

【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】令和1年6月13日(2019.6.13)

【公表番号】特表2018-519357(P2018-519357A)

【公表日】平成30年7月19日(2018.7.19)

【年通号数】公開・登録公報2018-027

【出願番号】特願2018-510695(P2018-510695)

【国際特許分類】

C 07 D	211/60	(2006.01)
C 07 D	207/16	(2006.01)
A 61 K	31/445	(2006.01)
A 61 K	31/40	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	1/18	(2006.01)
A 61 P	11/00	(2006.01)
A 61 P	1/04	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
C 07 K	14/435	(2006.01)
C 12 N	5/09	(2010.01)

【F I】

C 07 D	211/60	C S P
C 07 D	207/16	Z N A
A 61 K	31/445	
A 61 K	31/40	
A 61 P	35/00	
A 61 P	1/18	
A 61 P	11/00	
A 61 P	1/04	
A 61 P	43/00	1 1 1
C 07 K	14/435	
C 12 N	5/09	

【手続補正書】

【提出日】令和1年5月7日(2019.5.7)

【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

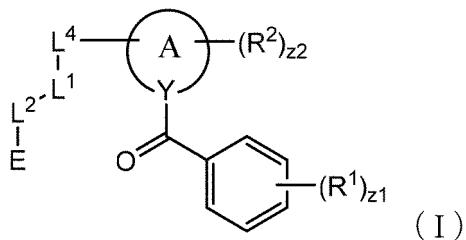
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式：

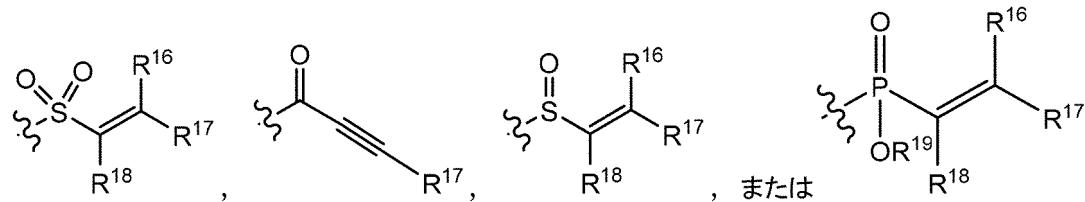
【化1】



[式中、

Eは、

【化2】



であり、ここで、

$R^{16}$ は、水素、ハロゲン、 $-CX^{16}{}_3$ 、 $-CHX^{16}{}_2$ 、 $-CH_2X^{16}$ 、 $-CN$ 、 $-SON_{n16}R^{16}D$ 、 $-SO_{v16}NR^{16}AR^{16}B$ 、 $-NHNR^{16}AR^{16}B$ 、 $-ONR^{16}AR^{16}B$ 、 $-NHC=(O)NHNR^{16}AR^{16}B$ 、 $-NHC(O)NR^{16}AR^{16}B$ 、 $-N(O)m16$ 、 $-NR^{16}AR^{16}B$ 、 $-C(O)R^{16}C$ 、 $-C(O)-OR^{16}C$ 、 $-C(O)NR^{16}AR^{16}B$ 、 $-OR^{16}D$ 、 $-NR^{16}ASO_2R^{16}D$ 、 $-NR^{16}AC(O)R^{16}C$ 、 $-NR^{16}AC(O)OR^{16}C$ 、 $-NR^{16}AOR^{16}C$ 、 $-OCX^{16}{}_3$ 、 $-OCHX^{16}{}_2$ 、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

$R^{17}$ は、水素、ハロゲン、 $-CX^{17}{}_3$ 、 $-CHX^{17}{}_2$ 、 $-CH_2X^{17}$ 、 $-CN$ 、 $-SON_{n17}R^{17}D$ 、 $-SO_{v17}NR^{17}AR^{17}B$ 、 $-NHNR^{17}AR^{17}B$ 、 $-ONR^{17}AR^{17}B$ 、 $-NHC=(O)NHNR^{17}AR^{17}B$ 、 $-NHC(O)NR^{17}AR^{17}B$ 、 $-N(O)m17$ 、 $-NR^{17}AR^{17}B$ 、 $-C(O)R^{17}C$ 、 $-C(O)-OR^{17}C$ 、 $-C(O)NR^{17}AR^{17}B$ 、 $-OR^{17}D$ 、 $-NR^{17}ASO_2R^{17}D$ 、 $-NR^{17}AC(O)R^{17}C$ 、 $-NR^{17}AC(O)OR^{17}C$ 、 $-NR^{17}AOR^{17}C$ 、 $-OCX^{17}{}_3$ 、 $-OCHX^{17}{}_2$ 、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

$R^{18}$ は、水素、ハロゲン、 $-CX^{18}{}_3$ 、 $-CHX^{18}{}_2$ 、 $-CH_2X^{18}$ 、 $-CN$ 、 $-SON_{n18}R^{18}D$ 、 $-SO_{v18}NR^{18}AR^{18}B$ 、 $-NHNR^{18}AR^{18}B$ 、 $-ONR^{18}AR^{18}B$ 、 $-NHC=(O)NHNR^{18}AR^{18}B$ 、 $-NHC(O)NR^{18}AR^{18}B$ 、 $-N(O)m18$ 、 $-NR^{18}AR^{18}B$ 、 $-C(O)R^{18}C$ 、 $-C(O)-OR^{18}C$ 、 $-C(O)NR^{18}AR^{18}B$ 、 $-OR^{18}D$ 、 $-NR^{18}ASO_2R^{18}D$ 、 $-NR^{18}AC(O)R^{18}C$ 、 $-NR^{18}AC(O)OR^{18}C$ 、 $-NR^{18}AOR^{18}C$ 、 $-OCX^{18}{}_3$ 、 $-OCHX^{18}{}_2$ 、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

$R^{19}$ は、水素、ハロゲン、 $-CX^{19}{}_3$ 、 $-CHX^{19}{}_2$ 、 $-CH_2X^{19}$ 、 $-CN$

N、 - S O <sub>n</sub> <sup>1~9</sup> R <sup>1~9</sup> D、 - S O <sub>v</sub> <sup>1~9</sup> N R <sup>1~9</sup> A R <sup>1~9</sup> B、 - N H N R <sup>1~9</sup> A R <sup>1~9</sup> B  
 B、 - O N R <sup>1~9</sup> A R <sup>1~9</sup> B、 - N H C = (O) N H N R <sup>1~9</sup> A R <sup>1~9</sup> B、 - N H C (O)  
 ) N R <sup>1~9</sup> A R <sup>1~9</sup> B、 - N (O) <sub>m</sub> <sup>1~9</sup>、 - N R <sup>1~9</sup> A R <sup>1~9</sup> B、 - C (O) R <sup>1~9</sup> C  
 、 - C (O) - O R <sup>1~9</sup> C、 - C (O) N R <sup>1~9</sup> A R <sup>1~9</sup> B、 - O R <sup>1~9</sup> D、 - N R <sup>1~9</sup>  
 A S O <sub>2</sub> R <sup>1~9</sup> D、 - N R <sup>1~9</sup> A C (O) R <sup>1~9</sup> C、 - N R <sup>1~9</sup> A C (O) O R <sup>1~9</sup> C、  
 - N R <sup>1~9</sup> A O R <sup>1~9</sup> C、 - O C X <sup>1~9</sup> <sub>3</sub>、 - O C H X <sup>1~9</sup> <sub>2</sub>、 置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

R <sup>1~6</sup> A、 R <sup>1~6</sup> B、 R <sup>1~6</sup> C、 R <sup>1~6</sup> D、 R <sup>1~7</sup> A、 R <sup>1~7</sup> B、 R <sup>1~7</sup> C、 R <sup>1~7</sup>  
 D、 R <sup>1~8</sup> A、 R <sup>1~8</sup> B、 R <sup>1~8</sup> C、 R <sup>1~8</sup> D、 R <sup>1~9</sup> A、 R <sup>1~9</sup> B、 R <sup>1~9</sup> C、 及び  
 R <sup>1~9</sup> D は、独立して、水素、ハロゲン、 - C X <sub>3</sub>、 - C N、 - OH、 - NH <sub>2</sub>、 - CO  
 OH、 - CONH <sub>2</sub>、 - NO <sub>2</sub>、 - SH、 - SO <sub>3</sub> H、 - SO <sub>4</sub> H、 - SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>、 -  
 NH NH <sub>2</sub>、 - ONH <sub>2</sub>、 - NHC (O) NH NH <sub>2</sub>、 - NHC (O) NH <sub>2</sub>、 - NHS  
 O <sub>2</sub> H、 - NHC (O) H、 - NHC (O) OH、 - NH OH、 - O C X <sub>3</sub>、 - O C H X  
<sub>2</sub>、 - C H <sub>2</sub> X、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

同一の窒素原子に結合した R <sup>1~6</sup> A 置換基及び R <sup>1~6</sup> B 置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；

同一の窒素原子に結合した R <sup>1~7</sup> A 置換基及び R <sup>1~7</sup> B 置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；

同一の窒素原子に結合した R <sup>1~8</sup> A 置換基及び R <sup>1~8</sup> B 置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；及び

同一の窒素原子に結合した R <sup>1~9</sup> A 置換基及び R <sup>1~9</sup> B 置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；

X、 X <sup>1~6</sup>、 X <sup>1~7</sup>、 X <sup>1~8</sup>、 及び X <sup>1~9</sup> は、それぞれ独立して、 - F、 - C 1、  
 - Br、または - I であり；

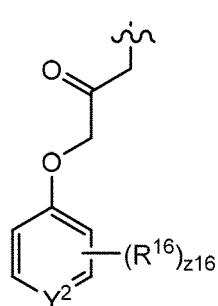
n <sup>1~6</sup>、 n <sup>1~7</sup>、 n <sup>1~8</sup>、 n <sup>1~9</sup>、 v <sup>1~6</sup>、 v <sup>1~7</sup>、 v <sup>1~8</sup>、 及び v <sup>1~9</sup> は、独立して、0 ~ 4 の整数であり；及び

m <sup>1~6</sup>、 m <sup>1~7</sup>、 m <sup>1~8</sup>、 及び m <sup>1~9</sup> は、独立して、1 または 2 であるか；

または

E は、

【化 3】



であり、ここで、

R <sup>1~6</sup> は、独立して、ハロゲン、 - C X <sup>1~6</sup> <sub>3</sub>、 - C H X <sup>1~6</sup> <sub>2</sub>、 - C H <sub>2</sub> X <sup>1~6</sup>、

- C N、 - O H、 - N H<sub>2</sub>、 - C O O H、 - C O N H<sub>2</sub>、 - N O<sub>2</sub>、 - S H、 - S O<sub>3</sub> H  
 、 - S O<sub>4</sub> H、 - S O<sub>2</sub> N H<sub>2</sub>、 - N H N H<sub>2</sub>、 - O N H<sub>2</sub>、 - N H C( O) N H N H<sub>2</sub>  
 、 - N H C( O) N H<sub>2</sub>、 - N H S O<sub>2</sub> H、 - N H C( O) H、 - N H C( O) O H、 -  
 N H O H、 - O C X<sup>1 6</sup><sub>3</sub>、 - O C H X<sup>1 6</sup><sub>2</sub>、 置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非  
 置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非  
 置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置  
 換のヘテロアリールであり；

