

【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27年2月26日 (2015.2.26)

【公表番号】特表2013-545749(P2013-545749A)

【公表日】平成25年12月26日 (2013.12.26)

【年通号数】公開・登録公報2013-069

【出願番号】特願2013-538894(P2013-538894)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/52 (2006.01)

C 0 7 D 513/04 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/5386 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/12 C S P

C 0 7 D 487/04 1 4 4

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 519/00 3 0 1

A 6 1 K 31/52

C 0 7 D 513/04 3 5 1

C 0 7 D 487/04 1 4 2

C 0 7 D 471/04 1 1 7 Z

A 6 1 K 31/5386

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/541

A 6 1 K 31/553

C 0 7 D 519/00

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 29/00

A 6 1 P 37/02

【手続補正書】

【提出日】平成27年1月6日 (2015.1.6)

【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

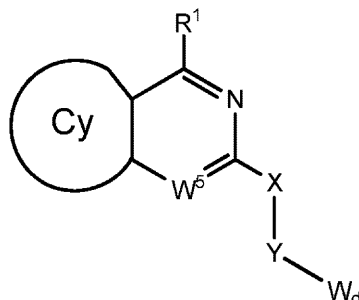
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (1a) の化合物、又はその医薬として許容し得る形態：

【化 1】



式 (1a)

(式中、

$W^5$  は、N 又は  $CR^4$  であり；

$R^4$  は、水素、アルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、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、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、チオ、スルホキシド、スルホン、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、又は  $NR'R''$  であり、ここで、 $R'$  及び  $R''$  は、窒素と一緒に、環部分を形成し；

Cy は、 $R^3$  の 0 ~ 4 回の出現によって置換されたアリール又はヘテロアリールであり；

$R^1$  は  $-(L)_n-R^{1'}$  であり；

各  $L$  は、独立に、結合、アルキレン、ヘテロアルキレン、 $-N(R^2)-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-P(=O)R^2-$ 、又は  $-O-$  であり；

$R^{1'}$  は、水素、アルキル、ヘテロアルキル、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、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、アミノ、アミド、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、 $-(C=O)-NR^{a1}R^{a2}$ 、又は  $NR^{a1}R^{a2}$  であり；

$R^{a1}$  及び  $R^{a2}$  は、各々独立に、水素、アルキル、ヘテロアルキル、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、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、チオ、スルホキシド、スルホン、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネートであるか、又は  $R^{a1}$  及び  $R^{a2}$  は、窒素と一緒に、環部分を形成し；

$R^2$  は、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアルキル、アリール、又はヘテロアリールであり；

各  $R^3$  は、独立に、アルキル、ヘテロアルキル、ハロアルキル、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、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、チオ、スルホキシド、スルホン、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、又は  $NR'R''$  であり、ここで、 $R'$  及び  $R''$  は、窒素と一緒に、環部分を形成し；

X は、 $-(CH(R^{10}))_z-$  であり；

Y は、非存在、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、 $-N(R^9)-$ 、 $-C(=O)-(CHR^{10})_z-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-N(R^9)-C(=O)-$ 、 $-C(=O)-N(R^9)-$ 、 $-N(R^9)-C(=O)NH-$ 、 $-N(R^9)C(R^{10})_2-$ 、 $-C(=O)-N(R^9)-(CHR$

$^{10})_z-$ 、又は $-P(=O)R^2-$ であり；

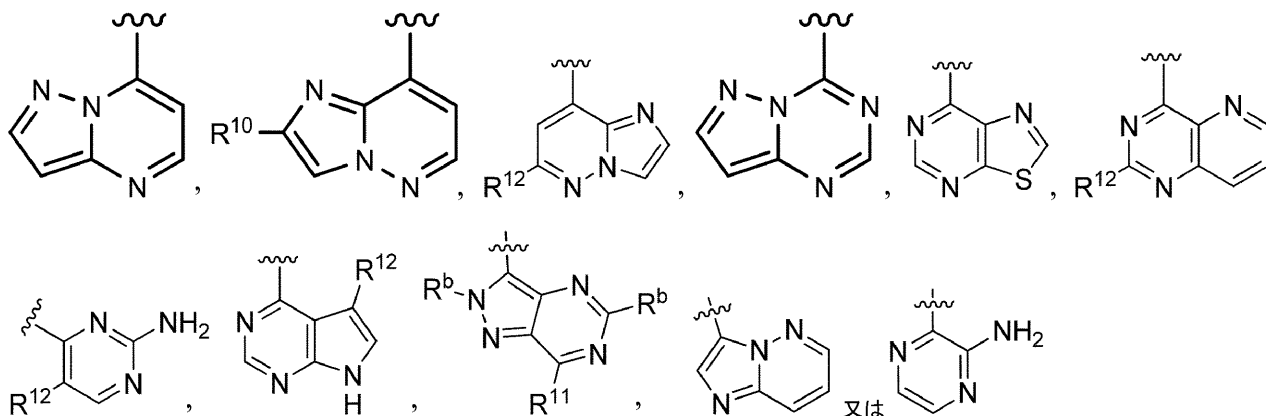
各 $z$ は、1、2、3、又は4の整数であり；

$n$ は、0、1、2、3、又は4の整数であり；

各 $R^9$ は、独立に、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、ヘテロアルキル、アリール、又はヘテロアリールであり；

$W_d$ は、

【化2】



であり；

各 $R^b$ は、独立に、水素、ハロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、又はヘテロシクロアルキルであり；かつ

各 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、及び $R^{12}$ は、独立に、水素、アルキル、ヘテロアルキル、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、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、ハロアルキル、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、又は $NR'R''$ であり、ここで、 $R'$ 及び $R''$ は、窒素と一緒にあって、環部分を形成する)。

【請求項2】

$n$ が、1、2、又は3である、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

各 $L$ が、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-S-$ 、アルキレン、又は結合である、請求項1記載の化合物。

【請求項4】

$R^{1'}$ が、アルキル、ヒドロキシ、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、 $-(C=O)-NR^{a1}R^{a2}$ 、又は $NR^{a1}R^{a2}$ であり；任意に、 $R^{a1}$ が、水素又はアルキルであり；任意に、 $R^{a2}$ が、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ヘテロシクロアルキル、アシル、又はヘテロシクロアルキルアルキルであり；任意に、 $R^{a1}$ 及び $R^{a2}$ が、それらが結合している窒素と一緒にあって、環部分を形成している、請求項1記載の化合物。

【請求項5】

$W^5$ がNであるか、又は $W^5$ が $CR^4$ であり、かつ $R^4$ が水素である、請求項1記載の化合物。

【請求項6】

$X$ が $-(CH(R^{10}))_z-$ であり、かつ $z$ が1又は2である、請求項1記載の化合物。

【請求項7】

$Y$ が、非存在、 $-O-$ 、 $-NH(R^9)-$ 、又は $-S(=O)_2-$ である、請求項1記載の化合物。

【請求項8】

$Cy$ が、 $R^3$ の0～4回の出現によって置換されたフェニルであり；任意に、 $Cy$ が、 $R^3$ の1回の出現によって置換されたフェニルである、請求項1記載の化合物。

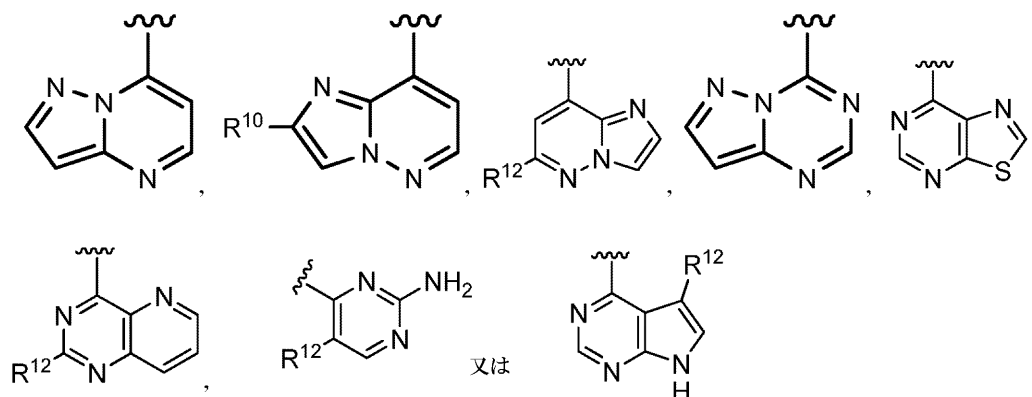
## 【請求項 9】

$R^3$  が、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アシル、又はヘテロアリールである、請求項1記載の化合物。

## 【請求項 10】

$W_d$  が:

## 【化 3】



である、請求項1記載の化合物。

## 【請求項 11】

$R^{10}$  が水素である、請求項10記載の化合物。

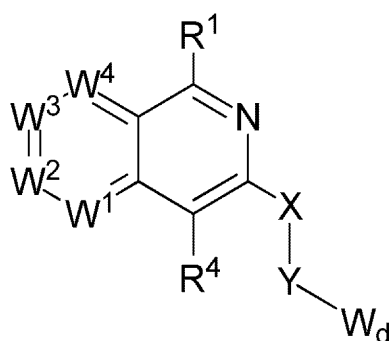
## 【請求項 12】

$R^{12}$  が、水素、ハロ、ハロアルキル、シアノ、アミノ、又はアミドである、請求項10記載の化合物。

## 【請求項 13】

前記式(Ia)の化合物が、式(II)の化合物、又はその医薬として許容し得る形態である、請求項1記載の化合物:

## 【化 4】



式 (II)

(式中:

$W^1$  はN又は $CR^{14}$ であり、 $W^2$  はN又は $CR^6$ であり、 $W^3$  はN又は $CR^7$ であり、かつ $W^4$  はN又は $CR^8$ であり、ここで、3個以上のN原子が隣接することはない;かつ

$R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、及び $R^{14}$ は、独立に、水素、アルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、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、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、チオ、スルホキシド、スルホン、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、又は $NR'R''$ であり、ここで、 $R'$ 及び $R''$ は、窒素と一緒になって、環部分を形成する)。

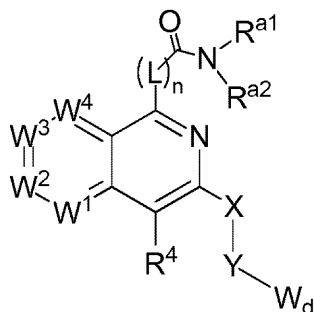
## 【請求項 14】

$R^{1'}$  が、水素、アミノ、アルコキシ、アルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、又は  $NR^{a1}R^{a2}$  であり、ここで、 $R^{a1}$  及び  $R^{a2}$  は、窒素と一緒に、環部分を形成し；任意に、 $R^{1'}$  が、アミノ、アルコキシ、アルキル、又は  $NR^{a1}R^{a2}$  であり、ここで、 $R^{a1}$  及び  $R^{a2}$  は、窒素と一緒に、環部分を形成する、請求項13記載の化合物。

【請求項 15】

前記式(Ia)の化合物が、式(IIIa)の化合物、又はその医薬として許容し得る形態である、請求項1記載の化合物：

【化 5】



式 (IIIa)

(式中、：

$W^1$  はN又は $CR^{14}$ であり、 $W^2$  はN又は $CR^6$ であり、 $W^3$  はN又は $CR^7$ であり、かつ $W^4$  はN又は $CR^8$ であり、ここで、3個以上のN原子が隣接することはなく；かつ

$R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、及び $R^{14}$ は、独立に、水素、アルキル、ヘテロアルキル、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、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、チオ、スルホキシド、スルホン、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、又は $NR'R''$ であり、ここで、 $R'$  及び  $R''$  は、窒素と一緒に、環部分を形成する)。

