

【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

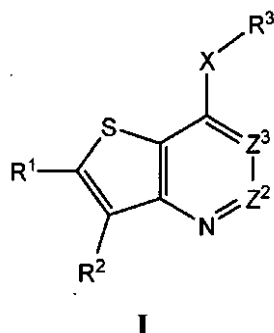
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

## 【化 1】



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<sup>10</sup>であり；

Z<sup>2</sup>およびZ<sup>3</sup>は、独立して、CR<sup>4</sup>およびNから選択され、ここで、Z<sup>2</sup>およびZ<sup>3</sup>の1個のみがNであり；

R<sup>1</sup>は、H、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル、-C(=O)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-(CR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>)<sub>t</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-NR<sup>10</sup>C(=Y)R<sup>11</sup>、-NR<sup>10</sup>C(=Y)OR<sup>11</sup>、-NR<sup>12</sup>C(=Y)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>またはNR<sup>12</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、または

R<sup>1</sup>は、単環式または二環式C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>炭素環、C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>ヘテロ環、C<sub>6</sub>-C<sub>20</sub>アリールまたはC<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>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、CF<sub>3</sub>、オキソ、OR<sup>10</sup>、SR<sup>10</sup>、-C(=Y)R<sup>10</sup>、-C(=Y)OR<sup>10</sup>、-C(=Y)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-(CR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>)<sub>n</sub>-NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-NR<sup>10</sup>C(=Y)R<sup>13</sup>、-NR<sup>10</sup>C(=Y)OR<sup>11</sup>、-NR<sup>12</sup>C(=Y)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-NR<sup>12</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>10</sup>、-OC(=Y)R<sup>10</sup>、-OC(=Y)OR<sup>10</sup>、-OC(=Y)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sup>10</sup>)、-OP(=Y)(OR<sup>10</sup>)(OR<sup>11</sup>)、-OP(OR<sup>10</sup>)(OR<sup>11</sup>)、-S(O)R<sup>10</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>10</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-S(O)(OR<sup>10</sup>)、-S(O)<sub>2</sub>(OR<sup>10</sup>)、-SC(=Y)R<sup>10</sup>、-SC(=Y)OR<sup>10</sup>、-SC(=Y)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>シクロアルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>ヘテロ環、C<sub>6</sub>-C<sub>20</sub>アリールおよびC<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>ヘテロアリール、-(CR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>)<sub>n</sub>-NR<sup>12</sup>C(=O)(CR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>)<sub>m</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、および-C(=O)(CR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>)<sub>n</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>から独立して選択される1個以上の基で置換され；

R<sup>2</sup>およびR<sup>4</sup>は、独立して、H、F、Cl、Br、I、CF<sub>3</sub>、CN、-C(=Y)R<sup>10</sup>、-C(=Y)OR<sup>10</sup>、-C(=Y)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-NR<sup>10</sup>C(=Y)R<sup>11</sup>、-NR<sup>10</sup>C(=Y)OR<sup>11</sup>、-NR<sup>12</sup>C(=Y)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-NR<sup>12</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-OR<sup>10</sup>、-OC(=Y)R<sup>10</sup>、-OC(=Y)OR<sup>10</sup>、-OC(=Y)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-C(=O)NR<sup>12</sup>(CR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>)<sub>t</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-OP(=Y)(OR<sup>10</sup>)(OR<sup>11</sup>)、-OP(OR<sup>10</sup>)(OR<sup>11</sup>)、-SR<sup>10</sup>、-S(O)R<sup>10</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>10</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-SC(=Y)R<sup>10</sup>、-SC(=Y)OR<sup>10</sup>、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>炭素環、C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>ヘテロ環、C<sub>6</sub>-C<sub>20</sub>アリールまたはC<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>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<sup>10</sup>およびNR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>から独立して選択される1個以上の基で置換され；

R<sup>3</sup>は、単環式または二環式C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>炭素環、C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>ヘテロ環、C<sub>6</sub>-C<sub>20</sub>

アリーール、または  $C_1 - C_{20}$  ヘテロアリーールであり、ここで、前記炭素環、ヘテロ環、アリーールおよびヘテロアリーールは、場合によって、F、Cl、Br、I、CN、 $CF_3$ 、 $OR^{10}$ 、 $SR^{10}$ 、 $-C(=Y)R^{10}$ 、 $-C(=Y)OR^{10}$ 、 $-C(=Y)NR^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{10}C(=Y)R^{13}$ 、 $-NR^{10}C(=Y)OR^{11}$ 、 $-NR^{12}C(=Y)NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{12}C(=O)C(=O)R^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{12}C(=O)C(=O)NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{12}C(=O)C(=O)OR^a$ 、 $-NR^{12}SO_2R^{10}$ 、 $-NR^{12}C(=Y^1)(CR^{14}R^{15})_n C(=Y^2)NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{12}C(=Y^1)NR^{10}C(=Y^2)(CR^{14}R^{15})_n R^{11}$ 、 $-NR^{12}C(=Y^1)(CR^{14}R^{15})_n C(=Y^2)(CR^{14}R^{15})_m R^{10}$ 、 $-OC(=Y)R^{10}$ 、 $-OC(=Y)OR^{10}$ 、 $-OC(=Y)NR^{10}R^{11}$ 、 $-OS(O)_2(OR^{10})$ 、 $-OP(=Y)(OR^{10})(OR^{11})$ 、 $-OP(OR^{10})(OR^{11})$ 、 $-S(O)R^{10}$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 、 $-S(O)(OR^{10})$ 、 $-S(O)_2(OR^{10})$ 、 $-SC(=Y)R^{10}$ 、 $-SC(=Y)OR^{10}$ 、 $-SC(=Y)NR^{10}R^{11}$ 、 $C_1 - C_{12}$  アルキル、 $C_2 - C_8$  アルケニル、 $C_2 - C_8$  アルキニル、 $C_3 - C_{12}$  シクロアルキル、 $C_2 - C_{20}$  ヘテロ環、 $C_6 - C_{20}$  アリーールおよび  $C_1 - C_{20}$  ヘテロアリー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、アリーールおよびヘテロアリーールは、場合によって、F、Cl、Br、I、OH、 $C_1 - C_{12}$  アルキル、オキソ、 $NR^{10}R^{11}$ 、 $-C(=Y)NR^{10}R^{11}$  および  $(CR^{14}R^{15})_n$  - アリーールから独立して選択される1個以上の基で置換され；

$R^{10}$ 、 $R^{11}$  および  $R^{12}$  は、独立して、H、 $OR^a$ 、 $C_1 - C_{12}$  アルキル、 $C_2 - C_8$  アルケニルまたは  $C_2 - C_8$  アルキニル、または単環式または二環式  $C_3 - C_{12}$  炭素環、 $C_2 - C_{20}$  ヘテロ環、 $C_6 - C_{20}$  アリーール、または  $C_1 - C_{20}$  ヘテロアリーールであり、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、アリーールおよびヘテロアリーールは、場合によって、F、Cl、Br、I、 $SO_2R^c$ 、CN、 $OR^a$ 、 $NR^aR^b$ 、 $C(=O)NR^aR^b$ 、 $CR^aC(=O)R^b$ 、 $C_1 - C_{12}$  アルキル、 $C_2 - C_8$  アルケニル、 $C_2 - C_8$  アルキニル、 $C_3 - C_{20}$  炭素環、 $C_6 - C_{20}$  アリーールおよび  $C_1 - C_{20}$  ヘテロアリー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

$R^{10}$  および  $R^{11}$  は、これらが結合する窒素と一緒にあって、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  $C_3 - C_{20}$  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、 $OR^a$ 、 $NR^aR^b$ 、 $CF_3$ 、F、Cl、Br、I、 $SO_2R^a$ 、 $C(=O)R^a$ 、 $NR^{10}C(=Y)R^{11}$ 、 $C(=Y)NR^{10}R^{11}$ 、 $C_1 - C_{12}$  アルキル、 $C_2 - C_8$  アルケニル、 $C_2 - C_8$  アルキニル、 $C_3 - C_{12}$  シクロアルキル、 $C_2 - C_{20}$  ヘテロ環、 $C_6 - C_{20}$  アリーールおよび  $C_1 - C_{20}$  ヘテロアリーールから独立して選択される1個以上の基で置換され；

$R^{13}$  は、H、 $C_1 - C_{12}$  アルキル、 $C_2 - C_8$  アルケニル、 $C_2 - C_8$  アルキニル、 $(CR^{14}R^{15})_n$  シクロアルキル、 $(CR^{14}R^{15})_n$  - ヘテロ環、 $(CR^{14}R^{15})_n$  - アリーール、 $(CR^{14}R^{15})_n$  - ヘテロアリーール、 $(CR^{14}R^{15})_n$  - O -  $(CR^{14}R^{15})_m$  - アリーール、 $(CR^{14}R^{15})_n$  -  $OR^{10}$ 、 $(CR^{14}R^{15})_n$  -  $NR^{10}R^{11}$ 、 $(CR^{14}R^{15})_n$  -  $NR^{10}C(=O)R^{11}$ 、または  $(CR^{14}R^{15})_n$  -  $NR^{10}(SO_2Me)$  -  $R^{11}$  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ール部分は、場合によって、F、Cl、Br、I、オキソ、 $SO_2R^c$ 、CN、 $OR^a$ 、 $C(=O)R^a$ 、 $C(=O)OR^a$ 、 $NR^aR^b$ 、 $NR^aC(=O)R^b$ 、 $C_1 - C_{12}$  アルキル、 $C_2 - C_8$  アルケニル、 $C_2 - C_8$  アルキニル、 $C_3 - C_{12}$  シクロアルキル、 $C_2 - C_{20}$  ヘテロ環、 $C_6 - C_{20}$  アリーールおよび  $C_1 - C_{20}$  ヘテロアリーールから独立して選択される1個以上の基で置換され；

