

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第6238942号
(P6238942)

(45) 発行日 平成29年11月29日 (2017.11.29)

(24) 登録日 平成29年11月10日 (2017.11.10)

(51) Int.Cl.

F I

C O 7 D 333/38 (2006.01)
C O 7 D 209/04 (2006.01)
C O 7 D 239/28 (2006.01)
C O 7 D 207/34 (2006.01)
C O 7 D 231/14 (2006.01)

C O 7 D 333/38 C S P
 C O 7 D 209/04
 C O 7 D 239/28
 C O 7 D 207/34
 C O 7 D 231/14

請求項の数 14 (全 469 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2015-194455 (P2015-194455)
 (22) 出願日 平成27年9月30日 (2015.9.30)
 (62) 分割の表示 特願2012-534288 (P2012-534288)
 の分割
 原出願日 平成22年10月12日 (2010.10.12)
 (65) 公開番号 特開2016-29074 (P2016-29074A)
 (43) 公開日 平成28年3月3日 (2016.3.3)
 審査請求日 平成27年10月27日 (2015.10.27)
 (31) 優先権主張番号 61/251, 259
 (32) 優先日 平成21年10月13日 (2009.10.13)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

前置審査

(73) 特許権者 500204625
 リガンド・ファーマシューティカルズ・イ
 ンコーポレイテッド
 アメリカ合衆国 92121 カリフォル
 ニア州 サンディエゴ ソレント バレー
 ブールバード 3911 スイート 1
 10
 (74) 代理人 100100158
 弁理士 鮫島 睦
 (74) 代理人 100126778
 弁理士 品川 永敏
 (74) 代理人 100156155
 弁理士 水原 正弘

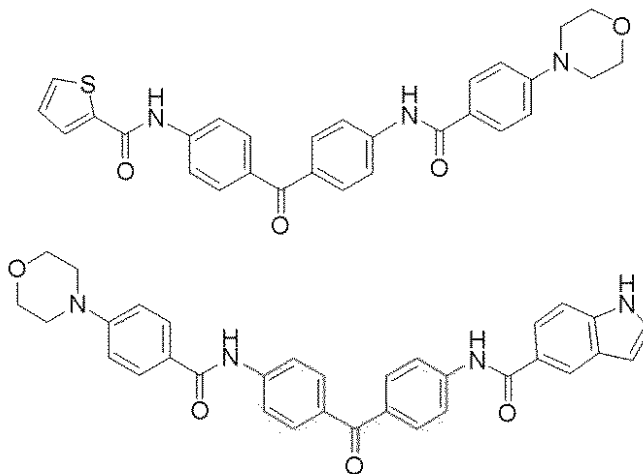
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 造血成長因子模倣小分子化合物およびそれらの使用

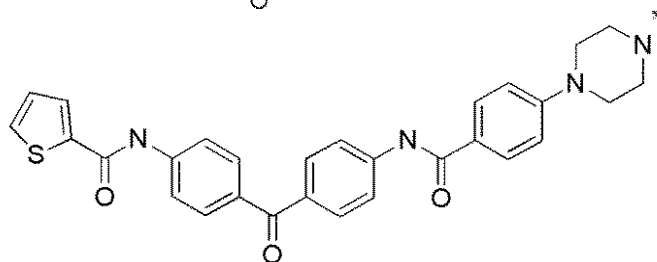
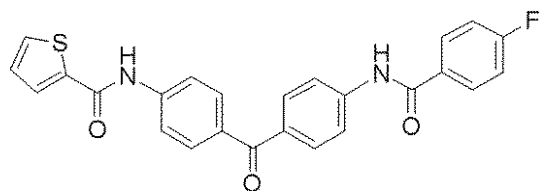
(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

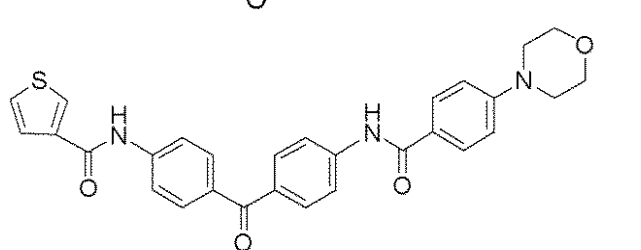
【化 1】



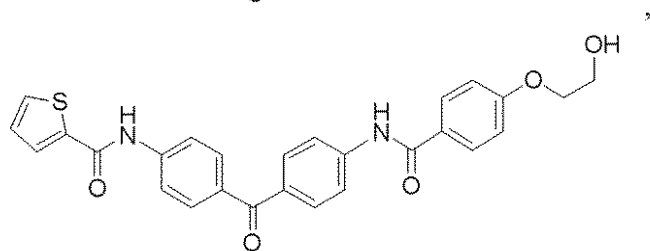
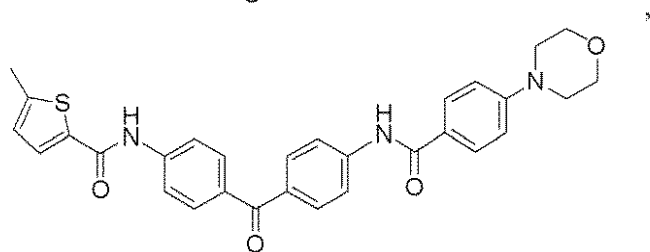
【化 2】



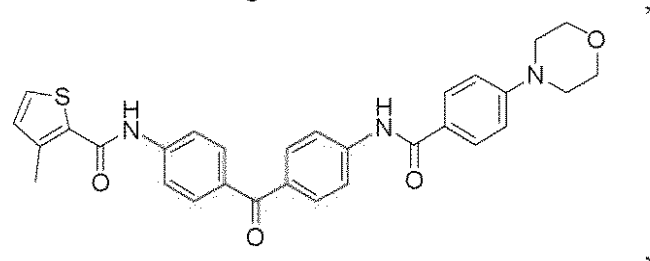
10



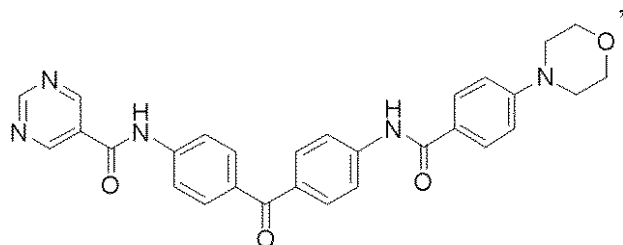
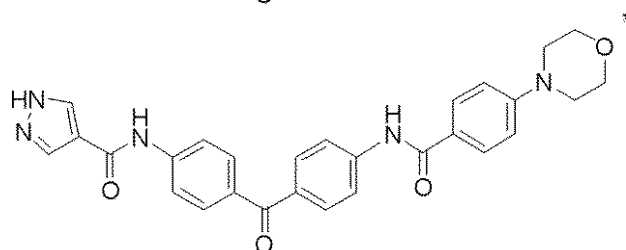
20



30

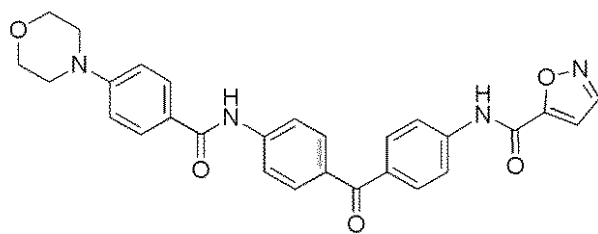
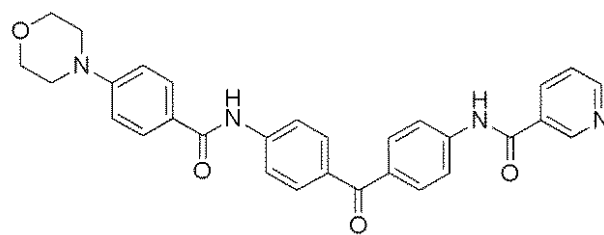
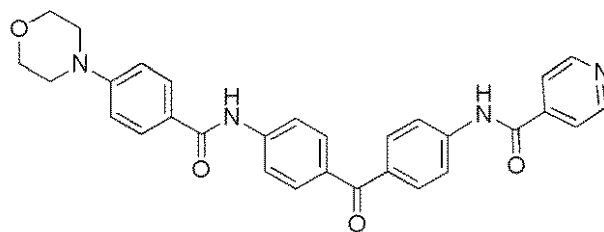
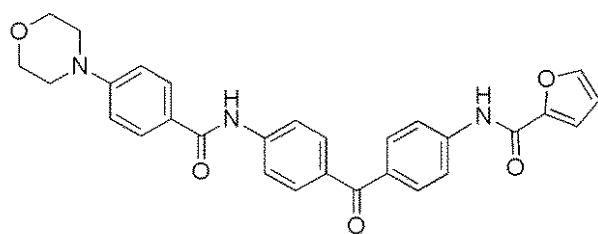
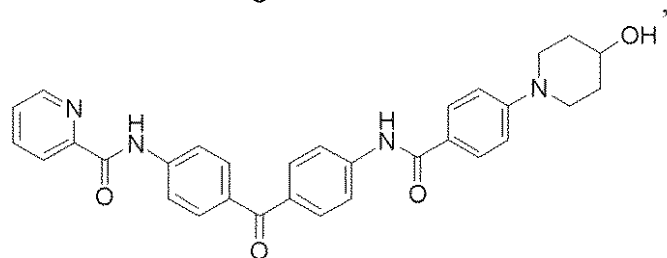
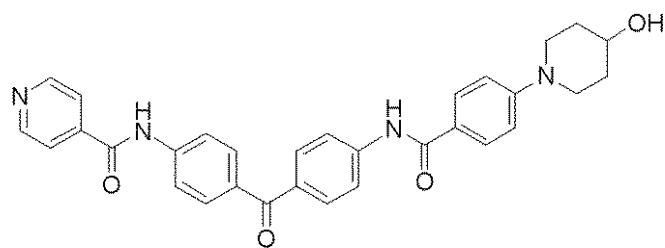


40

Cc1cc(C(=O)Nc2ccc(cc2)C(=O)c3ccc(cc3)Nc4ccc(cc4)C(=O)Nc5ccc(cc5)N6CCOCC6)cs1O=C1C=CC=C1NC(=O)Nc2ccc(cc2)C(=O)c3ccc(cc3)NC(=O)c4ccc(cc4)N5CCOCC5Cc1c[nH]c(C(=O)Nc2ccc(cc2)C(=O)c3ccc(cc3)Nc4ccc(cc4)N5CCOCC5)c1Oc1ccccc1Nc2ccc(cc2)C(=O)Nc3ccc(cc3)C(=O)Nc4ccc(cc4)C(=O)c5ccccc5

40

【化 4】



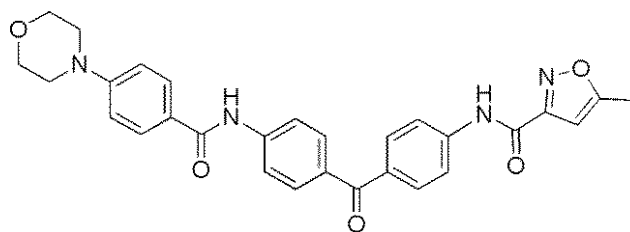
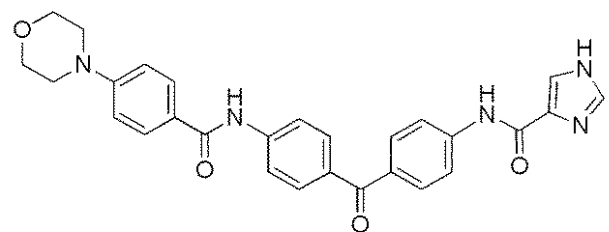
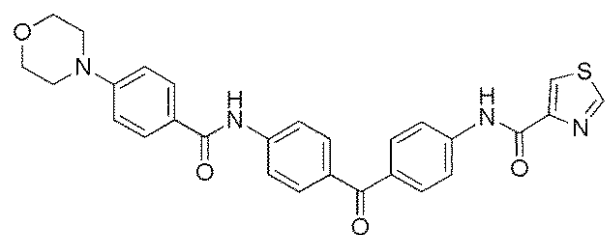
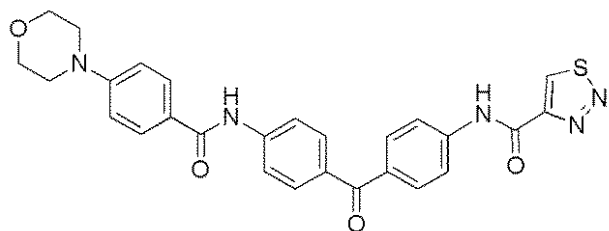
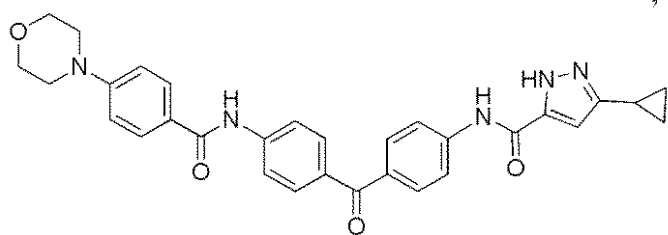
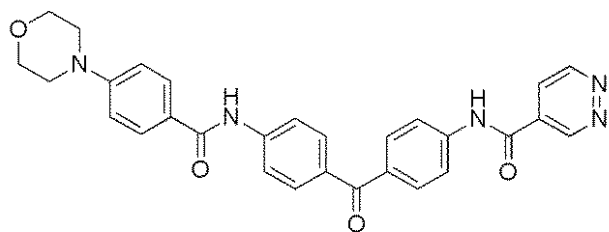
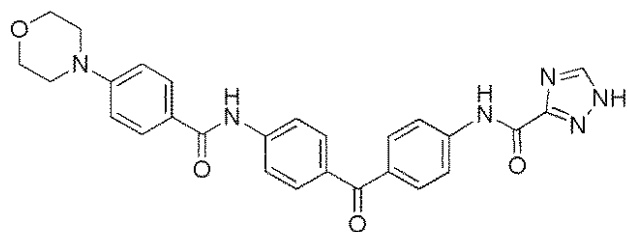
10

20

30

40

【化 5】



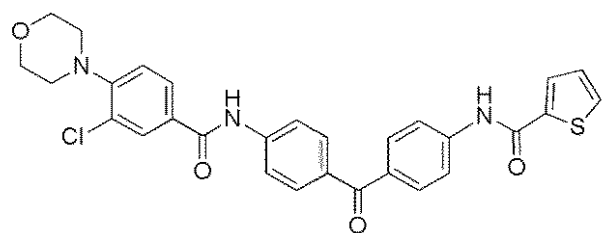
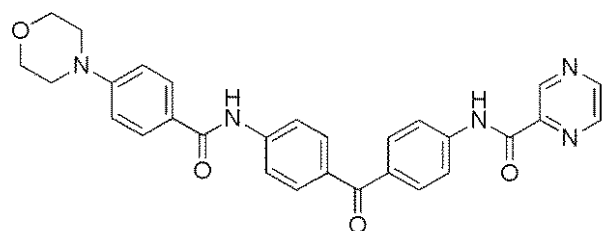
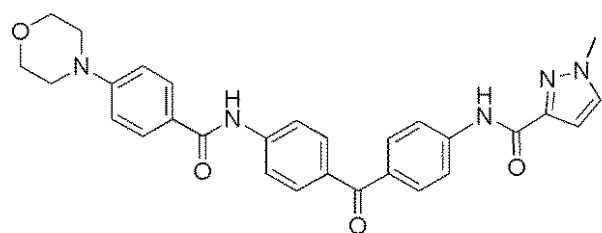
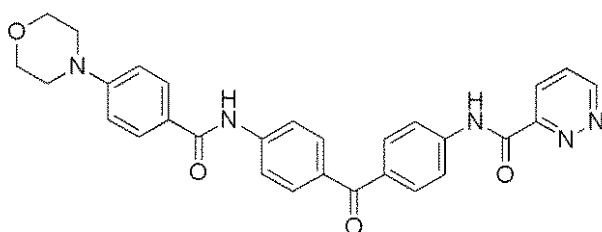
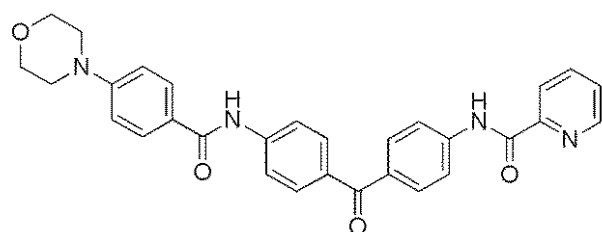
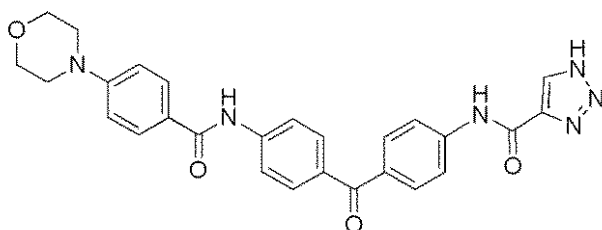
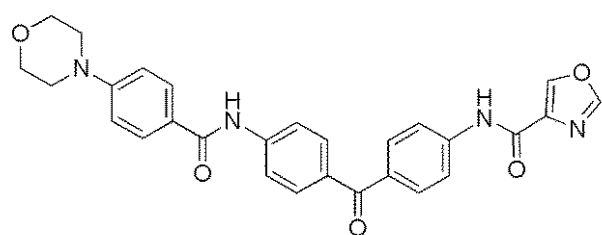
10

20

30

40

【化 6】



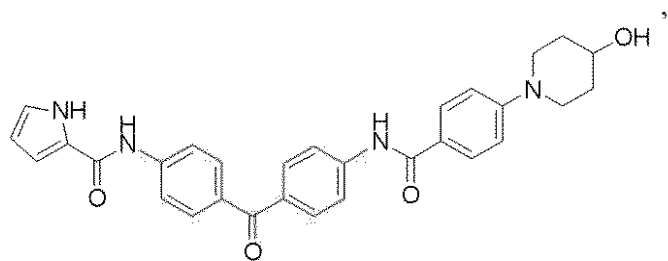
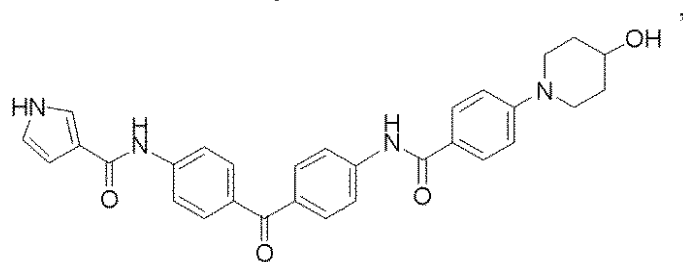
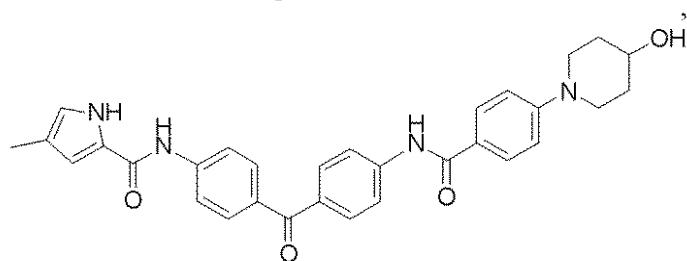
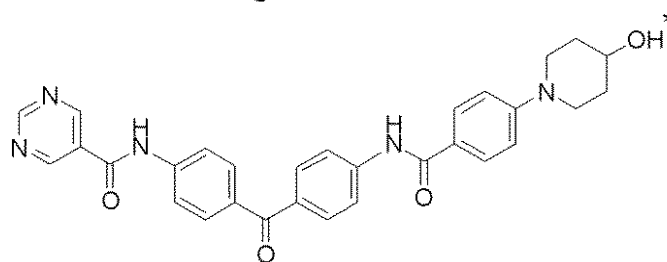
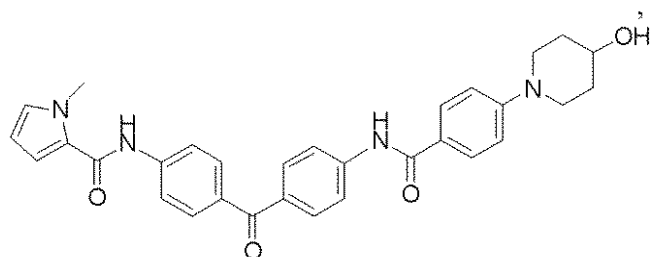
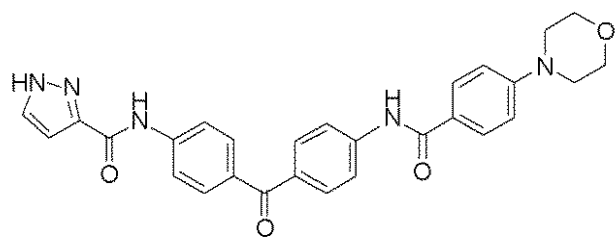
10

20

30

40

【化 7】



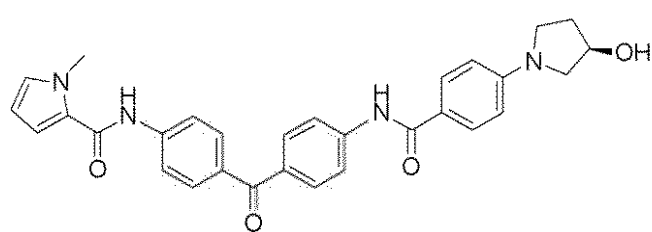
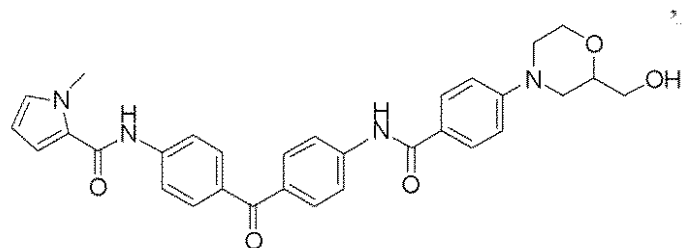
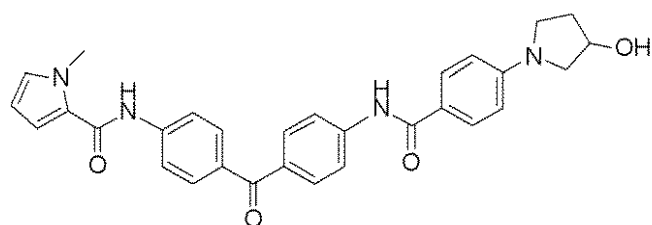
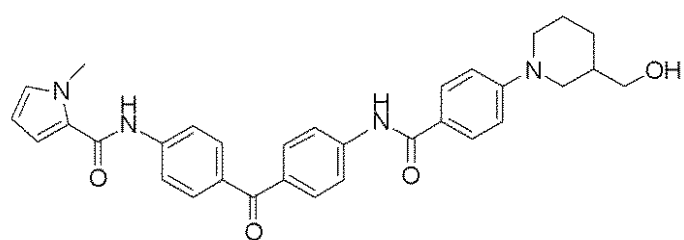
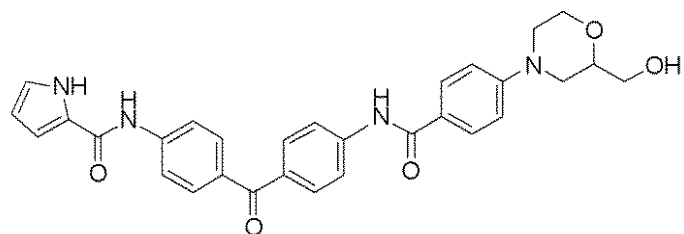
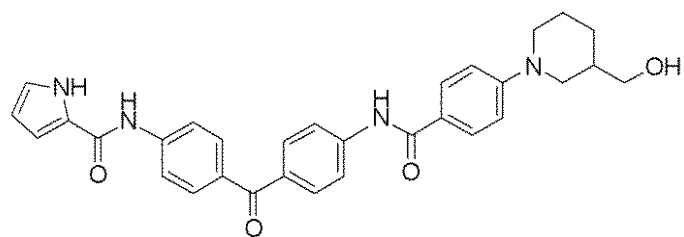
10

20

30

40

【化 8】



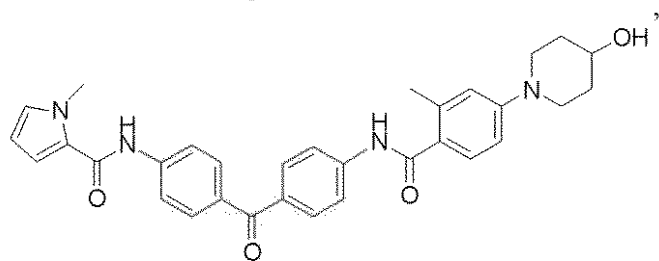
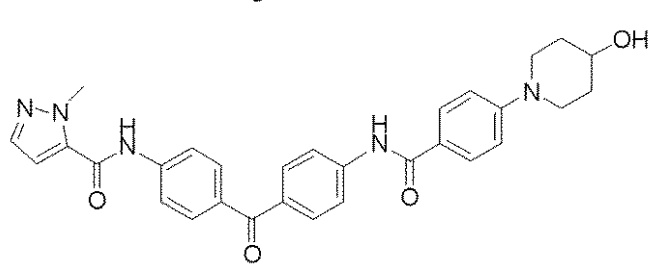
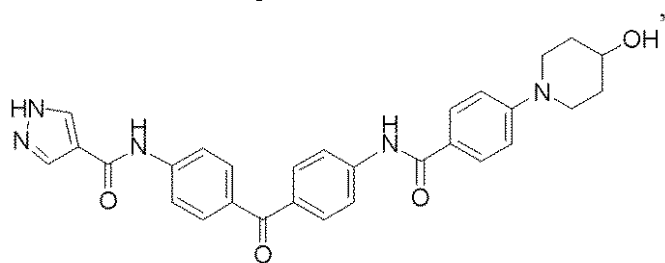
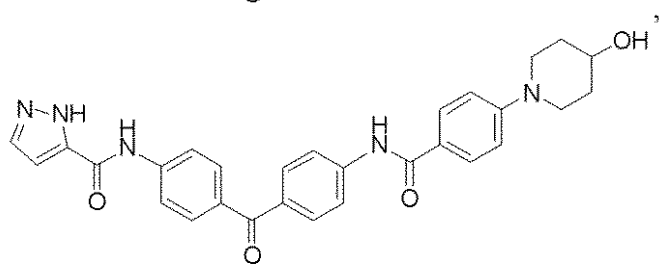
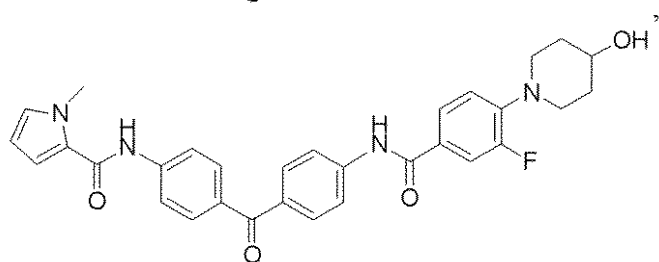
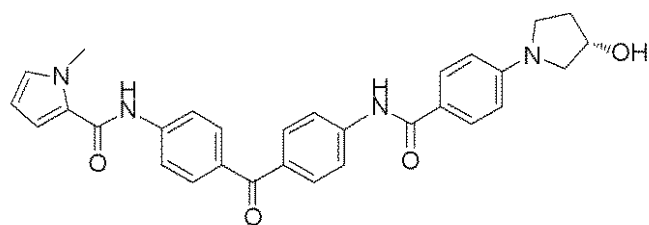
10

20

30

40

【化 9】



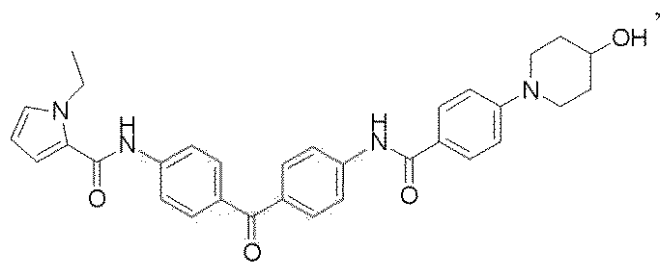
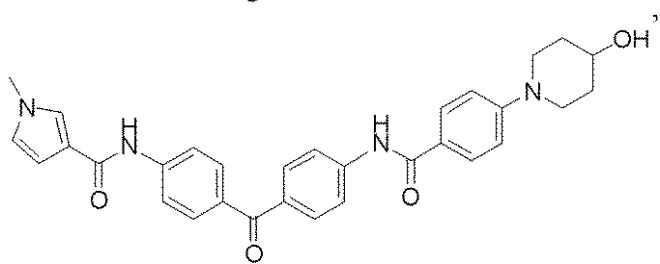
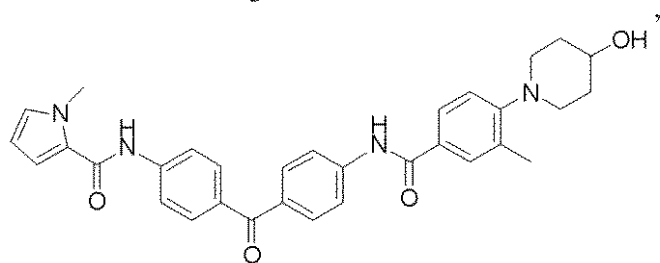
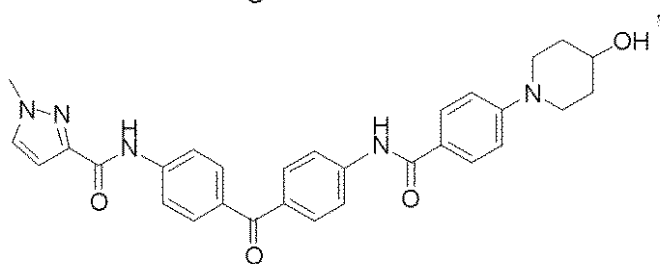
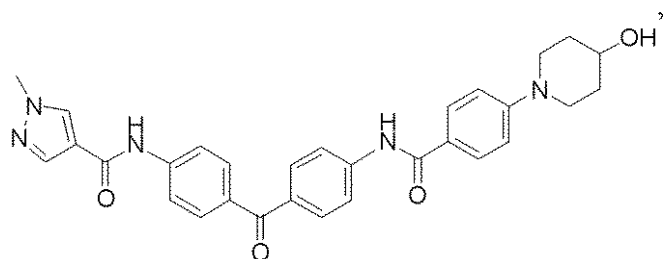
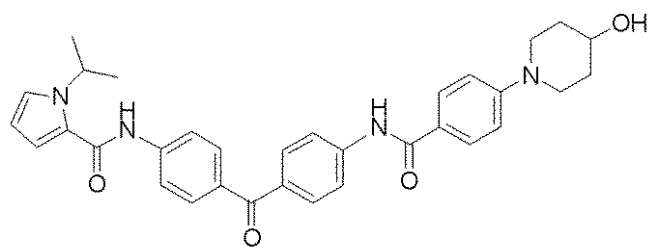
10

20

30

40

【化 10】



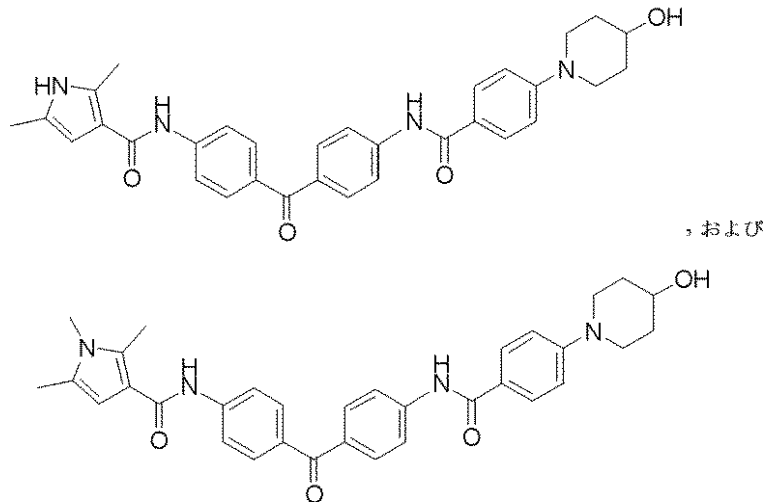
10

20

30

40

【化 1 1】



10

からなる群より選択される、化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 2】

HGF 模倣体、HGF 受容体アゴニストまたは HGF 受容体アンタゴニストである、請求項 1 に記載の化合物。

20

【請求項 3】

造血成長因子模倣体、造血成長因子受容体アゴニストまたは造血成長因子受容体アンタゴニストである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

EPO 模倣体である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

選択的 EPO 受容体アゴニストである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

選択的 EPO 受容体部分アゴニストである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

選択的 EPO 受容体アンタゴニストである、請求項 1 に記載の化合物。

30

【請求項 8】

選択的 EPO 受容体結合化合物である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

細胞の EPO 活性を調節するための、請求項 1 に記載の化合物を含む薬剤。

【請求項 10】

EPO 活性を調節する化合物を同定する方法であって、EPO 受容体を発現する細胞を、請求項 1 に記載の化合物と接触させ；前記細胞に対する前記化合物の効果を監視することを特徴とする方法。

【請求項 11】

患者の血小板減少症を治療するための、請求項 1 に記載の化合物を含む、医薬組成物。

40

【請求項 12】

前記血小板減少症が、放射線または化学療法に起因する、請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

貧血、好中球減少症、心血管疾患、免疫／自己免疫疾患、または神経疾患を治療するための、請求項 1 に記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 14】

生理学的に許容できる担体、希釈剤、または賦形剤と；請求項 1 に記載の化合物とを含む、医薬組成物。

50

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

関連出願

本出願は、全体が参照により本明細書に援用される、2009年10月13日に出願された米国仮特許出願第61/251,259号の利益を主張するものである。

【0002】

本発明の実施形態は、造血成長因子受容体の活性化などの生理作用を有する化合物に関する。本発明の実施形態は、造血病態および造血障害などの様々な病態、疾患および疾病を治療するための、上記化合物の使用にも関する。

10

【背景技術】

【0003】

造血成長因子（HGF）は、造血前駆細胞および成熟血球の増殖、分化、および機能的活性化の過程において重要な調節機能を果たす糖タンパク質などの生体分子の一種である。HGF化合物は、骨髄における赤血球の増殖および成長の強力な調節剤であり得る。HGF化合物は、骨髄機能不全が存在する場合に造血を促すことができる。組み換えDNA技術により、これらの因子の多くに関与する遺伝子のクローニングが可能になった。

【0004】

HGFの一例は、糖タンパク質ホルモンのエリスロポエチン（EPO）である。EPOは、赤血球前駆細胞の重要な生存および成長因子である。EPOは、4本の α -ヘリックス束からなる小型の球状構造に折り畳まれるクラスIサイトカインファミリーのメンバーである。EPOの分子量は30.4 kDaであるが、SDS-ポリアクリルアミドゲルにおいて34~38 kDaの見掛けの大きさで移動する。165個のアミノ酸のペプチドコアが受容体結合および赤血球産生の生体外刺激に十分である一方、糖部分（全分子の40%）が、ホルモンの生体内での生存に必要とされる。EPOの4つの糖鎖が詳細に分析されている。アスパラギン24、38および83における3つの複合型のN-結合型オリゴ糖が、血液循環中のEPOの安定化に関与するようである。EPOは、主に、胎児期に肝細胞によって産生される。出生後、ほとんど全ての循環しているEPOは、腎臓の皮質にある尿細管周囲（peritubular）線維芽細胞様細胞に由来する。GATAファミリーの転写因子は、EPO遺伝子の時間特異的および組織特異的発現の制御に重要であり得る。成人の場合、少量のEPO mRNAが、肝実質、脾臓、肺、睾丸および脳で発現される。脳内で、EPOは、神経栄養効果および神経保護的効果を発揮し、これらの効果は、赤血球産生組織において循環しているEPOの作用とは別のものである。例えば、Jelkmann, W., Internal Medicine Vol. 43, No. 8 (2004年8月)を参照されたい。

20

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

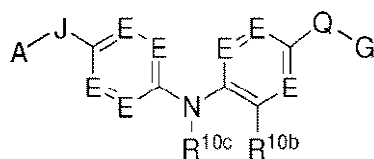
【0005】

本明細書に開示されるある実施形態は、式VIII:

【化1】

30

40

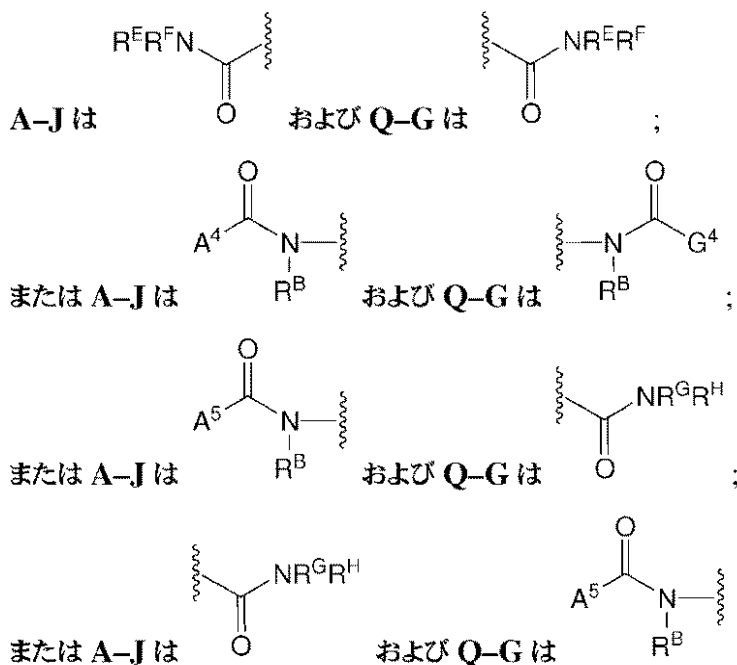


(VIII)

の化合物またはその医薬的に許容される塩を提供し；

式中：

【化 2】



10

であり ;

20

各 E が、 $-\text{CR}^{10a}-$ および N（窒素）からなる群より別々に選択され ;

各 R^{10a} が、H（水素）、ハロゲン、シアノ、最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニル、最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、および最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルケニルからなる群より別々に選択され ;

R^{10b} が、 R^{10bb} 、H（水素）、ハロゲン、シアノ、最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニル、最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、および最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルケニルからなる群より選択され ;

30

R^{10c} が、H（水素）、 $\text{R}^{\text{U}}\text{SO}_2-$ 、 $\text{R}^{\text{U}}\text{C}(=\text{O})-$ 、最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、および最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキルからなる群より選択され、または R^{10b} が R^{10bb} である場合、 R^{10c} が R^{10cc} であり ;

R^{10cc} および R^{10bb} が、それらが結合される原子と合わせて、ハロゲン、シアノ、最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル $\text{C}(=\text{O})-$ および $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル $\text{C}(=\text{O})-$ からなる群よりそれぞれ別々に選択される 1 つ以上の置換基で適宜置換されていてもよい五員ヘテロアリールであり ;

40

A^4 が、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルケニル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヘテロアルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、 $-(\text{CH}_2)_m\text{NR}^{\text{P}}\text{R}^{\text{L}}$ 、複素環、多環式ヘテロシクリル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、前記 $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルケニル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヘテロアルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、複素環、多環式ヘテロシクリル、アリール、およびヘテロアリールは、 R^1 、 R^2 、および R^3 から

50

なる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよく；

G^4 が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、多環式ヘテロシクリル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され；

A^5 が、 R^1 、 R^2 、および R^3 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、多環式ヘテロシクリル、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され；

各 R^B が、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルケニル、および適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルからなる群より別々に選択され；

各 $-NR^E R^F$ が別々に選択され、各 R^E が、独立して、水素および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択され、各 R^F が、独立して、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^F の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、 $-C(=O)NR^N R^O$ 、 $-OC(=O)NR^N R^O$ 、 $-NHC(=O)NR^N R^O$ 、 $-O(CH_2)_q NR^N R^O$ 、 $-NH(CH_2)_q NR^N R^O$ 、 $-(CH_2)_p NR^N R^O$ 、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールでそれぞれ適宜置換されていてもよく、 R^F の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

R^G が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキニル、複素環、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^G の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく、または R^G が、 $-OR^L$ または $-NR^P R^L$ であり；

R^H が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、および $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルからなる群より選択され、または $-NR^G R^H$ が、環

窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

各 R^1 が、ハロゲン、シアノ、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択され；

各 R^2 が、ハロゲン、 $-O(CH_2)_m OR^I$ 、 $-(CH_2)_m OR^I$ 、 $-NR^J R^K$ 、 $-(CH_2)_m SR^I$ 、 $-C(=O)R^L$ 、 $-(CH_2)_m R^L$ 、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルからなる群より別々に選択され、前記 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルはさらに、アリールまたはヘテロアリールと適宜縮合されていてもよく；

各 R^3 が、ハロゲン、 $-(CH_2)_m OR^G$ 、 $-NR^L C(=O)R^M$ 、 $-NR^L C(=O)OR^M$ 、 $-NR^L C(=O)NR^N R^O$ 、 $-NR^N R^O$ 、 $-(CH_2)_m S(O)_{0 \sim 2} R^M$ 、 $-(CH_2)_m NHS(O)_{0 \sim 2} R^M$ 、 $-(CH_2)_m NO_2$ 、 $-(CH_2)_m CN$ 、 $-(CH_2)_m R^P$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロア

10

20

30

40

50

ルキル、複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールからなる群より別々に選択され、 R^3 の定義中の前記複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールは、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-C(=O)OR^M$ 、または $-NR^JR^K$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく；

各 R^4 が、ハロゲン、シアノ、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択され；

10

各 R^5 が、ハロゲン、 $-O(CH_2)_mOR^I$ 、 $-(CH_2)_mOR^I$ 、 $-NR^JR^K$ 、 $-(CH_2)_mSR^I$ 、 $-(CH_2)_mC(=O)R^L$ 、 $-(CH_2)_mR^L$ 、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より別々に選択され；

各 R^6 が、ハロゲン、 $-(CH_2)_mOR^G$ 、 $-NR^LC(=O)R^M$ 、 $-NR^LC(=O)OR^M$ 、 $-NR^LC(=O)NR^NR^O$ 、 $-NR^NR^O$ 、 $-(CH_2)_mS(O)_{0 \sim 2}R^M$ 、 $-(CH_2)_mNHS(O)_{0 \sim 2}R^M$ 、 $-(CH_2)_mNO_2$ 、 $-(CH_2)_mCN$ 、 $-(CH_2)_mR^P$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールからなる群より別々に選択され、 R^6 の定義中の前記複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-C(=O)OR^M$ 、または $-NR^JR^K$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく；

20

各 R^I が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロハロアルキルからなる群より別々に選択され；

30

各 $-NR^JR^K$ が別々に選択され、 R^J および R^K がそれぞれ、独立して、水素、最大5つのフルオロで適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-(CH_2)_mOR^JA$ 、 $-(CH_2)_mNR^JB R^JC$ 、 $-(CH_2)_mR^R$ 、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、複素環、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^J および R^K の定義中の前記 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、複素環、アリールおよびヘテロアリールはそれぞれ、独立して、ハロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択される1つ以上の置換基で適宜置換されていてもよく、 R^J および R^K の前記アリールおよびヘテロアリール置換基は、1つ以上のハロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、または $-(CH_2)_mNR^KAR^KB$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく；または $-NR^JR^K$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

40

各 R^JA が、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

各 $-NR^JB R^JC$ が別々に選択され、 R^JB および R^JC がそれぞれ、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

各 $-NR^KAR^KB$ が別々に選択され、 R^KA および R^KB がそれぞれ、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

各 R^M が、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルキニ

50

ル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、および $-(CH_2)_m R^P$ からなる群より選択され；

各 $-NR^N R^O$ が別々に選択され、 R^N および R^O がそれぞれ、独立して、水素、 $-(CH_2)_m NR^N R^O$ 、アリーールおよびヘテロアリーールからなる群より選択され、 R^N および R^O の定義中の前記アリーールおよびヘテロアリーールはそれぞれ、独立して、 $-(CH_2)_m NR^O R^O$ 、ハロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、アリーールおよびヘテロアリーールからなる群より選択される1つ以上の置換基で適宜置換されていてもよく、 R^N および R^O の前記アリーールおよびヘテロアリーール置換基は、1つ以上のハロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、または $-NR^N R^O$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく、

各 $-NR^N R^O$ が別々に選択され、 R^N および R^O がそれぞれ、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

各 $-NR^O R^O$ が別々に選択され、 R^O および R^O がそれぞれ、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

各 R^P が、独立して、水素および $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択され；

各 R^L が、独立して、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-(CH_2)_m OR^L$ 、 $-(CH_2)_m NR^L R^L$ 、アリーールおよびヘテロアリーールからなる群より選択され、 R^L の定義中の前記アリーールおよびヘテロアリーールはそれぞれ、独立して、ハロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-(CH_2)_m NR^L R^L$ 、アリーールおよびヘテロアリーールからなる群より選択される1つ以上の置換基で適宜置換されていてもよく、 R^L の前記アリーールおよびヘテロアリーール置換基は、1つ以上のハロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、または $-(CH_2)_m NR^L R^L$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく；

各 R^L が、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

R^L および R^L がそれぞれ、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルケニルからなる群より選択され、前記 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルケニルは、1つ以上のハロゲン、シアノ、または $-(CH_2)_m C(=O)OH$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく；または $-NR^L R^L$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

各 $-NR^L R^L$ が別々に選択され、 R^L および R^L がそれぞれ、独立して、水素、アリーール、ヘテロアリーール、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択され、 R^L および R^L の定義中の前記アリーールおよびヘテロアリーールは、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ アルコキシでそれぞれ適宜置換されていてもよく；または $-NR^L R^L$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

各 $-NR^L R^L$ が別々に選択され、 R^L および R^L がそれぞれ、独立して、水素、および $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択され；または $-NR^L R^L$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

R^R が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよいアリーール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリーールからなる群より選択され；

R^U が、最大5つのフルオロで適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および適宜置換されていてもよいヘテロアリーールからなる群より選択され；

各 m が、独立して、0、1、2、または3であり；

各 p が、独立して、0、1、2、3、4、5、または6であり；

各 q が、独立して、1、2、3、4、5、または6である。

【0006】

10

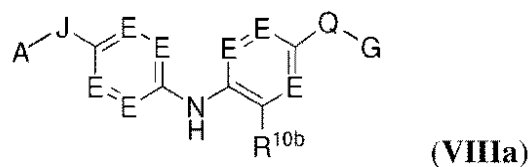
20

30

40

50

本明細書に開示されるある実施形態は、式 V I I I a :
【化 3】

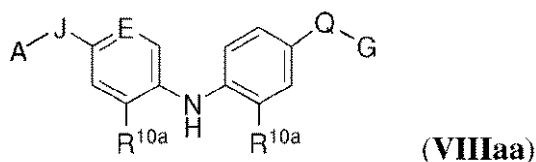


で表される式 V I I I の化合物またはその医薬的に許容される塩を提供する。

【0007】

10

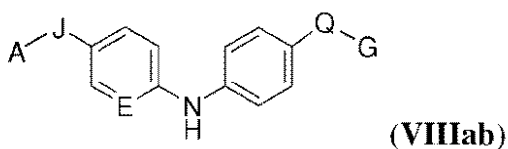
本明細書に開示されるある実施形態は、式 V I I I a a :
【化 4】



で表される式 V I I I a の化合物またはその医薬的に許容される塩、ならびに式 V I I I a b :

【化 5】

20

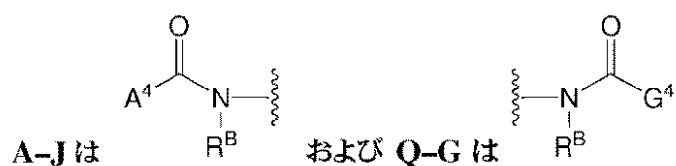


で表される式 V I I I a の化合物またはその医薬的に許容される塩を提供する。

【0008】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 V I I I a a の化合物を提供し、式中、
【化 6】

30

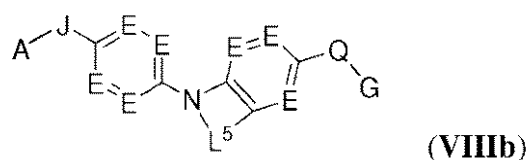


であり、A⁴が、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、ヘテロアリール芳香環を形成する少なくとも1個の原子がN（窒素）であり、前記アリールおよびヘテロアリールは、R¹、R²、およびR³からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよく、G⁴が、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、ヘテロアリール芳香環を形成する少なくとも1個の原子がN（窒素）であり、前記アリールおよびヘテロアリールは、R⁴、R⁵、およびR⁶からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい。

40

【0009】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 V I I I b :
【化 7】



で表される式 V I I I の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供し、式中、L⁵

50

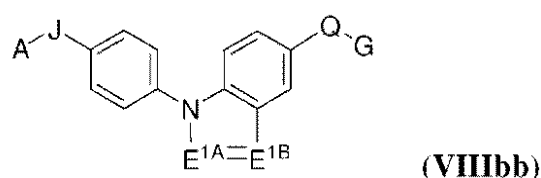
が、 $E^1 = E^1$ または $E^2 - E^2$ であり、各 E^1 が、 $-CR^{10}dd-$ および N（窒素）からなる群より別々に選択され、各 $R^{10}dd$ が、H（水素）、ハロゲン、シアノ、最大5つのフルオロで適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、最大5つのフルオロで適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル $C(=O)-$ および $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル $C(=O)-$ からなる群より別々に選択され、各 E^2 が、 $-CR^7R^8-$ および NR^9 からなる群より別々に選択され、 R^7 および R^8 がそれぞれ、独立して、水素、 $-OH$ 、および最大5つのフルオロで適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択され、または適宜置換されていてもよい CR^7R^8 が $-C(=O)-$ であり、 R^9 が、水素、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル $C(O)-$ および $C_1 \sim C_6$ アルキル $C(O)-$ 、および最大5つのフルオロで適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択される。

10

【0010】

本明細書に開示されるある実施形態は、式VIIIbb：

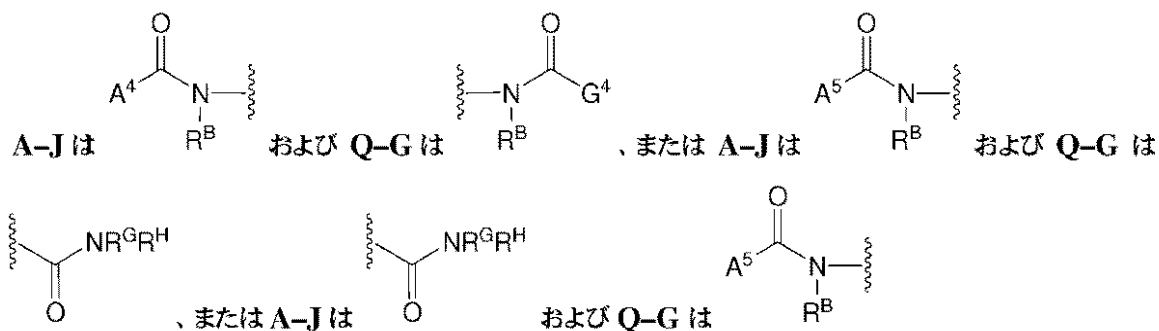
【化8】



で表される式VIIIbの化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供し、式中、 E^{1A} がN（窒素）であり、 E^{1B} が $-CH-$ であり、または E^{1A} が $-CH-$ であり、 E^{1B} がN（窒素）であり；

20

【化9】

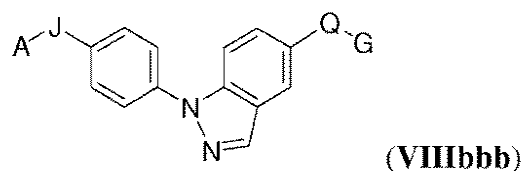


である。

【0011】

本明細書に開示されるある実施形態は、式VIIIbbb：

【化10】

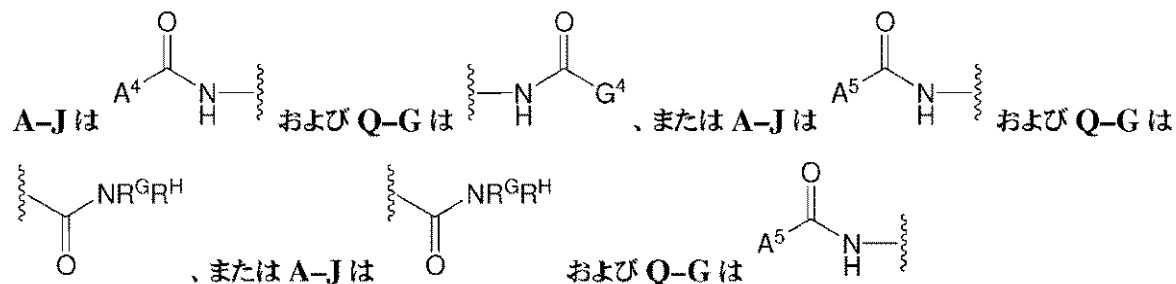


で表される式VIIIbbの化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供し、式中、

30

40

【化 1 1】

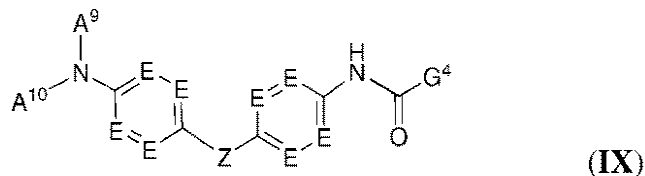


であり、 A^4 が、 $\text{C}_5 \sim \text{C}_7$ シクロアルケニル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヘテロアルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、 $-\text{NR}^{\text{P}}\text{R}^{\text{L}}$ 、複素環、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、前記 $\text{C}_5 \sim \text{C}_7$ シクロアルケニル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヘテロアルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、複素環、アリール、およびヘテロアリールは、 R^1 、 R^2 、および R^3 からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよく、各 R^1 が、ハロゲン、シアノ、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択され、各 R^2 が、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{OR}^{\text{I}}$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{OR}^{\text{I}}$ 、 $-\text{NR}^{\text{J}}\text{R}^{\text{K}}$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{SR}^{\text{I}}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{\text{L}}$ 、および $-(\text{CH}_2)_m\text{R}^{\text{L}}$ からなる群より別々に選択され、各 R^3 が、 $-(\text{CH}_2)_m\text{OR}^{\text{G}}$ 、 $-\text{NR}^{\text{L}}\text{C}(=\text{O})\text{R}^{\text{M}}$ 、 $-\text{NR}^{\text{L}}\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{\text{M}}$ 、 $-\text{NR}^{\text{L}}\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{\text{N}}\text{R}^{\text{O}}$ 、 $-\text{NR}^{\text{N}}\text{R}^{\text{O}}$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{S}(\text{O})_{0 \sim 2}\text{R}^{\text{M}}$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{NHS}(\text{O})_{0 \sim 2}\text{R}^{\text{M}}$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{NO}_2$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{CN}$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{R}^{\text{P}}$ 、複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールからなる群より別々に選択され、 R^3 の定義中の前記複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールは、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{\text{M}}$ 、または $-\text{NR}^{\text{J}}\text{R}^{\text{K}}$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく、 G^4 が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、各 R^4 が、ハロゲン、シアノ、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、および適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヘテロアルキルからなる群より別々に選択され、各 R^5 が、ハロゲン、 $-(\text{CH}_2)_m\text{OH}$ 、 $-\text{NR}^{\text{J}}\text{R}^{\text{K}}$ 、および $-(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{R}^{\text{L}}$ からなる群より別々に選択され、各 R^{L} が、独立して、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、および $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシからなる群より選択され、各 R^6 が、 $-\text{NR}^{\text{L}}\text{C}(=\text{O})\text{R}^{\text{M}}$ 、 $-\text{NR}^{\text{L}}\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{\text{M}}$ 、 $-\text{NR}^{\text{L}}\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{\text{N}}\text{R}^{\text{O}}$ 、 $-\text{NR}^{\text{N}}\text{R}^{\text{O}}$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{R}^{\text{P}}$ 、複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールからなる群より別々に選択され、 R^6 の定義中の前記複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{\text{M}}$ 、または $-\text{NR}^{\text{J}}\text{R}^{\text{K}}$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく、 $-\text{NR}^{\text{G}}\text{R}^{\text{H}}$ の定義中の R^{G} が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される 1 つ以上の置換基で適宜置換されていてもよいヘテロアリールであり、 $-\text{NR}^{\text{G}}\text{R}^{\text{H}}$ の定義中の R^{H} が水素である。

【0012】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I X：

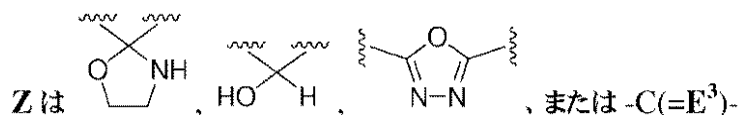
【化 1 2】



で表される化合物およびその医薬的に許容される塩を提供し；

式中：

【化 1 3】



であり；

各 E が、 $-CR^{10a}-$ および N（窒素）からなる群より別々に選択され；

各 R^{10a} が、H（水素）、ハロゲン、最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、および最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシからなる群より別々に選択され；

E^3 が、O（酸素）、 $N-NHR^Q$ または $N-OR^Q$ であり、 E^3 の定義中の R^Q が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $-(CH_2)_m R^{RA}$ 、および $-C(=O)(CH_2)_m R^{RA}$ からなる群より選択され；

R^{RA} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され；

A^9 が、水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

A^{10} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $-C(=O)R^A$ 、 $-C(=O)C(=O)R^A$ 、 $-(CH_2)R^B$ 、 $-(CH_2)OR^B$ からなる群より選択され；

R^A が、 R^1 、 R^2 、および R^3 からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、複素環、多環式ヘテロシクリル、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され；

R^B が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、およびヘテロアリールからなる群より選択され；

G^4 が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、多環式ヘテロシクリル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され；

各 R^1 が、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択され；

各 R^2 が、ハロゲン、 $-O(CH_2)_m OR^I$ 、 $-(CH_2)_m OR^I$ 、 $-NR^J R^K$ 、 $-(CH_2)_m SR^I$ 、 $-C(=O)R^L$ 、 $-(CH_2)_m R^L$ 、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルからなる群より別々に選択され、前記 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルはさらに、アリールまたはヘテロアリールと適宜縮合されていてもよく；

各 R^3 が、ハロゲン、 $-(CH_2)_m OR^G$ 、 $-NR^L C(=O)R^M$ 、 $-NR^L C$

10

20

30

40

50

$=O)OR^M$ 、 $-NR^L C(=O)NR^N R^O$ 、 $-NR^N R^O$ 、 $-(CH_2)_m S(O)_{0\sim 2}R^M$ 、 $-(CH_2)_m NHS(O)_{0\sim 2}R^M$ 、 $-(CH_2)_m CN$ 、 $-(CH_2)_m R^P$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $C_3\sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールからなる群より別々に選択され、 R^3 の定義中の前記複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールは、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $-C(=O)OR^M$ 、または $-NR^J R^K$ でそれぞれ適宜置換されていてよく；

各 R^4 が、ハロゲン、シアノ、 $C_1\sim C_6$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2\sim C_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2\sim C_6$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3\sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択され；

各 R^5 が、ハロゲン、 $-O(CH_2)_m OR^I$ 、 $-(CH_2)_m OR^I$ 、 $-NR^J R^K$ 、 $-(CH_2)_m SR^I$ 、 $-(CH_2)_m C(=O)R^L$ 、 $-(CH_2)_m R^L$ 、 $C_1\sim C_6$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2\sim C_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_3\sim C_7$ シクロアルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_6$ ハロアルキルからなる群より別々に選択され；

各 R^6 が、ハロゲン、 $-(CH_2)_m OR^G$ 、 $-NR^L C(=O)R^M$ 、 $-NR^L C(=O)OR^M$ 、 $-NR^L C(=O)NR^N R^O$ 、 $-NR^N R^O$ 、 $-(CH_2)_m S(O)_{0\sim 2}R^M$ 、 $-(CH_2)_m NHS(O)_{0\sim 2}R^M$ 、 $-(CH_2)_m CN$ 、 $-(CH_2)_m R^P$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $C_3\sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ヘテロアルキル、複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールからなる群より別々に選択され、 R^6 の定義中の前記複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $-C(=O)OR^M$ 、または $-NR^J R^K$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく；

R^G が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_1\sim C_6$ ヘテロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ヘテロアルケニル、 $C_1\sim C_6$ ヘテロアルキニル、複素環、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^G の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく、または R^G が、 $-OR^L$ または $-NR^P R^L$ であり；

各 R^I が、水素、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_2\sim C_4$ アルケニル、 $C_2\sim C_4$ アルキニル、 $C_3\sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ヘテロアルキル、および $C_1\sim C_6$ ヘテロハロアルキルからなる群より別々に選択され；

各 $-NR^J R^K$ が別々に選択され、 R^J および R^K がそれぞれ、独立して、水素、最大5つのフルオロで適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_6$ アルキル、 $-(CH_2)_m OR^J$ 、 $-(CH_2)_m NR^J R^K$ 、 $-(CH_2)_m R^K$ 、 $C_3\sim C_7$ シクロアルキル、複素環、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^J および R^K の定義中の前記 $C_3\sim C_7$ シクロアルキル、複素環、アリールおよびヘテロアリールはそれぞれ、独立して、ハロ、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択される1つ以上の置換基で適宜置換されていてもよく、 R^J および R^K の前記アリールおよびヘテロアリール置換基は、1つ以上のハロ、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、

10

20

30

40

50

または $-(CH_2)_mNR^KAR^KB$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく；または $-NR^JR^K$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

各 R^JA が、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

各 $-NR^JB$ R^JC が別々に選択され、 R^JB および R^JC がそれぞれ、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

各 $-NR^KAR^KB$ が別々に選択され、 R^KA および R^KB がそれぞれ、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

各 R^M が、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、および $-(CH_2)_mR^P$ からなる群より選択され；

各 $-NR^NRO$ が別々に選択され、 R^N および R^O がそれぞれ、独立して、水素、 $-(CH_2)_mNR^NAR^NB$ 、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^N および R^O の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれ、独立して、 $-(CH_2)_mNR^OAR^OB$ 、ハロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択される1つ以上の置換基で適宜置換されていてもよく、 R^N および R^O の前記アリールおよびヘテロアリール置換基は、1つ以上のハロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、または $-NR^NAR^NB$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく、

各 $-NR^NAR^NB$ が別々に選択され、 R^NA および R^NB がそれぞれ、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

各 $-NR^OAR^OB$ が別々に選択され、 R^OA および R^OB がそれぞれ、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

R^P が、水素および $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択され；

各 R^L が、独立して、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-(CH_2)_mOR^LA$ 、 $-(CH_2)_mNR^LBR^LC$ 、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^L の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれ、独立して、ハロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-(CH_2)_mNR^LDR^LE$ 、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択される1つ以上の置換基で適宜置換されていてもよく、 R^L の前記アリールおよびヘテロアリール置換基は、1つ以上のハロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、または $-(CH_2)_mNR^LFR^LG$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく；

各 R^LA が、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

R^LB および R^LC がそれぞれ、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルケニルからなる群より選択され、前記 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルケニルは、1つ以上のハロゲン、シアノ、または $-(CH_2)_mC(=O)OH$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく；または $-NR^LBR^LC$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

各 $-NR^LDR^LE$ が別々に選択され、 R^LD および R^LE がそれぞれ、独立して、水素、アリール、ヘテロアリール、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択され、 R^LD および R^LE の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールは、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ アルコキシでそれぞれ適宜置換されていてもよく；または $-NR^LDR^LE$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

各 $-NR^LFR^LG$ が別々に選択され、 R^LF および R^LG がそれぞれ、独立して、水

10

20

30

40

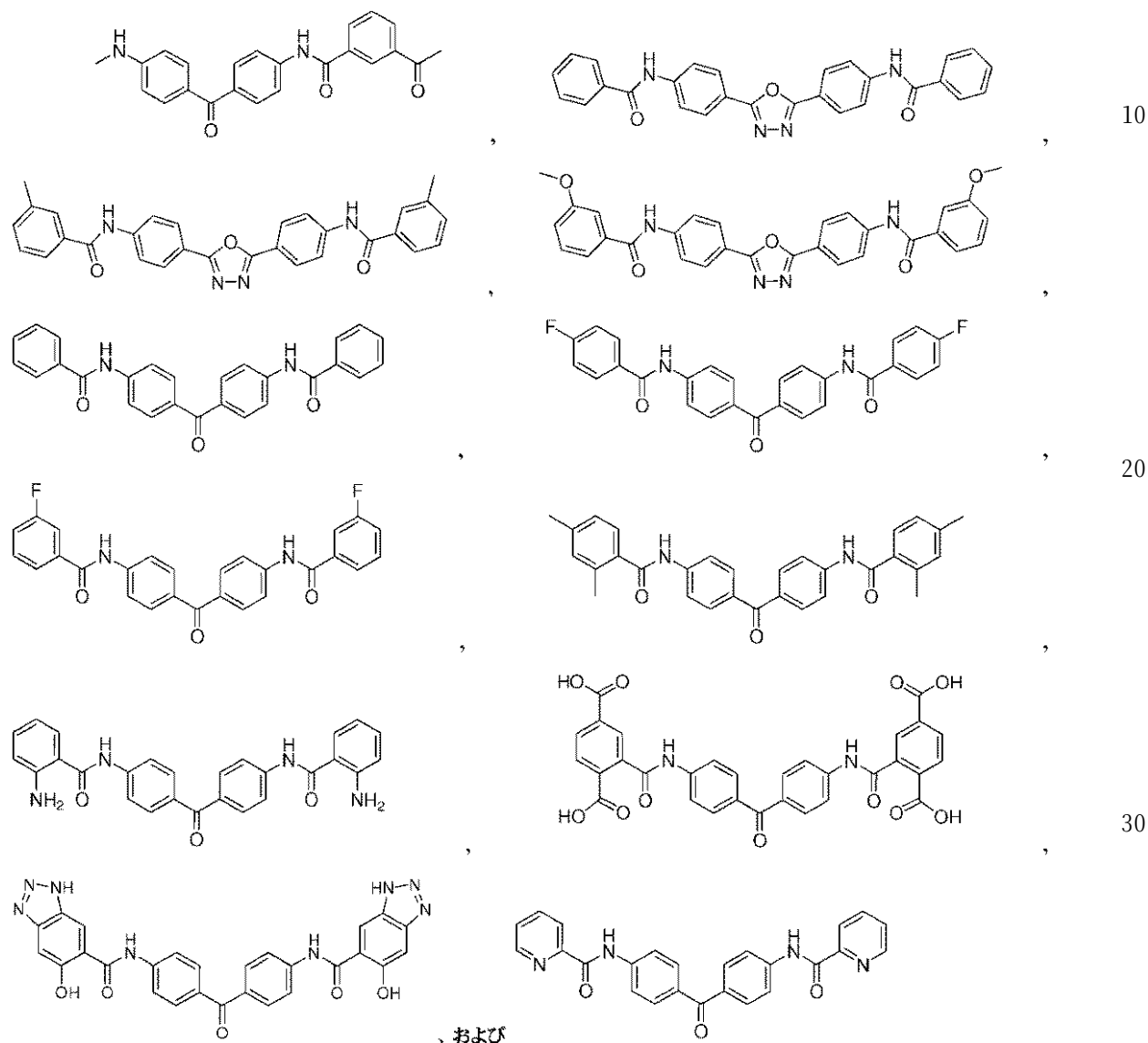
50

素、および $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択され；または $-NR^L R^G$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

R^R が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択され；

各 m が、独立して、0、1、2、または3であり、ただし、式 IX の化合物が：

【化 1 4】



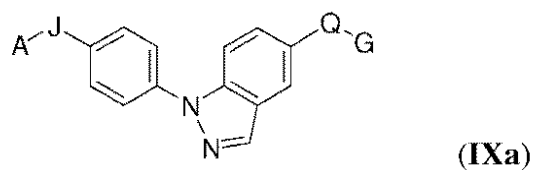
からなる群より選択されないことを条件とする。

【0013】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 IX a：

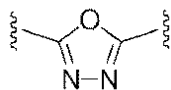
40

【化 1 5】



で表される式 IX の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供し、式中、Z が、

【化 1 6】



、または $-C(=O)-$ であり、 R^A が、 R^1 、 R^2 、および R^3 からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ置換される、複素環、多環式ヘテロシクリル、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、各 R^1 が、クロロ、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より別々に選択され、各 R^2 が、 $-O(CH_2)_mOR^I$ 、 $-(CH_2)_mOR^I$ 、 $-NR^JR^K$ 、 $-(CH_2)_mSR^I$ 、 $-C(=O)R^L$ 、および $-(CH_2)_mR^L$ からなる群より別々に選択され、各 R^3 が、 $-(CH_2)_mOR^G$ 、 $-NR^LC(=O)R^M$ 、 $-NR^LC(=O)OR^M$ 、 $-NR^LC(=O)NR^NR^O$ 、 $-NR^NR^O$ 、 $-(CH_2)_mS(O)_{0 \sim 2}R^M$ 、 $-(CH_2)_mNHS(O)_{0 \sim 2}R^M$ 、 $-(CH_2)_mCN$ 、 $-(CH_2)_mR^P$ 、複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールからなる群より別々に選択され、 R^3 の定義中の前記複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールは、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-C(=O)OR^M$ 、または $-NR^JR^K$ でそれぞれ適宜置換されていてもよい。

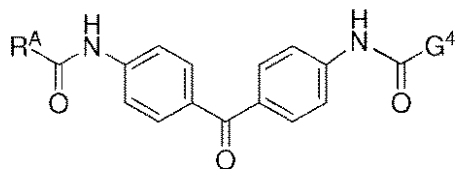
10

20

【0014】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 IXaa :

【化 1 7】



(IXaa)

で表される式 IXa の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供し、式中、 G^4 が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ置換される、多環式ヘテロシクリル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、各 R^4 が、クロロ、シアノ、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択され、各 R^5 が、 $-O(CH_2)_mOR^I$ 、 $-(CH_2)_mOR^I$ 、 $-NR^JR^K$ 、 $-(CH_2)_mSR^I$ 、 $-(CH_2)_mC(=O)R^L$ 、 $-(CH_2)_mR^L$ 、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より別々に選択され、各 R^6 が、 $-(CH_2)_mOR^G$ 、 $-NR^LC(=O)R^M$ 、 $-NR^LC(=O)OR^M$ 、 $-NR^LC(=O)NR^NR^O$ 、 $-NR^NR^O$ 、 $-(CH_2)_mS(O)_{0 \sim 2}R^M$ 、 $-(CH_2)_mNHS(O)_{0 \sim 2}R^M$ 、 $-(CH_2)_mNO_2$ 、 $-(CH_2)_mCN$ 、 $-(CH_2)_mR^P$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールからなる群より別々に選択され、 R

30

40

50

⁶ の定義中の前記複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-C(=O)OR^M$ 、または $-NR^J R^K$ でそれぞれ適宜置換されていてもよい。

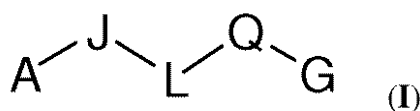
【0015】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 IX a の化合物を提供し、式中、各 R^1 が、シアノ、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択され、各 R^2 が、 $-O(CH_2)_m OR^I$ 、 $-(CH_2)_m OR^I$ 、 $-NR^J R^K$ 、 $-(CH_2)_m SR^I$ 、 $-C(=O)R^L$ 、および $-(CH_2)_m R^L$ からなる群より別々に選択され、各 R^3 が、 $-(CH_2)_m OR^G$ 、 $-NR^L C(=O)R^M$ 、 $-NR^L C(=O)OR^M$ 、 $-NR^L C(=O)NR^N R^O$ 、 $-NR^N R^O$ 、 $-(CH_2)_m S(O)_{0 \sim 2} R^M$ 、 $-(CH_2)_m NHS(O)_{0 \sim 2} R^M$ 、 $-(CH_2)_m NO_2$ 、 $-(CH_2)_m CN$ 、 $-(CH_2)_m R^P$ 、複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールからなる群より別々に選択され、 R^3 の定義中の前記複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールは、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-C(=O)OR^M$ 、または $-NR^J R^K$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく、各 R^4 が、シアノ、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より別々に選択され、各 R^5 が、 $-(CH_2)_m OH$ 、 $-NR^J R^K$ 、および $-(CH_2)_m C(=O)R^L$ からなる群より別々に選択され、各 R^L が、独立して、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ アルコキシからなる群より選択され、各 R^6 が、 $-NR^L C(=O)R^M$ 、 $-NR^L C(=O)OR^M$ 、 $-NR^L C(=O)NR^N R^O$ 、 $-NR^N R^O$ 、 $-(CH_2)_m R^P$ 、複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールからなる群より別々に選択され、 R^6 の定義中の前記複素環、アリール、多環式ヘテロシクリル、およびヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-C(=O)OR^M$ 、または $-NR^J R^K$ でそれぞれ適宜置換されていてもよい。

【0016】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I :

【化18】



の化合物またはその医薬的に許容される塩、エステル、立体異性体、互変異性体もしくはプロドラッグを提供し；

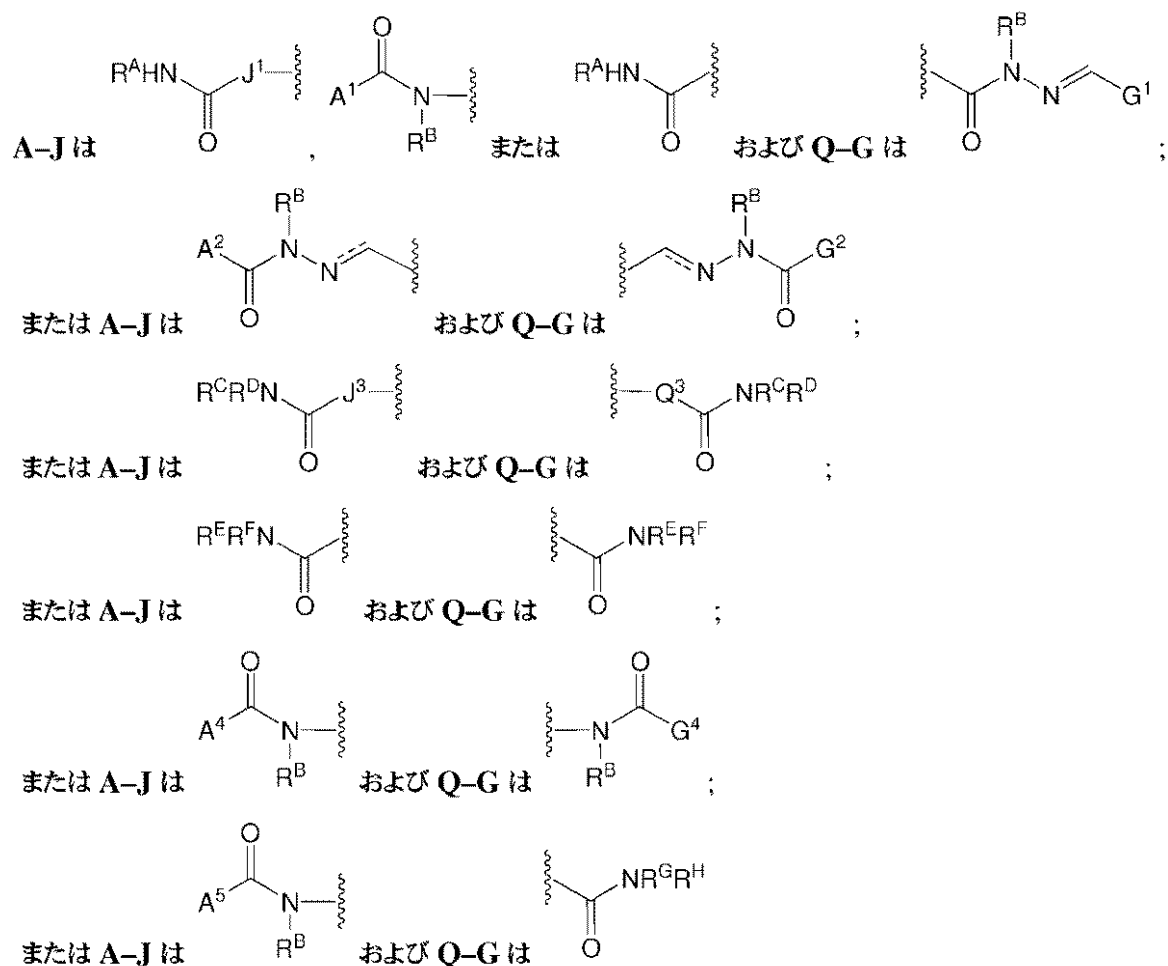
式中：

10

20

30

【化 19】



10

20

であり；

A^1 が、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルケニル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、 $-(\text{CH}_2)_m \text{NR}^{\text{P}} \text{R}^{\text{L}}$ 、複素環、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、前記 $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルケニル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、複素環、アリール、およびヘテロアリールは、 R^1 、 R^2 、および R^3 からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよく、 A^1 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

30

J^1 が、 $-(\text{CH}_2)_r \text{NR}^{\text{B}} \text{C}(=\text{O}) (\text{CH}_2)_m -$ および $-(\text{CH}_2)_r \text{NR}^{\text{B}} (\text{CH}_2)_m -$ 、および $-(\text{CH}_2)_r -$ からなる群より選択され；

G^1 が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 G^1 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

40

A^2 が、 R^1 、 R^2 、および R^3 からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 A^2 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

G^2 が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞ

50

れ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 G^2 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

J^3 が、適宜置換されていてもよいアリール、 $-(CH_2)_mNR^B C(=O)(CH_2)_m-$ 、 $-(CH_2)_rO(CH_2)_m-$ 、 $-(CH_2)_rNR^B(CH_2)_m-$ 、および $-(CH=CH)_m-$ からなる群より選択され；

Q^3 が、適宜置換されていてもよいアリール、 $-(CH_2)_rNR^B C(=O)(CH_2)_m-$ 、 $-(CH_2)_rO(CH_2)_m-$ 、 $-(CH_2)_rNR^B(CH_2)_m-$ 、および $-(CH=CH)_r-$ からなる群より選択され；

A^4 が、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-(CH_2)_mNR^P R^L$ 、複素環、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、前記 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、複素環、アリール、およびヘテロアリールは、 R^1 、 R^2 、および R^3 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよく、 A^4 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

G^4 が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、 G^4 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

A^5 が、 R^1 、 R^2 、および R^3 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 A^5 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

R^A が、 $-(CH_2)_p R^L$ 、 $-(CH_2)_p OR^L$ 、 $-SO_2 R^L$ 、 $-C(=O) R^L$ 、 $-C(=O) NR^N R^O$ 、 $-(CH_2)_p NR^N R^O$ 、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^A の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、 $-C(=O) NR^N R^O$ 、 $-OC(=O) NR^N R^O$ 、 $-NHC(=O) NR^N R^O$ 、 $-O(CH_2)_q NR^N R^O$ 、 $-NH(CH_2)_q NR^N R^O$ 、 $-(CH_2)_p NR^N R^O$ 、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールでそれぞれ適宜置換されていてもよく、 R^A の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

各 R^B が、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルケニル、および適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルからなる群より別々に選択され；

各 $-NR^C R^D$ が別々に選択され、各 R^C が、独立して、水素および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択され、各 R^D が、独立して、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^D の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、 $-C(=O) NR^N R^O$ 、 $-OC(=O) NR^N R^O$ 、 $-NHC(=O) NR^N R^O$ 、 $-O(CH_2)_q NR^N R^O$ 、 $-NH(CH_2)_q NR^N R^O$ 、 $-(CH_2)_p NR^N R^O$ 、適宜置換されていてもよいアリールお

10

20

30

40

50

よび適宜置換されていてもよいヘテロアリールでそれぞれ適宜置換されていてもよく、 R^D の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

各 $-NR^E R^F$ が別々に選択され、各 R^E が、独立して、水素および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択され、各 R^F が、独立して、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^F の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、 $-C(=O)NR^N R^O$ 、 $-OC(=O)NR^N R^O$ 、 $-NHC(=O)NR^N R^O$ 、 $-O(CH_2)_q NR^N R^O$ 、 $-NH(CH_2)_q NR^N R^O$ 、 $-(CH_2)_p NR^N R^O$ 、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールでそれぞれ適宜置換されていてもよく、 R^F の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

$-NR^G R^H$ の定義中の R^G が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキニル、複素環、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^G の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく、または R^G が、 $-OR^L$ または $-NR^P R^L$ であり；

$-NR^G R^H$ の定義中の R^H が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、および $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルからなる群より選択され、または $-NR^G R^H$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

各 R^1 が、ハロゲン、シアノ、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択され；

各 R^2 が、ハロゲン、 $-O(CH_2)_m OR^I$ 、 $-(CH_2)_m OR^I$ 、 $-NR^J R^K$ 、 $-(CH_2)_m SR^I$ 、 $-C(=O)R^L$ 、 $-(CH_2)_m R^L$ 、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルからなる群より別々に選択され、前記 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルはさらに、アリールまたはヘテロアリールと適宜縮合されていてもよく；

各 R^3 が、ハロゲン、 $-(CH_2)_m OR^G$ 、 $-NR^L C(=O)R^M$ 、 $-NR^L C(=O)OR^M$ 、 $-NR^L C(=O)NR^N R^O$ 、 $-NR^N R^O$ 、 $-(CH_2)_m S(O)_{0 \sim 2} R^M$ 、 $-(CH_2)_m NHS(O)_{0 \sim 2} R^M$ 、 $-(CH_2)_m NO_2$ 、 $-(CH_2)_m CN$ 、 $-(CH_2)_m R^P$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、複素環、アリール、およびヘテロアリールからなる群より別々に選択され、 R^3 の定義中の前記複素環、アリールおよびヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、または $-NR^J R^K$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく；

10

20

30

40

50

各 R^4 が、ハロゲン、シアノ、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択され；

各 R^5 が、ハロゲン、 $-O(CH_2)_mOR^I$ 、 $-(CH_2)_mOR^I$ 、 $-NR^JR^K$ 、 $-(CH_2)_mSR^I$ 、 $-C(=O)R^L$ 、 $-(CH_2)_mR^L$ 、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より別々に選択され；

10

各 R^6 が、ハロゲン、 $-(CH_2)_mOR^G$ 、 $-NR^LC(=O)R^M$ 、 $-NR^LC(=O)OR^M$ 、 $-NR^LC(=O)NR^NR^O$ 、 $-NR^NR^O$ 、 $-(CH_2)_mS(O)_{0 \sim 2}R^M$ 、 $-(CH_2)_mNHS(O)_{0 \sim 2}R^M$ 、 $-(CH_2)_mNO_2$ 、 $-(CH_2)_mCN$ 、 $-(CH_2)_mR^P$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、複素環、アリール、およびヘテロアリールからなる群より別々に選択され、 R^6 の定義中の前記複素環、アリールおよびヘテロアリールは、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、または $-NR^JR^K$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく；

20

各 R^I が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロハロアルキルからなる群より別々に選択され；

各 $-NR^JR^K$ が別々に選択され、 R^J および R^K がそれぞれ、独立して、水素、最大5つのフルオロで適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-(CH_2)_mOR^JA$ 、 $-(CH_2)_mNR^JB R^JC$ 、 $-(CH_2)_mR^R$ 、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、複素環、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^J および R^K の定義中の前記 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、複素環、アリールおよびヘテロアリールはそれぞれ、独立して、ハロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択される1つ以上の置換基で適宜置換されていてもよく、 R^J および R^K の前記アリールおよびヘテロアリール置換基は、1つ以上のハロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、または $-(CH_2)_mNR^K A R^K B$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく；または $-NR^JR^K$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；または $-NR^JR^K$ が、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミノであり；

30

各 R^JA が、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

各 $-NR^JB R^JC$ が別々に選択され、 R^JB および R^JC がそれぞれ、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

40

各 $-NR^K A R^K B$ が別々に選択され、 $R^K A$ および $R^K B$ がそれぞれ、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

各 R^M が、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、および $-(CH_2)_mR^P$ からなる群より選択され；

各 $-NR^N R^O$ が別々に選択され、 R^N および R^O がそれぞれ、独立して、水素、 $-(CH_2)_mNR^N A R^N B$ 、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^N および R^O の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれ、独立して、 $-($

50

$\text{CH}_2)_m \text{NR}^{\text{O A}} \text{R}^{\text{O B}}$ 、ハロ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、アリーールおよびヘテロアリーールからなる群より選択される1つ以上の置換基で適宜置換されていてもよく、 R^{N} および R^{O} の前記アリーールおよびヘテロアリーール置換基は、1つ以上のハロ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、または $-\text{NR}^{\text{N A}} \text{R}^{\text{N B}}$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく、

各 $-\text{NR}^{\text{N A}} \text{R}^{\text{N B}}$ が別々に選択され、 $\text{R}^{\text{N A}}$ および $\text{R}^{\text{N B}}$ がそれぞれ、独立して、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、および $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

各 $-\text{NR}^{\text{O A}} \text{R}^{\text{O B}}$ が別々に選択され、 $\text{R}^{\text{O A}}$ および $\text{R}^{\text{O B}}$ がそれぞれ、独立して、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、および $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

R^{P} が、水素および $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルからなる群より選択され；

10

R^{L} が、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、 $-(\text{CH}_2)_m \text{OR}^{\text{L A}}$ 、 $-(\text{CH}_2)_m \text{NR}^{\text{L B}} \text{R}^{\text{L C}}$ 、アリーールおよびヘテロアリーールからなる群より選択され、 R^{L} の定義中の前記アリーールおよびヘテロアリーールはそれぞれ、独立して、ハロ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、 $-(\text{CH}_2)_m \text{NR}^{\text{L D}} \text{R}^{\text{L E}}$ 、アリーールおよびヘテロアリーールからなる群より選択される1つ以上の置換基で適宜置換されていてもよく、 R^{L} の前記アリーールおよびヘテロアリーール置換基は、1つ以上のハロ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、または $-(\text{CH}_2)_m \text{NR}^{\text{L F}} \text{R}^{\text{L G}}$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく；

$\text{R}^{\text{L A}}$ が、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、および $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

20

$\text{R}^{\text{L B}}$ および $\text{R}^{\text{L C}}$ がそれぞれ、独立して、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、および $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヘテロアルケニルからなる群より選択され；または $-\text{NR}^{\text{L B}} \text{R}^{\text{L C}}$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

各 $-\text{NR}^{\text{L D}} \text{R}^{\text{L E}}$ が別々に選択され、 $\text{R}^{\text{L D}}$ および $\text{R}^{\text{L E}}$ がそれぞれ、独立して、水素、アリーール、ヘテロアリーール、および適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルからなる群より選択され、 $\text{R}^{\text{L D}}$ および $\text{R}^{\text{L E}}$ の定義中の前記アリーールおよびヘテロアリーールは、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシでそれぞれ適宜置換されていてもよく；または $-\text{NR}^{\text{L D}} \text{R}^{\text{L E}}$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

30

各 $-\text{NR}^{\text{L F}} \text{R}^{\text{L G}}$ が別々に選択され、 $\text{R}^{\text{L F}}$ および $\text{R}^{\text{L G}}$ がそれぞれ、独立して、水素、および $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルからなる群より選択され；または $-\text{NR}^{\text{L F}} \text{R}^{\text{L G}}$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

L が、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_p \text{O}-$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_7$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_7$ ヘテロアルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルケニル、適宜置換されていてもよい複素環、適宜置換されていてもよいアリーール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリーールからなる群より選択され、または L が、 $\text{L}^1 - \text{L}^2$ 、 $\text{L}^1 - \text{O} - \text{L}^2$ 、 $\text{L}^1 - \text{S} - \text{L}^2$ 、 $\text{L}^1 - \text{NR}^9 - \text{L}^2$ 、 $\text{L}^1 - \text{L}^2 - \text{L}^3$ 、 $\text{L}^1 - \text{L}^2 - \text{L}^3 - \text{L}^4$ 、 $\text{L}^1 - \text{C}(=\text{E}) - \text{L}^2$ 、および $\text{L}^1 - \text{CR}^7 \text{R}^8 - \text{L}^2$ からなる群より選択され；

40

L^1 が、適宜置換されていてもよいアリーール、適宜置換されていてもよいヘテロアリーール、および適宜置換されていてもよい複素環からなる群より選択され；

L^2 が、適宜置換されていてもよいアリーール、適宜置換されていてもよいヘテロアリーール、および適宜置換されていてもよい複素環からなる群より選択され；

L^3 が、適宜置換されていてもよいアリーール、適宜置換されていてもよいヘテロアリーール、および適宜置換されていてもよい複素環からなる群より選択され；

L^4 が、適宜置換されていてもよいアリーールであり；

E が、 O （酸素）、 $\text{N}-\text{NHR}^{\text{Q}}$ または $\text{N}-\text{OR}^{\text{Q}}$ であり、 E の定義中の R^{Q} が、水素、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、 $-(\text{CH}_2)_m \text{R}^{\text{R}}$ 、および $-\text{C}(=\text{O})(\text{CH}_2)_m \text{R}^{\text{R}}$ からなる群より

50

選択され；

R^R が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択され；

R^7 および R^8 がそれぞれ、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $-OH$ からなる群より選択され；または CR^7R^8 が、1～3個のさらなるヘテロ原子が適宜環に組み込まれてもよい適宜置換されていてもよい三員～八員炭素環であり；

R^9 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル $C(O)-$ および $C_1 \sim C_6$ アルキル $C(O)-$ からなる群より選択され；

各 m が、独立して、0、1、2、または3であり；

各 p が、独立して、0、1、2、3、4、5、または6であり；

各 q が、独立して、1、2、3、4、5、または6であり；

各 r が、独立して、1、2、3、または4であり；

破線および実線で表されるいずれの結合も、単結合および二重結合からなる群より選択される結合を表す。

【0017】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I の化合物を提供し、式中、 R^1 が、フッ素、塩素、およびメチルからなる群より選択することができ； R^2 が、 $-(CH_2)_mOR^1$ 、 $-NR^JR^K$ 、および $-(CH_2)_mSR^1$ からなる群より選択することができ； R^3 が、 $-(CH_2)_mR^P$ 、 $-(CH_2)_mOR^M$ 、および $-NR^NR^O$ からなる群より選択することができ； R^4 が、フッ素、塩素、およびメチルからなる群より選択することができ； R^5 が、 $-(CH_2)_mOR^1$ 、 $-NR^JR^K$ 、および $-(CH_2)_mSR^1$ からなる群より選択することができ； R^6 が、 $-(CH_2)_mR^P$ 、 $-(CH_2)_mOR^M$ 、および $-NR^NR^O$ からなる群より選択することができ； R^I が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より選択することができ；各 $-NR^JR^K$ を別々に選択することができ、 R^J および R^K がそれぞれ、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より選択することができ；または $-NR^JR^K$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり得；または $-NR^JR^K$ が、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミノであり得；各 R^M が、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $-(CH_2)_mR^P$ からなる群より選択することができ； R^L が、水素、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、および適宜置換されていてもよいアリールまたは適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択することができ； m が、0、1、または2であり得る。

【0018】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I の化合物を提供し、式中、 G^1 が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換されるアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 G^1 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、非芳香族複素環または非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； A^2 が、 R^1 、 R^2 、および R^3 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換されるアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 A^2 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、非芳香族複素環または非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； G^2 が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換されるアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 G^2 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、非芳香族複素環または非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； A^4 が、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル

10

20

30

40

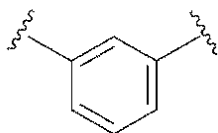
50

、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-(CH_2)_m NR^P R^L$ 、複素環、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択することができ、前記 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、複素環、アリール、およびヘテロアリールは、 R^1 、 R^2 、および R^3 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換され、 A^4 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、非芳香族複素環または非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； G^4 が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換される、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 G^4 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、非芳香族複素環または非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； A^5 が、 R^1 、 R^2 、および R^3 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換されるアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 A^5 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、非芳香族複素環または非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； R^1 が、フッ素、塩素、およびメチルからなる群より選択することができ； R^2 が、 $-(CH_2)_m OR^I$ および $-NR^J R^K$ からなる群より選択することができ； R^3 が $-R^P$ であり得； R^4 が、フッ素、塩素、およびメチルからなる群より選択することができ； R^5 が、 $-(CH_2)_m OR^I$ および $-NR^J R^K$ からなる群より選択することができ； R^6 が $-R^P$ であり得； R^L が、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択することができる。

【0019】

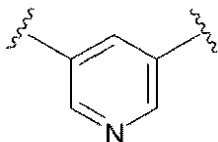
本明細書に開示されるある実施形態は、式 I の化合物を提供し、式中、L が、適宜置換されていてもよい

【化20】



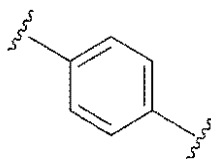
、適宜置換されていてもよい

【化21】



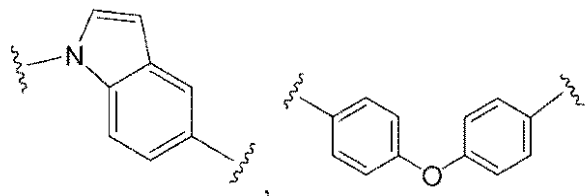
、適宜置換されていてもよい

【化22】



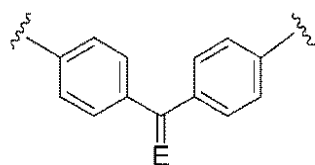
、適宜置換されていてもよい

【化 2 3】



および

【化 2 4】

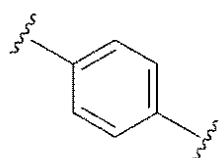


10

からなる群より選択することができ；Eが、O（酸素）、N-NHR^QまたはN-OR^Qであり得、Eの定義中のR^Qが、水素、適宜置換されていてもよいC₁～C₆アルキル、適宜置換されていてもよいC₂～C₄アルケニル、-R^R、および-C(=O)R^Rからなる群より選択することができる。ある実施形態において、Lが、適宜置換されていてもよい

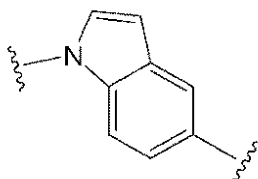
20

【化 2 5】



および適宜置換されていてもよい

【化 2 6】



30

からなる群より選択することができ；各R¹が、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択することができ；各R²が、ハロゲン、-(CH₂)_mOR^I、および-NR^BR^Cからなる群より別々に選択することができ、R²の定義中のR^Iが、水素、およびC₁～C₆アルキルからなる群より選択することができ；各R³がフルオロであり得；各-NR^JR^Kを別々に選択することができ、R^JおよびR^Kがそれぞれ、独立して、水素およびC₁～C₆アルキルからなる群より選択することができ；または-NR^JR^Kが、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり得；各R⁴が、クロロ、フルオロ、および適宜置換されていてもよいC₁～C₆アルキルからなる群より別々に選択することができ；各R⁵が、-OCH₂CH₂OR^I、-(CH₂)_mOR^I、および-NR^JR^Kからなる群より別々に選択することができ、R⁵の定義中のR^Iが、水素、およびC₁～C₆アルキルからなる群より選択することができ；各R⁶が、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択することができる。

40

【0020】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I の化合物を提供し、式中、A¹、A²、A

50

⁴、および A⁵ がそれぞれ、R¹ および R² からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ置換される、フェニル、ナフチル、ベンゾ [d] [1, 3] ジオキソリル、インドリル、およびベンゾ [d] イミダゾリルからなる群より選択することができ；各 R¹ が、C₁ ~ C₆ アルキル、C₁ ~ C₆ アルコキシ、C₁ ~ C₆ アルキルHN—および (C₁ ~ C₆ アルキル)₂N—から選択される置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、フェニル、ピロリル、およびイミダゾリルからなる群より別々に選択することができ；各 R² が、プロモ、クロロ、フルオロ、—(CH₂)_mOR¹、—(CH₂)_mR^L、および—NR^JR^K からなる群より別々に選択することができ、R² の定義中の各 R¹ が、水素および C₁ ~ C₆ アルキルからなる群より別々に選択することができ；各—NR^JR^K を別々に選択することができ、R^J および R^K がそれぞれ、独立して、水素、および最大 3 つのフルオロで適宜置換されていてもよい C₁ ~ C₆ アルキルからなる群より選択することができ；または—NR^JR^K が、1 つ以上のオキソでそれぞれ適宜置換されていてもよい、モルホリニル、ピペラジニル、ピロリジニル、およびピペリジニルであり得；各 R^L が、ハロゲン、最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい C₁ ~ C₆ アルキル、および最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい C₁ ~ C₆ アルコキシからなる群よりそれぞれ別々に選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より別々に選択することができ；G¹、G²、および G⁴ がそれぞれ、R⁴ および R⁵ からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ置換される、フェニル、ナフチル、ベンゾ [d] [1, 3] ジオキソリル、インドリル、およびベンゾ [d] イミダゾリルからなる群より選択することができ；各 R⁴ が、C₁ ~ C₆ アルキル、C₁ ~ C₆ アルコキシ、C₁ ~ C₆ アルキルHN—および (C₁ ~ C₆ アルキル)₂N—から選択される置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、フェニル、ピロリル、およびイミダゾリルからなる群より別々に選択することができ；各 R⁵ が、プロモ、クロロ、フルオロ、—(CH₂)_mOR¹、および—NR^JR^K からなる群より別々に選択することができ、R⁵ の定義中の各 R¹ が、水素および C₁ ~ C₆ アルキルからなる群より別々に選択することができる。

【0021】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I の化合物を提供し、式中、A² が、R¹ および R² からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ置換される、フェニル、ナフチル、および、インドリルからなる群より選択することができ；各 R¹ が、C₁ ~ C₆ アルキル、C₁ ~ C₆ アルコキシ、C₁ ~ C₆ アルキルHN—および (C₁ ~ C₆ アルキル)₂N—から選択される置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、フェニル、ピロリル、およびイミダゾリルからなる群より別々に選択することができ；各 R² が、プロモ、クロロ、フルオロ、—(CH₂)_mOR¹、—(CH₂)_mR^L、および—NR^JR^K からなる群より別々に選択することができ、R² の定義中の各 R¹ が、水素および C₁ ~ C₆ アルキルからなる群より別々に選択することができ；各—NR^JR^K を別々に選択することができ、R^J および R^K がそれぞれ、独立して、水素、および最大 3 つのフルオロで適宜置換されていてもよい C₁ ~ C₆ アルキルからなる群より選択することができ；または—NR^JR^K が、1 つ以上のオキソでそれぞれ適宜置換されていてもよい、モルホリニル、ピペラジニル、ピロリジニル、およびピペリジニルであり得；各 R^L が、ハロゲン、最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい C₁ ~ C₆ アルキル、および最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい C₁ ~ C₆ アルコキシからなる群よりそれぞれ別々に選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より別々に選択することができ；G² が、R⁴ および R⁵ からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ置換される、フェニル、ナフチル、および、インドリルからなる群より選択することができ；各 R⁴ が、C₁ ~ C₆ アルキル、C₁ ~ C₆ アルコキシ、C₁ ~ C₆ アルキルHN—および (C₁ ~ C₆ アルキル)₂N—から選択される置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、フェニル、ピロリル、およびイミダゾリルからなる群より別々に選択することができ；各 R⁵ が、プロモ、クロロ、フルオロ、—(CH₂)_mOR¹、および—NR^JR^K からなる群より別々に選択するこ

とができ、 R^5 の定義中の各 R^1 が、水素および $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より別々に選択することができる。

【0022】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I の化合物を提供し、式中、 A^1 、 A^2 、 A^4 、および A^5 がそれぞれ、 R^1 、 R^2 、および R^3 からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ置換される、フェニル、ナフチル、ベンゾ [d] [1, 3] ジオキノリルからなる群より選択することができ； G^1 、 G^2 、および G^4 がそれぞれ、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ置換され、かつ非芳香族複素環または炭素環とそれぞれ適宜縮合されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができる。

10

【0023】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I の化合物を提供し、式中、L が、アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルケニル O-、アリール C (=O)-、アリール C (=O) NH-、アリール NHC (=O)-、アリール $(CH_2)_{0 \sim 3} O (CH_2)_{0 \sim 3}$ -、アリール $(CH_2)_{0 \sim 3} NH (CH_2)_{0 \sim 3}$ -、 $HO (CH_2)_{1 \sim 3} NH$ -、 $HO (CH_2)_{1 \sim 3} O$ -、 $HO (CH_2)_{1 \sim 3}$ -、 $HO (CH_2)_{1 \sim 3} O (CH_2)_{1 \sim 3}$ -、およびアミノからなる群よりそれぞれ個々に選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ置換されるアリール、およびヘテロアリールからなる群より選択することができる。

【0024】

20

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I の化合物を提供し、式中、L が、 $L^1 - L^2$ 、または $L^1 - O - L^2$ 、または $L^1 - NR^9 - L^2$ 、または $L^1 - L^2 - L^3$ 、または $L^1 - L^2 - L^3 - L^4$ 、または $L^1 - C (=E) - L^2$ であり得る。

【0025】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I の化合物を提供し、式中、 L^1 が、アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルケニル O-、アリール C (=O)-、アリール C (=O) NH-、アリール NHC (=O)-、アリール $(CH_2)_{0 \sim 3} O (CH_2)_{0 \sim 3}$ -、アリール $(CH_2)_{0 \sim 3} NH (CH_2)_{0 \sim 3}$ -、 $HO (CH_2)_{1 \sim 3} NH$ -、 $HO (CH_2)_{1 \sim 3} O$ -、 $HO (CH_2)_{1 \sim 3}$ -、 $HO (CH_2)_{1 \sim 3} O (CH_2)_{1 \sim 3}$ -、およびアミノからなる群よりそれぞれ個々に選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ置換されるアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができる。

30

【0026】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I の化合物を提供し、式中、 L^2 が、アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルケニル O-、アリール C (=O)-、アリール C (=O) NH-、アリール NHC (=O)-、アリール $(CH_2)_{0 \sim 3} O (CH_2)_{0 \sim 3}$ -、アリール $(CH_2)_{0 \sim 3} NH (CH_2)_{0 \sim 3}$ -、 $HO (CH_2)_{1 \sim 3} NH$ -、 $HO (CH_2)_{1 \sim 3} O$ -、 $HO (CH_2)_{1 \sim 3}$ -、 $HO (CH_2)_{1 \sim 3} O (CH_2)_{1 \sim 3}$ -、およびアミノからなる群よりそれぞれ個々に選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ置換される、アリール、ヘテロアリール、およびヘテロシクリルからなる群より選択することができる。

40

【0027】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I の化合物を提供し、式中、 L^3 が、アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルケニル O-、アリール C (=O)-、アリール C (=O) NH-、アリール NHC (=O)-、アリール $(CH_2)_{0 \sim 3} O (CH_2)_{0 \sim 3}$ -、アリール $(CH_2)_{0 \sim 3} NH (CH_2)_{0 \sim 3}$ -、 $HO (CH_2)_{1 \sim 3} NH$ -、 $HO (CH_2)_{1 \sim 3} O$ -、 $HO (CH_2)_{1 \sim 3}$ -、 $HO (CH_2)_{1 \sim 3} O (CH_2)_{1 \sim 3}$ -、およびアミノからなる群よりそれぞれ個々に選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ置換される、アリール、ヘテロアリール、およびヘテロシクリルからなる群より選択することができる。

50

【0028】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I の化合物を提供し、式中、 L^4 が、アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルケニルOー、アリーールC(=O)ー、アリーールC(=O)NHー、アリーールNHC(=O)ー、アリーール(CH₂)_{0~3}O(CH₂)_{0~3}ー、アリーール(CH₂)_{0~3}NH(CH₂)_{0~3}ー、HO(CH₂)_{1~3}NHー、HO(CH₂)_{1~3}Oー、HO(CH₂)_{1~3}ー、HO(CH₂)_{1~3}O(CH₂)_{1~3}ー、およびアミノからなる群よりそれぞれ個々に選択される1つ以上の置換基で置換されるアリーールであり得る。

【0029】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I の化合物を提供し、ただし、式 I の化合物が以下のものからなる群より選択されないことを条件とする：

【0030】

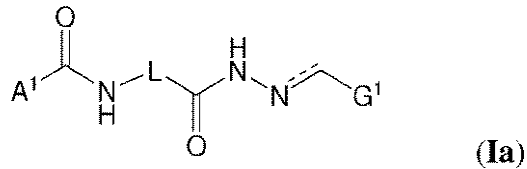
【表1】

		20
		30
および		40

【0031】

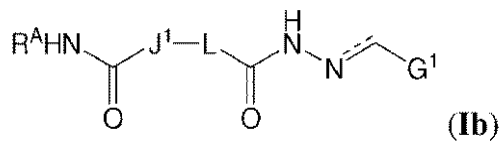
本明細書に開示されるある実施形態は、式 Ia：

【化 2 7】



で表される式 I の化合物、およびその医薬的に許容される塩、式 I b :

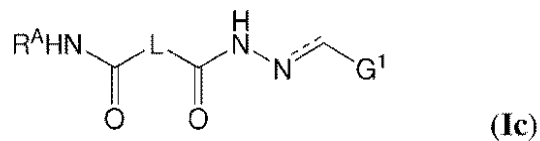
【化 2 8】



10

で表される式 I の化合物、およびその医薬的に許容される塩、または式 I c :

【化 2 9】



20

で表される式 I の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供する。

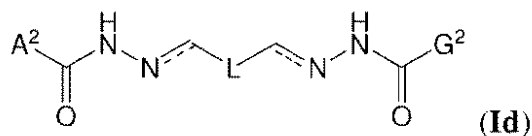
【0032】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I a、I b、I c、または I d の化合物を提供し、式中、L が、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択することができる。

【0033】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I d :

【化 3 0】



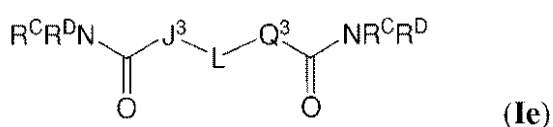
30

で表される式 I の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供する。

【0034】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I e :

【化 3 1】



40

の構造を有する式 I の化合物またはその医薬的に許容される塩を提供する。

【0035】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I e の化合物を提供し、式中、L が、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_p\text{O}-$ 、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択することができ、または L が L^1-L^2 であり； J^3 が、適宜置換されていてもよいアリール、 $-(\text{CH}_2)_m\text{NR}^B\text{C}(=\text{O})-$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{O}-$ 、および $-(\text{CH}=\text{CH})_m-$ からなる群より選択することができ； Q^3 が、

50

【 0 0 3 6 】

【化 3 2】



【 0 0 3 7 】

20

【 0 0 3 8 】

【化 3 3】



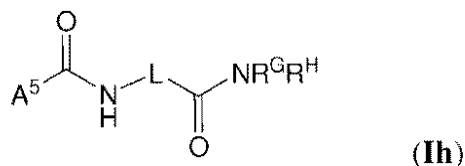
【 0 0 3 9 】

40

【 0 0 4 0 】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I h :

【化 3 4】



の構造を有する式 I の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供する。

【0041】

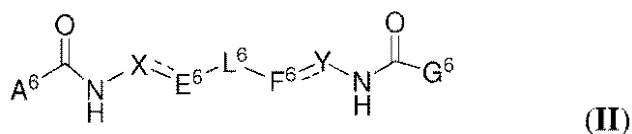
本明細書に開示されるある実施形態は、式 I h の化合物を提供し、式中、L が、適宜置換されていてもよいアリールからなる群より選択することができ、または L が、 $L^1 - L^2$ 、および $L^1 - L^2 - L^3$ からなる群より選択することができ； L^1 が、適宜置換されていてもよいヘテロアリールであり得； L^2 が、適宜置換されていてもよいアリール、適宜置換されていてもよいヘテロアリール、および適宜置換されていてもよい複素環からなる群より選択することができ； L^3 が、適宜置換されていてもよい複素環であり得る。

10

【0042】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I I :

【化 3 5】



20

の化合物またはその医薬的に許容される塩、エステル、立体異性体、互変異性体もしくはプロドラッグを提供し；

式中：

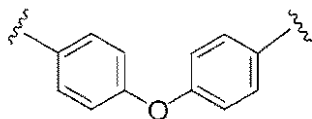
A^6 が、 R^{11} 、 R^{12} 、および R^{13} からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 A^6 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

30

G^6 が、 R^{14} 、 R^{15} 、および R^{16} からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 G^6 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

L^6 が、適宜置換されていてもよいアリール、または適宜置換されていてもよいヘテロアリールであり； L^6 の定義中のアリールおよびヘテロアリールは、非芳香族複素環または非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；または L^6 が、適宜置換されていてもよい

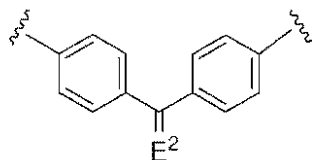
【化 3 6】



40

、および適宜置換されていてもよい

【化 37】



からなる群より選択され；

E^2 が、O（酸素）または $N-OR^D$ であり、 E^2 の定義中の R^D が、水素および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択され；

各 R^{11} が、ハロゲン、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択され；

各 R^{12} が、 $-O(CH_2)_mOR^A$ 、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-NR^BR^C$ 、および $-(CH_2)_mSR^A$ からなる群より別々に選択され；

各 R^{13} が、 $-(CH_2)_mOR^D$ 、 $-NR^ER^F$ 、 $-S(O)_{0 \sim 2}R^D$ 、 $-(CH_2)_mNO_2$ 、 $-(CH_2)_mCN$ 、および $-(CH_2)_mR^G$ からなる群より別々に選択され；

各 R^{14} が、ハロゲン、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択され；

各 R^{15} が、 $-O(CH_2)_mOR^A$ 、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-NR^BR^C$ 、および $-(CH_2)_mSR^A$ からなる群より別々に選択され；

各 R^{16} が、 $-(CH_2)_mOR^D$ 、 $-NR^ER^F$ 、 $-(CH_2)_mS(O)_{0 \sim 2}R^D$ 、 $-(CH_2)_mNO_2$ 、 $-(CH_2)_mCN$ 、および $-(CH_2)_mR^G$ からなる群より別々に選択され；

E^6 と X との間の破線が二重結合を表す場合、 E^6 が CR^{17} であり；または E^6 と X との間の破線が単結合を表す場合、 E^6 が $CR^{17}R^{17}$ であり；

F^6 と Y との間の破線が二重結合を表す場合、 F^6 が CR^{18} であり；または F^6 と Y との間の破線が単結合を表す場合、 F^6 が $CR^{18}R^{18}$ であり；

各 R^{17} が、独立して、水素、ハロゲン、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群より選択され；

各 R^{18} が、独立して、水素、ハロゲン、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群より選択され；

R^A が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロハロアルキルからなる群より選択され；

各 $-NR^BR^C$ が別々に選択され、 R^B および R^C がそれぞれ、独立して、水素、 $-SO_2R^H$ 、 $-C(=O)R^H$ 、 $-C(=O)NR^ER^F$ 、複素環、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロハロアルキルからなる群より選択され、 R^B および R^C の定義中の $C_1 \sim C_6$ アルキルが、適宜置換されていてもよいアリールまたは適宜置換されていてもよいヘテロアリ

10

20

30

40

50

ールで適宜置換されていてもよく、 R^B および R^C の定義中の $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルおよび複素環が、アリールまたはヘテロアリールと適宜縮合されていてもよく；または $-NR^B R^C$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；または $-NR^B R^C$ が、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミノであり；

各 R^D が、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $-(CH_2)_m R^G$ からなる群より選択され；

各 $-NR^E R^F$ が別々に選択され、 R^E および R^F がそれぞれ、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $-(CH_2)_m R^G$ からなる群より選択され；または $-NR^E R^F$ が、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミノであり；または $-NR^E R^F$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり； R^G が、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールから選択され；

R^H が、水素、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、および適宜置換されていてもよいアリールまたはヘテロアリールからなる群より選択され；

X および Y が、独立して、 N （窒素）、 NH 、 CR^{19} 、および $CR^{19} R^{20}$ から選択され；

各 R^{19} および R^{20} が、独立して、水素および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群より選択され；

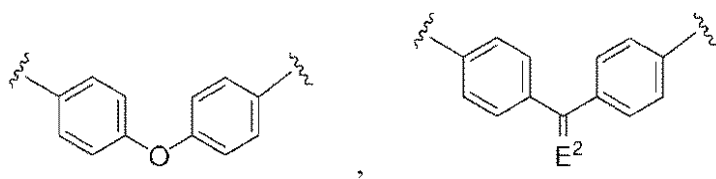
各 m が、独立して、0、1、または2であり；

破線および実線で表されるいずれの結合も、単結合および二重結合からなる群より選択される結合を表す。

【0043】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I I の化合物を提供し、式中、 A^6 が、 R^{11} 、 R^{12} 、および R^{13} からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 A^6 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、非芳香族複素環または炭素環と任意に縮合することができ； L^6 が、

【化38】



、適宜置換されていてもよい

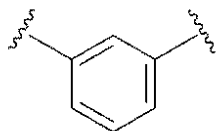
10

20

30

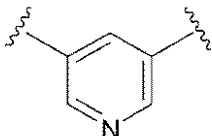
40

【化 3 9】



、適宜置換されていてもよい

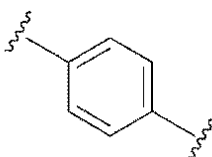
【化 4 0】



10

、適宜置換されていてもよい

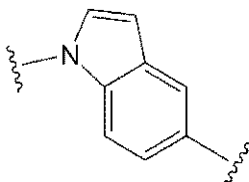
【化 4 1】



20

、および適宜置換されていてもよい

【化 4 2】



からなる群より選択することができ； E^2 が、O（酸素）または $N-OR^D$ であり得、 E^2 の定義中の R^D が、水素および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択することができ； G^6 が、 R^{14} 、 R^{15} 、および R^{16} からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 G^6 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、非芳香族複素環または炭素環と任意に縮合することができ；各 R^{11} が、フルオロ、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択することができ；各 R^{12} が、 $-O(CH_2)_mOR^A$ 、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、および $-NR^BR^C$ からなる群より別々に選択することができ、 R^{12} の定義中の R^A が、水素、および $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択することができ；各 R^{13} が、 $-OR^D$ 、 $-NR^ER^F$ 、 $-S(O)_2R^D$ 、 $-CN$ 、および $-R^G$ からなる群より別々に選択することができ；各 $-NR^BR^C$ を別々に選択することができ、 R^B および R^C がそれぞれ、独立して、水素、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択することができ、 R^B および R^C の定義中の $C_1 \sim C_6$ アルキルが、適宜置換されていてもよいアリールまたは適宜置換されていてもよいヘテロアリールで任意に置換することができ、 R^B および R^C の定義中の $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルが、適宜置換されていてもよいアリールと任意に縮合することができ；または $-NR^BR^C$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり得； R^H が、水素、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択することができ；各 R^{14} が、クロロ、フルオロ、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されてい

30

40

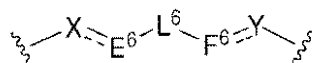
50

もよいヘテロアリールからなる群より別々に選択することができ； R^{15} が、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、および $-NR^BR^C$ からなる群より別々に選択することができ、 R^{15} の定義中の R^A が、水素、および $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択することができ；各 R^{16} が、 $-OR^D$ 、 $-NR^ER^F$ 、 $-S(O)_2R^D$ 、 $-CN$ 、および $-R^G$ からなる群より別々に選択することができる。ある実施形態において、 A^6 が、 R^{11} 、 R^{12} 、および R^{13} からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換されるアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 A^6 の定義中の前記アリールはそれぞれさらに、非芳香族複素環または非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； G^6 が、 R^{14} 、 R^{15} 、および R^{16} からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換されるアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 G^6 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、非芳香族複素環または炭素環と任意に縮合することができ；各 R^{11} が、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択することができ；各 R^{12} が、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、および $-NR^BR^C$ からなる群より別々に選択することができ、 R^{12} の定義中の R^A が、水素、および $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択することができ；各 R^{13} がフルオロであり得；各 $-NR^BR^C$ を別々に選択することができ、 R^B および R^C がそれぞれ、独立して、水素、 $-C(=O)R^H$ 、および $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択することができ；または $-NR^BR^C$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり得；各 R^{14} が、クロロ、フルオロ、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択することができ；各 R^{15} が、 $-OCH_2CH_2OR^A$ 、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、および $-NR^BR^C$ からなる群より別々に選択することができ、 R^{15} の定義中の R^A が、水素、および $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択することができ；各 R^{16} がフルオロであり得る。

【0044】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I I の化合物を提供し、式中、

【化 4 3】



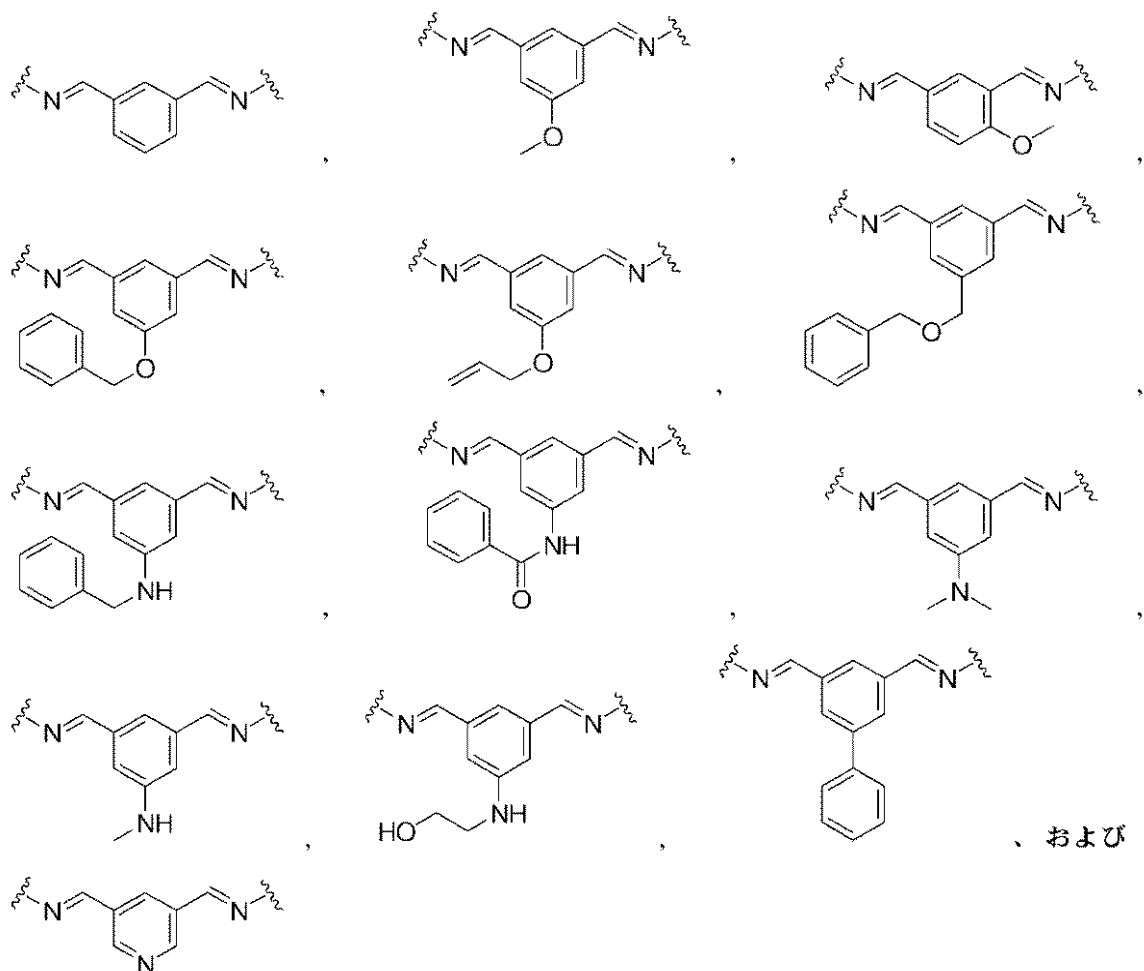
が、以下のものからなる群より選択される：

10

20

30

【化 4 4】



10

20

、および

【0045】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I I の化合物を提供し、式中、 A^6 が、 R^{11} および R^{12} からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されてい

てもよい、フェニル、ナフチル、ベンゾ [d] [1, 3] ジオキソリル、インドリル、およびベンゾ [d] イミダゾリルからなる群より選択することができ；各 R^{11} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル HN- および ($C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ N- から選択される置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、フェニル、ピロリル、およびイミダゾリルからなる群より別々に選択することができ；各 R^{12} が、

ブromo、クロロ、フルオロ、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、および $-NR^B R^C$ からなる群より別々に選択することができ、 R^{12} の定義中の各 R^A が、水素および $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より別々に選択することができ；各 $-NR^B R^C$ を別々に選択することができ、 R^B および R^C がそれぞれ、独立して、水素、 $-C(=O)R^H$ 、最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、およびさらにフェニルと適宜縮合されて

いてもよい適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルからなる群より選択することができ；または $-NR^B R^C$ が、1 つ以上のオキソでそれぞれ適宜置換されていてもよい、モルホリニル、ピペラジニル、ピロリジニル、およびピペリジニルであり得；各 R^H が、ハロゲン、最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、および最大 5 つのフルオロで適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシからなる群よりそれぞれ別々に選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より別々に選択することができ； G^6 が、 R^{14} および R^{15} からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されてい

てもよい、フェニル、ナフチル、ベンゾ [d] [1, 3] ジオキソリル、インドリル、およびベンゾ [d] イミダゾリルからなる群より選択することができ；各 R^{14} が、 $C_1 \sim$

30

40

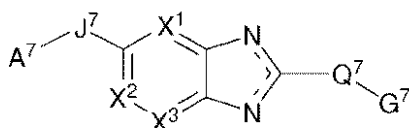
50

C₆アルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルキルHNーおよび(C₁～C₆アルキル)₂Nーから選択される置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、フェニル、ピロリル、およびイミダゾリルからなる群より別々に選択することができ；各R^{1 5}が、ブromo、クロロ、フルオロ、ー(CH₂)_mOR^A、およびーNR^BR^Cからなる群より別々に選択することができ、R^{1 5}の定義中の各R^Aが、水素およびC₁～C₆アルキルからなる群より別々に選択することができる。

【0046】

本明細書に開示されるある実施形態は、式III：

【化45】



(III)

の化合物またはその医薬的に許容される塩、エステル、立体異性体、互変異性体もしくはプロドラッグを提供し；

式中：

A⁷が、R^{2 1}、R^{2 2}、およびR^{2 3}からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、アリール、ヘテロアリール、イソインドリニル、インデニル、ジヒドロインデニル、テトラヒドロイソキノリニル、およびテトラヒドロナフタレニルからなる群より選択され、A⁷の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；またはA⁷が、R^{2 1}、R^{2 2}、およびR^{2 3}からなる群より選択される1つ以上の置換基で適宜置換されていてもよいC₃～C₇シクロアルキルであり、A⁷の定義中の前記C₃～C₇シクロアルキルは、適宜置換されていてもよいアリールまたは適宜置換されていてもよいヘテロアリールと縮合され；

各R^{2 1}が、独立して、ハロゲン、シアノ、適宜置換されていてもよいC₁～C₆アルキル、適宜置換されていてもよいC₁～C₆アルコキシ、適宜置換されていてもよいC₂～C₄アルケニル、適宜置換されていてもよいC₂～C₄アルキニル、適宜置換されていてもよいC₃～C₇シクロアルキル、適宜置換されていてもよいアリール、適宜置換されていてもよいヘテロアリール、および適宜置換されていてもよい複素環からなる群より選択され；

