

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成26年12月4日 (2014.12.4)

【公表番号】特表2013-542941 (P2013-542941A)

【公表日】平成25年11月28日 (2013.11.28)

【年通号数】公開・登録公報2013-064

【出願番号】特願2013-534002 (P2013-534002)

【国際特許分類】

C 0 7 D 277/60 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/542 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/4436 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/428 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/4433 (2006.01)

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

C 0 7 D 497/04 (2006.01)

C 0 7 D 409/04 (2006.01)

C 0 7 D 513/04 (2006.01)

C 0 7 D 495/10 (2006.01)

C 0 7 D 417/04 (2006.01)

C 0 7 D 333/50 (2006.01)

C 0 7 D 333/52 (2006.01)

C 0 7 D 491/048 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 498/04 (2006.01)

C 0 7 D 513/20 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 277/60 C S P

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 7/02

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 31/542
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 K 31/4436
 A 6 1 K 31/4439
 A 6 1 K 31/428
 A 6 1 K 31/444
 A 6 1 K 31/4433
 C 0 7 D 495/04 1 0 8
 C 0 7 D 497/04
 C 0 7 D 495/04 1 0 1
 C 0 7 D 409/04
 C 0 7 D 495/04 1 0 3
 C 0 7 D 513/04 3 7 1
 C 0 7 D 513/04 3 6 1
 C 0 7 D 495/10
 C 0 7 D 417/04
 C 0 7 D 333/50
 C 0 7 D 333/52
 C 0 7 D 495/04 1 0 5 Z
 C 0 7 D 491/048
 C 0 7 D 487/04 1 5 0
 C 0 7 D 498/04 1 0 8
 C 0 7 D 495/04 1 0 5 A
 C 0 7 D 513/20

【手続補正書】

【提出日】平成26年10月14日(2014.10.14)

【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】

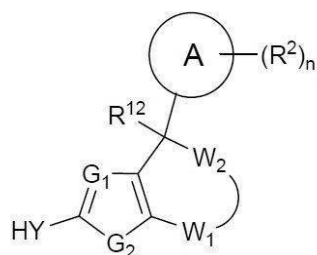
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

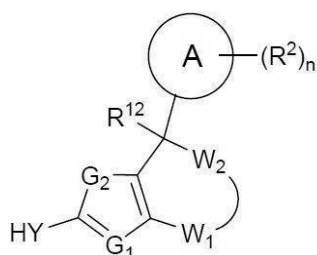
構造式 I - A または I - B に示す化合物

【化 1 - 3】

【化 1】



I-A



I-B

または薬剂的に許容される塩であり、式中

G_1 は N または CR^1 であり、 R^1 は H、-CN、ハロゲン、または C_{1-6} 脂肪族、
 3 ~ 10 員の脂環式、または -Z- R^{11} から選択される任意に置換される基であり、こ

こで

Zは任意に置換される $C_1 - 3$ アルキレン鎖、 $-O-$ 、 $-N(R^{1a})-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(O)NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})C(O)-$ 、 $-N(R^{1a})CO_2-$ 、 $-S(O)_2NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})S(O)_2-$ 、 $-OC(O)N(R^{1a})-$ 、 $-N(R^{1a})C(O)NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})S(O)_2N(R^{1a})-$ 、または $-OC(O)-$ から選択され、

R^{1a} は水素または任意に置換される $C_1 - 4$ 脂肪族であり、および

R^{11} は水素または $C_1 - 6$ 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、または6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、および

G_2 はSであり、

環Aは6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^2 の各出現は独立して $-R^{12a}$ 、 $-T_2-R^{12d}$ 、または $-V_2-T_2-R^{12d}$ であり、および

R^{12a} の各出現は独立してハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{12c}$ 、 $-N(R^{12b})_2$ 、 $-OR^{12b}$ 、 $-SR^{12c}$ 、 $-S(O)_2R^{12c}$ 、 $-C(O)R^{12b}$ 、 $-C(O)OR^{12b}$ 、 $-C(O)N(R^{12b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{12b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{12b})_2$ 、 $-N(R^{12e})C(O)R^{12b}$ 、 $-N(R^{12e})SO_2R^{12c}$ 、 $-N(R^{12e})C(O)OR^{12b}$ 、 $-N(R^{12e})C(O)N(R^{12b})_2$ 、または $-N(R^{12e})SO_2N(R^{12b})_2$ であり、または R^{12b} の2つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒に、窒素、酸素若しくは硫黄から選択される0～1の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される4～7員のヘテロシクリル環を形成し、

R^{12b} の各出現は独立して水素、または $C_1 - C_6$ 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{12c} の各出現は独立して、 $C_1 - 6$ 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{12d} の各出現は独立して水素、または3～10員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{12e} の各出現は独立して水素または任意に置換される $C_1 - 6$ 脂肪族基であり、

V_2 の各出現は独立して $-N(R^{12e})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{12e})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{12e})-$ 、 $-OC(O)N(R^{12e})-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)-$ 、 $-N(R^{12e})SO_2-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)O-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)N(R^{12e})-$ 、 $-N(R^{12e})SO_2N(R^{12e})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{12e})-O-$ であり、および

T_2 は任意に置換される $C_1 - C_6$ アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N$

(R^{13}) -、-O-、-S-、-S(O)-、-S(O)₂-、-C(O)-、-C(O)O-、-C(O)N(R^{13})-、-S(O)₂N(R^{13})-、-OC(O)N(R^{13})-、-N(R^{13})C(O)-、-N(R^{13})SO₂-、-N(R^{13})C(O)O-、-N(R^{13})C(O)N(R^{13})-、-N(R^{13})S(O)₂N(R^{13})-、-OC(O)-、または-C(O)N(R^{13})-O-によって任意に割り込まれ、またはT₂若しくはその部分は任意に置換される3～7員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分を任意に形成し、ここで R^{13} は水素または任意に置換されるC₁₋₆脂肪族基であり、

nは0～4であり、

R^{12} は水素、ハロ、またはC₁₋₆脂肪族、-C(O)N(R^{5a})₂、3～10員の脂環式、-N(R^{4b})₂、-OR^{4a}、または-SR^{4a}から選択される任意に置換される基であり、

またはR²および R^{12} は任意に置換される3～10員の脂環式を形成し、

W₁は、-C(O)NR^{4a}-、-C(O)C(R⁴)₂-、-C(R⁴)₂C(O)-、-C(O)O-、-OC(O)-、-NR^{4a}C(O)-、-C(=NR^{4b})C(R⁴)₂-、-C(R⁴)₂C(=NR^{4b})-、-C(=NR^{4b})O-、-OC(=NR^{4b})-、-C(=NR^{4b})NR^{4a}-、-NR^{4a}C(=NR^{4b})-、-S(O)C(R⁴)₂-、-C(R⁴)₂S(O)-、-S(O)O-、-OS(O)-、-S(O)NR^{4a}-、-NR^{4a}S(O)-、-S(O)₂C(R⁴)₂-、-C(R⁴)₂S(O)₂-、-S(O)₂O-、-OS(O)₂-、-S(O)₂NR^{4a}-、-NR^{4a}S(O)₂-、-C(S)C(R⁴)₂-、-C(R⁴)₂C(S)-、-C(S)O-、-OC(S)-、-C(S)NR^{4a}-、または-NR^{4a}C(S)-から選択され、

W₂は-(C-W₃)_rであるか、またはW₂の任意の2つの出現は独立して-C(R⁵)=C(R⁵)-であり、

ここでW₃の各出現は独立して-(R⁵)₂または=Oであり、

rは0～3であり、

R⁴の各出現は独立して水素、ハロ、または任意に置換されるC₁₋₆脂肪族または-C(O)OR^{4c}であり、

R^{4a}の各出現は独立して水素または任意に置換されるC₁₋₆脂肪族であり、

R^{4b}の各出現は独立して水素、または任意に置換されるC₁₋₆脂肪族、-OR^{4c}、または-N(R^{4a})₂から選択される基であり、

R^{4c}の各出現は独立して水素または任意に置換されるC₁₋₆脂肪族であり、

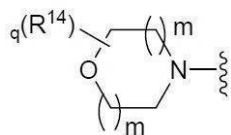
R⁵の各出現は独立して水素、ハロ、またはC₁₋₆脂肪族、-C(O)N(R^{5a})₂、3～10員の脂環式、6～10員のアリール、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリール、-N(R^{4b})₂、-OR^{4a}、または-SR^{4a}から選択される任意に置換される基であり、

R^{5a}の各出現は独立して水素または任意に置換されるC₁₋₆脂肪族であり、

HYは

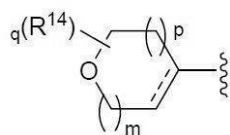
【化3-3】

【化3】



E

または



F

であり、

ここで R^{14} の各出現は独立して $-R^{14a}$ または $-T_1 - R^{14d}$ であり、ここで R^{14a} の各出現は、原子価および安定性が許容できる範囲で独立してフッ素、 $=O$ 、 $=S$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{14c}$ 、 $-N(R^{14b})_2$ 、 $-OR^{14b}$ 、 $-SR^{14c}$ 、 $-S(O)_2R^{14c}$ 、 $-C(O)R^{14b}$ 、 $-C(O)OR^{14b}$ 、 $-C(O)N(R^{14b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{14b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{14b})_2$ 、 $-N(R^{14e})C(O)R^{14b}$ 、 $-N(R^{14e})SO_2R^{14c}$ 、 $-N(R^{14e})C(O)OR^{14b}$ 、 $-N(R^{14e})C(O)N(R^{14b})_2$ 、または $-N(R^{14e})SO_2N(R^{14b})_2$ であるが、 R^{14b} の2つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒に、窒素、酸素、または硫黄から選択される0～1の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される4～7員のヘテロシクリル環を形成し、

R^{14b} の各出現は独立して水素、または $C_1 - C_6$ 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{14c} の各出現は独立して $C_1 - C_6$ 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{14d} の各出現は独立して水素、または3～10員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから任意に置換され、

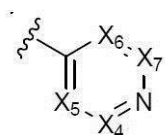
R^{14e} の各出現は独立して水素または任意に置換される $C_1 - C_6$ 脂肪族基であり、および

T_1 は任意に置換される $C_1 - C_6$ アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^{14b})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{14b})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{14b})-$ 、 $-OC(O)N(R^{14b})-$ 、 $-N(R^{14b})C(O)-$ 、 $-N(R^{14b})SO_2-$ 、 $-N(R^{14b})C(O)O-$ 、 $-NR^{14b}C(O)N(R^{14b})-$ 、 $-N(R^{14b})S(O)_2N(R^{14b})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{14b})-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_1 若しくはその部分は、任意に置換される3～7員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分を任意に形成し、または

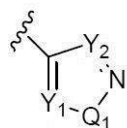
HYは以下の構造式から選択される任意に置換される基であり、

【化2-3】

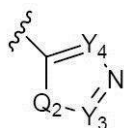
【化2】



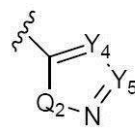
A、



B、



C、または



D

ここで X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、ただし X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 のうちの2つより多い出現が N であることはなく、 Q_1 および Q_2 の各出現は独立して S 、 O または $-NR^6$ であり、

Y_1 、 Y_2 、 Y_3 、 Y_4 、および Y_5 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、または、 X_4 および X_5 、 X_6 および X_7 、 Y_1 および Q_1 、 Y_3 および Q_2 、また

は Y_4 および Y_5 の 2 つの隣接する出現は、それらが結合される原子と一緒にあって、5 ~ 6 員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 6 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される縮合基を形成し、

ここで R^{10} は $-R^{10b}$ 、 $-V_1-R^{10c}$ 、 $-T_1-R^{10b}$ 、または $-V_1-T_1-R^{10b}$ であり、ここで

V_1 は $-NR^7$ 、 $-NR^7-C(O)-$ 、 $-NR^7-C(S)-$ 、 $-NR^7-C(NR^7)-$ 、 $-NR^7-C(O)OR^{10a}$ 、 $-NR^7-C(O)NR^7$ 、 $-NR^7-C(O)SR^{10a}$ 、 $-NR^7-C(S)OR^{10a}$ 、 $-NR^7-C(S)NR^7$ 、 $-NR^7-C(S)SR^{10a}$ 、 $-NR^7-C(NR^7)OR^{10a}$ 、 $-NR^7-C(NR^7)NR^7$ 、 $-NR^7-S(O)_2$ 、 $-NR^7-S(O)_2NR^7$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2$ 、 $-C(O)NR^7$ 、 $-C(O)NR^7O-$ 、 $-SO_2$ 、または $-SO_2NR^7$ であり、

R^{10a} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

T_1 は任意に置換される C_{1-6} アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^7)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^7)-$ 、 $-S(O)_2N(R^7)-$ 、 $-OC(O)N(R^7)-$ 、 $-N(R^7)C(O)-$ 、 $-N(R^7)SO_2-$ 、 $-N(R^{10a})C(O)O-$ 、 $-NR^{10a}C(O)N(R^{10a})-$ 、 $-N(R^{10a})S(O)_2N(R^{10a})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^7)-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_1 は任意に置換される 3 ~ 7 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分形成し、

R^{10b} の各出現は独立して水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^7)_2$ 、 $-OR^{10a}$ 、 $-SR^{10a}$ 、 $-S(O)_2R^{10a}$ 、 $-C(O)R^{10a}$ 、 $-C(O)OR^{10a}$ 、 $-C(O)N(R^7)_2$ 、 $-S(O)_2N(R^7)_2$ 、 $-OC(O)N(R^7)_2$ 、 $-N(R^7)C(O)R^{10a}$ 、 $-N(R^7)SO_2R^{10a}$ 、 $-N(R^7)C(O)OR^{10a}$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^7)_2$ 、または $-N(R^7)SO_2N(R^7)_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{10c} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、または

R^7 および R^{10c} は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される 0 ~ 1 の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環を形成し、

R^7 の各出現は独立して水素、 $-C(O)R^{7a}$ 、 $-CO_2R^{7a}$ 、 $-C(O)N(R^{7a})_2$ 、 $-C(O)N(R^{7a})-OR^{7a}$ 、 $-SO_2R^{7a}$ 、 $-SO_2N(R^{7a})_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

ここで R^{7a} の各出現は独立して水素または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員

のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{6a} の各出現は独立して水素、 $-C(O)R^{6a}$ 、 $-CO_2R^{6a}$ 、 $-C(O)N(R^{6b})_2$ 、 $-SO_2R^{6a}$ 、 $-SO_2N(R^{6b})_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

ここで R^{6a} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{6b} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、または R^{6b} の2つの出現はそれらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する3～6員のヘテロシクリル、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基を形成し、

q は0～6であり、

m は1または2であり、および

p は0、1、または2である、化合物または薬剤的に許容される塩。

【請求項2】

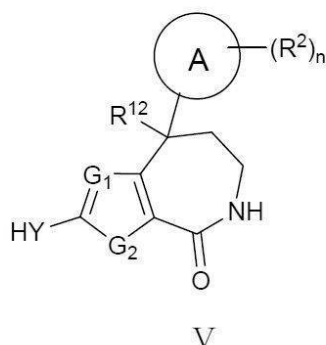
G_2 はSであり、 G_1 はNであり、HYはモルホリノであり、 W_1 は $-C(=O)NH-$ であり、 W_2 は $-(CH_2)_2-$ であり、 R^{12} はHであり、環Aは任意に置換される6～10員のアリールであり、 n は1であり、 R^2 は任意に置換されるフェニルまたは5～6員のヘテロアリールである、請求項1に記載の式I-Aの化合物。

【請求項3】

以下に示す構造式Vを有する、請求項1に記載の化合物：

【化34-1】

【化34】



または薬剤的に許容される塩。

【請求項4】

G_2 はSであり、 G_1 はNであり、HYはモルホリノであり、 R^{12} はHであり、環Aは任意に置換される6～10員のアリールであり、 n は1であり、 R^2 は任意に置換され

るフェニルまたは 5 ～ 6 員のヘテロアリールである、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

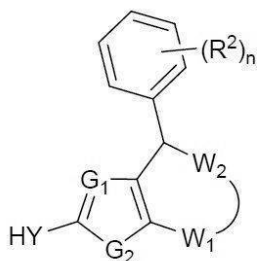
環 A は 10 員のアリールである、請求項 2 または 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

以下に示す構造式 I V を有する、請求項 1 に記載の化合物：

【化 10 - 3】

【化 10】



I V。

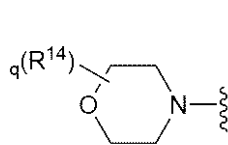
または薬剂的に許容される塩。

【請求項 7】

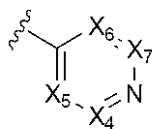
請求項 1、3 または 6 のいずれかに記載の化合物であって、HY は以下に示す構造式から選択され、

【化 11 - 3】

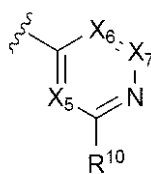
【化 11】



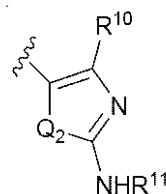
J、



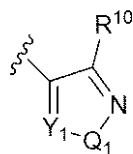
A、



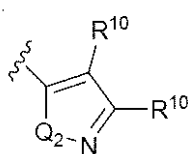
H、



K、



L、または M



式中 X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、ただし X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 のうちの 2 つより多い出現が N であることはなく、

Q_1 および Q_2 の各出現は独立して S、O または $-NR^6$ であり、

Y_1 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、

または X_6 および X_7 、または Y_1 および Q_1 の 2 つの隣接する出現は、それらが結合される原子と一緒にあって、5 ～ 6 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 5 ～ 6 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される縮合基を形成し、

R^{14} の各出現は独立して任意に置換される C_{1-6} 脂肪族基である、化合物。

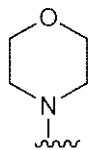
【請求項 8】

請求項 1、3、6 または 7 のいずれかに記載の化合物であって、HY は以下に示す構造

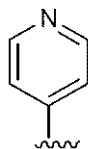
式から選択され、

【化 1 2 - 3】

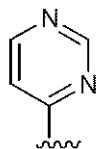
【化 1 2】



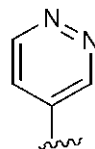
i v、



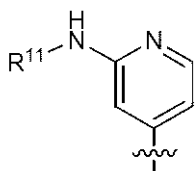
i、



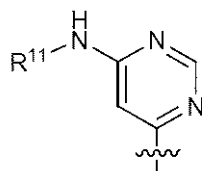
i i、



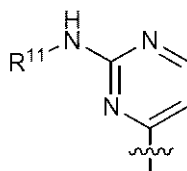
i i i、



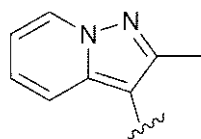
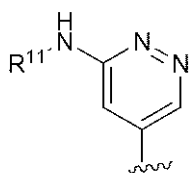
v、



v i、



v i i、



v i i i または i x

各 H Y 基は R^{10} または R^{14} の 1 つまたは複数の出現で、任意に、さらに置換される、化合物。

【請求項 9】

G_1 は N である、請求項 1 ~ 8 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 10】

請求項 1 または 3 のいずれかに記載の化合物であって、環 A はフェニル基であり、 R^2 の各出現は独立してハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 $-CN$ 、 C_{1-3} ハロアルキル、 $-OC_{1-3}$ アルキル、 $-OC_{1-3}$ ハロアルキル、 $-NHC(O)C_{1-3}$ アルキル、 $-NHC(O)NHC_{1-3}$ アルキル、 $-NHS(O)_2C_{1-3}$ アルキル、または $-C(O)H$ であり、 n は 0 ~ 3 である、化合物。

【請求項 11】

請求項 10 に記載の化合物であって、 R^2 の各出現は独立してハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 $-CN$ 、 C_{1-3} ハロアルキル、 $-OC_{1-3}$ アルキル、 $-OC_{1-3}$ ハロアルキル、 $-NHC(O)C_{1-3}$ アルキル、 $-NHC(O)NHC_{1-3}$ アルキル、 $-NHS(O)_2C_{1-3}$ アルキル、または $-C(O)H$ であり、 n は 0 ~ 3 である、化合物。

【請求項 12】

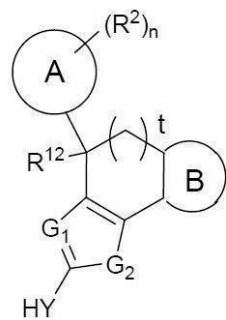
R^2 はハロゲンであり、および n は 1 または 2 である、請求項 10 または 11 に記載の化合物。

【請求項 13】

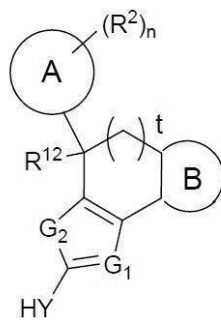
構造式 V I - A または V I - B に示す化合物

【化 16 - 3】

【化 16】



VI-A



VI-B

または薬剂的に許容される塩であり、式中

G_1 は N または CR^1 であり、ここで R^1 は H、 $-CN$ 、ハロゲン、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、または $-Z-R^{11}$ から選択される任意に置換される基であり、ここで

Z は任意に置換される C_{1-3} アルキレン鎖、 $-O-$ 、 $-N(R^{1a})-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(O)NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})C(O)-$ 、 $-N(R^{1a})CO_2-$ 、 $-S(O)_2NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})S(O)_2-$ 、 $-OC(O)N(R^{1a})-$ 、 $-N(R^{1a})C(O)NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})S(O)_2N(R^{1a})-$ 、または $-OC(O)-$ であり、

R^{1a} は水素または任意に置換される C_{1-4} 脂肪族であり、および

R^{11} は水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、および

G_2 は S、O、または NR^3 であり、ここで R^3 は水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族であり、

環 A は 6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

環 B は窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 のヘテロ原子を有する 5 または 6 員のヘテロシクリル、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 のヘテロ原子を有する 5 または 6 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、ただし環 B には酸素または硫黄の出現が 1 つよりおおくることはなく、

t は 1 ~ 3 であり、

R^2 の各出現は独立して $-R^{12a}$ 、 $-T_2-R^{12d}$ 、または $-V_2-T_2-R^{12d}$ であり、および

R^{12a} の各出現は独立してハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{12c}$ 、 $-N(R^{12b})_2$ 、 $-OR^{12b}$ 、 $-SR^{12c}$ 、 $-S(O)_2R^{12c}$ 、 $-C(O)R^{12b}$ 、 $-C(O)OR^{12b}$ 、 $-C(O)N(R^{12b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{12b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{12b})_2$ 、 $-N(R^{12e})C(O)R^{12b}$ 、 $-N(R^{12e})SO_2R^{12c}$ 、 $-N(R^{12e})C(O)OR^{12b}$ 、 $-N(R^{12e})C(O)N(R^{12b})_2$ 、または $-N(R^{12e})SO_2N(R^{12b})_2$ であり、または R^{12b} の

2つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から選択される0～1の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される4～7員のヘテロシクリル環を形成し、

R^{12b} の各出現は独立して水素、または $C_1 - C_6$ 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{12c} の各出現は独立して $C_1 - C_6$ 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{12d} の各出現は独立して水素、または3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから任意に置換され、

R^{12e} の各出現は独立して水素または任意に置換される $C_1 - C_6$ 脂肪族基であり、 V_2 の各出現は独立して $-N(R^{12e})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{12e})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{12e})-$ 、 $-OC(O)N(R^{12e})-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)-$ 、 $-N(R^{12e})SO_2-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)O-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)N(R^{12e})-$ 、 $-N(R^{12e})SO_2N(R^{12e})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{12e})-O-$ であり、および

T_2 は任意に置換される $C_1 - C_6$ アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^{13})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{13})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{13})-$ 、 $-OC(O)N(R^{13})-$ 、 $-N(R^{13})C(O)-$ 、 $-N(R^{13})SO_2-$ 、 $-N(R^{13})C(O)O-$ 、 $-N(R^{13})C(O)N(R^{13})-$ 、 $-N(R^{13})S(O)_2N(R^{13})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{13})-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_2 若しくはその部分は、任意に置換される3～7員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分を任意に形成し、ここで R^{13} は水素または任意に置換される $C_1 - C_4$ 脂肪族基であり、

n は0～4であり、

R^{12} は水素、ハロ、または $C_1 - C_6$ 脂肪族、 $-C(O)N(R^{5a})_2$ 、3～10員の脂環式、 $-N(R^{4b})_2$ 、 $-OR^{4a}$ 、または $-SR^{4a}$ から選択される任意に置換される基であり、