【請求項 16】

$R^{a1}$  及び  $R^{a2}$  が窒素と一緒に、環部分を形成しており；任意に、前記環部分が、5員又は6員である、請求項15記載の化合物。

【請求項 17】

$n$  が1であり、かつ $L$  がアルキレンであり；任意に、 $L$  が、メチレン又はエチレンである、請求項15記載の化合物。

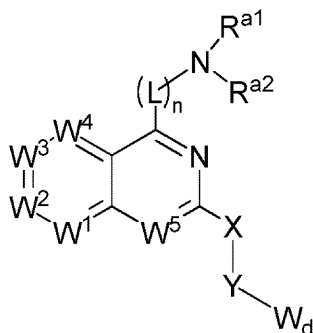
【請求項 18】

$L$  が、アリール、ヘテロアリール、又はハロによって置換されたアルキレンである、請求項15記載の化合物。

【請求項 19】

前記式(Ia)の化合物が、式(IV)の化合物、又はその医薬として許容し得る形態である、請求項1記載の化合物：

## 【化 6】



式 (IV)

(式中:

$W^1$  はN又は $CR^{14}$ であり、 $W^2$  はN又は $CR^6$ であり、 $W^3$  はN又は $CR^7$ であり、 $W^4$  はN又は $CR^8$ であり、かつ $W^5$  はN又は $CR^4$ であり、ここで、3個以上のN原子が隣接することはない；かつ

$R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、及び $R^{14}$ は、独立に、水素、アルキル、ヘテロアルキル、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、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、チオ、スルホキシド、スルホン、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、又は $NR'R''$ であり、ここで、 $R'$ 及び $R''$ は、窒素と一緒に、環部分を形成する)。

## 【請求項 20】

請求項13、15及び19のいずれか一項記載の化合物であって：

$W^1$  がNであり、 $W^2$  が $CR^6$ であり、 $W^3$  が $CR^7$ であり、 $W^4$  が $CR^8$ であるか；

$W^1$  が $CR^{14}$ であり、 $W^2$  がNであり、 $W^3$  が $CR^7$ であり、 $W^4$  が $CR^8$ であるか；

$W^1$  が $CR^{14}$ であり、 $W^2$  が $CR^6$ であり、 $W^3$  がNであり、 $W^4$  が $CR^8$ であるか；

$W^1$  がNであり、 $W^2$  が $CR^6$ であり、 $W^3$  がNであり、 $W^4$  が $CR^8$ であるか；

$W^1$  がNであり、 $W^2$  がNであり、 $W^3$  が $CR^7$ であり、 $W^4$  が $CR^8$ であるか；

$W^1$  がNであり、 $W^2$  が $CR^6$ であり、 $W^3$  が $CR^7$ であり、 $W^4$  がNであるか；

$W^1$  が $CR^{14}$ であり、 $W^2$  がNであり、 $W^3$  がNであり、 $W^4$  が $CR^8$ であるか；

$W^1$  が $CR^{14}$ であり、 $W^2$  がNであり、 $W^3$  が $CR^7$ であり、 $W^4$  がNであるか；

$W^1$  が $CR^{14}$ であり、 $W^2$  が $CR^6$ であり、 $W^3$  がNであり、 $W^4$  がNであるか；又は

$W^1$  が $CR^{14}$ であり、 $W^2$  が $CR^6$ であり、 $W^3$  が $CR^7$ であり、 $W^4$  が $CR^8$ である、前記化合物。

## 【請求項 21】

$W^1$  が $CR^{14}$ であり、 $W^2$  が $CR^6$ であり、 $W^3$  が $CR^7$ であり、かつ $W^4$  が $CR^8$ である、請求項20記載の化合物。

## 【請求項 22】

$R^8$  が、水素、アルキル、ヘテロアルキル、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、アルコキシ、スルホンアミド、チオ、スルホキシド、スルホン、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、又は $NR'R''$ であり、ここで、 $R'$ 及び $R''$ は、窒素と一緒に、環部分を形成し；任意に、 $R^8$  が、水素又はアルキルであり；任意に、 $R^8$  が、1以上のフルオロで置換されたアルキルである、請求項13、15及び19のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 23】

Xが、 $-CH_2-$ 、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-CH(C_6H_5)-$ 、又は $-CH(CH_2CH_3)-$ であり；任意に、 $-CH(CH_3)-$ 又は $-CH(CH_2CH_3)-$ のCH炭素が、主に、(S)立体化学配置を有する、請求項1、13、15及び19のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 24】

Yが、非存在、 $-O-$ 、 $-N(R^9)-$ 、 $-N(R^9)C(R^{10})_2-$ 、又は $-S(=O)_2-$ であり；任意に、 $R^9$ 及び $R^{10}$

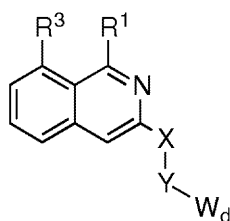
【請求項 25】

【請求項 26】

【請求項 27】

【請求項 28】

【化 7】



式 (V)

○

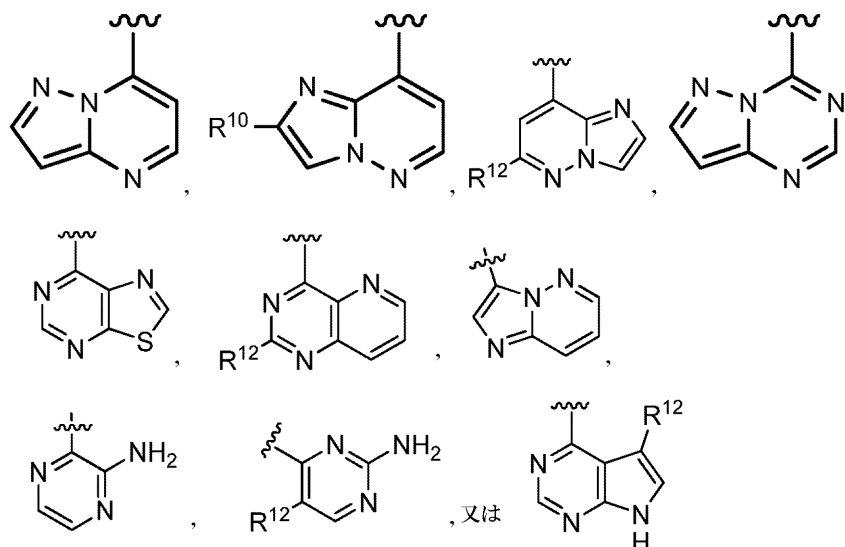
【請求項 29】

(式中、

各Lは、 $-O-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、 $-S-$ 、又はアルキレンであり；

$W_d$  は:

【化 8】



であり；

R<sup>10</sup>は水素であり；

R<sup>12</sup>は、水素、ハロ、ハロアルキル、シアノ、アミノ、又はアミドであり；かつ  
nは、0、1、2、3、又は4である）。

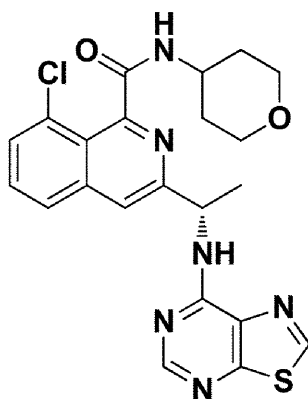
【請求項30】

Lが、-O-又はアルキレンであり；かつnが、0、1、又は2である、請求項29記載の化合物  
。

【請求項31】

前記化合物が、

【化9】

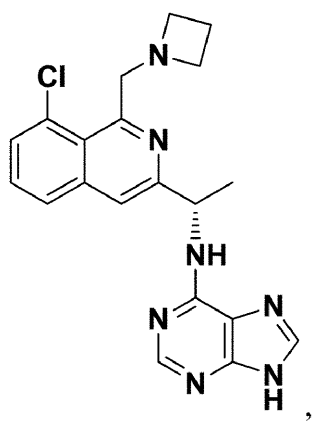


又はその医薬として許容し得る形態である、請求項1記載の化合物。

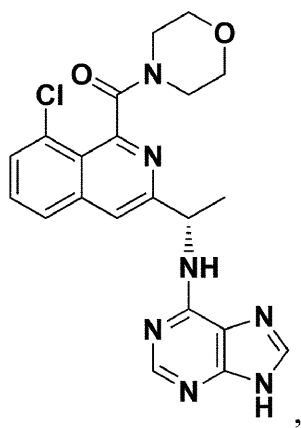
【請求項32】



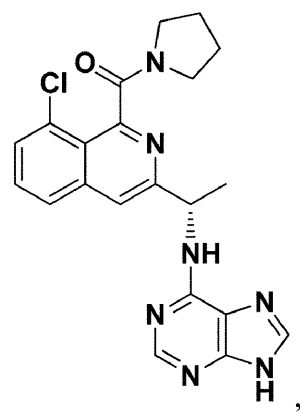
【化 10】



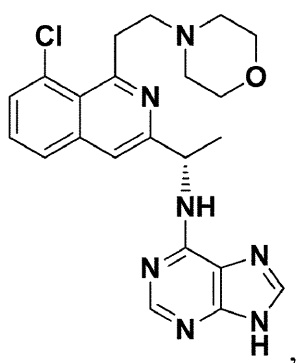
9



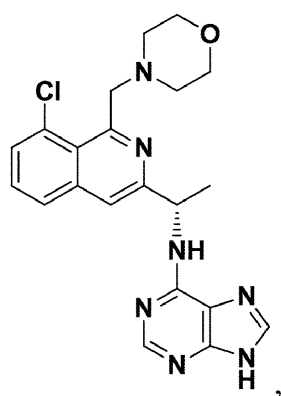
13



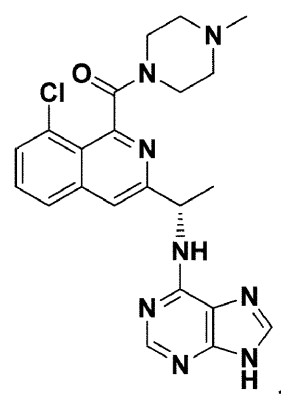
14



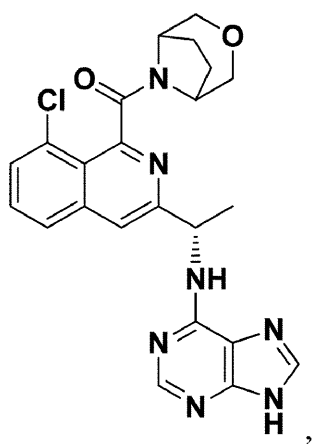
4



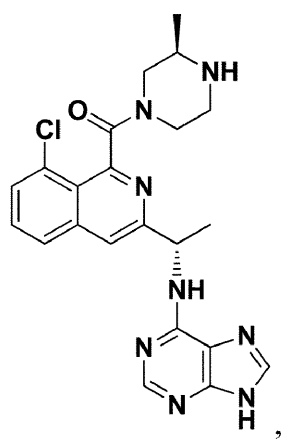
7



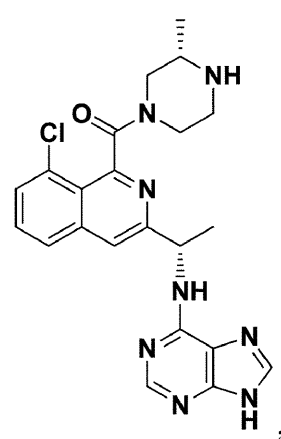
15



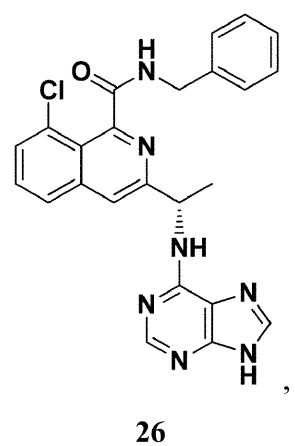
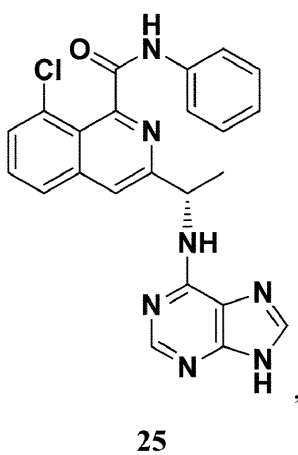
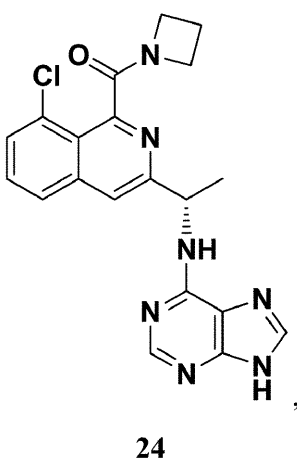
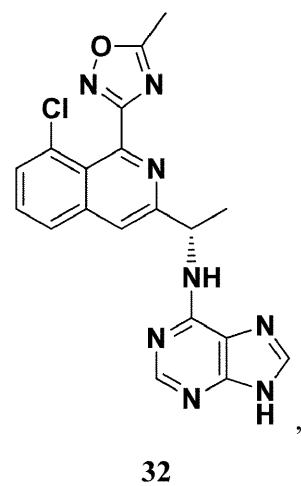
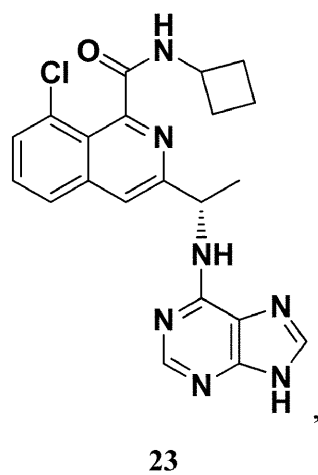
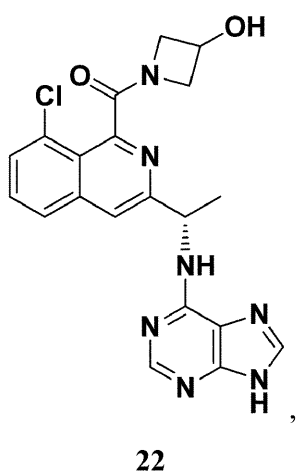
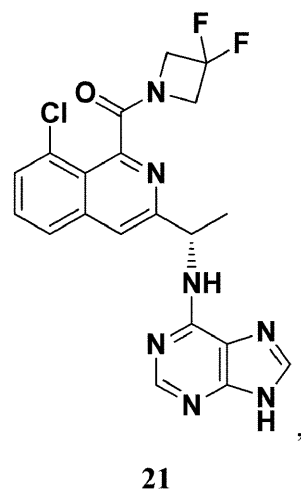
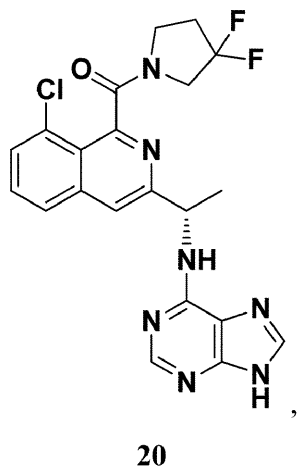
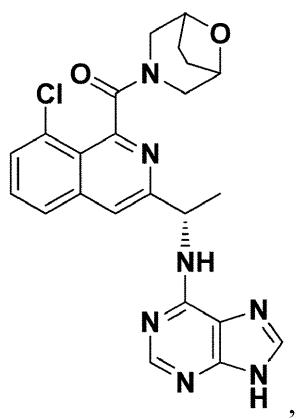
16

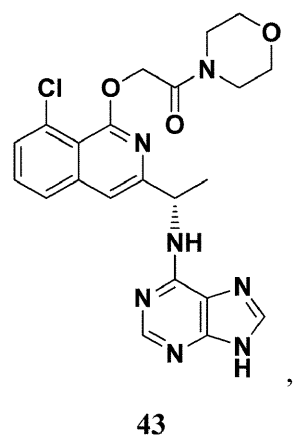
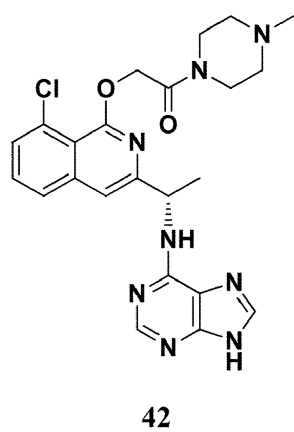
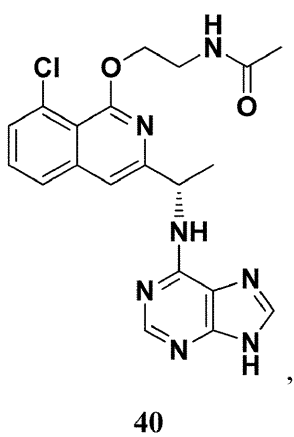
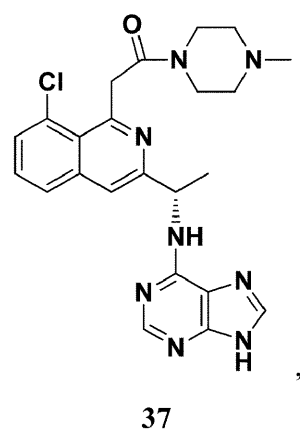
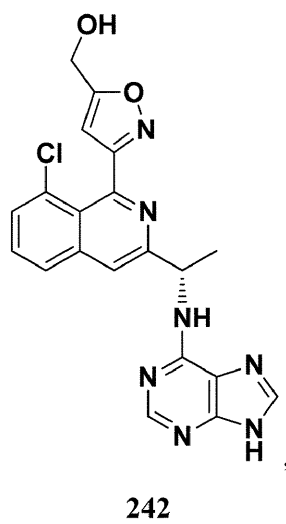
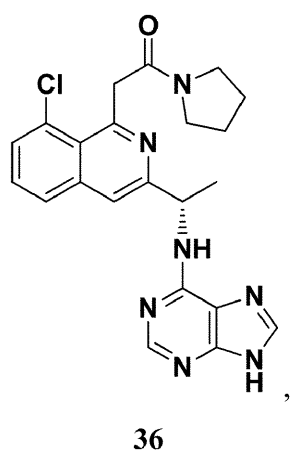
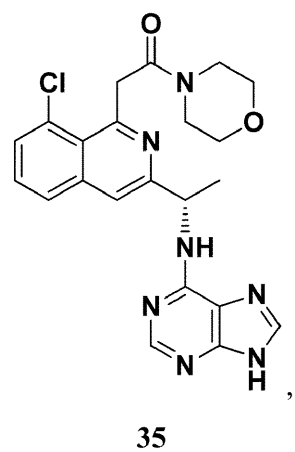
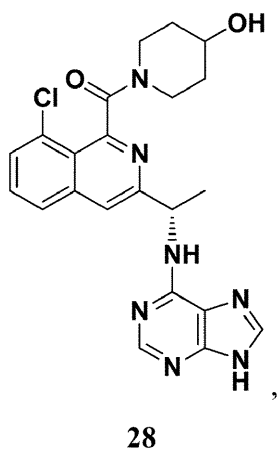
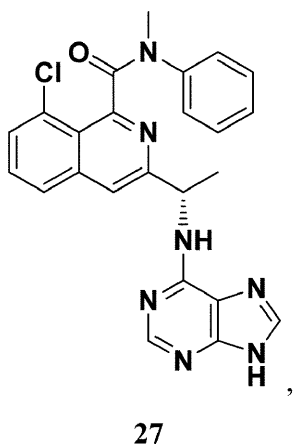