各R^{2 2}が、独立して、ー(CH₂)_mOR^A、ーO(CH₂)_mOR^A、ーC(=O)OR^A、ーO(CH₂)_oNR^BR^C、ー(CH₂)_mNR^BR^C、ーC(=O)NR^BR^C、およびー(CH₂)_mSR^Aからなる群より選択され；

各R^{2 3}が、独立して、フェニル、ーNHC(=NH)NH₂、ー(CH₂)_mOR^D、ーC(=NNR^BR^C)H、ーNR^LC(=O)NR^BR^C、ーC(=O)NR^DN(=CHR^G)、ー(CH₂)_mS(O)_{0~2}R^D、ー(CH₂)_mNO₂、ー(CH₂)_mCN、およびー(CH₂)_mR^Gからなる群より選択され、R^{2 3}の定義中の前記フェニルは、ハロゲン、シアノ、C₁～C₃アルキル、適宜置換されていてもよいC₁～C₃アルコキシ、ーO(CH₂)_mOR^A、ー(CH₂)_mNR^BR^Cからなる群より選択される1つ以上の置換基で置換され；

J⁷が、ー(CH₂)_n[NHC(=O)](CH₂)_o[NHC(=O)](CH₂)_pー、ー(CH₂)_n[NHC(=O)](CH₂)_o[NH]_qー、ーNH[C(=O)] [C(=O)] NHーおよび

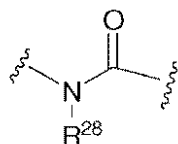
10

20

30

40

【化 4 6】



からなる群より選択され；

Q^7 が、O（酸素）、 $-NR^{28}-$ 、アリール、およびアリールアミドからなる群より選択され；または Q^7 がゼロであり；

各 R^{28} が、独立して、水素および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群より選択され； 10

G^7 が、 R^{24} 、 R^{25} 、および R^{26} からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、アリール、ヘテロアリール、および複素環からなる群より選択され、 G^7 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

各 R^{24} が、独立して、ハロゲン、シアノ、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよいアリール、適宜置換されていてもよいヘテロアリール、および適宜置換されていてもよい複素環からなる群より選択され； 20

各 R^{25} が、独立して、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-O(CH_2)_mOR^A$ 、 $-C(=O)OR^A$ 、 $-O(CH_2)_oNR^BR^C$ 、 $-(CH_2)_mNR^BR^C$ 、 $-(CH_2)_mC(=O)NR^BR^C$ 、 $-C(=NNR^BR^C)H$ 、および $-(CH_2)_mSR^A$ からなる群より選択され；

各 R^{26} が、独立して、フェニル、 $-NHC(=NH)NH_2$ 、 $-(CH_2)_mOR^D$ 、 $-C(=NNR^BR^C)H$ 、 $-NR^LC(=O)NR^BR^C$ 、 $-C(=O)NR^DN(=CH)R^G$ 、 $-(CH_2)_mS(O)_{0 \sim 2}R^D$ 、 $-(CH_2)_mNO_2$ 、 $-(CH_2)_mCN$ 、 $-(CH_2)_mR^G$ からなる群より選択され、 R^{23} の定義中の前記フェニルは、 $-(CH_2)_mNR^BR^C$ で置換され； 30

X^1 、 X^2 、および X^3 がそれぞれ、独立して、N（窒素）および CR^{27} から選択され；

R^{27} が、水素、ハロゲン、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群より選択され；

R^A が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

各 $-NR^BR^C$ が別々に選択され、 R^B および R^C がそれぞれ、独立して、水素、 $-SO_2R^H$ 、 $-C(=O)R^H$ 、 $-(CH_2)_nOR^H$ 、 $-(CH_2)_mR^I$ 、 $-(CH_2)_mR^J$ 、 $-(CH_2)_nC(=O)NR^ER^F$ 、 $-(CH_2)_nNR^ER^F$ 、 $-SO_2NR^ER^F$ 、複素環、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロハロアルキルからなる群より選択され、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルおよび複素環が、適宜置換されていてもよいアリールまたは適宜置換されていてもよいヘテロアリールとそれぞれ適宜縮合されていてもよく；または $-NR^BR^C$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり、前記適宜置換されていてもよい非芳香族複素環は、適宜置換されていてもよいアリールまたは適宜置換されていてもよいヘテロアリールと適宜縮合されていてもよく； 40

各 R^D が、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロ 50

アルキル、および $-(CH_2)_m R^I$ からなる群より選択され；

各 $-NR^E R^F$ が別々に選択され、 R^E および R^F がそれぞれ、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい複素環、および $-(CH_2)_m R^G$ からなる群より選択され；または $-NR^E R^F$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；または $-NR^E R^F$ が、適宜置換されていてもよいアリールで置換される $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミノであり；

各 R^G が、独立して、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールから選択され；

10

各 R^H が、独立して、水素、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択され；

各 R^I が、独立して、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択され；

各 R^J が、独立して、1つ以上の $-NR^E R^F$ でそれぞれ置換されるアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され；

各 R^L が、独立して、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-(CH_2)_m OR^{LA}$ 、 $-(CH_2)_m NR^{LB} R^{LC}$ 、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^L の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれ、独立して、ハロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-(CH_2)_m NR^{LD} R^{LE}$ 、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択される1つ以上の置換基で適宜置換されていてもよく、 R^L の前記アリールおよびヘテロアリール置換基は、1つ以上のハロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、または $-(CH_2)_m NR^{LF} R^{LG}$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく；

20

各 R^{LA} が、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

R^{LB} および R^{LC} がそれぞれ、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルケニルからなる群より選択され；または $-NR^{LB} R^{LC}$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

30

各 $-NR^{LD} R^{LE}$ が別々に選択され、 R^{LD} および R^{LE} がそれぞれ、独立して、水素、アリール、ヘテロアリール、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択され、 R^{LD} および R^{LE} の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールは、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ アルコキシでそれぞれ適宜置換されていてもよく；または $-NR^{LD} R^{LE}$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

各 $-NR^{LF} R^{LG}$ が別々に選択され、 R^{LF} および R^{LG} がそれぞれ、独立して、水素、および $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択され；または $-NR^{LF} R^{LG}$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

40

各 m が、独立して、0、1、または2であり；

各 n が、独立して、0、1、2、3、または4であり；

各 o が、独立して、1、2、または3であり；

各 p が、独立して、0、1、2、または3であり；

各 q が、独立して、0または1であり；

破線および実線で表されるいずれの結合も、単結合および二重結合からなる群より選択される結合を表す。

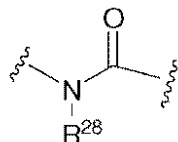
【0047】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I I I の化合物を提供し、式中、 A^7 が、 R

50

R^{21} 、 R^{22} 、および R^{23} からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換される、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、チエニル、インドリル、およびベンズイミダゾリルからなる群より選択することができ、 A^7 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； G^7 が、 R^{24} 、 R^{25} 、および R^{26} からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換される、アリール、ヘテロアリール、および複素環からなる群より選択することができ、 G^7 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； R^{21} が、フッ素および塩素からなる群より選択することができ； R^{22} が、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-C(=O)NR^B R^C$ 、 $-NR^B R^C$ 、および $-(CH_2)_mSR^A$ からなる群より選択することができ； R^{23} が、 $-(CH_2)_mOR^D$ 、および $-C(=O)NR^D N(=CHR^G)$ からなる群より選択することができ； R^{25} が、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-C(=O)NR^B R^C$ 、 $-NR^B R^C$ からなる群より選択することができ；各 R^A が、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より選択することができ；各 $-NR^B R^C$ を別々に選択することができ、 R^B および R^C がそれぞれ、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロハロアルキルからなる群より選択することができ；または $-NR^B R^C$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり得；または $-NR^B R^C$ が、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミノであり； J^7 が、

【化47】

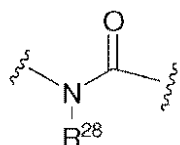


であり得；各 R^{28} が、独立して、水素および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルキルからなる群より選択することができ、ただし、 A^7 および G^7 がフェニルである場合、 R^{22} 、 R^{23} 、 R^{25} 、および R^{26} のうちの少なくとも1つが、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-(CH_2)_mOR^D$ 、 $-NR^B R^C$ 、 $-C(=O)NR^D N(=CHR^G)$ 、 $-NR^E R^F$ 、 $-C(=O)NR^B R^C$ 、および適宜置換されていてもよいフェニルからなる群より選択することができることを条件とする。

【0048】

本明細書に開示されるある実施形態は、式IIIの化合物を提供し、式中、 A^7 が、 R^{21} 、 R^{22} 、および R^{23} からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換される、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、チエニル、インドリル、およびベンズイミダゾリルからなる群より選択することができ、 A^7 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； G^7 が、 R^{24} 、 R^{25} 、および R^{26} からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換される、アリール、ヘテロアリール、および複素環からなる群より選択することができ、 G^7 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； R^{21} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フッ素、および塩素からなる群より選択することができ； R^{22} が、 $-NHC(=O)R^E R^F$ 、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、および $-NR^B R^C$ からなる群より選択することができ； R^{23} が、 $-(CH_2)_mOR^D$ 、および $-C(=O)NR^D N(=CHR^G)$ からなる群より選択することができ； R^A が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからな

る群より選択することができ；各 $-NR^B R^C$ を別々に選択することができ、 R^B および R^C がそれぞれ、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロハロアルキルからなる群より選択することができ；または $-NR^B R^C$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり得；または $-NR^B R^C$ が、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミニルであり得； J^7 が、
【化48】



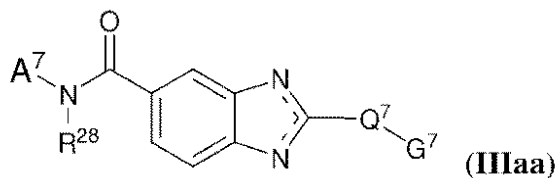
10

であり得、ただし、 A^7 および G^7 がフェニルである場合、 R^{22} 、 R^{23} 、 R^{25} 、および R^{26} のうちの少なくとも1つが、 $-(CH_2)_m OR^A$ 、 $-(CH_2)_m OR^D$ 、 $-NR^B R^C$ 、 $-NHC(=O)R^E R^F$ 、 $-C(=O)NR^D N(=CHR^G)$ 、および適宜置換されていてもよいフェニルからなる群より選択することができることを条件とする。

【0049】

本明細書に開示されるある実施形態は、式IIIaa：

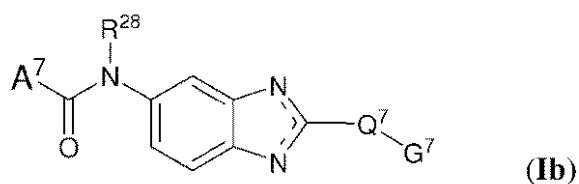
【化49】



20

の構造を有する式IIIの化合物、およびその医薬的に許容される塩、エステル、立体異性体、互変異性体もしくはプロドラッグ、または式IIIab：

【化50】



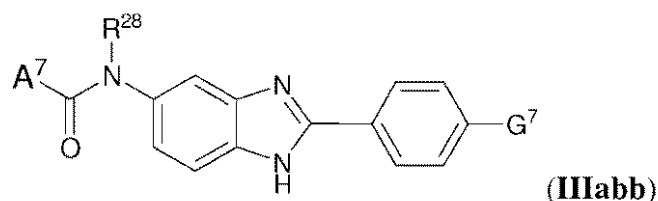
30

で表される式IIIの化合物、およびその医薬的に許容される塩、エステル、立体異性体、互変異性体もしくはプロドラッグを提供する。

【0050】

本明細書に開示されるある実施形態は、式IIIabb：

【化51】



40

の構造を有する式IIIabの化合物、およびその医薬的に許容される塩、エステル、立体異性体、互変異性体もしくはプロドラッグを提供し、式中、 A^7 が、 R^{21} 、 R^{22} 、および R^{23} からなる群より選択される1つ以上の置換基で置換されるアリールであり得；各 R^{21} が、独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ア

50

ルコキシからなる群より選択することができ；各 $R^{2,2}$ が、独立して、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-O(CH_2)_mOR^A$ および $-(CH_2)_mNR^B R^C$ からなる群より選択することができ；各 $R^{2,3}$ が、 $-(CH_2)_mNR^B R^C$ で置換されるフェニルであり得； G^7 が、 $R^{2,4}$ 、 $R^{2,5}$ 、および $R^{2,6}$ からなる群より選択される1つ以上の置換基で置換される複素環であり得；各 $R^{2,4}$ が、独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ アルコキシからなる群より選択することができ；各 $R^{2,5}$ が、独立して、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-O(CH_2)_mOR^A$ からなる群より選択することができ；各 $R^{2,6}$ が、1つ以上の $-(CH_2)_mNR^B R^C$ で置換されるフェニルであり得； R^B が水素であり得； R^C が $-C(=O)R^H$ であり得； R^H が、適宜置換されていてもよいアリールであり得る。

10

【0051】

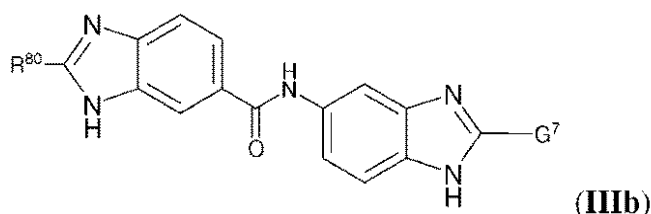
本明細書に開示されるある実施形態は、式 III a b b の化合物を提供し、式中、 A^7 が、 $R^{2,2}$ からなる群より選択される1つ以上の置換基で置換されるフェニルであり得；各 $R^{2,2}$ が、独立して、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、および $-O(CH_2)_mOR^A$ からなる群より選択することができ；各 R^A が、独立して、水素、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、および $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルからなる群より選択することができ； G^7 が、 $R^{2,6}$ からなる群より選択される1つ以上の置換基で置換されるピペリジニルであり得；各 $R^{2,6}$ が、 $-NH C(=O)R^H$ で置換されるフェニルであり得； R^H が、適宜置換されていてもよいフェニルであり得る。

20

【0052】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 III b :

【化52】



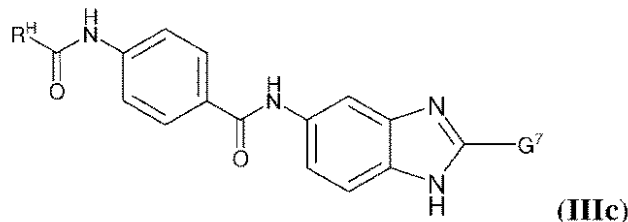
の構造を有する式 III の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供し、式中、 $R^{8,0}$ が、水素、 $R^{2,1}$ 、 $R^{2,2}$ 、および $R^{2,3}$ からなる群より選択することができる。

30

【0053】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 III c :

【化53】



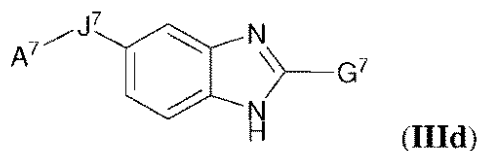
40

の構造を有する式 III の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供する。

【0054】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 III d :

【化54】

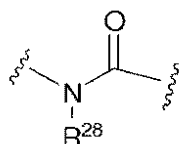


50

の構造を有する式 I I I の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供し、式中、 A^7 が、 R^{21} 、 R^{22} 、および R^{23} からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ置換されるアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 A^7 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と任意に縮合することができ；または A^7 が、 R^{21} 、 R^{22} 、および R^{23} からなる群より選択される 1 つ以上の置換基で適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり得、 A^7 の定義中の前記 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルは、適宜置換されていてもよいアリールまたは適宜置換されていてもよいヘテロアリールと縮合することができ； J^7 が、 $-(CH_2)_n [NHC(=O)] (CH_2)_o NHC(=O) (CH_2)_p -$ 、 $-(CH_2)_n [NHC(=O)] (CH_2)_o [NH]_q -$ 、および

10

【化 5 5】



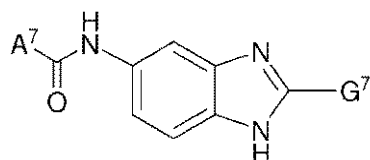
からなる群より選択することができ； G^7 が、 R^{24} 、 R^{25} 、および R^{26} からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ置換されるアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 G^7 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と任意に縮合することができる。

20

【0 0 5 5】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I I I d a :

【化 5 6】



(IIIIda)

30

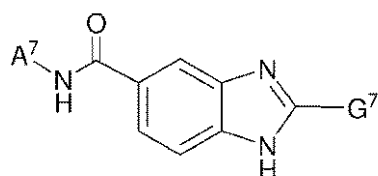
の構造を有する式 I I I d の化合物、およびその医薬的に許容される塩、エステル、またはプロドラッグを提供し、式中、 A^7 が、 R^{21} 、 R^{22} 、および R^{23} からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ置換される、フェニル、インドリル、ピリジニル、ピリミジニル、チエニル、ベンゾチオフラニル、ナフタレニル、およびテトラヒドロナフタレニルからなる群より選択することができ； G^7 が、 R^{24} 、 R^{25} 、および R^{26} からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 G^7 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と任意に縮合することができる。

40

【0 0 5 6】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I I I d b :

【化 5 7】



(IIIIdb)

の構造を有する式 I I I d の化合物、およびその医薬的に許容される塩、エステル、また

50

はプロドラッグを提供し、式中、 A^7 が、 R^{21} 、 R^{22} 、および R^{23} からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換される、フェニル、インドリル、ピリジニル、ピリミジニル、チエニル、ベンゾチオフラニル、ナフタレニル、およびテトラヒドロナフタレニルからなる群より選択することができ； G^7 が、 R^{24} 、 R^{25} 、および R^{26} からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 G^7 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と任意に縮合することができる。

【0057】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I I I d a または式 I I I d b の化合物を提供し、式中、 G^7 が、 R^{24} 、 R^{25} 、および R^{26} からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、フェニル、ナフチル、インドリル、ジヒドロベンゾフラニル、1, 4-ベンゾジオキサニル、ベンゾトリアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、および2, 1, 3-ベンゾオキサジアゾリルからなる群より選択することができる。ある実施形態において、 R^{21} が、ハロゲン、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルからなる群より選択することができ； R^{22} が、 $-(CH_2)_m OR^A$ 、 $-O(CH_2)_m OR^A$ 、および $-NR^B R^C$ からなる群より選択することができ； R^{23} が、 $-(CH_2)_m OR^D$ 、 $-(CH_2)_m S(O)_{0 \sim 2} R^D$ 、および $-(CH_2)_m R^G$ からなる群より選択することができ； R^{24} が、ハロゲン、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルからなる群より選択することができ； R^{25} が、 $-(CH_2)_m OR^A$ 、 $-O(CH_2)_m OR^A$ 、 $-C(=O)NR^B R^C$ 、 $-C(=NNR^B R^C)H$ 、 $-NR^B R^C$ からなる群より選択することができ； R^{26} が、 $-(CH_2)_m OR^D$ 、 $-(CH_2)_m R^G$ からなる群より選択することができ； R^A が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択することができ；各 $-NR^B R^C$ を別々に選択することができ、 R^B および R^C がそれぞれ、独立して、水素、 $-SO_2 R^H$ 、 $-C(=O)R^H$ 、 $-(CH_2)_n OR^H$ 、 $-(CH_2)_m R^I$ 、 $-(CH_2)_m R^J$ 、 $-(CH_2)_n C(=O)NR^E R^F$ 、 $-(CH_2)_n NR^E R^F$ 、 $-SO_2 NR^E R^F$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロハロアルキルからなる群より選択することができ、アルキルおよびヘテロアルキルが、アリールまたはヘテロアリールと適宜縮合されていてもよく；または $-NR^B R^C$ が、適宜置換されていてもよい複素環であり得；各 R^D が、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $-(CH_2)_m R^I$ からなる群より選択することができ；各 $-NR^E R^F$ を別々に選択することができ、 R^E および R^F がそれぞれ、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $-(CH_2)_m R^G$ からなる群より選択することができ；または $-NR^E R^F$ が、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミノであり得；または $-NR^E R^F$ が、適宜置換されていてもよい複素環であり得；各 R^G が、独立して、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択することができ；各 R^H が、独立して、水素、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択することができ；各 R^I が、独立して、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択することができ；各 R^J が、独立して、1つ以上の $-NR^E R^F$ でそれぞれ置換されるアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ；各 m が、独立して、0、1、または2であり得；各 n が、独立して、0、1、2、3、または4であり得る。

【0058】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I I I の化合物を提供し、ただし、式 I I I の化合物が以下のものからなる群より選択されないことを条件とする：

【 0 0 5 9 】

【表 2】

		10
		20

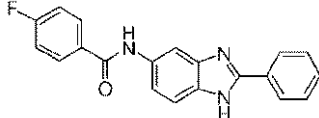
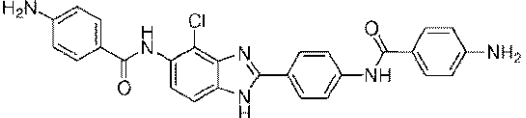
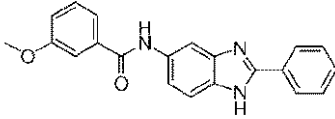
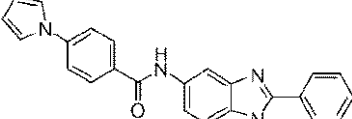
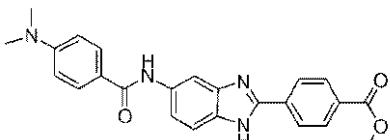
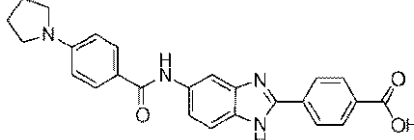
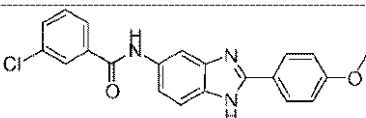
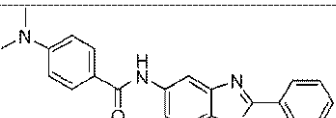
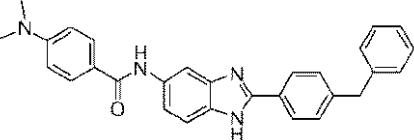
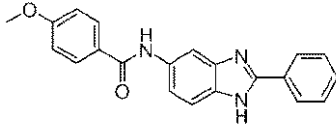
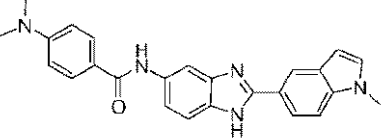
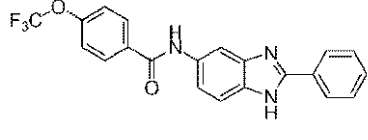
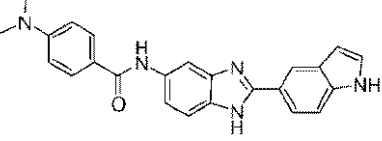
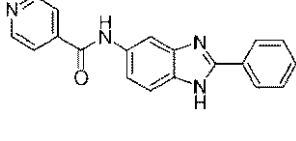
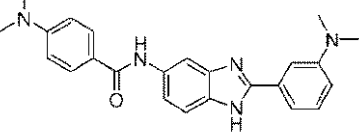
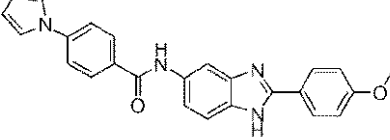
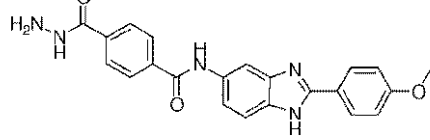
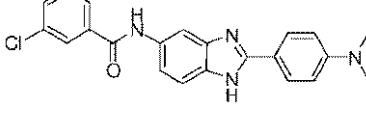
【 0 0 6 0 】

10

20

30

【表 3】

		10
		
		
		20
		
		
		30
		
		
		40

【 0 0 6 1 】

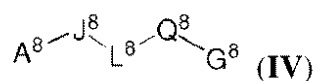
【表 4】

		10
および		20

【0062】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V：

【化 5 8】



の化合物またはその医薬的に許容される塩、エステル、立体異性体、互変異性体もしくはプロドラッグを提供し；

式中：

A^8 が、 R^{31} 、 R^{32} 、および R^{33} からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、複素環、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 A^8 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

G^8 が、 R^{34} 、 R^{35} 、および R^{36} からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 G^8 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

J^8 が、アリール、ヘテロアリール、複素環、 $-C(=O)-$ 、 $-(CH=CH)-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-NHC(=O)NH-$ 、 $-NHC(=S)NH-$ 、 $-S(=O)_2$ 、 $-NH_2-$ 、 $-OC(=S)-$ 、 $-NHC(=S)-$ 、 $-(CH_2)_nNH-$ 、 $-(CH_2)_n[NHC(=O)](CH_2)_oNHC(=O)(CH_2)_p-$ 、 $-(CH_2)_n$

10

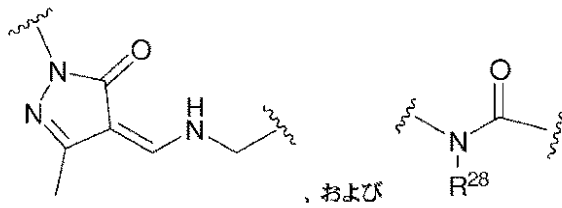
20

30

40

50

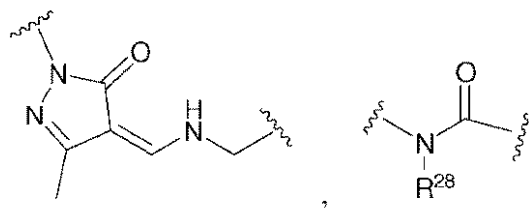
$[\text{NHC}(=\text{O})](\text{CH}_2)_o[\text{NH}]_q-$ 、
【化 5 9】



からなる群より選択され；または J^8 がゼロであり；

Q^8 が、アリール、ヘテロアリール、複素環、 $-\text{C}(=\text{O})-$ 、 $-(\text{CH}=\text{CH})-$ 、
10 $-\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $-\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}-$ 、 $-\text{NHC}(=\text{S})\text{NH}-$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2$
 $-\text{NH}_2-$ 、 $-\text{OC}(=\text{S})-$ 、 $-\text{NHC}(=\text{S})-$ 、 $-(\text{CH}_2)_n\text{NH}-$ 、 $-(\text{CH}_2)_n$
 $[\text{NHC}(=\text{O})](\text{CH}_2)_o\text{NHC}(=\text{O})(\text{CH}_2)_p-$ 、 $-(\text{CH}_2)_n$
 $[\text{NHC}(=\text{O})](\text{CH}_2)_o[\text{NH}]_q-$ 、

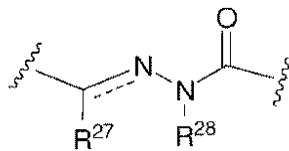
【化 6 0】



20

および

【化 6 1】

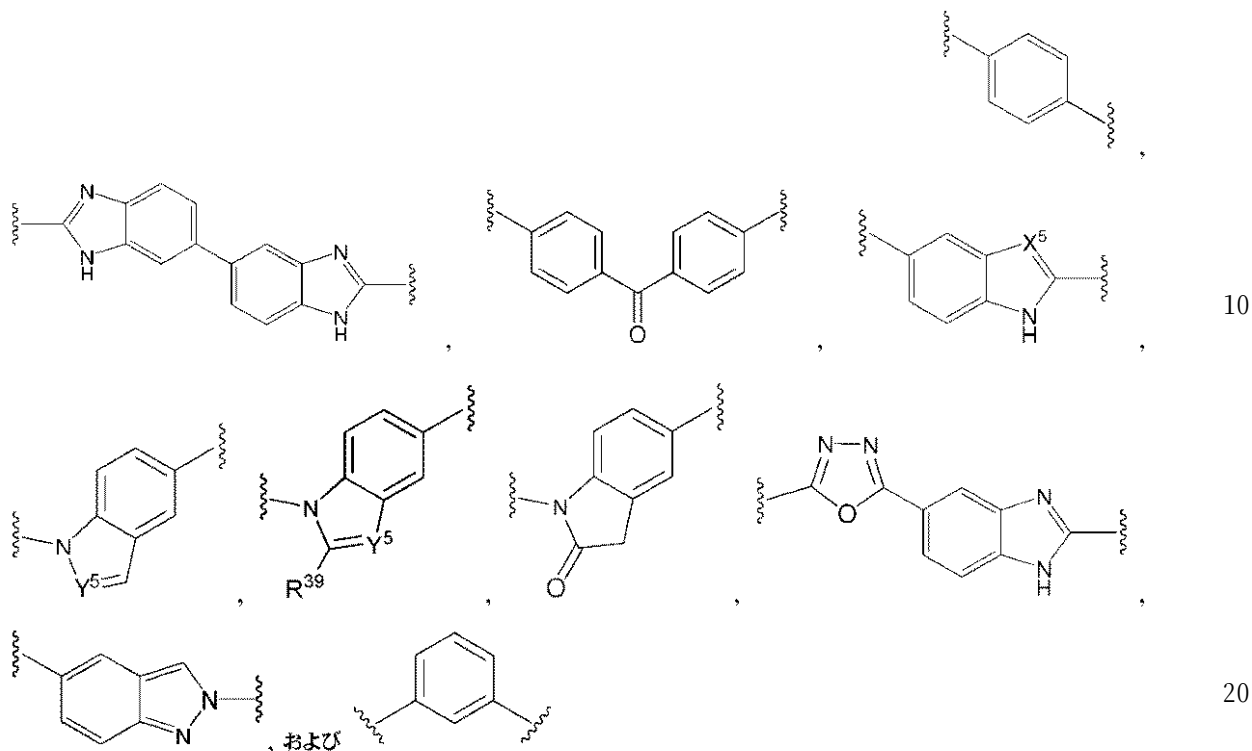


からなる群より選択され；または Q^8 がゼロであり；

30

L^8 が、

【化 6 2】



からなる群より選択され；

X^5 が、N（窒素）および CR^{39} からなる群より選択され；

Y^5 が、N（窒素）および CR^{40} からなる群より選択され；

各 R^{27} が、独立して、水素、ハロゲン、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群より選択され；

各 R^{28} が、独立して、水素および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群より選択され；

各 R^{31} が、独立して、ハロゲン、シアノ、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より選択され；

各 R^{32} が、独立して、ハロゲン、 $-(CH_2)_m OR^A$ 、 $-NR^B R^C$ 、および $-(CH_2)_m SR^A$ からなる群より選択され；

各 R^{33} が、独立して、ハロゲン、 $-C(=O)OH$ 、 $-(CH_2)_m OR^D$ 、 $-NR^E R^F$ 、 $-NR^L C(=O)NR^B R^C$ 、 $-(CH_2)_m S(O)_{0 \sim 2} R^D$ 、 $-(CH_2)_m NO_2$ 、 $-(CH_2)_m CN$ 、および $-(CH_2)_m R^G$ からなる群より選択され；

各 R^{34} が、独立して、ハロゲン、シアノ、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より選択され；

各 R^{35} が、独立して、ハロゲン、 $C(=O)OH$ 、 $-(CH_2)_m OR^A$ 、 $-NR^B R^C$ 、 $-C(=O)NR^B R^C$ 、および $-(CH_2)_m SR^A$ からなる群より選択され；

各 R^{36} が、独立して、ハロゲン、 $-(CH_2)_m OR^D$ 、 $-NR^E R^F$ 、 $-NR^L C(=O)NR^B R^C$ 、 $-(CH_2)_m S(O)_{0 \sim 2} R^D$ 、 $-(CH_2)_m NO_2$ 、 $-($

10

20

30

40

50

$\text{CH}_2)_m\text{CN}$ 、および $-(\text{CH}_2)_m\text{R}^G$ からなる群より選択され；

各 R^{39} および R^{40} が、独立して、水素、ハロゲン、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NHR}^B$ 、および適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルからなる群より選択され；

各 R^A が、独立して、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヘテロアルキル、および $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヘテロハロアルキルからなる群より選択され；

各 $-\text{NR}^B\text{R}^C$ が別々に選択され、 R^B および R^C がそれぞれ、独立して、水素、 $-\text{SO}_2\text{R}^H$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^H$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{R}^H$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{OR}^H$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^E\text{R}^F$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{R}^G$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{OR}^H$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{R}^H$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、非芳香族複素環、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヘテロアルキル、および $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヘテロハロアルキルからなる群より選択され、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキルおよび非芳香族複素環が、適宜置換されていてもよいアリールまたは適宜置換されていてもよいヘテロアリールと適宜縮合されていてもよく；または $-\text{NR}^B\text{R}^C$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；または $-\text{NR}^B\text{R}^C$ が、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキリデンアミノであり；

10

各 R^D が、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヘテロアルキル、および $-(\text{CH}_2)_m\text{R}^G$ からなる群より選択され；

各 $-\text{NR}^E\text{R}^F$ が別々に選択され、 R^E および R^F がそれぞれ、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヘテロアルキル、および $-(\text{CH}_2)_m\text{R}^G$ からなる群より選択され；または $-\text{NR}^E\text{R}^F$ が、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキリデンアミニルであり；または $-\text{NR}^E\text{R}^F$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

20

各 R^G が、独立して、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールから選択され；

R^H が、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ ハロアルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、および適宜置換されていてもよいアリールまたは適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択され；

各 R^L が、独立して、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、 $-(\text{CH}_2)_m\text{OR}^{LA}$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{NR}^L\text{R}^{LC}$ 、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^L の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれ、独立して、ハロ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、 $-(\text{CH}_2)_m\text{NR}^L\text{R}^{LD}\text{R}^{LE}$ 、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択される1つ以上の置換基で適宜置換されていてもよく、 R^L の前記アリールおよびヘテロアリール置換基は、1つ以上のハロ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、または $-(\text{CH}_2)_m\text{NR}^L\text{R}^{LF}\text{R}^{LG}$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく；

30

各 R^{LA} が、独立して、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、および $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；

40

R^{LB} および R^{LC} がそれぞれ、独立して、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、および $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ヘテロアルケニルからなる群より選択され；または $-\text{NR}^{LB}\text{R}^{LC}$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

各 $-\text{NR}^{LD}\text{R}^{LE}$ が別々に選択され、 R^{LD} および R^{LE} がそれぞれ、独立して、水素、アリール、ヘテロアリール、および適宜置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルからなる群より選択され、 R^{LD} および R^{LE} の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールは、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシでそれぞれ適宜置換されていてもよく；または $-\text{NR}^{LD}\text{R}^{LE}$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

50

各 $-NR^{LF}R^{LG}$ が別々に選択され、 R^{LF} および R^{LG} がそれぞれ、独立して、水素、および $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択され；または $-NR^{LF}R^{LG}$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

各 $-NR^{LF}R^{LG}$ が別々に選択され、 R^{LF} および R^{LG} がそれぞれ、独立して、水素、および $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択され；または $-NR^{LF}R^{LG}$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

各 m が、独立して、0、1、または2であり；

各 n が、独立して、0、1、2、3、または4であり；

各 o が、独立して、1、2、または3であり；

各 p が、独立して、0、1、2、または3であり；

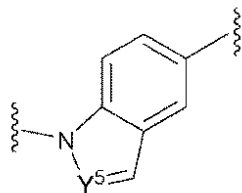
各 q が、独立して、0または1であり；

破線および実線で表されるいずれの結合も、単結合および二重結合からなる群より選択される結合を表す。

【0063】

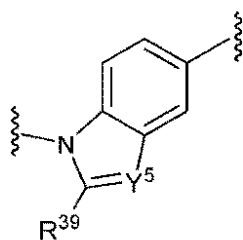
本明細書に開示されるある実施形態は、式IVの化合物を提供し、式中、 J^8 および Q^8 がそれぞれゼロであり得る。本明細書に開示されるある実施形態は、式IVの化合物を提供し、式中、 A^8 が、 R^{31} 、 R^{32} 、および R^{33} からなる群より選択される1つ以上の置換基で置換されるアリールであり得； J^8 が $-NHC(=O)-$ であり得； L^8 が、

【化63】



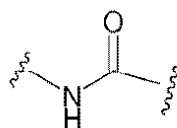
であり得； Q^8 がゼロであり得； G^8 が、 R^{34} 、 R^{35} 、および R^{36} からなる群より選択される1つ以上の置換基で置換されるアリールであり得る。本明細書に開示されるある実施形態は、式IVの化合物を提供し、式中、 A^8 が、1つ以上の R^{32} で置換されるアリールであり得； J^8 が $-C(=O)-$ であり得； L^8 が、

【化64】



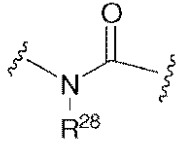
であり得； Q^8 が、

【化65】



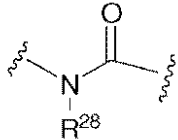
であり得； G^8 が、1つ以上の R^{35} で置換されるアリールであり得る。本明細書に開示されるある実施形態は、式IVの化合物を提供し、式中、 A^8 が、 R^{31} 、 R^{32} 、および R^{33} からなる群より選択される1つ以上の置換基で置換されるヘテロアリールであり得； G^8 が、 R^{34} 、 R^{35} 、および R^{36} からなる群より選択される1つ以上の置換基で置換されるヘテロアリールであり得； J^8 が、

【化 6 6】



であり得； Q^8 が、

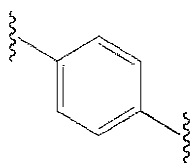
【化 6 7】



10

であり得る。本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V の化合物を提供し、式中、 L^8 が、

【化 6 8】



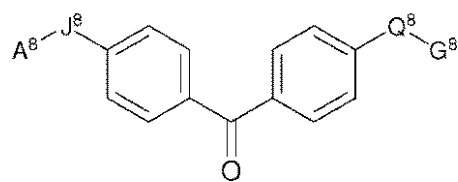
20

であり得； J^8 が $-C(=O)-$ であり得； Q^8 が $-C(=O)NH-$ であり得； A^8 が、 $R^{3,2}$ で置換されるアリールであり得； G^8 が、 $R^{3,5}$ で置換されるアリールであり得； $R^{3,2}$ が $-NR^B R^C$ であり得、 $R^{3,5}$ が $-NR^B R^C$ であり得る。

【0064】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V a：

【化 6 9】

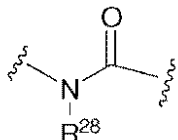


(IVa)

30

の構造を有する式 I V の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供し、式中、 J^8 が、 $-OC(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-NH_2-$ 、 $-(CH_2)_nNH-$ 、および

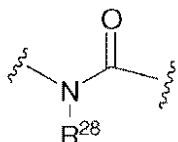
【化 7 0】



40

からなる群より選択することができ； Q^8 が、 $-OC(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-NH_2-$ 、 $-(CH_2)_nNH-$ 、および

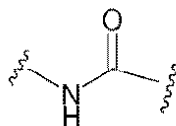
【化 7 1】



50

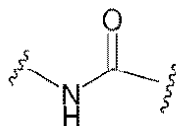
からなる群より選択することができる。本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V a の化合物を提供し、式中、 J^8 が、 $-S(=O)_2-NH_2-$ および

【化 7 2】



からなる群より選択することができる； Q^8 が、 $-S(=O)_2-NH_2-$ 、および

【化 7 3】

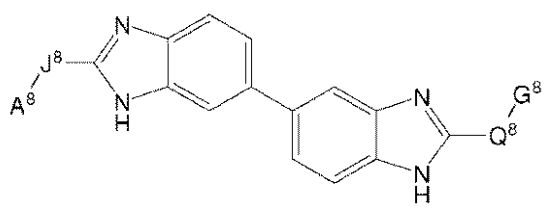


からなる群より選択することができる。

【0065】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V b :

【化 7 4】



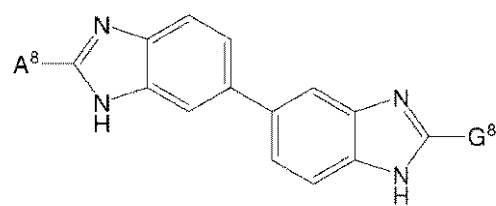
(IVb)

の構造を有する式 I V の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供し、式中、 J^8 が $-CH=CH-$ であり得；または J^8 がゼロであり得； Q^8 が $-CH=CH-$ であり得；または Q^8 がゼロであり得る。

【0066】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V b a :

【化 7 5】



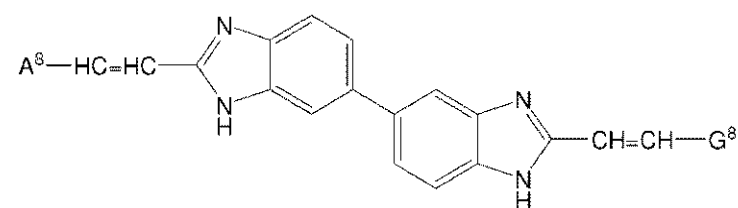
(IVba)

の構造を有する式 I V b の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供する。

【0067】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V b c :

【化 7 6】



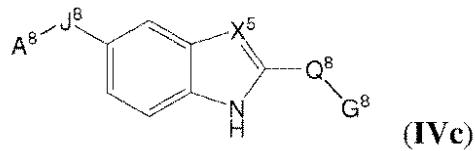
(IVba)

の構造を有する式 I V b の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供する。

【0068】

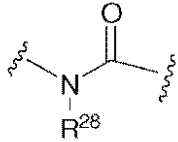
本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V c :

【化 7 7】



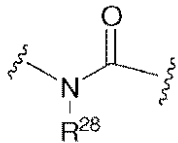
の構造を有する式 I V の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供し、式中、J⁸ が、 $-\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $-\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}-$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{NH}_2-$ 、および

【化 7 8】



からなる群より選択することができ；または J⁸ がゼロであり得；Q⁸ が、 $-\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $-\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}-$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{NH}_2-$ 、および

【化 7 9】

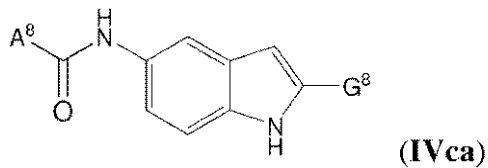


からなる群より選択することができ；または Q⁸ がゼロであり得る。

【0069】

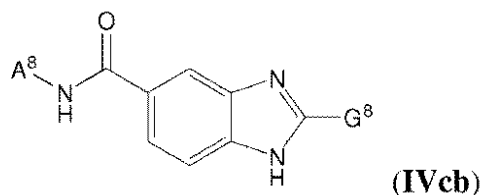
本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V c a :

【化 8 0】



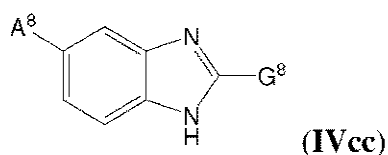
の構造を有する式 I V c の化合物、およびその医薬的に許容される塩、または式 I V c b :

【化 8 1】



の構造を有する式 I V c の化合物、およびその医薬的に許容される塩、または式 I V c c :

【化 8 2】

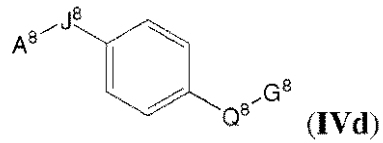


の構造を有する式 I V c の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供する。

【0070】

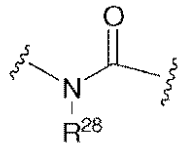
本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V d :

【化 8 3】



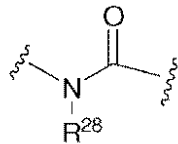
の構造を有する式 I V の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供し、式中、 J^8 が、 $-C(=O)-$ 、 $-(CH_2)_nNH-$ 、 $-NHC(=S)NH-$ 、および

【化 8 4】



からなる群より選択することができ；または J^8 がゼロであり得； Q^8 が、 $-C(=O)-$ 、 $-NHC(=S)NH-$ 、および

【化 8 5】

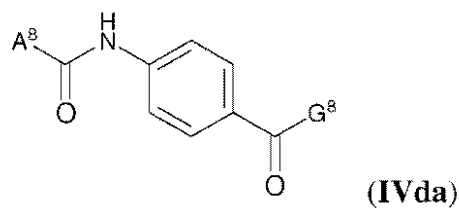


からなる群より選択することができる。

【0071】

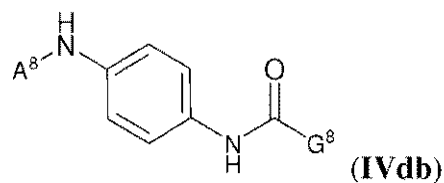
本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V d a :

【化 8 6】



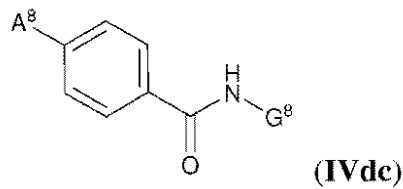
の構造を有する式 I V d の化合物、およびその医薬的に許容される塩、または式 I V d b :

【化 8 7】



の構造を有する式 I V d の化合物、およびその医薬的に許容される塩、または式 I V d c :

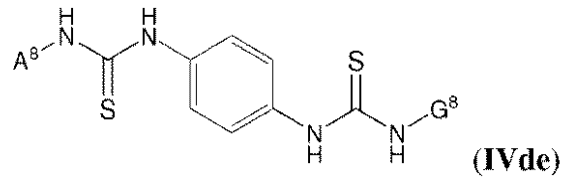
【化 8 8】



の構造を有する式 I V d の化合物、およびその医薬的に許容される塩、または式 I V d e
:

【化 8 9】

10



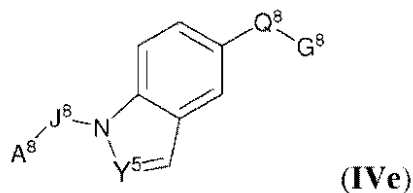
の構造を有する式 I V d の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供する。

【0072】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V e :

【化 9 0】

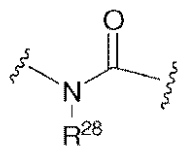
20



の構造を有する式 I V の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供し、式中、J⁸
がゼロであり得；Q⁸が、

【化 9 1】

30



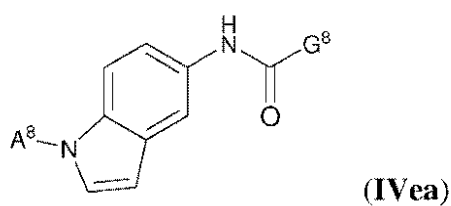
であり得る。

【0073】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V e a :

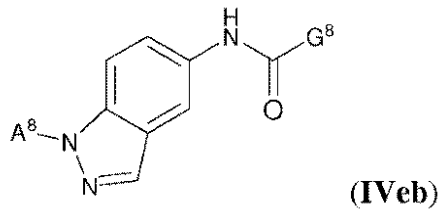
【化 9 2】

40



の構造を有する式 I V e の化合物、およびその医薬的に許容される塩、または式 I V e b
:

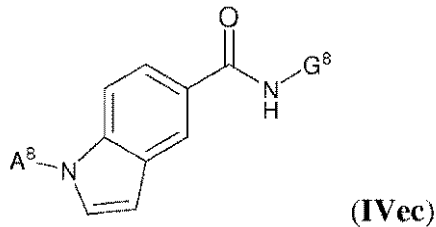
【化 9 3】



の構造を有する式 I V e の化合物、およびその医薬的に許容される塩、または式 I V e c

10

【化 9 4】



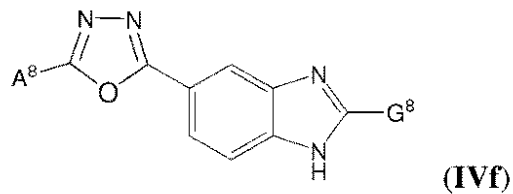
の構造を有する式 I V e の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供する。

【0074】

20

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V f :

【化 9 5】



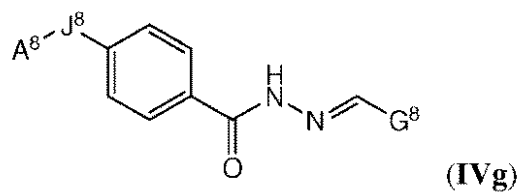
の構造を有する式 I V の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供する。

【0075】

30

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V g :

【化 9 6】



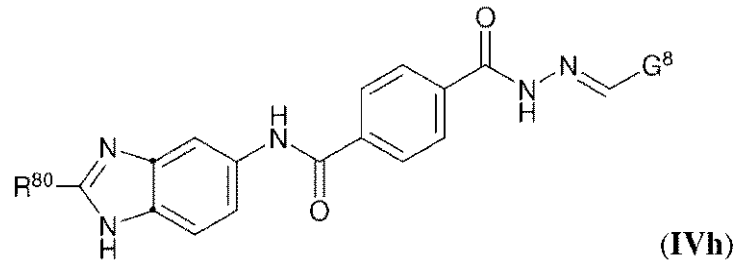
の構造を有する式 I V の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供し、式中、J⁸が、-(CH₂)_n[NHC(=O)](CH₂)_oNHC(=O)(CH₂)_p-および-(CH₂)_n[NHC(=O)](CH₂)_o[NH]_q-からなる群より選択することができる。

40

【0076】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V h :

【化 9 7】

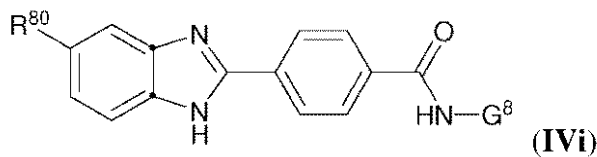


の構造を有する式 I V の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供し、式中、 R^{80} が、水素、 R^{31} 、 R^{32} 、および R^{33} からなる群より選択することができる。

【0077】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V i :

【化 9 8】



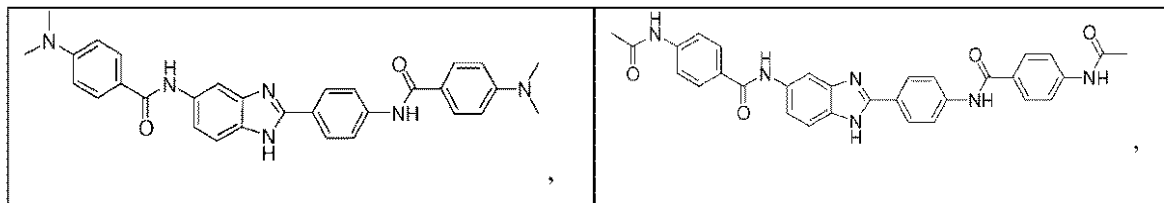
の構造を有する式 I V の化合物、およびその医薬的に許容される塩を提供し、式中、 R^{80} が、水素、 R^{31} 、 R^{32} 、および R^{33} からなる群より選択することができる。本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V i の化合物を提供し、式中、 G^8 が、 R^{34} 、 R^{35} 、および R^{36} からなる群より選択される 1 つ以上の置換基で適宜置換されていてもよいフェニルであり得る。

【0078】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I V の化合物を提供し、ただし、式 I V の化合物が以下のものからなる群より選択されないことを条件とする：

【0079】

【表 5】



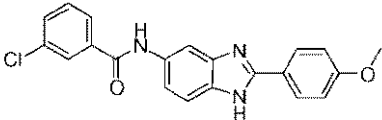
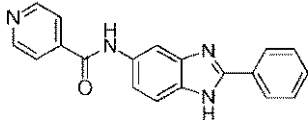
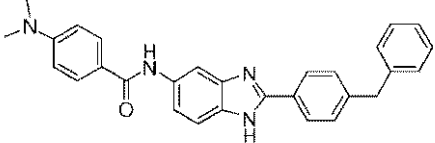
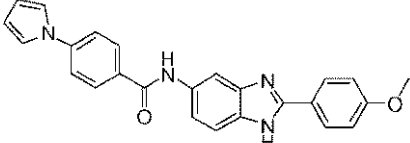
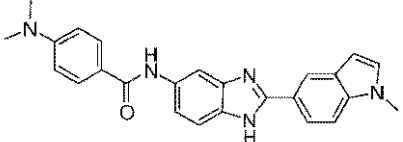
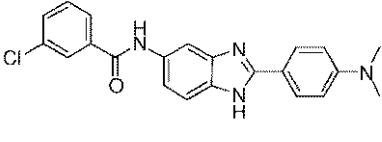
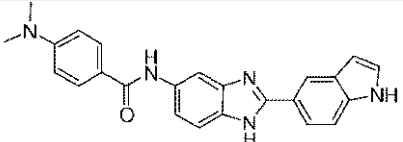
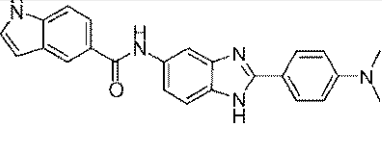
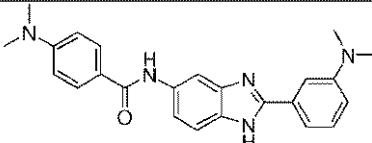
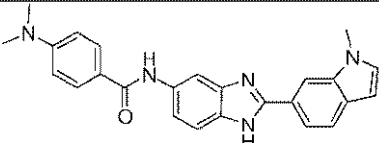
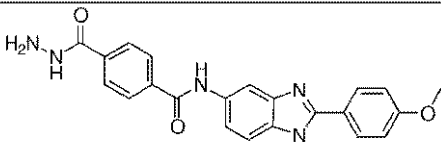
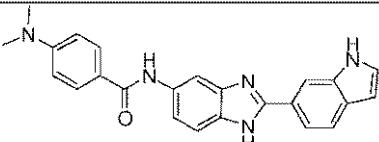
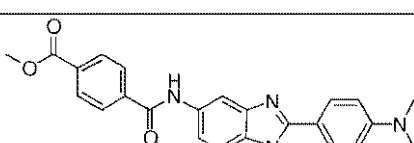
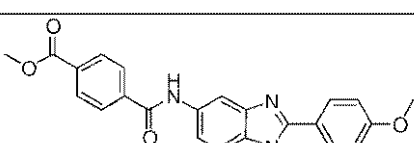
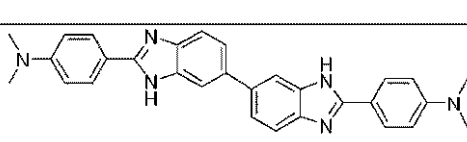
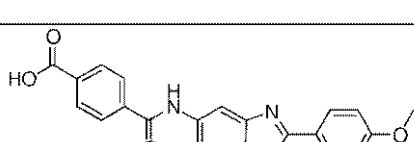
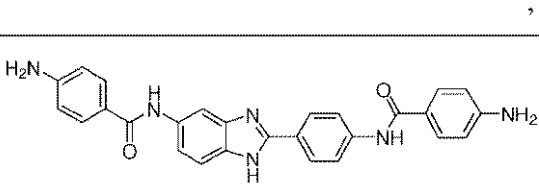
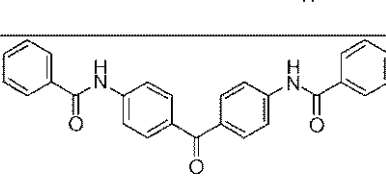
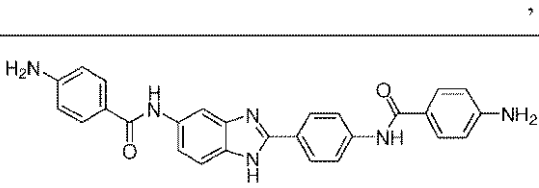
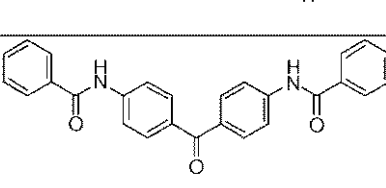
【0080】

【表 6】

		10
		20
		30
		40

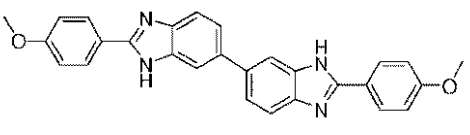
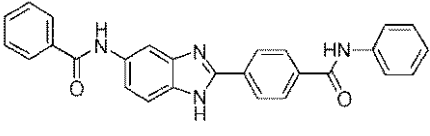
【0081】

【表 7】

		10
		
		
		20
		
		
		30
		
		
		40

【 0 0 8 2 】

【表 8】

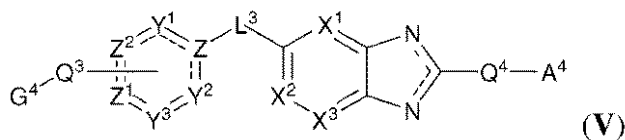
	および
	

10

【0083】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 V：

【化 99】



20

の化合物またはその医薬的に許容される塩、エステル、立体異性体、互変異性体もしくはプロドラッグを提供し；

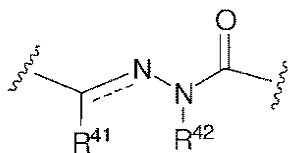
式中：

G^4 が、 R^{43} および R^{44} からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 G^4 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

Q^3 が、エステル、アミド、尿素、カルバミド、チオアミド、スルホンアミドからなる群より選択され；または Q^3 が、 $-C(=O)O-$ 、 $-C(=O)NR^{45}-$ 、 $-C(=O)NHN=CH-$ 、 $-NR^{45}C(=O)NR^{45}-$ 、 $-NR^{45}C(=O)(CH_2)_mO-$ 、 $-OC(=O)NR^{45}-$ 、 $-C(=S)NR^{45}-$ 、 $-NR^{45}S(O)_1 \sim 2-$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミノ、および

30

【化 100】



からなる群より選択され；または Y^3 が、 $-Q^3-G^4$ で置換される C（炭素）である場合、 Q^3 が、 Z^1 と適宜縮合されて、五員環複素環を形成してもよく；

40

L^3 が、 $-C(=O)NR^{45}-$ 、 $-O-C_1 \sim C_8$ アルキル、 $-C(=NR^{45})-$ 、 $-NR^{45}C(=O)-(CH_2)_mC(=O)NR^{45}-$ 、および $-NR^{45}C(=O)-(CH_2)_mNR^{45}C(=O)-$ からなる群より選択され；

Q^4 が、 NR^{48} 、および O（酸素）からなる群より選択され；または Q^4 がゼロであり；

A^4 が、 R^{41} および R^{42} からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、フェニル、ピリジニル、イミダゾリル、およびチエニルからなる群より選択され

50

;

X^1 、 X^2 、および X^3 がそれぞれ、独立して、N（窒素）および CR^{46} から選択され；

Y^1 、 Y^2 、および Y^3 がそれぞれ、独立して、N（窒素）および CR^{47} から選択され；

Z、 Z^1 、および Z^2 がそれぞれ、独立して、C（炭素）、CH、およびN（窒素）から選択され；

R^{41} が、独立して、ハロゲン、シアノ、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より選択され；

各 R^{42} が、独立して、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-O(CH_2)_mOR^A$ 、 $-NR^BR^C$ 、 $-C(=O)NR^BR^C$ 、 $-C(=NNR^BR^C)H$ 、 $-(CH_2)_mSR^A$ 、 $-(CH_2)_mR^K$ 、 $-O(CH_2)_mR^K$ からなる群より選択され；

または R^{41} および R^{42} が連結されて、適宜置換されていてもよい環を形成し；

各 R^{43} が、独立して、ハロゲン、シアノ、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より選択され；

各 R^{44} が、独立して、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-O(CH_2)_mOR^A$ 、 $-NR^BR^C$ 、 $-C(=O)NR^BR^C$ 、 $-C(=NNR^BR^C)H$ 、 $-(CH_2)_mSR^A$ 、 $-(CH_2)_mR^K$ 、 $-O(CH_2)_mR^K$ からなる群より選択され；

各 R^{45} が、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より選択され；

各 R^{46} および R^{47} が、独立して、水素、ハロゲン、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より選択され；

R^{48} が、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より選択され；

各 R^A が、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロハロアルキルからなる群より選択され；

各 $-NR^BR^C$ が別々に選択され、 R^B および R^C がそれぞれ、独立して、水素、 $-SO_2R^F$ 、 $-C(=O)R^F$ 、 $-(CH_2)_mR^F$ 、 $-SO_2NR^DR^E$ 、 $-C(=O)NR^DR^E$ 、 $-(CH_2)_mNR^DR^E$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロハロアルキルからなる群より選択され、アルキルおよびヘテロアルキルが、アリールまたはヘテロアリールと適宜縮合されていてもよく；または $-NR^BR^C$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；または $-NR^BR^C$ が、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミノであり；

各 $-NR^DR^E$ が別々に選択され、 R^D および R^E がそれぞれ、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $-(CH_2)_mR^G$ からなる群より選択され；または $-NR^DR^E$ が、適宜置換さ

10

20

30

40

50

れていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミニルであり；または $-NR^D R^E$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

各 R^F が、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^F の定義中のアリールおよびヘテロアリールが、 $-C(=O)NR^D R^E$ または $-NR^D R^E$ でそれぞれ適宜置換されていてもよく；

各 R^G が、独立して、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択され；

各 R^K が、独立して、 $-C(=O)NR^D R^E$ 、 $-NR^D R^E$ 、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択され；

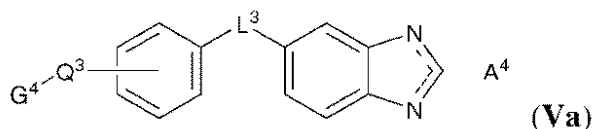
各 m が、独立して、0、1、または2であり；

各破線が、適宜二重結合でもよいことを表す。

【0084】

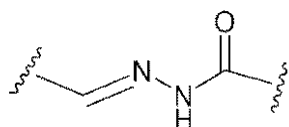
本明細書に開示されるある実施形態は、式 Va：

【化101】



の構造を有する式 V の化合物、およびその医薬的に許容される塩、エステル、またはプロドラッグを提供し、式中、 G^4 が、水素、ハロゲン、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-O(CH_2)_mOR^A$ 、 $-NR^B R^C$ 、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよいフェニル、適宜置換されていてもよいピリジニル、適宜置換されていてもよいテトラゾリル、および適宜置換されていてもよいイミダゾリルからなる群より選択することができ； Q^3 が、 $-C(=O)O-$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-C(=O)NHNH-$ 、 $-NR^{45}C(=O)NR^{45}-$ 、 $-OC(=O)NR^{45}-$ 、 $-C(=S)NR^{45}-$ 、 $-NR^{45}S(O)_{1 \sim 2}-$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミニル、および

【化102】



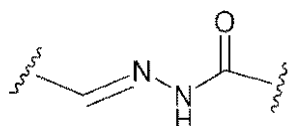
からなる群より選択することができ；または Q^3 がゼロであり得； A^4 が、 R^{41} および R^{42} からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換されるアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 A^4 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； L^3 が、 $-O-$ （酸素）、 $-S(O)_{0 \sim 2}-$ 、 $-NR^{45}S(O)_{1 \sim 2}-$ 、 $-NR^{45}C(=O)-(CH_2)_mC(=O)NR^{45}-$ 、 $-NR^{45}C(=O)-(CH_2)_mNR^{45}C(=O)-$ 、 $-NR^{45}-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-C(=O)NR^{45}-$ 、 $-C(=NR^{45})-$ 、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_8$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよい複素環、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールから選択することができ；または L^3 がゼロであり得；各 R^{41} が、独立して、水素、ハロゲン、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルキルからなる群より選択することができ；各 R^{42} が、独立して、水素および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルキルからなる群より選択することができ；各 R^{43} が、独立して、ハロゲン、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、

適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より選択することができ；各 R^{44} が、独立して、ハロゲン、 $-(CH_2)_m OR^A$ 、 $-O(CH_2)_m OR^A$ 、 $-NR^B R^C$ 、 $-C(=O)NR^B R^C$ 、 $-C(=NNR^B R^C)H$ 、 $-(CH_2)_m R^K$ 、 $-O(CH_2)_m R^K$ 、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より選択することができ；各 R^{45} が、独立して、水素、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群より選択することができ；各 R^A が、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択することができ；各 $-NR^B R^C$ を別々に選択することができ、 R^B および R^C がそれぞれ、独立して、水素、 $-SO_2 R^F$ 、 $-C(=O)R^F$ 、 $-(CH_2)_m R^F$ 、 $-(CH_2)_m OR^F$ 、 $-SO_2 NR^D R^E$ 、 $-C(=O)NR^D R^E$ 、 $-C(=NH)NR^D R^E$ 、 $-(CH_2)_m NR^D R^E$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロハロアルキルからなる群より選択することができ、アルキルおよびヘテロアルキルが、アリールまたはヘテロアリールと適宜縮合されていてもよく；または $-NR^B R^C$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり得；または $-NR^B R^C$ が、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミノであり得；各 $-NR^D R^E$ を別々に選択することができ、 R^D および R^E がそれぞれ、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $-(CH_2)_m R^G$ からなる群より選択することができ；または $-NR^D R^E$ が、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミノであり得；または $-NR^D R^E$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり得；各 R^F が、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 R^F の定義中のアリールおよびヘテロアリールが、 $-C(=O)NR^D R^E$ または $-NR^D R^E$ でそれぞれ任意に置換することができ；各 R^G が、独立して、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールから選択することができ；各 R^K が、独立して、 $-C(=O)NR^D R^E$ 、 $-NR^D R^E$ 、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択することができ；各 m が、独立して、0、1、または2であり得；各破線が、適宜二重結合でもよいことを表す。

【0085】

本明細書に開示されるある実施形態は、式Vaの化合物を提供し、式中、 G^4 が、水素、ハロゲン、 $-(CH_2)_m OR^A$ 、 $-O(CH_2)_m OR^A$ 、 $-NR^B R^C$ 、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよいフェニル、適宜置換されていてもよいピリジニル、適宜置換されていてもよいテトラゾリル、および適宜置換されていてもよいイミダゾリルからなる群より選択することができ； Q^3 が、 $-C(=O)NH-$ 、および

【化103】



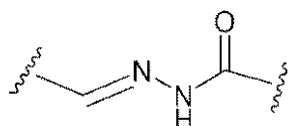
からなる群より選択することができ；または Q^3 がゼロであり得； A^4 が、 R^{41} および R^{42} からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい

、フェニル、ナフチル、ジヒドロベンゾフラニル、1, 4-ベンゾジオキサニル、ベンゾ
 トリアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、および2, 1, 3-ベンゾオキサ
 ジアゾリルからなる群より選択することができ； L^3 が、 $-NR^{45}-$ 、 $-C(=O)-$
 $-C(=S)-$ 、および $-C(=O)NR^{45}-$ から選択される1つ以上の基を含む1
 ～6個の原子の長鎖リンカーであり得；または L^3 がゼロであり得；各 R^{41} が、独立し
 て、ハロゲン、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、および適宜置換されてい
 てもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシからなる群より選択することができ；各 R^{42} が、独立し
 て、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-O(CH_2)_mOR^A$ 、 $-NR^B R^C$ 、 $-C(=O)NR^B R^C$ 、 $-C(=NNR^B R^C)H$ 、 $-(CH_2)_m R^K$ および $-O(CH_2)_m R^K$ から
 なる群より選択することができ；各 R^{45} が、独立して、水素、およびメチルからなる
 群より選択することができ；各 R^A が、独立して、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、および $C_1 \sim C_4$
 ハロアルキルからなる群より選択することができ；各 $-NR^B R^C$ を別々に選択
 することができ、 R^B および R^C がそれぞれ、独立して、水素、 $-C(=O)R^F$ 、 $-(CH_2)_m R^F$ 、
 $-SO_2 NR^D R^E$ 、 $-C(=O)NR^D R^E$ 、 $-C(=NH)NR^D R^E$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、
 および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択することができ；または $-NR^B R^C$
 が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり得；
 または $-NR^B R^C$ が、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミノであり
 得；各 $-NR^D R^E$ を別々に選択することができ、 R^D および R^E がそれぞれ、独立して
 、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい C_3
 $\sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、適宜置
 換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および $-(CH_2)_m R^G$ からなる群より
 選択することができ；または $-NR^D R^E$ が、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アル
 キリデンアミニルであり得；または $-NR^D R^E$ が、環窒素原子を介して連結された適宜
 置換されていてもよい非芳香族複素環であり得；各 R^F が、独立して、水素、適宜置換さ
 れていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_6$ シクロアルキ
 ル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル、適宜置換されていてもよい
 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することが
 でき、 R^F の定義中のアリールおよびヘテロアリールが、 $-C(=O)NR^D R^E$ または
 $-NR^D R^E$ でそれぞれ任意に置換することができ；各 R^G が、独立して、適宜置換され
 ていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールから選択すること
 ができ；各 m が、独立して、0、1、または2であり得；各破線が、適宜二重結合でもよ
 いことを表す。

【0086】

本明細書に開示されるある実施形態は、式Vの化合物を提供し、式中、 G^4 が、水素、
 ハロゲン、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-O(CH_2)_mOR^A$ 、 $-NR^B R^C$ 、適宜置換され
 ていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよいフェニル、適宜置換され
 ていてもよいピリジニル、適宜置換されていてもよいテトラゾリル、および適宜置換され
 ていてもよいイミダゾリルからなる群より選択することができ； Q^3 が、エステル、アミ
 ド、尿素、カルバミド、チオアミド、イミドアミド、スルホンアミド、およびヒドラジド
 誘導体からなる群より選択することができ；または Q^3 が、 $-C(=O)O-$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-NR^{45}C(=O)NR^{45}-$ 、 $-OC(=O)NR^{45}-$ 、 $-C(=S)NR^{45}-$ 、 $-NR^{45}S(O)_{1 \sim 2}-$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミニル、および

【化104】



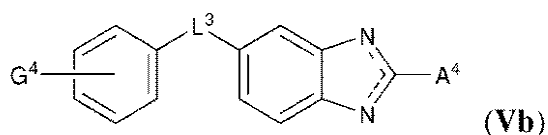
からなる群より選択され；または Q^3 がゼロであり得； A^4 が、 R^{41} および R^{42} から
 なる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換されるアリールおよびヘテロアリ

ールからなる群より選択することができ、 A^4 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； L^3 が、 $-O-$ （酸素）、 $-S(O)_0 \sim 2-$ 、 $-NR^{45}S(O)_1 \sim 2-$ 、 $-NR^{45}-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-C(=O)NR^{45}-$ 、 $-C(=NR^{45})-$ 、 $-NR^{45}C(=O)-$ 、 $(CH_2)_mC(=O)NR^{45}-$ 、 $-NR^{45}C(=O)-(CH_2)_mNR^{45}C(=O)-$ 、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_8$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよい複素環、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールから選択することができ；または L^3 がゼロであり得；各 R^{41} が、独立して、ハロゲン、シアノ、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、およびゼロからなる群より選択することができ；各 R^{42} が、独立して、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-NR^BR^C$ 、 $-C(=O)NR^BR^C$ 、 $-C(=NNR^BR^C)H$ 、 $-(CH_2)_mR^K$ 、 $-O(CH_2)_mR^K$ 、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より選択することができ；各 R^{45} が、独立して、水素、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群より選択することができ；各 R^A が、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択することができ；各 $-NR^BR^C$ を別々に選択することができ、 R^B および R^C がそれぞれ、独立して、水素、 $-SO_2R^F$ 、 $-C(=O)R^F$ 、 $-(CH_2)_mR^F$ 、 $-(CH_2)_mOR^F$ 、 $-SO_2NR^DR^E$ 、 $-C(=O)NR^DR^E$ 、 $-C(=NH)NR^DR^E$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロハロアルキルからなる群より選択することができ、アルキルおよびヘテロアルキルが、アリールまたはヘテロアリールと適宜縮合されていてもよく；または $-NR^BR^C$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり得；または $-NR^BR^C$ が、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミノであり得；各 $-NR^DR^E$ を別々に選択することができ、 R^D および R^E がそれぞれ、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $-(CH_2)_mR^G$ からなる群より選択することができ；または $-NR^DR^E$ が、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミノであり得；または $-NR^DR^E$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり得；各 R^F が、独立して、水素、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 R^F の定義中のアリールおよびヘテロアリールが、 $-C(=O)NR^DR^E$ または $-NR^DR^E$ でそれぞれ任意に置換することができ；各 R^G が、独立して、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールから選択することができ；各 m が、独立して、0、1、または2であり得；1つの破線が二重結合を表す。

【0087】

本明細書に開示されるある実施形態は、式Vb：

【化105】



の構造を有する式V a の化合物、および医薬的に許容される塩を提供し、式中、 G^4 が、水素、ハロゲン、フルオロ、クロロ、ブロモ、 $-OR^A$ 、 $-O(CH_2)_mOR^A$ 、 $-N$

$R^B R^C$ 、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよいフェニル、適宜置換されていてもよいピリジニル、適宜置換されていてもよいテトラゾリル、および適宜置換されていてもよいイミダゾリルからなる群より選択することができ； A^4 が、 R^{41} および R^{42} からなる群より選択される1つ以上の置換基で適宜置換されていてもよいフェニルであり得、 A^4 の定義中のフェニルがさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； L^3 が、 $-C(=O)NR^{45}-$ 、 $-NR^{45}C(=O)-(CH_2)_mC(=O)NR^{45}-$ 、 $-NR^{45}C(=O)-(CH_2)_mNR^{45}C(=O)-$ 、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールから選択することができ；または L^3 がゼロであり得；各 R^{41} が、独立して、ハロゲン、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシからなる群より選択することができ；各 R^{42} が、独立して、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-O(CH_2)_mOR^A$ 、 $-NR^B R^C$ 、 $-C(=O)NR^B R^C$ 、 $-C(=NNR^B R^C)H$ 、 $-(CH_2)_mR^K$ 、 $-O(CH_2)_mR^K$ からなる群より選択することができ；各 R^{45} が、独立して、水素、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群より選択することができ；各 R^A が、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルからなる群より選択され；各 $-NR^B R^C$ を別々に選択することができ、 R^B および R^C がそれぞれ、独立して、水素、 $-SO_2R^F$ 、 $-C(=O)R^F$ 、 $-(CH_2)_mR^F$ 、 $-(CH_2)_mOR^F$ 、 $-SO_2NR^D R^E$ 、 $-C(=O)NR^D R^E$ 、 $-C(=NH)NR^D R^E$ 、 $-(CH_2)_mNR^D R^E$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $C_1 \sim C_6$ ヘテロハロアルキルからなる群より選択することができ、アルキルおよびヘテロアルキルが、アリールまたはヘテロアリールと適宜縮合されていてもよく；または $-NR^B R^C$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり得；各 $-NR^D R^E$ を別々に選択することができ、 R^D および R^E がそれぞれ、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、および $-(CH_2)_mR^G$ からなる群より選択することができ；または $-NR^D R^E$ が、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミニルであり得；または $-NR^D R^E$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり得；各 R^F が、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 R^F の定義中のアリールおよびヘテロアリールが、 $-C(=O)NR^D R^E$ または $-NR^D R^E$ でそれぞれ任意に置換することができ；各 R^G が、独立して、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールから選択することができ；各 R^K が、独立して、 $-C(=O)NR^D R^E$ 、 $-NR^D R^E$ 、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択することができ；各 m が、独立して、0、1、または2であり得；各破線が、適宜二重結合でもよいことを表す。

【0088】

本明細書に開示されるある実施形態は、式Vbの化合物を提供し、式中、 G^4 が、水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、イミダゾリル、テトラゾリル、N-メチル-N-(2-ヒドロキシエチル)アミニル、メチルアミノスルホンアミド、2-ヒドロキシエチルオキシ、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-O(CH_2)_mOR^A$ 、および $-NR^B R^C$ からなる群より選択することができ； A^4 が、 R^{41} および R^{42} からなる群より選択される1つ以上の置換基で適宜置換されていてもよいフェニルであり得、 G^4 の定義中のフェニルがさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； L^3 が、 $-C(=O)NH-$ 、 $-NHC(=O)-C(=O)NH-$ および適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択する

ことができ；または L^3 がゼロであり得；各 $R^{4\ 1}$ が、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシであり得；各 $R^{4\ 2}$ が、独立して、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-O(CH_2)_mOR^A$ 、 $-NR^BR^C$ 、 $-C(=O)NR^BR^C$ 、 $-C(=NNR^BR^C)H$ 、 $-(CH_2)_mR^K$ 、および $-O(CH_2)_mR^K$ からなる群より選択することができ；各 R^A が、独立して、水素、および $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択することができ；各 $-NR^BR^C$ を別々に選択することができ、 R^B および R^C がそれぞれ、独立して、水素、 $-SO_2R^F$ 、 $-C(=O)R^F$ 、 $-(CH_2)_mR^F$ 、 $-OR^F$ 、 $-SO_2NR^DR^E$ 、 $-(CH_2)_mNR^DR^E$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルからなる群より選択することができ；または $-NR^BR^C$ が、オキソでそれぞれ適宜置換されていてもよい、ピロリジニル、モルホリニル、4-メチルピペラジニル、ピペラジニル、ピペリジニル、3-ヒドロキシピロリジニル、および4-ヒドロキシピペリジニルからなる群より選択することができ；各 $-NR^DR^E$ を別々に選択することができ、 R^D および R^E がそれぞれ、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、および $-(CH_2)_mR^G$ からなる群より選択することができ；または $-NR^DR^E$ が、オキソでそれぞれ適宜置換されていてもよい、ピロリジニル、モルホリニル、4-メチルピペラジニル、ピペラジニル、ピペリジニル、3-ヒドロキシピロリジニル、および4-ヒドロキシピペリジニルからなる群より選択することができ；各 R^F が、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 R^F の定義中のアリールおよびヘテロアリールが、 $-NR^DR^E$ でそれぞれ任意に置換することができ；各 R^G が、独立して、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールから選択することができ；各 R^K が、独立して、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択することができ；各 m が、独立して、0、1、または2であり得；各破線が、適宜二重結合でもよいことを表す。

【0089】

本明細書に開示されるある実施形態は、式Vの化合物を提供し、ただし、式Vの化合物が以下のものからなる群より選択されないことを条件とする：

【0090】

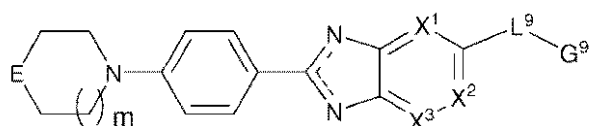
【表9】

および	

【0091】

本明細書に開示されるある実施形態は、式VI：

【化106】



(VI)

の化合物またはその医薬的に許容される塩、エステル、立体異性体、互変異性体もしくはは

10

20

30

40

50

プロドラッグを提供し；

式中：

Eが、O（酸素）、S（硫黄）、 $\text{NR}^{4\ 1}$ および $\text{CR}^{4\ 2}\text{R}^{4\ 3}$ からなる群より選択され；

$\text{R}^{4\ 1}$ が、水素、ハロゲン、シアノ、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{\text{C}}$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ヘテロアルキル、および適宜置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルからなる群より選択され；

$\text{R}^{4\ 2}$ および $\text{R}^{4\ 3}$ がそれぞれ、独立して、水素、ハロゲン、 $-\text{OR}^{\text{A}\ \text{A}}$ 、 $-\text{OR}^{\text{C}\ \text{C}}$ 、 $-\text{NR}^{\text{A}\ \text{R}^{\text{B}}}$ 、 $-\text{NR}^{\text{C}\ \text{R}^{\text{D}}}$ 、 $-\text{SR}^{\text{A}\ \text{A}}$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{R}^{\text{E}}$ 、 $-\text{CONR}^{\text{C}\ \text{R}^{\text{D}}}$ 、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、および適宜置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ヘテロアルキルからなる群より選択され；または $\text{CR}^{4\ 2}\text{R}^{4\ 3}$ が、適宜置換されていてもよい $\text{C}_3\sim\text{C}_7$ シクロアルキルであり；

X^1 、 X^2 、および X^3 がそれぞれ、独立して、N（窒素）および $\text{CR}^{4\ 1}$ からなる群より選択され；

G^9 が、 $\text{R}^{4\ 4}$ および $\text{R}^{4\ 5}$ からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 G^9 の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

各 $\text{R}^{4\ 4}$ が、ハロゲン、シアノ、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_3\sim\text{C}_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、および適宜置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ヘテロアルキルからなる群より別々に選択され；

各 $\text{R}^{4\ 5}$ が、水素、ハロゲン、 $-\text{OR}^{\text{A}\ \text{A}}$ 、 $-\text{OR}^{\text{C}\ \text{C}}$ 、 $-\text{NR}^{\text{A}\ \text{R}^{\text{B}}}$ 、 $-\text{NR}^{\text{C}\ \text{R}^{\text{D}}}$ 、 $-\text{SR}^{\text{A}\ \text{A}}$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{R}^{\text{E}}$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ヘテロアルキル、および適宜置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルからなる群より別々に選択され；

各 $\text{R}^{\text{A}\ \text{A}}$ が、独立して、水素、 $-(\text{CH}_2)_m\text{SO}_2\text{R}^{\text{F}}$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{R}^{\text{F}}$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{\text{C}\ \text{R}^{\text{D}}}$ 、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_8$ アルキル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_8$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルキニル、および適宜置換されていてもよい $\text{C}_3\sim\text{C}_7$ シクロアルキルからなる群より選択され、前記 $\text{C}_3\sim\text{C}_7$ シクロアルキルは、アリールまたはヘテロアリールと適宜縮合されていてもよく；

各 $\text{R}^{\text{B}\ \text{B}}$ が、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_8$ アルキル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_8$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_3\sim\text{C}_7$ シクロアルキル、および $(\text{CH}_2)_m\text{R}^{\text{E}}$ からなる群より選択され；

各 $-\text{NR}^{\text{A}\ \text{R}^{\text{B}}}$ が別々に選択され、 R^{A} および R^{B} がそれぞれ、独立して、水素、 $-(\text{CH}_2)_m\text{SO}_2\text{R}^{\text{F}}$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{R}^{\text{F}}$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{\text{C}\ \text{R}^{\text{D}}}$ 、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_8$ アルキル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_8$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルキニル、および適宜置換されていてもよい $\text{C}_3\sim\text{C}_7$ シクロアルキルからなる群より選択され、前記 $\text{C}_3\sim\text{C}_7$ シクロアルキルは、アリールまたはヘテロアリールと適宜縮合されていてもよく；または $-\text{NR}^{\text{A}\ \text{R}^{\text{B}}}$ が、アリールまたはヘテロアリールと適宜縮合されていてもよい環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；または $-\text{NR}^{\text{A}\ \text{R}^{\text{B}}}$ が、適宜置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキリデンアミノであり；

各 $-\text{NR}^{\text{C}\ \text{R}^{\text{D}}}$ が別々に選択され、 R^{C} および R^{D} がそれぞれ、独立して、水素、適宜

10

20

30

40

50

置換されていてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_8$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_8$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、および $(CH_2)_m R^E$ からなる群より選択され；または $-NR^C R^D$ が、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキリデンアミノであり；または $-NR^C R^D$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

各 R^E が、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択され；

各 R^F が、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択され；

L^9 が、 $-(CH_2)_m C(=O)NR^{4,6}(CH_2)_q-$ 、 $-(CH_2)_m C(=O)NR^{4,6}(CH_2)_q C(=O)NR^{4,6}-$ 、 $-S(O)_2NH-$ 、 O (酸素)、 $-NR^{4,6}-$ 、 $-OC(=O)O-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-NHC(=O)NH-$ 、 $-NHC=SNH-$ 、 $-C(=NR^{4,6})-$ 、 $-C(=O)NR^{4,6}-$ 、 $-C(=S)NR^{4,6}-$ からなる群より選択され；または L^9 がゼロであり；

各 $R^{4,6}$ が、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群より選択され；

各 m が、独立して、0、1、または2であり；

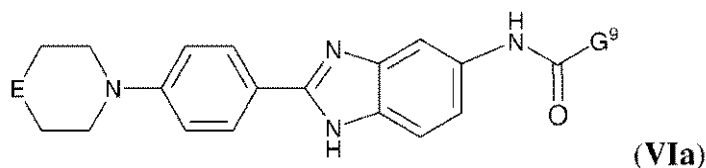
各 q が、独立して、1、2、3、4、5、または6であり；

破線および実線で表されるいずれの結合も、単結合および二重結合からなる群より選択される結合を表す。

【0092】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 VIa ：

【化107】

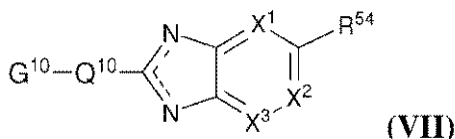


の構造を有する式 VI の化合物、および医薬的に許容される塩を提供する。

【0093】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 VII ：

【化108】



の化合物またはその医薬的に許容される塩、エステル、立体異性体、互変異性体もしくはプロドラッグを提供し；

式中：

G^{10} が、 $R^{5,1}$ 、 $R^{5,2}$ 、および $R^{5,3}$ からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、複素環、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、 G^{10} の定義中の前記アリールおよび

10

20

30

40

50

ヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

Q^{10} が、 Q^{11} 、 $Q^{11}-Q^{12}$ 、および $Q^{11}-Q^{12}-Q^{13}$ からなる群より選択され；

Q^{11} および Q^{13} がそれぞれ、独立して、ピペラジニル、 $-C(=O)O-$ 、 $-C(=O)NR^{51}-$ 、 $-NR^{51}C(=O)NR^{51}-$ 、 $-OC(=O)NR^{51}-$ 、 $-C(=S)NR^{51}-$ 、 $-NR^{51}S(O)_{1\sim 2}-$ 、 $-(CH_2)_mC(=O)NR^{51}(CH_2)_q-$ 、および $-(CH_2)_mC(=O)NR^{51}(CH_2)_qC(=O)NR^{51}-$ からなる群より選択され；

Q^{12} が、適宜置換されていてもよいアリール、適宜置換されていてもよいヘテロアリールおよび適宜置換されていてもよい複素環からなる群より選択され； 10

各 R^{51} が、水素、ハロゲン、シアノ、適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2\sim C_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2\sim C_6$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3\sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3\sim C_7$ シクロアルケニル、適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より別々に選択され；

各 R^{52} が、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-(CH_2)_mNR^BR^C$ 、 $-(CH_2)_mSO_2NR^BR^C$ 、および $-(CH_2)_mSR^A$ からなる群より別々に選択され；

各 R^{53} が、 $-(CH_2)_mOR^D$ 、 $-(CH_2)_mNR^ER^F$ 、 $-(CH_2)_mS(O)_{0\sim 2}R^D$ 、 $-(CH_2)_mNO_2$ 、 $-(CH_2)_mCN$ 、および $-(CH_2)_mR^G$ からなる群より別々に選択され； 20

各 R^{54} が、水素、 $-(CH_2)_mOR^A$ 、 $-(CH_2)_mNR^BR^C$ 、 $-O(CH_2)_mNR^BR^C$ 、 $-C(=O)NR^BR^C$ 、 $-(CH_2)_mSR^A$ 、 $-(CH_2)_mR^G$ 、 $-O(CH_2)_mR^G$ 、 $-(CH_2)_mSO_2NR^BR^C$ 、 $-(CH_2)_mCN$ 、適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_6$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2\sim C_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2\sim C_6$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3\sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3\sim C_7$ シクロアルケニル、適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より別々に選択され； 30

各 R^A が、水素、適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_6$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_2\sim C_6$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2\sim C_6$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3\sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3\sim C_7$ シクロアルケニル、適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より別々に選択され；

各 $-NR^BR^C$ が別々に選択され、 R^B および R^C がそれぞれ、独立して、水素、 $-(CH_2)_mSO_2R^H$ 、 $-(CH_2)_mCOR^H$ 、 $-(CH_2)_mCONR^ER^F$ 、適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_8$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_8$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2\sim C_8$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2\sim C_8$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3\sim C_7$ シクロアルキル、および $-(CH_2)_mR^G$ からなる群より選択され、前記 $C_3\sim C_7$ シクロアルキルは、アリールまたはヘテロアリールと適宜縮合されていてもよく；または $-NR^BR^C$ が、アリールまたはヘテロアリールと適宜縮合されていてもよい環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；または $-NR^BR^C$ が、適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_8$ アルキリデンアミノであり；

各 R^D が、水素、適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_8$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_2\sim C_8$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2\sim C_8$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3\sim C_8$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_3\sim C_8$ シクロアルケニル、適宜置換されていてもよい $C_1\sim C_8$ ハロアルキル、および適宜置換さ 50

れていてもよい $C_1 \sim C_8$ ヘテロアルキルからなる群より別々に選択され；

各 $-NR^E R^F$ が別々に選択され、 R^E および R^F がそれぞれ、独立して、水素、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_8$ アルケニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_8$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、および $(CH_2)_m R^G$ からなる群より選択され；または $-NR^E R^F$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；または $-NR^C R^D$ が、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキリデンアミノであり；

各 R^G が、置換または非置換のアリールおよび置換または非置換のヘテロアリールから別々に選択され；

10

各 R^H が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよい複素環、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択され；

X^1 、 X^2 、および X^3 がそれぞれ、独立して、N（窒素）および $CR^{4,7}$ からなる群より選択され；

各 $R^{4,7}$ が、水素、ハロゲン、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、および適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキルからなる群より別々に選択され；

各 m が、独立して、0、1、2、または3であり；

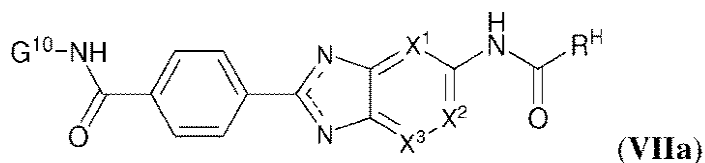
20

破線および実線で表されるいずれの結合も、単結合および二重結合からなる群より選択される結合を表す。

【0094】

本明細書に開示されるある実施形態は、式VIIa：

【化109】



30

の構造を有する式VIIの化合物、および医薬的に許容される塩を提供する。

【0095】

本明細書に開示されるある実施形態は、式VIIの化合物を提供し、ただし、式VIIの化合物が以下のものからなる群より選択されないことを条件とする：

【0096】

【表 10】

		10
		20

【0097】

本明細書に開示されるある実施形態は、HGF模倣体、HGF受容体アゴニストまたはHGF受容体アンタゴニストである、式I～IXのいずれかの化合物、または本明細書に具体的に開示されるいずれかの化合物を提供する。

【0098】

本明細書に開示されるある実施形態は、造血成長因子模倣体、造血成長因子受容体アゴニストまたは造血成長因子受容体アンタゴニストである、式I～IXのいずれかの化合物、または本明細書に具体的に開示されるいずれかの化合物を提供する。

【0099】

本明細書に開示されるある実施形態は、EPO模倣体である、式I～IXのいずれかの化合物、または本明細書に具体的に開示されるいずれかの化合物を提供する。

【0100】

本明細書に開示されるある実施形態は、選択的EPO受容体アゴニストである、式I～IXのいずれかの化合物、または本明細書に具体的に開示されるいずれかの化合物を提供する。

【0101】

本明細書に開示されるある実施形態は、選択的EPO受容体部分アゴニストである、式I～IXのいずれかの化合物、または本明細書に具体的に開示されるいずれかの化合物を提供する。

【0102】

本明細書に開示されるある実施形態は、選択的EPO受容体アンタゴニストである、式I～IXのいずれかの化合物、または本明細書に具体的に開示されるいずれかの化合物を提供する。

【0103】

10

20

30

40

50

本明細書に開示されるある実施形態は、選択的 E P O 受容体結合化合物である、式 I ～ I X のいずれかの化合物、または本明細書に具体的に開示されるいずれかの化合物を提供する。

【0104】

本明細書に開示されるある実施形態は、式 I ～ I X のいずれかの化合物、または本明細書に具体的に開示されるいずれかの化合物と細胞を接触させることを特徴とする、細胞の E P O 活性を調節するための方法を提供する。

【0105】

本明細書に開示されるある実施形態は、E P O 活性を調節する化合物を同定するための方法であって、E P O 受容体を発現する細胞を、式 I ～ I X のいずれかの化合物、または本明細書に具体的に開示されるいずれかの化合物と接触させ；細胞に対する上記化合物の効果を監視することを特徴とする方法を提供する。

10

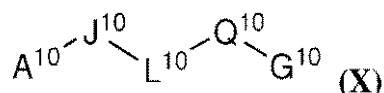
【0106】

本明細書に開示されるある実施形態は、治療的に有効な量の式 I ～ I X のいずれかの化合物、または本明細書に具体的に開示されるいずれかの化合物を患者に投与することを特徴とする、患者を治療する方法を提供する。

【0107】

本明細書に開示されるある実施形態は、治療的に有効な量の式 X :

【化110】



20

で表される化合物およびその医薬的に許容される塩、エステル、立体異性体、互変異性体もしくはプロドラッグを患者に投与することを特徴とする、患者を治療する方法を提供し；

式中：

A^{10} が、 R^1 、 R^2 、および R^3 からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、複素環、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、 A^{10} の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

30

G^{10} が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、複素環、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、 G^{10} の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

40

J^{10} が、2 つの結合によって隔てられる少なくとも 2 個のヘテロ原子を含有し、かつ $-S(O)_2NR^A-$ 、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよい複素環、および適宜置換されていてもよいヘテロアルキル複素環から選択される 1 つ以上の基を含む 1 ～ 8 個の原子の長鎖スペーサであり；ただし、 J^{10} が、3 つまたは 4 つの結合によって隔てられる少なくとも 2 個のヘテロ原子を含有し、かつ適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよい複素環、および適宜置換されていてもよいヘテロアルキル複素環から選択される 1 つ以上の基を含む 1 ～ 8 個の原子のスペーサでないことを条件とし；

Q^{10} が、2 つの結合によって隔てられる少なくとも 2 個のヘテロ原子を含有し、かつ

50

—S(O)₂NR^A—、適宜置換されていてもよいC₁～C₆ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよい複素環、および適宜置換されていてもよいヘテロアルキル複素環から選択される1つ以上の基を含む1～8個の原子の長鎖スペーサであり；

L¹⁰が、—O—(酸素)、—C(=O)—、—C(=S)—、—NR^A—、—S(O)₀～₂—、—NR^AS(O)₁～₂NR^A—、および—NR^AS(O)₁～₂O—から選択される1つ以上の基、ならびに—O—(酸素)、—C(=O)—、—C(=S)—、—NR^A—、—S(O)₀～₂—、—NR^AS(O)₁～₂NR^A—、および—NR^AS(O)₁～₂O—、適宜置換されていてもよいC₁～C₁₀アルキル、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールから選択される1つ以上の基を含む2～14個の原子の長鎖スペーサであり；L¹⁰の定義中の適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールがそれぞれさらに、適宜置換されていてもよい非芳香族複素環または適宜置換されていてもよい非芳香族炭素環と適宜縮合されていてもよく；

10

R¹が、ハロゲン、適宜置換されていてもよいC₁～C₆アルキル、適宜置換されていてもよいC₁～C₆アルコキシ、適宜置換されていてもよいC₂～C₆アルケニル、適宜置換されていてもよいC₂～C₆アルキニル、適宜置換されていてもよいC₃～C₇シクロアルキル、適宜置換されていてもよいC₃～C₇シクロアルケニル、および適宜置換されていてもよいC₁～C₆ヘテロアルキルからなる群より選択され；

R²が、ハロゲン、—OR^A、—NR^BR^C、—SR^Aからなる群より選択され；

R³が、—OR^D、—NR^ER^F、—S(O)₀～₂R^D、—NO₂、—CN、および—(CH₂)_mR^Gからなる群より選択され；

20

R⁴が、ハロゲン、適宜置換されていてもよいC₁～C₆アルキル、適宜置換されていてもよいC₁～C₆アルコキシ、適宜置換されていてもよいC₂～C₆アルケニル、適宜置換されていてもよいC₂～C₆アルキニル、適宜置換されていてもよいC₃～C₇シクロアルキル、適宜置換されていてもよいC₃～C₇シクロアルケニル、適宜置換されていてもよいC₁～C₆ヘテロアルキルからなる群より選択され；

R⁵が、—OR^A、—NR^BR^C、—SR^Aからなる群より選択され；

R⁶が、—OR^D、—NR^ER^F、—S(O)₀～₂R^D、—NO₂、—CN、および—(CH₂)_mR^Gからなる群より選択され；

各R^Aが、水素、—SO₂R^F、—C(=O)R^F、—C(=O)NR^CR^D、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₃～C₇シクロアルキル、C₃～C₇シクロアルケニル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆ヘテロアルキル、およびC₁～C₆ヘテロハロアルキルからなる群より別々に選択され、R^Aの定義中のC₁～C₆アルキル、C₃～C₇シクロアルキル、C₁～C₆ヘテロアルキル、およびC₁～C₆ヘテロハロアルキルが適宜置換されていてもよく；

30

各—NR^BR^Cが別々に選択され、R^BおよびR^Cがそれぞれ、独立して、水素、—SO₂R^H、—C(=O)R^H、—C(=O)NR^ER^F、C₁～C₆アルキル、C₂～C₄アルケニル、適宜置換されていてもよいC₂～C₄アルキニル、C₃～C₇シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆ヘテロアルキル、複素環、およびC₁～C₆ヘテロハロアルキルからなる群より選択され、シクロアルキルおよび複素環が、アリールまたはヘテロアリールと適宜縮合されていてもよく；または—NR^BR^Cが、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；または—NR^BR^Cが、適宜置換されていてもよいC₁～C₆アルキリデンアミノであり；

40

各R^Dが、独立して、水素、適宜置換されていてもよいC₁～C₆アルキル、適宜置換されていてもよいC₂～C₄アルケニル、適宜置換されていてもよいC₂～C₄アルキニル、適宜置換されていてもよいC₃～C₇シクロアルキル、適宜置換されていてもよいC₁～C₆ハロアルキル、適宜置換されていてもよいC₁～C₆ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよい複素環、および—(CH₂)_mR^Gからなる群より選択され；

各—NR^ER^Fが別々に選択され、R^EおよびR^Fがそれぞれ、独立して、水素、適宜置換されていてもよいC₁～C₆アルキル、適宜置換されていてもよいC₂～C₄アルケ

50

ニル、適宜置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ アルキニル、適宜置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、適宜置換されていてもよい複素環、および $(CH_2)_m R^G$ からなる群より選択され；または $-NR^E R^F$ が、環窒素原子を介して連結された適宜置換されていてもよい非芳香族複素環であり；

各 R^G が、適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールから別々に選択され；

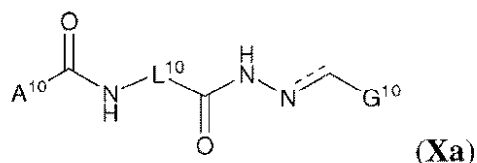
各 R^H が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、適宜置換されていてもよい複素環、および適宜置換されていてもよいアリールまたは適宜置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より別々に選択され；

各 m が、独立して、0、1、または2である。

【0108】

本明細書に開示されるある実施形態は、治療的に有効な量の式 X a：

【化111】

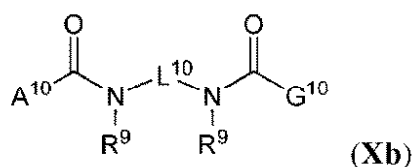


の構造を有する式 X で表される化合物、およびその医薬的に許容される塩を患者に投与することを特徴とする、患者を治療する方法を提供し、式中、 A^{10} が、 R^1 、 R^2 、および R^3 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 A^{10} の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、非芳香族複素環または非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； G^{10} が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 G^{10} の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、非芳香族複素環または非芳香族炭素環と任意に縮合することができる。

【0109】

本明細書に開示されるある実施形態は、治療的に有効な量の式 X b：

【化112】



の構造を有する式 X で表される化合物、およびその医薬的に許容される塩を患者に投与することを特徴とする、患者を治療する方法を提供し、式中、 A^{10} が、 R^1 、 R^2 、および R^3 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 A^{10} の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、非芳香族複素環または非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； G^{10} が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ適宜置換されていてもよいアリールおよびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 G^{10} の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、非芳香族複素環または非芳香族炭素環と任意に縮合することができる。

【0110】

本明細書に開示されるある実施形態は、治療的に有効な量の式 X で表される化合物を患

者に投与することを特徴とする、患者を治療する方法を提供し、式中、 A^{10} が、 R^1 、 R^2 、および R^3 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換される、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、複素環、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 A^{10} の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、非芳香族複素環または非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； G^{10} が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換される、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、複素環、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択することができ、 G^{10} の定義中の前記アリールおよびヘテロアリールはそれぞれさらに、非芳香族複素環または非芳香族炭素環と任意に縮合することができ； R^1 が、フッ素、塩素、およびメチルからなる群より選択することができ； R^2 が、 $-OR^A$ 、 $-NR^B R^C$ 、および $-SR^A$ からなる群より選択することができ； R^3 が、 $-(CH_2)_m R^G$ 、 $-OR^D$ 、および $-NR^E R^F$ からなる群より選択することができ； R^4 が、フッ素、塩素、およびメチルからなる群より選択することができ； R^5 が、 $-OR^A$ 、 $-NR^B R^C$ 、および $-SR^A$ からなる群より選択することができ； R^6 が、 $-(CH_2)_m R^G$ 、 $-OR^D$ 、および $-NR^E R^F$ からなる群より選択することができ； J^{10} および Q^{10} がそれぞれ、独立して、エステル、アミド、尿素、カルバミド、 $-S(O)_2 NR^A -$ 、チオアミド、チオエステル、およびイミドアミドからなる群より選択することができ； L^{10} が、 $-O-$ （酸素）、 $-NR^A -$ 、 $-S(O)_{0 \sim 2} -$ 、および $-NR^A S(O)_{1 \sim 2} O -$ から選択される1つ以上の基、ならびに $-O-$ （酸素）、 $-NR^A -$ 、 $-S(O)_{0 \sim 2} -$ 、および $-NR^A S(O)_{1 \sim 2} O -$ 、適宜置換されていてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキル、適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールから選択される1つ以上の基を含む3～13個の原子の長鎖リンカーであり得； L^{10} の定義中の適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールがそれぞれさらに、非芳香族複素環または非芳香族炭素環と任意に縮合することができ；各mが、独立して、0、1、または2であり得る。

【0111】

本明細書に開示されるある実施形態は、治療的に有効な量の式Xで表される化合物を患者に投与することを特徴とする、患者を治療する方法を提供し、式中、 A^{10} が、 R^1 、 R^2 、および R^3 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換される、 $C_2 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、複素環、フェニル、ピリジニル、ピロリル、ピリミジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、チエニル、インドリル、ベンゾオキサゾリル、ベンズチアゾリル、ベンズイミダゾリル、およびプリニルからなる群より選択することができ； G^{10} が、 R^4 、 R^5 、および R^6 からなる群より選択される1つ以上の置換基でそれぞれ置換される、 $C_2 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヘテロアルキル、複素環、フェニル、ピリジニル、ピロリル、ピリミジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、チエニル、インドリル、ベンゾオキサゾリル、ベンズチアゾリル、ベンズイミダゾリル、およびプリニルからなる群より選択することができ； R^1 が、フッ素、塩素、およびメチルからなる群より選択することができ； R^2 が、 $-OR^A$ および $-NR^B R^C$ からなる群より選択することができ； R^3 が R^G であり得； R^4 が、フッ素、塩素、およびメチルからなる群より選択することができ； R^5 が、 $-OR^A$ および $-NR^A R^B$ からなる群より選択することができ； R^6 が R^G であり得； J^{10} および Q^{10} がそれぞれ、独立して、アミド、尿素、カルバミド、 $-S(O)_2 NR^A -$ 、チオアミド、およびイミドアミドからなる群より選択することができ； L^{10} が、 $-O-$ （酸素）、 $-C(=O)-$ 、 $-NR^A -$ 、 $-S(O)_{0 \sim 2} -$ 、 $-NR^A S(O)_{1 \sim 2} NR^A -$ から選択される1つ以上の基、ならびに適宜置換されていてもよいアリール、および適宜置換されていてもよいヘテロアリールから選択される1つ以上の基を含む3～13個の原子の長鎖リンカーであり得； L^{10} の定義中の適宜置換されていてもよいアリールおよび適宜置換されていてもよいヘテロアリールがそれぞれさらに、非芳香族複素環または非芳香族炭素環と任意に縮合す

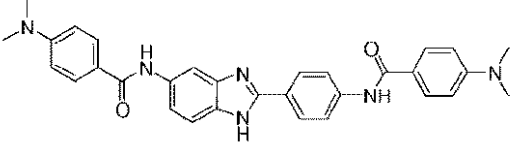
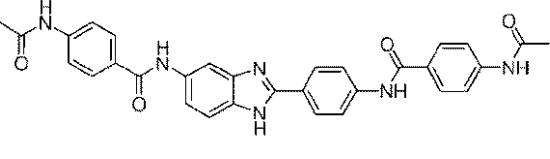
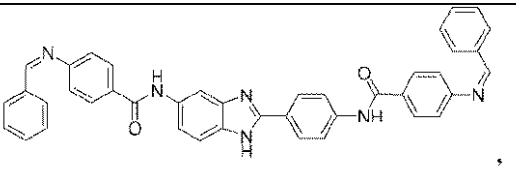
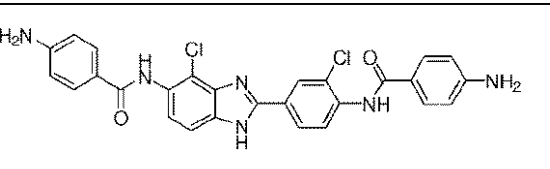
ることができる。

【0112】

本明細書に開示されるある実施形態は、治療的に有効な量の、以下の構造を有する化合物を患者に投与することを特徴とする、患者を治療する方法を提供する：

【0113】

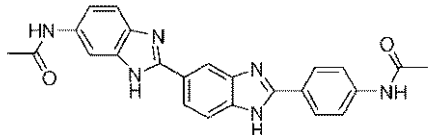
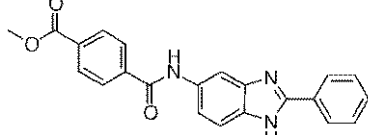
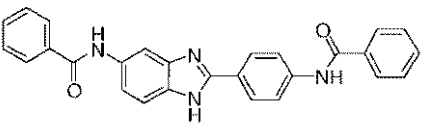
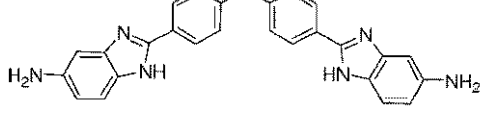
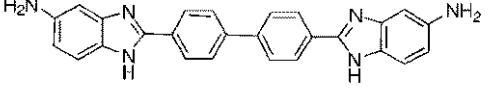
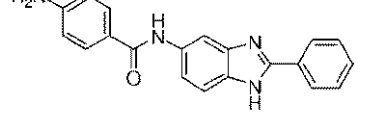
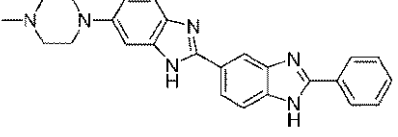
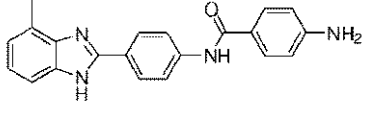
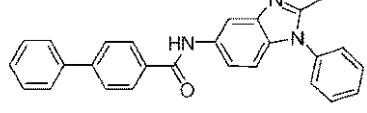
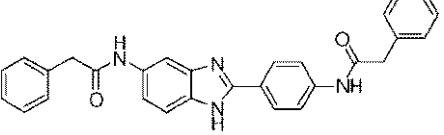
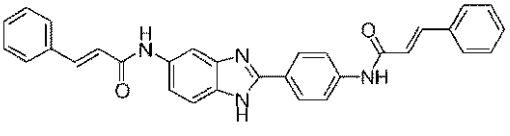
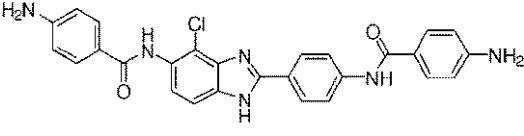
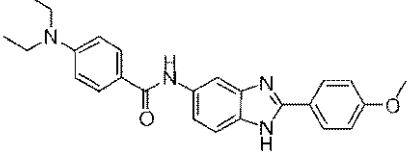
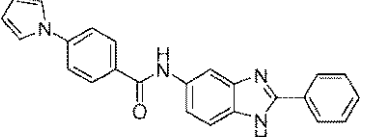
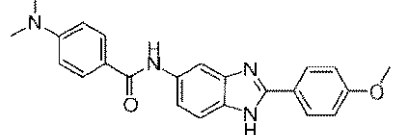
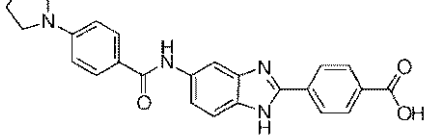
【表11】

10

【0114】

【表 1 2】

		10
		
		
		
		20
		
		
		

10

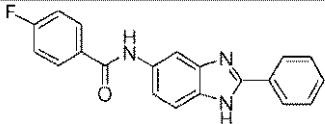
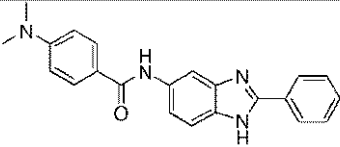
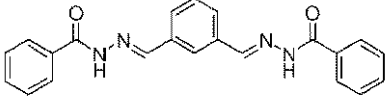
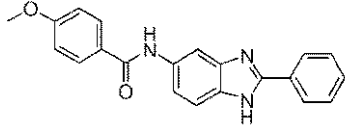
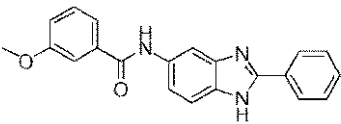
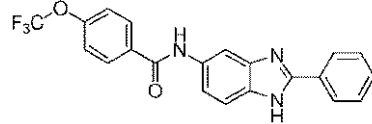
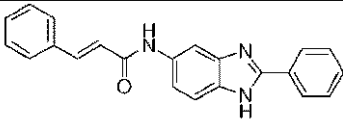
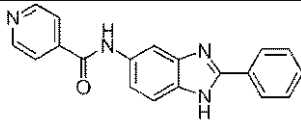
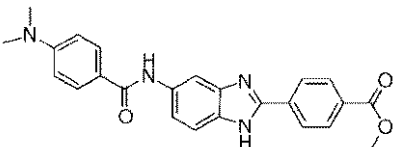
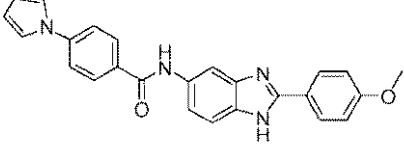
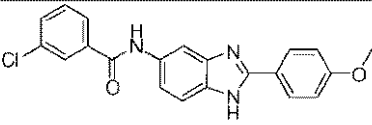
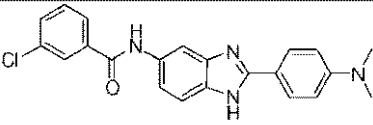
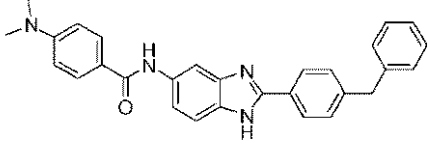
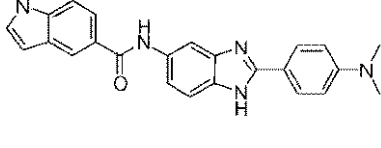
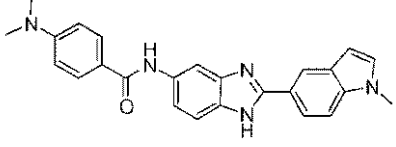
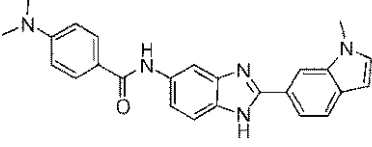
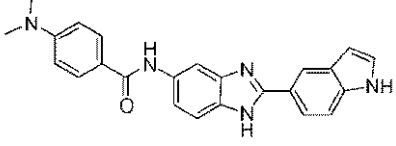
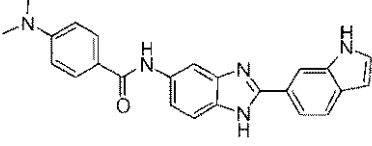
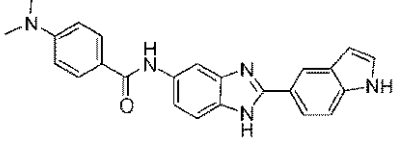
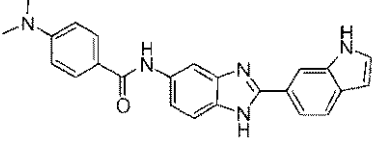
20

30

40

【0 1 1 5】

【表 1 3】

		10
		
		
		20
		
		
		30
		
		
		40

【0 1 1 6】

【表 1 4】

		10
		20
	および	30

【0117】

本明細書に開示されるある実施形態は、生理学的に許容できる担体、希釈剤、または賦形剤と；式 I ～ I X のいずれかの化合物、または本明細書に具体的に開示されるいずれかの化合物とを含む医薬組成物を提供する。

【0118】

生理学的に許容できる担体、希釈剤、または賦形剤と；式 I ～ I X のいずれかの化合物、または本明細書に具体的に開示されるいずれかの化合物とを含む医薬組成物。

【0119】

特定の実施形態において、式 I、II、III、IV、V、VI、VII、VIII、または IX の化合物が、造血成長因子模倣体である。

【0120】

特定の実施形態において、HGF 受容体の活性を調節するための方法が提供される。このような方法は、本発明の実施形態の 1 つ以上の化合物を細胞と接触させることを特徴とする。このような方法には、限定はされないが、HGF および／または HGF 受容体を、本発明の実施形態の 1 つ以上の化合物と接触させる工程が含まれる。

【0121】

特定の実施形態において、実施形態は、HGF 活性を調節することが可能な化合物を同

10

20

30

40

50

定するための方法であって：a) HGF活性が可能な細胞を、本発明の実施形態の化合物と接触させ；b) 細胞に対する効果を監視することの特徴とする方法を提供する。特定のこのような実施形態において、細胞は、HGF受容体を発現する。

【0122】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の化合物を患者に投与することの特徴とする、患者を治療する方法が提供される。特定の実施形態において、このような患者は、血小板減少症に罹患している。特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物は、化学療法、骨髄移植、および／または放射線治療の前、その間、またはその後に患者に投与される。特定の実施形態において、実施形態の1つ以上の化合物は、再生不良性貧血、骨髄不全、および／または特発性血小板減少症に罹患している患者に投与される。特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物は、神経系の疾患に罹患している患者に投与される。特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物は、筋萎縮性側索硬化症、多発性硬化症、または多発性ジストロフィー (multiple dystrophy) に罹患している患者に投与される。特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物は、限定はされないが、脊髄損傷を含む神経損傷を有する患者に投与される。

10

【0123】

特定の実施形態において、i) 生理学的に許容できる担体、希釈剤、または賦形剤、あるいはそれらの組合せと；ii) 本発明の実施形態の1つ以上の化合物とを含む医薬組成物が提供される。

20

【0124】

特定の実施形態は、選択的HGF調節剤を提供する。特定の実施形態は、選択的HGF受容体アゴニストを提供する。特定の実施形態は、選択的HGF受容体アンタゴニストを提供する。特定の実施形態は、選択的HGF部分アゴニストを提供する。特定の実施形態は、選択的HGF受容体結合化合物を提供する。特定の実施形態は、HGF模倣体を提供する。

【発明を実施するための形態】

【0125】

上記の全般的な説明および以下の詳細な説明は両方とも、単に例示および説明のためのものであり、権利請求される実施形態を限定するものではないことが理解されるべきである。本出願において、単数形の使用は、特に規定されない限り複数形を包含する。本出願において、「または」の使用は、特に規定されない限り「および／または」を意味する。さらに、用語「含む (including)」ならびに「含む (includes)」および「含まれる (included)」などの他の形態の使用は限定するものではない。

30

【0126】

本明細書で使用される項の見出しは、単に構成上の目的のためのものであり、記載される主題を限定するものと解釈されるべきではない。限定はされないが、特許、特許出願、記事、書籍、説明書、および論文を含む、本出願に引用される全ての文献、または文献の一部は、あらゆる目的のためにその全体が参照により本明細書に明確に援用される。

【0127】

定義

40

具体的な定義が示されない限り、本明細書に記載される分析化学、有機合成化学、ならびに医化学および製薬化学と関連して用いられる用語体系、ならびに実験手順および技術は、当該技術分野で公知のものである。標準的な化学記号が、このような記号によって表される正式名称と同義的に用いられる。したがって、例えば、用語「水素」および「H」は、同じ意味を有するものと理解される。化学合成、化学分析、医薬品の調製、製剤化、および送達、ならびに患者の治療には、標準的な技術を用いることができる。組み換えDNA、オリゴヌクレオチド合成、ならびに組織の培養および形質転換 (例えば、エレクトロポレーション、リポフェクション) には、標準的な技術を用いることができる。例えば、製造業者の仕様書にしたがってキットを用いて、あるいは当該技術分野で一般的に行わ

50

れるようにまたは本明細書に記載されるように、反応および精製技術を行うことができる。上記の技術および手順は一般に、当該技術分野で周知の従来の方法にしたがって、ならびに本明細書全体を通して引用および説明される様々な全般的およびより具体的な参考文献に記載されるように行うことができる。例えば、あらゆる目的のために全体が参照により本明細書に援用される Sambrook et al. *Molecular Cloning: A Laboratory Manual* (第2版、Cold Spring Harbor Laboratory Press、Cold Spring Harbor、N. Y. (1989)) を参照されたい。

【0128】

本明細書で使用される際、以下の用語は、特に明記されない限り、以下の意味で定義される。

10

【0129】

用語「選択的結合化合物」は、1つ以上の標的のいずれかの部分に選択的に結合する化合物を指す。

【0130】

用語「選択的HGF受容体結合化合物」は、HGF受容体のいずれかの部分に選択的に結合する化合物を指す。

【0131】

用語「選択的に結合する」は、選択的結合化合物が、非標的受容体に結合するより大きい親和性で標的受容体に結合する能力を指す。特定の実施形態において、選択的結合は、非標的に対する親和性より少なくとも10倍、50倍、100倍、250倍、500倍、または1000倍高い親和性で標的に結合することを指す。

20

【0132】

用語「標的受容体」は、選択的結合化合物によって結合可能な受容体または受容体の一部を指す。特定の実施形態において、標的受容体がHGF受容体である。

【0133】

用語「調節剤」は、活性を変化させる化合物を指す。例えば、調節剤は、調節剤を用いない場合の活性の大きさと比較して所定の活性の大きさを増大または減少させることができる。特定の実施形態において、調節剤は、1つ以上の活性の大きさを減少させる阻害剤である。特定の実施形態において、阻害剤は、1つ以上の生物学的活性を完全に妨げる。特定の実施形態において、調節剤は、少なくとも1つの活性の大きさを増大させる活性剤である。特定の実施形態において、調節剤が存在すると、調節剤を用いない場合には生じない活性が生じる。

30

【0134】

用語「選択的調節剤」は、標的活性を選択的に調節する化合物を指す。

【0135】

用語「選択的HGF調節剤」は、少なくとも1つのHGF活性を選択的に調節する化合物を指す。選択的HGF調節剤という用語には、限定はされないが、それが存在することで少なくとも1つのHGF活性を生じる化合物を指す「HGF模倣体」が含まれる。

【0136】

40

用語「選択的に調節する」は、選択的調節剤が、非標的活性を調節するより高い程度に標的活性を調節する能力を指す。

【0137】

用語「標的活性」は、選択的調節剤によって調節可能な生物学的活性を指す。特定の例示的な標的活性には、限定はされないが、結合親和性、シグナル伝達、酵素活性、前駆細胞の増殖および／または分化、血小板の産生、および疾患または病態の症状の緩和が含まれる。

【0138】

用語「HGF活性」は、HGFの存在から直接または間接的に生じる生物学的活性を指す。例示的なHGF活性には、限定はされないが、血小板を産生する前駆細胞の増殖およ

50

びまたは分化；造血；グリア細胞の増殖および／または成長；神経細胞の修復；および血小板減少症の緩和が含まれる。

【0139】

用語「受容体を介した活性」は、受容体へのリガンドの結合から直接または間接的に得られる何らかの生物学的活性を指す。

【0140】

用語「アゴニスト」は、それが存在することで、受容体に対する天然リガンドの存在から得られる生物学的活性と同じ、受容体の生物学的活性を生じる化合物を指す。

【0141】

用語「部分アゴニスト」は、それが存在することで、受容体に対する天然リガンドの存在から得られるものと同じタイプであるがより程度の低い、受容体の生物学的活性を生じる化合物を指す。

10

【0142】

用語「アンタゴニスト」は、それが存在することで、受容体の生物学的活性の大きさを減少させる化合物を指す。特定の実施形態において、アンタゴニストが存在すると、受容体の生物学的活性が完全に抑制される。

【0143】

用語「アルキル」は、分枝状または非分枝状の完全飽和非環式脂肪族炭化水素基を指す。アルキルは、分枝状または直鎖状であり得る。アルキルは、置換されていてもまたは非置換であってもよい。アルキルには、限定はされないが、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、第三級ブチル、ペンチル、ヘキシルなどが含まれ、それぞれが任意に置換されていてもよい。

20

【0144】

特定の実施形態において、アルキルは、1～20個の炭素原子を含む（この表現が本明細書に出てくる場合には常に、「1～20個」などの数値範囲は、所与の範囲の各整数を指し；例えば、「1～20個の炭素原子」は、アルキル基が、1個のみの炭素原子、2個の炭素原子、3個の炭素原子など、最大20個まで（20個を含む）の炭素原子を含み得ることを意味するが、用語「アルキル」は、炭素原子の数値範囲が指定されない場合も含む）。アルキルは、「C₁～C₆アルキル」または同様の表記として表され得る。ほんの一例として、「C₁～C₄アルキル」は、1個、2個、3個、または4個の炭素原子を有するアルキルを示し、例えば、アルキルは、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、およびtert-ブチルから選択される。

30

【0145】

本明細書で使用される用語「アルケニル」は、限定はされないが、1-プロペニル、2-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニルなどを含む、少なくとも1つの炭素-炭素二重結合を含有する2～20個の炭素原子の一価の直鎖状または分枝鎖状脂肪族炭化水素基を指す。特定の実施形態において、アルケニルは、2～20個の炭素原子を含む（この表現が本明細書に出てくる場合には常に、「2～20個」などの数値範囲は、所与の範囲の各整数を指し；例えば、「2～20個の炭素原子」は、アルケニル基が、2個のみの炭素原子、3個の炭素原子など、最大20個まで（20個を含む）の炭素原子を含み得ることを意味するが、用語「アルケニル」は、炭素原子の数値範囲が指定されない場合も含む）。アルケニルは、「C₂～C₆アルケニル」または同様の表記として表され得る。ほんの一例として、「C₂～C₄アルケニル」は、2個、3個、または4個の炭素原子を有するアルケニルを示し、例えば、アルケニルは、エテニル、プロペニル、およびブテニルから選択される。

40

【0146】

本明細書で使用される用語「アルキニル」は、限定はされないが、1-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニルなどを含む、少なくとも1つの炭素-炭素三重結合を含有する2～20個の炭素原子の一価の直鎖状または分枝鎖状脂肪族炭化水素基を指す。特定の実施形態において、アルキニルは、2～20個の炭素原子を含む（この表現が本明細書に出

50

てくる場合には常に、「2～20個」などの数値範囲は、所与の範囲の各整数を指し；例えば、「2～20個の炭素原子」は、アルキニル基が、2個のみの炭素原子、3個の炭素原子など、最大20個まで（20個を含む）の炭素原子を含み得ることを意味するが、用語「アルキニル」は、炭素原子の数値範囲が指定されない場合も含む）。アルキニルは、「 $C_2 \sim C_6$ アルキニル」または同様の表記として表され得る。ほんの一例として、「 $C_2 \sim C_4$ アルキニル」は、2個、3個、または4個の炭素原子を有するアルケニルを示し、例えば、アルケニルは、エチニル、プロピニル、およびブチニルから選択される。