Y<sup>2</sup> は、 N または C H であり；

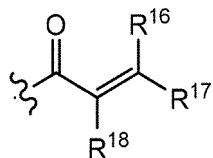
z<sup>1 6</sup> は、 0 ~ 4 の整数であり； 及び

X<sup>1 6</sup> は、 それぞれ独立して、 - F、 - C l、 - B r、 または - I であるか；

または

E は、

【化 4】



であり、ここで、

R<sup>1 6</sup> は、 水素、 ハロゲン、 - C X<sup>1 6</sup><sub>3</sub>、 - C H X<sup>1 6</sup><sub>2</sub>、 - C H<sub>2</sub> X<sup>1 6</sup>、 - C  
 N、 - S O<sub>n</sub><sup>1 6</sup> R<sup>1 6</sup><sub>D</sub>、 - S O<sub>v</sub><sup>1 6</sup> N R<sup>1 6</sup><sub>A</sub> R<sup>1 6</sup><sub>B</sub>、 - N H N R<sup>1 6</sup><sub>A</sub> R<sup>1 6</sup>  
 B、 - O N R<sup>1 6</sup><sub>A</sub> R<sup>1 6</sup><sub>B</sub>、 - N H C = ( O ) N H N R<sup>1 6</sup><sub>A</sub> R<sup>1 6</sup><sub>B</sub>、 - N H C( O)  
 ) N R<sup>1 6</sup><sub>A</sub> R<sup>1 6</sup><sub>B</sub>、 - N ( O )<sub>m</sub><sup>1 6</sup>、 - N R<sup>1 6</sup><sub>A</sub> R<sup>1 6</sup><sub>B</sub>、 - C ( O ) R<sup>1 6</sup><sub>C</sub>  
 、 - C ( O ) - O R<sup>1 6</sup><sub>C</sub>、 - C ( O ) N R<sup>1 6</sup><sub>A</sub> R<sup>1 6</sup><sub>B</sub>、 - O R<sup>1 6</sup><sub>D</sub>、 - N R<sup>1 6</sup>  
 A S O<sub>2</sub> R<sup>1 6</sup><sub>D</sub>、 - N R<sup>1 6</sup><sub>A</sub> C ( O ) R<sup>1 6</sup><sub>C</sub>、 - N R<sup>1 6</sup><sub>A</sub> C ( O ) O R<sup>1 6</sup><sub>C</sub>、  
 - N R<sup>1 6</sup><sub>A</sub> O R<sup>1 6</sup><sub>C</sub>、 - O C X<sup>1 6</sup><sub>3</sub>、 - O C H X<sup>1 6</sup><sub>2</sub>、 置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

R<sup>1 7</sup> は、 水素、 ハロゲン、 - C X<sup>1 7</sup><sub>3</sub>、 - C H X<sup>1 7</sup><sub>2</sub>、 - C H<sub>2</sub> X<sup>1 7</sup>、 - C  
 N、 - S O<sub>n</sub><sup>1 7</sup> R<sup>1 7</sup><sub>D</sub>、 - S O<sub>v</sub><sup>1 7</sup> N R<sup>1 7</sup><sub>A</sub> R<sup>1 7</sup><sub>B</sub>、 - N H N R<sup>1 7</sup><sub>A</sub> R<sup>1 7</sup>  
 B、 - O N R<sup>1 7</sup><sub>A</sub> R<sup>1 7</sup><sub>B</sub>、 - N H C = ( O ) N H N R<sup>1 7</sup><sub>A</sub> R<sup>1 7</sup><sub>B</sub>、 - N H C( O)  
 ) N R<sup>1 7</sup><sub>A</sub> R<sup>1 7</sup><sub>B</sub>、 - N ( O )<sub>m</sub><sup>1 7</sup>、 - N R<sup>1 7</sup><sub>A</sub> R<sup>1 7</sup><sub>B</sub>、 - C ( O ) R<sup>1 7</sup><sub>C</sub>  
 、 - C ( O ) - O R<sup>1 7</sup><sub>C</sub>、 - C ( O ) N R<sup>1 7</sup><sub>A</sub> R<sup>1 7</sup><sub>B</sub>、 - O R<sup>1 7</sup><sub>D</sub>、 - N R<sup>1 7</sup>  
 A S O<sub>2</sub> R<sup>1 7</sup><sub>D</sub>、 - N R<sup>1 7</sup><sub>A</sub> C ( O ) R<sup>1 7</sup><sub>C</sub>、 - N R<sup>1 7</sup><sub>A</sub> C ( O ) O R<sup>1 7</sup><sub>C</sub>、  
 - N R<sup>1 7</sup><sub>A</sub> O R<sup>1 7</sup><sub>C</sub>、 - O C X<sup>1 7</sup><sub>3</sub>、 - O C H X<sup>1 7</sup><sub>2</sub>、 置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

R<sup>1 8</sup> は、 ハロゲン、 C X<sup>1 8</sup><sub>3</sub>、 - C H X<sup>1 8</sup><sub>2</sub>、 - C H<sub>2</sub> X<sup>1 8</sup>、 - C N、 - S  
 O<sub>n</sub><sup>1 8</sup> R<sup>1 8</sup><sub>D</sub>、 - S O<sub>v</sub><sup>1 8</sup> N R<sup>1 8</sup><sub>A</sub> R<sup>1 8</sup><sub>B</sub>、 - N H N R<sup>1 8</sup><sub>A</sub> R<sup>1 8</sup><sub>B</sub>、 - O  
 N R<sup>1 8</sup><sub>A</sub> R<sup>1 8</sup><sub>B</sub>、 - N H C = ( O ) N H N R<sup>1 8</sup><sub>A</sub> R<sup>1 8</sup><sub>B</sub>、 - N H C( O ) N R<sup>1</sup>  
 8 A R<sup>1 8</sup><sub>B</sub>、 - N ( O )<sub>m</sub><sup>1 8</sup>、 - N R<sup>1 8</sup><sub>A</sub> R<sup>1 8</sup><sub>B</sub>、 - C ( O ) R<sup>1 8</sup><sub>C</sub>、 - C ( O )  
 - O R<sup>1 8</sup><sub>C</sub>、 - C ( O ) N R<sup>1 8</sup><sub>A</sub> R<sup>1 8</sup><sub>B</sub>、 - O R<sup>1 8</sup><sub>D</sub>、 - N R<sup>1 8</sup><sub>A</sub> S O<sub>2</sub>  
 R<sup>1 8</sup><sub>D</sub>、 - N R<sup>1 8</sup><sub>A</sub> C ( O ) R<sup>1 8</sup><sub>C</sub>、 - N R<sup>1 8</sup><sub>A</sub> C ( O ) O R<sup>1 8</sup><sub>C</sub>、 - N R<sup>1</sup>  
 8 A O R<sup>1 8</sup><sub>C</sub>、 - O C X<sup>1 8</sup><sub>3</sub>、 - O C H X<sup>1 8</sup><sub>2</sub>、 置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

$R^{1-6}A$ 、 $R^{1-6}B$ 、 $R^{1-6}C$ 、 $R^{1-6}D$ 、 $R^{1-7}A$ 、 $R^{1-7}B$ 、 $R^{1-7}C$ 、 $R^{1-7}D$ 、 $R^{1-8}A$ 、 $R^{1-8}B$ 、 $R^{1-8}C$ 、及び $R^{1-8}D$ は、独立して、水素、ハロゲン、-CX<sub>3</sub>、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-COOH、-CONH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-SH、-SO<sub>3</sub>H、-SO<sub>4</sub>H、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-NHNH<sub>2</sub>、-ONH<sub>2</sub>、-NHC(O)NH<sub>2</sub>、-NHC(O)NH<sub>2</sub>、-NHSO<sub>2</sub>H、-NHC(O)H、-NHC(O)OH、-NHOH、-OCX<sub>3</sub>、-OCHX<sub>2</sub>、-CHX<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>X、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

同一の窒素原子に結合したR<sup>1-6</sup>A置換基及びR<sup>1-6</sup>B置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；

同一の窒素原子に結合したR<sup>1-7</sup>A置換基及びR<sup>1-7</sup>B置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；及び

同一の窒素原子に結合したR<sup>1-8</sup>A置換基及びR<sup>1-8</sup>B置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；

X、X<sup>1-6</sup>、X<sup>1-7</sup>、及びX<sup>1-8</sup>は、それぞれ独立して、-F、-Cl、-Br、または-Iであり；

n<sub>1-6</sub>、n<sub>1-7</sub>、n<sub>1-8</sub>、v<sub>1-6</sub>、v<sub>1-7</sub>、及びv<sub>1-8</sub>は、独立して、0～4の整数であり；及び

m<sub>1-6</sub>、m<sub>1-7</sub>、及びm<sub>1-8</sub>は、独立して、1または2であり；

Yは、NまたはCHであり；

A環は、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>シクロアルキルまたは3～7員ヘテロシクロアルキルであり；

R<sup>1</sup>は、独立して、ハロゲン、-CX<sup>1-3</sup>、-CHX<sup>1-2</sup>、-CH<sub>2</sub>X<sup>1</sup>、-CN、-SO<sub>2</sub>Cl、-SO<sub>n-1</sub>R<sup>1-0</sup>、-SO<sub>v-1</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NHN R<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-ONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NHC(O)NHNR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NHC(O)NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-N(O)m<sub>1</sub>、-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-C(O)R<sup>9</sup>、-C(O)-OR<sup>9</sup>、-C(O)NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-OR<sup>1-0</sup>、-NR<sup>7</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>1-0</sup>、-NR<sup>7</sup>C(O)R<sup>9</sup>、-NR<sup>7</sup>C(O)OR<sup>9</sup>、-NR<sup>7</sup>OR<sup>9</sup>、-OCX<sup>1-3</sup>、-OCHX<sup>1-2</sup>、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；及び

2つの隣接したR<sup>1</sup>置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；

L<sup>1</sup>は、結合、置換もしくは非置換のアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレンであり；

L<sup>2</sup>は、結合、-O-、-C(O)-、-S-、-SO-、-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sup>7</sup>B-、-NR<sup>7</sup>B C(O)-、-C(O)NR<sup>7</sup>B-、-SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>B-、-NR<sup>7</sup>B SO<sub>2</sub>-、-OC(O)NR<sup>7</sup>B-、-NR<sup>7</sup>B C(O)O-、-CR<sup>9</sup>B=NO-、-ON=CR<sup>9</sup>B-、-NR<sup>8</sup>B C(O)NR<sup>7</sup>B-、-NR<sup>8</sup>B C(=NR<sup>1-0</sup>B)NR<sup>7</sup>B-、-NR<sup>8</sup>B C(=NR<sup>1-0</sup>B)-、-C(=NR<sup>1-0</sup>B)NR<sup>7</sup>B-、-OC(=NR<sup>1-0</sup>B)-、-C(=NR<sup>1-0</sup>B)O-、置換もしくは非置換のアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレンであり；

$L^4$  は、結合、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR^4-$ 、 $-NR^4C(O)-$ 、 $-C(O)NR^4-$ 、 $-SO_2NR^4-$ 、 $-NR^4SO_2-$ 、 $-OC(O)NR^4-$ 、 $-NR^4C(O)O-$ 、置換もしくは非置換の  $C_1-C_3$  アルキレン、または置換もしくは非置換の 2~3 員ヘテロアルキレンであり；