または R^{2} および R^{12} は任意に置換される3～10員の脂環式を形成し、

R^{4a} の各出現は独立して水素または任意に置換される $C_1 - C_6$ 脂肪族であり、

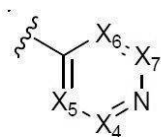
R^{4b} の各出現は独立して水素、または任意に置換される $C_1 - C_6$ 脂肪族、 $-OR^{4c}$ 、または $-N(R^{4a})_2$ から選択される基であり、

R^{4c} の各出現は独立して水素または任意に置換される $C_1 - C_6$ 脂肪族であり、

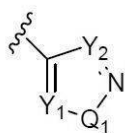
HY は以下に示す構造式から選択される任意に置換される基であり、

【化 17 - 3】

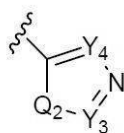
【化 17】



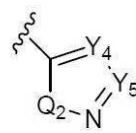
A、



B、



C、または



D

ここで X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、ただし X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 のうちの 2 つより多い出現が N であることはなく、 Q_1 および Q_2 の各出現は独立して S、O または $-NR^6$ であり、

Y_1 、 Y_2 、 Y_3 、 Y_4 、および Y_5 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、または X_4 および X_5 、 X_6 および X_7 、 Y_1 および Q_1 、 Y_3 および Q_2 、または Y_4 および Y_5 の 2 つの隣接する出現は、それらが結合する原子と一緒にあって、5～6 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1～5 のヘテロ原子を有する 5～6 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される縮合基を形成し、

ここで R^{10} は $-R^{10b}$ 、 $-V_1-R^{10c}$ 、 $-T_1-R^{10b}$ 、または $-V_1-T_1-R^{10b}$ であり、ここで

V_1 は $-NR^7$ 、 $-NR^7-C(O)-$ 、 $-NR^7-C(S)-$ 、 $-NR^7-C(NR^7)-$ 、 $-NR^7C(O)OR^{10a}$ 、 $-NR^7C(O)NR^7$ 、 $-NR^7C(O)SR^{10a}$ 、 $-NR^7C(S)OR^{10a}$ 、 $-NR^7C(S)NR^7$ 、 $-NR^7C(S)SR^{10a}$ 、 $-NR^7C(NR^7)OR^{10a}$ 、 $-NR^7C(NR^7)NR^7$ 、 $-NR^7S(O)_2$ 、 $-NR^7S(O)_2NR^7$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2$ 、 $-C(O)NR^7$ 、 $-C(O)NR^7O-$ 、 $-SO_2$ 、または $-SO_2NR^7$ であり、

R^{10a} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3～10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1～5 のヘテロ原子を有する 4～10 員のヘテロシクリル、6～10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1～5 のヘテロ原子を有する 5～10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

T_1 は任意に置換される C_{1-6} アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^7)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^7)-$ 、 $-S(O)_2N(R^7)-$ 、 $-OC(O)N(R^7)-$ 、 $-N(R^7)C(O)-$ 、 $-N(R^7)SO_2-$ 、 $-N(R^{10a})C(O)O-$ 、 $-NR^{10a}C(O)N(R^{10a})-$ 、 $-N(R^{10a})S(O)_2N(R^{10a})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^7)-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_1 は任意に置換される 3～7 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分形成し、

R^{10b} の各出現は独立して水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^7)_2$ 、 $-OR^{10a}$ 、 $-SR^{10a}$ 、 $-S(O)_2R^{10a}$ 、 $-C(O)R^{10a}$ 、 $-C(O)OR^{10a}$ 、 $-C(O)N(R^7)_2$ 、 $-S(O)_2N(R^7)_2$ 、 $-OC(O)N(R^7)_2$ 、 $-N(R^7)C(O)R^{10a}$ 、 $-N(R^7)SO_2R^{10a}$ 、 $-N(R^7)C(O)OR^{10a}$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^7)_2$ 、または $-N(R^7)SO_2N(R^7)_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3～10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1～5 のヘテロ原子を有する 4～10 員のヘテロシクリル、6～10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1～5 のヘテロ原子を有する 5～10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{10c} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、または

R^7 および R^{10c} はそれらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される0～1の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される4～7員のヘテロシクリル環を形成し、

R^7 の各出現は独立して水素、 $-C(O)R^{7a}$ 、 $-CO_2R^{7a}$ 、 $-C(O)N(R^{7a})_2$ 、 $-C(O)N(R^{7a})-OR^{7a}$ 、 $-SO_2R^{7a}$ 、 $-SO_2N(R^{7a})_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

ここで R^{7a} の各出現は独立して水素または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^6 の各出現は独立して水素、 $-C(O)R^{6a}$ 、 $-CO_2R^{6a}$ 、 $-C(O)N(R^{6b})_2$ 、 $-SO_2R^{6a}$ 、 $-SO_2N(R^{6b})_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

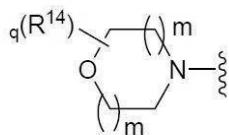
ここで R^{6a} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{6b} の各出現は水素または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であるか、または R^{6b} の2つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する3～6員のヘテロシクリル、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基を形成し、

または H Y は

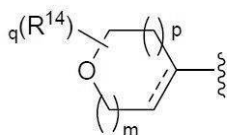
【化18-3】

【化18】



E

または



F

であり、

ここで R^{14} の各出現は独立して $-R^{14a}$ または $-T_1 - R^{14d}$ であり、ここで R^{14a} の各出現は、原子価および安定性が許容できる範囲で独立してフッ素、 $=O$ 、 $=S$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{14c}$ 、 $-N(R^{14b})_2$ 、 $-OR^{14b}$ 、 $-SR^{14c}$ 、 $-S(O)_2 R^{14c}$ 、 $-C(O)R^{14b}$ 、 $-C(O)OR^{14b}$ 、 $-C(O)N(R^{14b})_2$ 、 $-S(O)_2 N(R^{14b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{14b})_2$ 、 $-N(R^{14e})C(O)R^{14b}$ 、 $-N(R^{14e})SO_2 R^{14c}$ 、 $-N(R^{14e})C(O)OR^{14b}$ 、 $-N(R^{14e})C(O)N(R^{14b})_2$ 、または $-N(R^{14e})SO_2 N(R^{14b})_2$ であるか、または R^{14b} の2つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から選択される0～1の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される4～7員のヘテロシクリル環を形成し、

R^{14b} の各出現は独立して水素、または $C_1 - C_6$ 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{14c} の各出現は独立して $C_1 - C_6$ 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{14d} の各出現は独立して水素、または3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから任意に置換され、

R^{14e} の各出現は独立して水素または任意に置換される $C_1 - C_6$ 脂肪族基であり、および

T_1 は任意に置換される $C_1 - C_6$ アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^{14b})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{14b})-$ 、 $-S(O)_2 N(R^{14b})-$ 、 $-OC(O)N(R^{14b})-$ 、 $-N(R^{14b})C(O)-$ 、 $-N(R^{14b})SO_2-$ 、 $-N(R^{14b})C(O)O-$ 、 $-NR^{14b}C(O)N(R^{14b})-$ 、 $-N(R^{14b})S(O)_2 N(R^{14b})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{14b})-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_1 若しくはその部分は、任意に置換される3～7員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分を任意に形成し、

q は0～6であり、

m は1または2であり、および

p は0、1、または2である、

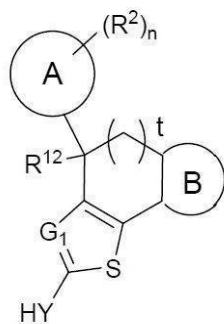
化合物または薬剂的に許容される塩。

【請求項14】

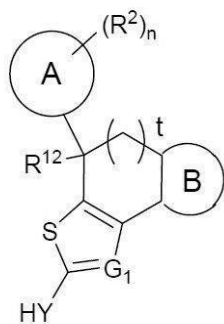
構造式 $VII - A$ または $VII - B$ に示す化合物

【化 19 - 3】

【化 19】



VII-A



VII-B

または薬剂的に許容される塩であって、式中

G_1 は N または CR^1 であり、ここで R^1 は H、 $-CN$ 、ハロゲン、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、または $-Z-R^{11}$ であり、ここで

Z は任意に置換される C_{1-3} アルキレン鎖、 $-O-$ 、 $-N(R^{1a})-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(O)NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})C(O)-$ 、 $-N(R^{1a})CO_2-$ 、 $-S(O)_2NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})S(O)_2-$ 、 $-OC(O)N(R^{1a})-$ 、 $-N(R^{1a})C(O)NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})S(O)_2N(R^{1a})-$ 、または $-OC(O)-$ から選択され、

R^{1a} は水素または任意に置換される C_{1-4} 脂肪族であり、および

R^{11} は水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、および

環 A は 6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

環 B は窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 のヘテロ原子を有する 5 または 6 員のヘテロシクリルまたは窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 のヘテロ原子を有する 5 または 6 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、ただし環 B には酸素または硫黄の出現が 1 つより多くなることはなく、

t は 1 ~ 3 であり、

R^2 の各出現は独立して $-R^{12}$ 、 $-T_2-R^{12d}$ 、または $-V_2-T_2-R^{12d}$ であり、および

R^{12a} の各出現は独立してハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{12c}$ 、 $-N(R^{12b})_2$ 、 $-OR^{12b}$ 、 $-SR^{12c}$ 、 $-S(O)_2R^{12c}$ 、 $-C(O)R^{12b}$ 、 $-C(O)OR^{12b}$ 、 $-C(O)N(R^{12b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{12b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{12b})_2$ 、 $-N(R^{12e})C(O)R^{12b}$ 、 $-N(R^{12e})SO_2R^{12c}$ 、 $-N(R^{12e})C(O)OR^{12b}$ 、 $-N(R^{12e})C(O)N(R^{12b})_2$ 、または $-N(R^{12e})SO_2N(R^{12b})_2$ であり、または R^{12b} の 2 つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒に、窒素、酸素、若しくは硫黄から選択される 0 ~ 1 の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環を形成し、

R^{12b} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立

して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{12c} の各出現は独立して $C_1 - 6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{12d} の各出現は独立して水素、または 3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから任意に置換され、

R^{12e} の各出現は独立して水素または任意に置換される $C_1 - 6$ 脂肪族基であり、

V_2 の各出現は独立して $-N(R^{12e})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{12e})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{12e})-$ 、 $-OC(O)N(R^{12e})-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)-$ 、 $-N(R^{12e})SO_2-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)O-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)N(R^{12e})-$ 、 $-N(R^{12e})SO_2N(R^{12e})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{12e})-O-$ であり、および

T_2 は任意に置換される $C_1 - C_6$ アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^{13})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{13})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{13})-$ 、 $-OC(O)N(R^{13})-$ 、 $-N(R^{13})C(O)-$ 、 $-N(R^{13})SO_2-$ 、 $-N(R^{13})C(O)O-$ 、 $-N(R^{13})C(O)N(R^{13})-$ 、 $-N(R^{13})S(O)_2N(R^{13})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{13})-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_2 若しくはその部分は任意に置換される 3 ~ 7 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分の部分を任意に形成し、ここで R^{13} は水素または任意に置換される $C_1 - 4$ 脂肪族基であり、

n は 0 ~ 4 であり、

R^{12} は水素、ハロまたは $C_1 - 6$ 脂肪族、 $-C(O)N(R^{5a})_2$ 、3 ~ 10 員の脂環式、 $-N(R^{4b})_2$ 、 $-OR^{4a}$ 、または $-SR^{4a}$ であり、

または R^2 および R^{12} は任意に置換される 3 ~ 10 員の脂環式を形成し、

R^{4a} の各出現は独立して水素または任意に置換される $C_1 - 6$ 脂肪族であり、

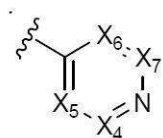
R^{4b} の各出現は独立して水素、または任意に置換される $-OR^{4c}$ 、または $-N(R^{4a})_2$ から選択される基であり、

R^{4c} の各出現は独立して水素または任意に置換される $C_1 - 6$ 脂肪族であり、

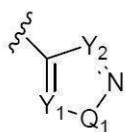
HY は以下に示す構造式から選択される任意に置換される基であり、

【化 20 - 3】

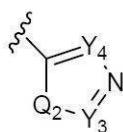
【化 20】



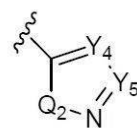
A、



B、



C、



D

ここで X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、ただし、 X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 のうちの 2 つより多い出現が N であることはなく、

Q_1 および Q_2 の各出現は独立して S 、 O または $-NR^6$ であり、

Y_1 、 Y_2 、 Y_3 、 Y_4 、および Y_5 の各出現は独立して $-CR^{10}$ またはNであり、
 または X_4 および X_5 、 X_6 および X_7 、 Y_1 および Q_1 、 Y_3 および Q_2 、または
 Y_4 および Y_5 の2つの隣接する出現は、それらが結合する原子と一緒にあって、5～6
 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ
 原子を有する5～6員のヘテロアリールから選択される任意に置換される縮合基を形成し
 、

ここで R^{10} は $-R^{10b}$ 、 $-V_1-R^{10c}$ 、 $-T_1-R^{10b}$ 、または $-V_1-T_1-R^{10b}$ であり、ここで

V_1 は $-NR^7$ 、 $-NR^7-C(O)-$ 、 $-NR^7-C(S)-$ 、 $-NR^7-C(NR^7)-$ 、 $-NR^7C(O)OR^{10a}$ 、 $-NR^7C(O)NR^7$ 、 $-NR^7C(O)SR^{10a}$ 、 $-NR^7C(S)OR^{10a}$ 、 $-NR^7C(S)NR^7$ 、 $-NR^7C(S)SR^{10a}$ 、 $-NR^7C(NR^7)OR^{10a}$ 、 $-NR^7C(NR^7)NR^7$ 、 $-NR^7S(O)_2$ 、 $-NR^7S(O)_2NR^7$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2$ 、 $-C(O)NR^7$ 、 $-C(O)NR^7O-$ 、 $-SO_2$ 、または $-SO_2NR^7$ であり、

R^{10a} の各出現は独立して水素、または C_1-6 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

T_1 は任意に置換される C_1-C_6 アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^7)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^7)-$ 、 $-S(O)_2N(R^7)-$ 、 $-OC(O)N(R^7)-$ 、 $-N(R^7)C(O)-$ 、 $-N(R^7)SO_2-$ 、 $-N(R^{10a})C(O)O-$ 、 $-NR^{10a}C(O)N(R^{10a})-$ 、 $-N(R^{10a})S(O)_2N(R^{10a})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^7)-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_1 は任意に置換される3～7員の脂環式またはヘテロシクリル環を形成し、

R^{10b} の各出現は独立して水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^7)_2$ 、 $-OR^{10a}$ 、 $-SR^{10a}$ 、 $-S(O)_2R^{10a}$ 、 $-C(O)R^{10a}$ 、 $-C(O)OR^{10a}$ 、 $-C(O)N(R^7)_2$ 、 $-S(O)_2N(R^7)_2$ 、 $-OC(O)N(R^7)_2$ 、 $-N(R^7)C(O)R^{10a}$ 、 $-N(R^7)SO_2R^{10a}$ 、 $-N(R^7)C(O)OR^{10a}$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^7)_2$ 、または $-N(R^7)SO_2N(R^7)_2$ 、または C_1-6 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{10c} の各出現は独立して水素、または C_1-6 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、または

R^7 および R^{10c} は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される0～1のヘテロ原子を有する任意に置換される4～7員のヘテロシクリル環を形成し、

R^7 の各出現は独立して水素、 $-C(O)R^7a$ 、 $-CO_2R^7a$ 、 $-C(O)N(R^7a)_2$ 、 $-C(O)N(R^7a)-OR^7a$ 、 $-SO_2R^7a$ 、 $-SO_2N(R^7a)_2$ 、または C_1-6 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

ここで R^{7a} の各出現は独立して水素、または $C_1 - 6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{6a} の各出現は独立して水素、 $-C(O)R^{6a}$ 、 $-CO_2R^{6a}$ 、 $-C(O)N(R^{6b})_2$ 、 $-SO_2R^{6a}$ 、 $-SO_2N(R^{6b})_2$ 、または $C_1 - 6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

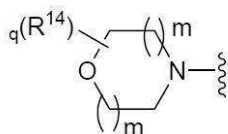
ここで R^{6a} の各出現は独立して水素、または $C_1 - 6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{6b} の各出現は独立して水素、または $C_1 - 6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であるか、または R^{6b} の 2 つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 3 ~ 6 員のヘテロシクリル、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基を形成し、

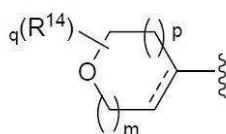
または HY は

【化 2 1 - 3】

【化 2 1】



E または



F

であり、

R^{14} の各出現は独立して $-R^{14a}$ または $-T_1 - R^{14d}$ であり、ここで

R^{14a} の各出現は、原子価および安定性が許容できる範囲で独立してフッ素、 $=O$ 、 $=S$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{14c}$ 、 $-N(R^{14b})_2$ 、 $-OR^{14b}$ 、 $-SR^{14c}$ 、 $-S(O)_2R^{14c}$ 、 $-C(O)R^{14b}$ 、 $-C(O)OR^{14b}$ 、 $-C(O)N(R^{14b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{14b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{14b})_2$ 、 $-N(R^{14e})C(O)R^{14b}$ 、 $-N(R^{14e})SO_2R^{14c}$ 、 $-N(R^{14e})C(O)OR^{14b}$ 、 $-N(R^{14e})C(O)N(R^{14b})_2$ 、または $-N(R^{14e})SO_2N(R^{14b})_2$ であるか、または R^{14a} の 2 つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から選択される 0 ~ 1 の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環を形成し、

R^{14b} の各出現は、独立して水素、または $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択され

る任意に置換される基であり、

R^{14c} の各出現は、独立して $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{14d} の各出現は、独立して水素、または 3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから任意に置換され、

R^{14e} の各出現は、独立して水素または任意に置換される $C_1 - C_6$ 脂肪族基であり、および

T_1 は任意に置換される $C_1 - C_6$ アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、
 $-N(R^{14b})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{14b})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{14b})-$ 、 $-OC(O)N(R^{14b})-$ 、 $-N(R^{14b})C(O)-$ 、 $-N(R^{14b})SO_2-$ 、 $-N(R^{14b})C(O)O-$ 、 $-NR^{14b}C(O)N(R^{14b})-$ 、 $-N(R^{14b})S(O)_2N(R^{14b})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{14b})-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_1 若しくはその部分は、任意に置換される 3 ~ 7 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分を任意に形成し、

q は 0 ~ 6 であり、

m は 1 または 2 であり、および

p は 0、1、または 2 である、

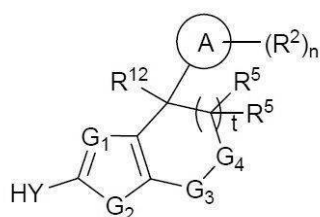
化合物または薬剤的に許容される塩。

【請求項 15】

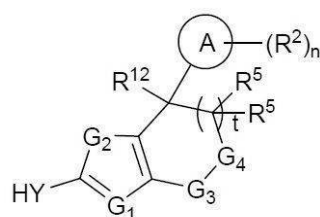
構造式 V I I I - A または V I I I - B を有する化合物

【化 24 - 3】

【化 24】



または



V I I I - A

V I I I - B

または薬剤的に許容される塩であり、式中

G_1 は N または CR^1 であり、ここで R^1 は H、 $-CN$ 、ハロゲン、または $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、または $-Z-R^{11}$ であり、ここで

Z は任意に置換される $C_1 - C_3$ アルキレン鎖、 $-O-$ 、 $-N(R^{1a})-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(O)NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})C(O)-$ 、 $-N(R^{1a})CO_2-$ 、 $-S(O)_2NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})S(O)_2-$ 、 $-OC(O)N(R^{1a})-$ 、 $-N(R^{1a})C(O)NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})S(O)_2N(R^{1a})-$ 、または $-OC(O)-$ から選択され、

R^{1a} は水素または任意に置換される $C_1 - C_4$ 脂肪族であり、および

R^{11} は水素、または $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基で

あり、および

G_2 は S、S e、O、または NR^3 であり、ここで R^3 は水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族であり、

G_3 は $C=O$ または SO_2 であり、

G_4 は NR^{4a} または O であり、ここで R^{4a} は水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族であり、

環 A は 6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^2 の各出現は独立して $-R^{12a}$ 、 $-T_2-R^{12d}$ 、または $-V_2-T_2-R^{12d}$ であり、および

R^{12a} の各出現は独立してハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{12c}$ 、 $-N(R^{12b})_2$ 、 $-OR^{12b}$ 、 $-SR^{12c}$ 、 $-S(O)_2R^{12c}$ 、 $-C(O)R^{12b}$ 、 $-C(O)OR^{12b}$ 、 $-C(O)N(R^{12b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{12b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{12b})_2$ 、 $-N(R^{12e})C(O)R^{12b}$ 、 $-N(R^{12e})SO_2R^{12c}$ 、 $-N(R^{12e})C(O)OR^{12b}$ 、 $-N(R^{12e})C(O)N(R^{12b})_2$ 、または $-N(R^{12e})SO_2N(R^{12b})_2$ であるか、または R^{12b} の 2 つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から選択される 0 ~ 1 の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環を形成し、

R^{12b} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{12c} の各出現は独立して C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{12d} の各出現は独立して水素、または 3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから任意に置換され、

R^{12e} の各出現は独立して水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族基であり、

V_2 の各出現は独立して $-N(R^{12e})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{12e})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{12e})-$ 、 $-OC(O)N(R^{12e})-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)-$ 、 $-N(R^{12e})SO_2-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)O-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)N(R^{12e})-$ 、 $-N(R^{12e})SO_2N(R^{12e})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{12e})-O-$ であり、および

T_2 は任意に置換される C_{1-6} アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^{13})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{13})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{13})-$ 、 $-OC(O)N(R^{13})-$ 、 $-N(R^{13})C(O)-$ 、 $-N(R^{13})SO_2-$ 、 $-N(R^{13})C(O)O-$ 、 $-N(R^{13})C(O)N(R^{13})-$ 、 $-N(R^{13})S(O)_2N(R^{13})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{13})-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_2 若しくはその部分は任意に置換される 3 ~ 7 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分形成し、ここで R^{13} は水素または任意に置換される C_{1-4} 脂肪族基であり、

n は 0 ~ 4 であり、

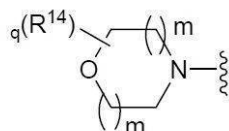
R^{12} は水素、ハロ、または C_{1-6} 脂肪族、 $-C(O)N(R^{5a})_2$ 、3 ~ 10 員の脂環式、 $-N(R^{4b})_2$ 、 $-OR^{4a}$ 、または $-SR^{4a}$ から選択される任意に置換される基であり、

または R^2 および R^{12} は任意に置換される 3 ~ 10 員の脂環式を形成し、

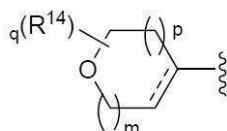
HY は

【化 2 6 - 3】

【化 2 6】



E



F

■

であり、

R^{14} の各出現は独立して $-R^{14a}$ または $-T_1-R^{14d}$ であり、ここで

R^{14a} の各出現は、原子価および安定性が許容できる範囲で独立してフッ素、 $=O$ 、 $=S$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{14c}$ 、 $-N(R^{14b})_2$ 、 $-OR^{14b}$ 、 $-SR^{14c}$ 、 $-S(O)_2R^{14c}$ 、 $-C(O)R^{14b}$ 、 $-C(O)OR^{14b}$ 、 $-C(O)N(R^{14b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{14b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{14b})_2$ 、 $-N(R^{14e})C(O)R^{14b}$ 、 $-N(R^{14e})SO_2R^{14c}$ 、 $-N(R^{14e})C(O)OR^{14b}$ 、 $-N(R^{14e})C(O)N(R^{14b})_2$ 、または $-N(R^{14e})SO_2N(R^{14b})_2$ であるか、または R^{14b} の 2 つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から選択される 0 ~ 1 の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環を形成し、

R^{14b} の各出現は、独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{14c} の各出現は、独立して C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{14d} の各出現は、独立して水素、または 3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから任意に置換され、

R^{14e} の各出現は、独立して水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族基であり、および