$R^{14}$  および  $R^{15}$  は、独立して、H、 $C_1 - C_{12}$  アルキルまたは  $(CR^{14}R^{15})_t$  - アリールであり、または

$R^{14}$  および  $R^{15}$  は、これらが結合する原子と一緒にあって、飽和または部分的に不飽和の  $C_3 - C_{12}$  炭素環を形成し；または

$R^{10}$  および  $R^{15}$  は、これらが結合する原子と一緒にあって、飽和または部分的に不飽和の  $C_1 - C_{20}$  ヘテロシクロ環であって、場合によって、F、Cl、Br、I、 $OR^a$ 、 $C_1 - C_{12}$  アルキル、 $C_2 - C_8$  アルケニル、 $C_2 - C_8$  アルキニル、 $C_3 - C_{12}$  シクロアルキル、 $C_2 - C_{20}$  ヘテロ環、 $C_6 - C_{20}$  アリールおよび  $C_1 - C_{20}$  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

$R^{14}$  は存在せず、かつ  $R^{10}$  および  $R^{15}$  は、これらが結合する原子と一緒にあって、1 個以上のヘテロ原子を有する  $C_1 - C_{20}$  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、 $C_1 - C_{12}$  アルキル、 $C_2 - C_8$  アルケニル、 $C_2 - C_8$  アルキニル、 $C_3 - C_{12}$  炭素環、 $C_2 - C_{20}$  ヘテロ環、 $C_6 - C_{20}$  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、 $C_1 - C_{12}$  アルキルまたは  $C_6 - C_{20}$  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  $C(=O)NR^aR^b$  から独立して選択される 1 個以上の基で置換され；

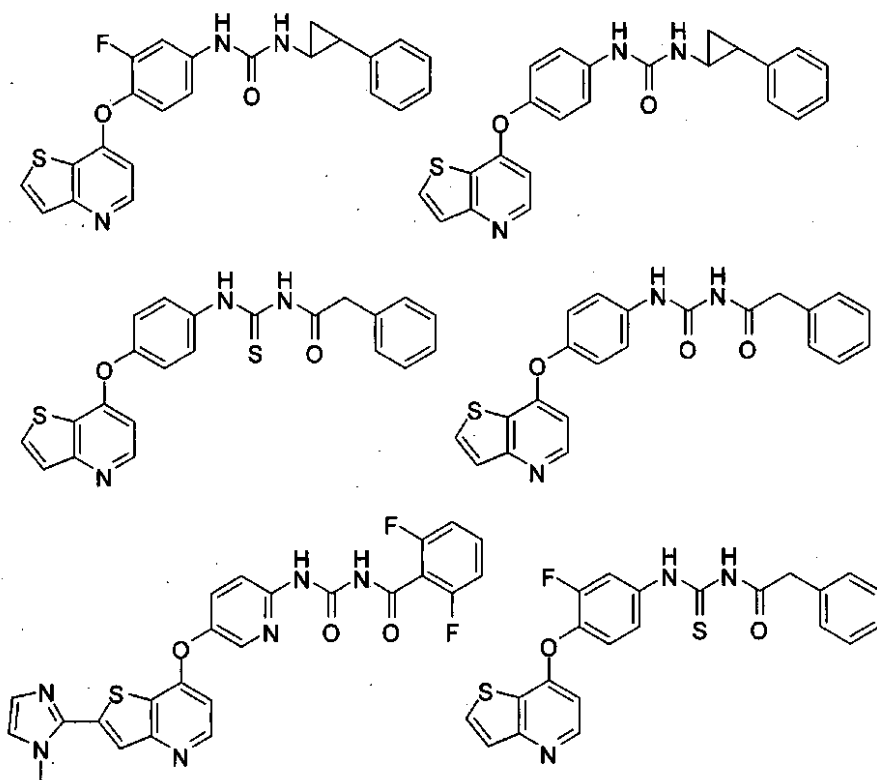
Y、 $Y^1$  および  $Y^2$  は、独立して、O または S であり；

t は、1、2、3、4、5 または 6 であり；そして

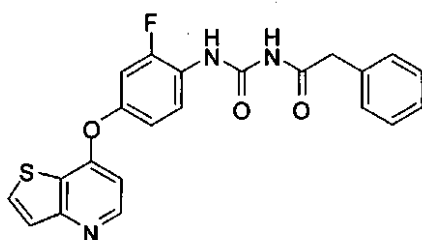
n および m は、独立して、0、1、2、3、4、5 または 6 であり；

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】

$R^3$  は、単環式または二環式  $C_3 - C_{12}$  炭素環、 $C_2 - C_{20}$  ヘテロ環、 $C_6 - C_{20}$  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、Cl、Br、I、CN、 $CF_3$ 、 $OR^{10}$ 、 $SR^{10}$ 、 $-C(=Y)R^{10}$ 、 $-C(=Y)OR^{10}$ 、 $-C(=Y)NR^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{10}C(=Y)R^{13}$ 、 $-NR^{10}C(=Y)OR^{11}$ 、 $-NR^{12}C(=Y)NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{12}C(=O)C(=O)R^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{12}C(=O)C(=O)OR^a$ 、 $-NR^{12}SO_2R^{10}$ 、 $-NR^{12}C(=Y^1)(CR^{14}R^{15})_nC(=Y^2)NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{12}C(=Y^1)(CR^{14}R^{15})_nC(=Y^2)(CR^{14}R^{15})_mR^{10}$ 、 $-OC(=Y)R^{10}$ 、 $-OC(=Y)OR^{10}$ 、 $-OC(=Y)NR^{10}R^{11}$ 、 $-OS(O)_2(OR^{10})$ 、 $-OP(=Y)(OR^{10})(OR^{11})$ 、 $-OP(OR^{10})(OR^{11})$ 、 $-S(O)R^{10}$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 、 $-S(O)(OR^{10})$ 、 $-S(O)_2(OR^{10})$ 、 $-SC(=Y)R^{10}$ 、 $-SC(=Y)OR^{10}$ 、 $-SC(=Y)NR^{10}R^{11}$ 、 $C_1 - C_{12}$  アルキル、 $C_2 - C_8$  アルケニル、 $C_2 - C_8$  アルキニル、 $C_3 - C_{12}$  シクロアルキル、 $C_2 - C_{20}$  ヘテロ環、 $C_6 - C_{20}$  アリールおよび  $C_1 - C_{20}$  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、アリーールおよびヘテロアリーールは、場合によって、F、Cl、Br、I、OH、 $C_1 - C_{12}$  アルキル、 $NR^{10}R^{11}$  および  $(CR^{14}R^{15})_n$  - アリーールから独立して選択される 1 個以上の基で置換され；

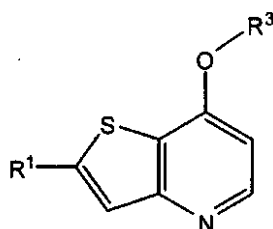
$R^{10}$ 、 $R^{11}$  および  $R^{12}$  は、独立して、H、 $C_1 - C_{12}$  アルキル、 $C_2 - C_8$  アルケニルまたは  $C_2 - C_8$  アルキニル、単環式または二環式  $C_3 - C_{12}$  炭素環、 $C_2 - C_{20}$  ヘテロ環、 $C_6 - C_{20}$  アリーール、あるいは  $C_1 - C_{20}$  ヘテロアリーールであり、ここで、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、炭素環、ヘテロ環、アリーールおよびヘテロアリーールは、場合によって、F、Cl、Br、I、 $SO_2R^c$ 、CN、 $OR^a$ 、 $NR^aR^b$ 、 $C(=O)NR^aR^b$ 、 $CR^aC(=O)R^b$ 、 $C_1 - C_{12}$  アルキル、 $C_2 - C_8$  アルケニル、 $C_2 - C_8$  アルキニル、 $C_6 - C_{20}$  アリーール、および  $C_1 - C_{20}$  ヘテロアリー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、 $C_1 - C_{12}$  アルキル、 $C_2 - C_8$  アルケニル、 $C_2 - C_8$  アルキニル、 $C_3 - C_{12}$  炭素環、 $C_2 - C_{20}$  ヘテロ環、 $C_6 - C_{20}$  アリーール、または  $C_1 - C_{20}$  ヘテロアリーールであり、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、アリーールおよびヘテロアリーールは、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 I b：

