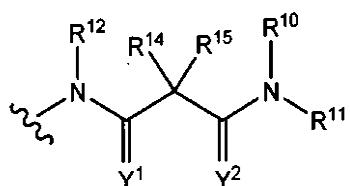


(式中、R²⁰は、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、R²¹およびR²²は、独立して、Hまたはアルキルから選択される)から選択されるヘテロアリール以外のC₁-C₂₀ヘテロアリールではなく、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールは、場合によって、F、Cl、Br、Iおよびアルキルから独立して選択される1個以上の基で置換される請求項14記載の化合物。

【請求項20】

R⁵は、構造式：

【化18】



から選択される請求項16記載の化合物。

【請求項21】

R¹¹は、アリール基であって、場合によって、ハロゲンで置換される請求項20記載の化合物。

【請求項22】

R¹⁴およびR¹⁵は、これらが結合する原子と一緒にになって、場合によって置換された炭素環を形成する請求項21記載の化合物。

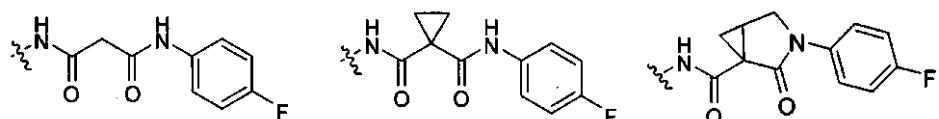
【請求項23】

R¹⁵およびR¹⁰は、これらが結合する原子と一緒にになって、オキソ置換5、6または7員单環式または二環式複素環を形成する請求項21記載の化合物。

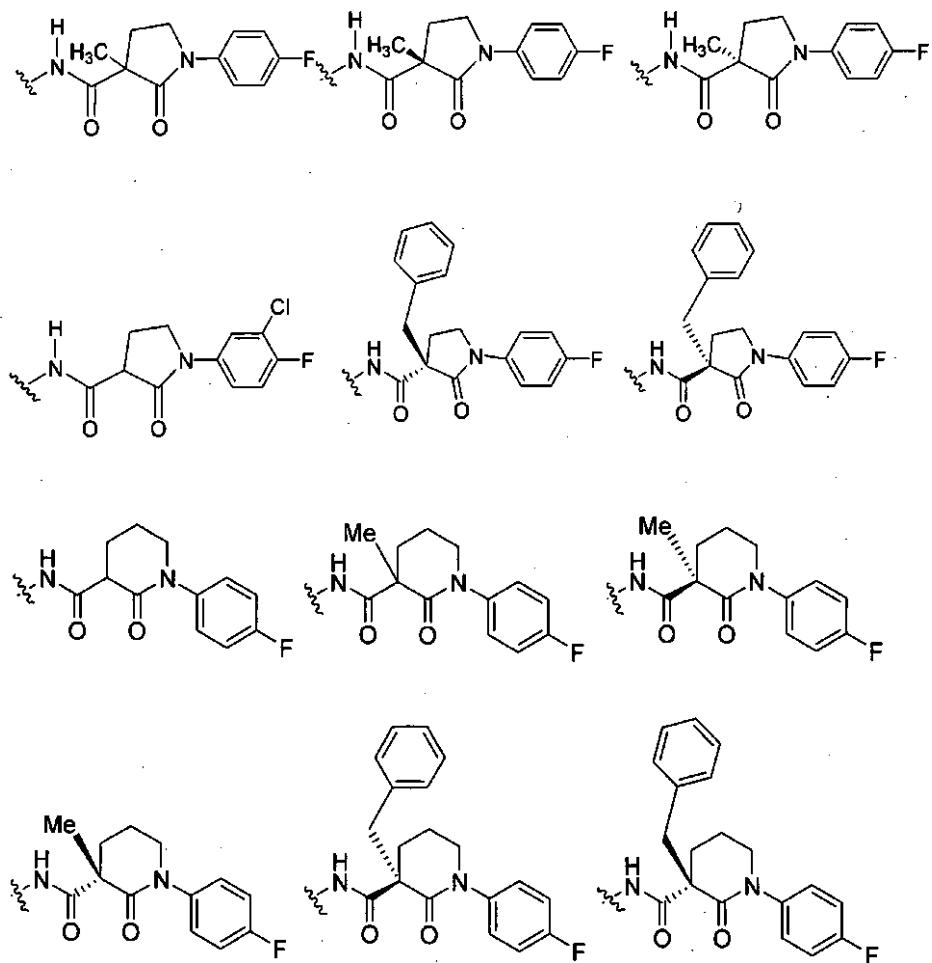
【請求項24】

R⁵は、構造式：

【化19】



【化 2 0】



から選択される請求項 2 0 記載の化合物。

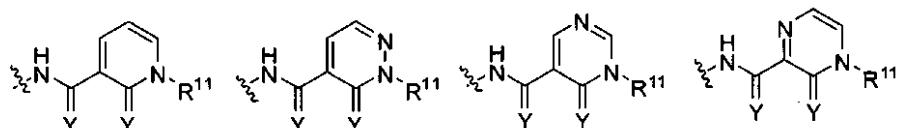
【請求項 2 5】

R^{1-4} は存在せず、かつ R^{1-0} および R^{1-5} は、これらが結合する原子と一緒にになって、環窒素原子および場合によって N、O および S から選択される 1 個以上の追加のヘテロ原子を有する、場合によって置換されたヘテロアリール環を形成する請求項 2 1 記載の化合物。