$R^2$  は、独立して、オキソ、ハロゲン、 $-CX^2_3$ 、 $-CHX^2_2$ 、 $-CH_2X^2$ 、 $-CN$ 、 $-SO_2Cl$ 、 $-SO_{n_2}R^{14}$ 、 $-SO_{v_2}NR^{11}R^{12}$ 、 $-NHNR^{11}R^{12}$ 、 $-ONR^{11}R^{12}$ 、 $-NHC(O)NHNR^{11}R^{12}$ 、 $-NHC(O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-N(O)m_2$ 、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-C(O)R^{14}$ 、 $-C(O)-OR^{14}$ 、 $-C(O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-NR^{11}SO_2R^{15}$ 、 $-NR^{11}C(O)R^{14}$ 、 $-NR^{11}C(O)OR^{14}$ 、 $-NR^{11}OR^{14}$ 、 $-OCX^2_3$ 、 $-CHX^2_2$ 、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；及び

2 つの隣接した  $R^2$  置換基、または同一の原子に結合した 2 つの  $R^2$  置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキルを形成し得；

$R^4$  は、独立して、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

$R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{7B}$ 、 $R^{8B}$ 、 $R^{9B}$ 、 $R^{10B}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{14}$ 、及び  $R^{15}$  は、独立して、水素、ハロゲン、 $-CX_3$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_2Cl$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-ONH_2$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-NHSO_2H$ 、 $-NHC(O)H$ 、 $-NHC(O)OH$ 、 $-NHOH$ 、 $-OCX_3$ 、 $-OCHX_2$ 、 $-CHX_2$ 、 $-CH_2X$ 、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

同一の窒素原子に結合した  $R^7$  置換基及び  $R^8$  置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；及び

同一の窒素原子に結合した  $R^{11}$  置換基及び  $R^{12}$  置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；

$X$ 、 $X^1$ 、及び  $X^2$  は、それぞれ独立して、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、または  $-I$  であり；

$n_1$ 、 $n_2$ 、 $v_1$ 、及び  $v_2$  は、独立して、0~4 の整数であり；

$m_1$  及び  $m_2$  は、独立して、1 または 2 であり；

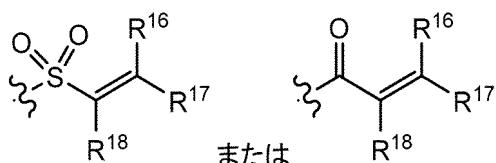
$z_1$  は、独立して、0~5 の整数であり；ならびに

$z_2$  は、独立して、0~10 の整数であり、

ここで、

E が、

【化 5】



である場合には、

$L^1$  は、結合、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレンであり；

$L^2$  は、結合、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR^7B-$ 、 $-NR^7BC(O)-$ 、 $-C(O)NR^7B-$ 、 $-SO_2NR^7B-$ 、 $-NR^7BSO_2-$ 、 $-OOC(O)NR^7B-$ 、 $-NR^7BC(O)O-$ 、 $-CR^9B=NO-$ 、 $-ON=CR^9B-$ 、 $-NR^8BC(O)NR^7B-$ 、 $-NR^8BC(=NR^{10}B)NR^7B-$ 、 $-NR^8BC(=NR^{10}B)-$ 、 $-C(=NR^{10}B)NR^7B-$ 、 $-OOC(=NR^{10}B)-$ 、 $-C(=NR^{10}B)O-$ 、置換もしくは非置換のアルキレン、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレンであり；及び

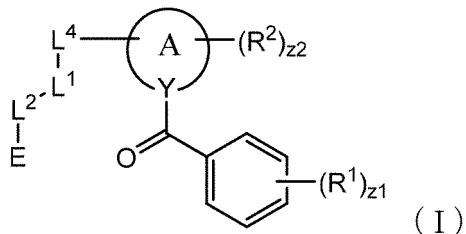
$L^4$  は、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR^4C(O)-$ 、 $-C(O)NR^4-$ 、 $-SO_2NR^4-$ 、 $-NR^4SO_2-$ 、 $-OOC(O)NR^4-$ 、 $-NR^4C(O)O-$ 、置換もしくは非置換の  $C_1-C_3$  アルキレン、または置換もしくは非置換の 2~3 員ヘテロアルキレンである。】

を有する化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

### 【請求項 2】

式：

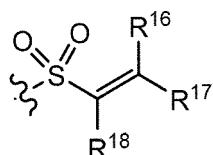
### 【化 6】



[式中、

E は、

### 【化 7】



であり、ここで、

$R^{1-6}$  は、水素、ハロゲン、 $-CX^{1-6}_3$ 、 $-CHX^{1-6}_2$ 、 $-CH_2X^{1-6}$ 、 $-CN$ 、 $-SON_{1-6}R^{1-6}D$ 、 $-SO_v^{1-6}NR^{1-6}A$ 、 $-NHR^{1-6}AR^{1-6}B$ 、 $-ONR^{1-6}AR^{1-6}B$ 、 $-NHCO(O)NHNHR^{1-6}AR^{1-6}B$ 、 $-NHCO(O)NHR^{1-6}AR^{1-6}B$ 、 $-NHR^{1-6}AR^{1-6}B$ 、 $-N(H)O$ 、 $-NR^{1-6}AR^{1-6}B$ 、 $-C(O)R^{1-6}C$ 、 $-C(O)OR^{1-6}C$ 、 $-C(O)NR^{1-6}AR^{1-6}B$ 、 $-OR^{1-6}D$ 、 $-NR^{1-6}ASO_2R^{1-6}D$ 、 $-NR^{1-6}AC(O)R^{1-6}C$ 、 $-NR^{1-6}AC(O)OR^{1-6}C$ 、 $-NR^{1-6}AOR^{1-6}C$ 、 $-OCX^{1-6}_3$ 、 $-OCHX^{1-6}_2$ 、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

$R^{1-7}$  は、水素、ハロゲン、 $-CX^{1-7}_3$ 、 $-CHX^{1-7}_2$ 、 $-CH_2X^{1-7}$ 、 $-CN$ 、 $-SON_{1-7}R^{1-7}D$ 、 $-SO_v^{1-7}NR^{1-7}A$ 、 $-NHR^{1-7}AR^{1-7}B$ 、 $-ONR^{1-7}AR^{1-7}B$ 、 $-NHCO(O)NHNHR^{1-7}AR^{1-7}B$ 、 $-NHCO(O)NHR^{1-7}AR^{1-7}B$

) N R <sup>1</sup> <sub>7</sub> A R <sup>1</sup> <sub>7</sub> B、 - N (O) <sub>m</sub> <sup>1</sup> <sub>7</sub>、 - N R <sup>1</sup> <sub>7</sub> A R <sup>1</sup> <sub>7</sub> B、 - C (O) R <sup>1</sup> <sub>7</sub> C  
 、 - C (O) - O R <sup>1</sup> <sub>7</sub> C、 - C (O) N R <sup>1</sup> <sub>7</sub> A R <sup>1</sup> <sub>7</sub> B、 - O R <sup>1</sup> <sub>7</sub> D、 - N R <sup>1</sup> <sub>7</sub>  
<sup>A</sup> S O <sub>2</sub> R <sup>1</sup> <sub>7</sub> D、 - N R <sup>1</sup> <sub>7</sub> A C (O) R <sup>1</sup> <sub>7</sub> C、 - N R <sup>1</sup> <sub>7</sub> A C (O) O R <sup>1</sup> <sub>7</sub> C、  
 - N R <sup>1</sup> <sub>7</sub> A O R <sup>1</sup> <sub>7</sub> C、 - O C X <sup>1</sup> <sub>7</sub> <sub>3</sub>、 - O C H X <sup>1</sup> <sub>7</sub> <sub>2</sub>、 置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

R <sup>1</sup> <sub>8</sub> は、水素、ハロゲン、- C X <sup>1</sup> <sub>8</sub> <sub>3</sub>、- C H X <sup>1</sup> <sub>8</sub> <sub>2</sub>、- C H <sub>2</sub> X <sup>1</sup> <sub>8</sub>、- C N、- S O <sub>n</sub> <sup>1</sup> <sub>8</sub> R <sup>1</sup> <sub>8</sub> D、- S O <sub>v</sub> <sup>1</sup> <sub>8</sub> N R <sup>1</sup> <sub>8</sub> A R <sup>1</sup> <sub>8</sub> B、- N H N R <sup>1</sup> <sub>8</sub> A R <sup>1</sup> <sub>8</sub>  
<sup>B</sup>、- O N R <sup>1</sup> <sub>8</sub> A R <sup>1</sup> <sub>8</sub> B、- N H C = (O) N H N R <sup>1</sup> <sub>8</sub> A R <sup>1</sup> <sub>8</sub> B、- N H C (O)  
 ) N R <sup>1</sup> <sub>8</sub> A R <sup>1</sup> <sub>8</sub> B、- N (O) <sub>m</sub> <sup>1</sup> <sub>8</sub>、- N R <sup>1</sup> <sub>8</sub> A R <sup>1</sup> <sub>8</sub> B、- C (O) R <sup>1</sup> <sub>8</sub> C  
 、- C (O) - O R <sup>1</sup> <sub>8</sub> C、- C (O) N R <sup>1</sup> <sub>8</sub> A R <sup>1</sup> <sub>8</sub> B、- O R <sup>1</sup> <sub>8</sub> D、- N R <sup>1</sup> <sub>8</sub>  
<sup>A</sup> S O <sub>2</sub> R <sup>1</sup> <sub>8</sub> D、- N R <sup>1</sup> <sub>8</sub> A C (O) R <sup>1</sup> <sub>8</sub> C、- N R <sup>1</sup> <sub>8</sub> A C (O) O R <sup>1</sup> <sub>8</sub> C、  
 - N R <sup>1</sup> <sub>8</sub> A O R <sup>1</sup> <sub>8</sub> C、- O C X <sup>1</sup> <sub>8</sub> <sub>3</sub>、- O C H X <sup>1</sup> <sub>8</sub> <sub>2</sub>、 置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

R <sup>1</sup> <sub>6</sub> A、R <sup>1</sup> <sub>6</sub> B、R <sup>1</sup> <sub>6</sub> C、R <sup>1</sup> <sub>6</sub> D、R <sup>1</sup> <sub>7</sub> A、R <sup>1</sup> <sub>7</sub> B、R <sup>1</sup> <sub>7</sub> C、R <sup>1</sup>  
<sub>7</sub> D、R <sup>1</sup> <sub>8</sub> A、R <sup>1</sup> <sub>8</sub> B、R <sup>1</sup> <sub>8</sub> C、及びR <sup>1</sup> <sub>8</sub> D は、独立して、水素、ハロゲン、- C X <sub>3</sub>、- C N、- O H、- N H <sub>2</sub>、- C O O H、- C O N H <sub>2</sub>、- N O <sub>2</sub>、- S H、- S O <sub>3</sub> H、- S O <sub>4</sub> H、- S O <sub>2</sub> N H <sub>2</sub>、- N H N H <sub>2</sub>、- O N H <sub>2</sub>、- N H C (O) N H N H <sub>2</sub>、- N H C (O) N H <sub>2</sub>、- N H C (O) N H <sub>2</sub>、- N H S O <sub>2</sub> H、- N H C (O) H、- N H C (O) O H、- N H O H、- O C X <sub>3</sub>、- O C H X <sub>2</sub>、- C H X <sub>2</sub>、- C H <sub>2</sub> X、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

同一の窒素原子に結合した R <sup>1</sup> <sub>6</sub> A 置換基及び R <sup>1</sup> <sub>6</sub> B 置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；

同一の窒素原子に結合した R <sup>1</sup> <sub>7</sub> A 置換基及び R <sup>1</sup> <sub>7</sub> B 置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；及び

同一の窒素原子に結合した R <sup>1</sup> <sub>8</sub> A 置換基及び R <sup>1</sup> <sub>8</sub> B 置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；

