

【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20年5月29日(2008.5.29)

【公表番号】特表2008-508192(P2008-508192A)

【公表日】平成20年3月21日(2008.3.21)

【年通号数】公開・登録公報2008-011

【出願番号】特願2007-522886(P2007-522886)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4365 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 487/04 1 4 0

C 0 7 D 495/04 1 0 5 A

C 0 7 D 495/04 C S P

A 6 1 K 31/4365

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/506

C 0 7 D 495/04 1 0 5 Z

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成20年4月9日(2008.4.9)

【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

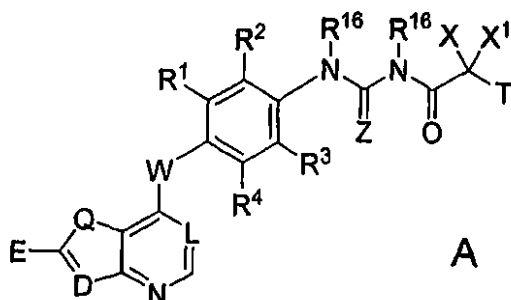
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

VEGFレセプターシグナル伝達およびHGFレセプターシグナル伝達の阻害剤である、式(A)で表される化合物並びにこれらの薬学的に許容し得る塩および複合体：

【化1】



式中、Tは、アリーールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリーールおよびヘテロアリーールからなる群から選択され、ここで、前記アリーールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリーールおよびヘテロアリーールの各々は、随意に1～3個の独立して選択された $R^{20}$ で置換されており；

各々の $R^{20}$ は、独立して、-H、ハロゲン、トリハロメチル、-CN、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-OR<sup>17</sup>、-OCF<sub>3</sub>、-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>、-S(O)<sub>0-2</sub>R<sup>17</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>17</sup>R<sup>17</sup>、-C(O)OR<sup>17</sup>、-C(O)NR<sup>17</sup>R<sup>17</sup>、-N(R<sup>17</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>17</sup>、-N(R<sup>17</sup>)C(O)R<sup>17</sup>、-N(R<sup>17</sup>)C(O)OR<sup>17</sup>、-C(O)R<sup>17</sup>、-C(O)SR<sup>17</sup>、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルチオ、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>アリーール、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>ヘテロアリーール、-(CH<sub>2</sub>)<sub>0-5</sub>(アリーール)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>0-5</sub>(ヘテロアリーール)、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>0-4</sub>-T<sup>2</sup>、随意に置換されているC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、随意にC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシにより置換されているC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルにより随意に置換されているアミノおよび飽和または不飽和の3～7員環炭素環式または複素環式基からなる群から選択され、ここで、T<sup>2</sup>は、-OH、-OMe、-OEt、-NH<sub>2</sub>、-NHMe、-NMe<sub>2</sub>、-NHEtおよび-NEt<sub>2</sub>からなる群から選択され、かつここで、アリーール、ヘテロアリーール、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルおよびC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルは、随意に置換されており；

Wは、O、S、NHおよびNMeからなる群から選択され；

Zは、OまたはSおよびNHからなる群から選択され；

XおよびX<sup>1</sup>は、独立して、H、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、ハロ、シアノまたはニトロからなる群から選択され、ここで、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルは、随意に置換されており、あるいはXおよびX<sup>1</sup>は、これらが結合している原子と一緒に、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキルを形成し；

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は、独立して、水素、ハロ、トリハロメチル、-CN、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-OR<sup>17</sup>、-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>、-C(O)OR<sup>17</sup>、-C(O)R<sup>17</sup>、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルを表し、ここで、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルおよびC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルは、随意に置換されており；

R<sup>17</sup>は、HおよびR<sup>18</sup>からなる群から選択され；

R<sup>18</sup>は、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、アリーール、アリーール(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、ヘテロシクリルおよびヘテロシクリル(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)からなる群から選択され、この各々は、随意に置換されており、あるいは

R<sup>17</sup>およびR<sup>18</sup>は、これらが結合している共通の窒素と一緒に、随意に置換されている5～7員環ヘテロシクリル、N、O、SおよびPからなる群から選択された少なくとも1個の追加の環状のヘテロ原子を随意に含む、随意に置換されている5～7員環ヘテロシクリルを形成し；

R<sup>16</sup>は、-H、-CN、-(CH<sub>2</sub>)<sub>0-5</sub>(アリーール)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>0-5</sub>(ヘテロアリーール)、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>0-4</sub>-T<sup>2</sup>、随意に置換されているC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルカルボニルおよび飽和または不飽和の3～7員環炭素環式または複素環式基からなる群から選択され、ここで、T<sup>2</sup>は、-OH、-OMe、-OEt、-NH<sub>2</sub>、-NHMe、-NMe<sub>2</sub>、-NHEtおよび-NEt<sub>2</sub>からなる群から選択され、かつここで、アリーール、ヘテロアリーール、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルおよびC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルは、随意に置換されており；

Qは、CH<sub>2</sub>、O、S、N(H)、N(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、N-Y-(アリーール)、-N-OMe、-NCH<sub>2</sub>OMeおよび-N-Bnからなる群から選択され；

Dは、C-EおよびNからなる群から選択され；

Lは、NまたはCRであり、ここで、Rは、-H、ハロ、-CN、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル

、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルおよび  $C_2 \sim C_6$  アルキニルからなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルおよび  $C_2 \sim C_6$  アルキニルは、随意に置換されており；また

$E$  は、 $E^1$ 、 $E^2$  および  $E^3$  からなる群から選択され、ここで

$E^1$  は、 $-H$ 、ハロゲン、ニトロ、アジド、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル、 $-C(O)NR^4 R^4$ 、 $-Y-NR^4 R^4$ 、 $-NR^4 C(O)R^4$ 、 $-SO_2 R^4$ 、 $-SO_2 NR^4 R^4$ 、 $-NR^3 SO_2 R^4$ 、 $-NR^3 SO_2 NR^4 R^4$ 、 $-C(=N-OR^4)R^4$ 、 $-C(=NR^4)R^4$ 、 $-NR^3 C(=NR^4)R^4$ 、 $-C(=NR^4)NR^3 R^4$ 、 $-NR^3 C(=NR^4)NR^3 R^4$ 、 $-C(O)R^4$ 、 $-CO_2 R^4$ 、 $-C(O)$  (ヘテロシクリル)、 $-C(O)$  ( $C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-C(O)$  (ヘテロアリール)、 $-Y$  ( $C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-Y$  (ヘテロアリール)、 $-Y$  (5~10員環複素環)、 $-NR^6 a R^6 b$ 、 $-NR^6 a SO_2 R^6 b$ 、 $-NR^6 a C(O)R^6 b$ 、 $-OC(O)R^6 b$ 、 $-NR^6 a C(O)OR^6 b$ 、 $-OC(O)NR^6 a R^6 b$ 、 $-OR^6 a$ 、 $-SR^6 a$ 、 $-S(O)R^6 a$ 、 $-SO_2 R^6 a$ 、 $-SO_3 R^6 a$ 、 $-SO_2 NR^6 a R^6 b$ 、 $-SO_2 NR^4 R^4$ 、 $-COR^6 a$ 、 $-CO_2 R^6 a$ 、 $-CONR^6 a R^6 b$ 、 $C_1 \sim C_4$  フルオロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  フルオロアルコキシ、 $-(CZ^3 Z^4)_a$   $C_N$  からなる群から選択され、ここで、 $n$  は、0~6の範囲内の整数であり、 $-H$  およびハロゲン以外の前記  $E^1$  基は、随意に、1~5個の独立して選択された  $R^3$  により置換されており、または  $E^1$  は、 $-(CZ^3 Z^4)_a$  - アリール、 $-(CZ^3 Z^4)_a$  - 複素環、 $C_2 \sim C_6$  アルキニル、 $-(CZ^3 Z^4)_a$  - ( $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル)、 $-(CZ^3 Z^4)_a$  - ( $C_5 \sim C_6$  シクロアルケニル)、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルおよび  $C_1 \sim C_6$  アルキルからなる群から選択された部分から選択され、これは、随意に、1~3個の独立して選択された  $Y^2$  基で置換されており、ここで、 $a$  は、0、1、2または3であり、またここで、 $a$  が2または3である場合には、 $CZ^3 Z^4$  単位は、同一であっても異なってもよく；ここで、

各々の  $R^3$  は、独立して、ハロ、シアノ、ニトロ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、アジド、 $-C(O)R^4$ 、 $-C(O)OR^4$ 、 $-OC(O)R^4$ 、 $-OC(O)OR^4$ 、 $-NR^3 C(O)R^3$ 、 $-C(O)NR^3 R^3$ 、 $-NR^3 R^3$ 、 $-OR^3$ 、 $-SO_2 NR^3 R^3$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-(CH_2)_j O(CH_2)_i NR^3 R^3$ 、 $-(CH_2)_n O(CH_2)_i OR^3$ 、 $-(CH_2)_n OR^3$ 、 $-S(O)_j (C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $-(CH_2)_n (C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-(CH_2)_n (C_5 \sim C_{10}$  ヘテロアリール)、 $-(CH_2)_n$  (5~10員環ヘテロシクリル)； $-C(O) (CH_2)_n (C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-(CH_2)_n O(CH_2)_j (C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-(CH_2)_n O(CH_2)_i$  (5~10員環ヘテロシクリル)、 $-C(O) (CH_2)_n$  (5~10員環ヘテロシクリル)、 $-(CH_2)_j NR^3 (CH_2)_i NR^3 R^3$ 、 $-(CH_2)_j NR^3 CH_2 C(O)NR^3 R^3$ 、 $-(CH_2)_j NR^3 (CH_2)_i NR^3 C(O)R^4$ 、 $-(CH_2)_j NR^3 (CH_2)_n O(CH_2)_i OR^3$ 、 $-(CH_2)_j NR^3 (CH_2)_i S(O)_j (C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $-(CH_2)_j NR^3 (CH_2)_n R^3$ 、 $-SO_2 (CH_2)_n (C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-SO_2 (CH_2)_n$  (5~10員環ヘテロシクリル)、 $-(CH_2)_n NR^3 R^3$ 、 $-NR^3 SO_2 NR^3 R^3$ 、 $SO_2 R^3$ 、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキルおよび  $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノから選択され、ここで、 $j$  は、0~2の範囲内の整数であり、 $n$  は、0~6の範囲内の整数であり、 $i$  は、0~6の範囲内の整数であり、前記  $R^3$  基の  $-(CH_2)_i$  および  $-(CH_2)_n$  部分は、随意に、炭素-炭素二重または三重結合を含み、ここで、 $n$  は、2~6の整数であり、前記  $R^3$  基のアルキル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリル部分は、随意に、独立してハロ、シアノ、ニトロ、トリフルオロメチル、アジド、 $-OH$ 、 $-C(O)R^4$ 、 $-C(O)OR^4$ 、 $-OC(O)R^4$ 、 $-OC(O)OR^4$ 、 $-NR^3 C(O)R^3$ 、 $-C(O)NR^3 R^3$

、 $-(CH_2)_n NR^{36} R^{39}$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル、 $-(CH_2)_n (C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-(CH_2)_n (5 \sim 10$  員環ヘテロシクリル)、 $-(CH_2)_n O(CH_2)_i OR^{37}$  および  $-(CH_2)_n OR^{37}$  からなる群から選択された1個または2個以上の置換基により置換されており、ここで  $n$  は、 $0 \sim 6$  の範囲内の整数であり、 $i$  は、 $2 \sim 6$  の範囲内の整数であり；

各々の  $R^{42}$  および  $R^{43}$  は、独立して  $H$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ヘテロアルキル、 $-Y-(C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル)、 $-Y-(C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-Y-(C_6 \sim C_{10}$  ヘテロアリール)、 $-Y-(5 \sim 10$  員環複素環)、 $-Y-O-Y^1$ 、 $-OR^{37}$ 、 $-Y^1-CO_2-R^{37}$  および  $-Y-OR^{37}$  からなる群から選択され、ここで前記  $R^{42}$  および  $R^{43}$  基のアルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよび複素環部分は、随意に、独立して  $R^{44}$  から選択された1個または2個以上の置換基により置換されており、ここで、

$Y$  は、結合であるかまたは  $-(C(R^{37})(H))_n$  であり、

$n$  は、 $1 \sim 6$  の範囲内の整数であり、また

$Y^1$  は、 $-(C(R^{37})(H))_n$  であり、あるいは

$R^{42}$  および  $R^{43}$  は、これらが結合している窒素と一緒に、 $C_5 \sim C_9$  ヘテロシクリル環またはヘテロアリール環を形成し、ここで、前記環は、随意に、 $1 \sim 5$  個の独立して選択された  $R^{44}$  置換基により置換されており、ただし、 $R^{42}$  および  $R^{43}$  は、両方が酸素を介して窒素に結合していることはなく；

各々の  $R^{44}$  は、独立して、ハロ、シアノ、ニトロ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、アジド、 $-C(O)R^{40}$ 、 $-C(O)OR^{40}$ 、 $-OC(O)R^{40}$ 、 $-OC(O)OR^{40}$ 、 $-NR^{36}C(O)R^{39}$ 、 $-C(O)NR^{36}R^{39}$ 、 $-NR^{36}R^{39}$ 、 $-OR^{37}$ 、 $-SO_2NR^{36}R^{39}$ 、 $-SO_2R^{36}$ 、 $-NR^{36}SO_2R^{39}$ 、 $-NR^{36}SO_2NR^{37}R^{41}$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_2 \sim C_6$  アルキニル、 $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル、 $-C_1 \sim C_6$  アルキルアミノ、 $-(CH_2)_j O(CH_2)_i NR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_n O(CH_2)_i OR^{37}$ 、 $-(CH_2)_n OR^{37}$ 、 $-S(O)_j (C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $-(CH_2)_n (C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-(CH_2)_n (5 \sim 10$  員環複素環)、 $-C(O)(CH_2)_n (C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-(CH_2)_n O(CH_2)_j (C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-(CH_2)_n O(CH_2)_i (5 \sim 10$  員環複素環)、 $-C(O)(CH_2)_n (5 \sim 10$  員環複素環)、 $-(CH_2)_j NR^{39} (CH_2)_i NR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_j NR^{39} CH_2 C(O)NR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_j NR^{39} (CH_2)_i NR^{37} C(O)R^{40}$ 、 $-(CH_2)_j NR^{39} (CH_2)_n O(CH_2)_i OR^{37}$ 、 $-(CH_2)_j NR^{39} (CH_2)_i S(O)_j (C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $-(CH_2)_j NR^{39} (CH_2)_n R^{36}$ 、 $-SO_2(CH_2)_n (C_6 \sim C_{10}$  アリール) および  $-SO_2(CH_2)_n (5 \sim 10$  員環複素環) からなる群から選択され、ここで、 $j$  は、 $0 \sim 2$  の整数であり、 $n$  が、 $0 \sim 6$  の整数であり、 $i$  は、 $2 \sim 6$  の範囲内の整数であり、前記  $R^{44}$  基の  $-(CH_2)_i$  および  $-(CH_2)_{n-1}$  部分は、随意に、炭素-炭素二重または三重結合を含み、ここで、 $n$  は、 $2 \sim 6$  の整数であり、前記  $R^{44}$  基のアルキル、アリールおよび複素環部分は、随意に、独立してハロ、シアノ、ニトロ、トリフルオロメチル、アジド、 $-OH$ 、 $-C(O)R^{40}$ 、 $-C(O)OR^{40}$ 、 $-OC(O)R^{40}$ 、 $-OC(O)OR^{40}$ 、 $-NR^{36}C(O)R^{39}$ 、 $-C(O)NR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_n NR^{36}R^{39}$ 、 $-SO_2R^{36}$ 、 $-SO_2NR^{36}R^{39}$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル、 $-(CH_2)_n (C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-(CH_2)_n (5 \sim 10$  員環複素環)、 $-(CH_2)_n O(CH_2)_i OR^{37}$  および  $-(CH_2)_n OR^{37}$  からなる群から選択された1個または2個以上の置換基により置換されており、ここで  $n$  は、 $0 \sim 6$  の整数であり、 $i$  は、 $2 \sim 6$  の整数であり；また