【請求項 2 6】

R^5 は、構造式：

【化 2 1】

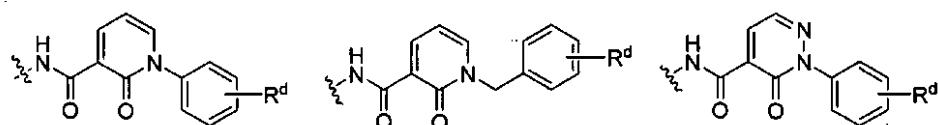


から選択される請求項 1 5 記載の化合物。

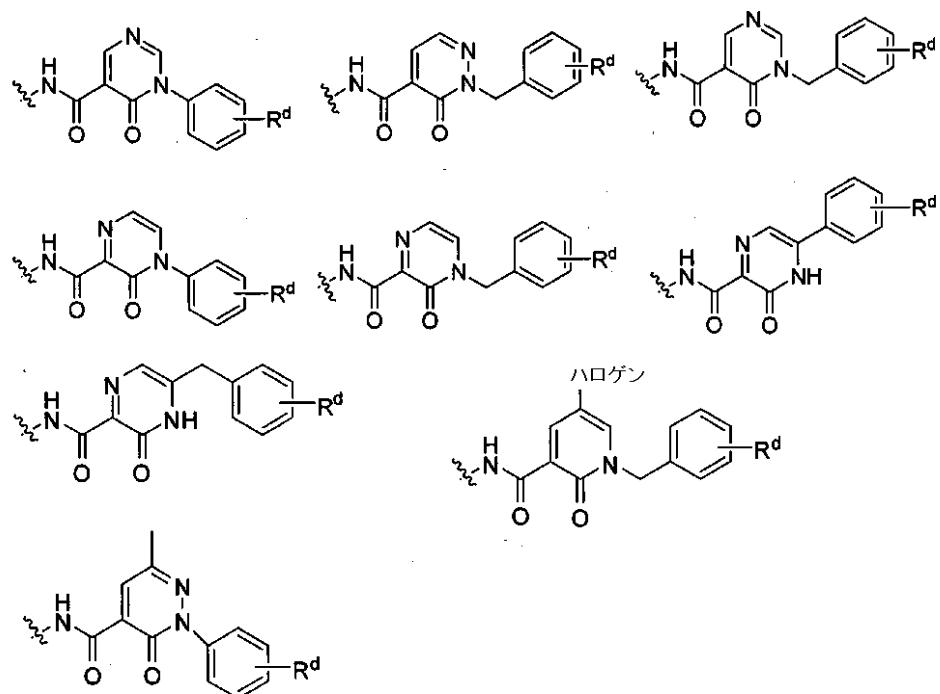
【請求項 2 7】

R^5 は、構造式：

【化 2 2】



【化23】

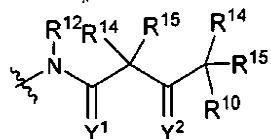


から選択され、ここで、フェニル基は、場合によって、F、C₁、Br、I、SO₂R^c、CN、OR^a、NR^aR^b、C(=O)NR^aR^b、CR^aC(=O)R^b、C₁-C₁₂アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル、C₆-C₂₀アリールおよびC₁-C₂₀ヘテロアリールから独立して選択される1個以上のR^d基で置換されている請求項26記載の化合物。

【請求項28】

R⁵は、構造式：

【化24】



で表される請求項16記載の化合物。

【請求項29】

R¹⁰は、場合によって置換されたアリールまたはC₆-アリールである請求項28記載の化合物。

【請求項30】

R¹⁴およびR¹⁵は、場合によって置換された炭素環を形成する請求項29記載の化合物。

【請求項31】

R⁵は、構造式：

【化25】

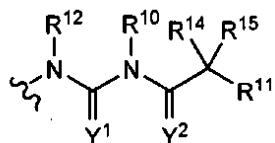


から選択される請求項28記載の化合物。

【請求項32】

R⁵は、構造式：

【化26】



で表される請求項16記載の化合物。

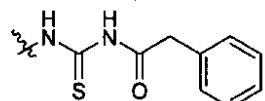
【請求項33】

R¹は、場合によって置換されたアリールである請求項32記載の化合物。

【請求項34】

R⁵は、構造式：

【化27】

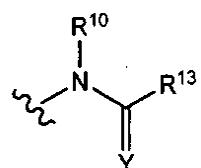


から選択される請求項32記載の化合物。

【請求項35】