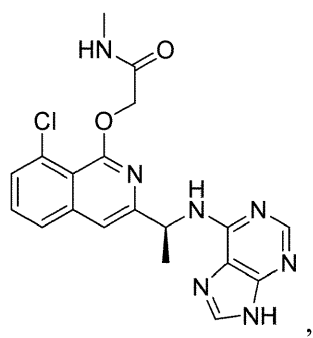
17



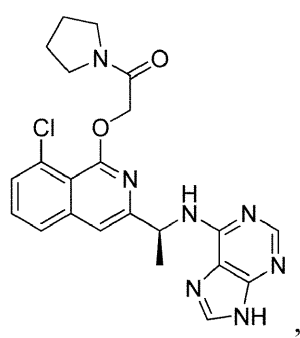
18



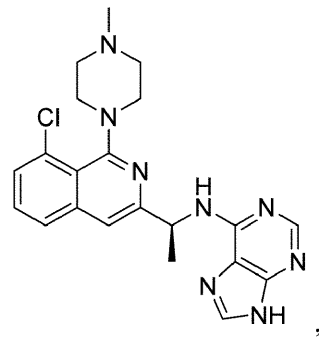




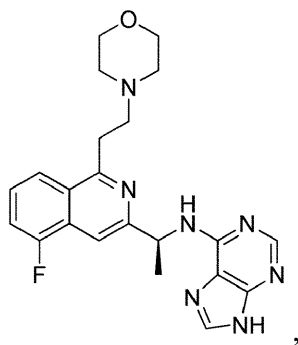
44



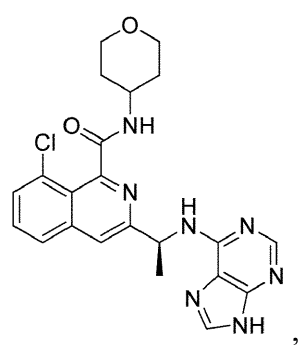
45



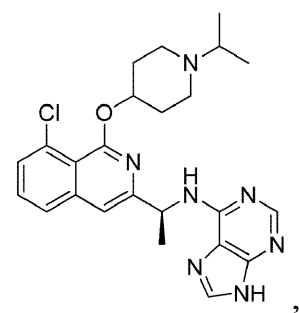
46



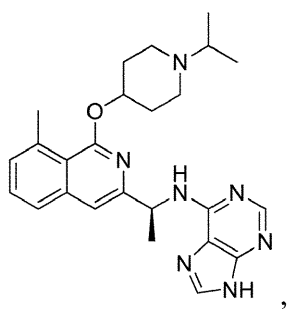
53



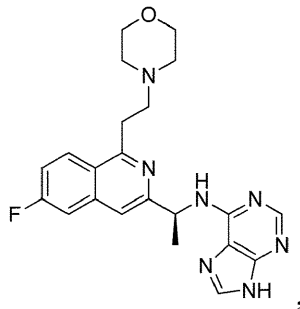
48



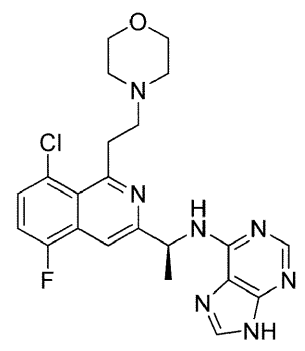
47



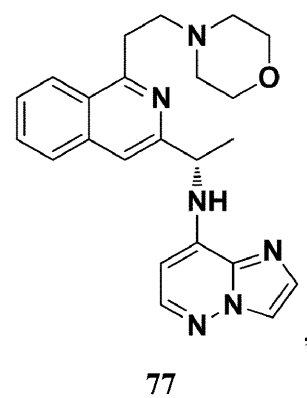
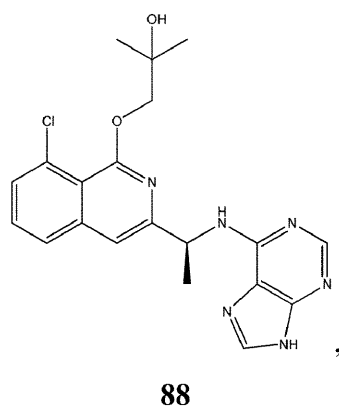
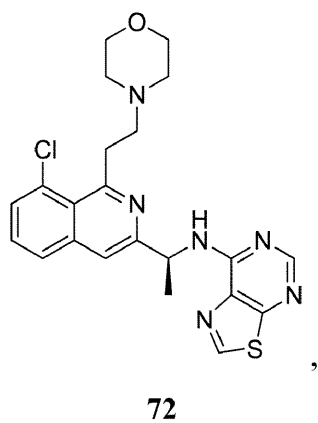
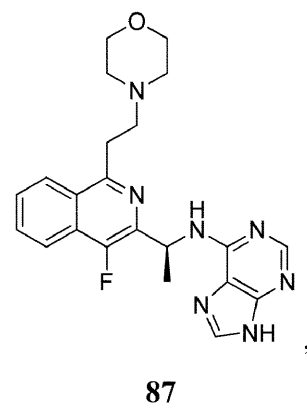
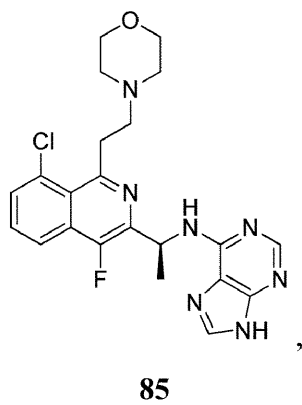
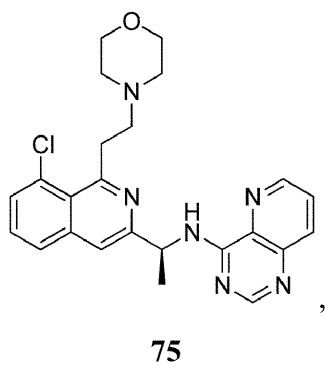
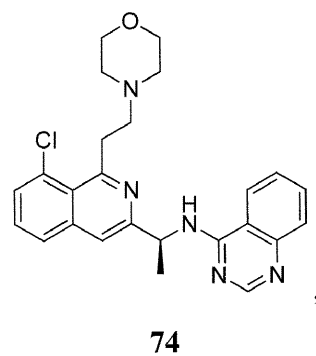
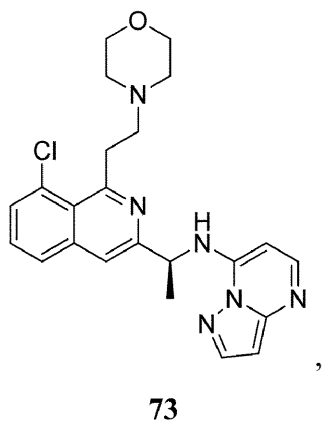
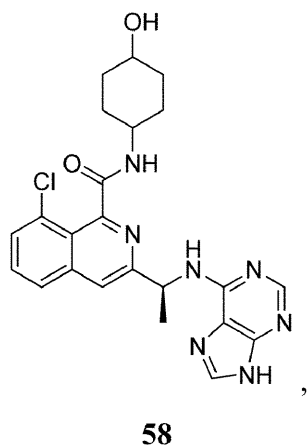
57

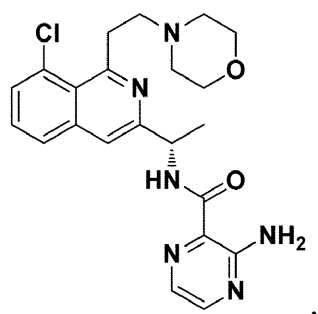


55

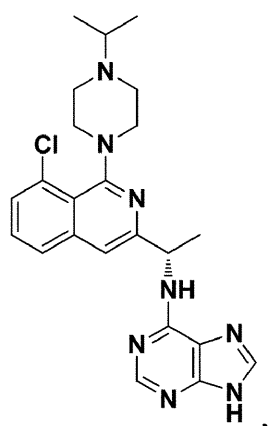


68

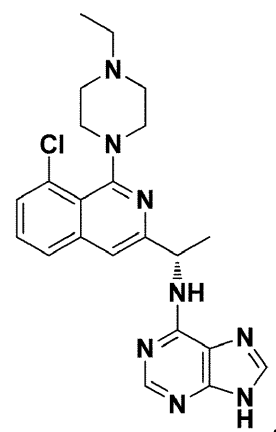




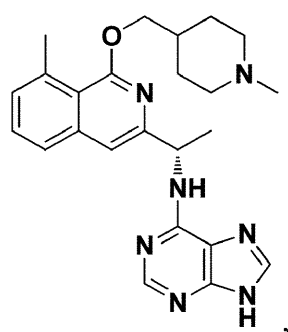
89



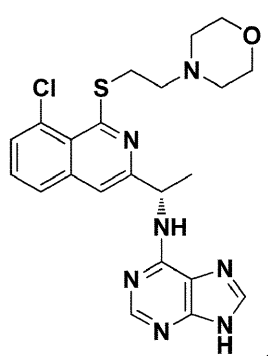
90



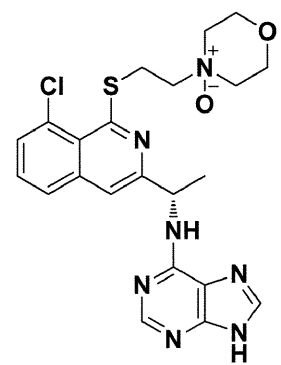
91



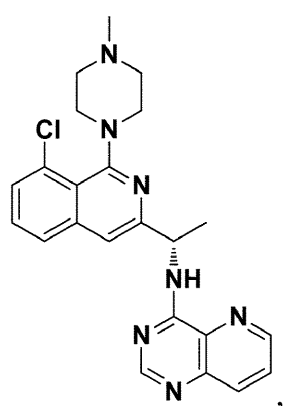
92



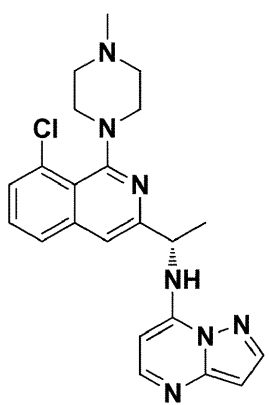
93



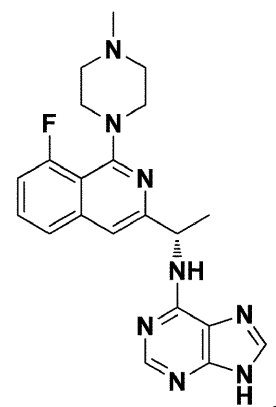
94



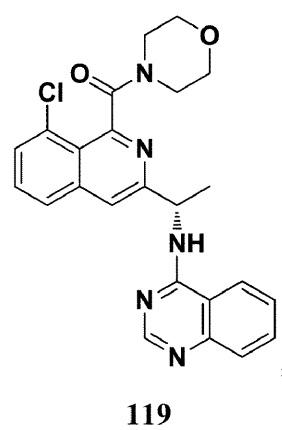
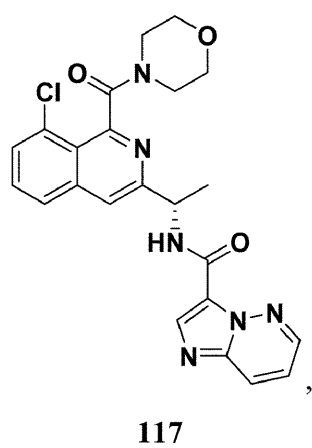
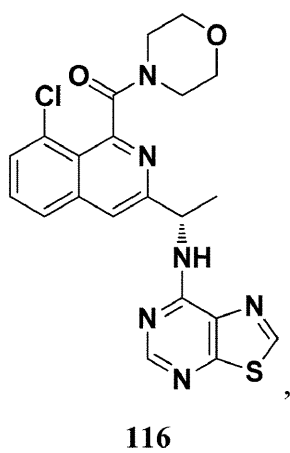
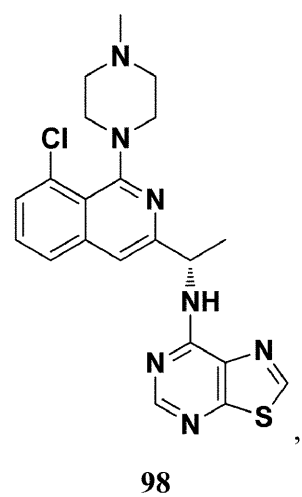
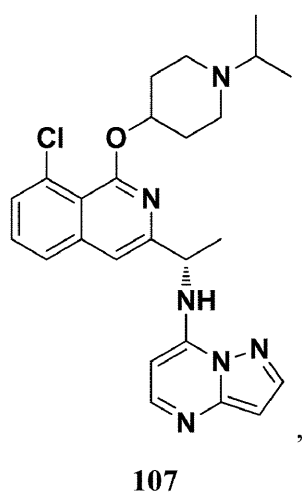
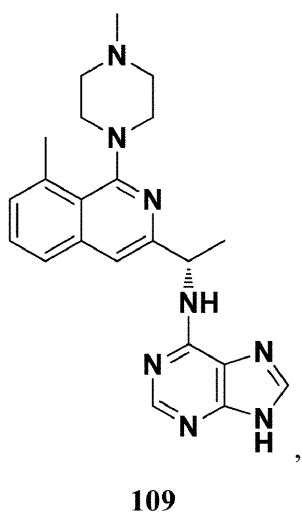
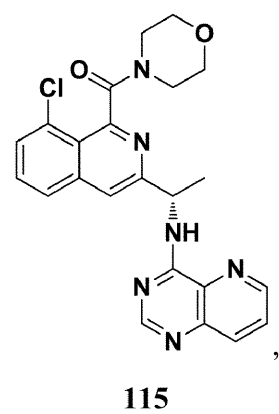
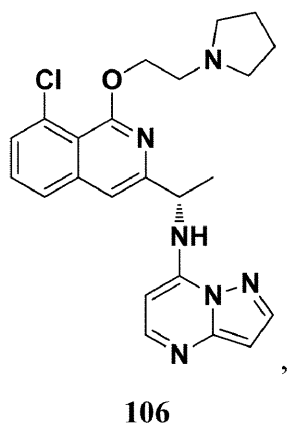
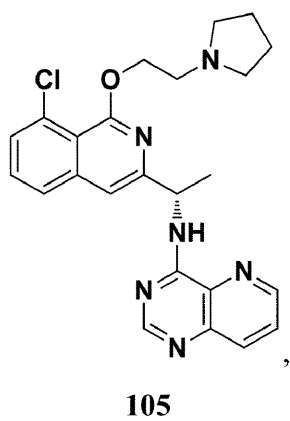
96

