

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】令和 1 年 12 月 12 日 (2019.12.12)

【公表番号】特表 2018-532760 (P2018-532760A)

【公表日】平成 30 年 11 月 8 日 (2018.11.8)

【年通号数】公開・登録公報 2018-043

【出願番号】特願 2018-523015 (P2018-523015)

【国際特許分類】

C 07D 487/04 (2006.01)

C 07D 519/00 (2006.01)

A 61K 31/519 (2006.01)

A 61K 31/541 (2006.01)

A 61K 31/554 (2006.01)

A 61K 31/5377 (2006.01)

A 61P 9/00 (2006.01)

A 61P 25/00 (2006.01)

A 61P 35/00 (2006.01)

A 61P 35/02 (2006.01)

A 61P 37/06 (2006.01)

【F I】

C 07D 487/04 1 4 2

C 07D 487/04 C S P

C 07D 519/00 3 1 1

A 61K 31/519

A 61K 31/541

C 07D 519/00 3 0 1

A 61K 31/554

A 61K 31/5377

A 61P 9/00

A 61P 25/00

A 61P 35/00

A 61P 35/02

A 61P 37/06

【手続補正書】

【提出日】令和 1 年 10 月 30 日 (2019.10.30)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

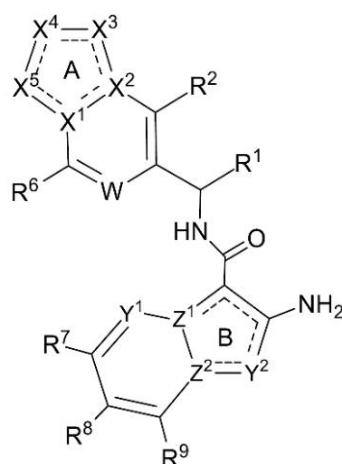
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物：

【化 1】



(I)

またはその薬学的に許容される塩：

[式中、

X^1 及び X^2 はそれぞれ独立に、C または N であるが、ただし、 X^1 及び X^2 が同時に N であることはなく；

X^3 は、N、 NR^{3a} 、または CR^3 であり；

X^4 は、N、 NR^{4a} 、または CR^4 であり；

X^5 は、N、 NR^{5a} 、または CR^5 であり；

W は、CH または N であり；

Y^1 は、N または CR^{10} であり；

Y^2 は、N または CR^{11} であり；

Z^1 及び Z^2 の一方は、N であり、 Z^1 及び Z^2 の他方は、C であり；

【化 2】

は、環 A 及び環 B が芳香族であることを維持する単結合または二重結合であり；

R^1 は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルまたは 4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキルであり、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、及び 4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2 または 3 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されており；

R^2 は、 OR^{13} 、 C_{3-6} シクロアルキル、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、または 5 ~ 10 員のヘテロアリールであり、 R^2 の C_{3-6} シクロアルキル、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び 5 ~ 10 員のヘテロアリールはそれぞれ、1、2、3、4、または 5 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されており；

R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 はそれぞれ、H、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル -、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル -、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル -、CN、 NO_2 、 OR^a 、 SR^a 、 $NHOR^a$ 、 $C(O)R^a$ 、 $C(O)NR^aR^a$ 、 $C(O)OR^a$ 、 $OC(O)R^a$ 、 $OC(O)NR^aR^a$ 、 NHR^a 、 NR^aR^a 、 $NR^aC(O)R^a$ 、 $NR^aC(O)OR^a$ 、 $NR^aC(O)NR^aR^a$ 、 $C(=NR^a)R^a$ 、 $C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $NR^aC(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $NR^aS(O)R^a$ 、 $NR^aS(O)_2R^a$ 、 $NR^aS(O)_2NR^aR^a$ 、 $S(O)R^a$ 、 $S(O)NR^aR^a$ 、 $S(O)_2R^a$ 、及び S

(O)₂NR^aR^aから独立に選択され、R³、R⁴、R⁵、及びR⁶のC₁～₆アルキル、C₂～₆アルケニル、C₂～₆アルキニル、C₆～₁₀アリール、C₃～₁₀シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、C₆～₁₀アリール-C₁～₄アルキル-、C₃～₁₀シクロアルキル-C₁～₄アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)-C₁～₄アルキル-、及び(4～10員のヘテロシクロアルキル)-C₁～₄アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択されるR^b置換基で任意選択で置換されており；

R^{3a}、R^{4a}、及びR^{5a}はそれぞれ、H、C₁～₆アルキル、C₂～₆アルケニル、C₂～₆アルキニル、C₁～₆ハロアルキル、C₆～₁₀アリール、C₃～₁₀シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、C₆～₁₀アリール-C₁～₄アルキル-、C₃～₁₀シクロアルキル-C₁～₄アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)-C₁～₄アルキル-、(4～10員のヘテロシクロアルキル)-C₁～₄アルキル-、C(O)R^a、C(O)NR^aR^a、C(O)OR^a、C(=NR^a)R^a、C(=NR^a)NR^aR^a、S(O)R^a、S(O)NR^aR^a、S(O)₂R^a、及びS(O)₂NR^aR^aから独立に選択され、R^{3a}、R^{4a}、及びR^{5a}のC₁～₆アルキル、C₂～₆アルケニル、C₂～₆アルキニル、C₆～₁₀アリール、C₃～₁₀シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、C₆～₁₀アリール-C₁～₄アルキル-、C₃～₁₀シクロアルキル-C₁～₄アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)-C₁～₄アルキル-、及び(4～10員のヘテロシクロアルキル)-C₁～₄アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択されるR^b置換基で任意選択で置換されており；

R⁷は、H、ハロ、CN、-OH、-C(O)O(C₁～₄アルキル)、-C(O)NH₂、-C(O)NH(C₁～₄アルキル)、-C(O)N(C₁～₄アルキル)₂、(C₁～₄アルキル)C(O)NH-、(C₁～₄アルキル)C(O)-、C₁～₄アルキルチオ、-NH(C₁～₄アルキル)、-N(C₁～₄アルキル)₂、C₁～₄アルキル、C₁～₄アルコキシ、C₁～₄ハロアルキル、C₁～₄ハロアルコキシ、-SO₂(C₁～₄アルキル)、-SO₂NH(C₁～₄アルキル)、-SO₂N(C₁～₄アルキル)₂、(C₁～₄アルキル)SO₂NH-、4～10員のヘテロシクロアルキル、及び5～10員のヘテロアリールから選択され、R⁷の-C(O)O(C₁～₄アルキル)、-C(O)NH(C₁～₄アルキル)、-C(O)N(C₁～₄アルキル)₂、(C₁～₄アルキル)C(O)NH-、(C₁～₄アルキル)C(O)-、C₁～₄アルキルチオ、-NH(C₁～₄アルキル)、-N(C₁～₄アルキル)₂、C₁～₄アルキル、C₁～₄アルコキシ、C₁～₄ハロアルキル、C₁～₄ハロアルコキシ、-SO₂(C₁～₄アルキル)、-SO₂NH(C₁～₄アルキル)、-SO₂N(C₁～₄アルキル)₂、(C₁～₄アルキル)SO₂NH-、4～10員のヘテロシクロアルキル、及び5～10員のヘテロアリール基はそれぞれ、1または2個の独立に選択されるR⁹置換基で任意選択で置換されており；

R⁸、R⁹、R¹⁰及びR¹¹はそれぞれ独立に、H、ハロ、CN、-OH、-C(O)O(C₁～₄アルキル)、-C(O)NH₂、-C(O)NH(C₁～₄アルキル)、-C(O)N(C₁～₄アルキル)₂、(C₁～₄アルキル)C(O)NH-、(C₁～₄アルキル)C(O)-、C₁～₄アルキルチオ、-NH(C₁～₄アルキル)、-N(C₁～₄アルキル)₂、C₁～₄アルキル、C₁～₄アルコキシ、C₁～₄ハロアルキル、C₁～₄ハロアルコキシ、-SO₂(C₁～₄アルキル)、-SO₂NH(C₁～₄アルキル)、-SO₂N(C₁～₄アルキル)₂、及び(C₁～₄アルキル)SO₂NH-であり、R⁸、R⁹、R¹⁰及びR¹¹の-C(O)O(C₁～₄アルキル)、-C(O)NH(C₁～₄アルキル)、-C(O)N(C₁～₄アルキル)₂、(C₁～₄アルキル)C(O)NH-、(C₁～₄アルキル)C(O)-、C₁～₄アルキルチオ、-NH(C₁～₄アルキル)、-N(C₁～₄アルキル)₂、C₁～₄アルキル、C₁～₄アルコキシ、C₁～₄ハロアルキル、C₁～₄ハロアルコキシ、-SO₂(C₁～₄アルキル)、-SO₂NH(C₁～₄アルキル)、-SO₂N(C₁～₄アルキル)₂及び(C₁

～₄ アルキル) SO₂NH-基はそれぞれ、1または2個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^{1 2} は、独立に選択される C₁～₆ アルキル基であり；

R^{1 3} は、Hか、または1、2もしくは3個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されている C₁～₆ アルキルであり；

各 R^a は、H、C₁～₆ アルキル、C₁～₄ ハロアルキル、C₂～₆ アルケニル、C₂～₆ アルキニル、C₆～₁₀ アリール、C₃～₁₀ シクロアルキル、5～₁₀ 員のヘテロアリール、4～₁₀ 員のヘテロシクロアルキル、C₆～₁₀ アリール-C₁～₄ アルキル-、C₃～₁₀ シクロアルキル-C₁～₄ アルキル-、(5～₁₀ 員のヘテロアリール)-C₁～₄ アルキル-、及び(4～₁₀ 員のヘテロシクロアルキル)-C₁～₄ アルキル-から独立に選択され、R^a の C₁～₆ アルキル、C₂～₆ アルケニル、C₂～₆ アルキニル、C₆～₁₀ アリール、C₃～₁₀ シクロアルキル、5～₁₀ 員のヘテロアリール、4～₁₀ 員のヘテロシクロアルキル、C₆～₁₀ アリール-C₁～₄ アルキル-、C₃～₁₀ シクロアルキル-C₁～₄ アルキル-、(5～₁₀ 員のヘテロアリール)-C₁～₄ アルキル- 及び (4～₁₀ 員のヘテロシクロアルキル)-C₁～₄ アルキル- はそれぞれ、1、2、3、4、または5個の独立に選択される R^d 置換基で任意選択で置換されているか；または

任意の2個の R^a 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2または3個の R^h 置換基で任意選択で置換されている 4員、5員、6員、7員、8員、9員 または 10員 のヘテロシクロアルキル基を形成しており；

各 R^b は、ハロ、C₁～₄ アルキル、C₁～₄ ハロアルキル、C₁～₄ ハロアルコキシ、C₆～₁₀ アリール、C₃～₁₀ シクロアルキル、5～₁₀ 員のヘテロアリール、4～₁₀ 員のヘテロシクロアルキル、C₆～₁₀ アリール-C₁～₄ アルキル-、C₃～₁₀ シクロアルキル-C₁～₄ アルキル-、(5～₁₀ 員のヘテロアリール)-C₁～₄ アルキル-、(4～₁₀ 員のヘテロシクロアルキル)-C₁～₄ アルキル-、CN、OH、NH₂、NO₂、NHOR^c、OR^c、SR^c、C(O)R^c、C(O)NR^cR^c、C(O)OR^c、OC(O)R^c、OC(O)NR^cR^c、C(=NR^c)NR^cR^c、NR^cC(=NR^c)NR^cR^c、NHR^c、NR^cR^c、NR^cC(O)R^c、NR^cC(O)OR^c、NR^cC(O)NR^cR^c、NR^cS(O)R^c、NR^cS(O)₂R^c、NR^cS(O)₂NR^cR^c、S(O)R^c、S(O)NR^cR^c、S(O)₂R^c 及び S(O)₂NR^cR^c から独立に選択され；R^b の C₁～₄ アルキル、C₁～₄ ハロアルキル、C₁～₄ ハロアルコキシ、C₆～₁₀ アリール、C₃～₁₀ シクロアルキル、5～₁₀ 員のヘテロアリール、4～₁₀ 員のヘテロシクロアルキル、C₆～₁₀ アリール-C₁～₄ アルキル-、C₃～₁₀ シクロアルキル-C₁～₄ アルキル-、(5～₁₀ 員のヘテロアリール)-C₁～₄ アルキル- 及び (4～₁₀ 員のヘテロシクロアルキル)-C₁～₄ アルキル- はそれぞれさらに、1、2、または3個の独立に選択される R^d 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^c は、H、C₁～₆ アルキル、C₁～₄ ハロアルキル、C₂～₆ アルケニル、C₂～₆ アルキニル、C₆～₁₀ アリール、C₃～₁₀ シクロアルキル、5～₁₀ 員のヘテロアリール、4～₁₀ 員のヘテロシクロアルキル、C₆～₁₀ アリール-C₁～₄ アルキル-、C₃～₁₀ シクロアルキル-C₁～₄ アルキル-、(5～₁₀ 員のヘテロアリール)-C₁～₄ アルキル-、及び(4～₁₀ 員のヘテロシクロアルキル)-C₁～₄ アルキル-から独立に選択され、R^c の C₁～₆ アルキル、C₂～₆ アルケニル、C₂～₆ アルキニル、C₆～₁₀ アリール、C₃～₁₀ シクロアルキル、5～₁₀ 員のヘテロアリール、4～₁₀ 員のヘテロシクロアルキル、C₆～₁₀ アリール-C₁～₄ アルキル-、C₃～₁₀ シクロアルキル-C₁～₄ アルキル-、(5～₁₀ 員のヘテロアリール)-C₁～₄ アルキル- 及び (4～₁₀ 員のヘテロシクロアルキル)-C₁～₄ アルキル- はそれぞれ、1、2、3、4、または5個の独立に選択される R^f 置換基で任意選択で置換されているか；または

任意の2個の R^c 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または

3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 員、5 員、6 員、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成しており；

各 R^d は、ハロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{3-10} シクロアルキル、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 CN 、 NH_2 、 $NHOR^e$ 、 OR^e 、 SR^e 、 $C(O)R^e$ 、 $C(O)NR^eR^e$ 、 $C(O)OR^e$ 、 $OC(O)R^e$ 、 $OC(O)NR^eR^e$ 、 NHR^e 、 NR^eR^e 、 $NR^eC(O)R^e$ 、 $NR^eC(O)NR^eR^e$ 、 $NR^eC(O)OR^e$ 、 $C(=NR^e)NR^eR^e$ 、 $NR^eC(=NR^e)NR^eR^e$ 、 $S(O)R^e$ 、 $S(O)NR^eR^e$ 、 $S(O)_2R^e$ 、 $NR^eS(O)_2R^e$ 、 $NR^eS(O)_2NR^eR^e$ 、及び $S(O)_2NR^eR^e$ から独立に選択され、 R^d の C_{1-4} アルキル、 C_{3-10} シクロアルキル及び 4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキルはそれぞれさらに、1、2、または 3 個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^f は、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル -、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル -、及び (4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル -、ハロ、 CN 、 $NHOR^g$ 、 OR^g 、 SR^g 、 $C(O)R^g$ 、 $C(O)NR^gR^g$ 、 $C(O)OR^g$ 、 $OC(O)R^g$ 、 $OC(O)NR^gR^g$ 、 NHR^g 、 NR^gR^g 、 $NR^gC(O)R^g$ 、 $NR^gC(O)NR^gR^g$ 、 $NR^gC(O)OR^g$ 、 $C(=NR^g)NR^gR^g$ 、 $NR^gC(=NR^g)NR^gR^g$ 、 $S(O)R^g$ 、 $S(O)NR^gR^g$ 、 $S(O)_2R^g$ 、 $NR^gS(O)_2R^g$ 、 $NR^gS(O)_2NR^gR^g$ 、及び $S(O)_2NR^gR^g$ から独立に選択され； R^f の C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル -、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル -、及び (4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、4、または 5 個の独立に選択される R^n 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^g は、 H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル -、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル -、及び (4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル - から独立に選択され、 R^g の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル -、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル - 及び (4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル - はそれぞれ、1、2、または 3 個の独立に選択される R^p 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^h は、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-10} シクロアルキル、4 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、5 ~ 6 員のヘテロアリール、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 6 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル -、(4 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル -、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、ハロ、 CN 、 OR^i 、 SR^i 、 $NHOR^i$ 、 $C(O)R^i$ 、 $C(O)NR^iR^i$ 、 $C(O)OR^i$ 、 $OC(O)R^i$ 、 $OC(O)NR^iR^i$ 、 NHR^i 、 NR^iR^i 、 $NR^iC(O)R^i$ 、 $NR^iC(O)NR^iR^i$ 、 $NR^iC(O)OR^i$ 、 $C(=NR^i)NR^iR^i$ 、 $NR^iC(=NR^i)NR^iR^i$ 、 $S(O)R^i$ 、 $S(O)NR^iR^i$ 、 $S(O)_2R^i$ 、 $NR^iS(O)_2R^i$ 、 $NR^iS(O)_2NR^iR^i$ 、及び $S(O)_2NR^iR^i$ から選択され、 R^h の C_{1-6} アルキル、 C_{3-10} シクロアルキル、4 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、5 ~ 6 員のヘテロ

アリール、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル - $C_1 \sim 4$ アルキル -、(5～6員のヘテロアリール) - $C_1 \sim 4$ アルキル -、(4～7員のヘテロシクロアルキル) - $C_1 \sim 4$ アルキル - はそれぞれさらに、1、2、または3個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されているか；または

4～10員のヘテロシクロアルキルの同じ炭素原子に結合している2個の R^h 基は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、または環員としてO、NもしくはSから選択される1～2個のヘテロ原子を有する4～6員のヘテロシクロアルキルを形成しており；

各 R^j 置換基は、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール、5または6員のヘテロアリール、 $C_2 \sim 4$ アルケニル、 $C_2 \sim 4$ アルキニル、ハロ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、CN、NHOR^k、OR^k、SR^k、C(O)R^k、C(O)NR^k、R^k、C(O)OR^k、OC(O)R^k、OC(O)NR^kR^k、NHR^k、NR^kR^k、NR^kC(O)R^k、NR^kC(O)NR^kR^k、NR^kC(O)OR^k、C(=NR^k)NR^kR^k、NR^kC(=NR^k)NR^kR^k、S(O)R^k、S(O)NR^kR^k、S(O)₂R^k、NR^kS(O)₂R^k、NR^kS(O)₂NR^kR^k、及びS(O)₂NR^kR^kから独立に選択され；