【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、

$R^1$  は、H、 $C_1 - C_{12}$  アルキル、 $C_2 - C_8$  アルキニル、 $-C(=O)NR^{10}R^{11}$ 、または

$R^1$  は、単環式または二環式  $C_3 - C_{12}$  炭素環、 $C_2 - C_{20}$  ヘテロ環、 $C_6 - C_{20}$  アリーール、または  $C_1 - C_{20}$  ヘテロアリーールであり、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、アリーールおよびヘテロアリーールは、場合によって、オキソ、 $-C(=Y)R^{10}$ 、 $-C(=Y)OR^{10}$ 、 $-C(=Y)NR^{10}R^{11}$ 、 $-(CR^{14}R^{15})_n - NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{10}C(=Y)R^{13}$ 、 $C_1 - C_{12}$  アルキル、 $C_2 - C_{20}$  ヘテロ環、および  $C_1 - C_{20}$  ヘテロアリー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

$R^3$  は、 $C_6 - C_{20}$  アリーールまたは  $C_1 - C_{20}$  ヘテロアリーールであり、ここで、前記アリーールおよびヘテロアリーールは、場合によって、F、Cl、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{10}C(=Y)R^{13}$ 、 $-NR^{10}C(=Y)OR^{11}$ 、 $-NR^{12}C(=Y)NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{12}C(=O)C(=O)NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{12}C(=O)C(=O)OR^a$ 、 $-NR^{12}SO_2R^{10}$ 、 $-NR^{12}C(=Y^1)(CR^{14}R^{15})_nC(=Y^2)NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{12}C(=Y^1)NR^{10}C(=Y^2)(CR^{14}R^{15})_nR^{11}$ 、 $-NR^{12}C(=Y^1)(CR^{14}R^{15})_nC(=Y^2)(CR^{14}R^{15})_mR^{10}$ 、 $C_1 - C_{12}$  アルキル、 $C_2 - C_{20}$  ヘテロ環および  $C_1 - C_{20}$  ヘテロアリー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ールは、場合によって、F、Cl、Br、I、OH、 $C_1 - C_{12}$  アルキル、オキソ、 $NR^{10}R^{11}$ 、 $-C(=Y)NR^{10}R^{11}$  および  $(CR^{14}R^{15})_n$

<sup>1 5</sup> ) <sub>n</sub> - 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<sup>1</sup> 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。

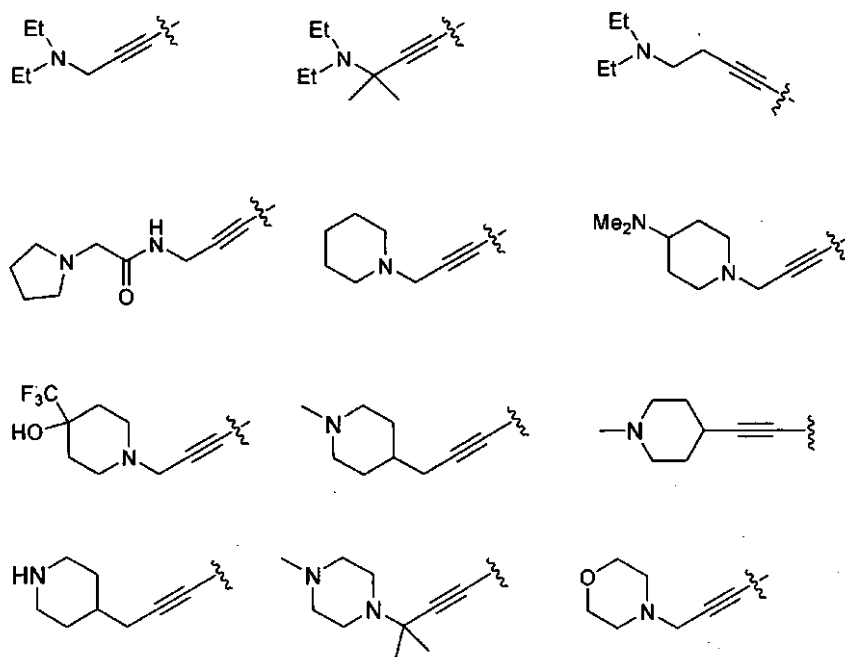
【請求項 5】

R<sup>1</sup> は、 $-C \equiv C (C R^{1 4} R^{1 5})_n N R^{1 2} C(=O) (C R^{1 4} R^{1 5})_m N R^{1 0} R^{1 1}$ 、 $-C \equiv C (C R^{1 4} R^{1 5})_n - N R^{1 0} R^{1 1}$  または、場合によって C<sub>5</sub> - C<sub>8</sub> 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】