【0147】

本明細書で使用される用語「シクロアルキル」は、3～20個の炭素原子を有する飽和脂肪族環系基を指す。シクロアルキルは、限定はされないが、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、ビシクロ〔4. 4. 0〕デカニル、ビシクロ〔2. 2. 1〕ヘプタニル、アダマンチル、ノルボルニルなどを含む単環式および多環式飽和脂肪族環系を指す。特定の実施形態において、シクロアルキルは、3～20個の炭素原子を含む（この表現が本明細書に出てくる場合には常に、「3～20個」などの数値範囲は、所与の範囲の各整数を指し；例えば、「3～20個の炭素原子」は、シクロアルキル基が、3個のみの炭素原子など、最大20個まで（20個を含む）の炭素原子を含み得ることを意味するが、用語「シクロアルキル」は、炭素原子の数値範囲が指定されない場合も含む）。シクロアルキルは、「 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル」または同様の表記として表され得る。ほんの一例として、「 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル」は、2個、3個、4個、5個または6個の炭素原子を有するアルケニルを示し、例えば、シクロアルキルは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、およびシクロヘキシルから選択される。

【0148】

本明細書で使用される用語「シクロアルケニル」は、環中に少なくとも1つの炭素-炭素二重結合を有する3～20個の炭素原子を有する脂肪族環系基を指す。シクロアルケニルは、限定はされないが、シクロプロペニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘプテニル、ビシクロ〔3. 1. 0〕ヘキシル、ノルボルニレニル、1, 1'-ビシクロペンテニルなどを含む単環式および多環式不飽和脂肪族環系を指す。特定の実施形態において、シクロアルケニルは、3～20個の炭素原子を含む（この表現が本明細書に出てくる場合には常に、「3～20個」などの数値範囲は、所与の範囲の各整数を指し；例えば、「3～20個の炭素原子」は、シクロアルケニル基が、3個のみの炭素原子など、最大20個まで（20個を含む）の炭素原子を含み得ることを意味するが、用語「シクロアルケニル」は、炭素原子の数値範囲が指定されない場合も含む）。シクロアルケニルは、「 $C_3 \sim C_7$ シクロアルケニル」または同様の表記として表され得る。ほんの一例として、「 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル」は、2個、3個、4個、5個または6個の炭素原子を有するアルケニルを示し、例えば、シクロアルキルは、シクロプロペニル、シクロブテニル、シクロペンテニル、およびシクロヘキセニルから選択される。

【0149】

用語「ハロアルキル」は、少なくとも1個の水素原子がハロゲン原子で置換されるアルキルを指す。2個以上の水素原子がハロゲン原子で置換される実施形態のいくつかにおいて、ハロゲン原子は、互いに全て同じである。このような実施形態のいくつかにおいて、ハロゲン原子は、互いに全て同じであるわけではない。

【0150】

用語「ヘテロアルキル」は、アルキルおよび1個以上のヘテロ原子を含む基を指す。いくつかのヘテロアルキルは、1個以上のヘテロ原子がアルキル鎖中にあるアシルアルキルである。ヘテロアルキルの例には、限定はされないが、 $CH_3C(=O)CH_2-$ 、 $CH_3C(=O)CH_2CH_2-$ 、 $CH_3CH_2C(=O)CH_2CH_2-$ 、 $CH_3C(=O)CH_2CH_2CH_2-$ 、 $CH_3OCH_2CH_2-$ 、 CH_3NHCH_2- 、 $CH_3NHC(=O)CH_2-$ などが含まれる。

【0151】

本明細書で使用される用語「アルコキシ」は、 $-O-$ 結合を介して親分子に共有結

10

20

30

40

50

合される直鎖状または分枝鎖状アルキル基を指す。アルコキシ基の例には、限定はされないが、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、*n*-ブトキシ、*sec*-ブトキシ、*tert*-ブトキシなどが含まれる。アルコキシは、「C₁~C₆アルコキシ」または同様の表記として表され得る。ほんの一例として、「C₁~C₄アルコキシ」は、1個、2個、3個、または4個の炭素原子を有するアルキルを示し、例えば、アルコキシは、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、*sec*-ブトキシ、および*tert*-ブトキシから選択される。

【0152】

用語「オレフィン」は、C=C結合を指す。

【0153】

本明細書で使用される用語「アルキリデンアミノ」は、少なくとも1つの炭素-窒素二重結合を含有する1~20個の炭素原子の部分了指し、この部分は、窒素を介して主基に結合され、限定はされないが、メチリデンアミノ、エチリデンアミノ、メチルエチリデンアミノ、プロピリデンアミノ、1-メチルプロピリデンアミノ、2-メチルプロピリデンアミノ、ブチリデンアミノ、1-メチルブチリデンアミノ、2-メチルブチリデンアミノ、シクロプロピリデンアミノ、シクロブチリデンアミノ、シクロペンチリデンアミノ、シクロヘキシリデンアミノなどを含む。

【0154】

用語「炭素環」は、環を形成する原子の各々が炭素原子である、共有結合で閉鎖された環を含む基を指す。炭素環は、3個、4個、5個、6個、7個、8個、9個、または10個以上の炭素原子によって形成され得る。炭素環は、任意に置換されていてもよい。

【0155】

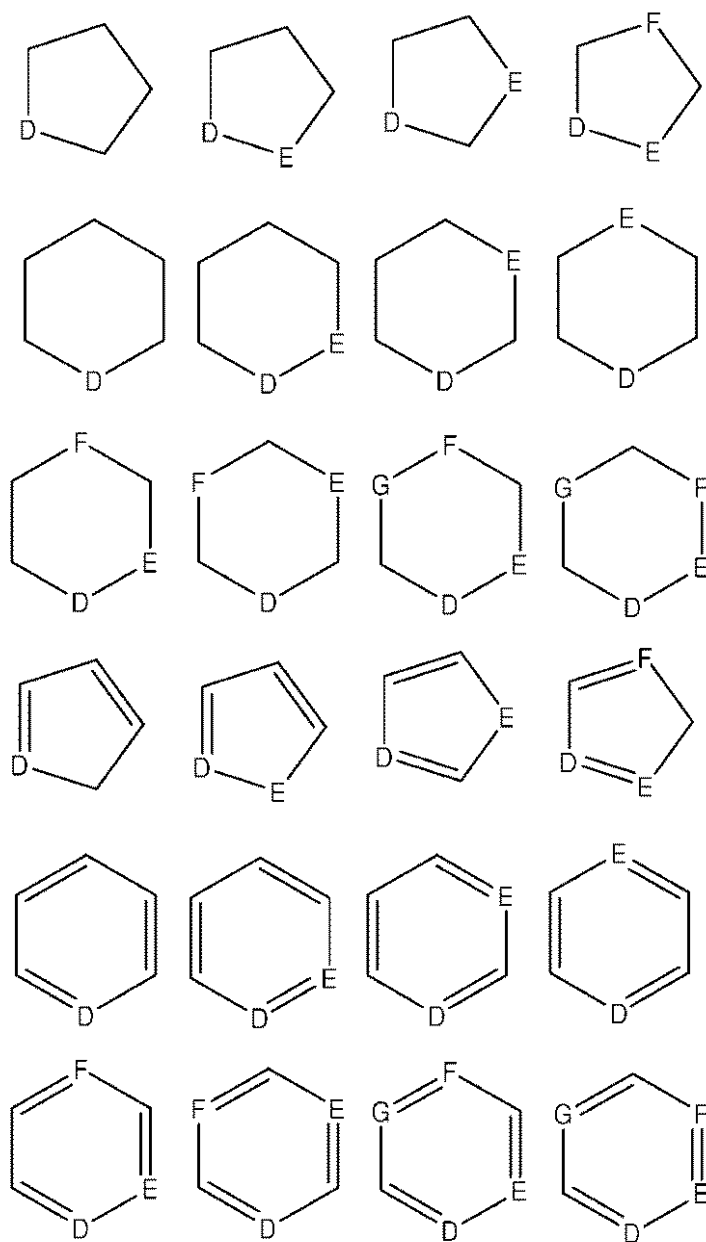
用語「複素環」は、環を形成する少なくとも1個の原子がヘテロ原子である、共有結合で閉鎖された環を含む基を指す。複素環は、3個、4個、5個、6個、7個、8個、9個、または10個以上の原子によって形成され得る。それらの原子のうちの任意の数がヘテロ原子であり得る（すなわち、複素環は、1個、2個、3個、4個、5個、6個、7個、8個、9個、または10個以上のヘテロ原子を含み得る）。2個以上のヘテロ原子を含む複素環において、それらの2個以上のヘテロ原子は、互いに同じであってもまたは異なってもよい。複素環は、任意に置換されていてもよい。複素環への結合は、ヘテロ原子においてまたは炭素原子を介して行われ得る。例えば、ベンゾ縮合誘導体の結合は、ベンゼノイド環の炭素を介して行われ得る。複素環の例には、限定はされないが、以下のものが含まれる：

10

20

30

【化 1 1 3】

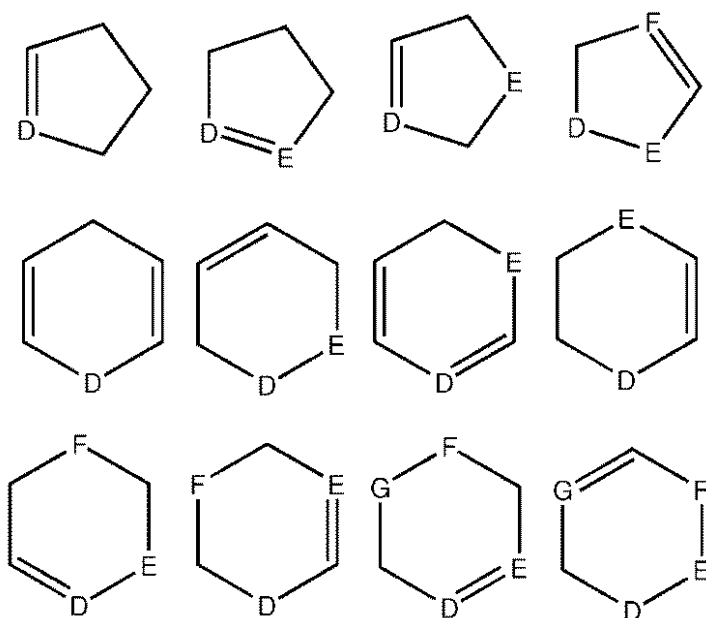


10

20

30

【化 1 1 4】



10

式中、D、E、F、およびGが、独立して、ヘテロ原子を表す。D、E、F、およびGの各々は、互いに同じであっても異なってもよい。複素環は、芳香族複素環（すなわち、ヘテロアリール）または非芳香族複素環であり得る。ある実施形態において、非芳香族複素環は、完全に飽和した共有結合で閉鎖された環である（例えば、ピペリジン、ピロリジン、モルホリン、ピペラジンなど）。

20

【0 1 5 6】

用語「ヘテロ原子」は、炭素または水素以外の原子を指す。ヘテロ原子は、典型的に、独立して、酸素、硫黄、窒素、およびリンから選択されるが、それらの原子に限定されない。2個以上のヘテロ原子が存在する実施形態において、2個以上のヘテロ原子は、互いに全て同じであってもよく、あるいは2個以上のヘテロ原子のいくつかまたは全てがそれぞれ、互いに異なってもよい。

30

【0 1 5 7】

用語「芳香族」は、非局在化 π 電子系を有する、共有結合で閉鎖された環を含む基を指す。芳香環は、5個、6個、7個、8個、9個、または10個以上の原子によって形成され得る。芳香族は、任意に置換されていてもよい。芳香族基の例には、限定はされないが、フェニル、ナフタレニル、フェナントレニル、アントラセニル、テトラリニル、フルオレニル、インデニル、およびインダニルが含まれる。芳香族という用語には、例えば、環を形成する炭素原子の1個を介して結合され、かつアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、非芳香族複素環、ハロ、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、ニトロ、アルキルアミド、アシル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1 \sim 6$ アミノアルキル、 $C_1 \sim 6$ アルキルアミノ、アルキルスルフェニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、スルファモイル、またはトリフルオロメチルから選択される1つ以上の置換基を任意に有するベンゼノイド基が含まれる。特定の実施形態において、芳香族基は、パラ位、メタ位、および／またはオルト位のうちの1つ以上において置換される。置換基を含む芳香族基の例には、限定はされないが、フェニル、3-ハロフェニル、4-ハロフェニル、3-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル、3-アミノフェニル、4-アミノフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、4-トリフルオロメトキシフェニル、3-シアノフェニル、4-シアノフェニル、ジメチルフェニル、ナフチル、ヒドロキシナフチル、ヒドロキシメチルフェニル、（トリフルオロメチル）フェニル、アルコキシフェニル、4-モルホリン-4-イルフェニル、4-ピロリジン-1-イルフェニル、4-ピラゾリルフェ

40

50

ニル、4-トリアゾリルフェニル、および4-(2-オキソピロリジン-1-イル)フェニルが含まれる。

【0158】

用語「アリール」は、環を形成する原子の各々が炭素原子である芳香族基を指す。アリール環は、5個、6個、7個、8個、9個、または10個以上の炭素原子によって形成され得る。アリール基は、任意に置換されていてもよい。

【0159】

用語「ヘテロアリール」は、芳香環系を形成する少なくとも1個の原子がヘテロ原子である芳香族単環系、二環系または三環系を指す。ヘテロアリール環は、3個、4個、5個、6個、7個、8個、9個、または10個以上の原子によって形成され得る。ヘテロアリール基は、任意に置換されていてもよい。ヘテロアリール基の例には、限定はされないが、1個の酸素または硫黄原子または最大4個の窒素原子、あるいは1個の酸素または硫黄原子と最大2個の窒素原子との組合せを含む芳香族C₃~₈複素環基、およびそれらの置換誘導体、ならびに例えば、環を形成する炭素原子の1個を介して結合されるベンゾーおよびピリド縮合誘導体が含まれる。特定の実施形態において、ヘテロアリール基は、ハロ、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、ニトロ、アルキルアミド、アシル、C₁~₆-アルコキシ、C₁~₆-アルキル、C₁~₆-ヒドロキシアルキル、C₁~₆-アミノアルキル、C₁~₆-アルキルアミノ、アルキルスルフェニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、スルファモイル、またはトリフルオロメチルから独立して選択される1つ以上の置換基で適宜置換されていてもよい。ある実施形態において、置換基は、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、O-C₁~₆-アルキル、C₁~₆-アルキル、ヒドロキシ-C₁~₆-アルキル、およびアミノ-C₁~₆-アルキルである。ヘテロアリール基の例には、限定はされないが、フラン、ベンゾフラン、チオフエン、ベンゾチオフエン、ピロール、ピリジン、インドール、オキサゾール、ベンゾオキサゾール、イソオキサゾール、ベンズイソオキサゾール、チアゾール、ベンゾチアゾール、イソチアゾール、イミダゾール、ベンズイミダゾール、ピラゾール、インダゾール、テトラゾール、キノリン、イソキノリン、ピリダジン、ピリミジン、プリンおよびピラジン、フラザン、1,2,3-オキサジアゾール、1,2,3-チアジアゾール、1,2,4-チアジアゾール、トリアゾール、ベンゾトリアゾール、プテリジン、フェノキサゾール、オキサジアゾール、ベンゾピラゾール、キノリジン、シンノリン、フタラジン、キナゾリン、およびキノキサリンの非置換および一置換または二置換の誘導体が含まれる。

【0160】

用語「非芳香環」は、非局在化π電子系を有さない共有結合で閉鎖された環を含む基を指す。

【0161】

用語「非芳香族複素環」は、環を形成する1個以上の原子がヘテロ原子である非芳香環を含む基を指す。非芳香族複素環は、3個、4個、5個、6個、7個、8個、9個、または10個以上の原子によって形成され得る。非芳香族複素環は、任意に置換されていてもよい。特定の実施形態において、非芳香族複素環は、例えば、オキソ-およびチオ含有基などの1つ以上のカルボニルまたはチオカルボニル基を含む。非芳香族複素環の例には、限定はされないが、ラクタム、ラクトン、環状イミド、環状チオイミド、環状カルバメート、テトラヒドロチオピラン、4H-ピラン、テトラヒドロピラン、ピペリジン、1,3-ジオキシン、1,3-ジオキサン、1,4-ジオキシン、1,4-ジオキサン、ピペラジン、1,3-オキサチアン、1,4-オキサチン、1,4-オキサチアン、テトラヒドロ-1,4-チアジン、2H-1,2-オキサジン、マレイミド、スクシンイミド、バルビツール酸、チオバルビツール酸、ジオキソペペラジン、ヒダントイン、ジヒドロウラシル、モルホリン、トリオキサン、ヘキサヒドロ-1,3,5-トリアジン、テトラヒドロチオフエン、テトラヒドロフラン、ピロリン、ピロリジン、ピロリドン、ピロリジノン、ピラゾリン、ピラゾリジン、イミダゾリン、イミダゾリジン、1,3-ジオキソール、1,3-ジオキソラン、1,3-ジチオール、1,3-ジチオラン、イソオキサゾリン、

【 0 1 6 2 】

【化 1 1 5】



【化 1 1 6】



【 0 1 6 3 】

40

【 0 1 6 4 】

【 0 1 6 5 】

50

【0166】

用語「環系」は、単一の環または2つ以上の環のいずれかを指し、2つ以上の環が存在する場合、2つ以上の環は縮合される。用語「縮合」は、2つ以上の環が1つ以上の結合を共有する構造を指す。

【0167】

用語「スペーサ」は、所望の数の原子によって2つ以上の基を互いに隔てる任意の原子または原子団を指す。例えば、特定の実施形態において、1個、2個、3個、4個、5個、6個、または7個以上の原子によって2つ以上の基を隔てるのが望ましいであろう。このような実施形態において、所望の数の原子によってそれらの基を隔てるのに、いかなる原子または原子団を用いてもよい。スペーサは、任意に置換されていてもよい。特定の実施形態において、スペーサは、飽和または不飽和アルキル、ヘテロアルキルおよび／またはハロアルキルを含む。特定の実施形態において、スペーサは、環の一部である原子を含む。

10

【0168】

単に例示のため、上記の定義を限定することなく、スペーサのいくつかの例が提供される。1個の原子のスペーサの例には、限定はされないが、以下のものが含まれる：

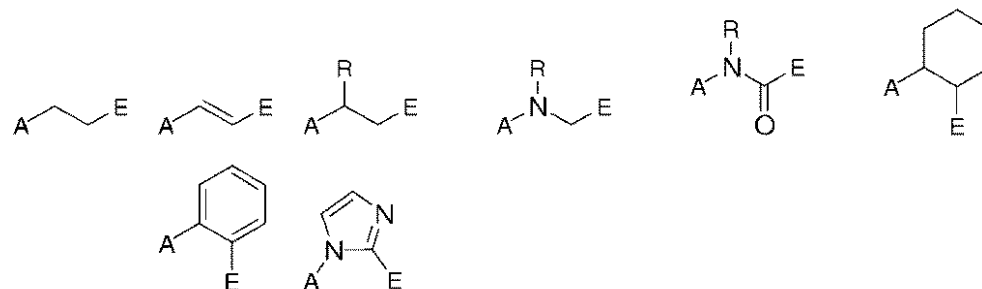
【化117】



20

式中、AおよびEが、所望の数の原子によって隔てられる基を表す。2個の原子のスペーサの例には、限定はされないが、以下のものが含まれる：

【化118】



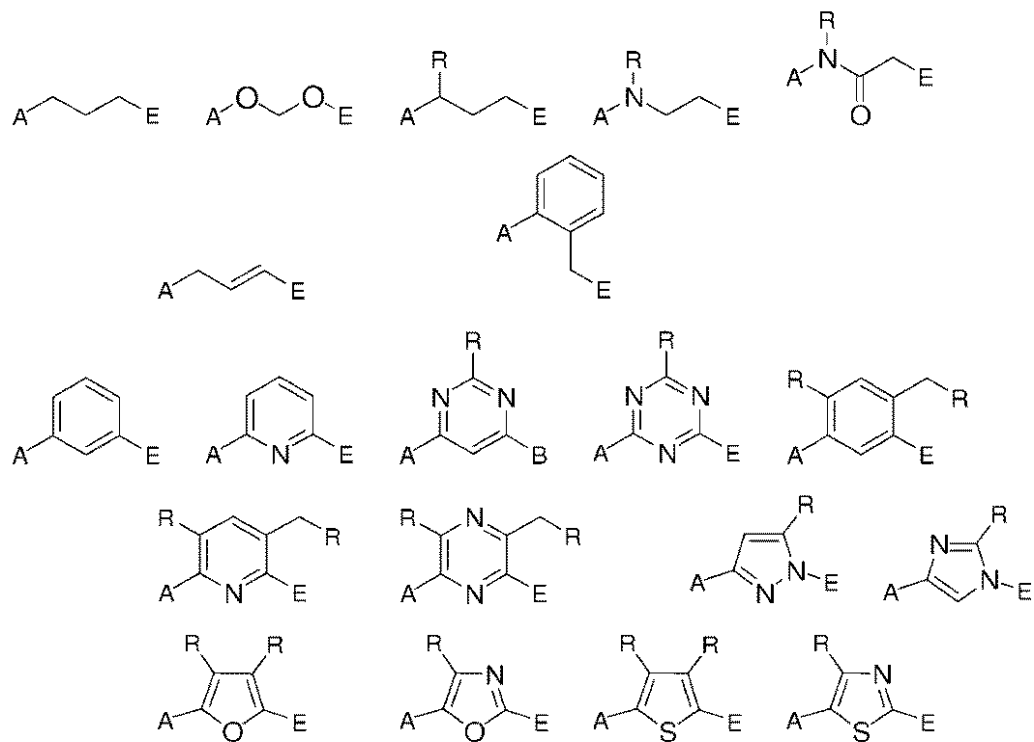
30

式中、AおよびEが、所望の数の原子によって隔てられる基を表す。

【0169】

3個の原子のスペーサの例には、限定はされないが、以下のものが含まれる：

【化 1 1 9】

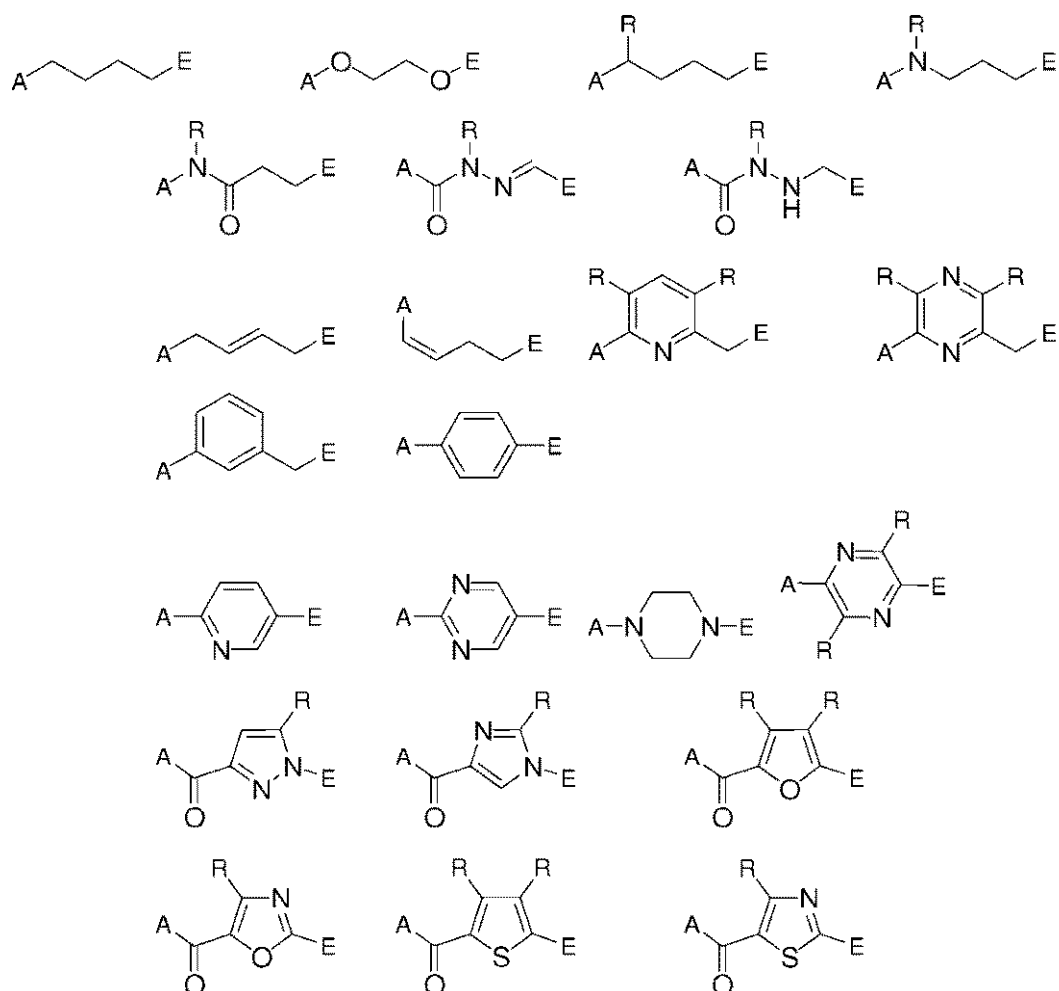


10

20

式中、AおよびEが、所望の数の原子によって隔てられる基を表す。4個の原子のスペーサの例には、限定はされないが、以下のものが含まれる：

【化 1 2 0】



10

20

式中、AおよびEが、所望の数の原子によって隔てられる基を表す。上記の例から明らかであるように、所望の離隔を作り出す原子は、それ自体が基の一部であり得る。その基は、例えば、アルキル、ヘテロアルキル、ハロアルキル、ヘテロハロアルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、非芳香族複素環、または置換アルキルであり得、それらは全て適宜置換されていてもよい。したがって、用語「1～5個の原子のスペーサ」は、1個、2個、3個、4個、または5個の原子によって2つの基を隔てるスペーサを指し、スペーサを構成する基の全体の大きさを示すものではない。

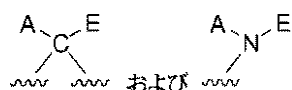
30

【0 1 7 0】

本明細書で使用される際、用語「連結されて環を形成する」は、単一の原子または複数の原子（それら自体が最終的に結合される）のいずれかに結合される2個の原子がそれぞれ、連結基に結合されることによって、得られる構造が環を形成する場合を指す。その得られる環は、連結されて環を形成する2個の原子、それらの原子を既に連結した1個または複数の原子、およびリンカーを含む。例えば、下記のAおよびEが「連結されて環を形成する」場合、

40

【化 1 2 1】

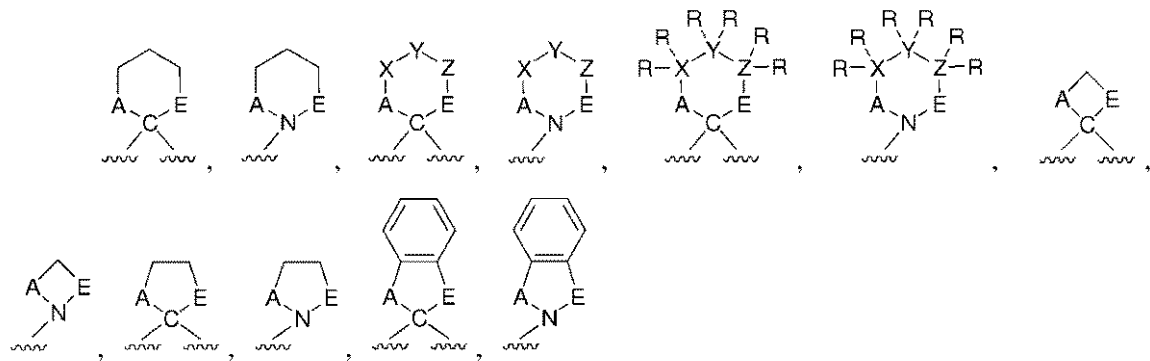


得られる環は、それらが結合されるA、E、C（炭素）またはN（窒素）、および連結基を含む。特に示されない限り、その連結基は、任意の長さを有するものであってもよく、任意に置換されていてもよい。上記の例を参照すると、得られる構造には、限定はされな

50

いが：

【化 1 2 2】



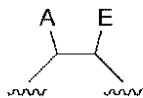
10

などが含まれる。

【0 1 7 1】

特定の実施形態において、一緒に環を形成する 2 つの置換基は、同じ原子に直接結合されない。例えば、下記の A および E が連結されて環を形成する場合：

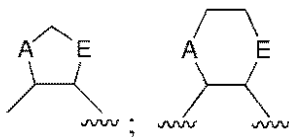
【化 1 2 3】



20

得られる環は、A、E、A および E を既に連結している 2 個の原子ならびに連結基を含む。得られる構造の例には、限定はされないが：

【化 1 2 4】



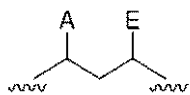
30

などが含まれる。

【0 1 7 2】

特定の実施形態において、一緒に環を形成する原子は、3 個以上の原子によって隔てられる。例えば、下記の A および E が連結されて環を形成する場合：

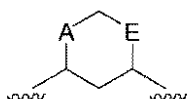
【化 1 2 5】



得られる環は、A、E、A および E を既に連結している 3 個の原子、ならびに連結基を含む。得られる構造の例には、限定はされないが：

40

【化 1 2 6】



などが含まれる。

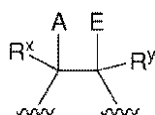
【0 1 7 3】

本明細書で使用される際、用語「一緒に結合を形成する」は、隣接する原子に対する 2 つの置換基がゼロであり、隣接する原子間の結合が二重結合になる場合を指す。例えば、

50

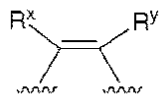
下記の A および E が「一緒に結合を形成する」場合、

【化 1 2 7】



得られる構造は以下のとおりである：

【化 1 2 8】



10

【0 1 7 4】

用語「ゼロ」は、ある構造にある基が存在しないことを指す。例えば、構造

【化 1 2 9】



(式中、場合により、X が N (窒素) である) において、X が N (窒素) である場合、R' または R'' のうち的一方がゼロであるとは、3 つのみの基が N (窒素) に結合されることを意味している。

20

【0 1 7 5】

単独で表されて、数字表記を伴わない置換基「R」は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール（環炭素を介して結合される）および非芳香族複素環（環炭素を介して結合される）から選択される置換基を指す。

【0 1 7 6】

用語「O-カルボキシ」は、式 $\text{RC}(=\text{O})\text{O}-$ からなる基を指す。

【0 1 7 7】

用語「C-カルボキシ」は、式 $- \text{C}(=\text{O})\text{OR}$ からなる基を指す。

【0 1 7 8】

用語「アセチル」は、式 $- \text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$ からなる基を指す。

30

【0 1 7 9】

用語「トリハロメタンスルホニル」は、式 $\text{X}_3\text{CS}(=\text{O})_2-$ (式中、X がハロゲンである) からなる基を指す。

【0 1 8 0】

用語「シアノ」は、式 $- \text{CN}$ からなる基を指す。

【0 1 8 1】

用語「イソシアナト」は、式 $- \text{NCO}$ からなる基を指す。

【0 1 8 2】

用語「チオシアナト」は、式 $- \text{CNS}$ からなる基を指す。

40

【0 1 8 3】

用語「イソチオシアナト」は、式 $- \text{NCS}$ からなる基を指す。

【0 1 8 4】

用語「スルホニル」は、式 $- \text{S}(=\text{O})_2\text{R}$ からなる基を指す。

【0 1 8 5】

用語「S-スルホンアミド」は、式 $- \text{S}(=\text{O})_2\text{NR}$ からなる基を指す。

【0 1 8 6】

用語「N-スルホンアミド」は、式 $\text{RS}(=\text{O})_2\text{NH}-$ からなる基を指す。

【0 1 8 7】

用語「トリハロメタンスルホンアミド」は、式 $\text{X}_3\text{CS}(=\text{O})_2\text{NR}-$ からなる基を

50

指す。

【0188】

用語「O-カルバミル」は、式 —OC(=O)—NR からなる基を指す。

【0189】

用語「N-カルバミル」は、式 ROC(=O)NH— からなる基を指す。

【0190】

用語「O-チオカルバミル」は、式 —OC(=S)—NR からなる基を指す。

【0191】

用語「N-チオカルバミル」は、式 ROC(=S)NH— からなる基を指す。

【0192】

用語「C-アミド」は、式 —C(=O)—NR_2 からなる基を指す。

【0193】

用語「N-アミド」は、式 RC(=O)NH— からなる基を指す。

【0194】

用語「オキシ」は、式 =O からなる基を指す。

【0195】

本明細書で使用される用語「ケト」および「カルボニル」は C=O を指す。

【0196】

本明細書で使用される用語「チオカルボニル」は C=S を指す。

【0197】

用語「エステル」は、式 $\text{—(R)}_n\text{—C(=O)OR'}$ で表される化学部分を指し、式中、R および R' が、独立して、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール（環炭素を介して結合される）および非芳香族複素環（環炭素を介して結合される）から選択され、n が 0 または 1 である。

【0198】

用語「アミド」は、式 $\text{—(R)}_n\text{—C(=O)NHR'}$ または $\text{—(R)}_n\text{—NHC(=O)R'}$ で表される化学部分を指し、式中、R が、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール（環炭素を介して結合される）および複素脂環式基（環炭素を介して結合される）から選択され、n が 0 または 1 であり、R' が、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール（環炭素を介して結合される）および複素脂環式基（環炭素を介して結合される）から選択され、n が 0 または 1 である。特定の実施形態において、アミドは、アミノ酸またはペプチドであり得る。

【0199】

用語「アミノ」は、式 —NHR'R'' で表される化学部分を指し、式中、R' および R'' がそれぞれ、独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール（環炭素を介して結合される）および複素脂環式基（環炭素を介して結合される）から選択される。

【0200】

用語「アミン」、「ヒドロキシ」、および「カルボキシル」は、エステル化またはアミド化されたこのような基を含む。エステル化およびアミド化を行うのに用いられる手順および具体的な基は、当業者に公知であり、全体が本明細書に援用される Greene および Wuts、Protective Groups in Organic Synthesis、第3版、John Wiley & Sons、New York、NY、1999 などの参考資料において容易に見出すことができる。

【0201】

特に示されない限り、用語「適宜置換されていてもよい」は、水素原子のうちのいずれも置換されないか、水素原子のうちの1個、または2個以上が、アルキル、アルケニル、シクロアルケニル、アルキニル、ヘテロアルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、アルケニルO—、アリールアルキルO—、アリールアルキルNH—、アルケニルO—、シクロアルキルC(=O)—、アリールC(=O)—、アリール

10

20

30

40

50

C(=O)NH-、アリールNHC(=O)-、アリール(CH₂)_{0~3}O(CH₂)_{0~3}-、HO(CH₂)_{1~3}NH-、HO(CH₂)_{1~3}O-、HO(CH₂)_{1~3}-、HO(CH₂)_{1~3}O(CH₂)_{1~3}-、-C(=O)NHNH₂、ヘテロアリール、複素環、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、メルカプト、アルキルチオ、アリールチオ、シアノ、ハロ、カルボニル、オキソ、チオカルボニル、O-カルバミル、N-カルバミル、O-チオカルバミル、N-チオカルバミル、C-アミド、N-アミド、S-スルホンアミド、N-スルホンアミド、C-カルボキシ、O-カルボキシ、イソシアナト、チオシアナト、イソチオシアナト、ニトロ、シリル、トリハロメタンスルホニル、およびアミノ（一置換および二置換のアミノ基、ならびにアミノ基の保護誘導体を含む）から個々にかつ独立して選択される1つ以上の基で置換された基を指す。このような保護誘導体（およびこのような保護誘導体を形成し得る保護基）は、当業者に公知であり、上記のGreeneおよびWutsなどの参照文献において見出すことができる。基が窒素、または硫黄を含有する場合、置換基としてのオキソは、酸化物、例えばピリジン-N-オキシド、チオピランスルホキシドおよびチオピラン-S，S-ジオキシドも含む。2個以上の水素原子が置換された実施形態において、置換基は、一緒に環を形成し得る。

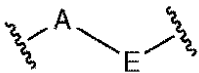
【0202】

本明細書で使用される際の用語「立体異性体」は、同じ構造を有するが、空間におけるその原子の配置が異なる異性体を意味する。例えば、全ての鏡像異性体、ジアステレオマー、幾何異性体、およびアトロプ異性体を含む。

【0203】

特に示されない限り、置換基がジラジカル（すなわち、分子の残りの部分に対して2つの結合点を有する）として表される場合には常に、置換基が任意の方向配置で結合可能であることが理解されるべきである。したがって、例えば、-AE-または

【化130】

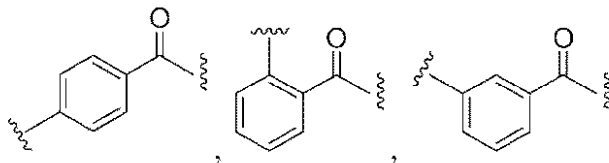


として表される置換基は、Aが分子の最も左の結合点で結合されるとともに、分子の最も右の結合点で結合されるように配向される置換基を含む。

【0204】

特定の基の命名規則は、文脈に応じて、モノラジカルまたはジラジカル of the いずれかを含み得ることが理解されるべきである。例えば、置換基が、分子の残りの部分に対する2つの結合点を必要とする場合、置換基はジラジカルであることが理解される。2つの結合点を必要とするアルキルとして特定される置換基は、-CH₂-、-CH₂CH₂-、-CH₂CH(CH₃)CH₂-などのジラジカルを含み；2つの結合点を必要とするアルコキシとして表される置換基は、-OCH₂-、-OCH₂CH₂-、-OCH₂CH(CH₃)CH₂-などのジラジカルを含み；2つの結合点を必要とするアリールC(=O)-として表される置換基は、

【化131】



などのジラジカルを含む。

【0205】

本明細書全体を通して、本明細書の基および置換基は、安定した部分および化合物を提供するように、当業者によって選択され得る。

【0206】

用語「担体」は、細胞または組織への別の化合物の組み込みを促進する化合物を指す。

10

20

30

40

50

例えば、ジメチルスルホキシド（DMSO）は、細胞または組織への特定の有機化合物の組み込みを改善するために一般的に用いられる担体である。

【0207】

用語「薬剤」は、患者における所望の治療効果を誘発することが可能な化学化合物または組成物を指す。特定の実施形態において、薬剤は、所望の治療効果を誘発する剤である活性剤を含む。特定の実施形態において、薬剤は、プロドラッグを含む。特定の実施形態において、薬剤は、担体、賦形剤などの不活性成分を含む。

【0208】

用語「治療的に有効な量」は、所望の治療効果を得るのに十分な薬剤の量を指す。

【0209】

用語「プロドラッグ」は、より活性の低い形態から対応するより活性の高い形態へと生体内で転化される薬剤を指す。

【0210】

用語「医薬的に許容される」は、製剤化された化合物が患者に投与されるときに、化合物の生物学的活性、薬理学的活性および／または他の特性を著しく損なわない化合物の製剤を指す。特定の実施形態において、医薬的に許容される製剤は、患者に大きな刺激を与えない。

【0211】

用語「共投与」は、2種以上の薬剤を患者に投与することを指す。特定の実施形態において、共投与される薬剤は、単一の投薬単位で一緒に投与される。特定の実施形態において、共投与される薬剤は、別々に投与される。特定の実施形態において、共投与される薬剤は、同時に投与される。特定の実施形態において、共投与される薬剤は、異なる時間に投与される。

【0212】

用語「患者」は、ヒト被験体および動物被験体を含む。

【0213】

用語「実質的に純粋」は、目的の化学種（例えば、化合物）が、存在する主な化学種である（すなわち、モル基準で、目的の化学種が、組成物中、いずれの他の個々の化学種より量が多い）ことを意味する。特定の実施形態において、実質的に精製された画分は、目的の化学種が存在する全ての化学種の少なくとも約50パーセント（モル基準で）を占める組成物である。特定の実施形態において、実質的に純粋な組成物は、組成物中に存在する全ての化学種の約80%、85%、90%、95%、または99%超を占めるであろう。特定の実施形態において、目的の化学種は、実質的に均一（従来の検出方法によって、汚染化学種が組成物中に検出できない）になるまで精製され、組成物は、単一の化学種から本質的になる。

【0214】

用語「組織選択的」は、化合物が、ある組織の生物学的活性を、別の組織の生物学的活性を調節するより大きいまたは小さい程度に調節する能力を指す。異なる組織の生物学的活性は、同じであってもまたは異なってもよい。異なる組織の生物学的活性は、同じタイプの標的受容体によって媒介され得る。例えば、特定の実施形態において、組織選択的化合物は、ある組織の受容体を介した生物学的活性を調節し、別の組織タイプの受容体を介した生物学的活性を調節できないか、またはより小さい程度に調節し得る。

【0215】

用語「監視」は、効果があることまたはいかなる効果もないことを観察することを指す。特定の実施形態において、本発明の実施形態の化合物と細胞を接触させた後にそれらの細胞を監視する。監視され得る効果の例には、限定はされないが、細胞表現型、細胞増殖、受容体活性、または受容体と受容体に結合することが知られている化合物との間の相互作用の変化が含まれる。

【0216】

用語「細胞表現型」は、物理的または生物学的特性を指す。表現型を構成する特性の例

10

20

30

40

50

には、限定はされないが、細胞の大きさ、細胞増殖、細胞分化、細胞生存、アポトーシス（細胞死）、または代謝栄養の利用（例えば、グルコースの取り込み）が含まれる。細胞表現型の特定の変化または変化がないことは、当該技術分野で公知の技術を用いて容易に監視される。

【0217】

用語「細胞増殖」は、細胞が分裂する速度を指す。特定の実施形態において、細胞は、生体内の原位置（*in situ*）にある。特定の実施形態において、細胞は、容器中、インビトロ（*in vitro*）で増殖される。容器中で増殖する細胞の数は、当業者によって定量され得る（例えば、顕微鏡を用いて所定の領域にある細胞の数を計測することにより、または適切な培地中で細胞の密度を測定する実験装置を用いることによる）。当業者は、細胞の数を2回以上測定することによって、細胞増殖を計算することができる。

10

【0218】

用語「接触」は、2つ以上の材料を、それらが相互作用し得るほど十分に近接させることを指す。特定の実施形態において、接触は、試験管、ペトリ皿などの容器中で行うことができる。特定の実施形態において、接触は、さらなる材料の存在下で行われてもよい。特定の実施形態において、接触は、細胞の存在下で行われてもよい。このような実施形態のいくつかにおいて、接触される材料の1つ以上が、細胞内にあってもよい。細胞は生きていてもまたは死んでいてもよい。細胞は無傷であってもまたは無傷でなくてもよい。

【0219】

特定の化合物

20

1つ以上のHGF活性を調節し、および／またはHGF受容体に結合する特定の化合物は、健康に関与する。特定の実施形態において、化合物は、様々な疾患または病態のいずれかを治療するのに有用である。

【0220】

特定の実施形態は、選択的HGF調節剤を提供する。特定の実施形態は、選択的HGF受容体結合剤を提供する。特定の実施形態は、選択的HGF調節剤および／または選択的HGF受容体結合剤の作製方法および使用方法を提供する。特定の実施形態において、選択的HGF調節剤は、HGF受容体のためのアゴニスト、部分アゴニスト、および／またはアンタゴニストである。

【0221】

30

本明細書に開示される化合物は、例えば、造血、赤血球産生、顆粒球形成、血小板産生、および骨髓造血を調節するために、単独でまたは他の剤と組み合わせて使用することができる。本発明の化合物は、造血、赤血球産生、顆粒球形成、血小板産生、および骨髓造血の機能異常によって引き起こされる疾患または病態の治療または予防の際にも、単独でまたは他の剤と組み合わせて使用することができる。疾患のいくつかの非限定的な例には、貧血、好中球減少症、血小板減少症、心血管疾患、免疫／自己免疫疾患、癌、感染症または感染病、および神経疾患が含まれる。

【0222】

当業者は、同様の化合物を合成するのに類似の合成スキームが用いられ得ることを認識するであろう。当業者は、本発明の実施形態の化合物が他の合成スキームを用いて合成され得ることを認識するであろう。特定の実施形態において、本明細書で提供される化合物のいずれかに対応する塩が提供される。

40

【0223】

特定の実施形態において、選択的HGF調節剤に対応する塩が提供される。特定の実施形態において、選択的HGF受容体結合剤に対応する塩が提供される。特定の実施形態において、塩酸、臭化水素酸、硫酸、硝酸、リン酸、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸、サリチル酸などの酸と化合物を反応させることによって塩が得られる。特定の実施形態において、化合物を塩基と反応させて、アンモニウム塩、ナトリウム塩またはカリウム塩などのアルカリ金属塩、カルシウム塩またはマグネシウム塩などのアルカリ土類金属塩、コリン、ジシクロヘキシルアミン、N-メチル-D-グルカミ

50

ン、トリス（ヒドロキシメチル）メチルアミン、4-（2-ヒドロキシエチル）-モルホリン、1-（2-ヒドロキシエチル）-ピロリジン、エタノールアミンなどの有機塩基の塩およびアルギニン、リジンなどのアミノ酸との塩などの塩を形成することによって塩が得られる。特定の実施形態において、遊離酸の形態の選択的HGF調節剤または選択的HGF結合剤を、ビス-ナトリウム、ビス-エタノールアミンなどの多モル当量の塩基と反応させることによって塩が得られる。

【0224】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の化合物に対応する塩は、酢酸塩、アンモニウム塩、ベンゼンスルホン酸塩、安息香酸塩、重炭酸塩、重硫酸塩、酒石酸水素塩、ホウ酸塩、臭化物、エデト酸カルシウム塩、カンシル酸塩、炭酸塩、塩化物、コリネート（*cholin ate*）、クラブラン酸塩、クエン酸塩、二塩酸塩、ニリン酸塩、エデト酸塩、エジシル酸塩、エストル酸塩（*estolate*）、エシル酸塩（*esylate*）、フマル酸塩、グルセプト酸塩（*gluceptate*）、グルコン酸塩、グルタミン酸塩、グリコリルアルサニル酸塩（*glycollylarsanilate*）、ヘキシルレゾルシン酸塩、ヒドラバニン（*hydrabanine*）、臭化水素酸塩、塩酸塩、ヒドロキシナフトエ酸塩、ヨウ化物、イセチオン酸塩、乳酸塩、ラクトビオン酸塩、ラウリン酸塩、マグネシウム塩、リンゴ酸塩、マレイン酸塩、マンデル酸塩、ムチン酸塩（*muccate*）、ナプシル酸塩（*napsylate*）、硝酸塩、N-メチルグルカミン塩、シュウ酸塩、パモ酸塩（エンボン酸塩）、パルミチン酸塩、パントテン酸塩、リン酸塩、ポリガラクトロン酸塩、カリウム塩、サリチル酸塩、ナトリウム塩、ステアリン酸塩、塩基性酢酸塩、コハク酸塩、硫酸塩、タンニン酸塩、酒石酸塩、テオクル酸塩、トシル酸塩、トリエチオジド（*triethiodide*）、トロメタミン塩、トリメチルアンモニウム塩、および吉草酸塩から選択される。

【0225】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の化合物の1個以上の炭素原子は、ケイ素で置換される。例えば、国際公開第03/037905A1号パンフレット；TackeおよびZilch、*Endeavour, New Series*, 10, 191-197 (1986)；BainsおよびTacke、*Curr. Opin. Drug Discov Devel.* Jul: 6 (4): 526-43 (2003)を参照されたい。それらは全て、全体が参照により本明細書に援用される。特定の実施形態において、1個以上のケイ素原子を含む化合物は、限定はされないが、炭素原子のいずれもケイ素原子で置換されていない同じ化合物と比較して、患者におけるより高い安定性および／またはより長い半減期を含む特定の所望の特性を有する。

【0226】

特定のアッセイ

特定の実施形態において、本発明の実施形態の化合物の活性を調節するHGFのレベルを測定するのにアッセイを用いてもよい。

【0227】

増殖アッセイ

ある実施形態において、EPO、GCSFまたは他のサイトカイン受容体を発現する細胞株（それらの増殖はこれらのサイトカインに応じて決まり得る）を用いたインビトロ（*in vitro*）での増殖アッセイにおいて化合物を試験する。

【0228】

ルシフェラーゼアッセイ

ある実施形態において、EPO、GCSFまたは他のサイトカイン受容体を発現する細胞株を用いたレポーターアッセイにおいて化合物を試験する。これらの細胞を、STAT応答性レポーター（ルシフェラーゼなど）でトランスフェクトし、化合物の活性を、レポーターアッセイによって測定する。

【0229】

分化アッセイ

ある実施形態において、精製されたヒトCD34+前駆細胞において化合物を試験する。化合物を細胞に加えた後、造血、赤血球産生、顆粒球形成、血小板産生、または骨髓造血のマーカーを発現する細胞の数を、フローサイトメトリーによってまたはこれらの経路に関連する遺伝子の発現を分析することによって測定する。

【0230】

特定の薬剤

特定の実施形態において、少なくとも1つの選択的HGF調節剤、またはその医薬的に許容される塩、エステル、アミド、および／またはプロドラッグは、単独でまたは1つ以上の医薬的に許容される担体と組み合わされて、薬剤を形成する。本発明の実施形態の化合物の製剤化および投与の技術は、例えば、全体が参照により本明細書に援用される「Remington's Pharmaceutical Sciences」、Mack Publishing Co.、Easton、PA、第18版、1990において見出すことができる。

10

【0231】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物を含む薬剤は、限定はされないが、混合、溶解、造粒、糖衣錠作製 (dragee-making)、研和 (levigating)、乳化、カプセル化、封入 (entrapping) または錠剤化プロセスを含む、公知の技術を用いて調製される。

【0232】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物を含む薬剤は、液体 (例えば、懸濁剤、エリキシル剤および／または溶液) である。このような実施形態のいくつかにおいて、本発明の実施形態の1つ以上の化合物を含む液体の薬剤は、限定はされないが、水、グリコール、油、アルコール、矯味剤、保存料、および着色剤を含む、当該技術分野で公知の成分を用いて調製される。

20

【0233】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物を含む薬剤は、固体 (例えば、粉末、錠剤、および／またはカプセル剤) である。このような実施形態のいくつかにおいて、本発明の実施形態の1つ以上の化合物を含む固体の薬剤は、限定はされないが、でんぷん、糖類、希釈剤、造粒剤、潤滑剤、結合剤、および崩壊剤を含む、当該技術分野で公知の成分を用いて調製される。

30

【0234】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物を含む薬剤は、デポー製剤として製剤化される。特定のこのようなデポー製剤は、典型的に、非デポー製剤より長く作用する。特定の実施形態において、このような製剤は、(例えば皮下または筋肉内) 注入によってまたは筋肉内注射によって投与される。特定の実施形態において、デポー製剤は、好適なポリマー材料もしくは疎水性材料 (例えば、許容できる油中の乳剤) またはイオン交換樹脂を用いて、あるいは難溶性誘導体として、例えば、難溶性塩として調製される。

【0235】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物を含む薬剤は、送達系を含む。送達系の例には、限定はされないが、リポソームおよび乳剤が含まれる。特定の送達系が、疎水性化合物を含む薬剤を含む特定の薬剤を調製するのに有用である。特定の実施形態において、ジメチルスルホキシドなどの特定の有機溶媒が使用される。

40

【0236】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物を含む薬剤は、薬剤を特定の組織または細胞型に送達するように設計された1つ以上の組織特異的送達分子を含む。例えば、特定の実施形態において、薬剤は、組織特異的抗体で被覆されたリポソームを含む。

【0237】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物を含む薬剤は、共溶媒

50

系を含む。このような共溶媒系のいくつかは、例えば、ベンジルアルコール、非極性界面活性剤、水混和性有機ポリマー、および水相を含む。特定の実施形態において、このような共溶媒系は、疎水性化合物に用いられる。このような共溶媒系の非限定的な例は、V P D共溶媒系であり、これは、3 % w/vのベンジルアルコール、8 % w/vの非極性界面活性剤Polysorbate 80（商標）、および65 % w/vのポリエチレングリコール300を含む無水エタノールの溶液である。このような共溶媒系の割合は、それらの溶解性および毒性特性を著しく変化させずにかなり変更してもよい。さらに、共溶媒成分の属性は、以下のように変更してもよい：例えば、Polysorbate 80（商標）の代わりに他の界面活性剤を用いてもよく；ポリエチレングリコールの分画サイズを変更してもよく；ポリエチレングリコールの代わりに、例えば、ポリビニルピロリドンといった他の生体適合性ポリマーを用いてもよく；デキストロースの代わりに他の糖類または多糖類を用いてもよい。

10

【0238】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物を含む薬剤は、持続放出系を含む。このような持続放出系の非限定的な例は、固体の疎水性ポリマーの半透過性マトリックスである。特定の実施形態において、持続放出系は、それらの化学的性質に応じて、数時間、数日、数週間または数ヶ月の期間にわたって化合物を放出し得る。

【0239】

本発明の実施形態の薬剤に用いられる特定の化合物は、薬学的に適合する対イオンとの医薬的に許容される塩として提供され得る。薬学的に適合する塩は、限定はされないが、塩酸、硫酸、酢酸、乳酸、酒石酸、リンゴ酸、コハク酸などを含む多くの酸とともに形成され得る。

20

【0240】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物を含む薬剤は、治療的に有効な量の活性成分を含む。特定の実施形態において、治療的に有効な量は、疾患の症状を予防、緩和または改善し、あるいは治療される被験体の生存期間を延長するのに十分な量である。治療的に有効な量の決定は、十分、当業者の能力の範囲内である。

【0241】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物を含む薬剤は、プロドラッグとして製剤化される。特定の実施形態において、プロドラッグは、対応する活性形態より投与するのが容易であるため有用である。例えば、場合によっては、プロドラッグは、対応する活性形態よりバイオアベイラビリティが高いことがある（例えば、経口投与による場合）。場合によっては、プロドラッグは、対応する活性形態と比較して改善された溶解性を有し得る。特定の実施形態において、プロドラッグはエステルである。特定の実施形態において、このようなプロドラッグは、対応する活性形態より水溶性が低い。場合によっては、このようなプロドラッグは、水溶性が移動に不利である細胞膜の透過が優れている。特定の実施形態において、このようなプロドラッグのエステルは、代謝により加水分解されてカルボン酸になる。場合によっては、カルボン酸含有化合物は、対応する活性形態である。特定の実施形態において、プロドラッグは、酸基に結合される短ペプチド（ポリアミノ酸）を含む。このような実施形態のいくつかにおいて、ペプチドは、代謝されて、対応する活性形態が形成される。

30

40

【0242】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物を含む薬剤は、哺乳類、特にヒト患者の病態または障害を治療するのに有用である。好適な投与経路には、限定はされないが、経口、直腸、経粘膜、腸管、経腸、局所、坐薬、吸入による投与、くも膜下腔内、脳室内、腹腔内、鼻腔内、眼内および非経口（例えば、静脈内、筋肉内、髄内、および皮下）が含まれる。特定の実施形態において、くも膜下腔内投与用の薬剤（pharmaceutical intrathecal）は、全身暴露ではなく局所暴露を行うために投与される。例えば、薬剤は、効果が望まれる領域（例えば、腎臓領域または心臓領域）に直接注射され得る。

50

【0243】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物を含む薬剤は、投薬単位（例えば、錠剤、カプセル剤、ボラスなど）の形態で投与される。特定の実施形態において、このような投薬単位は、体重1kg当たり約1μgから体重1kg当たり約50mgの用量で選択的HGF調節剤を含む。特定の実施形態において、このような投薬単位は、体重1kg当たり約2μgから体重1kg当たり約25mgの用量で選択的HGF調節剤を含む。特定の実施形態において、このような投薬単位は、体重1kg当たり約10μgから体重1kg当たり約5mgの用量で選択的HGF調節剤を含む。特定の実施形態において、薬剤は、必要に応じて、1日に1回、1日に2回、1日に3回、または1日に4回以上投与される。具体的な投与量、頻度、および投与期間が、限定はされないが、所望の生物学的活性、患者の病態、および薬剤に対する耐容性を含むいくつかの因子に左右されることが当業者によって認識される。

10

【0244】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の化合物を含む薬剤は、経口投与用に調製される。このような実施形態のいくつかにおいて、薬剤は、本発明の実施形態の1つ以上の化合物を、1つ以上の医薬的に許容される担体と組み合わせることによって製剤化される。このような担体のいくつかにより、本発明の実施形態の化合物を、患者による経口摂取用の、錠剤、丸薬、糖衣錠、カプセル剤、液体、ゲル、シロップ、スラリー、懸濁剤などとして製剤化することができる。特定の実施形態において、経口用の薬剤は、本発明の実施形態の1つ以上の化合物と1つ以上の固体賦形剤とを混合することによって得られる。好適な賦形剤には、限定はされないが、ラクトース、スクロース、マンニトール、またはソルビトールを含む糖類などの増量剤；例えば、トウモロコシでんぷん、コムギでんぷん、コメでんぷん、ジャガイモデンプン、ゼラチン、トラガカントゴム、メチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースナトリウム、および／またはポリビニルピロリドン（PVP）などのセルロース調製物が含まれる。特定の実施形態において、このような混合物は、任意に粉碎され、助剤が任意に添加される。特定の実施形態において、薬剤は、錠剤または糖衣錠コア（*dragee core*）を得るために形成される。特定の実施形態において、崩壊剤（例えば、架橋ポリビニルピロリドン、寒天、あるいはアルギン酸またはアルギン酸ナトリウムなどのアルギン酸塩）が添加される。

20

30

【0245】

特定の実施形態において、糖衣錠コアにはコーティングが施される。このような実施形態のいくつかにおいて、濃縮された糖溶液が用いられてもよく、この溶液は、アラビアゴム、タルク、ポリビニルピロリドン、カーボポール（*carbopol*）ゲル、ポリエチレングリコール、および／または二酸化チタン、ラッカー溶液、および好適な有機溶媒または溶媒混合物を任意に含有してもよい。染料または色素が、錠剤または糖衣錠コーティングに添加されていてもよい。

【0246】

特定の実施形態において、経口投与用の薬剤は、ゼラチンで作製される押し込み式カプセル剤である。このような押し込み式カプセル剤のいくつかは、1つ以上の、ラクトースなどの増量剤、でんぷんなどの結合剤、および／またはタルクまたはステアリン酸マグネシウムなどの潤滑剤および任意に安定剤と混合される、本発明の実施形態の1つ以上の化合物を含む。特定の実施形態において、経口投与用の薬剤は、ゼラチンと、グリセロールまたはソルビトールなどの可塑剤とで作製される封入された軟カプセル剤である。特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物が、脂肪油、液体パラフィン、または液体ポリエチレングリコールなどの好適な液体に溶解または懸濁される。さらに、安定剤が添加されていてもよい。

40

【0247】

特定の実施形態において、薬剤は、口腔投与用に調製される。このような薬剤のいくつかは、従来の方法で製剤化される錠剤またはトローチ剤である。

50

【0248】

特定の実施形態において、薬剤は、注射による投与（例えば、静脈内、皮下、筋肉内など）用に調製される。このような実施形態のいくつかにおいて、薬剤は、担体を含み、水あるいはハanks液、リンゲル液、または生理食塩水緩衝液などの生理学的に適合する緩衝液などの水溶液中で製剤化される。特定の実施形態において、他の成分が含まれる（例えば、溶解性を助け、または保存料として働く成分）。特定の実施形態において、注射用懸濁剤は、適切な液体担体、懸濁化剤などを用いて調製される。特定の注射用薬剤は、例えば、アンプルまたは複数回投与用容器中の単位剤形で提供される。特定の注射用薬剤は、油性または水性媒体中の懸濁剤、溶液または乳剤であり、懸濁化剤、安定剤および／または分散剤などの製剤化剤（*formulatory agent*）を含有してもよい。

注射用薬剤に使用するのに適したいくつかの溶媒には、限定はされないが、親油性溶媒およびゴマ油などの脂肪油、オレイン酸エチルまたはトリグリセリドなどの合成脂肪酸エステル、およびリポソームが含まれる。水性の注射用懸濁剤は、カルボキシメチルセルロースナトリウム、ソルビトール、またはデキストランなどの、懸濁剤の粘度を高める物質を含有してもよい。任意に、このような懸濁剤は、好適な安定剤または高濃度の溶液の調製を可能にするために化合物の溶解性を高める剤も含有してもよい。

10

【0249】

特定の実施形態において、薬剤は、経粘膜投与用に調製される。このような実施形態のいくつかにおいて、透過されるべき障壁に適した浸透剤が、製剤に用いられる。このような浸透剤は、一般に、当該技術分野で公知である。

20

【0250】

特定の実施形態において、薬剤は、吸入による投与用に調製される。このような吸入用の薬剤のいくつかは、加圧パック（*pressurized pack*）または噴霧器中のエアロゾルスプレーの形態で調製される。このような薬剤のいくつかは、噴射剤、例えば、ジクロロジフルオロメタン、トリクロロフルオロメタン、ジクロロテトラフルオロエタン、二酸化炭素または他の好適なガスを含む。加圧エアロゾルを用いた特定の実施形態において、投薬単位は、一定量を供給する弁によって決定され得る。特定の実施形態において、吸入具または吸入器に使用するためのカプセル剤およびカートリッジが、製剤化されていてもよい。このような製剤のいくつかは、本発明の実施形態の化合物とラクトースまたはでんぷんなどの好適な粉末基剤との粉末混合物を含む。

30

【0251】

特定の実施形態において、薬剤は、坐薬または停留かん腸など、直腸投与用に調製される。このような薬剤のいくつかは、ココアバターおよび／または他のグリセリドなどの公知の成分を含む。

【0252】

特定の実施形態において、薬剤は、局所投与用に調製される。このような薬剤のいくつかは、軟膏またはクリームなどの刺激の少ない保湿基剤を含む。例示的な好適な軟膏基剤には、限定はされないが、ワセリン、ワセリンに揮発性シリコーンを加えたもの、ラノリンおよびBeiersdorf（Cincinnati, Ohio）から入手可能なEucerin（商標）などの油中水型乳剤が含まれる。例示的な好適なクリーム基剤には、限定はされないが、Beiersdorf（Cincinnati, Ohio）から入手可能なNivea（商標）Cream、コールドクリーム（USP）、Johnson & Johnson（New Brunswick, New Jersey）から入手可能なPurpose Cream（商標）、親水軟膏（USP）およびPfizer（Morris Plains, New Jersey）から入手可能なLubriderm（商標）が含まれる。

40

【0253】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の薬剤の製剤化、投与経路および用量は、具体的な患者の病態を考慮して選択することができる。（例えば、全体が参照により本明細書に援用されるFinglet al. 1975、「The Pharmacolo

50

gical Basis of Therapeutics」、Ch. 1、p. 1を参照されたい)。特定の実施形態において、薬剤は、単回投薬として投与される。特定の実施形態において、薬剤は、1日以上にわたって投与される2回以上の一連の投薬として投与される。

【0254】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の薬剤は、確立されたヒト投与量の約0.1%～500%、5%～200%、10%～100%、15%～85%、25%～75%、または40%～60%で患者に投与される。ヒト投与量が確立されていない場合、好適なヒト投与量は、ED₅₀またはID₅₀値、あるいはインビトロ (in vitro) またはインビボ (in vivo) 試験から得られる他の適切な値から推定され得る。

10

【0255】

特定の実施形態において、患者のための1日当たりの投薬計画は、0.1mg～2000mg、5mg～1500mg、10mg～1000mg、20mg～500mg、30mg～200mg、または40mg～100mgの本発明の実施形態の化合物の経口用量を含む。特定の実施形態において、1日当たりの投薬計画は、1日当たりの単回投薬量として投与される。特定の実施形態において、1日当たりの投薬計画は、2回、3回、4回、または5回以上の投薬として投与される。

【0256】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の薬剤は、連続の静脈内注射によって投与される。このような実施形態のいくつかにおいて、1日当たり0.1mg～500mgの本発明の実施形態の組成物が投与される。

20

【0257】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の薬剤は、連続治療の期間にわたって投与される。例えば、本発明の実施形態の薬剤は、数日、数週間、数ヶ月、または数年の期間にわたって投与され得る。

【0258】

投与量、投与間隔、および治療期間は、所望の効果が得られるように調節され得る。特定の実施形態において、投与量および投与間隔は、患者における化合物の所望の濃度を保つように調節される。例えば、特定の実施形態において、投与量および投与間隔は、所望の効果をj得るのに十分な量で本発明の実施形態の化合物の血漿濃度を与えるように調節される。このような実施形態のいくつかにおいて、血漿濃度は、最小有効濃度 (MEC) より高い濃度に保たれる。特定の実施形態において、本発明の実施形態の薬剤は、10～90%の時間、30～90%の時間、または50～90%の時間にわたって、MECより高い濃度を保つように設計された投薬計画によって投与される。

30

【0259】

薬剤が局所的に投与される特定の実施形態において、投薬計画は、本発明の実施形態の化合物の所望の局所濃度が得られるように調節される。

【0260】

特定の実施形態において、薬剤は、活性成分を含有する1つ以上の単位剤形を含有し得るパックまたはディスペンサー装置中に提供され得る。パックは、例えば、金属箔またはプラスチック箔 (ブリスターパックなど) を含み得る。パックまたはディスペンサー装置には、投与の説明書が添付されていることがある。パックまたはディスペンサーには、医薬品の製造、使用、または販売を規制する政府機関によって規定された形態で容器に付随する注意書きが添付されていることもあり、この注意書きは、ヒトまたは動物投与用の薬剤の形態の、上記機関による承認を反映している。このような注意書きは、例えば、処方薬のために米国食品医薬品局 (the U. S. Food and Drug Administration) によって承認された表示、または承認された製品の添付文書であり得る。適合する医薬担体中で製剤化された本発明の実施形態の化合物を含む組成物を、適応症 (indicated condition) の治療のために、調製し、適切な容器に入れ、表示を付けることもできる。

40

50

【0261】

特定の実施形態において、薬剤は、好適な媒体、例えば、発熱性物質除去滅菌水とともに構成するため、使用前は、粉末形態である。

【0262】

特定の併用療法

特定の実施形態において、本発明の実施形態の1種以上の薬剤は、1種以上の他の薬剤と共投与される。特定の実施形態において、このような1種以上の他の薬剤は、本発明の実施形態の1種以上の薬剤と同じ疾患または病態を治療するように設計される。特定の実施形態において、このような1種以上の他の薬剤は、本発明の実施形態の1種以上の薬剤と異なる疾患または病態を治療するように設計される。特定の実施形態において、このよ
10
うな1種以上の他の薬剤は、本発明の実施形態の1種以上の薬剤の好ましくない作用を治療するように設計される。特定の実施形態において、本発明の実施形態の1種以上の薬剤は、該当する他の薬剤の好ましくない作用を治療するために、別の薬剤と共投与される。特定の実施形態において、本発明の実施形態の1種以上の薬剤および1種以上の他の薬剤は、同時に投与される。特定の実施形態において、本発明の実施形態の1種以上の薬剤および1種以上の他の薬剤は、異なる時間に投与される。特定の実施形態において、本発明の実施形態の1種以上の薬剤および1種以上の他の薬剤は、単一の製剤中で一緒に調製される。特定の実施形態において、本発明の実施形態の1種以上の薬剤および1種以上の他の薬剤は、別々に調製される。

【0263】

本発明の実施形態の薬剤と共投与され得る薬剤の例には、限定はされないが、化学療法および放射線治療を含む抗癌治療；限定はされないが、プレドニゾンを含むコルチコステロイド；限定はされないが、静脈注射用免疫グロブリン（IVIg）を含む免疫グロブリン；鎮痛薬（例えば、アセトアミノフェン）；限定はされないが、非ステロイド系抗炎症薬（例えば、イブプロフェン、COX-1阻害剤、およびCOX-2阻害剤）を含む抗炎症薬；サリチル酸塩；抗生物質；抗ウイルス剤；抗真菌剤；抗糖尿病薬（例えば、ビッグアニド、グルコシダーゼ阻害剤、インスリン、スルホニル尿素、およびチアゾリデンジオン（thiazolidenedione））；アドレナリン調節剤（adrenergic modifier）；利尿薬；ホルモン（例えば、アナボリックステロイド、アンドロゲン、エストロゲン、カルシトニン、プロゲステロン、ソマトスタチン、および甲状腺ホル
30
モン）；免疫調節剤；筋弛緩薬；抗ヒスタミン剤；骨粗鬆症薬（例えば、ビスホスホネート、カルシトニン、およびエストロゲン）；プロスタグランジン、抗腫瘍薬；精神治療薬；鎮静剤；ウルシ（poison oak）またはドクウルシ（poison sumac）製品；抗体；およびワクチンが含まれるがこれらに限定されない。

【0264】

特定の適応症

特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物を投与することの特徴とする、患者の治療方法が提供される。特定の実施形態において、このような患者は、血小板減少症に罹患している。特定のこのような実施形態において、血小板減少症は、化学療法および／または放射線治療に起因する。特定の実施形態において、血小板減少症は、
40
骨髄移植および／または再生不良性貧血によって生じる骨髄不全に起因する。特定の実施形態において、血小板減少症は特発性である。特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物は、末梢血前駆細胞の採取と併せて、および／または血小板アフェレーシスと併せて、患者に投与される。このような投与は、このような採取の前、その間、および／またはその後に行われ得る。

【0265】

特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物は、限定はされないが、神経系を侵す疾患および神経系の損傷を含む、神経系を侵す病態に罹患している患者に投与される。このような疾患には、限定はされないが、筋萎縮性側索硬化症、多発性硬化症、および多発性ジストロフィーが含まれる。神経系の損傷には、限定はされないが、外
50

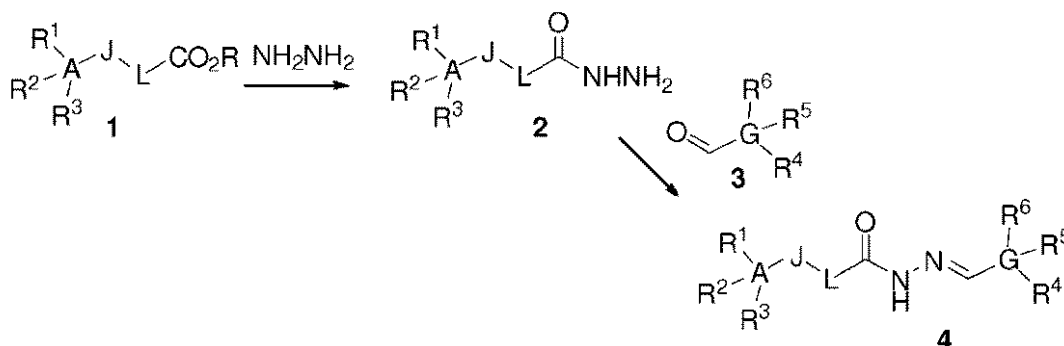
傷または脳卒中に起因する損傷を含む、脊髓損傷または末梢神経損傷が含まれるがこれらに限定されない。特定の実施形態において、本発明の実施形態の1つ以上の化合物は、グリア細胞の増殖および／または成長を促進するのに用いられる。このようなグリア細胞は、神経細胞を修復し得る。特定の実施形態において、本発明の実施形態の化合物は、限定はされないが、認知障害を含む精神的疾患を治療するのに用いられる。

【0266】

特定の合成方法

スキーム I

【化132】



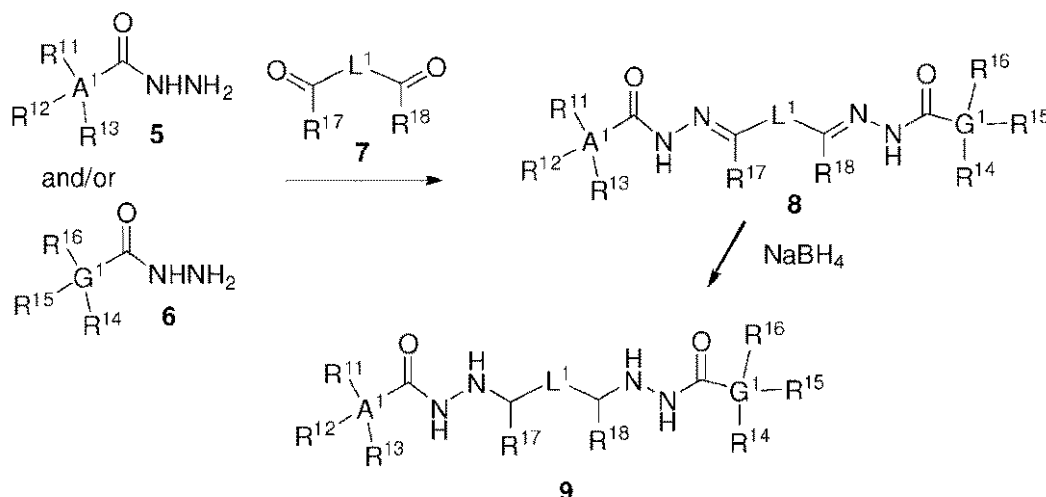
10

スキーム I のプロセスは、式 I で表される一般構造 4 の化合物の一般的合成を表し、式中、Rが、C₁ ~ C₆ アルキル、アリールなどであり得る。ヒドラジンによる一般構造 1 のエステル誘導体の処理により、一般構造 2 のヒドラジド誘導体を得られる。一般構造 2 の中間体は、一般構造 3 のアルデヒドと縮合されて、一般構造 4 の化合物が生成される。

20

スキーム I I

【化133】



30

【0267】

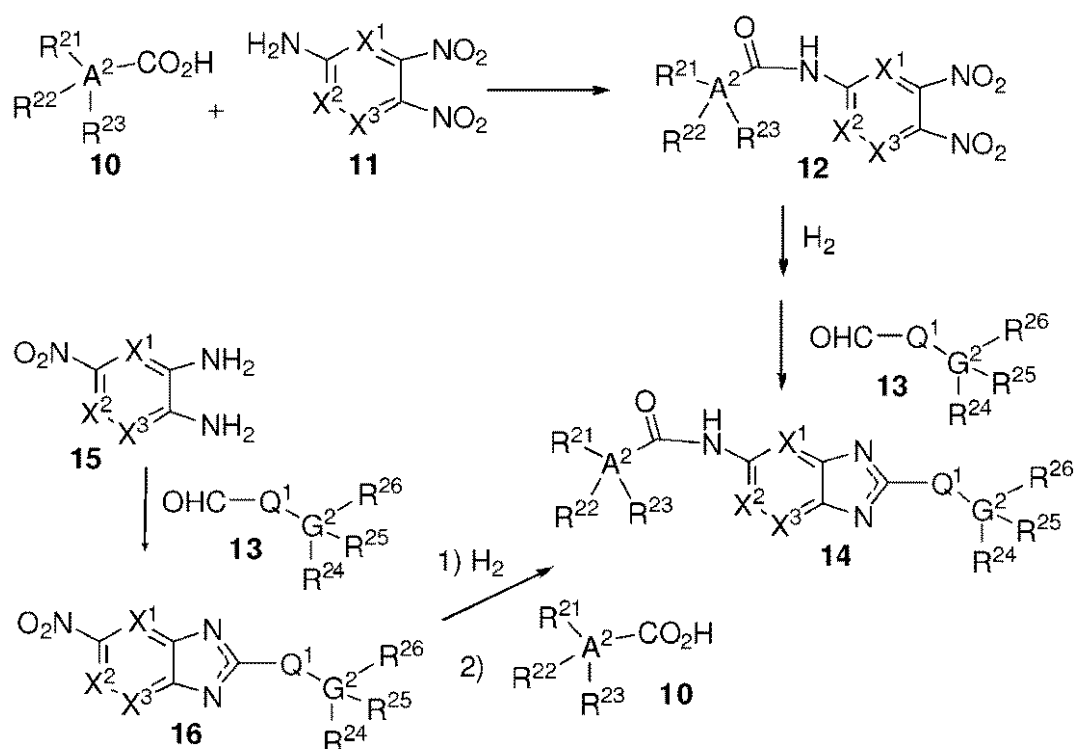
スキーム I I のプロセスは、式 I I の化合物の一般的合成を表す。標準条件下での、一般構造 7 のビスカルボニル化合物と、一般構造 5 または 6 の置換ヒドラジドとの縮合反応により、構造 8 の擬似対称型化合物を得られる。あるいは、一般構造 5 および 6 のヒドラジドが異なる場合、縮合反応を連続して行って、一般構造 8 の化合物を得ることができる。一般構造 9 の化合物は、一般構造 8 の化合物の標準的な還元によって得ることができる。例えば、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、シアノ水素化ホウ素ナトリウム、トリシアミル水素化ホウ素カリウム、水素化トリセーブチルホウ素カリウム、トリシアミル水素化ホウ素リチウム、水素化トリセーブチルホウ素リチウム、水素化ジイソブチルアルミニウム、水素化トリエトキシアルミニウムリチウムなどの還元剤を還元剤に用いることができる。

40

50

スキーム I I I

【化 1 3 4】



10

20

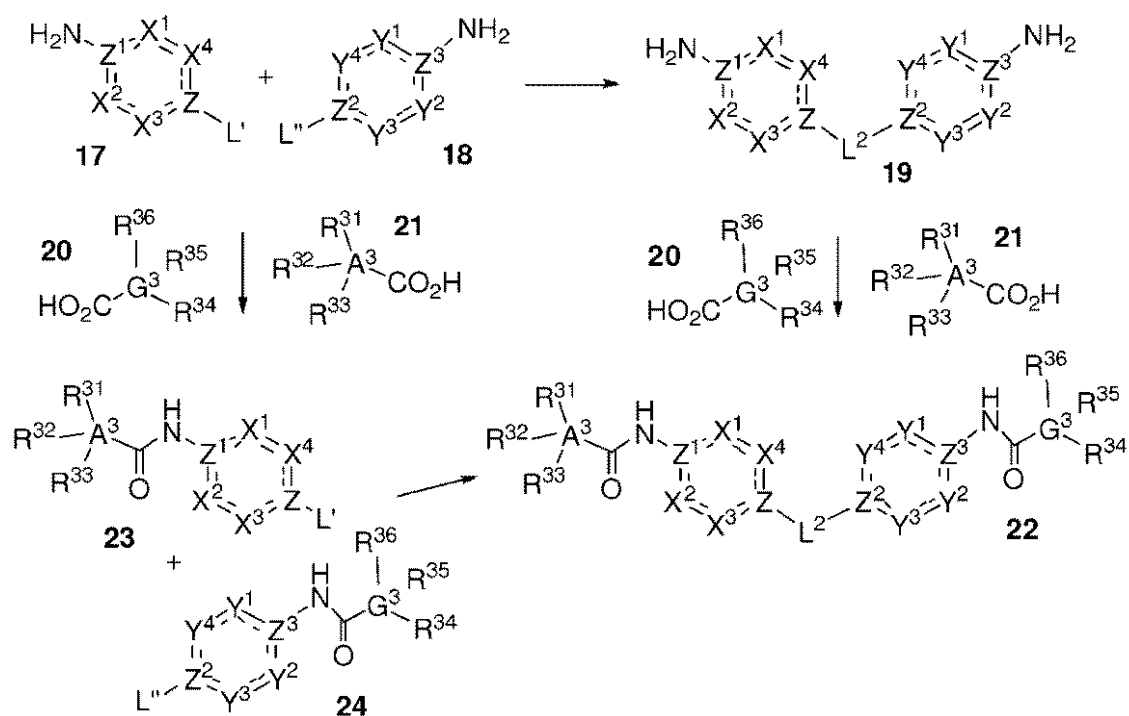
【0 2 6 8】

スキーム I I I のプロセスは、式 I I I の化合物の一般的合成を表す。標準条件下での、構造 10 の酸誘導体と、構造 11 のアミノ誘導体とのカップリングにより、構造 12 のアミド中間体得られる。構造 12 の 2 つのニトロ基が、金属で触媒される水素化などの典型的な還元条件下で還元されて、ジアミノ中間体得られ、次に、この中間体は、酸化条件下で構造 13 のアルデヒドと縮合されて、構造 14 の所望の化合物得られる。あるいは、構造 10 の化合物は、構造 15 のジアミノ誘導体から調製することができる。酸化条件下での、構造 15 の化合物と、構造 13 の化合物との縮合反応により、構造 16 の中

30

スキーム I V

【化 1 3 5】



10

20

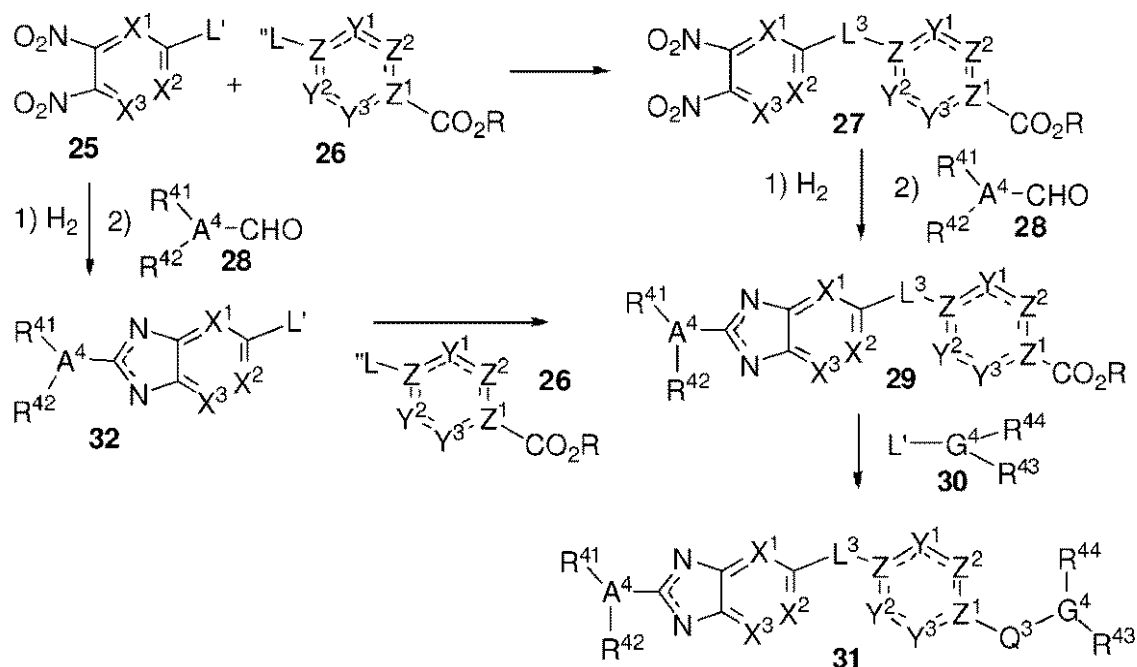
【0 2 6 9】

スキーム I V のプロセスは、式 I V の化合物の一般的合成を表す。置換基 L' および L'' の性質に基づいた、標準条件下での、構造 17 の化合物と、構造 18 の化合物とのカップリング反応により、構造 19 の中間体を得られる。構造 20 および 21 の化合物と、構造 19 の中間体とのアミド形成反応により、構造 22 の生成物を得られる。あるいは、特に、異なる環または側鎖を有する構造 22 の化合物の場合、構造 22 の化合物は、異なるカップリング法によって調製することができる。構造 17 および 21 の化合物のアミドカップリング反応ならびに構造 18 および 20 の化合物のアミドカップリング反応により、構造 23 および 24 の別個の中間体が生成される。次に、構造 23 および 24 の中間体はカップリングされて、構造 22 の最終化合物が形成される。

スキーム V

30

【化 1 3 6】



【0 2 7 0】

スキーム V のプロセスは、式 V の化合物の一般的合成を表す。構造 25 および 26 の化合物の一般的なカップリング反応により、構造 27 の中間体が得られる。金属で触媒される水素化などの、還元剤による構造 27 の中間体の還元と、その後の構造 28 の化合物との酸化縮合により、構造 29 の中間体が得られる。構造 29 の酸誘導体が、構造 30 の化合物とカップリングされて、構造 31 の最終生成物が得られる。あるいは、構造 25 の化合物が、還元され、アルデヒド 28 とカップリングされて、構造 32 の二環式イミダゾール誘導体を得ることができる。構造 32 および 26 の化合物のカップリング反応により、構造 29 の同じ中間体が得られる。

【実施例】

【0 2 7 1】

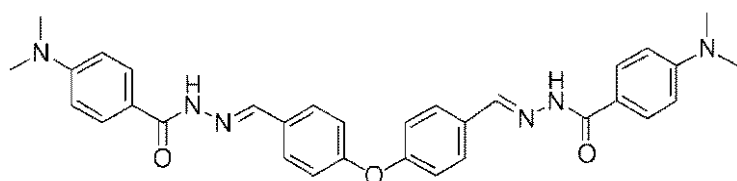
以下の実施例は、あくまでも実施形態の理解を助けるために記載されるものであり、本明細書に記載され、権利請求される実施形態を限定するものと決して解釈されるべきではない。当業者の知識の範囲内であり得る、現在公知でないかまたは将来開発される全ての均等物の置き換えを含む本発明の変形、および配合の変更または実験計画の細部の変更は、本明細書に組み込まれる本発明の範囲内にあるものとみなされるべきである。

【0 2 7 2】

実施例 1

(N', N' ' ' E, N', N' ' ' E) - N', N' ' ' - ((オキシビス(4, 1-フェニレン))ビス(メタニリリデン(methanylylidene)))ビス(4-(ジメチルアミノ)ベンゾヒドラジド) (化合物 101)

【化 1 3 7】



スキーム II に表される手順にしたがって化合物 101 を調製した。3 mL のエタノール中の 4, 4' - オキシビスベンズアルデヒド (Aldrich、42 mg、0.186

mmol) および 4-ジメチルアミノベンゾヒドラジド (dimethylaminobenzohydrazide) (Alfa Aesar、73mg、0.408mmol) の溶液に、3 滴の酢酸を添加した。反応物を 12 時間にわたって 60℃まで加熱し、室温まで冷まし、ろ過した。白色の沈殿物を水 (5mL) で洗浄した後メタノール (5mL) で洗浄し、減圧下で乾燥させて、55mg の化合物 101 を白色粉末として得た。[M+H]⁺ C₃₂H₃₃N₆O₃ についての計算値：549.26；実測値：549.05。

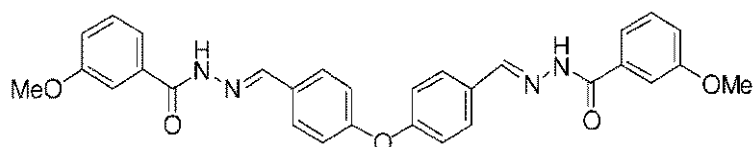
【0273】

実施例 2

(N', N''', E, N', N''', E) - N', N''' - ((オキシビス(4, 1-フェニレン))ビス(メタニリリデン))ビス(3-メトキシベンゾヒドラジド) (化合物 102)

10

【化138】



スキーム II に表される手順にしたがって、4, 4'-オキシビスベンズアルデヒドおよび 3-メトキシベンズエートから化合物 102 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₆N₄O₅ についての計算値：523.20；実測値：513.15。

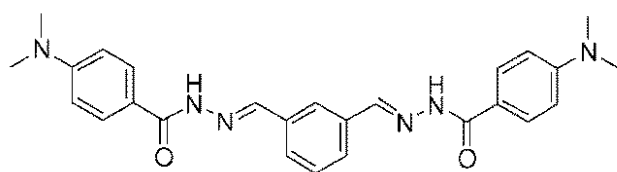
20

【0274】

実施例 3

(N', N''', E, N', N''', E) - N', N''' - (1, 3-フェニレンビス(メタニリリデン))ビス(4-(ジメチルアミノ)ベンゾヒドラジド) (化合物 103)

【化139】



30

スキーム II に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアレヒドおよび 4-ジメチルアミノベンズエートから化合物 103 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₈N₆O₂ についての計算値：457.23；実測値：457.01。

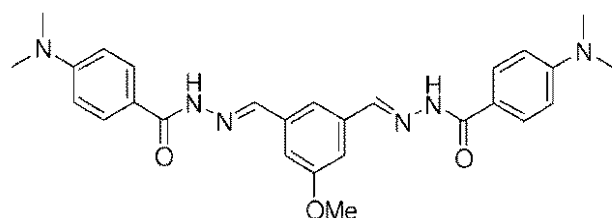
【0275】

実施例 4

(N', N''', E, N', N''', E) - N', N''' - ((5-メトキシ-1, 3-フェニレン)ビス(メタニリリデン))ビス(4-(ジメチルアミノ)ベンゾヒドラジド) (化合物 104)

40

【化140】



50

スキーム I I に表される手順にしたがって、5-5-メトキシベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物104を調製した。¹H NMR (300 MHz, DMSO-d₆) δ 11.62 (s, 2H)、8.41 (s, 2H)、7.81 (d, J=7.5 Hz, 4H)、7.60 (s, 1H)、7.26 (d, J=3 Hz, 2H)、6.76 (d, J=7.5 Hz, 4H)、3.84 (s, 3H)、2.99 (s, 12H)。

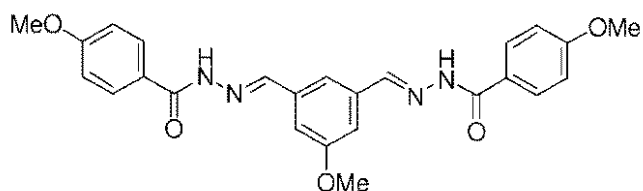
【0276】

実施例5

(N', N''', E, N', N''', E)-N', N'''-(5-メトキシ-1, 3-フェニレン)ビス(メタニリリデン)ビス(4-メトキシベンゾヒドラジド) (化合物105)

10

【化141】



スキーム I I に表される手順にしたがって、5-5-メトキシベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-メトキシベンゾエートから化合物105を調製した。[M + H]⁺ C₂₅H₂₄N₄O₅ についての計算値: 461.18; 実測値: 461.00。

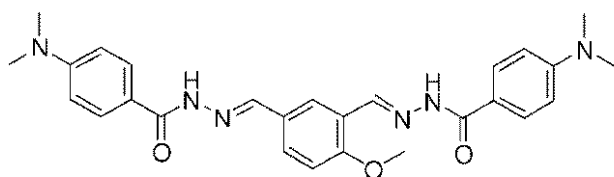
20

【0277】

実施例6

(N', N''', E, N', N''', E)-N', N'''-(4-メトキシ-1, 3-フェニレン)ビス(メタニリリデン)ビス(4-(ジメチルアミノ)ベンゾヒドラジド) (化合物106)

【化142】



30

スキーム I I に表される手順にしたがって、4-4-メトキシベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物106を調製した。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 11.72 (s, 1H)、11.58 (s, 1H)、8.88 (s, 1H)、8.51 (s, 1H)、8.33 (s, 1H)、7.94 (dd, J=7.5, 1.5 Hz, 4H)、7.80 (d, J=7.5 Hz, 1H)、7.29 (d, J=7.5 Hz, 1H)、6.86 (d, J=7.5 Hz, 4H)、4.10 (s, 3H)、3.10 (s, 12H)。

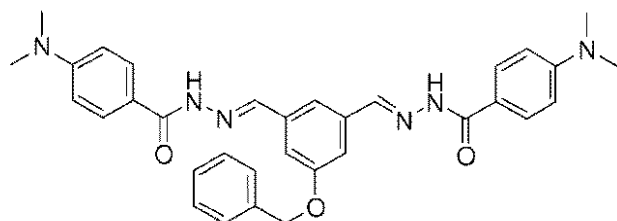
40

【0278】

実施例7

(N', N''', E, N', N''', E)-N', N'''-(5-(ベンジルオキシ)-1, 3-フェニレン)ビス(メタニリリデン)ビス(4-(ジメチルアミノ)ベンゾヒドラジド) (化合物107)

【化 1 4 3】



スキーム I I に表される手順にしたがって、5-5-ベンジルオキシベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 1 0 7 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₅N₆O₃ についての計算値：563.28；実測値：563.08。

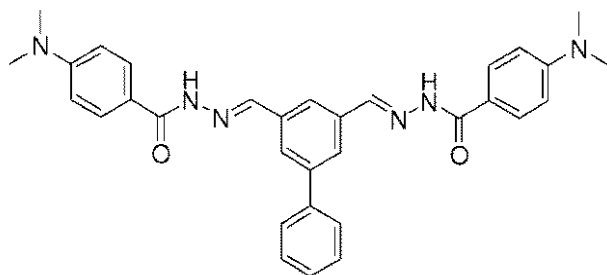
10

【0279】

実施例 8

2 (N', N', N', E, N', N', N', E) - N', N', N' - ([1, 1'-ビフェニル] - 3, 5-ジイルピス (メタニリリデン)) ビス (4- (ジメチルアミノ) ベンゾヒドラジド) (化合物 1 0 8)

【化 1 4 4】



20

スキーム I I に表される手順にしたがって、5-フェニルベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 1 0 8 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₂N₆O₂ についての計算値：533.26；実測値：533.08。

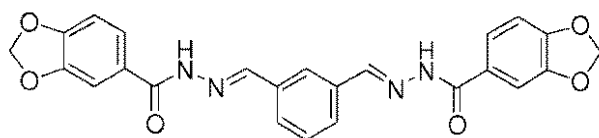
30

【0280】

実施例 9

(N', N', N', E, N', N', N', E) - N', N', N' - (1, 3-フェニレンピス (メタニリリデン)) ビス (ベンゾ [d] [1, 3] ジオキソール-5-カルボヒドラジド) (化合物 1 0 9)

【化 1 4 5】



40

スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび5- (1, 3-ジオキサラノ) ベンゾエートから化合物 1 0 9 を調製した。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 11.88 (s, 2H)、8.58 (s, 2H)、8.19 (s, 1H)、7.85 (d, J=6.3 Hz, 2H)、7.64 (m, 3H)、7.56 (s, 2H)、7.17 (d, J=6 Hz, 2H)、6.22 (s, 4H)。

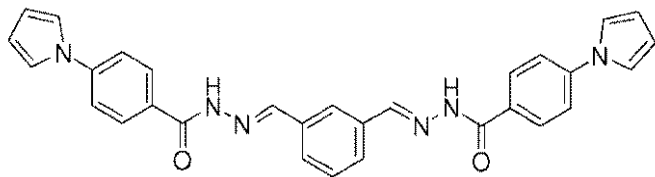
【0281】

実施例 10

50

(N', N''', E, N', N''', E) - N', N''' - (1, 3-フェニレンビス(メタニリリデン))ビス(4-(1H-ピロール-1-イル)ベンゾヒドラジド) (化合物110)

【化146】



10

スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-ピロールベンゾエートから化合物110を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 12.15 (s, 2H)、8.63 (s, 2H)、8.24 (s, 1H)、8.13 (d, J=7.5 Hz、4H)、7.89 (d, J=7.5 Hz、6H)、7.64 (m, 5H)、6.43 (s, 4H)。

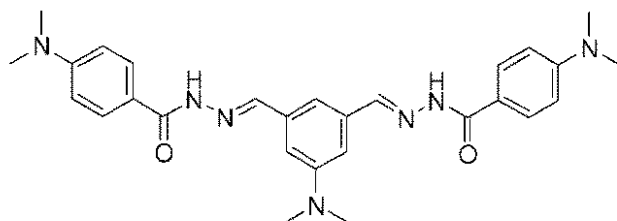
【0282】

実施例11

(N', N''', E, N', N''', E) - N', N''' - ((5-(ジメチルアミノ)-1, 3-フェニレン)ビス(メタニリリデン))ビス(4-(ジメチルアミノ)ベンゾヒドラジド) (化合物111)

20

【化147】



スキーム I I に表される手順にしたがって、5-ジメチルアミノベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物111を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₃₃N₇O₂ についての計算値: 500.27; 実測値: 500.07。

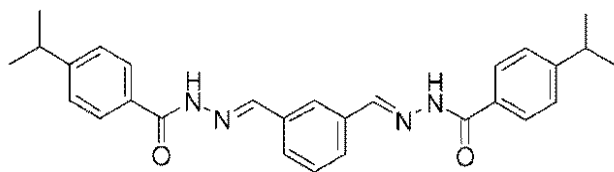
30

【0283】

実施例12

(N', N''', E, N', N''', E) - N', N''' - (1, 3-フェニレンビス(メタニリリデン))ビス(4-イソプロピルベンゾヒドラジド) (化合物112)

【化148】



40

スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-イソプロピルベンゾエートから化合物112を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 11.9 (s, 2H)、8.51 (s, 2H)、8.12 (s, 1H)、7.87 (d, J=8.1 Hz、4H)、7.77 (d, J=7.3 Hz、2H)、7.56 (dd, J=7.3、7.3 Hz、1H)、7.42 (d, J=8.1 Hz、4H)、3.01~2.96 (m, 2H)、1.25 (d, J=6.8 Hz、12H)。

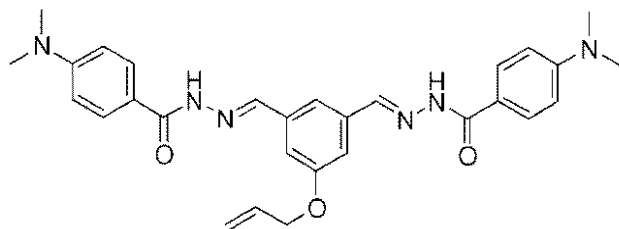
50

【0284】

実施例 13

(N', N', N', E, N', N', N', E) - N', N', N' - ((5 - (アリルオキシ) - 1, 3 - フェニレン) ビス (メタニリリデン)) ビス (4 - (ジメチルアミノ) ベンゾヒドラジド) (化合物 113)

【化149】



10

スキーム I I に表される手順にしたがって、5 - アリルオキシベンゼン - 1, 3 - ジカルボキシアルデヒドおよび 4 - ジメチルアミノベンゾエートから化合物 113 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₂N₆O₃ についての計算値: 513.26; 実測値: 513.10。

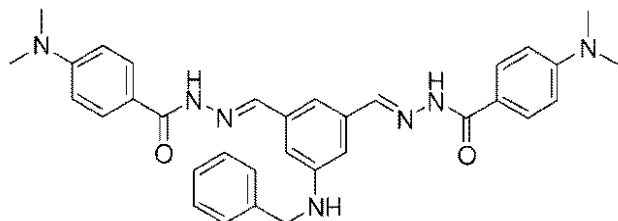
【0285】

実施例 14

(N', N', N', E, N', N', N', E) - N', N', N' - ((5 - (ベンジルアミノ) - 1, 3 - フェニレン) ビス (メタニリリデン)) ビス (4 - (ジメチルアミノ) ベンゾヒドラジド) (化合物 114)

20

【化150】



30

スキーム I I に表される手順にしたがって、5 - ベンジルアミノベンゼン - 1, 3 - ジカルボキシアルデヒドおよび 4 - ジメチルアミノベンゾエートから化合物 114 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₅N₇O₂ についての計算値: 562.29; 実測値: 562.17。

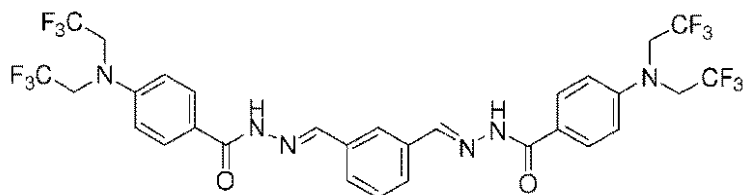
【0286】

実施例 15

(N', N', N', E, N', N', N', E) - N', N', N' - (1, 3 - フェニレンビス (メタニリリデン)) ビス (4 - (ビス (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) アミノ) ベンゾヒドラジド) (化合物 115)

【化151】

40



スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン - 1, 3 - ジカルボキシアルデヒドおよび 4 - ジ (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) アミノベンゾエートから化合物 115 を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 11.7 (s, 2H)、8.47 (s, 2H)、8.08 (s, 1H)、7.83 (d, J = 8.3 Hz、4H

50

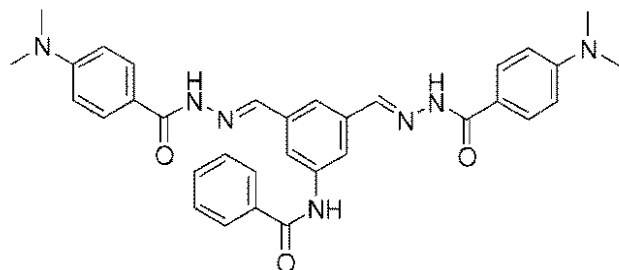
)、7.72 (m, 2H)、7.53 (t, $J=7.8$ Hz、1H)、7.19 (d, $J=7.8$ Hz、4H)、4.49 (q, $J_{H-F}=8.3$ Hz、8H)。

【0287】

実施例16

N-(3, 5-ビス((E)-(2-(4-(ジメチルアミノ)ベンゾイル)ヒドラゾノ)メチル)フェニル)ベンズアミド(化合物116)

【化152】



10

スキームIIに表される手順にしたがって、5-ベンゾイルアミノベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物116を調製した。[M+H]⁺ C₃₅H₃₈N₈O₃についての計算値: 619.31; 実測値: 619.16。

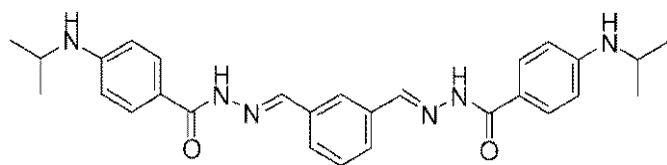
20

【0288】

実施例17

((N', N''', E, N', N''', E)-N', N'''-(1, 3-フェニレンビス(メタニリリデン))ビス(4-(イソプロピルアミノ)ベンゾヒドラジド)(化合物117)

【化153】



30

スキームIIに表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-イソプロピルアミノベンゾエートから化合物117を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 11.52 (s, 2H)、8.45 (s, 2H)、8.04 (s, 1H)、7.74~7.69 (m, 6H)、7.52 (t, $J=7.8$ Hz、1H)、6.61 (d, $J=8.8$ Hz、4H)、6.16 (d, $J=7.8$ Hz、2H)、3.68~3.61 (m, 2H)、1.16 (d, $J=6.3$ Hz、12H)。

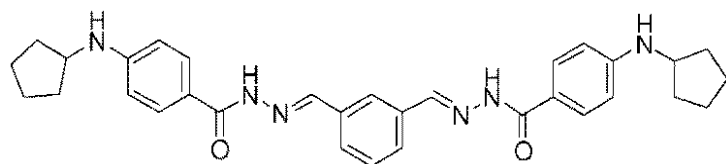
【0289】

実施例18

((N', N''', E, N', N''', E)-N', N'''-(1, 3-フェニレンビス(メタニリリデン))ビス(4-(シクロペンチルアミノ)ベンゾヒドラジド)(化合物118)

40

【化 1 5 4】



スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-シクロペンチルアミノベンゾエートから化合物 1 1 8 を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 11.95 (s, 1H)、7.91 (d, J = 8.9 Hz、1H)、7.17 (d, J = 8.9 Hz、1H)、6.70 (s, 1H)、5.28 (q, J = 9.2 Hz、2H)、3.04 (q, J = 7.3 Hz、2H)、2.44 (s, 3H)、1.09 (t, J = 7.3 Hz、3H)。

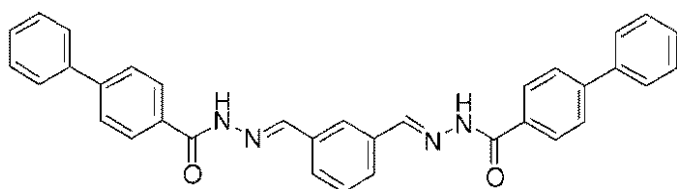
10

【0 2 9 0】

実施例 1 9

(N', N''', E, N', N''', E) - N', N''' - (1, 3-フェニレンビス(メタニリリデン)) ビス(([1, 1'-ビフェニル] - 4-カルボヒドラジド)) (化合物 1 1 9)

【化 1 5 5】



20

スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-フェニルベンゾエートから化合物 1 1 9 を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 11.95 (s, 1H)、7.91 (d, J = 8.9 Hz、1H)、7.17 (d, J = 8.9 Hz、1H)、6.70 (s, 1H)、5.28 (q, J = 9.2 Hz、2H)、3.04 (q, J = 7.3 Hz、2H)、2.44 (s, 3H)、1.09 (t, J = 7.3 Hz、3H)。

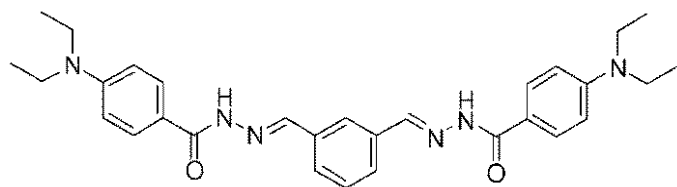
30

【0 2 9 1】

実施例 2 0

(N', N''', E, N', N''', E) - N', N''' - (1, 3-フェニレンビス(メタニリリデン)) ビス(4-(ジエチルアミノ)ベンゾヒドラジド) (化合物 1 2 0)

【化 1 5 6】



40

スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-ジエチルアミノベンゾエートから化合物 1 2 0 を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 11.95 (s, 1H)、7.91 (d, J = 8.9 Hz、1H)、7.17 (d, J = 8.9 Hz、1H)、6.70 (s, 1H)、5.28 (q, J = 9.2 Hz、2H)、3.04 (q, J = 7.3 Hz、2H)、2.44 (s, 3H)、1.09 (t, J = 7.3 Hz、3H)。

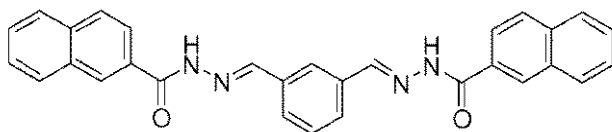
【0 2 9 2】

50

実施例 2 1

(N', N''', E, N', N''', E) - N', N''' - (1, 3-フェニレンビス
(メタニリリデン)) ビス (2-ナフトヒドラジド) (化合物 1 2 1)

【化 1 5 7】



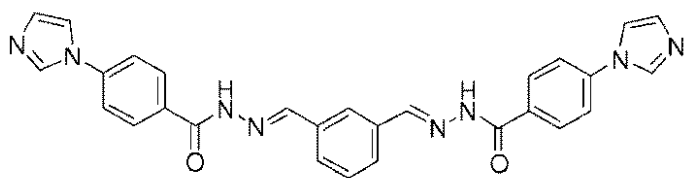
スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 1 2 1 を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 11.95 (s, 1H)、7.91 (d, J=8.9 Hz、1H)、7.17 (d, J=8.9 Hz、1H)、6.70 (s, 1H)、5.28 (q, J=9.2 Hz、2H)、3.04 (q, J=7.3 Hz、2H)、2.44 (s, 3H)、1.09 (t, J=7.3 Hz、3H)。

【0 2 9 3】

実施例 2 2

(N', N''', E, N', N''', E) - N', N''' - (1, 3-フェニレンビス
(メタニリリデン)) ビス (4-(1H-イミダゾール-1-イル) ベンゾヒドラジド)
(化合物 1 2 2)

【化 1 5 8】



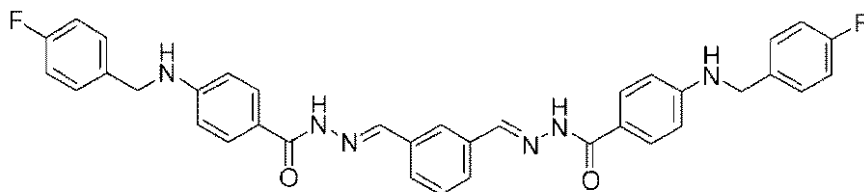
スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-イミダゾールベンゾエートから化合物 1 2 2 を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 12.0 (s, 2H)、8.55 (s, 2H)、8.49 (s, 2H)、8.16 (s, 1H)、8.09 (d, J=8.3 Hz、4H)、7.93 (s, 2H)、7.89 (d, J=7.5 Hz、4H)、7.81 (d, J=7.5 Hz、2H)、7.58 (t, J=7.6 Hz、1H)、7.21 (bs, 2H)。

【0 2 9 4】

実施例 2 3

(N', N''', E, N', N''', E) - N', N''' - (1, 3-フェニレンビス
(メタニリリデン)) ビス (4-(4-フルオロベンジル) アミノ) ベンゾヒドラジド)
(化合物 1 2 3)

【化 1 5 9】



スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-(4-フルオロベンジルアミノ)ベンゾエートから化合物 1 2 3 を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 11.95 (s, 1H)、7.91 (d, J=8.9 Hz、1H)、7.17 (d, J=8.9 Hz、1H)、6.70 (s

10

20

30

40

50

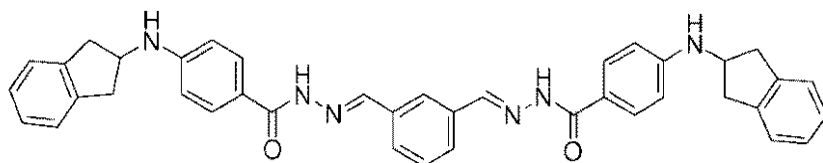
, 1 H)、5. 28 (q, J=9. 2 Hz、2 H)、3. 04 (q, J=7. 3 Hz、2 H)、2. 44 (s, 3 H)、1. 09 (t, J=7. 3 Hz、3 H)。

【0295】

実施例 24

(N', N''', E, N', N''', E) - N', N''' - (1, 3-フェニレンビス(メタニリリデン))ビス(4-(2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イル)アミノ)ベンゾヒドラジド(化合物124)

【化160】



10

スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-(2-インダニルアミノ)ベンゾエートから化合物124を調製した。¹H

NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 11. 95 (s, 1 H)、7. 91 (d, J=8. 9 Hz、1 H)、7. 17 (d, J=8. 9 Hz、1 H)、6. 70 (s, 1 H)、5. 28 (q, J=9. 2 Hz、2 H)、3. 04 (q, J=7. 3 Hz、2 H)、2. 44 (s, 3 H)、1. 09 (t, J=7. 3 Hz、3 H)。

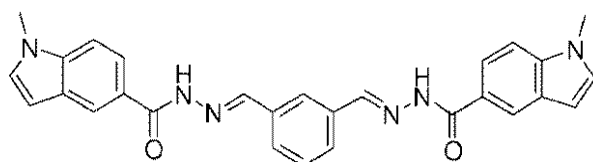
20

【0296】

実施例 25

(N', N''', E, N', N''', E) - N', N''' - (1, 3-フェニレンビス(メタニリリデン))ビス(1-メチル-1H-インドール-5-カルボヒドラジド)(化合物125)

【化161】



30

スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび1-メチル-5-インドールカルボキシレートから化合物125を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₄N₆O₂ についての計算値: 477. 20; 実測値: 477. 06。

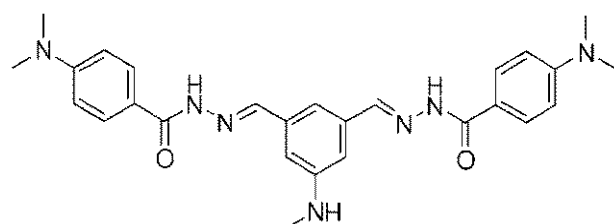
【0297】

実施例 26

(N', N''', E, N', N''', E) - N', N''' - ((5-(メチルアミノ)-1, 3-フェニレン)ビス(メタニリリデン))ビス(4-(ジメチルアミノ)ベンゾヒドラジド)(化合物126)

40

【化162】



スキーム I I に表される手順にしたがって、5-メチルアミノベンゼン-1, 3-ジカ

50

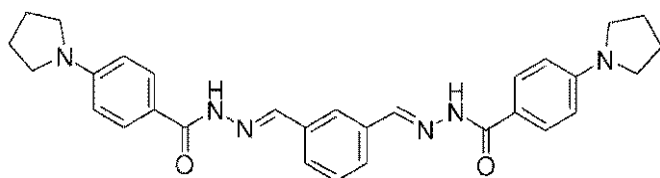
ルボキシアルデヒドおよび 4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 126 を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{27}H_{31}N_7O_2$ についての計算値：486.26；実測値：486.03。

【0298】

実施例 27

(N', N''', E, N', N''', E) - N', N''' - (1, 3-フェニレンビス(メタニリリデン)) ビス(4-(ピロリジン-1-イル)ベンゾヒドラジド) (化合物 127)

【化163】



10

スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび 4-ピロリジンベンゾエートから化合物 127 を調製した。 ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 11.95 (s, 1H)、7.91 (d, $J=8.9$ Hz、1H)、7.17 (d, $J=8.9$ Hz、1H)、6.70 (s, 1H)、5.28 (q, $J=9.2$ Hz、2H)、3.04 (q, $J=7.3$ Hz、2H)、2.44 (s, 3H)、1.09 (t, $J=7.3$ Hz、3H)。

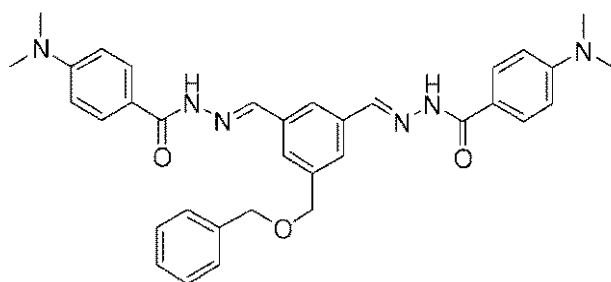
20

【0299】

実施例 28

(N', N''', E, N', N''', E) - N', N''' - ((5-(ベンジルオキシ)メチル)-1, 3-フェニレン) ビス(メタニリリデン) ビス(4-(ジメチルアミノ)ベンゾヒドラジド) (化合物 128)

【化164】



30

スキーム I I に表される手順にしたがって、5-ベンジルオキシメチルベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび 4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 128 を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{34}H_{36}N_6O_3$ についての計算値：577.26；実測値：577.10。

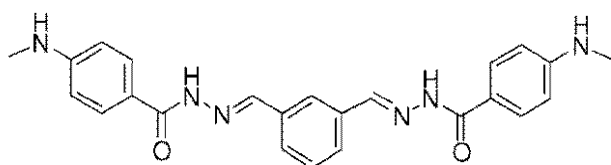
【0300】

40

実施例 29

(N', N''', E, N', N''', E) - N', N''' - (1, 3-フェニレンビス(メタニリリデン)) ビス(4-(メチルアミノ)ベンゾヒドラジド) (化合物 129)

【化165】



50

スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアリドおよび4-メチルアミノベンゾエートから化合物 1 2 9 を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 11.95 (s, 1H)、7.91 (d, J=8.9 Hz、1H)、7.17 (d, J=8.9 Hz、1H)、6.70 (s, 1H)、5.28 (q, J=9.2 Hz、2H)、3.04 (q, J=7.3 Hz、2H)、2.44 (s, 3H)、1.09 (t, J=7.3 Hz、3H)。

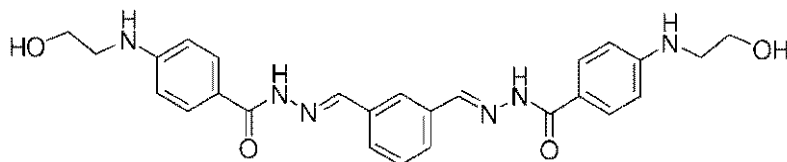
【0301】

実施例 30

(N', N''', E, N', N''', E)-N', N'''-(1, 3-フェニレンビス(メタニリリデン))ビス(4-((2-ヒドロキシエチル)アミノ)ベンゾヒドラジド) (化合物 130)

10

【化 166】



スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアリドおよび4-((2-ヒドロキシエチル)アミノ)ベンゾエートから化合物 130 を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 11.95 (s, 1H)、7.91 (d, J=8.9 Hz、1H)、7.17 (d, J=8.9 Hz、1H)、6.70 (s, 1H)、5.28 (q, J=9.2 Hz、2H)、3.04 (q, J=7.3 Hz、2H)、2.44 (s, 3H)、1.09 (t, J=7.3 Hz、3H)。

20

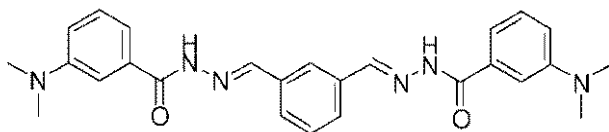
【0302】

実施例 31

(N', N''', E, N', N''', E)-N', N'''-(1, 3-フェニレンビス(メタニリリデン))ビス(3-(ジメチルアミノ)ベンゾヒドラジド) (化合物 131)

【化 167】

30



スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアリドおよび3-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 131 を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 11.82 (s, 2H)、8.52 (s, 2H)、8.11 (s, 1H)、7.76 (d, J=7.5 Hz、2H)、7.56 (t, J=7.5 Hz、1H)、7.33 (t, J=8.0 Hz、2H)、7.19 (d, J=7.0 Hz、4H)、6.94 (d, J=2.2 Hz、2H)、2.97 (s, 12H)。

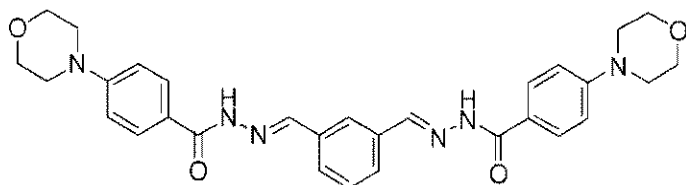
40

【0303】

実施例 32

(N', N''', E, N', N''', E)-N', N'''-(1, 3-フェニレンビス(メタニリリデン))ビス(4-モルホリノベンゾヒドラジド) (化合物 132)

【化 1 6 8】



スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-ホルホルノベンゾエートから化合物 1 3 2 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₃N₆O₄ についての計算値: 541.26; 実測値: 541.05。

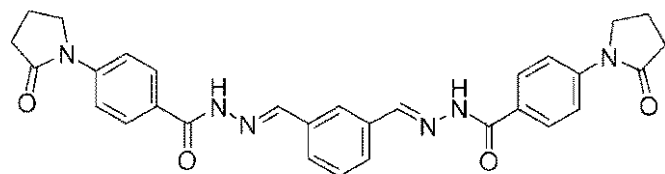
10

【0304】

実施例 3 3

(N', N', N', E, N', N', N', E) - N', N', N' - (1, 3-フェニレンビス(メタニリリデン))ビス(4-(2-オキソピロリジン-1-イル)ベンゾヒドラジド) (化合物 1 3 3)

【化 1 6 9】



20

スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-ピロリドノ(pyrrolidono)ベンゾエートから化合物 1 3 3 を調製した。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 11.93 (s, 2H)、8.47 (s, 2H)、8.17 (s, 1H)、7.95 (d, J=13.7 Hz, 4H)、7.81 (d, J=10 Hz, 4H)、7.77 (d, J=10 Hz, 2H)、7.55 (t, J=10, 12.5 Hz, 1H)、4.28 (m, 4H)、2.53 (m, 4H)、2.07 (m, 4H)。

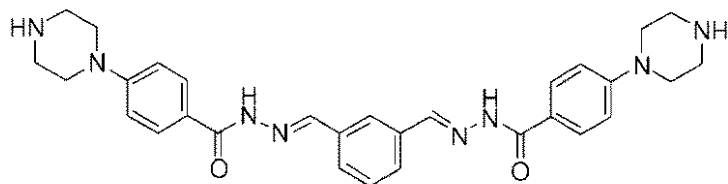
【0305】

30

実施例 3 4

(N', N', N', E, N', N', N', E) - N', N', N' - (1, 3-フェニレンビス(メタニリリデン))ビス(4-(ピペラジン-1-イル)ベンゾヒドラジド) (化合物 1 3 4)

【化 1 7 0】



40

スキーム I I に表される手順にしたがって、ベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-ピペリジニルベンゾエートから化合物 1 3 4 を調製した。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 11.54 (s, 2H)、10.15 (s, 2H)、8.47 (s, 2H)、8.25 (s, 1H)、7.86 (d, J=12 Hz, 4H)、7.71 (m, 3H)、7.02 (d, J=12 Hz, 4H)、3.17 (m, 8H)、2.86 (m, 8H)。

【0306】

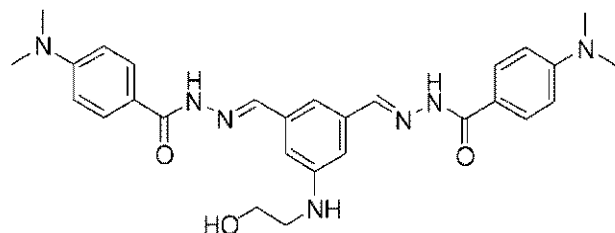
実施例 3 5

(N', N', N', E, N', N', N', E) - N', N', N' - ((5-((2-ヒドロキ

50

シエチル) アミノ) - 1, 3-フェニレン) ビス (メタニリリデン)) ビス (4- (ジメチルアミノ) ベンゾヒドラジド) (化合物 135)

【化 171】



10

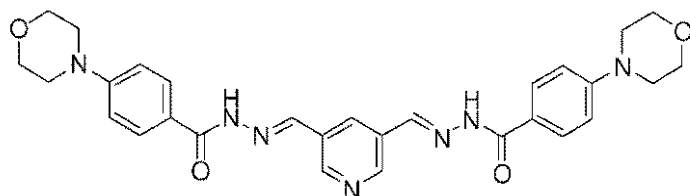
スキーム I I に表される手順にしたがって、5- (2-ヒドロキシエチル) アミノベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 135 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₃₃N₇O₃ についての計算値: 516.27; 実測値: 516.00。

【0307】

実施例 36

(N', N', N', E, N', N', N', E) - N', N', N' - (ピリジン-3, 5-ジイルビス (メタニリリデン)) ビス (4-モルホリノベンゾヒドラジド) (化合物 136)

【化 172】



20

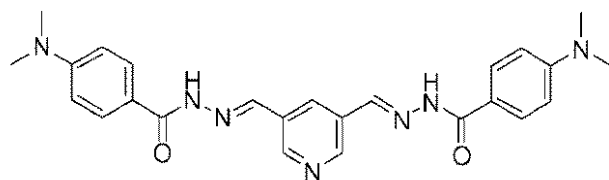
スキーム I I に表される手順にしたがって、ピリジン-3, 5-ジカルボキシアルデヒドおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物 136 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₁N₇O₄ についての計算値: 542.25; 実測値: 541.99。

【0308】

実施例 37

(N', N', N', E, N', N', N', E) - N', N', N' - (ピリジン-3, 5-ジイルビス (メタニリリデン)) ビス (4- (ジメチルアミノ) ベンゾヒドラジド) (化合物 137)

【化 173】



40

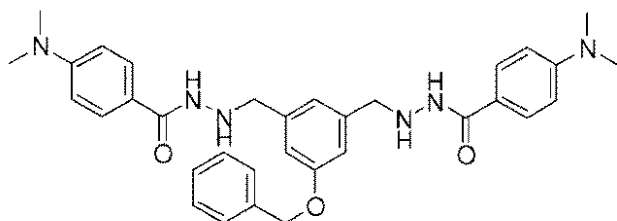
スキーム I I に表される手順にしたがって、ピリジン-3, 5-ジカルボキシアルデヒドおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 137 を調製した。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 11.79 (s, 2H)、8.81 (d, J=3.75 Hz, 2H)、8.51 (s, 2H)、8.45 (s, 1H)、7.83 (d, J=15 Hz, 4H)、6.77 (d, J=11.2 Hz, 4H)、3.01 (s, 12H)。

【0309】

実施例 38

N', N', N' - ((5- (ベンジルオキシ) - 1, 3-フェニレン) ビス (メチレン)) ビス (4- (ジメチルアミノ) ベンゾヒドラジド) (化合物 138)

【化 1 7 4】



スキーム I I に表される手順にしたがって、5-5-ベンジルオキシベンゼン-1, 3-ジカルボキシアルデヒドおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 1 3 8 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₂₈N₆O₃ についての計算値：567.30；実測値：567.17。

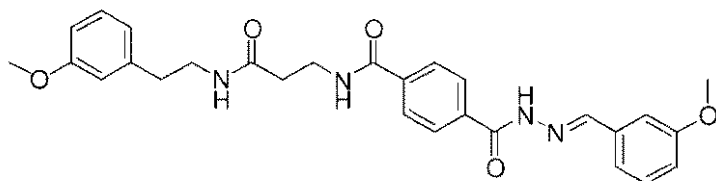
10

【0310】

実施例 3 9

(E)-4-(2-(3-メトキシベンジリデン)ヒドラジンカルボニル)-N-(3-((3-メトキシフェネチル)アミノ)-3-オキソプロピル)ベンズアミド (化合物 1 3 9)