各 R^n は、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、ハロ、CN、R^o、NHOR^o、OR^o、SR^o、C(O)R^o、C(O)NR^oR^o、C(O)OR^o、OC(O)R^o、OC(O)NR^oR^o、NHR^o、NR^oR^o、NR^oC(O)R^o、NR^oC(O)NR^oR^o、NR^oC(O)OR^o、C(=NR^o)NR^oR^o、NR^oC(=NR^o)NR^oR^o、S(O)R^o、S(O)NR^oR^o、S(O)₂R^o、NR^oS(O)₂R^o、NR^oS(O)₂NR^oR^o、及びS(O)₂NR^oR^oから独立に選択され；

各 R^e 、 R^i 、 R^k 、 R^o または R^p は、H、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim 4$ アルケニル、 $C_2 \sim 4$ アルキニル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール、及び5または6員のヘテロアリールから独立に選択され； R^e 、 R^i 、 R^k 、 R^o または R^p の $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim 4$ アルケニル、 $C_2 \sim 4$ アルキニル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール、5または6員のヘテロアリールはそれぞれ、1、2または3個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されているか；または

任意の2個の R^e 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または3個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている4員、5員、6員、または7員のヘテロシクロアルキル基を形成しているか；または

任意の2個の R^g 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または3個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている4員、5員、6員、または7員のヘテロシクロアルキル基を形成しているか；または

任意の2個の R^i 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または3個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている4員、5員、6員、または7員のヘテロシクロアルキル基を形成しているか；

または任意の2個の R^k 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または3個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている4員、5員、6員、または7員のヘテロシクロアルキル基を形成しているか；

または任意の2個の R^o 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または3個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている4員、5員、6員、または7員のヘテロシクロアルキル基を形成しており；

各 R^q は、OH、CN、-COOH、NH₂、ハロ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオ、フェニル、5～6員のヘテロアリール、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、NHR^{1 2}、NR^{1 2}R^{1 2}、及び $C_1 \sim 4$ ハロアルコキシから独立に選択され、 R^q の $C_1 \sim 4$ アルキル、フェニル及び5～6員のヘテロアリールはそれぞれ、OH、CN、-COOH、NH₂、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、及び4～6員のヘテロシクロアルキルで任意選択で置換されている]。

【請求項 2】

X^1 及び X^2 がそれぞれ独立に、C または N であるが、ただし、 X^1 及び X^2 が同時に N であることはなく；

X^3 が、N、 NR^{3a} 、または CR^3 であり；

X^4 が、N、 NR^{4a} 、または CR^4 であり；

X^5 が、N、 NR^{5a} 、または CR^5 であり；

W が、CH または N であり；

Y^1 が、N または CR^{10} であり；

Y^2 が、N または CR^{11} であり；

Z^1 及び Z^2 の一方が、N であり、 Z^1 及び Z^2 の他方が、C であり；

【化 3】

が、環 A 及び環 B が芳香族であることを維持する単結合または二重結合であり；

R^1 が、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルまたは 4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキルであり、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、及び 4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキルがそれぞれ、1、2 または 3 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されており；

R^2 が、 OR^{13} 、 C_{3-6} シクロアルキル、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、または 5 ~ 10 員のヘテロアリールであり、 R^2 の C_{3-6} シクロアルキル、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び 5 ~ 10 員のヘテロアリールがそれぞれ、1、2、3、4、または 5 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されており；

R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 がそれぞれ、H、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル -、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル -、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル -、CN、 NO_2 、 OR^a 、 SR^a 、 $NHOR^a$ 、 $C(O)R^a$ 、 $C(O)NR^aR^a$ 、 $C(O)OR^a$ 、 $OC(O)R^a$ 、 $OC(O)NR^aR^a$ 、 NHR^a 、 NR^aR^a 、 $NR^aC(O)R^a$ 、 $NR^aC(O)OR^a$ 、 $NR^aC(O)NR^aR^a$ 、 $C(=NR^a)R^a$ 、 $C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $NR^aC(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $NR^aS(O)R^a$ 、 $NR^aS(O)_2R^a$ 、 $NR^aS(O)_2NR^aR^a$ 、 $S(O)R^a$ 、 $S(O)NR^aR^a$ 、 $S(O)_2R^a$ 、及び $S(O)_2NR^aR^a$ から独立に選択され、 R^3 、 R^4 、 R^5 、及び R^6 の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル -、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル -、及び (4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル - がそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立に選択される R^b 置換基で任意選択で置換されており；

R^{3a} 、 R^{4a} 、及び R^{5a} がそれぞれ、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル -、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル -、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル -、 $C(O)R^a$ 、 $C(O)NR^aR^a$ 、 $C(O)OR^a$ 、 $C(=NR^a)R^a$ 、 $C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $S(O)R^a$ 、 $S(O)NR^aR^a$ 、 $S(O)_2R^a$ 、及び $S(O)_2NR^aR^a$ から独立に選択され、 R^{3a} 、 R^{4a} 、及び R^{5a} の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール

ル、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル、 $5 \sim 10$ 員のヘテロアリール、 $4 \sim 10$ 員のヘテロシクロアルキル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - 、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - 、 $(5 \sim 10$ 員のヘテロアリール) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - 、及び $(4 \sim 10$ 員のヘテロシクロアルキル) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - がそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基で任意選択で置換されており；

R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 及び R^{11} がそれぞれ独立に、H、ハロ、CN、-OH、-C(O)O($C_{1 \sim 4}$ アルキル)、-C(O)NH₂、-C(O)NH($C_{1 \sim 4}$ アルキル)、-C(O)N($C_{1 \sim 4}$ アルキル)₂、($C_{1 \sim 4}$ アルキル)C(O)NH-、($C_{1 \sim 4}$ アルキル)C(O)-、 $C_{1 \sim 4}$ アルキルチオ、-NH($C_{1 \sim 4}$ アルキル)、-N($C_{1 \sim 4}$ アルキル)₂、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、 $C_{1 \sim 4}$ アルコキシ、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルコキシ、-SO₂($C_{1 \sim 4}$ アルキル)、-SO₂NH($C_{1 \sim 4}$ アルキル)、-SO₂N($C_{1 \sim 4}$ アルキル)₂、及び($C_{1 \sim 4}$ アルキル)SO₂NH-であり、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 及び R^{11} の-C(O)O($C_{1 \sim 4}$ アルキル)、-C(O)NH($C_{1 \sim 4}$ アルキル)、-C(O)N($C_{1 \sim 4}$ アルキル)₂、($C_{1 \sim 4}$ アルキル)C(O)NH-、($C_{1 \sim 4}$ アルキル)C(O)-、 $C_{1 \sim 4}$ アルキルチオ、-NH($C_{1 \sim 4}$ アルキル)、-N($C_{1 \sim 4}$ アルキル)₂、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、 $C_{1 \sim 4}$ アルコキシ、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルコキシ、-SO₂($C_{1 \sim 4}$ アルキル)、-SO₂NH($C_{1 \sim 4}$ アルキル)、-SO₂N($C_{1 \sim 4}$ アルキル)₂及び($C_{1 \sim 4}$ アルキル)SO₂NH-基がそれぞれ、1または2個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^{12} が、独立に選択される $C_{1 \sim 6}$ アルキル基であり；

R^{13} が、Hか、または1、2または3個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されている $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり；

各 R^a が、H、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、 $C_{2 \sim 6}$ アルケニル、 $C_{2 \sim 6}$ アルキニル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル、 $5 \sim 10$ 員のヘテロアリール、 $4 \sim 10$ 員のヘテロシクロアルキル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - 、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - 、 $(5 \sim 10$ 員のヘテロアリール) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - 、及び $(4 \sim 10$ 員のヘテロシクロアルキル) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - から独立に選択され、 R^a の $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{2 \sim 6}$ アルケニル、 $C_{2 \sim 6}$ アルキニル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル、 $5 \sim 10$ 員のヘテロアリール、 $4 \sim 10$ 員のヘテロシクロアルキル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - 、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - 、 $(5 \sim 10$ 員のヘテロアリール) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - 及び $(4 \sim 10$ 員のヘテロシクロアルキル) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - がそれぞれ、1、2、3、4、または5個の独立に選択される R^d 置換基で任意選択で置換されているか；または

任意の2個の R^a 置換基が、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2または3個の R^h 置換基で任意選択で置換されている4員、5員、6員、7員、8員、9員または10員のヘテロシクロアルキル基を形成しており；

各 R^b が、ハロ、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルコキシ、 $C_{6 \sim 10}$ アリール、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル、 $5 \sim 10$ 員のヘテロアリール、 $4 \sim 10$ 員のヘテロシクロアルキル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - 、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - 、 $(5 \sim 10$ 員のヘテロアリール) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - 、 $(4 \sim 10$ 員のヘテロシクロアルキル) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - 、CN、OH、NH₂、NO₂、NHOR^c、OR^c、SR^c、C(O)R^c、C(O)NR^cR^c、C(O)OR^c、OC(O)R^c、OC(O)NR^cR^c、C(=NR^c)NR^cR^c、NR^cC(=NR^c)NR^cR^c、NHR^c、NR^cR^c、NR^cC(O)R^c、NR^cC(O)OR^c、NR^cC(O)NR^cR^c、NR^cS(O)R^c、NR^cS(O)₂R^c、NR^cS(O)₂NR^cR^c、S(O)R^c、S(O)NR^cR^c、S(O)₂R^c及びS(O)₂NR^cR^cから独立に選択され； R^b の $C_{1 \sim 4}$ アルキル、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルコキシ、 $C_{6 \sim 10}$ アリール、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル、 $5 \sim$

10員のヘテロアリーール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリーール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリーール)- C_{1-4} アルキル-及び(4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-がそれぞれさらに、1、2、または3個の独立に選択される R^d 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^c が、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリーール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリーール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリーール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリーール)- C_{1-4} アルキル-、及び(4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-から独立に選択され、 R^c の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリーール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリーール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリーール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリーール)- C_{1-4} アルキル-及び(4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-がそれぞれ、1、2、3、4、または5個の独立に選択される R^f 置換基で任意選択で置換されているか；または

任意の2個の R^c 置換基が、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または3個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている4員、5員、6員、または7員のヘテロシクロアルキル基を形成しており；

各 R^d が、ハロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{3-10} シクロアルキル、4～10員のヘテロシクロアルキル、CN、 NH_2 、 $NHOR^e$ 、 OR^e 、 SR^e 、 $C(O)R^e$ 、 $C(O)NR^eR^e$ 、 $C(O)OR^e$ 、 $OC(O)R^e$ 、 $OC(O)NR^eR^e$ 、 NHR^e 、 NR^eR^e 、 $NR^eC(O)R^e$ 、 $NR^eC(O)NR^eR^e$ 、 $NR^eC(O)OR^e$ 、 $C(=NR^e)NR^eR^e$ 、 $NR^eC(=NR^e)NR^eR^e$ 、 $S(O)R^e$ 、 $S(O)NR^eR^e$ 、 $S(O)_2R^e$ 、 $NR^eS(O)_2R^e$ 、 $NR^eS(O)_2NR^eR^e$ 、及び $S(O)_2NR^eR^e$ から独立に選択され、 R^d の C_{1-4} アルキル、 C_{3-10} シクロアルキル及び4～10員のヘテロシクロアルキルがそれぞれさらに、1、2、または3個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^f が、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリーール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリーール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリーール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリーール)- C_{1-4} アルキル-、及び(4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-、ハロ、CN、 $NHOR^g$ 、 OR^g 、 SR^g 、 $C(O)R^g$ 、 $C(O)NR^gR^g$ 、 $C(O)OR^g$ 、 $OC(O)R^g$ 、 $OC(O)NR^gR^g$ 、 NHR^g 、 NR^gR^g 、 $NR^gC(O)R^g$ 、 $NR^gC(O)NR^gR^g$ 、 $NR^gC(O)OR^g$ 、 $C(=NR^g)NR^gR^g$ 、 $NR^gC(=NR^g)NR^gR^g$ 、 $S(O)R^g$ 、 $S(O)NR^gR^g$ 、 $S(O)_2R^g$ 、 $NR^gS(O)_2R^g$ 、 $NR^gS(O)_2NR^gR^g$ 、及び $S(O)_2NR^gR^g$ から独立に選択され； R^f の C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリーール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリーール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリーール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリーール)- C_{1-4} アルキル-、及び(4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-がそれぞれ、1、2、3、4、または5個の独立に選択される R^n 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^g が、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリーール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリーール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリーール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリーール)

- $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、及び (4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - から独立に選択され、 R^g の $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{2 \sim 6}$ アルケニル、 $C_{2 \sim 6}$ アルキニル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - 及び (4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - がそれぞれ、1、2、または3個の独立に選択される R^p 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^h が、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル、4 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール、5 ~ 6 員のヘテロアリール、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、(5 ~ 6 員のヘテロアリール) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、(4 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、 $C_{1 \sim 6}$ ハロアルキル、 $C_{2 \sim 6}$ アルケニル、 $C_{2 \sim 6}$ アルキニル、ハロ、CN、 OR^i 、 SR^i 、 $NHOR^i$ 、 $C(O)R^i$ 、 $C(O)NR^iR^i$ 、 $C(O)OR^i$ 、 $OC(O)R^i$ 、 $OC(O)NR^iR^i$ 、 NHR^i 、 NR^iR^i 、 $NR^iC(O)R^i$ 、 $NR^iC(O)NR^iR^i$ 、 $NR^iC(O)OR^i$ 、 $C(=NR^i)NR^iR^i$ 、 $NR^iC(=NR^i)NR^iR^i$ 、 $S(O)R^i$ 、 $S(O)NR^iR^i$ 、 $S(O)_2R^i$ 、 $NR^iS(O)_2R^i$ 、 $NR^iS(O)_2NR^iR^i$ 、及び $S(O)_2NR^iR^i$ から選択され、 R^h の $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル、4 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール、5 ~ 6 員のヘテロアリール、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、(5 ~ 6 員のヘテロアリール) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、(4 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - がそれぞれさらに、1、2、または3個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されているか；または

4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキルの同じ炭素原子に結合している2個の R^h 基が、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_{3 \sim 6}$ シクロアルキル、または環員としてO、NもしくはSから選択される1 ~ 2個のヘテロ原子を有する4 ~ 6員のヘテロシクロアルキルを形成しており；

各 R^j 置換基が、 $C_{3 \sim 6}$ シクロアルキル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール、5または6員のヘテロアリール、 $C_{2 \sim 4}$ アルケニル、 $C_{2 \sim 4}$ アルキニル、ハロ、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、CN、 $NHOR^k$ 、 OR^k 、 SR^k 、 $C(O)R^k$ 、 $C(O)NR^kR^k$ 、 $C(O)OR^k$ 、 $OC(O)R^k$ 、 $OC(O)NR^kR^k$ 、 NHR^k 、 NR^kR^k 、 $NR^kC(O)R^k$ 、 $NR^kC(O)NR^kR^k$ 、 $NR^kC(O)OR^k$ 、 $C(=NR^k)NR^kR^k$ 、 $NR^kC(=NR^k)NR^kR^k$ 、 $S(O)R^k$ 、 $S(O)NR^kR^k$ 、 $S(O)_2R^k$ 、 $NR^kS(O)_2R^k$ 、 $NR^kS(O)_2NR^kR^k$ 、及び $S(O)_2NR^kR^k$ から独立に選択され；

各 R^n が、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、ハロ、CN、 R^o 、 $NHOR^o$ 、 OR^o 、 SR^o 、 $C(O)R^o$ 、 $C(O)NR^oR^o$ 、 $C(O)OR^o$ 、 $OC(O)R^o$ 、 $OC(O)NR^oR^o$ 、 NHR^o 、 NR^oR^o 、 $NR^oC(O)R^o$ 、 $NR^oC(O)NR^oR^o$ 、 $NR^oC(O)OR^o$ 、 $C(=NR^o)NR^oR^o$ 、 $NR^oC(=NR^o)NR^oR^o$ 、 $S(O)R^o$ 、 $S(O)NR^oR^o$ 、 $S(O)_2R^o$ 、 $NR^oS(O)_2R^o$ 、 $NR^oS(O)_2NR^oR^o$ 、及び $S(O)_2NR^oR^o$ から独立に選択され；

各 R^e 、 R^i 、 R^k 、 R^o または R^p が、H、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、 $C_{2 \sim 4}$ アルケニル、 $C_{2 \sim 4}$ アルキニル、 $C_{3 \sim 6}$ シクロアルキル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール、及び5または6員のヘテロアリールから独立に選択され； R^e 、 R^i 、 R^k 、 R^o または R^p の $C_{1 \sim 4}$ アルキル、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、 $C_{2 \sim 4}$ アルケニル、 $C_{2 \sim 4}$ アルキニル、 $C_{3 \sim 6}$ シクロアルキル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール、5または6員のヘテロアリールがそれぞれ、1、2または3個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されているか；または

任意の2個の R^e 置換基が、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または3個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている4員、5員、6員、または7員のヘテロシクロアルキル基を形成しているか；または

任意の 2 個の R^g 置換基が、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 員、5 員、6 員、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成しているか；または

任意の 2 個の R^i 置換基が、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 員、5 員、6 員、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成しているか；または

任意の 2 個の R^k 置換基が、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 員、5 員、6 員、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成しているか；または

任意の 2 個の R^o 置換基が、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 員、5 員、6 員、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成しており；

各 R^q が、OH、CN、 $-COOH$ 、 NH_2 、ハロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルチオ、フェニル、5～6 員のヘテロアリール、 C_{3-6} シクロアルキル、 NHR^{12} 、 $NR^{12}R^{12}$ 、及び C_{1-4} ハロアルコキシから独立に選択され、 R^q の C_{1-4} アルキル、フェニル及び 5～6 員のヘテロアリールがそれぞれ、OH、CN、 $-COOH$ 、 NH_2 、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{3-10} シクロアルキル、及び 4～6 員のヘテロシクロアルキルで任意選択で置換されている、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 3】