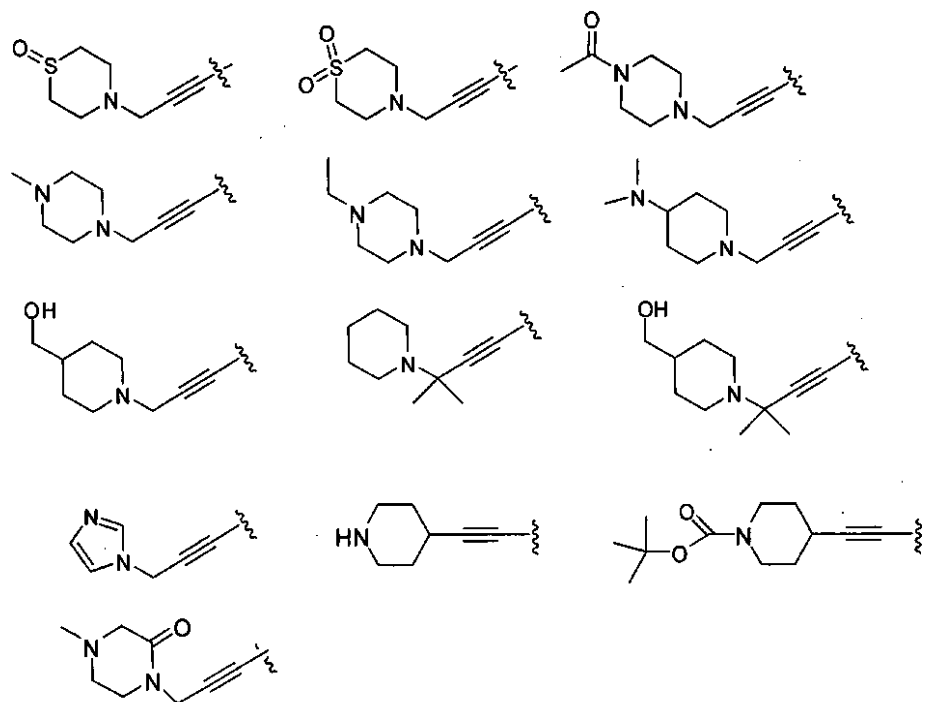
R<sup>1</sup> は、構造式：

【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。

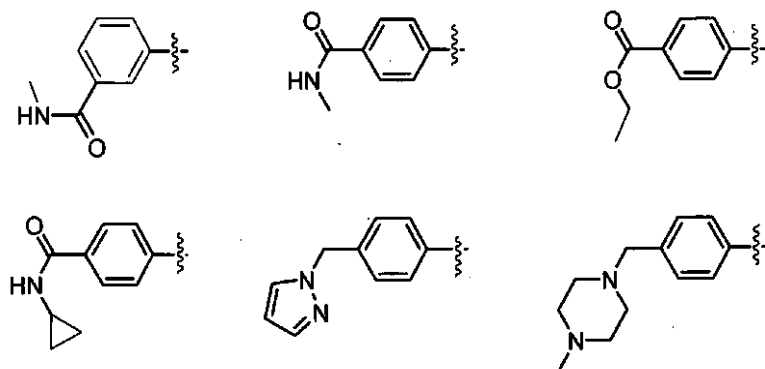
## 【請求項 7】

R<sup>1</sup> 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。

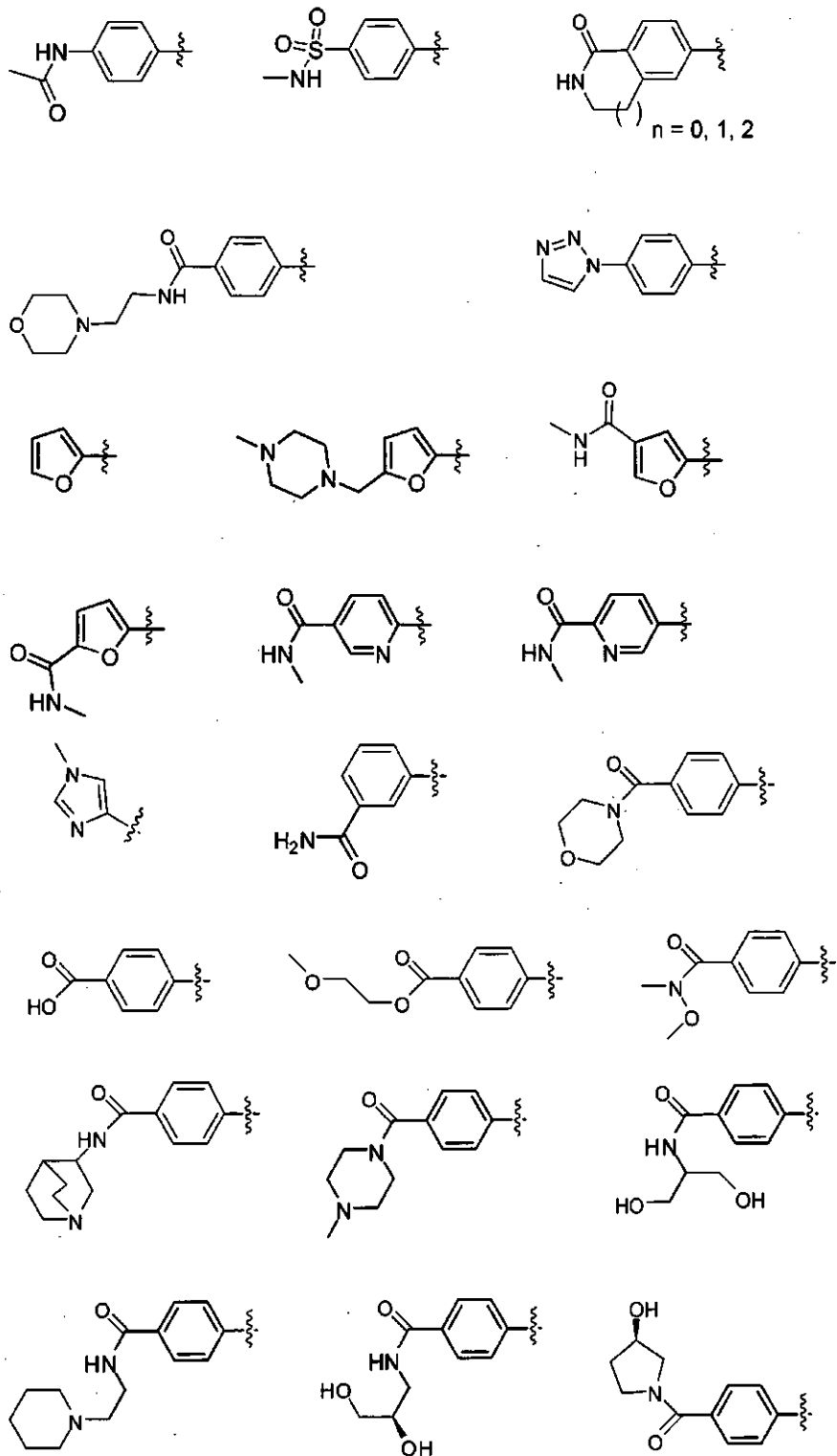
## 【請求項 8】

R<sup>1</sup> は、構造式：

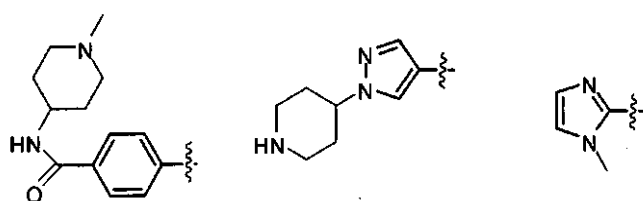
## 【化 6】



## 【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】

$R^1$  は、(a) フェニルであって、場合によってハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $SO_2$   $NH(C_1 - C_6$  アルキル)、ヘテロアリールまたは $CH_2$  - 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 $C_1 - C_6$  アルキルで置換されている)で置換され、 $CH_2$  - *hetCyc* (ここで、*hetCyc* は、NおよびOから独立して選択される1~2個の環ヘテロ原子を有する5または6員環であって、場合によって、 $C_1 - C_6$  アルキルで置換されている)、 $NR^hC(=O)R^i$ 、 $C(=O)R^h$ 、 $C(=O)NR^hR^i$  または  $NR^hR^i$  (ここで、 $R^h$  および  $R^i$  は、独立して、H、OH、 $O(C_1 - C_6$  アルキル)、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_3 - C_6$  炭素環、または5~8員ヘテロ環(ここで、前記  $O(C_1 - C_6$  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、 $OCH_3$ 、 $C_1 - C_6$  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個の環ヘテロ原子を有する5または6員ヘテロアリールであって、場合によって、 $C_1 - C_6$  アルキルで置換されたヘテロアリール、 $C(=O)NR^hR^i$  (ここで、 $R^h$  および  $R^i$  は、独立して、H、 $C_1 - C_6$  アルキルまたは $C_3 - C_6$  炭素環である)、*hetCyc* または  $CH_2$  - *hetCyc* (ここで、*hetCyc* は、場合によって、 $C_1 - C_6$  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。

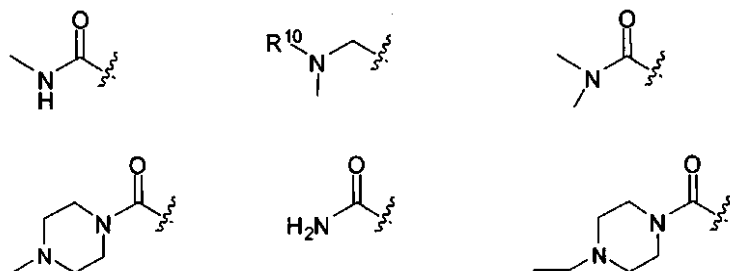
【請求項10】

$R^1$  は、 $-C(=O)NR^{10}R^{11}$  または  $-(CR^{14}R^{15})_tNR^{10}R^{11}$  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】

$R^1$  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。

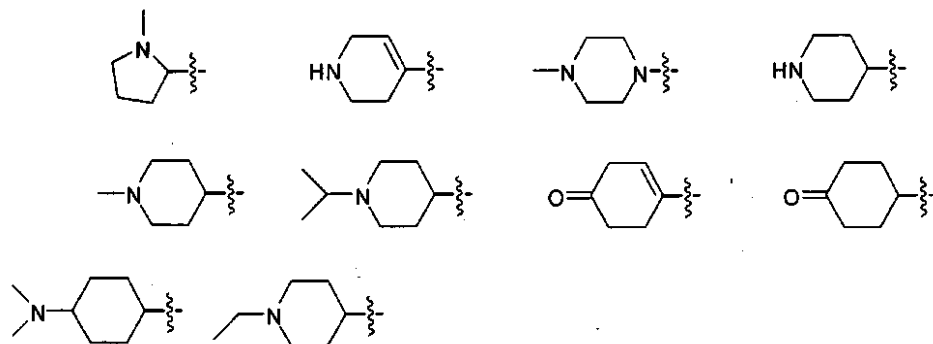
【請求項12】

$R^1$  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】

$R^1$  は、構造式：

## 【化 1 0】

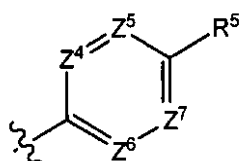


から選択される請求項 1 2 記載の化合物。

## 【請求項 1 4】

R<sup>3</sup> が、構造式：

## 【化 1 1】



(式中、波線は、O への結合点を示し；

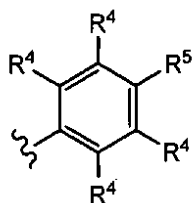
Z<sup>4</sup>、Z<sup>5</sup>、Z<sup>6</sup> および Z<sup>7</sup> は、独立して、C R<sup>4</sup> または N であり、かつ 0、1 または 2 個の Z<sup>4</sup>、Z<sup>5</sup>、Z<sup>6</sup> および Z<sup>7</sup> が N であるが、ここで Z<sup>4</sup> および Z<sup>5</sup> または Z<sup>6</sup> および Z<sup>7</sup> が C R<sup>4</sup> である場合、Z<sup>4</sup> および Z<sup>5</sup> または Z<sup>6</sup> および Z<sup>7</sup> 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<sup>5</sup> は、F、Cl、-NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-NR<sup>10</sup>C(=Y)R<sup>13</sup>、-NR<sup>10</sup>C(=Y)OR<sup>11</sup>、-NR<sup>12</sup>C(=Y)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-NR<sup>12</sup>C(=O)C(=O)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-NR<sup>12</sup>C(=O)C(=O)OR<sup>a</sup>、-NR<sup>12</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>10</sup>、-NR<sup>12</sup>C(=Y<sup>1</sup>)(C R<sup>14</sup>R<sup>15</sup>)<sub>n</sub>C(=Y<sup>2</sup>)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-NR<sup>12</sup>C(=Y<sup>1</sup>)NR<sup>10</sup>C(=Y<sup>2</sup>)(C R<sup>14</sup>R<sup>15</sup>)<sub>n</sub>R<sup>11</sup>、-NR<sup>12</sup>C(=Y<sup>1</sup>)(C R<sup>14</sup>R<sup>15</sup>)<sub>n</sub>C(=Y<sup>2</sup>)(C R<sup>14</sup>R<sup>15</sup>)<sub>m</sub>R<sup>10</sup>、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub> ヘテロ環または C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub> 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、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> アルキル、オキソ、NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-C(=Y)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup> および (C R<sup>14</sup>R<sup>15</sup>)<sub>n</sub>-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 ~ 1 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