【化 1 7 5】



20

スキーム I に表される一般的な手順にしたがって、化合物 1 3 9 を調製した。3-((tert-ブトキシカルボニル)アミノ)プロパン酸の調製：β-アラニン (Sigma-Aldrich、1.0 g、11.2 mmol) および K₂CO₃ (3.1 g、22.4 mmol) を、ジオキサン (25 mL) と水 (12.5 mL) との混合物に溶解させ、次に、溶液を氷浴中で 0℃ まで冷却した。ジ-tert-ブチルジカーボネート (2.7 g、12.3 mmol) を添加し、次に、溶液を室温までゆっくりと温め、一晩攪拌させた。完了したら、溶液を pH 3 になるまで KHSO₄ で酸性化し、次に、酢酸エチルで抽出した。有機層を塩水で洗浄し、Na₂SO₄ 上で乾燥させ、次に、溶媒を減圧下で除去して、粗生成物を得て、この粗生成物をさらに精製せずに次の工程に使用した。

30

【0311】

tert-ブチル (3-((3-メトキシフェネチル)アミノ)-3-オキソプロピル)カルバメートの調製：3-メトキシフェネチルアミン (Aldrich、100 mg、0.66 mmol)、3-((tert-ブトキシカルボニル)アミノ)プロパン酸 (125 mg、0.66 mmol)、ヒドロキシベンゾトリアゾール (8.9 mg、0.066 mmol)、トリエチルアミン (102 μL、0.73 mmol) およびジメチルホルムアミド (6.6 mL) を組み合わせて、次に、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド (139 mg、0.73 mmol) を添加した。溶液を室温で一晩攪拌させた。完了したら、酢酸エチルおよび水を添加し、層を分離させた。水相を酢酸エチルで抽出し、次に、組み合わされた有機層を塩水で洗浄し、Na₂SO₄ 上で乾燥させた。溶媒を減圧下で除去して粗生成物を得て、この粗生成物を、溶離液として 0～80% の酢酸エチル/ヘキサンを用いたフラッシュクロマトグラフィーによって精製して、純粋な白色の固体としての生成物 (140 mg、66%) を得た。

40

【0312】

3-アミノ-N-(3-メトキシフェネチル)プロパンアミドの調製：tert-ブチル (3-((3-メトキシフェネチル)アミノ)-3-オキソプロピル)カルバメートをジクロロメタン (0.5 mL) に溶解させ、次に、この溶液を氷浴中で 0℃ まで冷却した

50

。トリフルオロ酢酸（300 μ L）を添加し、次に、溶液を攪拌しながら室温までゆっくりと温めた。反応が完了したら、溶媒を減圧下で除去して、粗生成物を得て、この粗生成物をさらに精製せずに使用する。

【0313】

メチル4-（（3-（（3-メトキシフェネチル）アミノ）-3-オキソプロピル）カルバモイル）ベンゾエートの調製：3-アミノ-N-（（3-メトキシフェネチル）プロパンアミド（60 mg、0.27 mmol）に、4-（メトキシカルボニル）安息香酸（49 mg、0.27 mmol）、ヒドロキシベンゾトリアゾール（3.7 mg、0.027 mmol）、トリエチルアミン（42 μ L、0.30 mmol）およびジメチルホルムアミド（2.7 mL）を添加した。最後に、1-エチル-3-（（3-ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド（57 mg、0.30 mmol）を添加し、溶液を、蓋をしたバイアル中で室温で一晩攪拌させた。反応が完了したら、水性処理（aqueous work up）を行って粗生成物を得て、この粗生成物を、フラッシュクロマトグラフィーを用いて精製した。

10

【0314】

4-（ヒドラジンカルボニル）-N-（（3-（（3-メトキシフェネチル）アミノ）-3-オキソプロピル）ベンズアミド）の調製：メチル4-（（3-（（3-メトキシフェネチル）アミノ）-3-オキソプロピル）カルバモイル）ベンゾエートを、メタノール（3 mL）およびヒドラジン水和物（300 μ L）で処理し、65 $^{\circ}$ Cまで加熱し、次に、一晩攪拌させた。反応をTLCによって監視し、完了したら、溶媒を減圧下で除去して、粗生成物を得て、この粗生成物をさらに精製せずに使用する。

20

【0315】

化合物139の調製：上記の粗生成物（15.0 mg、0.039 mmol）に、3-アニスアルデヒド（9.5 μ L、0.078 mmol）、酢酸（数滴）およびエタノール（1 mL）を添加した。反応物を室温で一晩攪拌させた。形成された固体生成物を遠心分離によって単離し、次に、LCMSによって分析する。MS $[M+H]^+$ $C_{28}H_{30}N_4O_5$ についての計算値：503.22；実測値：503.04。

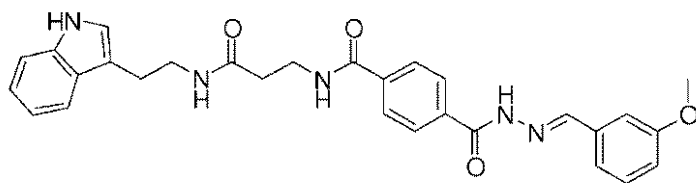
【0316】

実施例40

(E)-N-（（3-（（2-（1H-インドール-3-イル）エチル）アミノ）-3-オキソプロピル）-4-（（2-（3-メトキシベンジリデン）ヒドラジンカルボニル）ベンズアミド（化合物140）

30

【化176】



スキームIに表される手順にしたがって、4-（（2-（3-インドリルエチル）アミノカルボニル）エチルアミノカルボニル）ベンゾエートおよび3-メトキシベンズアルデヒドから化合物140を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{29}H_{29}N_5O_4$ についての計算値：512.22；実測値：512.03。

40

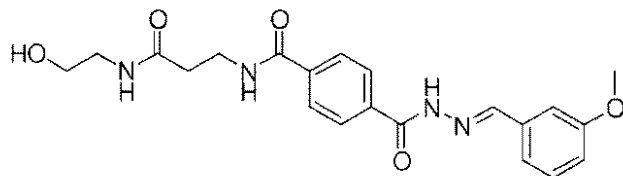
【0317】

実施例41

(E)-N-（（3-（（2-ヒドロキシエチル）アミノ）-3-オキソプロピル）-4-（（2-（3-メトキシベンジリデン）ヒドラジンカルボニル）ベンズアミド（化合物141）

1)

【化 1 7 7】



スキーム I に表される手順にしたがって、4-（2-（2-ヒドロキシエチルアミノカルボニル）エチルアミノカルボニル）ベンゾエートおよび3-メトキシベンズアルデヒドから化合物 1 4 1 を調製した。[M+H]⁺ C₂₁H₂₄N₄O₅ についての計算値：413.17；実測値：413.00。

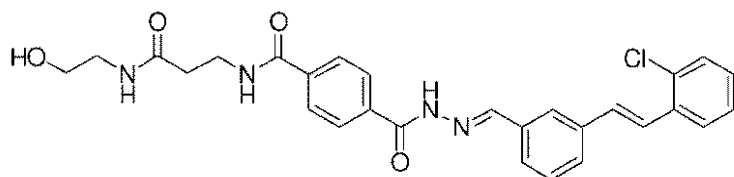
10

【0 3 1 8】

実施例 4 2

4-（（E）-2-（3-（（E）-2-クロロスチリル）ベンジリデン）ヒドラジンカルボニル）-N-（3-（（2-ヒドロキシエチル）アミノ）-3-オキソプロピル）ベンズアミド（化合物 1 4 2）

【化 1 7 8】



20

スキーム I に表される手順にしたがって、4-（2-（2-ヒドロキシエチルアミノカルボニル）エチルアミノカルボニル）ベンゾエートおよび3-（（E）-2-（2-クロロフェニル）エテニル）ベンズアルデヒドから化合物 1 4 2 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₇ClN₄O₄ についての計算値：519.17；実測値：519.00。

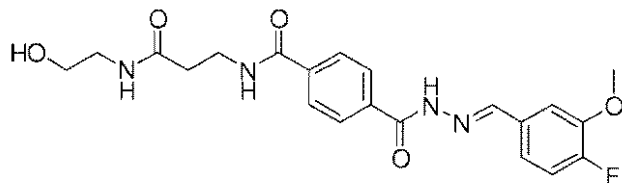
【0 3 1 9】

実施例 4 3

（E）-4-（2-（4-フルオロ-3-メトキシベンジリデン）ヒドラジンカルボニル）-N-（3-（（2-ヒドロキシエチル）アミノ）-3-オキソプロピル）ベンズアミド（化合物 1 4 3）

30

【化 1 7 9】



スキーム I に表される手順にしたがって、4-（2-（2-ヒドロキシエチルアミノカルボニル）エチルアミノカルボニル）ベンゾエートおよび4-フルオロ-3-メトキシベンズアルデヒドから化合物 1 4 3 を調製した。[M+H]⁺ C₂₁H₂₃FN₄O₅ についての計算値：431.17；実測値：431.00。

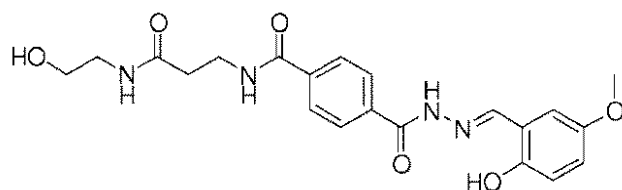
40

【0 3 2 0】

実施例 4 4

（E）-4-（2-（2-ヒドロキシ-5-メトキシベンジリデン）ヒドラジンカルボニル）-N-（3-（（2-ヒドロキシエチル）アミノ）-3-オキソプロピル）ベンズアミド（化合物 1 4 4）

【化 1 8 0】



スキーム I に表される手順にしたがって、4-（2-（2-ヒドロキシエチルアミノカルボニル）エチルアミノカルボニル）ベンゾエートおよび2-ヒドロキシ-5-メトキシベンズアルデヒドから化合物 1 4 4 を調製した。[M+H]⁺ C₂₁H₂₄N₄O₆ についての計算値：429.17；実測値：429.00。

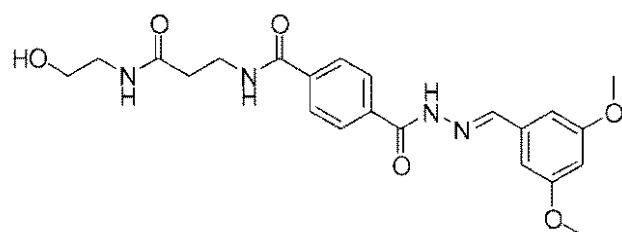
10

【0 3 2 1】

実施例 4 5

(E)-4-（2-（3,5-ジメトキシベンジリデン）ヒドラジンカルボニル）-N-（3-（（2-ヒドロキシエチル）アミノ）-3-オキソプロピル）ベンズアミド（化合物 1 4 5）

【化 1 8 1】



20

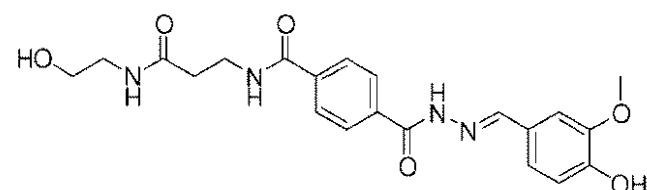
スキーム I に表される手順にしたがって、4-（2-（2-ヒドロキシエチルアミノカルボニル）エチルアミノカルボニル）ベンゾエートおよび3,5-ジメトキシベンズアルデヒドから化合物 1 4 5 を調製した。[M+H]⁺ C₂₂H₂₆N₄O₆ についての計算値：443.19；実測値：442.91。

【0 3 2 2】

実施例 4 6

(E)-4-（2-（4-ヒドロキシ-3-メトキシベンジリデン）ヒドラジンカルボニル）-N-（3-（（2-ヒドロキシエチル）アミノ）-3-オキソプロピル）ベンズアミド（化合物 1 4 6）

【化 1 8 2】



40

スキーム I に表される手順にしたがって、4-（2-（2-ヒドロキシエチルアミノカルボニル）エチルアミノカルボニル）ベンゾエートおよび4-ヒドロキシ-5-メトキシベンズアルデヒドから化合物 1 4 6 を調製した。[M+H]⁺ C₂₁H₂₄N₄O₆ についての計算値：429.17；実測値：428.88。

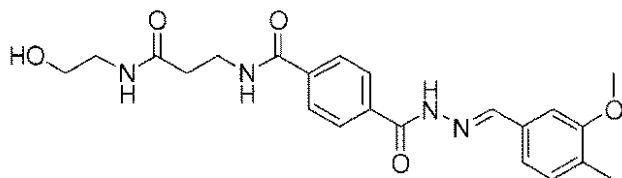
【0 3 2 3】

実施例 4 7

(E)-N-（3-（（2-ヒドロキシエチル）アミノ）-3-オキソプロピル）-4-（2-（3-メトキシ-4-メチルベンジリデン）ヒドラジンカルボニル）ベンズアミド（化合物 1 4 7）

50

【化 1 8 3】



スキーム I に表される手順にしたがって、4-（2-（2-ヒドロキシエチルアミノカルボニル）エチルアミノカルボニル）ベンゾエートおよび3-メトキシ-4-メチルベンズアルデヒドから化合物 1 4 7 を調製した。[M+H]⁺ C₂₂H₂₆N₄O₅ について

10

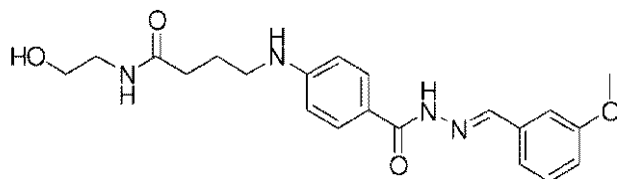
の計算値：427.19；実測値：426.92。

【0 3 2 4】

実施例 4 8

(E)-N-（2-ヒドロキシエチル）-4-（（4-（2-（3-メトキシベンジリデン）ヒドラジンカルボニル）フェニル）アミノ）ブタンアミド（化合物 1 4 8）

【化 1 8 4】



20

スキーム I に表される手順にしたがって、4-（3-（2-ヒドロキシエチルアミノカルボニル）プロピルアミノ）ベンゾエートおよび3-メトキシベンズアルデヒドから化合物 1 4 8 を調製した。[M+H]⁺ C₂₁H₂₆N₄O₄ についての計算値：399.20；実測値：399.47。

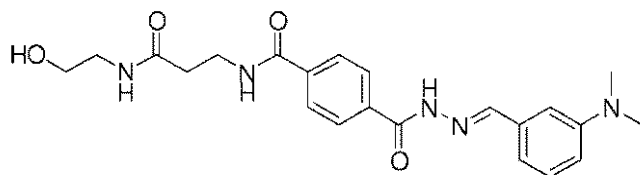
【0 3 2 5】

実施例 4 9

(E)-4-（2-（3-（ジメチルアミノ）ベンジリデン）ヒドラジンカルボニル）-N-（3-（（2-ヒドロキシエチル）アミノ）-3-オキソプロピル）ベンズアミド（化合物 1 4 9）

30

【化 1 8 5】



スキーム I に表される手順にしたがって、4-（2-（2-ヒドロキシエチルアミノカルボニル）エチルアミノカルボニル）ベンゾエートおよび3-ジメチルアミノベンズアルデヒドから化合物 1 4 9 を調製した。[M+H]⁺ C₂₂H₂₇N₅O₄ についての計算値：426.21；実測値：426.53。

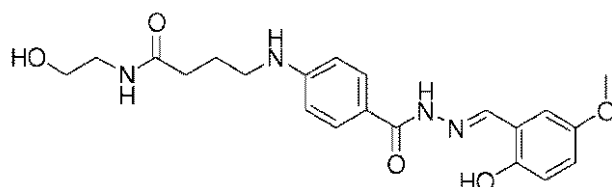
40

【0 3 2 6】

実施例 5 0

(E)-4-（（4-（2-（2-ヒドロキシ-5-メトキシベンジリデン）ヒドラジンカルボニル）フェニル）アミノ）-N-（2-ヒドロキシエチル）ブタンアミド（化合物 1 5 0）

【化 1 8 6】



スキーム I に表される手順にしたがって、4-((3-((2-ヒドロキシエチルアミノ)カルボニル)プロピルアミノ)ベンゾエートおよび2-ヒドロキシ-5-メトキシベンズアルデヒドから化合物150を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{21}H_{26}N_4O_5$ についての計算値：415.19；実測値：415.53。

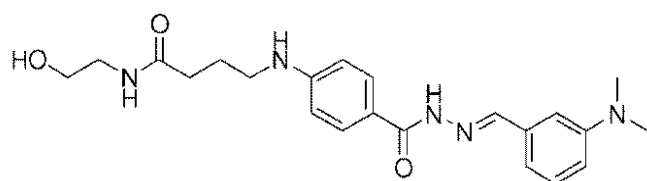
10

【0327】

実施例51

(E)-4-((4-((2-((3-(ジメチルアミノ)ベンジリデン)ヒドラジンカルボニル)フェニル)アミノ)-N-(2-ヒドロキシエチル)ブタンアミド(化合物151)

【化 1 8 7】



20

スキーム I に表される手順にしたがって、4-((3-((2-ヒドロキシエチルアミノ)カルボニル)プロピルアミノ)ベンゾエートおよび3-ジメチルアミノベンズアルデヒドから化合物151を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{22}H_{29}N_5O_3$ についての計算値：412.23；実測値：412.56。

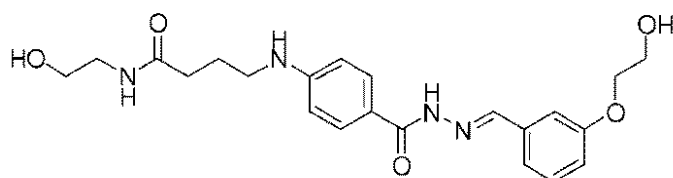
【0328】

実施例52

(E)-4-((4-((2-((3-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンジリデン)ヒドラジンカルボニル)フェニル)アミノ)-N-(2-ヒドロキシエチル)ブタンアミド(化合物152)

30

【化 1 8 8】



スキーム I に表される手順にしたがって、4-((3-((2-ヒドロキシエチルアミノ)カルボニル)プロピルアミノ)ベンゾエートおよび3-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンズアルデヒドから化合物152を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{22}H_{28}N_4O_5$ についての計算値：429.21；実測値：429.50。

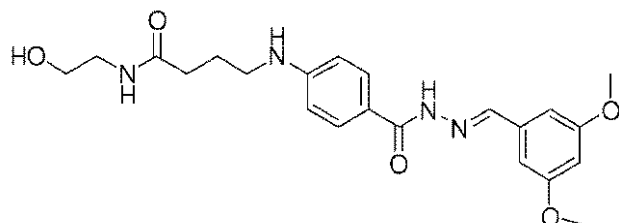
40

【0329】

実施例53

(E)-4-((4-((2-((3,5-ジメトキシベンジリデン)ヒドラジンカルボニル)フェニル)アミノ)-N-(2-ヒドロキシエチル)ブタンアミド(化合物153)

【化 1 8 9】



スキーム I に表される手順にしたがって、4-（3-（2-ヒドロキシエチルアミノカルボニル）プロピルアミノ）ベンゾエートおよび 3, 5-ジメトキシベンズアルデヒドから化合物 153 を調製した。[M+H]⁺ C₂₂H₂₈N₄O₅ についての計算値：429.21；実測値：429.50。

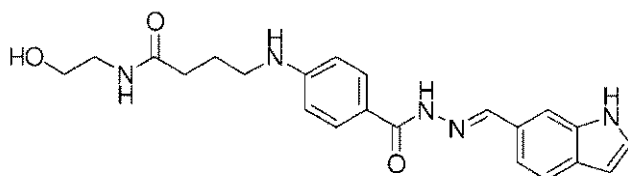
10

【0330】

実施例 54

(E)-4-（（4-（2-（（1H-インドール-6-イル）メチレン）ヒドラジンカルボニル）フェニル）アミノ）-N-（2-ヒドロキシエチル）ブタンアミド（化合物 154）

【化 1 9 0】



20

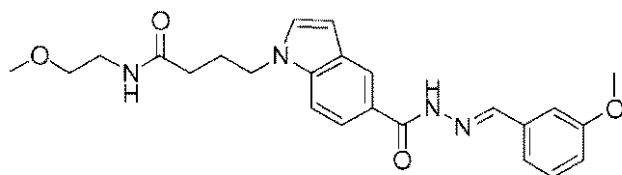
スキーム I に表される手順にしたがって、4-（3-（2-ヒドロキシエチルアミノカルボニル）プロピルアミノ）ベンゾエートおよび 6-インドールカルボキシアリドから化合物 154 を調製した。[M+H]⁺ C₂₂H₂₅N₅O₃ についての計算値：408.20；実測値：408.51。

【0331】

実施例 55

(E)-4-（（5-（2-（3-メトキシベンジリデン）ヒドラジンカルボニル）-1H-インドール-1-イル）-N-（2-メトキシエチル）ブタンアミド（化合物 155）

【化 1 9 1】



30

スキーム I に表される手順にしたがって、1-（3-（2-メトキシエチル）アミノカルボニルプロピル）インドール-5-カルボキシレートおよび 3-メトキシベンズアルデヒドから化合物 155 を調製した。¹H NMR（500 MHz、DMSO-d₆）δ 11.77（s, 1H）、8.43（s, 1H）、8.20（d, J=1.5 Hz, 1H）、7.89（t, J=5.5 Hz, 1H）、7.72（dd, J=2.9 Hz, 1H）、7.57（d, J=9 Hz, 1H）、7.46（d, J=3 Hz, 1H）、7.36（t, J=8 Hz, 1H）、7.27（s, 2H）、6.99（d, J=8 Hz, 1H）、6.58（d, J=2.5 Hz, 1H）、4.20（t, J=6.5 Hz, 2H）、3.80（s, 3H）、3.32~3.29（m, 2H）、3.20~3.14（m, 5H）、2.05（t, J=8 Hz, 2H）、1.96（p, J=7 Hz, 2H）。

40

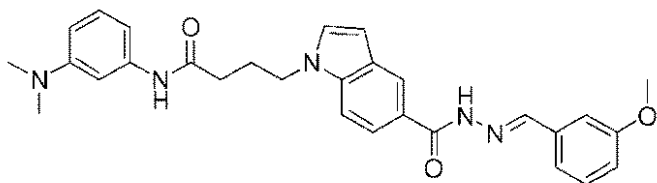
【0332】

50

実施例 56

(E)-N-(3-(ジメチルアミノ)フェニル)-4-(5-(2-(3-メトキシベンジリデン)ヒドラジンカルボニル)-1H-インドール-1-イル)ブタンアミド(化合物156)

【化192】



10

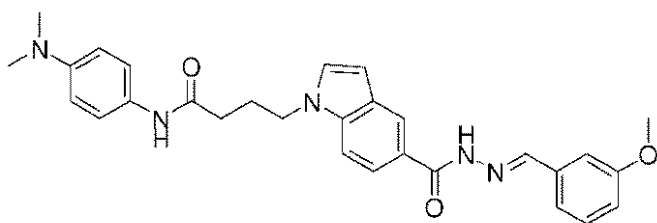
スキーム I に表される手順にしたがって、1-(3-(3-ジメチルアミノフェニル)アミノカルボニルプロピル)インドール-5-カルボキシレートおよび3-メトキシベンズアルデヒドから化合物156を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₁N₅O₃ についての計算値：498.24；実測値：497.98。

【0333】

実施例 57

(E)-N-(4-(ジメチルアミノ)フェニル)-4-(5-(2-(3-メトキシベンジリデン)ヒドラジンカルボニル)-1H-インドール-1-イル)ブタンアミド(化合物157)

【化193】



20

スキーム I に表される手順にしたがって、1-(3-(4-ジメチルアミノフェニル)アミノカルボニルプロピル)インドール-5-カルボキシレートおよび3-メトキシベンズアルデヒドから化合物157を調製した。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 11.77 (s, 1H)、9.58 (s, 1H)、8.43 (bs, 1H)、8.21 (d, J=1.0 Hz, 1H)、7.73 (dd, J=1.5, 8.5 Hz, 1H)、7.60 (d, J=8.5 Hz, 1H)、7.50 (d, J=2.5 Hz, 1H)、7.44 (m, 1H)、7.36 (d, J=9 Hz, 2H)、7.26 (m, 2H)、6.99 (d, J=8 Hz, 1H)、6.75 (d, J=9 Hz, 1H)、6.65 (d, J=9 Hz, 2H)、6.60 (d, J=2.5 Hz, 1H)、4.27 (t, J=7 Hz, 2H)、3.80 (s, 3H)、2.81 (s, 6H)、2.23 (t, J=7.5 Hz, 2H)、2.06 (p, J=7.5 Hz, 2H)。

【0334】

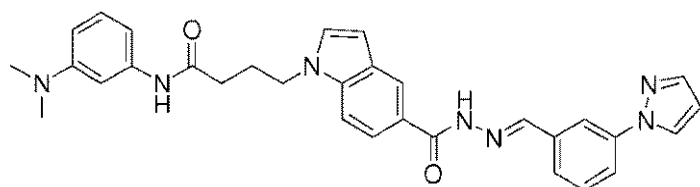
実施例 58

(E)-4-(5-(2-(3-(1H-ピラゾール-1-イル)ベンジリデン)ヒドラジンカルボニル)-1H-インドール-1-イル)-N-(3-(ジメチルアミノ)フェニル)ブタンアミド(化合物158)

30

40

【化 1 9 4】



スキーム I に表される手順にしたがって、1-(3-(3-ジメチルアミノフェニル)アミノカルボニルプロピル)インドール-5-カルボキシレートおよび3-(ピラゾール-1-イル)ベンズアルデヒドから化合物 1 5 8 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₁N₇O₂ についての計算値：534.25；実測値：534.00。

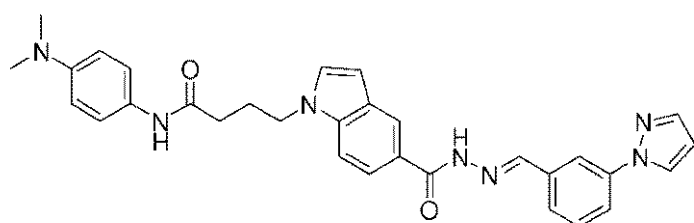
10

【0335】

実施例 5 9

(E)-4-(5-(2-(3-(1H-pyrazol-1-yl)benzylidene)hydrazinyl)indol-1-yl)-N-(4-(dimethylamino)phenyl)butanamide (化合物 1 5 9)

【化 1 9 5】



20

スキーム I に表される手順にしたがって、1-(3-(4-ジメチルアミノフェニル)アミノカルボニルプロピル)インドール-5-カルボキシレートおよび3-(ピラゾール-1-イル)ベンズアルデヒドから化合物 1 5 9 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₁N₇O₂ についての計算値：534.25；実測値：533.97。

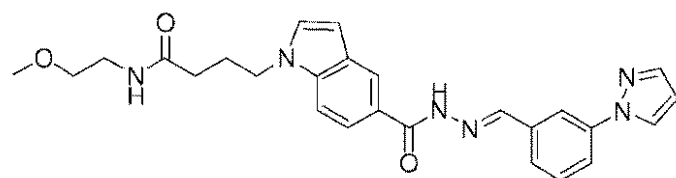
【0336】

実施例 6 0

(E)-4-(5-(2-(3-(1H-pyrazol-1-yl)benzylidene)hydrazinyl)indol-1-yl)-N-(2-methoxyethyl)butanamide (化合物 1 6 0)

30

【化 1 9 6】



40

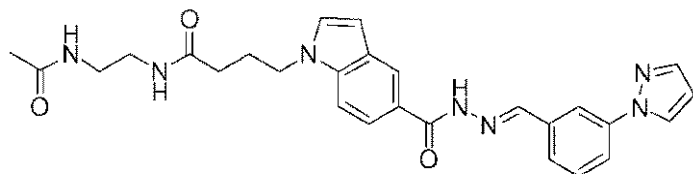
スキーム I に表される手順にしたがって、1-(3-(2-メトキシエチル)アミノカルボニルプロピル)インドール-5-カルボキシレートおよび3-(ピラゾール-1-イル)ベンズアルデヒドから化合物 1 6 0 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₈N₆O₃ についての計算値：473.22；実測値：472.94。

【0337】

実施例 6 1

(E)-4-(5-(2-(3-(1H-pyrazol-1-yl)benzylidene)hydrazinyl)indol-1-yl)-N-(2-acetamidethyl)butanamide (化合物 1 6 1)

【化 1 9 7】



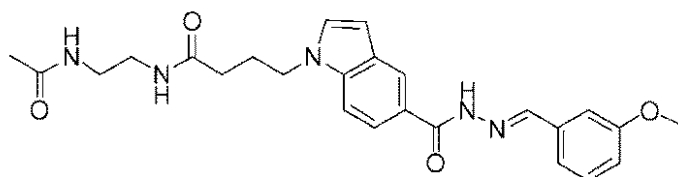
スキーム I に表される手順にしたがって、1-(3-(2-アセチルアミドエチル)アミノカルボニルプロピル)インドール-5-カルボキシレートおよび 3-(ピラゾール-1-イル)ベンズアルデヒドから化合物 161 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₉N₇O₃ についての計算値：500.23；実測値：499.94。

【 0 3 3 8 】

实施例 6 2

(E)-N-(2-アセトアミドエチル)-4-(5-(2-(3-メトキシベンジリデン)ヒドラジンカルボニル)-1H-インドール-1-イル)ブタンアミド (化合物 162)

【化 1 9 8】



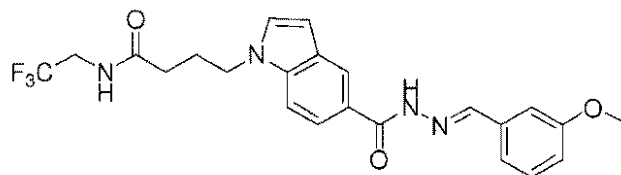
スキーム I に表される手順にしたがって、1-(3-(2-アセチルアミドエチル)アミノカルボニルプロピル)インドール-5-カルボキシレートおよび3-メトキシベンズアルデヒドから化合物 162 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₉N₅O₄ についての計算値：464.22；実測値：463.93。

【 0 3 3 9 】

实施例 63

(E)-4-(5-(2-(3-メトキシベンジリデン)ヒドラジンカルボニル)-1H-インドール-1-イル)-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)ブタンアミド (化合物 163)

【化 1 9 9】



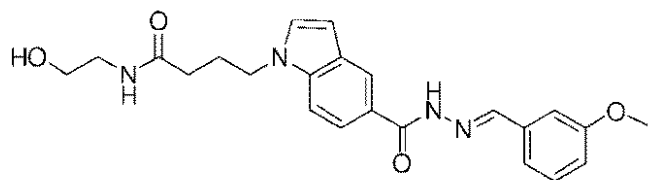
スキーム I に表される手順にしたがって、1-(3-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノカルボニルプロピル)インドール-5-カルボキシレートおよび3-メトキシベンズアルデヒドから化合物 163 を調製した。[M+H]⁺ C₂₃H₂₃F₃N₄O₃ についての計算値：461.17；実測値：460.92。

【 0 3 4 0 】

实施例 64

(E)-N-(2-ヒドロキシエチル)-4-(5-(2-(3-メトキシベンジリデン)ヒドラジンカルボニル)-1H-インドール-1-イル)ブタンアミド (化合物164)

【化 2 0 0】



スキーム I に表される手順にしたがって、1-(3-(2-ヒドロキシエチル)アミノカルボニルプロピル)インドール-5-カルボキシレートおよび3-メトキシベンズアルデヒドから化合物164を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{23}H_{26}N_4O_4$ についての計算値：423.20；実測値：422.88。

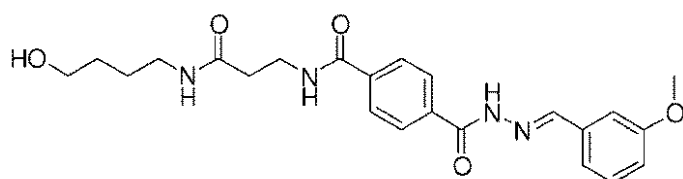
10

【0341】

実施例 65

(E)-N-(3-((4-ヒドロキシブチル)アミノ)-3-オキソプロピル)-4-(2-(3-メトキシベンジリデン)ヒドラジンカルボニル)ベンズアミド(化合物165)

【化 2 0 1】



20

スキーム I に表される手順にしたがって、4-(2-(4-ヒドロキシブチルアミノカルボニル)エチルアミノカルボニル)ベンゾエートおよび3-メトキシベンズアルデヒドから化合物165を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{23}H_{28}N_4O_5$ についての計算値：441.21；実測値：441.01。

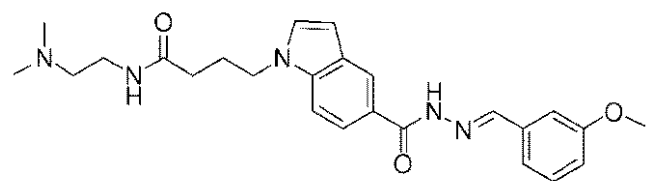
【0342】

実施例 66

(E)-N-(2-(ジメチルアミノ)エチル)-4-(5-(2-(3-メトキシベンジリデン)ヒドラジンカルボニル)-1H-インドール-1-イル)ブタンアミド(化合物166)

30

【化 2 0 2】



スキーム I に表される手順にしたがって、1-(3-(2-ジメチルアミノエチル)アミノカルボニルプロピル)インドール-5-カルボキシレートおよび3-メトキシベンズアルデヒドから化合物166を調製した。 ^1H NMR (500 MHz、アセトン- d_6) δ 11.09 (bs, 1H)、8.51 (bs, 1H)、8.26 (d, $J=19$ Hz、2H)、7.83 (dd, $J=1.5$ 、8.5 Hz、1H)、7.39 (bs, 1H)、7.35 (t, $J=7.5$ Hz、1H)、7.30 (m, 1H)、7.08 (s, 1H)、6.99~6.97 (m, 1H)、6.58 (d, $J=3$ Hz、1H)、4.31 (t, $J=7$ Hz、2H)、3.85 (s, 3H)、3.39 (q, $J=6$ Hz、2H)、2.67 (t, $J=6$ Hz、2H)、2.41 (s, 6H)、2.18~2.11 (m, 4H)。

40

【0343】

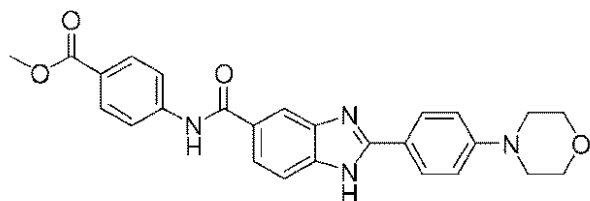
50

実施例 67

メチル 4- (2- (4-モルホリノフェニル) -1H-ベンゾ [d] イミダゾール-5-カルボキサミド) ベンゾエート

(化合物 167)

【化 203】



10

スキーム I I I に表されるのと同様の一般的手順にしたがって化合物 167 を調製した。2- (4-モルホリノフェニル) -1H-ベンゾ [d] イミダゾール-5-カルボン酸の調製：4-モルホリノベンズアルデヒド (475 mg、2.5 mmol)、メタ重亜硫酸ナトリウム (85 mg) および 3,4-ジアミノ安息香酸 (152 mg、2.7 mmol) を 10-mL のマイクロ波管に入れ、5.0 mL の HPLC グレードの 2-プロパノールを添加した。反応混合物に、170℃で 55 分間、マイクロ波を当てた。反応混合物を、25 mL の水に滴下して添加し、室温で 30 分間攪拌し、次に、それをろ過し、大量の水、酢酸エチルおよびヘキサンで洗浄し、乾燥させて純粋な中間体の酸 (323 mg、40% の収率) を得た。この化合物をさらに全く精製せずに次の工程に使用した。

20

【0344】

化合物 167 の調製：2- (4-モルホリノフェニル) -1H-ベンゾ [d] イミダゾール-5-カルボン酸 (32 mg、0.1 mmol) および N- (3-ジメチルアミノプロピル) -N'-エチルカルボジイミド塩酸塩 (EDC) (40 mg、0.2 mmol) を、20 mL のバイアルに入れ、ピリジン (1.0 mL) を添加し、しっかりと蓋を閉めた。反応混合物を室温で一晩攪拌した。反応混合物を蒸発乾固させ、残渣を大量の水、ヘキサンおよび EtOAc でよく洗浄してから乾燥させた。メタノール/水から結晶化させることで、25% の収率で化合物 167 (11.4 mg) を得た。[M+H]⁺ C₂₆H₂₄N₄O₄ についての計算値：457.18；実測値：456.94。

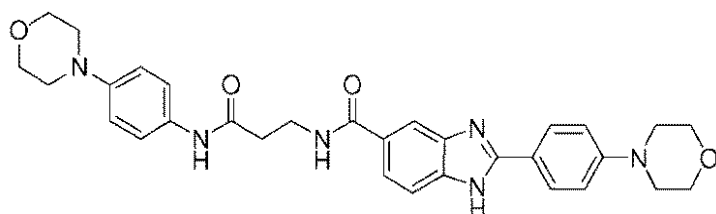
30

【0345】

実施例 68

2- (4-モルホリノフェニル) -N- (3- ((4-モルホリノフェニル) アミノ) -3-オキソプロピル) -1H-ベンゾ [d] イミダゾール-5-カルボキサミド (化合物 168)

【化 204】



40

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロベンズアミドおよび 4-モルホリノベンズアルデヒドから化合物 168 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₄N₆O₄ についての計算値：555.26；実測値：555.03。

【0346】

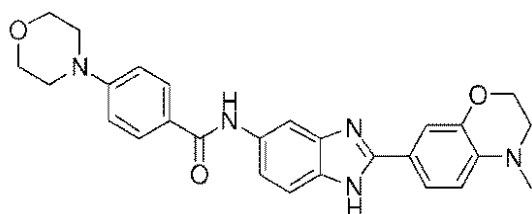
実施例 69

N- (2- (4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ [b] [1,4] オキサジン-7-イル) -1H-ベンゾイミダゾール-5-イル) -4-モルホリノベンズアミド (

50

化合物 169)

【化 205】



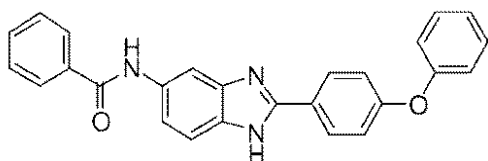
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、5-アミノ-2-(4-メチル-3, 4-ジヒドロベンズオキサジン-7-イル) ベンズイミダゾールおよび4-モルホリノ安息香酸から化合物 169 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₇N₅O₃ についての計算値：470. 21；実測値：496. 96。

【0347】

実施例 70

N-(2-(4-フェノキシフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル) ベンズアミド (化合物 170)

【化 206】



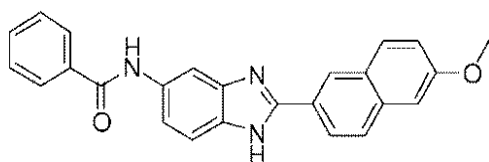
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-ベンゾアニリンおよび4-フェノキシベンズアルデヒドから化合物 170 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₁₉N₃O₂ についての計算値：406. 16；実測値：406. 08。

【0348】

実施例 71

N-(2-(6-メトキシナフタレン-2-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル) ベンズアミド (化合物 171)

【化 207】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-ベンゾアニリンおよび6-メトキシナフタレン-2-カルボキシアルデヒドから化合物 171 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₁₉N₃O₂ についての計算値：394. 15；実測値：394. 10。

【0349】

実施例 72

N-(2-フェニル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-[1, 1'-ビフェニル]-4-カルボキサミド (化合物 172)

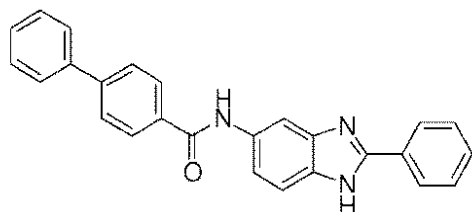
10

20

30

40

【化 2 0 8】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-フェニルベンゾ) アニリンおよびベンズアルデヒドから化合物 1 7 2 を調製した。¹ H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 10.62 (s, 1H)、8.83 (m, 1H)、8.52 (d, J=1.5 Hz、1H)、8.23 (m, 2H)、8.13 (d, J=8.5 Hz、2H)、7.82 (d, J=9 Hz、3H)、7.79 (dd, J=1.5、9 Hz、1H)、7.70 (dd, J=1.5、9 Hz、2H)、7.73 (m, 3H)、7.53 (t, J=7.5 Hz、2H)、7.44 (dt, J=1、7.5 Hz、1H)。

10

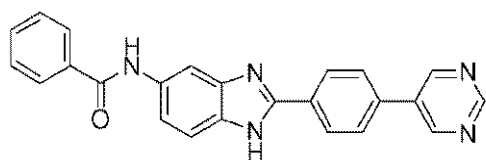
【0 3 5 0】

実施例 7 3

N-(2-(4-(ピリミジン-5-イル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 1 7 3)

20

【化 2 0 9】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-ベンゾアニリンおよび4-(ピリミジン-5-イル)ベンズアルデヒドから化合物 1 7 3 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₁₇N₅O についての計算値：392.15；実測値：391.91。

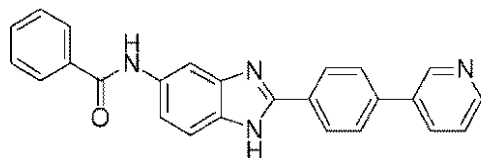
30

【0 3 5 1】

実施例 7 4

N-(2-(4-(ピリジン-3-イル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 1 7 4)

【化 2 1 0】



40

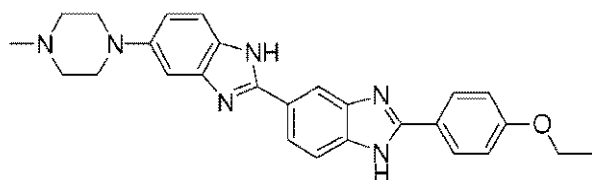
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-ベンゾアニリンおよび4-(ピリジル-3-)ベンズアルデヒドから化合物 1 7 4 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₁₈N₄O についての計算値：391.16；実測値：390.90。

【0 3 5 2】

実施例 7 5

2'-(4-エトキシフェニル)-5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H, 1'H-2, 5'-ビベンゾ[d]イミダゾール (化合物 1 7 5)

【化 2 1 1】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、5-(N-メチルピペリジニル)-2-(3,4-ジアミノフェニル)ベンズイミダゾールおよび4-エトキシベンズアルデヒドから化合物 175 を調製した。

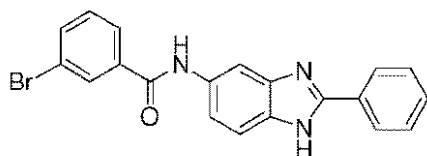
10

【0 3 5 3】

実施例 7 6

3-ブロモ-N-(2-フェニル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物 176)

【化 2 1 2】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(3-ブロモベンゾ)アニリンおよびベンズアルデヒドから化合物 176 を調製した。¹H

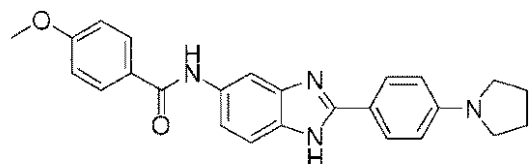
NMR (300 MHz、アセトン-d₆) δ 9.77 (bs, 1H)、8.37 (s, 1H)、8.23 (d, J=7 Hz, 2H)、8.18 (s, 1H)、8.04 (m, 1H)、7.75 (d, J=8.5 Hz, 1H)、7.62~7.46 (m, 7H)。

【0 3 5 4】

実施例 7 7

4-メトキシ-N-(2-(4-(ピロリジン-1-イル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物 177)

【化 2 1 3】



30

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-メトキシベンゾ)アニリンおよび4-(ピロリジン-1-イル)ベンズアルデヒドから化合物 177 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₄N₄O₂ についての計算値: 413.20; 実測値: 413.51。

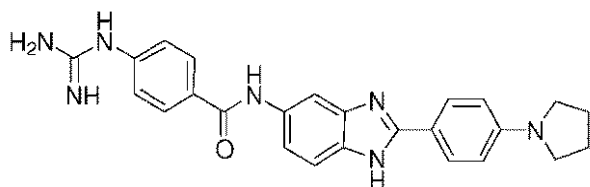
40

【0 3 5 5】

実施例 7 8

4-グアニジノ-N-(2-(4-(ピロリジン-1-イル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物 178)

【化 2 1 4】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-アミノアミノベンゾ)アニリンおよび4-(ピロリジン-1-イル)ベンズアルデヒドから化合物178を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₅N₇O についての計算値 : 440.22 ; 実測値 : 440.57。

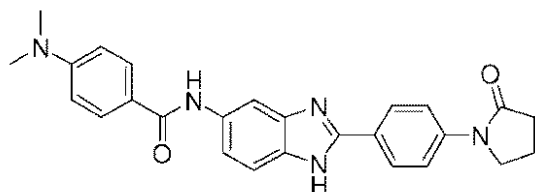
10

【0356】

実施例79

4-(ジメチルアミノ)-N-(2-(4-(2-オキソピロリジン-1-イル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物179)

【化 2 1 5】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-ジメチルアミノベンゾ)アニリンおよび4-(ピロリドン-1-イル)ベンズアルデヒドから化合物179を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₅N₅O₂ についての計算値 : 440.20 ; 実測値 : 440.50。

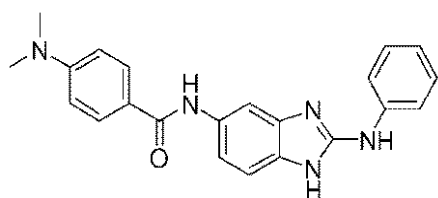
【0357】

実施例80

4-(ジメチルアミノ)-N-(2-(フェニルアミノ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物180)

30

【化 2 1 6】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、4-ジメチルアミノ安息香酸および5-アミノ-2-フェニルアミノベンズイミダゾールから化合物180を調製した。[M+H]⁺ C₂₂H₂₂N₅O についての計算値 : 372.18 ; 実測値 : 371.95。

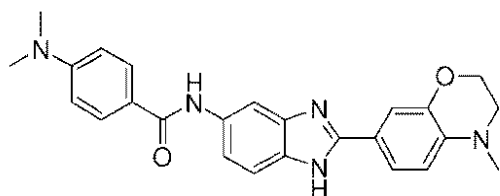
40

【0358】

実施例81

4-(ジメチルアミノ)-N-(2-(4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-7-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物181)

【化 2 1 7】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-ジメチルアミノベンゾイル)アニリンおよび1-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾ [1, 4] オキサジーン-6-カルボキシアルデヒドから化合物 1 8 1 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₅N₅O₂ についての計算値：428.20；実測値：428.49。

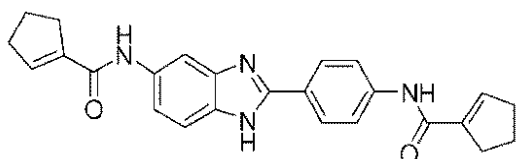
10

【0359】

実施例 8 2

N-(4-(5-(シクロペンター-1-エンカルボキサミド)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)フェニル)シクロペンター-1-エンカルボキサミド (化合物 1 8 2)

【化 2 1 8】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、5-アミノ-2-(4-アミノフェニル)ベンゾイミダゾールおよび1-シクロヘキセンカルボン酸から化合物 1 8 2 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₄N₄O₂ についての計算値：413.20；実測値：412.96。

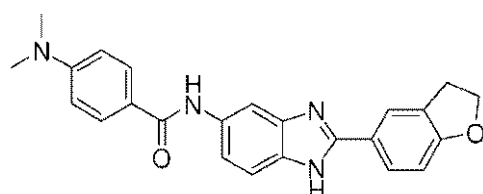
【0360】

実施例 8 3

N-(2-(2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド (化合物 1 8 3)

30

【化 2 1 9】



40

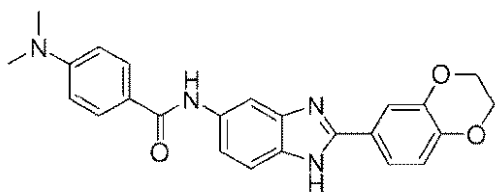
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-ジメチルアミノベンゾイル)アニリンおよび2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-カルボキシアルデヒドから化合物 1 8 3 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₄N₄O₂ についての計算値：399.18；実測値：399.47。

【0361】

実施例 8 4

N-(2-(2, 3-ジヒドロベンゾ[b][1, 4]ジオキシシン-6-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド (化合物 1 8 4)

【化 2 2 0】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-ジメチルアミノベンゾイル)アニリンおよびベンゾ [1, 4] ジオキサン-6-カルボキシアルデヒドから化合物 184 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₂N₄O₃ についての計算値：415.17；実測値：415.47。

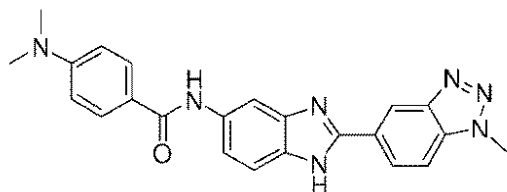
10

【0362】

実施例 85

4-(ジメチルアミノ)-N-(2-(1-メチル-1H-ベンゾ [d] [1, 2, 3] トリアゾール-5-イル)-1H-ベンゾ [d] イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 185)

【化 2 2 1】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-ジメチルアミノベンゾイル)アニリンおよび1-メチルベンゾトリアゾール-5-カルボキシアルデヒドから化合物 185 を調製した。[M+H]⁺ C₂₃H₂₁N₇O についての計算値：412.18；実測値：412.50。

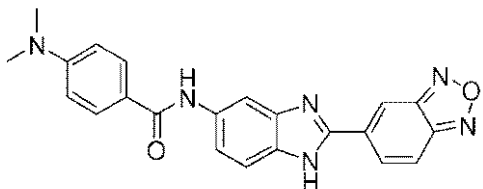
【0363】

実施例 86

N-(2-(ベンゾ [c] [1, 2, 5] オキサジアゾール-5-イル)-1H-ベンゾ [d] イミダゾール-5-イル)-4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド (化合物 186)

30

【化 2 2 2】



40

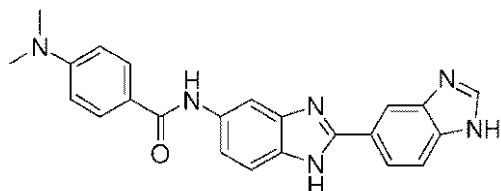
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-ジメチルアミノベンゾイル)アニリンおよびベンゾフラザン-5-カルボキシアルデヒドから化合物 186 を調製した。[M+H]⁺ C₂₂H₁₈N₆O₂ についての計算値：399.15；実測値：399.47。

【0364】

実施例 87

N-(1H, 1'-H-[2, 5'-ビベンゾ [d] イミダゾール]-5-イル)-4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド (化合物 187)

【化 2 2 3】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-ジメチルアミノベンゾイル)アニリンおよびベンズイミダゾール-5-カルボキシアルデヒドから化合物 187 を調製した。[M+H]⁺ C₂₃H₂₀N₆O についての計算値：397.17；実測値：397.52。

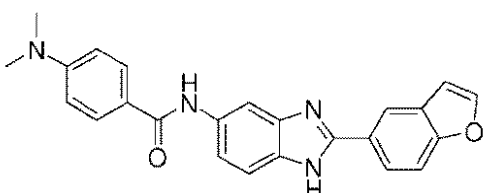
10

【0365】

実施例 88

N-(2-(ベンゾフラン-5-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド (化合物 188)

【化 2 2 4】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-ジメチルアミノベンゾイル)アニリンおよびベンゾフラン-5-カルボキシアルデヒドから化合物 188 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₀N₄O₂ についての計算値：397.16；実測値：397.52。

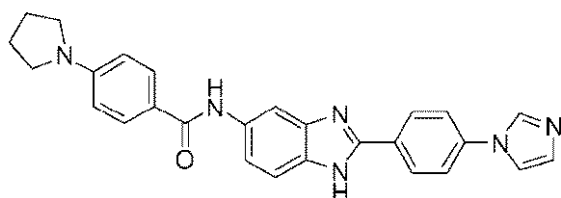
【0366】

実施例 89

2N-(2-(4-(1H-イミダゾール-1-イル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-4-(ピロリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 189)

30

【化 2 2 5】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-ピロリジン-1-イルベンゾイル)アニリンおよび4-イミダゾリルベンズアルデヒドから化合物 189 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₄N₆O についての計算値：449.21；実測値：449.48。

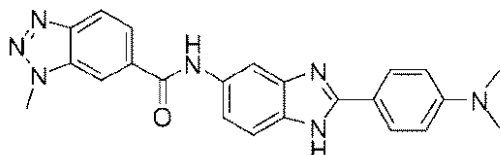
40

【0367】

実施例 90

N-(2-(4-(ジメチルアミノ)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-1-メチル-1H-ベンゾ[d][1, 2, 3]トリアゾール-6-カルボキサミド (化合物 190)

【化 2 2 6】



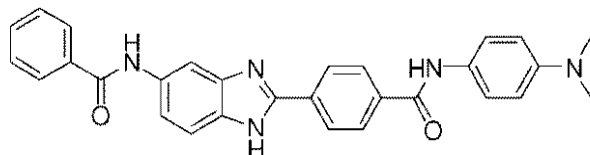
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(1-メチル-6-ベンゾトリアゾリルカルボニル)アニリンおよび4-ジメチルアミノベンズアルデヒドから化合物 190 を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 10.74 (s, 1H)、8.78 (s, 1H)、8.43 (d, J=1.5 Hz, 1H)、8.16 (dd, J=1, 8.5 Hz, 1H)、8.10 (d, J=9 Hz, 2H)、8.01 (d, J=8.5 Hz, 2H)、7.84 (dd, J=2, 9 Hz, 1H)、7.72 (d, J=9 Hz, 1H)、6.96 (d, J=9 Hz, 2H)、4.39 (s, 3H)、3.10 (s, 6H)。

【0368】

実施例 9 1

4-(5-ベンズアミド-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(4-(ジメチルアミノ)フェニル)ベンズアミド (化合物 191)

【化 2 2 7】



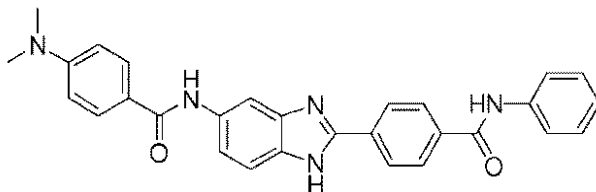
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-ジメチルアミノベンゾイル)アニリンおよび4-フェニルアミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 191 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₅N₅O₂ についての計算値：476.20；実測値：475.98。

【0369】

実施例 9 2

4-(ジメチルアミノ)-N-(2-(4-(フェニルカルバモイル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 192)

【化 2 2 8】



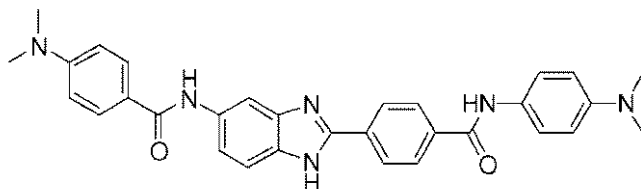
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-ベンゾイルアニリンおよび4-(4-ジメチルアミノフェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 192 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₅N₅O₂ についての計算値：476.20；実測値：475.91。

【0370】

実施例 9 3

4-(ジメチルアミノ)-N-(2-(4-(4-(ジメチルアミノ)フェニル)カルバモイル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 193)

【化 2 2 9】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-ジメチルアミノベンゾイル) アニリンおよび4-(4-ジメチルアミノフェニル) アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 1 9 3 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀N₆O₂ についての計算値：519.24；実測値：519.04。

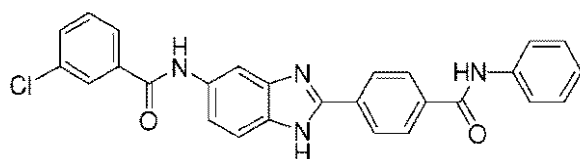
10

【0 3 7 1】

実施例 9 4

3-クロロ-N-(2-(4-(フェニルカルバモイル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 1 9 4)

【化 2 3 0】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-クロロベンゾイル) アニリンおよび4-フェニルアミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 1 9 4 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₁₉ClN₄O₂ についての計算値：467.12；実測値：466.93。

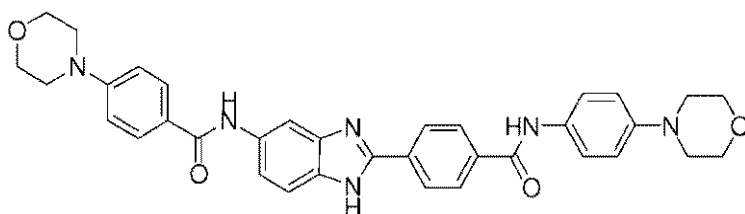
【0 3 7 2】

実施例 9 5

4-モルホリノ-N-(2-(4-(4-モルホリノフェニル)カルバモイル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 1 9 5)

30

【化 2 3 1】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-モルホリン-4-イルベンゾイル) アニリンおよび4-(4-モルホリニルフェニル) アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 1 9 5 を調製した。[M+H]⁺ C₃₅H₃₄N₆O₄ についての計算値：603.26；実測値：603.36。

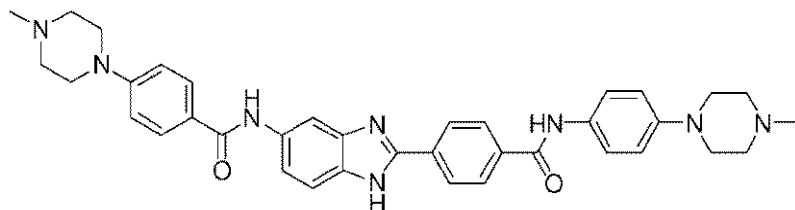
40

【0 3 7 3】

実施例 9 6

4-(4-メチルピペラジン-1-イル)-N-(2-(4-(4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル)カルバモイル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 1 9 6)

【化 2 3 2】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-(4-メチルピペラジン-1-イル)ベンゾイル)アニリンおよび4-(4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 196 を調製した。[M+H]⁺ C₃₇H₄₀N₈O₂ についての計算値: 629.33; 実測値: 629.16。

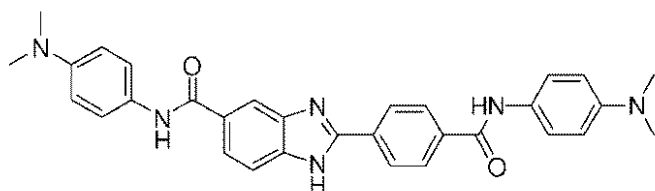
10

【0374】

実施例 97

N-(4-(ジメチルアミノ)フェニル)-2-(4-(4-(ジメチルアミノ)フェニル)カルバモイル)フェニル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-カルボキサミド (化合物 197)

【化 2 3 3】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(4-ジメチルアミノフェニル)-3, 4-ジニトロベンズアミドおよび4-(4-ジメチルアミノフェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 197 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀N₆O₂ についての計算値: 519.24; 実測値: 519.04。

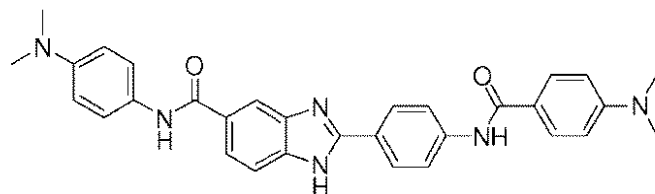
【0375】

30

実施例 98

2-(4-(4-(4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド)フェニル)-N-(4-(ジメチルアミノ)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-カルボキサミド (化合物 198)

【化 2 3 4】



40

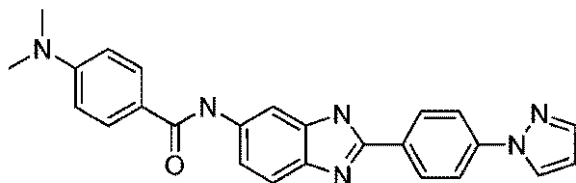
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(4-ジメチルアミノフェニル)-3, 4-ジニトロベンズアミドおよび4-(4-ジメチルアミノベンズ)アミドベンズアルデヒドから化合物 198 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀N₆O₂ についての計算値: 519.24; 実測値: 518.97。

【0376】

実施例 99

N-(2-(4-(1H-ピラゾール-1-イル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-イル)-4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド (化合物 199)

【化 2 3 5】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-ジメチルアミノベンゾイル)アニリンおよび4-イミダゾリルベンズアルデヒドから化合物 199 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₂N₆O についての計算値：423.20；実測値：423.01。

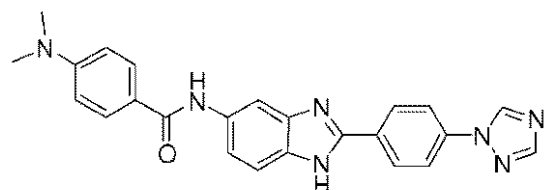
10

【0377】

実施例 100

N-(2-(4-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド (化合物 200)

【化 2 3 6】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-ジメチルアミノベンゾイル)アニリンおよび4-(1, 2, 4-トリアゾリル-1-)ベンズアルデヒドから化合物 200 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₁N₇O についての計算値：424.19；実測値：424.02。

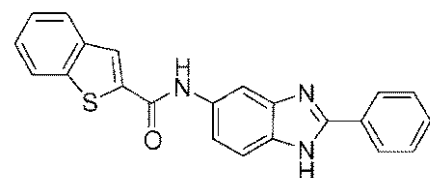
【0378】

実施例 101

N-(2-フェニル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボキサミド (化合物 201)

30

【化 2 3 7】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3, 4-ジニトロフェニル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボキサミドおよびベンズアルデヒドから化合物 201 を調製した。¹H NMR (500 MHz, CD₃OD) δ 8.18 (d, J = 2 Hz, 1H)、8.14 (s, 1H)、8.06 (d, J = 8 Hz, 2H)、7.91 (m, 2H)、7.85 (d, J = 8.5 Hz, 1H)、7.73 (d, J = 8.5 Hz, 1H)、7.60 (d, J = 8.5 Hz, 1H)、7.53 (m, 3H)、7.44 (m, 3H)。

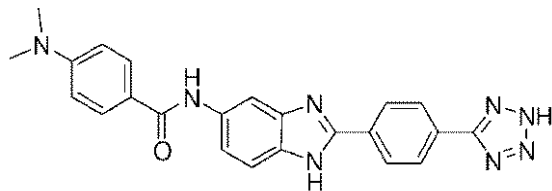
40

【0379】

実施例 102

N-(2-(4-(2H-テトラゾール-5-イル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド (化合物 202)

【化 2 3 8】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-ジメチルアミノベンゾイル)アニリンおよび4-(1, 2, 3, 5-テトラゾリル-5-)ベンズアルデヒドから化合物 202 を調製した。[M+H]⁺ C₂₃H₂₀N₈O についての計算値：415.19；実測値：424.97。

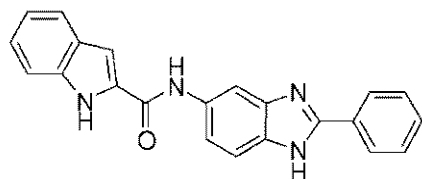
10

【0380】

実施例 103

N-(2-フェニル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-1H-インドール-2-カルボキサミド (化合物 203)

【化 2 3 9】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(インドール-2-オイル (oil)) アニリンおよびベンズアルデヒドから化合物 203 を調製した。¹H NMR (500 MHz, CD₃OD) δ 8.20 (d, J=1.5 Hz, 1H)、8.09 (dd, J=1.5, 8 Hz, 2H)、7.66 (d, J=8 Hz, 1H)、7.61 (d, J=8.5 Hz, 1H)、7.57~7.52 (m, 4H)、7.48 (dd, J=0.5, 8 Hz, 1H)、7.34 (s, 1H)、7.25 (dt, J=1, 7 Hz, 1H)、7.09 (dt, J=0.5, 8 Hz, 1H)。

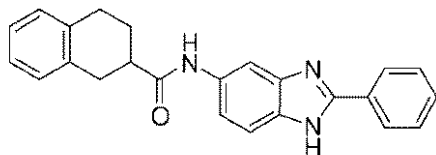
30

【0381】

実施例 104

N-(2-フェニル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-2-カルボキサミド (化合物 204)

【化 2 4 0】



40

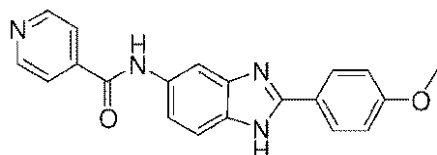
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-2-オイル) アニリンおよびベンズアルデヒドから化合物 204 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₁N₃O についての計算値：368.17；実測値：368.00。

【0382】

実施例 105

N-(2-(4-メトキシフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)イソニコチンアミド (化合物 205)

【化 2 4 1】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(ピリジン-4-オイル) アニリンおよび4-メトキシベンズアルデヒドから化合物 205 を調製した。[M+H]⁺ C₂₀H₁₆N₄O₂ についての計算値：345.13；実測値：345.00。

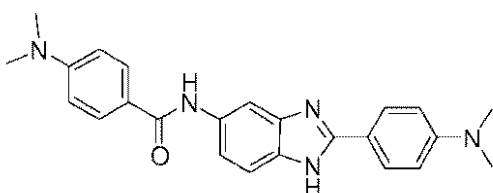
10

【0383】

実施例 106

4-(ジメチルアミノ)-N-(2-(4-(ジメチルアミノ)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物 206)

【化 2 4 2】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-ジメチルアミノベンゾイル) アニリンおよび4-ジメチルアミノベンズアルデヒドから化合物 206 を調製した。¹H NMR (300 MHz, DMSO-d₆) δ 10.20 (s, 1H)、8.39 (s, 1H)、8.11 (d, J=8 Hz, 2H)、7.90 (d, J=9 Hz, 2H)、7.81 (d, J=9 Hz, 2H)、7.68 (d, J=9 Hz, 2H)、6.95 (d, J=9 Hz, 2H)、6.78 (d, J=9 Hz, 2H)、3.07 (s, 6H)、2.99 (s, 6H)。

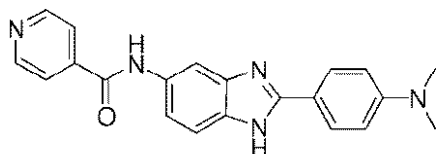
30

【0384】

実施例 107

N-(2-(4-(ジメチルアミノ)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)イソニコチンアミド(化合物 207)

【化 2 4 3】



40

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(ピリジン-4-オイル) アニリンおよび4-ジメチルアミノベンズアルデヒドから化合物 207 を調製した。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 10.90 (s, 1H)、8.83 (d, J=6 Hz, 2H)、8.40 (s, 1H)、8.10 (d, J=9 Hz, 2H)、7.98 (d, J=6 Hz, 2H)、7.81 (dd, J=2, 9 Hz, 1H)、7.75 (d, J=9 Hz, 1H)、6.97 (d, J=9 Hz, 2H)、3.09 (s, 6H)。

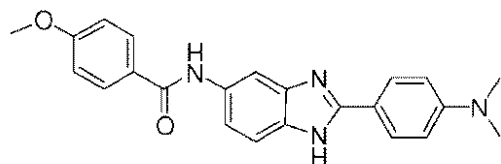
【0385】

実施例 108

50

N-(2-(4-(ジメチルアミノ)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-4-メトキシベンズアミド(化合物208)

【化244】



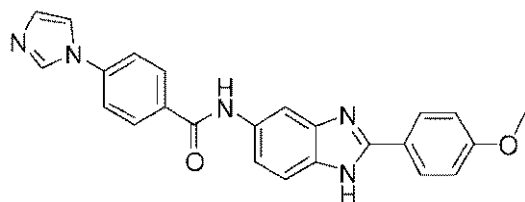
スキームIIIに表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-メトキシベンゾイル)アニリンおよび4-ジメチルアミノベンズアルデヒドから化合物208を調製した。¹H NMR(500MHz、DMSO-d₆) δ 10.41(s, 1H)、8.39(d, J=1.5Hz、1H)、8.08(d, J=9.5Hz、2H)、8.01(d, J=7Hz、2H)、7.79(dd, J=2、9Hz、1H)、7.67(d, J=9Hz、1H)、7.09(d, J=9Hz、2H)、6.96(d, J=9Hz、2H)、3.82(s, 3H)、3.08(s, 6H)。

【0386】

実施例109

4-(1H-イミダゾール-1-イル)-N-(2-(4-メトキシフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物209)

【化245】



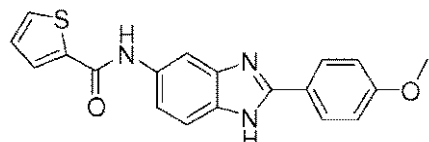
スキームIIIに表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-イミダゾール-1-イル)ベンゾイル)アニリンおよび4-メトキシベンズアルデヒドから化合物209を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₁₉N₅O₂についての計算値：410.05；実測値：410.00。

【0387】

実施例110

N-(2-(4-メトキシフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)チエン-2-カルボキサミド(化合物210)

【化246】



スキームIIIに表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(チエン-2-オイル)アニリンおよび4-メトキシベンズアルデヒドから化合物210を調製した。[M+H]⁺ C₁₉H₁₅N₃O₂Sについての計算値：350.09；実測値：349.89。

【0388】

実施例111

N,2-ビス(4-モルホリノフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-カルボキサミド(化合物211)

10

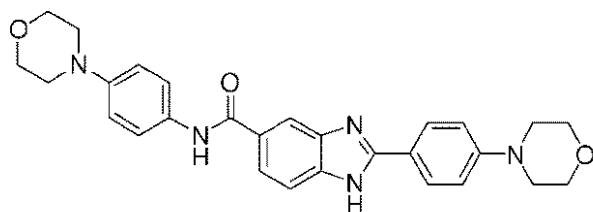
20

30

40

50

【化 2 4 7】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(4-モルホリニルフェニル)-3,4-ジニトロベンズアミドおよび4-モルホリニルベンズアルデヒドから化合物 2 1 1 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₉N₅O₃ についての計算値：484.23；実測値：483.92。

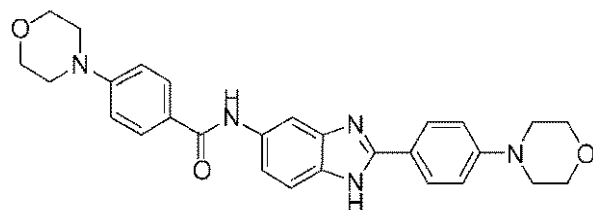
10

【0389】

実施例 1 1 2

4-モルホリノ-N-(2-(4-モルホリノフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 2 1 2)

【化 2 4 8】



20

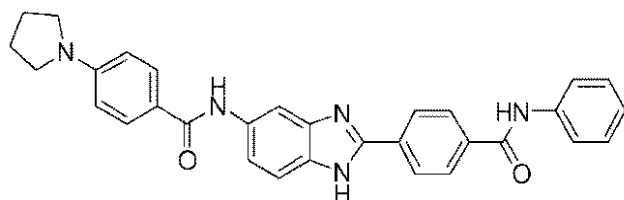
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-モルホリノ-4-イルベンゾイル)アニリンおよび4-モルホリニルベンズアルデヒドから化合物 2 1 2 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₉N₅O₃ についての計算値：484.23；実測値：483.94。

【0390】

実施例 1 1 3

N-フェニル-4-(5-(4-(ピロリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド (化合物 2 1 3)

【化 2 4 9】



40

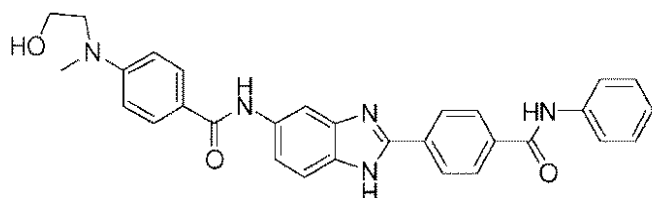
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-ピロリジニルベンズアミドおよび4-フェニルアミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 2 1 3 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₇N₅O₂ についての計算値：502.23；実測値：502.03。

【0391】

実施例 1 1 4

4-((2-ヒドロキシエチル)(メチル)アミノ)-N-(2-(4-(フェニルカルバモイル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 2 1 4)

【化 2 5 0】



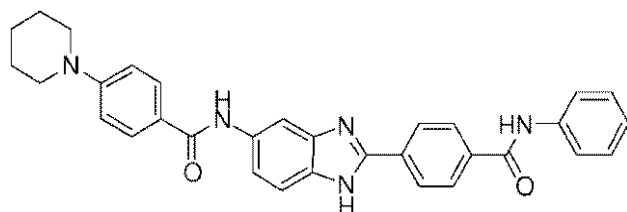
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-(N-メチル-N-2-ヒドロキシエチルアミノ)ベンズアミドおよび4-フェニルアミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 2 1 4 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₇N₅O₃ についての計算値：506.22；実測値：506.01。

【0392】

実施例 1 1 5

N-フェニル-4-(5-(4-(ピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド (化合物 2 1 5)

【化 2 5 1】



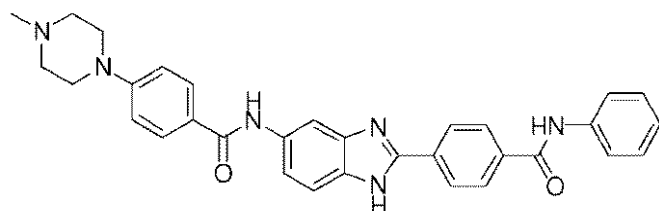
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-ピペリジニルベンズアミドおよび4-フェニルアミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 2 1 5 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₂₉N₅O₂ についての計算値：516.24；実測値：516.07。

【0393】

実施例 1 1 6

4-(4-メチルピペラジン-1-イル)-N-(2-(4-(フェニルカルバモイル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 2 1 6)

【化 2 5 2】



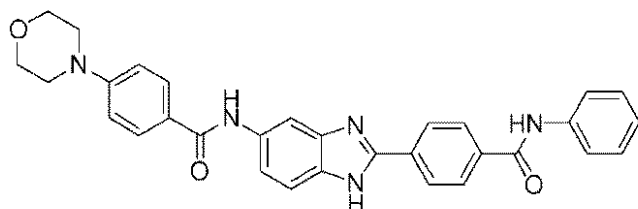
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-(1-メチル-4-ピペラジニル)ベンズアミドおよび4-フェニルアミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 2 1 6 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₀N₆O₂ についての計算値：531.25；実測値：531.05。

【0394】

実施例 1 1 7

4-モルホリノ-N-(2-(4-(フェニルカルバモイル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 2 1 7)

【化 2 5 3】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-ホルホルニルベンズアミドおよび4-フェニルアミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 2 1 7 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₇N₅O₃ についての計算値：518.22；実測値：518.03。

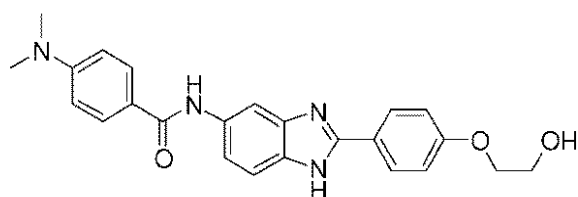
10

【0395】

実施例 1 1 8

4-(ジメチルアミノ)-N-(2-(4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 2 1 8)

【化 2 5 4】



20

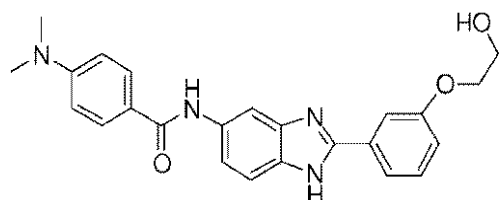
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-ジメチルアミノベンズアミドおよび4-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ベンズアルデヒドから化合物 2 1 8 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₄N₄O₃ についての計算値：417.19；実測値：417.00。

【0396】

実施例 1 1 9

4-(ジメチルアミノ)-N-(2-(3-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 2 1 9)

【化 2 5 5】



30

40

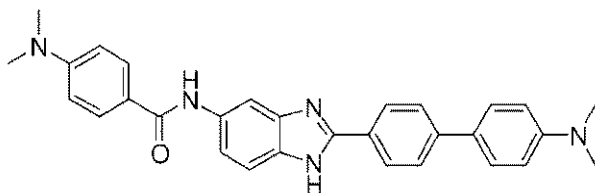
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-ジメチルアミノベンズアミドおよび3-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ベンズアルデヒドから化合物 2 1 9 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₄N₄O₃ についての計算値：417.19；実測値：416.94。

【0397】

実施例 1 2 0

4-(ジメチルアミノ)-N-(2-(4'-(ジメチルアミノ)-[1,1'-ビフェニル]-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 2 2 0)

【化 2 5 6】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-ジメチルアミノベンズアミドおよび4-(4-ジメチルアミノフェニル)ベンズアルデヒドから化合物 2 2 0 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₉N₅O についての計算値：476.24；実測値：475.98。

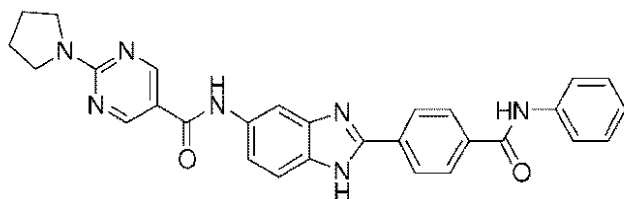
10

【0 3 9 8】

実施例 1 2 1

N-(2-(4-(フェニルカルバモイル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-2-(ピロリジン-1-イル)ピリミジン-5-カルボキサミド (化合物 2 2 1)

【化 2 5 7】



20

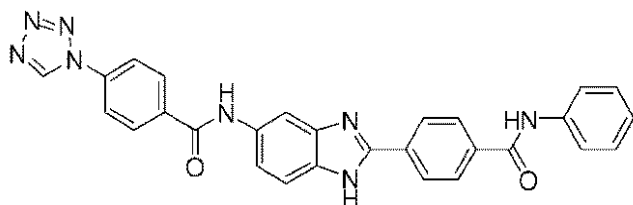
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-2-(ピロリジン-1-イル)ピリミジン-5-カルボキサミドおよび4-フェニルアミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 2 2 1 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₅N₇O₂ についての計算値：504.22；実測値：503.92。

【0 3 9 9】

実施例 1 2 2

4-(5-(4-(1H-テトラゾール-1-イル)ベンズアミド)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-フェニルベンズアミド (化合物 2 2 2)

【化 2 5 8】



40

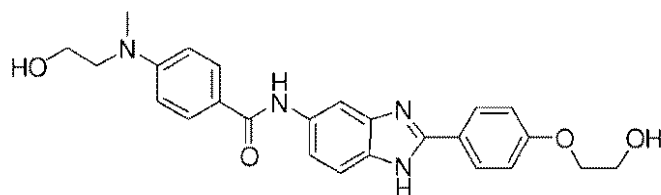
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-テトラゾリルベンズアミドおよび4-フェニルアミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 2 2 2 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₀N₈O₂ についての計算値：501.18；実測値：500.88。

【0 4 0 0】

実施例 1 2 3

N-(2-(4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-4-((2-ヒドロキシエチル)(メチル)アミノ)ベンズアミド (化合物 2 2 3)

【化 2 5 9】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-(N-メチル-N-2-ヒドロキシエチルアミノ)ベンズアミドおよび4-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ベンズアルデヒドから化合物 2 2 3 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₆N₄O₄ についての計算値：447.21；実測値：446.89。

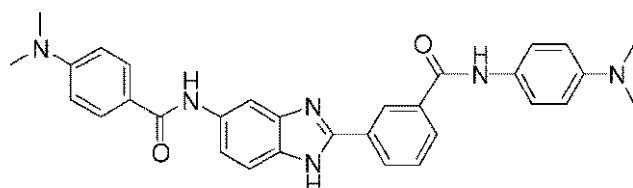
10

【0401】

実施例 1 2 4

3-(5-(4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(4-(ジメチルアミノ)フェニル)ベンズアミド (化合物 2 2 4)

【化 2 6 0】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-ジメチルアミノベンゾ)アニリンおよび3-(4-ジメチルアミノフェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 2 2 4 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀N₆O₂ についての計算値：519.25；実測値：519.04。

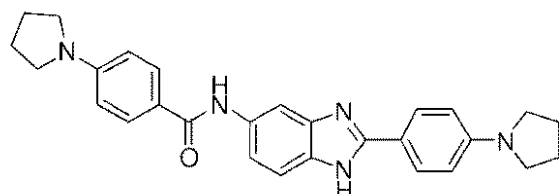
【0402】

実施例 1 2 5

4-(ピロリジン-1-イル)-N-(2-(4-(ピロリジン-1-イル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 2 2 5)

30

【化 2 6 1】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-ピロリジニルベンズアミドおよび4-ピロリジニルベンズアルデヒドから化合物 2 2 5 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₉N₅O についての計算値：452.25；実測値：451.95。

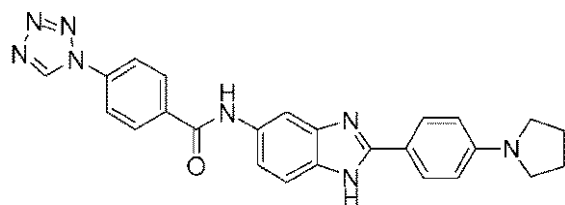
40

【0403】

実施例 1 2 6

N-(2-(4-(ピロリジン-1-イル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-4-(1H-テトラゾール-1-イル)ベンズアミド (化合物 2 2 6)

【化 2 6 2】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-テトラゾリルベンズアミドおよび4-ピロリジニルベンズアルデヒドから化合物 2 2 6 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₂N₈O についての計算値：451.20；実測値：451.50。

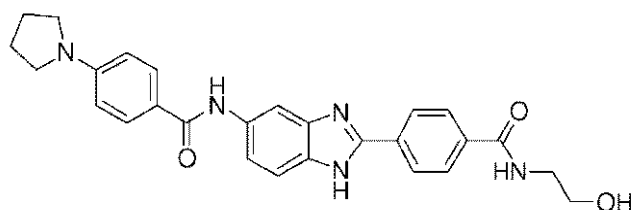
10

【0404】

実施例 1 2 7

N-(2-ヒドロキシエチル)-4-(5-(4-(ピロリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド (化合物 2 2 7)

【化 2 6 3】



20

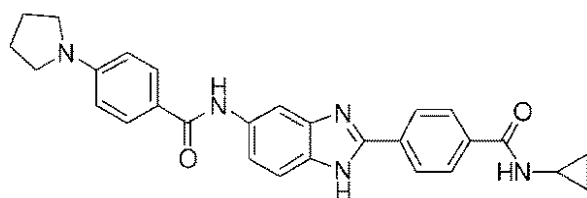
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-ピロリジニルベンズアミドおよび4-(2-ヒドロキシエチル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 2 2 7 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₇N₅O₃ についての計算値：470.22；実測値：469.58。

【0405】

実施例 1 2 8

N-シクロプロピル-4-(5-(4-(ピロリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド (化合物 2 2 8)

【化 2 6 4】



40

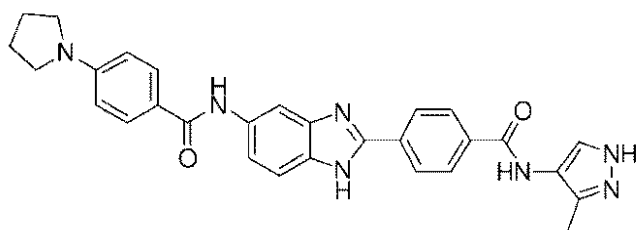
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-ピロリジニルベンズアミドおよび4-シクロプロピルアミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 2 2 8 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₇N₅O₂ についての計算値：466.23；実測値：466.55。

【0406】

実施例 1 2 9

N-(2,3-ジヒドロキシプロピル)-4-(5-(4-(ピロリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド (化合物 2 2 9)

【化 2 6 8】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-ピロリジニルベンズアミドおよび4-(3-メチル-4-ピラゾリル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 232 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₇N₇O₂ についての計算値：506.23；実測値：506.25。

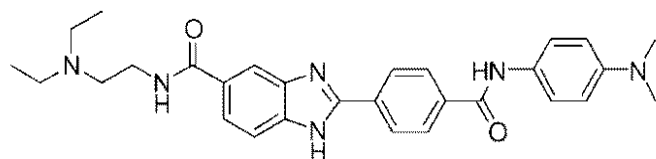
10

【0410】

実施例 133

N-(2-(ジエチルアミノ)エチル)-2-(4-(4-(ジメチルアミノ)フェニル)カルバモイル)フェニル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-カルボキサミド (化合物 233)

【化 2 6 9】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(2-N,N-ジエチルアミノエチル)-ジニトロフェニル-3,4-ジニトロベンズアミドおよび4-(4-ジメチルアミノフェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 233 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₄N₆O₂ についての計算値：499.27；実測値：499.61。

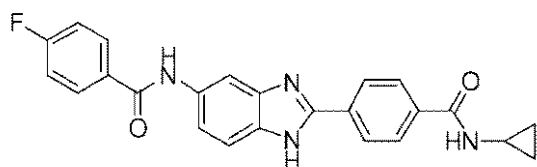
【0411】

30

実施例 134

N-シクロプロピル-4-(5-(4-フルオロベンズアミド)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド (化合物 234)

【化 2 7 0】



40

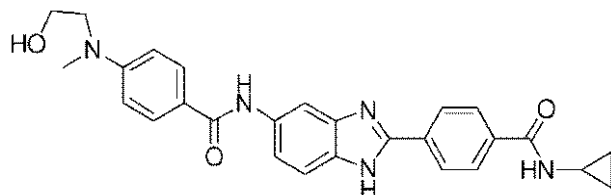
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-フルオロベンズアミドおよび4-シクロプロピルアミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 234 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₁₉FN₄O₂ についての計算値：415.16；実測値：415.53。

【0412】

実施例 135

N-シクロプロピル-4-(5-(4-(2-ヒドロキシエチル)(メチル)アミノ)ベンズアミド)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド (化合物 235)

【化 2 7 1】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-(N-2-ヒドロキシエチル-N-メチルアミノ)ベンズアミドおよび4-シクロプロピルアミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 2 3 5 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₇N₅O₃ についての計算値：470.22；実測値：470.60。

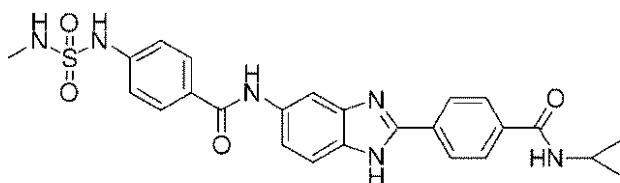
10

【0 4 1 3】

実施例 1 3 6

N-シクロプロピル-4-(5-(4-(N-メチルスルファモイル)アミノ)ベンズアミド)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド(化合物 2 3 6)

【化 2 7 2】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-メチルアミノスルホンアミド)ベンズアミドおよび4-シクロプロピルアミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 2 3 6 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₄N₆O₄S についての計算値：505.17；実測値：504.47。

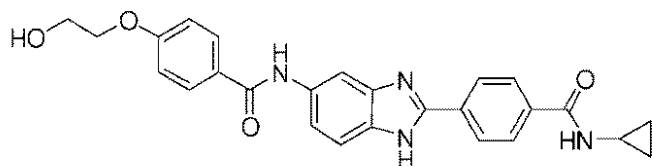
【0 4 1 4】

実施例 1 3 7

N-シクロプロピル-4-(5-(4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンズアミド)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド(化合物 2 3 7)

30

【化 2 7 3】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンズアミドおよび4-シクロプロピルアミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 2 3 7 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₄N₄O₄ についての計算値：457.19；実測値：457.51。

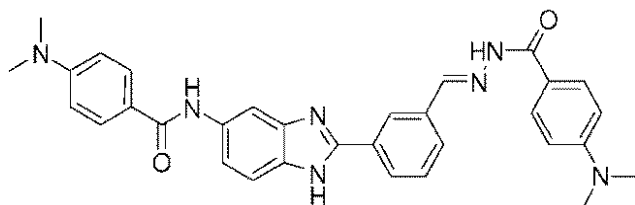
40

【0 4 1 5】

実施例 1 3 8

(E)-4-(ジメチルアミノ)-N-(2-(3-(2-(4-(ジメチルアミノ)ベンゾイル)ヒドラゾノ)メチル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物 2 3 8)

【化 2 7 4】



スキーム I に表される手順にしたがって、4-ジメチルアミノベンゾヒドラジドおよび 3-(5-(4-ジメチルアミノベンズアミド)ベンズイミダゾール-2-)ベンズアルデヒドから化合物 238 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₁N₇O₂ についての計算値：546.26；実測値：546.65。

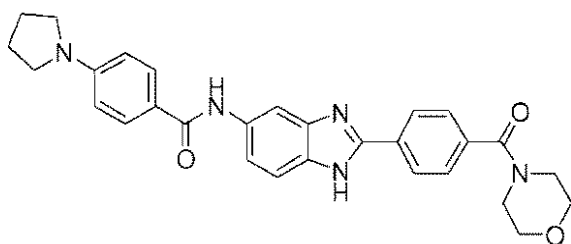
10

【0416】

実施例 139

N-(2-(4-(モルホリン-4-カルボニル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-4-(ピロリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 239)

【化 2 7 5】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-ピロリジニルベンズアミドおよび 4-モルホリニルカルボニルベンズアルデヒドから化合物 239 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₉N₅O₃ についての計算値：496.24；実測値：496.25。

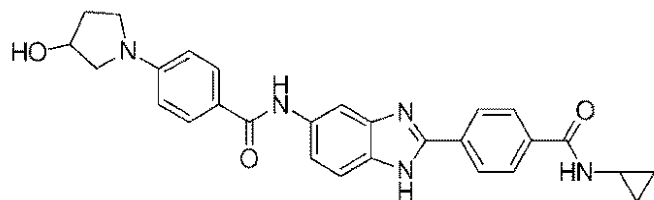
【0417】

30

実施例 140

N-(シクロプロピル-4-(5-(4-(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド (化合物 240)

【化 2 7 6】



40

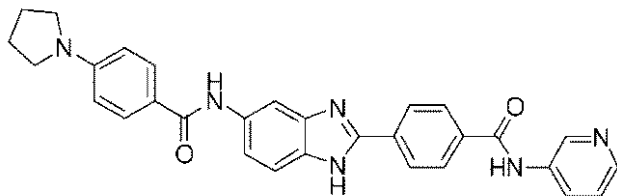
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-(3-ヒドロキシピロリジニル)ベンズアミドおよび 4-シクロプロピルアミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 240 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₇N₅O₃ についての計算値：482.22；実測値：481.93。

【0418】

実施例 141

N-(ピロリジン-3-イル)-4-(5-(4-(ピロリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド (化合物 241)

【化 2 7 7】



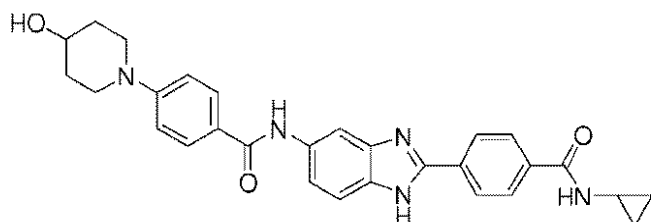
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-ピロリジニルベンズアミドおよび4-(3-ピリジニルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 2 4 1 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₆N₆O₂ 10
 についての計算値：503.22；実測値：502.97。

【0 4 1 9】

実施例 1 4 2

N-シクロプロピル-4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド (化合物 2 4 2)

【化 2 7 8】



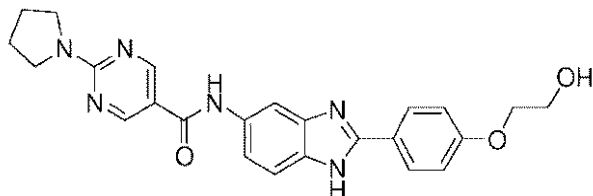
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-(2-ヒドロキシピペリジニル)ベンズアミドおよび4-シクロプロピルアミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 2 4 2 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₉N₅O₃ 20
 についての計算値：496.24；実測値：495.95。

【0 4 2 0】

実施例 1 4 3

N-(2-(4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-2-(ピロリジン-1-イル)ピリミジン-5-カルボキサミド (化合物 2 4 3)

【化 2 7 9】



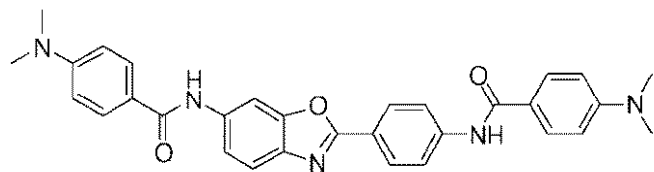
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-2-(ピロリジン-1-イル)ピリミジン-5-カルボキサミドおよび4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンズアルデヒドから化合物 2 4 3 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₄N₆O₃ 40
 についての計算値：445.20；実測値：444.87。

【0 4 2 1】

実施例 1 4 4

4-(ジメチルアミノ)-N-(4-(6-(4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)フェニル)ベンズアミド (化合物 2 4 4)

【化 2 8 0】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3-ヒドロキシ-4-ニトロ)フェニル-4-ジメチルアミノベンズアミドおよび4-(4-ジメチルアミノベンズ)アミドベンズアルデヒドから化合物 2 4 4 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₉N₅O₃ についての計算値：520.23；実測値：520.60。

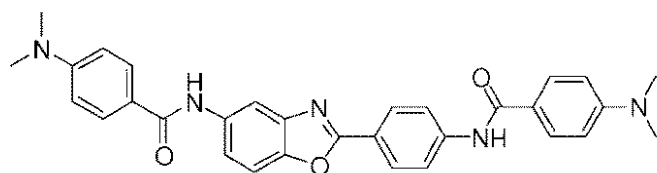
10

【0 4 2 2】

実施例 1 4 5

4-(ジメチルアミノ)-N-(4-(5-(4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)フェニル)ベンズアミド (化合物 2 4 5)

【化 2 8 1】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(4-ヒドロキシ-3-ニトロ)フェニル-4-ジメチルアミノベンズアミドおよび4-(4-ジメチルアミノベンズ)アミドベンズアルデヒドから化合物 2 4 5 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₉N₅O₃ についての計算値：520.23；実測値：520.60。

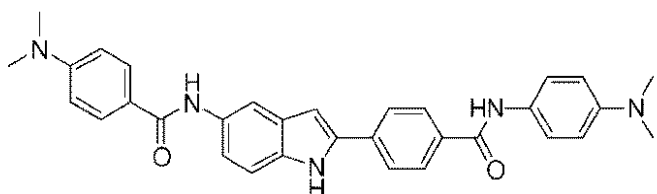
【0 4 2 3】

実施例 1 4 6

4-(ジメチルアミノ)-N-(2-(4-(4-(ジメチルアミノ)フェニル)カルバモイル)フェニル)-1H-インドール-5-イル)ベンズアミド (化合物 2 4 6)

30

【化 2 8 2】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、5-ニトロ-2-(4-メトキシカルボニルフェニル)インドール、4-ジメチルアミノアニリン、および4-ジメチルアミノ安息香酸から化合物 2 4 6 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀N₆O₂ についての計算値：519.25；実測値：519.59。

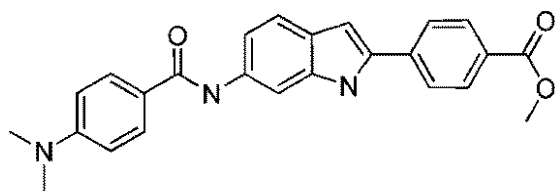
40

【0 4 2 4】

実施例 1 4 7

メチル 4-(6-(4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド)-1H-インドール-2-イル)ベンズエート (化合物 2 4 7)

【化 2 8 3】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、5-ニトロ-2-(4-メトキシカルボニルフェニル)インドールおよび4-ジメチルアミノ安息香酸から化合物 247 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₂N₄O₃ についての計算値：415.17；実測値：415.60。

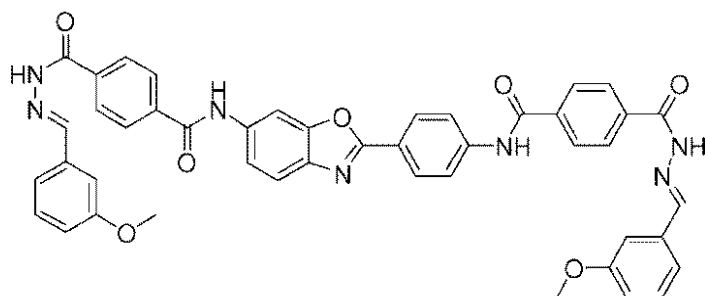
10

【0425】

実施例 148

4-((E)-2-(3-メトキシベンジリデン)ヒドラジンカルボニル)-N-(4-(6-(4-((E)-2-(3-メトキシベンジリデン)ヒドラジンカルボニル)ベンズアミド)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)フェニル)ベンズアミド (化合物 248)

【化 2 8 4】



20

スキーム I I に表されるものと同様の手順にしたがって、2-フェニルベンゾオキサゾール-ビス-ヒドラジドおよび3-メトキシベンズアルデヒドから化合物 248 を調製した。[M+H]⁺ C₄₅H₃₅N₇O₇ についての計算値：786.26；実測値：786.23。

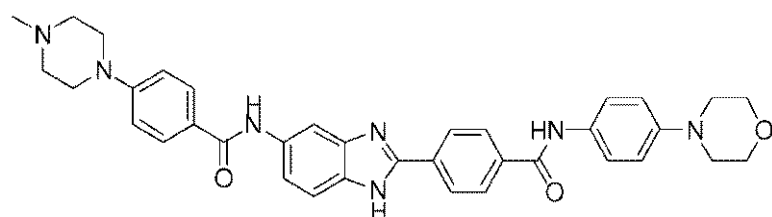
30

【0426】

実施例 149

4-(4-メチルピペラジン-1-イル)-N-(2-(4-(4-モルホリノフェニル)カルバモイル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 249)

【化 2 8 5】



40

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-(4-メチルピペラジニル)ベンズアミドおよび4-(4-モルホリノフェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 249 を調製した。[M+H]⁺ C₃₆H₃₇N₇O₃ についての計算値：616.30；実測値：616.09。

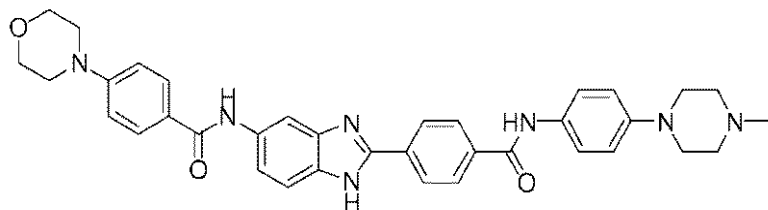
【0427】

50

実施例 150

N-(4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル)-4-(5-(4-モルホリノベンズアミド)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド (化合物 250)

【化 286】



10

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-モルホリノベンズアミドおよび4-(4-(4-メチルピペラジニル)フェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 250 を調製した。[M+H]⁺

C₃₆H₃₇N₇O₃ についての計算値：616.30；実測値：616.13。

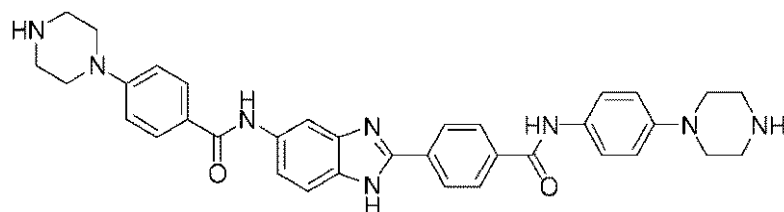
【0428】

実施例 151

4-(ピペラジン-1-イル)-N-(2-(4-(4-(ピペラジン-1-イル)フェニル)カルバモイル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 251)

20

【化 287】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-ピペラジニルベンズアミドおよび4-(4-(4-メチルピペラジニル)フェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 251 を調製した。[M+H]⁺

30

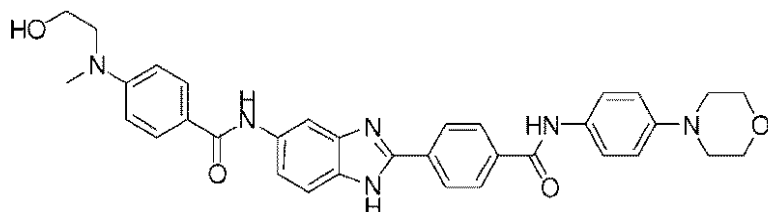
C₃₅H₃₆N₈O₂ についての計算値：601.30；実測値：601.19。

【0429】

実施例 152

4-((2-ヒドロキシエチル)(メチル)アミノ)-N-(2-(4-(4-モルホリノフェニル)カルバモイル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 252)

【化 288】



40

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-(3,4-ジニトロフェニル)-4-(N-メチル-N-2-ヒドロキシエチルアミノ)-ベンズアミドおよび4-(4-モルホリノフェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 252 を調製した。[M+H]⁺

C₃₄H₃₄N₆O₄ についての計算値：591.26；実測

50

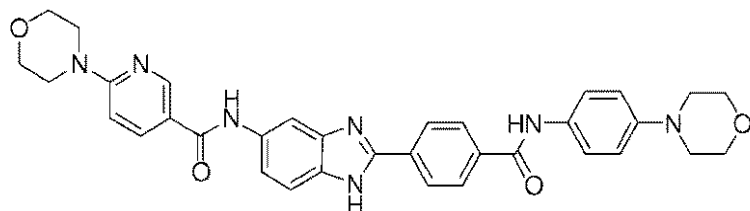
値：591.06。

【0430】

実施例153

6-モルホリノ-N-(2-(4-(4-モルホリノフェニル)カルバモイル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ニコチンアミド(化合物253)

【化289】



10

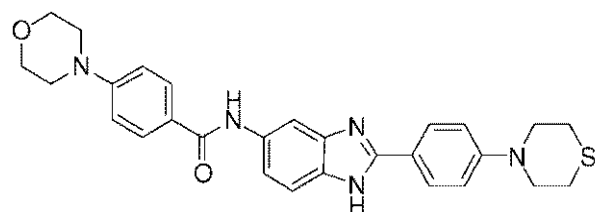
スキームIIIに表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(2-モルホリニル-5-ピリジンカルボニル)アニリンおよび4-(4-モルホリニルフェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物253を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{34}H_{33}N_7O_4$ についての計算値：604.26；実測値：604.10。

【0431】

実施例154

4-モルホリノ-N-(2-(4-チオモルホリノフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物254)

【化290】



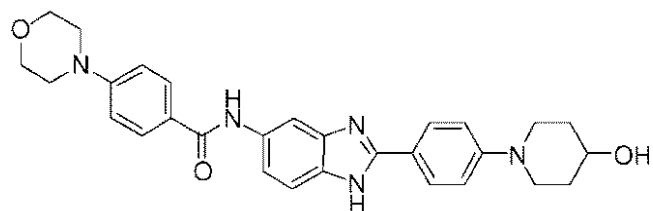
スキームIIIに表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-チオモルホリニルベンゾイル)アニリンおよび4-モルホリニルベンズアルデヒドから化合物254を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{28}H_{29}N_5O_2S$ についての計算値：500.20；実測値：500.00。

【0432】

実施例155

N-(2-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド(化合物255)

【化291】



40

スキームIIIに表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-モルホリニルベンズ)アニリンおよび4-(4-ヒドロキシピペリジニル)ベンズアルデヒドから化合物255を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{29}H_{31}N_5O_3$ についての計算値：498.24；実測値：497.98。

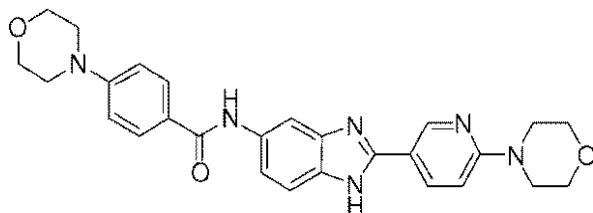
【0433】

50

実施例 156

4-モルホリノ-N-(2-(6-モルホリノピリジン-3-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物256)

【化292】



10

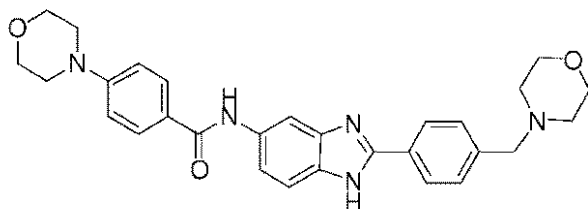
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-モルホリニルベンズ)アニリンおよび6-モルホリニルピリジン-3-カルボキシアルデヒドから化合物256を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₈N₆O₃ についての計算値: 485.22; 実測値: 484.99。

【0434】

実施例 157

4-モルホリノ-N-(2-(4-(モルホリノメチル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物257)

【化293】



20

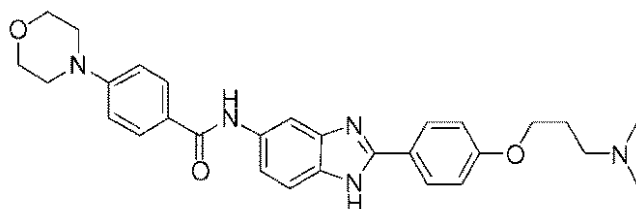
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-モルホリニルベンズ)アニリンおよび4-モルホリノメチルベンズアルデヒドから化合物257を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₁N₅O₃ についての計算値: 498.24; 実測値: 498.02。

【0435】

実施例 158

N-(2-(4-(3-(ジメチルアミノ)プロポキシ)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド(化合物258)

【化294】



40

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-モルホリニルベンズ)アニリンおよび4-(3-ジメチルアミノプロピルオキシ)ベンズアルデヒドから化合物258を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₃N₅O₃ についての計算値: 500.26; 実測値: 500.01。

【0436】

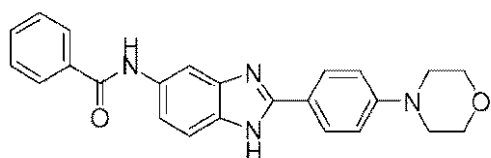
実施例 159

N-(2-(4-モルホリノフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)

50

ベンズアミド（化合物 259）

【化 295】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-ベンゾイルアニリンおよび4-モルホリニルベンズアルデヒドから化合物 259 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₂N₄O₂ についての計算値：399.18；実測値：398.99。

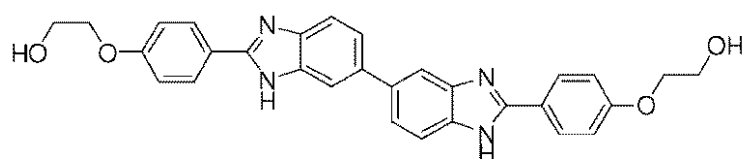
10

【0437】

実施例 160

2,2'-((1H,3'H-[5,5'-ビベンゾ[d]イミダゾール]-2,2'-ジイルビス(4,1-フェニレン))ビス(オキシ))ジエタノール（化合物 260）

【化 296】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,3'-ジアミノベンジンおよび4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンズアルデヒドから化合物 260 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₆N₄O₄ についての計算値：507.20；実測値：507.00。

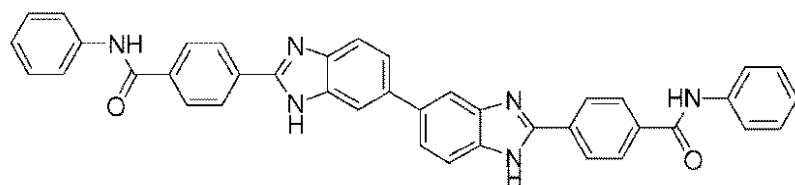
【0438】

実施例 161

4,4'-((1H,3'H-[5,5'-ビベンゾ[d]イミダゾール]-2,2'-ジイル)ビス(N-フェニルベンズアミド))（化合物 261）

30

【化 297】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,3'-ジアミノベンジンおよび4-フェニルアミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 261 を調製した。[M+H]⁺ C₄₀H₂₈N₆O₂ についての計算値：625.23；実測値：625.53。

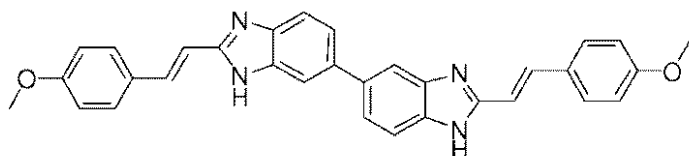
40

【0439】

実施例 162

2,2'-ビス((E)-4-メトキシスチル)-1H,3'H-5,5'-ビベンゾ[d]イミダゾール（化合物 262）

【化 2 9 8】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 3'-ジアミノベンジジンおよび3-(4-メトキシフェニル)アクリルアルデヒドから化合物262を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{32}H_{26}N_4O_2$ についての計算値：499.21；実測値：499.00。

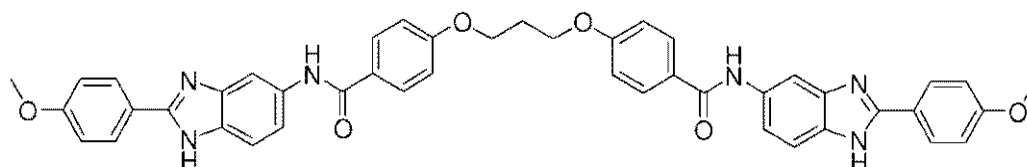
10

【0440】

実施例163

4, 4'-(プロパン-1, 3-ジイルビス(オキシ))ビス(N-(2-(4-メトキシフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド) (化合物263)

【化 2 9 9】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1, 3-プロパンジオキシビス-(4-安息香酸)および5-アミノ-2-(4-メトキシフェニル)ベンズイミダゾールから化合物263を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{45}H_{38}N_6O_6$ についての計算値：759.29；実測値：759.54。

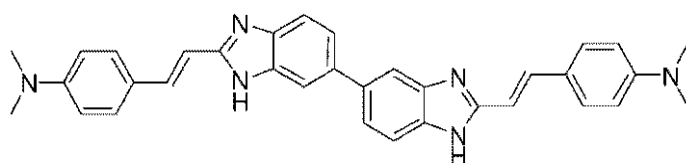
【0441】

実施例164

4, 4'-((1E, 1'E)-1H, 3'H-[5, 5'-ビベンゾ[d]イミダゾール]-2, 2'-ジイルビス(エテン-2, 1-ジイル))ビス(N, N-ジメチルアニリン) (化合物264)

30

【化 3 0 0】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 3'-ジアミノベンジジンおよび3-(4-ジメチルアミノフェニル)アクリルアルデヒドから化合物264を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{34}H_{32}N_6$ についての計算値：525.27；実測値：525.59。

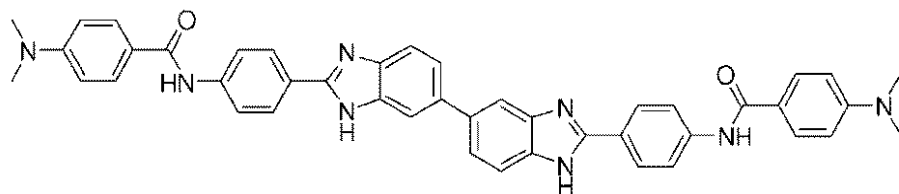
40

【0442】

実施例165

N, N'-(1H, 3'H-[5, 5'-ビベンゾ[d]イミダゾール]-2, 2'-ジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド) (化合物265)

【化 3 0 1】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 3'-ジアミノベンジジンおよび4-(4-ジメチルアミノベンズアミド)ベンズアルデヒドから化合物265を調製した。[M+H]⁺ C₄₄H₃₈N₈O₂ についての計算値: 711.31; 実測値: 711.38。

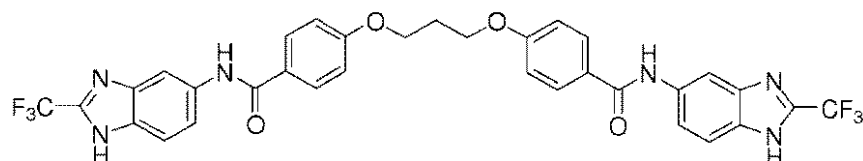
10

【0443】

実施例166

4, 4'-(プロパン-1, 3-ジイルビス(オキシ))ビス(N-(2-(トリフルオロメチル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)ベンズアミド)(化合物266)

【化 3 0 2】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1, 3-プロパンジオキシビス-(4-安息香酸)および5-アミノ-2-トリフルオロメチルベンズイミダゾールから化合物266を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₂₄F₆N₆O₄ についての計算値: 683.18; 実測値: 683.04。

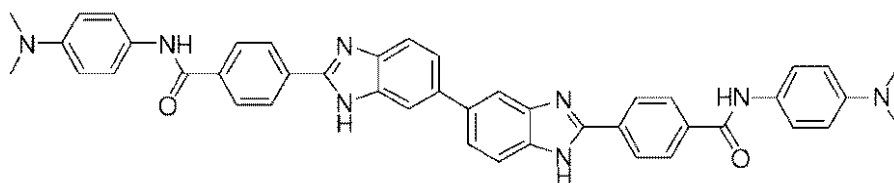
【0444】

実施例167

4, 4'-(1H, 3'H-[5, 5'-ビベンゾ[d]イミダゾール]-2, 2'-ジイル)ビス(N-(4-(ジメチルアミノ)フェニル)ベンズアミド)(化合物267)

30

【化 3 0 3】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 3'-ジアミノベンジジンおよび4-(4-ジメチルアミノフェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物267を調製した。[M+H]⁺ C₄₄H₃₈N₈O₂ についての計算値: 711.31; 実測値: 711.38。

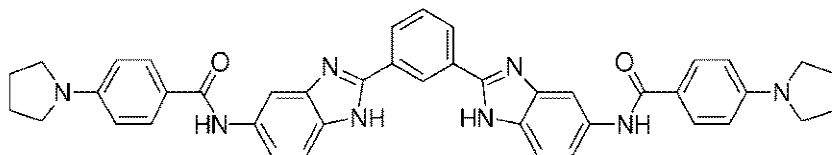
40

【0445】

実施例168

N, N'-(2, 2'-(1, 3-フェニレン)ビス(1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5, 2-ジイル))ビス(4-(ピロリジン-1-イル)ベンズアミド)(化合物268)

【化 3 0 4】



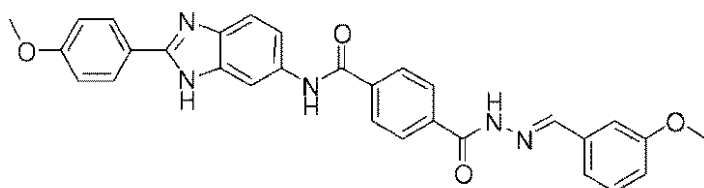
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、N-（3，4-ジニトロフェニル）-4-ピロリジニルベンズアミドおよび1，3-ベンズビスアルデヒド（benz bis aldehyde）から化合物 2 6 8 を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{42}H_{48}N_8O_2$ 10
 についての計算値：687.32；実測値：687.19。

【0 4 4 6】

実施例 1 6 9

（E）-4-（2-（3-メトキシベンジリデン）ヒドラジンカルボニル）-N-（2-（4-メトキシフェニル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-イル）ベンズアミド（化合物 2 6 9）

【化 3 0 5】



スキーム V に表される一般的な手順にしたがって、化合物 2 6 9 を調製した。メチル 4-（（2-（4-メトキシフェニル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-イル）カルバモイル）ベンゾエートの調製：2-（4-メトキシフェニル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-アミン（120mg、0.5mmol）およびメチル 4-（クロロカルボニル）ベンゾエート（80mg、0.4mmol）を 20mL のバイアルに入れ、ピリジン（2.0mL）を添加し、しっかりと蓋を閉めた。固体が析出されるまで反応混合物を室温で 2 時間攪拌した。この混合物に、10mL の EtOAc を添加し、さらに 1 5 分間攪拌してからろ過した。ろ過ケーキを、大量の水で、次にいくつかの EtOAc（10mL）で洗浄し、乾燥させて、純粋な表題化合物（70mg、44%の収率）を得た。 20
 。

【0 4 4 7】

4-（ヒドラジンカルボニル）-N-（2-（4-メトキシフェニル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-イル）ベンズアミドの調製：15-mL の密閉管中で、メチル 4-（（2-（4-メトキシフェニル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-イル）カルバモイル）ベンゾエート（28mg、0.07mmol）を 2mL の無水エタノールに溶解させ、ヒドラジン（1mL）を添加した。反応混合物を、油浴中、70℃で一晩加熱した。翌朝、反応混合物を蒸発乾固させて、表題化合物（28mg、99%、95%より高い純度（ ^1H -NMRにより測定））を得た。この化合物をさらに全く精製せずに次の工程に使用した。 40

【0 4 4 8】

化合物 2 6 9 の調製：20-mL の密閉管中で、4-（ヒドラジンカルボニル）-N-（2-（4-メトキシフェニル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-イル）ベンズアミド（28mg、0.07mmol）を 2mL の無水エタノールに溶解させ、次に、氷酢酸（1.0mL）および酢酸ナトリウム（20mg）を添加した。反応混合物を、油浴中、72℃で一晩加熱した。翌朝、水（5.0mL）を添加し、15分間攪拌してからろ過した。ろ過ケーキを、水、ヘキサン、酢酸エチルで洗浄し、乾燥させて、純粋な化合物 2 6 9（10mg、27%の収率）を得た。 $[M+H]^+$ $C_{30}H_{25}N_5O_4$ 50

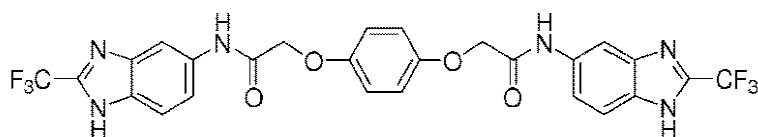
いての計算値：520.19；実測値：519.98。

【0449】

実施例170

2, 2' - (1, 4 - フェニレンビス (オキシ)) ビス (N - (2 - (トリフルオロメチル) - 1H - ベンゾ [d] イミダゾール - 5 - イル) アセトアミド) (化合物270)

【化306】



10

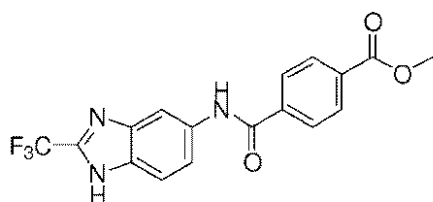
スキームVに表されるものと同様の手順にしたがって、1, 4 - フェニルジオキシビスアセテートおよび5 - アミノ - 2 - トリフルオロメチルベンズイミダゾールから化合物270を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₁₈F₆N₆O₄についての計算値：593.13；実測値：592.86。

【0450】

実施例171

メチル4 - ((2 - (トリフルオロメチル) - 1H - ベンゾ [d] イミダゾール - 5 - イル) カルバモイル) ベンゾエート (化合物271)

【化307】



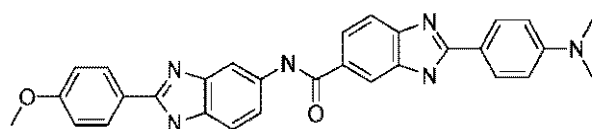
スキームVに表されるものと同様の手順にしたがって、テレフタル酸モノエステルおよび5 - アミノ - 2 - トリフルオロメチルベンズイミダゾールから化合物271を調製した。[M+H]⁺ C₁₇H₁₂F₃N₃O₃についての計算値：364.08；実測値：363.86。

【0451】

実施例172

2 - (4 - (ジメチルアミノ) フェニル) - N - (2 - (4 - メトキシフェニル) - 1H - ベンゾ [d] イミダゾール - 5 - イル) - 1H - ベンゾ [d] イミダゾール - 6 - カルボキサミド (化合物272)

【化308】



40

スキームVに表されるものと同様の手順にしたがって、2 - (4 - ジメチルアミノフェニル) - 5 - アミノベンズイミダゾールおよび2 - (4 - ジメチルアミノフェニル) ベンズイミダゾール - 5 - カルボキシレートから化合物272を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₆N₆O₂についての計算値：503.21；実測値：503.25。

【0452】

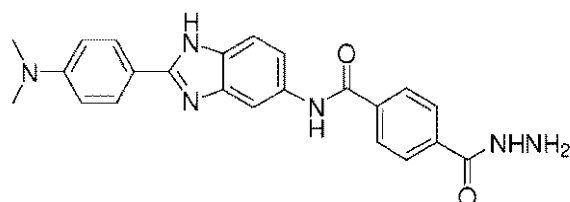
実施例173

N - (2 - (4 - (ジメチルアミノ) フェニル) - 1H - ベンゾ [d] イミダゾール - 5

50

－イル）－４－（ヒドラジンカルボニル）ベンズアミド（化合物２７３）

【化３０９】



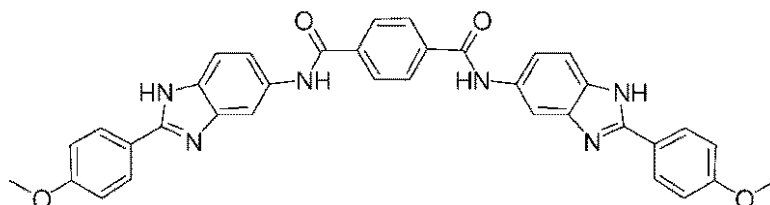
スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、２－（４－ジメチルアミノフェニル）－５－アミノベンズイミダゾールおよびテレフタル酸から化合物２７３を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{23}H_{22}N_6O_2$ についての計算値：４１５．１８；実測値：４１４．９１。

【０４５３】

実施例１７４

N^1, N^4 －ビス（２－（４－メトキシフェニル）－１Ｈ－ベンゾ[d]イミダゾール－５－イル）テレフタルアミド（化合物２７４）

【化３１０】



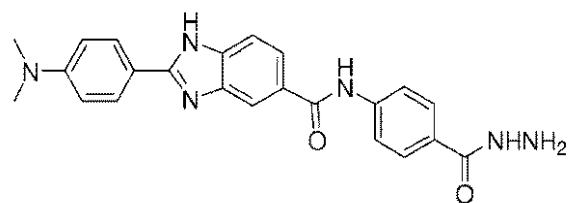
スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、２－（４－メトキシフェニル）－５－アミノベンズイミダゾールおよびテレフタル酸から化合物２７４を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{36}H_{28}N_6O_4$ についての計算値：６０９．２２；実測値：６０８．９９。

【０４５４】

実施例１７５

２－（４－（ジメチルアミノ）フェニル）－ N －（４－（ヒドラジンカルボニル）フェニル）－１Ｈ－ベンゾ[d]イミダゾール－５－カルボキサミド（化合物２７５）

【化３１１】



スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、２－（４－ジメチルアミノフェニル）ベンズイミダゾール－５－カルボン酸および４－アミノベンズヒドラジドから化合物２７５を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{23}H_{22}N_6O_2$ についての計算値：４１５．１８；実測値：４１４．９１。

【０４５５】

実施例１７６

（ E ）－４－（２－（３－メトキシベンジリデン）ヒドラジンカルボニル）－ N －（２－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－ベンゾ[d]イミダゾール－５－イル）ベンズアミド（化合物２７６）