R^1 が、H または C_{1-6} アルキルである、請求項 1 もしくは 2 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 4】

R^1 が、 C_{1-6} アルキルである、請求項 1 もしくは 2 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 5】

R^1 が、メチルである、請求項 1 もしくは 2 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 6】

R^2 が、 OR^{13} 、 C_{6-10} アリール、5～10 員のヘテロシクロアルキル、または 5～10 員のヘテロアリールであり； R^2 の前記 C_{6-10} アリール、5～10 員のヘテロシクロアルキル、及び 5～10 員のヘテロアリールがそれぞれ、1、2、3、4、または 5 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されている、請求項 1～5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 7】

R^2 が、 OR^{13} 、 C_{6-10} アリール、または 5～10 員のヘテロアリールであり； R^2 の前記 C_{6-10} アリールまたは 5～10 員のヘテロアリールがそれぞれ、1、2、3、4、または 5 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されている、請求項 1～5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 8】

R^2 が、 OR^{13} または C_{6-10} アリールであり； R^2 の前記 C_{6-10} アリールが、1、2、または 3 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されている、請求項 1～5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 9】

R^2 が、 C_{1-6} アルコキシ、フェニル、または単環式 5～6 員のヘテロアリールであり； R^2 の前記フェニルまたは単環式 5～6 員のヘテロアリールがそれぞれ、1、2、または 3 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されている、請求項 1～5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 10】

R^2 が、 C_{1-6} アルコキシまたはフェニルであり、 R^2 の前記フェニルが、1、2、

または 3 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されている、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 1】

R^2 が、 C_{1-6} アルコキシ、フェニル、5 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル、または単環式 5 ~ 6 員のヘテロアリールであり； R^2 の前記フェニル、5 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル、単環式 5 ~ 6 員のヘテロアリールがそれぞれ、1、2、または 3 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されている、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 2】

各 R^j が、ハロ、CN、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 $NHOR^k$ 、 OR^k 、 $C(O)R^k$ 、 $C(O)NR^kR^k$ 、 $C(O)OR^k$ 、 $OC(O)R^k$ 、 $OC(O)NR^kR^k$ 、 NHR^k 、 NR^kR^k 、 $NR^kC(O)R^k$ 、 $S(O)_2R^k$ 、 $NR^kS(O)_2R^k$ 、及び $S(O)_2NR^kR^k$ から独立に選択される、請求項 1 ~ 1 1 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 3】

各 R^k が、H、 C_{1-4} アルキル、及び C_{1-4} ハロアルキルから独立に選択される、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 4】

各 R^j が、ハロ、CN、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} ハロアルコキシ、アミノ、 C_{1-4} アルキルアミノ、及びジ(C_{1-4} アルキル)アミノから独立に選択される、請求項 1 ~ 1 1 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 5】

各 R^j が独立に、ハロである、請求項 1 ~ 1 1 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 6】

R^2 が、エトキシ、フェニル、または 3 - フルオロフェニルである、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 7】

R^{3a} が、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル - 、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル - 、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル - 、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル - から選択され； R^{3a} の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル - 、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル - 、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル - 、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル - がそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されている、請求項 1 ~ 1 6 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 8】

R^{3a} が、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、フェニル - C_{1-4} アルキル - 、(5 ~ 6 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル、及び(4 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキルであり； R^{3a} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル、フェニル - C_{1-4} アルキル - 、(5 ~ 6 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル、及び(4 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキルがそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されている、請求項 1 ~ 1 6 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬

学的に許容される塩。

【請求項 19】

各 R^b が、ハロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 CN 、 OH 、 NH_2 、 $NHOR^c$ 、 OR^c 、 $C(O)R^c$ 、 $C(O)NR^cR^c$ 、 $C(O)OR^c$ 、 $OC(O)R^c$ 、 $OC(O)NR^cR^c$ 、 NHR^c 、 NR^cR^c 、 $NR^cC(O)R^c$ 、 $NR^cC(O)OR^c$ 、 $NR^cS(O)R^c$ 、 $NR^cS(O)_2R^c$ 、 $S(O)_2R^c$ 及び $S(O)_2NR^cR^c$ から独立に選択される、請求項 17 または 18 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 20】

各 R^b が、 C_{1-4} アルキル、 OH 、 OR^c 、 CN 、 $C(O)NR^cR^c$ 、及び NR^cR^c から独立に選択される、請求項 17 または 18 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 21】

各 R^c が、 H 及び C_{1-6} アルキルから独立に選択される、請求項 17 または 18 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 22】

R^{3a} が、 H 、メチル、イソプロピル、イソブチル、 $-CH_2C(C)CH_3$ 、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2OCH_3$ 、 $-CH_2CN$ 、 $-CH_2CH_2NH_2$ 、 $-CH_2C(O)NH_2$ 、ベンジル、シクロブチル、 $-CH_2-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)$ 、または $-CH_2CH_2-(モルホリン-4-イル)$ である、請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 23】

R^3 が、 H 、ハロ、 CN 、 C_{1-6} アルキル、または C_{1-6} ハロアルキルである、請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 24】

R^3 が、 H または C_{1-6} アルキルである、請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 25】

R^3 が、 H 、メチル、またはエチルである、請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 26】

R^{4a} が、 H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5 ~ 10 員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル- から選択され； R^{4a} の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5 ~ 10 員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル- がそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されている、請求項 1 ~ 25 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 27】

R^{4a} が、 H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、フェニル- C_{1-4} アルキル-、及び (5 ~ 6 員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル- から選択され、 R^{4a} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、フェニル- C_{1-4} アルキル-、及び (5 ~ 6 員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル- がそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されている、請求項 1 ~ 25 のいずれか 1 項に記載の化合物、または

その薬学的に許容される塩。

【請求項 28】

各 R^b が、ハロ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 CN 、 OH 、 NH_2 、 $NHOR^c$ 、 OR^c 、 $C(O)R^c$ 、 $C(O)NR^cR^c$ 、 $C(O)OR^c$ 、 $OC(O)R^c$ 、 $OC(O)NR^cR^c$ 、 NHR^c 、 NR^cR^c 、 $NR^cC(O)R^c$ 、 $NR^cC(O)OR^c$ 、 $NR^cS(O)R^c$ 、 $NR^cS(O)_2R^c$ 、 $S(O)_2R^c$ 及び $S(O)_2NR^cR^c$ から独立に選択される、請求項 27 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 29】

各 R^b が、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 OH 、 OR^c 、 CN 、 NR^cR^c 、及び $C(O)NR^cR^c$ から独立に選択される、請求項 27 または 28 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 30】

各 R^c が独立に、 H または $C_1 \sim 6$ アルキルであるか；または任意の 2 個の R^c 置換基が、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 員、5 員、6 員、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成している、請求項 28 または 29 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 31】

R^{4a} が、 H 、メチル、エチル、イソプロピル、イソブチル、 $-CH_2C(C)CH_3$ 、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2OCH_3$ 、 $-CH_2CN$ 、 $-CH_2CH_2NH_2$ 、シクロブチル、ベンジル、 $-CH_2C(O)NH_2$ 、 $-CH_2-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)$ 、または $-CH_2C(O)-(モルホリン-4-イル)$ である、請求項 1 ~ 25 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 32】

R^4 が、 H 、ハロ、 CN 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、または $C_1 \sim 6$ ハロアルキルである、請求項 1 ~ 25 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 33】

R^4 が、 H または $C_1 \sim 6$ アルキルである、請求項 1 ~ 25 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 34】

R^5 が、 H 、ハロ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、または $C_1 \sim 6$ ハロアルキルである、請求項 1 ~ 33 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 35】

R^5 が、 H 、ハロ、または $C_1 \sim 6$ アルキルである、請求項 1 ~ 33 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 36】

R^5 が、 H 、ブromo、またはメチルである、請求項 1 ~ 33 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 37】

R^6 が、 H 、ハロ、 CN 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、または $C_1 \sim 6$ ハロアルキルである、請求項 1 ~ 36 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 38】

R^6 が、ハロ、 CN 、または $C_1 \sim 6$ アルキルである、請求項 1 ~ 36 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 39】

R^6 は、クロロ、 CN 、またはメチルである、請求項 1 ~ 36 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 40】

R^7 が、 H 、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、または 5 ~ 10 員のヘテロアリール

であり、前記 4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル及び 5 ~ 10 員のヘテロアリールがそれぞれ、1 または 2 個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されている、請求項 1 ~ 39 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 4 1】

R^7 が、H、5 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル、または 5 ~ 6 員のヘテロアリールであり、前記 5 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル及び 5 ~ 6 員のヘテロアリールがそれぞれ、1 または 2 個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されている、請求項 1 ~ 39 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 4 2】

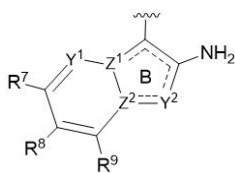
R^7 が、H、ピペリジニル、またはピリジルであり、前記ピペリジニル及びピリジル基がそれぞれ、1 または 2 個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されている、請求項 1 ~ 39 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 4 3】

R^7 、 R^8 、及び R^9 がそれぞれ、H である、請求項 1 ~ 39 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 4 4】

【化 4】



が、

【化 5】



であり；

R^1 が、H または C_{1-6} アルキルであり；

R^2 が、 OR^{13} 、 C_{6-10} アリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、または 5 ~ 10 員のヘテロアリールであり； R^2 の前記 C_{6-10} アリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、及び 5 ~ 10 員のヘテロアリールがそれぞれ、1、2、3、4、または 5 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^j が、ハロ、CN、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 $NHOR^k$ 、 OR^k 、 $C(O)R^k$ 、 $C(O)NR^kR^k$ 、 $C(O)OR^k$ 、 $OC(O)R^k$ 、 $OC(O)NR^kR^k$ 、 NHR^k 、 NR^kR^k 、 $NR^kC(O)R^k$ 、 $S(O)_2R^k$ 、 $NR^kS(O)_2R^k$ 、及び $S(O)_2NR^kR^k$ から独立に選択され；

R^{3a} が、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル -、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル -、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル - から選択され； R^{3a} の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル -、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル -、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル - がそれぞれ、1、2、

3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

R^{4a} が、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、(4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-から選択され； R^{4a} の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、(4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-がそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

R^3 が、Hまたは C_{1-6} アルキルであり；

R^4 が、Hまたは C_{1-6} アルキルであり；

R^5 が、H、ハロ、 C_{1-6} アルキル、または C_{1-6} ハロアルキルであり；

R^{5a} が、Hまたは C_{1-6} アルキルであり；

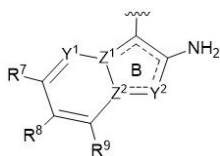
R^6 が、H、ハロ、CN、 C_{1-6} アルキル、または C_{1-6} ハロアルキルであり；

R^7 が、H、ハロ、CN、 C_{1-4} アルキル、または C_{1-4} ハロアルキルである、

請求項1もしくは2に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

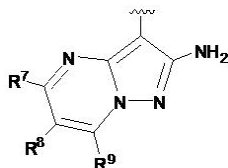
【請求項45】

【化6】



が、

【化7】



であり；

R^1 が、Hまたは C_{1-6} アルキルであり；

R^2 が、 OR^{13} 、 C_{6-10} アリール、または5～10員のヘテロアリールであり；

R^2 の前記 C_{6-10} アリールまたは5～10員のヘテロアリールがそれぞれ、1、2、3、4、または5個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^j が、ハロ、CN、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 $NHOR^k$ 、 OR^k 、 $C(O)R^k$ 、 $C(O)NR^kR^k$ 、 $C(O)OR^k$ 、 $OC(O)R^k$ 、 $OC(O)NR^kR^k$ 、 NHR^k 、 NR^kR^k 、 $NR^kC(O)R^k$ 、 $S(O)_2R^k$ 、 $NR^kS(O)_2R^k$ 、及び $S(O)_2NR^kR^k$ から独立に選択され；

R^{3a} が、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、(4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-から選択され； R^{3a} の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シク

ロアルキル - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - がそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

R^{4a} が、H、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{2 \sim 6}$ アルケニル、 $C_{2 \sim 6}$ アルキニル、 $C_{1 \sim 6}$ ハロアルキル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - から選択され； R^{4a} の $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{2 \sim 6}$ アルケニル、 $C_{2 \sim 6}$ アルキニル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - がそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

R^3 が、Hまたは $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり；

R^4 が、Hまたは $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり；

R^5 が、H、ハロ、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、または $C_{1 \sim 6}$ ハロアルキルであり；

R^{5a} が、Hまたは $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり；

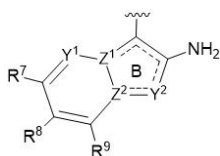
R^6 が、H、ハロ、CN、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、または $C_{1 \sim 6}$ ハロアルキルであり；

R^7 が、H、ハロ、CN、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、または $C_{1 \sim 4}$ ハロアルキルである、

請求項1もしくは2に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

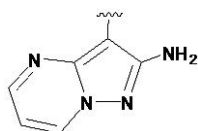
【請求項46】

【化8】



が、

【化9】



であり；

R^1 が、 $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり；

R^2 が、 $C_{1 \sim 6}$ アルコキシ、フェニル、または単環式5 ~ 6員のヘテロアリールであり； R^2 の前記フェニルまたは単環式5 ~ 6員のヘテロアリールがそれぞれ、1、2、または3個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^j が、ハロ、CN、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、 $C_{2 \sim 4}$ アルケニル、 $C_{2 \sim 4}$ アルキニル、 $NHOR^k$ 、 OR^k 、 $C(O)R^k$ 、 $C(O)NR^kR^k$ 、 $C(O)OR^k$ 、 $OC(O)R^k$ 、 $OC(O)NR^kR^k$ 、 NHR^k 、 NR^kR^k 、 $NR^kC(O)R^k$ 、 $S(O)_2R^k$ 、 $NR^kS(O)_2R^k$ 、及び $S(O)_2NR^kR^k$ から独立に選択され；

各 R^k が、H、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、及び $C_{1 \sim 4}$ ハロアルキルから独立に選択され；

R^{3a} が、H、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{2 \sim 6}$ アルキニル、 $C_{3 \sim 7}$ シクロアルキル、フェニル - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、(5 ~ 6員のヘテロアリール) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル、及び(4 ~ 6員のヘテロシクロアルキル) - $C_{1 \sim 4}$ アルキルであり； R^{3a} の前記 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{3 \sim 7}$ シクロアルキル、フェニル - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、(5 ~ 6員のヘテロアリール) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル、及び(4 ~ 6員のヘテロシクロアルキル) - $C_{1 \sim 4}$ アルキルがそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任

意選択で置換されており；

各 R^b が、ハロ、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、 CN 、 OH 、 NH_2 、 $NHOR^c$ 、 OR^c 、 $C(O)R^c$ 、 $C(O)NR^cR^c$ 、 $C(O)OR^c$ 、 $OC(O)R^c$ 、 $OC(O)NR^cR^c$ 、 NHR^c 、 NR^cR^c 、 $NR^cC(O)R^c$ 、 $NR^cC(O)OR^c$ 、 $NR^cS(O)R^c$ 、 $NR^cS(O)_2R^c$ 、 $S(O)_2R^c$ 及び $S(O)_2NR^cR^c$ から独立に選択され；

R^{4a} が、 H 、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{2 \sim 6}$ アルキニル、 $C_{3 \sim 7}$ シクロアルキル、フェニル- $C_{1 \sim 4}$ アルキル-、及び(5～6員のヘテロアリール)- $C_{1 \sim 4}$ アルキル-から選択され； R^{4a} の前記 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{2 \sim 6}$ アルキニル、 $C_{3 \sim 7}$ シクロアルキル、フェニル- $C_{1 \sim 4}$ アルキル-、及び(5～6員のヘテロアリール)- $C_{1 \sim 4}$ アルキル-がそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

R^3 が、 H または $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり；

R^4 が、 H または $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり；

R^{5a} が、 H または $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり；

R^5 が、 H 、ハロ、または $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり；

R^6 が、ハロ、 CN 、または $C_{1 \sim 4}$ アルキルであり；

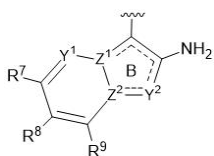
各 R^c が独立に、 H または $C_{1 \sim 6}$ アルキルであるか；または

任意の2個の R^c 置換基が、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または3個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている4員、5員、6員、または7員のヘテロシクロアルキル基を形成している、

請求項1もしくは2に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

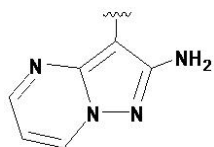
【請求項47】

【化10】



が、

【化11】



であり；

R^1 が、 $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり；

R^2 が、 $C_{1 \sim 6}$ アルコキシまたはフェニルであり、 R^2 の前記フェニルが、1、2、または3個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^j が、ハロ、 CN 、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、 $C_{1 \sim 4}$ アルコキシ、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルコキシ、アミノ、 $C_{1 \sim 4}$ アルキルアミノ、及びジ($C_{1 \sim 4}$ アルキル)アミノから独立に選択され；

R^{3a} が、 H 、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{2 \sim 6}$ アルキニル、 $C_{3 \sim 7}$ シクロアルキル、フェニル- $C_{1 \sim 4}$ アルキル-、(5～6員のヘテロアリール)- $C_{1 \sim 4}$ アルキル、及び(4～6員のヘテロシクロアルキル)- $C_{1 \sim 4}$ アルキルであり； R^{3a} の前記 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{3 \sim 7}$ シクロアルキル、フェニル- $C_{1 \sim 4}$ アルキル-、(5～6員のヘテロアリール)- $C_{1 \sim 4}$ アルキル、及び(4～6員のヘテロシクロアルキル)- $C_{1 \sim 4}$ アルキルがそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

R^{4a} が、 H 、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{2 \sim 6}$ アルキニル、 $C_{3 \sim 7}$ シクロアルキル、フェニル- $C_{1 \sim 4}$ アルキル-、及び(5～6員のヘテロアリール)- $C_{1 \sim 4}$ アルキル-