X、X <sup>1</sup> <sub>6</sub>、X <sup>1</sup> <sub>7</sub>、及びX <sup>1</sup> <sub>8</sub> は、それぞれ独立して、- F、- C l、- B r、または- I であり；

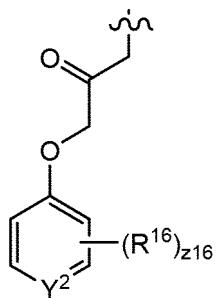
n <sub>1</sub> 6、n <sub>1</sub> 7、n <sub>1</sub> 8、v <sub>1</sub> 6、v <sub>1</sub> 7、及びv <sub>1</sub> 8 は、独立して、0 ~ 4 の整数であり；及び

m <sub>1</sub> 6、m <sub>1</sub> 7、及びm <sub>1</sub> 8 は、独立して、1 または 2 であるか；

または

E は、

## 【化8】



であり、ここで、

$R^{1-6}$ は、独立して、ハロゲン、 $-CX^{1-6}_3$ 、 $-CHX^{1-6}_2$ 、 $-CH_2X^{1-6}$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NHNH_2$ 、 $-ONH_2$ 、 $-NHC(O)NHNH_2$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NHSO_2H$ 、 $-NHC(O)H$ 、 $-NHC(O)OH$ 、 $-NHOH$ 、 $-OCX^{1-6}_3$ 、 $-OCHX^{1-6}_2$ 、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

$Y^2$ は、NまたはC Hであり；

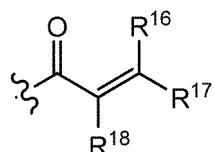
$z_{16}$ は、0～4の整数であり；及び

$X^{1-6}$ は、それぞれ独立して、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、または $-I$ であるか；

または

Eは、

## 【化9】



であり、ここで、

$R^{1-6}$ は、水素、ハロゲン、 $-CX^{1-6}_3$ 、 $-CHX^{1-6}_2$ 、 $-CH_2X^{1-6}$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n-1}R^{1-6}D$ 、 $-SO_vR^{1-6}NR^{1-6}AR^{1-6}B$ 、 $-NHNRR^{1-6}AR^{1-6}B$ 、 $-ONR^{1-6}AR^{1-6}B$ 、 $-NHC(O)NHNR^{1-6}AR^{1-6}B$ 、 $-NHC(O)NR^{1-6}AR^{1-6}B$ 、 $-C(O)R^{1-6}C$ 、 $-C(O)-OR^{1-6}C$ 、 $-C(O)NR^{1-6}AR^{1-6}B$ 、 $-OR^{1-6}D$ 、 $-NRR^{1-6}ASO_2R^{1-6}D$ 、 $-NR^{1-6}AC(O)R^{1-6}C$ 、 $-NR^{1-6}AC(O)OR^{1-6}C$ 、 $-NR^{1-6}AOR^{1-6}C$ 、 $-OCX^{1-6}_3$ 、 $-OCHX^{1-6}_2$ 、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

$R^{1-7}$ は、水素、ハロゲン、 $-CX^{1-7}_3$ 、 $-CHX^{1-7}_2$ 、 $-CH_2X^{1-7}$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n-1}R^{1-7}D$ 、 $-SO_vR^{1-7}NR^{1-7}AR^{1-7}B$ 、 $-NHNRR^{1-7}AR^{1-7}B$ 、 $-ONR^{1-7}AR^{1-7}B$ 、 $-NHC(O)NHNR^{1-7}AR^{1-7}B$ 、 $-NHC(O)NR^{1-7}AR^{1-7}B$ 、 $-C(O)R^{1-7}C$ 、 $-C(O)-OR^{1-7}C$ 、 $-C(O)NR^{1-7}AR^{1-7}B$ 、 $-OR^{1-7}D$ 、 $-NRR^{1-7}ASO_2R^{1-7}D$ 、 $-NR^{1-7}AC(O)R^{1-7}C$ 、 $-NR^{1-7}AC(O)OR^{1-7}C$ 、 $-NR^{1-7}AOR^{1-7}C$ 、 $-OCX^{1-7}_3$ 、 $-OCHX^{1-7}_2$ 、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

$R^{1-8}$  は、 $-CN$  であり；

$R^{1-6A}$ 、 $R^{1-6B}$ 、 $R^{1-6C}$ 、 $R^{1-6D}$ 、 $R^{1-7A}$ 、 $R^{1-7B}$ 、 $R^{1-7C}$ 、及び  
 $R^{1-7D}$  は、独立して、水素、ハロゲン、 $-CX_3$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-CO$   
 $OH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-$   
 $NHNH_2$ 、 $-ONH_2$ 、 $-NHC(O)NHNH_2$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NHS$   
 $O_2H$ 、 $-NHC(O)H$ 、 $-NHC(O)OH$ 、 $-NHOH$ 、 $-OCX_3$ 、 $-OCHX$   
 $_2$ 、 $-CHX_2$ 、 $-CH_2X$ 、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘ  
テロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシク  
ロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリー  
ルであり；

同一の窒素原子に結合した  $R^{1-6A}$  置換基及び  $R^{1-6B}$  置換基は、任意選択で連結され  
て、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘ  
テロアリールを形成し得；及び

同一の窒素原子に結合した  $R^{1-7A}$  置換基及び  $R^{1-7B}$  置換基は、任意選択で連結され  
て、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘ  
テロアリールを形成し得；

$X$ 、 $X^{1-6}$ 、及び  $X^{1-7}$  は、それぞれ独立して、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、または $-I$  あり；

$n^{1-6}$ 、 $n^{1-7}$ 、 $v^{1-6}$ 、及び  $v^{1-7}$  は、独立して、0 ~ 4 の整数であり；及び

$m^{1-6}$  及び  $m^{1-7}$  は、独立して、1 または 2 あり；

$Y$  は、 $N$  または  $CH$  あり；

$A$  環は、 $C_3-C_7$  シクロアルキルまたは 3 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルあり；

$R^1$  は、独立して、ハロゲン、 $-CX^{1-3}$ 、 $-CHX^{1-2}$ 、 $-CH_2X^{1-1}$ 、 $-CN$ 、 $-$   
 $SO_2Cl$ 、 $-SO_{n-1}R^{1-0}$ 、 $-SO_{v-1}NR^{7-8}$ 、 $-NHNH_2$ 、 $-ONR^{7-8}$ 、 $-NHC(O)NHNH_2$ 、 $-NHC(O)NR^{7-8}$ 、 $-N(O)m-1$ 、  
 $-NR^{7-8}$ 、 $-C(O)R^9$ 、 $-C(O)-OR^9$ 、 $-C(O)NR^{7-8}$ 、 $-OR^1$   
 $^0$ 、 $-NR^7SO_2R^{1-0}$ 、 $-NR^7C(O)R^9$ 、 $-NR^7C(O)OR^9$ 、 $-NR^7$   
 $OR^9$ 、 $-OCX^{1-3}$ 、 $-OCHX^{1-2}$ 、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは  
非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換の  
ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘ  
テロアリールあり；及び

2 つの隣接した  $R^1$  置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のシク  
ロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリ  
ル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；

$L^1$  は、結合、置換もしくは非置換のアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロアルキ  
レン、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアル  
キレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレ  
ンあり；

$L^2$  は、結合、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR^{7-8}$   
 $B-$ 、 $-NR^{7-8}C(O)-$ 、 $-C(O)NR^{7-8}B-$ 、 $-SO_2NR^{7-8}B-$ 、 $-NR^{7-8}B$   
 $SO_2-$ 、 $-OC(O)NR^{7-8}B-$ 、 $-NR^{7-8}C(O)O-$ 、 $-CR^{9-8}B=NO-$ 、 $-$   
 $ON=CR^{9-8}B-$ 、 $-NR^{8-7}B$ 、 $-NR^{7-8}C(O)NR^{7-8}B-$ 、 $-NR^{8-7}B$ 、 $C(=NR^{1-0}B)NR$   
 $7-8B-$ 、 $-NR^{8-7}B$ 、 $C(=NR^{1-0}B)-$ 、 $-C(=NR^{1-0}B)NR^{7-8}B-$ 、 $-OC($   
 $=NR^{1-0}B)-$ 、 $-C(=NR^{1-0}B)O-$ 、置換もしくは非置換のアルキレン、置換  
もしくは非置換のヘテロアルキレン、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換も  
しくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換  
もしくは非置換のヘテロアリーレンあり；

$L^4$  は、結合、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR^{4-8}$   
 $-$ 、 $-NR^{4-8}C(O)-$ 、 $-C(O)NR^{4-8}-$ 、 $-SO_2NR^{4-8}-$ 、 $-NR^{4-8}SO_2-$ 、  
 $-OC(O)NR^{4-8}-$ 、 $-NR^{4-8}C(O)O-$ 、置換もしくは非置換の  $C_1-C_3$  アルキ

レン、または置換もしくは非置換の2～3員ヘテロアルキレンであり；

$R^2$  は、独立して、オキソ、ハロゲン、 $-CX_3^2$ 、 $-CHX_2^2$ 、 $-CH_2X^2$ 、 $-CN$ 、 $-SO_2Cl$ 、 $-SO_{n2}R^{14}$ 、 $-SO_{v2}NR^{11}R^{12}$ 、 $-NHNR^{11}R^{12}$ 、 $-NHC(O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-NHC(=O)NHNR^{11}R^{12}$ 、 $-NHC(O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-N(O)m_2$ 、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-C(O)R^{14}$ 、 $-C(O)-OR^{14}$ 、 $-C(O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-NR^{11}SO_2R^{15}$ 、 $-NR^{11}C(O)R^{14}$ 、 $-NR^{11}OR^{14}$ 、 $-OCX_3^2$ 、 $-OCHX_2^2$ 、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；及び

2つの隣接した $R^2$ 置換基、または同一の原子に結合した2つの $R^2$ 置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキルを形成し得；

$R^4$  は、独立して、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

$R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{7B}$ 、 $R^{8B}$ 、 $R^{9B}$ 、 $R^{10B}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{14}$ 、及び $R^{15}$ は、独立して、水素、ハロゲン、 $-CX_3$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_2Cl$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NH_2NH_2$ 、 $-ONH_2$ 、 $-NHC(O)NH_2NH_2$ 、 $-NH_2C(O)NH_2$ 、 $-NHSO_2H$ 、 $-NHC(O)H$ 、 $-NHC(O)OH$ 、 $-NHOH$ 、 $-OCX_3$ 、 $-OCHX_2$ 、 $-CHX_2$ 、 $-CH_2X$ 、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

同一の窒素原子に結合した $R^7$ 置換基及び $R^8$ 置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；及び

同一の窒素原子に結合した $R^{11}$ 置換基及び $R^{12}$ 置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；

$X$ 、 $X^1$ 、及び $X^2$ は、それぞれ独立して、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、または $-I$ であり；