各々の  $R^{40}$  は、独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $-(CH_2)_n (C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキルおよび  $-(CH_2)_n (5 \sim 10$  員環複素環) から選択され、ここで  $n$  が、 $0 \sim 6$  の範囲内の整数であり；

各々の  $R^{36}$  および  $R^{39}$  は、独立して H、-OH、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル、 $-(CH_2)_n (C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-(CH_2)_n (5 \sim 10$  員環複素環)、 $-(CH_2)_n O (CH_2)_i OR^{37}$ 、 $-(CH_2)_n CN (CH_2)_n OR^{37}$ 、 $-(CH_2)_n CN (CH_2)_n R^{37}$  および  $-(CH_2)_n OR^{37}$  からなる群から選択され、ここで、 $n$  は、 $0 \sim 6$  の範囲内の整数であり、 $i$  は、 $2 \sim 6$  の範囲内の整数であり、前記  $R^{36}$  および  $R^{39}$  基のアルキル、アリールおよび複素環部分は、随意に、独立して -OH、ハロ、シアノ、ニトロ、トリフルオロメチル、アジド、 $-C(O)R^{40}$ 、 $-C(O)OR^{40}$ 、 $-CO(O)R^{40}$ 、 $-OC(O)OR^{40}$ 、 $-NR^{37}C(O)R^{41}$ 、 $-C(O)NR^{37}R^{41}$ 、 $-NR^{37}R^{41}$ 、 $-C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-(CH_2)_n (C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-(CH_2)_n (5 \sim 10$  員環複素環)、 $-(CH_2)_n O (CH_2)_i OR^{37}$  および  $-(CH_2)_n OR^{37}$  から選択された 1 個または 2 個以上の置換基により置換されており、ここで  $n$  は、 $0 \sim 6$  の範囲内の整数であり、 $i$  は、 $2 \sim 6$  の範囲内の整数であり、ただし  $R^{36}$  および  $R^{39}$  が共に同一の窒素に結合している場合には、 $R^{36}$  および  $R^{39}$  は、両方が直接酸素を介して窒素に結合していることはなく；

各々の  $R^{37}$  および  $R^{41}$  は、独立して、H、 $OR^{36}$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキルおよび  $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキルからなる群から選択され；

各々の  $R^{6a}$  および  $R^{6b}$  は、独立して、水素、 $-(CZ^5Z^6)_u - (C_3 \sim C_6$  シクロアルキル)、 $-(CZ^5Z^6)_u - (C_5 \sim C_6$  シクロアルケニル)、 $-(CZ^5Z^6)_u -$  アリール、 $-(CZ^5Z^6)_u -$  ヘテロアリール、 $-(CZ^5Z^6)_u -$  複素環、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルおよび  $C_1 \sim C_6$  アルキルからなる群から選択され、この各々は、随意に、 $1 \sim 3$  個の独立して選択された  $Y^3$  基で置換されており、ここで、 $u$  は、 $0$ 、 $1$ 、 $2$  または  $3$  であり、またここで、 $u$  は  $2$  または  $3$  である場合には、 $CZ^5Z^6$  単位は、同一であっても異なってもよく、あるいは

$R^{6a}$  および  $R^{6b}$  は、隣接する原子と一緒に複素環を形成することができ；

各々の  $Z^3$ 、 $Z^4$ 、 $Z^5$  および  $Z^6$  は、独立して、H、F および  $C_1 \sim C_6$  アルキルからなる群から選択され、あるいは、

各々の  $Z^3$  および  $Z^4$ 、または  $Z^5$  および  $Z^6$  は、一緒に炭素環を形成するように選択され、あるいは

隣接する炭素原子上の 2 個の  $Z^3$  基は、一緒に随意に炭素環を形成するように選択され；

各々の  $Y^2$  および  $Y^3$  は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、テトラゾリル、グアニジノ、アミジノ、メチルグアニジノ、アジド、 $-C(O)Z^7$ 、 $-OC(O)NH_2$ 、 $-OC(O)NHZ^7$ 、 $-OC(O)NZ^7Z^8$ 、 $-NHC(O)Z^7$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NHC(O)NHZ^7$ 、 $-NHC(O)NZ^7Z^8$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OZ^7$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(O)NHZ^7$ 、 $-C(O)NZ^7Z^8$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-P(O)_3(Z^7)_2$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-S(O)Z^7$ 、 $-S(O)_2Z^7$ 、 $-S(O)_3Z^7$ 、 $-Z^7$ 、 $-OZ^7$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NHZ^7$ 、 $-NZ^7Z^8$ 、 $-C(=NH)NH_2$ 、 $-C(=NOH)NH_2$ 、 $-N$ -モルホリノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_2 \sim C_6$  アルキニル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$  ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシ、 $-(CZ^9Z^{10})_r NH_2$ 、 $-(CZ^9Z^{10})_r NHZ^3$ 、 $-(CZ^9Z^{10})_r NZ^7Z^8$ 、 $-X^6(CZ^9Z^{10})_r - (C_3 \sim C_8$  シクロアルキル)、 $-X^6(CZ^9Z^{10})_r - (C_5 \sim C_8$  シクロアルケニル)、 $-X^6(CZ^9Z^{10})_r -$  アリールおよび  $-X^6(CZ^9Z^{10})_r -$  複素環からなる群から選択され、ここで、

$r$  は、 $1$ 、 $2$ 、 $3$  または  $4$  であり；

$X^6$  は、O、S、NH、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)NH-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$  および  $-S(O)_3-$  からなる群から選択され；

$Z^7$  および  $Z^8$  は、独立して、 $1 \sim 12$  個の炭素原子を有するアルキル、 $2 \sim 12$  個の炭素原子を有するアルケニル、 $2 \sim 12$  個の炭素原子を有するアルキニル、 $3 \sim 8$  個の炭素原子を有するシクロアルキル、 $5 \sim 8$  個の炭素原子を有するシクロアルケニル、 $6 \sim 1$

4 個の炭素原子を有するアリール、5 ~ 14 個の環原子を有する複素環、7 ~ 15 個の炭素原子を有するアラルキル、および 5 ~ 14 個の環原子を有するヘテロアラルキルからなる群から選択され、あるいは、

$Z^7$  および  $Z^8$  は、一緒に随意に複素環を形成することができ；

$Z^9$  および  $Z^{10}$  は、独立して、H、F、 $C_1 \sim C_{12}$  アルキル、 $C_6 \sim C_{14}$  アリール、 $C_5 \sim C_{14}$  ヘテロアリール、 $C_7 \sim C_{15}$  アラルキル および  $C_5 \sim C_{14}$  ヘテロアラルキル からなる群から選択され、あるいは、

$Z^9$  および  $Z^{10}$  は、一緒に炭素環を形成し、あるいは、

隣接している炭素原子上の 2 個の  $Z^9$  基は、一緒に炭素環を形成し；あるいは、隣接する炭素原子に結合した 2 つの  $Y^2$  または  $Y^3$  基はいずれも、一緒になって、 $-O[C(Z^9)(Z^{10})]_rO$  または  $-O[C(Z^9)(Z^{10})]_{r+1}$  であってもよく、あるいは、

同一の、または隣接する炭素原子に結合した 2 つの  $Y^2$  または  $Y^3$  基はいずれも、炭素環または複素環を形成するように一緒に選択されてもよく；またここで、ハロゲン、SO もしくは  $SO_2$  基または N、O もしくは S 原子に結合していない  $CH_3$  (メチル)、 $CH_2$  (メチレン)、または CH (メチン) 基を含む前述の置換基はいずれも、随意に、前記基上に、ヒドロキシ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルコキシ および  $-N[C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}][C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}]$  から選択された置換基を有し；

$E^2$  は、 $-C=CH$  または  $-C=C-(CR^{45}R^{45})_n-R^{46}$  であり；

$R^{45}$  は、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル および  $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル からなる群から選択され；

$R^{46}$  は、ヘテロシクリル、 $-N(R^{47})-C(O)-N(R^{47})(R^{48})$ 、 $-N(R^{47})-C(S)-N(R^{47})(R^{48})$ 、 $-N(R^{47})-C(O)-OR^{48}$ 、 $-N(R^{47})-C(O)-(CH_2)_n-R^{48}$ 、 $-N(R^{47})-SO_2R^{47}$ 、 $-(CH_2)_nNR^{47}R^{48}$ 、 $-(CH_2)_nOR^{48}$ 、 $-(CH_2)_nSR^{49}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)R^{49}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_2R^{49}$ 、 $-OC(O)R^{49}$ 、 $-OC(O)OR^{49}$ 、 $-C(O)NR^{47}R^{48}$ 、並びにハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-CN$ 、 $-SO_2R^{50}$  および  $-(CH_2)_nNR^{50}R^{51}$  からなる群から選択された 1 つまたは 2 つ以上の置換基で随意に置換されているヘテロアリール、並びにハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-CN$ 、 $-SO_2R^{50}$  および  $-(CH_2)_nNR^{50}R^{51}$  からなる群から選択された 1 つまたは 2 つ以上の置換基で随意に置換されているアリールからなる群から選択され；

$R^{47}$  および  $R^{48}$  は、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、ヘテロシクリル、 $-(CH_2)_nNR^{50}R^{51}$ 、 $-(CH_2)_nOR^{50}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R^{49}$ 、 $-C(O)_2R^{49}$ 、 $-(CH_2)_nSR^{49}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)R^{49}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_2R^{49}$ 、 $-(CH_2)_nR^{49}$ 、 $-(CH_2)_nCN$ 、並びにハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-CN$ 、 $-(CH_2)_nOR^{49}$ 、 $-(CH_2)_n$ ヘテロシクリル、 $-(CH_2)_n$ ヘテロアリール、 $-SO_2R^{50}$  および  $-(CH_2)_nNR^{50}R^{51}$  からなる群から選択された 1 つまたは 2 つ以上の置換基で随意に置換されているアリール、並びにハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-CN$ 、 $-(CH_2)_nOR^{49}$ 、 $-(CH_2)_n$ ヘテロシクリル、 $-(CH_2)_n$ ヘテロアリール、 $-SO_2R^{50}$  および  $-(CH_2)_nNR^{50}R^{51}$  からなる群から選択された 1 つまたは 2 つ以上の置換基で随意に置換されているヘテロアリールからなる群から選択され、あるいは、

$R^{47}$  および  $R^{48}$  は、これらが結合している原子と一緒に、3 ~ 8 員環を形成し；

$R^{49}$  は、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、ヘテロシクリル ( $C_1 \sim C_6$  アルキレン)、アリール ( $C_1 \sim C_6$  アルキレン)、アリールは随意にハロ、 $-CF$

3、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CN$ 、 $-SO_2R^{50}$  および  $-(CH_2)_nNR^{50}R^{51}$  からなる群から選択された1つまたは2つ以上の置換基で置換されているアリール $C_1 \sim C_6$ アルキレン、ヘテロアリールは随意にハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CN$ 、 $-SO_2R^{50}$  および  $-(CH_2)_nNR^{50}R^{51}$  からなる群から選択された1つまたは2つ以上の置換基で置換されているヘテロアリール( $C_1 \sim C_6$ アルキレン)、並びに随意にハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CN$ 、 $-SO_2R^{50}$  および  $-(CH_2)_nNR^{50}R^{51}$  からなる群から選択された1つまたは2つ以上の置換基で置換されているアリール、並びに随意にハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CN$ 、 $-SO_2R^{50}$  および  $-(CH_2)_nNR^{50}R^{51}$  からなる群から選択された1つまたは2つ以上の置換基で置換されているヘテロアリールからなる群から選択され；

$R^{50}$  および  $R^{51}$  は、独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル および  $-C(O)R^{45}$  からなる群から選択され、あるいは、

$R^{50}$  および  $R^{51}$  は、これらが結合している原子と一緒に、3～8員環を形成し；また  $E^3$  は、 $-(Z^{11})-(Z^{12})_m-(Z^{13})_{m1}$  により定義される基であり、ここで、

$Z^{11}$  は、ヘテロシクリルまたはヘテロシクリレンであり；

$Z^{12}$  は、 $OC(O)$ 、 $OC(S)$  および  $C(O)$  からなる群から選択され；

$Z^{13}$  は、ヘテロシクリル、アラルキル、 $N(H)R^{52}$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-OR^{52}$ 、ハロ、 $S(O)_2R^{56}$ 、 $C_1 \sim C_3$ ヒドロキシアルキル および  $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルからなる群から選択され；

$m$  は、0または1であり；

$m1$  は、0または1であり；

$R^{52}$  は、 $H$ 、 $-(CH_2)_qS(O)_2R^{54}$ 、 $R^{55}NR^{53}R^{53}$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-(CH_2)_qOR^{53}$ 、 $-C(O)R^{54}$  および  $-C(O)OR^{53}$  からなる群から選択され；

$q$  は、0、1、2、3または4であり；

$R^{53}$  は、 $C_1 \sim C_3$ アルキルであり；

$R^{54}$  は、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $N(H)R^{53}$ であり；

$R^{55}$  は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；また

$R^{56}$  は、 $NH_2$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルキル および  $OR^{52}$  からなる群から選択される。

#### 【請求項2】

Tが、アリールまたはヘテロアリールであり、ここで、前記アリールおよびヘテロアリールの各々は、随意に1～3個の独立して選択された $R^{20}$ で置換されている、請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項3】

$R^{20}$ が、 $H$ 、ハロゲン、 $-OR^{17}$  および  $-C(O)OR^{17}$  からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項4】

WがOである、請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項5】

ZがSまたはOである、請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項6】

Xおよび $X^1$ が、独立してHおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群から選択され、ここで $C_1 \sim C_6$ アルキルは、随意に置換されている、請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項7】

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  および  $R^4$  が、独立して、 $H$ 、ハロゲン、トリハロメチル、 $OR^{17}$ 、 $-NR^{17}R^{18}$  および  $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群から選択される、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 8】

R<sup>1 6</sup> が H または C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 9】