10

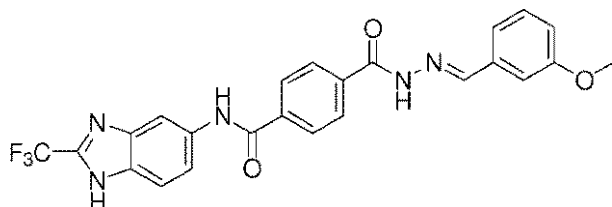
20

30

40

50

【化 3 1 2】



スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、テレフタル酸モノエステル、3-メトキシベンズアルデヒドおよび5-アミノ-2-トリフルオロメチルベンズイミダゾールから化合物 276 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₁₈F₃N₅O₃ についての計算値：482.14；実測値：481.45。

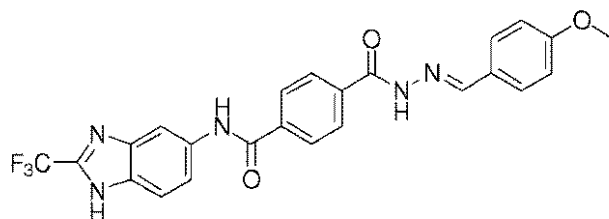
10

【0456】

実施例 177

(E)-4-(2-(4-(2-(3-(trifluoromethyl)benzimidazol-5-yl)benzoyl)phenyl)hydrazinyl)benzoic acid (化合物 277)

【化 3 1 3】



20

スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、テレフタル酸モノエステル、4-メトキシベンズアルデヒドおよび5-アミノ-2-トリフルオロメチルベンズイミダゾールから化合物 277 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₁₈F₃N₅O₃ についての計算値：482.14；実測値：481.45。

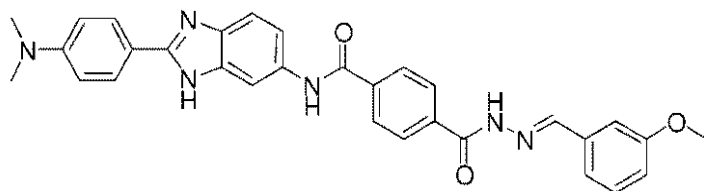
【0457】

30

実施例 178

(E)-N-(2-(4-(2-(3-(trifluoromethyl)benzimidazol-5-yl)benzoyl)phenyl)hydrazinyl)benzoic acid (化合物 278)

【化 3 1 4】



40

スキーム V に表される手順にしたがって、5-アミノ-2-(4-ジメチルアミノフェニル)ベンズイミダゾール、テレフタル酸、および3-メトキシベンズアルデヒドから化合物 278 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₈N₆O₃ についての計算値：533.22；実測値：532.96。

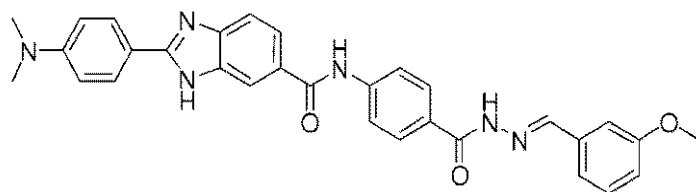
【0458】

実施例 179

(E)-2-(4-(2-(3-(trifluoromethyl)benzimidazol-5-yl)benzoyl)phenyl)hydrazinyl)benzoic acid (化合物 279)

50

【化 3 1 5】



スキーム V に表される手順にしたがって、2-（4-ジメチルアミノフェニル）ベンズイミダゾール-5-カルボン酸、4-アミノ安息香酸、および 3-メトキシベンズアルデヒドから化合物 279 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₈N₆O₃ についての計算値：533.22；実測値：532.95。

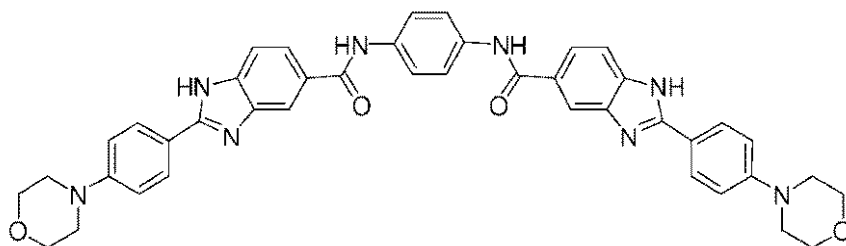
10

【0459】

実施例 180

N, N'-（1, 4-フェニレン）ビス（2-（4-モルホリノフェニル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-カルボキサミド）（化合物 280）

【化 3 1 6】



20

スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、2-（4-モルホリニルフェニル）ベンズイミダゾール-5-カルボン酸および 1, 4-フェニレンジアミンから化合物 280 を調製した。[M+H]⁺ C₄₂H₃₈N₈O₄ についての計算値：719.30；実測値：719.12。

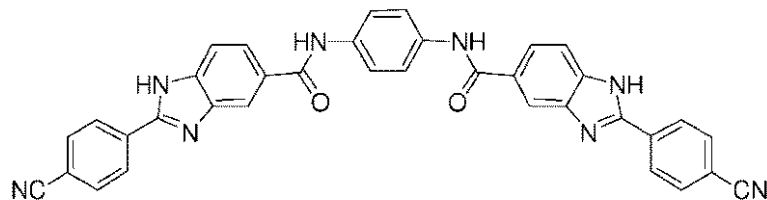
【0460】

30

実施例 181

N, N'-（1, 4-フェニレン）ビス（2-（4-シアノフェニル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-カルボキサミド）（化合物 281）

【化 3 1 7】



40

スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、2-（4-シアノフェニル）ベンズイミダゾール-5-カルボン酸および 1, 4-フェニレンジアミンから化合物 281 を調製した。[M+H]⁺ C₃₆H₂₂N₈O₂ についての計算値：599.19；実測値：598.97。

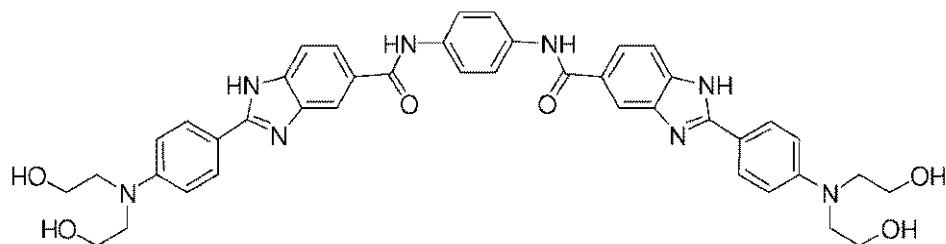
【0461】

実施例 182

N, N'-（1, 4-フェニレン）ビス（2-（4-（ビス（2-ヒドロキシエチル）アミノ）フェニル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-カルボキサミド）（化合物 282）

50

【化 3 1 8】



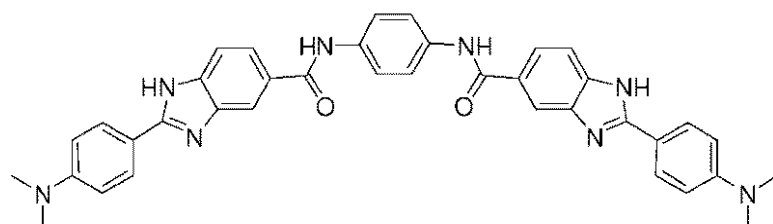
スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、2-(4-(2-ヒドロキシエチル)アミノフェニル)ベンズイミダゾール-5-カルボン酸および 1,4-フェニレンジアミンから化合物 282 を調製した。[M+H]⁺ C₄₂H₄₂N₈O₆ についての計算値：755.32；実測値：755.16。

【0462】

実施例 183

N, N'-(1,4-フェニレン)ビス(2-(4-(ジメチルアミノ)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-カルボキサミド) (化合物 283)

【化 3 1 9】



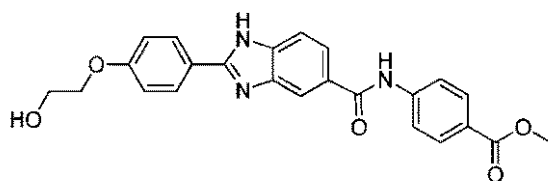
スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、2-(4-(ジメチルアミノフェニル)ベンズイミダゾール-5-カルボン酸および 1,4-フェニレンジアミンから化合物 283 を調製した。[M+H]⁺ C₃₈H₃₄N₈O₂ についての計算値：635.28；実測値：635.05。

【0463】

実施例 184

メチル 4-(2-(4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)カルバモイル)ベンズエート (化合物 284)

【化 3 2 0】



スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、2-(4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル)-5-アミノベンズイミダゾールおよびテレフタル酸モノエステルから化合物 284 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₁N₃O₅ についての計算値：432.15；実測値：431.86。

【0464】

実施例 185

N⁴, N^{4'}-ビス(2-クロロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-[1,1'-ビフェニル]-4,4'-ジカルボキサミド (化合物 285)

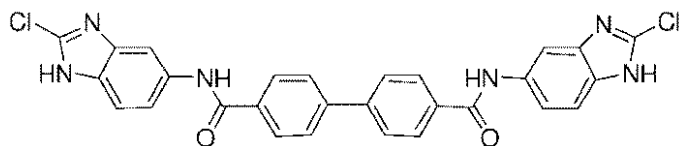
10

20

30

40

【化 3 2 1】



スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、4, 4'-ビス安息香酸および 5-アミノ-2-クロロベンズイミダゾールから化合物 285 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₁₈N₆O₂ についての計算値：541.09；実測値：541.91。

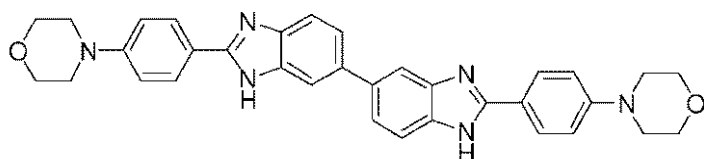
10

【0465】

実施例 186

4, 4'-(1H, 3'H-[5, 5'-ビベンゾ[d]イミダゾール]-2, 2'-ジイルビス(4, 1-フェニレン))ジモルホリン(化合物 286)

【化 3 2 2】



20

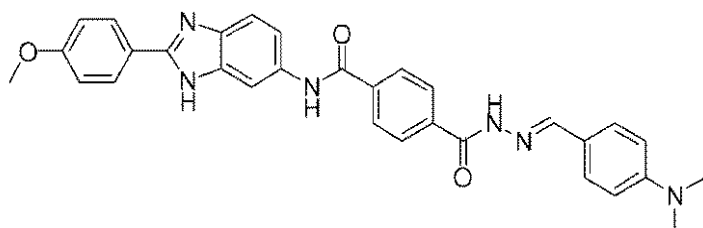
スキーム III に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 3'-ジアミノベンジンおよび 4-モルホリニルベンズアルデヒドから化合物 286 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₂N₆O₂ についての計算値：557.26；実測値：557.58。

【0466】

実施例 187

(E)-4-(2-(4-(ジメチルアミノ)ベンジリデン)ヒドラジンカルボニル)-N-(2-(4-メトキシフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-イル)ベンズアミド(化合物 287)

【化 3 2 3】



30

スキーム V に表される手順にしたがって、5-アミノ-2-(4-メトキシフェニル)ベンズイミダゾール、テレフタル酸、および 4-ジメチルアミノベンズアルデヒドから化合物 287 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₈N₆O₃ についての計算値：533.22；実測値：532.55。

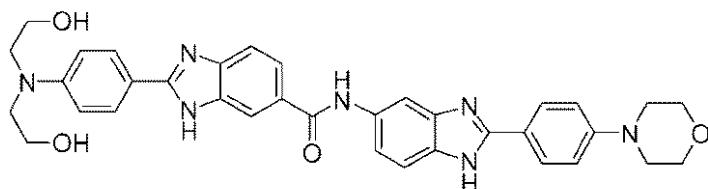
40

【0467】

実施例 188

2-(4-(ビス(2-ヒドロキシエチル)アミノ)フェニル)-N-(2-(4-モルホリノフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-カルボキサミド(化合物 288)

【化 3 2 4】



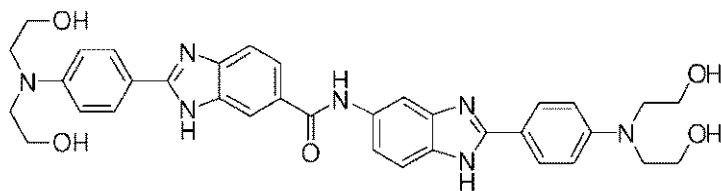
スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、2-(4-モルホリノフェニル)-5-アミノベンズイミダゾールおよび2-(4-N,N-(2-ヒドロキシエチル)アミノフェニル)ベンズイミダゾール-5-カルボキシレートから化合物 288 を調製した。[M+H]⁺ C₃₅H₃₅N₇O₄ についての計算値：618.28；実測値：618.03。

【0468】

実施例 189

(2-(4-(ビス(2-ヒドロキシエチル)アミノ)フェニル)-N-(2-(4-(ビス(2-ヒドロキシエチル)アミノ)フェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-1H-ベンズイミダゾール-6-カルボキサミド (化合物 289))

【化 3 2 5】



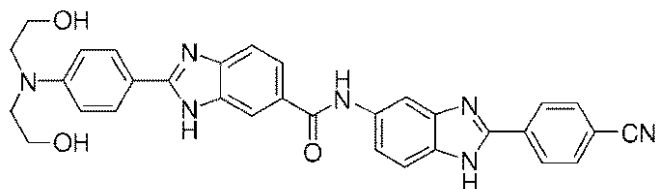
スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、2-(4-(ビス(2-ヒドロキシエチル)アミノ)フェニル)-5-アミノベンズイミダゾールおよび2-(4-(ビス(2-ヒドロキシエチル)アミノ)フェニル)ベンズイミダゾール-5-カルボキシレートから化合物 289 を調製した。[M+H]⁺ C₃₅H₃₇N₇O₅ についての計算値：636.29；実測値：636.06。

【0469】

実施例 190

(2-(4-(ビス(2-ヒドロキシエチル)アミノ)フェニル)-N-(2-(4-シアノ)フェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-1H-ベンズイミダゾール-6-カルボキサミド (化合物 290))

【化 3 2 6】



スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、2-(4-シアノフェニル)-5-アミノベンズイミダゾールおよび2-(4-(ビス(2-ヒドロキシエチル)アミノ)フェニル)ベンズイミダゾール-5-カルボキシレートから化合物 290 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₂₇N₇O₃ についての計算値：558.22；実測値：557.95。

【0470】

実施例 191

(2-(4-(ビス(2-ヒドロキシエチル)アミノ)フェニル)-N-(2-(4-(2-ヒドロキシ)エトキシ)フェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-1H

10

20

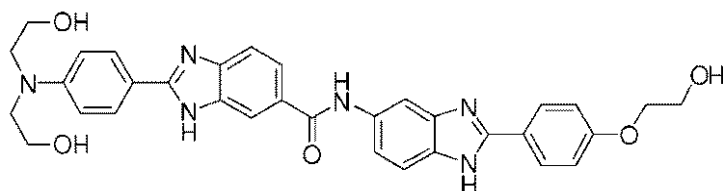
30

40

50

ーベンズイミダゾールー6ーカルボキサミド（化合物291）

【化327】



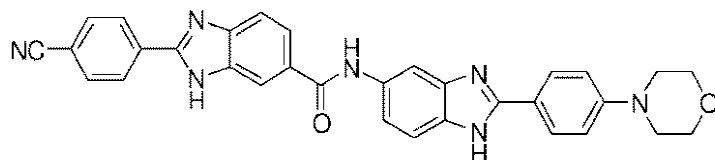
スキームVに表されるものと同様の手順にしたがって、2-(4-(2-ヒドロキシ)エトキシフェニル)-5-アミノベンズイミダゾールおよび2-(4-(ビス(2-ヒドロキシエチル)アミノ)フェニル)ベンズイミダゾールー5-カルボキシレートから化合物291を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{33}H_{32}N_6O_5$ についての計算値：593.24；実測値：593.03。

【0471】

実施例192

2-(4-シアノフェニル)-N-(2-(4-モルホリノフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾールー5-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾールー6-カルボキサミド（化合物292）

【化328】



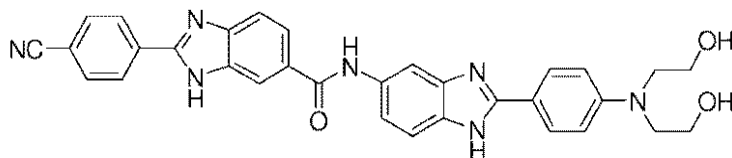
スキームVに表されるものと同様の手順にしたがって、2-(4-モルホリノフェニル)-5-アミノベンズイミダゾールおよび2-(4-シアノフェニル)ベンズイミダゾールー5-カルボキシレートから化合物292を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{32}H_{25}N_7O_2$ についての計算値：540.21；実測値：539.97。

【0472】

実施例193

N-(2-(4-(ビス(2-ヒドロキシエチル)アミノ)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾールー5-イル)-2-(4-シアノフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾールー6-カルボキサミド（化合物293）

【化329】



スキームVに表されるものと同様の手順にしたがって、2-(4-(ビス(2-ヒドロキシエチル)アミノ)フェニル)-5-アミノベンズイミダゾールおよび2-(4-シアノフェニル)ベンズイミダゾールー5-カルボキシレートから化合物293を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{32}H_{25}N_7O_3$ についての計算値：558.22；実測値：557.99。

【0473】

実施例194

2-(4-シアノフェニル)-N-(2-(4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾールー5-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾールー6

10

20

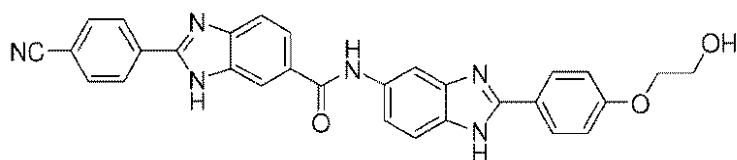
30

40

50

ーカルボキサミド（化合物 294）

【化 330】



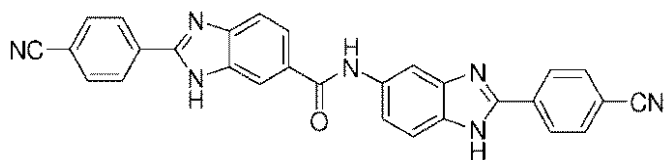
スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、2-（4-（2-ヒドロキシエトキシ）アミノ）フェニル）-5-アミノベンズイミダゾールおよび2-（4-シアノフェニル）ベンズイミダゾール-5-カルボキシレートから化合物 294 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₂N₆O₃ についての計算値：515.18；実測値：514.92。

【0474】

実施例 195

2-（4-シアノフェニル）-N-（2-（4-シアノフェニル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-カルボキサミド（化合物 295）

【化 331】



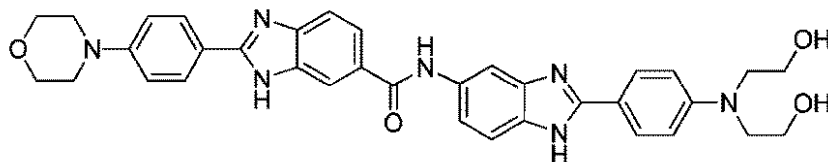
スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、2-（4-シアノ）フェニル）-5-アミノベンズイミダゾールおよび2-（4-シアノフェニル）ベンズイミダゾール-5-カルボキシレートから化合物 295 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₁₇N₇O についての計算値：480.15；実測値：479.89。

【0475】

実施例 196

N-（2-（4-（ビス（2-ヒドロキシエチル）アミノ）フェニル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル）-2-（4-モルホリノフェニル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-カルボキサミド（化合物 296）

【化 332】



スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、2-（4-（ビス（2-ヒドロキシエチル）アミノ）フェニル）-5-アミノベンズイミダゾールおよび2-（4-モルホリノフェニル）ベンズイミダゾール-5-カルボキシレートから化合物 296 を調製した。[M+H]⁺ C₃₅H₃₅N₇O₄ についての計算値：618.28；実測値：618.03。

【0476】

実施例 197

N-（2-（4-（2-ヒドロキシエトキシ）フェニル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル）-2-（4-モルホリノフェニル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-カルボキサミド（化合物 297）

10

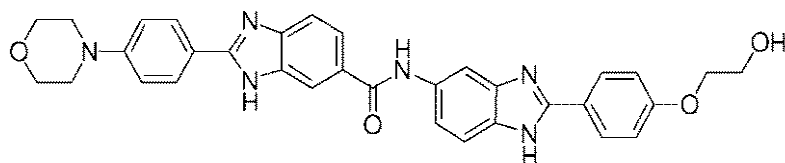
20

30

40

50

【化 3 3 3】



スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、2-（4-（2-ヒドロキシエトキシ）フェニル）-5-アミノベンズイミダゾールおよび2-（4-モルホリノフェニル）ベンズイミダゾール-5-カルボキシレートから化合物 297 を調製した。

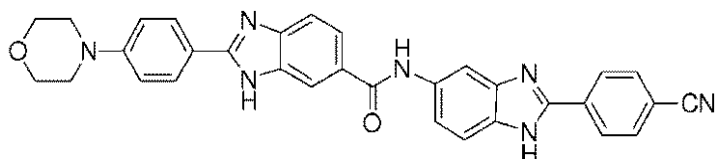
$[M+H]^+$ $C_{33}H_{30}N_6O_4$ についての計算値：575.23；実測値：575.00。

【0477】

実施例 198

N-（2-（4-シアノフェニル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル）-2-（4-モルホリノフェニル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-カルボキサミド（化合物 298）

【化 3 3 4】



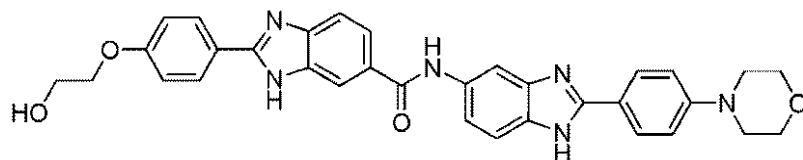
スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、2-（4-シアノ）フェニル）-5-アミノベンズイミダゾールおよび2-（4-モルホリノフェニル）ベンズイミダゾール-5-カルボキシレートから化合物 298 を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{32}H_{25}N_7O_2$ についての計算値：540.21；実測値：539.97。

【0478】

実施例 199

2-（4-（2-ヒドロキシエトキシ）フェニル）-N-（2-（4-モルホリノフェニル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル）-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-カルボキサミド（化合物 299）

【化 3 3 5】



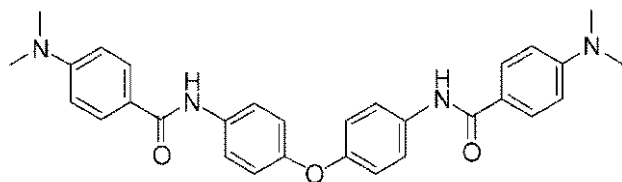
スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、2-（4-モルホリノフェニル）-5-アミノベンズイミダゾールおよび2-（4-（2-ヒドロキシエトキシ）フェニル）ベンズイミダゾール-5-カルボキシレートから化合物 299 を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{33}H_{30}N_6O_4$ についての計算値：575.23；実測値：575.07。

【0479】

実施例 200

N, N'-（オキシビス（4, 1-フェニレン））ビス（4-（ジメチルアミノ）ベンズアミド）（化合物 300）

【化 3 3 6】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-オキシビスフェニルアミンおよび 4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 300 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₁N₄O₃ についての計算値：495.24；実測値：495.01。

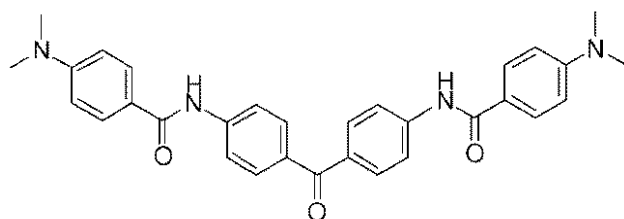
10

【0480】

実施例 201

N, N'-（カルボニルビス（4, 1-フェニレン））ビス（4-（ジメチルアミノ）ベンズアミド）（化合物 301）

【化 3 3 7】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって化合物 301 を調製した。1 mL の塩化メチレン中の 4-（ジメチルアミノ）ベンゾイルクロリド（Aldrich、151 mg、0.825 mmol）を、0.3 mL のピリジンを含む 3 mL の塩化メチレン中の 4, 4'-ジアミノベンゾフェノン（Aldrich、70 mg、0.330 mmol）に 5 分間かけてゆっくりと添加した。反応物を室温で 12 時間攪拌させ、ろ過した。白色の沈殿物を水（5 mL）、エタノール（2 mL）で洗浄し、減圧下で乾燥させて、165 mg の N, N'-（カルボニルビス（4, 1-フェニレン））ビス（4-（ジメチルアミノ）ベンズアミド）を白色粉末として得た。¹H NMR（500 MHz、DMSO-d₆）δ 10.19（s, 2H）、7.97（d, J=8.7 Hz, 4H）、7.89（d, J=8.5 Hz, 4H）、7.77（d, J=8.5 Hz, 4H）、6.77（d, J=8.7 Hz, 4H）、3.00（s, 12H）。

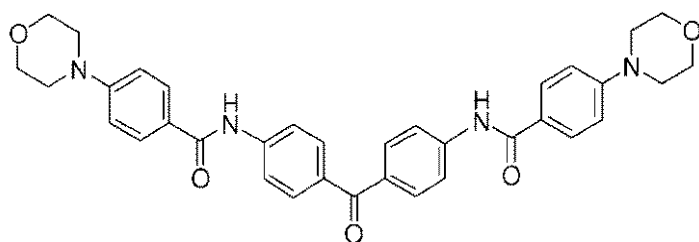
30

【0481】

実施例 202

N, N'-（カルボニルビス（4, 1-フェニレン））ビス（4-モルホリノベンズアミド）（化合物 302）

【化 3 3 8】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリニルベンゾエートから化合物 302 を調製した。[M+H]⁺ C₃₅H₃₅N₄O₅ についての計算値：591.26；実測値：591.20。

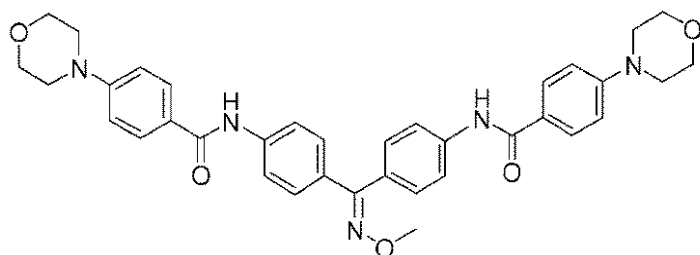
【0482】

実施例 203

50

N, N' - (((メトキシイミノ) メチレン) ビス (4, 1-フェニレン)) ビス (4-
モルホリノベンズアミド) (化合物 303)

【化 339】



10

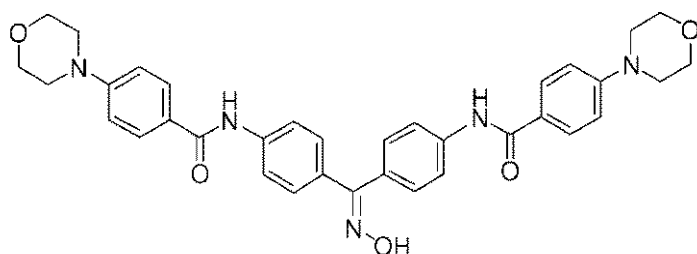
標準的なオキシム合成手順によって、化合物 302 から化合物 303 を調製した。[M
+H]⁺ C₃₆H₃₇N₅O₅ についての計算値：620.24；実測値：620.11。

【0483】

実施例 204

N, N' - (((ヒドロキシイミノ) メチレン) ビス (4, 1-フェニレン)) ビス (4-
モルホリノベンズアミド) (化合物 304)

【化 340】



20

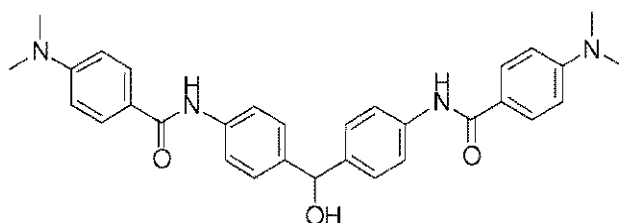
標準的なオキシム合成手順によって、化合物 302 から化合物 304 を調製した。[M
+H]⁺ C₃₅H₃₅N₅O₅ についての計算値：606.27；実測値：606.06。

【0484】

実施例 205

N, N' - (((ヒドロキシメチレン) ビス (4, 1-フェニレン)) ビス (4- (ジメチ
ルアミノ) ベンズアミド) (化合物 305)

【化 341】



40

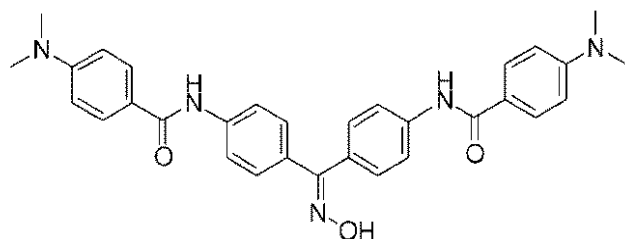
標準的な還元条件によって、化合物 301 から化合物 305 を調製した。[M+H]⁺
C₃₁H₃₂N₄O₃ についての計算値：509.14；実測値：508.98。

【0485】

実施例 206

N, N' - (((ヒドロキシイミノ) メチレン) ビス (4, 1-フェニレン)) ビス (4-
(ジメチルアミノ) ベンズアミド) (化合物 306)

【化 3 4 2】



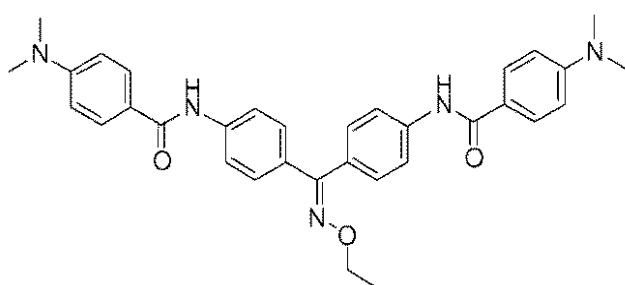
標準的なオキシム合成手順によって、化合物 3 0 1 から化合物 3 0 6 を調製した。[M + H]⁺ C₃₁H₃₁N₅O₃ についての計算値：522.25；実測値：522.01。 10

【0 4 8 6】

実施例 2 0 7

N, N' - (((エトキシイミノ) メチレン) ビス (4, 1 - フェニレン)) ビス (4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド) (化合物 3 0 7)

【化 3 4 3】



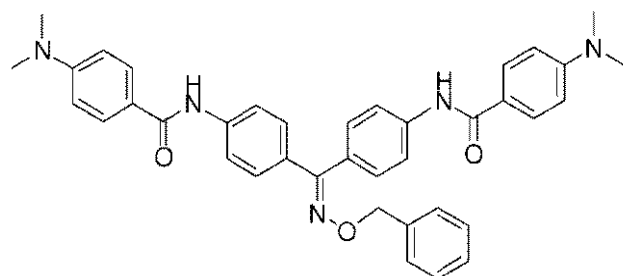
標準的なオキシム合成手順によって、化合物 3 0 1 から化合物 3 0 7 を調製した。[M + H]⁺ C₃₃H₃₅N₅O₃ についての計算値：550.28；実測値：550.02。 20

【0 4 8 7】

実施例 2 0 8

N, N' - (((ベンジルオキシ) イミノ) メチレン) ビス (4, 1 - フェニレン)) ビス (4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド) (化合物 3 0 8) 30

【化 3 4 4】



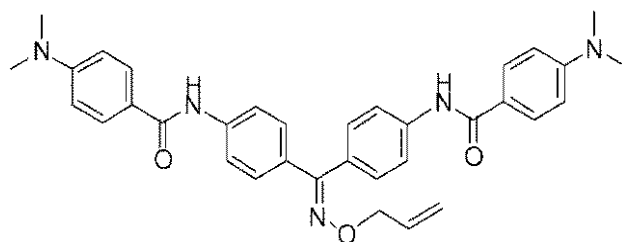
標準的なオキシム合成手順によって、化合物 3 0 1 から化合物 3 0 8 を調製した。[M + H]⁺ C₃₈H₃₇N₅O₃ についての計算値：612.29；実測値：612.07。 40

【0 4 8 8】

実施例 2 0 9

N, N' - (((アリルオキシ) イミノ) メチレン) ビス (4, 1 - フェニレン)) ビス (4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド) (化合物 3 0 9)

【化 3 4 5】



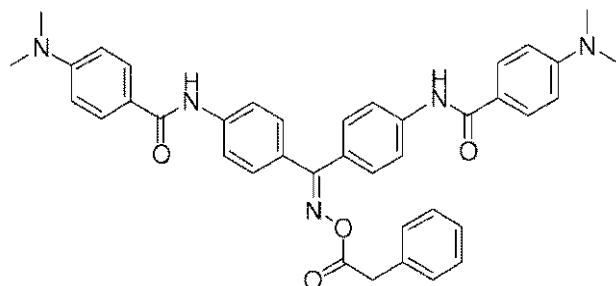
標準的なオキシム合成手順によって、化合物 3 0 1 から化合物 3 0 9 を調製した。[M + H]⁺ C₃₄H₃₅N₅O₃ についての計算値：562.28；実測値：562.04。

【0 4 8 9】

実施例 2 1 0

N, N' - (((2 - フェニルアセトキシ) イミノ) メチレン) ビス (4 , 1 - フェニレン)) ビス (4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド) (化合物 3 1 0)

【化 3 4 6】



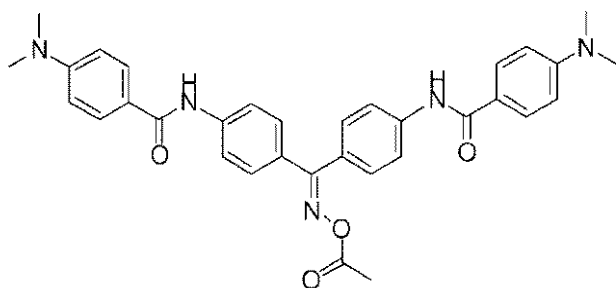
標準的なオキシム合成手順によって、化合物 3 0 1 から化合物 3 1 0 を調製した。[M + H]⁺ C₃₉H₃₇N₅O₄ についての計算値：640.29；実測値：640.23。

【0 4 9 0】

実施例 2 1 1

N, N' - (((アセトキシイミノ) メチレン) ビス (4 , 1 - フェニレン)) ビス (4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド) (化合物 3 1 1)

【化 3 4 7】



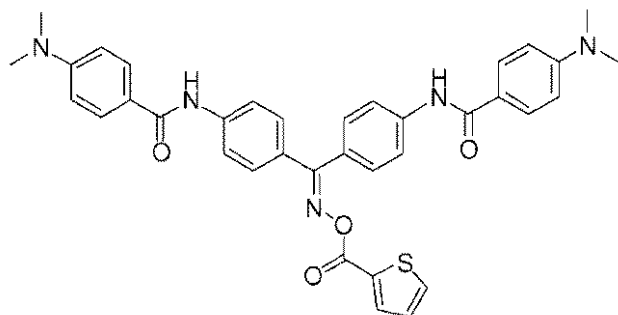
標準的なオキシム合成手順によって、化合物 3 0 1 から化合物 3 1 1 を調製した。[M + H]⁺ C₃₃H₃₃N₅O₄ についての計算値：564.26；実測値：564.00。

【0 4 9 1】

実施例 2 1 2

N, N' - ((((チオフェン - 2 - カルボニル) オキシ) イミノ) メチレン) ビス (4 , 1 - フェニレン)) ビス (4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド) (化合物 3 1 2)

【化 3 4 8】



10

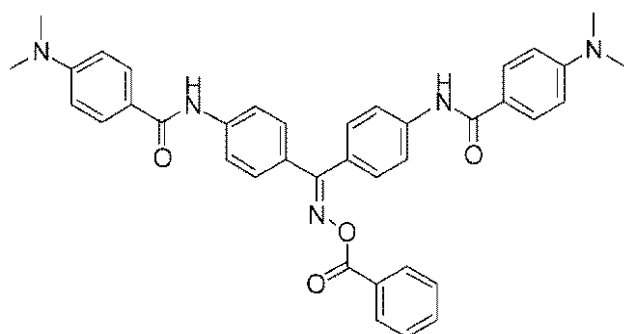
標準的なオキシム合成手順によって、化合物 3 0 1 から化合物 3 1 2 を調製した。[M + H]⁺ C₃₆H₃₃N₅O₄S についての計算値：632.77；実測値：631.99。

【0 4 9 2】

実施例 2 1 3

N, N' - ((((ベンゾイルオキシ) イミノ) メチレン) ビス (4, 1-フェニレン)) ビス (4- (ジメチルアミノ) ベンズアミド) (化合物 3 1 3)

【化 3 4 9】



20

標準的なオキシム合成手順によって、化合物 3 0 1 から化合物 3 1 3 を調製した。[M + Na]⁺ C₃₈H₃₅N₅O₄ についての計算値：647.74；実測値：647.86。

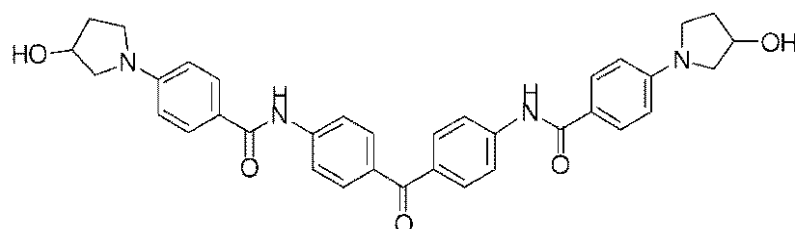
30

【0 4 9 3】

実施例 2 1 4

N, N' - (カルボニルビス (4, 1-フェニレン)) ビス (4- (3-ヒドロキシピロリジン-1-イル) ベンズアミド) (化合物 3 1 4)

【化 3 5 0】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4- (2-ヒドロキシピロリジノ) ベンズエートから化合物 3 1 4 を調製した。[M + H]⁺ C₃₅H₃₅N₄O₅ についての計算値：591.26；実測値：591.03。

【0 4 9 4】

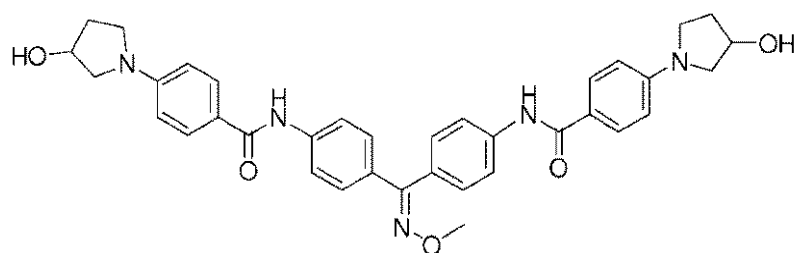
実施例 2 1 5

N, N' - (((メトキシイミノ) メチレン) ビス (4, 1-フェニレン)) ビス (4-

50

(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物315)

【化351】



10

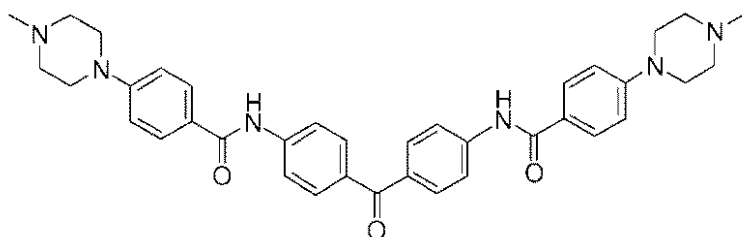
標準的なオキシム合成手順によって、化合物314から化合物315を調製した。[M+H]⁺ C₃₆H₃₇N₅O₅ についての計算値：620.28；実測値：620.11。

【0495】

実施例216

N, N'-(カルボニルビス(4,1-フェニレン))ビス(4-(4-メチルピペラジン-1-イル)ベンズアミド) (化合物316)

【化352】



20

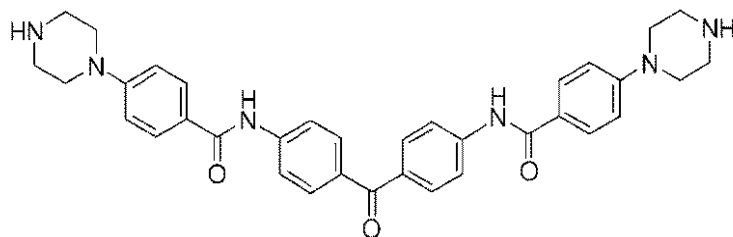
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノンおよび4-(4-メチルピペラジノ)ベンゾエートから化合物316を調製した。[M+H]⁺ C₃₇H₄₁N₆O₃ についての計算値：617.32；実測値：617.12。

【0496】

実施例217

N, N'-(カルボニルビス(4,1-フェニレン))ビス(4-(ピペラジン-1-イル)ベンズアミド) (化合物317)

【化353】



40

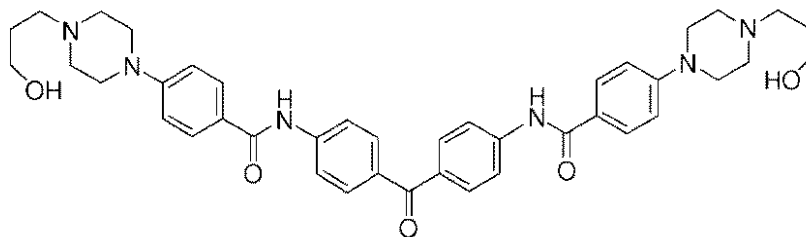
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノンおよび4-ピペラジノベンゾエートから化合物317を調製した。[M+H]⁺ C₃₅H₃₇N₆O₃ についての計算値：589.29；実測値：589.07。

【0497】

実施例218

N, N'-(カルボニルビス(4,1-フェニレン))ビス(4-(4-(3-ヒドロキシプロピル)ピペラジン-1-イル)ベンズアミド) (化合物318)

【化 3 5 4】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-(4-(3-ヒドロキシプロピル)ピペラジノ)ベンゾエートから化合物 318 を調製した。[M+H]⁺ C₄₁H₄₈N₆O₅ についての計算値：705.37；実測値：705.19。

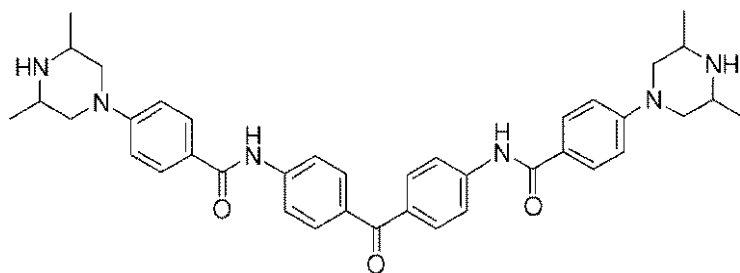
10

【0498】

実施例 219

N, N'-(カルボニルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(3, 5-ジメチルピペラジン-1-イル)ベンズアミド) (化合物 319)

【化 3 5 5】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-(3, 5-ジメチルピペラジノ)ベンゾエートから化合物 319 を調製した。[M+H]⁺ C₃₉H₄₄N₆O₃ についての計算値：645.35；実測値：645.16。

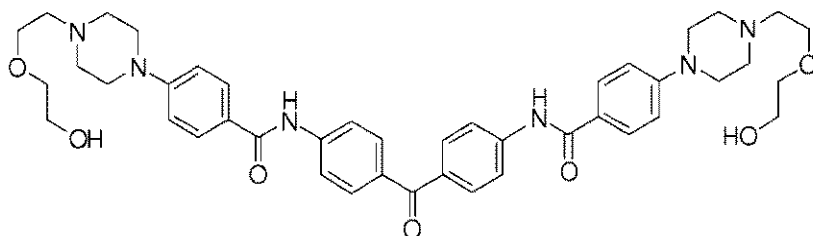
【0499】

30

実施例 220

N, N'-(カルボニルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(4-(2-(2-ヒドロキシエトキシ)エチル)ピペラジン-1-イル)ベンズアミド) (化合物 320)

【化 3 5 6】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-(4-(2-(2-ヒドロキシエトキシ)エチル)ピペラジノ)ベンゾエートから化合物 320 を調製した。[M+H]⁺ C₄₃H₅₂N₆O₇ についての計算値：765.39；実測値：765.36。

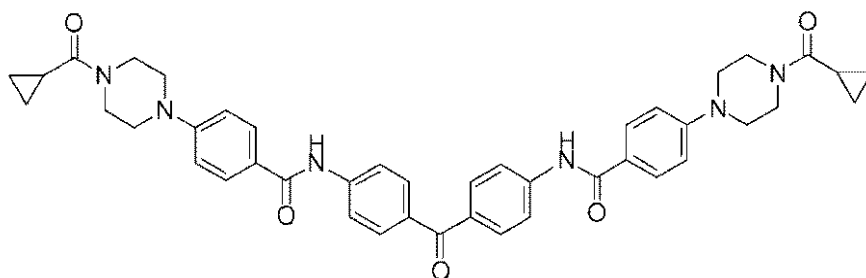
【0500】

実施例 221

N, N'-(カルボニルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(4-(シクロプロパンカルボニル)ピペラジン-1-イル)ベンズアミド) (化合物 321)

50

【化 3 5 7】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-(4-シクロプロピルカルボニル)ピペラジノ)ベンゾエートから化合物 321 を調製した。[M+H]⁺ C₄₃H₄₄N₆O₅ についての計算値：725.34；実測値：725.11。

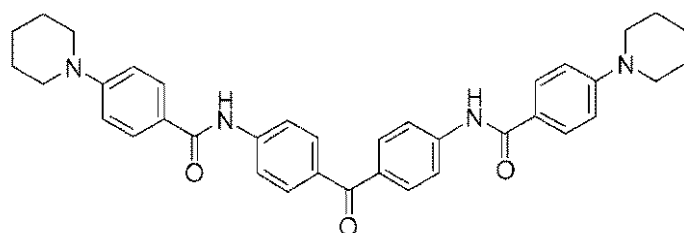
10

【0501】

実施例 222

N, N'-(カルボニルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(ピペリジン-1-イル)ベンズアミド) (化合物 322)

【化 3 5 8】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-ピペリジノベンゾエートから化合物 322 を調製した。[M+H]⁺ C₃₇H₃₈N₄O₃ についての計算値：587.30；実測値：587.02。

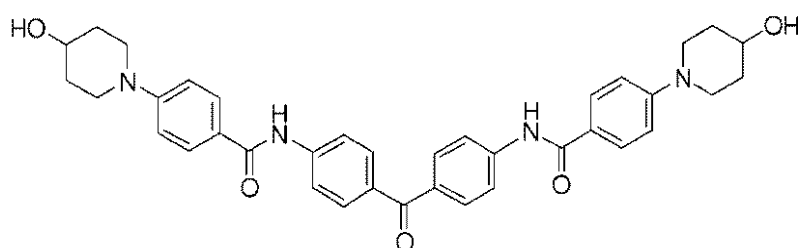
【0502】

実施例 223

N, N'-(カルボニルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド) (化合物 323)

30

【化 3 5 9】



40

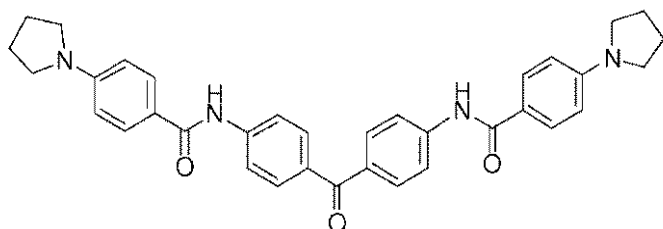
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-(4-ヒドロキシピペリジノ)ベンゾエートから化合物 323 を調製した。[M+H]⁺ C₃₇H₃₉N₄O₅ についての計算値：619.29；実測値：619.10。

【0503】

実施例 224

N, N'-(カルボニルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(ピロリジン-1-イル)ベンズアミド) (化合物 324)

【化 3 6 0】



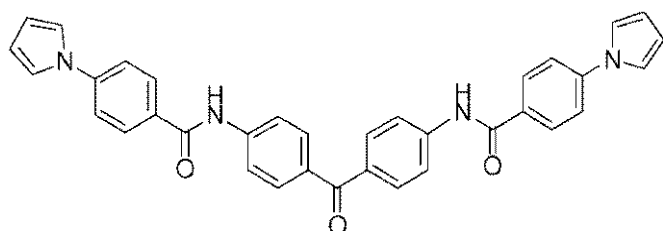
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-ピロリジノベンゾエートから化合物 3 2 4 を調製した。[M+H]⁺ C₃₅H₃₄N₄O₃ 10
 についての計算値：559.27；実測値：559.00。

【0504】

実施例 2 2 5

N, N'-(カルボニルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(1H-ピロール-1-イル)ベンズアミド) (化合物 3 2 5)

【化 3 6 1】



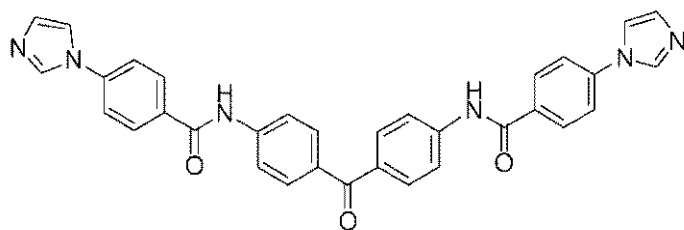
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-ピロリルベンゾエートから化合物 3 2 5 を調製した。[M+H]⁺ C₃₅H₂₆N₄O₃ 20
 についての計算値：551.20；実測値：551.04。

【0505】

実施例 2 2 6

N, N'-(カルボニルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(1H-イミダゾール-1-イル)ベンズアミド) (化合物 3 2 6) 30

【化 3 6 2】



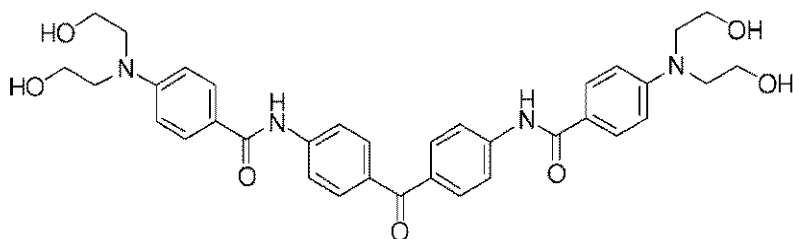
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-イミダゾリルベンゾエートから化合物 3 2 6 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₂₄N₆O₃ 40
 についての計算値：553.19；実測値：552.98。

【0506】

実施例 2 2 7

N, N'-(カルボニルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(ビス(2-ヒドロキシエチル)アミノ)ベンズアミド) (化合物 3 2 7)

【化 3 6 3】



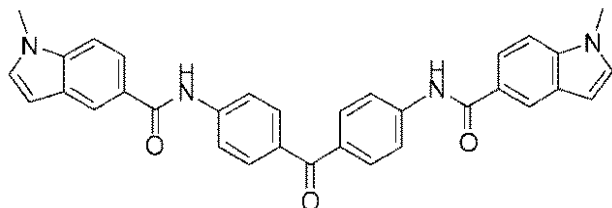
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-ビス(2-ヒドロキシエチル)アミノベンゾエートから化合物 327 を調製した。[M+H]⁺ C₃₅H₃₈N₄O₇ についての計算値: 627.28; 実測値: 627.06。

【0507】

実施例 228

N, N'-(カルボニルビス(4, 1-フェニレン))ビス(1-メチル-1H-インドール-5-カルボキサミド) (化合物 328)

【化 3 6 4】



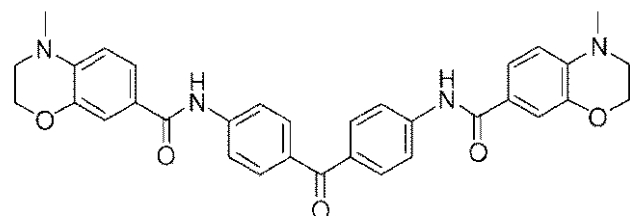
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 5-(1-メチルインドール)カルボキシレートから化合物 328 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₂₆N₄O₃ についての計算値: 527.20; 実測値: 527.00。

【0508】

実施例 229

N, N'-(カルボニルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1, 4]オキサジンを-7-カルボキサミド) (化合物 329)

【化 3 6 5】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 6-(1-メチル-1, 4-ベンゾオキサジン)カルボキシレートから化合物 329 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₀N₄O₅ についての計算値: 563.22; 実測値: 562.92。

【0509】

実施例 230

N, N'-(カルボニルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-((2-ヒドロキシエチル)(メチル)アミノ)ベンズアミド) (化合物 330)

10

20

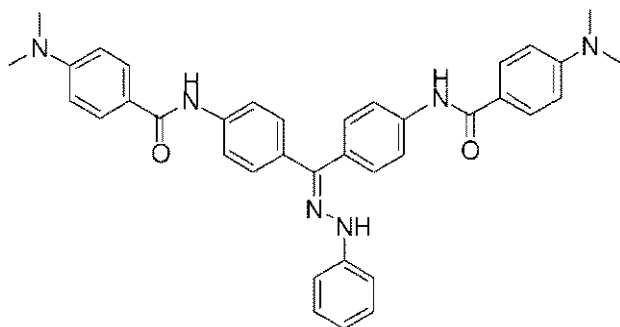
30

40

CN(C)CCOC(=O)c1ccc(NC(=O)c2ccc(cc2)C(=O)c3ccc(NC(=O)c4ccc(N(C)CCOC)cc4)cc3)cc1

10

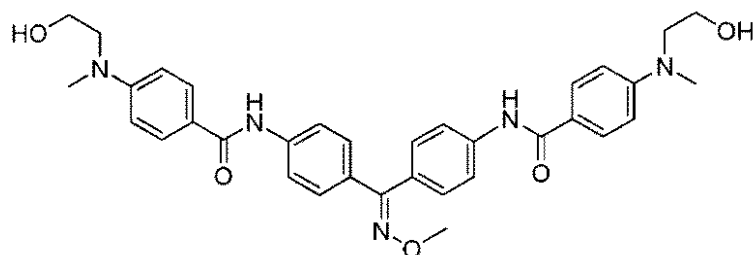
【化 3 6 7】



20

30

【化 3 6 8】

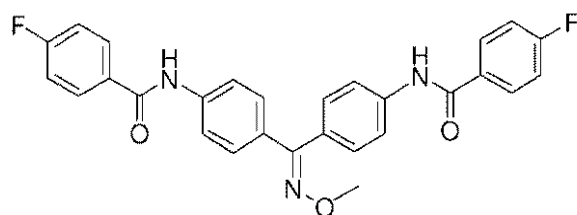


40

50

フルオロベンズアミド) (化合物 333)

【化 369】



10

スキーム I V に表される手順と、その後の標準的なオキシム合成手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび4-フルオロベンゾエートから化合物 333 を調製した。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 11.00 (d, J = 12.5 Hz, 1H)、10.41 (d, J = 12.5 Hz, 1H)、8.03 (m, 4H)、7.85 (d, J = 15 Hz, 2H)、7.79 (d, J = 15 Hz, 2H)、7.38 (m, 6H)、7.29 (d, J = 15 Hz, 2H)、3.79 (s, 3H)。

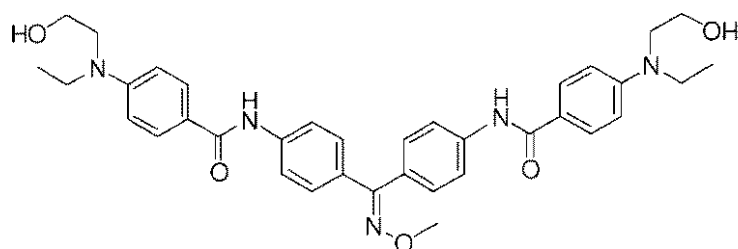
【0513】

実施例 234

N, N'-(((メトキシイミノ) メチレン) ビス (4, 1-フェニレン)) ビス (4-(エチル (2-ヒドロキシエチル) アミノ) ベンズアミド) (化合物 334)

20

【化 370】



標準的な手順によって、化合物 333 および N-2-ヒドロキシエチル-N-エチルアミンから化合物 334 を調製した。[M+H]⁺ C₃₆H₄₁N₅O₅ についての計算値: 624.31; 実測値: 624.09。

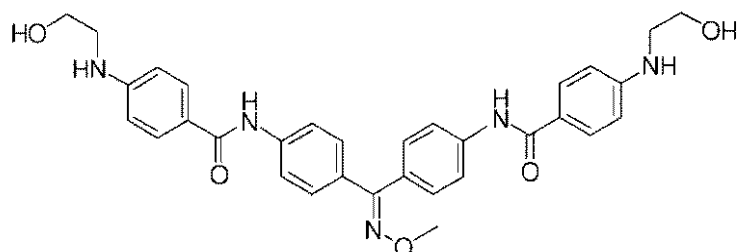
30

【0514】

実施例 235

N, N'-(((メトキシイミノ) メチレン) ビス (4, 1-フェニレン)) ビス (4-(2-ヒドロキシエチル) アミノ) ベンズアミド) (化合物 335)

【化 371】



40

標準的な手順によって、化合物 333 および 2-ヒドロキシエチルアミンから化合物 335 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₃N₅O₅ についての計算値: 568.25; 実測値: 567.98。

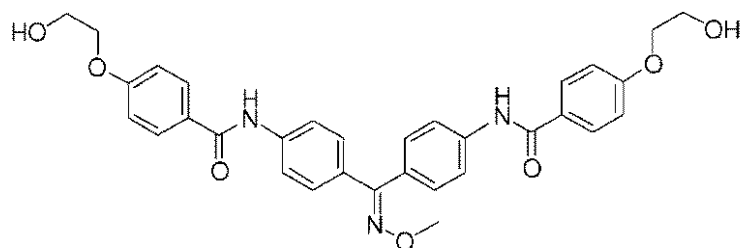
【0515】

実施例 236

50

N, N' - (((メトキシイミノ) メチレン) ビス (4, 1-フェニレン)) ビス (4-(2-ヒドロキシエトキシ) ベンズアミド) (化合物 336)

【化 372】



10

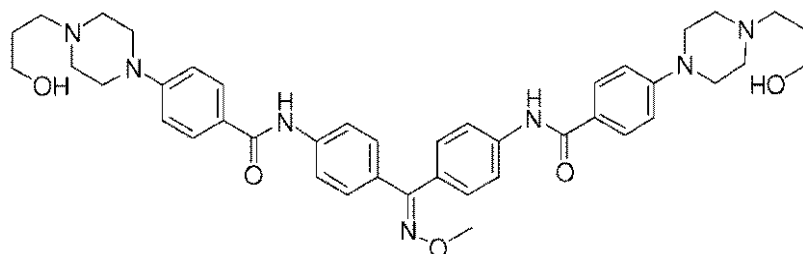
標準的な手順によって、化合物 333 およびエチレンジオールから化合物 336 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₁N₃O₇ についての計算値：570.22；実測値：570.01。

【0516】

実施例 237

N, N' - (((メトキシイミノ) メチレン) ビス (4, 1-フェニレン)) ビス (4-(4-(3-ヒドロキシプロピル) ピペラジン-1-イル) ベンズアミド) (化合物 337)

【化 373】



20

標準的な手順によって、化合物 333 および 3-ヒドロキシプロピルピペラジンから化合物 337 を調製した。[M+H]⁺ C₄₂H₅₁N₇O₅ についての計算値：734.93；実測値：734.23。

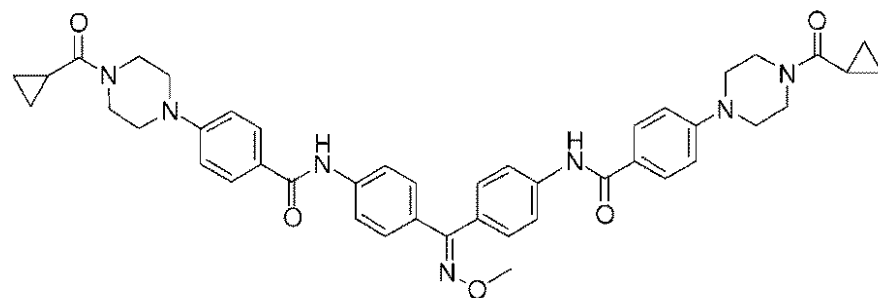
30

【0517】

実施例 238

N, N' - (((メトキシイミノ) メチレン) ビス (4, 1-フェニレン)) ビス (4-(4-(シクロプロパンカルボニル) ピペラジン-1-イル) ベンズアミド) (化合物 338)

【化 374】



40

標準的な手順によって、化合物 333 および 4-シクロプロピルカルボニルピペラジンから化合物 338 を調製した。[M+H]⁺ C₄₄H₄₇N₇O₅ についての計算値：754.92；実測値：754.29。

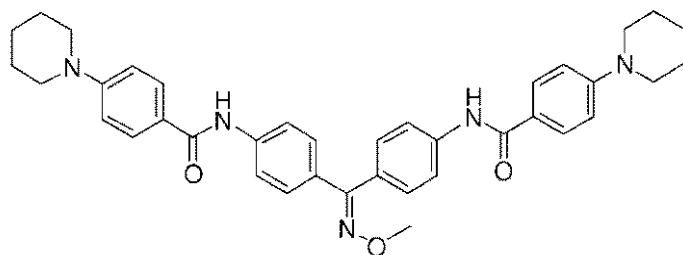
【0518】

50

実施例 2 3 9

N, N' - (((メトキシイミノ) メチレン) ビス (4, 1-フェニレン)) ビス (4- (ピペリジン-1-イル) ベンズアミド) (化合物 3 3 9)

【化 3 7 5】



10

標準的な手順によって、化合物 3 3 3 およびピペリジンから化合物 3 3 9 を調製した。

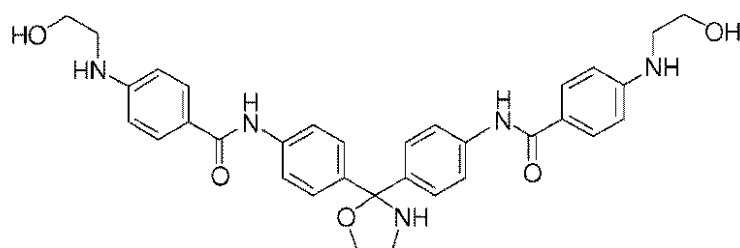
$[M+H]^+$ $C_{38}H_{41}N_5O_3$ についての計算値：616.79；実測値：616.19。

【0 5 1 9】

実施例 2 4 0

N, N' - (4, 4' - (オキサゾリジン-2, 2-ジイル) ビス (4, 1-フェニレン)) ビス (4- (2-ヒドロキシエチルアミノ) ベンズアミド) (化合物 3 4 0)

【化 3 7 6】



20

標準的な手順によって、N, N' - (4, 4' - ベンゾフェノン) ビス (4-フルオロベンズアミド) および 2-ヒドロキシエチルアミンから化合物 3 4 0 を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{33}H_{36}N_5O_5$ についての計算値：582.27；実測値：582.07。

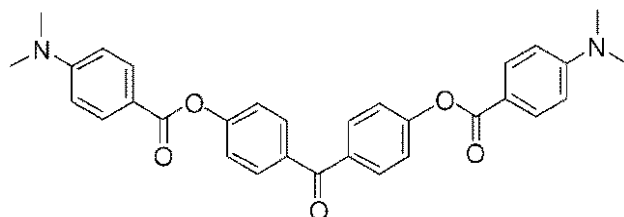
30

【0 5 2 0】

実施例 2 4 1

4, 4' - カルボニルビス (4, 1-フェニレン) ビス (4- (ジメチルアミノ) ベンズエート) (化合物 3 4 1)

【化 3 7 7】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4' - ジヒドロキシベンゾフェノンおよび 4-ジメチルアミノ安息香酸から化合物 3 4 1 を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{31}H_{28}N_2O_5$ についての計算値：509.20；実測値：509.05。

【0 5 2 1】

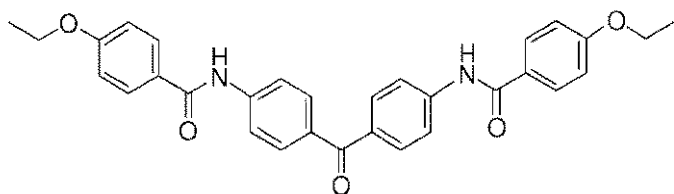
実施例 2 4 2

N, N' - (4, 4' - カルボニルビス (4, 1-フェニレン)) ビス (4-エトキシベ

50

ンズアミド) (化合物 3 4 2)

【化 3 7 8】



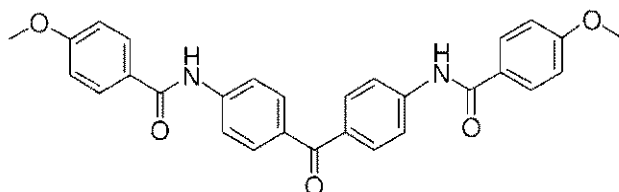
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-エトキシベンゾエートから化合物 3 4 2 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₈N₂O₅ についての計算値: 509.20; 実測値: 508.98。

【0522】

実施例 2 4 3

N, N'- (4, 4'-カルボニルビス (4, 1-フェニレン)) ビス (4-メトキシベンズアミド) (化合物 3 4 3)

【化 3 7 9】



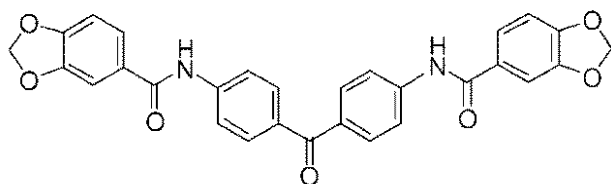
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-メトキシベンゾエートから化合物 3 4 3 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₄N₂O₅ についての計算値: 481.17; 実測値: 480.90。

【0523】

実施例 2 4 4

N, N'- (4, 4'-カルボニルビス (4, 1-フェニレン)) ジベンゾ [1, 3] ジオキソール-5-カルボキサミド (化合物 3 4 4)

【化 3 8 0】



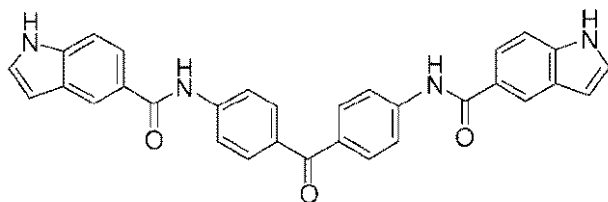
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび ベンゾ [1, 3] ジオキソール-5-カルボキシレートから化合物 3 4 4 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₀N₂O₇ についての計算値: 509.13; 実測値: 508.91。

【0524】

実施例 2 4 5

N, N'- (4, 4'-カルボニルビス (4, 1-フェニレン)) ビス (1H-インドール-5-カルボキサミド) (化合物 3 4 5)

【化 3 8 1】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 1H-インドール-5-カルボキシレートから化合物 345 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₂N₄O₃ についての計算値：499.17；実測値：498.92。

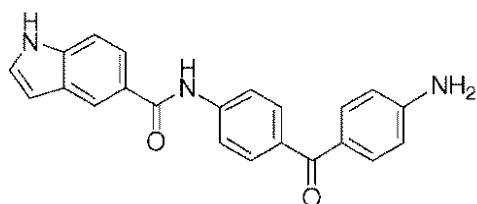
10

【0525】

実施例 246

N-(4-(4-アミノベンゾイル)フェニル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 346)

【化 3 8 2】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 1H-インドール-5-カルボキシレートから化合物 346 を調製した。[M+H]⁺ C₂₂H₁₇N₃O₂ についての計算値：356.14；実測値：355.90。

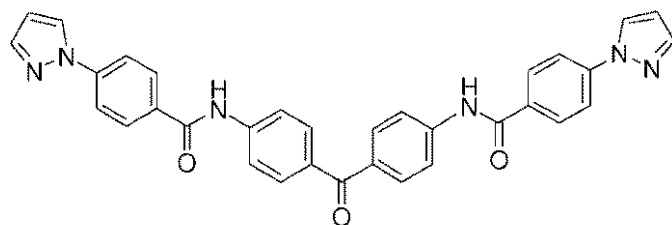
【0526】

実施例 247

N, N'-(4, 4'-カルボニルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(1H-ピラゾール-1-イル)ベンゾアミド) (化合物 347)

30

【化 3 8 3】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-(ピラゾール-1-イル)ベンゾエートから化合物 347 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₂₄N₆O₃ についての計算値：553.19；実測値：552.99。

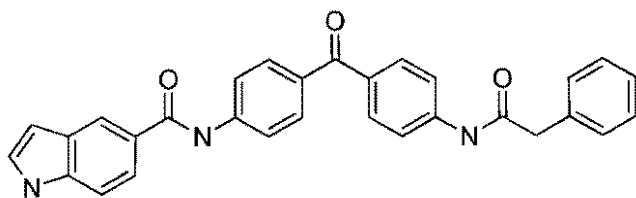
40

【0527】

実施例 248

N-(4-(4-(2-フェニルアセトアミド)ベンゾイル)フェニル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 348)

【化 3 8 4】



化合物 3 4 6 およびベンジルブロミドから化合物 3 4 8 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₃N₃O₃ についての計算値：474.05；実測値：474.49。

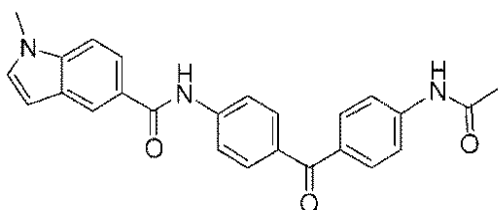
10

【0 5 2 8】

実施例 2 4 9

4-エトキシ-N-(4-(4-(2-(4-エトキシフェニル)-2-オキソエチル)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 3 4 9)

【化 3 8 5】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 1-メチルインドール-5-カルボキシレートから化合物 3 4 9 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₁N₃O₃ についての計算値：412.07；実測値：411.94。

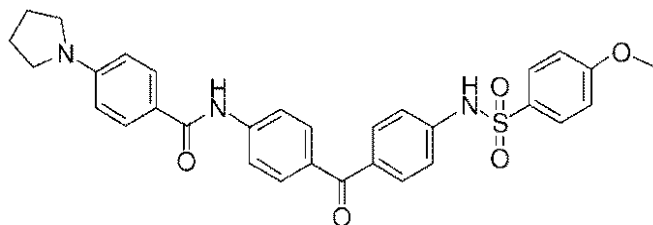
【0 5 2 9】

実施例 2 5 0

N-(4-(4-(4-メトキシフェニルスルホンアミド)ベンゾイル)フェニル)-4-(ピロリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 3 5 0)

【化 3 8 6】

30



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-ピロリジニルベンゾエートから化合物 3 5 0 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₉N₃O₅S についての計算値：556.17；実測値：555.99。

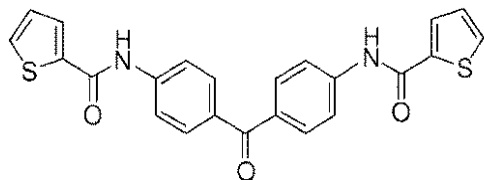
40

【0 5 3 0】

実施例 2 5 1

N, N'-(4, 4'-カルボニルビス(4, 1-フェニレン))ジチオフェン-2-カルボキサミド (化合物 3 5 1)

【化 3 8 7】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 2-チオフェンカルボキシレートから化合物 351 を調製した。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 10.54 (s, 2H)、8.09 (d, J = 3.75 Hz、2H)、7.94 (d, J = 12.5 Hz、4H)、7.91 (d, J = 3.75 Hz、2H)、7.88 (d, J = 12.5 Hz、4H)、7.25 (t, J = 3.75 Hz、2H)。

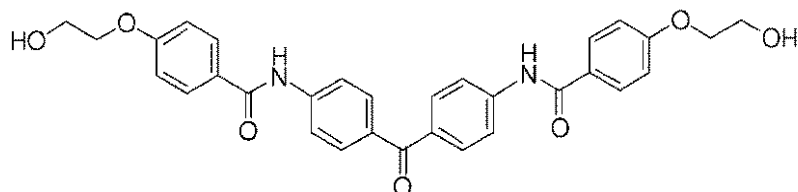
10

【0 5 3 1】

実施例 2 5 2

N, N'-(4, 4'-カルボニルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンズアミド) (化合物 352)

【化 3 8 8】



20

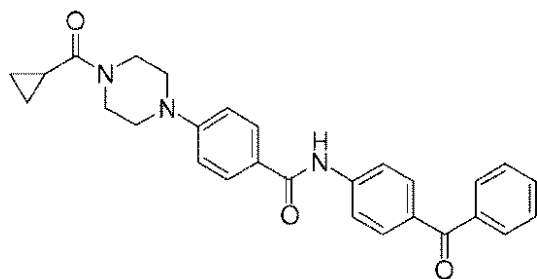
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンゾエートから化合物 352 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₈N₂O₇ についての計算値：541.09；実測値：541.05。

【0 5 3 2】

実施例 2 5 3

N-(4-ベンゾイルフェニル)-4-(4-シクロプロパンカルボニルピペラジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 353)

【化 3 8 9】



40

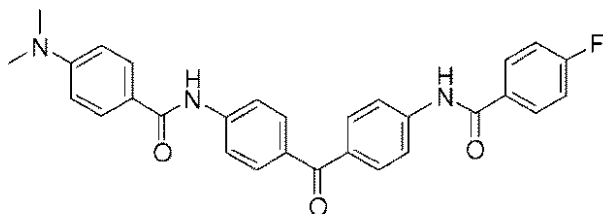
スキーム I V に表される手順にしたがって、4-アミノベンゾフェノンおよび 4-ピペラジンベンゾエートから化合物 353 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₈N₃O₃ についての計算値：454.21；実測値：454.01。

【0 5 3 3】

実施例 2 5 4

4-(ジメチルアミノ)-N-(4-(4-(4-フルオロベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 354)

【化 3 9 0】



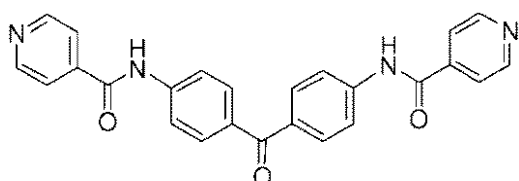
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび置換ベンゾエートから化合物 3 5 4 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₅FN₃O₃ 10
 についての計算値：482.19；実測値：482.22。

【0 5 3 4】

実施例 2 5 5

N, N'- (4, 4'-カルボニルビス (4, 1-フェニレン)) ジイソニコチンアミド
 (化合物 3 5 5)

【化 3 9 1】



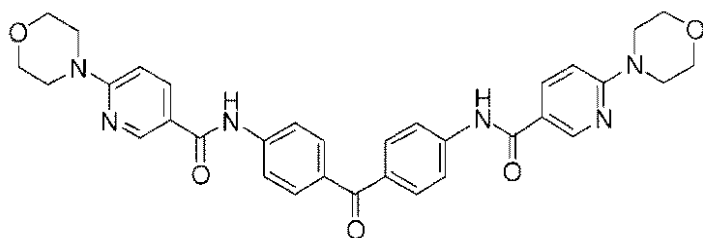
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび4-ピコリン酸から化合物 3 5 5 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₁₉N₄O₃ 20
 についての計算値：423.15；実測値：422.87。

【0 5 3 5】

実施例 2 5 6

N, N'- (4, 4'-カルボニルビス (4, 1-フェニレン)) ビス (6-モルホリノニコチンアミド) (化合物 3 5 6) 30

【化 3 9 2】



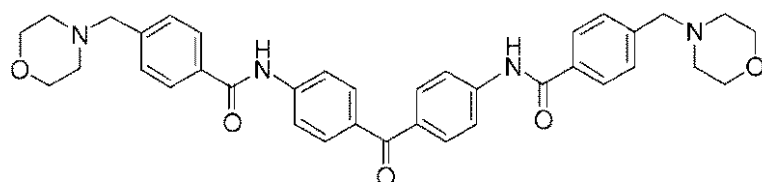
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび6-モルホリノニコチン酸から化合物 3 5 6 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₃N₆O₅ 40
 についての計算値：593.25；実測値：593.03。

【0 5 3 6】

実施例 2 5 7

N, N'- (4, 4'-カルボニルビス (4, 1-フェニレン)) ビス (4-(モルホリノメチル)ベンズアミド) (化合物 3 5 7)

【化 3 9 3】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノメチルベンゾエートから化合物 357 を調製した。[M+H]⁺ C₃₇H₃₉N₄O₅ についての計算値：619.29；実測値：619.10。

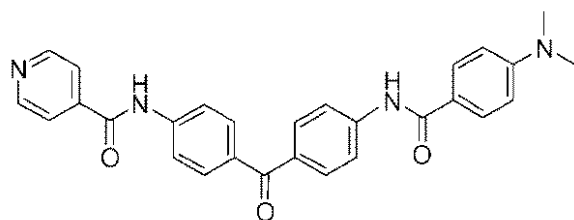
10

【0537】

実施例 258

N-(4-(4-(4-ジメチルアミノ)ベンゾイル)フェニル)イソニコチンアミド (化合物 358)

【化 3 9 4】



20

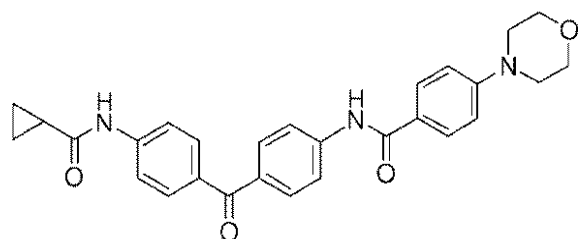
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-ピコリン酸から化合物 358 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₅N₄O₃ についての計算値：465.19；実測値：464.98。

【0538】

実施例 259

N-(4-(4-(4-シクロプロパンカルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)-4-モルホリノベンズアミド (化合物 359)

【化 3 9 5】



30

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 359 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₈N₃O₄ についての計算値：470.21；実測値：469.97。

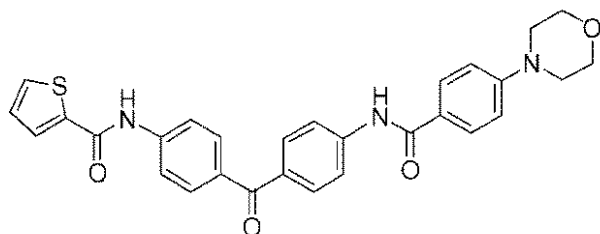
40

【0539】

実施例 260

N-(4-(4-(2-チエニル)カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)-4-モルホリノベンズアミド (化合物 360)

【化 3 9 6】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 360 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₆N₃O₄S についての計算値：512.16；実測値：511.95。

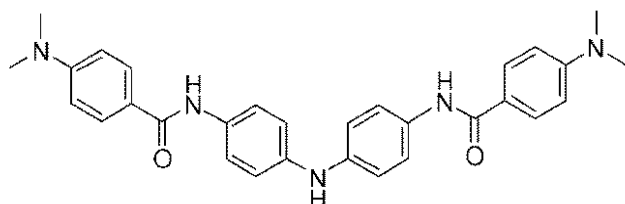
10

【0540】

実施例 261

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド) (化合物 361)

【化 3 9 7】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 361 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₁N₅O₂ についての計算値：494.25；実測値：494.04。

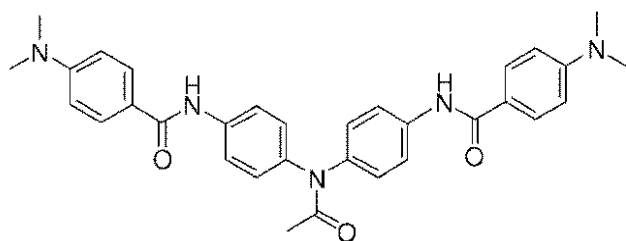
【0541】

実施例 262

4-(ジメチルアミノ)-N-(4-(N-(4-(4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド)フェニル)アセトアミド)フェニル)ベンズアミド (化合物 362)

30

【化 3 9 8】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 362 を調製した。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 9.99 (bs, 1H)、9.89 (bs, 1H)、7.84 (d, J=9 Hz, 6H)、7.70 (bs, 2H)、7.36 (bs, 2H)、7.20 (bs, 2H)、6.73 (d, J=9 Hz, 4H)、2.98 (s, 12H)、1.93 (s, 3H)。

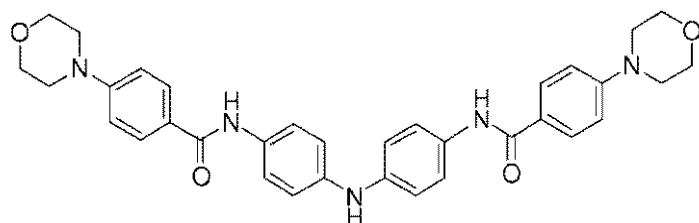
40

【0542】

実施例 263

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-モルホリノベンズアミド) (化合物 363)

【化 3 9 9】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 363 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₅N₅O₄ についての計算値：578.27；実測値：578.11。

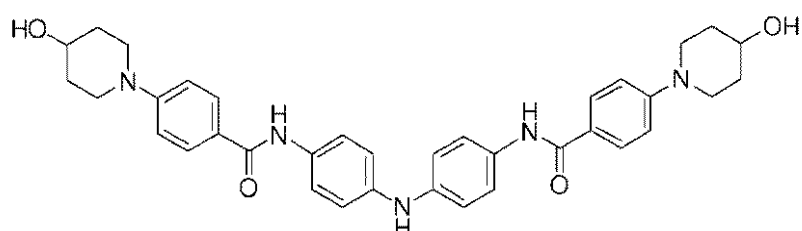
10

【0543】

実施例 264

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(4-ヒドロキシピペリジノ)ベンズアミド) (化合物 364)

【化 400】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-(4-ヒドロキシピペリジノ)ベンゾエートから化合物 364 を調製した。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 9.75 (s, 2H)、7.94 (s, 1H)、7.82 (d, J=9 Hz, 4H)、7.57 (d, J=9 Hz, 4H)、6.98 (t, J=9 Hz, 8H)、4.71 (d, J=4.5 Hz, 2H)、3.67 (m, 8H)、2.98 (dt, J=3, 10 Hz, 2H)、1.80 (m, 4H)、1.43 (m, 4H)。

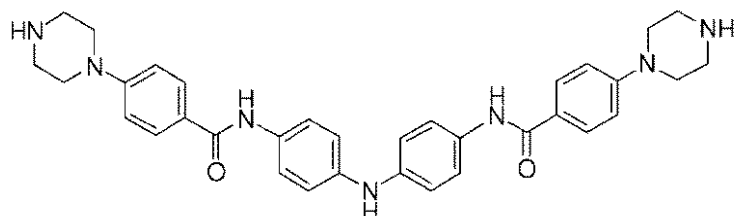
30

【0544】

実施例 265

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-ピペラジノベンズアミド) (化合物 365)

【化 401】



40

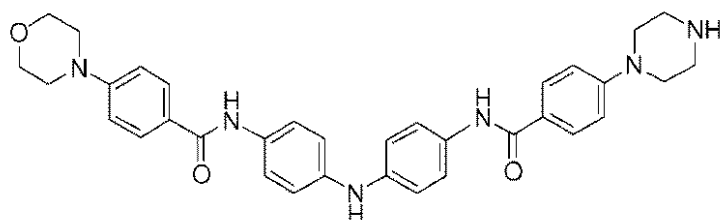
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-ピペラジノベンゾエートから化合物 365 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₈N₇O₂ についての計算値：576.31；実測値：576.17。

【0545】

実施例 266

4-モルホリノ-N-(4-(4-(4-(ピペラジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)ベンズアミド (化合物 366)

【化 4 0 2】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 366 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₆N₆O₃ についての計算値：577.21；実測値：577.16。

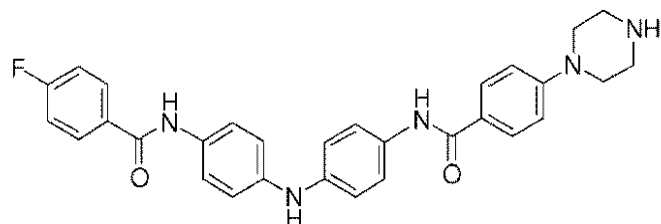
10

【0546】

実施例 267

4-フルオロ-N-(4-(4-(4-ピペラジノベンズアミド)フェニルアミノ)フェニル)ベンズアミド (化合物 367)

【化 4 0 3】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-ピペラジノベンゾエートから化合物 367 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₉FN₅O₂ についての計算値：510.23；実測値：510.06。

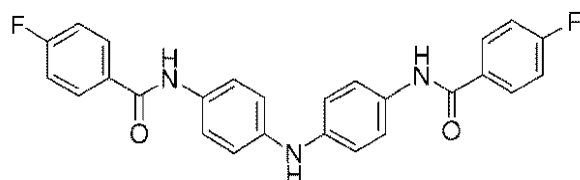
【0547】

実施例 268

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-フルオロベンズアミド) (化合物 368)

30

【化 4 0 4】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-フルオロベンゾエートから化合物 368 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₁₉F₂N₃O₂ についての計算値：444.14；実測値：443.86。

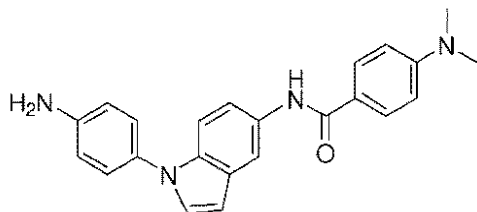
40

【0548】

実施例 269

N-(1-(4-アミノフェニル)-1H-インドール-5-イル)-4-ジメチルアミノベンズアミド (化合物 369)

【化 4 0 5】



スキーム I V に表される一般的な手順にしたがって、化合物 3 6 9 を調製した。4 - (ジメチルアミノ) - N - (1 H - インドール - 5 - イル) ベンズアミドの調製：1 H - インドール - 5 - アミン (2 0 0 m g、1 . 5 1 m m o l)、ヒドロキシベンゾトリアゾール (2 0 4 m g、1 . 5 1 m m o l)、トリエチルアミン (0 . 2 3 m L、1 . 6 6 m m o l)、および 4 - (ジメチルアミノ) 安息香酸 (2 7 5 m g、1 . 6 6 m m o l) を D M F (7 . 5 m L) 中に取り、攪拌した。E D C (3 1 9 m g、1 . 6 6 m m o l) を溶液に最後に添加した。添加した後、溶液を室温で 4 時間攪拌した。次に、水を溶液に添加し、1 0 分間攪拌した。形成された沈殿物をろ過し、水で、その後ヘキサンでよく洗浄した。灰色がかった固体を減圧下で乾燥させて、3 9 3 m g (9 3 %) の生成物を得た。

【0 5 4 9】

4 - (ジメチルアミノ) - N - (1 - (4 - ニトロフェニル) - 1 H - インドール - 5 - イル) ベンズアミドの調製：4 - (ジメチルアミノ) - N - (1 H - インドール - 5 - イル) ベンズアミド (2 0 0 m g、0 . 7 1 m m o l)、4 - フルオロニトロベンゼン (1 0 1 m g、0 . 7 1 m m o l) および炭酸カリウム (9 9 m g、0 . 7 2 m m o l) を D M S O (7 . 2 m L) 中にとった。溶液を 1 0 0 °C まで加熱し、2 4 時間攪拌した。溶液を冷ました後、沈殿物が形成されるまで水で希釈し、5 分間、よく攪拌した。ろ過により黄色の固体を得て、次に、それを水で、その後ヘキサンでよく洗浄した。固体を減圧下で乾燥させて、2 5 8 m g (9 0 %) の生成物を黄色の固体として得た。

【0 5 5 0】

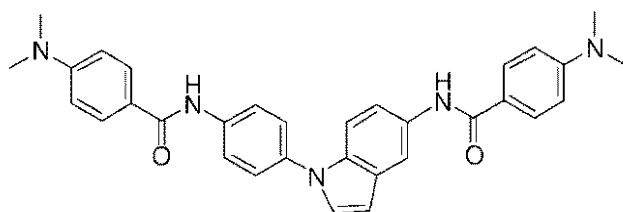
化合物 3 6 9 の調製：4 - (ジメチルアミノ) - N - (1 - (4 - ニトロフェニル) - 1 H - インドール - 5 - イル) ベンズアミド (3 3 0 m g、0 . 8 2 m m o l) を、窒素下でエタノール (2 8 m L) 中にとった。溶液を P d (O H) ₂ (3 5 m g、0 . 2 4 m m o l) で処理し、H₂ ガスのバルーン下に置いた。室温で 2 時間攪拌した後、セライトを通したろ過によって触媒を除去した。ろ液を濃縮して、2 6 0 m g (8 5 %) の化合物 3 6 9 を得た。M S [M + H]⁺ C₂₃H₂₂N₄O についての計算値：3 7 1 . 1 8 ; 実測値：3 7 0 . 9 4。

【0 5 5 1】

実施例 2 7 0

N - (1 - (4 - (4 - ジメチルアミノベンズアミド) フェニル) - 1 H - インドール - 5 - イル) - 4 - ジメチルアミノベンズアミド (化合物 3 7 0)

【化 4 0 6】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5 - アミノ - 1 - (4 - アミノフェニル) インドールおよび 4 - ジメチルアミノベンゾエートから化合物 3 7 0 を調製した。[M + H]⁺ C₃₂H₃₁N₅O₂ についての計算値：5 1 8 . 2 5 ; 実測値：5 1 7 . 9 5

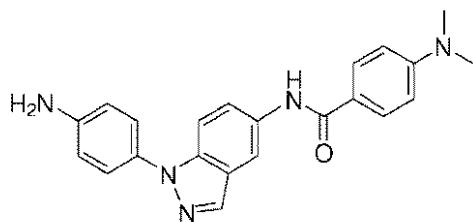
。

【0552】

実施例271

N-(1-(4-アミノフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-ジメチルアミノベンズアミド(化合物371)

【化407】



10

スキームIVに表される一般的な手順にしたがって、化合物371を調製した。4-(ジメチルアミノ)-N-(1H-インダゾール-5-イル)ベンズアミドの調製：1H-インダゾール-5-アミン(200mg、1.50mmol)、ヒドロキシベンゾトリアゾール(20mg、0.15mmol)、トリエチルアミン(0.23mL、1.65mmol)、および4-(ジメチルアミノ)安息香酸(273mg、1.65mmol)をDMF(7.5mL)中に取り、攪拌した。EDC(317mg、1.65mmol)を溶液に最後に添加した。添加した後、溶液を室温で4時間攪拌した。次に、水を溶液に添加し、10分間攪拌した。形成された沈殿物をろ過し、水で、その後ヘキサンでよく洗浄した。固体を減圧下で乾燥させて、410mg(97%)の生成物を褐色の固体として得た。

20

【0553】

4-(ジメチルアミノ)-N-(1-(4-ニトロフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)ベンズアミドの調製：4-(ジメチルアミノ)-N-(1H-インダゾール-5-イル)ベンズアミド(100mg、0.35mmol)、4-フルオロニトロベンゼン(50mg、0.35mmol)および炭酸カリウム(49mg、0.35mmol)をDMSO(3.6mL)中にとった。溶液を100℃まで加熱し、24時間攪拌した。溶液を冷ました後、沈殿物が形成されるまで水で希釈し、5分間、よく攪拌した。ろ過により黄色の固体を得て、次に、それを水で、その後ヘキサンでよく洗浄した。固体を減圧下で乾燥させて、133mg(93%)の生成物を黄色の固体として得た。

30

【0554】

化合物371の調製：4-(ジメチルアミノ)-N-(1-(4-ニトロフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)ベンズアミド(400mg、0.99mmol)を、窒素下でエタノール(33mL)中にとった。溶液をPd(OH)₂(35mg、0.25mmol)で処理し、H₂ガスのバルーン下に置いた。室温で2時間攪拌した後、セライトを通したろ過によって触媒を除去した。ろ液を減圧下でシリカ上に濃縮した。フラッシュクロマトグラフィー(0~5%のMeOH/CH₂Cl₂)による精製により、180mg(48%)の最終化合物371を淡褐色の固体として得た。¹H NMR(500MHz、DMSO-d₆) 9.95(s, 1H)、8.29(s, 1H)、8.18(s, 1H)、7.89(d, J=9Hz, 2H)、7.69(dd, J=2, 9Hz, 1H)、7.58(d, J=9Hz, 1H)、7.32(d, J=9Hz, 2H)、6.76(d, J=9Hz, 2H)、6.71(d, J=9Hz, 2H)、5.32(s, 2H)、2.99(s, 6H)。

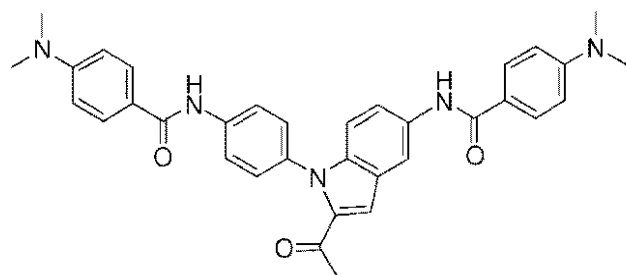
40

【0555】

実施例272

N-(2-アセチル-1-(4-(4-ジメチルアミノベンズアミド)フェニル)-1H-インドール-5-イル)-4-ジメチルアミノベンズアミド(化合物372)

【化 4 0 8】



10

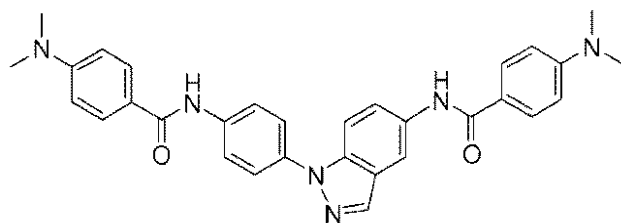
スキーム I V に表される手順にしたがって、2-アセチル-5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インドールおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 372 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₃N₅O₃ についての計算値：560.26；実測値：560.02。

【0556】

実施例 273

N-(1-(4-(4-ジメチルアミノベンゾアミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-ジメチルアミノベンゾアミド (化合物 373)

【化 4 0 9】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 373 を調製した。¹H

NMR (500 MHz、アセトン-d₆) δ 9.44 (s, 1H)、9.38 (s, 1H)、8.49 (s, 1H)、8.23 (s, 1H)、8.08 (d, J=9 Hz、2H)、7.95 (d, J=9 Hz、4H)、7.81 (m, 2H)、7.76 (d, J=9 Hz、2H)、6.79 (d, J=9 Hz、4H)、3.06 (s, 6H)、3.05 (s, 6H)。

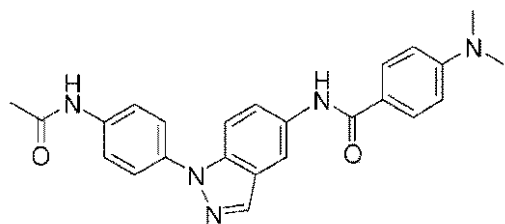
30

【0557】

実施例 274

N-(1-(4-アセトアミドフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-ジメチルアミノベンゾアミド (化合物 374)

【化 4 1 0】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 374 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₃N₅O₂ についての計算値：414.19；実測値：413.97。

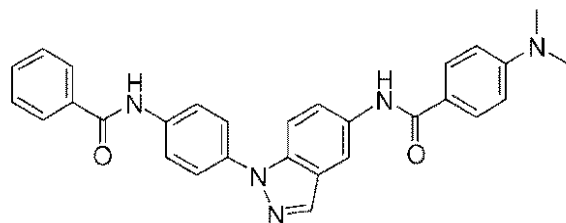
【0558】

50

実施例 275

N-(1-(4-ベンズアミドフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-ジメチルアミノベンズアミド(化合物375)

【化411】



10

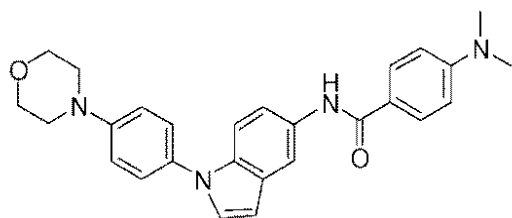
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物375を調製した。¹H NMR(500MHz、DMSO-d₆) δ 10.45(s, 1H)、10.01(s, 1H)、8.37(d, J=1.5Hz, 1H)、8.33(d, J=1Hz, 1H)、8.01~7.78(m, 11H)、7.55(t, J=8Hz, 2H)、6.77(d, J=9Hz, 2H)、3.00(s, 6H)。

【0559】

実施例 276

4-(ジメチルアミノ)-N-(1-(4-モルホリノフェニル)-1H-インドール-5-イル)ベンズアミド(化合物376)

【化412】



30

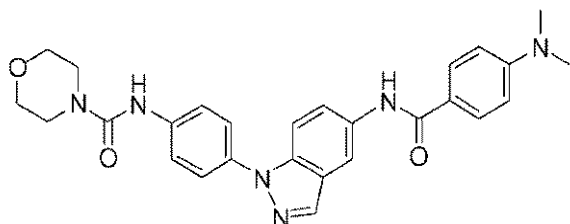
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-モルホリノフェニル)インドールおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物376を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₈N₄O₂についての計算値: 441.22; 実測値: 441.02。

【0560】

実施例 277

N-(1-(4-モルホリノカルボキサミドフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-ジメチルアミノベンズアミド(化合物377)

【化413】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-モルホリノカルボキサミドフェニル)インダゾールおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物377を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₈N₆O₃についての計算値: 485.22;

50

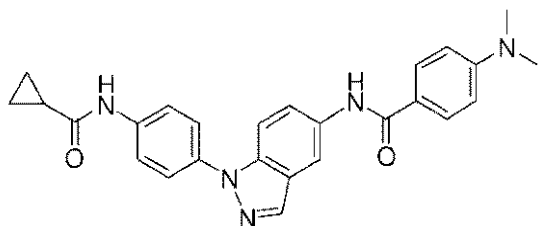
実測値：485.02。

【0561】

実施例278

N-(1-(4-シクロプロパンカルボキサミドフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-ジメチルアミノベンズアミド(化合物378)

【化414】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物378を調製した。¹H

NMR(500MHz、DMSO-d₆) δ 10.38(s, 1H)、10.00(s, 1H)、8.35(t, J=1Hz, 1H)、8.30(d, J=1Hz, 1H)、7.89(d, J=7Hz, 2H)、7.80~7.76(m, 4H)、7.68(d, J=9Hz, 2H)、6.76(d, J=9Hz, 2H)、3.00(s, 6H)、1.80(m, 1H)、0.82(m, 4H)。

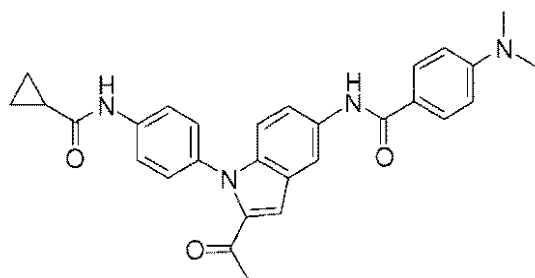
20

【0562】

実施例279

N-(2-アセチル-1-(4-シクロプロパンカルボキサミドフェニル)-1H-インドール-5-イル)-4-ジメチルアミノベンズアミド(化合物379)

【化415】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、2-アセチル-5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インドールおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物379を調製した。 $[M+H]^+$ C₂₉H₂₈N₄O₃についての計算値：481.22；実測値：480.97。

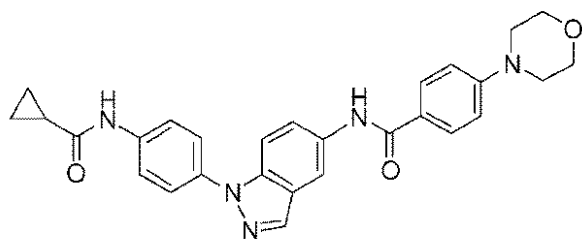
【0563】

実施例280

N-(1-(4-シクロプロパンカルボキサミドフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド(化合物380)

40

【化 4 1 6】



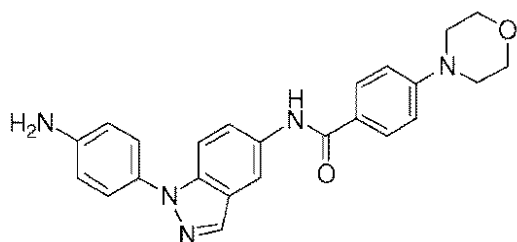
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物 380 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₇N₅O₃ についての計算値：482.21；実測値：481.98。

【0564】

実施例 281

N-(1-(4-アミノフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド (化合物 381)

【化 4 1 7】



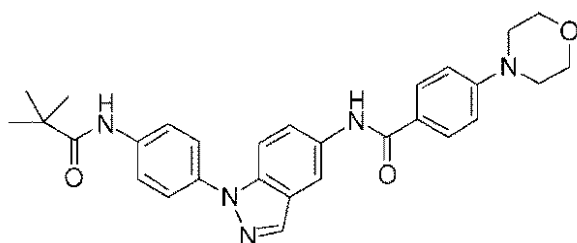
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物 381 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₃N₅O₂ についての計算値：414.19；実測値：414.01。

【0565】

実施例 282

N-(1-(4-ピバロイルアミノフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド (化合物 382)

【化 4 1 8】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物 382 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₁N₅O₃ についての計算値：498.24；実測値：498.05。

【0566】

実施例 283

tert-ブチル 1-(4-(4-ジメチルアミノベンズアミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イルカルバメート (化合物 383)

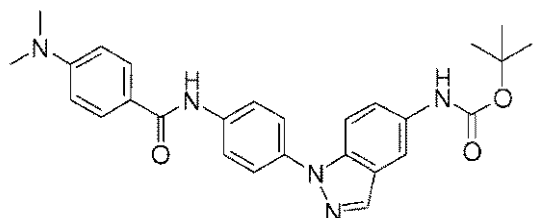
10

20

30

40

【化 4 1 9】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 383 を調製した。[M + H]⁺ C₂₇H₂₉N₅O₃ についての計算値：472.23；実測値：472.06。

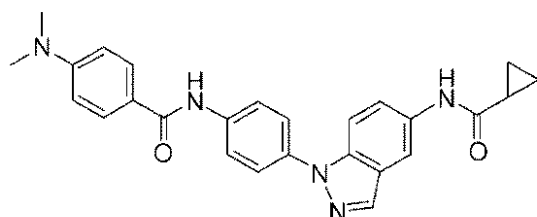
10

【0567】

実施例 284

N-(4-(5-(シクロプロパンカルボキサミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド (化合物 384)

【化 4 2 0】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 384 を調製した。¹H

NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 10.30 (s, 1H)、10.05 (s, 1H)、8.27 (d, J = 1 Hz, 1H)、8.23 (s, 1H)、7.97 (d, J = 9 Hz, 2H)、7.89 (d, J = 9 Hz, 2H)、7.78 (d, J = 9 Hz, 1H)、7.70 (d, J = 9 Hz, 1H)、7.55 (dd, J = 2, 12 Hz, 1H)、6.77 (d, J = 9 Hz, 2H)、3.00 (s, 6H)、1.79 (m, 1H)、0.81 (m, 4H)。

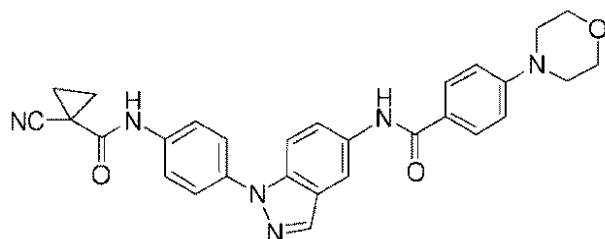
30

【0568】

実施例 285

N-(1-(4-(1-シアノシクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド (化合物 385)

【化 4 2 1】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物 385 を調製した。[M + H]⁺ C₂₉H₂₆N₆O₃ についての計算値：507.21；実測値：507.01。

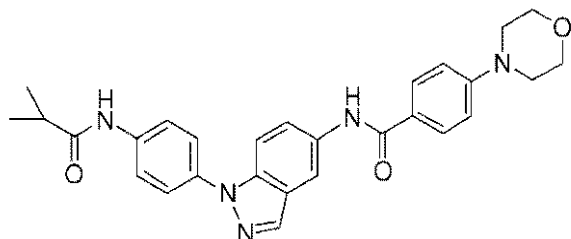
【0569】

実施例 286

50

N-（1-（4-イソブチルアミドフェニル）-1H-インダゾール-5-イル）-4-モルホリノベンズアミド（化合物386）

【化422】



10

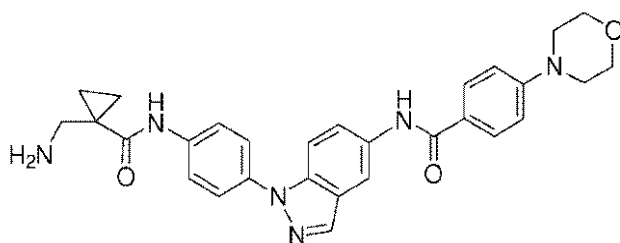
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-（4-アミノフェニル）インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物386を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₉N₅O₃についての計算値：484.23；実測値：484.01。

【0570】

実施例287

N-（1-（4-（1-アミノメチルシクロプロパンカルボキサミド）フェニル）-1H-インダゾール-5-イル）-4-モルホリノベンズアミド（化合物387）

【化423】



20

化合物385の還元によって化合物387を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₀N₆O₃についての計算値：511.24；実測値：511.01。

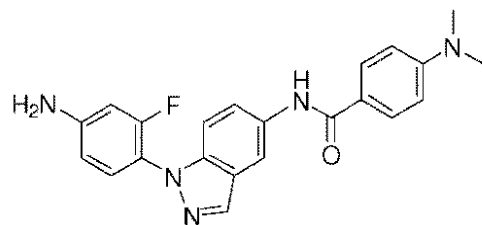
【0571】

30

実施例288

N-（1-（4-アミノ-2-フルオロフェニル）-1H-インダゾール-5-イル）-4-ジメチルアミノベンズアミド（化合物388）

【化424】



40

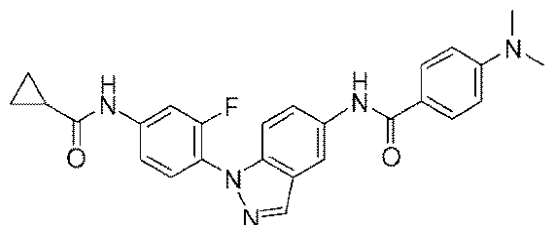
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-（4-アミノ-2-フルオロフェニル）インダゾールおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物388を調製した。[M+H]⁺ C₂₂H₂₀FN₅Oについての計算値：390.17；実測値：389.96。

【0572】

実施例289

N-（1-（4-シクロプロパンカルボキサミド-2-フルオロフェニル）-1H-インダゾール-5-イル）-4-ジメチルアミノベンズアミド（化合物389）

【化 4 2 5】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノ-2-フルオロフェニル)インダゾールおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 389 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₄FN₅O₂ についての計算値：458.19；実測値：457.98。

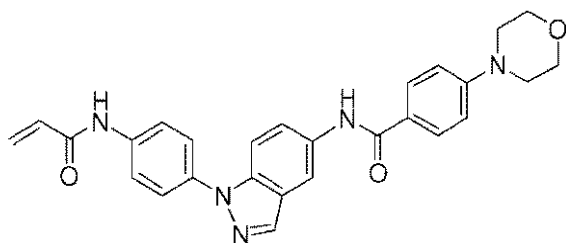
10

【0573】

実施例 290

N-(1-(4-(アクリルアミドフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド (化合物 390)

【化 4 2 6】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物 390 を調製した。¹H NMR (500 MHz、アセトン-d₆) δ 9.59 (s, 1H)、9.47 (s, 1H)、8.49 (s, 1H)、8.24 (s, 1H)、7.98 (dd, J=2、9 Hz、4H)、7.81 (m, 2H)、7.77 (d, J=9 Hz、1H)、7.05 (d, J=9 Hz、2H)、6.52~6.38 (m, 2H)、5.75 (dd, J=2、10 Hz、1H)、3.80 (m, 4H)、3.29 (m, 4H)。

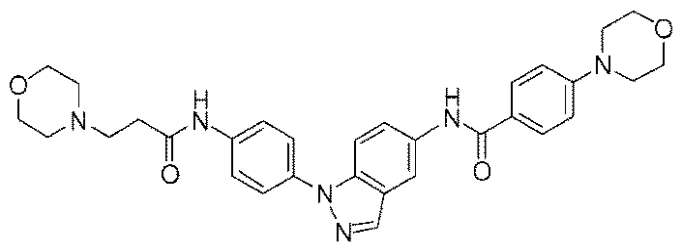
30

【0574】

実施例 291

N-(1-(4-(3-モルホリノプロパンアミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド (化合物 391)

【化 4 2 7】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物 391 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₄N₆O₄ についての計算値：555.26；実測値：555.09。

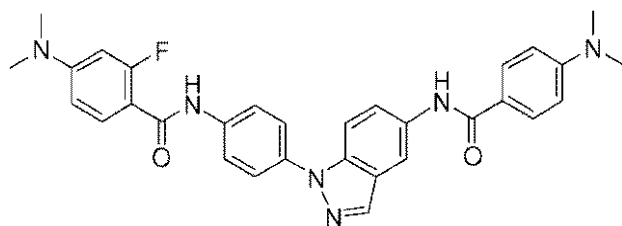
【0575】

実施例 292

50

N-(1-(4-(4-ジメチルアミノベンズアミド)-2-フルオロフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-ジメチルアミノベンズアミド(化合物392)

【化428】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-ジメチルアミノベンズエートから化合物392を調製した。¹H

NMR(500MHz、DMSO-d₆) δ 9.64(s, 1H)、9.37(s, 1H)、8.49(m, 1H)、8.26(s, 1H)、8.21(m, 1H)、7.95(d, J=9Hz, 4H)、7.79(dt, J=2, 9Hz, 1H)、7.76(m, 1H)、7.61(t, J=9Hz, 1H)、7.41(dd, J=3, 9Hz, 1H)、6.80(m, 4H)、3.07(s, 6H)、3.05(s, 6H)。

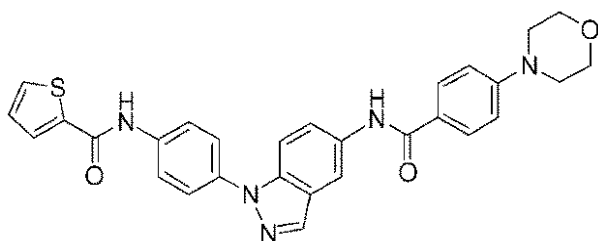
【0576】

実施例293

N-(1-(4-(2-チエニル)カルボキシアミノフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド(化合物393)

20

【化429】



30

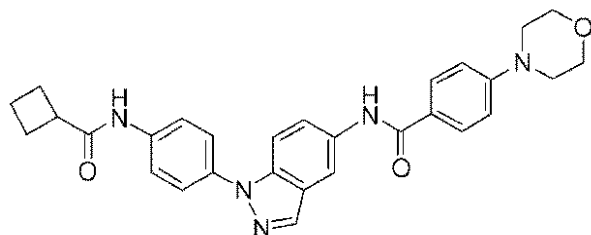
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンズエートから化合物393を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₅N₅O₃Sについての計算値: 524.17; 実測値: 523.97。

【0577】

実施例294

N-(1-(4-(シクロブタンカルボキシアミノフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド(化合物394)

【化430】



40

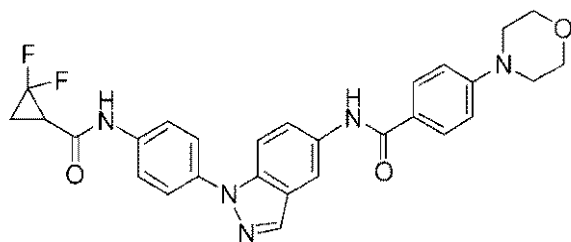
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンズエートから化合物394を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₉N₅O₃についての計算値: 496.23; 実測値: 496.03。

50

【0578】

実施例295

(±)-N-(1-(4-(2,2-ジフルオロシクロプロパン)カルボキサミドフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド (化合物395)
【化431】



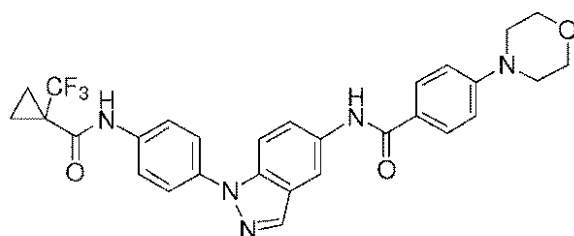
10

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンズエートから化合物395を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₅F₂N₅O₃ についての計算値: 518.19; 実測値: 518.03。

【0579】

実施例296

N-(1-(4-(1-トリフルオロメチルシクロプロパン)カルボキサミノフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド (化合物396)
【化432】



20

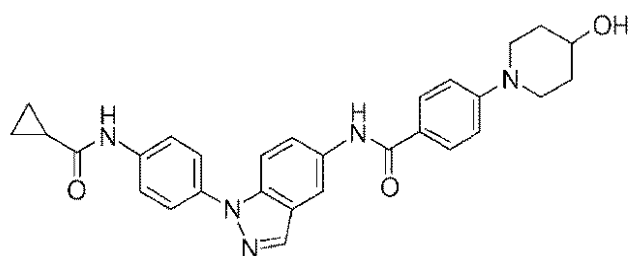
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンズエートから化合物396を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₆F₃N₅O₃ についての計算値: 550.21; 実測値: 550.16。

30

【0580】

実施例297

N-(1-(4-シクロプロパンカルボキサミドフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(4-ヒドロキシピペリジノ)ベンズアミド (化合物397)
【化433】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(4-ヒドロキシピペリジノ)ベンズエートから化合物397を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₉N₅O₃ についての計算値: 496.23; 実測値: 496.10。

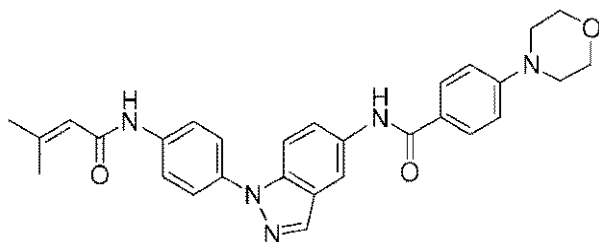
50

【0581】

実施例298

N-(1-(4-(3-メチルブタ-2-エンアミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド(化合物398)

【化434】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物398を調製した。¹H NMR(500MHz、アセトン-d₆) δ 9.47(s, 1H)、9.27(s, 1H)、8.48(s, 1H)、8.23(s, 1H)、7.98(d, J=8.5Hz、2H)、7.94(d, J=8.5Hz、2H)、7.80(s, 2H)、7.73(d, J=8.5Hz、2H)、7.05(d, J=8.5Hz、2H)、5.92(s, 1H)、3.80(t, J=5Hz、4H)、3.29(t, J=5Hz、4H)、2.24(s, 3H)、1.90(s, 3H)。

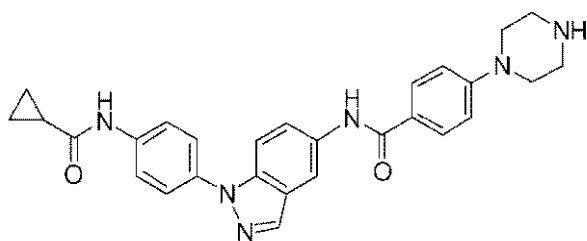
20

【0582】

実施例299

N-(1-(4-シクロプロパンカルボキサミドフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-ピペラジノベンズアミド(化合物399)

【化435】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-ピペラジノベンゾエートから化合物399を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₈N₆O₂についての計算値：481.23；実測値：481.04。

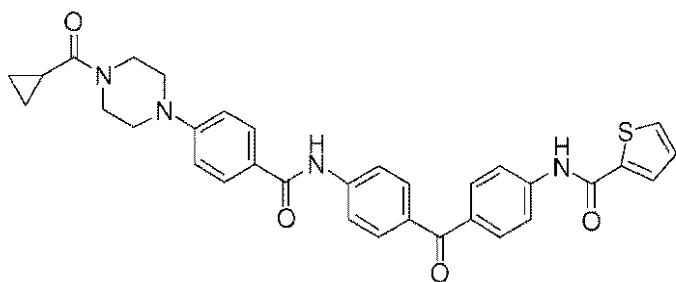
【0583】

実施例300

N-(4-(4-(4-(4-シクロプロパンカルボニル)ピペラジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)チオフエン-2-カルボキサミド(化合物400)

40

【化 4 3 6】



10

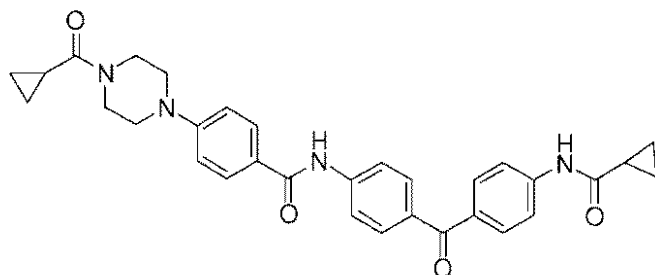
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-ピペラジンベンゾエートから化合物 400 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₀N₄O₄S についての計算値：579.51；実測値：579.06。

【0584】

実施例 301

N-(4-(4-(4-(4-cyclopropylcarbonyl)piperazin-1-yl)benzoyl)phenyl)benzamide (化合物 401)

【化 4 3 7】



20

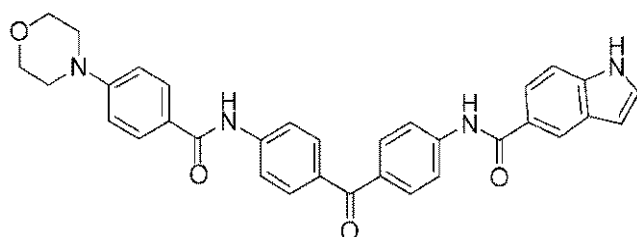
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-ピペラジンベンゾエートから化合物 401 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₂N₄O₄ についての計算値：537.15；実測値：537.06。

【0585】

実施例 302

N-(4-(4-(4-morpholinobenzoyl)phenyl)benzoyl)phenyl-1H-indole-5-carboxamide (化合物 402)

【化 4 3 8】



40

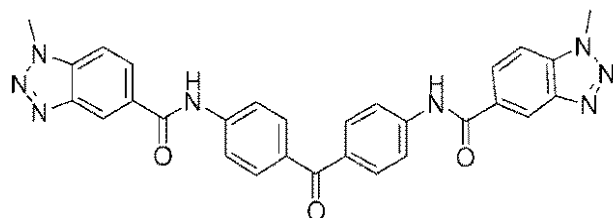
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-ピペラジンベンゾエートから化合物 402 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₂₈N₄O₄ についての計算値：545.13；実測値：545.03。

【0586】

実施例 303

N, N'-(carbonylbis(4, 1-phenylene))bis(1-methyl-1H-benzotriazole-5-carboxamide) (化合物 403)

【化 4 3 9】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 1-メチル-1H-ベンゾトリアゾール-5-カルボキシレートから化合物 403 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₂N₈O₃ についての計算値：531.06；実測値：531.05。

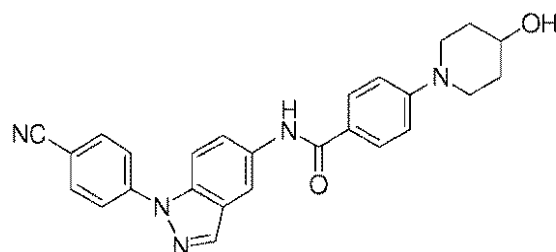
10

【0587】

実施例 304

N-(1-(4-シアノフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(4-ヒドロキシピペリジノ)ベンズアミド (化合物 404)

【化 4 4 0】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-シアノフェニル)インダゾールおよび 4-(4-ヒドロキシピペリジノ)ベンゾエートから化合物 404 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₃N₅O₂ についての計算値：438.19；実測値：437.99。

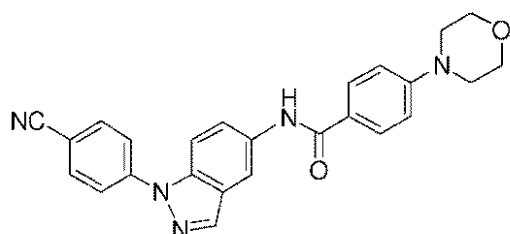
【0588】

30

実施例 305

N-(1-(4-シアノフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド (化合物 405)

【化 4 4 1】



40

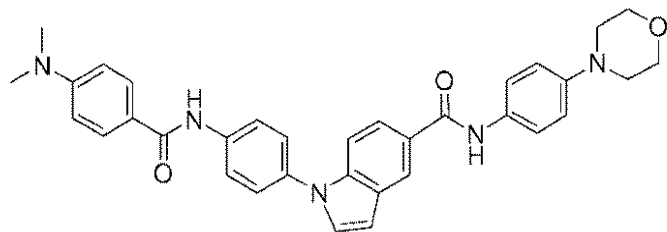
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-シアノフェニル)インダゾールおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 405 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₁N₅O₂ についての計算値：424.17；実測値：424.09。

【0589】

実施例 306

1-(4-(4-ジメチルアミノベンズアミド)フェニル)-N-(4-モルホリノフェニル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 406)

【化 4 4 2】



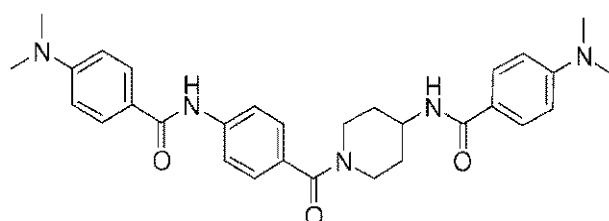
スキーム I V に表される手順にしたがって、1-(4-ジメチルアミノフェニルベンズアミド) インドールおよび 4-モルホリノアニリンから化合物 406 を調製した。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 10.08 (s, 1H)、10.02 (2, 1H)、8.33 (d, J=2 Hz, 1H)、7.99 (d, J=9 Hz, 2H)、7.89 (d, J=9 Hz, 2H)、7.82 (dd, J=2, 9 Hz, 1H)、7.74 (d, J=3 Hz, 1H)、7.66 (d, J=9 Hz, 2H)、7.60 (d, J=9 Hz, 1H)、7.57 (d, J=5 Hz, 2H)、6.93 (d, J=9 Hz, 2H)、6.83 (d, J=3 Hz, 1H)、6.78 (d, J=9 Hz, 2H)、3.73 (m, 4H)、3.06 (m, 4H)、3.01 (s, 6H)。

【0590】

実施例 307

4-ジメチルアミノ-N-(1-(4-(4-ジメチルアミノベンズアミド)ベンゾイル)ピペリジン-4-イル)ベンズアミド (化合物 407)

【化 4 4 3】



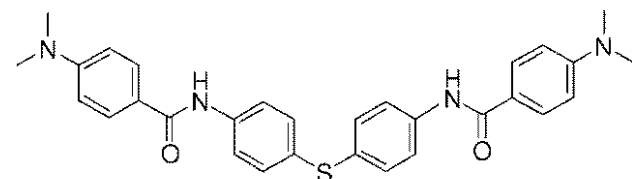
スキーム I V に表される手順にしたがって、4-(4-ジメチルアミノベンズアミド)ベンゾエートおよび 4-(4-ジメチルアミノフェニル)ピペリジンから化合物 407 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₅N₅O₃ についての計算値：514.27；実測値：513.98。

【0591】

実施例 308

N, N'-(4, 4'-チオビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド) (化合物 408)

【化 4 4 4】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 408 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₀N₄O₂S についての計算値：511.21；実測値：510.94。