$n1$ 、 $n2$ 、 $v1$ 、及び $v2$ は、独立して、0～4の整数であり；

$m1$ 及び $m2$ は、独立して、1または2であり；

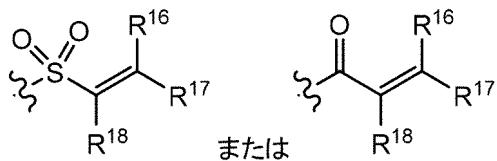
$z1$ は、独立して、0～5の整数であり；ならびに

$z2$ は、独立して、0～10の整数であり、

ここで、

Eが、

【化10】



である場合には、

$L^1$ は、結合、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレンであり；

$L^2$  は、結合、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR^7_B-$ 、 $-NR^{7_B}C(O)-$ 、 $-C(O)NR^{7_B}-$ 、 $-SO_2NR^{7_B}-$ 、 $-NR^{7_B}$ 、 $-SO_2-$ 、 $-OC(O)NR^{7_B}-$ 、 $-NR^{7_B}C(O)O-$ 、 $-CR^{9_B}=NO-$ 、 $-ON=CR^{9_B}-$ 、 $-NR^{8_B}C(O)NR^{7_B}-$ 、 $-NR^{8_B}C(=NR^{10_B})NR^{7_B}-$ 、 $-NR^{8_B}C(=NR^{10_B})-$ 、 $-C(=NR^{10_B})NR^{7_B}-$ 、 $-OC(=NR^{10_B})-$ 、 $-C(=NR^{10_B})O-$ 、置換もしくは非置換のアルキレン、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレンであり；及び

$L^4$  は、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR^4C(O)-$ 、 $-C(O)NR^4-$ 、 $-SO_2NR^4-$ 、 $-NR^4SO_2-$ 、 $-OC(O)NR^4-$ 、 $-NR^4C(O)O-$ 、置換もしくは非置換の  $C_1-C_3$  アルキレン、または置換もしくは非置換の 2～3員ヘテロアルキレンである。】

を有する、請求項 1 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

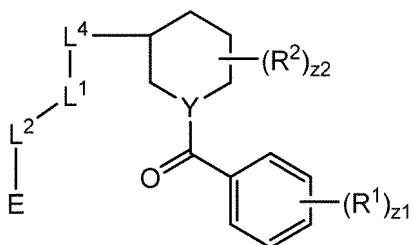
### 【請求項 3】

Y が N である、請求項 2 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

### 【請求項 4】

式：

### 【化 1 1】

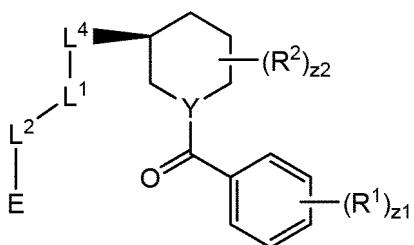


を有する、請求項 2 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

### 【請求項 5】

式：

### 【化 1 2】



を有する、請求項 2 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

### 【請求項 6】

$R^1$  は、それぞれ独立して、ハロゲン、 $-CX^{1_3}$ 、 $-CHX^{1_2}$ 、 $-CH_2X^1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{v_1}NR^{7_B}R^8$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR^{7_B}R^8$ 、 $-C(O)R^9$ 、 $-C(O)-OR^9$ 、 $-C(O)NR^{7_B}R^8$ 、 $-OR^{10}$ 、 $-NR^{7_B}C(O)R^9$ 、 $-NR^{7_B}C(O)OR^9$ 、 $-OCX^{1_3}$ 、 $-OCHX^{1_2}$ 、置換もしくは非置換の  $C_1-C_8$  アルキル、置換もしくは非置換の  $C_3-C_8$  シクロアルキル、置換もしくは非置換の 3～8員ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換の  $C_6-C_{10}$  アリール、または置換もしくは非置換の 5～10員ヘテロアリールであり；

$R^7$  は、水素、 $R^{4-8}$  で置換されるかもしくは非置換の  $C_1-C_8$  アルキル、 $R^{4-8}$  で置換されるかもしくは非置換の  $C_3-C_8$  シクロアルキル、 $R^{4-8}$  で置換されるかもしくは非置換の 3～8員ヘテロシクロアルキル、 $R^{4-8}$  で置換されるかもしくは非置換の  $C$

$C_6 - C_{10}$  アリール、または  $R^{4-8}$  で置換されるかもしくは非置換の 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり、

ここで、 $R^{4-8}$  は、ハロゲン、 $-CX^{4-8}_3$ 、 $-CHX^{4-8}_2$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NHC(O)OH$ 、 $-O CX^{4-8}_3$ 、 $-O CHX^{4-8}_2$ 、または $-OCH_2X^{4-8}$  であり、 $X^{4-8}$  は、ハロゲンであり；

$R^8$  は、水素、 $R^{5-1}$  で置換されるかもしくは非置換の  $C_1 - C_8$  アルキル、 $R^{5-1}$  で置換されるかもしくは非置換の  $C_3 - C_8$  シクロアルキル、 $R^{5-1}$  で置換されるかもしくは非置換の 3 ~ 8 員ヘテロシクロアルキル、 $R^{5-1}$  で置換されるかもしくは非置換の  $C_6 - C_{10}$  アリール、または  $R^{5-1}$  で置換されるかもしくは非置換の 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり、

ここで、 $R^{5-1}$  は、ハロゲン、 $-CX^{5-1}_3$ 、 $-CHX^{5-1}_2$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NHC(O)OH$ 、 $-O CX^{5-1}_3$ 、 $-O CHX^{5-1}_2$ 、または $-OCH_2X^{5-1}$  であり、 $X^{5-1}$  は、ハロゲンであり；

$R^9$  は、水素、 $R^{5-4}$  で置換されるかもしくは非置換の  $C_1 - C_8$  アルキル、 $R^{5-4}$  で置換されるかもしくは非置換の  $C_3 - C_8$  シクロアルキル、 $R^{5-4}$  で置換されるかもしくは非置換の 3 ~ 8 員ヘテロシクロアルキル、 $R^{5-4}$  で置換されるかもしくは非置換の  $C_6 - C_{10}$  アリール、または  $R^{5-4}$  で置換されるかもしくは非置換の 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり、

ここで、 $R^{5-4}$  は、ハロゲン、 $-CX^{5-4}_3$ 、 $-CHX^{5-4}_2$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NHC(O)OH$ 、 $-O CX^{5-4}_3$ 、 $-O CHX^{5-4}_2$ 、または $-OCH_2X^{5-4}$  であり、 $X^{5-4}$  は、ハロゲンであり；ならびに

$R^{1-0}$  は、水素、 $R^{5-7}$  で置換されるかもしくは非置換の  $C_1 - C_8$  アルキル、 $R^{5-7}$  で置換されるかもしくは非置換の  $C_3 - C_8$  シクロアルキル、 $R^{5-7}$  で置換されるかもしくは非置換の 3 ~ 8 員ヘテロシクロアルキル、 $R^{5-7}$  で置換されるかもしくは非置換の  $C_6 - C_{10}$  アリール、または  $R^{5-7}$  で置換されるかもしくは非置換の 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり、

ここで、 $R^{5-7}$  は、ハロゲン、 $-CX^{5-7}_3$ 、 $-CHX^{5-7}_2$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NHC(O)OH$ 、 $-O CX^{5-7}_3$ 、 $-O CHX^{5-7}_2$ 、または $-OCH_2X^{5-7}$  であり、 $X^{5-7}$  は、ハロゲンである、

請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

### 【請求項 7】

$R^1$  が、それぞれ独立して、ハロゲン、 $-CX^{1-3}_3$ 、 $-CHX^{1-2}_2$ 、 $-CH_2X^{1-1}$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NHNH_2$ 、 $-ONH_2$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NHSO_2H$ 、 $-NHC(O)H$ 、 $-NHC(O)OH$ 、 $-NHOH$ 、 $-O CX^{1-3}_3$ 、 $-O CHX^{1-2}_2$ 、置換もしくは非置換の  $C_1 - C_6$  アルキル、置換もしくは非置換の 2 ~ 6 員ヘテロアルキル、置換もしくは非置換の  $C_3 - C_8$  シクロアルキル、置換もしくは非置換の 3 ~ 8 員ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換の  $C_6$  アリール、または置換もしくは非置換の 5 ~ 6 員ヘテロアリールである、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

### 【請求項 8】

$R^1$  が、独立して、ハロゲン、 $-CX^{1-3}_3$ 、 $-CHX^{1-2}_2$ 、 $-CH_2X^{1-1}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-COOH$ 、 $-O CX^{1-3}_3$ 、 $-O CHX^{1-2}_2$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-SCH_3$ 、または $-SC_2CH_3$  である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

### 【請求項 9】

$z_1$  が、2 または 3 である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 1 0】

$R^2$  が、それぞれ独立して、オキソ、ハロゲン、 $-CX^{2-}_3$ 、 $-CHX^{2-}_2$ 、 $-CH_2X^{2-}$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NHNH_2$ 、 $-ONH_2$ 、 $-NHC(O)NH$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NHSO_2H$ 、 $-NHC(O)H$ 、 $-NHC(O)OH$ 、 $-NHOH$ 、 $-OCX^{2-}_3$ 、 $-OCHX^{2-}_2$ 、置換もしくは非置換の  $C_1$  ~  $C_6$  アルキル、置換もしくは非置換の 2 ~ 6 員ヘテロアルキル、置換もしくは非置換の  $C_3$  ~  $C_8$  シクロアルキル、置換もしくは非置換の 3 ~ 8 員ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換の  $C_6$  アリール、または置換もしくは非置換の 5 ~ 6 員ヘテロアリールである、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 1 1】

$R^2$  が、それぞれ独立して、オキソ、ハロゲン、 $-CX^{2-}_3$ 、 $-CHX^{2-}_2$ 、 $-CH_2X^{2-}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-OCX^{2-}_3$ 、 $-OCHX^{2-}_2$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-SCH_3$ 、または  $-SCH_2CH_3$  である、請求項 1 0 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 1 2】

$z_2$  が 0 である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 1 3】

$L^1$  が、結合、置換もしくは非置換のアルキレン、または置換もしくは非置換のヘテロアルキレンである、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 1 4】

$L^1$  が、結合、非置換の  $C_1$  ~  $C_4$  アルキレン、または非置換の 2 ~ 4 員ヘテロアルキレンである、請求項 1 3 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 1 5】

$L^1$  が結合である、請求項 1 4 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 1 6】

$L^2$  が、結合、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NH-$ 、 $-NHC(O)-$ 、 $-C(O)NH-$ 、 $-SO_2NH-$ 、 $-NHSO_2-$ 、 $-OOC(O)NH-$ 、 $-NHC(O)O-$ 、 $-NHC(O)NH-$ 、置換もしくは非置換のアルキレン、または置換もしくは非置換のヘテロアルキレンである、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 1 7】

$L^2$  が、結合、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-NH-$ 、 $-NHC(O)-$ 、 $-C(O)NH-$ 、非置換の  $C_1$  ~  $C_4$  アルキレン、または非置換の 2 ~ 4 員ヘテロアルキレンである、請求項 1 6 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 1 8】

$L^2$  が、 $-NH-$ 、結合、または  $-CH_2-$  である、請求項 1 7 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 1 9】

$L^4$  が、結合、非置換の  $C_1$  ~  $C_3$  アルキレン、または非置換の 2 ~ 3 員ヘテロアルキレンである、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 2 0】

$L^4$  が  $-CH_2-$  である、請求項 1 9 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

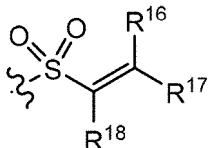
【請求項 2 1】

$L^4$  が  $-CH_2-$  であり、 $L^1$  が結合であり、及び  $L^2$  が  $-NH-$  である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 2 2】