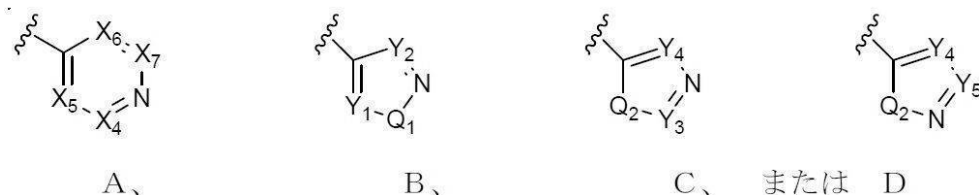
T_1 は、任意に置換される C_{1-6} アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^{14b})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{14b})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{14b})-$ 、 $-OC(O)N(R^{14b})-$ 、 $-N(R^{14b})C(O)-$ 、 $-N(R^{14b})SO_2-$ 、 $-N(R^{14b})C(O)O-$ 、 $-NR^{14b}C(O)N(R^{14b})-$ 、 $-N(R^{14b})S(O)_2N(R^{14b})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{14b})-O$

- によって任意に割り込まれ、または T_1 若しくはその部分は任意に置換される 3 ~ 7 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分を任意に形成し、
または

H Y は以下に示す構造式から選択される任意に置換される基であり、

【化 2 5 - 3】

【化 2 5】



ここで X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、
ただし X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 のうちの 2 つより多い出現が N であることはなく、

Q_1 および Q_2 の各出現は独立して S、O または $-NR^6$ であり、

Y_1 、 Y_2 、 Y_3 、 Y_4 、および Y_5 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、

または X_4 および X_5 、 X_6 および X_7 、 Y_1 および Q_1 、 Y_3 および Q_2 、または
 Y_4 および Y_5 の 2 つの隣接する出現は、それらが結合する原子と一緒にあって、5 ~ 6
員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ
原子を有する 5 ~ 6 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される縮合基を形成し

、
 R^{10} は $-R^{10b}$ 、 $-V_1 - R^{10c}$ 、 $-T_1 - R^{10b}$ 、または $-V_1 - T_1 - R^{10b}$ であり、ここで

V_1 は $-NR^7$ 、 $-NR^7 - C(O)$ 、 $-NR^7 - C(S)$ 、 $-NR^7 - C(NR^7)$ 、 $-NR^7 C(O)OR^{10a}$ 、 $-NR^7 C(O)NR^7$ 、 $-NR^7 C(O)SR^{10a}$ 、 $-NR^7 C(S)OR^{10a}$ 、 $-NR^7 C(S)NR^7$ 、 $-NR^7 C(S)SR^{10a}$ 、 $-NR^7 C(NR^7)OR^{10a}$ 、 $-NR^7 C(NR^7)NR^7$ 、 $-NR^7 S(O)_2$ 、 $-NR^7 S(O)_2 NR^7$ 、 $-C(O)$ 、 $-CO_2$ 、 $-C(O)NR^7$ 、 $-C(O)NR^7 O$ 、 $-SO_2$ 、または $-SO_2 NR^7$ であり、

R^{10a} の各出現は独立して水素、または $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒
素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員
のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立し
て選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任
意に置換される基であり、

T_1 は任意に置換される $C_1 - C_6$ アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、
 $-N(R^7)$ 、 $-O$ 、 $-S$ 、 $-S(O)$ 、 $-S(O)_2$ 、 $-C(O)$ 、 $-C(O)O$ 、 $-C(O)N(R^7)$ 、 $-S(O)_2 N(R^7)$ 、 $-OC(O)N(R^7)$ 、 $-N(R^7)C(O)$ 、 $-N(R^7)SO_2$ 、 $-N(R^{10a})C(O)O$ 、 $-NR^{10a}C(O)N(R^{10a})$ 、 $-N(R^{10a})S(O)_2 N(R^{10a})$ 、 $-OC(O)$ 、または $-C(O)N(R^7) - O$ によって任意に割り込まれ、ま
たは T_1 は任意に置換される 3 ~ 7 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分を形成し、

R^{10b} の各出現は独立して水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^7)_2$ 、
 $-OR^{10a}$ 、 $-SR^{10a}$ 、 $-S(O)_2 R^{10a}$ 、 $-C(O)R^{10a}$ 、 $-C(O)OR^{10a}$ 、 $-C(O)N(R^7)_2$ 、 $-S(O)_2 N(R^7)_2$ 、 $-OC(O)N(R^7)_2$ 、 $-N(R^7)C(O)R^{10a}$ 、 $-N(R^7)SO_2 R^{10a}$ 、 $-N(R^7)C(O)OR^{10a}$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^7)_2$ 、または $-N(R^7)SO_2 N(R^7)_2$ 、または $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から

独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{10c} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、または

R^7 および R^{10c} は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 0 ~ 1 の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環を形成し、

R^7 の各出現は独立して水素、 $-C(O)R^{7a}$ 、 $-CO_2R^{7a}$ 、 $-C(O)N(R^{7a})_2$ 、 $-C(O)N(R^{7a})-OR^{7a}$ 、 $-SO_2R^{7a}$ 、 $-SO_2N(R^{7a})_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

ここで R^{7a} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^6 の各出現は独立して水素、 $-C(O)R^{6a}$ 、 $-CO_2R^{6a}$ 、 $-C(O)N(R^{6b})_2$ 、 $-SO_2R^{6a}$ 、 $-SO_2N(R^{6b})_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

ここで R^{6a} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、および

R^{6b} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であるか、または R^{6b} の 2 つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 3 ~ 6 員のヘテロシクリル、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基を形成し、

q は 0 ~ 6 であり、

m は 1 または 2 であり、

p は 0、1、または 2 であり、

t は 1 または 2 であり、

R^5 の各出現は、独立して $-R^{15a}$ または $-T_5-R^{15d}$ であり、ここで

R^{15a} の各出現は、原子価および安定性が許容できる範囲で独立して水素、フッ素、 $=O$ 、 $=S$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{15c}$ 、 $-N(R^{15b})_2$ 、 $-OR^{15b}$ 、 $-SR^{15c}$ 、 $-S(O)_2R^{15c}$ 、 $-C(O)R^{15b}$ 、 $-C(O)OR^{15b}$ 、 $-C$

(O)N(R^{1 5 b})₂、-S(O)₂N(R^{1 5 b})₂、-OC(O)N(R^{1 5 b})₂、-N(R^{1 5 e})C(O)R^{1 5 b}、-N(R^{1 5 e})SO₂R^{1 5 c}、-N(R^{1 5 e})C(O)OR^{1 5 b}、-N(R^{1 5 e})C(O)N(R^{1 5 b})₂、または-N(R^{1 5 e})SO₂N(R^{1 5 b})₂であるか、R^{1 5 b}の2つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から選択される0～1の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される4～7員のヘテロシクリル環を形成し、

R^{1 5 b}の各出現は、独立して水素、またはC₁～C₆脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{1 5 c}の各出現は、独立してC₁～C₆脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{1 5 d}の各出現は、独立して水素、-N(R^{1 5 b})₂、-OR^{1 5 b}、-SR^{1 5 c}、-S(O)₂R^{1 5 c}、-C(O)R^{1 5 b}、-C(O)OR^{1 5 b}、-C(O)N(R^{1 5 b})₂、-S(O)₂N(R^{1 5 b})₂、-OC(O)N(R^{1 5 b})₂、-N(R^{1 5 e})C(O)R^{1 5 b}、-N(R^{1 5 e})SO₂R^{1 5 c}、-N(R^{1 5 e})C(O)OR^{1 5 b}、-N(R^{1 5 e})C(O)N(R^{1 5 b})₂、-N(R^{1 5 e})SO₂N(R^{1 5 b})₂、または3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{1 5 e}の各出現は、独立して水素または任意に置換されるC₁～C₆脂肪族基であり、および

T₅は、任意に置換されるC₁～C₆アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、-N(R^{1 5 b})-、-O-、-S-、-S(O)-、-S(O)₂-、-C(O)-、-C(O)O-、-C(O)N(R^{1 5 b})-、-S(O)₂N(R^{1 5 b})-、-OC(O)N(R^{1 5 b})-、-N(R^{1 5 b})C(O)-、-N(R^{1 5 b})SO₂-、-N(R^{1 5 b})C(O)O-、-NR^{1 5 b}C(O)N(R^{1 5 b})-、-N(R^{1 5 b})S(O)₂N(R^{1 5 b})-、-OC(O)-、または-C(O)N(R^{1 5 b})-O-により任意に割り込まれ、またはT₅若しくはその部分は任意に置換される3～7員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分を任意に形成する、化合物または薬剤的に許容される塩。

【請求項16】

G₂はSであり、G₁はNであり、HYは、モルホリノであり、G₃は-C(=O)-であり、G₄は-NH-であり、tは2であり、R⁵はHであり、R^{1 2}はHであり、環Aは任意に置換される6～10員のアリールであり、nは1であり、R²は任意に置換されるフェニルまたは5～6員のヘテロアリールである、請求項15に記載のVIII-Aの化合物。

【請求項17】

環Aは10員のアリールである、請求項16に記載の化合物。

【請求項18】

G₁はCR¹であり、およびG₂はSである、請求項15に記載の化合物。

【請求項19】

G₁はNであり、およびG₂はSである、請求項15に記載の化合物。

【請求項20】

構造式VIII-Aを有する、請求項15～19のいずれか1項に記載の化合物または

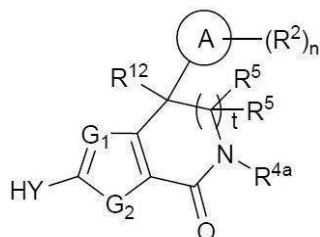
薬剂的に許容される塩。

【請求項 2 1】

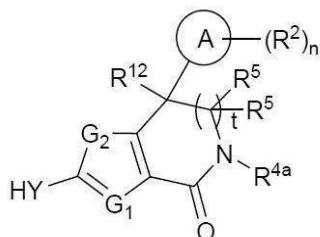
構造式 V I I I - A - i または V I I I - B - i を有する、請求項 1 5、1 8 または 1 9 のいずれか 1 項に記載の化合物：

【化 2 7 - 3】

【化 2 7】



V I I I - A - i



V I I I - B - i。

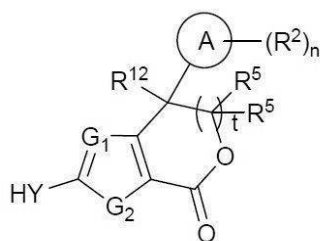
または薬剂的に許容される塩。

【請求項 2 2】

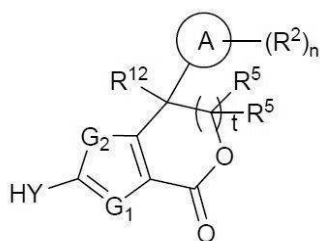
以下の式の 1 つに従う構造式を有する、請求項 1 5、1 8 または 1 9 のいずれか 1 項に記載の化合物：

【化 2 8 - 3】

【化 2 8】



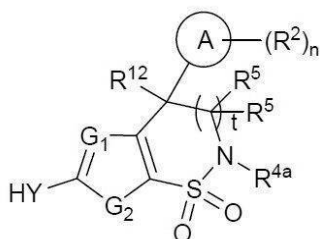
V I I I - A - i i



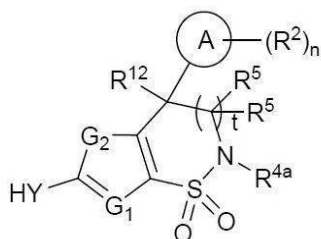
V I I I - B - i i。

【化 2 9 - 3】

【化 2 9】



V I I I - A - i i i



V I I I - B - i i i。

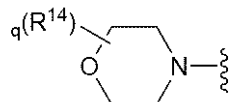
または薬剂的に許容される塩。

【請求項 2 3】

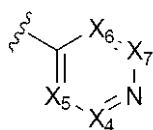
請求項 1 5 または 1 8 ~ 2 2 のいずれか 1 項に記載の化合物であって、H Y は以下に示す構造式から選択され、

【化 3 0 - 3】

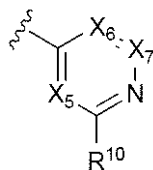
【化 3 0】



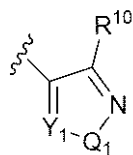
J、



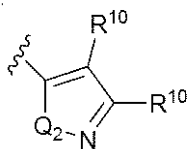
A、



H、

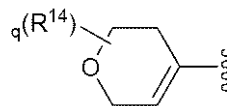


L、



M、

または



F-i

式中 X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、
ただし X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 のうちの 2 つより多い出現が N であることはなく、

Q_1 および Q_2 の各出現は独立して S 、 O または $-NR^6$ であり、

Y_1 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、

または X_6 および X_7 、または Y_1 および Q_1 の 2 つの隣接する出現は、それらが結合される原子と一緒にあって、5～6 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1～5 のヘテロ原子を有する 5～6 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される縮合基を形成し、

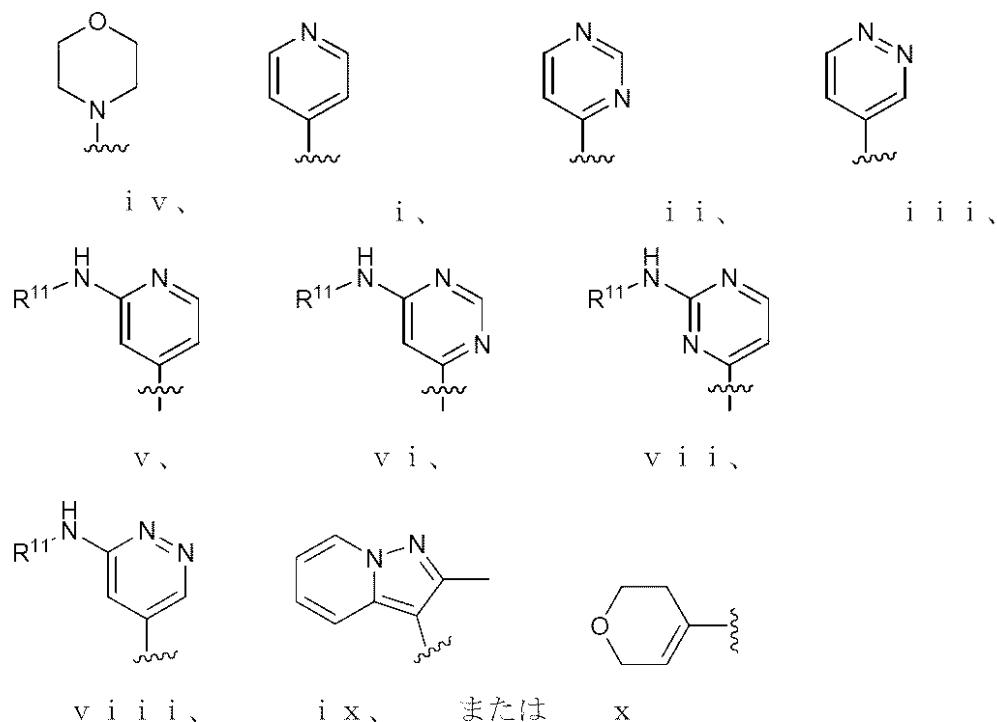
R^{14} の各出現は独立して任意に置換される C_{1-6} 脂肪族基である、
化合物。

【請求項 24】

請求項 15 または 18～22 のいずれか 1 項に記載の化合物であって、 HY は以下に示す構造式から選択され、

【化 3 1 - 3】

【化 3 1】



各 H Y 基は R^{10} または R^{14} の 1 つまたは複数の出現で、任意に、さらに置換される化合物。

【請求項 2 5】

H Y は任意に置換されるモルホリン (i v) またはジヒドロピラン (x) から選択される、請求項 2 4 に記載の化合物。

【請求項 2 6】

H Y は任意に置換されるモルホリン (i v) から選択される、請求項 2 5 に記載の化合物。

【請求項 2 7】

請求項 1 5 または 1 8 ~ 2 2 のいずれか 1 項に記載の化合物であって、環 A は任意に置換されるナフチル、フェニル、キノリン、イソキノリン、またはベンズイミダゾール環である、化合物。

【請求項 2 8】

請求項 2 7 に記載の化合物であって、環 A は R^2 によって任意に置換され、および R^2 の各出現は独立してハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 $-CN$ 、 C_{1-3} ハロアルキル、 $-OC_{1-3}$ アルキル、 $-OC_{1-3}$ ハロアルキル、 $-NHC(O)C_{1-3}$ アルキル、 $-NHC(O)NHC_{1-3}$ アルキル、 $-NHS(O)_2C_{1-3}$ アルキル、または $-C(O)H$ であり、 n は 0 ~ 3 である、化合物。

【請求項 2 9】

請求項 2 8 に記載の化合物であって、環 A はフェニル基であり、 R^2 の各出現は独立してハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 $-CN$ 、 C_{1-3} ハロアルキル、 $-OC_{1-3}$ アルキル、 $-OC_{1-3}$ ハロアルキル、 $-NHC(O)C_{1-3}$ アルキル、 $-NHC(O)NHC_{1-3}$ アルキル、 $-NHS(O)_2C_{1-3}$ アルキル、または $-C(O)H$ であり、 n は 0 ~ 3 である、化合物。

【請求項 3 0】

請求項 2 8 に記載の化合物であって、環 A はフェニル基であり、 R^2 はハロゲンであり

、 n は 1 または 2 である、化合物。

【請求項 3 1】

請求項 1 5 に記載の化合物であって、 R^5 の各出現は独立して水素、ハロ、または C_{1-6} 脂肪族、 $-C(O)N(R^{15b})_2$ 、 $-C(O)OR^{15b}$ 、 $-CH_2N(R^{15b})_2$ 、 $-CH_2OR^{15b}$ 、 $-CH_2SR^{15c}$ 、3 ~ 10 員の脂環式、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基である、化合物。