R⁵は、構造式：

【化28】



で表される請求項16記載の化合物。

【請求項36】

R¹は、アルキル、(CR¹₄R¹₅)_n-O-(CR¹₄R¹₅)_m-アリール、(CR¹₄R¹₅)_n-アリール、(CR¹₄R¹₅)_n-ヘテロアリール、(CR¹₄R¹₅)_n-ヘテロ環、(CR¹₄R¹₅)-NR¹₀(SO₂Me)R¹₁、または(CR¹₄R¹₅)_n-NR¹₀C(=O)R¹₁であり、ここで、前記アルキル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環部分は、場合によって、置換されている請求項35記載の化合物。

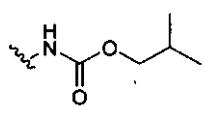
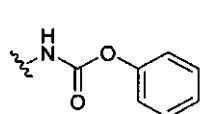
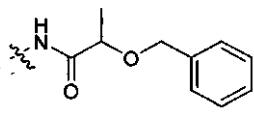
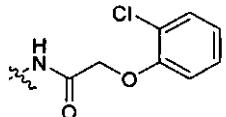
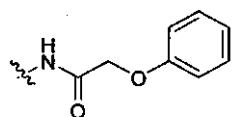
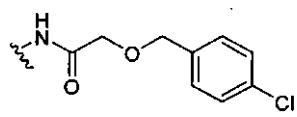
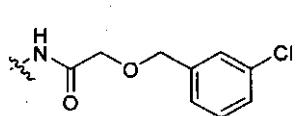
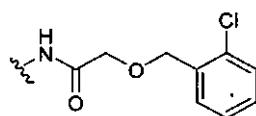
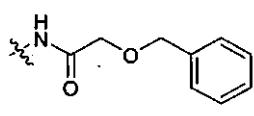
【請求項37】

R¹は、アルキル、(CR¹₄R¹₅)_n-O-(CR¹₄R¹₅)_m-アリール、(CR¹₄R¹₅)-アリール、(CR¹₄R¹₅)-ヘテロアリール、(CR¹₄R¹₅)-ヘテロ環、(CR¹₄R¹₅)-N(SO₂R^a)(CR¹₄R¹₅)R¹₁または(CR¹₄R¹₅)NR¹₀C(=O)-アリールであり、ここで、前記アルキル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環部分は、場合によって、置換されている請求項35記載の化合物。