Q が、CH<sub>2</sub>、S、-N-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル)、N-Y-(アリール) および -N-OMe からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 10】

D が C-E である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 11】

D が CH である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 12】

L が C-R である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 13】

R が H またはハロゲンである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 14】

E が E<sup>1</sup> である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 15】

E が E<sup>1</sup> であり、ここで E<sup>1</sup> は、H、ハロゲン、-C(O)NR<sup>4 2</sup>R<sup>4 3</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>4 2</sup>R<sup>4 3</sup>、C(=NR<sup>4 2</sup>)NR<sup>3 7</sup>R<sup>4 3</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>4 2</sup>、-C(O)(ヘテロシクリル)、-C(O)(ヘテロアリール)、-Y-(C<sub>6</sub> ~ C<sub>10</sub> アリール)、-Y-(ヘテロアリール)、-Y-(5 ~ 10 員環複素環)、-SR<sup>6 a</sup>、-S(O)R<sup>6 a</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>6 a</sup> からなる群から選択され、ここで、H およびハロゲン以外の前記 E<sup>1</sup> の各々は、随意に、1 ~ 5 個の独立して選択された R<sup>3 8</sup> で置換されており、または E<sup>1</sup> は、随意に 1 ~ 3 個の独立して選択された Y<sup>2</sup> 基で置換されている C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 16】

R<sup>3 8</sup> が、ハロゲン、-C(O)OR<sup>4 0</sup>、-NR<sup>3 6</sup>C(O)R<sup>3 9</sup>、-C(O)NR<sup>3 6</sup>R<sup>3 9</sup>、-NR<sup>3 6</sup>R<sup>3 9</sup>、-OR<sup>3 7</sup>、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、-C(CH<sub>2</sub>)<sub>j</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>i</sub>NR<sup>3 6</sup>R<sup>3 9</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OR<sup>3 7</sup>、-S(O)<sub>j</sub>(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-(5 ~ 10 員環複素環)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>i</sub>(5 ~ 10 員環複素環)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>(5 ~ 10 員環ヘテロアリール)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>j</sub>NR<sup>3 9</sup>(CH<sub>2</sub>)<sub>i</sub>NR<sup>3 6</sup>R<sup>3 9</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>j</sub>NR<sup>3 9</sup>(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>R<sup>3 6</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sup>3 6</sup>R<sup>3 9</sup> からなる群から選択され、ここで、j は、0 ~ 2 の範囲内の整数であり、n は、0 ~ 6 の範囲内の整数であり、i は、1 ~ 6 の範囲内の整数であり、前記 R<sup>3 8</sup> 基の -(CH<sub>2</sub>)<sub>i</sub> および -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> 部分は、随意に、炭素-炭素二重または三重結合を含み、ここで、n は、2 ~ 6 の整数であり、前記 R<sup>3 8</sup> 基のアルキル、アリール、ヘテロアリールおよび複素環部分は、随意に、独立してハロ、シアノ、ニトロ、トリフルオロメチル、アジド、-OH、-C(O)R<sup>4 0</sup>、-C(O)OR<sup>4 0</sup>、-OC(O)R<sup>4 0</sup>、-OC(O)OR<sup>4 0</sup>、-NR<sup>3 6</sup>C(O)R<sup>3 9</sup>、-C(O)NR<sup>3 6</sup>R<sup>3 9</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sup>3 6</sup>R<sup>3 9</sup>、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルキル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>(C<sub>6</sub> ~ C<sub>10</sub> アリール)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>(5 ~ 10 員環ヘテロシクリル)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>i</sub>OR<sup>3 7</sup> および -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OR<sup>3 7</sup> からなる群から選択された 1 個または 2 個以上の置換基により置換されており、ここで n は、0 ~ 6 の範囲内の整数であり、i は、2 ~ 6 の範囲内の整数である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 17】

各々の R<sup>3 6</sup> および R<sup>3 9</sup> が、独立して H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>(5 ~ 10 員環複素環) および -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OR<sup>3 7</sup> からなる群から選択され、ここで n は、0 ~ 6 の範囲内の整数であり、i は、2 ~ 6 の範囲内の整数であり、ただし R<sup>3 6</sup> および R<sup>3 9</sup> が共に同一の窒素に結合している場合には、R<sup>3 6</sup> および R<sup>3 9</sup> は、両方が直接酸素を介して窒素に結合していることはない、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項18】

ZがOまたはSであり；

XおよびX<sup>1</sup>が、独立して、H、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、ハロ、シアノおよびニトロからなる群から選択され、ここで、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルは、随意に置換されており；

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>が、独立して、水素、ハロ、トリハロメチル、-OR<sup>17</sup>、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルからなる群から選択され、ここで、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルおよびC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルは、随意に置換されており；

Qが、O、S、NH、N(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)またはN-Y-(アリール)であり；

Dが、CR<sup>11</sup>またはNであり；

Lが、NまたはCRであり、ここで、Rは、H、ハロ、-CN、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルであり、ここで、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルおよびC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルは、随意に置換されており；また

R<sup>7</sup>が、H、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、-C(O)NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、-C(O)(C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール)、-C(O)(ヘテロシクリル)、-C(O)(ヘテロアリール)、-Y-(C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール)、-Y-(5～10員環ヘテロシクリル)、-Y-(ヘテロアリール)、-S-アリール、-S-(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-SO-(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-Y-NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>またはCO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>であり、ここで、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、アリール、複素環およびヘテロアリールは、各々独立して、随意にR<sup>38</sup>から選択される置換基によって独立して置換されており；

R<sup>9</sup>およびR<sup>10</sup>が、独立して、H、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、-Y-(C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルキル)、-Y-(C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール)、-Y-(C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクリル)、-Y-(C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロアリール)、-Y-O-Y<sup>1</sup>-O-R<sup>11</sup>、-Y<sup>1</sup>-CO<sub>2</sub>-R<sup>11</sup>および-Y-O-R<sup>11</sup>から選択され、ここで、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、シクロアルキル、アリール、複素環、およびヘテロアリールは、各々随意にR<sup>44</sup>から選択される1つまたは2つ以上の置換基によって独立して置換されており、あるいは、

R<sup>9</sup>およびR<sup>10</sup>が、これらが結合している窒素と一緒に、C<sub>5</sub>～C<sub>9</sub>ヘテロシクリル環またはヘテロアリール環を形成し、ここで、前記環は、随意にR<sup>44</sup>から選択される1つ～5つの置換基によって独立して置換されており、ただしR<sup>9</sup>およびR<sup>10</sup>の両方が酸素を通して窒素に直接結合していることはなく；

Yが、結合であるかまたは-(C(R<sup>11</sup>)(H))<sub>t</sub>-であり、ここでtは、1～6の整数であり；

Y<sup>1</sup>が、-(C(R<sup>11</sup>)(H))<sub>t</sub>-であり、

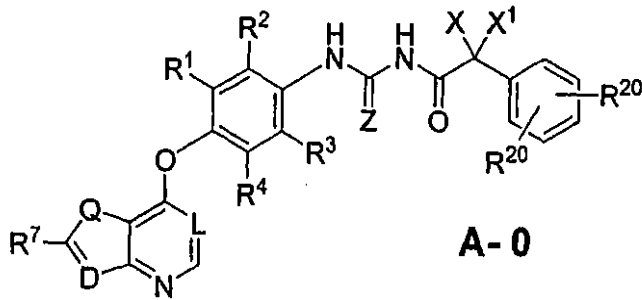
R<sup>11</sup>が、各々の存在において、独立してHまたはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであり、ここで、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルは、随意に置換されており、

各々のR<sup>20</sup>が、独立して、水素、ハロ、トリハロメチル、OR<sup>17</sup>、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルからなる群から選択され、ここでC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルおよびC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルは、随意に置換されており、また

各々のR<sup>17</sup>が、独立して選択されたC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであり、ここで、前記C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルは、随意に置換されている、

式A-0：

## 【化2】



により表される請求項1に記載の化合物並びにこれらの薬学的に許容し得る塩および複合体。

## 【請求項19】

$R^1$  が、水素、ハロ、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_6$  アルキニルからなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルおよび  $C_2 \sim C_6$  アルキニルは、随意に置換されており；

$X$  および  $X^1$  が、独立して、 $H$  および  $C_1 \sim C_6$  アルキルからなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキルは、随意に置換されており、または

$X$  および  $X^1$  が、これらが結合している原子と一緒に、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキルを形成し；

$R^7$  が、 $H$ 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-C(O)NR^9R^{10}$ 、 $-C(O)(C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-C(O)$  (ヘテロシクリル)、 $-C(O)$  (ヘテロアリール)、 $-Y-(C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-Y-(5 \sim 10$  員環ヘテロシクリル)、 $-Y$  (ヘテロアリール)、 $-SR^{6a}$ 、 $-S$ -アリール、 $-S$ -(ヘテロアリール)、 $-S-(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $-SO-(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $-SO_2-(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $-Y-NR^9R^{10}$ 、 $-SO_2NR^9R^{10}$ 、 $CO_2R^9$ 、 $-C=C-(CR^{45}R^{45})_n-R^{46}$  および  $-C(=NR^{42})NR^{37}R^{43}$  であり、ここで、 $n$  は、 $0 \sim 6$  の範囲内の整数であり、またここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、アリール、複素環およびヘテロアリールは、各々独立して、随意に  $1 \sim 5$  個の独立して選択された  $R^{38}$  で置換されており；

$R^9$  および  $R^{10}$  が、独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-Y-(C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル)、 $C_1 \sim C_6$  ヘテロアルキル、 $-Y-(C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-Y-(5 \sim 10$  員環ヘテロシクリル)、 $-Y-(C_6 \sim C_{10}$  ヘテロアリール)、 $-Y-O-Y^1-O-R^{11}$ 、 $-Y^1-CO_2-R^{11}$ 、 $Y^1-C(O)OR^{37}$  および  $-Y-O-R^{11}$  から選択され、ここで、前記  $C_1 \sim C_6$  アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、アリール、複素環、およびヘテロアリールは、各々随意に  $1$  個または  $2$  個以上の独立して選択された  $R^{44}$  で置換されており、あるいは、

$R^9$  および  $R^{10}$  が、これらが結合している窒素と一緒に、 $C_5 \sim C_9$  ヘテロシクリル環またはヘテロアリール環を形成し、ここで、前記環は、随意に  $1 \sim 5$  個の独立して選択された  $R^{44}$  で置換されており、ただし  $R^9$  および  $R^{10}$  の両方が酸素を通して窒素に直接結合していることはなく；

各々の  $R^{20}$  が、独立して、 $H$ 、ハロ、 $-OR^{17}$  および  $-C(O)OR^{17}$  からなる群から選択され；

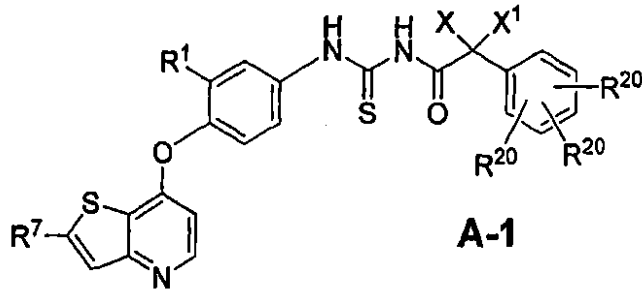
$Y$  が、結合であるかまたは  $-(C(R^{11})(H))_t-$  であり、ここで  $t$  は、 $1 \sim 6$  の整数であり；

$Y^1$  が、 $-(C(R^{11})(H))_t-$  であり、

$R^{11}$  は、各々の存在において、独立して  $H$  または  $C_1 \sim C_6$  アルキルである、

式 A-1：

## 【化3】



により表される請求項1に記載の化合物並びにこれらの薬学的に許容し得る塩および複合体。

## 【請求項20】

$R^{38}$  が、ハロゲン、 $-OR^{37}$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-(CH_2)_n-$  (5~10員環ヘテロシクリル)、 $-(CH_2)_jNR^{39}$  ( $CH_2$ ) $_nR^{36}$ 、 $-(CH_2)_jNR^{39}$  ( $CH_2$ ) $_iNR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_n-$  ( $C_6 \sim C_{10}$ ヘテロアリール)、 $-C(O)NR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_nO(CH_2)_i$  (5~10員環ヘテロシクリル) および  $-(CH_2)_jO(CH_2)_iNR^{36}R^{39}$  からなる群から選択され、ここで、 $n$  は、0~6の範囲内の整数であり、 $j$  は、0~2の範囲内の整数であり、 $i$  は、1~6の範囲内の整数であり、またここで、前記  $R^{38}$  基のアルキル、ヘテロアリールおよびヘテロシクリル部分は、随意に、独立してハロ、シアノ、ニトロ、トリフルオロメチル、アジド、 $-OH$ 、 $-C(O)R^{40}$ 、 $-C(O)OR^{40}$ 、 $-OC(O)R^{40}$ 、 $-OC(O)OR^{40}$ 、 $-NR^{36}C(O)R^{39}$ 、 $-C(O)NR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_nNR^{36}R^{39}$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル、 $-(CH_2)_n$  ( $C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-(CH_2)_n$  (5~10員環ヘテロシクリル)、 $-(CH_2)_nO(CH_2)_iOR^{37}$  および  $-(CH_2)_nOR^{37}$  からなる群から選択された1個または2個以上の置換基により置換されており、ここで  $n$  は、0~6の範囲内の整数であり、 $i$  は、2~6の範囲内の整数である、請求項19に記載の化合物。

## 【請求項21】

$R^{36}$  が、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-(CH_2)_nOR^{37}$  および  $-(CH_2)_n$  (5~10員環ヘテロシクリル) からなる群から選択され、ここで、 $n$  は0~6の範囲内の整数である、請求項19に記載の化合物。

## 【請求項22】

$R^1$  が、水素、ハロ、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_6$  アルキニルからなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルおよび  $C_2 \sim C_6$  アルキニルは、随意に置換されており；

$R^4$  が、 $H$  およびハロゲンからなる群から選択され；

$R^7$  が、 $H$ 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-C(O)NR^9R^{10}$ 、 $-C(O)$  ( $C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-C(O)$  (ヘテロシクリル)、 $-C(O)$  (ヘテロアリール)、 $-Y-$  ( $C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-Y-$  (5~10員環ヘテロシクリル)、 $-Y-$  (ヘテロアリール)、 $-S-$  アリール、 $-S-$  ( $C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $-SO-$  ( $C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $-SO_2-$  ( $C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $-Y-NR^9R^{10}$ 、 $-SO_2NR^9R^{10}$  および  $CO_2R^9$  からなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、アリール、複素環およびヘテロアリールは、各々独立して、随意に1~5個の独立して選択された  $R^{38}$  で置換されており；