【請求項 3 2】

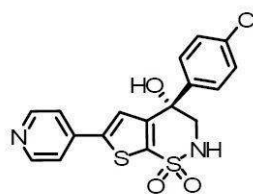
以下：

【表 1 - 1】

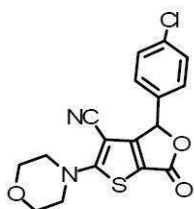
【表 1】



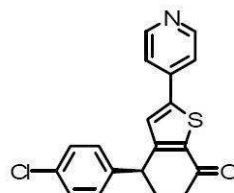
1



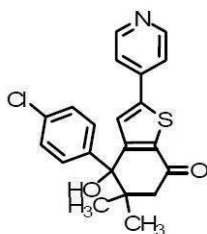
2



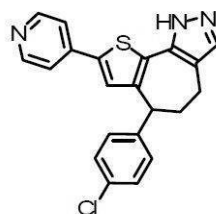
3



4

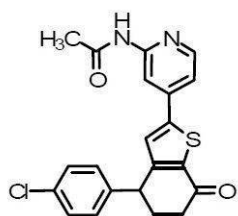


5

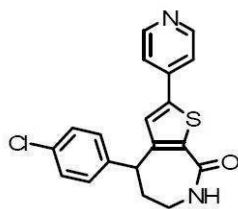


6

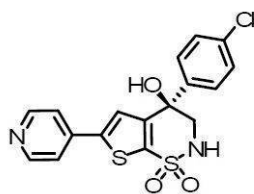
【表 1 - 2】



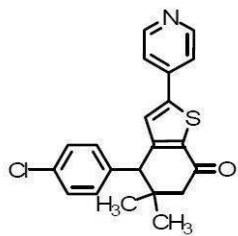
7



8



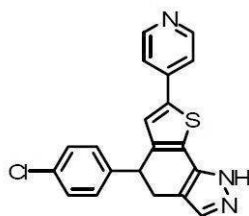
9



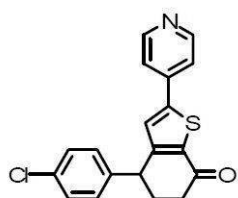
10



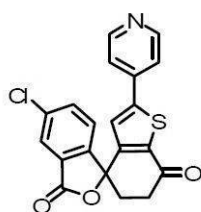
11



12

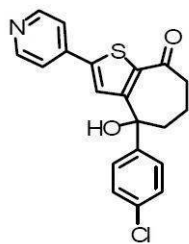


13

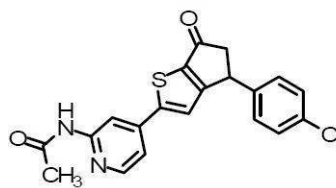


14

【表 1 - 3】



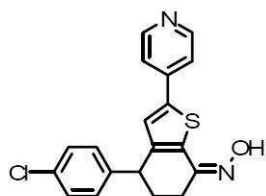
15



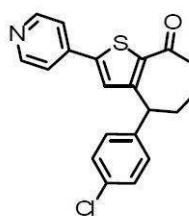
16



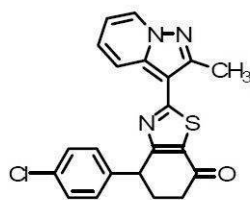
17



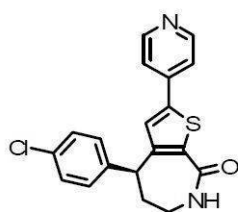
18



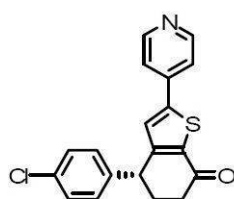
19



20

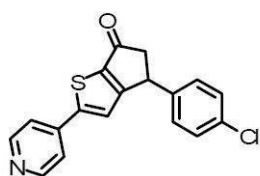


21

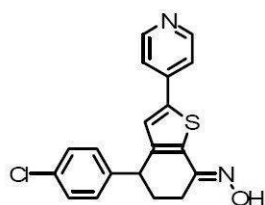


22

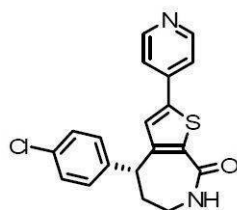
【表 1 - 4】



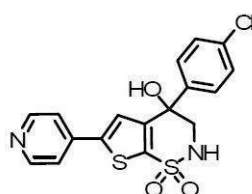
23



24



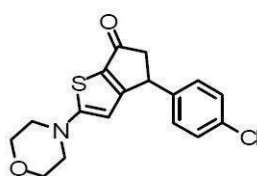
25



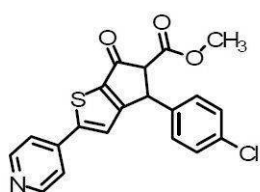
26



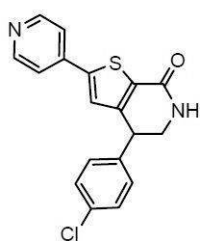
27



28



29

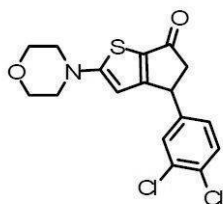


30

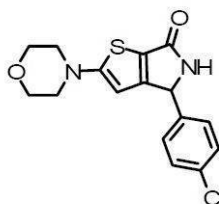
【表 1 - 5】



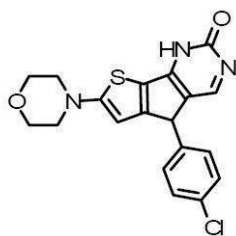
31



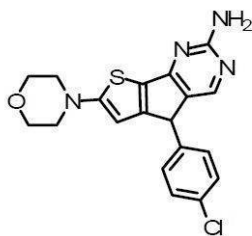
32



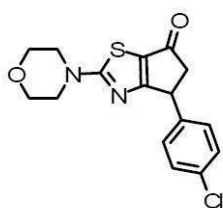
33



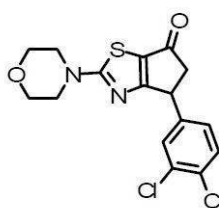
34



35

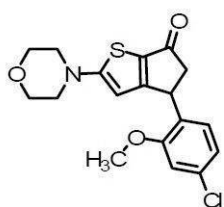


36

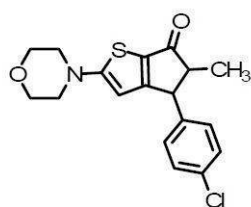


37

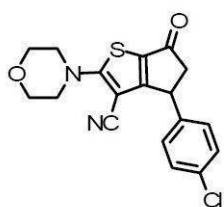
【表 1 - 6】



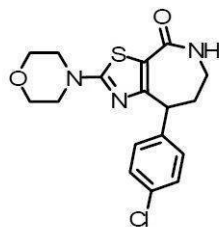
38



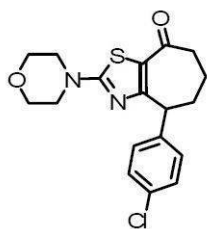
39



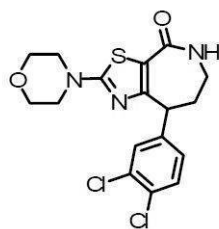
40



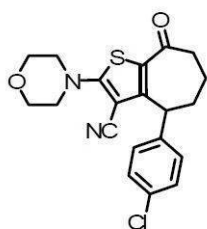
41



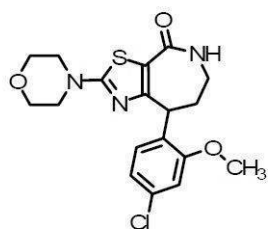
42



43

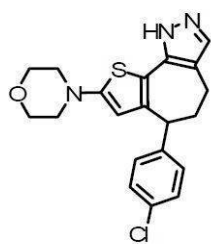


44

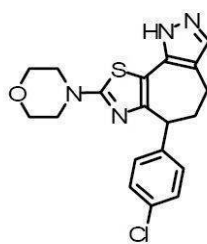


45

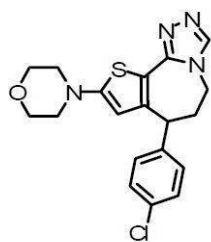
【表 1 - 7】



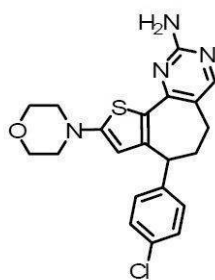
46



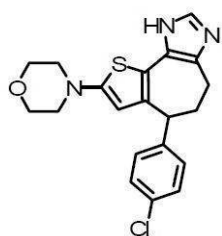
47



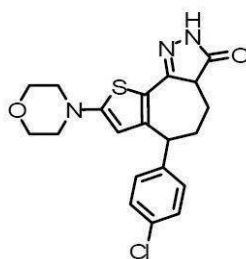
48



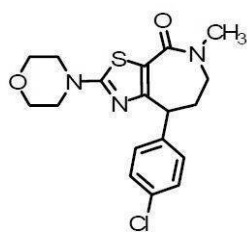
49



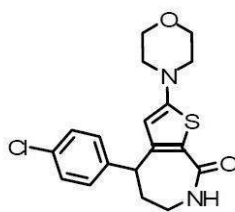
50



51

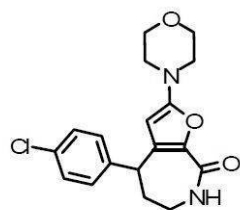


52

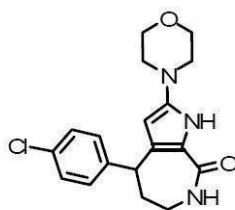


53

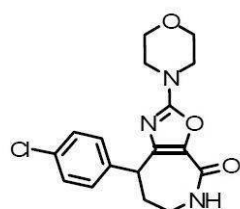
【表 1 - 8】



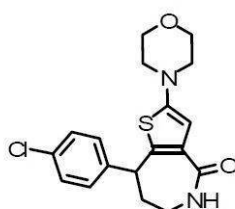
54



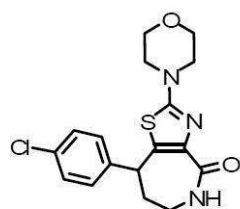
55



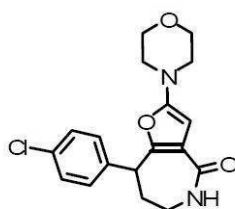
56



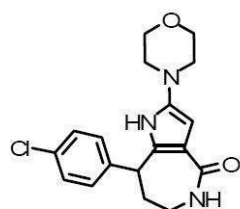
57



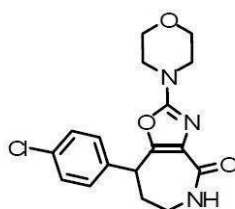
58



59

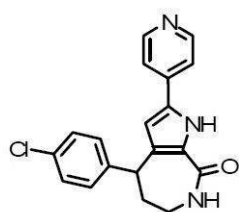


60

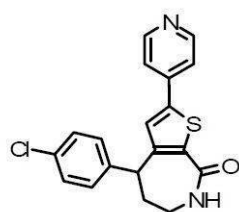


61

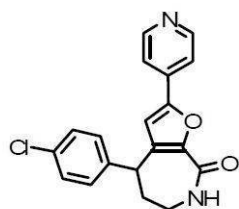
【表 1 - 9】



62



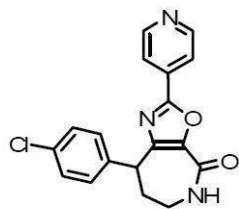
63



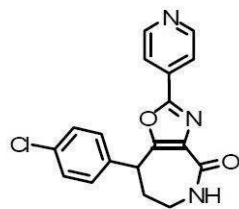
64



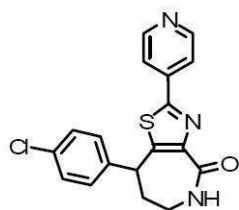
65



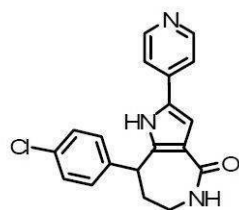
66



67

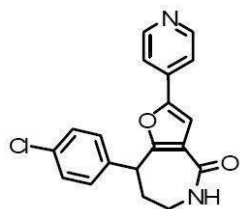


68

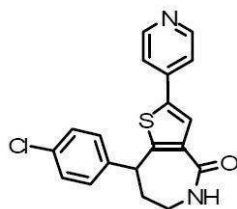


69

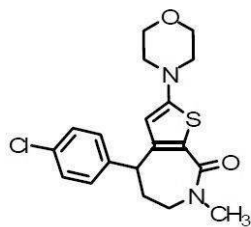
【表 1 - 1 0】



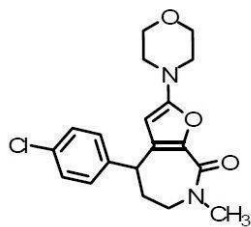
70



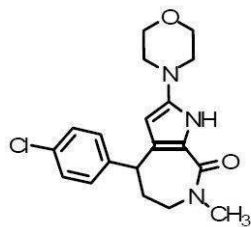
71



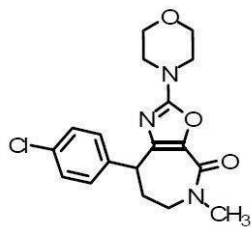
72



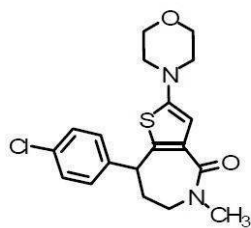
73



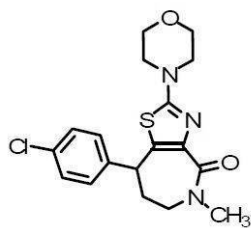
74



75

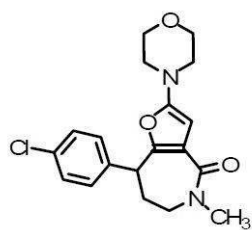


76

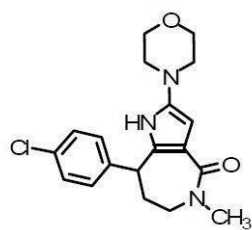


77

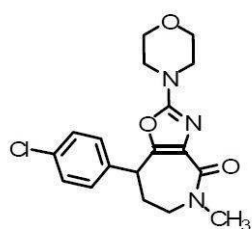
【表 1 - 1 1】



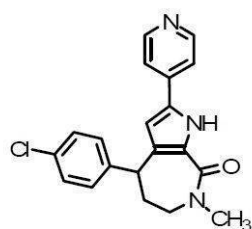
78



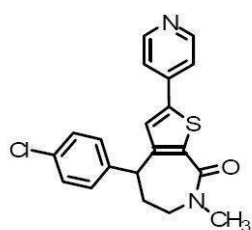
79



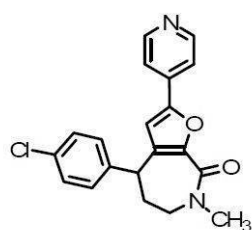
80



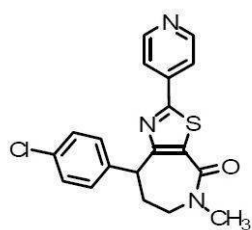
81



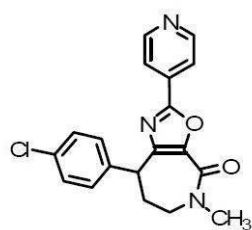
82



83

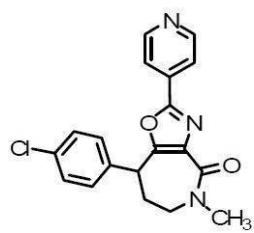


84

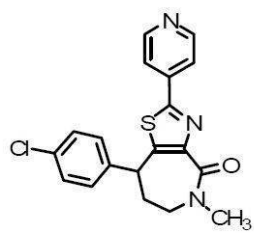


85

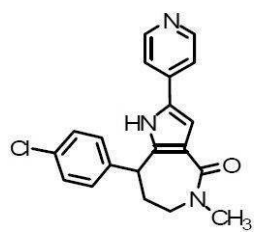
【表 1 - 1 2】



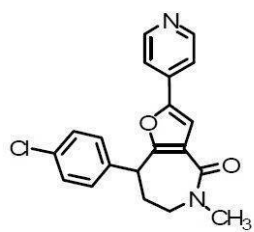
86



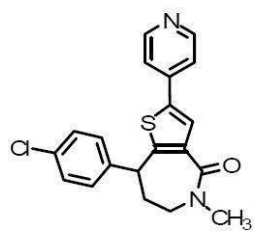
87



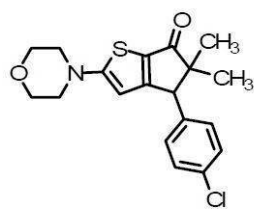
88



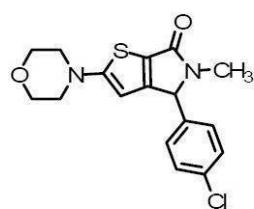
89



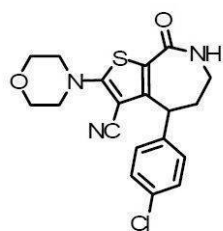
90



91

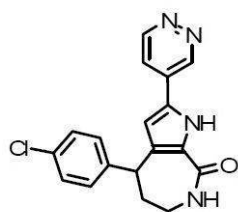


92



93

【表 1 - 1 3】



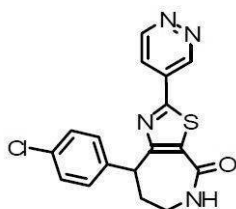
94



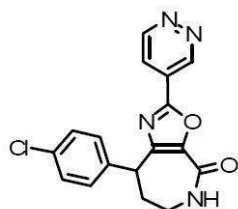
95



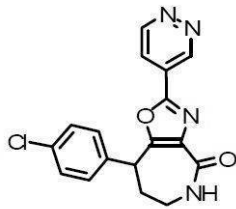
96



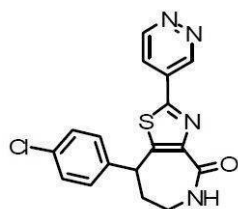
97



98



99

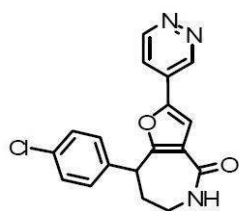


100

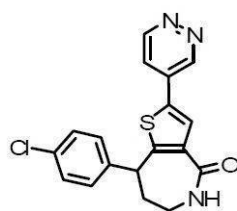


101

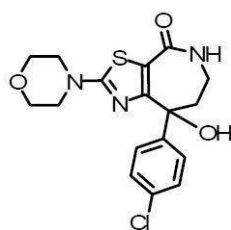
【表 1 - 1 4】



102



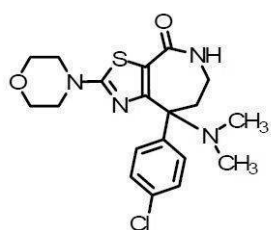
103



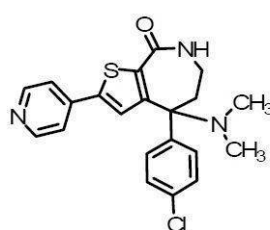
104



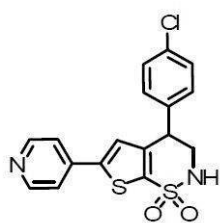
105



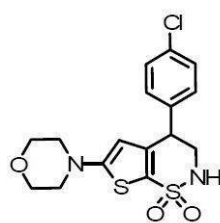
106



107

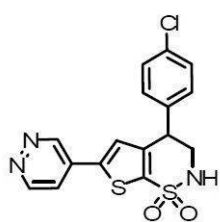


108

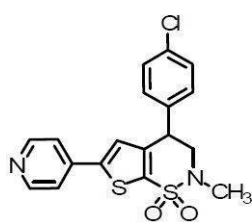


109

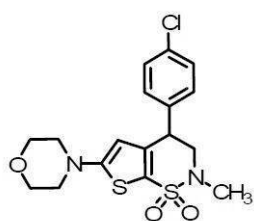
【表 1 - 1 5】



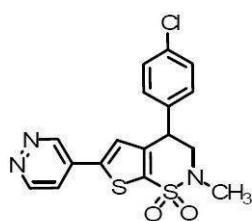
110



111



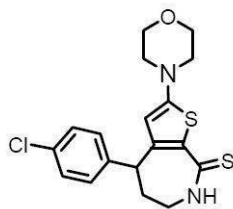
112



113



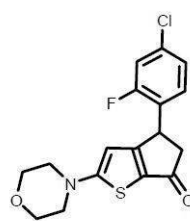
114



115



116

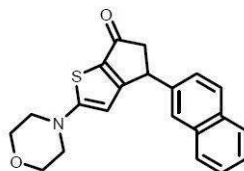


117

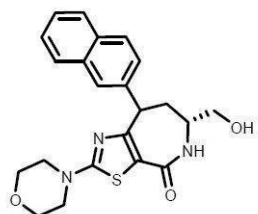
【表 1 - 16】



118



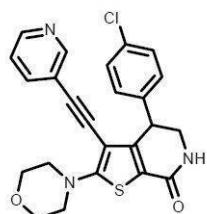
119



120



121



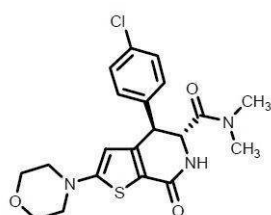
122



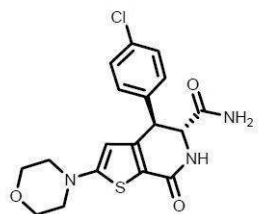
123



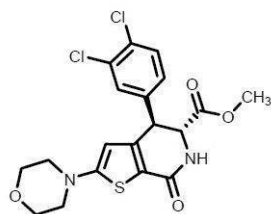
124



125

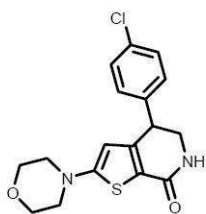


126

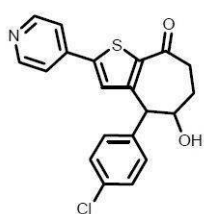


127

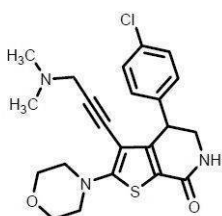
【表 1 - 17】



128



129



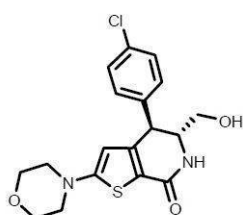
130



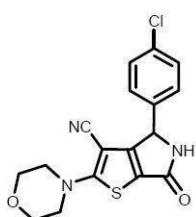
131



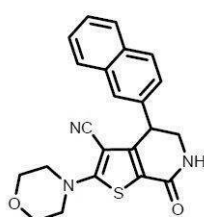
132



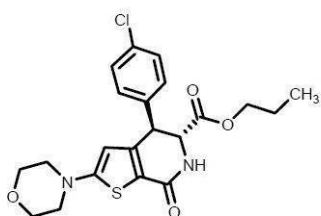
133



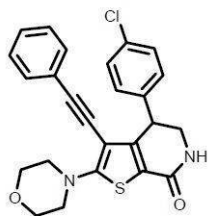
134



135



136

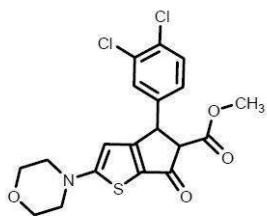


137

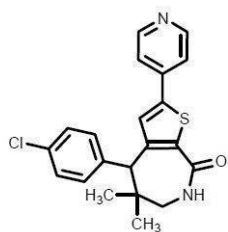
【表 1 - 18】



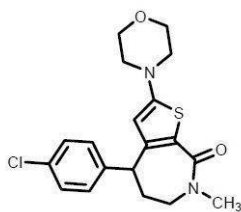
138



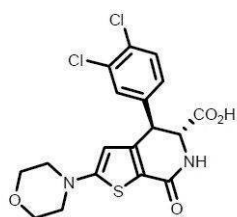
139



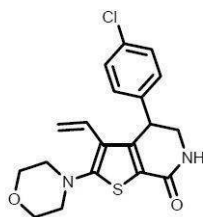
140



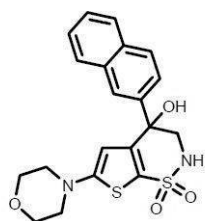
141



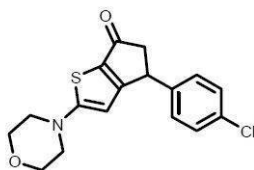
142



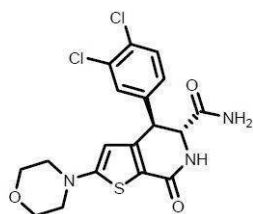
143



144



145

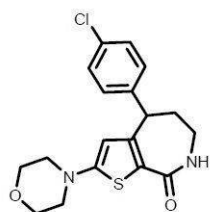


146



147

【表 1 - 19】



148



149



150



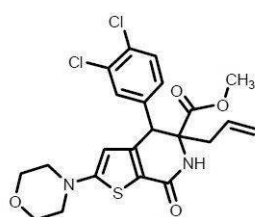
151



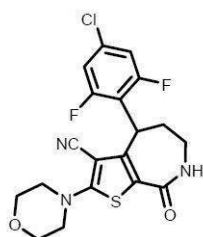
152



153



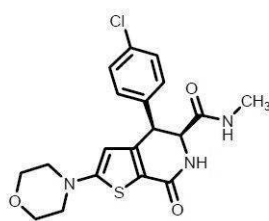
154



155

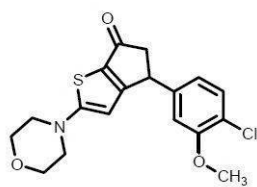


156



157

【表 1 - 20】



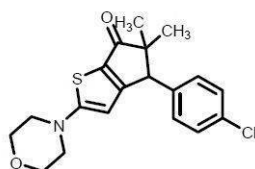
158



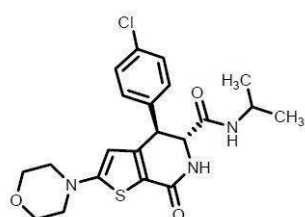
159



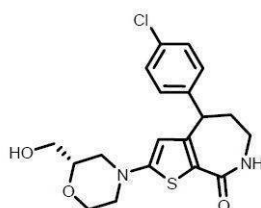
160



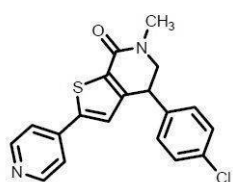
161



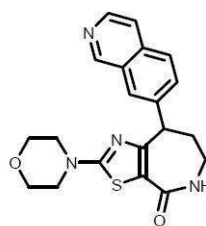
162



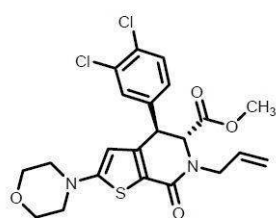
163



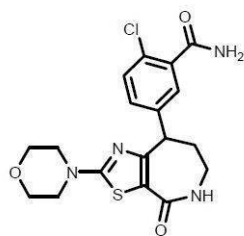
164



165



166

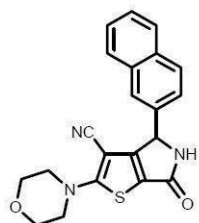


167

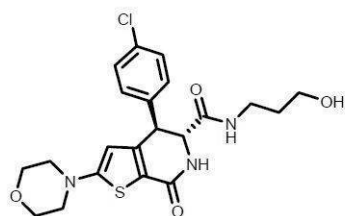
【表 1 - 2 1】



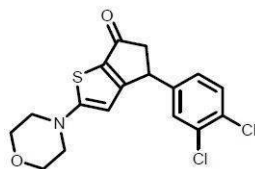
168



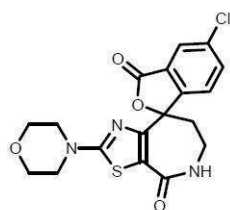
169



170



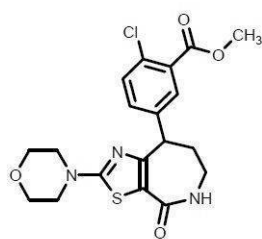
171



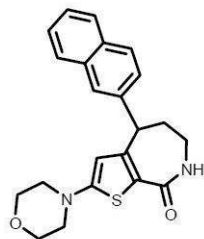
172



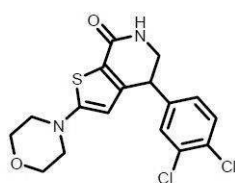
173



174



175



176

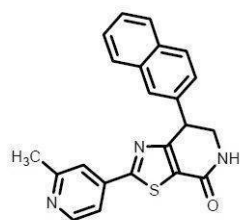


177

【表 1 - 2 2】



178



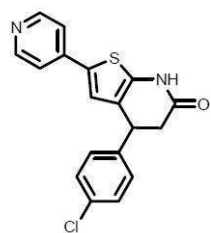
179



180



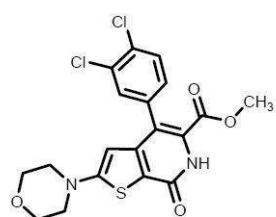
181



182



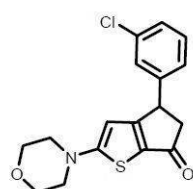
183



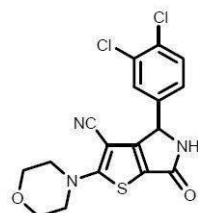
184



185

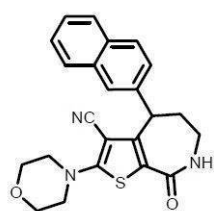


186

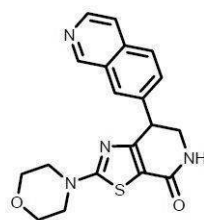


187

【表 1 - 2 3】



188



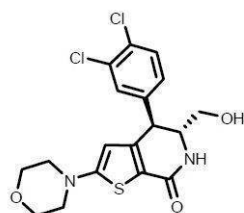
189



190



191



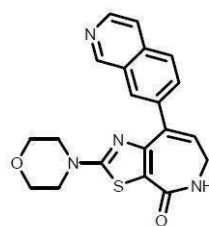
192



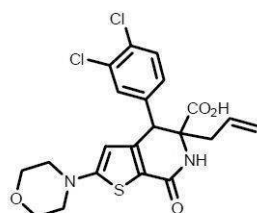
193



194



195



196



197

【表 1 - 2 4】



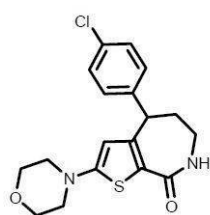
198



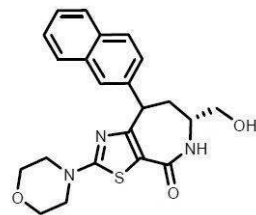
199



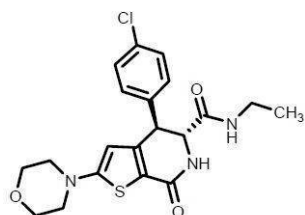
200



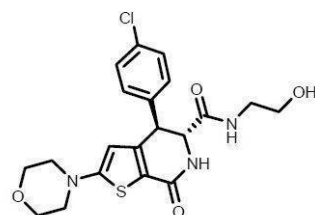
201



202



203



204



205

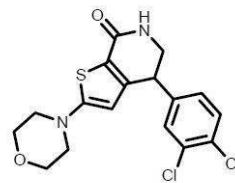


206

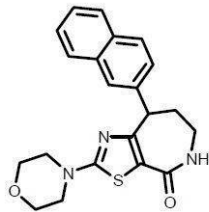
【表 1 - 2 5】



207



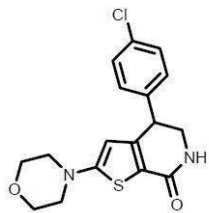
208



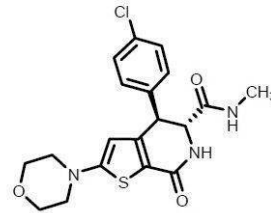
209



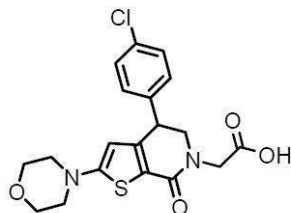
210



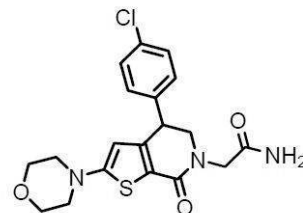
211



212



213



214

からなる群から選択される、化合物または薬剂的に許容される塩。

【請求項 3 3】

請求項 1 ~ 3 2 のいずれか 1 項に記載の化合物および薬剂的に許容される担体を含む組成物。

【請求項 3 4】

患者における増殖性障害、炎症性障害、または心血管障害を治療するための組成物であって、治療有効量の請求項 1 ~ 3 2 に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項 3 5】