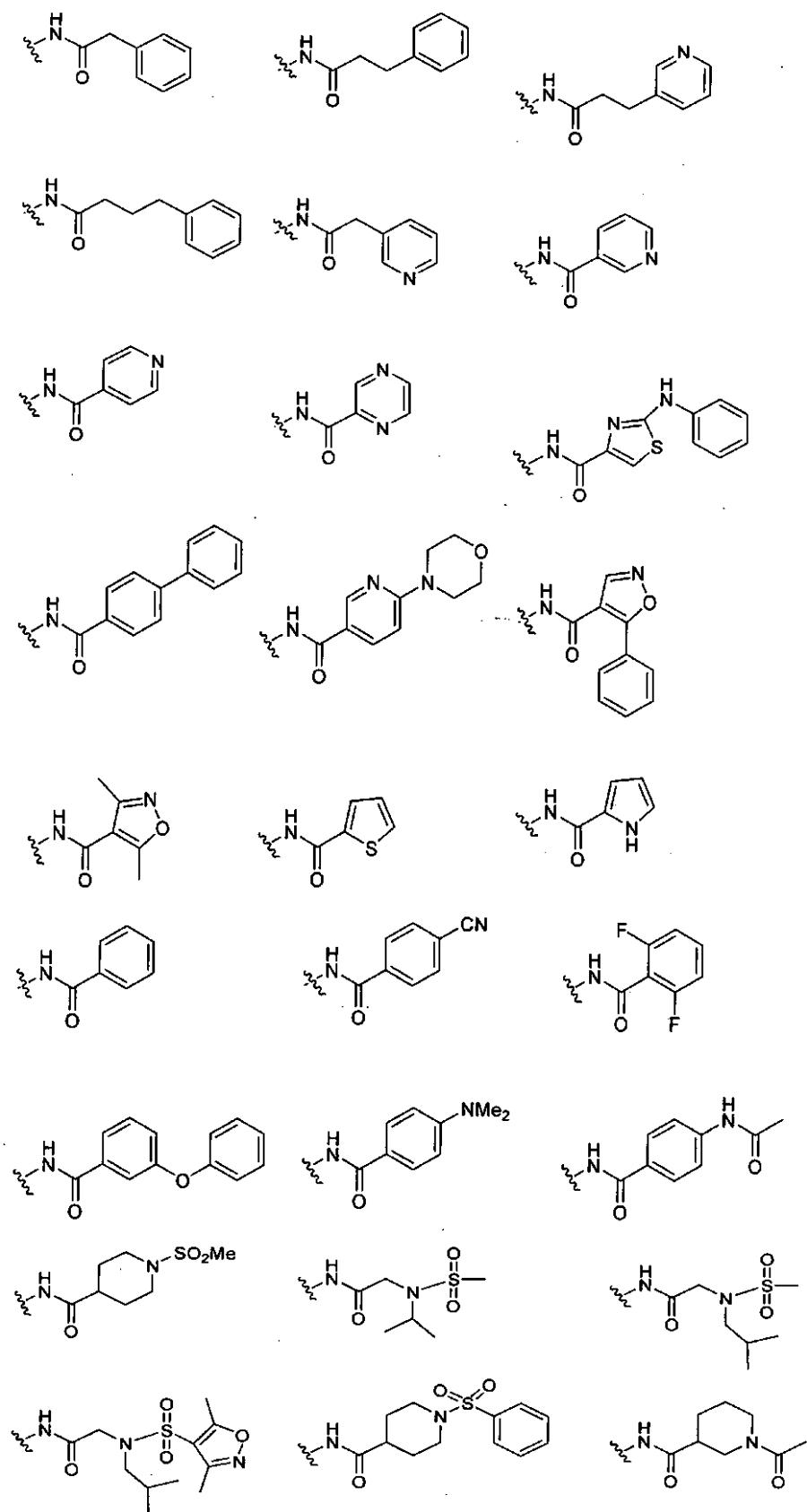
【請求項38】

R⁵は、構造式：

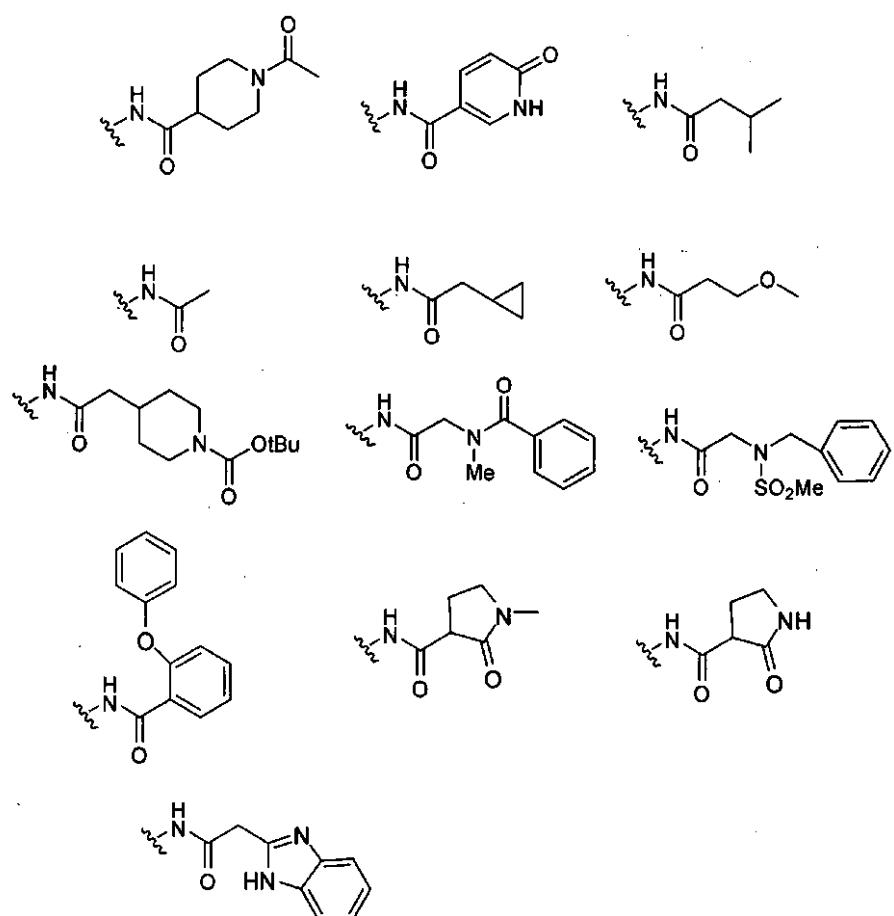
【化 2 9】



【化 3 0】



【化31】

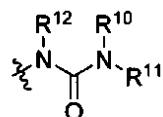


から選択される請求項35記載の化合物。

【請求項39】

 R^5 は、構造式：

【化32】



で表される請求項16記載の化合物。

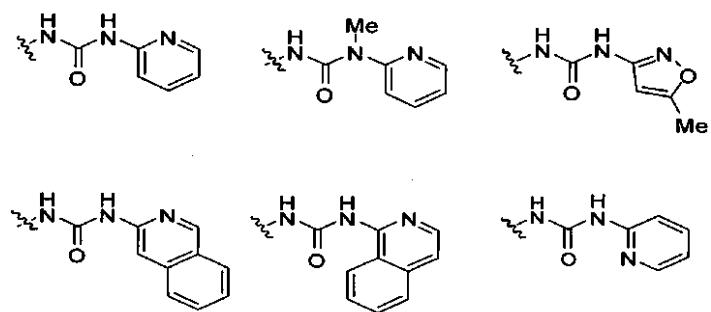