E が、

【化 1 3】



であり、

$R^{16}$ 、 $R^{17}$  及び  $R^{18}$  が、水素である、

請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

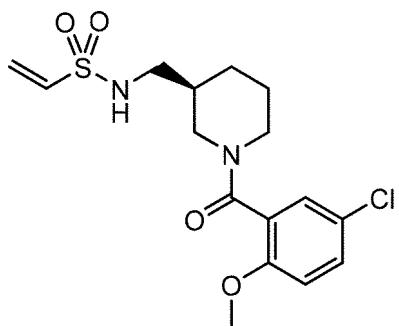
【請求項 2 3】

$L^4$  が  $-CH_2-$  であり、 $L^1$  が結合であり、及び  $L^2$  が  $-NH-$  である、請求項 2 2 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 2 4】

化合物が、

【化 1 4】

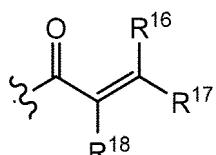


である、請求項 2 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 2 5】

E が、

【化 1 5】



である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 2 6】

$L^4$  が  $-CH_2-$  であり、 $L^1$  が結合であり、及び  $L^2$  が  $-NH-$  である、請求項 2 5 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 2 7】

$R^{16}$  が、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換の 6 員ヘテロアリールである、請求項 2 5 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 2 8】

$R^{17}$  が、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換の 6 員ヘテロアリールである、請求項 2 5 に記載の化合物またはそ

の医薬的に許容可能な塩。

【請求項 29】

$R^{16}$  が水素であり、及び

$R^{17}$  が、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールである、請求項 25 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 30】

$R^{17}$  が、水素、 $R^{7-8}$  で置換されるかもしくは非置換の  $C_1-C_8$  アルキル、 $R^{7-8}$  で置換されるかもしくは非置換の  $C_3-C_8$  シクロアルキル、 $R^{7-8}$  で置換されるかもしくは非置換の 3~8 員ヘテロシクロアルキル、 $R^{7-8}$  で置換されるかもしくは非置換の  $C_6-C_{10}$  アリール、または  $R^{7-8}$  で置換されるかもしくは非置換の 6 員ヘテロアリールであり；

$R^{7-8}$  が、それぞれ独立して、オキソ、ハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-COOH、-CONH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-SH、-SO<sub>3</sub>H、-SO<sub>4</sub>H、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-NHC(O)-OH、-OCX<sup>7-8</sup><sub>3</sub>、-OCH<sub>2</sub>X<sup>7-8</sup><sub>2</sub>、 $R^{7-9}$  で置換されるかもしくは非置換のアルキル、 $R^{7-9}$  で置換されるかもしくは非置換のシクロアルキル、または  $R^{7-9}$  で置換されるかもしくは非置換のヘテロシクロアルキルであり；

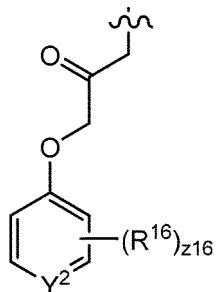
$R^{7-9}$  が、独立して、オキソ、ハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-OCX<sup>7-9</sup><sub>3</sub>、-OCH<sub>2</sub>X<sup>7-9</sup><sub>2</sub>、-OCH<sub>2</sub>X<sup>7-9</sup><sub>1</sub>、または非置換のアルキルであり；ならびに

$X^{7-8}$  及び  $X^{7-9}$  が、独立して、ハロゲンである、請求項 25 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 31】

E が、

【化 16】



である、請求項 1~5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 32】

$R^{16}$  が、それぞれ独立して、ハロゲンである、請求項 11 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 33】

$R^{16}$  が、それぞれ独立して、-F である、請求項 11 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 34】

$z_{16}$  が 4 である、請求項 31 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

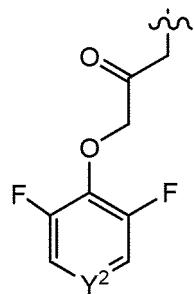
【請求項 35】

$z_{16}$  が 2 である、請求項 31 に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 36】

E が、

## 【化17】



である、請求項31に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

## 【請求項37】

$Y^2$  が  $C\ H$  である、請求項31に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

## 【請求項38】

$Y^2$  が  $N$  である、請求項31に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

## 【請求項39】

$L^4$  が  $-N(R^4)C(O)-$  である、請求項31に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

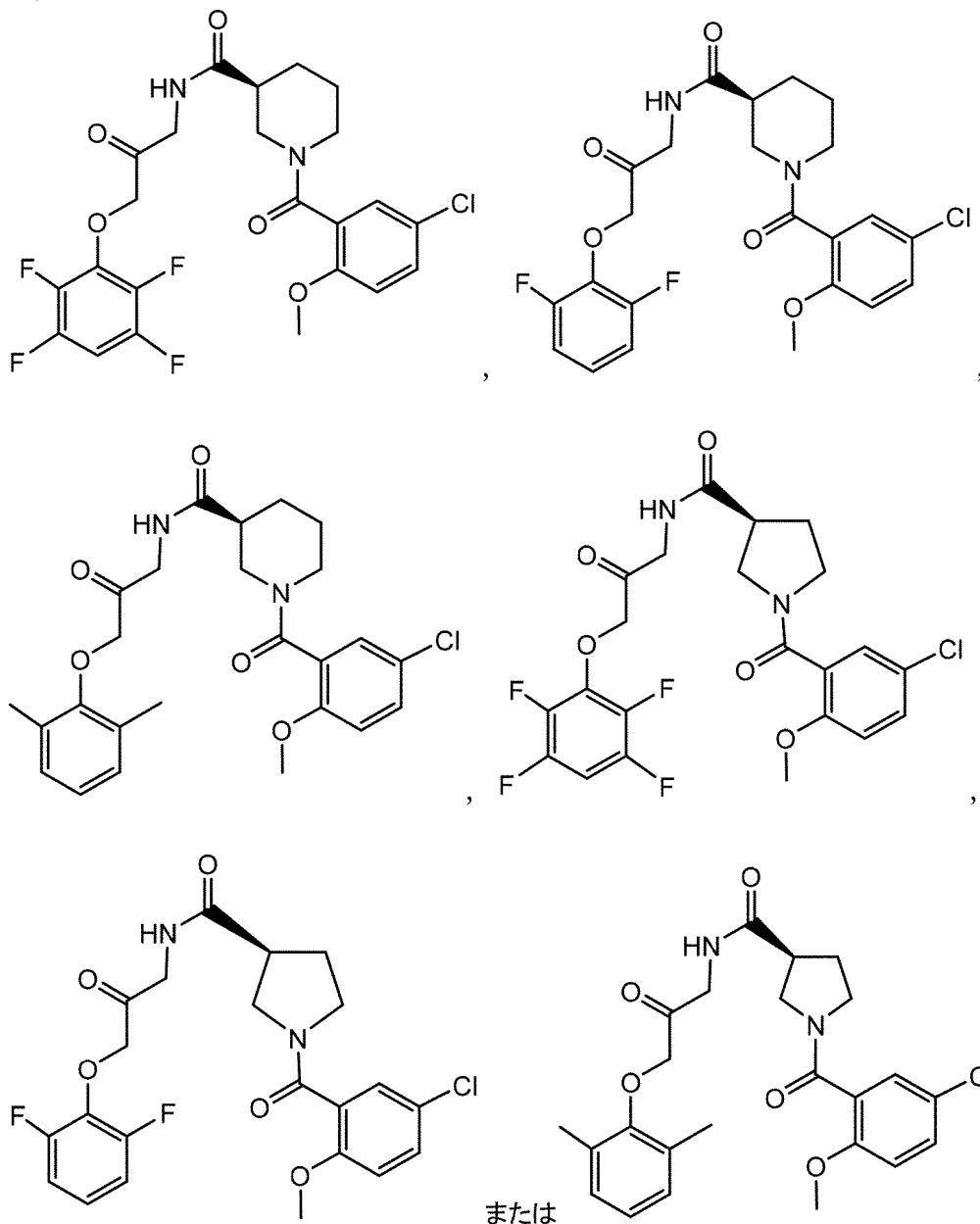
## 【請求項40】

$R^4$  が水素である、請求項39に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

## 【請求項41】

化合物が、

## 【化18】



である、請求項2に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

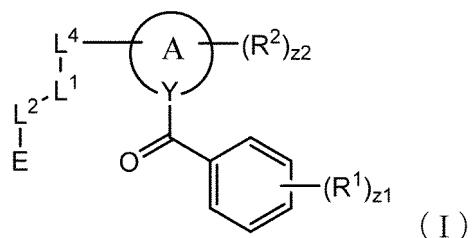
## 【請求項42】

請求項1～41のいずれか1項に記載の化合物またはその医薬的に許容可能な塩、及び医薬的に許容可能な添加剤を含む、医薬組成物。

## 【請求項43】

K-Rasタンパク質の活性レベルを低減させるための医薬組成物であって、式：

## 【化19】



[式中、

Yが、NまたはC Hであり；

A 環が、C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub> シクロアルキルまたは3 ~ 7員ヘテロシクロアルキルであり；R<sup>1</sup> が、独立して、ハロゲン、-CX<sup>1</sup><sub>3</sub>、-CHX<sup>1</sup><sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>X<sup>1</sup>、-CN、-SO<sub>2</sub>C<sub>1</sub>、-SON<sub>n</sub><sub>1</sub>R<sup>1</sup><sub>0</sub>、-SO<sub>v</sub><sub>1</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NHNR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-ONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NHC=(O)NHNR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NHC(O)NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-N(O)<sub>m</sub><sub>1</sub>、-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-C(O)R<sup>9</sup>、-C(O)-OR<sup>9</sup>、-C(O)NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-OR<sup>1</sup><sub>0</sub>、-NR<sup>7</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>1</sup><sub>0</sub>、-NR<sup>7</sup>C(O)R<sup>9</sup>、-NR<sup>7</sup>C(O)OR<sup>9</sup>、-NR<sup>7</sup>OR<sup>9</sup>、-OCX<sup>1</sup><sub>3</sub>、-OCHX<sup>1</sup><sub>2</sub>、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；及び

2つの隣接したR<sup>1</sup>置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；

L<sup>1</sup> が、結合、置換もしくは非置換のアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレンであり；

L<sup>2</sup> が、結合、-O-、-C(O)-、-S-、-SO-、-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-NR<sup>7</sup><sub>B</sub>C(O)-、-C(O)NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-NR<sup>7</sup><sub>B</sub>SO<sub>2</sub>-、-OC(O)NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-NR<sup>7</sup><sub>B</sub>C(O)O-、-CR<sup>9</sup><sub>B</sub>=NO-、-ON=CR<sup>9</sup><sub>B</sub>-、-NR<sup>8</sup><sub>B</sub>C(O)NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-NR<sup>8</sup><sub>B</sub>C(=NR<sup>1</sup><sub>0</sub><sub>B</sub>)NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-NR<sup>8</sup><sub>B</sub>C(=NR<sup>1</sup><sub>0</sub><sub>B</sub>)-、-C(=NR<sup>1</sup><sub>0</sub><sub>B</sub>)NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-OC(=NR<sup>1</sup><sub>0</sub><sub>B</sub>)-、-C(=NR<sup>1</sup><sub>0</sub><sub>B</sub>)O-、置換もしくは非置換のアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレンであり；

L<sup>4</sup> が、結合、-O-、-C(O)-、-S-、-SO-、-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sup>4</sup>-、-NR<sup>4</sup>C(O)-、-C(O)NR<sup>4</sup>-、-SO<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>-、-NR<sup>4</sup>SO<sub>2</sub>-、-OC(O)NR<sup>4</sup>-、-NR<sup>4</sup>C(O)O-、置換もしくは非置換のC<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキレン、または置換もしくは非置換の2 ~ 3員ヘテロアルキレンであり；