患者における P I 3 K または m T o r 活性を阻害するための組成物であって、治療有効量の請求項 1 ~ 3 2 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 0 9

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 0 9】

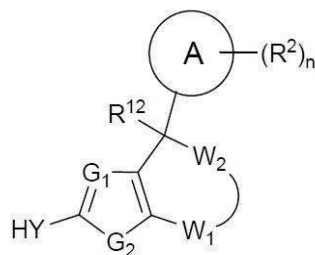
一実施形態において、例えば、以下の項目が提供される。

(項目1)

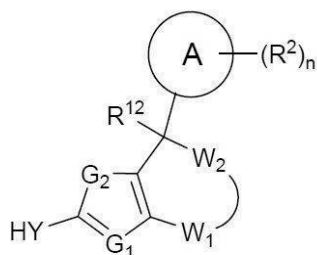
構造式 I - A または I - B に示す化合物

【化1-3】

【化1】



I-A



I-B

または薬剤的に許容される塩であり、式中

G_1 は N または CR^1 であり、 R^1 は H、 $-CN$ 、ハロゲン、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、または $-Z-R^{11}$ から選択される任意に置換される基であり、ここで

Z は任意に置換される C_{1-3} アルキレン鎖、 $-O-$ 、 $-N(R^{1a})-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(O)NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})C(O)-$ 、 $-N(R^{1a})CO_2-$ 、 $-S(O)_2NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})S(O)_2-$ 、 $-OC(O)N(R^{1a})-$ 、 $-N(R^{1a})C(O)NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})S(O)_2N(R^{1a})-$ 、または $-OC(O)-$ から選択され、

R^{1a} は水素または任意に置換される C_{1-4} 脂肪族であり、および

R^{11} は水素または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、または 6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、および

G_2 は S、O、または NR^3 であり、ここで R^3 は水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族であり、

環 A は 6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^2 の各出現は独立して $-R^{12a}$ 、 $-T_2-R^{12d}$ 、または $-V_2-T_2-R^{12d}$ であり、および

R^{12a} の各出現は独立してハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{12c}$ 、 $-N(R^{12b})_2$ 、 $-OR^{12b}$ 、 $-SR^{12c}$ 、 $-S(O)_2R^{12c}$ 、 $-C(O)R^{12b}$ 、 $-C(O)OR^{12b}$ 、 $-C(O)N(R^{12b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{12b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{12b})_2$ 、 $-N(R^{12e})C(O)R^{12b}$ 、 $-N(R^{12e})SO_2R^{12c}$ 、 $-N(R^{12e})C(O)OR^{12b}$ 、 $-N(R^{12e})C(O)N(R^{12b})_2$ 、または $-N(R^{12e})SO_2N(R^{12b})_2$ であり、または R^{12b} の 2 つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒に、窒素、酸素若しくは硫黄から選択される 0 ~ 1 の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環を形成し、

R^{12b} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して

選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{12c} の各出現は独立して、 C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{12d} の各出現は独立して水素、または 3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{12e} の各出現は独立して水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族基であり、 V_2 の各出現は独立して -N(R^{12e}) -、-O -、-S -、-S(O) -、-S(O)₂ -、-C(O) -、-C(O)O -、-C(O)N(R^{12e}) -、-S(O)₂N(R^{12e}) -、-OC(O)N(R^{12e}) -、-N(R^{12e})C(O) -、-N(R^{12e})SO₂ -、-N(R^{12e})C(O)O -、-N(R^{12e})C(O)N(R^{12e}) -、-N(R^{12e})SO₂N(R^{12e}) -、-OC(O) -、または -C(O)N(R^{12e}) - O - であり、および

T_2 は任意に置換される C_{1-6} アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、-N(R^{13}) -、-O -、-S -、-S(O) -、-S(O)₂ -、-C(O) -、-C(O)O -、-C(O)N(R^{13}) -、-S(O)₂N(R^{13}) -、-OC(O)N(R^{13}) -、-N(R^{13})C(O) -、-N(R^{13})SO₂ -、-N(R^{13})C(O)O -、-N(R^{13})C(O)N(R^{13}) -、-N(R^{13})S(O)₂N(R^{13}) -、-OC(O) -、または -C(O)N(R^{13}) - O - によって任意に割り込まれ、または T_2 若しくはその部分は任意に置換される 3 ~ 7 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分を任意に形成し、ここで R^{13} は水素または任意に置換される C_{1-4} 脂肪族基であり、

n は 0 ~ 4 であり、

R^{12} は水素、ハロ、または C_{1-6} 脂肪族、-C(O)N(R^{5a})₂、3 ~ 10 員の脂環式、-N(R^{4b})₂、-OR^{4a}、または -SR^{4a} から選択される任意に置換される基であり、

または R^{2} および R^{12} は任意に置換される 3 ~ 10 員の脂環式を形成し、

W_1 は、-C(O)C(R^4)₂ -、-C(R^4)₂C(O) -、-C(O)O -、-OC(O) -、-C(O)NR^{4a} -、-NR^{4a}C(O) -、-C(=NR^{4b})C(R^4)₂ -、-C(R^4)₂C(=NR^{4b}) -、-C(=NR^{4b})O -、-OC(=NR^{4b}) -、-C(=NR^{4b})NR^{4a} -、-NR^{4a}C(=NR^{4b}) -、-S(O)C(R^4)₂ -、-C(R^4)₂S(O) -、-S(O)O -、-OS(O) -、-S(O)NR^{4a} -、-NR^{4a}S(O) -、-S(O)₂C(R^4)₂ -、-C(R^4)₂S(O)₂ -、-S(O)₂O -、-OS(O)₂ -、-S(O)₂NR^{4a} -、-NR^{4a}S(O)₂ -、-C(S)C(R^4)₂ -、-C(R^4)₂C(S) -、-C(S)O -、-OC(S) -、-C(S)NR^{4a} -、または -NR^{4a}C(S) - から選択され、

W_2 は - (C - W_3)_r であるか、または W_2 の任意の 2 つの出現は独立して -C(R^5) = C(R^5) - であり、

ここで W_3 の各出現は独立して - (R^5)₂ または = O であり、

r は 0 ~ 3 であり、

R^4 の各出現は独立して水素、ハロ、または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族または -C(O)OR^{4c} であり、

R^{4a} の各出現は独立して水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族であり、

R^{4b} の各出現は独立して水素、または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族、 $-OR^{4c}$ 、または $-N(R^{4a})_2$ から選択される基であり、

R^{4c} の各出現は独立して水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族であり、

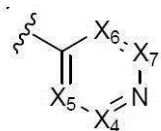
R^5 の各出現は独立して水素、ハロ、または C_{1-6} 脂肪族、 $-C(O)N(R^5)_2$ 、3～10員の脂環式、6～10員のアリール、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリール、 $-N(R^{4b})_2$ 、 $-OR^{4a}$ 、または $-SR^{4a}$ から選択される任意に置換される基であり、

R^{5a} の各出現は独立して水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族であり、

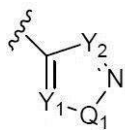
HY は以下の構造式から選択される任意に置換される基であり、

【化2-3】

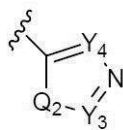
【化2】



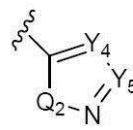
A、



B、



C、または



D

ここで X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、ただし X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 のうちの2つより多い出現が N であることはなく、

Q_1 および Q_2 の各出現は独立して S、O または $-NR^6$ であり、

Y_1 、 Y_2 、 Y_3 、 Y_4 、および Y_5 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、

または、 X_4 および X_5 、 X_6 および X_7 、 Y_1 および Q_1 、 Y_3 および Q_2 、または Y_4 および Y_5 の2つの隣接する出現は、それらが結合される原子と一緒にあって、5～6員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～6員のヘテロアリールから選択される任意に置換される縮合基を形成し、

ここで R^{10} は $-R^{10b}$ 、 $-V_1-R^{10c}$ 、 $-T_1-R^{10b}$ 、または $-V_1-T_1-R^{10b}$ であり、ここで

V_1 は $-NR^7$ 、 $-NR^7-C(O)-$ 、 $-NR^7-C(S)-$ 、 $-NR^7-C(NR^7)-$ 、 $-NR^7C(O)OR^{10a}$ 、 $-NR^7C(O)NR^7$ 、 $-NR^7C(O)SR^{10a}$ 、 $-NR^7C(S)OR^{10a}$ 、 $-NR^7C(S)NR^7$ 、 $-NR^7C(S)SR^{10a}$ 、 $-NR^7C(NR^7)OR^{10a}$ 、 $-NR^7C(NR^7)NR^7$ 、 $-NR^7S(O)_2$ 、 $-NR^7S(O)_2NR^7$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2$ 、 $-C(O)NR^7$ 、 $-C(O)NR^7O$ 、 $-SO_2$ 、または $-SO_2NR^7$ であり、

R^{10a} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

T_1 は任意に置換される C_{1-6} アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^7)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^7)-$ 、 $-S(O)_2N(R^7)-$ 、 $-OC(O)N(R^7)-$ 、 $-N(R^7)C(O)-$ 、 $-N(R^7)SO_2-$ 、 $-N(R^{10a})C(O)O-$ 、 $-NR^{10a}C(O)N(R^{10a})-$ 、 $-N(R^{10a})S(O)_2N(R^{10a})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^7)-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_1 は任意に置換される3～7員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分形成し、

R^{10b} の各出現は独立して水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^7)_2$ 、 $-OR^{10a}$ 、 $-SR^{10a}$ 、 $-S(O)_2R^{10a}$ 、 $-C(O)R^{10a}$ 、 $-C(O)OR^{10a}$ 、 $-C(O)N(R^7)_2$ 、 $-S(O)_2N(R^7)_2$ 、 $-OC(O)N(R^7)_2$ 、 $-N(R^7)C(O)R^{10a}$ 、 $-N(R^7)SO_2R^{10a}$ 、 $-N(R^7)C(O)OR^{10a}$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^7)_2$ 、または $-N(R^7)SO_2N(R^7)_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{10c} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、または

R^7 および R^{10c} は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される0～1の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される4～7員のヘテロシクリル環を形成し、

R^7 の各出現は独立して水素、 $-C(O)R^7a$ 、 $-CO_2R^7a$ 、 $-C(O)N(R^7a)_2$ 、 $-C(O)N(R^7a)-OR^7a$ 、 $-SO_2R^7a$ 、 $-SO_2N(R^7a)_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

ここで R^7a の各出現は独立して水素または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^6 の各出現は独立して水素、 $-C(O)R^6a$ 、 $-CO_2R^6a$ 、 $-C(O)N(R^6b)_2$ 、 $-SO_2R^6a$ 、 $-SO_2N(R^6b)_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

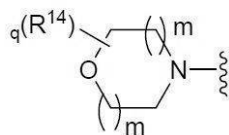
ここで R^6a の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^6b の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、または R^6b の2つの出現はそれらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する3～6員のヘテロシクリル、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基を形成し、

または HY は

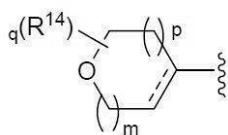
【化 3 - 3】

【化 3】



E

または



F

であり、

ここで R^{14} の各出現は独立して $-R^{14a}$ または $-T_1 - R^{14d}$ であり、ここで R^{14a} の各出現は、原子価および安定性が許容できる範囲で独立してフッ素、 $=O$ 、 $=S$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{14c}$ 、 $-N(R^{14b})_2$ 、 $-OR^{14b}$ 、 $-SR^{14c}$ 、 $-S(O)_2 R^{14c}$ 、 $-C(O)R^{14b}$ 、 $-C(O)OR^{14b}$ 、 $-C(O)N(R^{14b})_2$ 、 $-S(O)_2 N(R^{14b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{14b})_2$ 、 $-N(R^{14e})C(O)R^{14b}$ 、 $-N(R^{14e})SO_2 R^{14c}$ 、 $-N(R^{14e})C(O)OR^{14b}$ 、 $-N(R^{14e})C(O)N(R^{14b})_2$ 、または $-N(R^{14e})SO_2 N(R^{14b})_2$ であるが、 R^{14b} の 2 つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、または硫黄から選択される 0 ~ 1 の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環を形成し、

R^{14b} の各出現は独立して水素、または $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{14c} の各出現は独立して $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{14d} の各出現は独立して水素、または 3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから任意に置換され、

R^{14e} の各出現は独立して水素または任意に置換される $C_1 - C_6$ 脂肪族基であり、および

T_1 は任意に置換される $C_1 - C_6$ アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^{14b})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{14b})-$ 、 $-S(O)_2 N(R^{14b})-$ 、 $-OC(O)N(R^{14b})-$ 、 $-N(R^{14b})C(O)-$ 、 $-N(R^{14b})SO_2-$ 、 $-N(R^{14b})C(O)O-$ 、 $-NR^{14b}C(O)N(R^{14b})-$ 、 $-N(R^{14b})S(O)_2 N(R^{14b})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{14b})-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_1 若しくはその部分は、任意に置換される 3 ~ 7 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分を任意に形成し、

q は 0 ~ 6 であり、

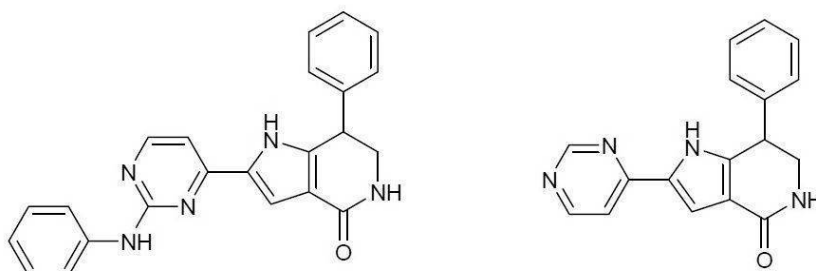
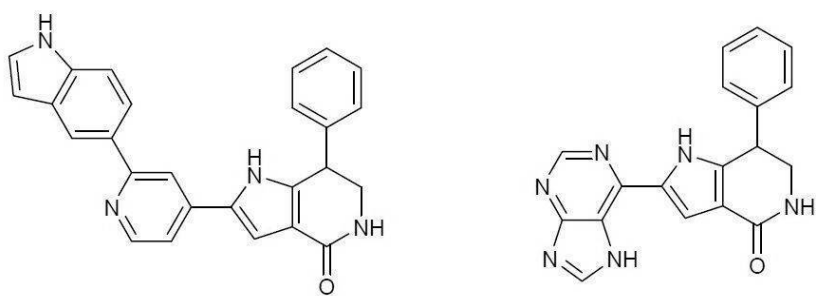
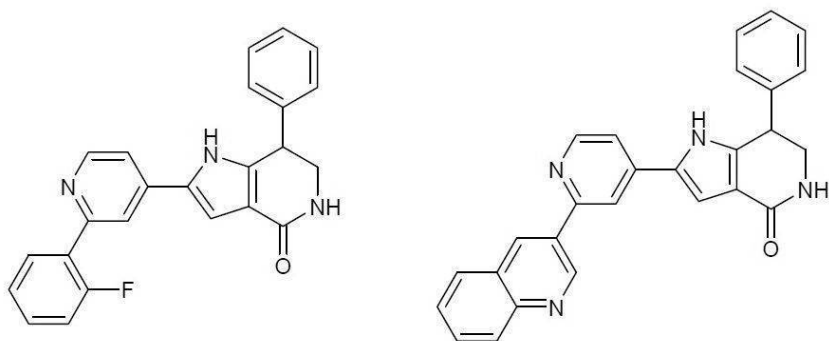
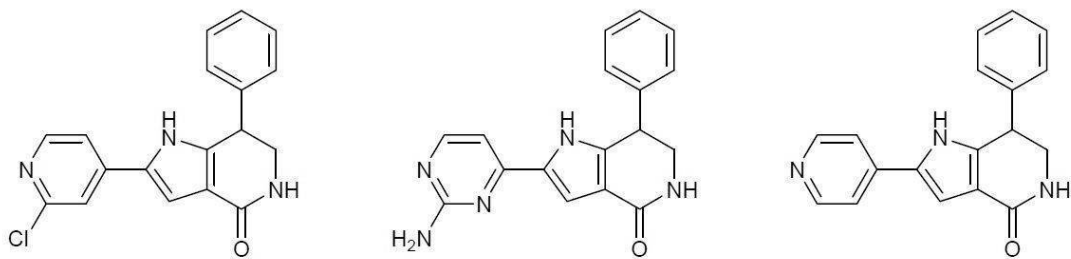
m は 1 または 2 であり、および

p は 0、1、または 2 であり、

ただし構造式 I - B の化合物については、以下に示す構造式以外である、化合物または薬剤的に許容される塩：

【化 4 - 3】

【化 4】



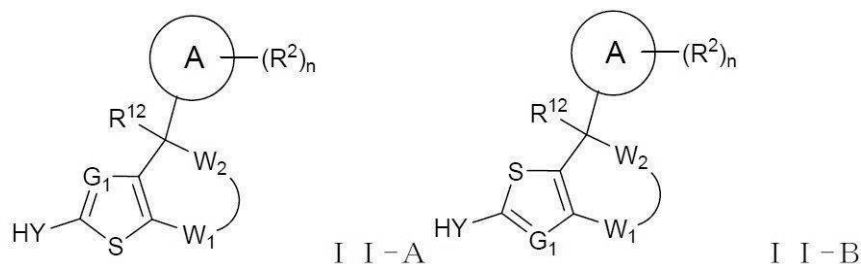
、または

(項目2)

構造式 I I - A または I I - B に示す化合物

【化5-3】

【化5】



または薬剤的に許容される塩であり、式中

G_1 は N または CR^1 であり、 R^1 は H、 $-CN$ 、ハロゲン、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、または $-Z-R^{11}$ から選択される任意に置換される基であり、ここで

Z は任意に置換される C_{1-3} アルキレン鎖、 $-O-$ 、 $-N(R^{1a})-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(O)NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})C(O)-$ 、 $-N(R^{1a})CO_2-$ 、 $-S(O)_2NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})S(O)_2-$ 、 $-OC(O)N(R^{1a})-$ 、 $-N(R^{1a})C(O)NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})S(O)_2N(R^{1a})-$ 、または $-OC(O)-$ から選択され、

R^{1a} は水素または任意に置換される C_{1-4} 脂肪族であり、および

R^{11} は水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、または 6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、および

環 A は 6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^2 の各出現は独立して $-R^{12a}$ 、 $-T_2-R^{12d}$ 、または $-V_2-T_2-R^{12d}$ であり、および

R^{12a} の各出現は独立してハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{12c}$ 、 $-N(R^{12b})_2$ 、 $-OR^{12b}$ 、 $-SR^{12c}$ 、 $-S(O)_2R^{12c}$ 、 $-C(O)R^{12b}$ 、 $-C(O)OR^{12b}$ 、 $-C(O)N(R^{12b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{12b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{12b})_2$ 、 $-N(R^{12e})C(O)R^{12b}$ 、 $-N(R^{12e})SO_2R^{12c}$ 、 $-N(R^{12e})C(O)OR^{12b}$ 、 $-N(R^{12e})C(O)N(R^{12b})_2$ 、または $-N(R^{12e})SO_2N(R^{12b})_2$ であり、または R^{12b} の 2 つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒に、窒素、酸素、若しくは硫黄から選択される 0 ~ 1 の追加のヘテロ原子を有する 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環を形成し、

R^{12b} の各出現は独立して水素または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{12c} の各出現は独立して C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{12d} の各出現は独立して水素、または3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換され、

R^{12e} の各出現は独立して水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族基であり、
 V_2 の各出現は独立して $-N(R^{12e})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{12e})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{12e})-$ 、 $-OC(O)N(R^{12e})-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)-$ 、 $-N(R^{12e})SO_2-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)O-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)N(R^{12e})-$ 、 $-N(R^{12e})SO_2N(R^{12e})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{12e})-O-$ であり、および

T_2 は任意に置換される C_{1-6} アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は $-N(R^{13})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{13})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{13})-$ 、 $-OC(O)N(R^{13})-$ 、 $-N(R^{13})C(O)-$ 、 $-N(R^{13})SO_2-$ 、 $-N(R^{13})C(O)O-$ 、 $-N(R^{13})C(O)N(R^{13})-$ 、 $-N(R^{13})S(O)_2N(R^{13})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{13})-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_2 若しくはその部分は任意に置換される3～7員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分を任意に形成し、 R^{13} は水素または任意に置換される C_{1-4} 脂肪族基であり、

n は0～4であり、

R^{12} は水素、ハロ、または C_{1-6} 脂肪族、 $-C(O)N(R^{5a})_2$ 、3～10員の脂環式、 $-N(R^{4b})_2$ 、 $-OR^{4a}$ 、または $-SR^{4a}$ から選択される任意に置換される基であり、

または R^2 および R^{12} は任意に置換される3～10員の脂環式を形成し、

W_1 は $-C(O)C(R^4)_2-$ 、 $-C(R^4)_2C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-OC(O)-$ 、 $-C(O)NR^{4a}-$ 、 $-NR^{4a}C(O)-$ 、 $-C(=NR^{4b})C(R^4)_2-$ 、 $-C(R^4)_2C(=NR^{4b})-$ 、 $-C(=NR^{4b})O-$ 、 $-OC(=NR^{4b})-$ 、 $-C(=NR^{4b})NR^{4a}-$ 、 $-NR^{4a}C(=NR^{4b})-$ 、 $-S(O)C(R^4)_2-$ 、 $-C(R^4)_2S(O)-$ 、 $-S(O)O-$ 、 $-OS(O)-$ 、 $-S(O)NR^{4a}-$ 、 $-NR^{4a}S(O)-$ 、 $-S(O)_2C(R^4)_2-$ 、 $-C(R^4)_2S(O)_2-$ 、 $-S(O)_2O-$ 、 $-OS(O)_2-$ 、 $-S(O)_2NR^{4a}-$ 、 $-NR^{4a}S(O)_2-$ 、 $-C(S)C(R^4)_2-$ 、 $-C(R^4)_2C(S)-$ 、 $-C(S)O-$ 、 $-OC(S)-$ 、 $-C(S)NR^{4a}-$ 、または $-NR^{4a}C(S)-$ から選択され、