## 【請求項 1 5】

R<sup>3</sup> は、構造式：

## 【化 1 2】

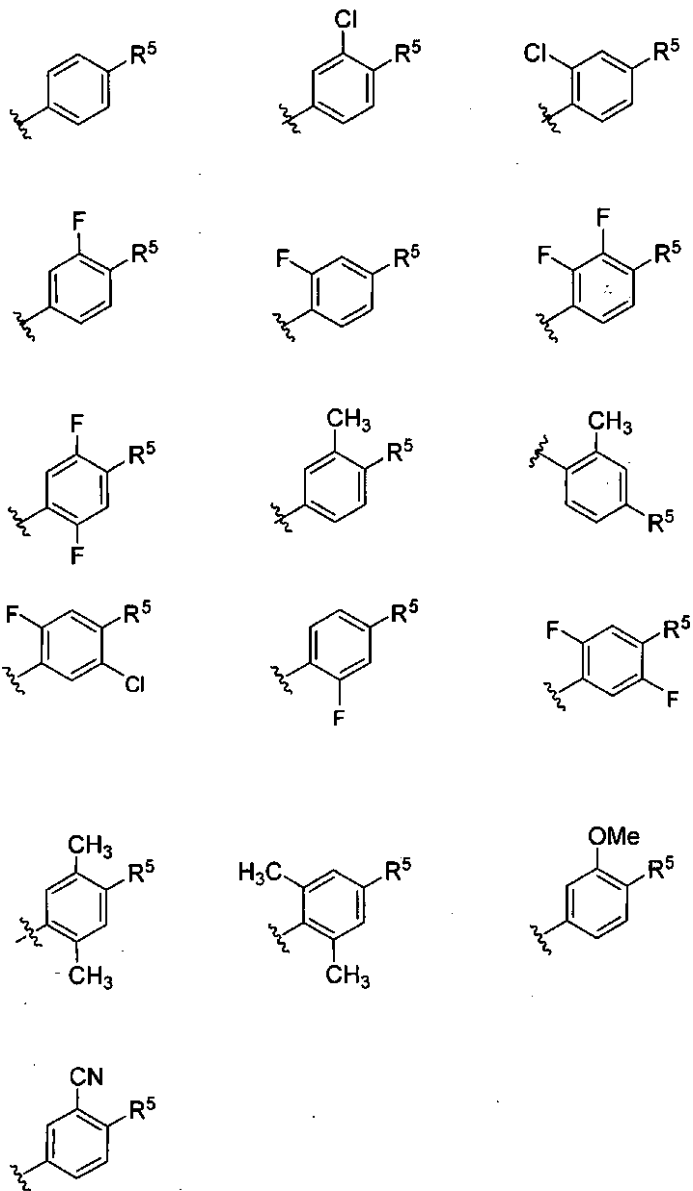


(式中、波線は、X への結合を示し、各 R<sup>4</sup> は、他のものとは独立している) で表される請求項 1 4 記載の化合物。

## 【請求項 1 6】

R<sup>3</sup> は、構造式：

## 【化 1 3】

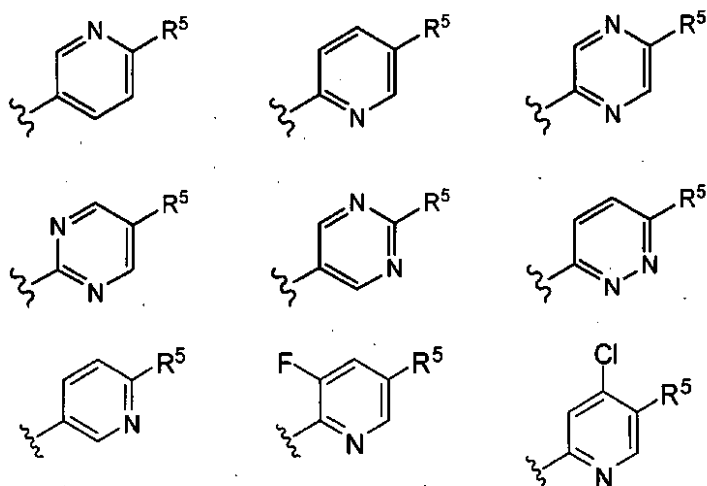


から選択される請求項 1 5 記載の化合物。

## 【請求項 1 7】

R<sup>3</sup> は、構造式：

## 【化 1 4】

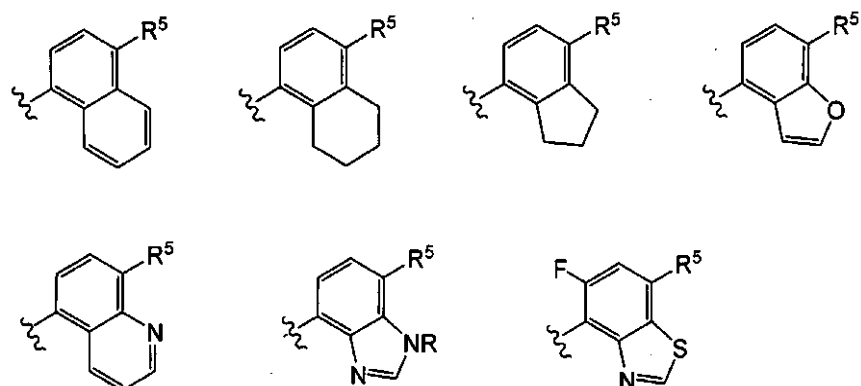


(式中、波線は、X への結合点を示す) から選択される請求項 1 4 記載の化合物。

## 【請求項 1 8】

R<sup>3</sup> は、構造式：

## 【化 1 5】

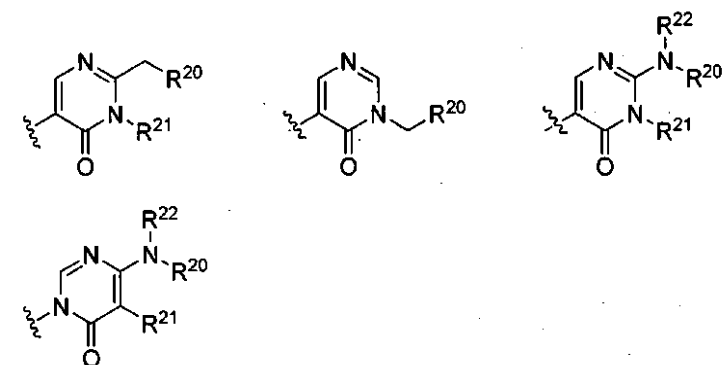


から選択される請求項 1 ~ 1 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

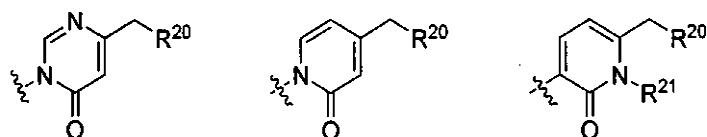
## 【請求項 1 9】

Z<sup>4</sup>、Z<sup>5</sup>、Z<sup>6</sup> および Z<sup>7</sup> がそれぞれ C R<sup>4</sup> であり、かつ R<sup>1</sup> が H、アルキルまたは -C(=O)NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup> である場合、R<sup>5</sup> は、F、Cl、-NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-NR<sup>10</sup>C(=O)R<sup>13</sup>、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> アルキル、または構造式：

## 【化 1 6】



## 【化 1 7】

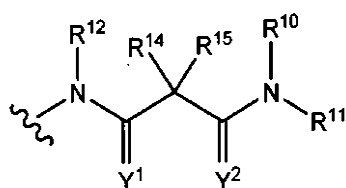


(式中、 $R^{20}$  は、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、 $R^{21}$  および  $R^{22}$  は、独立して、Hまたはアルキルから選択される)から選択されるヘテロアリール以外の  $C_1 - C_{20}$  ヘテロアリールではなく、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールは、場合によって、F、Cl、Br、Iおよびアルキルから独立して選択される1個以上の基で置換される請求項14記載の化合物。

## 【請求項 20】

$R^5$  は、構造式：

## 【化 1 8】



から選択される請求項16記載の化合物。

## 【請求項 21】

$R^{11}$  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】

$R^{14}$  および  $R^{15}$  は、これらが結合する原子と一緒にあって、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。

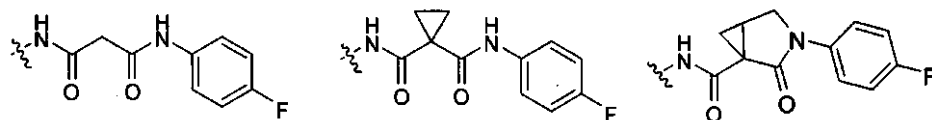
## 【請求項 23】

$R^{15}$  および  $R^{10}$  は、これらが結合する原子と一緒にあって、オキソ置換5、6または7員単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。