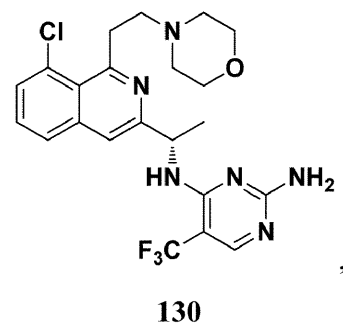
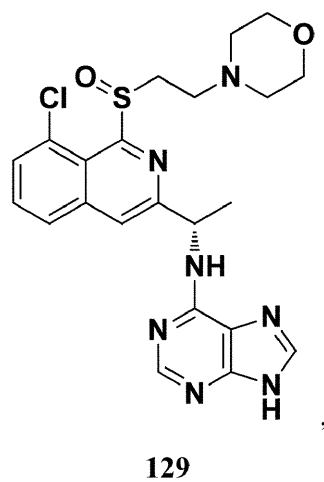
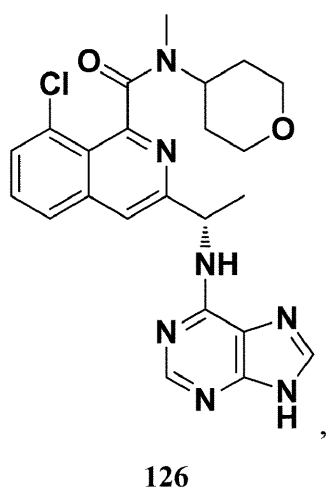
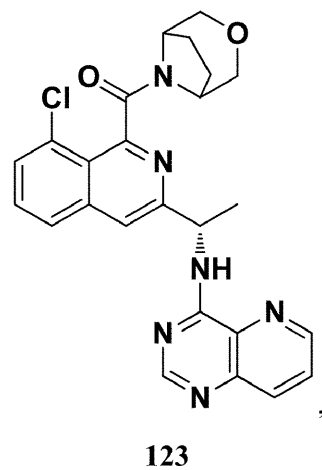
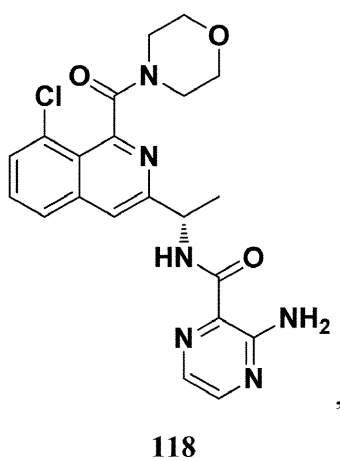
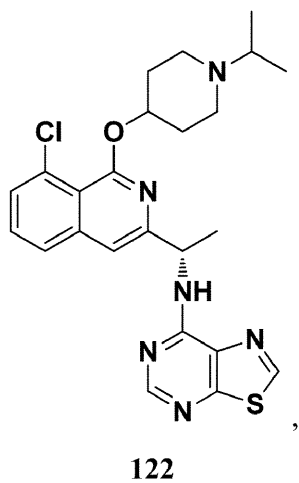
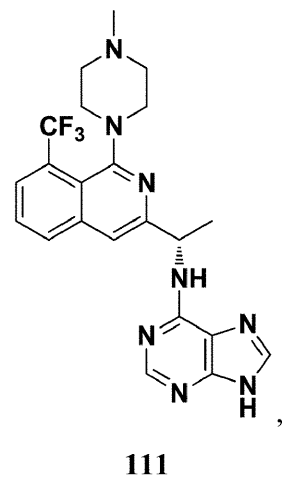
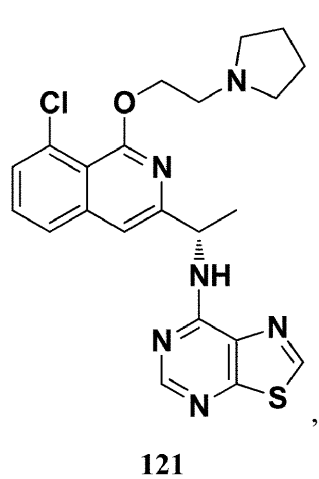
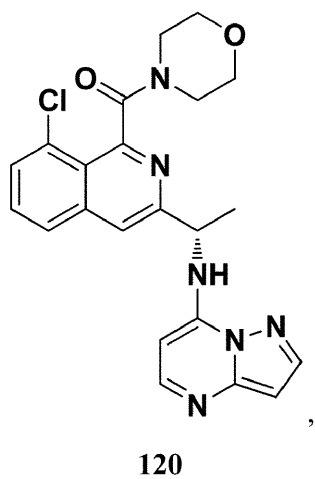