$R^9$  および  $R^{10}$  が、独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-Y-$  ( $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル)、 $-Y-$  ( $C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-Y-$  (5~10員環ヘテロシクリル)、 $-Y-$  ( $C_6 \sim C_{10}$  ヘテロアリール)、 $-Y-O-Y^1-O-R^{11}$ 、 $-Y^1-CO_2-R^{11}$  および  $-Y-O-R^{11}$  からなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、シクロアルキル、アリール、複素環、およびヘテロアリールは、各々随意に1個または2個以上の独立して選択された  $R^{44}$  で置換されており、あるいは、

$R^9$  および  $R^{10}$  は、これらが結合している窒素と一緒に、 $C_5 \sim C_9$  ヘテロシクリル環またはヘテロアリール環を形成し、ここで、前記環は、随意に 1 ~ 5 個の独立して選択された  $R^{44}$  で置換されており、ただし  $R^9$  および  $R^{10}$  の両方が酸素を通して窒素に直接結合していることはなく；

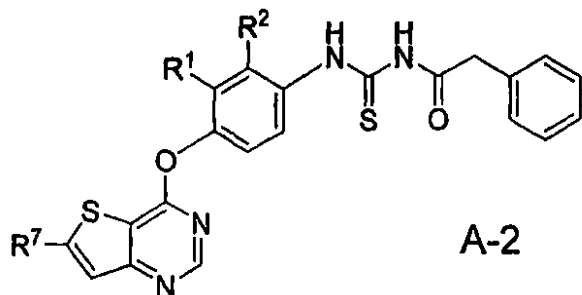
Y が、結合であるかまたは  $-(C(R^{11})(H))_t-$  であり、ここで t は、1 ~ 6 の整数であり；

$Y_1$  が、 $-(C(R^{11})(H))_t-$  であり、また

$R^{11}$  が、各々の存在において、独立して H または  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキルは、随意に置換されている、

式 A - 2：

【化 4】



により表される請求項 1 に記載の化合物並びにこれらの薬学的に許容し得る塩および複合体。

【請求項 2 3】

$R^7$  が、H、 $-Y-(C_6 \sim C_{10}$  アリール) および  $-Y-($ ヘテロアリール) からなる群から選択され、ここで、 $-Y-(C_6 \sim C_{10}$  アリール) および  $-Y-($ ヘテロアリール) は、随意に 1 ~ 5 個の独立して選択された  $R^{38}$  で置換されており；

$R^1$  が、水素、ハロ、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルおよび  $C_2 \sim C_6$  アルキニルからなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルおよび  $C_2 \sim C_6$  アルキニルは、随意に置換されており；

$R^{12}$  が、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-OMe$  および  $-Y-($ アリール) からなる群から選択され；

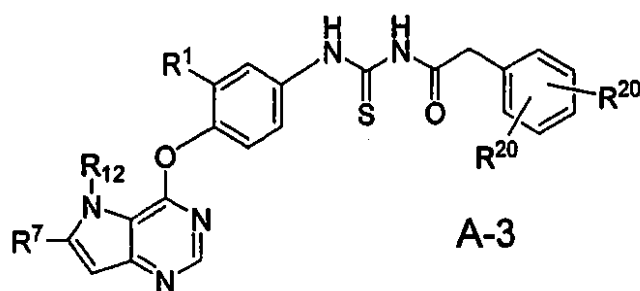
Y が、結合であるかまたは  $-(C(R^{11})(H))_t-$  であり、ここで t は、1 ~ 6 の整数であり；

$R^{11}$  が、H または  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり；また

各々の  $R^{20}$  が、独立して H およびハロゲンからなる群から選択される、

式 A - 3：

【化 5】



により表される請求項 1 に記載の化合物並びにこれらの薬学的に許容し得る塩および複合体。

【請求項 2 4】

Z が O または S であり；

X および  $X^1$  が、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、ハロ、シアノおよびニトロからなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキルは、随意に置換されており；

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  が、独立して、水素、ハロ、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_2 \sim C_6$  アルキニルおよび  $NR^{17}R^{18}$  からなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルおよび  $C_2 \sim C_6$  アルキニルは、随意に置換されており；

$R^{17}$  および  $R^{18}$  が、独立して  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり；

Q が、O、S、NH、N ( $C_1 \sim C_6$  アルキル) または N - Y - (アリール) であり；

D が、CR<sup>11</sup> または N であり；

L が、N または CR であり、ここで、R は、H、ハロ、-CN、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルおよび  $C_2 \sim C_6$  アルキニルからなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルおよび  $C_2 \sim C_6$  アルキニルは、随意に置換されており；また

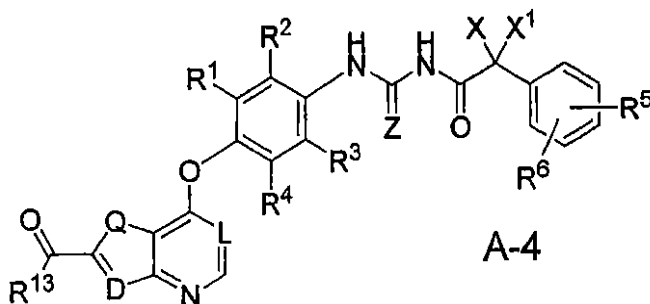
$R^{13}$  が、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールであり、ここで、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールは、随意に 1 ~ 5 個の独立して選択された  $R^{38}$  で置換されており；

Y が、結合であるかまたは  $-(C(R^{11}))(H)_t-$  であり、ここで t は、1 ~ 6 の整数であり；また

$R^{11}$  が、各々の存在において、独立して H または  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキルは、随意に置換されている、

式 A - 4 :

【化 6】



A-4

により表される請求項 1 に記載の化合物並びにこれらの薬学的に許容し得る塩および複合体。

【請求項 25】

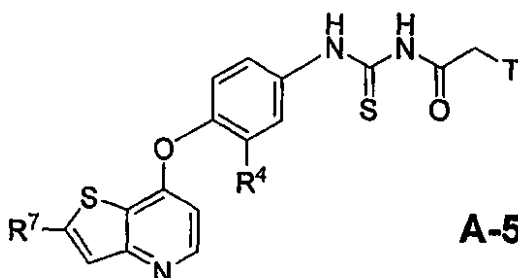
$R^7$  が、H、-C(O)NR<sup>42</sup>R<sup>43</sup>、-Y-( $C_6 \sim C_{10}$  アリール)、-Y-(ヘテロアリール)、-C(O)-(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub> シクロアルキル)、-C(O)-(ヘテロシクリル)、-C(O)-(C<sub>6</sub>~C<sub>10</sub> アリール) および -C(O)-(ヘテロアリール) からなる群から選択され、ここで、H 以外の前記  $R^7$  基は、随意に 1 ~ 5 個の独立して選択された  $R^{38}$  で置換されており；

$R^4$  が、H およびハロゲンからなる群から選択され；また

T が、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリールおよびアリールアルキルからなる群から選択され、この各々は、随意に 1 ~ 3 個の独立して選択された  $R^2$  で置換されている；

式 A - 5 :

【化 7】



A-5

により表される請求項 1 に記載の化合物並びにこれらの薬学的に許容し得る塩および複合

体。

【請求項 26】

$R^1$  が、水素、ハロ、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_6$  アルキニルからなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルおよび  $C_2 \sim C_6$  アルキニルは、随意に置換されており；

$R^7$  が、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-C(O)NR^9R^{10}$ 、 $-C(O)(C_{6 \sim C_{10}} \text{アリアル})$ 、 $-C(O)(5 \sim 10 \text{員環ヘテロシクリル})$ 、 $-C(O)(\text{ヘテロアリアル})$ 、 $-Y-(C_{6 \sim C_{10}} \text{アリアル})$ 、 $-Y-(\text{ヘテロシクリル})$ 、 $-Y-(\text{ヘテロアリアル})$ 、 $-SR^{6a}$ 、 $-S\text{-アリアル}$ 、 $-S-(\text{ヘテロアリアル})$ 、 $-S-(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-SO-(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-SO_2-(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-Y-NR^9R^{10}$ 、 $-SO_2NR^9R^{10}$ 、 $CO_2R^9$ 、 $-C=C-(CR^4R^5)_n$ 、 $-R^4R^6$  および  $-C(=NR^4R^2)NR^3R^4R^3$  からなる群から選択され、ここで、 $n$  は、 $0 \sim 6$  の範囲内の整数であり、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、アリアル、複素環およびヘテロアリアルは、各々独立して、随意に  $1 \sim 5$  個の独立して選択された  $R^{38}$  で置換されており；

$R^9$  および  $R^{10}$  が、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-Y-(C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル)、 $C_1 \sim C_6$  ヘテロアルキル、 $-Y-(C_{6 \sim C_{10}} \text{アリアル})$ 、 $-Y-(5 \sim 10 \text{員環ヘテロシクリル})$ 、 $-Y-(C_{6 \sim C_{10}} \text{ヘテロアリアル})$ 、 $-Y-O-Y^1-O-R^{11}$ 、 $-Y^1-CO_2-R^{11}$ 、 $Y^1-C(O)OR^{37}$  および  $-Y-O-R^{11}$  からなる群から選択され、ここで、前記  $C_1 \sim C_6$  アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、アリアル、複素環、およびヘテロアリアルは、各々随意に  $1$  個または  $2$  個以上の独立して選択された  $R^{44}$  で置換されており、あるいは、

$R^9$  および  $R^{10}$  が、これらが結合している窒素と一緒に、 $C_5 \sim C_9$  ヘテロシクリル環またはヘテロアリアル環を形成し、ここで、前記環は、随意に  $1 \sim 5$  個の独立して選択された  $R^{44}$  で置換されており、ただし  $R^9$  および  $R^{10}$  の両方が酸素を通して窒素に直接結合していることはなく；

各々の  $R^{20}$  が、独立して H、ハロ、 $-OR^{17}$  および  $-C(O)OR^{17}$  からなる群から選択され；

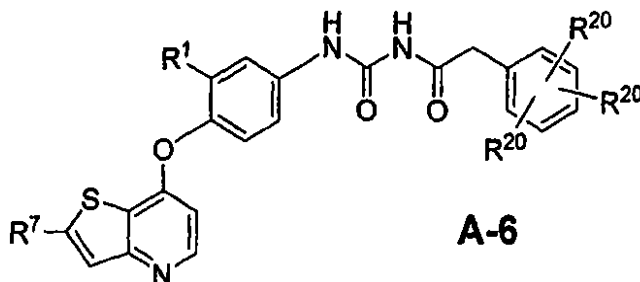
$Y$  が、結合であるかまたは  $-(C(R^{11})(H))_t-$  であり、ここで  $t$  は、 $1 \sim 6$  の整数であり；

$Y^1$  が、 $-(C(R^{11})(H))_t-$  であり；また

$R^{11}$  が、各々の存在において、独立して H または  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキルは、随意に置換されている、

式 A-6：

【化 8】

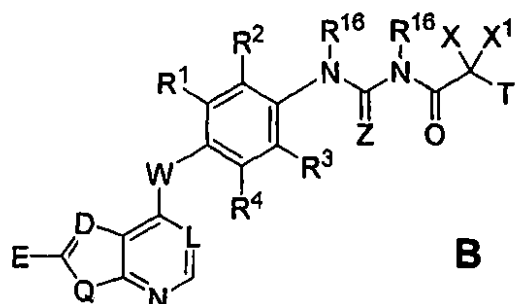


により表される請求項 1 に記載の化合物並びにこれらの薬学的に許容し得る塩および複合体。

【請求項 27】

VEGF レセプターシグナル伝達および HGF レセプターシグナル伝達の阻害剤である、式 (B) で表される化合物並びにこれらの薬学的に許容し得る塩および複合体：

## 【化9】



式中、Tは、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールおよびヘテロアリールからなる群から選択され、ここで、前記シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールおよびヘテロアリールの各々は、随意に1～3個の $R^{20}$ で置換されており；

各々の $R^{20}$ は、独立して、-H、ハロゲン、トリハロメチル、-CN、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-OR<sup>17</sup>、-OCF<sub>3</sub>、-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>、-S(O)<sub>0-2</sub>R<sup>17</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>17</sup>R<sup>17</sup>、-C(O)OR<sup>17</sup>、-C(O)NR<sup>17</sup>R<sup>17</sup>、-N(R<sup>17</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>17</sup>、-N(R<sup>17</sup>)C(O)R<sup>17</sup>、-N(R<sup>17</sup>)C(O)OR<sup>17</sup>、-C(O)R<sup>17</sup>、-C(O)SR<sup>17</sup>、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルチオ、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>アリール、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>ヘテロアリール、-(CH<sub>2</sub>)<sub>0-5</sub>(アリール)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>0-5</sub>(ヘテロアリール)、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>0-4</sub>-T<sup>2</sup>、随意に置換されているC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、随意にC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシにより置換されているC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルにより随意に置換されているアミノおよび飽和または不飽和の3～7員環炭素環式または複素環式基からなる群から選択され、ここで、T<sup>2</sup>は、-OH、-OMe、-OEt、-NH<sub>2</sub>、-NHMe、-NMe<sub>2</sub>、-NHEtおよび-NEt<sub>2</sub>からなる群から選択され、かつここで、アリール、ヘテロアリール、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルおよびC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルは、随意に置換されており；

Wは、O、SおよびNHからなる群から選択され；

Zは、OまたはSおよびNHからなる群から選択され；

XおよびX<sup>1</sup>は、独立して、H、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、ハロ、シアノまたはニトロからなる群から選択され、ここで、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルは、随意に置換されており、あるいはXおよびX<sup>1</sup>は、これらが結合している原子と一緒に、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキルを形成し；

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は、独立して、水素、ハロ、トリハロメチル、-CN、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-OR<sup>17</sup>、-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>、-C(O)OR<sup>17</sup>、-C(O)R<sup>17</sup>、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルからなる群から選択され、ここで、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルおよびC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルは、随意に置換されており；

R<sup>17</sup>は、HおよびR<sup>18</sup>からなる群から選択され；

R<sup>18</sup>は、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、アリール、アリール(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、ヘテロシクリルおよびヘテロシクリル(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)からなる群から選択され、この各々は、随意に置換されており、あるいは

R<sup>17</sup>およびR<sup>18</sup>が、これらが結合している共通の窒素と一緒に、随意に置換されている5～7員環ヘテロシクリル、N、O、SおよびPからなる群から選択された少なくとも1個の追加の環状のヘテロ原子を随意に含む、随意に置換されている5～7員環ヘテロシクリルを形成し；

R<sup>16</sup>は、-H、-CN、-(CH<sub>2</sub>)<sub>0-5</sub>(アリール)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>0-5</sub>(ヘ

テロアリアル)、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-CH_2(CH_2)_{0-4}-T^2$ 、随意に置換されている $C_1 \sim 4$ アルキルカルボニルおよび飽和または不飽和の3~7員環炭素環式または複素環式基からなる群から選択され、ここで、 $T^2$ は、 $-OH$ 、 $-OMe$ 、 $-OEt$ 、 $-NH_2$ 、 $-NHMe$ 、 $-NMe_2$ 、 $-NHEt$ および $-NEt_2$ からなる群から選択され、かつここで、アリアル、ヘテロアリアル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルおよび $C_2 \sim C_6$ アルキニルは、随意に置換されており；