【請求項40】

 R^{11} は、場合によって、置換されたアリールまたはヘテロアリールである請求項39記載の化合物。

【請求項41】

 R^5 は、構造式：

【化33】



から選択される請求項 3 9 記載の化合物。

【請求項 4 2】

R^5 は、 $N R^{1-2} SO_2 R^{1-0}$ である請求項 1 6 記載の化合物。

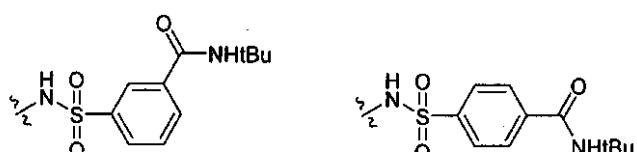
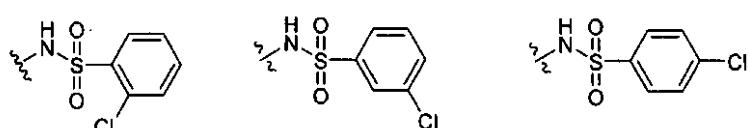
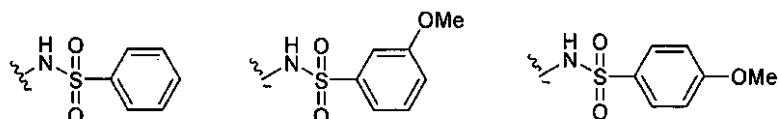
【請求項 4 3】

R^{1-0} は、場合によって、置換されたアリールである請求項 4 2 記載の化合物。

【請求項 4 4】

R^5 は、構造式：

【化 3 4】



から選択される請求項 4 2 記載の化合物。

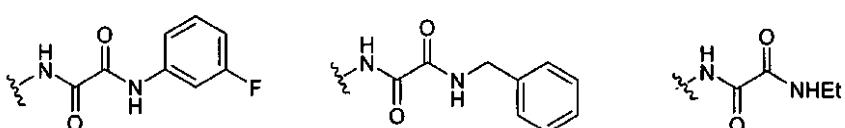
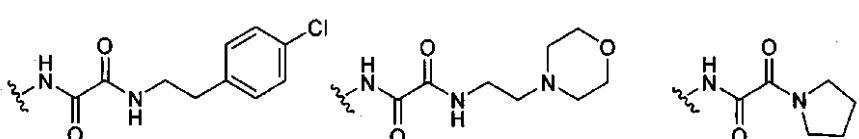
【請求項 4 5】