97

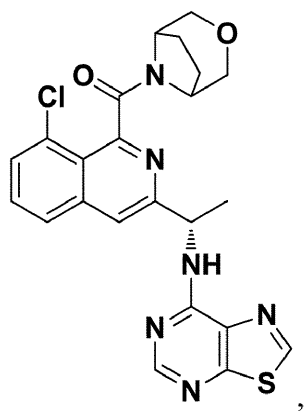


100

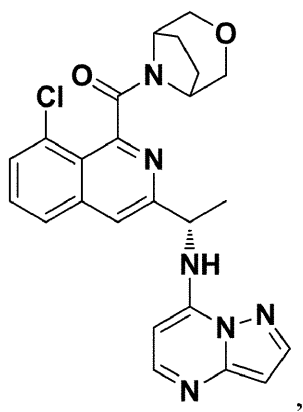




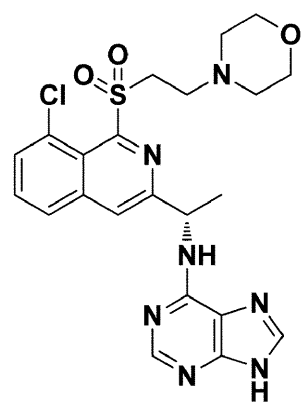




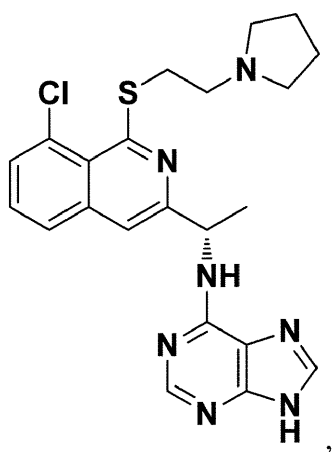
124



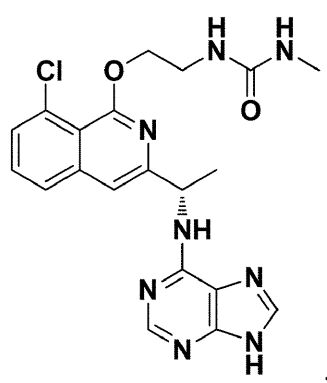
125



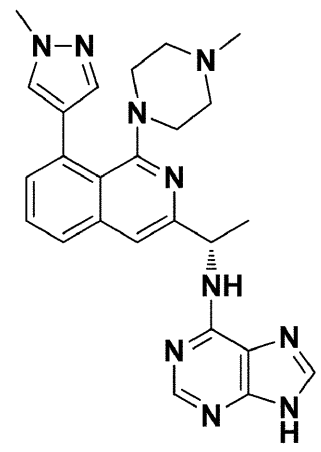
134



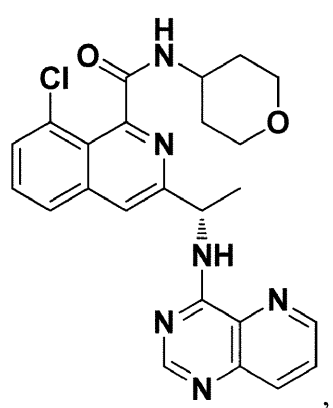
135



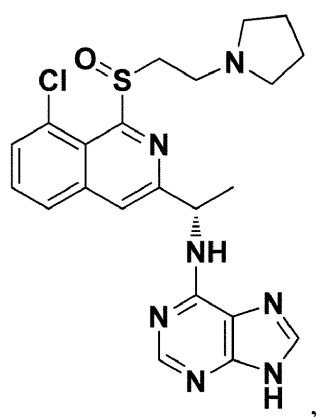
139



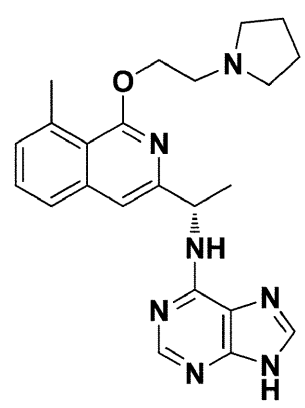
142



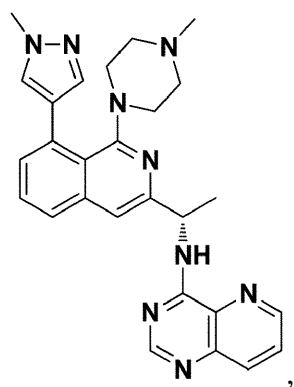
143



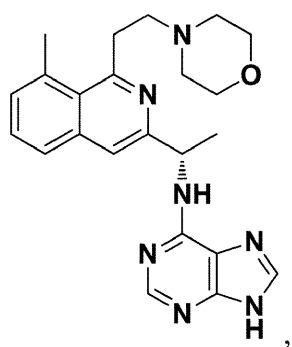
136



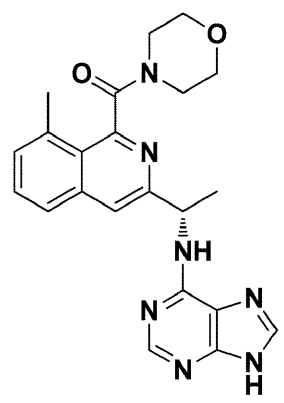
145



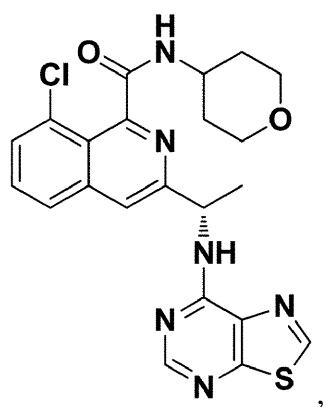
243



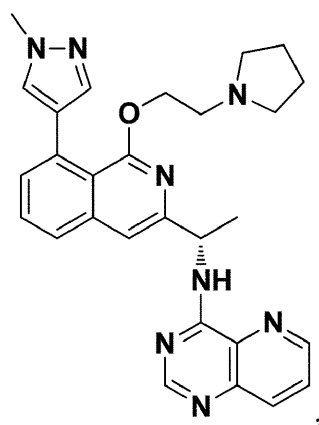
146



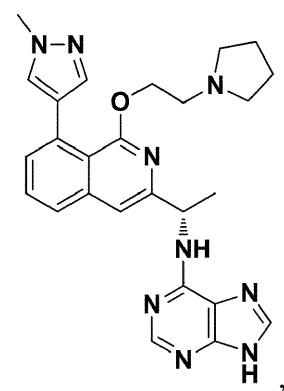
147



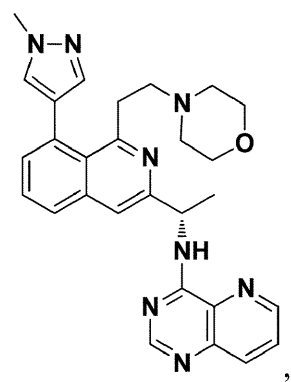
144



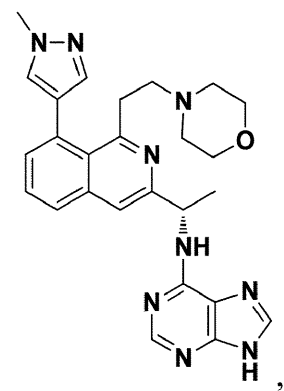
148



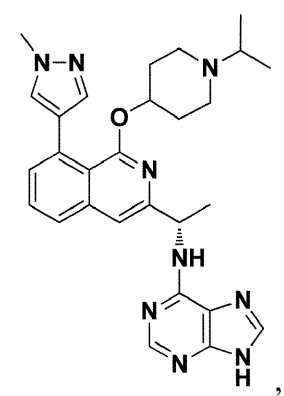
151



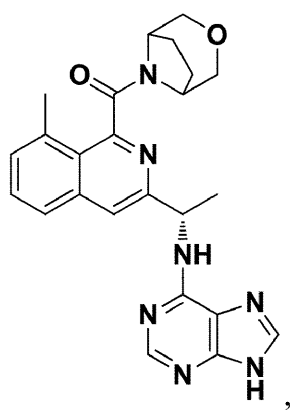
154



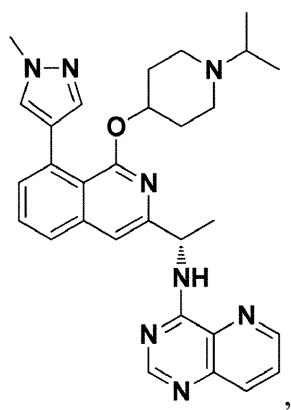
157



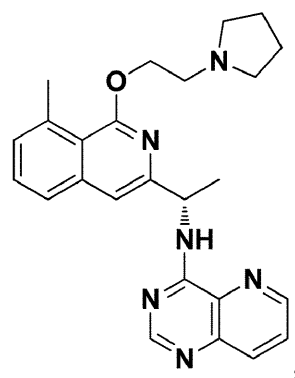
158



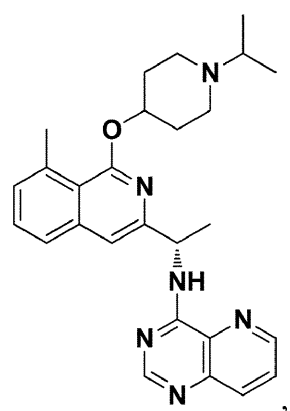
149



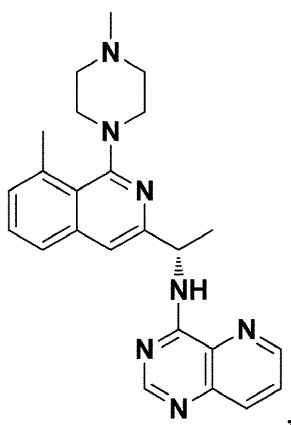
160



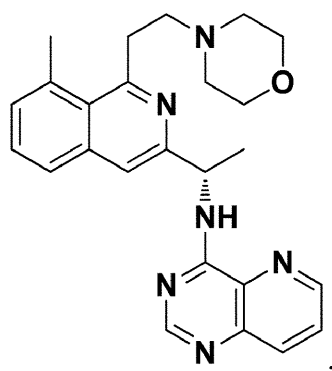
162



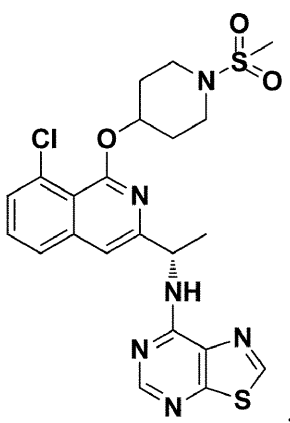
163



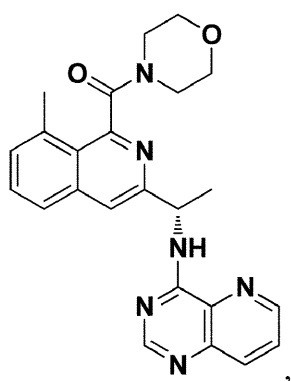
164



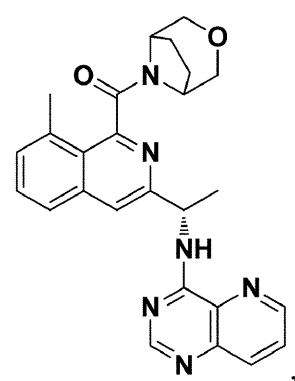
165



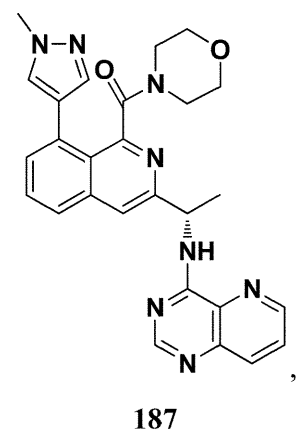
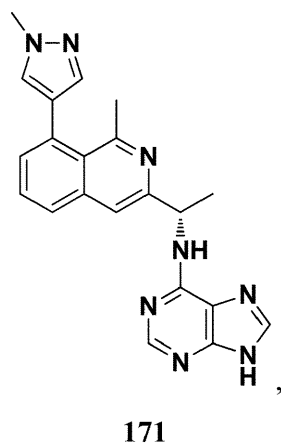
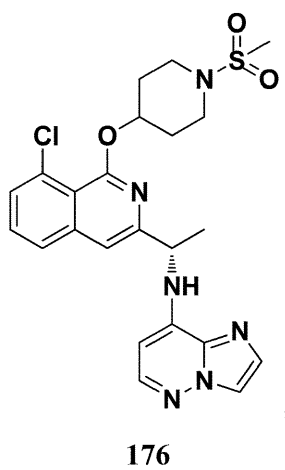
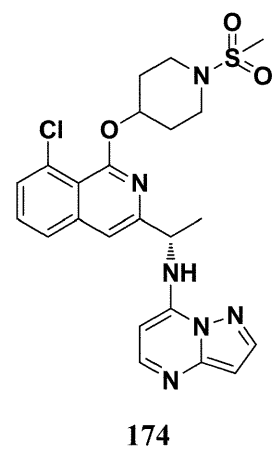
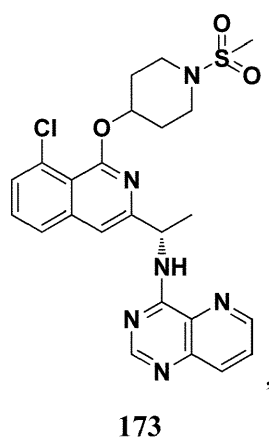
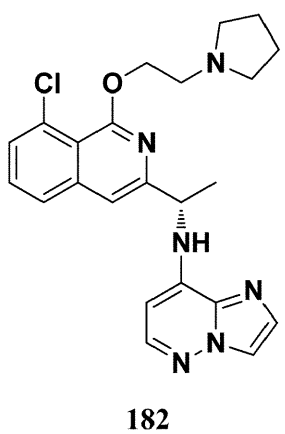
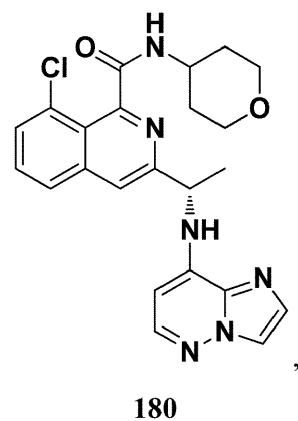
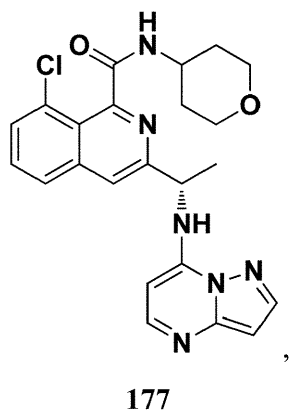
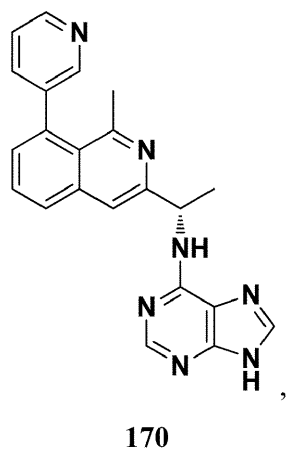
172