$Q$ は、 $CH_2$ 、 $O$ 、 $S$ 、 $NH$ 、 $N-(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ または $N-Y-(\text{アリアル})$ 、 $-N-OMe$ 、 $-NCH_2OMe$ および $-N-Bn$ からなる群から選択され；

$D$ は、 $C-E$ および $N$ からなる群から選択され；

$L$ は、 $N$ または $CR$ であり、ここで、 $R$ は、 $-H$ 、ハロ、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルおよび $C_2 \sim C_6$ アルキニルからなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルおよび $C_2 \sim C_6$ アルキニルは、随意に置換されており；また

$E$ は、 $E^1$ 、 $E^2$ および $E^3$ からなる群から選択され、ここで

$E^1$ は、 $-H$ 、ハロゲン、ニトロ、アジド、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $-C(O)NR^{42}R^{43}$ 、 $-Y-NR^{42}R^{43}$ 、 $-NR^{42}C(O)R^4$ 、 $-SO_2R^{42}$ 、 $-SO_2NR^{42}R^{43}$ 、 $-NR^{37}SO_2R^{42}$ 、 $-NR^{37}SO_2NR^{42}R^{43}$ 、 $-C(=N-OR^{42})R^{43}$ 、 $-C(=NR^{42})R^{43}$ 、 $-NR^{37}C(=NR^{42})R^{43}$ 、 $-C(=NR^{42})NR^{37}R^{43}$ 、 $-NR^{37}C(=NR^{42})NR^{37}R^{43}$ 、 $-C(O)R^{42}$ 、 $-CO_2R^{42}$ 、 $-C(O)(\text{ヘテロシクリル})$ 、 $-C(O)(C_6 \sim C_{10} \text{アリアル})$ 、 $-C(O)(\text{ヘテロアリアル})$ 、 $-Y-(C_6 \sim C_{10} \text{アリアル})$ 、 $-Y-(\text{ヘテロアリアル})$ 、 $-Y-(5 \sim 10 \text{員環複素環})$ 、 $-NR^{6a}R^{6b}$ 、 $-NR^{6a}SO_2R^{6b}$ 、 $-NR^{6a}C(O)R^{6b}$ 、 $-OC(O)R^{6b}$ 、 $-NR^{6a}C(O)OR^{6b}$ 、 $-OC(O)NR^{6a}R^{6b}$ 、 $-OR^{6a}$ 、 $-SR^{6a}$ 、 $-S(O)R^{6a}$ 、 $-SO_2R^{6a}$ 、 $-SO_3R^{6a}$ 、 $-SO_2NR^{6a}R^{6b}$ 、 $-SO_2NR^{42}R^{43}$ 、 $-COR^{6a}$ 、 $-CO_2R^{6a}$ 、 $-CONR^{6a}R^{6b}$ 、 $C_1 \sim C_4$ フルオロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ フルオロアルコキシ、 $-(CZ^3Z^4)_aCN$ からなる群から選択され、ここで、 $n$ は、 $0 \sim 6$ の範囲内の整数であり、 $-H$ およびハロゲン以外の前記 $E^1$ 基は、随意に、 $1 \sim 5$ 個の独立して選択された $R^{38}$ により置換されており、または $E^1$ は、 $-(CZ^3Z^4)_a$ -アリアル、 $-(CZ^3Z^4)_a$ -複素環、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-(CZ^3Z^4)_a$ - $(C_3 \sim C_6 \text{シクロアルキル})$ 、 $-(CZ^3Z^4)_a$ - $(C_5 \sim C_6 \text{シクロアルケニル})$ 、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群から選択された部分から選択され、これは、随意に、 $1 \sim 3$ 個の独立して選択された $Y^2$ 基で置換されており、ここで、 $a$ は、 $0$ 、 $1$ 、 $2$ または $3$ であり、またここで、 $a$ が $2$ または $3$ である場合には、 $CZ^3Z^4$ 単位は、同一であっても異なってもよく；ここで、

各々の $R^{38}$ は、独立して、ハロ、シアノ、ニトロ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、アジド、 $-C(O)R^{40}$ 、 $-C(O)OR^{40}$ 、 $-OC(O)R^{40}$ 、 $-OC(O)OR^{40}$ 、 $-NR^{36}C(O)R^{39}$ 、 $-C(O)NR^{36}R^{39}$ 、 $-NR^{36}R^{39}$ 、 $-OR^{37}$ 、 $-SO_2NR^{36}R^{39}$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-(CH_2)_jO(CH_2)_iNR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_nO(CH_2)_iOR^{37}$ 、 $-(CH_2)_nOR^{37}$ 、 $-S(O)_j(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-(CH_2)_n(C_6 \sim C_{10} \text{アリアル})$ 、 $-(CH_2)_n(C_5 \sim C_{10} \text{ヘテロアリアル})$ 、 $-(CH_2)_n(5 \sim 10 \text{員環ヘテロシクリル})$ ； $-C(O)(CH_2)_n(C_6 \sim C_{10} \text{アリアル})$ 、 $-(CH_2)_nO(CH_2)_j(C_6 \sim C_{10} \text{アリアル})$ 、 $-(CH_2)_nO(CH_2)_i(5 \sim 10 \text{員環ヘテロシクリル})$ 、 $-C(O)(CH_2)_n(5 \sim 10 \text{員環ヘテロシクリル})$ 、 $-(CH_2)_jNR^{39}(CH_2)_iNR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_jNR^{39}CH_2C(O)NR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_jNR^{39}(CH_2)_iNR^{37}C(O)R^{40}$ 、 $-(CH_2)_jNR^{39}(CH_2)_nO(CH_2)_iOR^{37}$ 、 $-(CH_2)_jNR^{39}(C$

$H_2)_i S(O)_j (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-(CH_2)_j NR^{39} (CH_2)_n R^3$   
 $^6$ 、 $-SO_2 (CH_2)_n (C_6 \sim C_{10} \text{ アリール})$ 、 $-SO_2 (CH_2)_n (5 \sim 10$   
 員環ヘテロシクリル)、 $-(CH_2)_n NR^{36} R^{39}$ 、 $-NR^{37} SO_2 NR^{36} R^3$   
 $^9$ 、 $SO_2 R^{36}$ 、 $C_2 \sim C_6 \text{ アルケニル}$ 、 $C_3 \sim C_{10} \text{ シクロアルキル}$ および $C_1 \sim C$   
 $_6 \text{ アルキルアミノ}$ から選択され、ここで、 $j$ は、 $0 \sim 2$ の範囲内の整数であり、 $n$ は、 $0$   
 $\sim 6$ の範囲内の整数であり、 $i$ は、 $0 \sim 6$ の範囲内の整数であり、前記 $R^{38}$ 基の $-(C$   
 $H_2)_i$  - および  $-(CH_2)_n$  - 部分は、随意に、炭素 - 炭素二重または三重結合を含  
 み、ここで、 $n$ は、 $2 \sim 6$ の整数であり、前記 $R^{38}$ 基のアルキル、アリール、ヘテロア  
 リールおよびヘテロシクリル部分は、随意に、独立してハロ、シアノ、ニトロ、トリフル  
 オロメチル、アジド、 $-OH$ 、 $-C(O)R^{40}$ 、 $-C(O)OR^{40}$ 、 $-OC(O)R$   
 $^{40}$ 、 $-OC(O)OR^{40}$ 、 $-NR^{36} C(O)R^{39}$ 、 $-C(O)NR^{36} R^{39}$ 、  
 $-(CH_2)_n NR^{36} R^{39}$ 、 $C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}$ 、 $C_3 \sim C_{10} \text{ シクロアルキル}$ 、  
 $-(CH_2)_n (C_6 \sim C_{10} \text{ アリール})$ 、 $-(CH_2)_n (5 \sim 10 \text{ 員環ヘテロシクリル})$ 、  
 $-(CH_2)_n O(CH_2)_i OR^{37}$  および  $-(CH_2)_n OR^{37}$  から選択され  
 た1個または2個以上の置換基により置換されており、ここで $n$ は、 $0 \sim 6$ の範囲内の整  
 数であり、 $i$ は、 $2 \sim 6$ の範囲内の整数であり；

各々の $R^{42}$ および $R^{43}$ は、独立して $H$ 、 $C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}$ 、 $C_1 \sim C_6 \text{ ヘテロアル}$   
 $\text{キル}$ 、 $-Y-(C_3 \sim C_{10} \text{ シクロアルキル})$ 、 $-Y-(C_6 \sim C_{10} \text{ アリール})$ 、 $-Y$   
 $-(C_6 \sim C_{10} \text{ ヘテロアリール})$ 、 $-Y-(5 \sim 10 \text{ 員環複素環})$ 、 $-Y-O-Y^1-$   
 $OR^{37}$ 、 $-Y^1-CO_2-R^{37}$  および  $-Y-OR^{37}$  からなる群から選択され、ここ  
 で前記 $R^{42}$ および $R^{43}$ 基のアルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、アリール、  
 ヘテロアリールおよび複素環部分は、随意に、独立して $R^{44}$ から選択された1個または  
 2個以上の置換基により置換されており、ここで、

$Y$ は、結合であるかまたは $-(C(R^{37})(H))_n$ であり、

$n$ は、 $1 \sim 6$ の範囲内の整数であり、また

$Y^1$ は、 $-(C(R^{37})(H))_n$ であり、あるいは

$R^{42}$ および $R^{43}$ は、これらが結合している窒素と一緒に、 $C_5 \sim C_9 \text{ ヘテロシクリ}$   
 $\text{ル環}$ または $\text{ヘテロアリール環}$ を形成し、ここで、前記環は、随意に、 $1 \sim 5$ 個の $R^{44}$ 置  
 換基により置換されており、ただし、 $R^{42}$ および $R^{43}$ は、両方が直接酸素を介して窒  
 素に結合していることはなく；

各々の $R^{44}$ は、独立して、ハロ、シアノ、ニトロ、トリフルオロメトキシ、トリフル  
 オロメチル、アジド、 $-C(O)R^{40}$ 、 $-C(O)OR^{40}$ 、 $-OC(O)R^{40}$ 、  
 $-OC(O)OR^{40}$ 、 $-NR^{36} C(O)R^{39}$ 、 $-C(O)NR^{36} R^{39}$ 、 $-NR^{36} R^{39}$ 、  
 $-OR^{37}$ 、 $-SO_2 NR^{36} R^{39}$ 、 $-SO_2 R^{36}$ 、 $-NR^{36} SO_2 R$   
 $^{39}$ 、 $-NR^{36} SO_2 NR^{37} R^{41}$ 、 $C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}$ 、 $C_2 \sim C_6 \text{ アルケニル}$ 、  
 $C_2 \sim C_6 \text{ アルキニル}$ 、 $C_3 \sim C_{10} \text{ シクロアルキル}$ 、 $-C_1 \sim C_6 \text{ アルキルアミノ}$ 、  
 $-(CH_2)_j O(CH_2)_i NR^{36} R^{39}$ 、 $-(CH_2)_n O(CH_2)_i OR^{37}$ 、  
 $-(CH_2)_n OR^{37}$ 、 $-S(O)_j (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-(CH_2)_n (C_6$   
 $\sim C_{10} \text{ アリール})$ 、 $-(CH_2)_n (5 \sim 10 \text{ 員環複素環})$ 、 $-C(O)(CH_2)_n$   
 $(C_6 \sim C_{10} \text{ アリール})$ 、 $-(CH_2)_n O(CH_2)_j (C_6 \sim C_{10} \text{ アリール})$ 、  
 $-(CH_2)_n O(CH_2)_i (5 \sim 10 \text{ 員環複素環})$ 、 $-C(O)(CH_2)_n (5 \sim$   
 $10 \text{ 員環複素環})$ 、 $-(CH_2)_j NR^{39} (CH_2)_i NR^{36} R^{39}$ 、 $-(CH_2)_j$   
 $NR^{39} CH_2 C(O)NR^{36} R^{39}$ 、 $-(CH_2)_j NR^{39} (CH_2)_i NR^3$   
 $^7 C(O)R^{40}$ 、 $-(CH_2)_j NR^{39} (CH_2)_n O(CH_2)_i OR^{37}$ 、  
 $-(CH_2)_j NR^{39} (CH_2)_i S(O)_j (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-(CH_2)_j N$   
 $R^{39} (CH_2)_n R^{36}$ 、 $-SO_2 (CH_2)_n (C_6 \sim C_{10} \text{ アリール})$  および  $-S$   
 $O_2 (CH_2)_n (5 \sim 10 \text{ 員環複素環})$  からなる群から選択され、ここで、 $j$ は、 $0 \sim$   
 $2$ の整数であり、 $n$ は、 $0 \sim 6$ の整数であり、 $i$ は、 $2 \sim 6$ の範囲内の整数であり、前記  
 $R^{44}$ 基の $-(CH_2)_i$  - および  $-(CH_2)_{n-1}$  - 部分は、随意に、炭素 - 炭素二重  
 または三重結合を含み、ここで、 $n$ は、 $2 \sim 6$ の整数であり、前記 $R^{44}$ 基のアルキル、

アリールおよび複素環部分は、随意に、独立してハロ、シアノ、ニトロ、トリフルオロメチル、アジド、 $-OH$ 、 $-C(O)R^{40}$ 、 $-C(O)OR^{40}$ 、 $-OC(O)R^{40}$ 、 $-OC(O)OR^{40}$ 、 $-NR^{36}C(O)R^{39}$ 、 $-C(O)NR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_nNR^{36}R^{39}$ 、 $-SO_2R^{36}$ 、 $-SO_2NR^{36}R^{39}$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $-(CH_2)_n(C_6 \sim C_{10}$ アリール)、 $-(CH_2)_n(5 \sim 10$ 員環複素環)、 $-(CH_2)_nO(CH_2)_iOR^{37}$ および $-(CH_2)_nOR^{37}$ からなる群から選択された1個または2個以上の置換基により置換されており、ここで $n$ は、 $0 \sim 6$ の整数であり、 $i$ は、 $2 \sim 6$ の整数であり；また

各々の $R^{40}$ は、独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $-(CH_2)_n(C_6 \sim C_{10}$ アリール)、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキルおよび $-(CH_2)_n(5 \sim 10$ 員環複素環)から選択され、ここで $n$ は、 $0 \sim 6$ の範囲内の整数であり；