R^5 は、 $N R^{1-2} C(=O)C(=O)N R^{1-0} R^{1-1}$ である請求項 1 6 記載の化合物。

【請求項 4 6】

R^5 は、構造式：

【化 3 5】



から選択される請求項 4 5 記載の化合物。

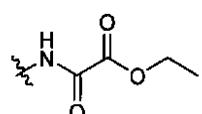
【請求項 4 7】

R^5 は、 $N R^{1-2} C(=O)C(=O)OR^a$ である請求項 1 6 記載の化合物。

【請求項 4 8】

R^5 は、構造式：

【化 3 6】



から選択される請求項 4 7 記載の化合物。

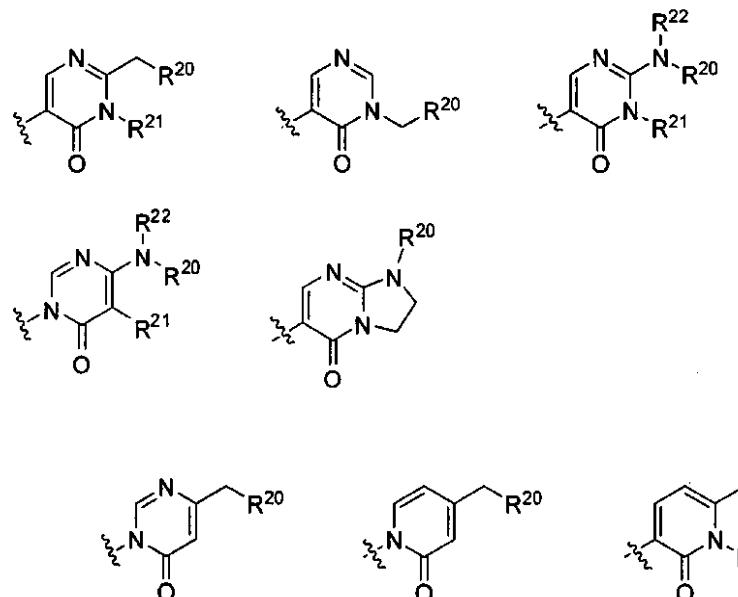
【請求項 4 9】

R⁵ は、場合によって、置換されたヘテロアリールである請求項 1 6 記載の化合物。

【請求項 5 0】

R⁵ は、構造式：

【化 3 7】

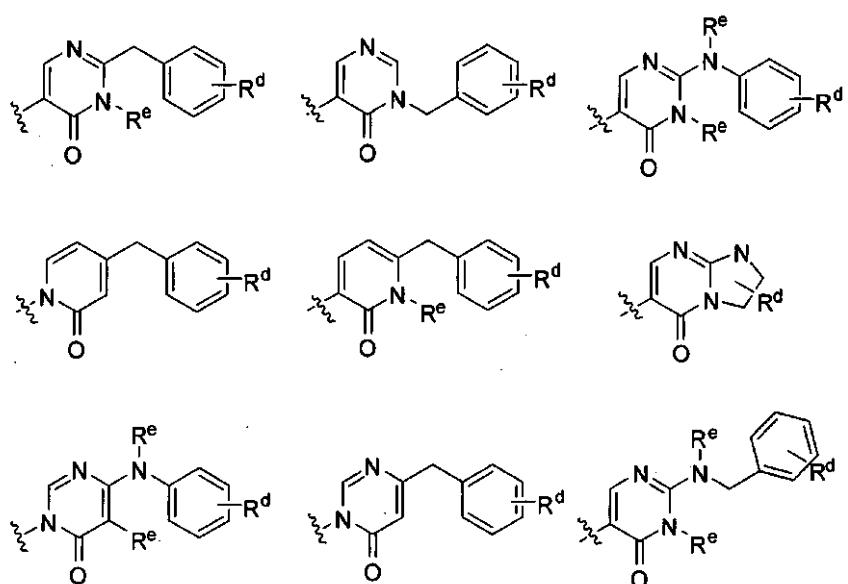


(式中、R²⁰ は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールであり、R²¹ および R²² は、独立して、H およびアルキルから選択され、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールは、場合によって、F、Cl、Br、I およびアルキルから独立して選択される 1 個以上の基で置換される) から選択される請求項 4 9 記載の化合物。

【請求項 5 1】

R⁵ は、構造式：

【化 3 8】



から選択される請求項 5 0 記載の化合物。

【請求項 5 2】

R⁵ は、-NR¹⁰R¹¹ である請求項 1 6 記載の化合物。

【請求項 5 3】

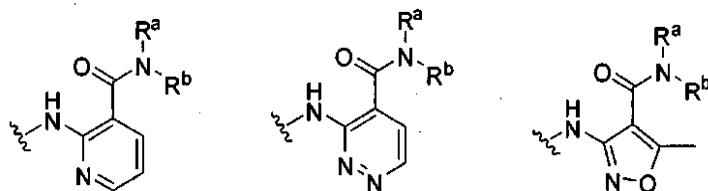
R¹¹ は、hetAr であり、該 hetAr は、少なくとも 1 個の環窒素原子および場合