から選択され； R^{4a} の前記 C_{1-6} アルキル及び（5～6員のヘテロアリール）- C_{1-4} アルキル-がそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

R^3 が、Hまたは C_{1-6} アルキルであり；

R^4 が、Hまたは C_{1-6} アルキルであり；

R^{5a} が、Hまたは C_{1-6} アルキルであり；

R^5 が、H、ハロ、または C_{1-6} アルキルであり；

R^6 が、ハロ、CN、または C_{1-6} アルキルであり；

各 R^b が、 C_{1-4} アルキル、OH、 OR^c 、CN、及び NR^cR^c 、及び $C(O)N$
 R^cR^c から独立に選択され；

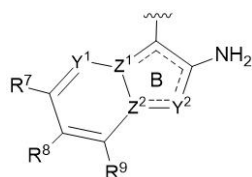
各 R^c が独立に、Hまたは C_{1-6} アルキルであるか；または

任意の2個の R^c 置換基が、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または3個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている4員、5員、6員、または7員のヘテロシクロアルキル基を形成している、

請求項1もしくは2に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

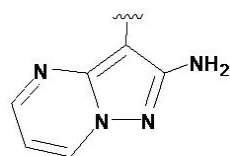
【請求項48】

【化12】



が、

【化13】



であり；

R^1 が、 C_{1-6} アルキルであり；

R^2 が、5～6員のヘテロシクロアルキルであり、 R^2 の前記5～6員のヘテロシクロアルキルが、1または2個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^j が独立に、 C_{1-4} アルキルであり；

R^{3a} が、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、フェニル- C_{1-4} アルキル-、（5～6員のヘテロアリール）- C_{1-4} アルキル、及び（4～6員のヘテロシクロアルキル）- C_{1-4} アルキルであり； R^{3a} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル、フェニル- C_{1-4} アルキル-、（5～6員のヘテロアリール）- C_{1-4} アルキル、及び（4～6員のヘテロシクロアルキル）- C_{1-4} アルキルがそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

R^{4a} が、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、フェニル- C_{1-4} アルキル-、及び（5～6員のヘテロアリール）- C_{1-4} アルキル-から選択され； R^{4a} の前記 C_{1-6} アルキル及び（5～6員のヘテロアリール）- C_{1-4} アルキル-がそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

R^3 が、Hまたは C_{1-6} アルキルであり；

R^4 が、Hまたは C_{1-6} アルキルであり；

R^{5a} が、Hまたは C_{1-6} アルキルであり；

R^5 が、H、ハロ、または C_{1-6} アルキルであり；

R^6 が、ハロ、CN、または C_{1-6} アルキルであり；

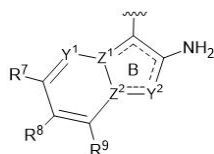
各 R^b が、 C_{1-4} アルキル、OH、 OR^c 、CN、及び NR^cR^c 、及び $C(O)NR^cR^c$ から独立に選択され；

各 R^c が独立に、H または C_{1-6} アルキルであるか；または
 任意の 2 個の R^c 置換基が、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 員、5 員、6 員、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成している、

請求項 1 もしくは 2 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

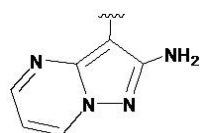
【請求項 49】

【化 14】



が、

【化 15】



であり；

R^1 が、 C_{1-6} アルキルであり；

R^2 が、 C_{1-6} アルコキシまたはフェニルであり、 R^2 の前記フェニルが、1、2、または 3 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^j が独立に、ハロであり；

R^{3a} が、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、フェニル- C_{1-4} アルキル-、(5~6 員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル、及び(4~6 員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキルであり； R^{3a} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル、フェニル- C_{1-4} アルキル-、(5~6 員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル、及び(4~6 員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキルがそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

R^{4a} が、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、フェニル- C_{1-4} アルキル-、及び(5~6 員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-から選択され； R^{4a} の前記 C_{1-6} アルキル及び(5~6 員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-がそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

R^3 が、H または C_{1-6} アルキルであり；

R^4 が、H または C_{1-6} アルキルであり；

R^{5a} が、H または C_{1-6} アルキルであり；

R^5 が、H、ハロ、または C_{1-6} アルキルであり；

R^6 が、ハロ、CN、または C_{1-6} アルキルであり；

各 R^b が、 C_{1-4} アルキル、OH、 OR^c 、CN、及び NR^cR^c 、及び $C(O)NR^cR^c$ から独立に選択され；

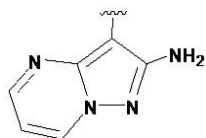
各 R^c が独立に、H または C_{1-6} アルキルであるか；または

任意の 2 個の R^c 置換基が、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 員、5 員、6 員、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成している、

請求項 1 もしくは 2 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 50】

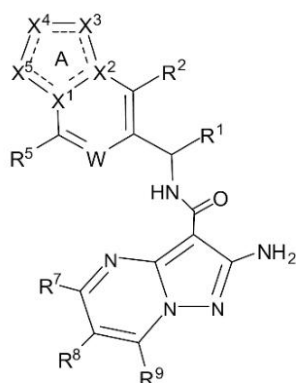
【化 1 7】



R⁶ が、クロロ、CN、またはメチルである、

【請求項 5 1】

【化 1 8】

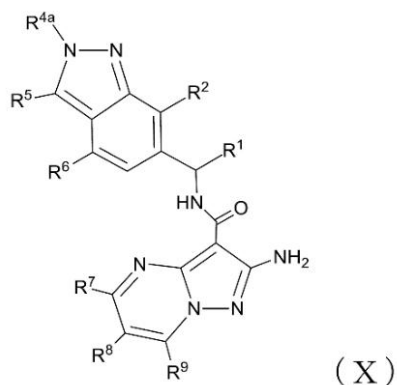


(I I)

【請求項 5 2】

式 (X) を有する、請求項 1 ~ 50 のいずれか 1 項に記載の化合物：

【化 19】



またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 53】

R^{4a} が、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、ベンジル、シアノメチル、2-メトキシエチル、2-ヒドロキシエチル、シクロブチル、シクロペンチル、2-アミノ-2-オキソエチル、N,N-ジメチル-2-アミノ-2-オキソエチル、(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)メチル、2-モルホリノエチル、2-モルホリノ-2-オキソエチルまたは2-アミノエチルである、請求項52に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 54】

R^2 が、ハロで任意選択で置換されているエトキシまたはフェニルである、請求項52または53に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 55】

R^1 が、メチルである、請求項52～54のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 56】

R^5 が、H、Brまたはメチルである、請求項52～55のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 57】

R^6 が、メチル、CNまたはClである、請求項52～56のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

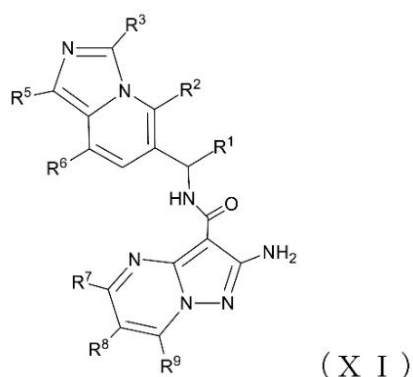
【請求項 58】

R^7 、 R^8 及び R^9 がそれぞれ、Hである、請求項52～57のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 59】

式(XI)を有する、請求項1～50のいずれか1項に記載の化合物：

【化 20】



またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 6 0】

R^{4a} が、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、ベンジル、シアノメチル、2 - メトキシエチル、2 - ヒドロキシエチル、シクロブチル、シクロペンチル、2 - アミノ - 2 - オキシエチル、N, N - ジメチル - 2 - アミノ - 2 - オキシエチル、(1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)メチル、2 - モルホリノエチル、2 - モルホリノ - 2 - オキシエチルまたは 2 - アミノエチルである、請求項 5 9 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 6 1】

R^2 が、エトキシ、 $C_1 \sim 4$ アルキル置換基で任意選択で置換されている 1, 1 - ジオキシシドチオモルホリノ、またはハロで任意選択で置換されているフェニルである、請求項 5 9 または 6 0 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 6 2】

R^2 が、エトキシ、またはハロで任意選択で置換されているフェニルである、請求項 5 9 または 6 0 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 6 3】

R^1 が、メチルである、請求項 5 9 ~ 6 2 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 6 4】

R^5 が、H、Br またはメチルである、請求項 5 9 ~ 6 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 6 5】

R^6 が、メチル、CN または Cl である、請求項 5 9 ~ 6 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 6 6】

R^7 が、H か、 $C_1 \sim 4$ アルキルもしくは $C_1 \sim 4$ アルコキシ ($C_1 \sim 4$ アルキル基が、OH によって置換されている) によって任意選択で置換されているピペリジン - 1 - イル、またはピリジン - 3 - イルである、請求項 5 9 ~ 6 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

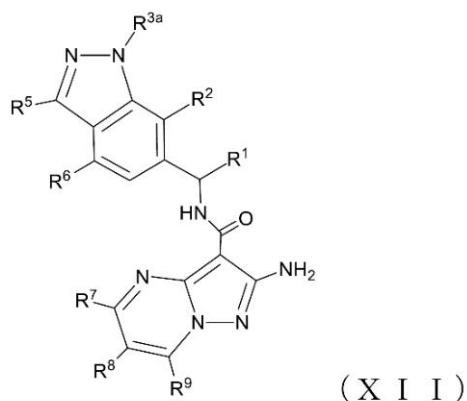
【請求項 6 7】

R^7 、 R^8 及び R^9 がそれぞれ、H である、請求項 5 9 ~ 6 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 6 8】

式 (XII) を有する、請求項 1 ~ 5 0 のいずれか 1 項に記載の化合物：

【化 2 1】



またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 6 9】

下記から選択される、請求項 1 または 2 に記載の化合物：

2 - アミノ - N - [1 - (4 - クロロ - 7 - エトキシ - 2 - メチル - 2 H - インダゾール - 6 - イル)エチル]ピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン - 3 - カルボキサミド；

2 - アミノ - N - (1 - (1 - (2 - アミノ - 2 - オキソエチル) - 4 - クロロ - 7 -
エトキシ - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン
- 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (2 - (ブタ - 2 - イニル) - 4 - クロロ - 7 - エトキシ - 2 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (1 - (ブタ - 2 - イン - 1 - イル) - 4 - クロロ - 7 - エトキシ - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 7 - フェニル - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 1 - メチル - 7 - フェニル - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 2 - メチル - 7 - フェニル - 2 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 1 - ((1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル) - 7 - フェニル - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 2 - ((1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル) - 7 - フェニル - 2 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 1 - (2 - モルホリノエチル) - 7 - フェニル - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 2 - (2 - モルホリノ - 2 - オキソエチル) - 7 - フェニル - 2 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (2 - (2 - アミノエチル) - 4 - クロロ - 7 - フェニル - 2 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (1 - (2 - アミノエチル) - 4 - クロロ - 7 - フェニル - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (3 - プロモ - 4 - クロロ - 7 - フェニル - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 3 - メチル - 7 - フェニル - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (3 , 4 - ジメチル - 7 - フェニル - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (3 - フルオロフェニル) - 3 - メチルイミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (8 - クロロ - 5 - フェニルイミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - クロロ - 5 - フェニルイミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [5 - (3 - フルオロフェニル) - 3 , 8 - ジメチルイミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - シアノ - 5 - フェニルイミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 70】

下記から選択される請求項 1 に記載の化合物：

2 - アミノ - N - (1 - [8 - クロロ - 5 - (2 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドチオモルホリン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド；

2 - アミノ - N - (1 - (8 - クロロ - 5 - (3 - シアノピロリジン - 1 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド；

2 - アミノ - N - (1 - (8 - クロロ - 5 - (3 - シアノ - 3 - メチルピロリジン - 1 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド；

2 - アミノ - N - (1 - (8 - クロロ - 5 - ((3 S , 4 S) - 3 , 4 - ジヒドロキシピロリジン - 1 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド；

2 - アミノ - N - (1 - (8 - クロロ - 5 - ((3 S , 4 S) - 3 - フルオロ - 4 - ヒドロキシピロリジン - 1 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド；

2 - アミノ - N - (1 - [8 - クロロ - 5 - (1 , 1 - ジオキシドチオモルホリン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド；

2 - アミノ - N - (1 - [8 - クロロ - 5 - (1 - オキシドチオモルホリン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド；

2 - アミノ - N - (1 - [8 - クロロ - 5 - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドチオモルホリン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド；

2 - アミノ - N - (1 - [8 - クロロ - 5 - (1 - イミノ - 1 - オキシドチオモルホリン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド；

2 - アミノ - N - (1 - [8 - クロロ - 5 - (2 , 2 - ジメチル - 1 , 1 - ジオキシドチオモルホリン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド；

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 7 - エトキシ - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) - 5 - (5 - メトキシピリジン - 3 - イル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド；

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 7 - エトキシ - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) - 5 - (5 - (ヒドロキシメチル) ピリジン - 3 - イル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド；

2 - アミノ - N - (1 - (3 , 4 - ジクロロ - 7 - エトキシ - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) - 5 - (5 - メトキシピリジン - 3 - イル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド；

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 7 - エトキシ - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) - 5 - (ピペリジン - 1 - イル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド；

2 - アミノ - 6 - クロロ - N - (1 - (4 - クロロ - 7 - エトキシ - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) イミダゾ [1 , 2 - b] ピリダジン - 3 - カルボキサミド；

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 7 - エトキシ - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) - 6 - メチルイミダゾ [1 , 2 - b] ピリダジン - 3 - カルボキサミド；

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 7 - エトキシ - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) - 6 - (ピペリジン - 1 - イル) イミダゾ [1 , 2 - b] ピリダジン - 3 - カルボキサミド；

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 7 - エトキシ - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) - 6 - (5 - (ヒドロキシメチル) ピリジン - 3 - イル) イミダゾ [1 , 2 - b] ピリダジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (3 , 4 - ジクロロ - 7 - エトキシ - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) - 6 - (5 - (ヒドロキシメチル) ピリジン - 3 - イル) イミダゾ [1 , 2 - b] ピリダジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (4 - クロロ - 7 - エトキシ - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル] - 5 - ピリジン - 3 - イルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 3 - エチル - 7 - フェニル - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (3 - ブロモ - 4 - クロロ - 7 - エトキシ - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (3 - ブロモ - 4 - クロロ - 7 - エトキシ - 2 - (2 - ヒドロキシエチル) - 2 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (3 - ブロモ - 4 - クロロ - 7 - エトキシ - 1 - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 3 - シアノ - 7 - フェニル - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 7 - (4 - シアノピペリジン - 1 - イル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

(S) - 2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 7 - (1 , 1 - ジオキシドチオモルホリノ) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

(S) - 2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 7 - (1 , 1 - ジオキシドチオモルホリノ) - 3 - フルオロピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 7 - (ピリジン - 3 - イル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 3 - シアノ - 7 - (1 , 1 - ジオキシドチオモルホリノ) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 3 - シアノ - 7 - ((S) - 3 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (8 - クロロ - 5 - シクロペンチルイミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 7 - フェニル - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [7 - (3 - アミノプロボキシ) - 4 - クロロ - 1 H - インダゾール - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (4 , 4 - ジフルオロピペリジン - 1 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (4 - フルオロピペリジン - 1 - イル) イ

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (2 - オキソ - 3 - オキサ - 1 , 8 - ジアザスピロ [4 . 5] デカ - 8 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (2 - オキソ - 1 - オキサ - 3 , 8 - ジアザスピロ [4 . 5] デカ - 8 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 7 - (2 - メトキシエトキシ) - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 7 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 7 - (ジフルオロメトキシ) - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 7 - (2 - ヒドロキシエトキシ) - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 7 - (2 , 3 - ジヒドロキシプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (4 - クロロ - 3 - シアノ - 7 - エトキシ - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (8 - クロロ - 5 - (4 - ヒドロキシ - 4 - メチルピペリジン - 1 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (8 - クロロ - 5 - (4 - シアノ - 4 - メチルピペリジン - 1 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (8 - クロロ - 5 - (4 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) ピペリジン - 1 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [4 - クロロ - 7 - (3 - ヒドロキシピロリジン - 1 - イル) - 2 H - インダゾール - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [4 - クロロ - 7 - (3 - メトキシピロリジン - 1 - イル) - 2 H - インダゾール - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (4 - クロロ - 7 - { 3 - [(メチルアミノ) スルホニル] ピロリジン - 1 - イル } - 2 H - インダゾール - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (4 - クロロ - 7 - { 4 - [(ジメチルアミノ) スルホニル] ピペリジン - 1 - イル } - 2 H - インダゾール - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [4 - クロロ - 7 - (1 , 1 - ジオキシドチオモルホリン - 4 - イル) - 2 H - インダゾール - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

N - (1 - { 7 - [(3 S) - 3 - (アセチルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] - 4 - クロロ - 2 H - インダゾール - 6 - イル } エチル) - 2 - アミノピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (4 - クロロ - 7 - { (3 S) - 3 - [(メチルスルホニル) アミノ] ピロリジン - 1 - イル } - 2 H - インダゾール - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (4 - クロロ - 7 - { (3 R) - 3 - [(メチルスルホニル) アミノ] ピロリジン - 1 - イル } - 2 H - インダゾール - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

エチル 4 - [6 - (1 - { [(2 - アミノピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) カルボニル] アミノ } エチル) - 4 - クロロ - 2 H - インダゾール - 7 - イル] シクロヘキサ - 3 - エン - 1 - カルボキシラート ;

ベンジル 4 - [6 - (1 - { [(2 - アミノピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) カルボニル] アミノ } エチル) - 4 - クロロ - 2 H - インダゾール - 7 - イル] - 3 , 6 - ジヒドロピリジン - 1 (2 H) - カルボキシラート ;

2 - アミノ - N - { 1 - [4 - クロロ - 7 - (1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロピリジン - 4 - イル) - 2 H - インダゾール - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [4 - クロロ - 7 - (4 - メトキシシクロヘキサ - 1 - エン - 1 - イル) - 2 H - インダゾール - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [4 - クロロ - 7 - (4 - シアノシクロヘキサ - 1 - エン - 1 - イル) - 2 H - インダゾール - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