E が、求電子性部分であり；

R<sup>2</sup> が、独立して、オキソ、ハロゲン、-CX<sup>2</sup><sub>3</sub>、-CHX<sup>2</sup><sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>X<sup>2</sup>、-CN、-SO<sub>2</sub>C<sub>1</sub>、-SON<sub>n</sub><sub>2</sub>R<sup>1</sup><sub>4</sub>、-SO<sub>v</sub><sub>2</sub>NR<sup>1</sup><sub>1</sub>R<sup>1</sup><sub>2</sub>、-NHNR<sup>1</sup><sub>1</sub>R<sup>1</sup><sub>2</sub>、-ONR<sup>1</sup><sub>1</sub>R<sup>1</sup><sub>2</sub>、-NHC=(O)NHNR<sup>1</sup><sub>1</sub>R<sup>1</sup><sub>2</sub>、-NHC(O)NR<sup>1</sup><sub>1</sub>R<sup>1</sup><sub>2</sub>、-N(O)<sub>m</sub><sub>2</sub>、-NR<sup>1</sup><sub>1</sub>R<sup>1</sup><sub>2</sub>、-C(O)R<sup>1</sup><sub>4</sub>、-C(O)-OR<sup>1</sup><sub>4</sub>、-C(O)NR<sup>1</sup><sub>1</sub>R<sup>1</sup><sub>2</sub>、-OR<sup>1</sup><sub>5</sub>、-NR<sup>1</sup><sub>1</sub>SO<sub>2</sub>R<sup>1</sup><sub>5</sub>、-NR<sup>1</sup><sub>1</sub>C(O)R<sup>1</sup><sub>4</sub>、-NR<sup>1</sup><sub>1</sub>C(O)OR<sup>1</sup><sub>4</sub>、-NR<sup>1</sup><sub>1</sub>OR<sup>1</sup><sub>4</sub>、-OCX<sup>2</sup><sub>3</sub>、-OCHX<sup>2</sup><sub>2</sub>、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；及び

2つの隣接したR<sup>2</sup>置換基、または同一の原子に結合した2つのR<sup>2</sup>置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のシクロアルキルまたは置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキルを形成し得；

R<sup>4</sup> が、独立して、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>1</sup><sub>0</sub>、R<sup>7</sup><sub>B</sub>、R<sup>8</sup><sub>B</sub>、R<sup>9</sup><sub>B</sub>、R<sup>1</sup><sub>0</sub><sub>B</sub>、R<sup>1</sup><sub>1</sub>、R<sup>1</sup><sub>2</sub>、R<sup>1</sup><sub>4</sub>、及びR<sup>1</sup><sub>5</sub> が、独立して、水素、ハロゲン、-CX<sub>3</sub>、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-COOH、-CONH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-SH、-SO<sub>2</sub>C<sub>1</sub>、-SO<sub>3</sub>H、-SO<sub>4</sub>

H、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-NHNH<sub>2</sub>、-ONH<sub>2</sub>、-NHC(O)NHNH<sub>2</sub>、-NHC(O)NH<sub>2</sub>、-NHSO<sub>2</sub>H、-NHC(O)H、-NHC(O)OH、-NHOH、-OCX<sub>3</sub>、-OCHX<sub>2</sub>、-CHX<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>X、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

同一の窒素原子に結合したR<sup>7</sup>及びR<sup>8</sup>置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；及び

同一の窒素原子に結合したR<sup>11</sup>及びR<sup>12</sup>置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；

X、X<sup>1</sup>、及びX<sup>2</sup>が、それぞれ独立して、-F、-Cl、-Br、または-Iであり；

n<sub>1</sub>、n<sub>2</sub>、v<sub>1</sub>、及びv<sub>2</sub>が、独立して、0～4の整数であり；

m<sub>1</sub>及びm<sub>2</sub>が、独立して、1または2であり；

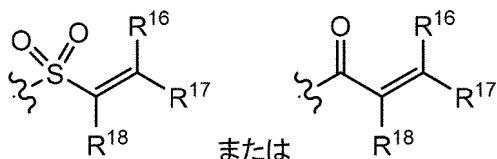
z<sub>1</sub>が、独立して、0～5の整数であり；ならびに

z<sub>2</sub>が、独立して、0～10の整数であり、

ここで、

Eが、

【化20】



である場合には、

L<sup>1</sup>が、結合、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレンであり；

L<sup>2</sup>が、結合、-O-、-C(O)-、-S-、-SO-、-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-NR<sup>7</sup><sub>B</sub>C(O)-、-C(O)NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-NR<sup>7</sup><sub>B</sub>SO<sub>2</sub>-、-OC(O)NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-NR<sup>7</sup><sub>B</sub>C(O)O-、-CR<sup>9</sup><sub>B</sub>=NO-、-ON=CR<sup>9</sup><sub>B</sub>-、-NR<sup>8</sup><sub>B</sub>C(O)NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-NR<sup>8</sup><sub>B</sub>C(=NR<sup>10</sup><sub>B</sub>)NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-NR<sup>8</sup><sub>B</sub>C(=NR<sup>10</sup><sub>B</sub>)-、-C(=NR<sup>10</sup><sub>B</sub>)NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-OC(=NR<sup>10</sup><sub>B</sub>)-、-C(=NR<sup>10</sup><sub>B</sub>)O-、置換もしくは非置換のアルキレン、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレンであり；及び

L<sup>4</sup>が、-O-、-C(O)-、-S-、-SO-、-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sup>4</sup>C(O)-、-C(O)NR<sup>4</sup>-、-SO<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>-、-NR<sup>4</sup>SO<sub>2</sub>-、-OC(O)NR<sup>4</sup>-、-NR<sup>4</sup>C(O)O-、置換もしくは非置換のC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキレン、または置換もしくは非置換の2～3員ヘテロアルキレンである。】

を有する化合物またはその医薬的に許容可能な塩を含む、前記医薬組成物。

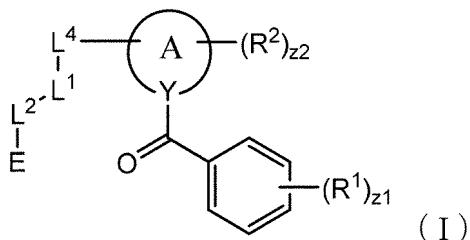
【請求項44】

前記K-Rasタンパク質が、K-Ras-4Bである、請求項43に記載の医薬組成物。

【請求項45】

K-Rasタンパク質の活性レベルを低減させるための医薬組成物であつて、式：

【化21】



[式中、

Yが、NまたはCHであり；

A環が、C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>シクロアルキルまたは3~7員ヘテロシクロアルキルであり；

R<sup>1</sup>が、独立して、ハロゲン、-CX<sup>1</sup><sub>3</sub>、-CHX<sup>1</sup><sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>X<sup>1</sup>、-CN、-SO<sub>2</sub>C<sub>1</sub>、-SO<sub>n</sub><sub>1</sub>R<sup>1</sup><sub>0</sub>、-SO<sub>v</sub><sub>1</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NHNR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-ONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NHC=(O)NHNR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NHC(O)NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-N(O)<sub>m</sub><sub>1</sub>、-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-C(O)R<sup>9</sup>、-C(O)-OR<sup>9</sup>、-C(O)NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-OR<sup>1</sup><sub>0</sub>、-NR<sup>7</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>1</sup><sub>0</sub>、-NR<sup>7</sup>C(O)R<sup>9</sup>、-NR<sup>7</sup>C(O)OR<sup>9</sup>、-NR<sup>7</sup>OR<sup>9</sup>、-OCX<sup>1</sup><sub>3</sub>、-OCHX<sup>1</sup><sub>2</sub>、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；及び

2つの隣接したR<sup>1</sup>置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；

L<sup>1</sup>が、結合、置換もしくは非置換のアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレンであり；

L<sup>2</sup>が、結合、-O-、-C(O)-、-S-、-SO-、-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-NR<sup>7</sup><sub>B</sub>C(O)-、-C(O)NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-NR<sup>7</sup><sub>B</sub>SO<sub>2</sub>-、-OC(O)NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-NR<sup>7</sup><sub>B</sub>C(O)O-、-CR<sup>9</sup><sub>B</sub>=NO-、-ON=CR<sup>9</sup><sub>B</sub>-、-NR<sup>8</sup><sub>B</sub>C(O)NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-NR<sup>8</sup><sub>B</sub>C(=NR<sup>1</sup><sub>0</sub><sub>B</sub>)NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-NR<sup>8</sup><sub>B</sub>C(=NR<sup>1</sup><sub>0</sub><sub>B</sub>)-、-C(=NR<sup>1</sup><sub>0</sub><sub>B</sub>)NR<sup>7</sup><sub>B</sub>-、-OC(=NR<sup>1</sup><sub>0</sub><sub>B</sub>)-、-C(=NR<sup>1</sup><sub>0</sub><sub>B</sub>)O-、置換もしくは非置換のアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレンであり；

L<sup>4</sup>が、結合、-O-、-C(O)-、-S-、-SO-、-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sup>4</sup>-、-NR<sup>4</sup>C(O)-、-C(O)NR<sup>4</sup>-、-SO<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>-、-NR<sup>4</sup>SO<sub>2</sub>-、-OC(O)NR<sup>4</sup>-、-NR<sup>4</sup>C(O)O-、置換もしくは非置換のC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキレン、または置換もしくは非置換の2~3員ヘテロアルキレンであり；

Eが、求電子性部分であり；

R<sup>2</sup>が、独立して、オキソ、ハロゲン、-CX<sup>2</sup><sub>3</sub>、-CHX<sup>2</sup><sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>X<sup>2</sup>、-CN、-SO<sub>2</sub>C<sub>1</sub>、-SO<sub>n</sub><sub>2</sub>R<sup>1</sup><sub>4</sub>、-SO<sub>v</sub><sub>2</sub>NR<sup>1</sup><sub>1</sub>R<sup>1</sup><sub>2</sub>、-NHNR<sup>1</sup><sub>1</sub>R<sup>1</sup><sub>2</sub>、-ONR<sup>1</sup><sub>1</sub>R<sup>1</sup><sub>2</sub>、-NHC=(O)NHNR<sup>1</sup><sub>1</sub>R<sup>1</sup><sub>2</sub>、-NHC(O)NR<sup>1</sup><sub>1</sub>R<sup>1</sup><sub>2</sub>、-N(O)<sub>m</sub><sub>2</sub>、-NR<sup>1</sup><sub>1</sub>R<sup>1</sup><sub>2</sub>、-C(O)R<sup>1</sup><sub>4</sub>、-C(O)-OR<sup>1</sup><sub>4</sub>、-C(O)NR<sup>1</sup><sub>1</sub>R<sup>1</sup><sub>2</sub>、-OR<sup>1</sup><sub>5</sub>、-NR<sup>1</sup><sub>1</sub>SO<sub>2</sub>R<sup>1</sup><sub>5</sub>、-NR<sup>1</sup><sub>1</sub>C(O)OR<sup>1</sup><sub>4</sub>、-NR<sup>1</sup><sub>1</sub>OR<sup>1</sup><sub>4</sub>、-OCX<sup>2</sup><sub>3</sub>、-OCHX<sup>2</sup><sub>2</sub>、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；及び

2つの隣接したR<sup>2</sup>置換基、または同一の原子に結合した2つのR<sup>2</sup>置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキルを形成し得；