【0592】

実施例 309

10

20

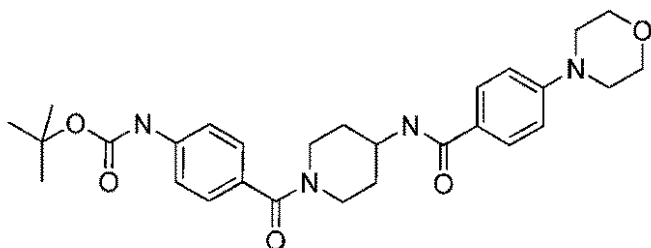
30

40

50

tert-ブチル (4- (4- (4-モルホリノベンズアミド) ピペリジン-1-カルボニル) フェニル) カルバメート (化合物 409)

【化 445】



10

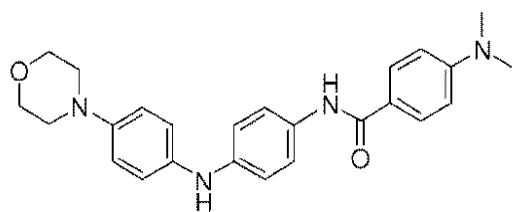
スキーム I V に表される手順にしたがって、4-アミノベンゾエートおよび 4- (4-ジメチルアミノフェニル) ピペリジンから化合物 409 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₃₆N₄O₅ についての計算値：509.27；実測値：508.99。

【0593】

実施例 310

N- (4- (4-モルホリノフェニルアミノ) フェニル) -4-ジメチルアミノベンズアミド (化合物 410)

【化 446】



20

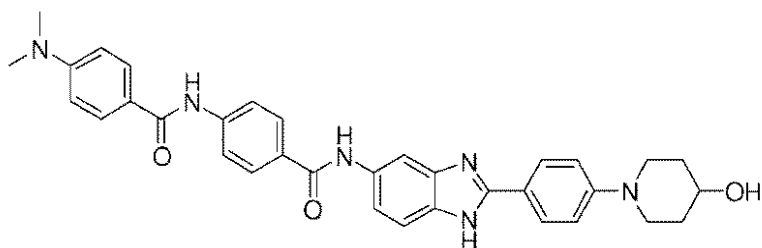
スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 410 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₉N₄O₂ についての計算値：417.23；実測値：417.01。

【0594】

実施例 311

4-ジメチルアミノ-N- (4- (2- (4- (4-ヒドロキシピペリジニル) フェニル) -1H-ベンズイミダゾール-5-イルカルバモイル) フェニル) ベンズアミド (化合物 411)

【化 447】



40

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N- (4-アミノベンゾイル) アニリンおよび 4- (4-ヒドロキシピペリジニル) ベンズアルデヒドから化合物 411 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₄N₆O₃ についての計算値：575.27；実測値：575.07。

【0595】

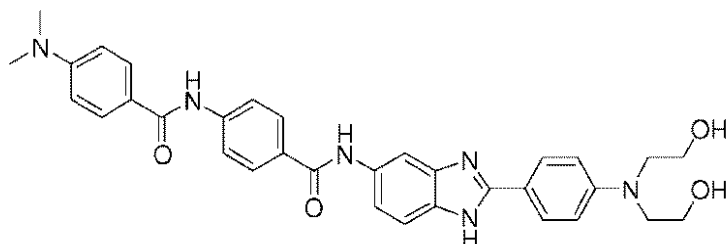
実施例 312

4-ジメチルアミノ-N- (4- (2- (4- (ビス (2-ヒドロキシエチル) アミノ)

50

フェニル) - 1H-ベンズイミダゾール-5-イルカルバモイル) フェニル) ベンズアミド (化合物 412)

【化 448】



10

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-アミノベンゾイル) アニリンおよび4-ビス(2-ヒドロキシエチル) アミノベンズアルデヒドから化合物 412 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₄N₆O₄ についての計算値: 579.26; 実測値: 579.06。

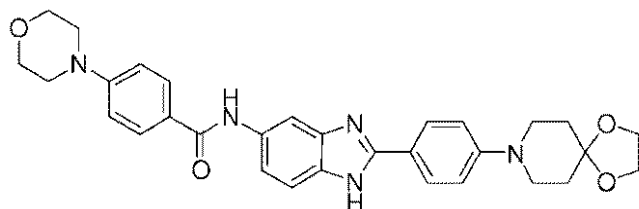
【0596】

実施例 313

N-(2-(4-(1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ[4, 5]デカナ-8-イル)フェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド (化合物 413)

20

【化 449】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-モルホリノベンゾイル) アニリンおよび4-(1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ[4, 5]デカナ-8-イル) ベンズアルデヒドから化合物 413 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₃N₅O₄ についての計算値: 540.25; 実測値: 540.05。

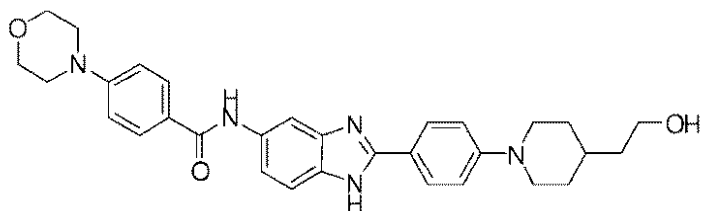
30

【0597】

実施例 314

N-(2-(4-(4-(2-ヒドロキシエチル)ピペリジニル)フェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド (化合物 414)

【化 450】



40

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-モルホリノベンゾイル) アニリンおよび4-(2-ヒドロキシエチル) ピペリジニルベンズアルデヒドから化合物 414 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₅N₅O₃ についての計算値: 526.27; 実測値: 526.11。

【0598】

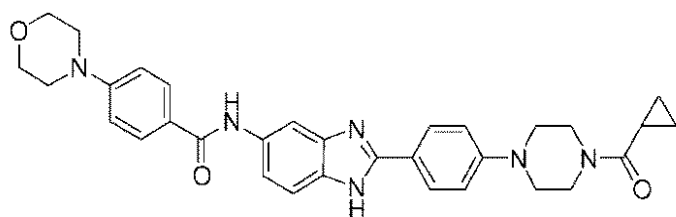
実施例 315

N-(2-(4-(4-シクロプロパンカルボニルピペラジニル)フェニル)-1H-ベ

50

ンズイミダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド (化合物 415)

【化 451】



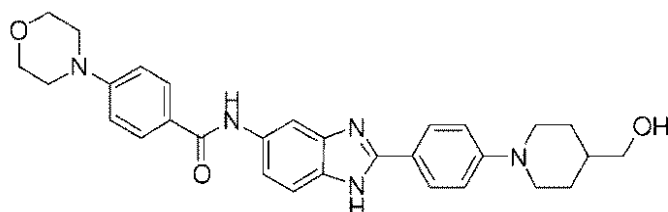
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-モルホリノベンゾイル)アニリンおよび4-(4-シクロプロパンカルボニルピペラジニル)ベンズアルデヒドから化合物 415 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₄N₆O₃ についての計算値: 551.27; 実測値: 551.10。

【0599】

実施例 316

N-(2-((4-(4-(2-hydroxymethyl)piperidin-2-yl)phenyl)-1H-benzimidazol-5-yl)-4-morpholinobenzoyl)aniline (化合物 416)

【化 452】



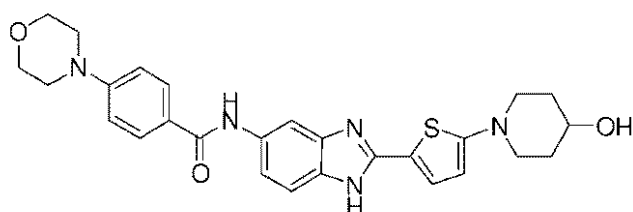
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-モルホリノベンゾイル)アニリンおよび4-(2-hydroxymethyl)piperidin-2-yl)phenyl)benzaldehyde から化合物 416 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₃N₅O₃ についての計算値: 512.26; 実測値: 512.09。

【0600】

実施例 317

N-(2-((4-(4-(2-hydroxymethyl)piperidin-2-yl)phenyl)-1H-benzimidazol-5-yl)-4-morpholinobenzoyl)aniline (化合物 417)

【化 453】



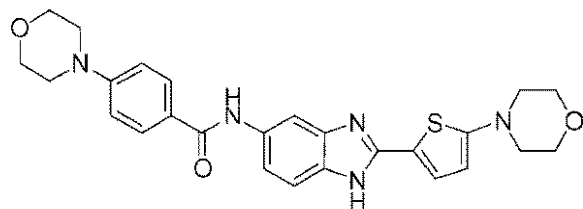
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-モルホリノベンゾイル)アニリンおよび5-(4-(2-hydroxymethyl)piperidin-2-yl)phenyl)thiophene-2-carboxaldehyde から化合物 417 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₉N₅O₃S についての計算値: 504.20; 実測値: 503.99。

【0601】

実施例 318

N-(2-((4-(4-(2-hydroxymethyl)piperidin-2-yl)phenyl)-1H-benzimidazol-5-yl)-4-morpholinobenzoyl)aniline (化合物 418)

【化 4 5 4】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-モルホリノベンゾイル) アニリンおよび5-モルホリノチオフエン-2-カルボキシアルデヒドから化合物 4 1 8 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₇N₅O₃S についての計算値：490.18；実測値：489.95。

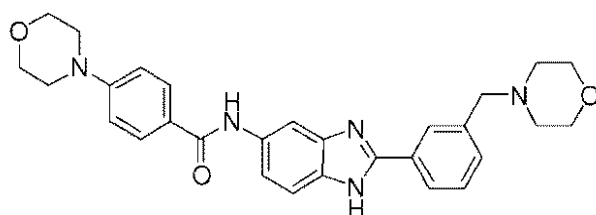
10

【0602】

実施例 3 1 9

N-(2-(3-モルホリノメチルフェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド (化合物 4 1 9)

【化 4 5 5】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-モルホリノベンゾイル) アニリンおよび3-モルホリノメチルベンズアルデヒドから化合物 4 1 9 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₁N₅O₃ についての計算値：498.24；実測値：497.98。

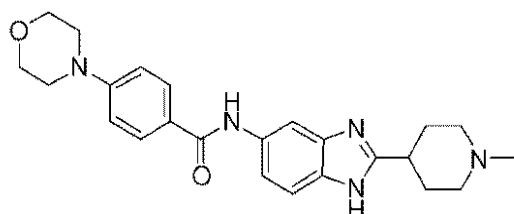
【0603】

実施例 3 2 0

N-(2-(1-メチルピペリジニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド (化合物 4 2 0)

30

【化 4 5 6】



40

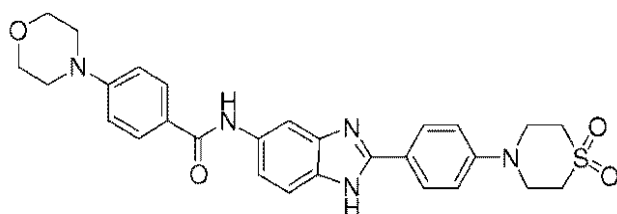
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロ-N-(4-モルホリノベンゾイル) アニリンおよび4-(1-メチルピペリジニル) カルボキシアルデヒドから化合物 4 2 0 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₉N₅O₂ についての計算値：420.23；実測値：420.04。

【0604】

実施例 3 2 1

N-(2-(4-(1, 1-ジオキソ-4-チオモルホリノ)フェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド (化合物 4 2 1)

【化 4 5 7】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-モルホリノベンゾイル)アニリンおよび4-(1,1-ジオキソ-4-チオモルホリノ)ベンズアルデヒドから化合物421を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₉N₅O₄S についての計算値532.19;実測値:532.02。

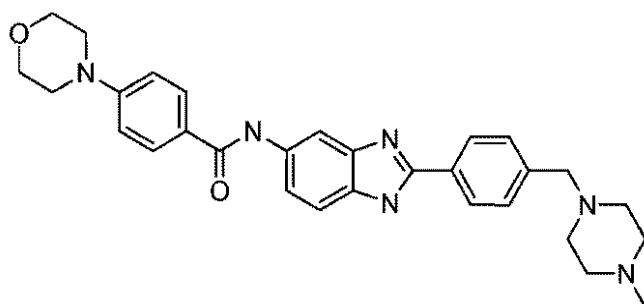
10

【0605】

実施例322

N-(2-(4-(4-メチルピペラジン-1-イル)メチル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド(化合物422)

【化 4 5 8】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-モルホリノベンゾイル)アニリンおよび4-ピペラジノメチルベンズアルデヒドから化合物422を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₄N₆O₂ についての計算値:511.27;実測値:511.07。

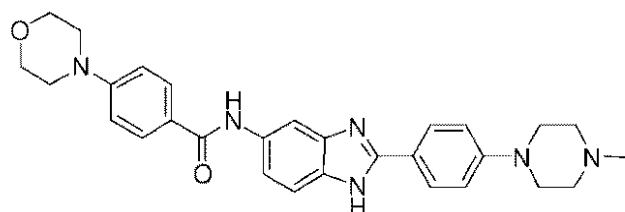
30

【0606】

実施例323

N-(2-(4-(4-メチルピペラジノ)フェニル)-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド(化合物423)

【化 4 5 9】



40

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-モルホリノベンゾイル)アニリンおよび4-(4-メチルピペラジノ)ベンズアルデヒドから化合物423を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₂N₆O₂ についての計算値:497.26;実測値:496.98。

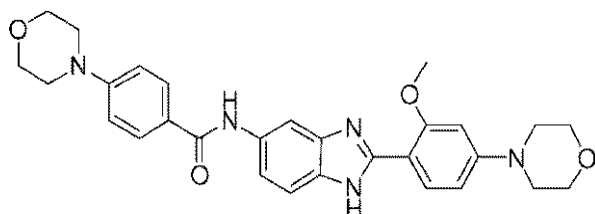
【0607】

実施例324

N-(2-(2-メトキシ-4-モルホリノフェニル)-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド(化合物424)

50

【化 4 6 0】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-モルホリノベンゾイル)アニリンおよび2-メトキシ-4-モルホリノベンズアルデヒドから化合物424を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₁N₅O₄ についての計算値：514.25；実測値：514.05。

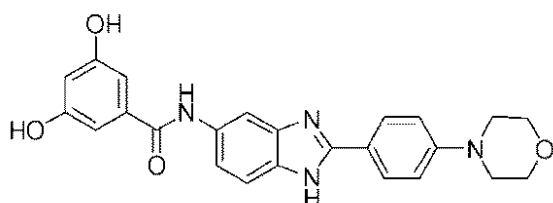
10

【0608】

実施例325

N-(2-(4-モルホリノフェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-3,5-ジヒドロキシベンズアミド (化合物425)

【化 4 6 1】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(3,5-ジヒドロキシベンゾイル)アニリンおよび4-モルホリノベンズアルデヒドから化合物425を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₂N₄O₄ についての計算値：431.17；実測値：431.18。

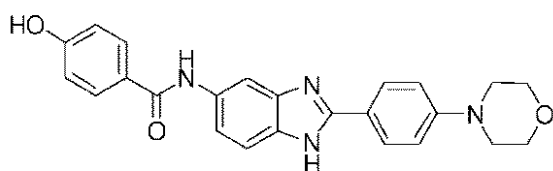
【0609】

実施例326

N-(2-(4-モルホリノフェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-4-ヒドロキシベンズアミド (化合物426)

30

【化 4 6 2】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(4-ヒドロキシベンゾイル)アニリンおよび4-モルホリノベンズアルデヒドから化合物426を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₂N₄O₃ についての計算値：415.18；実測値：415.17。

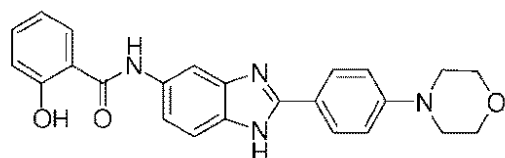
40

【0610】

実施例327

N-(2-(4-モルホリノフェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-2-ヒドロキシベンズアミド (化合物427)

【化 4 6 3】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-N-(2-ヒドロキシベンゾイル)アニリンおよび4-モルホリノベンズアルデヒドから化合物 4 2 7 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₂N₄O₃ についての計算値：415.18；実測値：414.98。

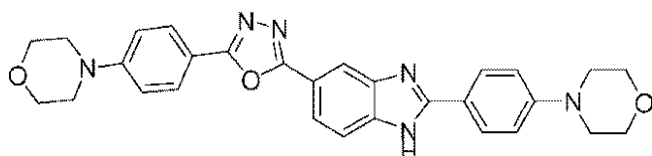
10

【0 6 1 1】

実施例 3 2 8

4-(4-(5-(5-(4-モルホリノフェニル)-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)フェニル)モルホリン(化合物 4 2 8)

【化 4 6 4】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロ-1-(5-(4-モルホリノフェニル)-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)ベンゼンおよび4-モルホリノベンズアルデヒドから化合物 4 2 8 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₈N₆O₃ についての計算値：590.23；実測値：508.98。

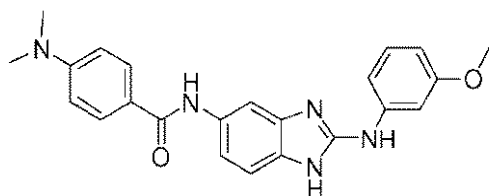
【0 6 1 2】

実施例 3 2 9

4-ジメチルアミノ-N-(2-(3-メトキシフェニルアミノ)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物 4 2 9)

30

【化 4 6 5】



標準条件によって、4-ジメチルアミノベンゾエートおよび5-アミノ-2-(3-メトキシフェニルアミノ)ベンズイミダゾールから化合物 4 2 9 を調製した。[M+H]⁺ C₂₃H₂₃N₅O₂ についての計算値：402.19；実測値：401.96。

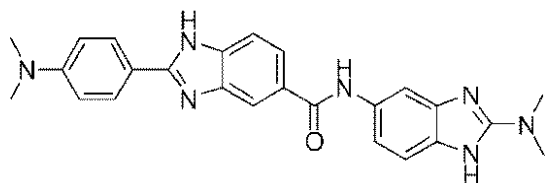
40

【0 6 1 3】

実施例 3 3 0

N-(2-ジメチルアミノ)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-2-(4-ジメチルアミノフェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-カルバミド(化合物 4 3 0)

【化 4 6 6】



標準条件によって、2-(4-(ジメチルアミノフェニル)ベンズイミダゾール-5-カルボキシレートおよび5-アミノ-2-(ジメチルアミノ)ベンズイミダゾールから化合物430を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₅N₇Oについての計算値：440.21；実測値：440.01。

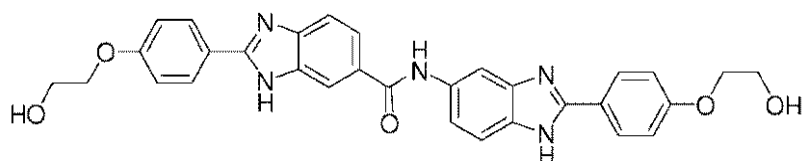
10

【0614】

実施例331

2-(4-(2-(ヒドロキシエトキシ)フェニル)-N-2-(4-(2-(ヒドロキシエトキシ)フェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-1H-ベンズイミダゾール-6-カルボキサミド (化合物431)

【化 4 6 7】



20

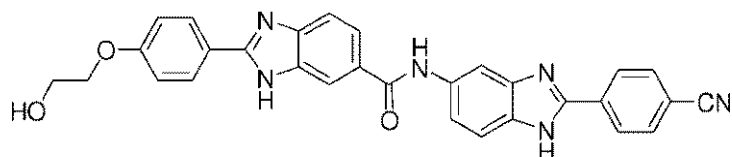
スキームVに表されるものと同様の手順にしたがって、2-(4-(2-(ヒドロキシエトキシ)フェニル)-5-アミノベンズイミダゾールおよび2-(4-(2-(ヒドロキシエトキシ)フェニル)ベンズイミダゾール-5-カルボキシレートから化合物431を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₇N₅O₅についての計算値：550.20；実測値：549.96。

【0615】

実施例332

2-(4-シアノフェニル)-N-2-(4-(2-(ヒドロキシエトキシ)フェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-1H-ベンズイミダゾール-6-カルボキサミド (化合物432)

【化 4 6 8】



40

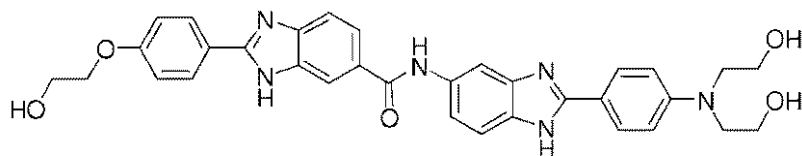
スキームVに表されるものと同様の手順にしたがって、2-(4-シアノフェニル)-5-アミノベンズイミダゾールおよび2-(4-(2-(ヒドロキシエトキシ)フェニル)ベンズイミダゾール-5-カルボキシレートから化合物432を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₂N₆O₃についての計算値：515.18；実測値：514.92。

【0616】

実施例333

2-(4-ビス(2-(ヒドロキシエチル)アミノフェニル)-N-2-(4-(2-(ヒドロキシエトキシ)フェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-1H-ベンズイミダゾール-6-カルボキサミド (化合物433)

【化 4 6 9】



スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、2-(4-ビス(2-ヒドロキシエチル)アミノフェニル)-5-アミノベンズイミダゾールおよび2-(4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル)ベンズイミダゾール-5-カルボキシレートから化合物 4 3 3 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₂N₆O₅ についての計算値：593.24；実測値：593.03。

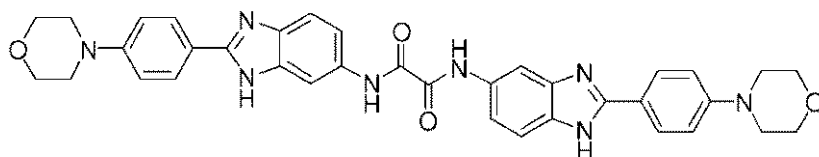
10

【0617】

実施例 334

N, N'-ビス-(2-(4-モルホリノフェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)オキサリアミド (化合物 434)

【化 4 7 0】



20

スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、2-(4-モルホリノフェニル)-5-アミノベンズイミダゾールおよびシュウ酸から化合物 434 を調製した。[M+H]⁺ C₃₆H₃₄N₈O₄ についての計算値：643.27；実測値：643.09。

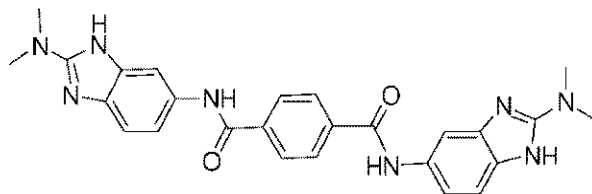
【0618】

実施例 335

N, N'-ビス(2-ジメチルアミノ-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)テレフタルアミド (化合物 435)

30

【化 4 7 1】



スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、2-ジメチルアミノ-5-アミノベンズイミダゾールおよびテレフタル酸から化合物 435 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₆N₈O₂ についての計算値：483.22；実測値：483.02。

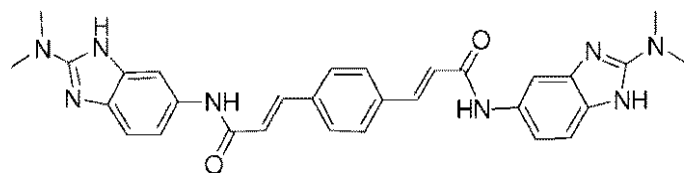
40

【0619】

実施例 336

N, N'-ビス(2-ジメチルアミノ-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-3(E), 3'(E)-(1,4-フェニレン)ビス(アクリルアミド) (化合物 436)

【化 4 7 2】



スキーム V に表されるものと同様の手順にしたがって、2-ジメチルアミノ-5-アミノベンズイミダゾールおよび 3 (E), 3' (E) - (1, 4-フェニレン) ビスアクリル酸から化合物 436 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₀N₈O₂ についての計算値：535.25；実測値：535.09。

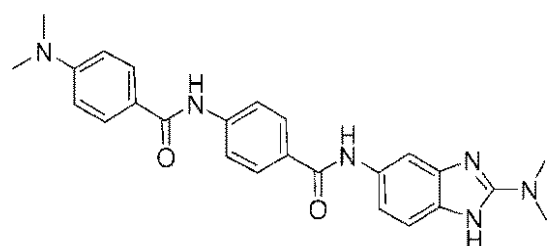
10

【0620】

実施例 337

N - (2-ジメチルアミノ) - 1H-ベンズイミダゾール-5-イル) - 4 - (4-ジメチルアミノベンズアミド) ベンズアミド (化合物 437)

【化 4 7 3】



20

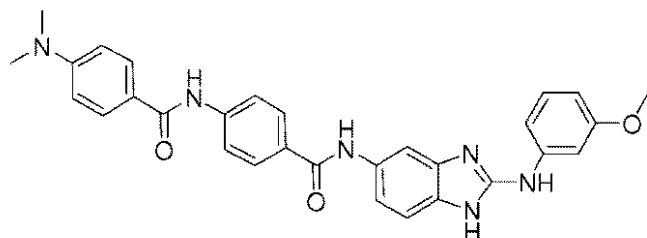
標準条件によって、4 - (4-ジメチルアミノベンズアミド) ベンゾエートおよび 5-アミノ-2 - (ジメチルアミノ) ベンズイミダゾールから化合物 437 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₆N₆O₂ についての計算値：443.21；実測値：443.05。

【0621】

実施例 338

N - (2 - (3-メトキシフェニル) アミノ) - 1H-ベンズイミダゾール-5-イル) - 4 - (4-ジメチルアミノベンズアミド) ベンズアミド (化合物 438)

【化 4 7 4】



40

標準条件によって、4 - (4-ジメチルアミノベンズアミド) ベンゾエートおよび 5-アミノ-2 - (3-メトキシフェニル) アミノベンズイミダゾールから化合物 438 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₈N₆O₃ についての計算値：521.22；実測値：521.06。

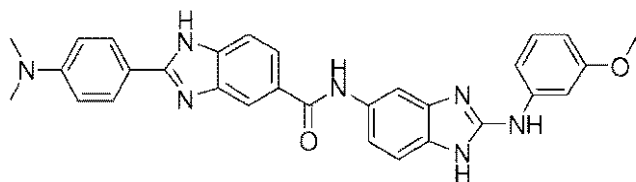
【0622】

実施例 339

N - (2 - (3-メトキシフェニル) アミノ-1H-ベンズイミダゾール-5-イル) - 2 - (4-ジメチルアミノフェニル) - 1H-ベンズイミダゾール-5-カルバミド (化合物 439)

50

【化 4 7 5】



標準条件によって、2-(4-ジメチルアミノフェニル)ベンズイミダゾール-5-カルボキシレートおよび5-アミノ-2-(3-メトキシフェニル)アミノベンズイミダゾールから化合物439を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{30}H_{27}N_7O_2$ についての計算値：518.22；実測値：518.03。

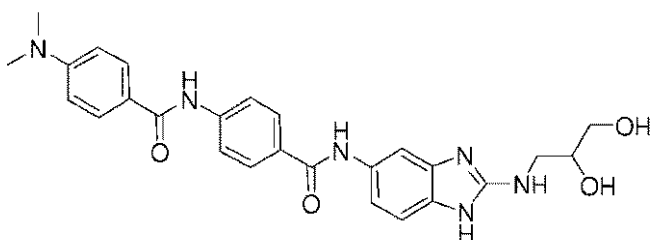
10

【0623】

実施例340

N-(2-(2,3-ジヒドロキシプロピル)アミノ-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-4-(4-ジメチルアミノベンズアミド)ベンズアミド(化合物440)

【化 4 7 6】



20

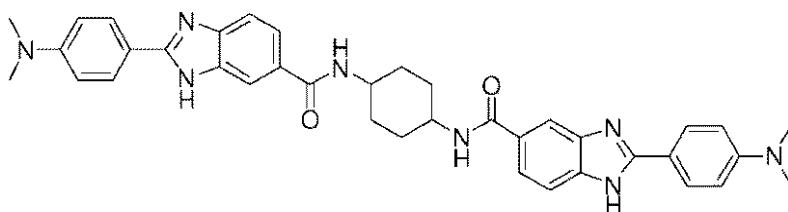
標準条件によって、4-(4-ジメチルアミノベンズアミド)ベンズエートおよび5-アミノ-2-(2,3-ジヒドロキシプロピルアミノ)ベンズイミダゾールから化合物440を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{26}H_{28}N_6O_4$ についての計算値：489.22；実測値：489.01。

【0624】

実施例341

N,N'-(1,4-シクロヘキサン)ビス(2-(4-ジメチルアミノフェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-カルボキサミド)(化合物441)

【化 4 7 7】



40

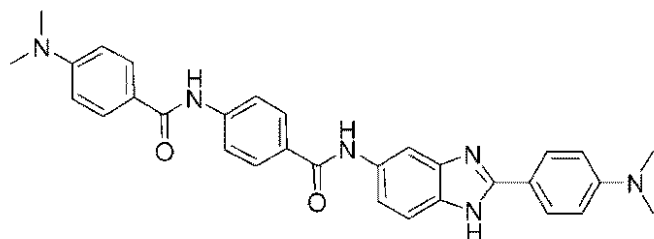
スキームVに表されるものと同様の手順にしたがって、1,4-シクロヘキサンジアミンおよび2-(4-ジメチルアミノフェニル)ベンズイミダゾール-5-カルボキシレートから化合物441を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{38}H_{40}N_8O_2$ についての計算値：641.33；実測値：641.24。

【0625】

実施例342

N-(2-(4-ジメチルアミノフェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-4-(4-ジメチルアミノベンズアミド)ベンズアミド(化合物442)

【化 4 7 8】



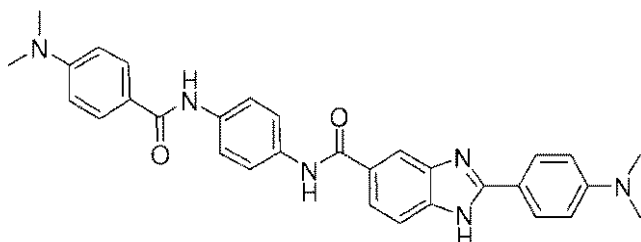
標準条件によって、4-(4-(ジメチルアミノベンズアミド)ベンゾエートおよび5-アミノ-2-(4-(ジメチルアミノフェニル)ベンズイミダゾールから化合物442を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀N₆O₂についての計算値：519.24；実測値：518.99。

【0626】

実施例343

N-(4-(4-(ジメチルアミノベンズアミド)フェニル)-2-(4-(ジメチルアミノフェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-カルボキサミド(化合物443)

【化 4 7 9】



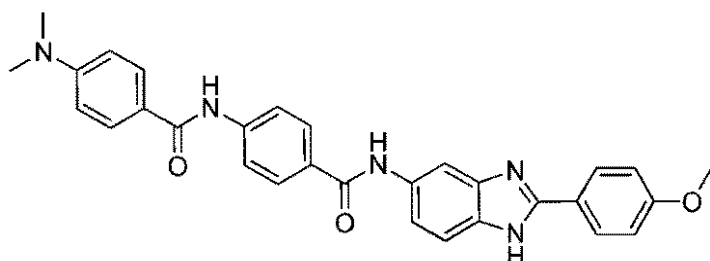
標準条件によって、4-(4-(ジメチルアミノベンズアミド)アニリンおよび2-(4-(ジメチルアミノフェニル)ベンズイミダゾール-5-カルボキシレートから化合物443を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀N₆O₂についての計算値：519.24；実測値：519.04。

【0627】

実施例344

4-(ジメチルアミノ)-N-(4-(2-(4-メトキシフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)カルバモイル)フェニル)ベンズアミド(化合物444)

【化 4 8 0】



標準条件によって、4-(4-(ジメチルアミノベンズアミド)アニリンおよび2-(4-メトキシフェニル)ベンズイミダゾール-5-カルボキシレートから化合物444を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₇N₅O₃についての計算値：506.21；実測値：507.02。

【0628】

実施例345

10

20

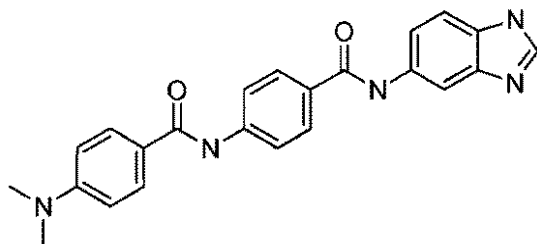
30

40

50

N-（4-（4-ジメチルアミノベンズアミド）フェニル）-1H-ベンズイミダゾール-5-カルボキサミド（化合物445）

【化481】



10

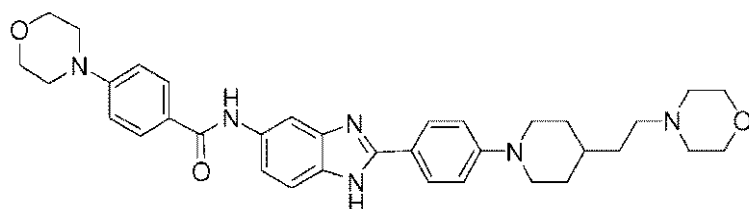
標準条件によって、4-（4-ジメチルアミノベンズアミド）アニリンおよびベンズイミダゾール-5-カルボキシレートから化合物445を調製した。[M+H]⁺ C₂₃H₂₁N₅O₂ についての計算値：400.17；実測値：400.01。

【0629】

実施例346

N-（2-（4-（4-（2-モルホリノエチル）ピペリジノ）フェニル）-1H-ベンズイミダゾール-5-イル）-4-モルホリノベンズアミド（化合物446）

【化482】



20

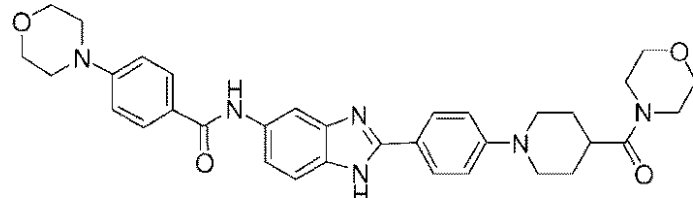
標準条件によって、4-モルホリノベンゾエートおよび5-アミノ-2-（4-（4-（2-モルホリノエチル）ピペリジノ）フェニル）ベンズイミダゾールから化合物446を調製した。[M+H]⁺：C₃₅H₄₂N₆O₃ についての計算値；595.33実測値：595.12。

【0630】

実施例347

N-（2-（4-（4-モルホリノカルボニル）ピペリジノ）フェニル）-1H-ベンズイミダゾール-5-イル）-4-モルホリノベンズアミド（化合物447）

【化483】



40

標準条件によって、4-モルホリノベンゾエートおよび5-アミノ-2-（4-（4-モルホリノカルボニル）ピペリジノ）フェニルベンズイミダゾールから化合物447を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₈N₆O₄ についての計算値：595.30；実測値：595.13。

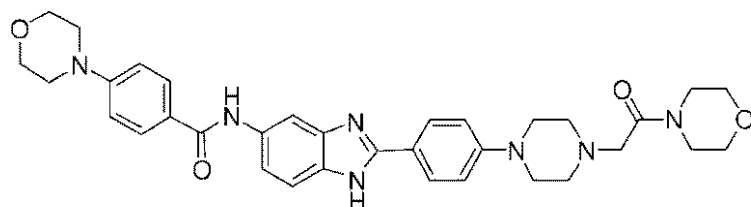
【0631】

実施例348

N-（2-（4-（4-モルホリノカルボニルメチル）ピペラジノ）フェニル）-1H-ベンズイミダゾール-5-イル）-4-モルホリノベンズアミド（化合物448）

50

【化 4 8 4】



標準条件によって、4-モルホリノベンゾエートおよび5-アミノ-2-(4-(4-モルホリノカルボニルメチル)ピペラジノ)フェニルベンズイミダゾールから化合物448を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₉N₇O₄についての計算値：610.31；実測値：610.11。

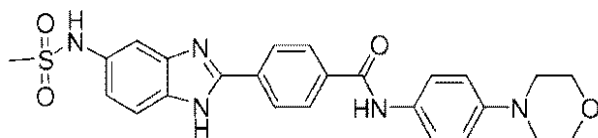
10

【0632】

実施例349

4-(5-メチルスルホニルアミド)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド(化合物449)

【化 4 8 5】



20

標準条件によって、4-モルホリノアニリンおよび4-(5-メチルスルホニルアミノ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)ベンゾエートから化合物449を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₅N₅O₄Sについての計算値：492.17；実測値：491.97。

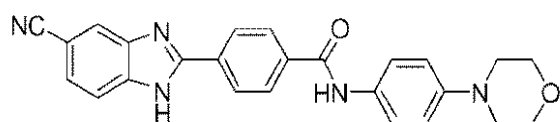
【0633】

実施例350

4-(5-シアノ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド(化合物450)

30

【化 4 8 6】



標準条件によって、4-モルホリノアニリンおよび4-(5-シアノ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)ベンゾエートから化合物450を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₁N₅O₂についての計算値：424.18；実測値：423.95。

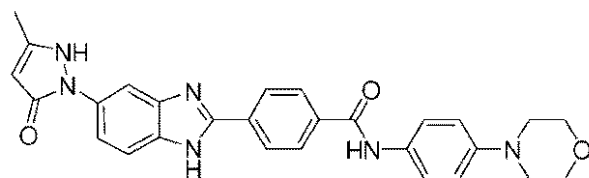
【0634】

40

実施例351

4-(5-(3-メチル-5-オキソ-2,5-ジヒドロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド(化合物451)

【化 4 8 7】



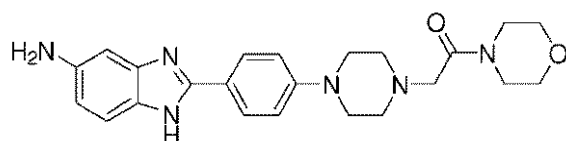
標準条件によって、4-モルホリノアニリンおよび4-(5-(3-メチル-5-オキ
ソ-2, 5-ジヒドロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1H-ベンズイミダゾール-2
-イル)ベンゾエートから化合物451を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₆N₆O₃ 10
3についての計算値：495.22；実測値：495.01。

【0635】

実施例352

5-アミノ-(2-(4-(4-モルホリノカルボニルメチル)ピペラジノ)フェニル)
-1H-ベンズイミダゾール(化合物452)

【化 4 8 8】



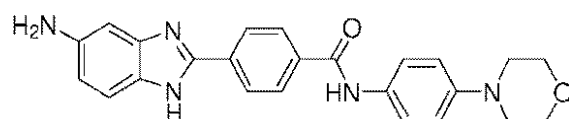
スキームIIIに表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロアニリン
および2-(4-(4-モルホリノカルボニルメチル)ピペラジノ)ベンズアルデヒドか
ら化合物452を調製した。[M+H]⁺ C₂₃H₂₈N₆O₂についての計算値：4
21.23；実測値：420.98。

【0636】

実施例353

4-(5-アミノ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェ
ニル)ベンズアミド(化合物453)

【化 4 8 9】



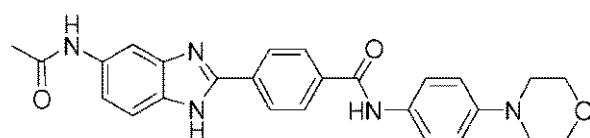
標準条件によって、4-モルホリノアニリンおよび4-(5-アミノ-1H-ベンズイ
ミダゾール-2-イル)ベンゾエートから化合物453を調製した。[M+H]⁺ C<sub>2
4</sub>H₂₃N₅O₂についての計算値：414.19；実測値：413.97。

【0637】

実施例354

4-(5-アセトアミノ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリ
ノフェニル)ベンズアミド(化合物454)

【化 4 9 0】



標準条件によって、4-モルホリノアニリンおよび4-(5-アセトアミノ-1H-ベ
ンズイミダゾール-2-イル)ベンゾエートから化合物454を調製した。[M+H]⁺ 50

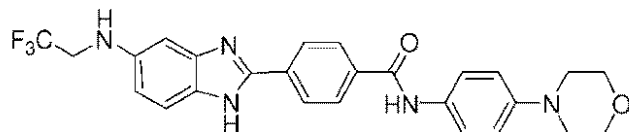
$C_{26}H_{25}N_5O_3$ についての計算値：456.20；実測値：455.95。

【0638】

実施例 355

4-（5-（2, 2, 2-トリフルオロエチル）アミノ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル）-N-（4-モルホリノフェニル）ベンズアミド（化合物 455）

【化 491】



10

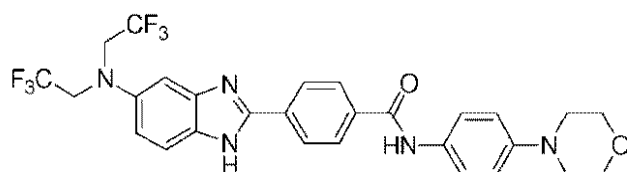
標準条件によって、4-モルホリノアニリンおよび4-（5-ビス（2, 2, 2-トリフルオロエチル）アミノ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル）ベンゾエートから化合物 455 を調製した。[M+H]⁺ $C_{26}H_{24}F_3N_5O_2$ についての計算値：496.19；実測値：496.02。

【0639】

実施例 356

4-（5-ビス（2, 2, 2-トリフルオロエチル）アミノ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル）-N-（4-モルホリノフェニル）ベンズアミド（化合物 456）

【化 492】



20

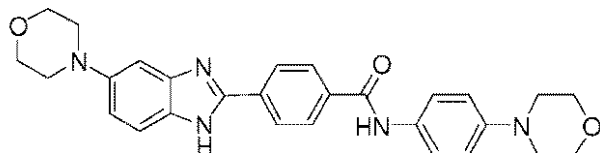
標準条件によって、4-モルホリノアニリンおよび4-（5-ビス（2, 2, 2-トリフルオロエチル）アミノ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル）ベンゾエートから化合物 456 を調製した。[M+H]⁺ $C_{28}H_{25}F_6N_5O_2$ についての計算値：578.19；実測値：578.04。

【0640】

実施例 357

4-（5-モルホリノ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル）-N-（4-モルホリノフェニル）ベンズアミド（化合物 457）

【化 493】



30

40

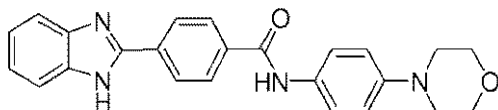
標準条件によって、4-モルホリノアニリンおよび4-（5-モルホリノ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル）ベンゾエートから化合物 457 を調製した。[M+H]⁺ $C_{28}H_{29}N_5O_3$ についての計算値：484.23；実測値：484.01。

【0641】

実施例 358

4-（1H-ベンズイミダゾール-2-イル）-N-（4-モルホリノフェニル）ベンズアミド（化合物 458）

【化 4 9 4】



標準条件によって、4-モルホリノアニリンおよび4-(1H-ベンズイミダゾール-2-イル)ベンゾエートから化合物458を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₂N₄O₂ についての計算値：399.17；実測値：398.98。

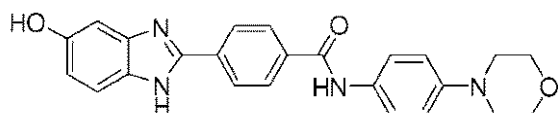
【0642】

10

実施例 359

4-(5-ヒドロキシ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド (化合物459)

【化 4 9 5】



標準条件によって、4-モルホリノアニリンおよび4-(5-ヒドロキシ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)ベンゾエートから化合物459を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₂N₄O₃ についての計算値：415.17；実測値：415.05。

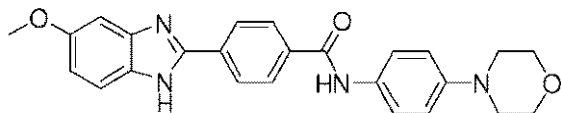
20

【0643】

実施例 360

4-(5-メトキシ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド (化合物460)

【化 4 9 6】



30

標準条件によって、4-モルホリノアニリンおよび4-(5-メトキシ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)ベンゾエートから化合物460を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₄N₄O₃ についての計算値：429.18；実測値：428.97。

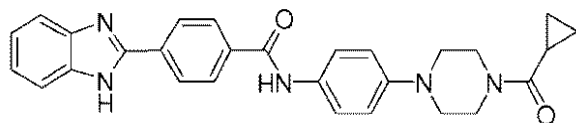
【0644】

実施例 361

4-(1H-ベンズイミダゾール-2-イル)-N-(4-(4-シクロプロパンカルボニルピペラジノ)フェニル)ベンズアミド (化合物461)

【化 4 9 7】

40



標準条件によって、4-(4-シクロプロパンカルボニル)ピペラジノアニリンおよび4-(1H-ベンズイミダゾール-2-イル)ベンゾエートから化合物461を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₇N₅O₂ についての計算値：466.22；実測値：465.99。

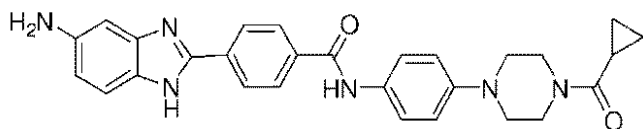
【0645】

50

実施例 362

4-（5-アミノ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル）-N-（4-（4-シクロプロパンカルボニルピペラジノ）フェニル）ベンズアミド（化合物462）

【化498】



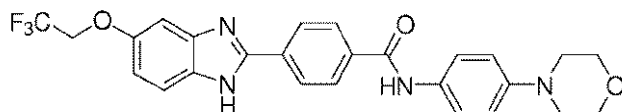
標準条件によって、4-（4-シクロプロパンカルボニル）ピペラジノアニリンおよび4-（5-アミノ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル）ベンゾエートから化合物462を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₈N₆O₂ についての計算値：481.23；実測値：481.05。

【0646】

実施例 363

4-（5-（2,2,2-トリフルオロエトキシ）-1H-ベンズイミダゾール-2-イル）-N-（4-モルホリノフェニル）ベンズアミド（化合物463）

【化499】



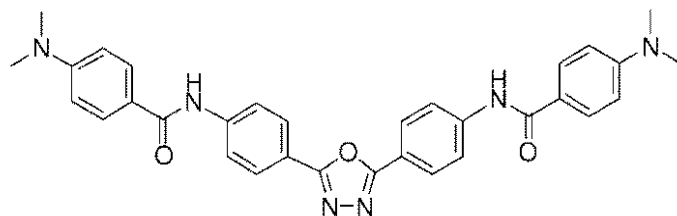
標準条件によって、4-モルホリノアニリンおよび4-（5-（2,2,2-トリフルオロエトキシ）-1H-ベンズイミダゾール-2-イル）ベンゾエートから化合物463を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₃F₃N₄O₃ についての計算値：497.17；実測値：496.97。

【0647】

実施例 364

N,N'-（4,4'-（1,3,4-オキサジアゾール-2,5-ジイル）ビス（4,1-フェニレン））ビス（4-ジメチルアミノベンズアミド）（化合物464）

【化500】



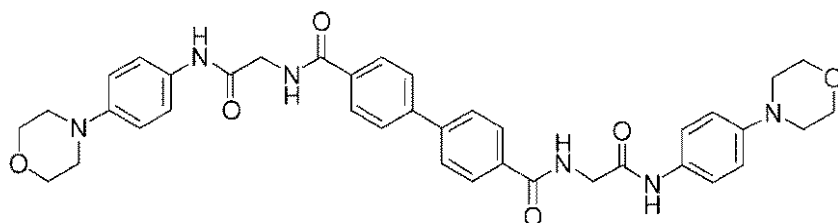
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-（1,3,4-オキサジアゾール-2,5-ジイル）ビス（4,1-フェニレン）ジアミンおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物464を調製した。¹H NMR（500MHz、DMSO-d₆）δ 10.20（s, 2H）、8.06（dq, J=2, 9Hz, 8H）、7.90（d, J=9Hz, 4H）、6.77（d, J=9Hz, 4H）、3.01（s, 12H）。

【0648】

実施例 365

N,N'-ビス（2-（4-モルホリノフェニルアミノ）-2-オキソエチル）ピフェニル-4,4'-ジカルボキサミド（化合物465）

【化 5 0 1】



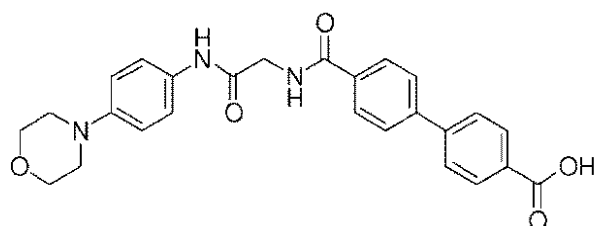
スキーム I V に表される手順にしたがって、4-モルホリノアニリン、グリシン、および 4, 4'-ビフェニルジカルボキシレートから化合物 465 を調製した。[M+H]⁺ C₃₈H₄₀N₆O₆ についての計算値：677.30；実測値：677.23。

【0649】

実施例 366

4'-(2-(4-モルホリノフェニルアミノ)-2-オキソエチルカルバモイル)ビフェニル-4-カルボキサミド (化合物 466)

【化 5 0 2】



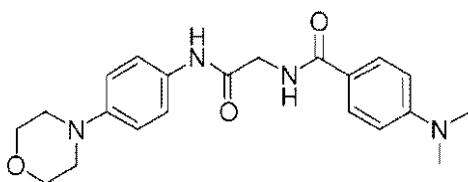
スキーム I V に表される手順にしたがって、4-モルホリノアニリン、グリシン、および 4, 4'-ビフェニルジカルボン酸から化合物 466 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₅N₃O₅ についての計算値：460.18；実測値：459.92。

【0650】

実施例 367

N-(2-(4-モルホリノフェニル)アミノ-2-オキソエチル)-4-ジメチルアミノベンゾアミド (化合物 467)

【化 5 0 3】



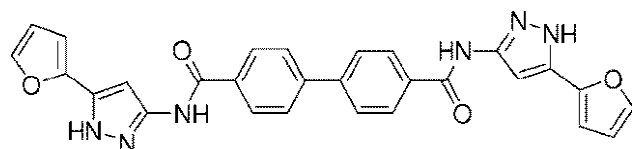
スキーム I V に表される手順にしたがって、4-モルホリノアニリン、グリシン、および 4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 467 を調製した。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.46 (s, 1H)、7.74 (s, J=9 Hz, 2H)、6.82 (t, J=5.5 Hz, 1H)、6.68 (d, J=9 Hz, 2H)、4.25 (d, J=5.5 Hz, 2H)、3.85 (m, 4H)、3.11 (m, 4H)、3.04 (s, 6H)。

【0651】

実施例 368

N, N'-ビス(5-(フラン-2-イル)-1H-ピラゾール-3-イル)ビフェニル-4, 4'-ジカルボキサミド (化合物 468)

【化 5 0 4】



3-アミノ-5-(2-フラニル)ピラゾールおよび4,4'-ビフェニルジカルボキシレートから化合物468を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₁N₆O₄についての計算値: 505.16; 実測値: 504.93。

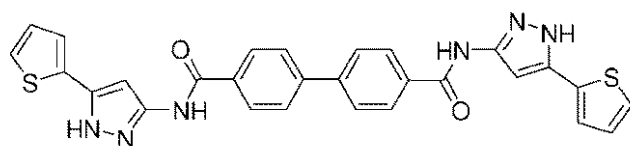
【0652】

10

実施例369

N,N'-ビス(5-(チオフェン-2-イル)-1H-ピラゾール-3-イル)ビフェニル-4,4'-ジカルボキサミド(化合物469)

【化 5 0 5】



3-アミノ-5-(2-チエニル)ピラゾールおよび4,4'-ビフェニルジカルボキシレートから化合物469を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₁N₆O₂S₂についての計算値: 537.12; 実測値: 536.93。

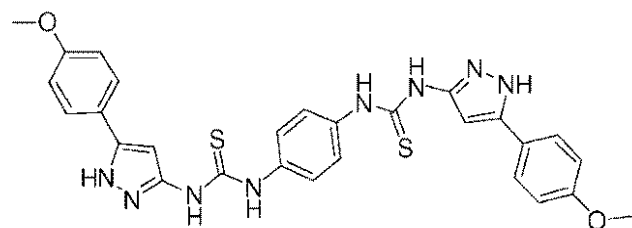
20

【0653】

実施例370

1,1'-ビス(1,4-フェニレン)ビス(3-(5-(4-メトキシフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル)チオ尿素)(化合物470)

【化 5 0 6】



30

3-アミノ-5-(4-メトキシフェニル)ピラゾールおよび1,4-フェニレンジアミンから化合物470を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₇N₈O₂S₂についての計算値: 571.17; 実測値: 570.89。

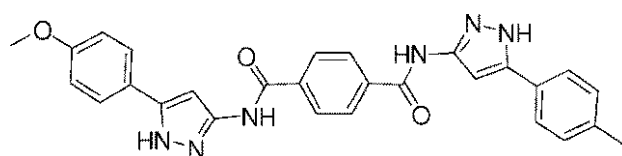
【0654】

実施例371

N-(5-(4-メトキシフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル)-N'-(5-(4-メチルフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル)テレフタルアミド(化合物471)

40

【化 5 0 7】



50

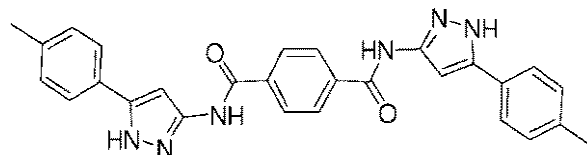
3-アミノ-5-(4-メトキシフェニル)ピラゾール、3-アミノ-5-(4-メチルフェニル)ピラゾール、およびテレフタル酸から化合物471を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₅N₆O₃ についての計算値：493.20；実測値：492.92。

【0655】

実施例372

N, N'-ビス(5-(4-メチルフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル)テレフタルアミド(化合物472)

【化508】



10

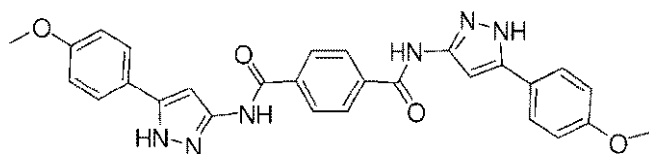
3-アミノ-5-(4-メチルフェニル)ピラゾールおよびテレフタル酸から化合物472を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₅N₆O₂ についての計算値：477.20；実測値：476.92。

【0656】

実施例373

N, N'-ビス(5-(4-メトキシフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル)テレフタルアミド(化合物473)

【化509】



20

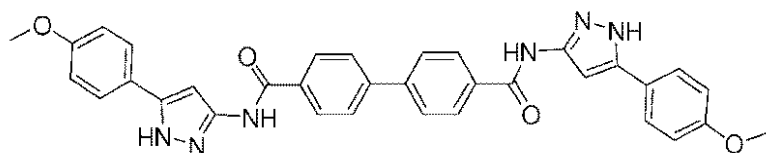
3-アミノ-5-(4-メトキシフェニル)ピラゾールおよびテレフタル酸から化合物473を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₅N₆O₄ についての計算値：509.19；実測値：508.91。

【0657】

実施例374

N, N'-ビス(5-(4-メトキシフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル)ビフェニル-4,4'-ジカルボキサミド(化合物474)

【化510】



40

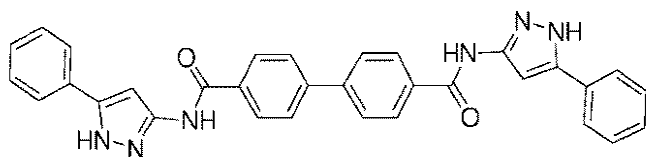
3-アミノ-5-(4-メトキシフェニル)ピラゾールおよびビフェニル-4,4'-ジカルボン酸から化合物474を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₂₉N₆O₄ についての計算値：585.23；実測値：585.01。

【0658】

実施例375

N, N'-ビス(5-フェニル-1H-ピラゾール-3-イル)ビフェニル-4,4'-ジカルボキサミド(化合物475)

【化 5 1 1】



3-アミノ-5-フェニルピラゾールおよびビフェニル-4,4'-ジカルボン酸から化合物 475 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₂₅N₆O₂ についての計算値：525.20；実測値：524.98。

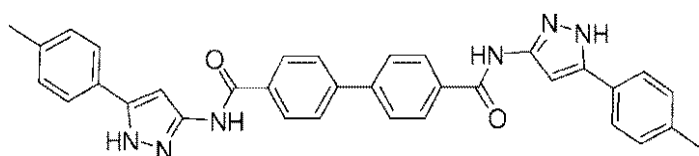
10

【0659】

実施例 376

N,N'-ビス(5-(4-メチルフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル)ビフェニル-4,4'-ジカルボキサミド(化合物 476)

【化 5 1 2】



20

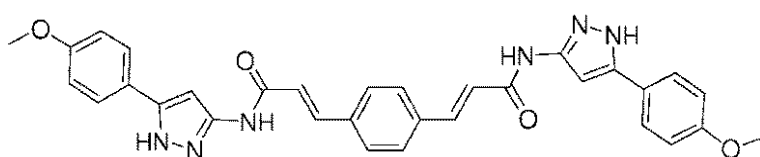
3-アミノ-5-(4-メチルフェニル)ピラゾールおよびビフェニル-4,4'-ジカルボン酸から化合物 476 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₂₉N₆O₂ についての計算値：553.24；実測値：553.06。

【0660】

実施例 377

N,N'-ビス(5-(4-メトキシフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル)-3(E),3'(E)-(1,4-フェニレン)ビス(アクリルアミド)(化合物 477)

【化 5 1 3】



30

3-アミノ-5-(4-メトキシフェニル)ピラゾールおよび 3(E),3'(E)-(1,4-フェニレン)ビス(アクリル酸)から化合物 477 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₂₈N₆O₄ についての計算値：561.23；実測値：561.05。

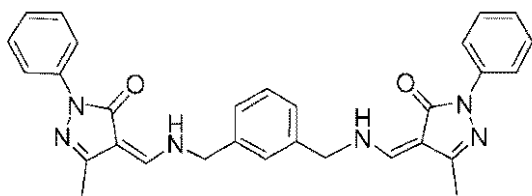
【0661】

実施例 378

4,4'-(1,3-フェニレンビス(メチレン)ビス(アザンジイル)ビス(メチリデン)ビス(3-メチル-1-フェニル-1H-ピラゾール-5(4H)-オン)(化合物 478)

40

【化 5 1 4】



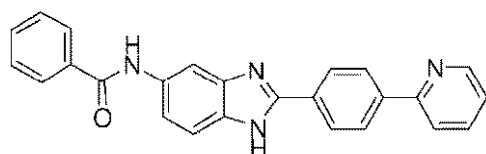
3-メチル-1-フェニル-1H-ピラゾール-5(4H)-オンおよび1,3-フェニレンビス(メチルアミン)から化合物478を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{30}H_{28}N_6O_2$ 10
 についての計算値: 505.23; 実測値: 505.07。

【0662】

実施例379

N-(2-(4-(ピリジン-2-イル)フェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物479)

【化 5 1 5】



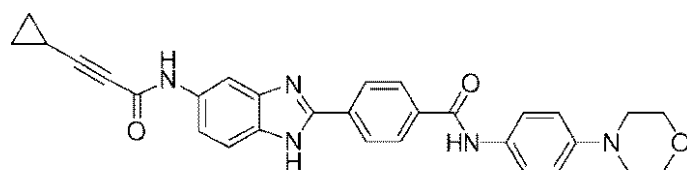
標準条件によって、5-アミノ-2-(4-(ピリジン-2-イル)フェニル)-1H-ベンズイミダゾールおよびベンゾエートから化合物479を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{25}H_{18}N_4O$ 20
 についての計算値: 391.16; 実測値: 390.91。

【0663】

実施例380

4-(5-シクロプロピルプロピオルアミド-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド(化合物480)

【化 5 1 6】



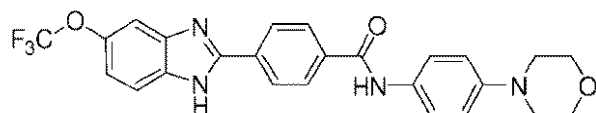
標準条件によって、4-モルホリノアニリンおよび4-(5-アミノ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)ベンゾエートから化合物480を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{30}H_{27}N_5O_3$ 30
 についての計算値: 506.22; 実測値: 506.01。

【0664】

実施例381

4-(5-トリフルオロメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド(化合物481)

【化 5 1 7】



標準条件によって、4-モルホリノアニリンおよび4-(5-トリフルオロメトキシ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)ベンゾエートから化合物481を調製した。 $[M$ 50

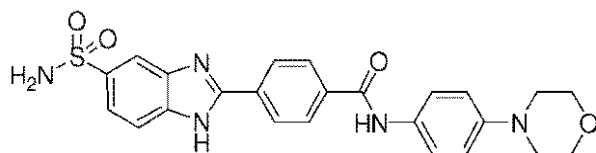
$[M+H]^+$ $C_{25}H_{21}F_3N_4O_3$ についての計算値：483.17；実測値：482.93。

【0665】

実施例382

4-(5-アミノスルホニル-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド(化合物482)

【化518】



10

標準条件によって、4-モルホリノアニリンおよび4-(5-アミノスルホニル-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)ベンゾエートから化合物482を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{24}H_{23}N_5O_4S$ についての計算値：478.16；実測値：477.93。

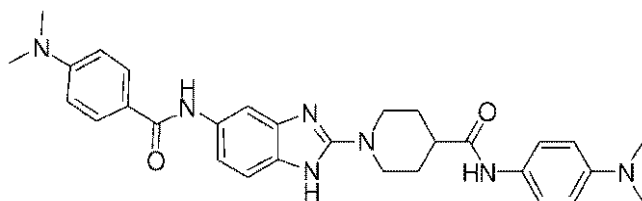
【0666】

実施例383

N-(2-(4-(4-ジメチルアミノフェニルカルバモイル)ピペリジノ)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)4-ジメチルアミノベンズアミド(化合物483)

20

【化519】



標準条件によって、4-ジメチルアミノアニリン、4-ジメチルアミノベンゾエート、および1-(5-アミノ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)ピペリジノ-4-カルボン酸から化合物483を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{30}H_{35}N_7O_2$ についての計算値：526.29；実測値：526.13。

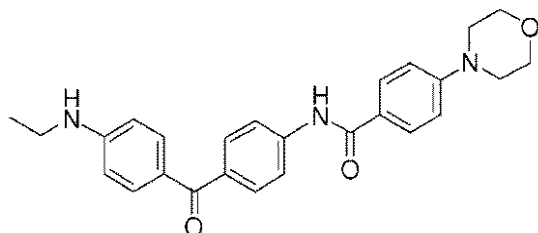
30

【0667】

実施例384

N-(4-(4-エチルアミノベンゾイル)フェニル)-4-モルホリノベンズアミド(化合物484)

【化520】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノンおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物484を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{26}H_{27}N_3O_3$ についての計算値：430.03；実測値：430.03。

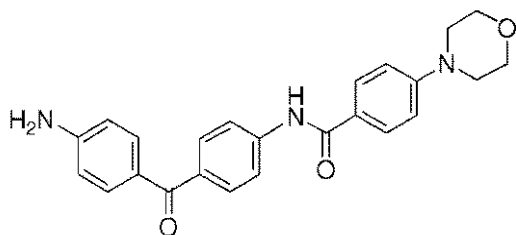
【0668】

実施例385

50

N-(4-(4-アミノベンゾイル)フェニル)-4-モルホリノベンズアミド (化合物 485)

【化521】



10

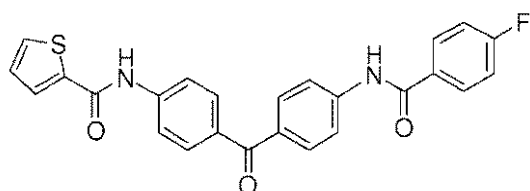
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノンおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物485を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₃N₃O₃についての計算値: 402.08; 実測値: 402.03。

【0669】

実施例386

N-(4-(4-(2-チエニル)カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)-4-フルオロベンズアミド (化合物486)

【化522】



20

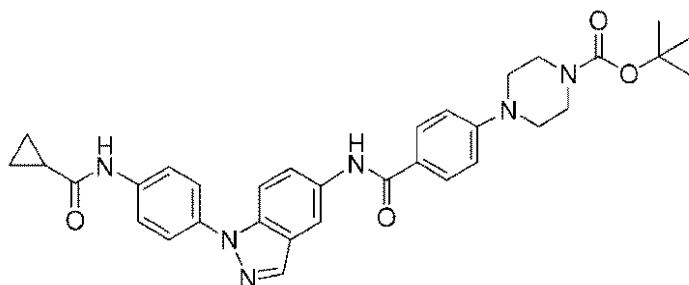
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノンおよび4-フルオロベンゾエートから化合物486を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₁₇FN₂O₃Sについての計算値: 445.00; 実測値: 444.94。

【0670】

実施例387

N-(1-(4-シクロプロパンカルボキサミドフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(4-tert-ブチルオキシカルボニルピペラジノ)ベンズアミド (化合物487)

【化523】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(4-tert-ブチルオキシカルボニルピペラジノ)ベンゾエートから化合物487を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₆N₆O₄についての計算値: 581.28; 実測値: 581.15。

【0671】

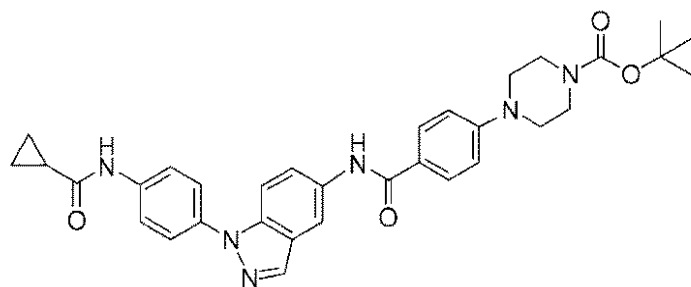
実施例388

N-(1-(4-シクロプロパンカルボキサミドフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(4-tert-ブチルオキシカルボニルピペラジノ)ベンズアミド (化合物488)

50

イル) - 4 - (4 - シクロプロパンカルボニルピペラジノ) ベンズアミド (化合物 488)

【化 5 2 4】



10

スキーム I V に表される手順にしたがって、5 - アミノ - 1 - (4 - アミノフェニル) インダゾールおよび 4 - (4 - シクロプロパンカルボニルピペラジノ) ベンゾエートから化合物 488 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₂N₆O₃ についての計算値: 549.25; 実測値: 549.16。

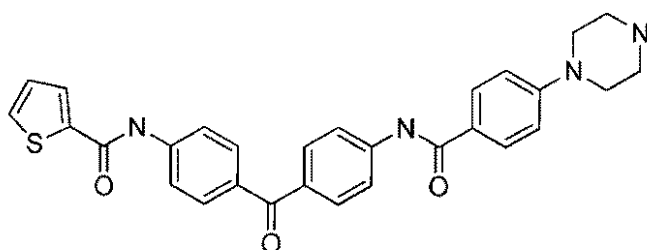
【0672】

実施例 389

N - (4 - (4 - (2 - チエニルカルボキサミド) ベンゾイル) フェニル) - 4 - モルホリノベンズアミド (化合物 489)

20

【化 5 2 5】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4' - ジアミノベンゾフェノンおよび 4 - モルホリノベンゾエートから化合物 489 を調製した。¹H NMR (500 MHz, CD₃OD) δ 7.98 (d, J = 5 Hz, 1H), 7.90 (dd, J = 2.5, 10.6 Hz, 6H), 7.82 (m, 4H), 7.76 (d, J = 5 Hz, 1H), 7.20 (t, J = 5 Hz, 1H), 7.03 (d, J = 10.6 Hz, 2H), 3.33 (m, 4H), 2.98 (m, 4H)。

30

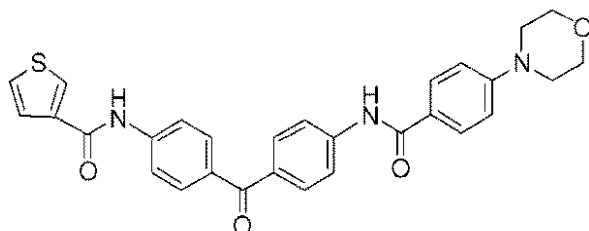
【0673】

実施例 390

N - (4 - (4 - (3 - チエニルカルボキサミド) ベンゾイル) フェニル) - 4 - モルホリノベンズアミド (化合物 490)

【化 5 2 6】

40



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4' - ジアミノベンゾフェノンおよび 4 - モルホリノベンゾエートから化合物 490 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₅

50

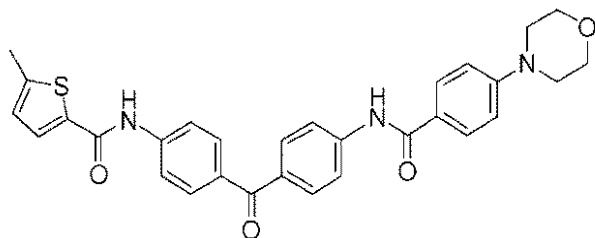
N_3O_4S についての計算値：512.11；実測値：512.09。

【0674】

実施例391

N-(4-(4-(2-(5-メチルチエニル)カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)-4-モルホリノベンズアミド(化合物491)

【化527】



10

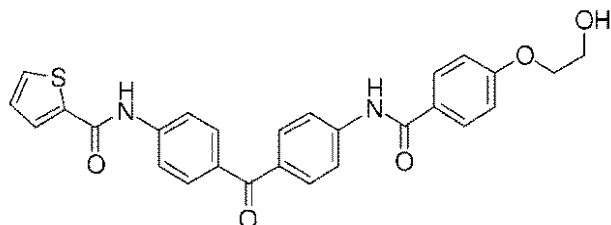
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノンおよび4-モルホリノベンズエートから化合物491を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{30}H_{27}N_3O_4S$ についての計算値：526.14；実測値：526.13。

【0675】

実施例392

N-(4-(4-(2-チエニル)カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)-4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンズアミド(化合物492)

【化528】



30

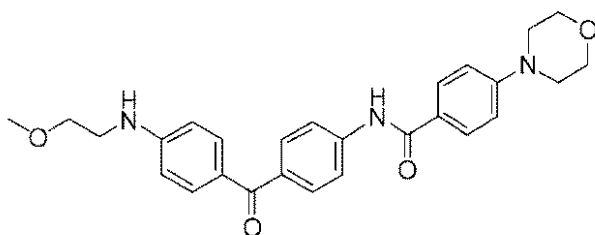
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノンおよび4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンズエートから化合物492を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{27}H_{22}N_2O_5S$ についての計算値：487.06；実測値：487.05。

【0676】

実施例393

N-(4-(4-(2-メトキシエチルアミノ)ベンゾイル)フェニル)-4-モルホリノベンズアミド(化合物493)

【化529】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノンおよび4-モルホリノベンズエートから化合物493を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{27}H_{29}N_3O_4$ についての計算値：460.06；実測値：460.12。

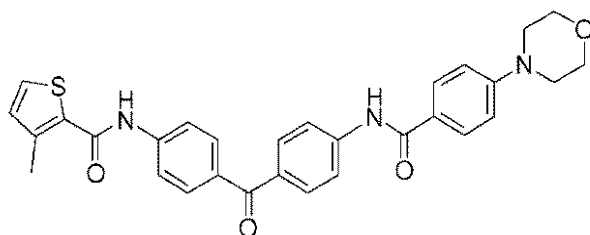
【0677】

50

実施例 394

N-(4-(4-(2-(3-メチルチエニル)カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)-4-モルホリノベンズアミド(化合物 494)

【化 530】



10

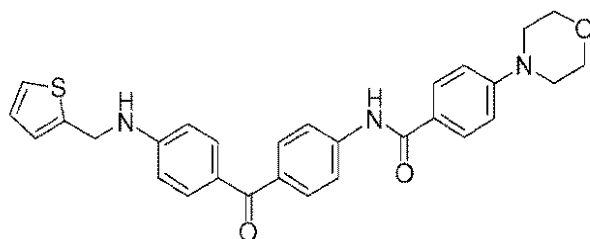
スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンズエートから化合物 494 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₇N₃O₄S についての計算値：526.14；実測値：526.13。

【0678】

実施例 395

4-モルホリノ-N-(4-(4-(チオフェン-2-イルメチルアミノ)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド(化合物 495)

【化 531】



20

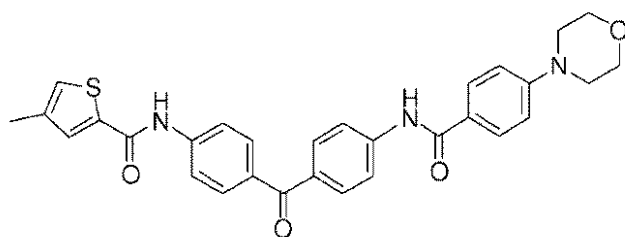
スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンズエートから化合物 495 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₇N₃O₃S についての計算値：498.13；実測値：498.05。

【0679】

実施例 396

N-(4-(4-(2-(4-メチルチエニル)カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)-4-モルホリノベンズアミド(化合物 496)

【化 532】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンズエートから化合物 496 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₇N₃O₄S についての計算値：526.14；実測値：526.06。

【0680】

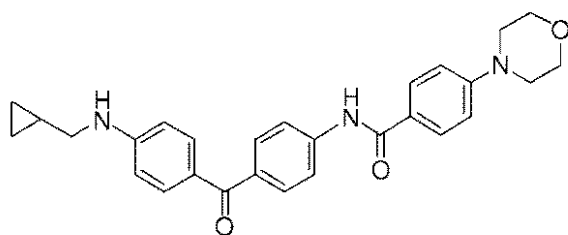
実施例 397

4-モルホリノ-N-(4-(4-(シクロプロピルメチルアミノ)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド(化合物 497)

50

ル) ベンズアミド (化合物 497)

【化 533】



10

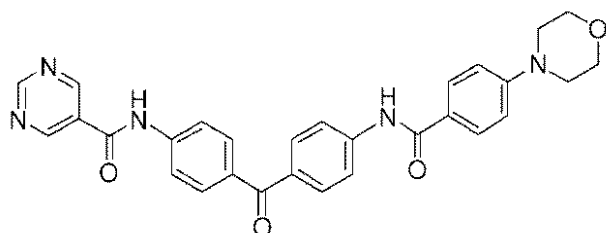
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 497 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₉N₃O₃ についての計算値：456.07；実測値：456.31。

【0681】

実施例 398

N-(4-(4-(4-モルホリノベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)ピリミジン-5-カルボキサミド (化合物 498)

【化 534】



20

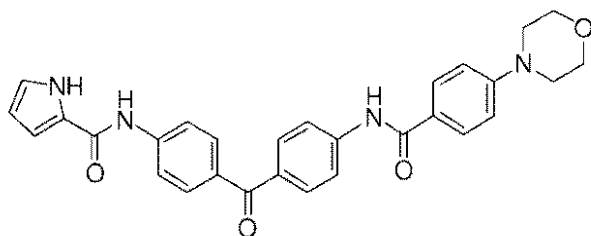
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 498 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₅N₅O₄ についての計算値：508.06；実測値：508.04。

【0682】

実施例 399

N-(4-(4-(4-モルホリノベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1H-ピロロール-2-カルボキサミド (化合物 499)

【化 535】



40

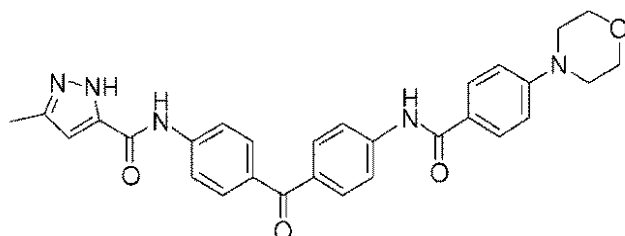
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 499 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₆N₄O₄ についての計算値：495.06；実測値：495.28。

【0683】

実施例 400

3-メチル-N-(4-(4-(4-モルホリノベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (化合物 500)

【化 5 3 6】



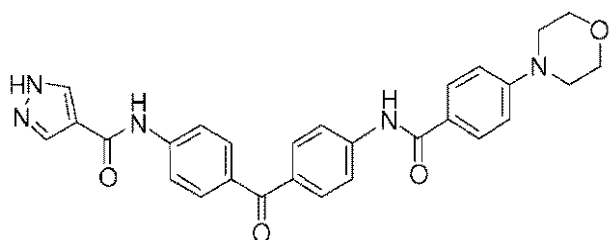
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 500 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₇N₅O₄ についての計算値：510.08；実測値：510.06。

【0684】

実施例 401

N-(4-(4-(4-モルホリノベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド (化合物 501)

【化 5 3 7】



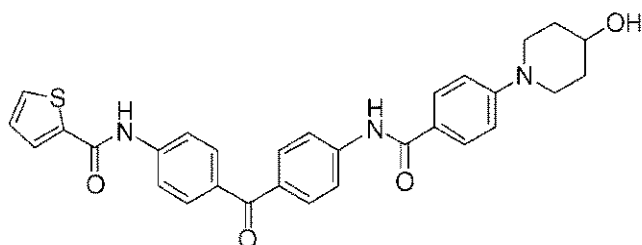
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 501 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₅N₅O₄ についての計算値：496.05；実測値：496.09。

【0685】

実施例 402

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)チオフェン-2-カルボキサミド (化合物 502)

【化 5 3 8】



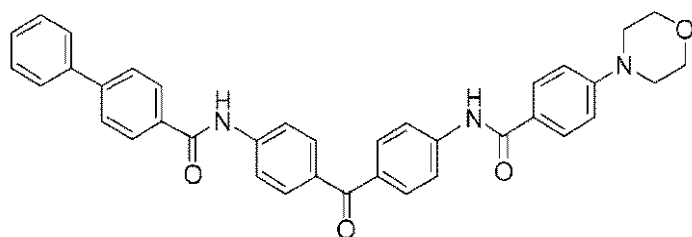
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-(4-ヒドロキシピペリジニル)ベンゾエートから化合物 502 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₇N₃O₄S についての計算値：526.14；実測値：525.99。

【0686】

実施例 403

N-(4-(4-(4-モルホリノベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)ビフェニル-4-カルボキサミド (化合物 503)

【化 5 3 9】



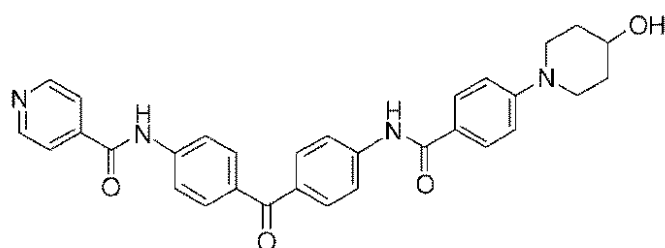
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 503 を調製した。[M+H]⁺ C₃₇H₃₁N₃O₄ についての計算値：582.19；実測値：582.16。

【0687】

実施例 404

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)ピリジン-4-カルボキサミド (化合物 504)

【化 5 4 0】



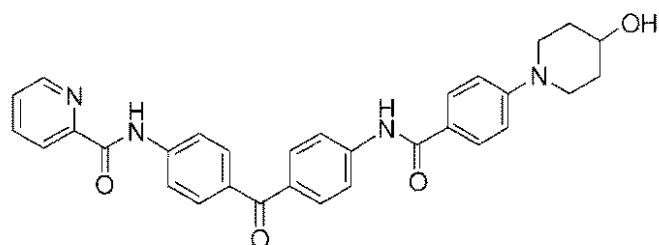
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-(4-ヒドロキシピペリジニル)ベンゾエートから化合物 504 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₈N₄O₄ についての計算値：521.10；実測値：521.06。

【0688】

実施例 405

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)ピリジン-2-カルボキサミド (化合物 505)

【化 5 4 1】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-(4-ヒドロキシピペリジニル)ベンゾエートから化合物 505 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₈N₄O₄ についての計算値：521.10；実測値：521.06。

【0689】

実施例 406

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物

10

20

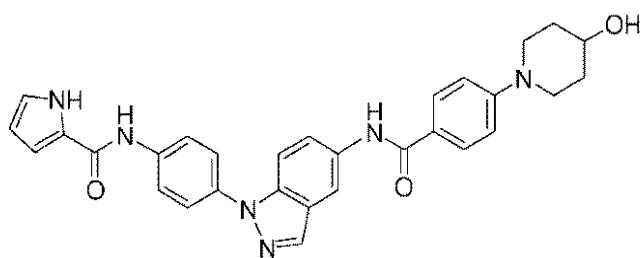
30

40

50

506)

【化542】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンゾエートから化合物506を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₈N₆O₃についての計算値：521.22；実測値：521.06。

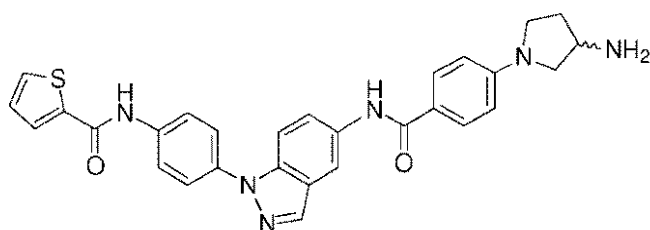
【0690】

実施例407

(±)-N-(4-(5-(4-(3-アミノピロリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チオフェン-2-カルボキサミド(化合物507)

【化543】

20



スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(3-アミノピロリジン-1-イル)ベンゾエートから化合物507を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₇N₆O₂Sについての計算値：523.19；実測値：523.02。

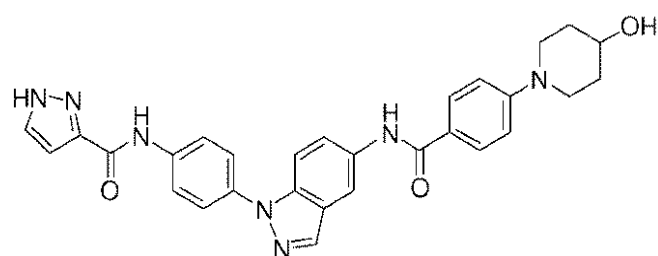
30

【0691】

実施例408

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド(化合物508)

【化544】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンゾエートから化合物508を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₇N₇O₃についての計算値：522.22；実測値：522.05。

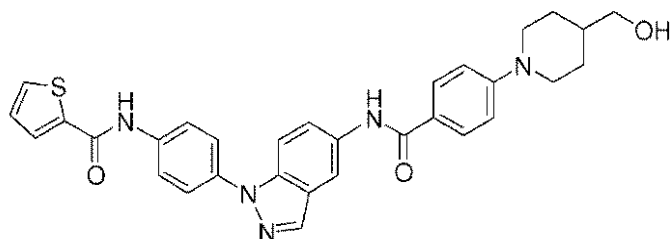
50

【0692】

実施例409

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシメチルピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チオフェン-2-カルボキサミド(化合物509)

【化545】



10

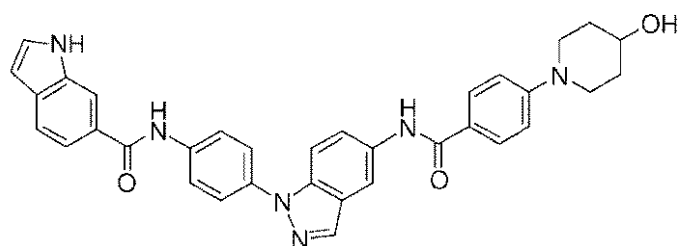
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(4-ヒドロキシメチルピペリジン-1-イル)ベンズエートから化合物509を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₉N₅O₃Sについての計算値：552.20；実測値：552.05。

【0693】

実施例410

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-1H-インドール-6-カルボキサミド(化合物510)

【化546】



30

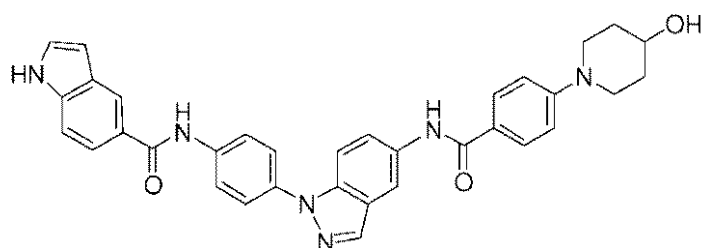
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズエートから化合物510を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₀N₆O₃についての計算値：571.24；実測値：571.16。

【0694】

実施例411

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-1H-インドール-5-カルボキサミド(化合物511)

【化547】



50

20

40

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(4-(2-ヒドロキシエチル)ピペリジン-1-イル)ベンゾエートから化合物 511 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₀N₆O₃ についての計算値：571.24；実測値：571.16。

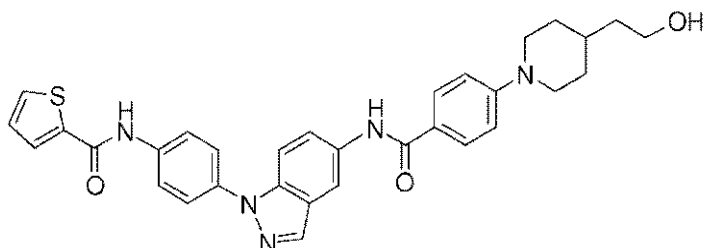
【0695】

実施例 412

N-(4-(5-(4-(4-(2-ヒドロキシエチル)ピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チオフェン-2-カルボキサミド (化合物 512)

【化548】

10



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(4-(2-ヒドロキシエチル)ピペリジン-1-イル)ベンゾエートから化合物 512 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₁N₅O₃S についての計算値：566.21；実測値：566.11。

20

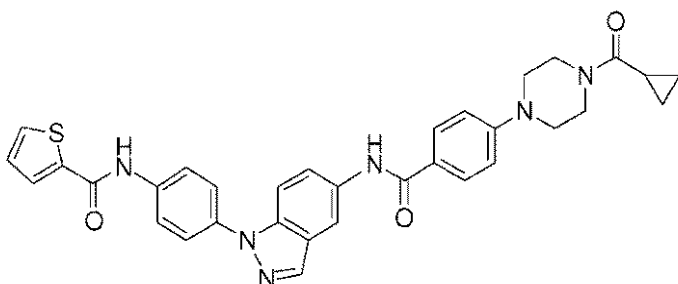
【0696】

実施例 413

N-(4-(5-(4-(4-(シクロプロピルカルボニル)ピペラジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チオフェン-2-カルボキサミド (化合物 513)

【化549】

30



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(4-(シクロプロピルカルボニル)ピペラジン-1-イル)ベンゾエートから化合物 513 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₀N₆O₃S についての計算値：591.21；実測値：591.14。

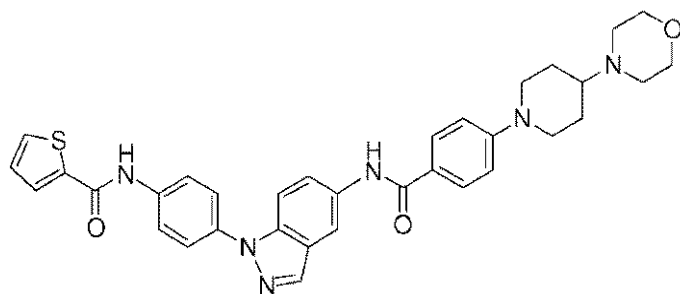
40

【0697】

実施例 414

N-(4-(5-(4-(4-(モルホリノ)ピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チオフェン-2-カルボキサミド (化合物 514)

【化 5 5 0】



10

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(4-モルホリノピペリジン-1-イル)ベンゾエートから化合物 514 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₅N₆O₃S についての計算値：607.25；実測値：607.19。

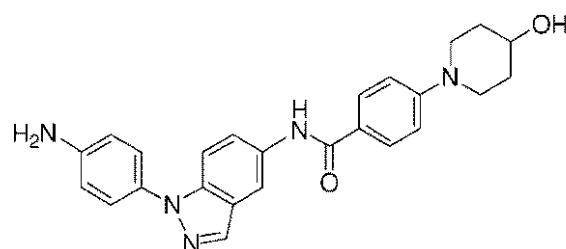
【0698】

実施例 415

N-(1-(4-アミノフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 515)

【化 5 5 1】

20



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンゾエートから化合物 515 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₅N₅O₂ についての計算値：428.20；実測値：427.93。

30

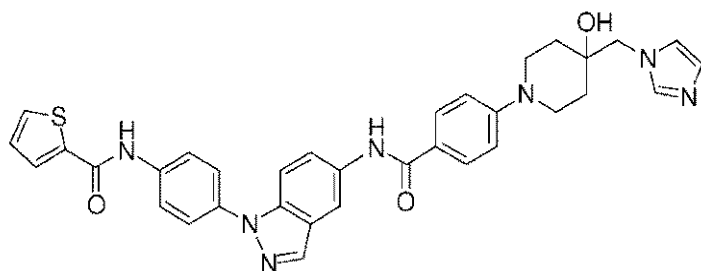
【0699】

実施例 416

N-(4-(5-(4-(4-(1H-イミダゾール-1-イル)メチル)-4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チオフェン-2-カルボキサミド (化合物 516)

【化 5 5 2】

40



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(4-(1H-イミダゾール-1-イル)メチル)-4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンゾエートから化合物 516 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₁N₇O₃S についての計算値：618.22；実測値：618.15。

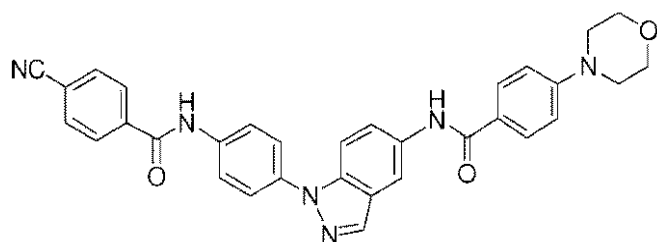
【0700】

50

実施例 4 1 7

4-シアノ-N-(4-(5-(4-モルホリノベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)ベンズアミド(化合物 5 1 7)

【化 5 5 3】



10

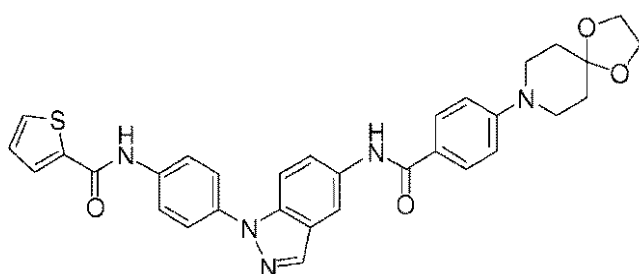
スキーム I Vに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンズエートから化合物 5 1 7を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₂₆N₆O₃についての計算値：543.21；実測値：543.08。

【0701】

実施例 4 1 8

N-(4-(5-(4-(1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4,5]デカナ-8-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チオフェン-2-カルボキサミド(化合物 5 1 8)

【化 5 5 4】



20

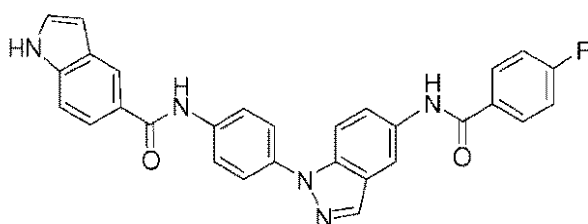
スキーム I Vに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4,5]デカナ-8-イル)ベンズエートから化合物 5 1 8を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₂₉N₅O₄Sについての計算値：580.19；実測値：580.07。

【0702】

実施例 4 1 9

N-(4-(5-(4-フルオロベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-1H-インドール-5-カルボキサミド(化合物 5 1 9)

【化 5 5 5】



30

40

スキーム I Vに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-フルオロベンズエートから化合物 5 1 9を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₀FN₅O₂についての計算値：490.16；実測値：490.01。

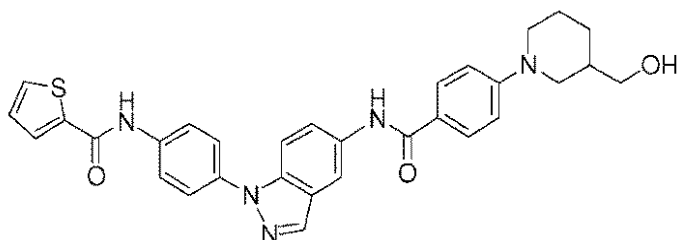
【0703】

50

実施例 4 2 0

(±)-N-(4-(5-(4-(3-ヒドロキシメチル)ピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チオフェン-2-カルボキサミド (化合物 5 2 0)

【化 5 5 6】



10

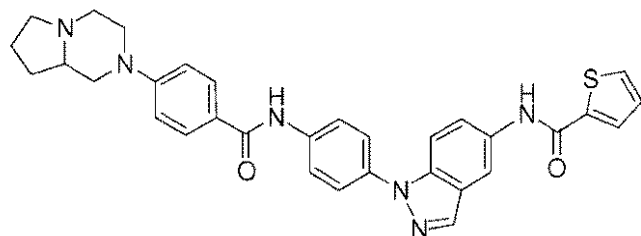
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(3-ヒドロキシメチル)ピペリジン-1-イル)ベンズエートから化合物 5 2 0 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₉N₅O₃S についての計算値：552.20；実測値：552.07。

【0704】

実施例 4 2 1

(±)-N-(1-(4-(4-(ヘキサヒドロピロロ[1,2-a]ピラジン-2(1H)-イル)ベンズアミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)チオフェン-2-カルボキサミド (化合物 5 2 1)

【化 5 5 7】



30

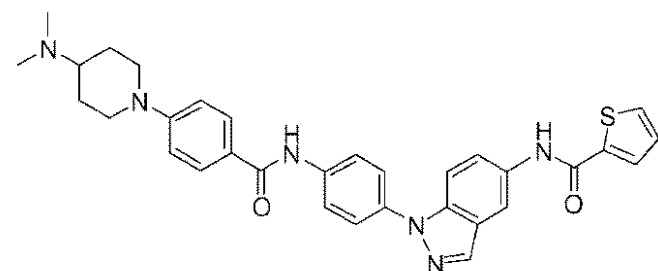
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(ヘキサヒドロピロロ[1,2-a]ピラジン-2(1H)-イル)ベンズエートから化合物 5 2 1 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₀N₆O₂S についての計算値：563.22；実測値：563.12。

【0705】

実施例 4 2 2

N-(1-(4-(4-(4-ジメチルアミノピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)チオフェン-2-カルボキサミド (化合物 5 2 2)

【化 5 5 8】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)

50

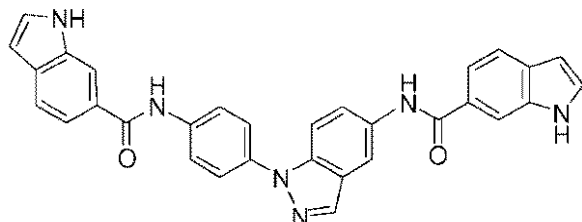
インダゾールおよび 4-(4-ジメチルアミノピペリジン-1-イル)ベンゾエートから化合物 522 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₂N₆O₂S についての計算値：565.23；実測値：565.14。

【0706】

実施例 423

N-(4-(5-(1H-インドール-6-カルボキサミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-1H-インドール-6-カルボキサミド (化合物 523)

【化 559】



10

スキーム IV に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび 1H-インドール-6-カルボン酸から化合物 523 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₂N₆O₂ についての計算値：511.18；実測値：511.02。

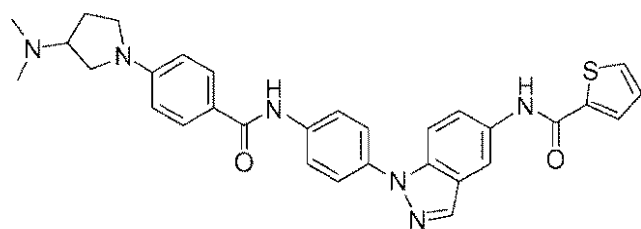
20

【0707】

実施例 424

(±)-N-(1-(4-(4-(3-ジメチルアミノピロリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)チオフェン-2-カルボキサミド (化合物 524)

【化 560】



30

スキーム IV に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび 4-(3-ジメチルアミノピロリジン-1-イル)ベンゾエートから化合物 524 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀N₆O₂S についての計算値：551.22；実測値：551.10。

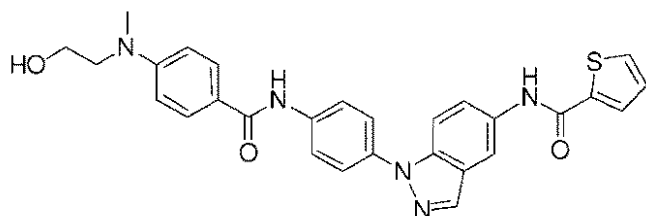
【0708】

実施例 425

(±)-N-(1-(4-(4-((2-ヒドロキシエチル)メチルアミノ)ベンズアミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)チオフェン-2-カルボキサミド (化合物 525)

40

【化 5 6 1】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-((2-ヒドロキシエチル) メチルアミノ) ベンゾエートから化合物 5 2 5 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₅N₅O₃S についての計算値：512.17；実測値：512.02。

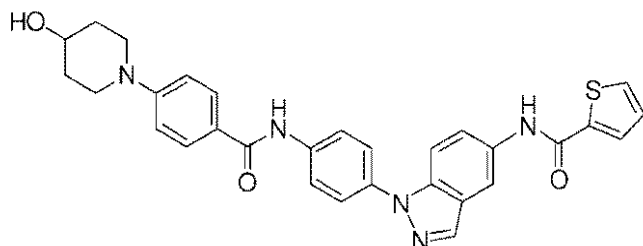
10

【0709】

実施例 4 2 6

N-(1-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) ベンズアミド) フェニル)-1H-インダゾール-5-イル) チオフェン-2-カルボキサミド (化合物 5 2 6)

【化 5 6 2】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) ベンゾエートから化合物 5 2 6 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₇N₅O₃S についての計算値：538.18；実測値：538.06。

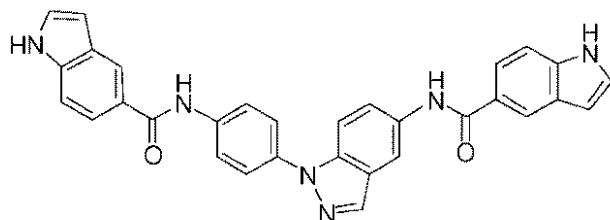
30

【0710】

実施例 4 2 7

N-(4-(5-(1H-インドール-5-カルボキサミド)-1H-インダゾール-1-イル) フェニル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 5 2 7)

【化 5 6 3】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび1H-インドール-5-カルボン酸から化合物 5 2 7 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₂N₆O₂ についての計算値：511.18；実測値：511.03。

【0711】

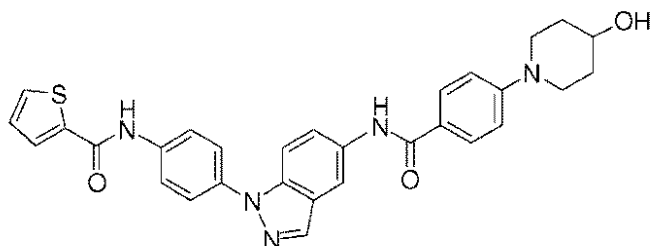
実施例 4 2 8

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) ベンズアミド)-1H

50

ーインダゾールー1-イル)フェニル)チオフエン-2-カルボキサミド(化合物528)

【化564】



10

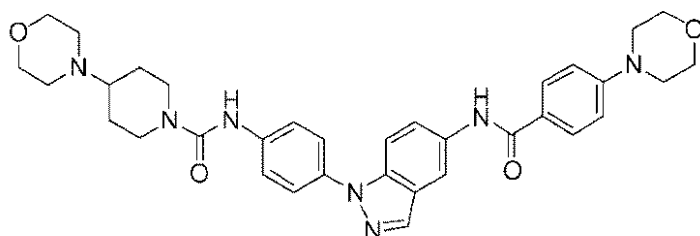
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンゾエートから化合物528を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₇N₅O₃Sについての計算値: 538.18; 実測値: 538.06。

【0712】

実施例429

4-モルホリノ-N-(4-(5-(4-モルホリノベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)ピペリジン-1-カルボキサミド(化合物529)

【化565】



20

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物529を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₉N₇O₄についての計算値: 610.31; 実測値: 610.25。

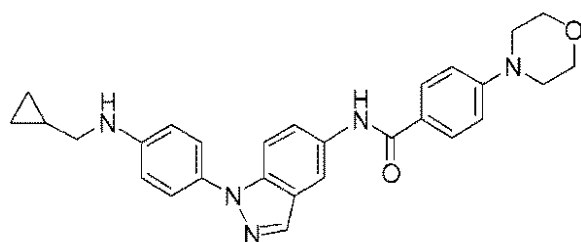
30

【0713】

実施例430

N-(1-(4-シクロプロピルメチルアミノ)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-モルホリノベンズアミド(化合物530)

【化566】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物530を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₉N₅O₂についての計算値: 468.23; 実測値: 468.08。

【0714】

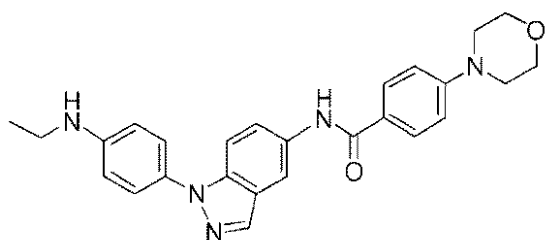
実施例431

N-(1-(4-エチルアミノ)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-モ

50

ルホリノベンズアミド（化合物 531）

【化 567】



10

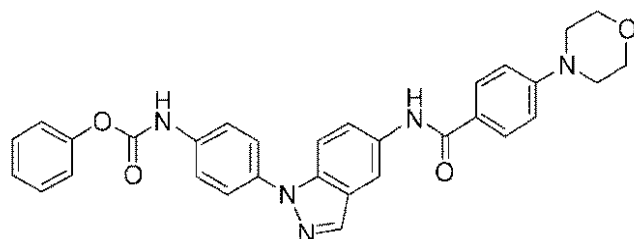
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンズエートから化合物 531 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₇N₅O₂ についての計算値：442.22；実測値：442.05。

【0715】

実施例 432

フェニル 4-(5-(4-モルホリノベンズアミド)-1H-インダゾール-5-イル)フェニルカルバメート（化合物 532）

【化 568】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンズエートから化合物 532 を調製した。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 10.49 (s, 1H)、9.97 (s, 1H)、8.97 (s, 1H)、8.03 (d, J=7.5 Hz, 2H)、7.91 (d, J=8 Hz, 2H)、7.68 (m, 3H)、7.56 (d, J=9 Hz, 1H)、7.44 (t, J=7.5 Hz, 2H)、7.26 (m, 3H)、7.03 (d, J=7.5 Hz, 2H)、3.74 (m, 4H)。

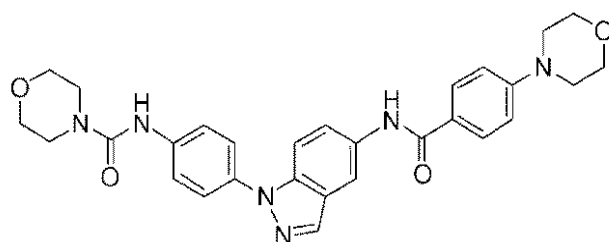
30

【0716】

実施例 433

N-(4-(5-(4-モルホリノベンズアミド)-1H-インダゾール-5-イル)フェニル)モルホリン-4-カルボキサミド（化合物 533）

【化 569】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンズエートから化合物 533 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₀N₆O₄ についての計算値：527.23；実測値：527.00。

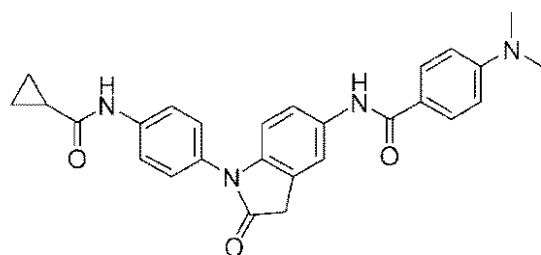
【0717】

50

実施例 4 3 4

N-（1-（4-シクロプロパンカルボキサミド）フェニル）-2-オキシインドリン-5-イル）4-ジメチルアミノベンズアミド（化合物 5 3 4）

【化 5 7 0】



10

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-（4-アミノフェニル）オキシインドールおよび4-ジメチルアミノベンズエートから化合物 5 3 4 を調製した。

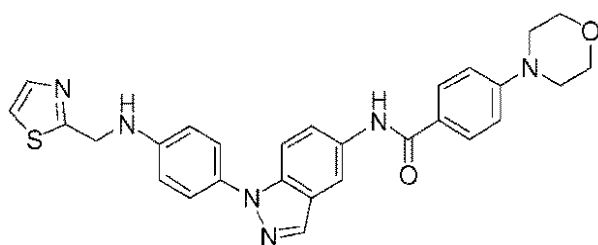
$[M+H]^+$ $C_{27}H_{26}N_4O_3$ についての計算値：455.20；実測値：455.00。

【0 7 1 8】

実施例 4 3 5

4-モルホリノ-N-（1-（4-（チアゾール-2-イルメチルアミノ）フェニル）-1H-インダゾール-5-イル）ベンズアミド（化合物 5 3 5）

【化 5 7 1】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-（4-アミノフェニル）インダゾールおよび4-モルホリノベンズエートから化合物 5 3 5 を調製した。 ^1H NMR（500 MHz、 $CDCl_3$ ） δ 8.17（s，1H）、8.12（s，1H）、7.85（m，3H）、7.78（m，1H）、7.59（d， $J=9$ Hz、1H）、7.49（d， $J=8$ Hz、1H）、7.30（m，1H）、6.95（d， $J=8$ Hz、2H）、6.82（d， $J=8.5$ Hz、2H）、4.76（s，2H）、3.89（t， $J=4$ Hz、4H）、3.29（t， $J=4.5$ Hz、4H）。

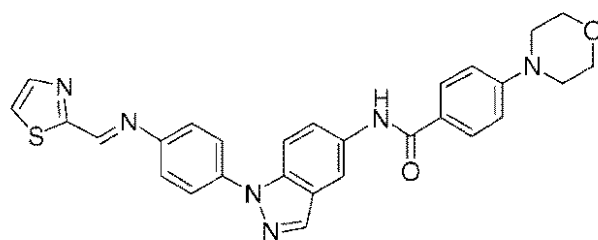
30

【0 7 1 9】

実施例 4 3 6

4-モルホリノ-N-（1-（4-（チアゾール-2-イルメチリデンアミノ）フェニル）-1H-インダゾール-5-イル）ベンズアミド（化合物 5 3 6）

【化 5 7 2】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-（4-アミノフェニル）

50

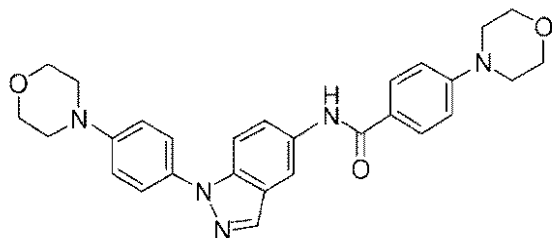
インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物536を調製した。データなし。

【0720】

実施例437

4-モルホリノ-N-(1-(4-モルホリノフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物537)

【化573】



10

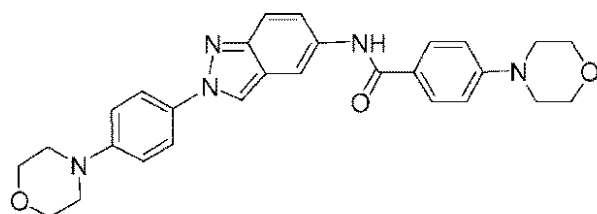
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物537を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₉N₅O₃についての計算値：484.23；実測値：484.11。

【0721】

実施例438

4-モルホリノ-N-(2-(4-モルホリノフェニル)-2H-インダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物538)

【化574】



20

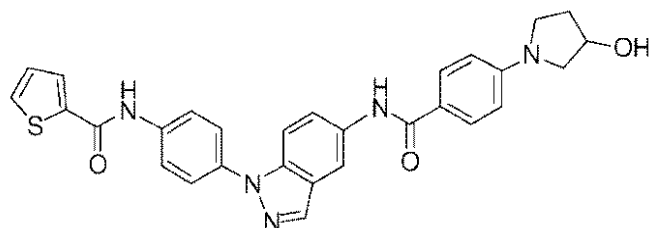
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-2-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物538を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₉N₅O₃についての計算値：484.23；実測値：484.13。

【0722】

実施例439

(±)-N-(4-(5-(4-(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チオフェン-2-カルボキサミド(化合物539)

【化575】



30

40

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(3-ヒドロキシピロリジニル)ベンゾエートから化合物539を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₅N₅O₃Sについての計算値：524.17；実測値：524.04。

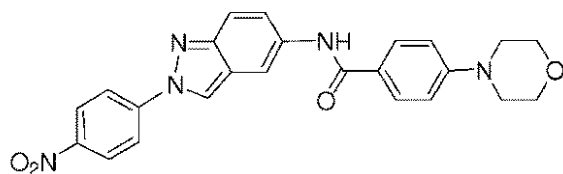
50

【0723】

実施例440

4-モルホリノ-N-(2-(4-ニトロフェニル)-2H-インダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物540)

【化576】



10

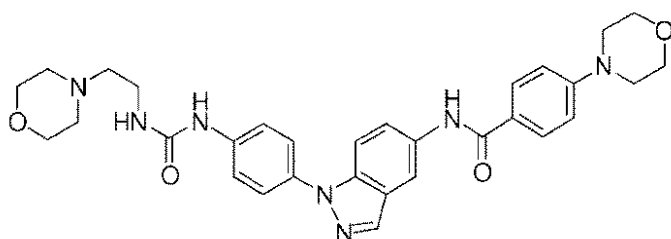
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-2-(4-ニトロフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物540を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₁N₅O₄についての計算値：444.16；実測値：444.27。

【0724】

実施例441

4-モルホリノ-N-(1-(4-(3-(2-モルホリノエチル)ウレイド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)フェニル)ベンズアミド(化合物541)

【化577】



20

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物541を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₅N₇O₄についての計算値：570.28；実測値：570.21。

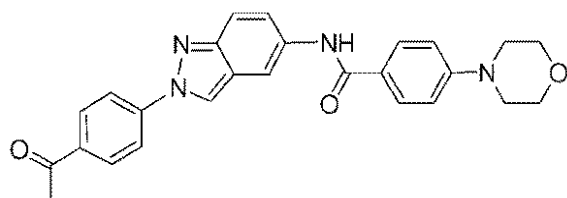
30

【0725】

実施例442

4-モルホリノ-N-(2-(4-アセチルフェニル)-2H-インダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物542)

【化578】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-2-(4-アセチルフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物542を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₄N₄O₃についての計算値：441.18；実測値：441.02。

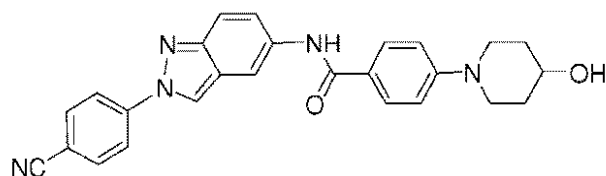
【0726】

実施例443

N-(2-(4-シアノフェニル)-2H-インダゾール-5-イル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド(化合物543)

50

【化 5 7 9】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-2-(4-アセチルフェニル)インダゾールおよび4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンゾエートから化合物 543 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₃N₅O₂ についての計算値：438.19；実測値：438.05。

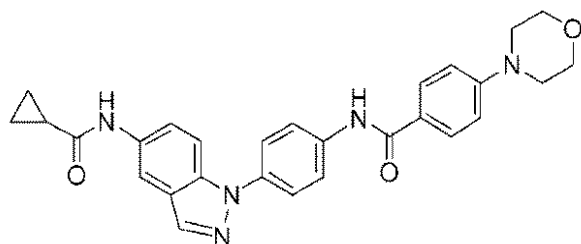
10

【0727】

実施例 444

N-(4-(5-(シクロプロパンカルボキサミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-4-モルホリノベンズアミド (化合物 544)

【化 580】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物 544 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₇N₅O₃ についての計算値：482.21；実測値：482.05。

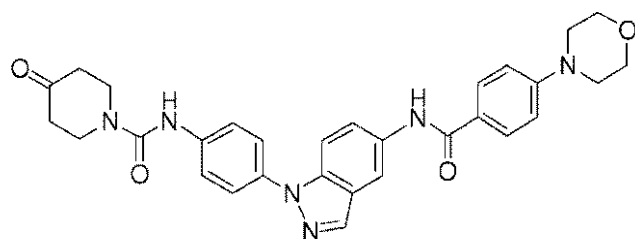
【0728】

実施例 445

N-(4-(5-(4-モルホリノベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-4-オキソピペリジン-1-カルボキサミド (化合物 545)

30

【化 581】



40

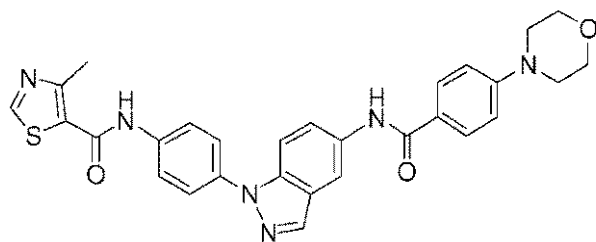
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物 545 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₀N₆O₄ についての計算値：539.23；実測値：539.12。

【0729】

実施例 446

4-メチル-N-(4-(5-(4-モルホリノベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チアゾール-5-カルボキサミド (化合物 546)

【化 5 8 2】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物 5 4 6 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₆N₆O₃S についての計算値：539.19；実測値：539.09。

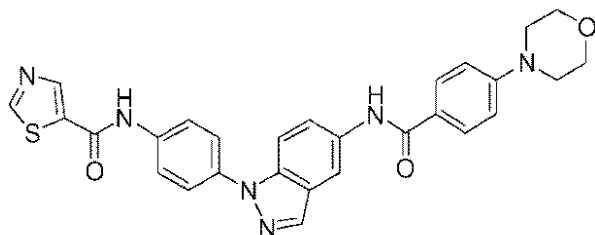
10

【0730】

実施例 4 4 7

N-(4-(5-(4-モルホリノベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チアゾール-5-カルボキサミド (化合物 5 4 7)

【化 5 8 3】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物 5 4 7 を調製した。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 10.66 (s, 1H)、10.12 (s, 1H)、9.34 (s, 1H)、8.75 (s, 1H)、8.40 (s, 1H)、8.36 (s, 1H)、7.94 (dd, J=3, 9 Hz, 4H)、7.87 (d, J=9 Hz, 1H)、7.81 (m, 3H)、7.05 (d, J=9 Hz, 2H)、3.76 (m, 4H)。

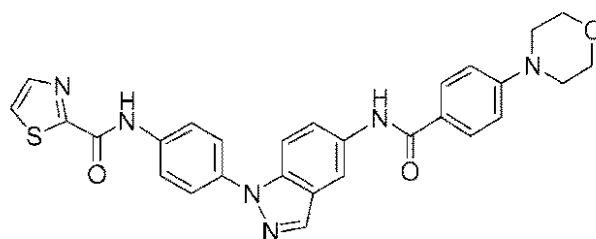
30

【0731】

実施例 4 4 8

N-(4-(5-(4-モルホリノベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チアゾール-2-カルボキサミド (化合物 5 4 8)

【化 5 8 4】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンゾエートから化合物 5 4 8 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₄N₆O₃S についての計算値：525.16；実測値：525.04。

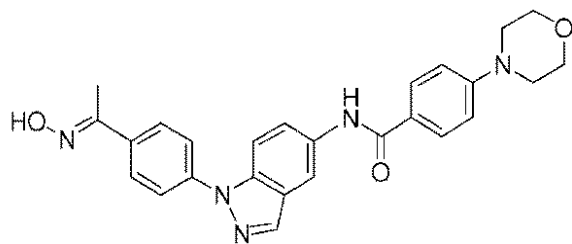
50

【0732】

実施例449

N-(1-(4-(1-(ヒドロキシイミノ)エチル)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)モルホリノベンズアミド(化合物549)

【化585】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アセチルフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンズエートから化合物549を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₅N₅O₃についての計算値：456.20；実測値：456.07。

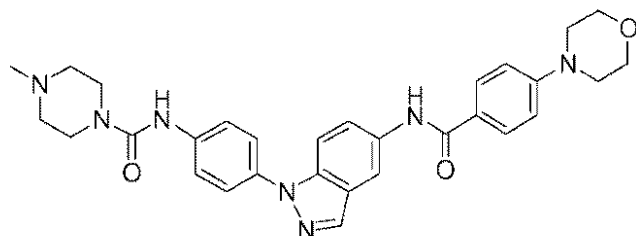
【0733】

実施例450

4-メチル-N-(4-(5-(4-モルホリノベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)ピペラジーン-1-カルボキサミド(化合物550)

20

【化586】



30

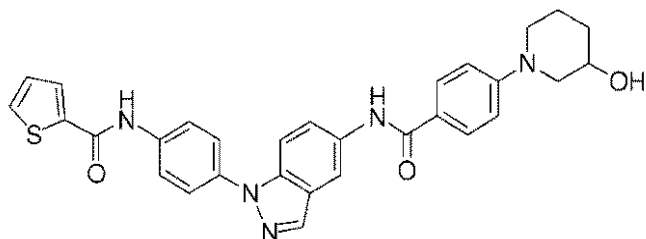
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-モルホリノベンズエートから化合物550を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₃N₇O₃についての計算値：540.26；実測値：540.15。

【0734】

実施例451

(±)-N-(4-(5-(4-(3-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チオフェン-2-カルボキサミド(化合物551)

【化587】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(3-ヒドロキシピペリジニル)ベンズエートから化合物551を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₇N₅O₃Sについての計算値：538.18；

50

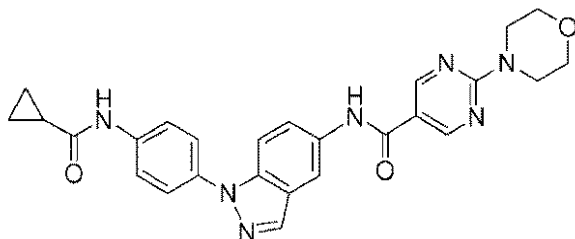
実測値：538.06。

【0735】

実施例452

N-(1-(4-シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-2-モルホリノピリミジン-5-カルボキサミド (化合物552)

【化588】



10

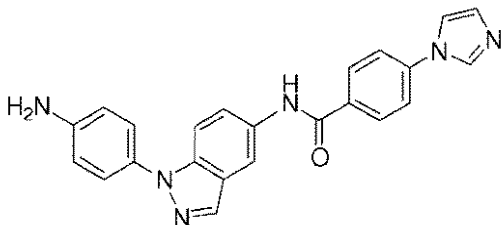
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび2-モルホリノ-5-ピリミジナルボキシレートから化合物552を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₅N₇O₃ についての計算値：484.20；実測値：484.01。

【0736】

実施例453

N-(1-(4-アミノフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(1H-イミダゾール-1-イル)ベンズアミド (化合物553)

【化589】



30

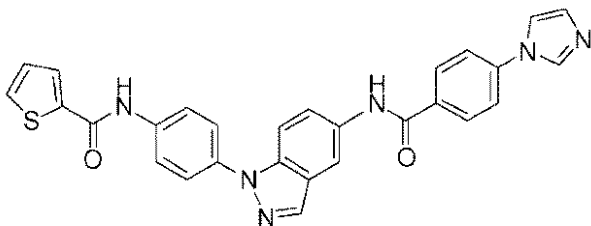
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-イミダゾリルベンゾエートから化合物553を調製した。¹H NMR (500MHz、アセトン-d₆) δ 9.78 (s, 1H)、8.45 (s, 1H)、8.20 (m, 4H)、7.82~7.67 (m, 5H)、7.42 (d, J=8.5Hz、2H)、7.16 (s, 1H)、6.87 (d, J=8.5Hz、2H)、4.93 (s, 2H)。

【0737】

実施例454

N-(4-(5-(4-(1H-イミダゾール-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チオフェン-2-カルボキサミド (化合物554)

【化590】



スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-イミダゾリルベンゾエートから化合物554を調製した。[M+

50

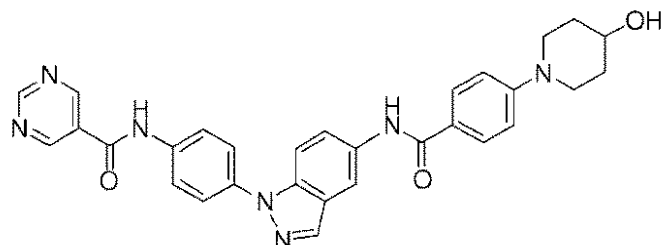
H] $^{+}$ C₂₈H₂₀N₆O₂S についての計算値：505.15；実測値：505.00。

【0738】

実施例455

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)ピリミジン-5-カルボキサミド(化合物555)

【化591】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズエートから化合物555を調製した。[M+H] $^{+}$ C₃₀H₂₇N₇O₃ についての計算値：534.22；実測値：534.09。

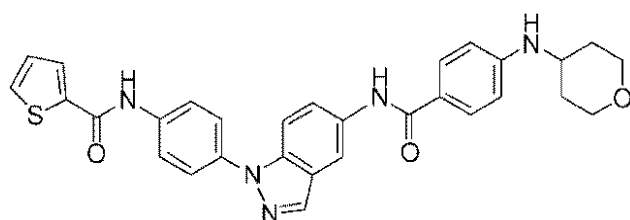
20

【0739】

実施例456

N-(4-(5-(4-(テトラヒドロピラン-4-イル)アミノ)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チオフェン-2-カルボキサミド(化合物556)

【化592】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(テトラヒドロピラン-4-イル)アミノベンズエートから化合物556を調製した。[M+H] $^{+}$ C₃₀H₂₈N₅O₃S についての計算値：538.19；実測値：538.08。

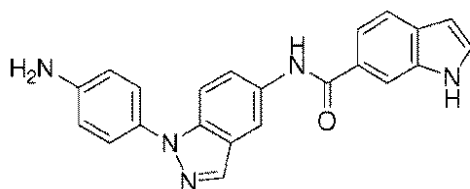
【0740】

実施例457

N-(1-(4-アミノフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-1H-インドール-6-カルボキサミド(化合物557)

40

【化593】



スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)

50

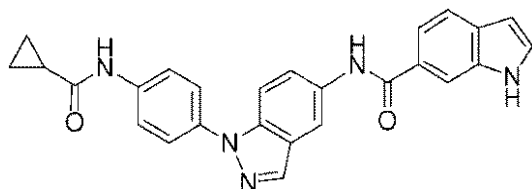
インダゾールおよびインドール-6-カルボン酸から化合物 557 を調製した。[M+H]⁺ C₂₂H₁₇N₅O についての計算値：368.14；実測値：367.90。

【0741】

実施例 458

N-(1-(4-(シクロプロピルカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-1H-インドール-6-カルボキサミド (化合物 558)

【化594】



10

スキーム IV に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよびインドール-6-カルボン酸から化合物 558 を調製した。¹H NMR (500 MHz、アセトン-d₆) δ 10.64 (s, 1H)、9.65 (m, 2H)、8.79 (s, 1H)、8.54 (m, 1H)、8.21 (m, 2H)、7.91~7.67 (m, 8H)、7.54 (m, 1H)、6.58 (m, 1H)、1.82 (m, 1H)、0.94 (m, 2H)、0.82 (m, 2H)。

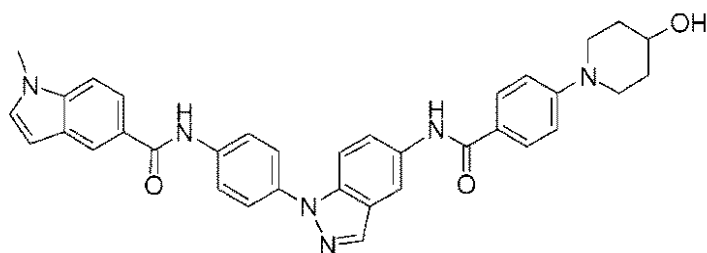
20

【0742】

実施例 459

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-1-メチル-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 559)