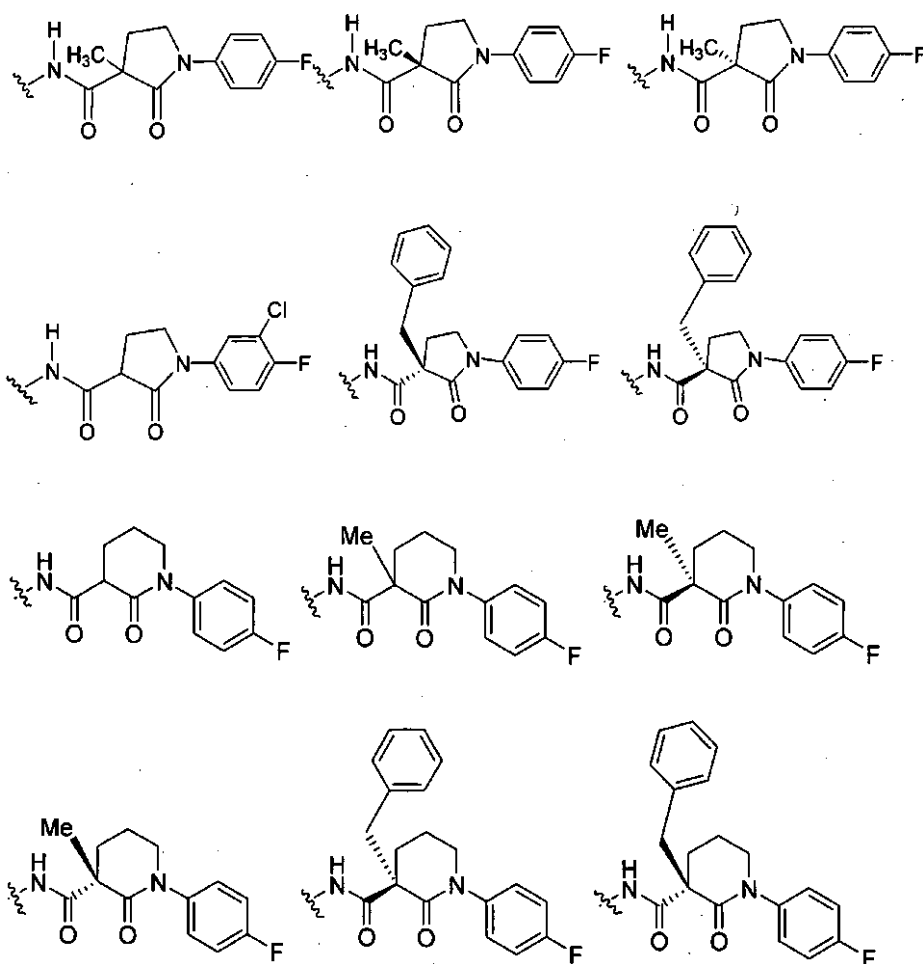
## 【請求項 24】

$R^5$  は、構造式：

## 【化 1 9】



## 【化 2 0】



から選択される請求項 2 0 記載の化合物。

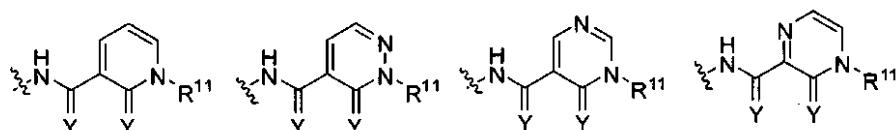
## 【請求項 2 5】

$R^{14}$  は存在せず、かつ  $R^{10}$  および  $R^{15}$  は、これらが結合する原子と一緒に、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】

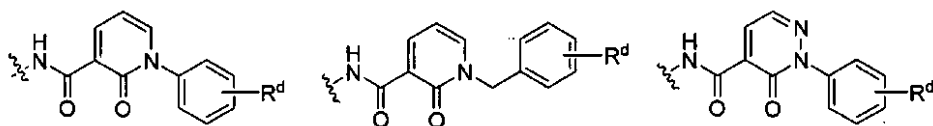


から選択される請求項 1 5 記載の化合物。

## 【請求項 2 7】

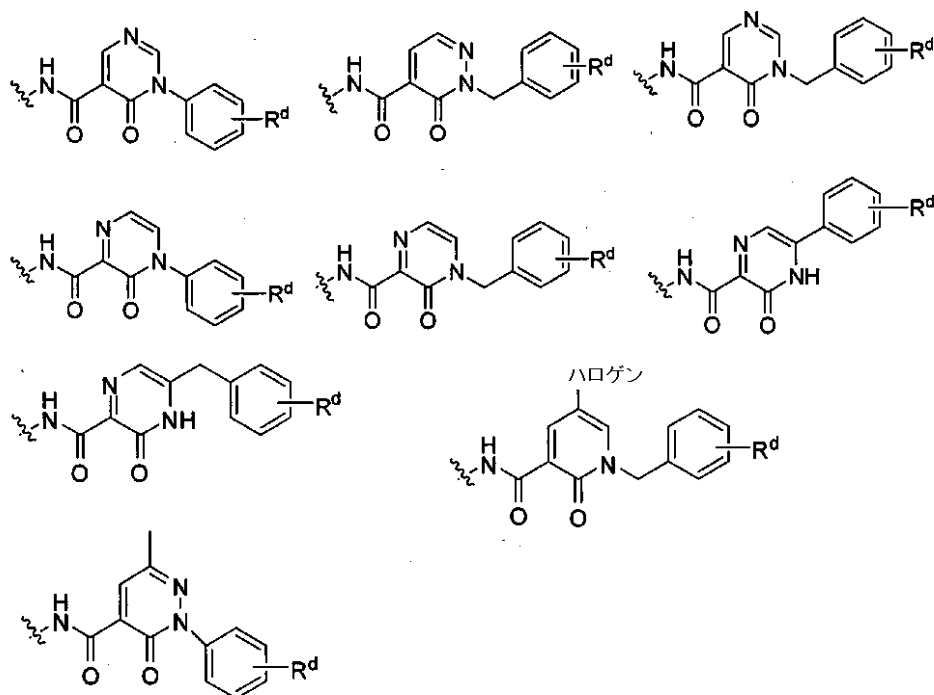
$R^5$  は、構造式：

## 【化 2 2】





## 【化 2 3】

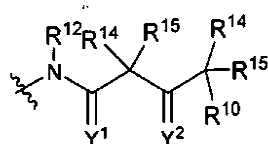


から選択され、ここで、フェニル基は、場合によって、F、Cl、Br、I、 $\text{SO}_2\text{R}^c$ 、CN、 $\text{OR}^a$ 、 $\text{NR}^a\text{R}^b$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b$ 、 $\text{CR}^a\text{C}(=\text{O})\text{R}^b$ 、 $\text{C}_1 - \text{C}_{12}$ アルキル、 $\text{C}_2 - \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_2 - \text{C}_8$ アルキニル、 $\text{C}_6 - \text{C}_{20}$ アリールおよび $\text{C}_1 - \text{C}_{20}$ ヘテロアリールから独立して選択される1個以上の $\text{R}^d$ 基で置換されている請求項26記載の化合物。

## 【請求項 2 8】

$\text{R}^5$  は、構造式：

## 【化 2 4】



で表される請求項16記載の化合物。

## 【請求項 2 9】

$\text{R}^{10}$  は、場合によって置換されたアリールまたは $\text{CH}_2$ -アリールである請求項28記載の化合物。

## 【請求項 3 0】

$\text{R}^{14}$  および  $\text{R}^{15}$  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 3 1】

$\text{R}^5$  は、構造式：

## 【化 2 5】

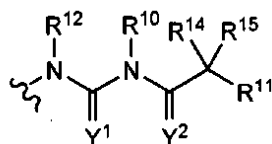


から選択される請求項28記載の化合物。

## 【請求項 3 2】

$\text{R}^5$  は、構造式：

## 【化 2 6】



で表される請求項 1 6 記載の化合物。

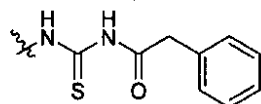
## 【請求項 3 3】

R<sup>1 1</sup> は、場合によって置換されたアリールである請求項 3 2 記載の化合物。

## 【請求項 3 4】

R<sup>5</sup> は、構造式：

## 【化 2 7】

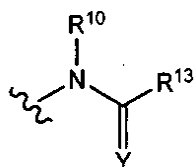


から選択される請求項 3 2 記載の化合物。

## 【請求項 3 5】

R<sup>5</sup> は、構造式：

## 【化 2 8】



で表される請求項 1 6 記載の化合物。

## 【請求項 3 6】

R<sup>1 3</sup> は、アルキル、(C R<sup>1 4</sup> R<sup>1 5</sup>)<sub>n</sub> - O - (C R<sup>1 4</sup> R<sup>1 5</sup>)<sub>m</sub> - アリール、(C R<sup>1 4</sup> R<sup>1 5</sup>)<sub>n</sub> - アリール、(C R<sup>1 4</sup> R<sup>1 5</sup>)<sub>n</sub> - ヘテロアリール、(C R<sup>1 4</sup> R<sup>1 5</sup>)<sub>n</sub> - ヘテロ環、(C R<sup>1 4</sup> R<sup>1 5</sup>) - N R<sup>1 0</sup> (S O<sub>2</sub> M e) R<sup>1 1</sup>、または (C R<sup>1 4</sup> R<sup>1 5</sup>)<sub>n</sub> - N R<sup>1 0</sup> C (= O) R<sup>1 1</sup> 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 3 5 記載の化合物。

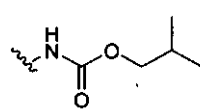
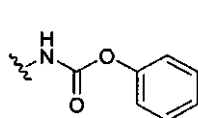
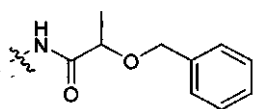
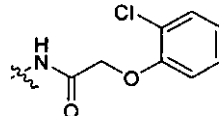
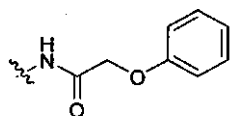
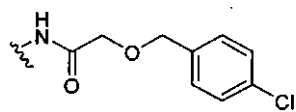
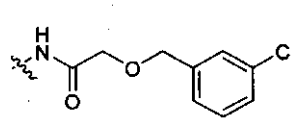
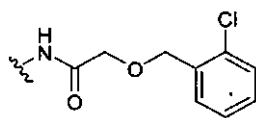
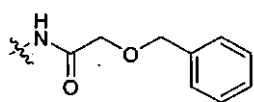
## 【請求項 3 7】