各々の $R^{36}$ および $R^{39}$ は、独立して $H$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $-(CH_2)_n(C_6 \sim C_{10}$ アリール)、 $-(CH_2)_n(5 \sim 10$ 員環複素環)、 $-(CH_2)_nO(CH_2)_iOR^{37}$ 、 $-(CH_2)_nCN(CH_2)_nOR^{37}$ 、 $-(CH_2)_nCN(CH_2)_nR^{37}$ および $-(CH_2)_nOR^{37}$ からなる群から選択され、ここで、 $n$ は、 $0 \sim 6$ の範囲内の整数であり、 $i$ は、 $2 \sim 6$ の範囲内の整数であり、前記 $R^{36}$ および $R^{39}$ 基のアルキル、アリールおよび複素環部分は、随意に、独立して $-OH$ 、ハロ、シアノ、ニトロ、トリフルオロメチル、アジド、 $-C(O)R^{40}$ 、 $-C(O)OR^{40}$ 、 $-CO(O)R^{40}$ 、 $-OC(O)OR^{40}$ 、 $-NR^{37}C(O)R^{41}$ 、 $-C(O)NR^{37}R^{41}$ 、 $-NR^{37}R^{41}$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-(CH_2)_n(C_6 \sim C_{10}$ アリール)、 $-(CH_2)_n(5 \sim 10$ 員環複素環)、 $-(CH_2)_nO(CH_2)_iOR^{37}$ および $-(CH_2)_nOR^{37}$ から選択された1個または2個以上の置換基により置換されており、ここで $n$ は、 $0 \sim 6$ の範囲内の整数であり、 $i$ は、 $2 \sim 6$ の範囲内の整数であり、ただし $R^{36}$ および $R^{39}$ は共に同一の窒素に結合している場合には、 $R^{36}$ および $R^{39}$ は、両方が直接酸素を介して窒素に結合していることはなく；

各々の $R^{37}$ および $R^{41}$ は、独立して、 $H$ 、 $OR^{36}$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルおよび $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキルからなる群から選択され；

各々の $R^{6a}$ および $R^{6b}$ は、独立して、水素、 $-(CZ^5Z^6)_u$ 、 $-(C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、 $-(CZ^5Z^6)_u$ 、 $-(C_5 \sim C_6$ シクロアルケニル)、 $-(CZ^5Z^6)_u$ 、アリール、 $-(CZ^5Z^6)_u$ 、複素環、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群から選択され、これは、随意に、 $1 \sim 3$ 個の独立して選択された $Y^3$ 基で置換されており、ここで、 $u$ は、 $0$ 、 $1$ 、 $2$ または $3$ であり、またここで、 $u$ は $2$ または $3$ である場合には、 $CZ^5Z^6$ 単位は、同一であっても異なってもよく、あるいは

$R^{6a}$ および $R^{6b}$ は、隣接する原子と一緒に複素環を形成することができ；

各々の $Z^3$ 、 $Z^4$ 、 $Z^5$ および $Z^6$ は、独立して、 $H$ 、 $F$ および $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群から選択され、あるいは、

各々の $Z^3$ および $Z^4$ 、または $Z^5$ および $Z^6$ は、一緒に炭素環を形成するように選択され、あるいは

隣接する炭素原子上の2個の $Z^3$ 基は、一緒に随意に炭素環を形成するように選択され；

各々の $Y^2$ および $Y^3$ は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、テトラゾリル、グアニジノ、アミジノ、メチルグアニジノ、アジド、 $-C(O)Z^7$ 、 $-OC(O)NH_2$ 、 $-OC(O)NHZ^7$ 、 $-OC(O)NZ^7Z^8$ 、 $-NHC(O)Z^7$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NHC(O)NHZ^7$ 、 $-NHC(O)NZ^7Z^8$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OZ^7$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(O)NHZ^7$ 、 $-C(O)NZ^7Z^8$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-P(O)_3(Z^7)_2$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-S(O)Z^7$ 、 $-S(O)_2Z^7$ 、 $-S(O)_3Z^7$ 、 $-Z^7$ 、 $-OZ^7$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NHZ^7$ 、 $-NZ^7Z^8$ 、 $-C(=NH)NH_2$ 、 $-C(=NOH)NH_2$ 、 $-N$ -モルホリノ、 $C_2 \sim C_6$ ア



$R^2$  )  $n$  CN、並びにハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-CN$ 、 $-(CH_2)_n OR^{49}$ 、 $-(CH_2)_n$  ヘテロシクリル、 $-(CH_2)_n$  ヘテロアリール、 $-SO_2 R^{50}$  および  $-(CH_2)_n NR^{50} R^{51}$  からなる群から選択された1つまたは2つ以上の置換基で随意に置換されているアリール、並びにハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-CN$ 、 $-(CH_2)_n OR^{49}$ 、 $-(CH_2)_n$  ヘテロシクリル、 $-(CH_2)_n$  ヘテロアリール、 $-SO_2 R^{50}$  および  $-(CH_2)_n NR^{50} R^{51}$  からなる群から選択された1つまたは2つ以上の置換基で随意に置換されているヘテロアリールからなる群から選択され、あるいは、

$R^{47}$  および  $R^{48}$  は、これらが結合している原子と一緒に、3～8員環を形成し；

$R^{49}$  は、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、ヘテロシクリル ( $C_1 \sim C_6$  アルキレン)、アリール ( $C_1 \sim C_6$  アルキレン)、アリールは随意にハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-CN$ 、 $-SO_2 R^{50}$  および  $-(CH_2)_n NR^{50} R^{51}$  からなる群から選択された1つまたは2つ以上の置換基で置換されているアリール ( $C_1 \sim C_6$  アルキレン)、ヘテロアリールは随意にハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-CN$ 、 $-SO_2 R^{50}$  および  $-(CH_2)_n NR^{50} R^{51}$  からなる群から選択された1つまたは2つ以上の置換基で置換されているヘテロアリール  $C_1 \sim C_6$  アルキレン、並びに随意にハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-CN$ 、 $-SO_2 R^{50}$  および  $-(CH_2)_n NR^{50} R^{51}$  からなる群から選択された1つまたは2つ以上の置換基で置換されているアリール、並びに随意にハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-CN$ 、 $-SO_2 R^{50}$  および  $-(CH_2)_n NR^{50} R^{51}$  からなる群から選択された1つまたは2つ以上の置換基で置換されているヘテロアリールからなる群から選択され；

$R^{50}$  および  $R^{51}$  は、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルおよび  $-C(O)R^{45}$  からなる群から選択され、あるいは、

$R^{50}$  および  $R^{51}$  は、これらが結合している原子と一緒に、3～8員環を形成し；また

$E^3$  は、 $-(Z^{11})-(Z^{12})_m-(Z^{13})_{m1}$  により定義される基であり、ここで、

$Z^{11}$  は、ヘテロシクリルまたはヘテロシクリレンであり；

$Z^{12}$  は、 $OC(O)$ 、 $OC(S)$  および  $C(O)$  からなる群から選択され；

$Z^{13}$  は、ヘテロシクリル、アラルキル、 $N(H)R^{52}$ 、 $C_1 \sim C_3$  アルキル、 $-OR^{52}$ 、ハロ、 $S(O)_2 R^{56}$ 、 $C_1 \sim C_3$  ヒドロキシアルキルおよび  $C_1 \sim C_3$  ハロアルキルからなる群から選択され；

$m$  は、0 または 1 であり；

$m1$  は、0 または 1 であり；

$R^{52}$  は、H、 $-(CH_2)_q S(O)_2 R^{54}$ 、 $R^{55} NR^{53} R^{53}$ 、 $C_1 \sim C_3$  アルキル、 $-(CH_2)_q OR^{53}$ 、 $-C(O)R^{54}$  および  $-C(O)OR^{53}$  からなる群から選択され；

$q$  は、0、1、2、3 または 4 であり；

$R^{53}$  は、 $C_1 \sim C_3$  アルキルであり；

$R^{54}$  は、 $C_1 \sim C_3$  アルキルまたは  $N(H)R^{53}$  であり；

$R^{55}$  は、 $C_1 \sim C_6$  アルキルであり；また

$R^{56}$  は、 $NH_2$ 、 $C_1 \sim C_3$  アルキルおよび  $OR^{52}$  からなる群から選択される。

#### 【請求項 28】

Z が O または S であり；

X および  $X^1$  が、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、ハロ、シアノまたはニトロからなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキルは、随意に置換されており；

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  が、独立して、水素、ハロ、 $C_1 \sim C_6$  アル

キル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルおよび  $C_2 \sim C_6$  アルキニルからなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルおよび  $C_2 \sim C_6$  アルキニルは、随意に置換されており；

Q が、O、S、NH、N ( $C_1 \sim C_6$  アルキル) または N - Y - (アリール) であり；

L が、N または CR であり、ここで、R は、ハロ、-CN、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_6$  アルキニルであり、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルおよび  $C_2 \sim C_6$  アルキニルは、随意に置換されており；また

R<sup>7</sup> が、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-C(O)NR^9R^{10}$ 、 $-C(O)(C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-C(O)(5 \sim 10$  員環ヘテロシクリル)、 $-C(O)($ ヘテロアリール)、 $-Y-(C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-Y-($ ヘテロシクリル)、 $-Y-($ ヘテロアリール)、 $-Y-NR^9R^{10}$ 、 $-SO_2NR^9R^{10}$  および  $CO_2R^9$  からなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、アリール、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールは、各々独立して、1 ~ 5 個の独立して選択された R<sup>3 8</sup> で随意に置換されており；

R<sup>9</sup> および R<sup>10</sup> が、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-Y-(C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル)、 $-Y-(C_6 \sim C_{10})$  アリール)、 $-Y-(5 \sim 10$  員環ヘテロシクリル)、 $-Y-(5 \sim 10$  員環ヘテロアリール)、 $-Y-O-Y^1-O-R^{11}$ 、 $-Y^1-CO_2-R^{11}$  および  $-Y-O-R^{11}$  からなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、およびヘテロアリールは、各々 1 個または 2 個以上の独立して選択された R<sup>4 4</sup> で随意に置換されており、あるいは、

R<sup>9</sup> および R<sup>10</sup> が、これらが結合している窒素と一緒にあって、 $C_5 \sim C_9$  ヘテロシクリル環またはヘテロアリール環を形成し、ここで、前記環は、1 ~ 5 個の独立して選択された R<sup>4 4</sup> で随意に置換されており、ただし R<sup>9</sup> および R<sup>10</sup> の両方が酸素を通して窒素に直接結合していることはなく；

R<sup>8</sup> が、H、ハロおよび  $C_1 \sim C_6$  アルキルからなる群から選択され、ここで  $C_1 \sim C_6$  アルキルは、1 ~ 5 個の独立して選択された R<sup>3 8</sup> で随意に置換されており；

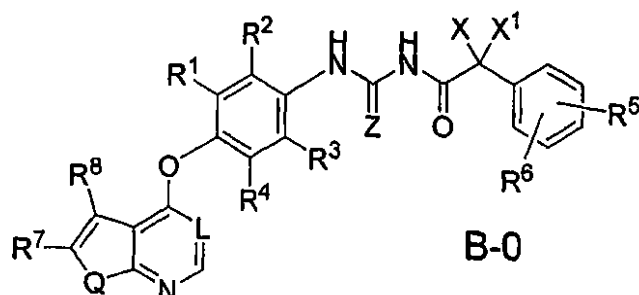
Y が、結合であるかまたは  $-(C(R^{11})(H))_t-$  であり、ここで t は、1 ~ 6 の整数であり；

Y<sup>1</sup> が、 $-(C(R^{11})(H))_t-$  であり、また

R<sup>11</sup> が、各々の存在において、独立して H または  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキルは、随意に置換されている、

式 B - 0 :

【化 10】



により表される請求項 161 に記載の化合物並びにこれらの薬学的に許容し得る塩および複合体。

【請求項 29】

R<sup>1</sup> が、水素、ハロ、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルおよび  $C_2 \sim C_6$  アルキニルからなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルおよび  $C_2 \sim C_6$  アルキニルは、随意に置換されており；

R<sup>7</sup> が、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-C(O)NR^9R^{10}$ 、 $-C(O)(C_6 \sim C_{10})$  アリール)、 $-C(O)($ ヘテロシクリル)、 $-C(O)($ ヘテロアリール)、 $-Y-(C_6 \sim C_{10})$  アリール)、 $-Y-(5 \sim 10$  員環ヘテロシクリル)、 $-Y-$

(ヘテロアリアル)、 $-Y-NR^9R^{10}$ 、 $-SO_2NR^9R^{10}$  および  $CO_2R^9$  からなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、アリール、複素環およびヘテロアリアルは、各々独立して、1~5個の独立して選択された  $R^{38}$  で随意に置換されており；

$R^9$  および  $R^{10}$  が、独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-Y$  - (シクロアルキル)、 $-Y$  - ( $C_6 \sim C_{10}$  アリール)、 $-Y$  - (5~10員環ヘテロシクリル)、 $-Y$  - ( $C_6 \sim C_{10}$  ヘテロアリアル)、 $-Y-O-Y^1-O-R^{11}$ 、 $-Y^1-CO_2-R^{11}$  および  $-Y-O-R^{11}$  からなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、シクロアルキル、アリール、複素環、およびヘテロアリアルは、1個または2個以上の独立して選択された  $R^{44}$  で各々随意に置換されており、あるいは、

$R^9$  および  $R^{10}$  が、これらが結合している窒素と一緒に、 $C_5 \sim C_9$  ヘテロシクリル環またはヘテロアリアル環を形成し、ここで、前記環は、1~5個の独立して選択された  $R^{44}$  で随意に置換されており、ただし  $R^9$  および  $R^{10}$  の両方が酸素を通して窒素に直接結合していることはなく；

$Y$  が、結合であるかまたは  $-(C(R^{11})(H))_t-$  であり、ここで  $t$  は、 $1 \sim 6$  の整数であり；

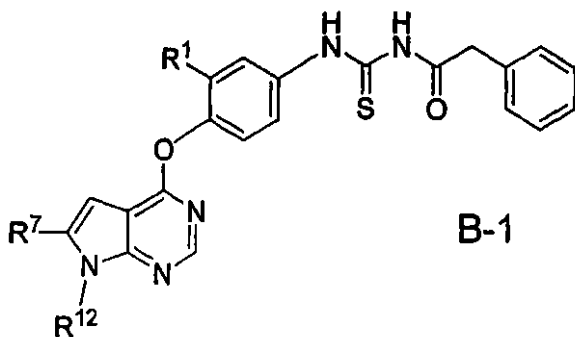
$Y_1$  が、 $-(C(R^{11})(H))_t-$  であり；

$R^{11}$  が、各々の存在において、独立して  $H$  または  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり；また

$R^{12}$  が、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキルおよび  $-Y$  - (アリール) からなる群から選択される、

式 B - 1:

【化 1 1】



により表される請求項 27 に記載の化合物並びにこれらの薬学的に許容し得る塩および複合体。

【請求項 30】

請求項 1 ~ 29 のいずれかに記載の化合物および薬学的に許容し得る担体を含む、医薬組成物。

【請求項 31】

V E G F レセプターシグナル伝達および H G F レセプターシグナル伝達を阻害する方法であって、該方法は、レセプターを、レセプター阻害量の請求項 1 ~ 29 のいずれかに記載の化合物と接触させることを含む、前記方法。

【請求項 32】

細胞中の V E G F レセプターシグナル伝達および H G F レセプターシグナル伝達を阻害する方法であって、該方法は、細胞を、レセプター阻害量の請求項 1 ~ 29 のいずれかに記載の化合物と接触させることを含む、前記方法。

【請求項 33】

請求項 1 ~ 29 のいずれかに記載の化合物の医薬組成物の製造のための使用であって、該医薬組成物は動物における V E G F レセプターシグナル伝達および H G F レセプターシグナル伝達を阻害するためのものである、前記使用。