【化595】



30

スキーム IV に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズエートから化合物 559 を調製した。[M+H]⁺ C₃₅H₃₂N₆O₃ についての計算値：585.25；実測値：585.19。

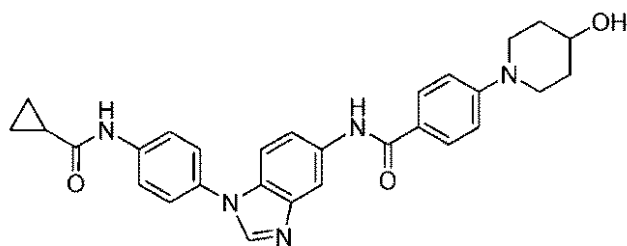
【0743】

実施例 460

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)フェニル)シクロプロピルカルボキサミド (化合物 560)

40

【化 5 9 6】



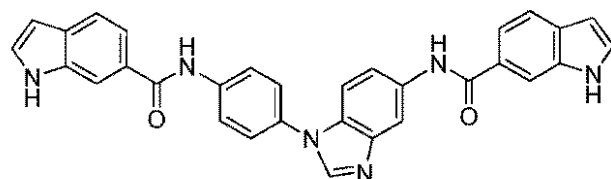
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)ベンズイミダゾールおよび4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンゾエートから化合物 560 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₉N₅O₃ についての計算値：496.24；実測値：496.08。

【0744】

実施例 461

N-(4-(5-(1H-インドール-6-カルボキサミド)-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)フェニル)-1H-インドール-6-カルボキサミド (化合物 561)

【化 5 9 7】



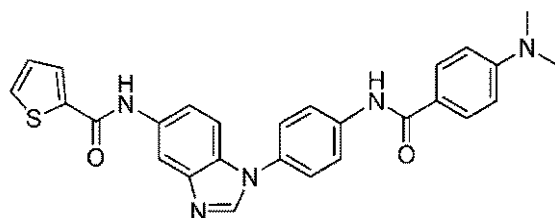
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)ベンズイミダゾールおよびインドール-6-カルボン酸から化合物 561 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₂N₆O₂ についての計算値：511.19；実測値：511.01。

【0745】

実施例 462

N-(1-(4-(4-ジメチルアミノベンズアミド)フェニル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)チオフェン-2-カルボキサミド (化合物 562)

【化 5 9 8】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)ベンズイミダゾールおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 562 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₃N₅O₂S についての計算値：482.16；実測値：481.98。

【0746】

実施例 463

N-(4-(5-(4-モルホリノベンズアミド)-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)フェニル)シクロプロピルカルボキサミド (化合物 563)

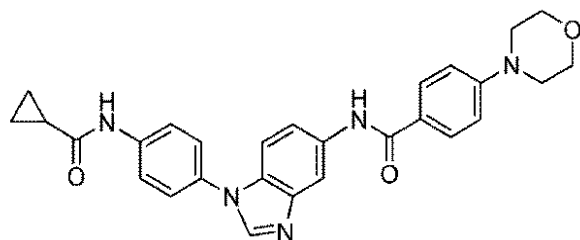
10

20

30

40

【化 5 9 9】



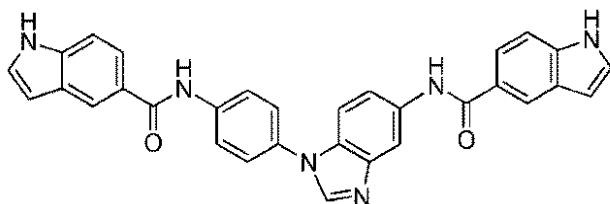
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)ベンズイミダゾールおよび4-ホルホルノベンゾエートから化合物 5 6 3 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₇N₅O₃ についての計算値：482.22；実測値：482.05。

【0747】

実施例 4 6 4

N-(4-(5-(1H-インドール-5-カルボキサミド)-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)フェニル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 5 6 4)

【化 6 0 0】



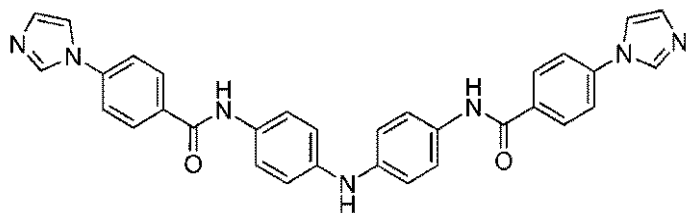
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)ベンズイミダゾールおよびインドール-5-カルボン酸から化合物 5 6 4 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₂N₆O₂ についての計算値：511.19；実測値：511.07。

【0748】

実施例 4 6 5

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(1H-イミダゾール-1-イル)ベンズアミド) (化合物 5 6 5)

【化 6 0 1】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび4-(イミダゾール-1-イル)ベンゾエートから化合物 5 6 5 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₂₅N₇O₂ についての計算値：540.21；実測値 539.97。

【0749】

実施例 4 6 6

N, N'-(4, 4'-オキサビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(1H-イミダゾール-1-イル)ベンズアミド) (化合物 5 6 6)

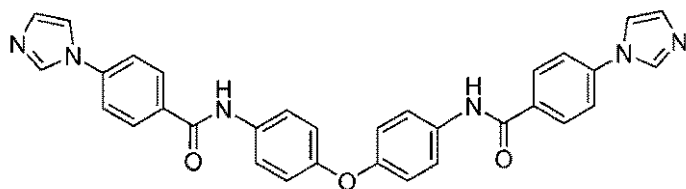
10

20

30

40

【化 6 0 2】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-オキサビスフェニルアミンおよび 4-(イミダゾール-1-イル)ベンゾエートから化合物 566 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₂₄N₆O₃ についての計算値：541.20；実測値 541.05。

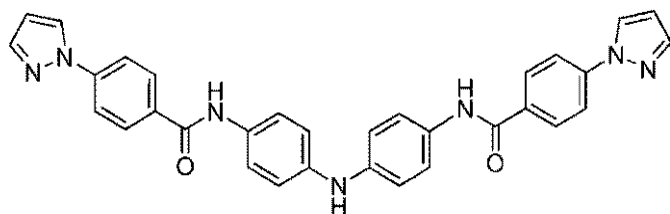
10

【0750】

実施例 467

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(1H-ピラゾール-1-イル)ベンズアミド) (化合物 567)

【化 6 0 3】



20

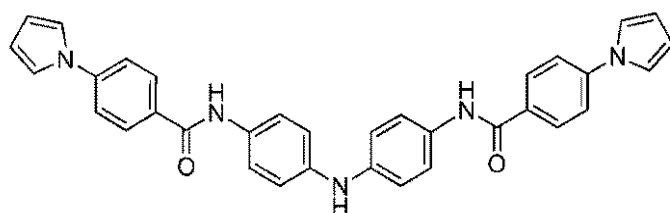
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-(ピラゾール-1-イル)ベンゾエートから化合物 567 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₂₅N₇O₂ についての計算値：540.21；実測値 539.97。

【0751】

実施例 468

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(1H-ピロール-1-イル)ベンズアミド) (化合物 568)

【化 6 0 4】



30

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-(ピロール-1-イル)ベンゾエートから化合物 568 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₂₇N₅O₂ についての計算値：538.22；実測値 538.09。

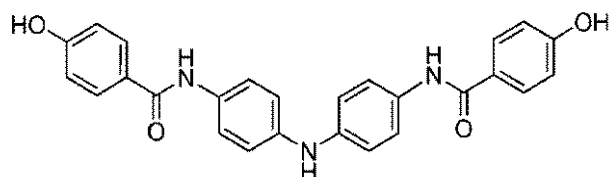
40

【0752】

実施例 469

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-ヒドロキシベンズアミド) (化合物 569)

【化 6 0 5】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-ヒドロキシベンゾエートから化合物 569 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₁N₃O₄ についての計算値：440.15；実測値 439.94。

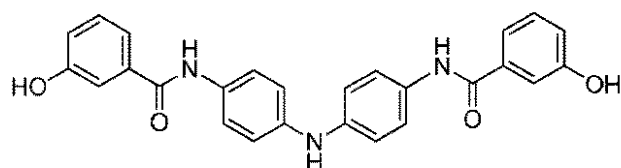
10

【0753】

実施例 470

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(3-ヒドロキシベンズアミド) (化合物 569)

【化 6 0 6】



20

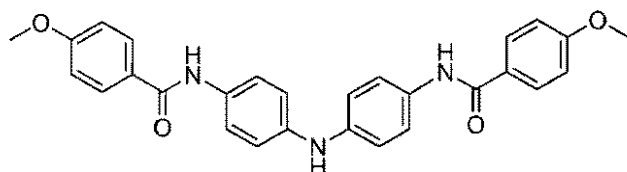
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 3-ヒドロキシベンゾエートから化合物 570 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₁N₃O₄ についての計算値：440.15；実測値 493.94。

【0754】

実施例 471

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-メトキシベンズアミド) (化合物 571)

【化 6 0 7】



30

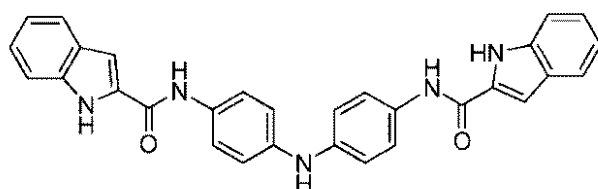
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-メトキシベンゾエートから化合物 571 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₅N₃O₄ についての計算値：468.18；実測値 468.01。

【0755】

実施例 472

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(1H-インドール-2-カルボキサミド) (化合物 572)

【化 6 0 8】



50

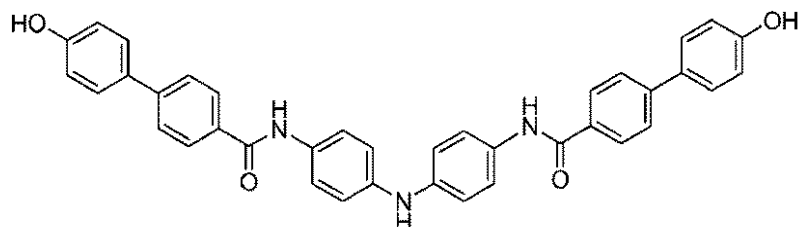
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよびインドール-2-カルボン酸から化合物 572 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₃N₅O₂ についての計算値：486.19；実測値 486.10。

【0756】

実施例 473

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(4-ヒドロキシフェニル)ベンズアミド) (化合物 573)

【化609】



10

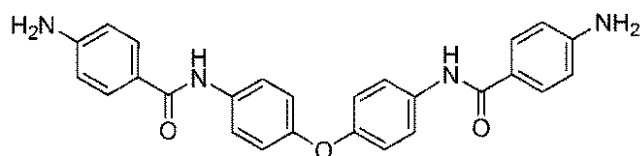
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび4-(4-ヒドロキシフェニル)ベンズエートから化合物 573 を調製した。[M+H]⁺ C₃₈H₂₉N₃O₄ についての計算値：592.22；実測値 592.12。

【0757】

実施例 474

N, N'-(4, 4'-オキサビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-アミノベンズアミド) (化合物 574)

【化610】



30

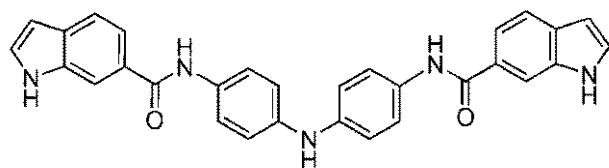
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-オキサビスフェニルアミンおよび4-アミノベンズエートから化合物 574 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₂N₄O₃ についての計算値：439.17；実測値 439.00。

【0758】

実施例 475

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(1H-インドール-6-カルボキサミド) (化合物 575)

【化611】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよびインドール-6-カルボン酸から化合物 575 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₃N₅O₂ についての計算値：486.19；実測値 486.03。

【0759】

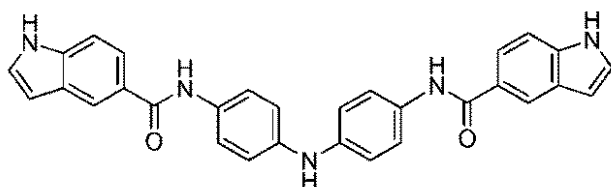
実施例 476

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(1H-インド

50

ールー5-カルボキサミド) (化合物576)

【化612】



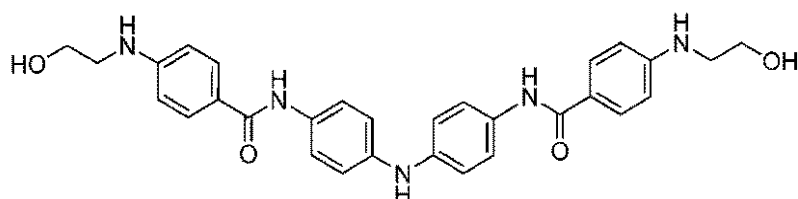
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミンおよびインドール-5-カルボン酸から化合物576を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₃N₅O₂ 10
についての計算値: 486.19; 実測値 486.03。

【0760】

実施例477

N,N'-(4,4'-アザンジイルビス(4,1-フェニレン))ビス(4-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ベンズアミド) (化合物577)

【化613】



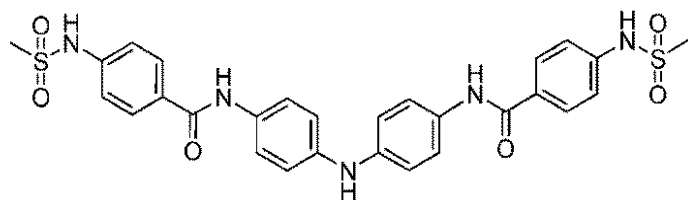
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミンおよび4-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ベンゾエートから化合物577を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₂N₅O₄ 20
についての計算値: 526.25; 実測値: 526.08。

【0761】

実施例478

N,N'-(4,4'-アザンジイルビス(4,1-フェニレン))ビス(4-メタンスルホンアミドベンズアミド) (化合物578) 30

【化614】



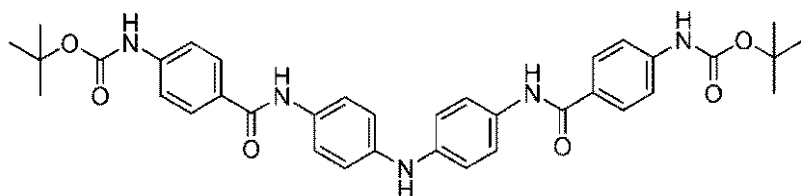
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミンおよび4-メタンスルホンアミドベンゾエートから化合物578を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₇N₅O₆S₂ 40
についての計算値: 594.14; 実測値 594.00。

【0762】

実施例479

N,N'-(4,4'-アザンジイルビス(4,1-フェニレン))ビス(4-tert-ブチルオキシカルボキサミドベンズアミド) (化合物579)

【化 6 1 5】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-tert-ブチルオキシカルボキサミドベンゾエートから化合物 579 を調製した。[M+H]⁺ C₃₆H₃₉N₅O₆ についての計算値: 638.29; 実測値 638.20。

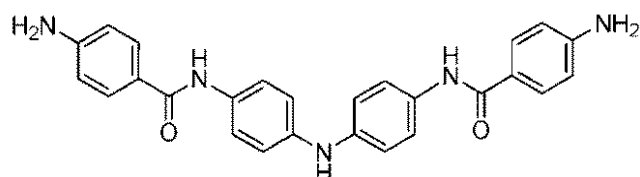
10

【0763】

実施例 480

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-アミノベンズアミド) (化合物 580)

【化 6 1 6】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-アミノベンゾエートから化合物 580 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₃N₅O₂ についての計算値: 438.19; 実測値 438.05。

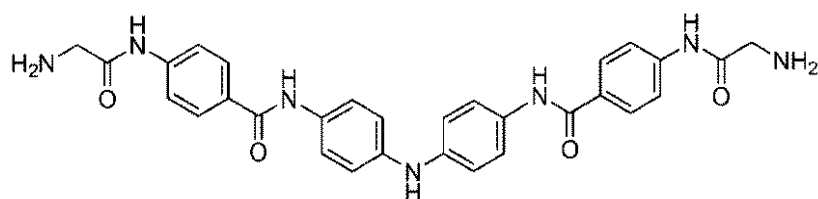
【0764】

実施例 481

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(2-アミノアセトアミド)ベンズアミド) (化合物 581)

30

【化 6 1 7】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-(2-アミノアセトアミド)ベンゾエートから化合物 581 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₉N₇O₄ についての計算値: 552.23; 実測値 552.12。

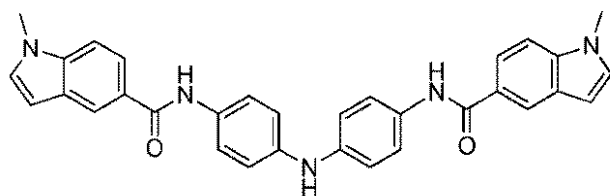
40

【0765】

実施例 482

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(1-メチル-1H-インドール-5-カルボキサミド) (化合物 582)

【化 6 1 8】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 1-メチルインドール-5-カルボン酸から化合物 582 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₂₇N₅O₂ についての計算値：514.22；実測値 514.11。

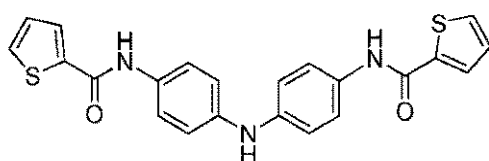
10

【0766】

実施例 483

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(チオフェン-2-カルボキサミド) (化合物 583)

【化 6 1 9】



20

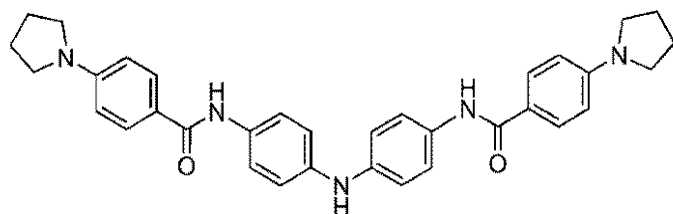
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよびチオフェン-2-カルボン酸から化合物 583 を調製した。[M+H]⁺ C₂₂H₁₇N₃O₂S₂ についての計算値：420.08；実測値 419.91。

【0767】

実施例 484

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-ピロリジンベンゾアミド) (化合物 584)

【化 6 2 0】



30

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-ピロリジンベンゾエートから化合物 584 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₅N₅O₂ についての計算値：546.28；実測値 546.07。

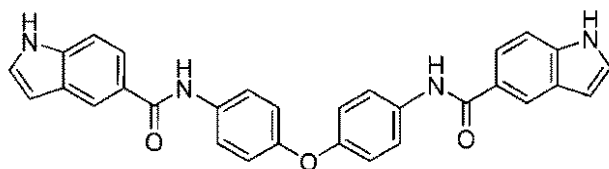
40

【0768】

実施例 485

N, N'-(4, 4'-オキサビス(4, 1-フェニレン))ビス(1H-インドール-5-カルボキサミド) (化合物 585)

【化 6 2 1】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよびインドール-5-カルボン酸から化合物 585 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₂N₄O₃ についての計算値：487.17；実測値 486.98。

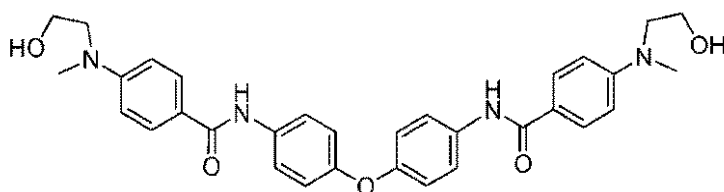
10

【0769】

実施例 486

N, N'-(4, 4'-オキサビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-N-メチル-N-(2-ヒドロキシエチル)アミノベンズアミド) (化合物 586)

【化 6 2 2】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-N-メチル-N-(2-ヒドロキシエチル)アミノベンズアミドから化合物 586 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₄N₄O₅ についての計算値：555.25；実測値 555.12。

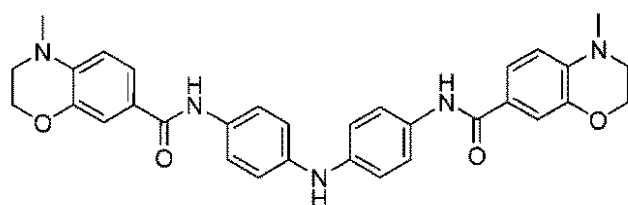
【0770】

実施例 487

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(1-メチル-1, 4-ベンゾオキサジン-6-カルボキサミド) (化合物 587)

30

【化 6 2 3】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 1-メチル-1, 4-ベンゾオキサジン-6-カルボン酸から化合物 587 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₁N₅O₄ についての計算値：550.24；実測値 550.05。

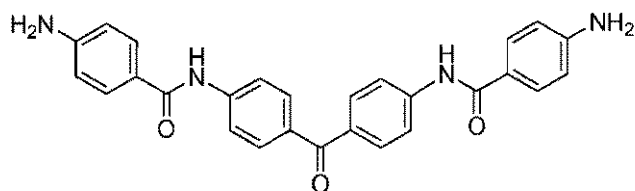
40

【0771】

実施例 488

N, N'-(4, 4'-カルボニルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-アミノベンズアミド) (化合物 588)

【化 6 2 4】



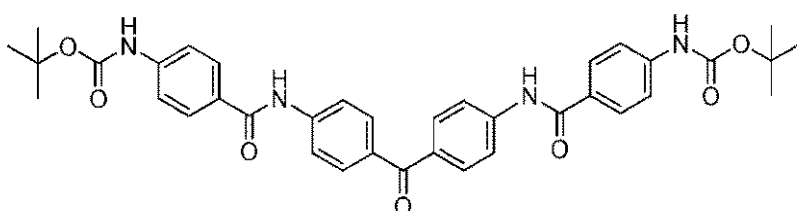
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-アミノベンゾエートから化合物 588 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₂N₄O₃ 10
 についての計算値：451.17；実測値 450.94。

【0772】

実施例 489

N, N'-(4, 4'-カルボニルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-tert-ブチルオキシカルバミドベンズアミド) (化合物 589)

【化 6 2 5】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-tert-ブチルオキシカルバミドベンゾエートから化合物 589 を調製した。[M+H]⁺ C₃₇H₃₈N₄O₇ 30
 についての計算値：651.27；実測値 651.10。

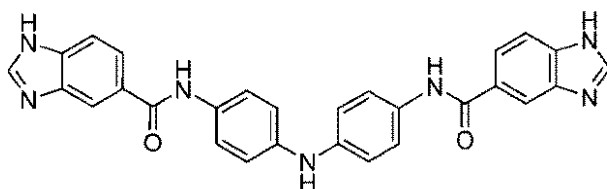
【0773】

実施例 490

N, N'-(4, 4'-アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(1H-ベンズイミダゾール-5-カルボキサミド) (化合物 590)

30

【化 6 2 6】



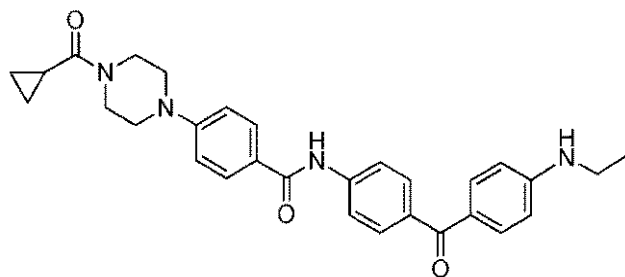
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよびベンズイミダゾール-5-カルボン酸から化合物 590 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₁N₇O₂ 40
 についての計算値：488.18；実測値 488.02。

【0774】

実施例 491

4-(4-シクロプロピルカルボニル)ピペラジン-1-イル-N-(4-(4-エチルアミノベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 591)

【化 6 2 7】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび (4-(4-シクロプロピルカルボニル) ピペラジン-1-イル) ベンゾエートから化合物 591 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₂N₄O₃ についての計算値：497.12；実測値：497.33。

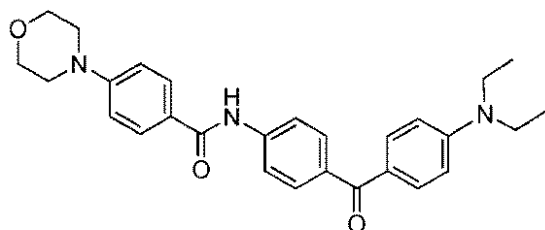
10

【0775】

実施例 492

4-モルホリノ-N-(4-(4-ジエチルアミノベンゾイル) フェニル) ベンズアミド (化合物 592)

【化 6 2 8】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 592 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₃₁N₃O₃ についての計算値：458.09；実測値：458.31。

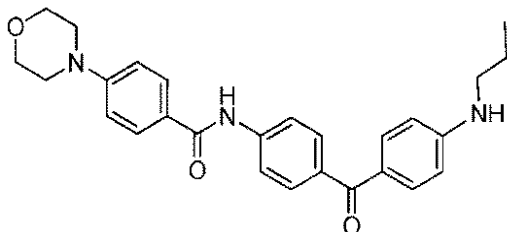
【0776】

30

実施例 493

4-モルホリノ-N-(4-(4-プロピルアミノベンゾイル) フェニル) ベンズアミド (化合物 593)

【化 6 2 9】



40

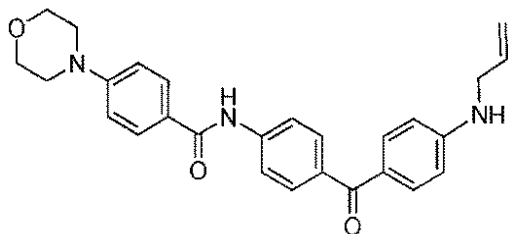
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 593 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₉N₃O₃ についての計算値：444.06；実測値：444.31。

【0777】

実施例 494

4-モルホリノ-N-(4-(4-アリルアミノベンゾイル) フェニル) ベンズアミド (化合物 594)

【化 6 3 0】



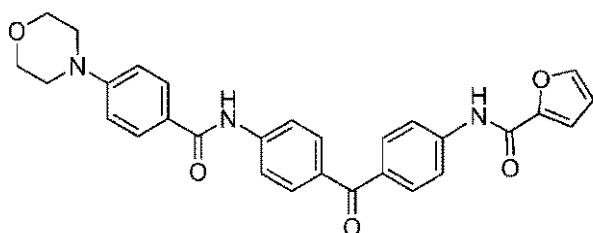
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 594 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₇N₃O₃ についての計算値：442.04；実測値：442.30。

【0778】

実施例 495

4-モルホリノ-N-(4-(4-(フラン-2-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 595)

【化 6 3 1】



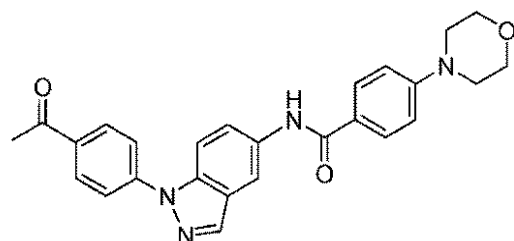
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 595 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₅N₃O₅ についての計算値：496.05；実測値：496.09。

【0779】

実施例 496

N-(1-(4-アセチルフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)モルホリノベンズアミド (化合物 596)

【化 6 3 2】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アセチルフェニル)インダゾールおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 596 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₄N₄O₃ についての計算値：441.18；実測値：441.02。

【0780】

実施例 497

4-モルホリノ-N-(4-(4-(ピリジン-4-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 597)

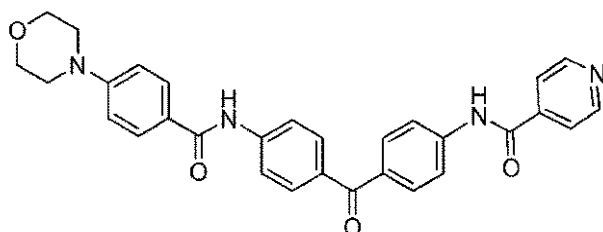
10

20

30

40

【化 6 3 3】



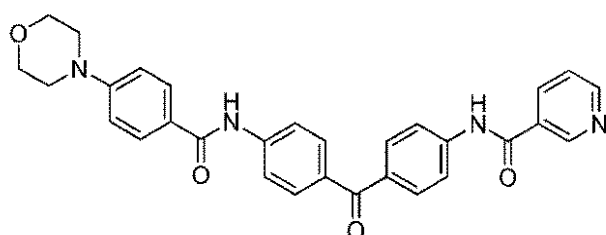
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 597 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₇N₄O₄ についての計算値：507.20；実測値：507.02。

【0781】

実施例 498

4-モルホリノ-N-(4-(4-(ピリジン-3-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 598)

【化 6 3 4】



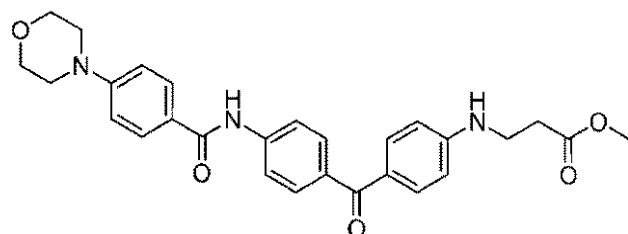
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 598 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₆N₄O₄ についての計算値：507.08；実測値：507.09。

【0782】

実施例 499

4-モルホリノ-N-(4-(4-(2-メトキシカルボニルエチル)アミノベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 599)

【化 6 3 5】



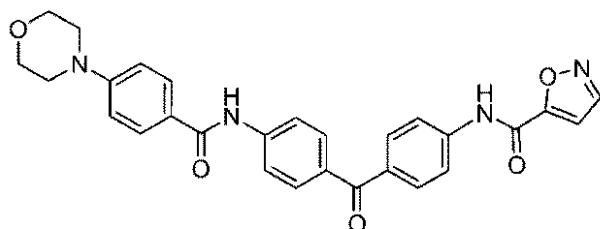
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 599 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₉N₃O₅ についての計算値：488.07；実測値：488.08。

【0783】

実施例 500

4-モルホリノ-N-(4-(4-(イソオキサゾール-5-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 600)

【化 6 3 6】



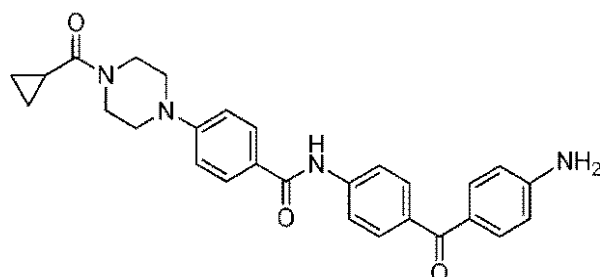
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 600 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₄N₄O₅ についての計算値：497.04；実測値：497.03。

【0784】

実施例 501

4-(4-シクロプロピルカルボニル)ピペラジン-1-イル-N-(4-(4-アミノベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 601)

【化 6 3 7】



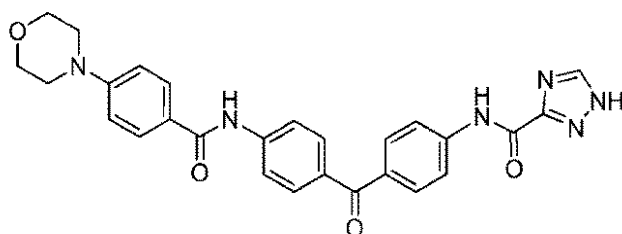
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび (4-(4-シクロプロピルカルボニル)ピペラジン-1-イル)ベンゾエートから化合物 601 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₈N₄O₃ についての計算値：469.07；実測値：469.09。

【0785】

実施例 502

4-モルホリノ-N-(4-(4-(1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 602)

【化 6 3 8】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 602 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₄N₆O₄ についての計算値：497.04；実測値：497.03。

【0786】

実施例 503

4-モルホリノ-N-(4-(4-(ピリダジン-4-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 603)

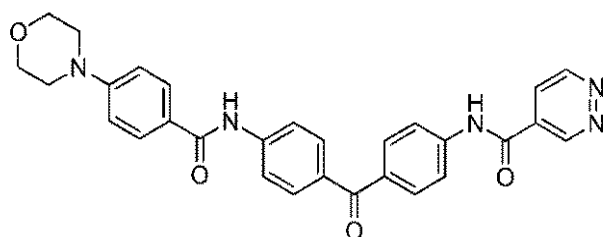
10

20

30

40

【化 6 3 9】



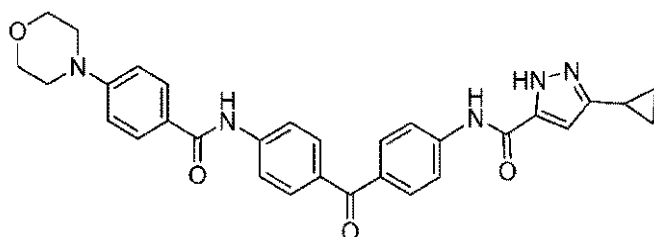
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 603 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₅N₅O₄ についての計算値：508.06；実測値：508.04。

【0787】

実施例 504

4-モルホリノ-N-(4-(4-(3-シクロプロピルピラゾール-5-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 604)

【化 6 4 0】



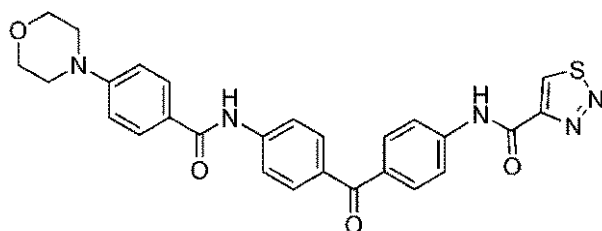
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 604 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀N₅O₄ についての計算値：536.23；実測値：536.10。

【0788】

実施例 505

4-モルホリノ-N-(4-(4-(1,2,3-チオジアゾール(thiodiazol)-4-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 605)

【化 6 4 1】



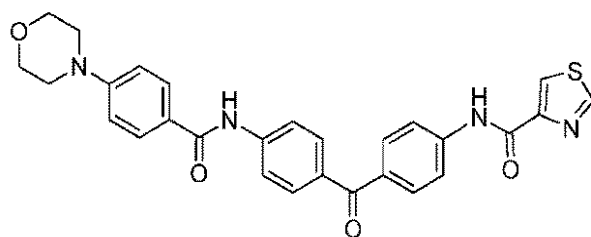
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 605 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₃N₅O₄S についての計算値：514.09；実測値：514.04。

【0789】

実施例 506

4-モルホリノ-N-(4-(4-(チアゾール-4-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 606)

【化 6 4 2】



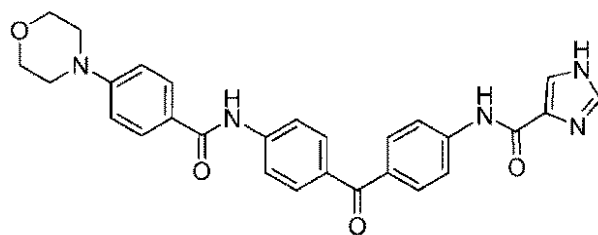
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 606 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₄N₄O₄S についての計算値：513.10；実測値：513.03。

【0790】

実施例 507

4-モルホリノ-N-(4-(4-(イミダゾール-4-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 607)

【化 6 4 3】



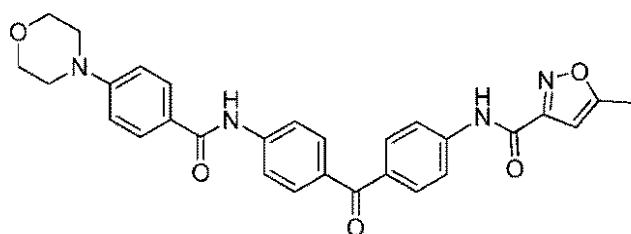
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 607 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₆N₅O₄ についての計算値：496.20；実測値：496.02。

【0791】

実施例 508

4-モルホリノ-N-(4-(4-(5-メチルイソオキサゾール-3-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 608)

【化 6 4 4】



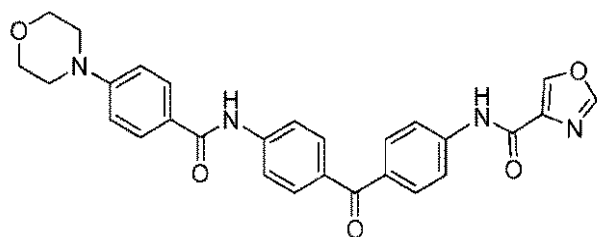
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 608 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₆N₄O₅ についての計算値：511.06；実測値：511.07。

【0792】

実施例 509

4-モルホリノ-N-(4-(4-(オキサゾール-4-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 609)

【化 6 4 5】



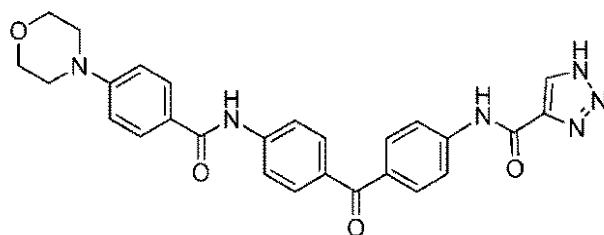
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 609 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₄N₄O₅ についての計算値：497.04；実測値：497.03。

【0793】

実施例 510

4-モルホリノ-N-(4-(4-(1, 2, 3-トリアゾール-4-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 610)

【化 6 4 6】



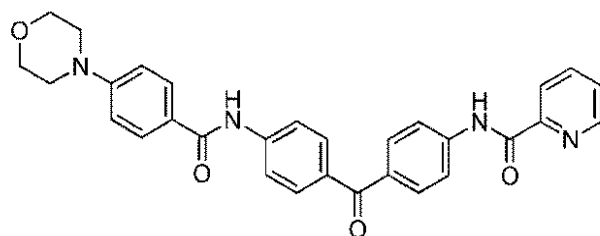
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 610 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₄N₆O₄ についての計算値：497.04；実測値：497.03。

【0794】

実施例 511

4-モルホリノ-N-(4-(4-(ピリジン-2-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 611)

【化 6 4 7】



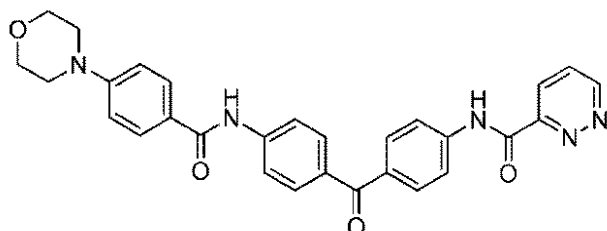
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 611 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₆N₄O₄ についての計算値：507.08；実測値：507.02。

【0795】

実施例 512

4-モルホリノ-N-(4-(4-(ピリダジン-3-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 612)

【化 6 4 8】



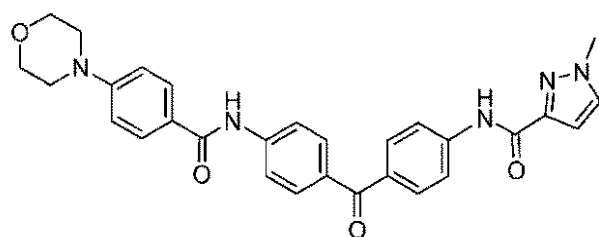
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-ホルホルノベンゾエートから化合物 6 1 2 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₅N₅O₄ についての計算値：508.06；実測値：508.29。

【0796】

実施例 5 1 3

4-ホルホルノ-N-(4-(4-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 6 1 3)

【化 6 4 9】



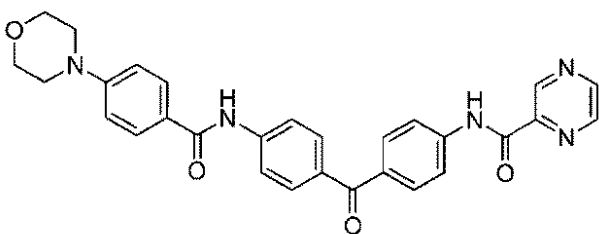
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-ホルホルノベンゾエートから化合物 6 1 3 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₇N₅O₄ についての計算値：510.08；実測値：510.06。

【0797】

実施例 5 1 4

4-ホルホルノ-N-(4-(4-(ピラジン-2-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 6 1 4)

【化 6 5 0】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-ホルホルノベンゾエートから化合物 6 1 4 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₅N₅O₄ についての計算値：508.06；実測値：508.04。

【0798】

実施例 5 1 5

4-ホルホルノ-N-(4-(4-(チオフェン-2-カルバニル (carbonyl) カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 6 1 5)

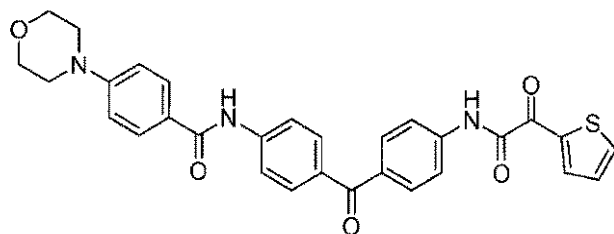
10

20

30

40

【化 6 5 1】



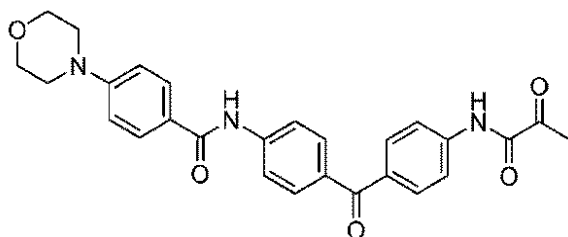
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 6 1 5 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₅N₃O₅S についての計算値：540.12；実測値：540.03。

【0799】

実施例 5 1 6

4-モルホリノ-N-(4-(4-アセチルカルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 6 1 6)

【化 6 5 2】



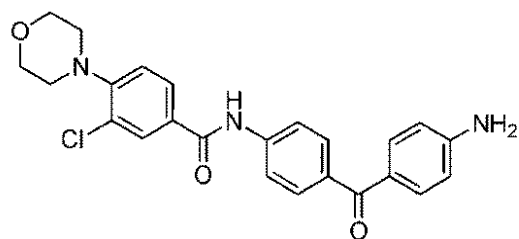
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 6 1 6 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₅N₃O₅ についての計算値：472.03；実測値：472.06。

【0800】

実施例 5 1 7

3-クロロ-4-モルホリノ-N-(4-(4-アミノベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 6 1 7)

【化 6 5 3】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 3-クロロ-4-モルホリノベンゾエートから化合物 6 1 7 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₃ClN₃O₃ についての計算値：436.14；実測値：435.97。

【0801】

実施例 5 1 8

3-クロロ-4-モルホリノ-N-(4-(4-(チオフェン-2-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 6 1 8)

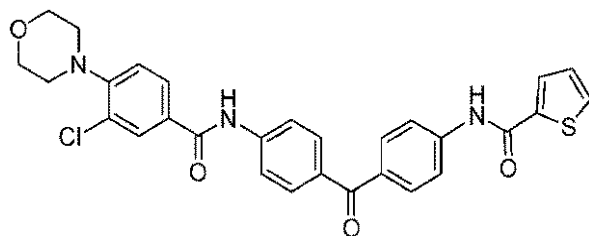
10

20

30

40

【化 6 5 4】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 3-クロロ-4-モルホリノベンゾエートから化合物 618 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₅ClN₃O₄S についての計算値：546.13；実測値：546.08。

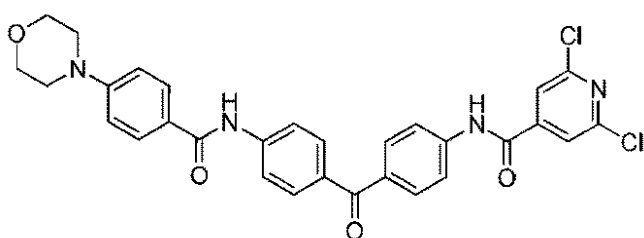
10

【0802】

実施例 519

4-モルホリノ-N-(4-(4-(2, 6-ジクロロピリジン-4-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 619)

【化 6 5 5】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 619 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₄Cl₂N₄O₄ についての計算値：576.07；実測値：576.15。

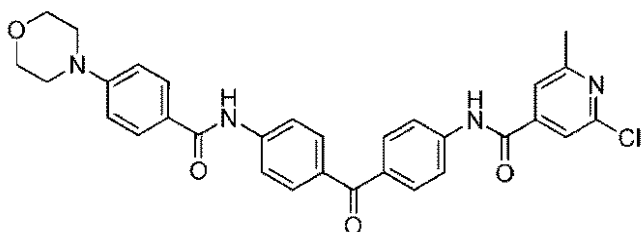
【0803】

実施例 520

4-モルホリノ-N-(4-(4-(2-クロロ-6-メチルピリジン-4-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 620)

30

【化 6 5 6】



40

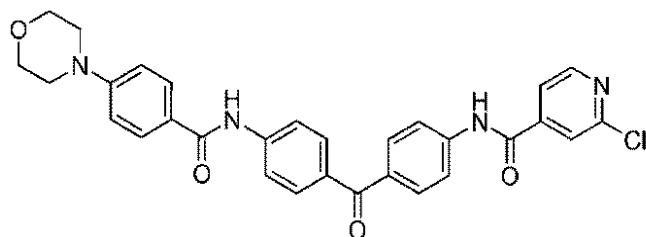
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 620 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₇ClN₄O₄ についての計算値：556.05；実測値：556.17。

【0804】

実施例 521

4-モルホリノ-N-(4-(4-(2-クロロピリジン-4-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物 621)

【化 6 5 7】



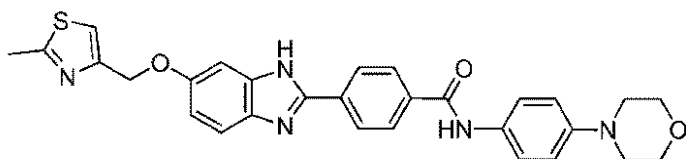
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび 4-モルホリノベンゾエートから化合物 621 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₅ClN₄O₄ についての計算値：542.02；実測値：541.92。

【0805】

実施例 522

4-(6-(2-メチルチアゾール-4-イルメトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド (化合物 622)

【化 6 5 8】



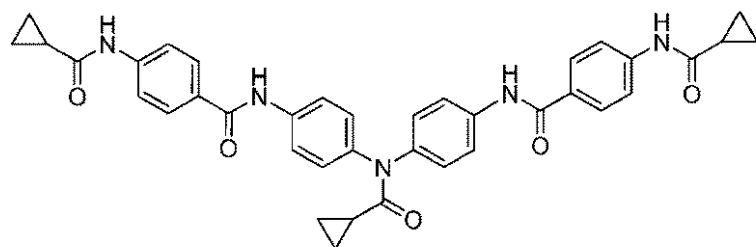
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(2-メチルチアゾール-4-イル)メトキシ-3, 4-ジニトロベンゼンおよび 4-(4-(4-モルホリノフェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒド)から化合物 622 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₇N₅O₃S についての計算値：526.18；実測値：526.06。

【0806】

実施例 523

4-(シクロプロパンカルボキサミド)-N-(4-(N-(4-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)ベンズアミド)フェニル)シクロファンカルボキサミド)フェニル)ベンズアミド (化合物 623)

【化 6 5 9】



一般的なアミド形成反応によって、シクロプロパンカルボン酸および化合物 580 から化合物 623 を調製した。[M+H]⁺ C₃₈H₃₅N₅O₅ についての計算値：642.26；実測値 642.19。

【0807】

実施例 524

4-(6-(ピリジン-2-イルメトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド (化合物 624)

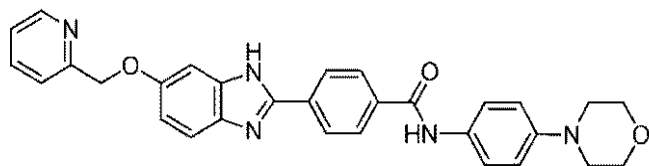
10

20

30

40

【化 6 6 0】



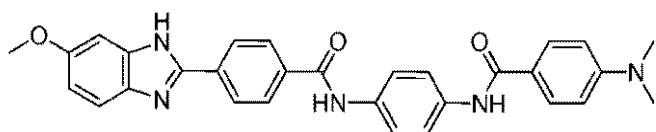
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-（ピリジン-2-イルメトキシ）-3, 4-ジニトロベンゼンおよび4-（4-（4-モルホリノフェニル）アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 6 2 4 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₇N₅O₃ 10

【0 8 0 8】

実施例 5 2 5

4-（ジメチルアミノ）-N-（4-（4-（6-メトキシ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル）ベンズアミド）フェニル）ベンズアミド（化合物 6 2 5）

【化 6 6 1】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、4-（6-メトキシ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル）安息香酸、1, 4-フェニレンジアミン、および4ジメチルアミノ安息香酸から化合物 6 2 5 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₇N₅O₃ 10

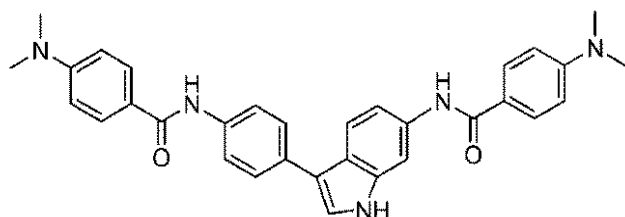
【0 8 0 9】

実施例 5 2 6

4-（ジメチルアミノ）-N-（4-（6-（4-（ジメチルアミノ）ベンズアミド）-1H-インドール-3-イル）フェニル）ベンズアミド（化合物 6 2 6）

【化 6 6 2】

30



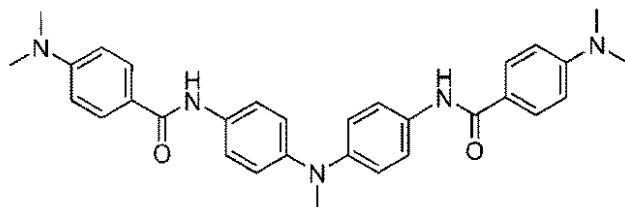
スキーム I V に表される手順にしたがって、6-アミノ-3-（4-アミノフェニル）-1H-インドールおよび4-ジメチルアミノベンゾエートから化合物 6 2 6 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₁N₅O₂ 40

【0 8 1 0】

実施例 5 2 7

N, N'-（（メチルアザンジイル）ビス（4, 1-フェニレン））ビス（4-ジメチルアミノベンズアミド）（化合物 6 2 7）

【化 6 6 3】



化合物 580 の還元的メチル化によって、化合物 627 を調製した。

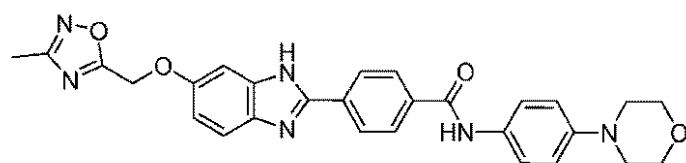
【0811】

10

実施例 528

4- (6- ((3-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル) メトキシ) -1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル) -N- (4-モルホリノフェニル) ベンズアミド (化合物 628)

【化 6 6 4】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1- (3-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル) メトキシ-3, 4-ジニトロベンゼンおよび4- (4- (4-モルホリノフェニル) アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 628 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₆N₆O₄ についての計算値: 511.20; 実測値: 511.04。

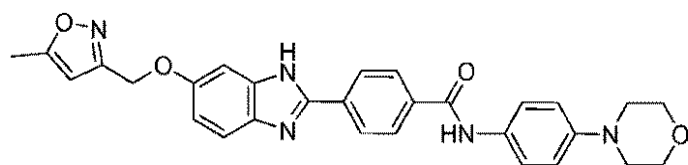
【0812】

実施例 529

4- (6- ((5-メチルイソオキサゾール-3-イル) メトキシ) -1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル) -N- (4-モルホリノフェニル) ベンズアミド (化合物 629)

30

【化 6 6 5】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1- (5-メチルイソオキサゾール-3-イル) メトキシ-3, 4-ジニトロベンゼンおよび4- (4- (4-モルホリノフェニル) アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 629 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₇N₅O₄ についての計算値: 510.21; 実測値: 510.06。

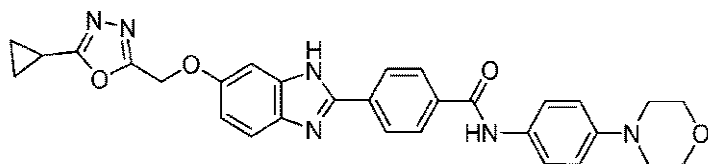
40

【0813】

実施例 530

4- (6- ((5-シクロプロピル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル) メトキシ) -1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル) -N- (4-モルホリノフェニル) ベンズアミド (化合物 630)

【化 6 6 6】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(5-シクロプロピル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)メトキシ-3, 4-ジニトロベンゼンおよび4-(4-(4-モルホリノフェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 6 3 0 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₈N₆O₄ についての計算値：537.22；実測値：537.06。

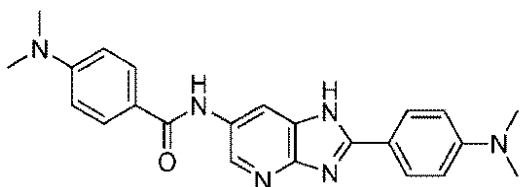
10

【0814】

実施例 5 3 1

4-(ジメチルアミノ)-N-(2-(4-ジメチルアミノフェニル)-1H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-6-イル)ベンズアミド (化合物 6 3 1)

【化 6 6 7】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、4-ジメチルアミノ安息香酸および6-アミノ-2-(4-ジメチルアミノフェニル)-1H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジンから化合物 6 3 1 を調製した。[M+H]⁺ C₂₃H₂₄N₆O についての計算値：401.20；実測値401.07。

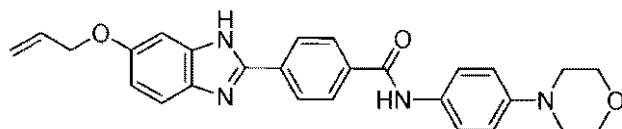
【0815】

実施例 5 3 2

4-(6-アリルオキシ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド (化合物 6 3 2)

30

【化 6 6 8】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-アリルオキシ-3, 4-ジニトロベンゼンおよび4-(4-(4-モルホリノフェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 6 3 2 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₆N₄O₃ についての計算値：455.21；実測値：455.00。

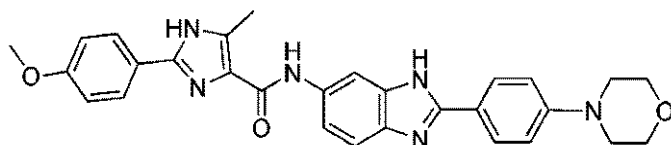
40

【0816】

実施例 5 3 3

2-(4-メトキシフェニル)-5-メチル-N-(2-(4-モルホリノフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-イル)-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド (化合物 6 3 3)

【化 6 6 9】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、2-(4-メトキシフェニル)-1H-イミダゾール-4-カルボン酸および6-アミノ-2-(4-モルホリノフェニル)ベンズイミダゾールから化合物 6 3 3 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₈N₆O₃ についての計算値：509.22；実測値 509.11。

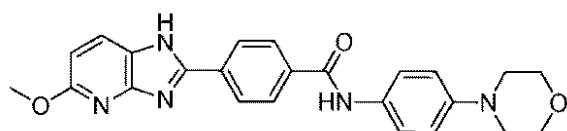
10

【0 8 1 7】

実施例 5 3 4

4-(5-メトキシ-1H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド (化合物 6 3 2)

【化 6 7 0】



20

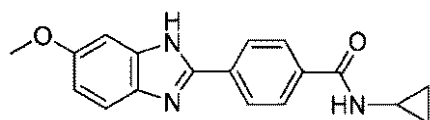
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、4-(5-メトキシ-1H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)安息香酸および4-モルホリノアニリンから化合物 6 3 4 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₃N₅O₃ についての計算値：430.18；実測値 429.96。

【0 8 1 8】

実施例 5 3 5

N-シクロプロピル-4-(6-メトキシ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド (化合物 6 3 5)

【化 6 7 1】



30

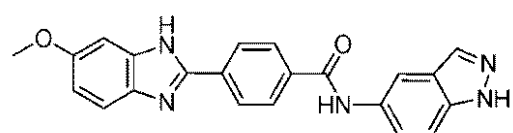
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-メトキシ-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-シクロプロピルアミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 6 3 5 を調製した。[M+H]⁺ C₁₈H₁₇N₃O₂ についての計算値：308.14；実測値：308.16。

【0 8 1 9】

実施例 5 3 6

N-(1H-インダゾール-5-イル)-4-(6-メトキシ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド (化合物 6 3 6)

【化 6 7 2】



40

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-メトキシ-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(1H-インダゾール-5-イル)アミノカルボニル)ベンズ

50

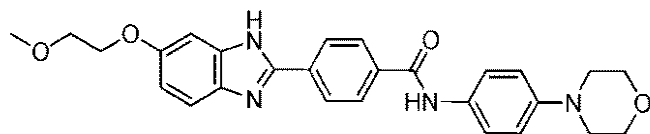
アルデヒドから化合物 636 を調製した。[M+H]⁺ C₂₂H₁₇N₅O₂ についての計算値：384.15；実測値：384.20。

【0820】

実施例 537

4-(6-(2-メトキシエチルオキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド(化合物 637)

【化 673】



10

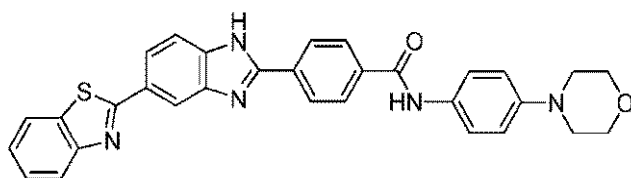
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(2-メトキシエチルオキシ)-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(4-(4-モルホリノフェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 637 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₈N₄O₄ についての計算値：473.21；実測値：473.08。

【0821】

実施例 538

4-(5-(ベンゾ[d]チアゾール-2-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド(化合物 638)

【化 674】



20

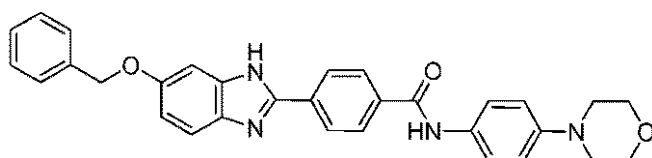
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(ベンゾチアゾール-2-イル)-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(4-(4-モルホリノフェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 638 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₅N₅O₂S についての計算値：532.18；実測値：532.07。

【0822】

実施例 539

4-(6-ベンジルオキシ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド(化合物 639)

【化 675】



40

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-ベンジルオキシ-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(4-(4-モルホリノフェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 639 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₈N₄O₄ についての計算値：473.21；実測値：473.08。

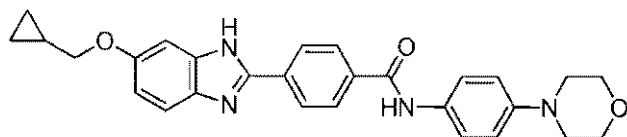
【0823】

実施例 540

4-(6-シクロプロピルメトキシ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド(化合物 640)

50

【化 6 7 6】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-シクロプロピルメトキシ-3, 4-ジニトロベンゼンおよび4-(4-(4-モルホリノフェニル)アミノ)カルボニルベンズアルデヒドから化合物 6 4 0 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₈N₄O₃ についての計算値：469.22；実測値：469.03。

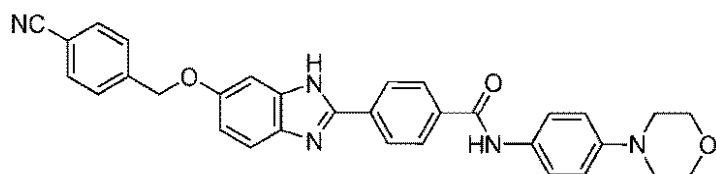
10

【0824】

実施例 5 4 1

4-(6-(4-シアノベンジルオキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド (化合物 6 4 1)

【化 6 7 7】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(4-シアノベンジルオキシ)-3, 4-ジニトロベンゼンおよび4-(4-(4-モルホリノフェニル)アミノ)カルボニルベンズアルデヒドから化合物 6 4 1 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₂₇N₅O₃ についての計算値：530.21；実測値：530.10。

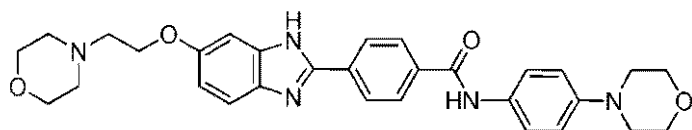
【0825】

実施例 5 4 2

4-(6-(2-(モルホリノエチルオキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド (化合物 6 4 2)

【化 6 7 8】

30



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(2-モルホリノエチルオキシ)-3, 4-ジニトロベンゼンおよび4-(4-(4-モルホリノフェニル)アミノ)カルボニルベンズアルデヒドから化合物 6 4 2 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₃N₅O₄ についての計算値：528.25；実測値：528.15。

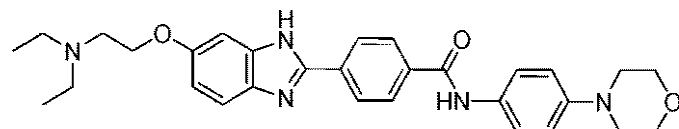
【0826】

40

実施例 5 4 3

4-(6-(2-(ジエチルアミノ)エチルオキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド (化合物 6 4 3)

【化 6 7 9】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(2-ジエチルアミノ

50

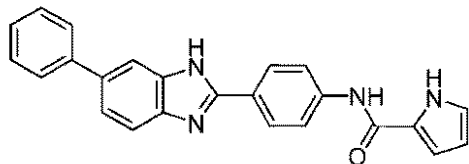
エチルオキシ) - 3, 4-ジニトロベンゼンおよび4-(4-(4-モルホリノフェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物643を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₅N₅O₃ についての計算値: 514.27; 実測値: 514.13。

【0827】

実施例544

(N-(4-(6-フェニル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)フェニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物644)

【化680】



10

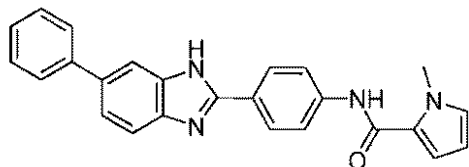
スキームIIIに表されるものと同様の手順にしたがって、1-フェニル-3, 4-ジニトロベンゼン、4-ニトロベンズアルデヒド、および2-ピロールカルボン酸から化合物644を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₁₈N₄O についての計算値: 379.15; 実測値: 378.96。

【0828】

実施例545

1-メチル-(N-(4-(6-フェニル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)フェニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物645)

【化681】



20

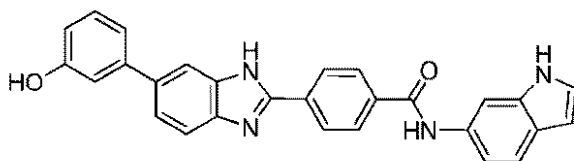
スキームIIIに表されるものと同様の手順にしたがって、1-フェニル-3, 4-ジニトロベンゼン、4-ニトロベンズアルデヒド、および1-メチルピロール-2-カルボン酸から化合物645を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₀N₄O についての計算値: 393.17; 実測値: 392.99。

【0829】

実施例546

(4-(6-(3-ヒドロキシフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-1H-インドール-6-イル)ベンズアミド (化合物646)

【化682】



30

40

スキームIIIに表されるものと同様の手順にしたがって、1-(3-ヒドロキシフェニル)-3, 4-ジニトロベンゼンおよび4-(6-インドリルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物646を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₀N₄O₂ についての計算値: 445.16; 実測値: 445.00。

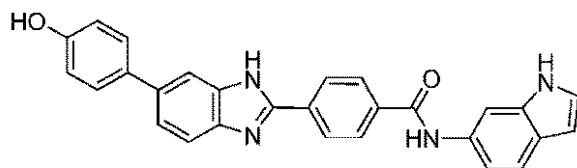
【0830】

実施例547

50

(4-(6-(4-ヒドロキシフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-1H-インドール-6-イル)ベンズアミド(化合物647)

【化683】



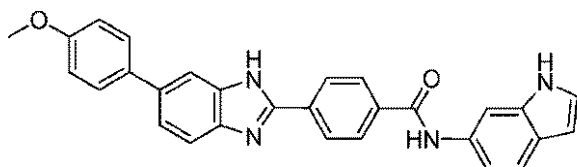
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(4-ヒドロキシフェニル)-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(6-インドリルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物647を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₀N₄O₂ についての計算値: 445.16; 実測値: 445.00。

【0831】

実施例548

(4-(6-(4-メトキシフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-1H-インドール-6-イル)ベンズアミド(化合物648)

【化684】



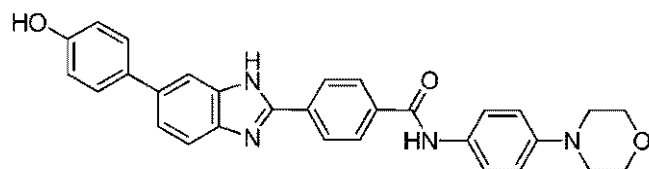
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(4-メトキシフェニル)-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(6-インドリルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物648を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₂N₄O₂ についての計算値: 459.17; 実測値: 458.97。

【0832】

実施例549

(4-(6-(4-ヒドロキシフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド(化合物649)

【化685】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(4-ヒドロキシフェニル)-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(4-モルホリノフェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物649を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₆N₄O₃ についての計算値: 491.20; 実測値: 491.03。

【0833】

実施例550

N-(1H-インドール-6-イル)-4-(6-(ピリジン-3-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド(化合物650)

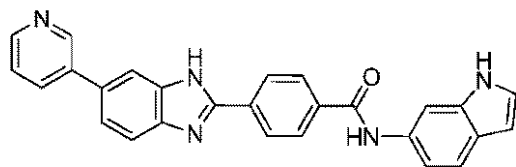
10

20

30

40

【化 6 8 6】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(3-ピリジニル)-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(6-インドリルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 6 5 0 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₁₉N₅O についての計算値

10

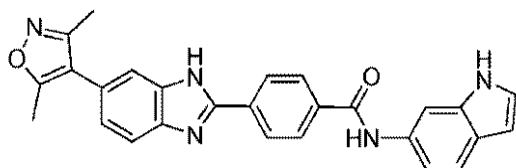
: 430.16; 実測値: 429.96。

【0 8 3 4】

実施例 5 5 1

4-(6-(3,5-ジメチルイソオキサゾール-4-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(1H-インドール-6-イル)ベンズアミド (化合物 6 5 1)

【化 6 8 7】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(3,5-ジメチルイソオキサゾール-4-イル)-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(6-インドリルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 6 5 1 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₁N₅O₂ についての計算値: 448.17; 実測値: 447.97。

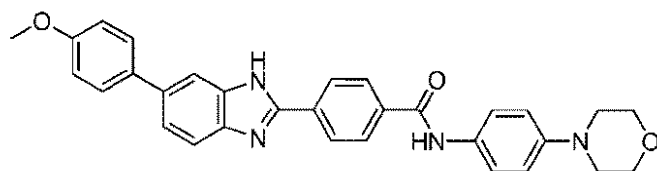
【0 8 3 5】

実施例 5 5 2

(4-(6-(4-メトキシフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド (化合物 6 5 2)

30

【化 6 8 8】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(4-メトキシフェニル)-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(4-モルホリノフェニル)アミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 6 5 2 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₈N₄O₃ についての計算値: 505.22; 実測値: 505.07。

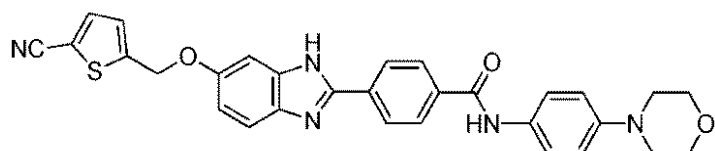
40

【0 8 3 6】

実施例 5 5 3

4-(6-(5-シアノチオフェン-2-イル)メトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド (化合物 6 5 3)

【化 6 8 9】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(5-シアノチオフェン-2-イル)メトキシ-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(4-モルホリノフェニル)アミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 6 5 3 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₅N₅O₃S についての計算値：536.17；実測値：536.05。

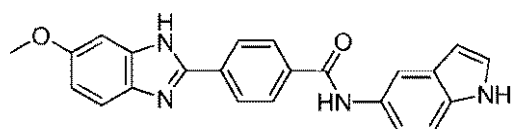
10

【0837】

実施例 5 5 4

N-(1H-インドール-5-イル)-4-(6-メトキシ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド (化合物 6 5 4)

【化 6 9 0】



20

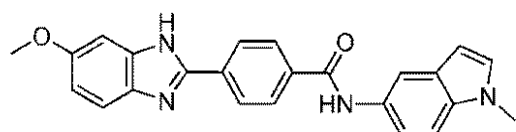
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロアニソールおよび4-(5-インドリルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 6 5 4 を調製した。[M+H]⁺ C₂₃H₁₈N₄O₂ についての計算値：383.14；実測値：383.01。

【0838】

実施例 5 5 5

N-(1-メチルインドール-5-イル)-4-(6-メトキシ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド (化合物 6 5 5)

【化 6 9 1】



30

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3,4-ジニトロアニソールおよび4-(5-(1-メチルインドリル)アミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 6 5 5 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₀N₄O₂ についての計算値：397.16；実測値：396.97。

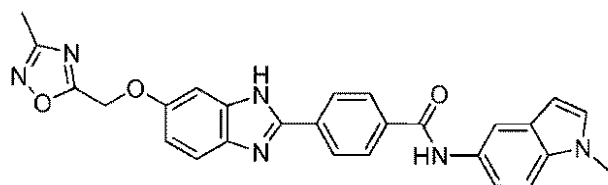
【0839】

実施例 5 5 6

4-(6-((3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)メトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(1-メチル-1H-インドール-5-イル)ベンズアミド (化合物 6 5 6)

40

【化 6 9 2】



50

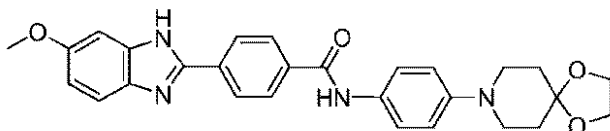
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(3-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル)メトキシ-3, 4-ジニトロベンゼンおよび4-(5-(1-メチルインドリル)アミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物656を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₂N₆O₃ についての計算値：479.18；実測値：479.01。

【0840】

実施例557

N-(4-(1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デカナ-8-イル)フェニル)-4-(6-メトキシ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド (化合物657)

【化693】



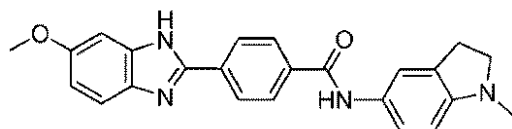
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロアニソールおよび4-(4-(1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デカナ-8-イル)フェニル)アミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物657を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₈N₄O₄ についての計算値：485.21；実測値：485.09。

【0841】

実施例558

4-(6-メトキシ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(1-メチルインドリン-5-イル)ベンズアミド (化合物658)

【化694】



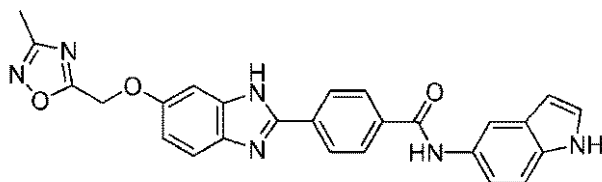
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、3, 4-ジニトロアニソールおよび4-(5-(1-メチルインドリル)アミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物658を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₂N₄O₂ についての計算値：399.17；実測値：398.99。

【0842】

実施例559

4-(6-(3-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル)メトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(1H-インドール-5-イル)ベンズアミド (化合物659)

【化695】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(3-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル)メトキシ-3, 4-ジニトロベンゼンおよび4-(5-インドリルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物659を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₀N₆O₃ についての計算値：465.16；実測値：464.9

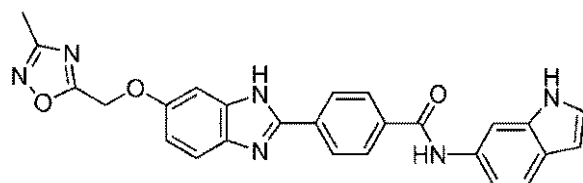
8。

【0843】

実施例560

4-(6-((3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)メトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(1H-インドール-6-イル)ベンズアミド(化合物660)

【化696】



10

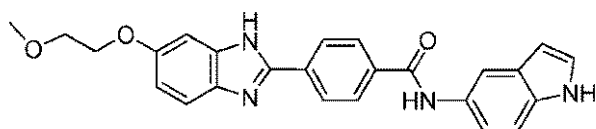
スキームIIIに表されるものと同様の手順にしたがって、1-(3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)メトキシ-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(6-インドリルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物660を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₀N₆O₃ についての計算値: 465.16; 実測値: 465.04。

【0844】

実施例561

4-(6-(2-メトキシエトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(1H-インドール-5-イル)ベンズアミド(化合物661)

【化697】



20

スキームIIIに表されるものと同様の手順にしたがって、1-(2-メトキシエトキシ-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(5-インドリルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物661を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₂N₄O₃ についての計算値: 427.17; 実測値: 426.99。

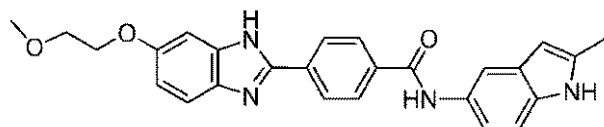
30

【0845】

実施例562

4-(6-(2-メトキシエトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(2-メチル-1H-インドール-5-イル)ベンズアミド(化合物662)

【化698】



40

スキームIIIに表されるものと同様の手順にしたがって、1-(2-メトキシエトキシ-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(2-メチル-5-インドリルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物662を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₄N₄O₃ についての計算値: 441.18; 実測値: 441.02。

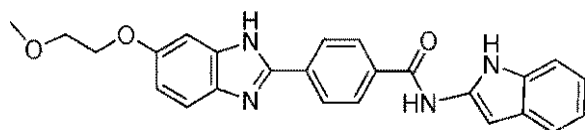
【0846】

実施例563

4-(6-(2-メトキシエトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(1H-インドール-2-イル)ベンズアミド(化合物663)

50

【化 6 9 9】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(2-メトキシエトキシ-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(2-インドリルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 6 6 3 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₂N₄O₃ についての計算値：427.17；実測値：426.99。

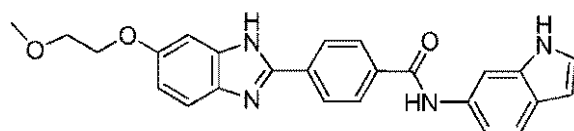
10

【0847】

実施例 5 6 4

4-(6-(2-メトキシエトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(1H-インドール-6-イル)ベンズアミド (化合物 6 6 4)

【化 7 0 0】



20

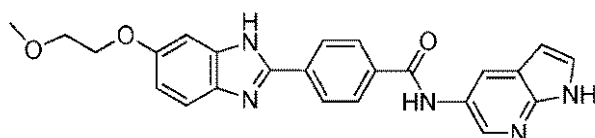
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(2-メトキシエトキシ-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(6-インドリルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 6 6 4 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₂N₄O₃ についての計算値：427.17；実測値：426.99。

【0848】

実施例 5 6 5

4-(6-(2-メトキシエトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)ベンズアミド (化合物 6 6 5)

【化 7 0 1】



30

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(2-メトキシエトキシ-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)アミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 6 6 5 を調製した。¹H NMR (500 MHz, CD₃OD) δ 8.45 (s, 1H)、8.35 (s, 1H)、8.19 (d, J=8.5 Hz, 2H)、8.15 (d, J=8.5 Hz, 2H)、7.55 (d, J=9 Hz, 1H)、7.42 (d, J=3.5 Hz, 1H)、7.15 (s, 1H)、7.05 (d, J=9 Hz, 1H)、6.51 (d, J=3.5 Hz, 1H)、4.19 (t, J=4.5 Hz, 2H)、3.79 (t, J=4.5 Hz, 2H)、3.31 (s, 3H)。

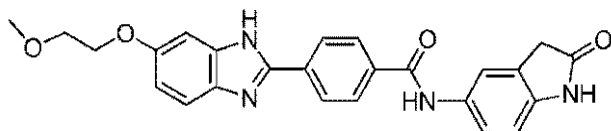
40

【0849】

実施例 5 6 6

4-(6-(2-メトキシエトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(2-オキシインドリン-5-イル)ベンズアミド (化合物 6 6 6)

【化 7 0 2】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(2-メトキシエトキシ-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-((2-オキソインドリン-5-イル)アミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 6 6 6 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₂N₄O₄ についての計算値：443.16；実測値：443.05。

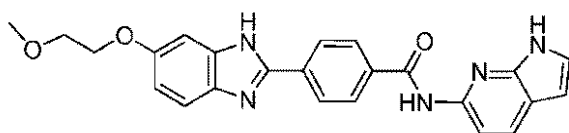
10

【0850】

実施例 5 6 7

4-(6-(2-メトキシエトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-6-イル)ベンズアミド (化合物 6 6 7)

【化 7 0 3】



20

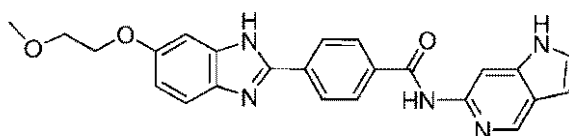
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(2-メトキシエトキシ-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-6-イル)アミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 6 6 7 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₁N₅O₃ についての計算値：428.17；実測値：428.00。

【0851】

実施例 5 6 8

4-(6-(2-メトキシエトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(1H-ピロロ[3,2-c]ピリジン-6-イル)ベンズアミド (化合物 6 6 8)

【化 7 0 4】



30

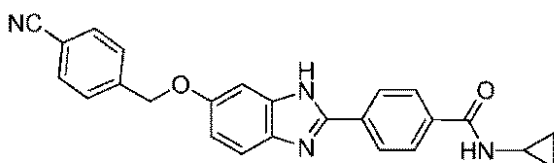
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(2-メトキシエトキシ-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(1H-ピロロ[3,2-c]ピリジン-6-イル)アミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 6 6 8 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₁N₅O₃ についての計算値：428.17；実測値：428.07。

【0852】

実施例 5 6 9

4-(6-((4-シアノベンジル)オキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-シクロプロピルベンズアミド (化合物 6 6 9)

【化 7 0 5】



40

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(4-シアノベンジル

50

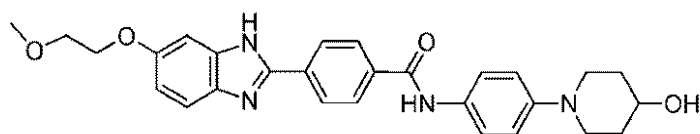
）オキシ-3, 4-ジニトロベンゼンおよび4-(シクロプロピルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物669を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₀N₄O₂についての計算値：409.16；実測値：409.04。

【0853】

実施例570

N-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)フェニル)-4-(6-(2-メトキシエトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ベンズアミド(化合物670)

【化706】



10

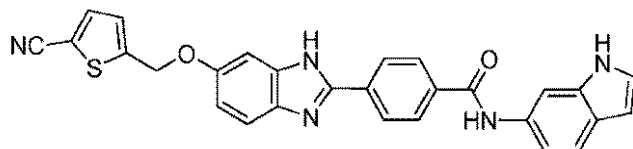
スキームIIIに表されるものと同様の手順にしたがって、1-(2-メトキシエトキシ-3, 4-ジニトロベンゼンおよび4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)フェニル)アミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物670を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₃₀N₄O₄についての計算値：487.23；実測値：487.05。

【0854】

実施例571

4-(6-(5-シアノチオフェン-2-イル)メトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(1H-インドール-6-イル)ベンズアミド(化合物671)

【化707】



30

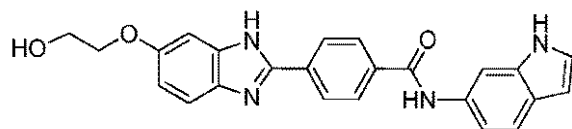
スキームIIIに表されるものと同様の手順にしたがって、1-(5-シアノチオフェン-2-イル)メトキシ-3, 4-ジニトロベンゼンおよび4-(インドール-6-イル)アミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物671を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₁₉N₅O₂Sについての計算値：490.13；実測値：489.95。

【0855】

実施例572

4-(6-(2-ヒドロキシエトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(1H-インドール-6-イル)ベンズアミド(化合物672)

【化708】



40

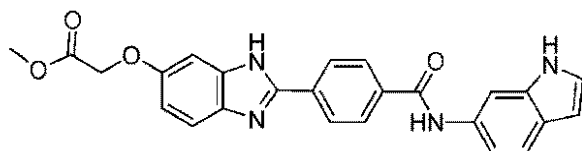
スキームIIIに表されるものと同様の手順にしたがって、1-(2-ヒドロキシエトキシ)-3, 4-ジニトロベンゼンおよび4-(6-インドリルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物672を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₀N₄O₃についての計算値：413.15；実測値：412.96。

【0856】

実施例573

50

メチル 2-((2-(4-((1H-インドール-6-イル)カルバモイル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-6-イル)オキシ)アセテート (化合物 673)
【化 709】



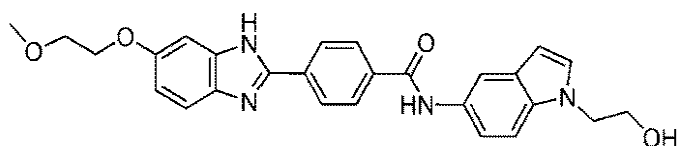
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(メトキシカルバニルメトキシ)-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(6-インドリルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 673 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₀N₄O₄ についての計算値: 441.15; 実測値: 440.96。

【0857】

実施例 574

4-(6-(2-メトキシエトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(1-(2-ヒドロキシエチル)インドール-5-イル)ベンズアミド (化合物 674)

【化 710】



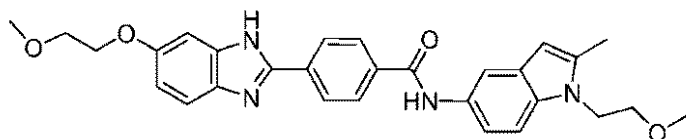
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(2-メトキシエトキシ)-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(1-(2-ヒドロキシエチル)-5-インドリルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 674 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₆N₄O₄ についての計算値: 471.20; 実測値: 471.05。

【0858】

実施例 575

4-(6-(2-メトキシエトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(1-(2-メトキシエチル)-2-メチルインドール-5-イル)ベンズアミド (化合物 675)

【化 711】



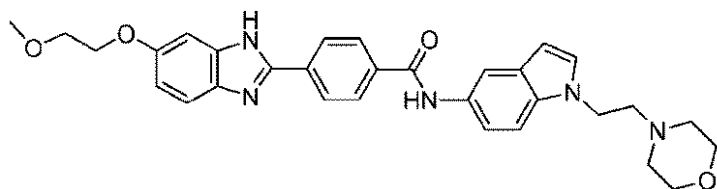
スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(2-メトキシエトキシ)-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(1-(2-メトキシエチル)-2-メチル-5-インドリルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 675 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₀N₄O₄ についての計算値: 499.24; 実測値: 499.06。

【0859】

実施例 576

4-(6-(2-メトキシエトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(1-(2-モルホリノエチル)インドール-5-イル)ベンズアミド (化合物 676)

【化 7 1 2】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(2-メトキシエトキシ-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(1-(2-モルホリノエチル)-5-インドリルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 6 7 6 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₃N₅O₄ についての計算値: 540.26; 実測値: 540.10。

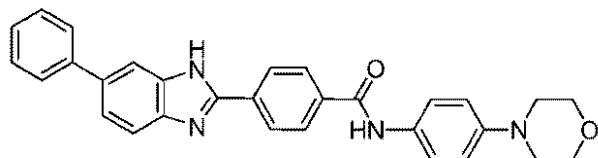
10

【0860】

実施例 5 7 7

(6-フェニル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド (化合物 6 7 7)

【化 7 1 3】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-フェニル-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(4-モルホリノフェニル)アミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 6 7 7 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₆N₄O₂ についての計算値: 475.22; 実測値: 475.03。

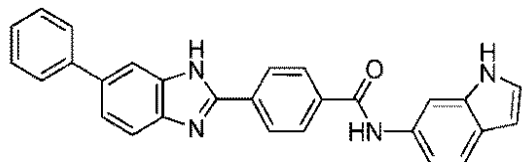
【0861】

実施例 5 7 8

(6-フェニル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-1H-インドール-6-イル)ベンズアミド (化合物 6 7 8)

30

【化 7 1 4】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-フェニル-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(6-インドリルアミノカルボニル)ベンズアルデヒドから化合物 6 7 8 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₀N₄O についての計算値: 429.16; 実測値: 428.95。

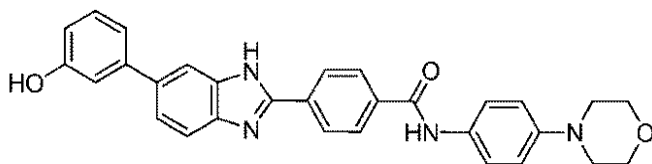
40

【0862】

実施例 5 7 9

(4-(6-(3-ヒドロキシフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド (化合物 6 7 9)

【化 7 1 5】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(3-ヒドロキシフェニル)-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(4-モルホリノフェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 6 7 9 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₆N₄O₃ についての計算値: 491.20; 実測値: 491.03。

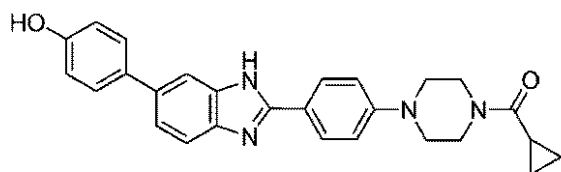
10

【0 8 6 3】

実施例 5 8 0

シクロプロピル(4-(4-(6-(4-ヒドロキシフェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)フェニル)ピペラジン-1-イル)メタノン(化合物 6 8 0)

【化 7 1 6】



20

スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(4-ヒドロキシフェニル)-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(4-(シクロプロピルカルボニルピペラジン-1-イル)ベンズアルデヒドから化合物 6 8 0 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₆N₄O₂ についての計算値: 439.21; 実測値: 438.93。

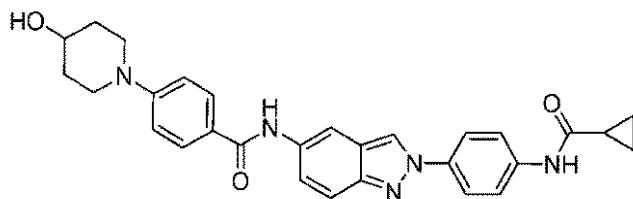
【0 8 6 4】

実施例 5 8 1

N-(2-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-2H-インダゾール-5-イル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド(化合物 6 8 1)

30

【化 7 1 7】



スキーム I V に表されるものと同様の手順にしたがって、4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸、シクロプロパンカルボン酸、および2-(4-アミノフェニル)-5-アミノ-2H-インダゾールから化合物 6 8 1 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₉N₅O₃ についての計算値: 496.23; 実測値 496.05。

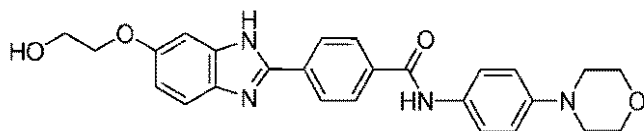
40

【0 8 6 5】

実施例 5 8 2

4-(6-(2-ヒドロキシエトキシ)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)ベンズアミド(化合物 6 8 2)

【化 7 1 8】



スキーム I I I に表されるものと同様の手順にしたがって、1-(4-メトキシフェニル)-3,4-ジニトロベンゼンおよび4-(4-モルホリノフェニル)アミノカルボニルベンズアルデヒドから化合物 6 8 2 を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{26}H_{26}N_4O_4$ についての計算値：459.20；実測値：458.97。

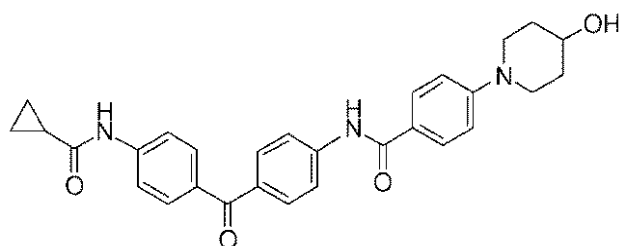
10

【0 8 6 6】

実施例 5 8 3

N-(4-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 6 8 3)

【化 7 1 9】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、シクロプロパンカルボン酸および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 6 8 3 を調製した。ジメチルホルムアミド (6 mL) 中の4,4'-ジアミノベンゾフェノン (Aldrich、150 mg、0.71 mmol)、4-フルオロ安息香酸 (Aldrich、129 mg、0.92 mmol)、HATU (Aldrich、349 mg、0.92 mmol) およびジイソプロピルエチルアミン (Aldrich、160 μ L、0.92 mmol) の溶液を、12時間にわたって100℃まで加熱した。反応物を室温まで冷まし、水 (10 mL) をゆっくりと添加した。得られた固体をろ過し、高温メタノールから再結晶化させて、N-(4-(4-アミノベンゾイル)フェニル)-4-フルオロベンズアミド (147 mg、0.44 mmol、62%) を得た。

30

【0 8 6 7】

5 mL の塩化メチレン中のシクロプロパンカルボニルクロリド (Aldrich、448 mg、4.31 mmol) の溶液を、3 mL のピリジンを含有する20 mL の塩化メチレン中のN-(4-(4-アミノベンゾイル)フェニル)-4-フルオロベンズアミド (1.2 g、3.59 mmol) に5分間かけてゆっくりと添加した。反応物を室温で12時間攪拌し、次に、40 mL の水で急冷した。層を分離させ、水層を酢酸エチル (2×50 mL) で抽出した。組み合わせられた有機物を、0.5 N の HCl (100 mL)、塩水 (100 mL) で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過した。有機物を濃縮して、褐色の固体としてN-(4-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)-4-フルオロベンズアミド (1.3 g、3.23 mmol) を得て、これをさらに精製せずに使用した。

40

【0 8 6 8】

ジメチルスルホキシド (35 mL) 中のN-(4-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)-4-フルオロベンズアミド (1.3 g、3.23 mmol) の溶液に、4-ヒドロキシピペリジン (Aldrich、5.2 g、51.5 mmol) を一度に添加した。反応物を24時間にわたって110℃まで加熱し、次に、室温まで冷ました。水 (100 mL) を、室温で、攪拌しながら3時間かけて反応物にゆっくり

50

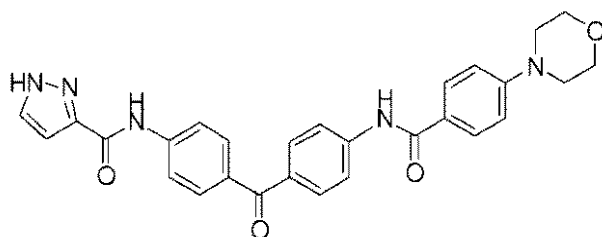
と添加した。完了したら、反応物をさらに 12 時間攪拌させ、次に、減圧下でろ過した。褐色の沈殿物を水 (50 mL)、メタノール (50 mL) で洗浄し、減圧下で乾燥させて、化合物 683 (1.2 g、2.48 mmol) を褐色の固体として得た。[M+H]⁺ C₂₉H₃₀N₃O₄ についての計算値：484.22；実測値：484.01。

【0869】

実施例 584

N-(4-(4-(4-モルホリノベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド (化合物 684)

【化720】



10

スキーム IV に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、3-ピラゾールカルボン酸および 4-モルホリノ安息香酸から化合物 684 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₅N₅O₄ についての計算値：496.05；実測値：496.02。

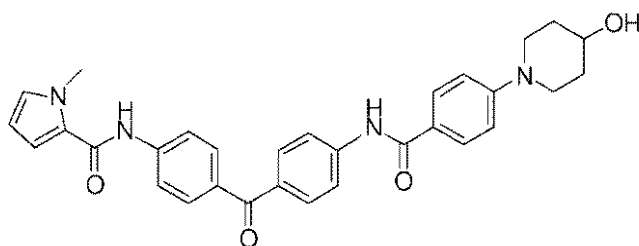
20

【0870】

実施例 585

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 685)

【化721】



30

スキーム IV に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、1-メチル-2-ピロールカルボン酸および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 685 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀N₄O₄ についての計算値：523.12；実測値：523.09。

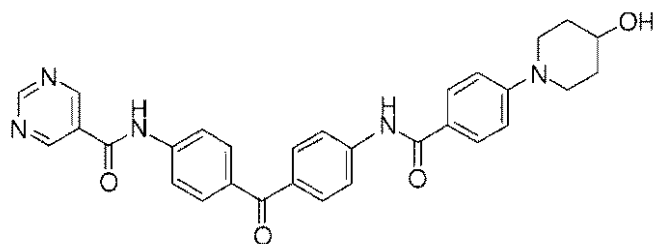
【0871】

実施例 586

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)ピリミジン-5-カルボキサミド (化合物 686)

40

【化 7 2 2】



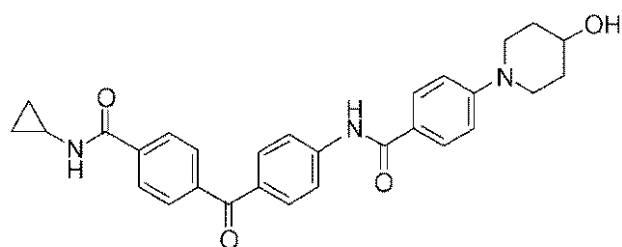
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、ピリミジン-5-カルボン酸および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 686 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₇N₅O₄ についての計算値：522.09；実測値：522.08。

【0872】

実施例 587

N-シクロプロピル-4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)ベンズアミド (化合物 687)

【化 7 2 3】



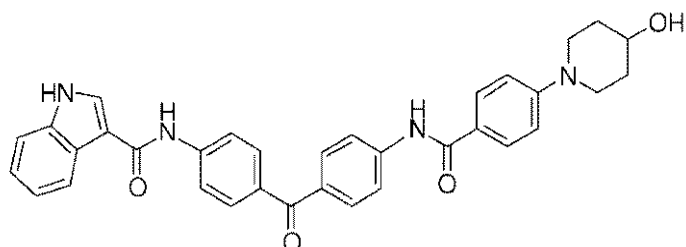
スキーム I V に表される手順にしたがって、N-シクロプロピル-4-(4-アミノベンゾイル)ベンズアミドおよび4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 687 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₀N₃O₄ についての計算値：484.22；実測値：484.08。

【0873】

実施例 588

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1H-インドリル-3-カルボキサミド (化合物 688)

【化 7 2 4】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、3-インドールカルボン酸および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 688 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₀N₄O₄ についての計算値：559.15；実測値：559.14。

【0874】

実施例 589

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾ

10

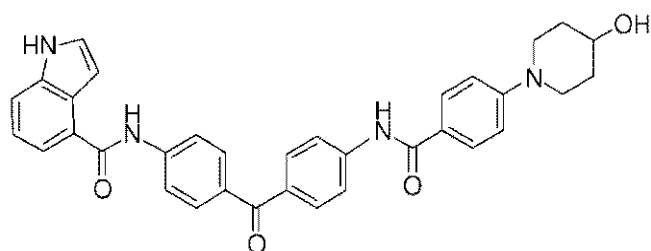
20

30

40

50

イル) フェニル) - 1H-インドリル-4-カルボキサミド (化合物 689)
【化 7 2 5】



10

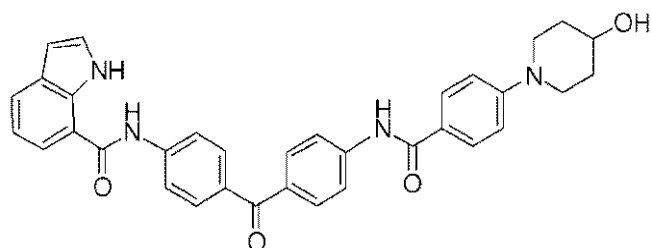
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、4-インドールカルボン酸および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 689 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₀N₄O₄ についての計算値: 559.15; 実測値: 559.14。

【0875】

実施例 590

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1H-インドリル-7-カルボキサミド (化合物 690)

【化 7 2 6】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、7-インドールカルボン酸および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 690 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₀N₄O₄ についての計算値: 559.15; 実測値: 559.07。

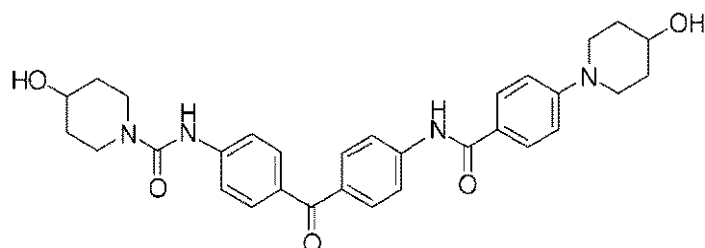
30

【0876】

実施例 591

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボキサミド (化合物 691)

【化 7 2 7】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、4-ヒドロキシピペリジン、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 691 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₅N₄O₅ についての計算値: 543.26; 実測値: 543.07。

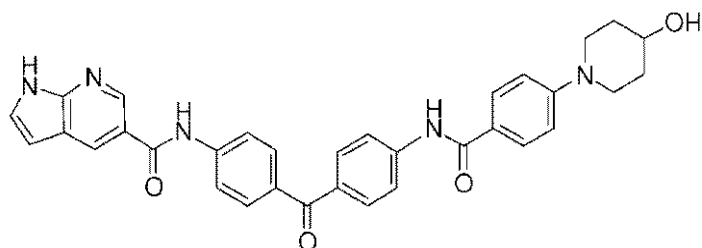
【0877】

実施例 592

50

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-カルボキサミド(化合物692)

【化728】



10

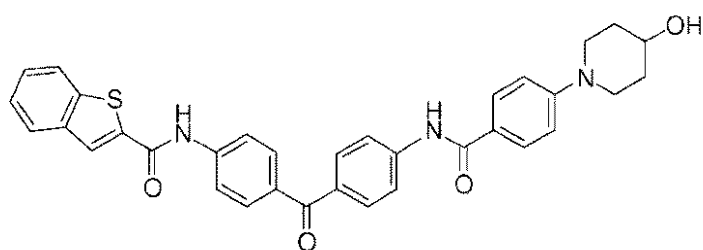
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-カルボン酸および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物692を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₂₉N₅O₄についての計算値: 560.14; 実測値: 560.08。

【0878】

実施例593

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボキサミド(化合物693)

【化729】



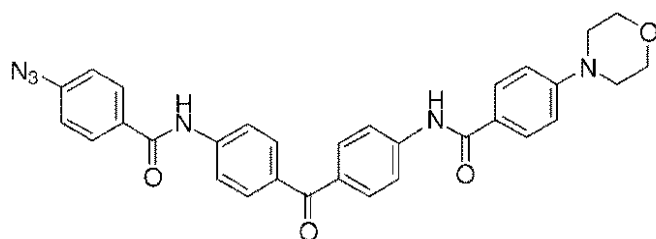
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、2-ベンゾチオフェンカルボン酸および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物693を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₂₉N₃O₄Sについての計算値: 576.20; 実測値: 576.08。

【0879】

実施例594

4-アジド-N-(4-(4-(4-(4-モルホリノベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド(化合物694)

【化730】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、4-アジド安息香酸および4-モルホリノ安息香酸から化合物694を調製した。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 10.56 (s, 1H)、10.28 (s, 1H)、8.04 (d, J=8.8 Hz, 2H)、7.97 (d, J=9.0 Hz, 2H)、7.96 (d, J=8.8 Hz, 2H)、7.91 (d, J=9.0 Hz, 2H)、7.

50

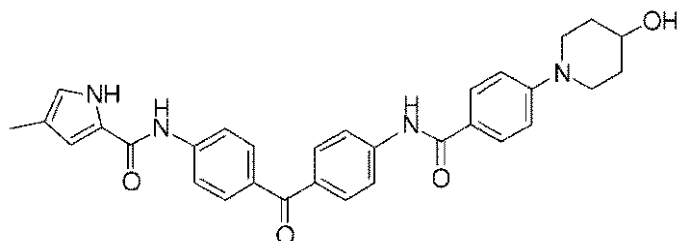
7.6 (d, J = 8.5 Hz, 2H)、7.74 (d, J = 8.8 Hz, 2H)、7.28 (d, J = 8.5 Hz, 2H)、7.03 (d, J = 9.0 Hz, 2H)、3.75 ~ 3.73 (m, 4H)、3.27 ~ 3.25 (m, 4H)。

【0880】

実施例 595

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-4-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 695)

【化731】



10

スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、4-メチル-2-ピロールカルボン酸および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 695 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀N₄O₄ についての計算値: 523.12; 実測値: 523.09。

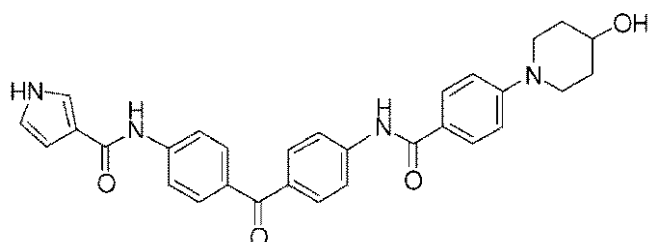
20

【0881】

実施例 596

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 696)

【化732】



30

スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、3-ピロールカルボン酸および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 696 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₈N₄O₄ についての計算値: 509.09; 実測値: 509.05。

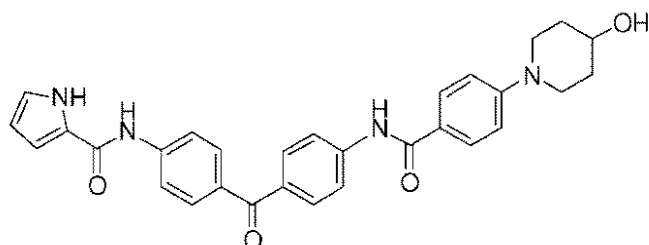
【0882】

実施例 597

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 697)

40

【化733】



50

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、2-ピロールカルボン酸および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 697 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₈N₄O₄ についての計算値：509.09；実測値：509.05。

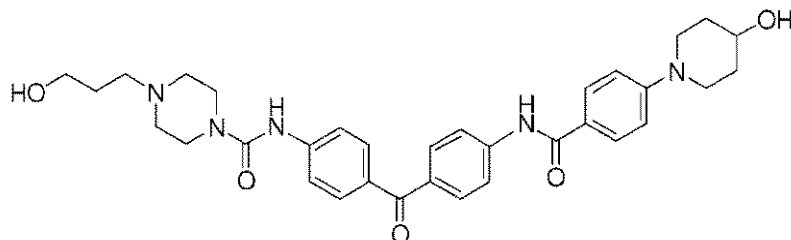
【0883】

実施例 598

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-4-(3-ヒドロキシプロピル)ピペラジン-1-カルボキサミド (化合物 698)

【化 734】

10



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、4-(3-ヒドロキシプロピル)ピペラジン、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 698 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₄₀N₅O₅ についての計算値：586.30；実測値：586.20。

20

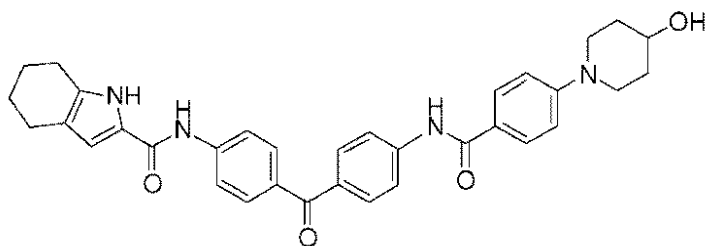
【0884】

実施例 599

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-1H-インドール-2-カルボキサミド (化合物 699)

【化 735】

30



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、4, 5, 6, 7-テトラヒドロインドール-2-カルボン酸および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 699 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₄N₄O₄ についての計算値：563.18；実測値：563.19。

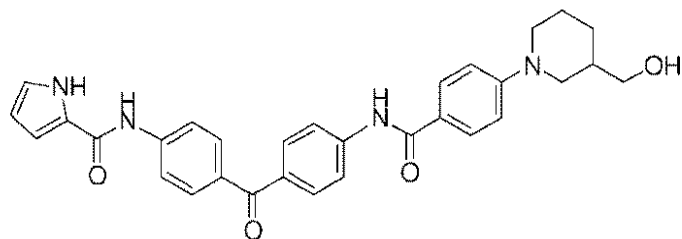
40

【0885】

実施例 600

(±)-N-(4-(4-(4-(3-(ヒドロキシメチル)ピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 700)

【化 7 3 6】



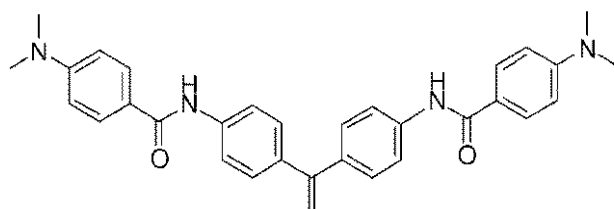
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、2-ピロールカルボン酸および 4-(3-ヒドロキシメチルピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 700 を調製した。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 10.25 (s, 1H)、10.07 (s, 1H)、7.98 (dd, J=9.0、10 Hz、4H)、7.91 (d, J=9.0 Hz、2H)、7.77 (dd, J=1.6、8.7 Hz、4H)、7.16 (bm, 1H)、7.02 (s, 1H)、7.01 (d, J=9.0 Hz、2H)、6.22 (m, 1H)、4.59 (t, J=5.3 Hz、1H)、1H)、3.88 (m, 2H)、2.86 (t, J=12 Hz、1H)、1.75 (m, 4H)、1.54 (m, 2H)、1.21 (m, 2H)。

【0886】

実施例 601

N, N'-(エテン-1, 1-ジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド) (化合物 701)

【化 7 3 7】



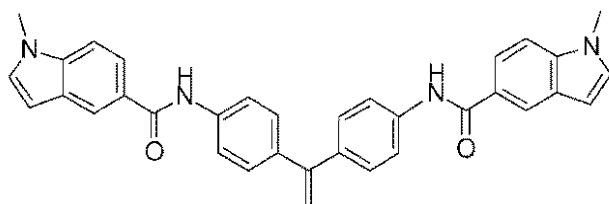
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-(エテン-1, 1-ジイル)ジアニリンおよび 4-N, N-ジメチルアミノ安息香酸から化合物 701 を調製した。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 9.94 (s, 2H)、7.86 (d, J=8.8 Hz、4H)、7.77 (d, J=8.5 Hz、4H)、7.26 (d, J=8.3 Hz、4H)、6.75 (d, J=8.8 Hz、4H)、5.38 (s, 2H)、2.99 (s, 12H)。

【0887】

実施例 602

N, N'-(エテン-1, 1-ジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(1-メチル-1H-インドール-5-カルボキサミド) (化合物 702)

【化 7 3 8】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-(エテン-1, 1-ジイル)ジアニリンおよび 1-メチルインドール-5-カルボン酸から化合物 702 を調製した。¹

¹H NMR (500 MHz、CDCl₃) δ 8.20 (s, 2H)、7.93 (s, 2H)、7.79 (dd, J=1.7、8.5 Hz、2H)、7.66 (dd, J=1.7、6.8 Hz、4H)、7.42 (d, J=2.3 Hz、2H)、7.39 (d, J=8.5 Hz、4H)、7.15 (d, J=2.3 Hz、2H)、6.61 (d, J=2.9 Hz、2H)、5.44 (s, 2H)、3.86 (s, 6H)。

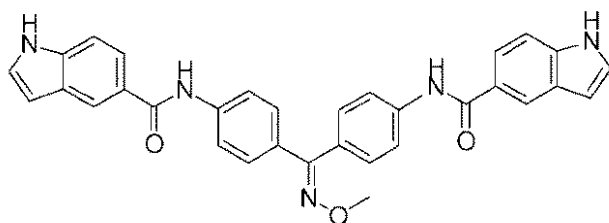
【0888】

実施例603

N, N'-((メトキシイミノ) メチレン) ビス(4, 1-フェニレン) ビス(1H-インドール-5-カルボキサミド) (化合物703)

【化739】

10



スキームIVに表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノンおよび1-メチルインドール-5-カルボン酸から化合物703を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₂₅N₅O₃ についての計算値: 528.10; 実測値: 528.15。

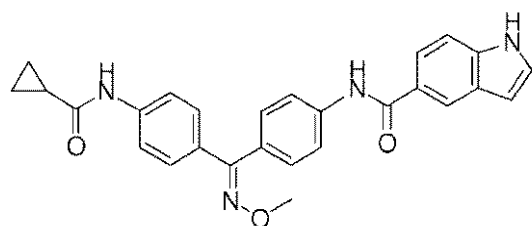
20

【0889】

実施例604

(Z/E)-N-(4-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)(メトキシイミノ)メチル)フェニル-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物704)

【化740】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、シクロプロパンカルボン酸、およびインドール-5-カルボン酸から化合物704を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₄N₄O₃ についての計算値: 453.03; 実測値: 453.03。

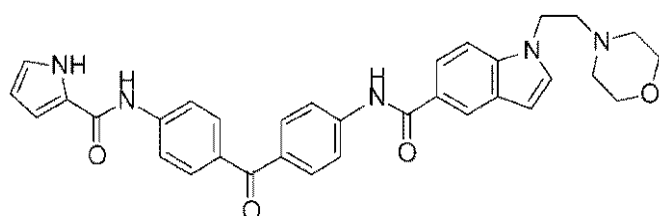
【0890】

実施例605

N-(4-(4-(1H-ピロール-2-カルボキサミド)ベンゾイル)フェニル)-1-(2-モルホリノエチル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物705)

40

【化741】



スキームIVに表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、2-

50

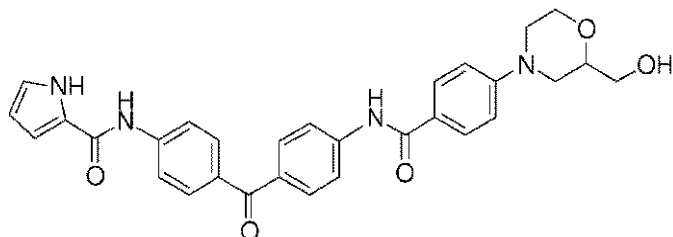
ピロールカルボン酸、および 1-(2-モルホリノエチル)インドール-5-カルボン酸から化合物 705 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₁N₅O₄ についての計算値：562.16；実測値：562.11。

【0891】

実施例 606

(±)-N-(4-(4-(4-(2-(ヒドロキシメチル)モルホリノ)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 706)

【化 742】



10

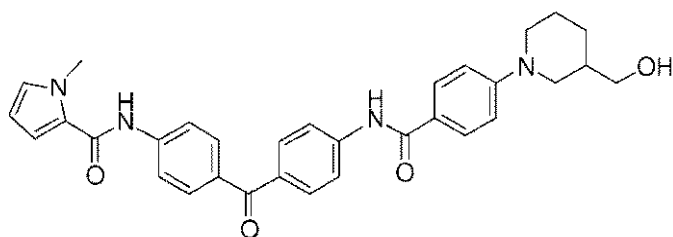
スキーム IV に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、2-ピロールカルボン酸、および 4-(2-ヒドロキシメチル)モルホリノ-4'-安息香酸から化合物 706 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₈N₄O₅ についての計算値：525.21；実測値：524.98。

【0892】

実施例 607

(±)-N-(4-(4-(4-(3-(ヒドロキシメチル)ピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 707)

【化 743】



30

スキーム IV に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、1-メチル-2-ピロールカルボン酸、および 4-(3-ヒドロキシメチルピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 707 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₂N₄O₄ についての計算値：537.24；実測値：537.06。

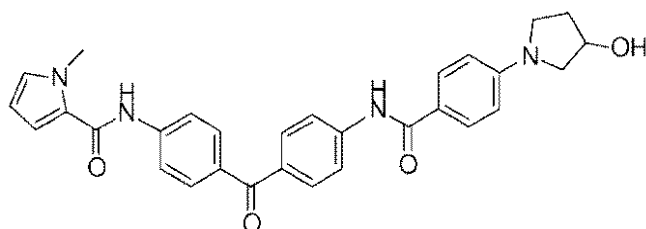
【0893】

実施例 608

(±)-N-(4-(4-(4-(3-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 708)

40

【化 7 4 4】



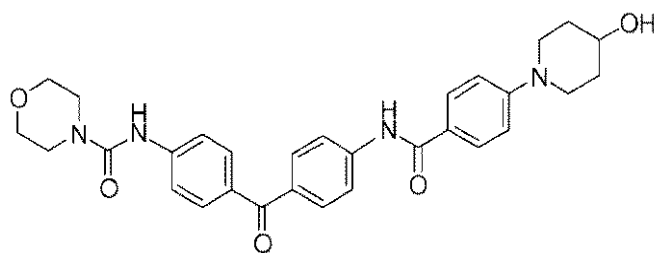
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、1-メチル-2-ピロールカルボン酸、および 4-(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)安息香酸から化合物 708 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₈N₄O₄ についての計算値：509.21；実測値：508.98。

【0894】

実施例 609

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-4-モルホリンカルボキサミド (化合物 709)

【化 7 4 5】



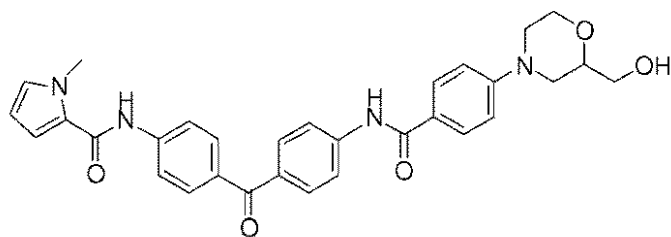
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、モルホリン、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 709 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₂N₄O₅ についての計算値：529.12；実測値：529.03。

【0895】

実施例 610

(±)-N-(4-(4-(4-(2-(ヒドロキシメチル)モルホリノ)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 710)

【化 7 4 6】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、1-メチル-2-ピロールカルボン酸、および 4-(2-ヒドロキシメチル)モルホリノ-4-安息香酸から化合物 710 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀N₄O₅ についての計算値：539.22；実測値：539.02。

【0896】

実施例 611

10

20

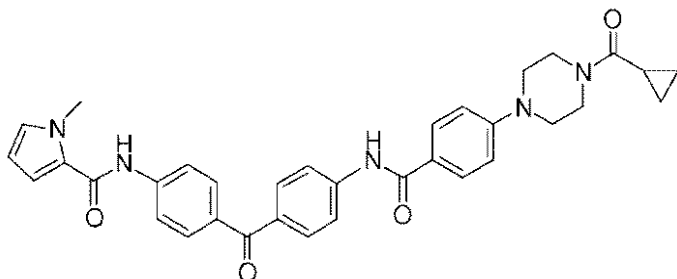
30

40

50

N-(4-(4-(4-(4-(シクロプロパンカルボニル)ピペラジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 711)

【化 747】



10

スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、1-メチル-2-ピロールカルボン酸、および 4-(4-シクロプロパンカルボニル)ピペラジノ安息香酸から化合物 711 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₃N₅O₄ についての計算値：576.25；実測値：576.08。

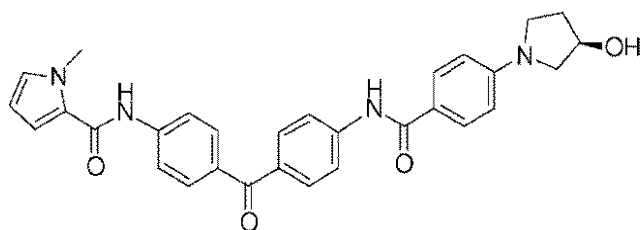
【0897】

実施例 612

(R)-N-(4-(4-(4-(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 712)

20

【化 748】



30

スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、1-メチル-2-ピロールカルボン酸、および (R)-4-(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)安息香酸から化合物 712 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₈N₄O₄ についての計算値：509.21；実測値：508.98。

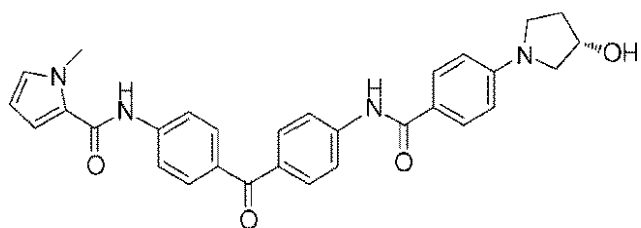
【0898】

実施例 613

(S)-N-(4-(4-(4-(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 713)

40

【化 749】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、1-

50

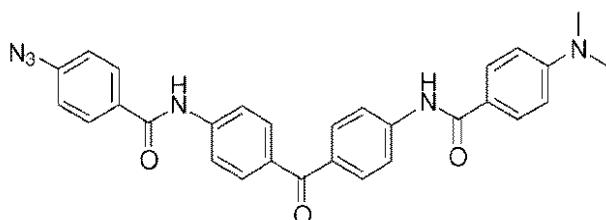
メチル-2-ピロールカルボン酸、および (S)-4-(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)安息香酸から化合物713を調製した。¹H NMR (400 MHz、アセトン-d₆) δ 9.49 (s, 1H)、9.38 (s, 1H)、8.02 (d, J=8.8 Hz, 2H)、7.95 (t, J=9 Hz, 3H)、7.78 (d, J=7 Hz, 3H)、7.03 (dd, J=2, 4 Hz, 1H)、6.97 (t, J=2 Hz, 1H)、6.61 (d, J=9 Hz, 2H)、6.11 (dd, J=2.5, 4 Hz, 1H)、4.60 (m, 1H)、3.99 (s, 3H)、3.59~3.42 (m, 3H)、3.31 (m, 1H)、2.20~2.14 (m, 3H)。

【0899】

実施例614

4-アジド-N-(4-(4-(4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)ベンズアミド (化合物714)

【化750】



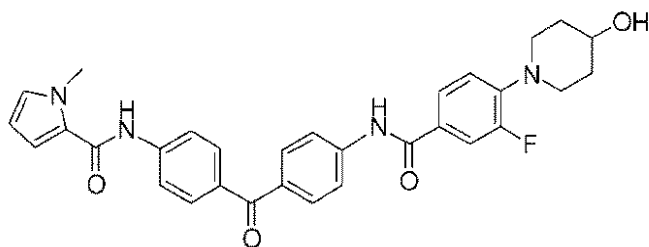
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、4-アジド安息香酸、および4-ジメチルアミノ安息香酸から化合物714を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₄N₆O₃ についての計算値: 505.19; 実測値 504.93。

【0900】

実施例615

N-(4-(4-(3-フルオロ-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物715)

【化751】



スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、1-メチル-2-ピロールカルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-3-フルオロ安息香酸から化合物715を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₉FN₄O₄ についての計算値: 541.22; 実測値: 541.05。

【0901】

実施例616

(E/Z)-N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)(メトキシイミノ)メチル)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物716)

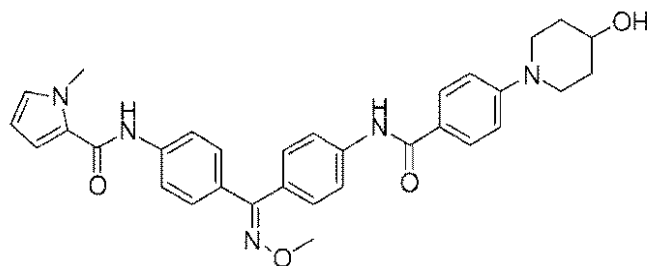
10

20

30

40

【化 7 5 2】



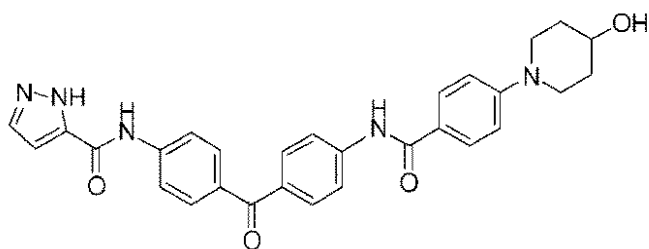
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、1-メチル-2-ピロールカルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 716 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₃N₅O₄ についての計算値：552.16；実測値：552.05。

【0902】

実施例 617

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (化合物 717)

【化 7 5 3】



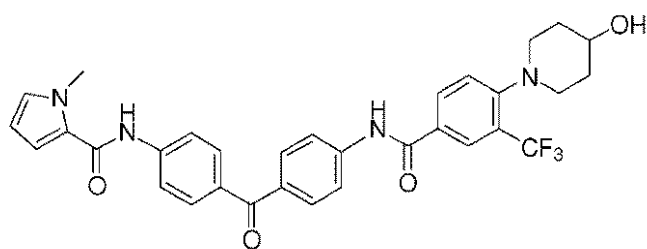
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、5-ピラゾールカルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 717 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₇N₅O₄ についての計算値：510.18；実測値：509.99。

【0903】

実施例 618

N-(4-(4-(3-トリフルオロメチル-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 718)

【化 7 5 4】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、1-メチル-2-ピロールカルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-3-トリフルオロメチル安息香酸から化合物 718 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₀F₃N₄O₄ についての計算値：591.22；実測値：591.07。

【0904】

実施例 619

10

20

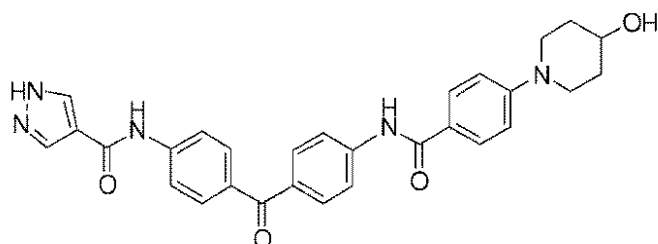
30

40

50

N-（4-（4-（4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド）ベンゾイル）フェニル）-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド（化合物719）

【化755】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、4-ピラゾールカルボン酸、および4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物719を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₇N₅O₄についての計算値：510.18；実測値：509.99。

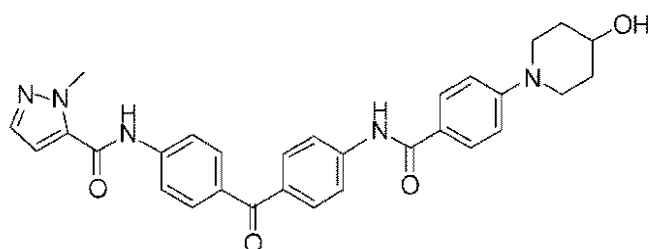
【0905】

実施例620

N-（4-（4-（4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド）ベンゾイル）フェニル）-1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド（化合物720）

20

【化756】



スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、1-メチル-5-ピラゾールカルボン酸、および4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物720を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₉N₅O₄についての計算値：524.11；実測値：524.03。

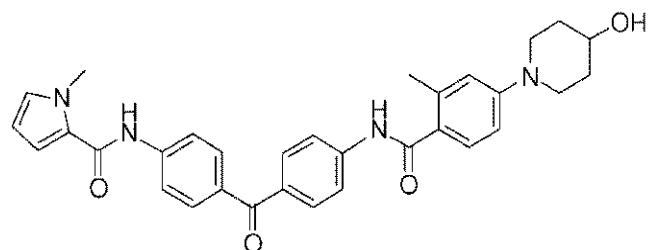
30

【0906】

実施例621

N-（4-（4-（2-メチル-4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド）ベンゾイル）フェニル）-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド（化合物721）

【化757】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、1-メチル-2-ピロールカルボン酸、および4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）-2-メチル安息香酸から化合物721を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₃N₄O