W_2 は $-(C-W_3)_r$ であり、または W_2 の任意の2つの出現は独立して $-C(R^5)=C(R^5)-$ であり、

ここで W_3 の各出現は独立して $-(R^5)_2$ または $=O$ であり、

r は0～3であり、

R^4 の各出現は独立して水素、ハロ、または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族または $-C(O)OR^{4c}$ であり、

R^{4a} の各出現は独立して水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族であり、

R^{4b} の各出現は独立して水素、または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族、 $-OR^{4c}$ 、または $-N(R^{4a})_2$ から選択される基であり、

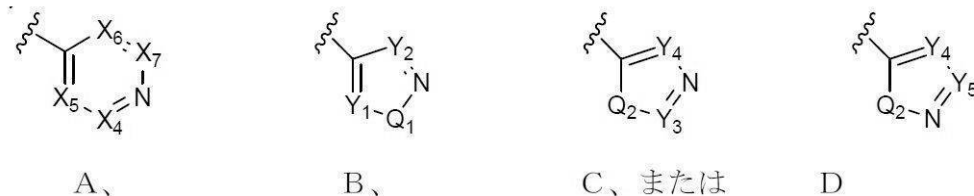
R^{4c} の各出現は独立して水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族であり、

R^5 の各出現は独立して水素、ハロゲン、または C_{1-6} 脂肪族、 $-C(O)N(R^{5a})_2$ 、 $3 \sim 10$ 員の脂環式、 $6 \sim 10$ 員のアリール、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される $1 \sim 5$ のヘテロ原子を有する $5 \sim 10$ 員のヘテロアリール、 $-N(R^{4b})_2$ 、 $-OR^{4a}$ 、または $-SR^{4a}$ であり、

R^{5a} の各出現は独立して水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族であり、
 HY は以下に示す構造式から選択される任意に置換される基であり、

【化 6 - 3】

【化 6】



ここで X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、
ただし X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 のうちの 2 つより多い出現が N であることはなく、

Q_1 および Q_2 の各出現は独立して S 、 O または $-NR^6$ であり、

Y_1 、 Y_2 、 Y_3 、 Y_4 、および Y_5 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、

または、 X_4 および X_5 、 X_6 および X_7 、 Y_1 および Q_1 、 Y_3 および Q_2 、または Y_4 および Y_5 の 2 つの隣接する出現は、それらが結合される原子と一緒にあって、 $5 \sim 6$ 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される $1 \sim 5$ のヘテロ原子を有する $5 \sim 6$ 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される縮合基を形成し、

ここで R^{10} は $-R^{10b}$ 、 $-V_1-R^{10c}$ 、 $-T_1-R^{10b}$ 、または $-V_1-T_1-R^{10b}$ であり、ここで

V_1 は $-NR^7$ 、 $-NR^7-C(O)-$ 、 $-NR^7-C(S)-$ 、 $-NR^7-C(NR^7)-$ 、 $-NR^7C(O)OR^{10a}$ 、 $-NR^7C(O)NR^7$ 、 $-NR^7C(O)SR^{10a}$ 、 $-NR^7C(S)OR^{10a}$ 、 $-NR^7C(S)NR^7$ 、 $-NR^7C(S)SR^{10a}$ 、 $-NR^7C(NR^7)OR^{10a}$ 、 $-NR^7C(NR^7)NR^7$ 、 $-NR^7S(O)_2$ 、 $-NR^7S(O)_2NR^7$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2$ 、 $-C(O)NR^7$ 、 $-C(O)NR^7O$ 、 $-SO_2$ 、または $-SO_2NR^7$ であり、

R^{10a} の各出現は独立して水素または C_{1-6} 脂肪族、 $3 \sim 10$ 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される $1 \sim 5$ のヘテロ原子を有する $4 \sim 10$ 員のヘテロシクリル、 $6 \sim 10$ 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される $1 \sim 5$ のヘテロ原子を有する $5 \sim 10$ 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

T_1 は任意に置換される C_1-C_6 アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は $-N(R^7)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^7)-$ 、 $-S(O)_2N(R^7)-$ 、 $-OC(O)N(R^7)-$ 、 $-N(R^7)C(O)-$ 、 $-N(R^7)SO_2-$ 、 $-N(R^{10a})C(O)O-$ 、 $-NR^{10a}C(O)N(R^{10a})-$ 、 $-N(R^{10a})S(O)_2N(R^{10a})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^7)-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_1 は任意に置換される $3 \sim 7$ 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分形成し、

R^{10b} の各出現は独立して水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^7)_2$ 、 $-OR^{10a}$ 、 $-SR^{10a}$ 、 $-S(O)_2R^{10a}$ 、 $-C(O)R^{10a}$ 、 $-C(O)OR^{10a}$ 、 $-C(O)N(R^7)_2$ 、 $-S(O)_2N(R^7)_2$ 、 $-OC(O)N(R^7)_2$ 、 $-N(R^7)C(O)R^{10a}$ 、 $-N(R^7)SO_2R^{10a}$ 、 $-N(R^7)C$

$(O)OR^{10a}$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^7)_2$ 、または $-N(R^7)SO_2N(R^7)_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{10c} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、または

R^7 および R^{10c} は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される0～1の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される4～7員のヘテロシクリル環を形成し、

R^7 の各出現は独立して水素、 $-C(O)R^{7a}$ 、 $-CO_2R^{7a}$ 、 $-C(O)N(R^{7a})_2$ 、 $-C(O)N(R^{7a})-OR^{7a}$ 、 $-SO_2R^{7a}$ 、 $-SO_2N(R^{7a})_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

ここで R^{7a} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^6 の各出現は独立して水素、 $-C(O)R^{6a}$ 、 $-CO_2R^{6a}$ 、 $-C(O)N(R^{6b})_2$ 、 $-SO_2R^{6a}$ 、 $-SO_2N(R^{6b})_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

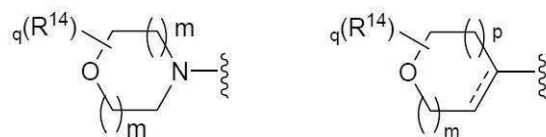
ここで R^{6a} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{6b} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であるか、または R^{6b} の2つの出現はそれらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する3～6員のヘテロシクリル、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基を形成し、

またはHYは

【化 7 - 3】

【化 7】



E または F

であり、

ここで R^{14} の各出現は独立して $-R^{14a}$ または $-T_1-R^{14d}$ であり、

R^{14a} の各出現は、原子価および安定性が許容できる範囲で独立してフッ素、 $=O$ 、 $=S$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{14c}$ 、 $-N(R^{14b})_2$ 、 $-OR^{14b}$ 、 $-SR^{14c}$ 、 $-S(O)_2R^{14c}$ 、 $-C(O)R^{14b}$ 、 $-C(O)OR^{14b}$ 、 $-C(O)N(R^{14b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{14b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{14b})_2$ 、 $-N(R^{14e})C(O)R^{14b}$ 、 $-N(R^{14e})SO_2R^{14c}$ 、 $-N(R^{14e})C(O)OR^{14b}$ 、 $-N(R^{14e})C(O)N(R^{14b})_2$ 、または $-N(R^{14e})SO_2N(R^{14b})_2$ であり、 R^{14b} の 2 つの出現はそれらが結合される窒素原子と一緒に、窒素、酸素、若しくは硫黄から選択される 0 ~ 1 の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環を形成し、

R^{14b} の各出現は独立して水素、または $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから任意に置換される基であり、

R^{14c} の各出現は独立して $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから任意に置換される基であり、

R^{14d} の各出現は独立して水素、または 3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから任意に置換され、

R^{14e} の各出現は独立して水素または任意に置換される $C_1 - C_6$ 脂肪族基であり、および

T_1 は任意に置換される $C_1 - C_6$ アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^{14b})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{14b})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{14b})-$ 、 $-OC(O)N(R^{14b})-$ 、 $-N(R^{14b})C(O)-$ 、 $-N(R^{14b})SO_2-$ 、 $-N(R^{14b})C(O)O-$ 、 $-NR^{14b}C(O)N(R^{14b})-$ 、 $-N(R^{14b})S(O)_2N(R^{14b})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{14b})-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_1 若しくはその部分は任意に置換される 3 ~ 7 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分を任意に形成し、

q は 0 ~ 6 であり、

m は 1 または 2 であり、および

p は 0、1、または 2 である、

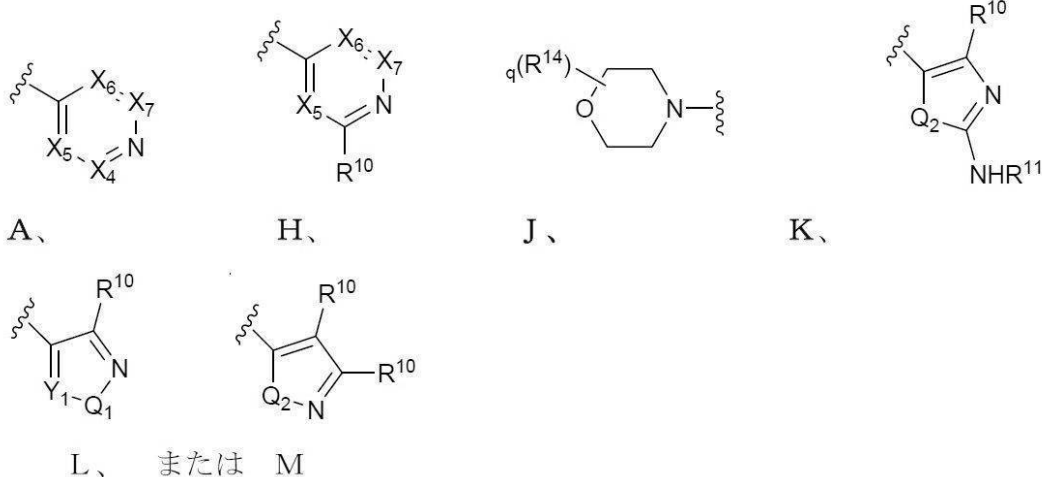
化合物または薬剤的に許容される塩。

(項目 3)

項目 1 または 2 に記載の化合物であって、HY は以下に示す構造式から選択され、

【化 8 - 3】

【化 8】



式中 X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、ただし X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 のうちの 2 つより多い出現が N であることはなく、

Q_1 および Q_2 の各出現は独立して S、O または $-NR^6$ であり、

Y_1 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、

または X_6 および X_7 、または Y_1 および Q_1 の 2 つの隣接する出現は、それらが結合される原子と一緒にあって、5～6 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1～5 のヘテロ原子を有する 5～6 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される縮合基を形成し、

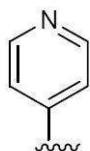
R^{14} の各出現は独立して任意に置換される C_{1-6} 脂肪族基である、化合物。

(項目 4)

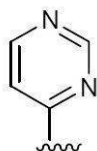
項目 1 または 2 に記載の化合物であって、HY は以下に示す構造式から選択され、

【化 9 - 3】

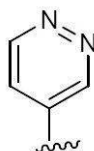
【化 9】



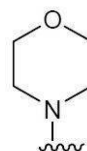
i、



ii、



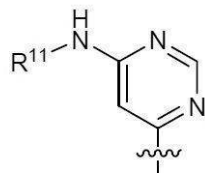
iii、



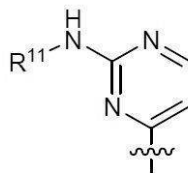
iv、



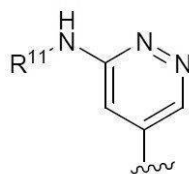
v、



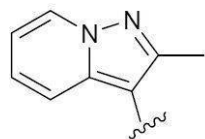
vi、



vii、



viii または ix



各 H Y 基は、 R^{10} または R^{14} の 1 つまたは複数の出現で、任意に、さらに置換される、化合物。

(項目 5)

G_1 は N である項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 6)

G_1 は CR^1 である項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 7)

項目 1 または 2 に記載の化合物であって、環 A はフェニル基であり、 R^2 の各出現は独立してハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 $-CN$ 、 C_{1-3} ハロアルキル、 $-OC_{1-3}$ アルキル、 $-OC_{1-3}$ ハロアルキル、 $-NHC(O)C_{1-3}$ アルキル、 $-NHC(O)NH C_{1-3}$ アルキル、 $-NHS(O)_2 C_{1-3}$ アルキル、または $-C(O)H$ であり、および n は 0 ~ 3 である、化合物。

(項目 8)

環 A はフェニル基であり、 R^2 はハロゲンであり、および n は 1 または 2 である、項目 7 に記載の化合物。

(項目 9)

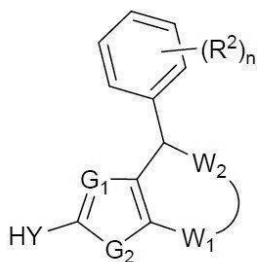
R^{12} は OH である、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 10)

以下に示す構造式 I V を有する、項目 1 に記載の化合物：

【化 1 0 - 3】

【化 1 0】



I V。

(項 目 1 1)

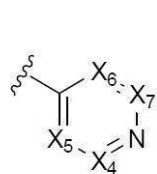
G_2 は S である、項目 1 0 に記載の化合物。

(項 目 1 2)

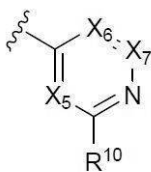
項目 1 0 に記載の化合物であって、HY は以下に示す構造式から選択され、

【化 1 1 - 3】

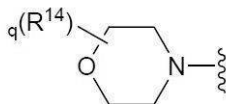
【化 1 1】



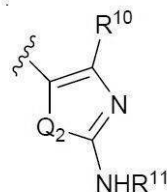
A、



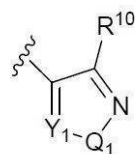
H、



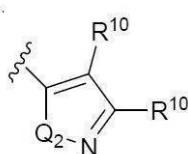
J、



K、



L、 または M



式中 X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、ただし X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 のうちの 2 つより多い出現が N であることはなく、

Q_1 および Q_2 の各出現は独立して S、O または $-NR^6$ であり、

Y_1 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、

または X_6 および X_7 、または Y_1 および Q_1 の 2 つの隣接する出現は、それらが結合される原子と一緒にあって、5～6 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1～5 のヘテロ原子を有する 5～6 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される縮合基を形成し、

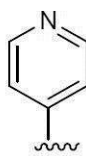
R^{14} の各出現は独立して任意に置換される C_{1-6} 脂肪族基である、化合物。

(項 目 1 3)

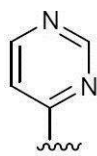
項目 1 0 に記載の化合物であって、HY は以下に示す構造式から選択され、

【化 1 2 - 3】

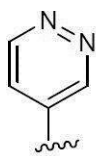
【化 1 2】



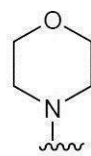
i、



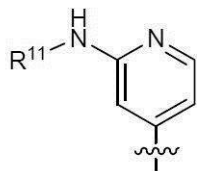
ii、



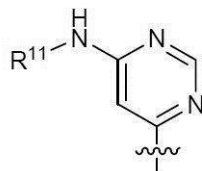
iii、



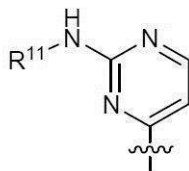
iv、



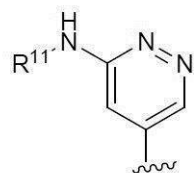
v、



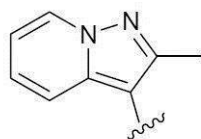
vi、



vii、



viii または ix



各 H Y 基は R^{10} または R^{14} の 1 つまたは複数の出現で、任意に、さらに置換される、化合物。

(項目 1 4)

G_1 は N である、項目 1 0 に記載の化合物。

(項目 1 5)

G_1 は CR^1 である、項目 1 0 に記載の化合物。

(項目 1 6)

項目 1 0 に記載の化合物であって、 R^2 の各出現は独立してハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 $-CN$ 、 C_{1-3} ハロアルキル、 $-OC_{1-3}$ アルキル、 $-OC_{1-3}$ ハロアルキル、 $-NHC(O)C_{1-3}$ アルキル、 $-NHC(O)NHC_{1-3}$ アルキル、 $-NHS(O)_2C_{1-3}$ アルキル、または $-C(O)H$ であり、 n は 0 ~ 3 である、化合物。

(項目 1 7)

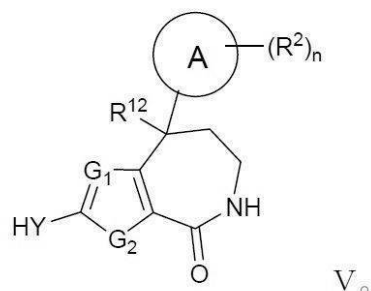
R^2 はハロゲンであり、および n は 1 または 2 である、項目 1 6 に記載の化合物。

(項目 1 8)

以下の構造式 V を有する、項目 1 に記載の化合物：

【化 1 3 - 3】

【化 1 3】



(項 目 1 9)

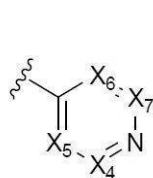
G_2 は S である、項目 1 8 に記載の化合物。

(項 目 2 0)

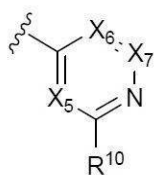
項目 1 8 に記載の化合物であって、HY は以下に示す構造式から選択され、

【化 1 4 - 3】

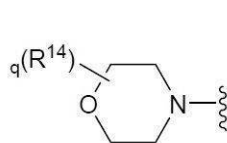
【化 1 4】



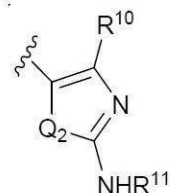
A、



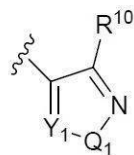
H、



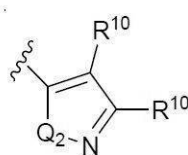
J、



K、



L、 または M



式中 X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、ただし X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 のうちの 2 つより多い出現が N であることはなく、

Q_1 および Q_2 の各出現は独立して S、O または $-NR^6$ であり、

Y_1 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、

または X_6 および X_7 、または Y_1 および Q_1 の 2 つの隣接する出現は、それらが結合される原子と一緒にあって、5～6 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1～5 のヘテロ原子を有する 5～6 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される縮合基を形成し、

R^{14} の各出現は独立して任意に置換される C_{1-6} 脂肪族基である、化合物。

(項 目 2 1)

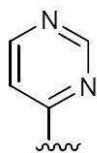
項目 1 8 に記載の化合物であって、HY は以下に示す構造式から選択され、

【化 15 - 3】

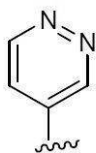
【化 15】



i、



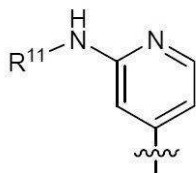
ii、



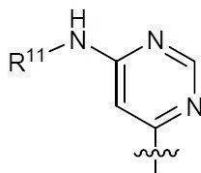
iii、



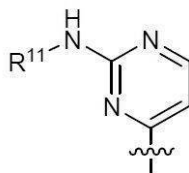
iv、



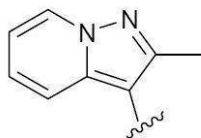
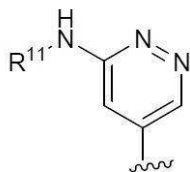
v、



vi、



vii、



viii または ix

各 H Y 基は R^{10} または R^{14} の 1 つまたは複数の出現で、任意に、さらに置換される、化合物。

(項目 22)

G_1 は N である、項目 18 に記載の化合物。

(項目 23)

G_1 は C_{1-3} である、項目 18 に記載の化合物。

(項目 24)

項目 18 に記載の化合物であって、環 A はフェニル基であり、 R^2 の各出現は独立してハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 $-CN$ 、 C_{1-3} ハロアルキル、 $-OC_{1-3}$ アルキル、 $-OC_{1-3}$ ハロアルキル、 $-NHC(O)C_{1-3}$ アルキル、 $-NHC(O)NHC_{1-3}$ アルキル、 $-NHS(O)_2C_{1-3}$ アルキル、または $-C(O)H$ であり、n は 0 ~ 3 である、化合物。

(項目 25)

環 A はフェニル基であり、 R^2 はハロゲンであり、および n は 1 または 2 である、項目 24 に記載の化合物。

(項目 26)

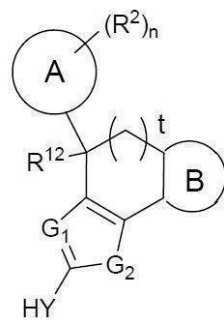
R^{12} は OH である、項目 18 に記載の化合物。

(項目 27)

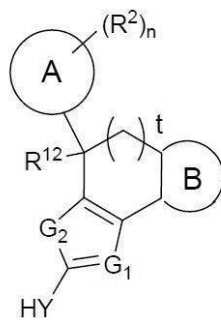
構造式 VI - A または VI - B に示す化合物

【化 16 - 3】

【化 16】



VI-A



VI-B

または薬剂的に許容される塩であり、式中

G_1 は N または CR^1 であり、ここで R^1 は H、 $-CN$ 、ハロゲン、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、または $-Z-R^{11}$ から選択される任意に置換される基であり、ここで

Z は任意に置換される C_{1-3} アルキレン鎖、 $-O-$ 、 $-N(R^{1a})-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(O)NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})C(O)-$ 、 $-N(R^{1a})CO_2-$ 、 $-S(O)_2NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})S(O)_2-$ 、 $-OC(O)N(R^{1a})-$ 、 $-N(R^{1a})C(O)NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})S(O)_2N(R^{1a})-$ 、または $-OC(O)-$ であり、

R^{1a} は水素または任意に置換される C_{1-4} 脂肪族であり、および

R^{11} は水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、および

G_2 は S、O、または NR^3 であり、ここで R^3 は水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族であり、

環 A は 6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

環 B は窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 のヘテロ原子を有する 5 または 6 員のヘテロシクリル、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 のヘテロ原子を有する 5 または 6 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、ただし環 B には酸素または硫黄の出現が 1 つよりおおくることはなく、

t は 1 ~ 3 であり、

R^2 の各出現は独立して $-R^{12a}$ 、 $-T_2-R^{12d}$ 、または $-V_2-T_2-R^{12d}$ であり、および

R^{12a} の各出現は独立してハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{12c}$ 、 $-N(R^{12b})_2$ 、 $-OR^{12b}$ 、 $-SR^{12c}$ 、 $-S(O)_2R^{12c}$ 、 $-C(O)R^{12b}$ 、 $-C(O)OR^{12b}$ 、 $-C(O)N(R^{12b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{12b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{12b})_2$ 、 $-N(R^{12e})C(O)R^{12b}$ 、 $-N(R^{12e})SO_2R^{12c}$ 、 $-N(R^{12e})C(O)OR^{12b}$ 、 $-N(R^{12e})C(O)N(R^{12e})$

$R^{1\ 2\ b})_2$ 、または $-N(R^{1\ 2\ e})SO_2N(R^{1\ 2\ b})_2$ であり、または $R^{1\ 2\ b}$ の 2 つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から選択される 0 ~ 1 の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環を形成し、

$R^{1\ 2\ b}$ の各出現は独立して水素、または $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

$R^{1\ 2\ c}$ の各出現は独立して $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

$R^{1\ 2\ d}$ の各出現は独立して水素、または 3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから任意に置換され、

$R^{1\ 2\ e}$ の各出現は独立して水素または任意に置換される $C_1 - C_6$ 脂肪族基であり、
 V_2 の各出現は独立して $-N(R^{1\ 2\ e})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{1\ 2\ e})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{1\ 2\ e})-$ 、 $-OC(O)N(R^{1\ 2\ e})-$ 、 $-N(R^{1\ 2\ e})C(O)-$ 、 $-N(R^{1\ 2\ e})SO_2-$ 、 $-N(R^{1\ 2\ e})C(O)O-$ 、 $-N(R^{1\ 2\ e})C(O)N(R^{1\ 2\ e})-$ 、 $-N(R^{1\ 2\ e})SO_2N(R^{1\ 2\ e})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{1\ 2\ e})-O-$ であり、および