メチル 1 - [6 - (1 - { [(2 - アミノピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) カルボニル] アミノ } エチル) - 4 - クロロ - 2 H - インダゾール - 7 - イル] ピロリジン - 3 - カルボキシラート ;

2 - アミノ - N - [1 - (4 - クロロ - 7 - { 3 - [(メチルアミノ) カルボニル] ピロリジン - 1 - イル } - 2 H - インダゾール - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

N - (1 - (7 - ((S) - 3 - アセトアミドピペリジン - 1 - イル) - 4 - クロロ - 1 H - インダゾール - 6 - イル) エチル) - 2 - アミノピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (4 - クロロ - 7 - { (3 S) - 3 - [(メチルスルホニル) アミノ] ピペリジン - 1 - イル } - 2 H - インダゾール - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

エチル 1 - [6 - (1 - { [(2 - アミノピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) カルボニル] アミノ } エチル) - 4 - クロロ - 2 H - インダゾール - 7 - イル] ピペリジン - 4 - カルボキシラート ;

2 - アミノ - N - [1 - (4 - クロロ - 7 - { 4 - [(メチルアミノ) カルボニル] ピペリジン - 1 - イル } - 2 H - インダゾール - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (4 - クロロ - 7 - { 4 - [(ジメチルアミノ) カルボニル] ピペリジン - 1 - イル } - 2 H - インダゾール - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [4 - クロロ - 7 - (1 , 1 - ジオキシド - 1 , 4 - チアゼパン - 4 - イル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [4 - クロロ - 7 - (1 , 1 - ジオキシド - 1 , 2 , 5 - チアジアゼパン - 5 - イル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [4 - クロロ - 7 - (2 , 2 - ジメチル - 1 , 1 - ジオキシドチオモルホリン - 4 - イル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [3 , 4 - ジクロロ - 7 - (2 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドチオモルホリン - 4 - イル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [3 , 4 - ジクロロ - 7 - (1 , 1 - ジオキシドチオモルホリン - 4 - イル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5

- a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [3 , 4 - ジクロロ - 7 - (1 , 1 - ジオキシド - 1 , 4 - チアゼパン - 4 - イル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [3 , 4 - ジクロロ - 7 - (1 , 1 - ジオキシド - 1 , 2 , 5 - チアジアゼパン - 5 - イル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [3 , 4 - ジクロロ - 7 - (2 , 2 - ジメチル - 1 , 1 - ジオキシドチオモルホリン - 4 - イル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - シクロプロピル - 5 - フェニルイミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 3 - メチル - 5 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 3 - メチル - 5 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - クロロ - 3 - メチル - 5 - ピリジン - 3 - イルイミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - クロロ - 3 - メチル - 5 - フェニルイミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [1 , 8 - ジクロロ - 3 - メチル - 5 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 1 - フルオロ - 3 - メチル - 5 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 3 - メチル - 5 - フェニル - 1 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - クロロ - 1 - シアノ - 3 - メチル - 5 - フェニルイミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - クロロ - 1 - エチニル - 3 - メチル - 5 - フェニルイミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - クロロ - 5 - ピリジン - 3 - イルイミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - クロロ - 1 - シアノ - 5 - ピリジン - 3 - イルイミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - クロロ - 1 - メチル - 5 - ピリジン - 3 - イルイミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (1 H - ピラゾール - 3 - イル) イミダゾ

[1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル } エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - { 8 - クロロ - 5 - [5 - (メチルスルホニル) ピリジン - 3 - イル] イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル } エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - クロロ - 5 - { 6 - [(メチルアミノ) カルボニル] ピリジン - 3 - イル } イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - クロロ - 5 - ピリジン - 2 - イルイミダゾ [1 , 5 - a]) ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (5 - メトキシピリジン - 3 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - クロロ - 5 - { 4 - [(メチルアミノ) スルホニル] フェニル } イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - { 8 - クロロ - 5 - [4 - (メチルスルホニル) フェニル] イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル } エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (5 - シアノピリジン - 3 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - クロロ - 5 - ピラジン - 2 - イルイミダゾ [1 , 5 - a]) ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - { 8 - クロロ - 5 - [4 - (メチルスルホニル) ピペラジン - 1 - イル] イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル } エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - クロロ - 5 - ピロリジン - 1 - イルイミダゾ [1 , 5 - a]) ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (4 - メトキシピペリジン - 1 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (3 - メトキシピロリジン - 1 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - クロロ - 5 - モルホリン - 4 - イルイミダゾ [1 , 5 - a]) ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [5 - (4 - プロモピペリジン - 1 - イル) - 8 - クロロイミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (3 - ヒドロキシピロリジン - 1 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (1 , 1 - ジオキシド - 1 , 2 , 5 - チアジアゼパン - 5 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - { 8 - クロロ - 5 - [(3 S , 5 S) - 3 , 5 - ジヒドロキシピペリジン - 1 - イル] イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル } エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (1 , 1 - ジオキシド - 1 , 4 - チアゼパン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - { 8 - クロロ - 5 - [(3 S) - 3 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル] イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル } エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (4 - シアノピペリジン - 1 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (4 - メチル - 3 - オキソペペラジン - 1 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - { 8 - クロロ - 5 - [(3 R , 5 R) - 3 , 5 - ジヒドロキシピペリジン - 1 - イル] イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル } エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - { 8 - クロロ - 5 - [(3 R , 5 S) - 3 , 5 - ジヒドロキシピペリジン - 1 - イル] イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル } エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - { 8 - クロロ - 5 - [(3 R , 5 R) - 3 - フルオロ - 5 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル] イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル } エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - { 8 - クロロ - 5 - [(3 S , 5 R) - 3 - シアノ - 5 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル] イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル } エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (8 - クロロ - 5 - (1 , 1 - ジオキシド - 1 , 4 - チアゼパン - 4 - イル) - 3 - メチルイミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (1 , 1 - ジオキシド - 1 , 2 , 5 - チアジアゼパン - 5 - イル) - 1 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { (1 S) - 1 - [1 , 8 - ジクロロ - 5 - (1 , 1 - ジオキシド - 1 , 2 , 5 - チアジアゼパン - 5 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { (1 S) - 1 - [1 , 8 - ジクロロ - 5 - (5 - オキソ - 1 , 4 - ジアゼパン - 1 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [1 , 8 - ジクロロ - 5 - (1 , 1 - ジオキシドチオモルホリン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル } ピラゾロ [1 , 5

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (1 , 1 - ジオキシドチオモルホリン - 4

- イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - { 1 - [8 - クロロ - 5 - (1 , 1 - ジオキシドチオモルホリン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] - 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル } ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - (1 - (8 - クロロ - 5 - (1 , 1 - ジオキシドチオモルホリノ) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) - 2 - メチルプロピル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - ((8 - クロロ - 5 - (1 , 1 - ジオキシドチオモルホリノ) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) (シクロプロピル) メチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - クロロ - 5 - シクロヘキシルイミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - クロロ - 3 - メチル - 5 - フェニル [1 , 2 , 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - N - [1 - (8 - クロロ - 5 - フェニル [1 , 2 , 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;

またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 7 1】

R^1 が結合している炭素原子が、(R) - 立体配置にある、請求項 1 ~ 7 0 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 7 2】

R^1 が結合している炭素原子が、(S) - 立体配置にある、請求項 1 ~ 7 0 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 7 3】

2 - アミノ - N - (1 - [8 - クロロ - 5 - (2 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドチオモルホリン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル] エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミドである、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 7 4】

2 - アミノ - N - ((1 S) - 1 - (8 - クロロ - 5 - (2 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドチオモルホリノ) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミドである、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 7 5】

2 - アミノ - N - ((S) - 1 - (8 - クロロ - 5 - ((R) - 2 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドチオモルホリノ) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミドである、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 7 6】

2 - アミノ - N - ((S) - 1 - (8 - クロロ - 5 - ((S) - 2 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドチオモルホリノ) イミダゾ [1 , 5 - a] ピリジン - 6 - イル) エチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキサミドである、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 7 7】

請求項 1 ~ 7 6 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、及び薬学的に許容される担体を含む、医薬組成物。

【請求項 7 8】

P I 3 K キナーゼを請求項 1 ~ 7 6 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩と接触させることを含む、インビトロで P I 3 K キナーゼを阻害する方法。

【請求項 7 9】

前記化合物、またはその薬学的に許容される塩が、P I 3 K 、P I 3 K 、及び P I 3 K キナーゼの 1 つまたは複数よりも、P I 3 K キナーゼを選択的に阻害する、請求項 7 8 に記載の方法。

【請求項 8 0】

P I 3 K キナーゼの異常な発現または活性と関連する疾患または障害を処置するための医薬であって、請求項 1 ~ 7 6 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩を含む、前記医薬。

【請求項 8 1】

前記疾患または障害が、自己免疫疾患もしくは障害、がん、心臓血管疾患、または神経変性疾患である、請求項 8 0 に記載の医薬。

【請求項 8 2】

疾患または障害が、肺癌、黒色腫、膵臓癌、乳癌、前立腺癌、肝臓癌、大腸癌、子宮内膜癌、膀胱癌、皮膚癌、子宮癌、腎臓癌、胃癌、または肉腫である、請求項 8 0 に記載の医薬。

【請求項 8 3】

前記肉腫が、アスキン腫瘍、ブドウ状肉腫、軟骨肉腫、ユーイング肉腫、悪性血管内皮腫、悪性神経鞘腫、骨肉腫、胞状軟部肉腫、血管肉腫、葉状嚢胞肉腫、隆起性皮膚線維肉腫、デスモイド腫瘍、線維形成性小円形細胞腫瘍、類上皮肉腫、骨外性軟骨肉腫、骨外性骨肉腫、線維肉腫、消化管間質腫瘍 (G I S T)、血管外皮細胞種、血管肉腫、カボジ肉腫、平滑筋肉腫、脂肪肉腫、リンパ管肉腫、リンパ肉腫、悪性末梢神経鞘腫瘍 (M P N S T)、神経線維肉腫、横紋筋肉腫、滑膜肉腫、または未分化多形肉腫である、請求項 8 2 に記載の医薬。

【請求項 8 4】

前記疾患または障害が、急性骨髄性白血病、急性単球性白血病、小リンパ球性リンパ腫、慢性リンパ球性白血病 (C L L)、慢性骨髄性白血病 (C M L)、多発性骨髄腫、T細胞急性リンパ芽急性白血病 (T - A L L)、皮膚T細胞リンパ腫、大顆粒リンパ球性白血病、成熟 (末梢) t細胞新生物 (P T C L)、未分化大細胞リンパ腫 (A L C L)、またはリンパ芽球性リンパ腫である、請求項 8 0 に記載の医薬。

【請求項 8 5】

前記成熟 (末梢) t細胞新生物 (P T C L) が、T細胞前リンパ球性白血病、T細胞顆粒リンパ球性白血病、アグレッシブNK細胞白血病、菌状息肉症 / セザリー症候群、未分化大細胞型リンパ腫 (T細胞種)、エンテロパシー型T細胞リンパ腫、成人T細胞白血病 / リンパ腫、または血管免疫芽細胞性T細胞リンパ腫である、請求項 8 4 に記載の医薬。

【請求項 8 6】

前記未分化大細胞リンパ腫 (A L C L) が、全身 A L C L または原発性皮膚 A L C L である、請求項 8 4 に記載の医薬。

【請求項 8 7】

前記疾患または障害が、パーキットリンパ腫、急性骨髄芽球性白血病、慢性骨髄性白血病、非ホジキンリンパ腫、ホジキンリンパ腫、ヘアリーセル白血病、マントル細胞リンパ腫、小リンパ球性リンパ腫、濾胞性リンパ腫、リンパ形質細胞性リンパ腫、節外周辺帯リンパ腫、ワルデンストレーママクログロブリン血症、前リンパ球性白血病、急性リンパ芽球性白血病、骨髄線維症、粘膜関連リンパ組織 (M A L T) リンパ腫、縦隔 (胸腺) 大細胞型B細胞リンパ腫、リンパ腫様肉芽腫症、脾臓辺縁帯リンパ腫、原発性体液性リンパ腫、血管内大細胞型B細胞リンパ腫、形質細胞性白血病、髄外形質細胞腫、くすぶり型骨髄腫 (無症候性骨髄腫としても公知)、意義不明の単クローン性ガンマグロブリン血症 (M G U S)、またはびまん性大細胞型B細胞リンパ腫である、請求項 8 0 に記載の医薬。

【請求項 8 8】

非ホジキンリンパ腫（NHL）が、再発NHL、難治性NHL、再発性濾胞性NHL、不活性NHL（iNHL）、またはアグレッシブNHL（aNHL）である、請求項8 7に記載の医薬。

【請求項 8 9】

前記びまん性大細胞型B細胞性リンパ腫が、活性化B細胞様（ABC）びまん性大細胞型B細胞性リンパ腫、または胚中心B細胞型（GCB）びまん性大細胞型B細胞性リンパ腫である、請求項8 7に記載の医薬。

【請求項 9 0】

前記バーキットリンパ腫が、風土病型バーキットリンパ腫、散発性バーキットリンパ腫、またはバーキット様リンパ腫である、請求項8 7に記載の医薬。

【請求項 9 1】

前記疾患または障害が、関節リウマチ、多発性硬化症、全身性エリテマトーデス、喘息、アレルギー、膵臓炎、乾癬、アナフィラキシー、糸球体腎炎、炎症性腸疾患（例えば、クローン病及び潰瘍性大腸炎）、血栓症、髄膜炎、脳炎、糖尿病性網膜症、良性前立腺肥大、重症筋無力症、シェーグレン症候群、変形性関節症、再狭窄、またはアテローム硬化症である、請求項8 0に記載の医薬。

【請求項 9 2】

前記疾患または障害が、心肥大、心筋細胞機能障害、慢性閉塞性肺疾患（COPD）、高血圧、虚血、虚血 - 再灌流、血管狭窄、貧血（例えば、溶血性貧血、再生不良性貧血、または真性赤血球性貧血）、細菌感染症、ウイルス感染症、移植片拒絶、腎疾患、アナフィラキシーショック線維症、骨格筋萎縮、骨格筋肥大、血管新生、敗血症、移植片拒絶、糸球体硬化症、進行性腎線維症、特発性血小板減少性紫斑病（ITP）、自己免疫性溶血性貧血、血管炎、全身性エリテマトーデス、ループス腎炎、天疱瘡、または膜性腎症である、請求項8 0に記載の医薬。

【請求項 9 3】

前記特発性血小板減少性紫斑病（ITP）が、再発ITPまたは難治性ITPである、請求項9 2に記載の医薬。

【請求項 9 4】

前記血管炎が、ベーチェット病、コーガン症候群、巨細胞性動脈炎、リウマチ性多発性筋痛（PMR）、高安動脈炎、バージャー病（閉塞性血栓性血管炎）、中枢神経系血管炎、川崎病、結節性多発性動脈炎、チャージ - ストラウス症候群、混合型クリオグロブリン血症血管炎（本態性またはC型肝炎ウイルス（HCV）誘発性）、ヘノッホ - シェーンライン紫斑病（HSP）、過敏症血管炎、顕微鏡的多発血管炎、ウェゲナー肉芽腫症、または抗好中球細胞質抗体関連（ANCA）全身性血管炎（AASV）である、請求項9 2に記載の医薬。

【請求項 9 5】

前記疾患または障害が、アルツハイマー病、中枢神経系外傷、または卒中である、請求項8 0に記載の医薬。

【請求項 9 6】

JAK1の阻害薬、JAK2の阻害薬、JAK1/JAK2の阻害薬、またはPI3Kの阻害薬と組み合わせて投与される、請求項80～95のいずれか1項に記載の医薬。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0018

【補正方法】変更

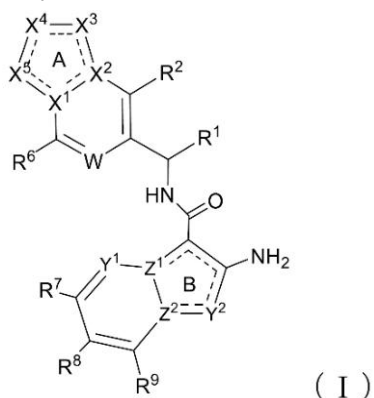
【補正の内容】

【0018】

化合物

本出願は特に、式Iの化合物：

【化 2】



またはその薬学的に許容される塩を提供する：

[式中、

X^1 及び X^2 はそれぞれ独立に、C または N であるが、ただし、 X^1 及び X^2 が同時に N であることはなく；

X^3 は、N、 NR^{3a} 、または CR^3 であり；

X^4 は、N、 NR^{4a} 、または CR^4 であり；

X^5 は、N、 NR^{5a} 、または CR^5 であり；

W は、CH または N であり；

Y^1 は、N または CR^{10} であり；

Y^2 は、N または CR^{11} であり；

Z^1 及び Z^2 の一方は、N であり、 Z^1 及び Z^2 の他方は、C であり；

【化 3】

は、環 A 及び環 B が芳香族であることを維持する単結合または二重結合であり；

R^1 は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルまたは 4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキルであり、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、及び 4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2 または 3 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されており；

R^2 は、 OR^{13} 、 C_{3-6} シクロアルキル、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、または 5 ~ 10 員のヘテロアリールであり、 R^2 の C_{3-6} シクロアルキル、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び 5 ~ 10 員のヘテロアリールはそれぞれ、1、2、3、4、または 5 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されており；

R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 はそれぞれ、H、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル -、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル -、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル -、CN、 NO_2 、 OR^a 、 SR^a 、 $NHOR^a$ 、 $C(O)R^a$ 、 $C(O)NR^aR^a$ 、 $C(O)OR^a$ 、 $OC(O)R^a$ 、 $OC(O)NR^aR^a$ 、 NHR^a 、 NR^aR^a 、 $NR^aC(O)R^a$ 、 $NR^aC(O)OR^a$ 、 $NR^aC(O)NR^aR^a$ 、 $C(=NR^a)R^a$ 、 $C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $NR^aC(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $NR^aS(O)R^a$ 、 $NR^aS(O)_2R^a$ 、 $NR^aS(O)_2NR^aR^a$ 、 $S(O)R^a$ 、 $S(O)NR^aR^a$ 、 $S(O)_2R^a$ 、及び $S(O)_2NR^aR^a$ から独立に選択され、 R^3 、 R^4 、 R^5 、及び R^6 の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10}