R<sup>4</sup>が、独立して、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>7B</sup>、R<sup>8B</sup>、R<sup>9B</sup>、R<sup>10B</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>14</sup>、及びR<sup>15</sup>が、独立して、水素、ハロゲン、-CX<sub>3</sub>、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-COOH、-CONH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-SH、-SO<sub>2</sub>Cl、-SO<sub>3</sub>H、-SO<sub>4</sub>H、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-NHNH<sub>2</sub>、-ONH<sub>2</sub>、-NHC(O)NHNH<sub>2</sub>、-NHC(O)NH<sub>2</sub>、-NHSO<sub>2</sub>H、-NHC(O)H、-NHC(O)OH、-NHOH、-OCX<sub>3</sub>、-OCHX<sub>2</sub>、-CHX<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>X、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

同一の窒素原子に結合したR<sup>7</sup>及びR<sup>8</sup>置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；及び

同一の窒素原子に結合したR<sup>11</sup>及びR<sup>12</sup>置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；

X、X<sup>1</sup>、及びX<sup>2</sup>が、それぞれ独立して、-F、-Cl、-Br、または-Iであり；

n<sub>1</sub>、n<sub>2</sub>、v<sub>1</sub>、及びv<sub>2</sub>が、独立して、0～4の整数であり；

m<sub>1</sub>及びm<sub>2</sub>が、独立して、1または2であり；

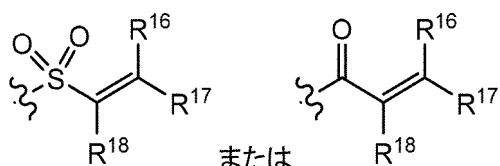
z<sub>1</sub>が、独立して、0～5の整数であり；ならびに

z<sub>2</sub>が、独立して、0～10の整数であり、

ここで、

Eが、

【化22】



である場合には、

L<sup>1</sup>が、結合、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレンであり；

L<sup>2</sup>が、結合、-O-、-C(O)-、-S-、-SO-、-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sup>7</sup>B-、-NR<sup>7B</sup>C(O)-、-C(O)NR<sup>7B</sup>-、-SO<sub>2</sub>NR<sup>7B</sup>-、-NR<sup>7B</sup>SO<sub>2</sub>-、-OC(O)NR<sup>7B</sup>-、-NR<sup>7B</sup>C(O)O-、-CR<sup>9B</sup>=NO-、-ON=CR<sup>9B</sup>-、-NR<sup>8B</sup>C(O)NR<sup>7B</sup>-、-NR<sup>8B</sup>C(=NR<sup>10B</sup>)NR<sup>7B</sup>-、-NR<sup>8B</sup>C(=NR<sup>10B</sup>)-、-C(=NR<sup>10B</sup>)NR<sup>7B</sup>-、-OC(=NR<sup>10B</sup>)-、-C(=NR<sup>10B</sup>)O-、置換もしくは非置換のアルキレン、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレンであり；及び

L<sup>4</sup>が、-O-、-C(O)-、-S-、-SO-、-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sup>4</sup>C(O)

) - 、 - C (O) NR<sup>4</sup> - 、 - SO<sub>2</sub> NR<sup>4</sup> - 、 - NR<sup>4</sup> SO<sub>2</sub> - 、 - OC (O) NR<sup>4</sup> - 、 - NR<sup>4</sup> C (O) O - 、 置換もしくは非置換の C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキレン、または置換もしくは非置換の 2 ~ 3 員ヘテロアルキレンである。]

を有する化合物またはその医薬的に許容可能な塩を含む、前記医薬組成物。

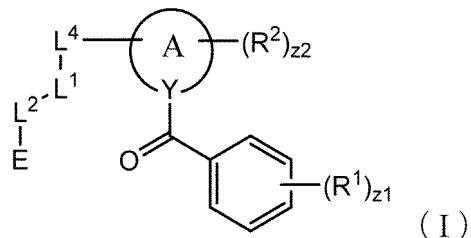
#### 【請求項 4 6】

前記 K - Ras タンパク質が、K - Ras - 4 B である、請求項 4 5 に記載の医薬組成物。

#### 【請求項 4 7】

癌の治療を必要とする対象における、癌を治療するための医薬組成物であって、式：

#### 【化 2 3】



[ 式中、

Y が、N または CH であり；

A 環が、C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub> シクロアルキルまたは 3 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルであり；

R<sup>1</sup> が、独立して、ハロゲン、- CX<sup>1</sup><sub>3</sub>、- CHX<sup>1</sup><sub>2</sub>、- CH<sub>2</sub>X<sup>1</sup>、- CN、- SO<sub>2</sub>C<sub>1</sub>、- SO<sub>n</sub><sub>1</sub>R<sup>1</sup><sub>0</sub>、- SO<sub>v</sub><sub>1</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、- NHNR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、- ONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、- NHC = (O) NHNR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、- NHC (O) NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、- N (O)<sub>m</sub><sub>1</sub>、- NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、- C (O) R<sup>9</sup>、- C (O) - OR<sup>9</sup>、- C (O) NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、- OR<sup>1</sup><sub>0</sub>、- NR<sup>7</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>1</sup><sub>0</sub>、- NR<sup>7</sup>C (O) R<sup>9</sup>、- NR<sup>7</sup>C (O) OR<sup>9</sup>、- NR<sup>7</sup>OR<sup>9</sup>、- OCX<sup>1</sup><sub>3</sub>、- OCHX<sup>1</sup><sub>2</sub>、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；及び

2 つの隣接した R<sup>1</sup> 置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；

L<sup>1</sup> が、結合、置換もしくは非置換のアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレンであり；

L<sup>2</sup> が、結合、- O - 、- C (O) - 、- S - 、- SO - 、- S (O)<sub>2</sub> - 、- NR<sup>7</sup>B - 、- NR<sup>7</sup>B C (O) - 、- C (O) NR<sup>7</sup>B - 、- SO<sub>2</sub> NR<sup>7</sup>B - 、- NR<sup>7</sup>B SO<sub>2</sub> - 、- OC (O) NR<sup>7</sup>B - 、- NR<sup>7</sup>B C (O) O - 、- CR<sup>9</sup>B = NO - 、- ON = CR<sup>9</sup>B - 、- NR<sup>8</sup>B C (O) NR<sup>7</sup>B - 、- NR<sup>8</sup>B C (= NR<sup>1</sup><sub>0</sub>B) NR<sup>7</sup>B - 、- NR<sup>8</sup>B C (= NR<sup>1</sup><sub>0</sub>B) - 、- C (= NR<sup>1</sup><sub>0</sub>B) NR<sup>7</sup>B - 、- OC (= NR<sup>1</sup><sub>0</sub>B) - 、- C (= NR<sup>1</sup><sub>0</sub>B) O - 、置換もしくは非置換のアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレンであり；

L<sup>4</sup> が、結合、- O - 、- C (O) - 、- S - 、- SO - 、- S (O)<sub>2</sub> - 、- NR<sup>4</sup> - 、- NR<sup>4</sup>C (O) - 、- C (O) NR<sup>4</sup> - 、- SO<sub>2</sub> NR<sup>4</sup> - 、- NR<sup>4</sup> SO<sub>2</sub> - 、- OC (O) NR<sup>4</sup> - 、- NR<sup>4</sup>C (O) O - 、置換もしくは非置換の C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキレン、または置換もしくは非置換の 2 ~ 3 員ヘテロアルキレンであり；

E が、求電子性部分であり；

$R^2$  が、独立して、オキソ、ハロゲン、 $-CX_3$ 、 $-CHX_2$ 、 $-CH_2X^2$ 、 $-CN$ 、 $-SO_2Cl$ 、 $-SO_{n_2}R^{14}$ 、 $-SO_{v_2}NR^{11}R^{12}$ 、 $-NHNR^{11}R^{12}$ 、 $-ONR^{11}R^{12}$ 、 $-NHC=(O)NHN R^{11}R^{12}$ 、 $-NHC(O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-N(O)m_2$ 、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-C(O)R^{14}$ 、 $-C(O)-OR^{14}$ 、 $-C(O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-NR^{11}SO_2R^{15}$ 、 $-NR^{11}C(O)OR^{14}$ 、 $-NR^{11}OR^{14}$ 、 $-OCX_3$ 、 $-OCHX_2$ 、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；及び

2つの隣接した  $R^2$  置換基、または同一の原子に結合した2つの  $R^2$  置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキルを形成し得；

$R^4$  が、独立して、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

$R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{7B}$ 、 $R^{8B}$ 、 $R^{9B}$ 、 $R^{10B}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{14}$ 、及び $R^{15}$ が、独立して、水素、ハロゲン、 $-CX_3$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_2Cl$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NHNH_2$ 、 $-ONH_2$ 、 $-NHC(O)NHNH_2$ 、 $-NH C(O)NH_2$ 、 $-NHSO_2H$ 、 $-NHC(O)H$ 、 $-NHC(O)OH$ 、 $-NHOH$ 、 $-OCX_3$ 、 $-OCHX_2$ 、 $-CHX_2$ 、 $-CH_2X$ 、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリールであり；

同一の窒素原子に結合した  $R^7$  及び  $R^8$  置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；及び

同一の窒素原子に結合した  $R^{11}$  及び  $R^{12}$  置換基は、任意選択で連結されて、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロアリールを形成し得；

$X$ 、 $X^1$ 、及び $X^2$  が、それぞれ独立して、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、または $-I$ であり；

$n_1$ 、 $n_2$ 、 $v_1$ 、及び $v_2$  が、独立して、0～4の整数であり；

$m_1$  及び  $m_2$  が、独立して、1または2であり；

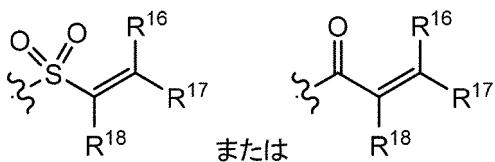
$z_1$  が、独立して、0～5の整数であり；ならびに

$z_2$  が、独立して、0～10の整数であり、

ここで、

$E$  が、

【化24】



である場合には、

$L^1$  が、結合、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレンであり；

$L^2$  が、結合、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR^7$

$B^-$ 、 $-NR^7B$ 、 $C(O)-$ 、 $-C(O)NR^7B$ 、 $-SO_2NR^7B$ 、 $-NCR^9B$   
 $SO_2-$ 、 $-OOC(O)NR^7B$ 、 $-NR^7B$ 、 $C(O)O-$ 、 $-CR^9B$ 、 $=NO-$ 、 $-$   
 $ON=CR^9B$ 、 $-NR^8B$ 、 $C(O)NR^7B$ 、 $-NR^8B$ 、 $C(=NR^{10}B)NR$   
 $7B$ 、 $-NR^8B$ 、 $C(=NR^{10}B)-$ 、 $-C(=NR^{10}B)NR^7B$ 、 $-OOC(=NR^{10}B)-$ 、 $-C(=NR^{10}B)O-$ 、置換もしくは非置換のアルキレン、置換もしくは非置換のシクロアルキレン、置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換のアリーレン、または置換もしくは非置換のヘテロアリーレンであり；及び

$L^4$ が、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR^4C(O)-$ 、 $-C(O)NR^4-$ 、 $-SO_2NR^4-$ 、 $-NR^4SO_2-$ 、 $-OOC(O)NR^4-$ 、 $-NR^4C(O)O-$ 、置換もしくは非置換の $C_1-C_3$ アルキレン、または置換もしくは非置換の2～3員ヘテロアルキレンである。】

を有する化合物またはその医薬的に許容可能な塩を含む、前記医薬組成物。

【請求項48】

前記癌が、膵癌、肺癌、または結腸直腸癌である、請求項47に記載の医薬組成物。