T_2 は任意に置換される $C_1 - C_6$ アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^{1\ 3})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{1\ 3})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{1\ 3})-$ 、 $-OC(O)N(R^{1\ 3})-$ 、 $-N(R^{1\ 3})C(O)-$ 、 $-N(R^{1\ 3})SO_2-$ 、 $-N(R^{1\ 3})C(O)O-$ 、 $-N(R^{1\ 3})C(O)N(R^{1\ 3})-$ 、 $-N(R^{1\ 3})S(O)_2N(R^{1\ 3})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{1\ 3})-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_2 若しくはその部分は、任意に置換される 3 ~ 7 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分を任意に形成し、ここで $R^{1\ 3}$ は水素または任意に置換される $C_1 - C_4$ 脂肪族基であり、

n は 0 ~ 4 であり、

$R^{1\ 2}$ は水素、ハロ、または $C_1 - C_6$ 脂肪族、 $-C(O)N(R^{5\ a})_2$ 、3 ~ 10 員の脂環式、 $-N(R^{4\ b})_2$ 、 $-OR^{4\ a}$ 、または $-SR^{4\ a}$ から選択される任意に置換される基であり、

または $R^{2\ 2}$ および $R^{1\ 2}$ は任意に置換される 3 ~ 10 員の脂環式を形成し、

$R^{4\ a}$ の各出現は独立して水素または任意に置換される $C_1 - C_6$ 脂肪族であり、

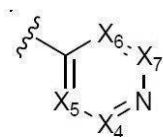
$R^{4\ b}$ の各出現は独立して水素、または任意に置換される $C_1 - C_6$ 脂肪族、 $-OR^{4\ c}$ 、または $-N(R^{4\ a})_2$ から選択される基であり、

$R^{4\ c}$ の各出現は独立して水素または任意に置換される $C_1 - C_6$ 脂肪族であり、

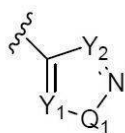
HY は以下に示す構造式から選択される任意に置換される基であり、

【化 17 - 3】

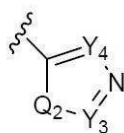
【化 17】



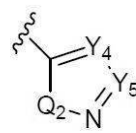
A、



B、



C、または



D

—

ここで X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、ただし X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 のうちの 2 つより多い出現が N であることはなく、 Q_1 および Q_2 の各出現は独立して S、O または $-NR^6$ であり、 Y_1 、 Y_2 、 Y_3 、 Y_4 、および Y_5 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、または X_4 および X_5 、 X_6 および X_7 、 Y_1 および Q_1 、 Y_3 および Q_2 、または Y_4 および Y_5 の 2 つの隣接する出現は、それらが結合する原子と一緒にあって、5 ~ 6 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 6 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される縮合基を形成し、

ここで R^{10} は $-R^{10b}$ 、 $-V_1-R^{10c}$ 、 $-T_1-R^{10b}$ 、または $-V_1-T_1-R^{10b}$ であり、ここで

V_1 は $-NR^7$ 、 $-NR^7-C(O)-$ 、 $-NR^7-C(S)-$ 、 $-NR^7-C(NR^7)-$ 、 $-NR^7C(O)OR^{10a}$ 、 $-NR^7C(O)NR^7$ 、 $-NR^7C(O)SR^{10a}$ 、 $-NR^7C(S)OR^{10a}$ 、 $-NR^7C(S)NR^7$ 、 $-NR^7C(S)SR^{10a}$ 、 $-NR^7C(NR^7)OR^{10a}$ 、 $-NR^7C(NR^7)NR^7$ 、 $-NR^7S(O)_2$ 、 $-NR^7S(O)_2NR^7$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2$ 、 $-C(O)NR^7$ 、 $-C(O)NR^7O$ 、 $-SO_2$ 、または $-SO_2NR^7$ であり、

R^{10a} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

T_1 は任意に置換される C_{1-6} アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^7)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^7)-$ 、 $-S(O)_2N(R^7)-$ 、 $-OC(O)N(R^7)-$ 、 $-N(R^7)C(O)-$ 、 $-N(R^7)SO_2-$ 、 $-N(R^{10a})C(O)O-$ 、 $-NR^{10a}C(O)N(R^{10a})-$ 、 $-N(R^{10a})S(O)_2N(R^{10a})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^7)-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_1 は任意に置換される 3 ~ 7 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分形成し、

R^{10b} の各出現は独立して水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^7)_2$ 、 $-OR^{10a}$ 、 $-SR^{10a}$ 、 $-S(O)_2R^{10a}$ 、 $-C(O)R^{10a}$ 、 $-C(O)OR^{10a}$ 、 $-C(O)N(R^7)_2$ 、 $-S(O)_2N(R^7)_2$ 、 $-OC(O)N(R^7)_2$ 、 $-N(R^7)C(O)R^{10a}$ 、 $-N(R^7)SO_2R^{10a}$ 、 $-N(R^7)C(O)OR^{10a}$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^7)_2$ 、または $-N(R^7)SO_2N(R^7)_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテ

口原子を有する 5 ～ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、
 R^{10c} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ～ 10 員の脂環式、
 窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 4 ～ 10
 員のヘテロシクリル、6 ～ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立
 して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 5 ～ 10 員のヘテロアリールから選択される
 任意に置換される基であり、または

R^7 および R^{10c} はそれらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若
 しくは硫黄から独立して選択される 0 ～ 1 の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される
 4 ～ 7 員のヘテロシクリル環を形成し、

R^7 の各出現は独立して水素、 $-C(O)R^{7a}$ 、 $-CO_2R^{7a}$ 、 $-C(O)N(R^{7a})_2$ 、 $-C(O)N(R^{7a})-OR^{7a}$ 、 $-SO_2R^{7a}$ 、 $-SO_2N(R^{7a})_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3 ～ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立し
 て選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 4 ～ 10 員のヘテロシクリル、6 ～ 10 員のア
 リール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を
 有する 5 ～ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

ここで R^{7a} の各出現は独立して水素または C_{1-6} 脂肪族、3 ～ 10 員の脂環式
 、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 4 ～ 1
 0 員のヘテロシクリル、6 ～ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独
 立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 5 ～ 10 員のヘテロアリールから選択され
 る任意に置換される基であり、

R^6 の各出現は独立して水素、 $-C(O)R^{6a}$ 、 $-CO_2R^{6a}$ 、 $-C(O)N(R^{6b})_2$ 、 $-SO_2R^{6a}$ 、 $-SO_2N(R^{6b})_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3 ～ 10
 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有
 する 4 ～ 10 員のヘテロシクリル、6 ～ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは
 硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 5 ～ 10 員のヘテロアリールか
 ら選択される任意に置換される基であり、

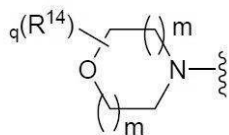
ここで R^{6a} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ～ 10 員の脂環式
 、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 4 ～ 1
 0 員のヘテロシクリル、6 ～ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独
 立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 5 ～ 10 員のヘテロアリールから選択され
 る任意に置換される基であり、

R^{6b} の各出現は水素または C_{1-6} 脂肪族、3 ～ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若
 しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 4 ～ 10 員のヘテロシク
 リル、6 ～ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される
 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 5 ～ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換され
 る基であるか、または R^{6b} の 2 つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒になっ
 て、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 3 ～
 6 員のヘテロシクリル、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5
 のヘテロ原子を有する 5 ～ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基を
 形成し、

または H Y は

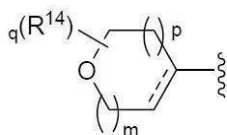
【化 18 - 3】

【化 18】



E

または



F

であり、

ここで R^{14} の各出現は独立して $-R^{14a}$ または $-T_1-R^{14d}$ であり、ここで R^{14a} の各出現は、原子価および安定性が許容できる範囲で独立してフッ素、 $=O$ 、 $=S$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{14c}$ 、 $-N(R^{14b})_2$ 、 $-OR^{14b}$ 、 $-SR^{14c}$ 、 $-S(O)_2R^{14c}$ 、 $-C(O)R^{14b}$ 、 $-C(O)OR^{14b}$ 、 $-C(O)N(R^{14b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{14b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{14b})_2$ 、 $-N(R^{14e})C(O)R^{14b}$ 、 $-N(R^{14e})SO_2R^{14c}$ 、 $-N(R^{14e})C(O)OR^{14b}$ 、 $-N(R^{14e})C(O)N(R^{14b})_2$ 、または $-N(R^{14e})SO_2N(R^{14b})_2$ であるか、または R^{14b} の 2 つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒に、窒素、酸素、若しくは硫黄から選択される 0 ~ 1 の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環を形成し、

R^{14b} の各出現は独立して水素、または $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから任意に置換される基であり、

R^{14c} の各出現は独立して $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから任意に置換される基であり、

R^{14d} の各出現は独立して水素、または 3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから任意に置換され、

R^{14e} の各出現は独立して水素または任意に置換される $C_1 - C_6$ 脂肪族基であり、および

T_1 は任意に置換される $C_1 - C_6$ アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^{14b})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{14b})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{14b})-$ 、 $-OC(O)N(R^{14b})-$ 、 $-N(R^{14b})C(O)-$ 、 $-N(R^{14b})SO_2-$ 、 $-N(R^{14b})C(O)O-$ 、 $-NR^{14b}C(O)N(R^{14b})-$ 、 $-N(R^{14b})S(O)_2N(R^{14b})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{14b})-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_1 若しくはその部分は、任意に置換される 3 ~ 7 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分を任意に形成し、

q は 0 ~ 6 であり、

m は 1 または 2 であり、および

p は 0、1、または 2 である、

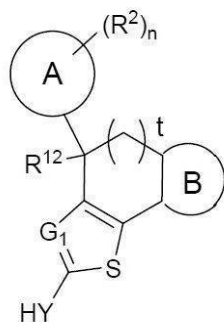
化合物または薬剂的に許容される塩。

(項目 28)

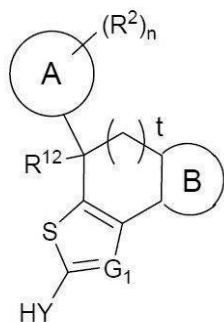
構造式 VII - A または VII - B に示す化合物

【化 19 - 3】

【化 19】



VII-A



VII-B

または薬剤的に許容される塩であって、式中

G_1 は N または CR^1 であり、ここで R^1 は H、 $-CN$ 、ハロゲン、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、または $-Z-R^{11}$ であり、ここで

Z は任意に置換される C_{1-3} アルキレン鎖、 $-O-$ 、 $-N(R^{1a})-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(O)NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})C(O)-$ 、 $-N(R^{1a})CO_2-$ 、 $-S(O)_2NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})S(O)_2-$ 、 $-OC(O)N(R^{1a})-$ 、 $-N(R^{1a})C(O)NR^{1a}-$ 、 $-N(R^{1a})S(O)_2N(R^{1a})-$ 、または $-OC(O)-$ から選択され、

R^{1a} は水素または任意に置換される C_{1-4} 脂肪族であり、および

R^{11} は水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、および

環 A は 6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

環 B は窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 のヘテロ原子を有する 5 または 6 員のヘテロシクリルまたは窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 のヘテロ原子を有する 5 または 6 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、ただし環 B には酸素または硫黄の出現が 1 つより多くなることはなく、

t は 1 ~ 3 であり、

R^2 の各出現は独立して $-R^{12}$ 、 $-T_2-R^{12d}$ 、または $-V_2-T_2-R^{12d}$ であり、および

R^{12a} の各出現は独立してハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{12c}$ 、 $-N(R^{12b})_2$ 、 $-OR^{12b}$ 、 $-SR^{12c}$ 、 $-S(O)_2R^{12c}$ 、 $-C(O)R^{12b}$ 、 $-C(O)OR^{12b}$ 、 $-C(O)N(R^{12b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{12b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{12b})_2$ 、 $-N(R^{12e})C(O)R^{12b}$ 、 $-N(R^{12e})SO_2R^{12c}$ 、 $-N(R^{12e})C(O)OR^{12b}$ 、 $-N(R^{12e})C(O)N(R^{12b})_2$ 、または $-N(R^{12e})SO_2N(R^{12b})_2$ であり、または R^{12b} の 2 つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒に、窒素、酸素、若しくは硫黄から選択される 0 ~ 1 の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環を形成し、

R^{12b} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、

窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1～5 のヘテロ原子を有する 4～10 員のヘテロシクリル、6～10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1～5 のヘテロ原子を有する 5～10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{12c} の各出現は独立して C_{1-6} 脂肪族、3～10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1～5 のヘテロ原子を有する 4～10 員のヘテロシクリル、6～10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1～5 のヘテロ原子を有する 5～10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{12d} の各出現は独立して水素、または 3～10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1～5 のヘテロ原子を有する 4～10 員のヘテロシクリル、6～10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1～5 のヘテロ原子を有する 5～10 員のヘテロアリールから任意に置換され、

R^{12e} の各出現は独立して水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族基であり、
 V_2 の各出現は独立して $-N(R^{12e})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{12e})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{12e})-$ 、 $-OC(O)N(R^{12e})-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)-$ 、 $-N(R^{12e})SO_2-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)O-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)N(R^{12e})-$ 、 $-N(R^{12e})SO_2N(R^{12e})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{12e})-O-$ であり、および

T_2 は任意に置換される C_{1-6} アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^{13})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{13})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{13})-$ 、 $-OC(O)N(R^{13})-$ 、 $-N(R^{13})C(O)-$ 、 $-N(R^{13})SO_2-$ 、 $-N(R^{13})C(O)O-$ 、 $-N(R^{13})C(O)N(R^{13})-$ 、 $-N(R^{13})S(O)_2N(R^{13})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{13})-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_2 若しくはその部分は任意に置換される 3～7 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分を任意に形成し、ここで R^{13} は水素または任意に置換される C_{1-4} 脂肪族基であり、

n は 0～4 であり、

R^{12} は水素、ハロまたは C_{1-6} 脂肪族、 $-C(O)N(R^{5a})_2$ 、3～10 員の脂環式、 $-N(R^{4b})_2$ 、 $-OR^{4a}$ 、または $-SR^{4a}$ であり、

または R^2 および R^{12} は任意に置換される 3～10 員の脂環式を形成し、

R^{4a} の各出現は独立して水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族であり、

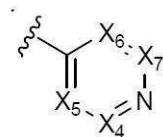
R^{4b} の各出現は独立して水素、または任意に置換される $-OR^{4c}$ 、または $-N(R^{4a})_2$ から選択される基であり、

R^{4c} の各出現は独立して水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族であり、

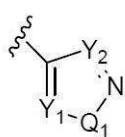
HY は以下に示す構造式から選択される任意に置換される基であり、

【化 20 - 3】

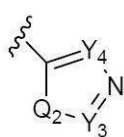
【化 20】



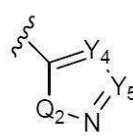
A、



B、



C、



D

ここで X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、

ただし、 X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 のうちの2つより多い出現がNであることはなく、

Q_1 および Q_2 の各出現は独立してS、Oまたは $-NR^6$ であり、

Y_1 、 Y_2 、 Y_3 、 Y_4 、および Y_5 の各出現は独立して $-CR^{10}$ またはNであり、

または X_4 および X_5 、 X_6 および X_7 、 Y_1 および Q_1 、 Y_3 および Q_2 、または Y_4 および Y_5 の2つの隣接する出現は、それらが結合する原子と一緒にあって、5～6員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～6員のヘテロアリールから選択される任意に置換される縮合基を形成し、

ここで R^{10} は $-R^{10b}$ 、 $-V_1-R^{10c}$ 、 $-T_1-R^{10b}$ 、または $-V_1-T_1-R^{10b}$ であり、ここで

V_1 は $-NR^7$ 、 $-NR^7-C(O)-$ 、 $-NR^7-C(S)-$ 、 $-NR^7-C(NR^7)-$ 、 $-NR^7C(O)OR^{10a}$ 、 $-NR^7C(O)NR^7$ 、 $-NR^7C(O)SR^{10a}$ 、 $-NR^7C(S)OR^{10a}$ 、 $-NR^7C(S)NR^7$ 、 $-NR^7C(S)SR^{10a}$ 、 $-NR^7C(NR^7)OR^{10a}$ 、 $-NR^7C(NR^7)NR^7$ 、 $-NR^7S(O)_2$ 、 $-NR^7S(O)_2NR^7$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2$ 、 $-C(O)NR^7$ 、 $-C(O)NR^7O-$ 、 $-SO_2$ 、または $-SO_2NR^7$ であり、

R^{10a} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

T_1 は任意に置換される C_{1-6} アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^7)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^7)-$ 、 $-S(O)_2N(R^7)-$ 、 $-OC(O)N(R^7)-$ 、 $-N(R^7)C(O)-$ 、 $-N(R^7)SO_2-$ 、 $-N(R^{10a})C(O)O-$ 、 $-NR^{10a}C(O)N(R^{10a})-$ 、 $-N(R^{10a})S(O)_2N(R^{10a})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^7)-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_1 は任意に置換される3～7員の脂環式またはヘテロシクリル環を形成し、

R^{10b} の各出現は独立して水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^7)_2$ 、 $-OR^{10a}$ 、 $-SR^{10a}$ 、 $-S(O)_2R^{10a}$ 、 $-C(O)R^{10a}$ 、 $-C(O)OR^{10a}$ 、 $-C(O)N(R^7)_2$ 、 $-S(O)_2N(R^7)_2$ 、 $-OC(O)N(R^7)_2$ 、 $-N(R^7)C(O)R^{10a}$ 、 $-N(R^7)SO_2R^{10a}$ 、 $-N(R^7)C(O)OR^{10a}$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^7)_2$ 、または $-N(R^7)SO_2N(R^7)_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{10c} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、または

R^7 および R^{10c} は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される0～1のヘテロ原子を有する任意に置換される4～7員のヘテロシクリル環を形成し、

R^7 の各出現は独立して水素、 $-C(O)R^{7a}$ 、 $-CO_2R^{7a}$ 、 $-C(O)N(R^{7a})_2$ 、 $-C(O)N(R^{7a})-OR^{7a}$ 、 $-SO_2R^{7a}$ 、 $-SO_2N(R^{7a})_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立し

て選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 4 ～ 10 員のヘテロシクリル、6 ～ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 5 ～ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

ここで R^{7a} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ～ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 4 ～ 10 員のヘテロシクリル、6 ～ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 5 ～ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{6a} の各出現は独立して水素、 $-C(O)R^{6a}$ 、 $-CO_2R^{6a}$ 、 $-C(O)N(R^{6b})_2$ 、 $-SO_2R^{6a}$ 、 $-SO_2N(R^{6b})_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3 ～ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 4 ～ 10 員のヘテロシクリル、6 ～ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 5 ～ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

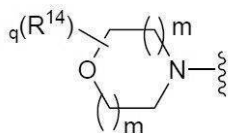
ここで R^{6a} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ～ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 4 ～ 10 員のヘテロシクリル、6 ～ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 5 ～ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{6b} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ～ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 4 ～ 10 員のヘテロシクリル、6 ～ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 5 ～ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であるか、または R^{6b} の 2 つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ～ 5 のヘテロ原子を有する 3 ～ 6 員のヘテロシクリル、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 5 ～ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基を形成し、

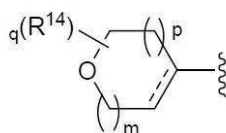
または HY は

【化 2 1 - 3】

【化 2 1】



E または



F

であり、

R^{14} の各出現は独立して $-R^{14a}$ または $-T_1-R^{14d}$ であり、ここで

R^{14a} の各出現は、原子価および安定性が許容できる範囲で独立してフッ素、 $=O$ 、 $=S$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{14c}$ 、 $-N(R^{14b})_2$ 、 $-OR^{14b}$ 、 $-SR^{14c}$ 、 $-S(O)_2R^{14c}$ 、 $-C(O)R^{14b}$ 、 $-C(O)OR^{14b}$ 、 $-C(O)N(R^{14b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{14b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{14b})_2$ 、 $-N(R^{14e})C(O)R^{14b}$ 、 $-N(R^{14e})SO_2R^{14c}$ 、 $-N(R^{14e})C(O)OR^{14b}$ 、 $-N(R^{14e})C(O)N(R^{14b})_2$ 、または $-N(R^{14e})SO_2N(R^{14b})_2$ であるか、または R^{14a} の 2 つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から選択される 0 ～ 1 の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される 4 ～ 7 員のヘテロシクリル環を形成し、

R^{14b} の各出現は、独立して水素、または $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{14c} の各出現は、独立して $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{14d} の各出現は、独立して水素、または 3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから任意に置換され、

R^{14e} の各出現は、独立して水素または任意に置換される $C_1 - C_6$ 脂肪族基であり、および

T_1 は任意に置換される $C_1 - C_6$ アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、
 $-N(R^{14b})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{14b})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{14b})-$ 、 $-OC(O)N(R^{14b})-$ 、 $-N(R^{14b})C(O)-$ 、 $-N(R^{14b})SO_2-$ 、 $-N(R^{14b})C(O)O-$ 、 $-NR^{14b}C(O)N(R^{14b})-$ 、 $-N(R^{14b})S(O)_2N(R^{14b})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{14b})-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_1 若しくはその部分は、任意に置換される 3 ~ 7 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分を任意に形成し、

q は 0 ~ 6 であり、

m は 1 または 2 であり、および

p は 0、1、または 2 である、

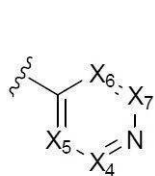
化合物または薬剂的に許容される塩。

(項目 29)

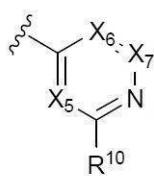
項目 27 または 28 に記載の化合物であって、 HY は以下に示す構造式から選択され、

【化 22 - 3】

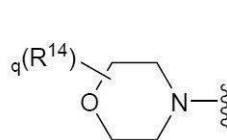
【化 22】



A、



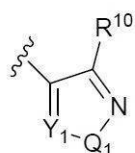
H、



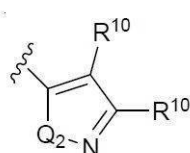
J、



K、



L、 または M



式中 X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、ただし X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 のうちの 2 つより多い出現が N であることはなく、

Q_1 および Q_2 の各出現は独立して S 、 O または $-NR^6$ であり、

Y_1 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、

または X_6 および X_7 、または Y_1 および Q_1 の 2 つの隣接する出現は、それらが結合される原子と一緒にあって、5～6 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1～5 のヘテロ原子を有する 5～6 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される縮合基を形成し、

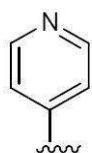
R^{14} の各出現は独立して任意に置換される C_{1-6} 脂肪族基である、
化合物。

(項目 30)

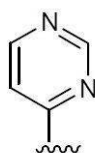
項目 27 または 28 に記載の化合物であって、HY は以下に示す構造式から選択され、

【化 23 - 3】

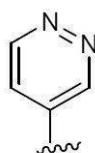
【化 23】



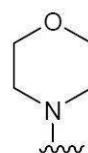
i、



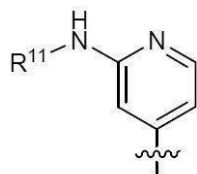
ii、



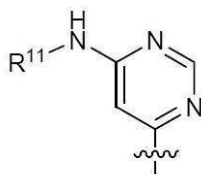
iii、



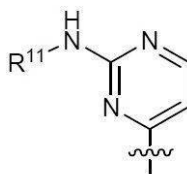
iv、



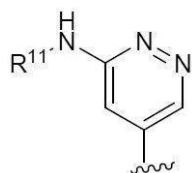
v、



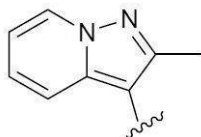
vi、



vii、



viii または ix



各 HY 基は、 R^{10} または R^{14} の 1 つまたは複数の出現で、任意に、さらに置換される、化合物。

(項目 31)

G_1 は N である、項目 27 または 28 に記載の化合物。

(項目 32)

G_1 は CR^1 である、項目 27 または 28 に記載の化合物。

(項目 33)

項目 27 または 28 に記載の化合物であって、環 A はフェニル基であり、 R^2 の各出現は独立してハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 $-CN$ 、 C_{1-3} ハロアルキル、 $-OC_{1-3}$ アルキル、 $-OC_{1-3}$ ハロアルキル、 $-NHC(O)C_{1-3}$ アルキル、 $-NHC(O)NHC_{1-3}$ アルキル、 $-NHS(O)_2C_{1-3}$ アルキル、または $-C(O)H$ であり、および n は 0～3 である、化合物。

(項目 34)

環 A はフェニル基であり、 R^2 はハロゲンであり、n は 1 または 2 である、項目 33 に記載の化合物。

(項目 35)