【請求項 34】

細胞の増殖活性を阻害する方法であって、該方法は、細胞を、有効な増殖阻害量の請求

項 1 ~ 29 のいずれかに記載の化合物と接触させることを含む、前記方法。

【請求項 35】

請求項 1 ~ 29 のいずれかに記載の化合物の医薬組成物の製造のための使用であって、該医薬組成物は患者における細胞増殖性疾患を処置するためのものである、前記使用。

【請求項 36】

請求項 1 ~ 29 のいずれかに記載の化合物の医薬組成物の製造のための使用であって、該医薬組成物は患者における腫瘍増殖を阻害するためのものである、前記使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0200

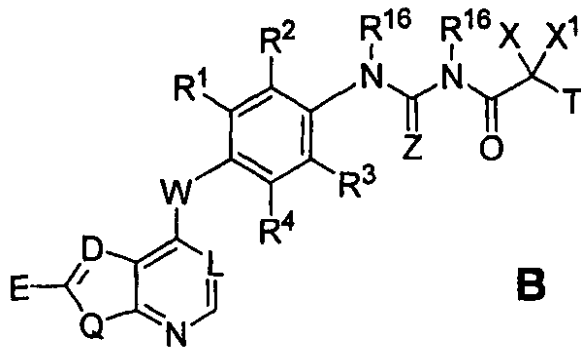
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0200】

第 2 の観点において、本発明は、VEGF レセプターシグナル伝達および HGF レセプターシグナル伝達の阻害剤である、式 (B) で表される化合物並びにこれらの薬学的に許容し得る塩および複合体を含む：

【化 10】



式中、T は、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールおよびヘテロアリールからなる群から選択され、ここで、前記シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールおよびヘテロアリールの各々は、随意に 1 ~ 3 個の  $R^{20}$  で置換されており；

各々の  $R^{20}$  は、独立して、-H、ハロゲン、トリハロメチル、-CN、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-OR<sup>17</sup>、-OCF<sub>3</sub>、-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>、-S(O)<sub>0-2</sub>R<sup>17</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>17</sup>R<sup>17</sup>、-C(O)OR<sup>17</sup>、-C(O)NR<sup>17</sup>R<sup>17</sup>、-N(R<sup>17</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>17</sup>、-N(R<sup>17</sup>)C(O)R<sup>17</sup>、-N(R<sup>17</sup>)C(O)OR<sup>17</sup>、-C(O)R<sup>17</sup>、-C(O)SR<sup>17</sup>、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルチオ、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>アリール、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>ヘテロアリール、-(CH<sub>2</sub>)<sub>0-5</sub>(アリール)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>0-5</sub>(ヘテロアリール)、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>0-4</sub>-T<sup>2</sup>、随意に置換されている C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシ、随意に C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシにより置換されている C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルにより随意に置換されているアミノおよび飽和または不飽和の 3 ~ 7 員環炭素環式または複素環式基からなる群から選択され、ここで、T<sup>2</sup> は、-OH、-OMe、-OEt、-NH<sub>2</sub>、-NHMe、-NMe<sub>2</sub>、-NHEt および -NEt<sub>2</sub> からなる群から選択され、かつここで、アリール、ヘテロアリール、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニルおよび C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニルは、随意に置換されており；

W は、O、S および NH からなる群から選択され；

Z は、O または S および NH からなる群から選択され；

X および X<sup>1</sup> は、独立して、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、ハロ、シアノまたはニトロからなる群から選択され、ここで、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルは、随意に置換されており、あるいは

XおよびX<sup>1</sup>は、これらが結合している原子と一緒に、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキルを形成し；

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は、独立して、水素、ハロ、トリハロメチル、-CN、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-OR<sup>17</sup>、-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>、-C(O)OR<sup>17</sup>、-C(O)R<sup>17</sup>、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルからなる群から選択され、ここで、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルおよびC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルは、随意に置換されており；

R<sup>17</sup>は、HおよびR<sup>18</sup>からなる群から選択され；

R<sup>18</sup>は、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、アリール、アリール(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、ヘテロシクリルおよびヘテロシクリル(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)からなる群から選択され、この各々は、随意に置換されており、あるいは

R<sup>17</sup>およびR<sup>18</sup>が、これらが結合している共通の窒素と一緒に、随意に置換されている5～7員環ヘテロシクリル、N、O、SおよびPからなる群から選択された少なくとも1個の追加の環状のヘテロ原子を随意に含む、随意に置換されている5～7員環ヘテロシクリルを形成し；

R<sup>16</sup>は、-H、-CN、-(CH<sub>2</sub>)<sub>0-5</sub>(アリール)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>0-5</sub>(ヘテロアリール)、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>0-4</sub>-T<sup>2</sup>、随意に置換されているC<sub>1-4</sub>アルキルカルボニルおよび飽和または不飽和の3～7員環炭素環式または複素環式基からなる群から選択され、ここで、T<sup>2</sup>は、-OH、-OMe、-OEt、-NH<sub>2</sub>、-NHMe、-NMe<sub>2</sub>、-NHEtおよび-NEt<sub>2</sub>からなる群から選択され、かつここで、アリール、ヘテロアリール、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルおよびC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルは、随意に置換されており；

Qは、CH<sub>2</sub>、O、S、NH、N-(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)またはN-Y-(アリール)、-N-OMe、-NCH<sub>2</sub>OMeおよび-N-Bnからなる群から選択され；

Dは、C-EおよびNからなる群から選択され；

Lは、NまたはCRであり、ここで、Rは、-H、ハロ、-CN、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルおよびC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルからなる群から選択され、ここで、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルおよびC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルは、随意に置換されており；また

Eは、E<sup>1</sup>、E<sup>2</sup>およびE<sup>3</sup>からなる群から選択され、ここで

E<sup>1</sup>は、-H、ハロゲン、ニトロ、アジド、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルキル、-C(O)NR<sup>42</sup>R<sup>43</sup>、-Y-NR<sup>42</sup>R<sup>43</sup>、-NR<sup>42</sup>C(O)R<sup>43</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>42</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>42</sup>R<sup>43</sup>、-NR<sup>37</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>42</sup>、-NR<sup>37</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>42</sup>R<sup>43</sup>、-C(=N-OR<sup>42</sup>)R<sup>43</sup>、-C(=NR<sup>42</sup>)R<sup>43</sup>、-NR<sup>37</sup>C(=NR<sup>42</sup>)R<sup>43</sup>、-C(=NR<sup>42</sup>)NR<sup>37</sup>R<sup>43</sup>、-NR<sup>37</sup>C(=NR<sup>42</sup>)NR<sup>37</sup>R<sup>43</sup>、-C(O)R<sup>42</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>42</sup>、-C(O)(ヘテロシクリル)、-C(O)(C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール)、-C(O)(ヘテロアリール)、-Y-(C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>アリール)、-Y-(ヘテロアリール)、-Y-(5～10員環複素環)、-NR<sup>6a</sup>R<sup>6b</sup>、-NR<sup>6a</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>6b</sup>、-NR<sup>6a</sup>C(O)R<sup>6b</sup>、-OC(O)R<sup>6b</sup>、-NR<sup>6a</sup>C(O)OR<sup>6b</sup>、-OC(O)NR<sup>6a</sup>R<sup>6b</sup>、-OR<sup>6a</sup>、-SR<sup>6a</sup>、-S(O)R<sup>6a</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>6a</sup>、-SO<sub>3</sub>R<sup>6a</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>6a</sup>R<sup>6b</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>42</sup>R<sup>43</sup>、-COR<sup>6a</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>6a</sup>、-CONR<sup>6a</sup>R<sup>6b</sup>、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>フルオロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>フルオロアルコキシ、-(CZ<sup>3</sup>Z<sup>4</sup>)<sub>a</sub>CNからなる群から選択され、ここで、nは、0～6の範囲内の整数であり、-Hおよびハロゲン以外の前記E<sup>1</sup>基は、随意に、1～5個の独立して選択されたR<sup>38</sup>により置換されており、またはE<sup>1</sup>は、-(CZ<sup>3</sup>Z<sup>4</sup>)<sub>a</sub>-アリール、-(CZ<sup>3</sup>Z<sup>4</sup>)<sub>a</sub>-複素環、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、-(CZ<sup>3</sup>Z<sup>4</sup>)<sub>a</sub>-(C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル)、-(CZ<sup>3</sup>Z<sup>4</sup>)<sub>a</sub>-(C<sub>5</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルケニル)、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルおよびC<sub>1</sub>～C

6 アルキルからなる群から選択された部分から選択され、これは、随意に、1~3個の独立して選択された $Y^2$ 基で置換されており、ここで、aは、0、1、2または3であり、またここで、aが2または3である場合には、 $CZ^3Z^4$ 単位は、同一であっても異なっているとしてもよく；ここで、

各々の $R^{38}$ は、独立して、ハロ、シアノ、ニトロ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、アジド、 $-C(O)R^{40}$ 、 $-C(O)OR^{40}$ 、 $-OC(O)R^{40}$ 、 $-OC(O)OR^{40}$ 、 $-NR^{36}C(O)R^{39}$ 、 $-C(O)NR^{36}R^{39}$ 、 $-NR^{36}R^{39}$ 、 $-OR^{37}$ 、 $-SO_2NR^{36}R^{39}$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $-(CH_2)_jO(CH_2)_iNR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_nO(CH_2)_iOR^{37}$ 、 $-(CH_2)_nOR^{37}$ 、 $-S(O)_j(C_1\sim C_6$ アルキル)、 $-(CH_2)_n(C_6\sim C_{10}$ アリール)、 $-(CH_2)_n(C_5\sim C_{10}$ ヘテロアリール)、 $-(CH_2)_n(5\sim 10$ 員環ヘテロシクリル)； $-C(O)(CH_2)_n(C_6\sim C_{10}$ アリール)、 $-(CH_2)_nO(CH_2)_j(C_6\sim C_{10}$ アリール)、 $-(CH_2)_nO(CH_2)_i(5\sim 10$ 員環ヘテロシクリル)、 $-C(O)(CH_2)_n(5\sim 10$ 員環ヘテロシクリル)、 $-(CH_2)_jNR^{39}(CH_2)_iNR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_jNR^{39}CH_2C(O)NR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_jNR^{39}(CH_2)_iNR^{37}C(O)R^{40}$ 、 $-(CH_2)_jNR^{39}(CH_2)_nO(CH_2)_iOR^{37}$ 、 $-(CH_2)_jNR^{39}(CH_2)_iS(O)_j(C_1\sim C_6$ アルキル)、 $-(CH_2)_jNR^{39}(CH_2)_nR^{36}$ 、 $-SO_2(CH_2)_n(C_6\sim C_{10}$ アリール)、 $-SO_2(CH_2)_n(5\sim 10$ 員環ヘテロシクリル)、 $-(CH_2)_nNR^{36}R^{39}$ 、 $-NR^{37}SO_2NR^{36}R^{39}$ 、 $SO_2R^{36}$ 、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_3\sim C_{10}$ シクロアルキルおよび $C_1\sim C_6$ アルキルアミノから選択され、ここで、jは、0~2の範囲内の整数であり、nは、0~6の範囲内の整数であり、iは、0~6の範囲内の整数であり、前記 $R^{38}$ 基の $-(CH_2)_i$ および $-(CH_2)_n$ 部分は、随意に、炭素-炭素二重または三重結合を含み、ここで、nは、2~6の整数であり、前記 $R^{38}$ 基のアルキル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリル部分は、随意に、独立してハロ、シアノ、ニトロ、トリフルオロメチル、アジド、 $-OH$ 、 $-C(O)R^{40}$ 、 $-C(O)OR^{40}$ 、 $-OC(O)R^{40}$ 、 $-OC(O)OR^{40}$ 、 $-NR^{36}C(O)R^{39}$ 、 $-C(O)NR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_nNR^{36}R^{39}$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_{10}$ シクロアルキル、 $-(CH_2)_n(C_6\sim C_{10}$ アリール)、 $-(CH_2)_n(5\sim 10$ 員環ヘテロシクリル)、 $-(CH_2)_nO(CH_2)_iOR^{37}$ および $-(CH_2)_nOR^{37}$ から選択された1個または2個以上の置換基により置換されており、ここでnは、0~6の範囲内の整数であり、iは、2~6の範囲内の整数であり；

各々の $R^{42}$ および $R^{43}$ は、独立してH、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ヘテロアルキル、 $-Y-(C_3\sim C_{10}$ シクロアルキル)、 $-Y-(C_6\sim C_{10}$ アリール)、 $-Y-(C_6\sim C_{10}$ ヘテロアリール)、 $-Y-(5\sim 10$ 員環複素環)、 $-Y-O-Y^1-OR^{37}$ 、 $-Y^1-CO_2-R^{37}$ および $-Y-OR^{37}$ からなる群から選択され、ここで前記 $R^{42}$ および $R^{43}$ 基のアルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよび複素環部分は、随意に、独立して $R^{44}$ から選択された1個または2個以上の置換基により置換されており、ここで、

Yは、結合であるかまたは $-(C(R^{37}))(H))_n$ であり、

nは、1~6の範囲内の整数であり、また

$Y^1$ は、 $-(C(R^{37}))(H))_n$ であり、あるいは

$R^{42}$ および $R^{43}$ は、これらが結合している窒素と一緒に、 $C_5\sim C_9$ ヘテロシクリル環またはヘテロアリール環を形成し、ここで、前記環は、随意に、1~5個の $R^{44}$ 置換基により置換されており、ただし、 $R^{42}$ および $R^{43}$ は、両方が直接酸素を介して窒素に結合していることはなく；

各々の $R^{44}$ は、独立して、ハロ、シアノ、ニトロ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、アジド、 $-C(O)R^{40}$ 、 $-C(O)OR^{40}$ 、 $-OC(O)R^{40}$ 、 $-OC(O)OR^{40}$ 、 $-NR^{36}C(O)R^{39}$ 、 $-C(O)NR^{36}R^{39}$ 、 $-NR^{36}$