R<sup>1 3</sup> は、アルキル、(C R<sup>1 4</sup> R<sup>1 5</sup>)<sub>n</sub> - O - (C R<sup>1 4</sup> R<sup>1 5</sup>)<sub>m</sub> - アリール、(C R<sup>1 4</sup> R<sup>1 5</sup>)<sub>n</sub> - アリール、(C R<sup>1 4</sup> R<sup>1 5</sup>)<sub>n</sub> - ヘテロアリール、(C R<sup>1 4</sup> R<sup>1 5</sup>)<sub>n</sub> - ヘテロ環、(C R<sup>1 4</sup> R<sup>1 5</sup>) - N (S O<sub>2</sub> R<sup>a</sup>) (C R<sup>1 4</sup> R<sup>1 5</sup>) R<sup>1 1</sup> または (C R<sup>1 4</sup> R<sup>1 5</sup>)<sub>n</sub> N R<sup>1 0</sup> C (= 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 3 5 記載の化合物。

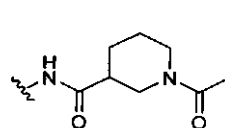
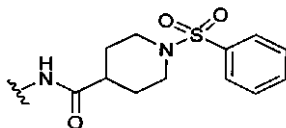
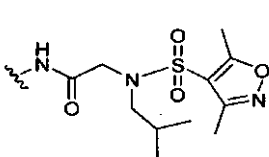
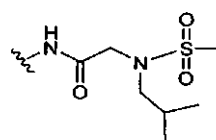
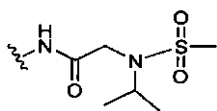
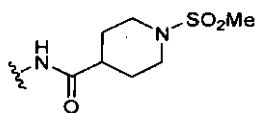
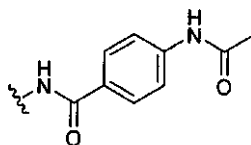
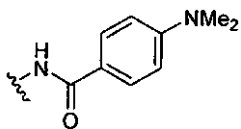
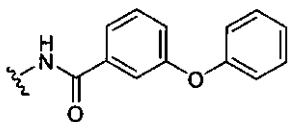
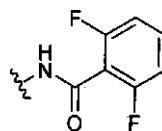
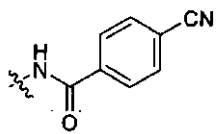
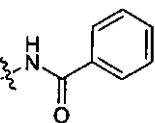
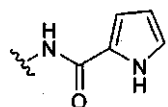
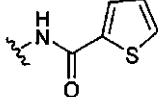
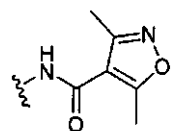
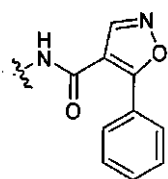
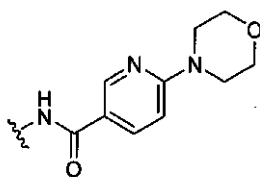
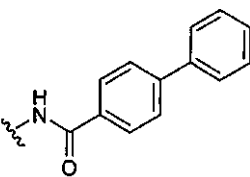
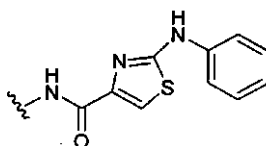
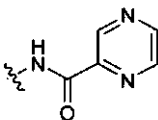
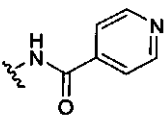
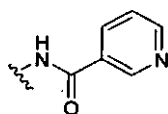
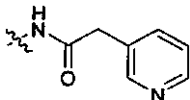
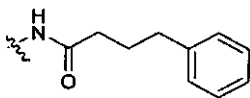
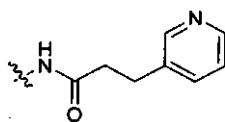
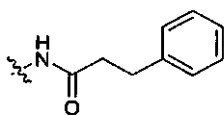
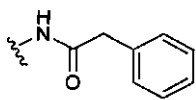
## 【請求項 3 8】

R<sup>5</sup> は、構造式：

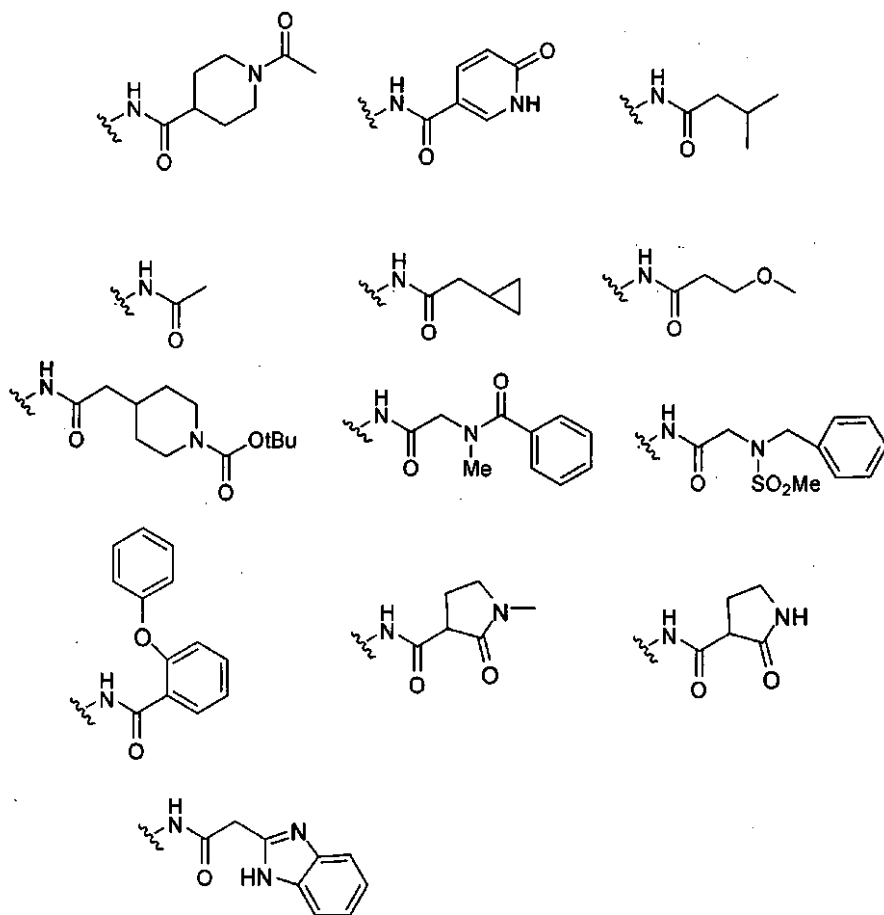
## 【化 2 9】



【化 30】



## 【化 3 1】

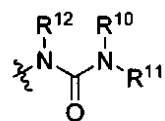


から選択される請求項 3 5 記載の化合物。

## 【請求項 3 9】

R<sup>5</sup> は、構造式：

## 【化 3 2】



で表される請求項 1 6 記載の化合物。

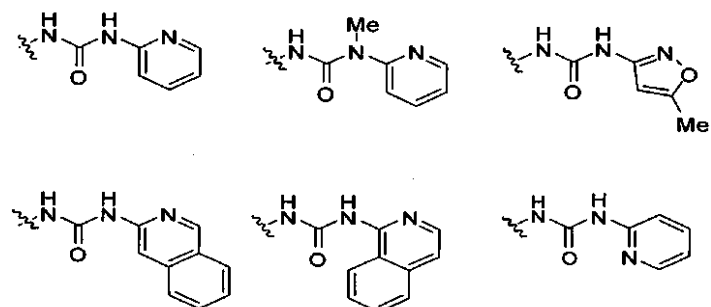
## 【請求項 4 0】

R<sup>11</sup> 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 3 9 記載の化合物。

## 【請求項 4 1】

R<sup>5</sup> は、構造式：

## 【化 3 3】



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、 $NR^{12}SO_2R^{10}$  である請求項 1 6 記載の化合物。