R^0 アリール - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、($5 \sim 10$ 員のヘテロアリール) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、及び($4 \sim 10$ 員のヘテロシクロアルキル) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基で任意選択で置換されており；

R^{3a} 、 R^{4a} 、及び R^{5a} はそれぞれ、H、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{2 \sim 6}$ アルケニル、 $C_{2 \sim 6}$ アルキニル、 $C_{1 \sim 6}$ ハロアルキル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル、 $5 \sim 10$ 員のヘテロアリール、 $4 \sim 10$ 員のヘテロシクロアルキル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、($5 \sim 10$ 員のヘテロアリール) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、($4 \sim 10$ 員のヘテロシクロアルキル) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、 $C(O)R^a$ 、 $C(O)NR^aR^a$ 、 $C(O)OR^a$ 、 $C(=NR^a)R^a$ 、 $C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $S(O)R^a$ 、 $S(O)NR^aR^a$ 、 $S(O)_2R^a$ 、及び $S(O)_2NR^aR^a$ から独立に選択され、 R^{3a} 、 R^{4a} 、及び R^{5a} の $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{2 \sim 6}$ アルケニル、 $C_{2 \sim 6}$ アルキニル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル、 $5 \sim 10$ 員のヘテロアリール、 $4 \sim 10$ 員のヘテロシクロアルキル、 $C_{6 \sim 10}$ アリール - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、 $C_{3 \sim 10}$ シクロアルキル - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、($5 \sim 10$ 員のヘテロアリール) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル -、及び($4 \sim 10$ 員のヘテロシクロアルキル) - $C_{1 \sim 4}$ アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基で任意選択で置換されており；

R^7 は、H、ハロ、CN、-OH、- $C(O)O(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $C(O)NH_2$ 、- $C(O)NH(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $C(O)N(C_{1 \sim 4}$ アルキル) $_2$ 、($C_{1 \sim 4}$ アルキル) $C(O)NH$ -、($C_{1 \sim 4}$ アルキル) $C(O)$ -、 $C_{1 \sim 4}$ アルキルチオ、- $NH(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $N(C_{1 \sim 4}$ アルキル) $_2$ 、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、 $C_{1 \sim 4}$ アルコキシ、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルコキシ、- $SO_2(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $SO_2NH(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $SO_2N(C_{1 \sim 4}$ アルキル) $_2$ 、($C_{1 \sim 4}$ アルキル) SO_2NH -、 $4 \sim 10$ 員のヘテロシクロアルキル、及び $5 \sim 10$ 員のヘテロアリールから選択され、 R^7 の - $C(O)O(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $C(O)NH(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $C(O)N(C_{1 \sim 4}$ アルキル) $_2$ 、($C_{1 \sim 4}$ アルキル) $C(O)NH$ -、($C_{1 \sim 4}$ アルキル) $C(O)$ -、 $C_{1 \sim 4}$ アルキルチオ、- $NH(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $N(C_{1 \sim 4}$ アルキル) $_2$ 、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、 $C_{1 \sim 4}$ アルコキシ、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルコキシ、- $SO_2(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $SO_2NH(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $SO_2N(C_{1 \sim 4}$ アルキル) $_2$ 、($C_{1 \sim 4}$ アルキル) SO_2NH -、 $4 \sim 10$ 員のヘテロシクロアルキル、及び $5 \sim 10$ 員のヘテロアリール基はそれぞれ、1または2個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されており；

R^8 、 R^9 、 R^{10} 及び R^{11} はそれぞれ独立に、H、ハロ、CN、-OH、- $C(O)O(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $C(O)NH_2$ 、- $C(O)NH(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $C(O)N(C_{1 \sim 4}$ アルキル) $_2$ 、($C_{1 \sim 4}$ アルキル) $C(O)NH$ -、($C_{1 \sim 4}$ アルキル) $C(O)$ -、 $C_{1 \sim 4}$ アルキルチオ、- $NH(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $N(C_{1 \sim 4}$ アルキル) $_2$ 、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、 $C_{1 \sim 4}$ アルコキシ、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルコキシ、- $SO_2(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $SO_2NH(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $SO_2N(C_{1 \sim 4}$ アルキル) $_2$ 、及び($C_{1 \sim 4}$ アルキル) SO_2NH -であり、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 及び R^{11} の - $C(O)O(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $C(O)NH(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $C(O)N(C_{1 \sim 4}$ アルキル) $_2$ 、($C_{1 \sim 4}$ アルキル) $C(O)NH$ -、($C_{1 \sim 4}$ アルキル) $C(O)$ -、 $C_{1 \sim 4}$ アルキルチオ、- $NH(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $N(C_{1 \sim 4}$ アルキル) $_2$ 、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、 $C_{1 \sim 4}$ アルコキシ、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、 $C_{1 \sim 4}$ ハロアルコキシ、- $SO_2(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $SO_2NH(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、- $SO_2N(C_{1 \sim 4}$ アルキル) $_2$ 及び($C_{1 \sim 4}$ アルキル) SO_2NH -基はそれぞれ、1または2個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^{12} は、独立に選択される $C_{1 \sim 6}$ アルキル基であり；

R^{13} は、H か、または 1、2 もしくは 3 個の独立に選択される R^a 置換基で任意選択で置換されている C_{1-6} アルキルであり；

各 R^a は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10 員のヘテロアリール、4～10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10 員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、及び(4～10 員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-から独立に選択され、 R^a の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10 員のヘテロアリール、4～10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10 員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル- 及び(4～10 員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル- はそれぞれ、1、2、3、4、または 5 個の独立に選択される R^d 置換基で任意選択で置換されているか；または

任意の 2 個の R^a 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2 または 3 個の R^h 置換基で任意選択で置換されている 4-、5-、6-、7-、8-、9- または 10 員のヘテロシクロアルキル基を形成しており；

各 R^b は、ハロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} ハロアルコキシ、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10 員のヘテロアリール、4～10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10 員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、(4～10 員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-、 CN 、 OH 、 NH_2 、 NO_2 、 $NHOR^c$ 、 OR^c 、 SR^c 、 $C(O)R^c$ 、 $C(O)NR^cR^c$ 、 $C(O)OR^c$ 、 $OC(O)R^c$ 、 $OC(O)NR^cR^c$ 、 $C(=NR^c)NR^cR^c$ 、 $NR^cC(=NR^c)NR^cR^c$ 、 NHR^c 、 NR^cR^c 、 $NR^cC(O)R^c$ 、 $NR^cC(O)OR^c$ 、 $NR^cC(O)NR^cR^c$ 、 $NR^cS(O)R^c$ 、 $NR^cS(O)_2R^c$ 、 $NR^cS(O)_2NR^cR^c$ 、 $S(O)R^c$ 、 $S(O)NR^cR^c$ 、 $S(O)_2R^c$ 及び $S(O)_2NR^cR^c$ から独立に選択され； R^b の C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} ハロアルコキシ、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10 員のヘテロアリール、4～10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10 員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル- 及び(4～10 員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル- はそれぞれさらに、1、2、または 3 個の独立に選択される R^d 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^c は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10 員のヘテロアリール、4～10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10 員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、及び(4～10 員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-から独立に選択され、 R^c の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10 員のヘテロアリール、4～10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10 員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル- 及び(4～10 員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル- はそれぞれ、1、2、3、4、または 5 個の独立に選択される R^f 置換基で任意選択で置換されているか；または

任意の 2 個の R^c 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4-、5-、6-、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成しており；

各 R^d は、ハロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{3-10} シクロアルキル

ル、4～10員のヘテロシクロアルキル、 CN 、 NH_2 、 NHOR^e 、 OR^e 、 SR^e 、 C(O)R^e 、 $\text{C(O)NR}^e\text{R}^e$ 、 C(O)OR^e 、 OC(O)R^e 、 $\text{OC(O)NR}^e\text{R}^e$ 、 NHR^e 、 NR^eR^e 、 $\text{NR}^e\text{C(O)R}^e$ 、 $\text{NR}^e\text{C(O)NR}^e\text{R}^e$ 、 $\text{NR}^e\text{C(O)OR}^e$ 、 $\text{C(=NR}^e)\text{NR}^e\text{R}^e$ 、 $\text{NR}^e\text{C(=NR}^e)\text{NR}^e\text{R}^e$ 、 S(O)R^e 、 $\text{S(O)NR}^e\text{R}^e$ 、 $\text{S(O)}_2\text{R}^e$ 、 $\text{NR}^e\text{S(O)}_2\text{R}^e$ 、 $\text{NR}^e\text{S(O)}_2\text{NR}^e\text{R}^e$ 、及び $\text{S(O)}_2\text{NR}^e\text{R}^e$ から独立に選択され、 R^d の C_{1-4} アルキル、 C_{3-10} シクロアルキル及び4～10員のヘテロシクロアルキルはそれぞれさらに、1、2、または3個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^f は、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、及び(4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-、ハロ、 CN 、 NHOR^g 、 OR^g 、 SR^g 、 C(O)R^g 、 $\text{C(O)NR}^g\text{R}^g$ 、 C(O)OR^g 、 OC(O)R^g 、 $\text{OC(O)NR}^g\text{R}^g$ 、 NHR^g 、 NR^gR^g 、 $\text{NR}^g\text{C(O)R}^g$ 、 $\text{NR}^g\text{C(O)NR}^g\text{R}^g$ 、 $\text{NR}^g\text{C(O)OR}^g$ 、 $\text{C(=NR}^g)\text{NR}^g\text{R}^g$ 、 $\text{NR}^g\text{C(=NR}^g)\text{NR}^g\text{R}^g$ 、 S(O)R^g 、 $\text{S(O)NR}^g\text{R}^g$ 、 $\text{S(O)}_2\text{R}^g$ 、 $\text{NR}^g\text{S(O)}_2\text{R}^g$ 、 $\text{NR}^g\text{S(O)}_2\text{NR}^g\text{R}^g$ 、及び $\text{S(O)}_2\text{NR}^g\text{R}^g$ から独立に選択され； R^f の C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、及び(4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、または5個の独立に選択される R^n 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^g は、 H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、及び(4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-から独立に選択され、 R^g の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-及び(4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-はそれぞれ、1、2、または3個の独立に選択される R^p 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^h は、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-10} シクロアルキル、4～7員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、5～6員のヘテロアリール、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～6員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、(4～7員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、ハロ、 CN 、 OR^i 、 SR^i 、 NHOR^i 、 C(O)R^i 、 $\text{C(O)NR}^i\text{R}^i$ 、 C(O)OR^i 、 OC(O)R^i 、 $\text{OC(O)NR}^i\text{R}^i$ 、 NHR^i 、 NR^iR^i 、 $\text{NR}^i\text{C(O)R}^i$ 、 $\text{NR}^i\text{C(O)NR}^i\text{R}^i$ 、 $\text{NR}^i\text{C(O)OR}^i$ 、 $\text{C(=NR}^i)\text{NR}^i\text{R}^i$ 、 $\text{NR}^i\text{C(=NR}^i)\text{NR}^i\text{R}^i$ 、 S(O)R^i 、 $\text{S(O)NR}^i\text{R}^i$ 、 $\text{S(O)}_2\text{R}^i$ 、 $\text{NR}^i\text{S(O)}_2\text{R}^i$ 、 $\text{NR}^i\text{S(O)}_2\text{NR}^i\text{R}^i$ 、及び $\text{S(O)}_2\text{NR}^i\text{R}^i$ から選択され、 R^h の C_{1-6} アルキル、 C_{3-10} シクロアルキル、4～7員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、5～6員のヘテロアリール、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～6員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、(4～7員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-はそれぞれさらに、1、2、または3個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換

されているか；または

4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキルの同じ炭素原子に結合している 2 個の R^h 基は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、または環員として O、N もしくは S から選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 6 員のヘテロシクロアルキルを形成しており；

各 R^j 置換基は、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール、5 または 6 員のヘテロアリール、 $C_2 \sim 4$ アルケニル、 $C_2 \sim 4$ アルキニル、ハロ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 CN 、 $NHOR^k$ 、 OR^k 、 SR^k 、 $C(O)R^k$ 、 $C(O)NR^k$ 、 R^k 、 $C(O)OR^k$ 、 $OC(O)R^k$ 、 $OC(O)NR^k$ 、 NHR^k 、 NR^k 、 $NR^kC(O)R^k$ 、 $NR^kC(O)NR^k$ 、 $NR^kC(O)OR^k$ 、 $C(=NR^k)NR^k$ 、 $NR^kC(=NR^k)NR^k$ 、 $S(O)R^k$ 、 $S(O)NR^k$ 、 $S(O)_2R^k$ 、 $NR^kS(O)_2R^k$ 、 $NR^kS(O)_2NR^k$ 、及び $S(O)_2NR^k$ から独立に選択され；

各 R^n は、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、ハロ、 CN 、 R^o 、 $NHOR^o$ 、 OR^o 、 SR^o 、 $C(O)R^o$ 、 $C(O)NR^o$ 、 $C(O)OR^o$ 、 $OC(O)R^o$ 、 $OC(O)NR^o$ 、 NHR^o 、 NR^o 、 $NR^oC(O)R^o$ 、 $NR^oC(O)NR^o$ 、 $NR^oC(O)OR^o$ 、 $C(=NR^o)NR^o$ 、 $NR^oC(=NR^o)NR^o$ 、 $S(O)R^o$ 、 $S(O)NR^o$ 、 $S(O)_2R^o$ 、 $NR^oS(O)_2R^o$ 、 $NR^oS(O)_2NR^o$ 、及び $S(O)_2NR^o$ から独立に選択され；

各 R^e 、 R^i 、 R^k 、 R^o または R^p は、H、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim 4$ アルケニル、 $C_2 \sim 4$ アルキニル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール、及び 5 または 6 員のヘテロアリールから独立に選択され； R^e 、 R^i 、 R^k 、 R^o または R^p の $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim 4$ アルケニル、 $C_2 \sim 4$ アルキニル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール、5 または 6 員のヘテロアリールはそれぞれ、1、2 または 3 個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されているか；または

任意の 2 個の R^e 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 -、5 -、6 -、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成しているか；または

任意の 2 個の R^g 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 -、5 -、6 -、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成しているか；または

任意の 2 個の R^i 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 -、5 -、6 -、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成しているか；

または任意の 2 個の R^k 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 -、5 -、6 -、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成しているか；

または任意の 2 個の R^o 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 -、5 -、6 -、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成しており；

各 R^q は、OH、 CN 、 $-COOH$ 、 NH_2 、ハロ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオ、フェニル、5 ~ 6 員のヘテロアリール、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、 NHR^{12} 、 NR^{12} 、及び $C_1 \sim 4$ ハロアルコキシから独立に選択され、 R^q の $C_1 \sim 4$ アルキル、フェニル及び 5 ~ 6 員のヘテロアリールはそれぞれ、OH、 CN 、 $-COOH$ 、 NH_2 、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、及び 4 ~ 6 員のヘテロシクロアルキルで任意選択で置換されている]。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0019

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0019】

一部の実施形態では：

X^1 及び X^2 はそれぞれ独立に、C または N であるが、ただし、 X^1 及び X^2 が同時に N であることはなく；

X^3 は、N、 NR^{3a} 、または CR^3 であり；

X^4 は、N、 NR^{4a} 、または CR^4 であり；

X^5 は、N、 NR^{5a} 、または CR^5 であり；

W は、CH または N であり；

Y^1 は、N または CR^{10} であり；

Y^2 は、N または CR^{11} であり；

Z^1 及び Z^2 の一方は、N であり、 Z^1 及び Z^2 の他方は、C であり；

【化4】

は、環 A 及び環 B が芳香族であることを維持する単結合または二重結合であり；

R^1 は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルまたは 4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキルであり、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、及び 4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2 または 3 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されており；

R^2 は、 OR^{13} 、 C_{3-6} シクロアルキル、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、または 5 ~ 10 員のヘテロアリールであり、 R^2 の C_{3-6} シクロアルキル、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール、及び 5 ~ 10 員のヘテロアリールはそれぞれ、1、2、3、4、または 5 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されており；

R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 はそれぞれ、H、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル -、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル -、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル -、CN、 NO_2 、 OR^a 、 SR^a 、 $NHOR^a$ 、 $C(O)R^a$ 、 $C(O)NR^aR^a$ 、 $C(O)OR^a$ 、 $OC(O)R^a$ 、 $OC(O)NR^aR^a$ 、 NHR^a 、 NR^aR^a 、 $NR^aC(O)R^a$ 、 $NR^aC(O)OR^a$ 、 $NR^aC(O)NR^aR^a$ 、 $C(=NR^a)R^a$ 、 $C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $NR^aC(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $NR^aS(O)R^a$ 、 $NR^aS(O)_2R^a$ 、 $NR^aS(O)_2NR^aR^a$ 、 $S(O)R^a$ 、 $S(O)NR^aR^a$ 、 $S(O)_2R^a$ 、及び $S(O)_2NR^aR^a$ から独立に選択され、 R^3 、 R^4 、 R^5 、及び R^6 の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル -、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル -、及び (4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立に選択される R^b 置換基で任意選択で置換されており；

R^{3a} 、 R^{4a} 、及び R^{5a} はそれぞれ、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル -、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル -、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル -、 $C(O)R^a$ 、 $C(O)NR^aR^a$ 、 $C(O)OR^a$ 、C

($=NR^a$) R^a 、 $C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $S(O)R^a$ 、 $S(O)NR^aR^a$ 、 $S(O)_2R^a$ 、及び $S(O)_2NR^aR^a$ から独立に選択され、 R^{3a} 、 R^{4a} 、及び R^{5a} の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、及び(4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基で任意選択で置換されており；