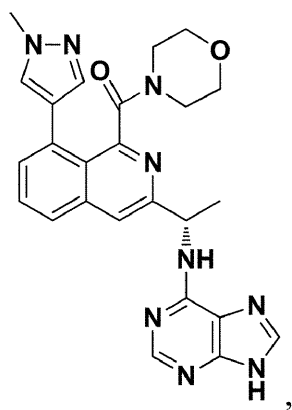


166

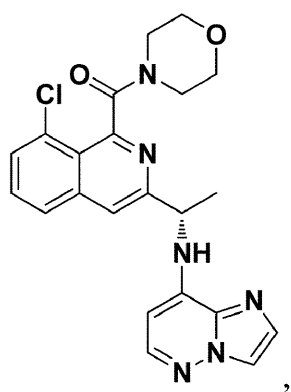


167

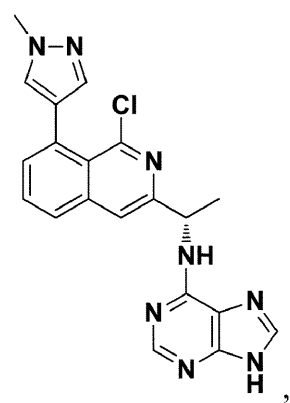




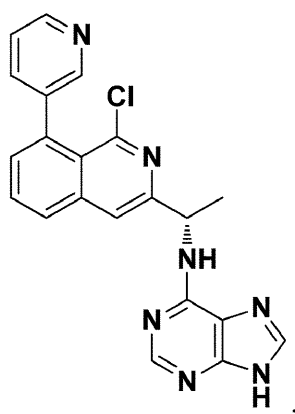
185



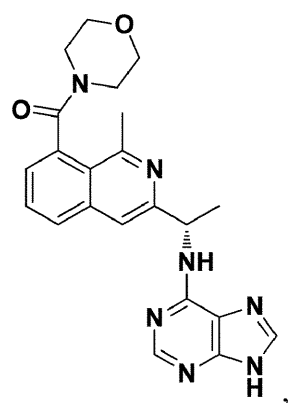
188



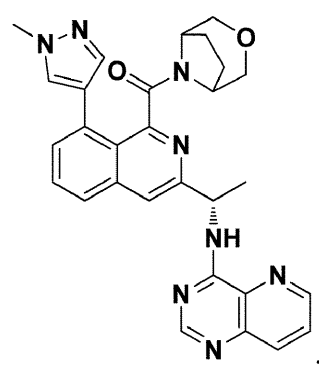
193



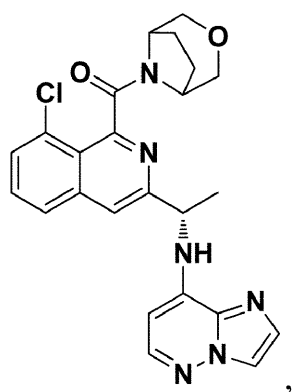
192



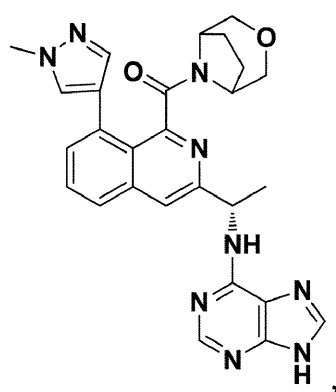
198



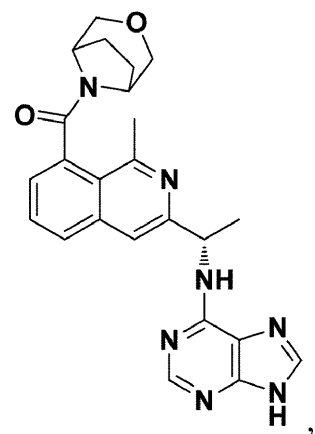
200



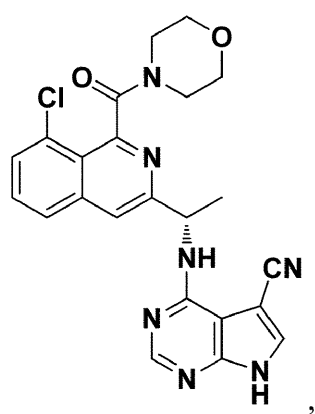
189



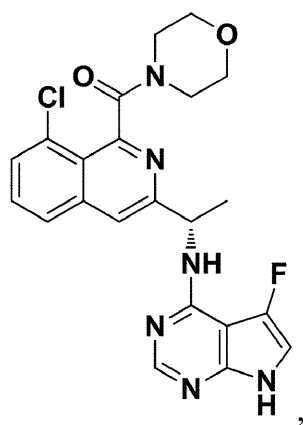
201



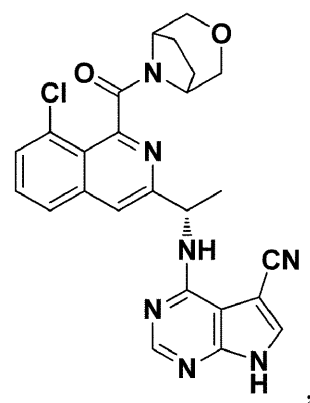
199



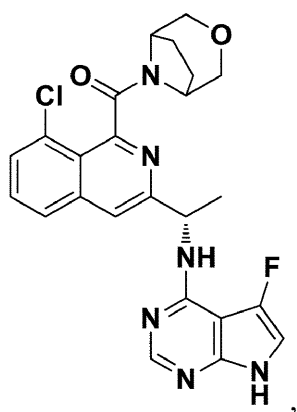
203



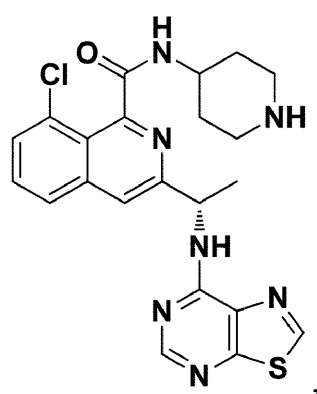
205



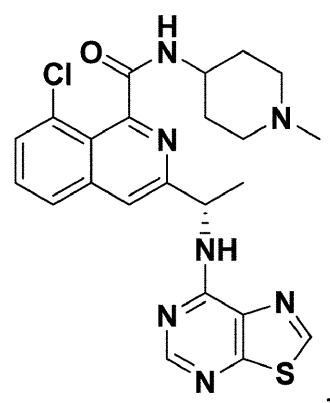
206



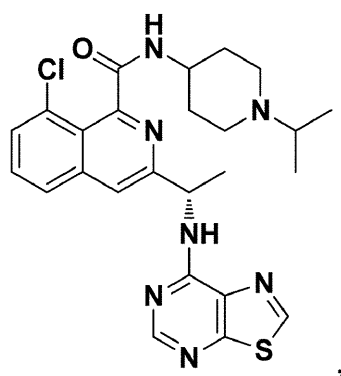
208



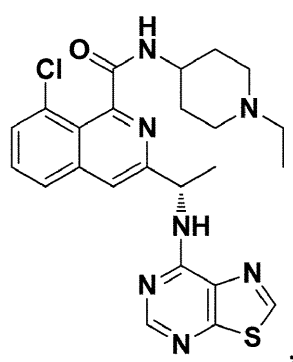
209



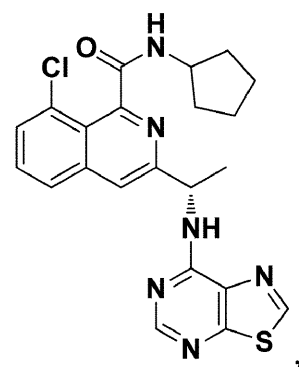
210



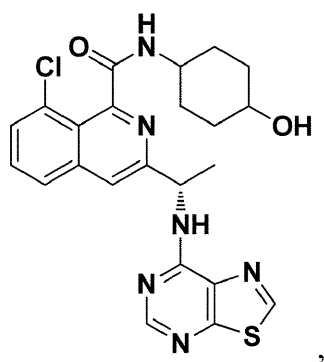
211



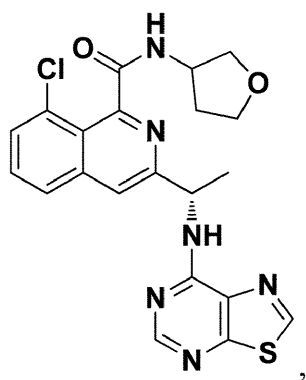
212



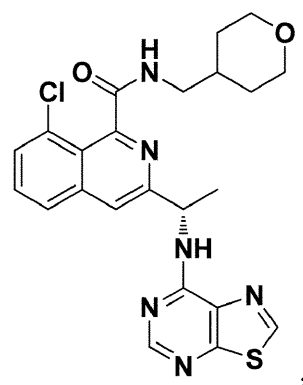
213



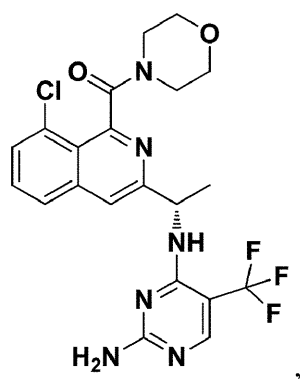
214



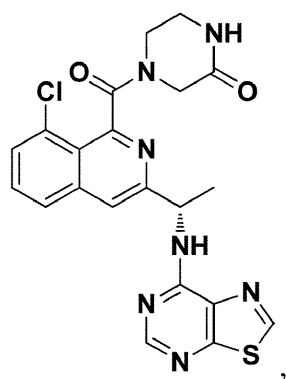
215



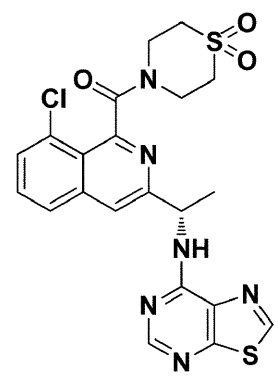
216



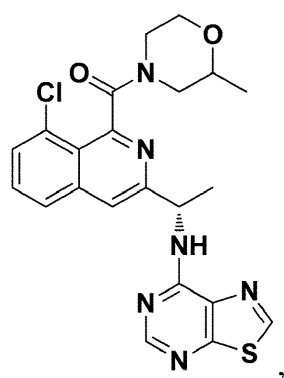
217



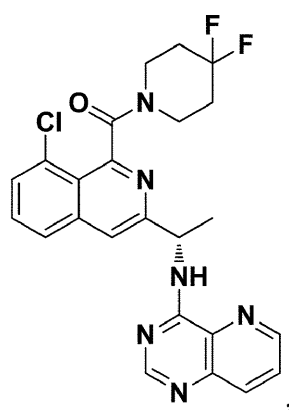
218



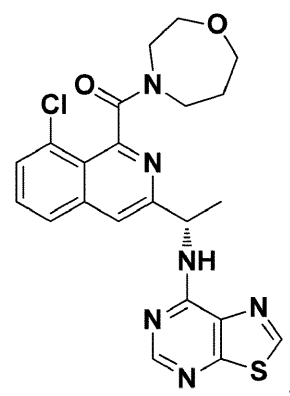
220



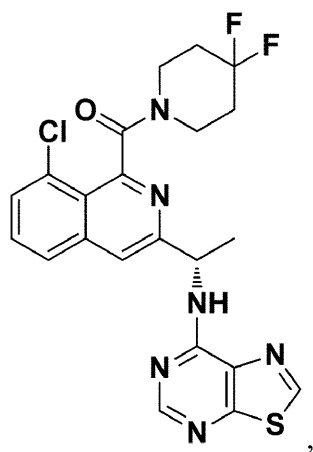
221



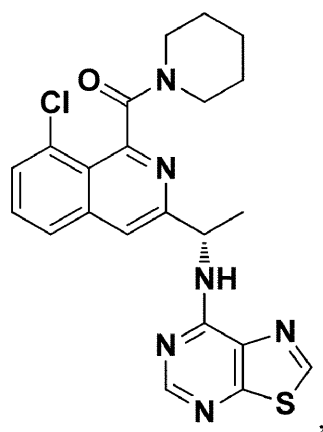
226



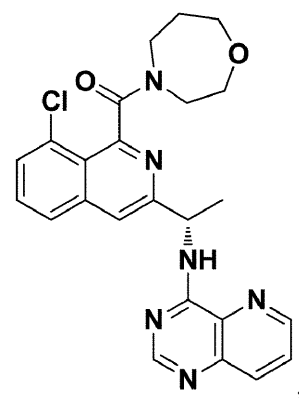
227



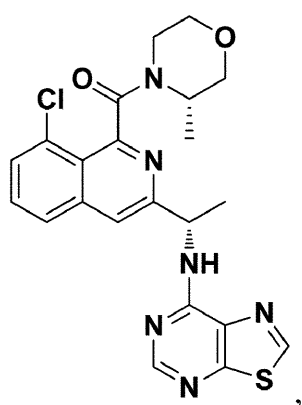
228



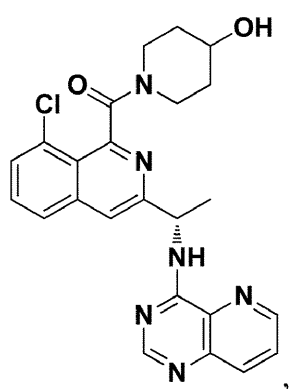
229



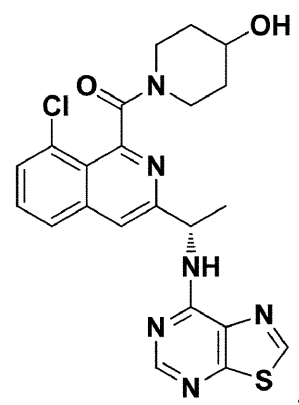
231



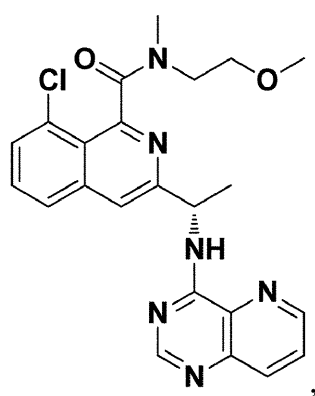
232



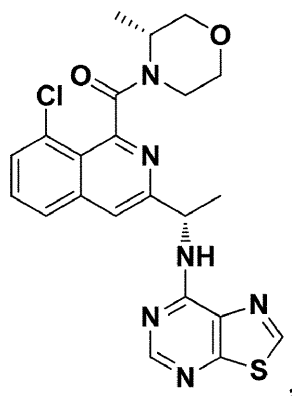
233



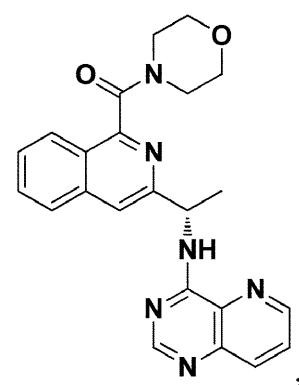
234



244

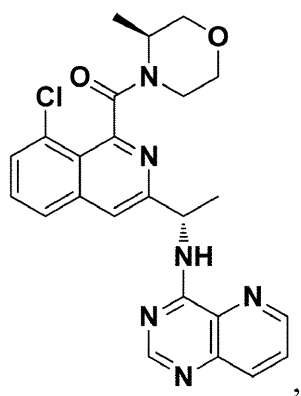


246

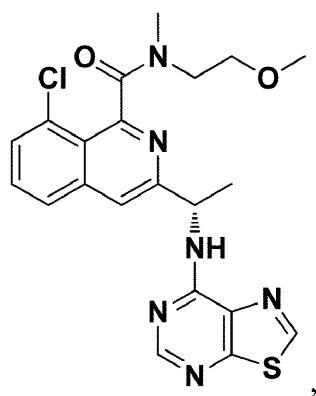


247

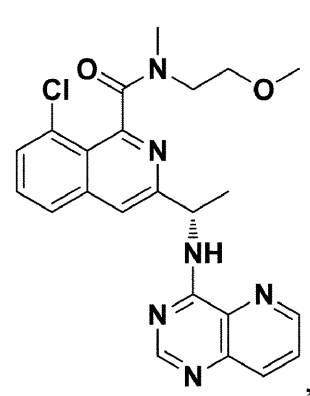




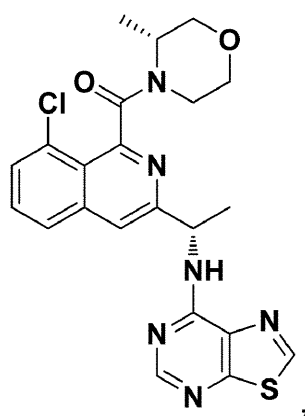
248



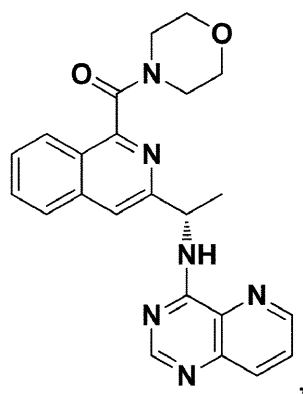
249



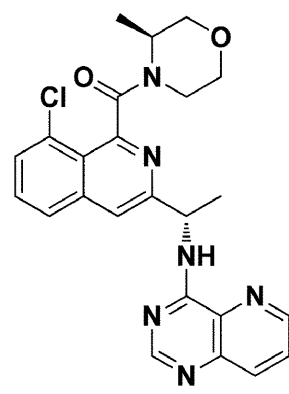
250



252

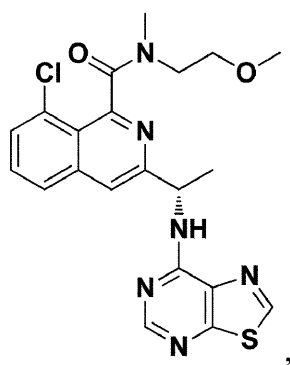


253



254

若しくは

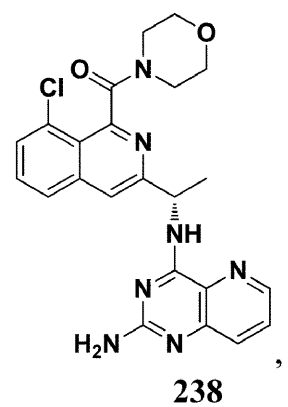
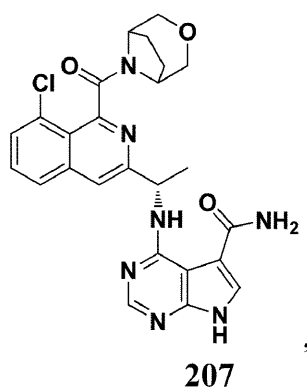
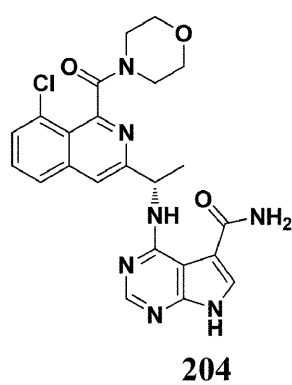
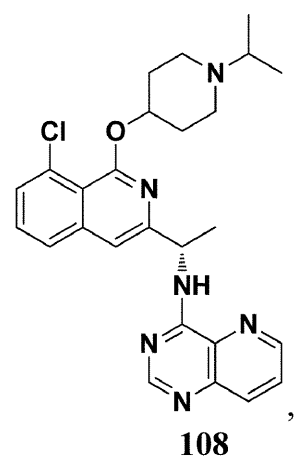
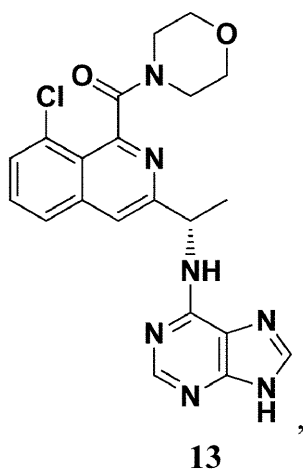
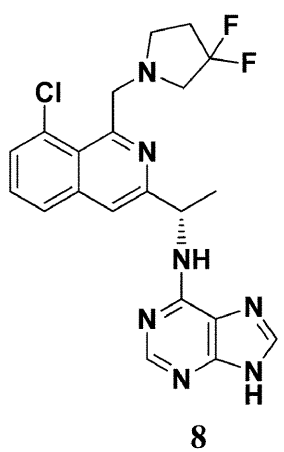
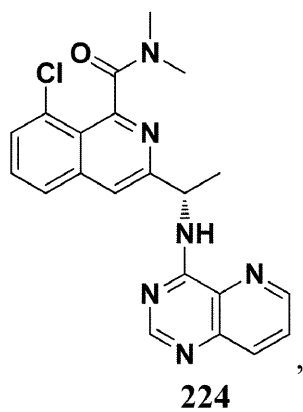
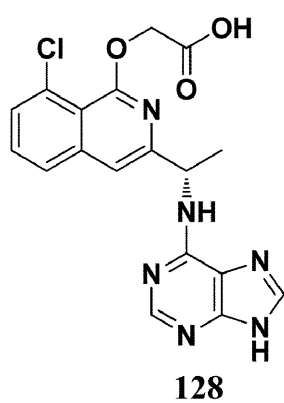


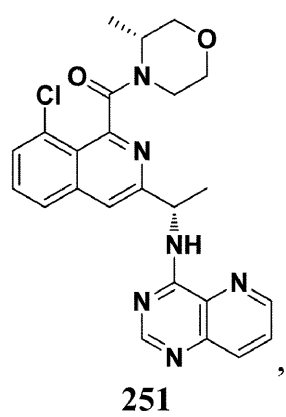
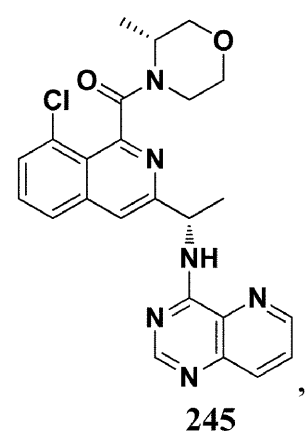
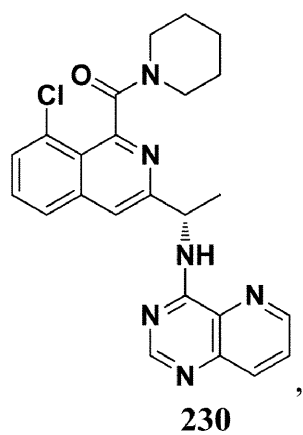
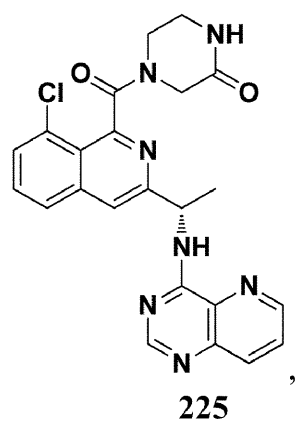
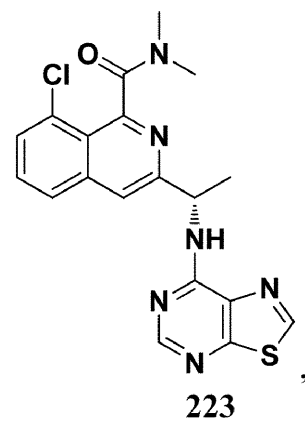
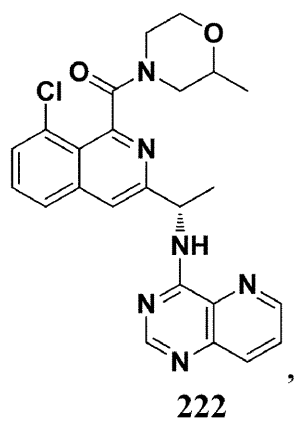
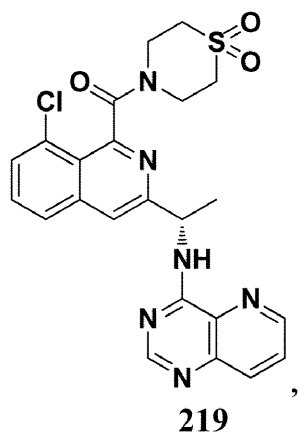
255

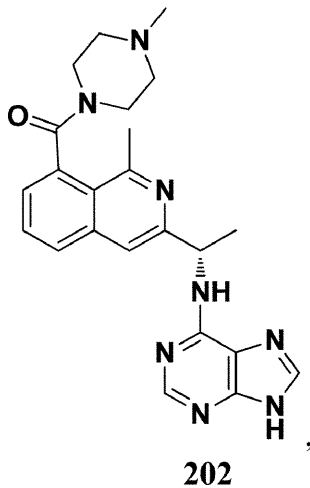
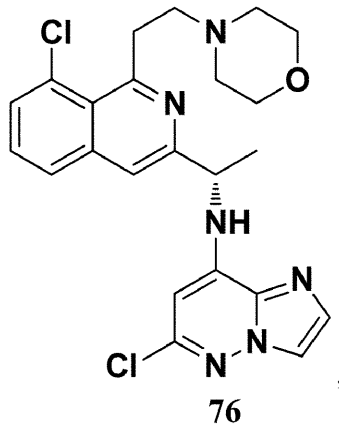
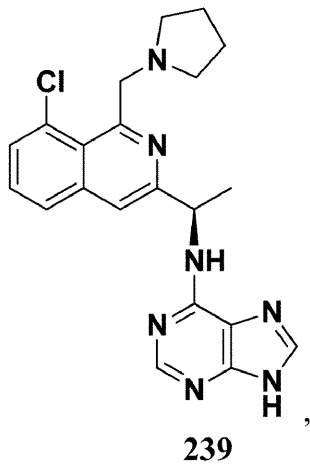
である化合物、又はその医薬として許容し得る形態。

【請求項 33】

【化 1 1】







である化合物又はその医薬として許容し得る形態。

【請求項 3 4】

請求項1～33のいずれか一項記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 3 5】