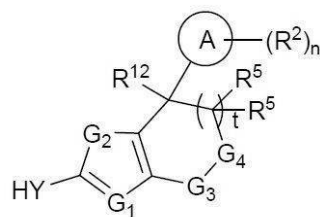
R^{12} は OH である、項目 27 または 28 に記載の化合物。

(項目 36)

(項目 3 7)

【化 2 4 - 3】

または



V I I I-B

R^{1 2 b}の各出現は独立して水素、またはC₁ - C₆脂肪族、3 ~ 10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1 ~ 5のヘテロ原子を有する4 ~ 10

員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{12c} の各出現は独立して C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{12d} の各出現は独立して水素、または3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから任意に置換され、

R^{12e} の各出現は独立して水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族基であり、 V_2 の各出現は独立して $-N(R^{12e})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{12e})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{12e})-$ 、 $-OC(O)N(R^{12e})-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)-$ 、 $-N(R^{12e})SO_2-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)O-$ 、 $-N(R^{12e})C(O)N(R^{12e})-$ 、 $-N(R^{12e})SO_2N(R^{12e})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{12e})-O-$ であり、および

T_2 は任意に置換される C_{1-6} アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^{13})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{13})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{13})-$ 、 $-OC(O)N(R^{13})-$ 、 $-N(R^{13})C(O)-$ 、 $-N(R^{13})SO_2-$ 、 $-N(R^{13})C(O)O-$ 、 $-N(R^{13})C(O)N(R^{13})-$ 、 $-N(R^{13})S(O)_2N(R^{13})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{13})-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_2 若しくはその部分は任意に置換される3～7員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分形成し、ここで R^{13} は水素または任意に置換される C_{1-4} 脂肪族基であり、

n は0～4であり、

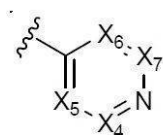
R^{12} は水素、ハロ、または C_{1-6} 脂肪族、 $-C(O)N(R^{5a})_2$ 、3～10員の脂環式、 $-N(R^{4b})_2$ 、 $-OR^{4a}$ 、または $-SR^{4a}$ から選択される任意に置換される基であり、

または R^2 および R^{12} は任意に置換される3～10員の脂環式を形成し、

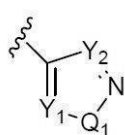
HY は以下に示す構造式から選択される任意に置換される基であり、

【化25-3】

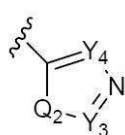
【化25】



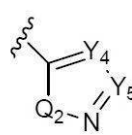
A、



B、



C、または D



ここで X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 の各出現は独立して $-CR^{10}$ またはNであり、ただし X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 のうちの2つより多い出現がNであることはなく、

Q_1 および Q_2 の各出現は独立してS、Oまたは $-NR^6$ であり、

Y_1 、 Y_2 、 Y_3 、 Y_4 、および Y_5 の各出現は独立して $-CR^{10}$ またはNであり、

または X_4 および X_5 、 X_6 および X_7 、 Y_1 および Q_1 、 Y_3 および Q_2 、または

Y_4 および Y_5 の 2 つの隣接する出現は、それらが結合する原子と一緒にあって、5 ~ 6 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 6 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される縮合基を形成し

R^{10} は $-R^{10b}$ 、 $-V_1-R^{10c}$ 、 $-T_1-R^{10b}$ 、または $-V_1-T_1-R^{10b}$ であり、ここで

V_1 は $-NR^7$ 、 $-NR^7-C(O)-$ 、 $-NR^7-C(S)-$ 、 $-NR^7-C(NR^7)-$ 、 $-NR^7-C(O)OR^{10a}$ 、 $-NR^7-C(O)NR^7$ 、 $-NR^7-C(O)SR^{10a}$ 、 $-NR^7-C(S)OR^{10a}$ 、 $-NR^7-C(S)NR^7$ 、 $-NR^7-C(S)SR^{10a}$ 、 $-NR^7-C(NR^7)OR^{10a}$ 、 $-NR^7-C(NR^7)NR^7$ 、 $-NR^7-S(O)_2$ 、 $-NR^7-S(O)_2NR^7$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2$ 、 $-C(O)NR^7$ 、 $-C(O)NR^7O-$ 、 $-SO_2$ 、または $-SO_2NR^7$ であり、

R^{10a} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

T_1 は任意に置換される C_{1-6} アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、 $-N(R^7)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^7)-$ 、 $-S(O)_2N(R^7)-$ 、 $-OC(O)N(R^7)-$ 、 $-N(R^7)C(O)-$ 、 $-N(R^7)SO_2-$ 、 $-N(R^{10a})C(O)O-$ 、 $-NR^{10a}C(O)N(R^{10a})-$ 、 $-N(R^{10a})S(O)_2N(R^{10a})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^7)-O-$ によって任意に割り込まれ、または T_1 は任意に置換される 3 ~ 7 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分形成し、

R^{10b} の各出現は独立して水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^7)_2$ 、 $-OR^{10a}$ 、 $-SR^{10a}$ 、 $-S(O)_2R^{10a}$ 、 $-C(O)R^{10a}$ 、 $-C(O)OR^{10a}$ 、 $-C(O)N(R^7)_2$ 、 $-S(O)_2N(R^7)_2$ 、 $-OC(O)N(R^7)_2$ 、 $-N(R^7)C(O)R^{10a}$ 、 $-N(R^7)SO_2R^{10a}$ 、 $-N(R^7)C(O)OR^{10a}$ 、 $-N(R^7)C(O)N(R^7)_2$ 、または $-N(R^7)SO_2N(R^7)_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{10c} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、または

R^7 および R^{10c} は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 0 ~ 1 の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環を形成し、

R^7 の各出現は独立して水素、 $-C(O)R^{7a}$ 、 $-CO_2R^{7a}$ 、 $-C(O)N(R^{7a})_2$ 、 $-C(O)N(R^{7a})-OR^{7a}$ 、 $-SO_2R^{7a}$ 、 $-SO_2N(R^{7a})_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

ここで R^{7a} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~

10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{6a} の各出現は独立して水素、 $-C(O)R^{6a}$ 、 $-CO_2R^{6a}$ 、 $-C(O)N(R^{6b})_2$ 、 $-SO_2R^{6a}$ 、 $-SO_2N(R^{6b})_2$ 、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

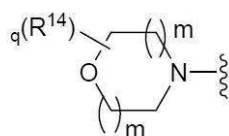
ここで R^{6a} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、および

R^{6b} の各出現は独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であるか、または R^{6b} の2つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する3～6員のヘテロシクリル、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基を形成し、

またはHYは

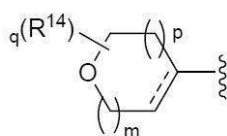
【化26-3】

【化26】



E

または



F

■

であり、

R^{14} の各出現は独立して $-R^{14a}$ または $-T_1-R^{14d}$ であり、ここで

R^{14a} の各出現は、原子価および安定性が許容できる範囲で独立してフッ素、 $=O$ 、 $=S$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{14c}$ 、 $-N(R^{14b})_2$ 、 $-OR^{14b}$ 、 $-SR^{14c}$ 、 $-S(O)_2R^{14c}$ 、 $-C(O)R^{14b}$ 、 $-C(O)OR^{14b}$ 、 $-C(O)N(R^{14b})_2$ 、 $-S(O)_2N(R^{14b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{14b})_2$ 、 $-N(R^{14e})C(O)R^{14b}$ 、 $-N(R^{14e})SO_2R^{14c}$ 、 $-N(R^{14e})C(O)OR^{14b}$ 、 $-N(R^{14e})C(O)N(R^{14b})_2$ 、または $-N(R^{14e})SO_2N(R^{14b})_2$ であるか、または R^{14b} の2つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から選択される0～1の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される4～7員のヘテロシクリル環を形成し、

R^{14b} の各出現は、独立して水素、または C_{1-6} 脂肪族、3～10員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する4～10員のヘテロシクリル、6～10員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される1～5のヘテロ原子を有する5～10員のヘテロアリールから選択され

る任意に置換される基であり、

R^{14c} の各出現は、独立して $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{14d} の各出現は、独立して水素、または 3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから任意に置換され、

R^{14e} の各出現は、独立して水素または任意に置換される $C_1 - C_6$ 脂肪族基であり、および

T_1 は、任意に置換される $C_1 - C_6$ アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、
 $-N(R^{14b})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、
 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{14b})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{14b})-$ 、 $-OC(O)N(R^{14b})-$ 、
 $-N(R^{14b})C(O)-$ 、 $-N(R^{14b})SO_2-$ 、 $-N(R^{14b})C(O)O-$ 、
 $-NR^{14b}C(O)N(R^{14b})-$ 、 $-N(R^{14b})S(O)_2N(R^{14b})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{14b})-O-$
 によって任意に割り込まれ、または T_1 若しくはその部分は任意に置換される 3 ~ 7 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分を任意に形成し、

q は 0 ~ 6 であり、

m は 1 または 2 であり、

p は 0、1、または 2 であり、

t は 1 または 2 であり、

R^5 の各出現は、独立して $-R^{15a}$ または $-T_5 - R^{15d}$ であり、ここで

R^{15a} の各出現は、原子価および安定性が許容できる範囲で独立して水素、フッ素、
 $=O$ 、 $=S$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-R^{15c}$ 、 $-N(R^{15b})_2$ 、 $-OR^{15b}$ 、 $-SR^{15c}$ 、
 $-S(O)_2R^{15c}$ 、 $-C(O)R^{15b}$ 、 $-C(O)OR^{15b}$ 、 $-C(O)N(R^{15b})_2$ 、
 $-S(O)_2N(R^{15b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{15b})_2$ 、 $-N(R^{15e})C(O)R^{15b}$ 、
 $-N(R^{15e})SO_2R^{15c}$ 、 $-N(R^{15e})C(O)OR^{15b}$ 、 $-N(R^{15e})C(O)N(R^{15b})_2$ 、
 または $-N(R^{15e})SO_2N(R^{15b})_2$ であるか、 R^{15b} の 2 つの出現は、それらが結合される窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素、若しくは硫黄から選択される 0 ~ 1 の追加のヘテロ原子を有する任意に置換される 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環を形成し、

R^{15b} の各出現は、独立して水素、または $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{15c} の各出現は、独立して $C_1 - C_6$ 脂肪族、3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{15d} の各出現は、独立して水素、 $-N(R^{15b})_2$ 、 $-OR^{15b}$ 、 $-SR^{15c}$ 、
 $-S(O)_2R^{15c}$ 、 $-C(O)R^{15b}$ 、 $-C(O)OR^{15b}$ 、 $-C(O)N(R^{15b})_2$ 、
 $-S(O)_2N(R^{15b})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{15b})_2$ 、 $-N(R^{15e})C(O)R^{15b}$ 、
 $-N(R^{15e})SO_2R^{15c}$ 、 $-N(R^{15e})C(O)OR^{15b}$ 、 $-N(R^{15e})C(O)N(R^{15b})_2$ 、
 $-N(R^{15e})SO_2N(R^{15b})_2$ 、または 3 ~ 10 員の脂環式、窒素、酸素、若しくは硫黄から独立

して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 4 ~ 10 員のヘテロシクリル、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基であり、

R^{15e} の各出現は、独立して水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族基であり、および

T_5 は、任意に置換される C_{1-6} アルキレン鎖であり、ここでアルキレン鎖は、
 $-N(R^{15b})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)-$ 、
 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R^{15b})-$ 、 $-S(O)_2N(R^{15b})-$ 、 $-OC(O)N(R^{15b})-$ 、
 $-N(R^{15b})C(O)-$ 、 $-N(R^{15b})SO_2-$ 、 $-N(R^{15b})C(O)O-$ 、
 $-NR^{15b}C(O)N(R^{15b})-$ 、 $-N(R^{15b})S(O)_2N(R^{15b})-$ 、 $-OC(O)-$ 、または $-C(O)N(R^{15b})-O-$
 により任意に割り込まれ、または T_5 若しくはその部分は任意に置換される 3 ~ 7 員の脂環式またはヘテロシクリル環の部分を任意に形成する、

化合物または薬剤的に許容される塩。

(項目 38)

G_1 は CR^1 または N であり、および G_2 は S である、項目 37 に記載の化合物。

(項目 39)

G_1 は CR^1 または N であり、および G_2 は Se である、項目 37 に記載の化合物。

(項目 40)

G_1 は CR^1 または N であり、および G_2 は O である、項目 37 に記載の化合物。

(項目 41)

G_1 は CR^1 または N であり、および G_2 は NR^3 である、項目 37 に記載の化合物。

(項目 42)

G_1 は CR^1 であり、および G_2 は S である、項目 37 に記載の化合物。

(項目 43)

G_1 は N であり、および G_2 は S である、項目 37 に記載の化合物。

(項目 44)

項目 37 ~ 43 のいずれか 1 項の化合物であって、 G_1 が CR^1 であるとき、 R^1 は水素、 CN 、任意に置換される C_{1-6} 脂肪族または C_{3-6} 脂環式、または任意に置換されるアルキンである、化合物。

(項目 45)

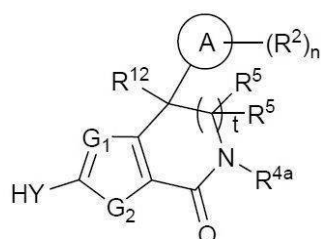
構造式 VII I I - A を有する、項目 37 ~ 43 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 46)

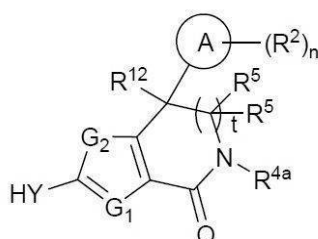
構造式 VII I I I - A - i または VII I I I - B - i を有する、項目 37 ~ 43 のいずれか 1 項に記載の化合物：

【化 27 - 3】

【化 27】



VII I I I - A - i



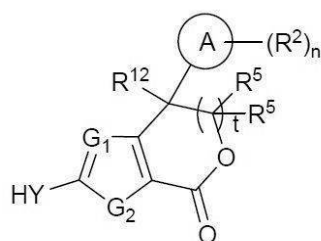
VII I I I - B - i。

(項目 47)

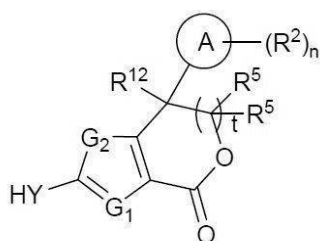
構造式 VII I I I I - A - i i または VII I I I I - B - i i を有する、項目 37 ~ 43 のいずれか 1 項に記載の化合物：

【化 2 8 - 3】

【化 2 8】



V I I I - A - i i i



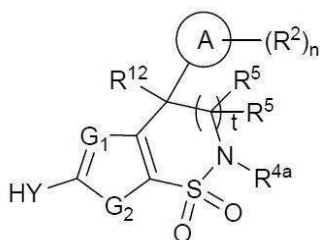
V I I I - B - i i i。

(項 目 4 8)

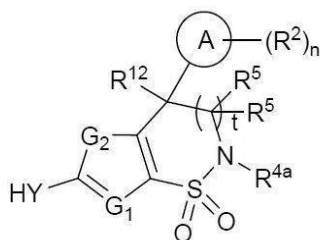
構造式 V I I I - A - i i i または V I I I - B - i i i を有する、項目 3 7 ~ 4 3 のいずれか 1 項に記載の化合物：

【化 2 9 - 3】

【化 2 9】



V I I I - A - i i i i



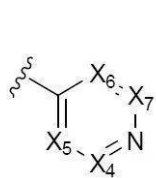
V I I I - B - i i i i。

(項 目 4 9)

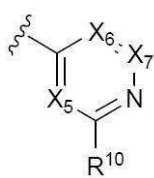
項目 3 7 ~ 4 8 のいずれか 1 項に記載の化合物であって、H Y は以下に示す構造式から選択され、

【化 3 0 - 3】

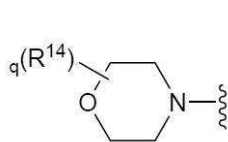
【化 3 0】



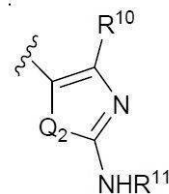
A、



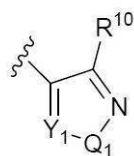
H、



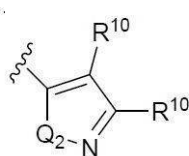
J、



K、

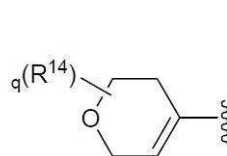


L、



M、

または



F - i

式中 X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 の各出現は独立して - C R ^{1 0} または N であり、
ただし X_4 、 X_5 、 X_6 、および X_7 のうちの 2 つより多い出現が N であることはなく、
 Q_1 および Q_2 の各出現は独立して S、O または - N R ⁶ であり、

Y_1 の各出現は独立して $-CR^{10}$ または N であり、

または X_6 および X_7 、または Y_1 および Q_1 の 2 つの隣接する出現は、それらが結合される原子と一緒に、5～6 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1～5 のヘテロ原子を有する 5～6 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される縮合基を形成し、

R^{14} の各出現は独立して任意に置換される C_{1-6} 脂肪族基である、

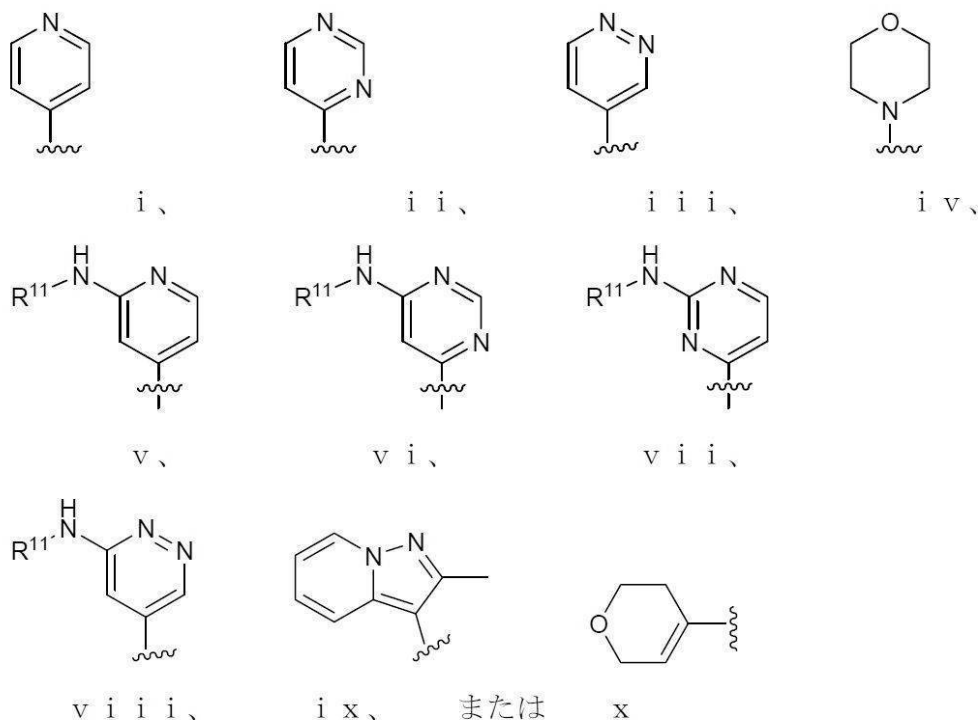
化合物。

(項目 50)

項目 37～48 のいずれか 1 項に記載の化合物であって、HY は以下に示す構造式から選択され、

【化 31-3】

【化 31】



各 HY 基は R^{10} または R^{14} の 1 つまたは複数の出現で、任意に、さらに置換される化合物。

(項目 51)

HY は任意に置換されるモルホリノ (iv) またはジヒドロピラン (x) から選択される、項目 50 に記載の化合物。

(項目 52)

HY は任意に置換されるモルホリノ (iv) から選択される、項目 51 に記載の化合物

(項目 53)

項目 37～48 のいずれか 1 項に記載の化合物であって、環 A は任意に置換されるフェニル、ナフチル、キノリン、イソキノリン、またはベンズイミダゾール環である、化合物

(項目 54)

項目 53 に記載の化合物であって、環 A は R^2 によって任意に置換され、および R^2 の各出現は独立してハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 $-CN$ 、 C_{1-3} ハロアルキル、 $-OC_{1-3}$ アルキル、 $-OC_{1-3}$ ハロアルキル、 $-NHC(O)C_{1-3}$ アルキル、 $-NH$

$C(O)NHC_{1-3}$ アルキル、 $-NHS(O)_2C_{1-3}$ アルキル、または $-C(O)H$ であり、 n は 0 ~ 3 である、化合物。

(項目 55)

項目 54 に記載の化合物であって、環 A はフェニル基であり、 R^2 の各出現は独立してハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 $-CN$ 、 C_{1-3} ハロアルキル、 $-OC_{1-3}$ アルキル、 $-OC_{1-3}$ ハロアルキル、 $-NHC(O)C_{1-3}$ アルキル、 $-NHC(O)NHC_{1-3}$ アルキル、 $-NHS(O)_2C_{1-3}$ アルキル、または $-C(O)H$ であり、 n は 0 ~ 3 である、化合物。

(項目 56)

項目 55 に記載の化合物であって、環 A はフェニル基であり、 R^2 はハロゲンであり、 n は 1 または 2 である、化合物。

(項目 57)

R^{4a} は任意に置換される脂肪族である、項目 37 に記載の化合物。

(項目 58)

項目 57 に記載の化合物であって、任意に置換される脂肪族は $-(C(R^{4d})_2)_1-4R^{4e}$ であり、 R^{4d} は水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族であり、 R^{4e} は水素、任意に置換される 5 員のヘテロアリール、 $COOR^{4f}$ または $CONR^{4f}$ であり、 R^{4f} は水素または任意に置換される C_{1-6} 脂肪族である、化合物。

(項目 59)

項目 37 に記載の化合物であって、 R^5 の各出現は独立して水素、ハロ、または C_{1-6} 脂肪族、 $-C(O)N(R^{15b})_2$ 、 $-C(O)OR^{15b}$ 、 $-CH_2N(R^{15b})_2$ 、 $-CH_2OR^{15b}$ 、 $-CH_2SR^{15c}$ 、3 ~ 10 員の脂環式、6 ~ 10 員のアリール、または窒素、酸素、若しくは硫黄から独立して選択される 1 ~ 5 のヘテロ原子を有する 5 ~ 10 員のヘテロアリールから選択される任意に置換される基である、化合物。

(項目 60)

項目 59 に記載の化合物であって、 R^{15b} は任意に置換される脂肪族基であり、および任意に置換される脂肪族基はヒドロキシル、 C_{1-6} アルコキシル、アミノ、または C_{1-6} ジアルキルアミノで、任意に、さらに置換される、化合物。

(項目 61)

項目 1、2、10、18、27、28、29、または 37 のいずれか 1 項に記載の化合物および薬剤的に許容される担体を含む組成物。

(項目 62)

患者における増殖性障害を治療する方法であって、治療有効量の項目 1、2、10、18、27、28、29、または 37 に記載の化合物を当該患者に投与することを含む、方法。

(項目 63)

前記増殖性障害は乳癌、膀胱癌、結腸癌、神経膠腫、膠芽腫、肺癌、肝細胞癌、胃癌、黒色腫、甲状腺癌、子宮内膜癌、腎癌、子宮頸癌、膵臓癌、食道癌、前立腺癌、脳癌、または卵巣癌である、項目 64 に記載の方法。

(項目 64)

患者における炎症性または心血管障害を治療する方法であって、治療有効量の項目 1、2、10、18、27、28、29 または 37 のいずれか 1 項に記載の化合物を当該患者に投与することを含む、方法。

(項目 65)

前記炎症性または心血管障害はアレルギー / アナフィラキシー、急性慢性炎症、関節リウマチ、自己免疫障害、血栓症、高血圧、心臓肥大、および心不全から選択される、項目 64 に記載の方法。

(項目 66)

患者における PI3K または mTOR 活性を阻害する方法であって、治療有効量の項目 1、2、10、18、27、28、29、または 37 のいずれか 1 項に記載の化合物を含

む組成物を投与することを含む、方法。

1．本発明の化合物の概要

本発明は P I 3 K の阻害剤であり、したがって増殖性、炎症性または心血管障害の治療に役立つ化合物を提供する。本発明の化合物は構造式 I - A または I - B に示され、