R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 及び R^{11} はそれぞれ独立に、H、ハロ、CN、-OH、- $C(O)O(C_{1-4}$ アルキル)、- $C(O)NH_2$ 、- $C(O)NH(C_{1-4}$ アルキル)、- $C(O)N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、(C_{1-4} アルキル) $C(O)NH$ -、(C_{1-4} アルキル) $C(O)$ -、 C_{1-4} アルキルチオ、- $NH(C_{1-4}$ アルキル)、- $N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} ハロアルコキシ、- $SO_2(C_{1-4}$ アルキル)、- $SO_2NH(C_{1-4}$ アルキル)、- $SO_2N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、及び(C_{1-4} アルキル) SO_2NH -であり、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 及び R^{11} の - $C(O)O(C_{1-4}$ アルキル)、- $C(O)NH(C_{1-4}$ アルキル)、- $C(O)N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、(C_{1-4} アルキル) $C(O)NH$ -、(C_{1-4} アルキル) $C(O)$ -、 C_{1-4} アルキルチオ、- $NH(C_{1-4}$ アルキル)、- $N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} ハロアルコキシ、- $SO_2(C_{1-4}$ アルキル)、- $SO_2NH(C_{1-4}$ アルキル)、- $SO_2N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 及び(C_{1-4} アルキル) SO_2NH -基はそれぞれ、1または2個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^{12} は、独立に選択される C_{1-6} アルキル基であり；

R^{13} は、Hか、または1、2または3個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されている C_{1-6} アルキルであり；

各 R^a は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、及び(4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-から独立に選択され、 R^a の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-及び(4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、または5個の独立に選択される R^d 置換基で任意選択で置換されているか；または

任意の2個の R^a 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2または3個の R^h 置換基で任意選択で置換されている4-、5-、6-、7-、8-、9-または10員のヘテロシクロアルキル基を形成しており；

各 R^b は、ハロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} ハロアルコキシ、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、(4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-、CN、OH、 NH_2 、 NO_2 、 $NHOR^c$ 、 OR^c 、 SR^c 、 $C(O)R^c$ 、 $C(O)NR^cR^c$ 、 $C(O)OR^c$ 、 $OC(O)R^c$ 、 $OC(O)NR^cR^c$ 、 $C(=NR^c)NR^cR^c$ 、 $NR^cC(=NR^c)NR^cR^c$ 、 NHR^c 、 NR^cR^c 、 $NR^cC(O)R^c$ 、 $NR^cC(O)OR^c$ 、 $NR^cC(O)NR^cR^c$ 、 $NR^cS(O)R^c$ 、 $NR^cS(O)_2R^c$ 、

$\text{NR}^c\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^c\text{R}^c$ 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^c$ 、 $\text{S}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^c$ 、 $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^c$ 及び $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^c\text{R}^c$ から独立に選択され； R^b の C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} ハロアルコキシ、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル- 及び (4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル- はそれぞれさらに、1、2、または3個の独立に選択される R^d 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^c は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、及び (4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル- から独立に選択され、 R^c の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル- 及び (4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル- はそれぞれ、1、2、3、4、または5個の独立に選択される R^f 置換基で任意選択で置換されているか；または

任意の2個の R^c 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または3個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている4-、5-、6-、または7員のヘテロシクロアルキル基を形成しており；

各 R^d は、ハロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{3-10} シクロアルキル、4～10員のヘテロシクロアルキル、 CN 、 NH_2 、 NHOR^e 、 OR^e 、 SR^e 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^e$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^e\text{R}^e$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^e$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^e$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^e\text{R}^e$ 、 NHR^e 、 NR^eR^e 、 $\text{NR}^e\text{C}(\text{O})\text{R}^e$ 、 $\text{NR}^e\text{C}(\text{O})\text{NR}^e\text{R}^e$ 、 $\text{NR}^e\text{C}(\text{O})\text{OR}^e$ 、 $\text{C}(=\text{NR}^e)\text{NR}^e\text{R}^e$ 、 $\text{NR}^e\text{C}(=\text{NR}^e)\text{NR}^e\text{R}^e$ 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^e$ 、 $\text{S}(\text{O})\text{NR}^e\text{R}^e$ 、 $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^e$ 、 $\text{NR}^e\text{S}(\text{O})_2\text{R}^e$ 、 $\text{NR}^e\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^e\text{R}^e$ 、及び $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^e\text{R}^e$ から独立に選択され、 R^d の C_{1-4} アルキル、 C_{3-10} シクロアルキル及び4～10員のヘテロシクロアルキルはそれぞれさらに、1、2、または3個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^f は、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、及び (4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル-、ハロ、 CN 、 NHOR^g 、 OR^g 、 SR^g 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^g$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^g\text{R}^g$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^g$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^g$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^g\text{R}^g$ 、 NHR^g 、 NR^gR^g 、 $\text{NR}^g\text{C}(\text{O})\text{R}^g$ 、 $\text{NR}^g\text{C}(\text{O})\text{NR}^g\text{R}^g$ 、 $\text{NR}^g\text{C}(\text{O})\text{OR}^g$ 、 $\text{C}(=\text{NR}^g)\text{NR}^g\text{R}^g$ 、 $\text{NR}^g\text{C}(=\text{NR}^g)\text{NR}^g\text{R}^g$ 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^g$ 、 $\text{S}(\text{O})\text{NR}^g\text{R}^g$ 、 $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^g$ 、 $\text{NR}^g\text{S}(\text{O})_2\text{R}^g$ 、 $\text{NR}^g\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^g\text{R}^g$ 、及び $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^g\text{R}^g$ から独立に選択され； R^f の C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-、及び (4～10員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキル- はそれぞれ、1、2、3、4、または5個の独立に選択される R^n 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^g は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6}

～₆ アルキニル、C₆～₁₀ アリール、C₃～₁₀ シクロアルキル、5～₁₀ 員のヘテロアリール、4～₁₀ 員のヘテロシクロアルキル、C₆～₁₀ アリール - C₁～₄ アルキル - 、C₃～₁₀ シクロアルキル - C₁～₄ アルキル - 、(5～₁₀ 員のヘテロアリール) - C₁～₄ アルキル - 、及び(4～₁₀ 員のヘテロシクロアルキル) - C₁～₄ アルキル - から独立に選択され、R^g の C₁～₆ アルキル、C₂～₆ アルケニル、C₂～₆ アルキニル、C₆～₁₀ アリール、C₃～₁₀ シクロアルキル、5～₁₀ 員のヘテロアリール、4～₁₀ 員のヘテロシクロアルキル、C₆～₁₀ アリール - C₁～₄ アルキル - 、C₃～₁₀ シクロアルキル - C₁～₄ アルキル - 、(5～₁₀ 員のヘテロアリール) - C₁～₄ アルキル - 及び(4～₁₀ 員のヘテロシクロアルキル) - C₁～₄ アルキル - はそれぞれ、1、2、または3個の独立に選択される R^p 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^h は、C₁～₆ アルキル、C₃～₁₀ シクロアルキル、4～7 員のヘテロシクロアルキル、C₆～₁₀ アリール、5～6 員のヘテロアリール、C₃～₁₀ シクロアルキル - C₁～₄ アルキル - 、(5～6 員のヘテロアリール) - C₁～₄ アルキル - 、(4～7 員のヘテロシクロアルキル) - C₁～₄ アルキル - 、C₁～₆ ハロアルキル、C₂～₆ アルケニル、C₂～₆ アルキニル、ハロ、CN、ORⁱ、SRⁱ、NHORⁱ、C(O)Rⁱ、C(O)NRⁱRⁱ、C(O)ORⁱ、OC(O)Rⁱ、OC(O)NRⁱRⁱ、NHRⁱ、NRⁱRⁱ、NRⁱC(O)Rⁱ、NRⁱC(O)NRⁱRⁱ、NRⁱC(O)ORⁱ、C(=NRⁱ)NRⁱRⁱ、NRⁱC(=NRⁱ)NRⁱRⁱ、S(O)Rⁱ、S(O)NRⁱRⁱ、S(O)₂Rⁱ、NRⁱS(O)₂Rⁱ、NRⁱS(O)₂NRⁱRⁱ、及びS(O)₂NRⁱRⁱから選択され、R^h の C₁～₆ アルキル、C₃～₁₀ シクロアルキル、4～7 員のヘテロシクロアルキル、C₆～₁₀ アリール、5～6 員のヘテロアリール、C₃～₁₀ シクロアルキル - C₁～₄ アルキル - 、(5～6 員のヘテロアリール) - C₁～₄ アルキル - 、(4～7 員のヘテロシクロアルキル) - C₁～₄ アルキル - はそれぞれさらに、1、2、または3個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されているか；または

4～₁₀ 員のヘテロシクロアルキルの同じ炭素原子に結合している2個の R^h 基は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、C₃～₆ シクロアルキル、または環員としてO、NもしくはSから選択される1～2個のヘテロ原子を有する4～6員のヘテロシクロアルキルを形成しており；

各 R^j 置換基は、C₃～₆ シクロアルキル、C₆～₁₀ アリール、5または6員のヘテロアリール、C₂～₄ アルケニル、C₂～₄ アルキニル、ハロ、C₁～₄ アルキル、C₁～₄ ハロアルキル、CN、NHOR^k、OR^k、SR^k、C(O)R^k、C(O)NR^kR^k、C(O)OR^k、OC(O)R^k、OC(O)NR^kR^k、NHR^k、NR^kR^k、NR^kC(O)R^k、NR^kC(O)NR^kR^k、NR^kC(O)OR^k、C(=NR^k)NR^kR^k、NR^kC(=NR^k)NR^kR^k、S(O)R^k、S(O)NR^kR^k、S(O)₂R^k、NR^kS(O)₂R^k、NR^kS(O)₂NR^kR^k、及びS(O)₂NR^kR^kから独立に選択され；

各 Rⁿ は、C₁～₄ アルキル、C₁～₄ ハロアルキル、ハロ、CN、R^o、NHOR^o、OR^o、SR^o、C(O)R^o、C(O)NR^oR^o、C(O)OR^o、OC(O)R^o、OC(O)NR^oR^o、NHR^o、NR^oR^o、NR^oC(O)R^o、NR^oC(O)NR^oR^o、NR^oC(O)OR^o、C(=NR^o)NR^oR^o、NR^oC(=NR^o)NR^oR^o、S(O)R^o、S(O)NR^oR^o、S(O)₂R^o、NR^oS(O)₂R^o、NR^oS(O)₂NR^oR^o、及びS(O)₂NR^oR^oから独立に選択され；

各 R^e、Rⁱ、R^k、R^oまたはR^pは、H、C₁～₄ アルキル、C₁～₄ ハロアルキル、C₂～₄ アルケニル、C₂～₄ アルキニル、C₃～₆ シクロアルキル、C₆～₁₀ アリール、及び5または6員のヘテロアリールから独立に選択され；R^e、Rⁱ、R^k、R^oまたはR^pの C₁～₄ アルキル、C₁～₄ ハロアルキル、C₂～₄ アルケニル、C₂～₄ アルキニル、C₃～₆ シクロアルキル、C₆～₁₀ アリール、5または6員のヘテロアリールはそれぞれ、1、2または3個の独立に選択される R^q 置換基で任意選択で置換されているか；または

任意の 2 個の R^e 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 -、5 -、6 -、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成しているか；または

任意の 2 個の R^g 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 -、5 -、6 -、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成しているか；または

任意の 2 個の R^i 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 -、5 -、6 -、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成しているか；または

任意の 2 個の R^k 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 -、5 -、6 -、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成しているか；または

任意の 2 個の R^o 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 -、5 -、6 -、または 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成しており；

各 R^q は、OH、CN、-COOH、 NH_2 、ハロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルチオ、フェニル、5～6 員のヘテロアリール、 C_{3-6} シクロアルキル、 NHR^{12} 、 $NR^{12}R^{12}$ 、及び C_{1-4} ハロアルコキシから独立に選択され、 R^q の C_{1-4} アルキル、フェニル及び 5～6 員のヘテロアリールはそれぞれ、OH、CN、-COOH、 NH_2 、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{3-10} シクロアルキル、及び 4～6 員のヘテロシクロアルキルで任意選択で置換されている。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0051

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0051】

一部の実施形態では、 R^2 は、 C_{1-6} アルコキシ、フェニル、または単環式 5～6 員のヘテロアリールであり； R^2 の前記フェニルまたは単環式 5～6 員のヘテロアリールはそれぞれ、1、2、または 3 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されている。

【手続補正 5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0053

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0053】

一部の実施形態では、 R^2 は、 C_{1-6} アルコキシ、フェニル、5～6 員のヘテロシクロアルキル、または単環式 5～6 員のヘテロアリールであり； R^2 の前記フェニル、5～6 員のヘテロシクロアルキル、単環式 5～6 員のヘテロアリールはそれぞれ、1、2、または 3 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されている。

【手続補正 6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0068

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0068】

一部の実施形態では、 R^{3a} は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5～10 員のヘテロアリール、4～10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリー

ル - $C_1 \sim 4$ アルキル -、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル - $C_1 \sim 4$ アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - $C_1 \sim 4$ アルキル -、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - $C_1 \sim 4$ アルキル - から選択され; R^{3a} の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_6 \sim 10$ アリール、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール - $C_1 \sim 4$ アルキル -、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル - $C_1 \sim 4$ アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - $C_1 \sim 4$ アルキル -、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - $C_1 \sim 4$ アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されている。

【手続補正7】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0074

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0074】

一部の実施形態では、 R^{4a} は、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_1 \sim 6$ ハロアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール - $C_1 \sim 4$ アルキル -、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル - $C_1 \sim 4$ アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - $C_1 \sim 4$ アルキル -、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - $C_1 \sim 4$ アルキル - から選択され; R^{4a} の $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_6 \sim 10$ アリール、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール - $C_1 \sim 4$ アルキル -、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル - $C_1 \sim 4$ アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - $C_1 \sim 4$ アルキル -、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - $C_1 \sim 4$ アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されている。

【手続補正8】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0075

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0075】

一部の実施形態では、 R^{4a} は、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、フェニル - $C_1 \sim 4$ アルキル -、及び(5 ~ 6 員のヘテロアリール) - $C_1 \sim 4$ アルキル - から選択され、 R^{4a} の前記 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、フェニル - $C_1 \sim 4$ アルキル -、及び(5 ~ 6 員のヘテロアリール) - $C_1 \sim 4$ アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されている。

【手続補正9】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0080

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0080】

一部の実施形態では、 R^4 は、H、ハロ、CN、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、フェニル - $C_1 \sim 4$ アルキル -、及び(5 ~ 6 員のヘテロアリール) - $C_1 \sim 4$ アルキル - から選択され、 R^4 の前記 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、フェニル - $C_1 \sim 4$ アルキル -、及び(5 ~ 6 員のヘテロアリール) - $C_1 \sim 4$ アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独

立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されている。

【手続補正 10】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0096

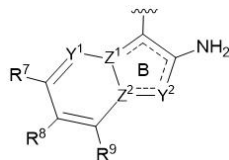
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0096】

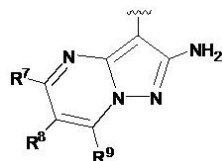
一部の実施形態では：

【化 1 1】



は、

【化 1 2】



であり；

R^1 は、H または C_{1-6} アルキルであり；

R^2 は、1、2 または 3 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されている 5 ~ 6 員のヘテロシクロアルキルであり；

各 R^j は、ハロ、CN、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 $NHOR^k$ 、 OR^k 、 $C(O)R^k$ 、 $C(O)NR^kR^k$ 、 $C(O)OR^k$ 、 $OC(O)R^k$ 、 $OC(O)NR^kR^k$ 、 NHR^k 、 NR^kR^k 、 $NR^kC(O)R^k$ 、 $S(O)_2R^k$ 、 $NR^kS(O)_2R^k$ 、及び $S(O)_2NR^kR^k$ から独立に選択され；

R^{3a} は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル -、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル -、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル - から選択され； R^{3a} の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル -、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル -、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

R^{4a} は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル -、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル -、(4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル) - C_{1-4} アルキル - から選択され； R^{4a} の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-10} シクロアルキル、5 ~ 10 員のヘテロアリール、4 ~ 10 員のヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル -、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル -、(5 ~ 10 員のヘテロアリール) - C_{1-4} アルキル -

-、(4～10員のヘテロシクロアルキル)-C₁～4アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択されるR^b置換基によって任意選択で置換されており；

R³は、HまたはC₁～6アルキルであり；

R⁴は、HまたはC₁～6アルキルであり；

R⁵は、H、ハロ、C₁～6アルキル、またはC₁～6ハロアルキルであり；

R^{5a}は、HまたはC₁～6アルキルであり；

R⁶は、H、ハロ、CN、C₁～6アルキル、またはC₁～6ハロアルキルであり；

R⁷は、H、ハロ、CN、C₁～6アルキル、またはC₁～6ハロアルキルである。

【手続補正11】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0098

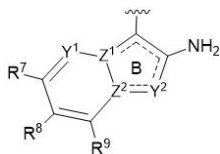
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0098】

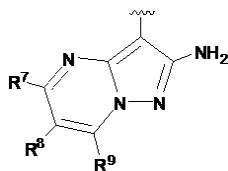
一部の実施形態では：

【化15】



は、

【化16】



であり；

R¹は、HまたはC₁～6アルキルであり；

R²は、OR¹³、C₆～10アリール、または5～10員のヘテロアリールであり；

R²の前記C₆～10アリールまたは5～10員のヘテロアリールはそれぞれ、1、2、3、4、または5個の独立に選択されるR^j置換基で任意選択で置換されており；

各R^jは、ハロ、CN、C₁～4アルキル、C₁～4ハロアルキル、C₂～4アルケニル、C₂～4アルキニル、NHOR^k、OR^k、C(O)R^k、C(O)NR^kR^k、C(O)OR^k、OC(O)R^k、OC(O)NR^kR^k、NHR^k、NR^kR^k、NR^kC(O)R^k、S(O)₂R^k、NR^kS(O)₂R^k、及びS(O)₂NR^kR^kから独立に選択され；