$R^{39}$ 、 $-OR^{37}$ 、 $-SO_2NR^{36}$ 、 $R^{39}$ 、 $-SO_2R^{36}$ 、 $-NR^{36}SO_2R^{39}$ 、 $-NR^{36}SO_2NR^{37}R^{41}$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $-C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $-(CH_2)_jO(CH_2)_iNR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_nO(CH_2)_iOR^{37}$ 、 $-(CH_2)_nOR^{37}$ 、 $-S(O)_j(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-(CH_2)_n(C_6 \sim C_{10}$ アリーール)、 $-(CH_2)_n(5 \sim 10$ 員環複素環)、 $-C(O)(CH_2)_n(C_6 \sim C_{10}$ アリーール)、 $-(CH_2)_nO(CH_2)_j(C_6 \sim C_{10}$ アリーール)、 $-(CH_2)_nO(CH_2)_i(5 \sim 10$ 員環複素環)、 $-C(O)(CH_2)_n(5 \sim 10$ 員環複素環)、 $-(CH_2)_jNR^{39}(CH_2)_iNR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_jNR^{39}CH_2C(O)NR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_jNR^{39}(CH_2)_iNR^{39}C(O)R^{40}$ 、 $-(CH_2)_jNR^{39}(CH_2)_nO(CH_2)_iOR^{37}$ 、 $-(CH_2)_jNR^{39}(CH_2)_iS(O)_j(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-(CH_2)_jNR^{39}(CH_2)_nR^{36}$ 、 $-SO_2(CH_2)_n(C_6 \sim C_{10}$ アリーール)および $-SO_2(CH_2)_n(5 \sim 10$ 員環複素環)からなる群から選択され、ここで、 $j$ は、 $0 \sim 2$ の整数であり、 $n$ は、 $0 \sim 6$ の整数であり、 $i$ は、 $2 \sim 6$ の範囲内の整数であり、前記 $R^{44}$ 基の $-(CH_2)_i$ および $-(CH_2)_{n-1}$ 部分は、随意に、炭素-炭素二重または三重結合を含み、ここで、 $n$ は、 $2 \sim 6$ の整数であり、前記 $R^{44}$ 基のアルキル、アリーールおよび複素環部分は、随意に、独立してハロ、シアノ、ニトロ、トリフルオロメチル、アジド、 $-OH$ 、 $-C(O)R^{40}$ 、 $-C(O)OR^{40}$ 、 $-OC(O)R^{40}$ 、 $-OC(O)OR^{40}$ 、 $-NR^{36}C(O)R^{39}$ 、 $-C(O)NR^{36}R^{39}$ 、 $-(CH_2)_nNR^{36}R^{39}$ 、 $-SO_2R^{36}$ 、 $-SO_2NR^{36}R^{39}$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $-(CH_2)_n(C_6 \sim C_{10}$ アリーール)、 $-(CH_2)_n(5 \sim 10$ 員環複素環)、 $-(CH_2)_nO(CH_2)_iOR^{37}$ および $-(CH_2)_nOR^{37}$ からなる群から選択された1個または2個以上の置換基により置換されており、ここで $n$ は、 $0 \sim 6$ の整数であり、 $i$ は、 $2 \sim 6$ の整数であり；また

各々の $R^{40}$ は、独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $-(CH_2)_n(C_6 \sim C_{10}$ アリーール)、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキルおよび $-(CH_2)_n(5 \sim 10$ 員環複素環)から選択され、ここで $n$ は、 $0 \sim 6$ の範囲内の整数であり；

各々の $R^{36}$ および $R^{39}$ は、独立して $H$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $-(CH_2)_n(C_6 \sim C_{10}$ アリーール)、 $-(CH_2)_n(5 \sim 10$ 員環複素環)、 $-(CH_2)_nO(CH_2)_iOR^{37}$ 、 $-(CH_2)_nCN(CH_2)_nOR^{37}$ 、 $-(CH_2)_nCN(CH_2)_nR^{37}$ および $-(CH_2)_nOR^{37}$ からなる群から選択され、ここで、 $n$ は、 $0 \sim 6$ の範囲内の整数であり、 $i$ は、 $2 \sim 6$ の範囲内の整数であり、前記 $R^{36}$ および $R^{39}$ 基のアルキル、アリーールおよび複素環部分は、随意に、独立して $-OH$ 、ハロ、シアノ、ニトロ、トリフルオロメチル、アジド、 $-C(O)R^{40}$ 、 $-C(O)OR^{40}$ 、 $-CO(O)R^{40}$ 、 $-OC(O)OR^{40}$ 、 $-NR^{37}C(O)R^{41}$ 、 $-C(O)NR^{37}R^{41}$ 、 $-NR^{37}R^{41}$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-(CH_2)_n(C_6 \sim C_{10}$ アリーール)、 $-(CH_2)_n(5 \sim 10$ 員環複素環)、 $-(CH_2)_nO(CH_2)_iOR^{37}$ および $-(CH_2)_nOR^{37}$ から選択された1個または2個以上の置換基により置換されており、ここで $n$ は、 $0 \sim 6$ の範囲内の整数であり、 $i$ は、 $2 \sim 6$ の範囲内の整数であり、ただし $R^{36}$ および $R^{39}$ は共に同一の窒素に結合している場合には、 $R^{36}$ および $R^{39}$ は、両方が直接酸素を介して窒素に結合していることはなく；

各々の $R^{37}$ および $R^{41}$ は、独立して、 $H$ 、 $OR^{36}$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルおよび $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキルからなる群から選択され；

各々の $R^{6a}$ および $R^{6b}$ は、独立して、水素、 $-(CZ^5Z^6)_u$ 、 $-(C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、 $-(CZ^5Z^6)_u$ 、 $-(C_5 \sim C_6$ シクロアルケニル)、 $-(CZ^5Z^6)_u$ 、アリーール、 $-(CZ^5Z^6)_u$ 、複素環、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群から選択され、これは、随意に、 $1 \sim 3$ 個の独立して選択された $Y^3$ 基で置換されており、ここで、 $u$ は、 $0$ 、 $1$ 、 $2$ または $3$ であり、またここで、 $u$ は $2$

または3である場合には、 $CZ^5Z^6$ 単位は、同一であっても異なってもよく、あるいは

$R^{6a}$ および $R^{6b}$ は、隣接する原子と一緒に複素環を形成することができ；  
各々の $Z^3$ 、 $Z^4$ 、 $Z^5$ および $Z^6$ は、独立して、H、Fおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群から選択され、あるいは、

各々の $Z^3$ および $Z^4$ 、または $Z^5$ および $Z^6$ は、一緒に炭素環を形成するように選択され、あるいは

隣接する炭素原子上の2個の $Z^3$ 基は、一緒に随意に炭素環を形成するように選択され；

各々の $Y^2$ および $Y^3$ は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、テトラゾリル、グアニジノ、アミジノ、メチルグアニジノ、アジド、 $-C(O)Z^7$ 、 $-OC(O)NH_2$ 、 $-OC(O)NHZ^7$ 、 $-OC(O)NZ^7Z^8$ 、 $-NHC(O)Z^7$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NHC(O)NHZ^7$ 、 $-NHC(O)NZ^7Z^8$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OZ^7$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(O)NHZ^7$ 、 $-C(O)NZ^7Z^8$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-P(O)_3(Z^7)_2$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-S(O)Z^7$ 、 $-S(O)_2Z^7$ 、 $-S(O)_3Z^7$ 、 $-Z^7$ 、 $-OZ^7$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NHZ^7$ 、 $-NZ^7Z^8$ 、 $-C(=NH)NH_2$ 、 $-C(=NOH)NH_2$ 、 $-N$ -モルホリノ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-(CZ^9Z^{10})_rNH_2$ 、 $-(CZ^9Z^{10})_rNHZ^3$ 、 $-(CZ^9Z^{10})_rNZ^7Z^8$ 、 $-X^6(CZ^9Z^{10})_r$ 、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-X^6(CZ^9Z^{10})_r$ 、 $-(C_5 \sim C_8$ シクロアルケニル)、 $-X^6(CZ^9Z^{10})_r$ 、アリーールおよび $-X^6(CZ^9Z^{10})_r$ 複素環からなる群から選択され、ここで、

$r$ は、1、2、3または4であり；

$X^6$ は、O、S、NH、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)NH-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ および $-S(O)_3-$ からなる群から選択され；

$Z^7$ および $Z^8$ は、独立して、1~12個の炭素原子を有するアルキル、2~12個の炭素原子を有するアルケニル、2~12個の炭素原子を有するアルキニル、3~8個の炭素原子を有するシクロアルキル、5~8個の炭素原子を有するシクロアルケニル、6~14個の炭素原子を有するアリーール、5~14個の環原子を有する複素環、7~15個の炭素原子を有するアラルキル、および5~14個の環原子を有するヘテロアラルキルからなる群から選択され、あるいは、

$Z^7$ および $Z^8$ は、一緒に随意に複素環を形成することができ；

$Z^9$ および $Z^{10}$ は、独立して、H、F、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_6 \sim C_{14}$ アリーール、 $C_6 \sim C_{14}$ ヘテロアリーール、 $C_7 \sim C_{15}$ アラルキルおよび $C_6 \sim C_{14}$ ヘテロアラルキルからなる群から選択され、あるいは、

$Z^9$ および $Z^{10}$ は、一緒に炭素環を形成し、あるいは、

隣接している炭素原子上の2個の $Z^9$ 基は、一緒に炭素環を形成し；あるいは、

隣接する炭素原子に結合した2つの $Y^2$ または $Y^3$ 基はいずれも、一緒になって、 $-O[C(Z^9)(Z^{10})]_rO$ または $-O[C(Z^9)(Z^{10})]_{r+1}$ であってもよく、あるいは、

同一の、または隣接する炭素原子に結合した2つの $Y^2$ または $Y^3$ 基はいずれも、炭素環または複素環を形成するように一緒に選択されてもよく；またここで、

ハロゲン、SOもしくは $SO_2$ 基またはN、OもしくはS原子に結合していない $CH_3$ （メチル）、 $CH_2$ （メチレン）、または $CH$ （メチン）基を含む前述の置換基はいずれも、随意に、前記基上に、ヒドロキシ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシおよび $-N[C_1 \sim C_4$ アルキル][ $C_1 \sim C_4$ アルキル]から選択された置換基を有し；

$E^2$ は、 $-C=CH$ または $-C=C-(CR^{45}R^{45})_n-R^{46}$ であり；

$R^{45}$ は、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキルおよび $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルからなる

る群から選択され；

$R^{46}$  は、ヘテロシクリル、 $-N(R^{47})-C(O)-N(R^{47})(R^{48})$ 、 $-N(R^{47})-C(S)-N(R^{47})(R^{48})$ 、 $-N(R^{47})-C(O)-OR^{48}$ 、 $-N(R^{47})-C(O)-(CH_2)_n-R^{48}$ 、 $-N(R^{47})-SO_2R^{47}$ 、 $-(CH_2)_nNR^{47}R^{48}$ 、 $-(CH_2)_nOR^{48}$ 、 $-(CH_2)_nSR^{49}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)R^{49}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_2R^{49}$ 、 $-OC(O)R^{49}$ 、 $-OC(O)OR^{49}$ 、 $-C(O)NR^{47}R^{48}$ 、並びにハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CN$ 、 $-SO_2R^{50}$  および  $-(CH_2)_nNR^{50}R^{51}$  からなる群から選択された1つまたは2つ以上の置換基で随意に置換されているヘテロアリアル、並びにハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CN$ 、 $-SO_2R^{50}$  および  $-(CH_2)_nNR^{50}R^{51}$  からなる群から選択された1つまたは2つ以上の置換基で随意に置換されているアリアルからなる群から選択され；

$R^{47}$  および  $R^{48}$  は、独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、ヘテロシクリル、 $-(CH_2)_nNR^{50}R^{51}$ 、 $-(CH_2)_nOR^{50}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R^{49}$ 、 $-C(O)_2R^{49}$ 、 $-(CH_2)_nSR^{49}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)R^{49}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_2R^{49}$ 、 $-(CH_2)_nR^{49}$ 、 $-(CH_2)_nCN$ 、並びにハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CN$ 、 $-(CH_2)_nOR^{49}$ 、 $-(CH_2)_n$ ヘテロシクリル、 $-(CH_2)_n$ ヘテロアリアル、 $-SO_2R^{50}$  および  $-(CH_2)_nNR^{50}R^{51}$  からなる群から選択された1つまたは2つ以上の置換基で随意に置換されているアリアル、並びにハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CN$ 、 $-(CH_2)_nOR^{49}$ 、 $-(CH_2)_n$ ヘテロシクリル、 $-(CH_2)_n$ ヘテロアリアル、 $-SO_2R^{50}$  および  $-(CH_2)_nNR^{50}R^{51}$  からなる群から選択された1つまたは2つ以上の置換基で随意に置換されているヘテロアリアルからなる群から選択され、あるいは、

$R^{47}$  および  $R^{48}$  は、これらが結合している原子と一緒に、3～8員環を形成し；

$R^{49}$  は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、ヘテロシクリル ( $C_1 \sim C_6$ アルキレン)、アリアル ( $C_1 \sim C_6$ アルキレン)、アリアルは随意にハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CN$ 、 $-SO_2R^{50}$  および  $-(CH_2)_nNR^{50}R^{51}$  からなる群から選択された1つまたは2つ以上の置換基で置換されているアリアル ( $C_1 \sim C_6$ アルキレン)、ヘテロアリアルは随意にハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CN$ 、 $-SO_2R^{50}$  および  $-(CH_2)_nNR^{50}R^{51}$  からなる群から選択された1つまたは2つ以上の置換基で置換されているヘテロアリアル  $C_1 \sim C_6$ アルキレン、並びに随意にハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CN$ 、 $-SO_2R^{50}$  および  $-(CH_2)_nNR^{50}R^{51}$  からなる群から選択された1つまたは2つ以上の置換基で置換されているアリアル、並びに随意にハロ、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CN$ 、 $-SO_2R^{50}$  および  $-(CH_2)_nNR^{50}R^{51}$  からなる群から選択された1つまたは2つ以上の置換基で置換されているヘテロアリアルからなる群から選択され；

$R^{50}$  および  $R^{51}$  は、独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル および  $-C(O)R^{45}$  からなる群から選択され、あるいは、

$R^{50}$  および  $R^{51}$  は、これらが結合している原子と一緒に、3～8員環を形成し；また

$E^3$  は、 $-(Z^{11})-(Z^{12})_m-(Z^{13})_{m1}$  により定義される基であり、ここで、

$Z^{11}$  は、ヘテロシクリルまたはヘテロシクリレンであり；

$Z^{12}$  は、 $OC(O)$ 、 $OC(S)$  および  $C(O)$  からなる群から選択され；

$Z^{13}$  は、ヘテロシクリル、アラルキル、 $N(H)R^{52}$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-O$

$R^{52}$ 、ハロ、 $S(O)_2 R^{56}$ 、 $C_1 \sim C_3$  ヒドロキシアルキルおよび  $C_1 \sim C_3$  ハロアルキルからなる群から選択され；

$m$  は、0 または 1 であり；

$m_1$  は、0 または 1 であり；

$R^{52}$  は、H、 $-(CH_2)_q S(O)_2 R^{54}$ 、 $R^{55} NR^{53} R^{53}$ 、 $C_1 \sim C_3$  アルキル、 $-(CH_2)_q OR^{53}$ 、 $-C(O)R^{54}$  および  $-C(O)OR^{53}$  からなる群から選択され；

$q$  は、0、1、2、3 または 4 であり；

$R^{53}$  は、 $C_1 \sim C_3$  アルキルであり；

$R^{54}$  は、 $C_1 \sim C_3$  アルキルまたは  $N(H)R^{53}$  であり；

$R^{55}$  は、 $C_1 \sim C_6$  アルキルであり；また

$R^{56}$  は、 $NH_2$ 、 $C_1 \sim C_3$  アルキルおよび  $OR^{52}$  からなる群から選択される。