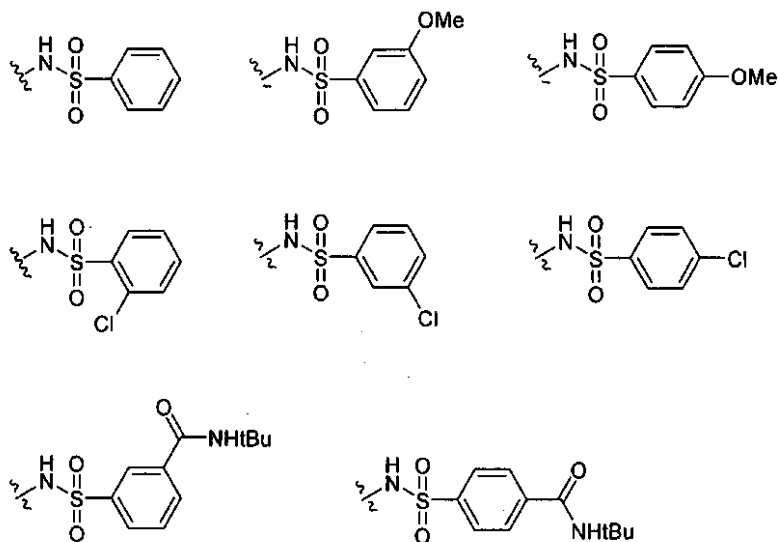
【請求項 4 3】

$R^{10}$  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。

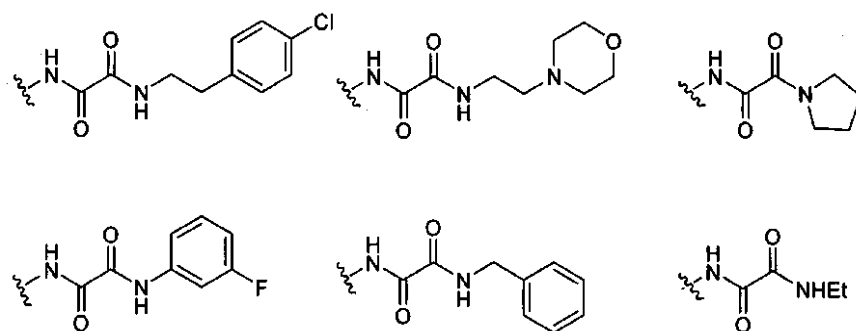
【請求項 4 5】

$R^5$  は、 $NR^{12}C(=O)C(=O)NR^{10}R^{11}$  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。

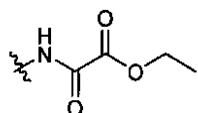
【請求項 4 7】

$R^5$  は、 $NR^{12}C(=O)C(=O)OR^a$  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。

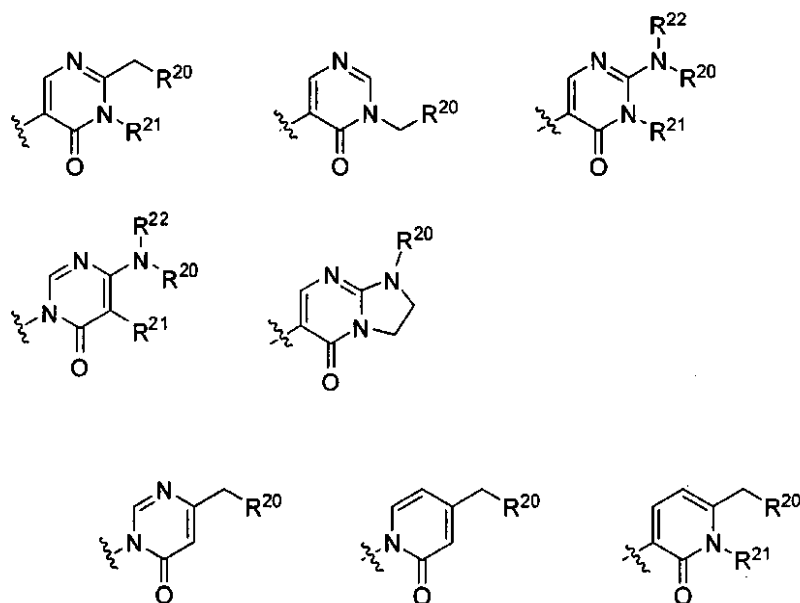
## 【請求項 49】

R<sup>5</sup> 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 16 記載の化合物。

## 【請求項 50】

R<sup>5</sup> は、構造式：

## 【化 37】

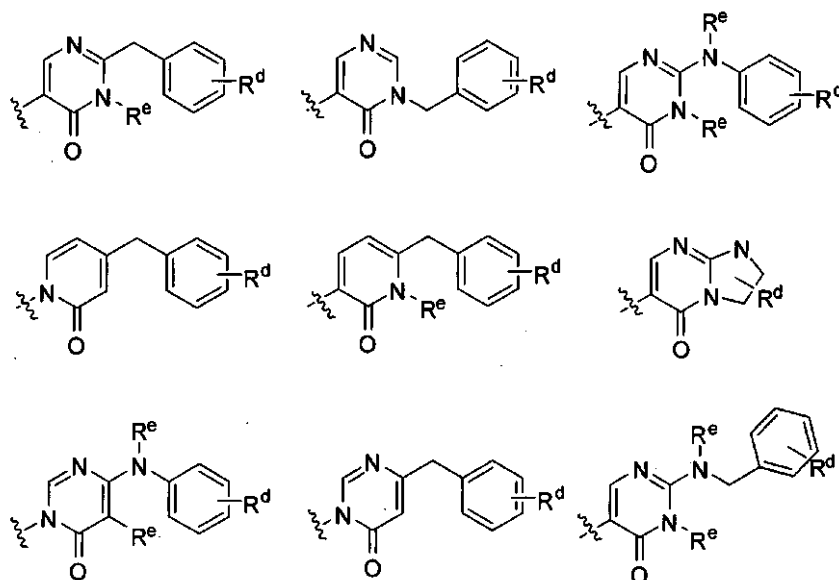


(式中、R<sup>20</sup> は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールであり、R<sup>21</sup> および R<sup>22</sup> は、独立して、H およびアルキルから選択され、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールは、場合によって、F、Cl、Br、I およびアルキルから独立して選択される 1 個以上の基で置換される) から選択される請求項 49 記載の化合物。

## 【請求項 51】

R<sup>5</sup> は、構造式：

## 【化 38】



から選択される請求項 50 記載の化合物。

## 【請求項 52】

R<sup>5</sup> は、-NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup> である請求項 16 記載の化合物。

## 【請求項 53】

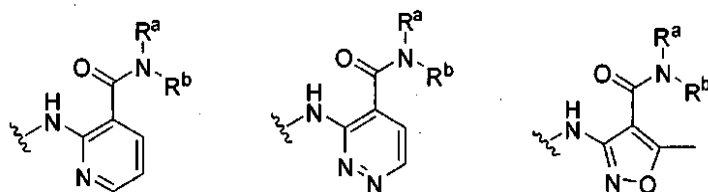
R<sup>11</sup> は、hetAr であり、該 hetAr は、少なくとも 1 個の環窒素原子および場合

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 5 2 記載の化合物。

【請求項 5 4】

R<sup>5</sup> は、構造式：

【化 3 9】

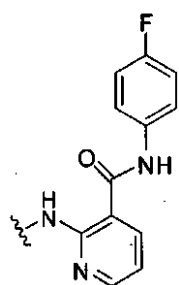


から選択される請求項 5 2 記載の化合物。

【請求項 5 5】

R<sup>5</sup> は、構造式：

【化 4 0】

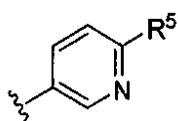


である請求項 5 4 記載の化合物。

【請求項 5 6】

R<sup>3</sup> は、

【化 4 1】



である請求項 1 7 記載の化合物。

【請求項 5 7】

R<sup>5</sup> は、C 1 である請求項 5 6 記載の化合物。

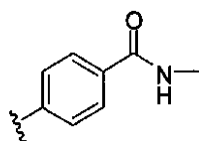
【請求項 5 8】

R<sup>5</sup> は、場合によって置換されたアリールである請求項 5 6 記載の化合物。

【請求項 5 9】

R<sup>5</sup> は、構造式：

【化 4 2】



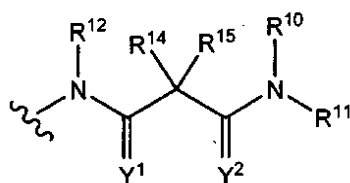
から選択される請求項 5 6 記載の化合物。

【請求項 6 0】

R<sup>5</sup> は、構造式：



## 【化 4 3】

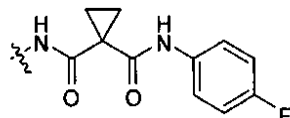


から選択される請求項 5 6 記載の化合物。

## 【請求項 6 1】

R<sup>5</sup> は、構造式：

## 【化 4 4】



から選択される請求項 6 0 記載の化合物。

## 【請求項 6 2】

請求項 1 で定義され、実施例 1 ~ 1 7 9 で命名されている、式 1 の化合物。

## 【請求項 6 3】

請求項 1 ~ 6 2 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 6 4】

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、抗ウイルス剤、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 6 3 記載の組成物。

## 【請求項 6 5】

M e t キナーゼ活性を検出可能に阻害する量の請求項 1 ~ 6 2 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 6 6】

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、嚢胞性線維症、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、トロンピンに誘導された血小板凝集、慢性骨髄性白血病（C M L）、肝疾患、T細胞の活性化に關与する病的な免疫状態およびC N S 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 6 3 記載の組成物を含む組成物。

## 【請求項 6 7】

前記疾患が癌である請求項 6 6 記載の組成物。

## 【請求項 6 8】

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 ~ 6 2 のいずれかに記載の化合物の用途。

## 【請求項 6 9】

治療に使用するための請求項 1 ~ 6 2 のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 7 0】

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 ~ 6 2 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 7 1】

前記レセプターチロシンキナーゼが c - M e t である請求項 7 0 記載の組成物。

## 【請求項 7 2】

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。