対象のPI3K媒介性障害の治療用医薬の製造における、請求項1～33のいずれか一項記載の化合物、又は、請求項34記載の医薬組成物の使用。

【請求項 3 6】

前記医薬が、第2の治療剤と共投与される、請求項35記載の使用。

【請求項 3 7】

前記障害が、癌、炎症性疾患、又は自己免疫疾患である、請求項35記載の使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 5 6

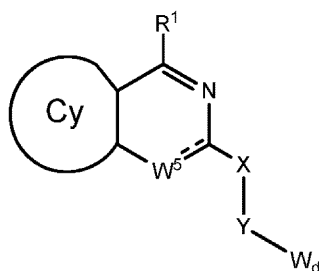
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 5 6】

一態様では、本明細書で記載されるのは、式(1)の化合物、又はその医薬として許容し得るその形態である：

## 【化 1 4】



式 (I)

(式中、

$W^5$  は、N、 $CHR^4$ 、又は $CR^4$ であり；

$R^4$  は、水素、アルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、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、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、チオ、スルホキシド、スルホン、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、又は $NR'R''$ であり、ここで、 $R'$ 及び $R''$ は、窒素と一緒に、環部分を形成し、

Cyは、 $R^3$ の0～4回の出現によって置換されたアリール又はヘテロアリールであり；

$R^1$ は $-(L)_n-R^{1'}$ であり；

各Lは、独立に、結合、アルキレン、ヘテロアルキレン、 $-N(R^2)-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-S-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-P(=O)R^2-$ 、又は $-O-$ であり；

$R^{1'}$ は、水素、アルキル、ヘテロアルキル、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、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、アミノ、アミド、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、 $-(C=O)-NR^{a1}R^{a2}$ 、又は $NR^{a1}R^{a2}$ であり；

$R^{a1}$ 及び $R^{a2}$ は、各々独立に、水素、アルキル、ヘテロアルキル、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、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、チオ、スルホキシド、スルホン、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネートであるか、又は $R^{a1}$ 及び $R^{a2}$ は、窒素と一緒に、環部分を形成し；

$R^2$ は、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアルキル、アリール、又はヘテロアリールであり；

各 $R^3$ は、独立に、アルキル、ヘテロアルキル、ハロアルキル、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、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、チオ、スルホキシド、スルホン、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、又は $NR'R''$ であり、ここで、 $R'$ 及び $R''$ は、窒素と一緒に、環部分を形成し；

Xは、存在しないか、又は $-(CH(R^{10}))_z-$ であり；

Yは、非存在、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、 $-N(R^9)-$ 、 $-C(=O)-(CHR^{10})_z-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-N(R^9)-C(=O)-$ 、 $-N(R^9)-C(=O)NH-$ 、 $-N(R^9)C(R^{10})_2-$ 、 $-C(=O)-(CHR^{10})_z-$ 、 $-C(=O)-N(R^9)-(CHR^{10})_z-$ 、又は $-P(=O)R_2-$ であり；

各zは、1、2、3、又は4の整数であり；

nは、0、1、2、3、又は4の整数であり；

各 $R^9$ は、独立に、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、ヘテロアルキル、アリール、又はヘテロアリールであり；

$W_d$ は、ヘテロシクロアルキル、アリール、シクロアルキル、又はヘテロアリールであり

、ここで、 $W_d$  は、1以上の $R^b$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、及び $R^{13}$ で任意に置換されており；かつ

各 $R_b$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、及び $R^{13}$ は、独立に、水素、アルキル、ヘテロアルキル、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、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコキシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、ハロアルキル、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、ホスフェート、尿素、カルボネート、又は $NR'R''$ であり、ここで、 $R'$ 及び $R''$ は、窒素と一緒にあって、環部分を形成する)。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】配列表

【補正方法】追加

【補正の内容】

【配列表】

2013545749000001.app