R^{3a}は、H、C₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、C₂～6アルキニル、C₁～6ハロアルキル、C₆～10アリール、C₃～10シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、C₆～10アリール-C₁～4アルキル-、C₃～10シクロアルキル-C₁～4アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)-C₁～4アルキル-、(4～10員のヘテロシクロアルキル)-C₁～4アルキル-から選択され；R^{3a}のC₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、C₂～6アルキニル、C₆～10アリール、C₃～10シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、C₆～10アリール-C₁～4アルキル-、C₃～10シクロアルキル-C₁～4アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)-C₁～4アルキル-、(4～10員のヘテロシクロアルキル)-C₁～4アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択されるR^b置換基によって任意選択で置換されており；

R^{4a}は、H、C₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、C₂～6アルキニル、C₁～6ハロアルキル、C₆～10アリール、C₃～10シクロアルキル、5～10員のヘテロ

アリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール- $C_1 \sim 4$ アルキル-、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル- $C_1 \sim 4$ アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)- $C_1 \sim 4$ アルキル-、(4～10員のヘテロシクロアルキル)- $C_1 \sim 4$ アルキル-から選択され； R^4 は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_6 \sim 10$ アリール、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、5～10員のヘテロアリール、4～10員のヘテロシクロアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール- $C_1 \sim 4$ アルキル-、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル- $C_1 \sim 4$ アルキル-、(5～10員のヘテロアリール)- $C_1 \sim 4$ アルキル-、(4～10員のヘテロシクロアルキル)- $C_1 \sim 4$ アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

R^3 は、Hまたは $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^4 は、Hまたは $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^5 は、H、ハロ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、または $C_1 \sim 6$ ハロアルキルであり；

R^{5a} は、Hまたは $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^6 は、H、ハロ、CN、 $C_1 \sim 6$ アルキル、または $C_1 \sim 6$ ハロアルキルであり；

R^7 は、H、ハロ、CN、 $C_1 \sim 6$ アルキル、または $C_1 \sim 6$ ハロアルキルである。

【手続補正12】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0099

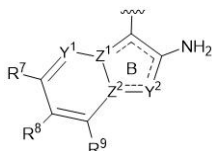
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0099】

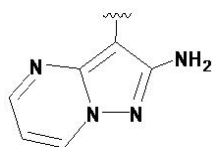
一部の実施形態では：

【化17】



は、

【化18】



であり；

R^1 は、 $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、フェニル、または単環式5～6員のヘテロアリールであり； R^2 の前記フェニルまたは単環式5～6員のヘテロアリールはそれぞれ、1、2、または3個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^j は、ハロ、CN、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim 4$ アルケニル、 $C_2 \sim 4$ アルキニル、 $NHOR^k$ 、 OR^k 、 $C(O)R^k$ 、 $C(O)NR^kR^k$ 、 $C(O)OR^k$ 、 $OC(O)R^k$ 、 $OC(O)NR^kR^k$ 、 NHR^k 、 NR^kR^k 、 $NR^kC(O)R^k$ 、 $S(O)_2R^k$ 、 $NR^kS(O)_2R^k$ 、及び $S(O)_2NR^kR^k$ から独立に選択され；

各 R^k は、H、 $C_1 \sim 4$ アルキル、及び $C_1 \sim 4$ ハロアルキルから独立に選択される；

R^{3a} は、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、フェニル- $C_1 \sim 4$ アルキル-、(5～6員のヘテロアリール)- $C_1 \sim 4$ アルキル、及び(4～6員のヘテロシクロアルキル)- $C_1 \sim 4$ アルキルであり； R^{3a} の前記 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、フェニル- $C_1 \sim 4$ アルキル-、(5～6員のヘテロアリール)- $C_1 \sim 4$ アルキル、及び(4～6員のヘテロシクロアルキル)- $C_1 \sim 4$ アルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される

R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

各 R^b は、ハロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 CN 、 OH 、 NH_2 、 $NHOR^c$ 、 OR^c 、 $C(O)R^c$ 、 $C(O)NR^cR^c$ 、 $C(O)OR^c$ 、 $OC(O)R^c$ 、 $OC(O)NR^cR^c$ 、 NHR^c 、 NR^cR^c 、 $NR^cC(O)R^c$ 、 $NR^cC(O)OR^c$ 、 $NR^cS(O)R^c$ 、 $NR^cS(O)_2R^c$ 、 $S(O)_2R^c$ 及び $S(O)_2NR^cR^c$ から独立に選択され；

R^{4a} は、 H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、フェニル- C_{1-4} アルキル-、及び(5~6員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-から選択され； R^{4a} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、フェニル- C_{1-4} アルキル-、及び(5~6員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

R^3 は、 H または C_{1-6} アルキルであり；

R^4 は、 H または C_{1-6} アルキルであり；

R^{5a} は、 H または C_{1-6} アルキルであり；

R^5 は、 H 、ハロ、または C_{1-6} アルキルであり；

R^6 は、ハロ、 CN 、または C_{1-6} アルキルであり；

各 R^c は独立に、 H または C_{1-6} アルキルであるか；または

任意の2個の R^c 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または3個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている4-、5-、6-、または7員のヘテロシクロアルキル基を形成している。

【手続補正13】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0103

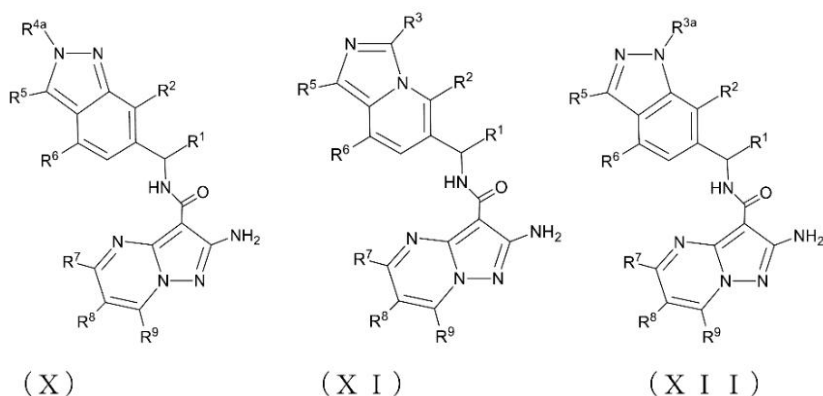
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0103】

一部の実施形態では、化合物は、式X、XI、もしくはXIIの化合物：

【化25】



またはその薬学的に許容される塩である：

[式中、

R^1 は、 C_{1-6} アルキルであり；

R^2 は、 C_{1-6} アルコキシ、フェニル、単環式5~6員のヘテロシクロアルキル、単環式5~6員のヘテロアリールであり； R^2 の前記フェニル、単環式5~6員のヘテロシクロアルキル、及び単環式5~6員のヘテロアリールはそれぞれ、1、2、または3個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^j は、ハロ、 CN 、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 $NHOR^k$ 、 OR^k 、 $C(O)R^k$ 、 $C(O)NR^kR^k$ 、 $C(O)OR^k$ 、 $OC(O)R^k$ 、 $OC(O)NR^kR^k$ 、 NHR^k 、 NR^kR^k 、 NR^k

$C(O)R^k$ 、 $S(O)_2R^k$ 、 $NR^kS(O)_2R^k$ 、及び $S(O)_2NR^kR^k$ から独立に選択され；

各 R^k は、H、 $C_{1\sim4}$ アルキル、及び $C_{1\sim4}$ ハロアルキルから独立に選択され；

R^3 は、Hまたは $C_{1\sim6}$ アルキルであり；

R^{3a} は、H、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、 $C_{3\sim7}$ シクロアルキル、フェニル- $C_{1\sim4}$ アルキル-、(5～6員のヘテロアリール)- $C_{1\sim4}$ アルキル、及び(4～6員のヘテロシクロアルキル)- $C_{1\sim4}$ アルキルであり； R^{3a} の前記 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、 $C_{3\sim7}$ シクロアルキル、フェニル- $C_{1\sim4}$ アルキル-、(5～6員のヘテロアリール)- $C_{1\sim4}$ アルキル、及び(4～6員のヘテロシクロアルキル)- $C_{1\sim4}$ アルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

各 R^b は、ハロ、 $C_{1\sim4}$ アルキル、 $C_{1\sim4}$ ハロアルキル、CN、OH、 NH_2 、 $NHOR^c$ 、 OR^c 、 $C(O)R^c$ 、 $C(O)NR^cR^c$ 、 $C(O)OR^c$ 、 $OC(O)R^c$ 、 $OC(O)NR^cR^c$ 、 NHR^c 、 NR^cR^c 、 $NR^cC(O)R^c$ 、 $NR^cC(O)OR^c$ 、 $NR^cS(O)R^c$ 、 $NR^cS(O)_2R^c$ 、 $S(O)_2R^c$ 及び $S(O)_2NR^cR^c$ から独立に選択され；

R^{4a} は、H、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、 $C_{3\sim7}$ シクロアルキル、フェニル- $C_{1\sim4}$ アルキル-、及び(5～6員のヘテロアリール)- $C_{1\sim4}$ アルキル-から選択され； R^{4a} の前記 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、 $C_{3\sim7}$ シクロアルキル、フェニル- $C_{1\sim4}$ アルキル-、及び(5～6員のヘテロアリール)- $C_{1\sim4}$ アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

R^3 は、Hまたは $C_{1\sim6}$ アルキルであり；

R^4 は、Hまたは $C_{1\sim6}$ アルキルであり；

R^{5a} は、Hまたは $C_{1\sim6}$ アルキルであり；

R^5 は、H、ハロ、または $C_{1\sim6}$ アルキルであり；

R^6 は、ハロ、CN、または $C_{1\sim6}$ アルキルであり；

R^7 、 R^8 、 R^9 はそれぞれ、Hであり；

各 R^c は独立に、Hまたは $C_{1\sim6}$ アルキルであるか；または

任意の2個の R^c 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または3個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている4-、5-、6-、または7員のヘテロシクロアルキル基を形成している】。

【手続補正14】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0104

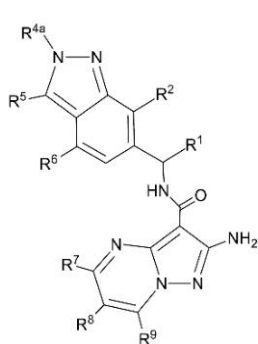
【補正方法】変更

【補正の内容】

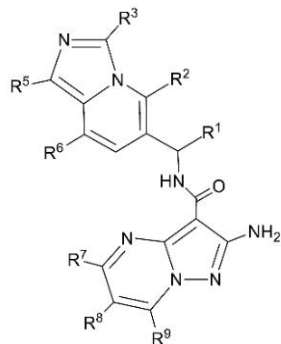
【0104】

一部の実施形態では、化合物は、式X、XI、もしくはXIIの化合物；

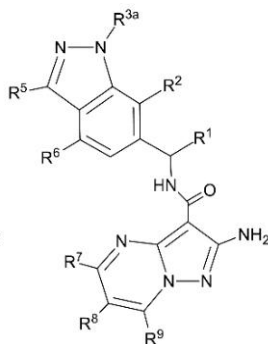
【化 26】



(X)



(XI)



(XII)

またはその薬学的に許容される塩である：

[式中、

R^1 は、 C_{1-6} アルキルであり；

R^2 は、 C_{1-6} アルコキシ、フェニル、5～6員の単環式ヘテロシクロアルキル、または単環式5～6員のヘテロアリールであり； R^2 の前記フェニルまたは単環式5～6員のヘテロアリールはそれぞれ、1、2、または3個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^j は、ハロ、CN、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 $NHOR^k$ 、 OR^k 、 $C(O)R^k$ 、 $C(O)NR^kR^k$ 、 $C(O)OR^k$ 、 $OC(O)R^k$ 、 $OC(O)NR^kR^k$ 、 NHR^k 、 NR^kR^k 、 $NR^kC(O)R^k$ 、 $S(O)_2R^k$ 、 $NR^kS(O)_2R^k$ 、及び $S(O)_2NR^kR^k$ から独立に選択され；

各 R^k は、H、 C_{1-4} アルキル、及び C_{1-4} ハロアルキルから独立に選択され；

R^3 は、Hまたは C_{1-6} アルキルであり；

R^{3a} は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、フェニル- C_{1-4} アルキル-、(5～6員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル、及び(4～6員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキルであり； R^{3a} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、フェニル- C_{1-4} アルキル-、(5～6員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル、及び(4～6員のヘテロシクロアルキル)- C_{1-4} アルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

各 R^b は、ハロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、CN、OH、 NH_2 、 $NHOR^c$ 、 OR^c 、 $C(O)R^c$ 、 $C(O)NR^cR^c$ 、 $C(O)OR^c$ 、 $OC(O)R^c$ 、 $OC(O)NR^cR^c$ 、 NHR^c 、 NR^cR^c 、 $NR^cC(O)R^c$ 、 $NR^cC(O)OR^c$ 、 $NR^cS(O)R^c$ 、 $NR^cS(O)_2R^c$ 、 $S(O)_2R^c$ 及び $S(O)_2NR^cR^c$ から独立に選択され；

R^{4a} は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、フェニル- C_{1-4} アルキル-、及び(5～6員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-から選択され； R^{4a} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、フェニル- C_{1-4} アルキル-、及び(5～6員のヘテロアリール)- C_{1-4} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

R^3 は、Hまたは C_{1-6} アルキルであり；

R^4 は、Hまたは C_{1-6} アルキルであり；

R^{5a} は、Hまたは C_{1-6} アルキルであり；

R^5 は、H、ハロ、または C_{1-6} アルキルであり；

R^6 は、ハロ、CN、または C_{1-6} アルキルであり；

R^7 、 R^8 、 R^9 はそれぞれ、Hであり；

各 R^c は独立に、H または $C_1 \sim 6$ アルキルであるか；または
 任意の 2 個の R^c 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または
 3 個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている 4 -、5 -、6 -、また
 は 7 員のヘテロシクロアルキル基を形成している】。

【手続補正 15】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0105

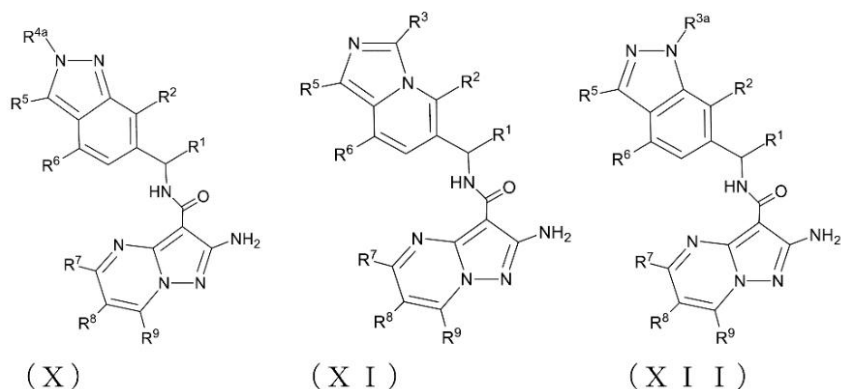
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0105】

一部の実施形態では、化合物は、式 X、X I、もしくは X I I の化合物：

【化 27】



またはその薬学的に許容される塩である：

[式中、

R^1 は、 $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^2 は、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、フェニル、または単環式 5 ~ 6 員のヘテロアリールであり； R^2 の前記 フェニル または単環式 5 ~ 6 員のヘテロアリールはそれぞれ、1、2、または 3 個の独立に選択される R^j 置換基で任意選択で置換されており；

各 R^j は、ハロ、CN、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim 4$ アルケニル、 $C_2 \sim 4$ アルキニル、 $NHOR^k$ 、 OR^k 、 $C(O)R^k$ 、 $C(O)NR^kR^k$ 、 $C(O)OR^k$ 、 $OC(O)R^k$ 、 $OC(O)NR^kR^k$ 、 NHR^k 、 NR^kR^k 、 $NR^kC(O)R^k$ 、 $S(O)_2R^k$ 、 $NR^kS(O)_2R^k$ 、及び $S(O)_2NR^kR^k$ から独立に選択され；

各 R^k は、H、 $C_1 \sim 4$ アルキル、及び $C_1 \sim 4$ ハロアルキルから独立に選択され；

R^3 は、H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^{3a} は、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、フェニル - $C_1 \sim 4$ アルキル -、(5 ~ 6 員のヘテロアリール) - $C_1 \sim 4$ アルキル、及び (4 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル) - $C_1 \sim 4$ アルキルであり； R^{3a} の前記 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、フェニル - $C_1 \sim 4$ アルキル -、(5 ~ 6 員のヘテロアリール) - $C_1 \sim 4$ アルキル、及び (4 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル) - $C_1 \sim 4$ アルキルはそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

各 R^b は、ハロ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、CN、OH、 NH_2 、 $NHOR^c$ 、 OR^c 、 $C(O)R^c$ 、 $C(O)NR^cR^c$ 、 $C(O)OR^c$ 、 $OC(O)R^c$ 、 $OC(O)NR^cR^c$ 、 NHR^c 、 NR^cR^c 、 $NR^cC(O)R^c$ 、 $NR^cC(O)OR^c$ 、 $NR^cS(O)R^c$ 、 $NR^cS(O)_2R^c$ 、 $S(O)_2R^c$ 及び $S(O)_2NR^cR^c$ から独立に選択され；

R^{4a} は、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、フェニル - $C_1 \sim 4$ アルキル -、及び (5 ~ 6 員のヘテロアリール) - $C_1 \sim 4$ アルキル -

から選択され； R^{4a} の前記 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、フェニル- $C_1 \sim 4$ アルキル-、及び（5～6員のヘテロアリール）- $C_1 \sim 4$ アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立に選択される R^b 置換基によって任意選択で置換されており；

R^3 は、Hまたは $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^4 は、Hまたは $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^{5a} は、Hまたは $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^5 は、H、ハロ、または $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^6 は、ハロ、CN、または $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^7 、 R^8 、 R^9 はそれぞれ、Hであり；

各 R^c は独立に、Hまたは $C_1 \sim 6$ アルキルであるか；または

任意の2個の R^c 置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1、2、または3個の独立に選択される R^h 置換基で任意選択で置換されている4-、5-、6-、または7員のヘテロシクロアルキル基を形成している]。