によってNおよびOから選択される第二の環ヘテロ原子を有する、置換されたまたは置換されていない5-6員ヘテロアリール基である請求項52記載の化合物。

【請求項54】

R⁵は、構造式：

【化39】

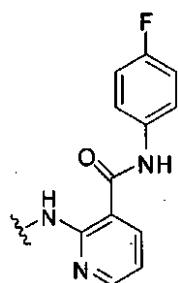


から選択される請求項52記載の化合物。

【請求項55】

R⁵は、構造式：

【化40】

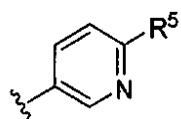


である請求項54記載の化合物。

【請求項56】

R³は、

【化41】



である請求項17記載の化合物。

【請求項57】

R⁵は、C1である請求項56記載の化合物。

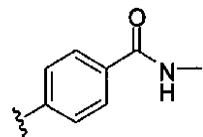
【請求項58】

R⁵は、場合によって置換されたアリールである請求項56記載の化合物。

【請求項59】

R⁵は、構造式：

【化42】

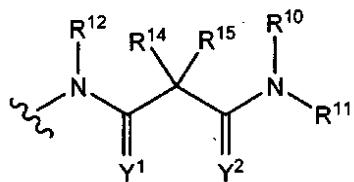


から選択される請求項56記載の化合物。

【請求項60】

R⁵は、構造式：

【化43】

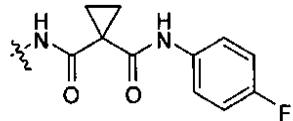


から選択される請求項56記載の化合物。

【請求項61】

R⁵は、構造式：

【化44】



から選択される請求項60記載の化合物。

【請求項62】

請求項1で定義され、実施例1～179で命名されている、式1の化合物。

【請求項63】

請求項1～62のいずれかに記載の化合物と、医薬的に許容し得る担体とを含む医薬組成物。

【請求項64】

さらに、抗増殖剤、抗炎症剤、免疫調整剤、向神経性因子、循環器疾患治療剤、肝疾患治療剤、抗ウィルス剤、血液障害治療剤、糖尿病治療剤または免疫不全障害治療剤から選択される追加の治療剤を含む請求項63記載の組成物。

【請求項65】

Metキナーゼ活性を検出可能に阻害する量の請求項1～62のいずれかに記載の化合物と、医薬的に許容し得る担体、アジュバントまたは媒介物を含む組成物。

【請求項66】

患者の癌、卒中、糖尿病、肝臓肥大、循環器疾患、アルツハイマー病、囊胞性線維症、ウイルス性疾患、自己免疫疾患、アテローム性硬化症、再発狭窄症、乾せん症、アレルギー性障害、炎症、神経障害、ホルモン関連疾患、臓器移植に伴う状態、免疫不全障害、破壊性骨障害、増殖性障害、感染性疾患、細胞死に伴う状態、トロンビンに誘導された血小板凝集、慢性骨髄性白血病(CML)、肝疾患、T細胞の活性化に関与する病的な免疫状態およびCNS障害からなる群から選択される疾患または状態を治療または重篤度を軽減するための組成物であって、請求項63記載の組成物を含む組成物。

【請求項67】

前記疾患が癌である請求項66記載の組成物。

【請求項68】

哺乳類の過剰増殖性疾患を治療するための医薬品の製造における請求項1～62のいずれかに記載の化合物の用途。

【請求項69】

治療に使用するための請求項1～62のいずれかに記載の化合物。

【請求項70】

レセプターチロシンキナーゼ活性を阻害または調整するための組成物であって、阻害に有効な量の請求項1～62のいずれかに記載の化合物を含み、前記組成物は、前記キナーゼと接触させられることを特徴とする、組成物。

【請求項71】

前記レセプターチロシンキナーゼがc-Metである請求項70記載の組成物。

【請求項72】

c M e t が媒介する状態を治療するキットであって、a) 請求項 1 ~ 6 2 のいずれかに記載の化合物を含む第一医薬組成物と、b) 使用に関する指示書とを含むキット。

【請求項 7 3】

さらに、(c) 第二医薬組成物を含むキットであって、該第二医薬組成物は、抗増殖性活性を有する第二化合物を含む請求項 7 2 記載のキット。

【請求項 7 4】

さらに、必要とする患者のために、第一および第二医薬組成物の同時、連続的または別個に投与するための指示書を含む請求項 7 3 記載のキット。

【請求項 7 5】

前記第一および第二医薬組成物が、別の容器に含まれている請求項 7 3 記載のキット。

【請求項 7 6】

前記第一および第二医薬組成物が、同じ容器に含まれている請求項 7 3 記載のキット。