50

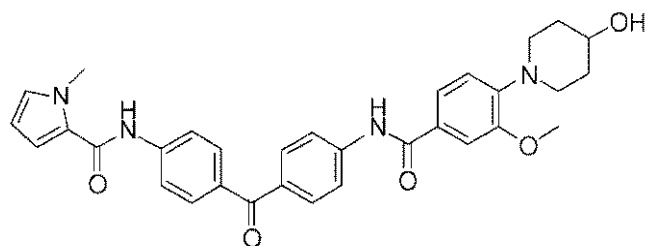
₄ についての計算値：537.25；実測値：537.06。

【0907】

実施例622

N-(4-(4-(3-メトキシ-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド(化合物722)

【化758】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、1-メチル-2-ピロールカルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-3-メトキシ安息香酸から化合物722を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{32}H_{33}N_4O_5$ についての計算値：553.25；実測値：553.06。

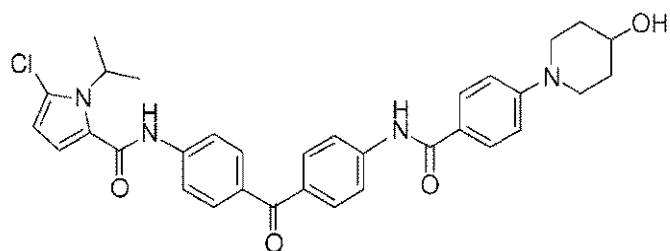
【0908】

20

実施例623

5-クロロ-N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-イソプロピル-1H-ピロール-2-カルボキサミド(化合物723)

【化759】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、5-クロロ-1-イソプロピル-2-ピロールカルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-3-トリフルオロメチル安息香酸から化合物723を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{33}H_{33}ClN_4O_4$ についての計算値：585.22；実測値：585.06。

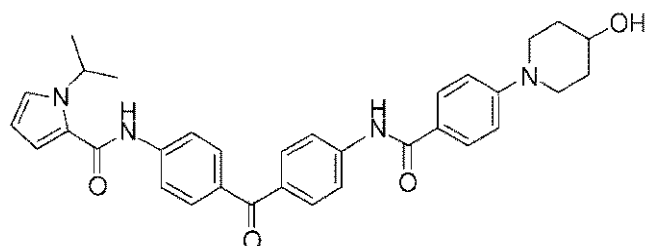
【0909】

実施例624

40

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-イソプロピル-1H-ピロール-2-カルボキサミド(化合物724)

【化 7 6 0】



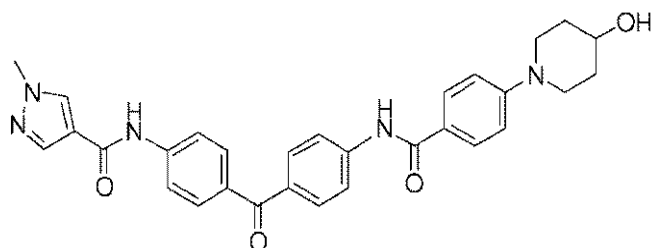
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、1-イソプロピル-2-ピロールカルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-3-トリフルオロメチル安息香酸から化合物 7 2 4 を調製した。¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.93~7.81 (m, 10H)、7.22 (dd, J = 1.7、2.7 Hz、1H)、7.05 (d, J = 9 Hz、2H)、7.00 (dd, J = 1.7、4 Hz、1H)、6.22 (dd, J = 2.7、4 Hz、1H)、5.51 (s, 1H)、3.84 (m, 3H)、3.10 (m, 2H)、1.9 (m, 2H)、1.64 (m, 2H)、1.50 (s, 3H)、1.48 (s, 3H)。

【0 9 1 0】

実施例 6 2 5

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド (化合物 7 2 5)

【化 7 6 1】



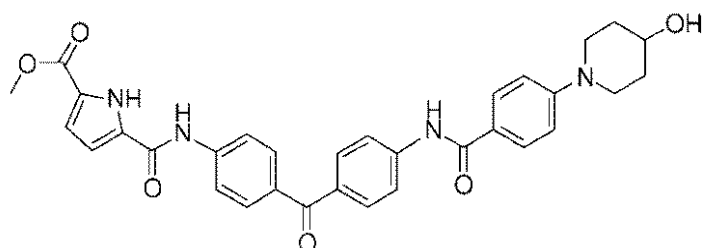
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、1-メチル-4-ピラゾールカルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 7 2 5 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₉N₅O₄ についての計算値：524.11；実測値：524.03。

【0 9 1 1】

実施例 6 2 6

メチル 5-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)カルバモイル)-1H-ピロール-2-カルボキシレート (化合物 7 2 6)

【化 7 6 2】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、1-

10

20

30

40

50

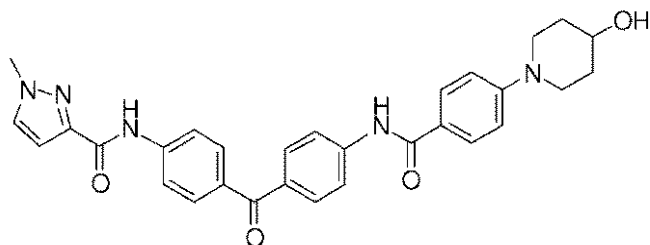
イソプロピル-2-ピロールカルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-3-トリフルオロメチル安息香酸から化合物726を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₀N₄O₆ についての計算値：567.13；実測値：567.04。

【0912】

実施例627

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド(化合物727)

【化763】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、1-メチル-3-ピラゾールカルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物727を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₉N₅O₄ についての計算値：524.11；実測値：524.03。

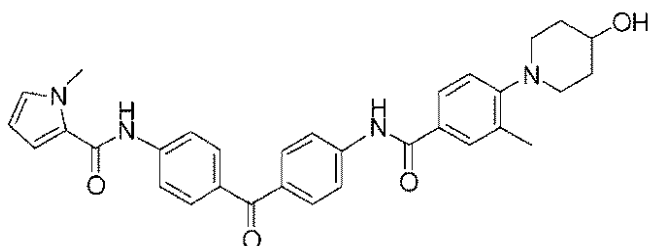
20

【0913】

実施例628

N-(4-(4-(3-メチル-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド(化合物728)

【化764】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、1-メチル-2-ピロールカルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-3-メチル安息香酸から化合物728を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₃N₄O₄ についての計算値：537.25；実測値：537.11。

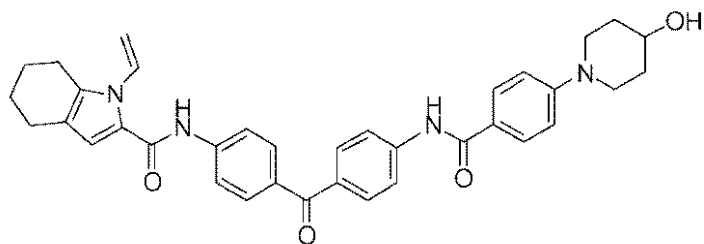
【0914】

実施例629

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-ビニル-4,5,6,7-テトラヒドロ-1H-インドール-2-カルボキサミド(化合物729)

40

【化 7 6 5】



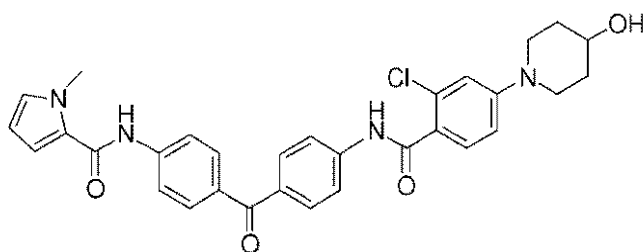
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、1-
 ビニル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロインドール-2-カルボン酸、および4-(4-
 ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物729を調製した。[M+H]⁺
 $C_{36}H_{36}N_4O_4$ についての計算値: 589.27; 実測値: 589.12。

【0915】

実施例 630

N-(4-(4-(2-クロロ-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化
 合物730)

【化 7 6 6】



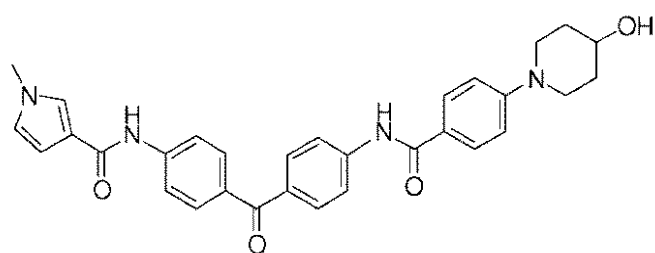
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、1-
 メチル-2-ピロールカルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-
 2-クロロ安息香酸から化合物730を調製した。[M+H]⁺ $C_{31}H_{30}ClN_4O_4$ についての計算値: 557.20; 実測値: 556.98。

【0916】

実施例 631

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化
 合物731)

【化 7 6 7】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、1-
 メチル-3-ピロールカルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)
 安息香酸から化合物731を調製した。[M+H]⁺ $C_{31}H_{30}N_4O_4$ についての
 計算値: 523.12; 実測値: 522.95。

【0917】

実施例 632

10

20

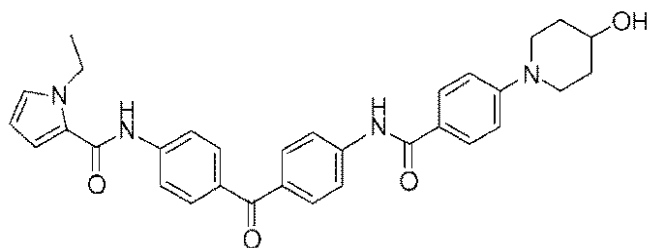
30

40

50

N-(4-(4-(2-クロロ-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-エチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド(化合物732)

【化768】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、1-エチル-2-ピロールカルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物732を調製した。¹H NMR(400MHz、CD₃OD) δ 7.89~7.79(m, 10H)、7.02(m, 4H)、6.15(m, 1H)、4.41(q, J=7.5Hz、2H)、3.82(m, 3H)、3.07(dt, J=3、13Hz、2H)、1.96(m, 2H)、1.60(m, 2H)、1.39(t, J=7.1Hz、3H)。

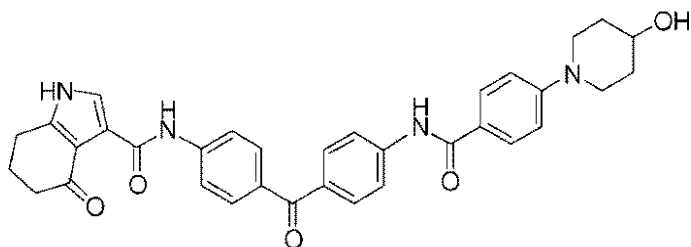
【0918】

20

実施例633

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-4-オキソ-4,5,6,7-テトラヒドロ-1H-インドール-3-カルボキサミド(化合物733)

【化769】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノベンゾフェノン、4-オキソ-4,5,6,7-テトラヒドロインドール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物733を調製した。¹H NMR(500MHz、DMSO-d₆) δ 12.91(s, 1H)、12.20(s, 1H)、10.24(s, 1H)、7.98(d, J=14Hz、2H)、7.90(q, J=2、14Hz、4H)、7.79(m, 4H)、7.62(s, 1H)、7.03(d, J=10Hz、2H)、4.72(d, J=8Hz、1H)、3.73(m, 3H)、3.06(m, 2H)、2.89(t, J=8、10Hz、2H)、2.61(m, 2H)、2.11(m, 2H)、1.82(m, 2H)、1.47(m, 2H)。

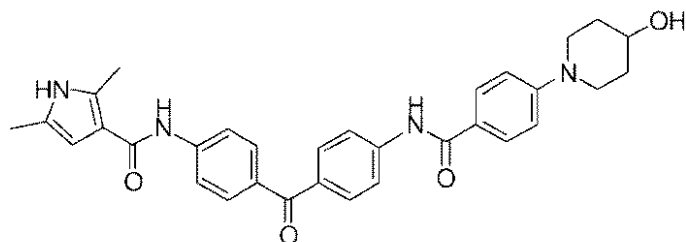
40

【0919】

実施例634

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-2,5-ジメチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド(化合物734)

【化 7 7 0】



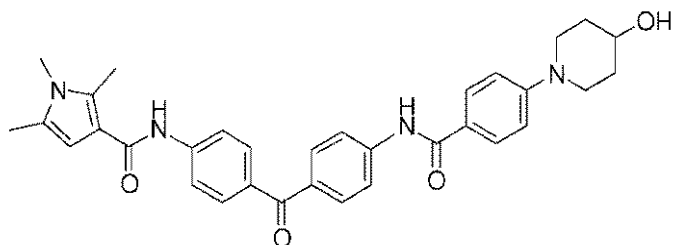
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、2, 5-ジメチル-3-ピロールカルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 734 を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 10.99 (s, 1H)、10.23 (s, 1H)、9.52 (s, 1H)、7.98 (dd, J = 12、12 Hz、4H)、7.89 (d, J = 8 Hz、2H)、7.72 (dd, J = 8、12 Hz、4H)、7.02 (d, J = 10 Hz、2H)、6.40 (s, 1H)、4.71 (d, J = 3 Hz、1H)、3.72 (m, 3H)、3.05 (m, 2H)、1.83 (m, 2H)、1.45 (m, 2H)。

【0920】

実施例 635

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1, 2, 5-トリメチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 735)

【化 7 7 1】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、1, 2, 5-トリメチル-3-ピロールカルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 735 を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 10.24 (s, 1H)、9.57 (s, 1H)、7.98 (dd, J = 10、16 Hz、4H)、7.89 (d, J = 8 Hz、2H)、7.72 (dd, J = 10、12 Hz、4H)、7.02 (d, J = 8 Hz、2H)、6.49 (s, 1H)、4.71 (d, J = 4 Hz、1H)、3.72 (m, 3H)、3.41 (s, 3H)、3.06 (m, 2H)、1.86 (m, 2H)、1.48 (m, 2H)。

【0921】

実施例 636

N-(4-(4-(2-クロロ-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-シアノメチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 736)

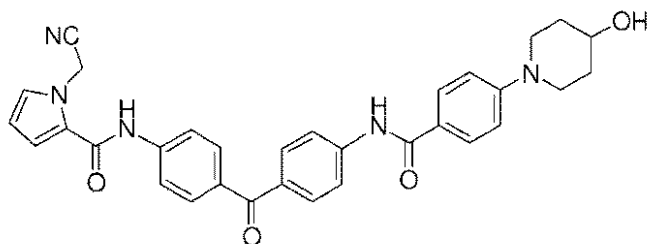
10

20

30

40

【化 7 7 2】



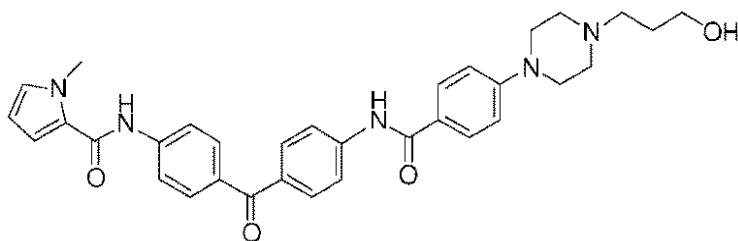
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、1-シアノメチル-2-ピロールカルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 736 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₂₉N₅O₄ についての計算値：548.22；実測値：548.07。

【0922】

実施例 637

N-(4-(4-(4-(4-(3-ヒドロキシプロピル)ピペラジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 737)

【化 7 7 3】



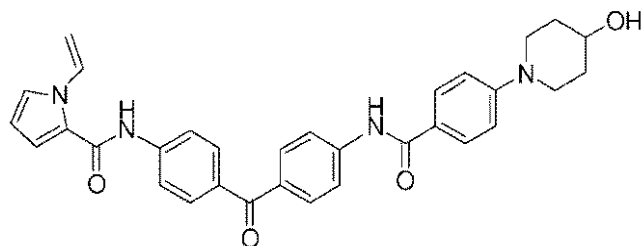
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、1-エチル-2-ピロールカルボン酸、および 4-(4-(3-ヒドロキシプロピル)ピペラジン-1-イル)安息香酸から化合物 737 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₆N₅O₄ についての計算値：566.28；実測値：566.12。

【0923】

実施例 638

N-(4-(4-(2-クロロ-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンゾイル)フェニル)-1-ビニル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 738)

【化 7 7 4】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノベンゾフェノン、1-ビニル-2-ピロールカルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 738 を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 10.38 (s, 1H)、10.35 (s, 1H)、7.99 (d, J=8 Hz、2H)、7.90 (m, 4H)、7.77 (d, J=10 Hz、4H)、7.63 (s, 1H

10

20

30

40

50

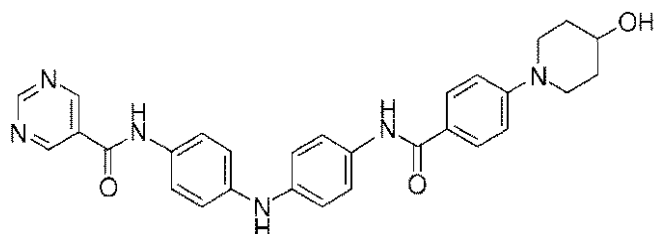
)、7.20 (s, 1H)、7.02 (d, J=10 Hz、2H)、6.34 (s, 1H)、5.42 (d, J=12 Hz、1H)、4.88 (d, J=8 Hz、1H)、4.71 (d, J=4 Hz、1H)、3.81 (m, 3H)、3.05 (m, 2H)、1.83 (m, 2H)、1.47 (m, 2H)。

【0924】

実施例639

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)ピリミジン-5-カルボキサミド(化合物739)

【化775】



スキームIVに表される一般的な手順にしたがって、化合物739を調製した。N-(4-ニトロフェニル)ベンゼン-1,4-ジアミンの調製：ベンゼン-1,4-ジアミン(5.4g、50mmol)および1-フルオロ-4-ニトロベンゼン(5.3mL、50mmol)を75mLのジメチルスルホキシドに溶解させ、炭酸カリウム(13.8g、100mmol)を添加した。反応混合物を油浴中90℃で加熱し、窒素雰囲気下で一晩撹拌した。反応混合物を室温まで冷まし、ゆっくりとした流れの中で250mLの水に添加し、固体が析出されるまで撹拌した。反応混合物をろ過して取り除き、得られた暗褐色の固体を大量の水で洗浄した。ヘキサン中20%~40%の酢酸エチルで溶離されるシリカゲル上でのフラッシュカラムクロマトグラフィーにより、表題化合物(6.1g、53%の収率)を得た。

【0925】

4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(4-(4-ニトロフェニル)アミノ)フェニル)-ベンズアミドの調製：N-4-(4-ニトロフェニル)ベンゼン-1,4-ジアミン(1.15g、5.0mmol)および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸(1.2g、5.5mmol)を20mLのピリジンに溶解させ、EDCI(1.2g、6.0mmol)を添加し、室温で、窒素雰囲気下で一晩撹拌した。水(80mL)を添加し、固体が析出されるまで混合物をさらに15分間撹拌した。反応混合物をろ過し、得られた赤色の固体を、水、酢酸エチル、およびヘキサンで洗浄してから乾燥させて、表題化合物(1.6g、80%の収率)を得た。この化合物をさらに全く精製せずに次の工程に使用した。

【0926】

化合物739の調製：4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(4-(4-ニトロフェニル)アミノ)フェニル)-ベンズアミド(1.8g、4.2mmol)を、無水エタノール(75mL)中の水酸化パラジウム(1.6g)を用いて水素化した。反応混合物を水素ガスのバルーン下で一晩撹拌した。それをセライトを通してろ過し、蒸発乾固させて、98%より高い純度の4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(4-(4-ニトロフェニル)アミノ)フェニル)-ベンズアミド(1.6g、95%の収率)を得た。生成物(22mg、0.05mmol)およびピリミジン-4-カルボン酸(8mg、0.06mmol)の一部を、1mLのピリジンに溶解させ、EDCI(19mg、0.1mmol)を添加した。反応混合物を、室温で、窒素雰囲気下で一晩撹拌した。水(5mL)を添加し、固体が析出されるまで混合物をさらに15分間撹拌した。反応混合物をろ過し、得られた赤色の固体を、水、酢酸エチル、ヘキサンで洗浄してから乾燥させて、粗化合物739(20mg、78%の収率)を得た。最終的な試料にするために分取HPLCを用いてさらなる精製を行った。[M+H]⁺ C₂₉H₂₈N₆

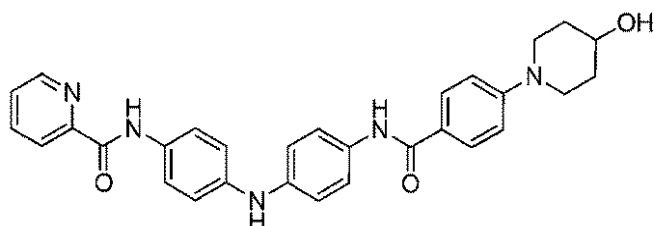
O₃ についての計算値：509.22；実測値508.98。

【0927】

実施例640

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)ニコチンアミド(化合物740)

【化776】



10

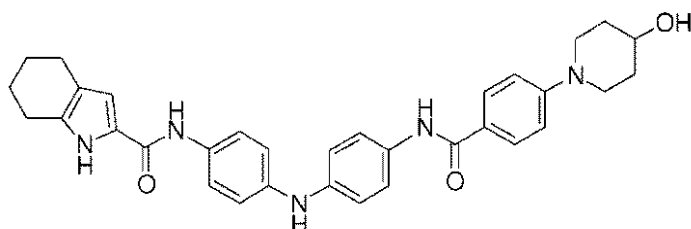
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、ニコチン酸および4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物740を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₉N₅O₃についての計算値：508.23；実測値507.97。

【0928】

実施例641

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-1H-インドール-2-カルボキサミド(化合物741)

【化777】



30

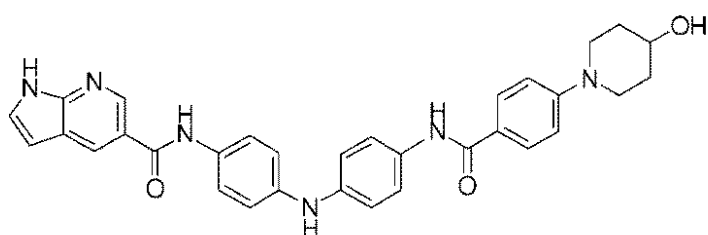
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、4,5,6,7-テトラヒドロ-1H-インドール-2-カルボン酸、および4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物741を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₅N₅O₃についての計算値：550.27；実測値550.09。

【0929】

実施例642

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-カルボキサミド(化合物742)

【化778】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1

50

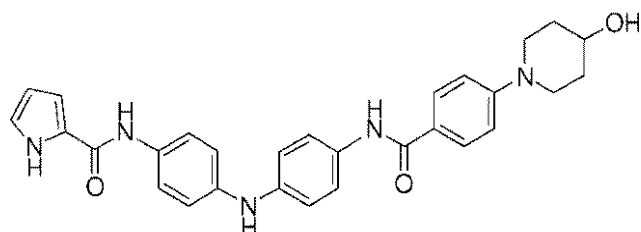
H-ピロロ [2, 3-b] ピリジン-5-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物742を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₀N₆O₃ についての計算値: 547.24; 実測値547.12。

【0930】

実施例643

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド(化合物743)

【化779】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物743を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₉N₅O₃ についての計算値: 496.23; 実測値496.02。

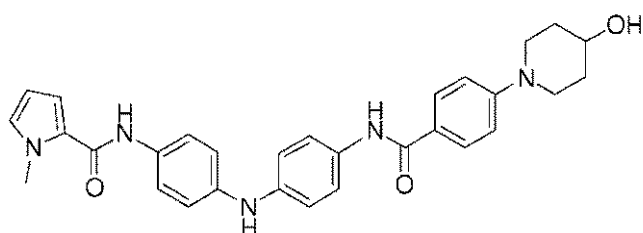
20

【0931】

実施例644

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド(化合物744)

【化780】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチルピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物744を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₁N₅O₃ についての計算値: 510.24; 実測値519.99。

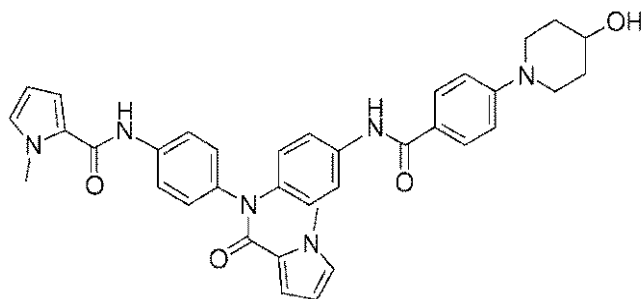
【0932】

実施例645

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)-1-メチル-N-(4-(1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド)フェニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド(化合物745)

40

【化 7 8 1】



10

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチルピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 745 を調製した。[M+H]⁺ C₃₆H₃₆N₆O₄ についての計算値: 617.28; 実測値 617.27。

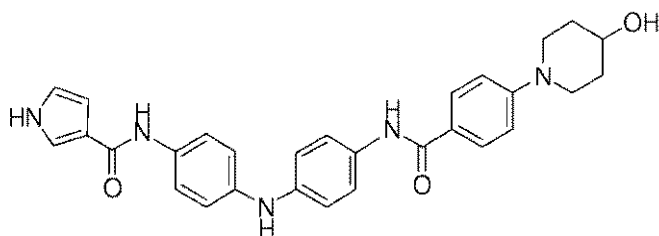
【0933】

実施例 646

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 746)

【化 7 8 2】

20



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1H-ピロール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 746 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₉N₅O₃ についての計算値: 496.23; 実測値 496.02。

30

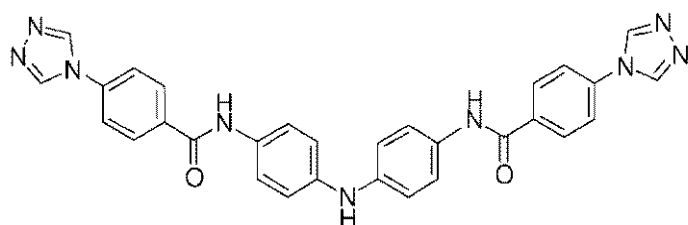
【0934】

実施例 647

N, N'-(アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(4H-1, 2, 4-トリアゾール-4-イル)ベンズアミド) (化合物 747)

【化 7 8 3】

40



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび4-(4H-1, 2, 4-トリアゾール-4-イル)安息香酸から化合物 747 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₃N₉O₂ についての計算値: 542.20; 実測値 541.99。

【0935】

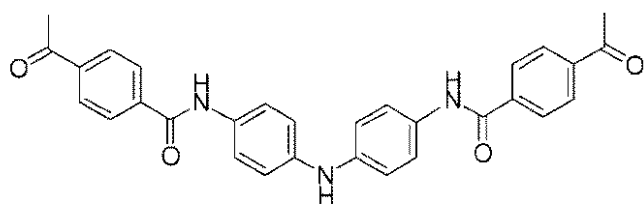
実施例 648

N, N'-(アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-アセチルベンズアミ

50

ド) (化合物 748)

【化 784】



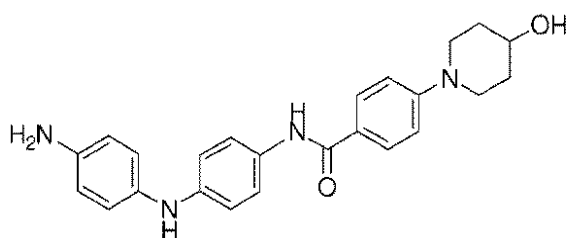
スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-アセチル安息香酸から化合物 748 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₅N₃O₄ についての計算値：492.18；実測値 492.00。

【0936】

実施例 649

N-(4-((4-アミノフェニル)アミノ)フェニル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 749)

【化 785】



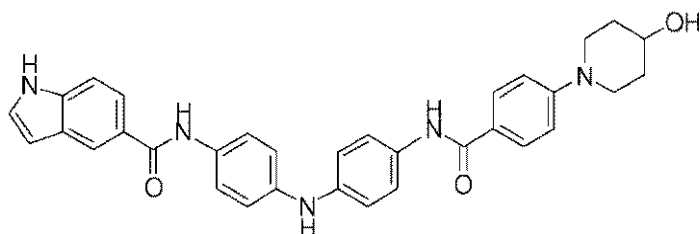
スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 749 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₆N₄O₃ についての計算値：403.21；実測値 403.04。

【0937】

実施例 650

N-(4-((4-((4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 750)

【化 786】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1H-インドール-5-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 750 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₁N₅O₃ についての計算値：546.24；実測値 546.04。

【0938】

実施例 651

N-(4-((4-((4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-インドール-6-カルボキサミド (化合物 751)

10

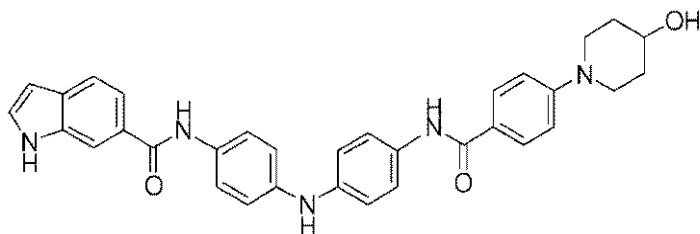
20

30

40

50

【化 7 8 7】



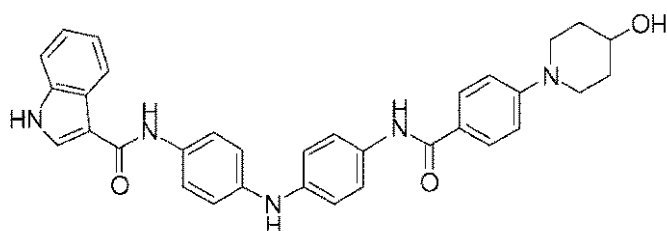
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1 H-インドール-6-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 7 5 1 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₁N₅O₃ についての計算値：546.24；実測値 546.11。

【0939】

実施例 6 5 2

N-(4-((4-((4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-インドール-3-カルボキサミド (化合物 7 5 2)

【化 7 8 8】



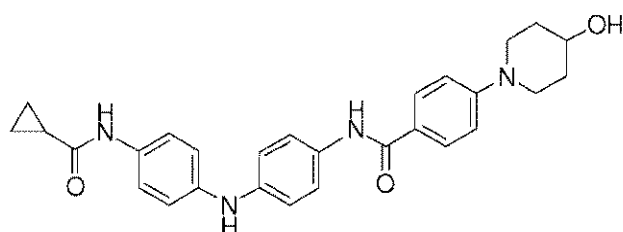
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1 H-インドール-3-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 7 5 2 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₁N₅O₃ についての計算値：546.24；実測値 545.97。

【0940】

実施例 6 5 3

N-(4-((4-((4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)シクロプロパンカルボキサミド (化合物 7 5 3)

【化 7 8 9】



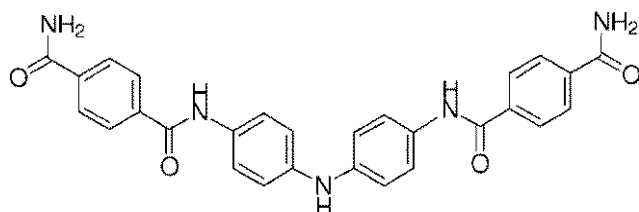
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、シクロプロパンカルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 7 5 3 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₃₀N₄O₃ についての計算値：471.23；実測値 471.05。

【0941】

実施例 6 5 4

N¹, N¹'-(アザンジイルビス(4, 1-フェニレン))ジテレフタルアミド (化合物 7 5 4)

【化 7 9 0】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミンおよび 4-カルバモイル安息香酸から化合物 754 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₃N₅O₄ について

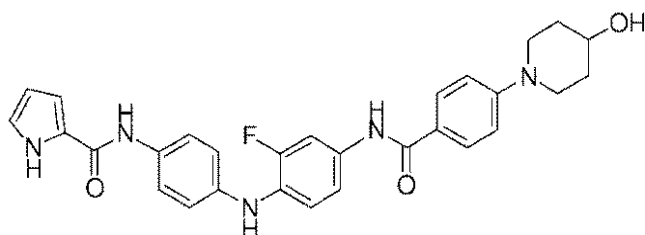
10

【0942】

実施例 655

N-(4-((2-フルオロ-4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 755)

【化 7 9 1】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1, 4-ジアミン、1H-ピロール-2-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 755 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₈FN₅O₃ について

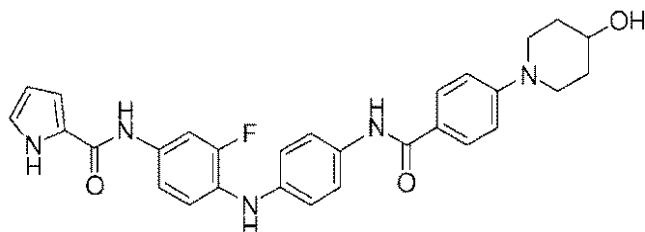
【0943】

30

実施例 656

N-(3-フルオロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 756)

【化 7 9 2】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1, 4-ジアミン、1H-ピロール-2-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 756 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₈FN₅O₃ について

【0944】

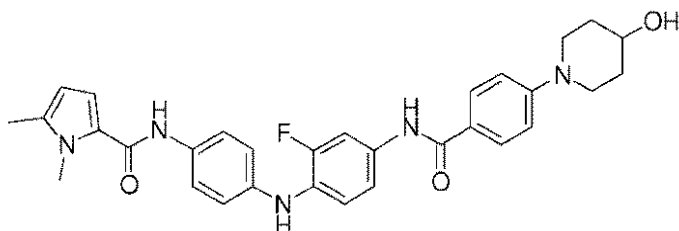
実施例 657

N-(4-((2-フルオロ-4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベン

50

ズアミド) フェニル) アミノ) フェニル) - 1, 5-ジメチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物757)

【化793】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1, 4-ジアミン、1, 5-ジメチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物757を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₂FN₅O₃についての計算値: 542.25; 実測値: 542.06。

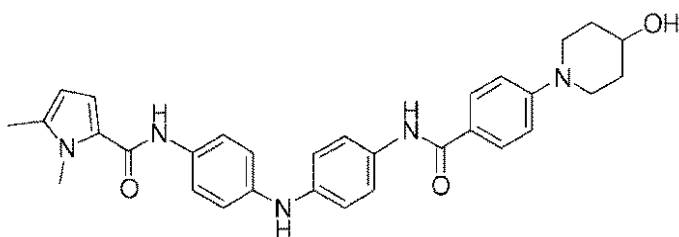
【0945】

実施例658

N-(4-((4-((4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1, 5-ジメチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物758)

20

【化794】



スキームIVに表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1, 5-ジメチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物758を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₃N₅O₃についての計算値: 524.26; 実測値: 524.03。

30

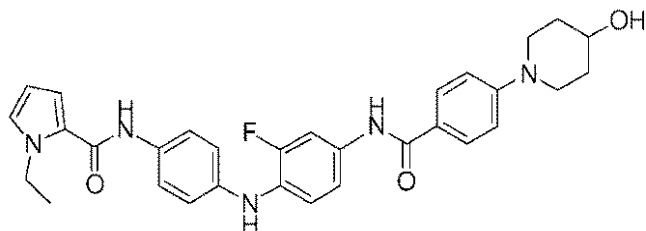
【0946】

実施例659

N-(4-((2-フルオロ-4-((4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-エチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物759)

【化795】

40



スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1, 4-ジアミン、1-エチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物759を調製した。

50

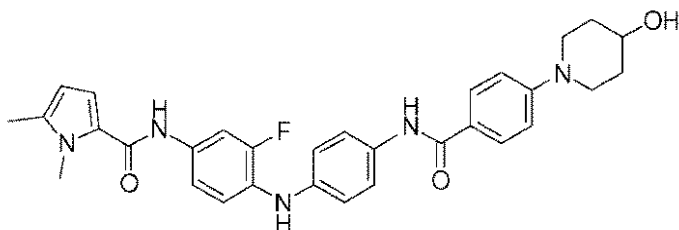
$[M+H]^+$ $C_{31}H_{32}FN_5O_3$ についての計算値：524.25；実測値：542.06。

【0947】

実施例660

N-(3-フルオロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1,5-ジメチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物760)

【化796】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1,4-ジアミン、1,5-ジメチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物760を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{31}H_{32}FN_5O_3$ についての計算値：542.25；実測値：542.06。

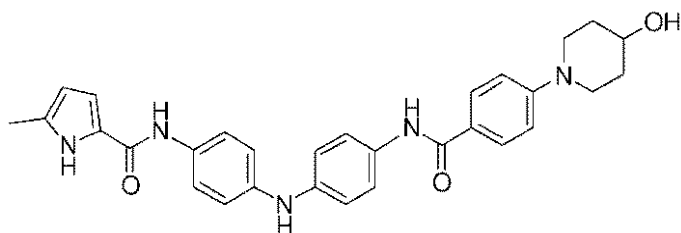
20

【0948】

実施例661

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-5-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物761)

【化797】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、5-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物761を調製した。¹H NMR (400 MHz、アセトン-d₆) δ 10.54 (s, 1H)、9.14 (s, 1H)、8.93 (s, 1H)、7.90 (d, J=9 Hz、2H)、7.70 (d, J=8.9 Hz、2H)、7.64 (d, J=9.0 Hz、2H)、7.18 (s, 1H)、7.07 (dd, J=3.0、9.0 Hz、4H)、7.00 (d, J=9.0 Hz、2H)、6.84 (t, J=3.4 Hz、1H)、5.89 (t, J=3.4 Hz、1H)、3.85 (m, 2H)、3.75 (m, 2H)、3.08 (ddd, J=3.0、3.2、11 Hz、2H)、2.32 (s, 3H)、1.94 (m, 2H)、1.60 (m, 2H)。

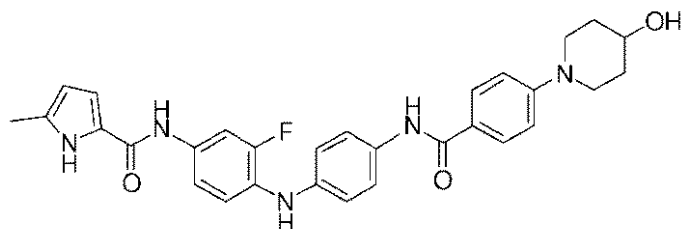
40

【0949】

実施例662

N-(3-フルオロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-5-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物762)

【化 7 9 8】



スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹ - (4 - アミノフェニル) - 2 - フル
オロベンゼン - 1, 4 - ジアミン、5 - メチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸、およ

10

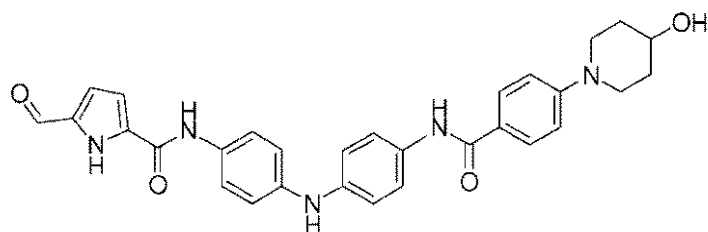
び 4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) 安息香酸から化合物 7 6 2 を調製した。
[M+H]⁺ C₃₀H₃₀FN₅O₃ についての計算値：528.23；実測値：528.02。

【0950】

実施例 6 6 3

5 - ホルミル - N - (4 - ((4 - (4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) ベン
ズアミド) フェニル) アミノ) フェニル) - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド (化
合物 7 6 3)

【化 7 9 9】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4' - ジアミノジフェニルアミン、5
- ホルミル - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸、および 4 - (4 - ヒドロキシピペリジン
- 1 - イル) 安息香酸から化合物 7 6 3 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₉N₅O₄ につい

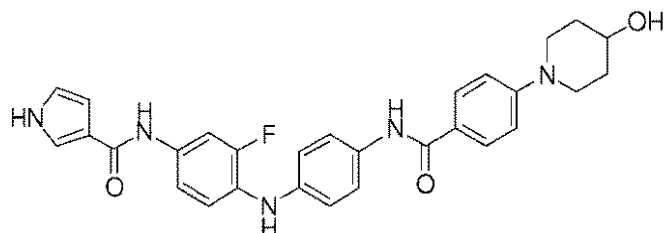
30

【0951】

実施例 6 6 4

N - (3 - フルオロ - 4 - ((4 - (4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) ベン
ズアミド) フェニル) アミノ) フェニル) - 1 H - ピロール - 3 - カルボキサミド (化
合物 7 6 4)

【化 8 0 0】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹ - (4 - アミノフェニル) - 2 - フル
オロベンゼン - 1, 4 - ジアミン、1 H - ピロール - 3 - カルボン酸、および 4 - (4 -
ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) 安息香酸から化合物 7 6 4 を調製した。[M+H]⁺

C₂₉H₂₈FN₅O₃ についての計算値：514.22；実測値 513.98。

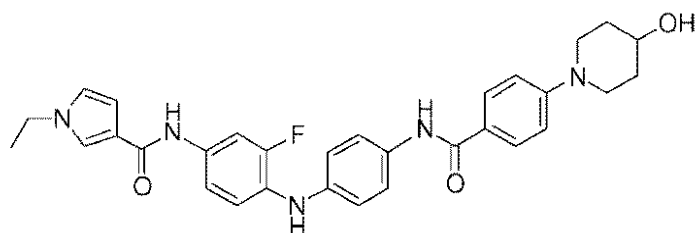
【0952】

50

実施例 665

N-(3-フルオロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-エチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 765)

【化 801】



10

スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1,4-ジアミン、1-エチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および 4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 765 を調製した。

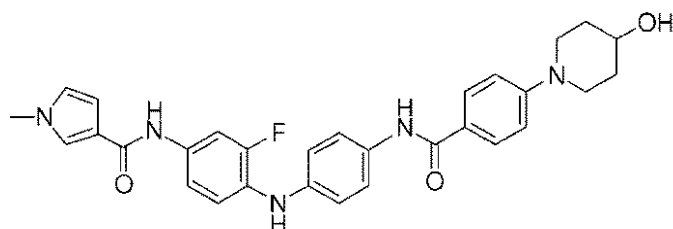
[M+H]⁺ C₃₁H₃₂FN₅O₃ についての計算値: 542.25; 実測値: 542.06。

【0953】

実施例 666

N-(3-フルオロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 766)

【化 802】



30

スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1,4-ジアミン、1-メチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および 4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 766 を調製した。

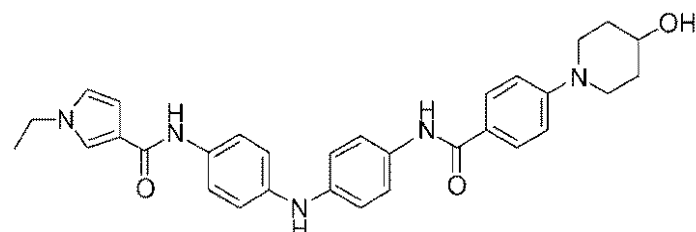
[M+H]⁺ C₃₀H₃₀FN₅O₃ についての計算値: 528.23; 実測値 528.02。

【0954】

実施例 667

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-エチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 767)

【化 803】



50

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-エチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物767を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{31}H_{33}N_5O_3$ についての計算値: 524.26; 実測値: 524.03。

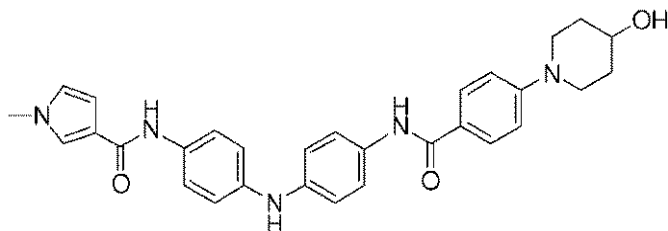
【0955】

実施例668

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物768)

【化804】

10



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物768を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{30}H_{31}N_5O_3$ についての計算値: 510.24; 実測値509.99。

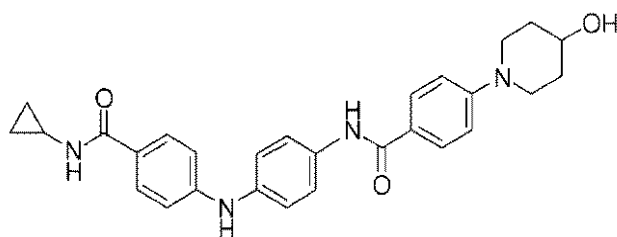
20

【0956】

実施例669

N-シクロプロピル-4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)ベンズアミド (化合物769)

【化805】



30

スキーム I V に表される手順にしたがって、シクロプロピルアミン、4-(4-アミノフェニル)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物769を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{28}H_{30}N_4O_3$ についての計算値: 471.23; 実測値471.05。

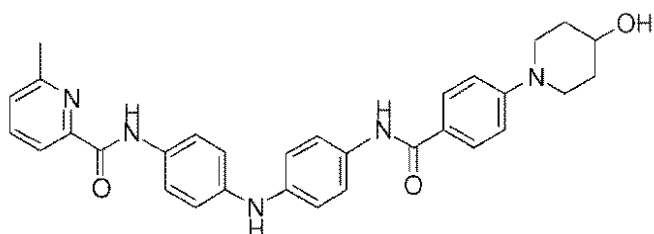
【0957】

実施例670

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-6-メチルピコリンアミド (化合物770)

40

【化 8 0 6】



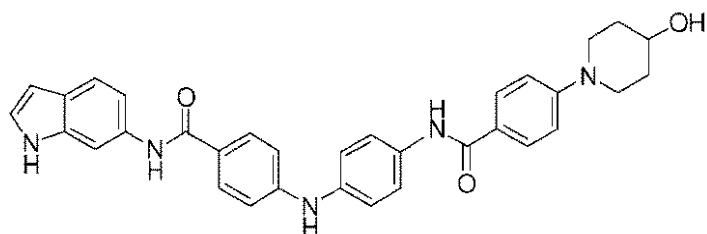
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、6-メチルピコリン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 770 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₁N₅O₃ についての計算値：522.24；実測値 522.08。

【0958】

実施例 671

N-(4-(4-(4-(1H-インドール-6-イル)カルバモイル)フェニル)アミノ)フェニル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 771)

【化 8 0 7】



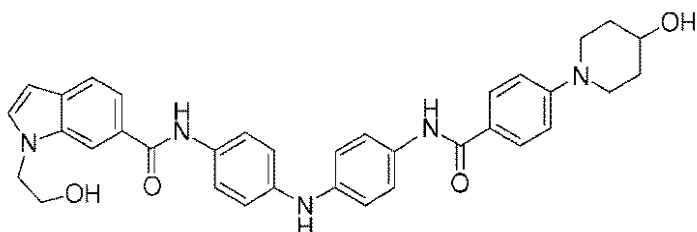
スキーム I V に表される手順にしたがって、6-アミノインドール、4-(4-アミノフェニルアミノ)安息香酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 771 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₁N₅O₃ についての計算値：546.24；実測値 546.04。

【0959】

実施例 672

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-6-カルボキサミド (化合物 772)

【化 8 0 8】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-6-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 772 を調製した。[M+H]⁺ C₃₅H₃₅N₅O₄ についての計算値：590.27；実測値 590.20。

【0960】

10

20

30

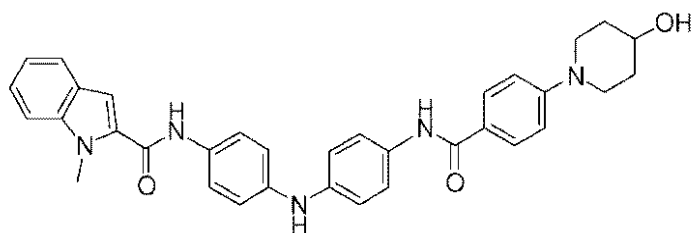
40

50

実施例 673

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-インドール-2-カルボキサミド (化合物 773)

【化 809】



10

スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-インドール-2-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 773 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₃N₅O₃ についての計算値: 560.26; 実測値 560.02。

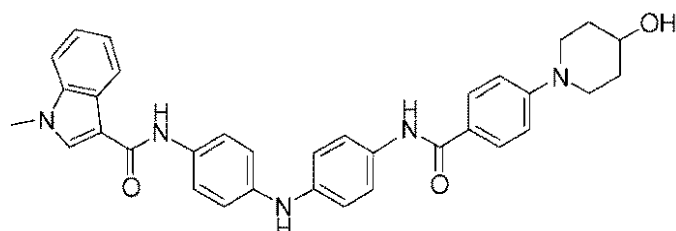
【0961】

実施例 674

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-インドール-3-カルボキサミド (化合物 774)

20

【化 810】



30

スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-インドール-3-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 774 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₃N₅O₃ についての計算値: 560.26; 実測値 560.02。

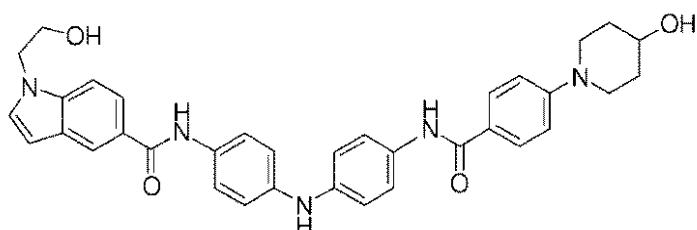
【0962】

実施例 675

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 775)

【化 811】

40



スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 775 を調製した。[M+H]⁺

50

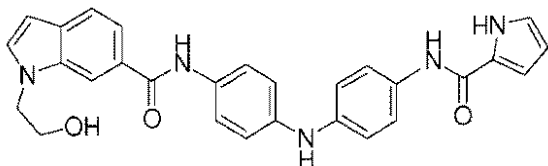
$C_{35}H_{35}N_5O_4$ についての計算値：590.27；実測値590.06。

【0963】

実施例676

N-(4-((4-(1H-ピロール-2-カルボキサミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-6-カルボキサミド (化合物776)

【化812】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-6-カルボン酸、および2-ピロールカルボン酸から化合物776を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{28}H_{25}N_5O_3$ についての計算値：480.20；実測値480.03。

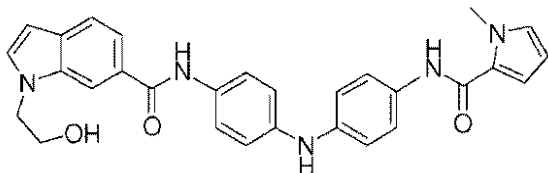
【0964】

実施例677

N-(4-((4-(1H-ピロール-2-カルボキサミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-(2-ヒドロキシエチル)-1-メチル-1H-インドール-6-カルボキサミド (化合物777)

20

【化813】



スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-6-カルボン酸、および1-メチル-2-ピロールカルボン酸から化合物777を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{29}H_{27}N_5O_3$ についての計算値：494.21；実測値494.06。

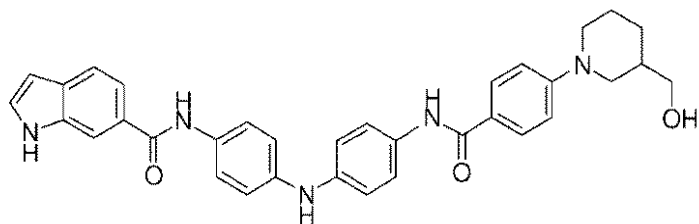
30

【0965】

実施例678

(±)-N-(4-((4-(4-(3-(ヒドロキシメチル)ピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-インドール-6-カルボキサミド (化合物778)

【化814】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1H-インドール-6-カルボン酸、および4-(3-ヒドロキシメチルピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物778を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{34}H_{33}N_5O_3$ についての計算値：560.26；実測値：560.08。

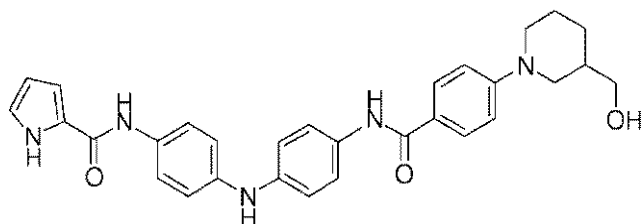
50

【0966】

実施例679

(±)-N-(4-((4-(4-(3-(ヒドロキシメチル)ピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物779)

【化815】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(3-ヒドロキシメチルピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物779を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₁N₅O₃についての計算値: 510.24; 実測値: 509.99。

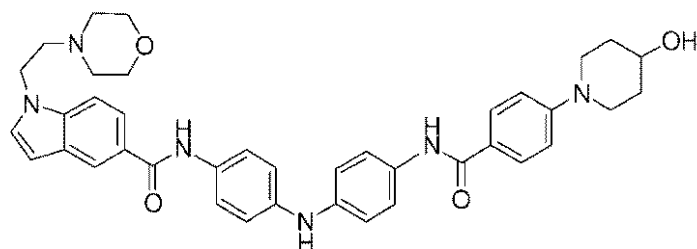
【0967】

実施例680

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-(2-モルホリノエチル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物780)

20

【化816】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1-(2-モルホリノエチル)-1H-インドール-5-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物780を調製した。[M+H]⁺ C₃₉H₄₂N₆O₄についての計算値: 659.33; 実測値659.20。

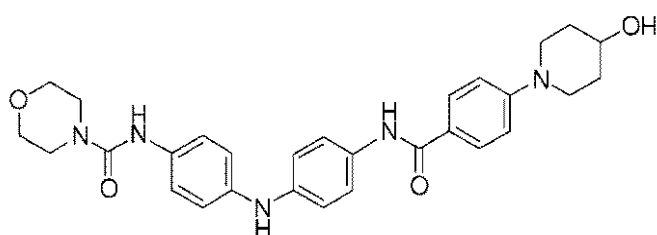
【0968】

実施例681

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)モルホリン-4-カルボキサミド (化合物781)

【化817】

40



スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、4-モルホリンカルボニルクロリド、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)

50

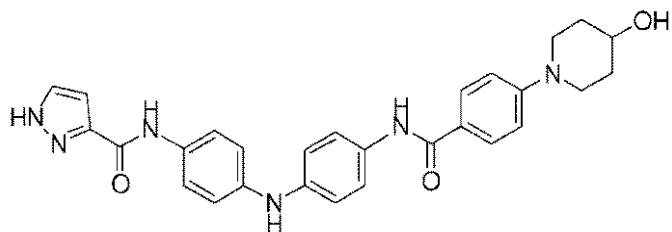
安息香酸から化合物 781 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₃N₅O₄ についての計算値：516.25；実測値 516.07。

【0969】

実施例 682

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド (化合物 782)

【化 818】



10

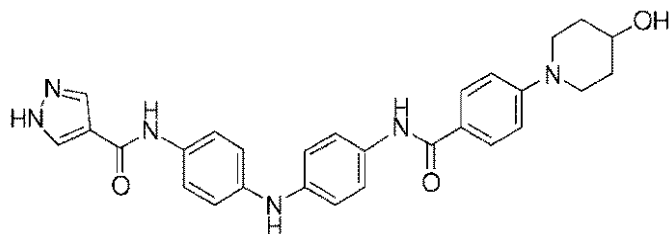
スキーム IV に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1H-ピラゾール-3-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 782 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₈N₆O₃ についての計算値：497.22；実測値 496.97。

【0970】

実施例 683

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド (化合物 783)

【化 819】



30

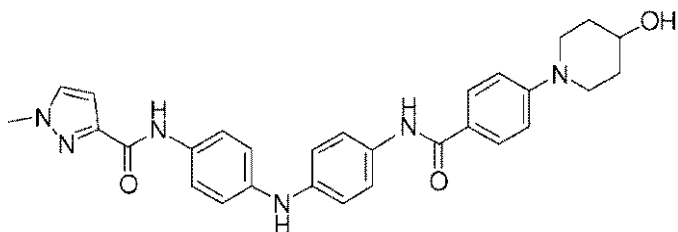
スキーム IV に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1H-ピラゾール-4-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 783 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₈N₆O₃ についての計算値：497.22；実測値 496.97。

【0971】

実施例 684

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド (化合物 784)

【化 820】



50

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物784を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₀N₆O₃ についての計算値：511.24；実測値511.01。

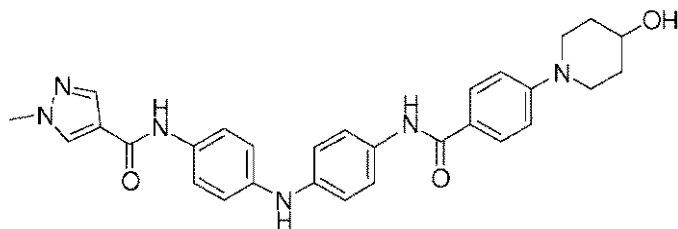
【0972】

実施例685

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド (化合物785)

【化821】

10



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物785を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₀N₆O₃ についての計算値：511.24；実測値511.01。

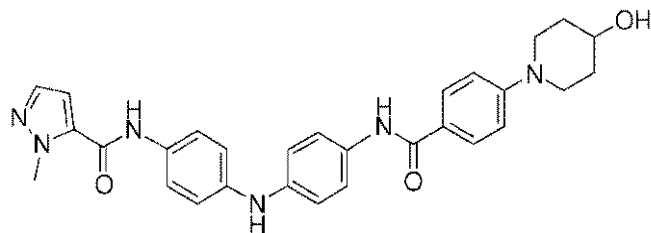
20

【0973】

実施例686

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (化合物786)

【化822】



30

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物786を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₀N₆O₃ についての計算値：511.24；実測値511.01。

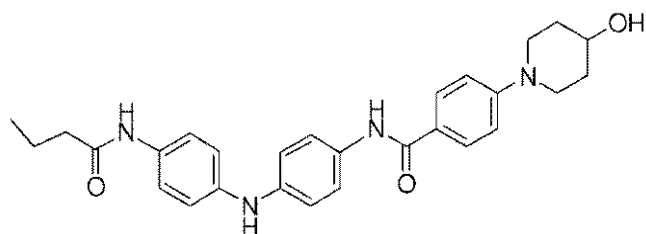
【0974】

実施例687

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)ブタミド (化合物787)

【化823】

40



50

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、ブタン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 787 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₃₂N₄O₃ についての計算値：473.25；実測値：473.01。

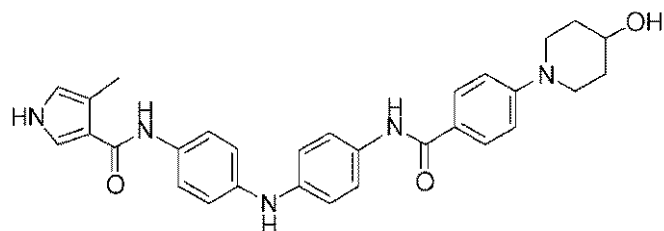
【0975】

実施例 688

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-4-メチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 788)

【化 824】

10



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、4-メチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 788 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₁N₅O₃ についての計算値：510.24；実測値：509.99。

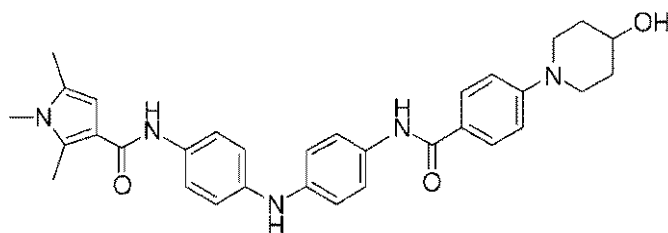
20

【0976】

実施例 689

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1, 2, 5-トリメチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 789)

【化 825】



30

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1, 2, 5-トリメチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 789 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₅N₅O₃ についての計算値：538.27；実測値 538.08。

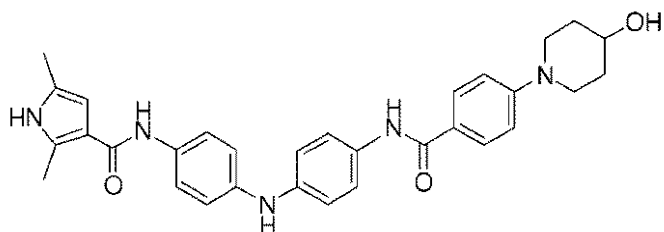
【0977】

40

実施例 690

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-2, 5-ジメチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 790)

【化 8 2 6】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、2, 5-ジメチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物790を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₃N₅O₃ についての計算値：524.26；実測値525.10。

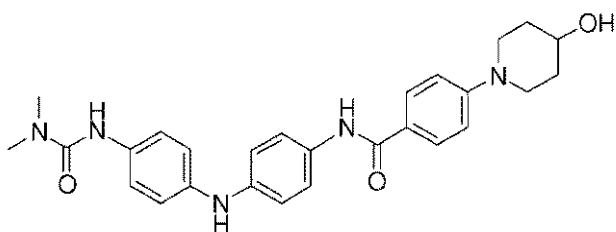
10

【0978】

実施例691

N-(4-((4-((3, 3-ジメチルウレイド)フェニル)アミノ)フェニル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド(化合物791)

【化 8 2 7】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、N、N-ジメチルクロロホルメート、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物791を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₃₁N₅O₃ についての計算値：474.24；実測値473.95。

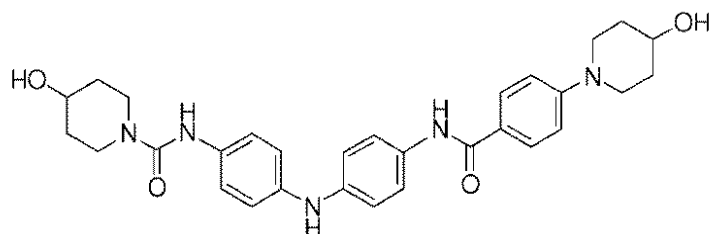
【0979】

30

実施例692

4-ヒドロキシ-N-(4-((4-((4-((4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)ピペリジン-1-カルボキサミド(化合物792)

【化 8 2 8】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)カルボニルクロリド、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物792を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₅N₅O₄ についての計算値：530.28；実測値：530.04。

【0980】

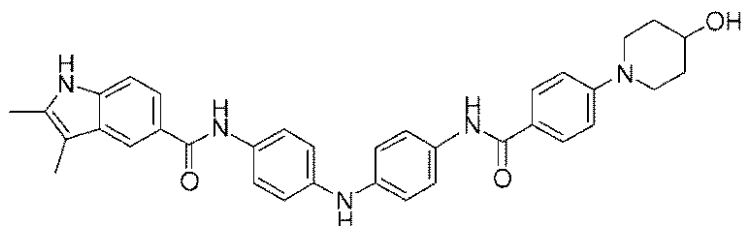
実施例693

N-(4-((4-((4-((4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェ

50

ニル) アミノ) フェニル) - 2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-カルボキサミド
(化合物 793)

【化 8 2 9】



10

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-カルボン酸、および 4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 793 を調製した。[M+H]⁺ C₃₅H₃₅N₅O₃ についての計算値：574.27；実測値 574.06。

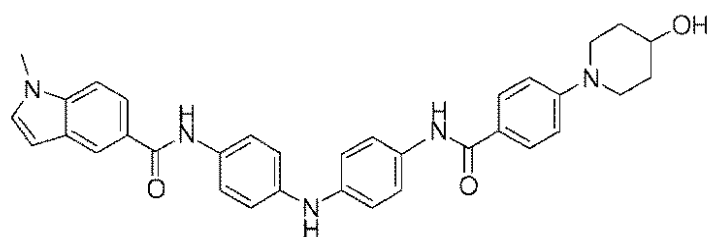
【0981】

実施例 694

N-(4-((4-((4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 794)

20

【化 8 3 0】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-インドール-5-カルボン酸、および 4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 794 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₃N₅O₃ についての計算値：560.26；実測値 560.02。

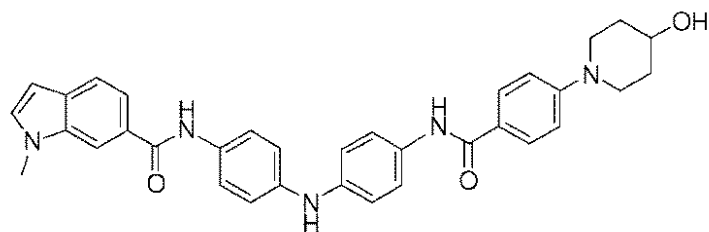
30

【0982】

実施例 695

N-(4-((4-((4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-インドール-6-カルボキサミド (化合物 795)

【化 8 3 1】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-インドール-6-カルボン酸、および 4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 795 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₃N₅O₃ についての計算値：560.26；実測値 560.07。

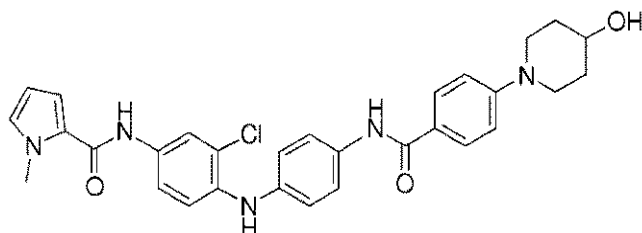
50

【0983】

実施例696

N-（3-クロロ-4-（（4-（4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド）フェニル）アミノ）フェニル）-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド（化合物796）

【化832】



10

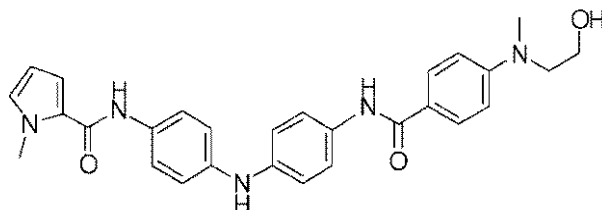
スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-（4-アミノフェニル）-2-クロロベンゼン-1，4-ジアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物796を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₀ClN₅O₃についての計算値：544.20；実測値544.02。

【0984】

実施例697

N-（4-（（4-（4-（（2-ヒドロキシエチル）（メチル）アミノ）ベンズアミド）フェニル）アミノ）フェニル）-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド（化合物797）

【化833】



30

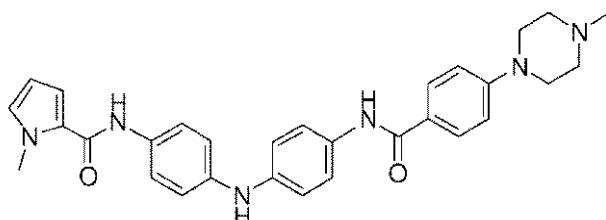
スキームIVに表される手順にしたがって、4，4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および（4-（2-ヒドロキシエチル）メチルアミノ）安息香酸から化合物797を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₉N₅O₃についての計算値：484.24；実測値：484.01。

【0985】

実施例698

1-メチル-N-（4-（（4-（4-（4-メチルピペラジン-1-イル）ベンズアミド）フェニル）アミノ）フェニル）-1H-ピロール-2-カルボキサミド（化合物798）

【化834】



スキームIVに表される手順にしたがって、4，4'-ジアミノジフェニルアミン、1

50

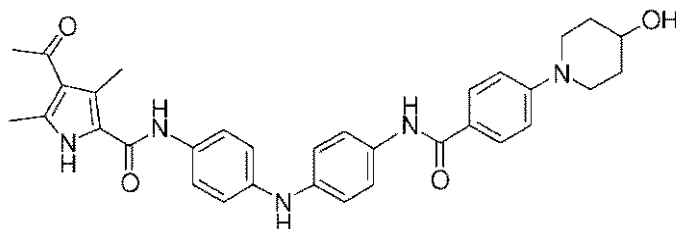
ーメチルー1H-ピロールー2-カルボン酸、および4-(4-メチルピペラジン-1-イル)安息香酸から化合物798を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₂N₆O₂についての計算値：509.27；実測値：509.05。

【0986】

実施例699

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-4-アセチル-3,5-ジメチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド(化合物799)

【化835】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、4-アセチル-3,5-ジメチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物799を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₅N₅O₄についての計算値：566.27；実測値566.09。

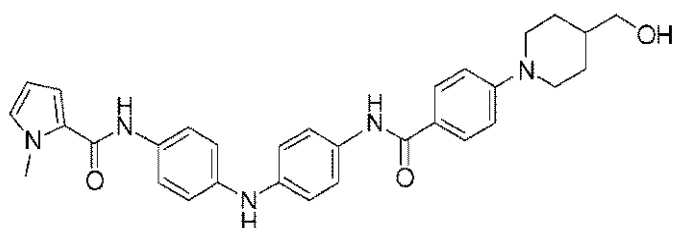
20

【0987】

実施例700

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシメチルピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド(化合物800)

【化836】



30

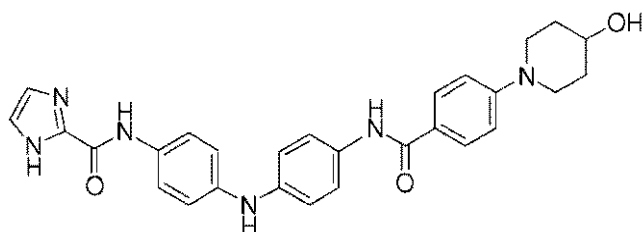
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシメチルピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物800を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₃N₅O₃についての計算値：524.26；実測値：523.64。

【0988】

実施例701

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド(化合物801)

【化837】



50

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1 H-イミダゾール-2-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 801 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₈N₆O₃ についての計算値：497.22；実測値 496.97。

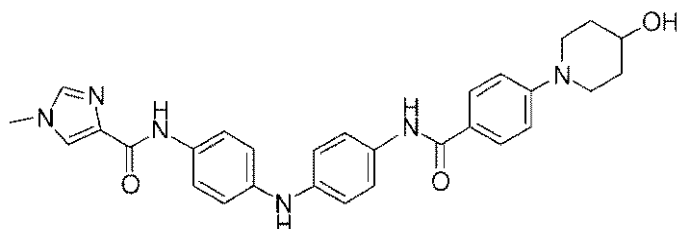
【0989】

実施例 702

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド (化合物 802)

【化 838】

10



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 802 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₀N₆O₃ についての計算値：511.24；実測値 511.01。

20

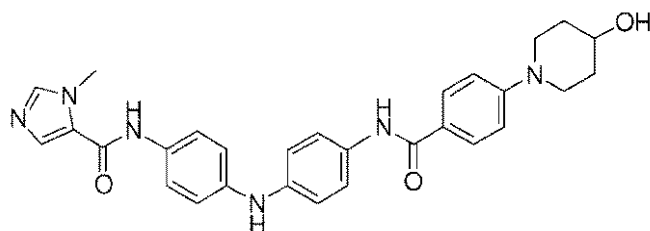
【0990】

実施例 703

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-イミダゾール-5-カルボキサミド (化合物 803)

【化 839】

30



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-イミダゾール-5-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 803 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₀N₆O₃ についての計算値：511.24；実測値 511.01。

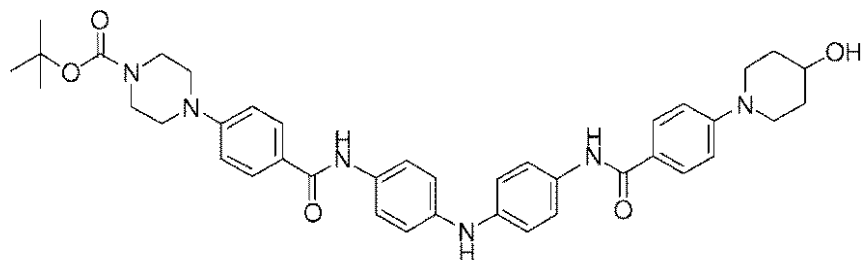
【0991】

実施例 704

tert-ブチル 4-(4-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)カルバモイル)フェニル)ピペラジン-1-カルボキシレート (化合物 804)

40

【化 8 4 0】



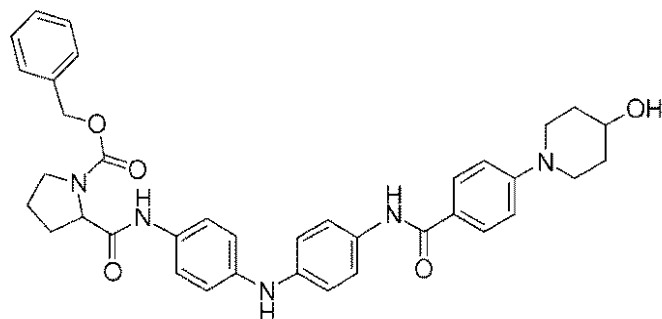
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、4- (4-t-BOC-ピペラジン-1-イル) 安息香酸、および 4- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) 安息香酸から化合物 804 を調製した。[M+H]⁺ C₄₀H₄₆N₆O₅ についての計算値：691.35；実測値 691.23。

【0992】

実施例 705

(±)-ベンジル 2- ((4- ((4- (4- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) ベンズアミド) フェニル) アミノ) フェニル) カルバモイル) ピロリジン-1-カルボキシレート (化合物 805)

【化 8 4 1】



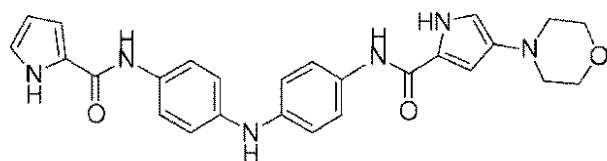
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-ベンジルオキシカルバニルピロリジン-2-カルボン酸、および 4- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) 安息香酸から化合物 805 を調製した。[M+H]⁺ C₃₇H₃₉N₅O₅ についての計算値：634.30；実測値 634.15。

【0993】

実施例 706

N- (4- ((4- (1H-ピロール-2-カルボキサミド) フェニル) アミノ) フェニル) -4-モルホリノ-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 806)

【化 8 4 2】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1H-ピロール-2-カルボン酸、および 4-モルホリノ-1H-ピロール-2-カルボン酸から化合物 806 を調製した。¹H NMR (400 MHz、アセトン-d₆) δ 10.75 (s, 1H)、10.31 (s, 1H)、9.01 (s, 1H)、8.91 (s, 1H)、7.62 (d, J=8.6 Hz、4H)、7.04 (m, 5H)、6.67 (s, 1H)、6.58 (s, 1H)、6.18 (s, 1H)、4.04 (dq, J=1.8

10

20

30

40

50

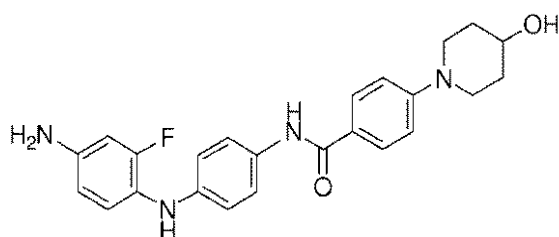
、7 Hz、2 H)、3.72 (m, 4 H)、1.19 (dq, J=1.8、7 Hz、4 H)。

【0994】

実施例707

N-(4-((4-アミノ-2-フルオロフェニル)アミノ)フェニル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド(化合物807)

【化843】



10

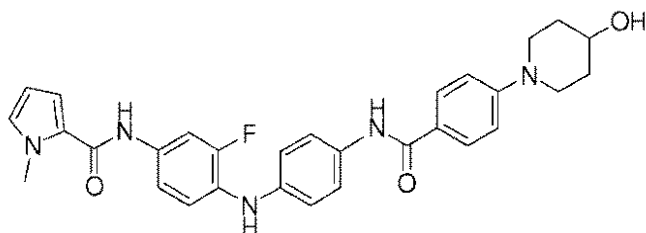
スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1,4-ジアミンおよび4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物807を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₅FN₄O₂についての計算値: 421.20; 実測値420.98。

【0995】

実施例708

N-(3-フルオロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド(化合物808)

【化844】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1,4-ジアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物808を調製した。

[M+H]⁺ C₃₀H₃₀FN₅O₃についての計算値: 528.23; 実測値528.02。

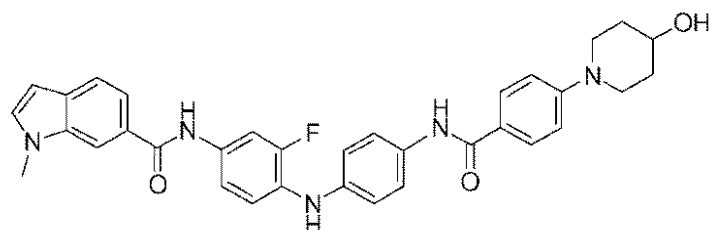
【0996】

実施例709

N-(3-フルオロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-インドール-6-カルボキサミド(化合物809)

40

【化 8 4 5】



スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1,4-ジアミン、1-メチル-1H-インドール-6-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物809を調製した。 $[M+H]^+$ C₃₄H₃₂FN₅O₃ についての計算値: 578.25; 実測値 578.04。

10

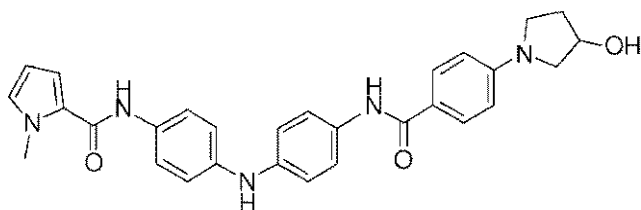
【0997】

実施例 710

(±)-N-(4-((4-((4-(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物810)

【化 8 4 6】

20



スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)安息香酸から化合物810を調製した。 $[M+H]^+$ C₂₉H₂₉N₅O₃ についての計算値: 496.23; 実測値: 495.95。

30

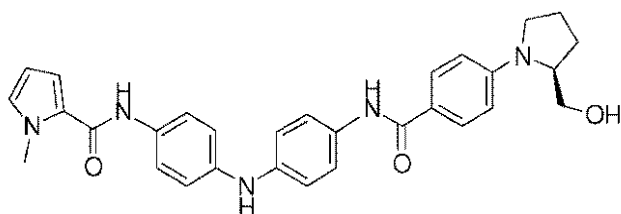
【0998】

実施例 711

(S)-N-(4-((4-((4-(2-(ヒドロキシメチル)ピロリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物811)

【化 8 4 7】

40



スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および(S)-4-(2-ヒドロキシメチルピロリジン-1-イル)安息香酸から化合物811を調製した。 $[M+H]^+$ C₃₀H₃₁N₅O₃ についての計算値: 510.24; 実測値: 510.06。

【0999】

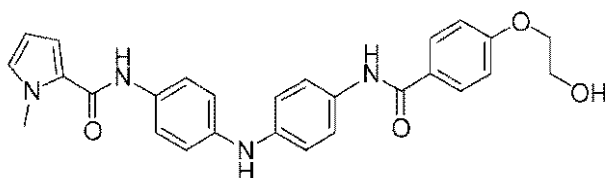
実施例 712

N-(4-((4-((4-(2-ヒドロキシエチル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)

50

フェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド (化合物 8 1 2)

【化 8 4 8】



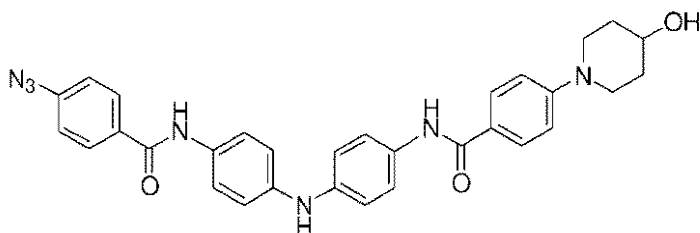
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4' - ジアミノジフェニルアミン、1 - メチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸、および 4 - (2 - ヒドロキシエチル) 安息香酸から化合物 8 1 2 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₆N₄O₄ についての計算値: 471.20; 実測値: 470.92。

【1000】

実施例 7 1 3

4 - アジド - N - (4 - ((4 - (4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) ベンズアミド) フェニル) アミノ) フェニル) ベンズアミド (化合物 8 1 3)

【化 8 4 9】



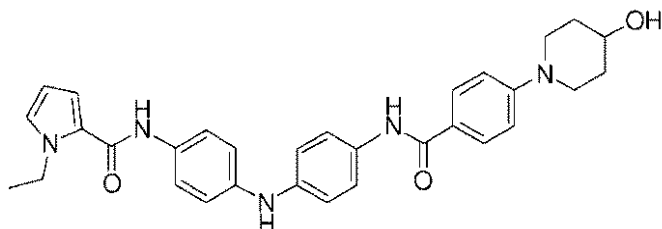
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4' - ジアミノジフェニルアミン、4 - アジド安息香酸、および 4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) 安息香酸から化合物 8 1 3 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₉N₇O₃ についての計算値: 548.23; 実測値 548.07。

【1001】

実施例 7 1 4

N - (4 - ((4 - (4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) ベンズアミド) フェニル) アミノ) フェニル) - 1 - エチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド (化合物 8 1 4)

【化 8 5 0】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4' - ジアミノジフェニルアミン、1 - エチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸、および 4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) 安息香酸から化合物 8 1 4 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₃N₅O₃ についての計算値: 524.26; 実測値: 524.03。

【1002】

実施例 7 1 5

N - (4 - ((4 - (3 - フルオロ - 4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) ベンズアミド) フェニル) アミノ) フェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボキ

10

20

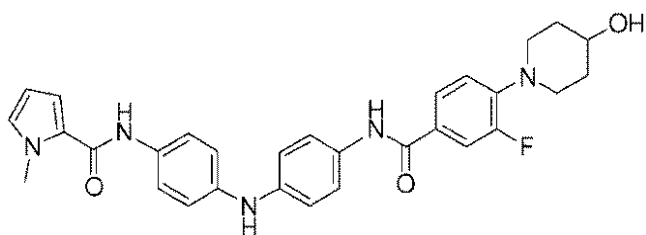
30

40

50

サミド (化合物 815)

【化 851】



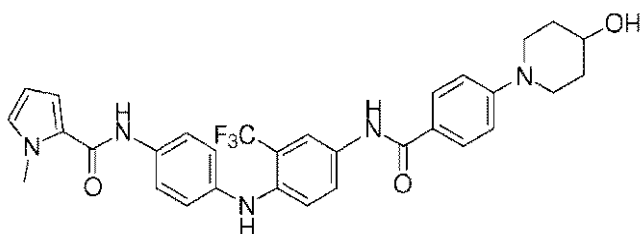
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および 3-フルオロ-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 815 を調製した。¹H NMR (400 MHz、アセトン-d₆) δ 9.25 (s, 1H)、8.94 (s, 1H)、7.75 (dd, J=1.9、8.4 Hz、1H)、7.69 (m, 3H)、7.63 (d, J=8.8 Hz、2H)、7.22 (s, 1H)、7.08 (m, 5H)、6.89 (m, 2H)、6.05 (m, 1H)、3.95 (s, 3H)、3.47 (m, 2H)、2.95 (ddd, J=3、9.8、12.4 Hz、2H)、1.67 (m, 2H)、1.27 (m, 2H)。

【1003】

実施例 716

N-(4-((4-((4-((4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-2-(トリフルオロメチル)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 816)

【化 852】



スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-トリフルオロメチルベンゼン-1, 4-ジアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 816 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀F₃N₅O₃ についての計算値：578.24；実測値：578.04。

【1004】

実施例 717

N-(4-((4-((4-((4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-2-(シアノ)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 817)

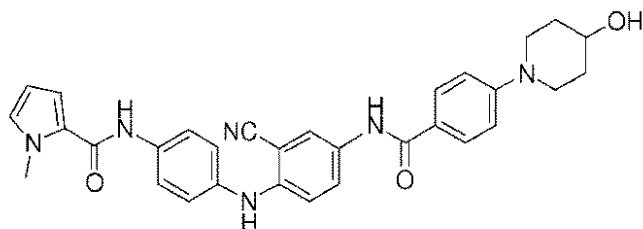
10

20

30

40

【化 8 5 3】



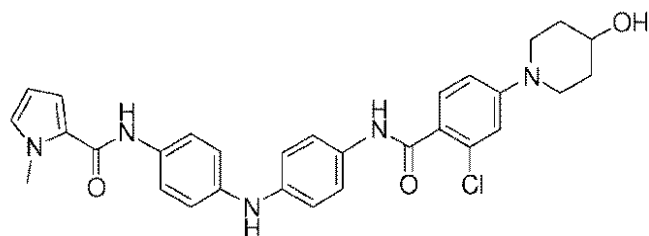
スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-シア
ノベンゼン-1, 4-ジアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および
4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 8 1 7 を調製した。[
M+H]⁺ C₃₁H₃₀N₆O₃ についての計算値：535.25；実測値：535.
04。

【1005】

実施例 7 1 8

N-(4-((4-((4-((2-クロロ-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズ
アミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサ
ミド(化合物 8 1 8)

【化 8 5 4】



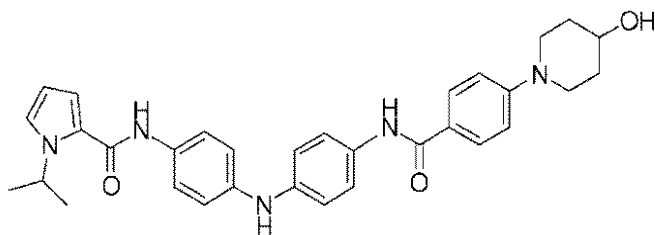
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1
-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および 2-クロロ-4-(4-ヒドロキシ
ピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 8 1 8 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H
30ClN₅O₃ についての計算値：544.20；実測値：544.02。

【1006】

実施例 7 1 9

N-(4-((4-((4-((4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェ
ニル)アミノ)フェニル)-1-イソプロピル-1H-ピロール-2-カルボキサミド(
化合物 8 1 9)

【化 8 5 5】



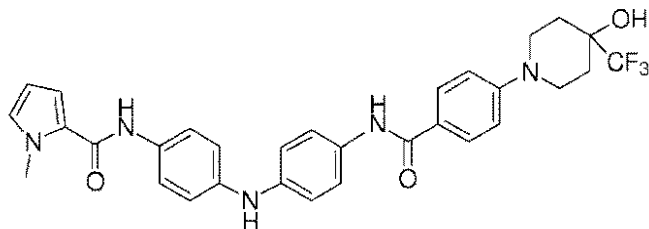
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1
-イソプロピル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリ
ジン-1-イル)安息香酸から化合物 8 1 9 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₅N
5O₃ についての計算値：538.27；実測値：538.08。

【1007】

実施例720

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシ-4-トリフルオロメチルピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物820)

【化856】



10

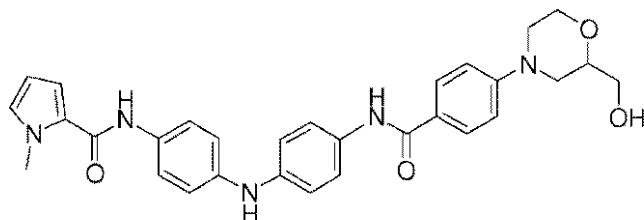
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-(4-(4-ヒドロキシ-4-トリフルオロメチルピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物820を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀F₃N₅O₃ についての計算値: 578.23; 実測値 578.04。

【1008】

実施例721

(±)-N-(4-((4-(4-(4-(2-ヒドロキシメチルモルホリ-4-ノ)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物821)

【化857】



30

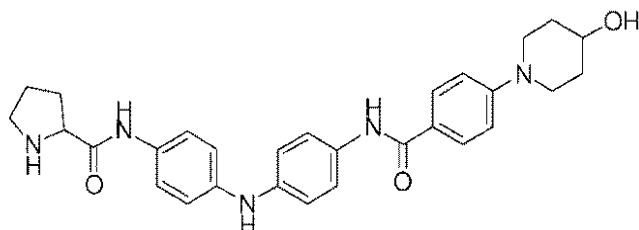
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(2-ヒドロキシメチルモルホリ-4-ノ)安息香酸から化合物821を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₁N₅O₄ についての計算値: 526.24; 実測値: 525.99。

【1009】

実施例722

(±)-N-(4-((4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)ピロリジン-2-カルボキサミド (化合物822)

【化858】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、ピロリジン-2-カルボン酸、および4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物822を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₃N₅O₃ についての計算値

50

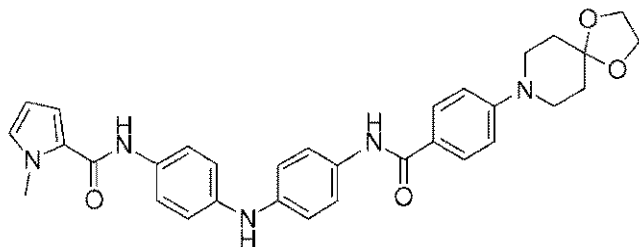
: 500.26; 実測値 499.94。

【1010】

実施例 723

N-(4-((4-(4-(1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デカナ-8-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 823)

【化 859】



10

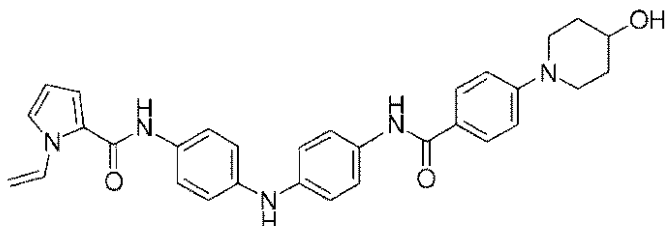
スキーム IV に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および 4-(1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デカナ-8-イル)安息香酸から化合物 823 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₃N₅O₄ についての計算値: 552.25; 実測値: 552.05。

【1011】

実施例 724

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-ビニル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 824)

【化 860】



30

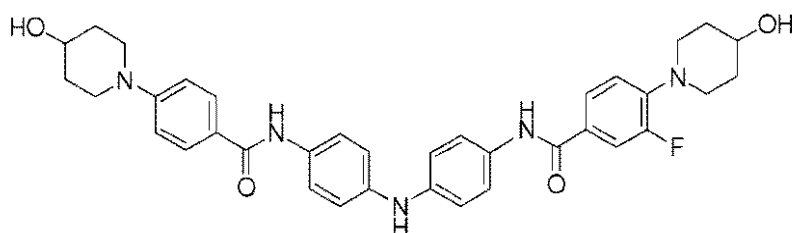
スキーム IV に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1-ビニル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 824 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₁N₅O₃ についての計算値: 522.24; 実測値 522.01。

【1012】

実施例 725

3-フルオロ-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)ベンズアミド (化合物 825)

【化 861】



50

スキーム IV に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、3

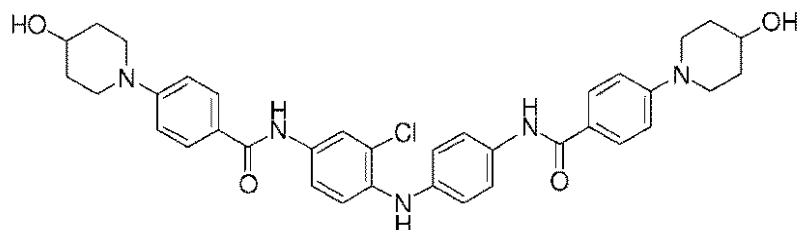
ーフルオロー４－（４－ヒドロキシピペリジン－１－イル）安息香酸、および４－（４－ヒドロキシピペリジン－１－イル）安息香酸から化合物８２５を調製した。[M+H]⁺ C₃₆H₃₈FN₅O₄ についての計算値：６２４．２９；実測値６２４．１３。

【１０１３】

実施例７２６

N－（３－クロロ－４－（（４－（４－（４－ヒドロキシピペリジン－１－イル）ベンズアミド）フェニル）アミノ）フェニル）－４－（４－ヒドロキシピペリジン－１－イル）ベンズアミド（化合物８２６）

【化８６２】



10

スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹－（４－アミノフェニル）－２－クロロベンゼン－１，４－ジアミンおよび４－（４－ヒドロキシピペリジン－１－イル）安息香酸から化合物８２６を調製した。[M+H]⁺ C₃₆H₃₈ClN₅O₄ についての計算値：６４０．２６；実測値６４０．１２。

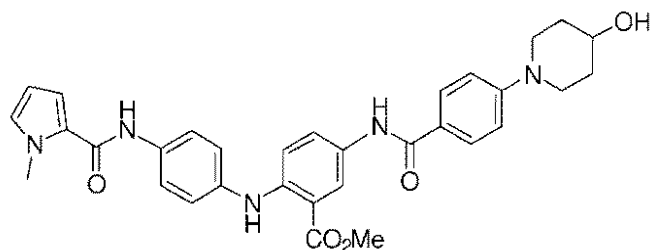
20

【１０１４】

実施例７２７

N－（４－（（４－（４－（４－ヒドロキシピペリジン－１－イル）ベンズアミド）－２－（メトキシカルボニル）フェニル）アミノ）フェニル）－１－メチル－１H－ピロール－２－カルボキサミド（化合物８２７）

【化８６３】



30

スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹－（４－アミノフェニル）－２－メトキシカルボニルベンゼン－１，４－ジアミン、１－メチル－１H－ピロール－２－カルボン酸、および４－（４－ヒドロキシピペリジン－１－イル）安息香酸から化合物８２７を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₃N₅O₅ についての計算値：５６８．２６；実測値：５６８．０５。

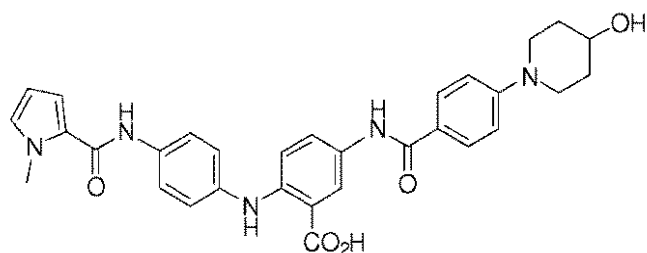
40

【１０１５】

実施例７２８

５－（４－（４－ヒドロキシピペリジン－１－イル）ベンズアミド）－２－（（４－（１－メチル－１H－ピロール－２－カルボキサミド）フェニル）アミノ）安息香酸（化合物８２８）

【化 8 6 4】



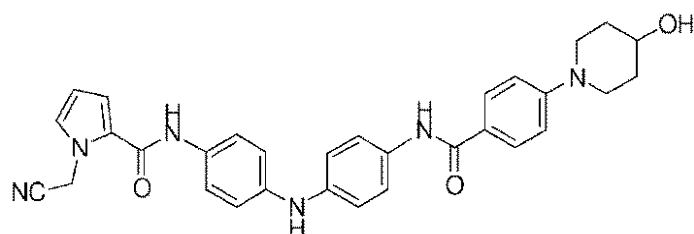
化合物 8 2 7 の加水分解によって、化合物 8 2 8 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₁N₅O₅ 10
 3 1 N₅O₅ についての計算値：554.24；実測値：554.01。

【1016】

実施例 7 2 9

N-（4-（（4-（4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド）フェニル）アミノ）フェニル）-1-シアノメチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド（化合物 8 2 9）

【化 8 6 5】



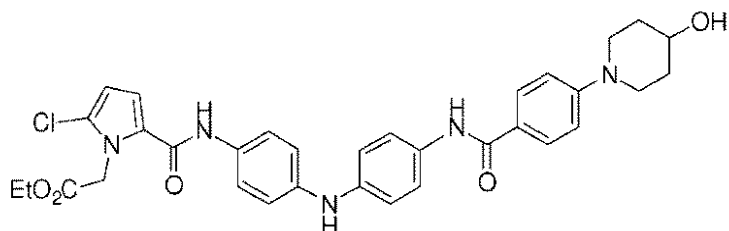
スキーム IV に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-シアノメチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および 4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物 8 2 9 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀N₆O₃ 20
 6 O₃ についての計算値：535.24；実測値：535.04。

【1017】

実施例 7 3 0

エチル 2-（2-クロロ-5-（（4-（（4-（4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド）フェニル）アミノ）フェニル）カルバモイル）-1H-ピロール-1-イル）アセテート（化合物 8 3 0）

【化 8 6 6】



スキーム IV に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、5-クロロ-1-エトキシカルボニルメチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および 4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物 8 3 0 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₄ClN₅O₅ 40
 6 O₅ についての計算値：616.22；実測値：616.06。

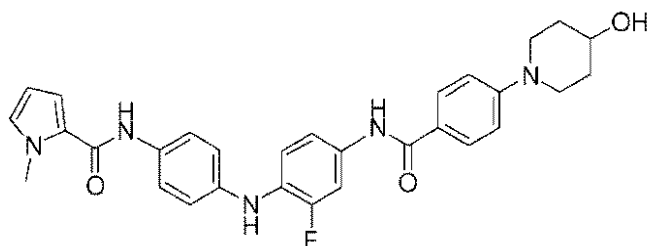
【1018】

実施例 7 3 1

50

N-（4-（（4-（4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド）-2-フルオロフェニル）アミノ）フェニル）-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド（化合物831）

【化867】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-（4-アミノフェニル）-2-フルオロベンゼン-1,4-ジアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物831を調製した。

[M+H]⁺ C₃₀H₃₀FN₅O₃ についての計算値：528.23；実測値528.02。

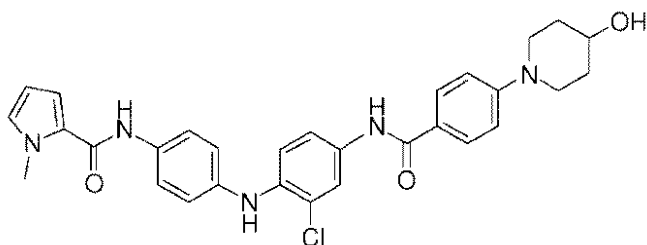
【1019】

実施例732

N-（4-（（4-（4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド）-2-クロロフェニル）アミノ）フェニル）-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド（化合物832）

20

【化868】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-（4-アミノフェニル）-2-クロロベンゼン-1,4-ジアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物832を調製した。

[M+H]⁺ C₃₀H₃₀ClN₅O₃ についての計算値：544.20；実測値544.02。

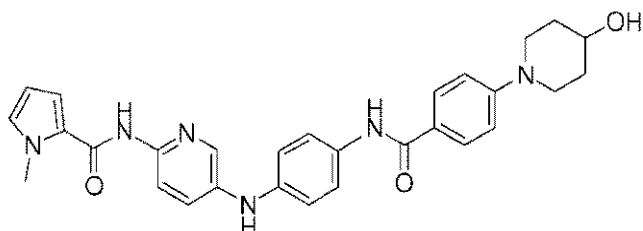
【1020】

実施例733

N-（5-（（4-（4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド）フェニル）アミノ）ピリジン-2-イル）-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド（化合物833）

40

【化869】



50

スキーム I V に表される手順にしたがって、 N^5 - (4-アミノフェニル) ピリジン-2, 5-ジアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) 安息香酸から化合物 833 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₀N₆O₃ についての計算値：511.24；実測値 511.01。

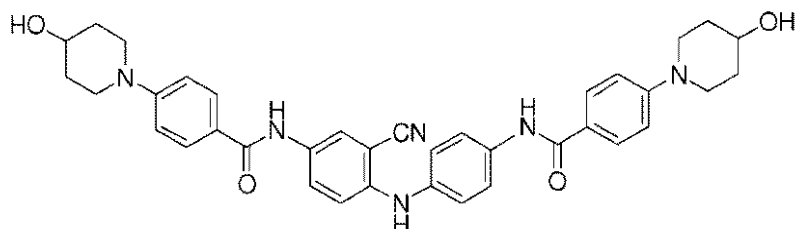
【1021】

実施例 734

N-(3-シアノ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) ベンズアミド) フェニル) アミノ) フェニル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) ベンズアミド (化合物 834)

【化 870】

10



スキーム I V に表される手順にしたがって、 N^1 - (4-アミノフェニル) -2-シアノベンゼン-1, 4-ジアミンおよび 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) 安息香酸から化合物 834 を調製した。[M+H]⁺ C₃₇H₃₈N₆O₄ についての計算値：631.30；実測値：631.11。

20

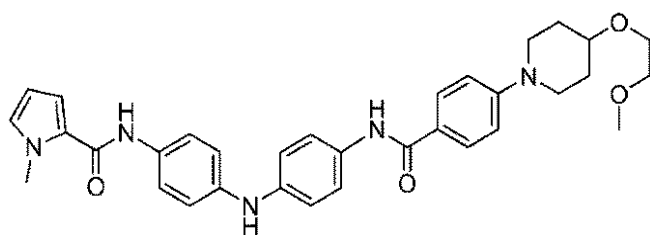
【1022】

実施例 735

N-(4-((4-(4-(4-(2-ヒドロキシエトキシ) ピペリジン-1-イル) ベンズアミド) フェニル) アミノ) フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 835)

【化 871】

30



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および 4-(4-(2-ヒドロキシエトキシ) ピペリジン-1-イル) 安息香酸から化合物 835 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₇N₅O₄ についての計算値：568.28；実測値：568.12。

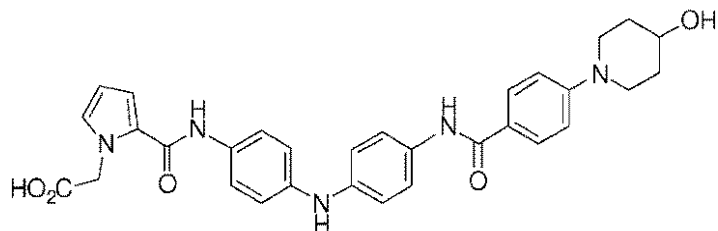
40

【1023】

実施例 736

2-(2-((4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) ベンズアミド) フェニル) アミノ) フェニル) カルバモイル)-1H-ピロール-1-イル) 酢酸 (化合物 836)

【化 8 7 2】



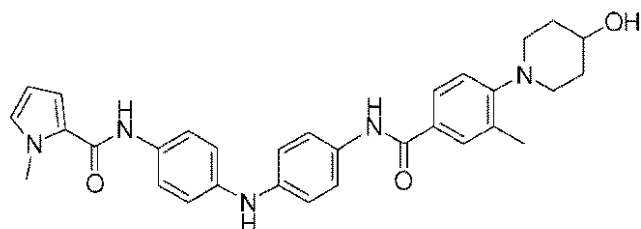
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メトキシカルボニルメチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物836を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₁N₅O₅ についての計算値：554.23；実測値：554.01。

【1024】

実施例 737

N-(4-((4-(3-メチル-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物837)

【化 8 7 3】



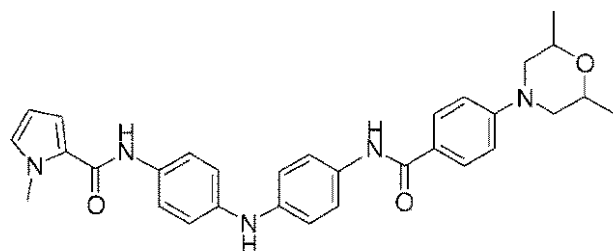
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および3-メチル-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物837を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₃N₅O₃ についての計算値：524.26；実測値：524.03。

【1025】

実施例 738

(±)-N-(4-((4-(4-(4-(2,6-ジメチル)モルホリー-4-ノ)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物838)

【化 8 7 4】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(2,6-ジメチルモルホリー-4-ノ)安息香酸から化合物838を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₃N₅O₃ についての計算値：524.26；実測値：524.03。

【1026】

実施例 739

10

20

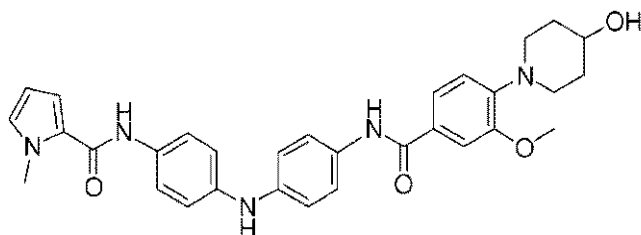
30

40

50

N-(4-((4-(3-メトキシ-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 839)

【化 875】



10

スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および 3-メトキシ-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 839 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₃N₅O₄ についての計算値：540.25；実測値：540.03。

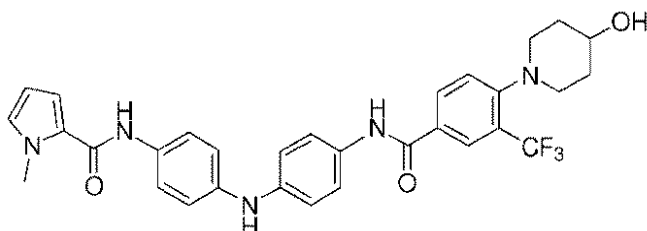
【1027】

実施例 740

N-(4-((4-(3-トリフルオロメチル-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 840)

20

【化 876】



30

スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および 3-トリフルオロメチル-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 840 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀F₃N₅O₃ についての計算値：578.23；実測値：578.04。

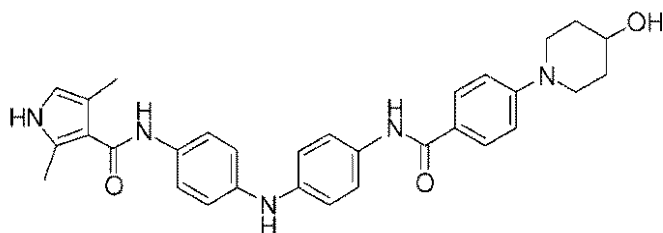
【1028】

実施例 741

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-2,4-ジメチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 841)

40

【化 877】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、2

50

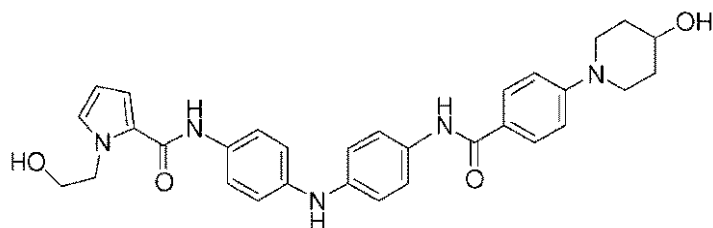
、4-ジメチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物841を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{31}H_{33}N_5O_3$ についての計算値：524.26；実測値524.03。

【1029】

実施例742

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物842)

【化878】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物842を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{31}H_{33}N_5O_4$ についての計算値：540.25；実測値：540.03。

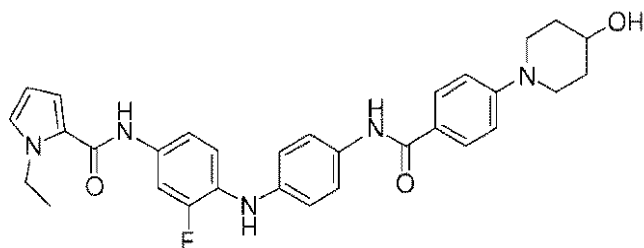
20

【1030】

実施例743

1-エチル-N-(3-フルオロ-4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物843)

【化879】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1,4-ジアミン、1-エチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物843を調製した。

$[M+H]^+$ $C_{31}H_{32}FN_5O_3$ についての計算値：542.25；実測値：542.06。

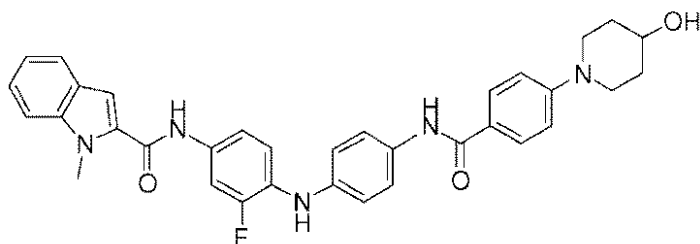
【1031】

実施例744

N-(3-フルオロ-4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-インドール-2-カルボキサミド (化合物844)

40

【化 8 8 0】



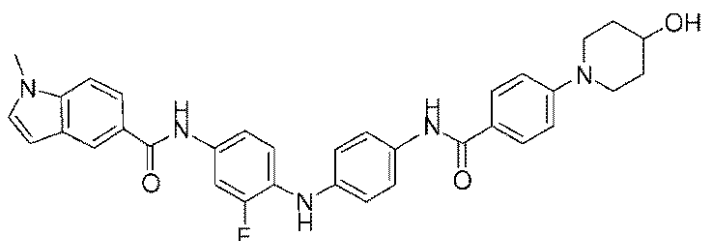
スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹ - (4 - アミノフェニル) - 2 - フル
 オロベンゼン - 1, 4 - ジアミン、1 - メチル - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸、お
 よび 4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) 安息香酸から化合物 8 4 4 を調製した
 。 [M + H]⁺ C₃₄H₃₂FN₅O₃ についての計算値：578.25；実測値 57
 8.11。

【1032】

実施例 7 4 5

N - (3 - フルオロ - 4 - ((4 - (4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) ベン
 ズアミド) フェニル) アミノ) フェニル) - 5 - メチル - 1 H - インドール - 2 - カルボ
 キサミド (化合物 8 4 5)

【化 8 8 1】



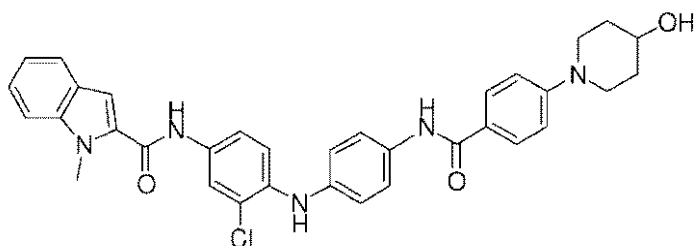
スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹ - (4 - アミノフェニル) - 2 - フル
 オロベンゼン - 1, 4 - ジアミン、1 - メチル - 1 H - インドール - 5 - カルボン酸、お
 よび 4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) 安息香酸から化合物 8 4 5 を調製した
 。 [M + H]⁺ C₃₄H₃₂FN₅O₃ についての計算値：578.25；実測値 57
 8.11。

【1033】

実施例 7 4 6

N - (3 - クロロ - 4 - ((4 - (4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) ベン
 ズアミド) フェニル) アミノ) フェニル) - 1 - メチル - 1 H - インドール - 2 - カルボキ
 サミド (化合物 8 4 6)

【化 8 8 2】



スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹ - (4 - アミノフェニル) - 2 - クロ
 ロベンゼン - 1, 4 - ジアミン、1 - メチル - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸、お
 よび 4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) 安息香酸から化合物 8 4 6 を調製した。

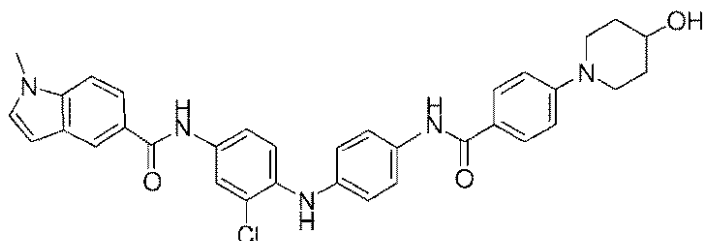
$[M+H]^+$ $C_{34}H_{32}ClN_5O_3$ についての計算値：594.22；実測値594.11。

【1034】

実施例747

N-(3-クロロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-5-メチル-1H-インドール-2-カルボキサミド (化合物847)

【化883】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-クロロベンゼン-1,4-ジアミン、1-メチル-1H-インドール-5-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物847を調製した。

$[M+H]^+$ $C_{34}H_{32}ClN_5O_3$ についての計算値：594.22；実測値594.11。

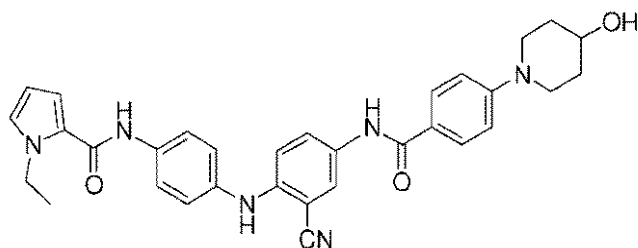
20

【1035】

実施例748

N-(4-((2-シアノ-4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-エチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物848)

【化884】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-シアノベンゼン-1,4-ジアミン、1-エチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物848を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{32}H_{32}N_6O_3$ についての計算値：549.25；実測値：549.08。

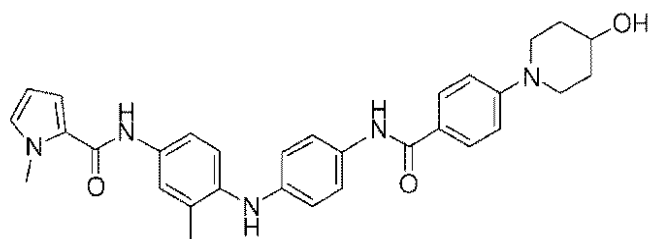
40

【1036】

実施例749

N-(3-メチル-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物849)

【化 8 8 5】



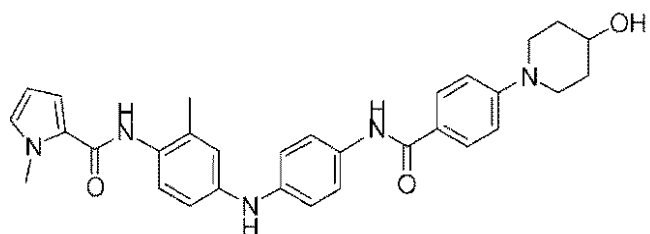
スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-メチルベンゼン-1, 4-ジアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 849 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₃N₅O₃ についての計算値：524.26；実測値 524.03。

【1037】

実施例 750

N-(4-((4-((4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)-2-メチルフェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 850)

【化 8 8 6】



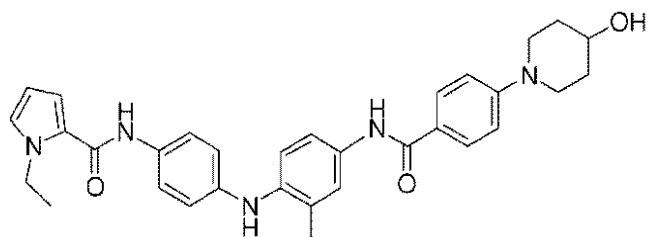
スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-3-メチルベンゼン-1, 4-ジアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 850 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₃N₅O₃ についての計算値：524.26；実測値 524.03。

【1038】

実施例 751

N-(4-((2-メチル-4-((4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-エチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 851)

【化 8 8 7】



スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-メチルベンゼン-1, 4-ジアミン、1-エチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 851 を調製した。¹

¹H NMR (400 MHz、アセトン-d₆) δ 9.09 (s, 1H)、8.95 (s, 1H)、7.89 (d, J=9.0 Hz、2H)、7.66 (m, 3H)、7.54 (dd, J=2.4、8.6 Hz、1H)、7.16 (d, J=8.6 Hz、1H)、6.99 (m, 3H)、6.94 (dd, J=2.6、4.0 Hz、1H)、6.89 (d, J=9.0 Hz、2H)、6.57 (s, 1H)、6.09 (dd, J=2.6、4.0 Hz、1H)、4.46 (q, J=7.1 Hz、2H)、3.85 (m, 1H)、3.75 (dt, J=4.4、13 Hz、2H)、3.08 (ddd, J=3.2、9.8、13.0 Hz、2H)、2.26 (s, 3H)、1.93 (m, 2H)、1.60 (m, 2H)、1.39 (t, J=7.1 Hz、3H)。

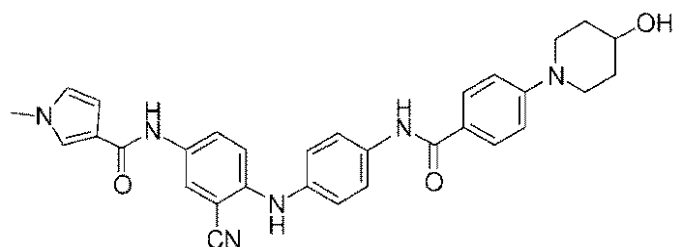
【1039】

10

実施例 752

N-(3-シアノ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 852)

【化 888】



20

スキーム IV に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-シアノベンゼン-1,4-ジアミン、1-メチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 852 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀N₆O₃ についての計算値: 535.25; 実測値: 535.04。

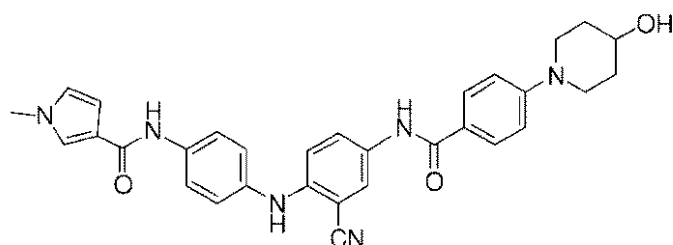
【1040】

実施例 753

N-(4-((2-シアノ-4-((4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 853)

30

【化 889】



40

スキーム IV に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-シアノベンゼン-1,4-ジアミン、1-メチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 853 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀N₆O₃ についての計算値: 535.25; 実測値: 535.04。

【1041】

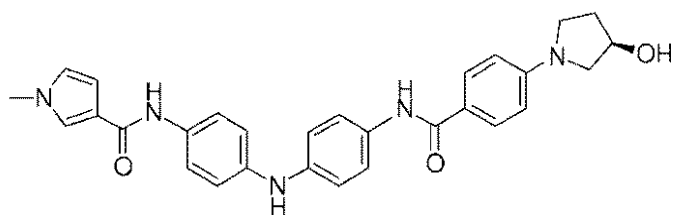
実施例 754

(R)-N-(4-((4-(4-(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド

50

(化合物 854)

【化 890】



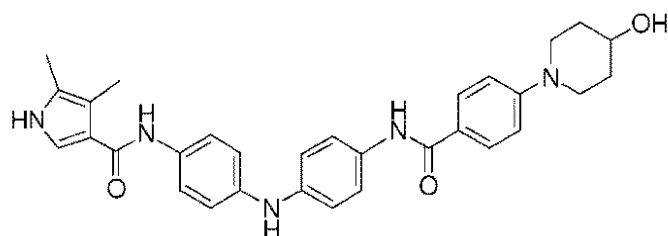
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および (R)-4-(3-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 854 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₉N₅O₃ についての計算値：496.23；実測値：495.95。

【1042】

実施例 755

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-4,5-ジメチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 855)

【化 891】



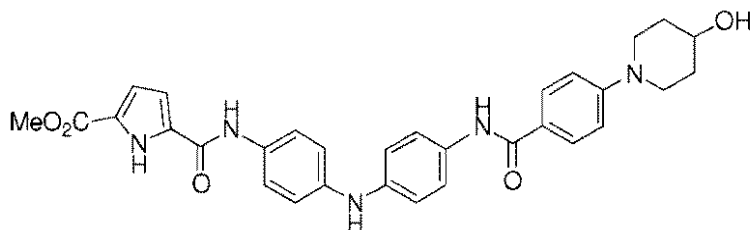
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、4,5-ジメチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 855 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₃N₅O₃ についての計算値：524.26；実測値：524.03。

【1043】

実施例 756

メチル 5-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)カルバモイル)-1H-ピロール-2-カルボキシレート (化合物 856)

【化 892】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、5-メトキシカルボニル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 856 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₁N₅O₅ についての計算値：554.13；実測値：554.07。

【1044】

実施例 757

10

20

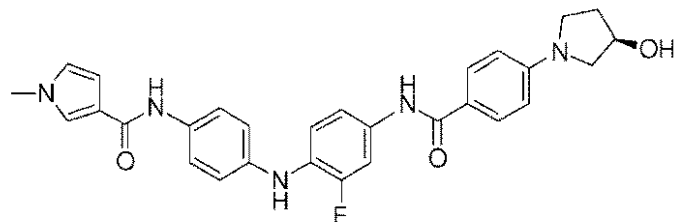
30

40

50

(R) - N - (4 - ((2 - フルオロ - 4 - (4 - (3 - ヒドロキシピロリジン - 1 - イル) ベンズアミド) フェニル) アミノ) フェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピロール - 3 - カルボキサミド (化合物 8 5 7)

【化 8 9 3】



10

スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹ - (4 - アミノフェニル) - 2 - フルオロベンゼン - 1 , 4 - ジアミン、1 - メチル - 1 H - ピロール - 3 - カルボン酸、および (R) - 4 - (3 - ヒドロキシピロリジン - 1 - イル) 安息香酸から化合物 8 5 7 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₈FN₅O₃ についての計算値：514.22；実測値：513.98。

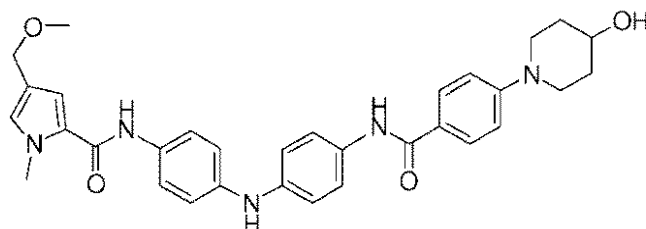
【1045】

実施例 7 5 8

N - (4 - ((4 - (4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) ベンズアミド) フェニル) アミノ) フェニル) - 4 - (メトキシメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボキサミド (化合物 8 5 8)

20

【化 8 9 4】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4' - ジアミノジフェニルアミン、4 - メトキシメチル - 1 - メチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸、および 4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) 安息香酸から化合物 8 5 8 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₆N₅O₄ についての計算値：554.28；実測値：554.07。

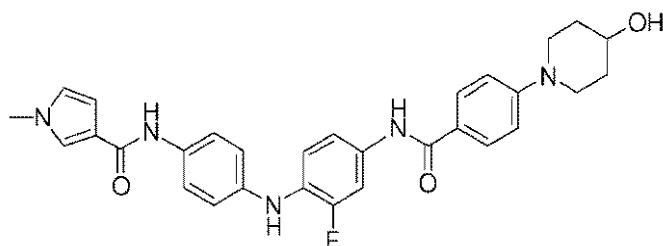
30

【1046】

実施例 7 5 9

N - (4 - ((2 - フルオロ - 4 - (4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) ベンズアミド) フェニル) アミノ) フェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピロール - 3 - カルボキサミド (化合物 8 5 9)

【化 8 9 5】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹ - (4 - アミノフェニル) - 2 - フルオロベンゼン - 1 , 4 - ジアミン、1 - メチル - 1 H - ピロール - 3 - カルボン酸、および 4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) 安息香酸から化合物 8 5 9 を調製した。

50

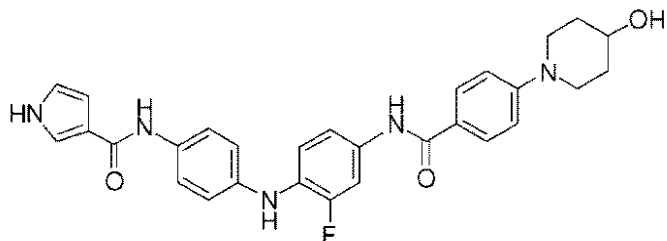
$[M+H]^+$ $C_{30}H_{30}FN_5O_3$ についての計算値：528.23；実測値528.02。

【1047】

実施例760

N-(4-((2-フルオロ-4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピロール-3-カルボキサミド(化合物860)

【化896】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1,4-ジアミン、1H-ピロール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物860を調製した。 $[M+H]^+$

$C_{29}H_{28}FN_5O_3$ についての計算値：514.22；実測値513.98。

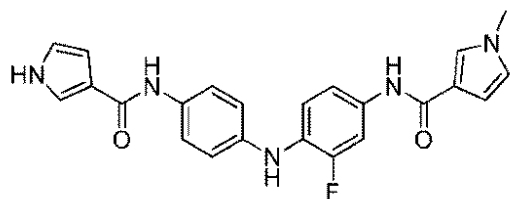
20

【1048】

実施例761

N-(4-((4-(1H-ピロール-3-カルボキサミド)フェニル)アミノ)-3-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド(化合物861)

【化897】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1,4-ジアミンおよび1H-ピロール-3-カルボン酸から化合物861を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{23}H_{20}FN_5O_2$ についての計算値：418.16；実測値417.88。

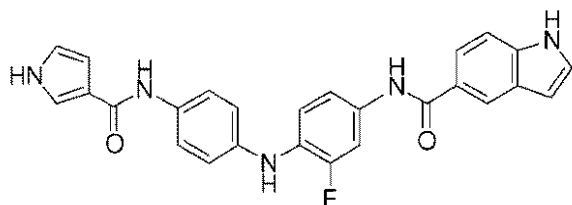
【1049】

実施例762

N-(4-((4-(1H-ピロール-3-カルボキサミド)フェニル)アミノ)-3-フルオロフェニル)-1H-インドール-5-カルボキサミド(化合物862)

40

【化898】



スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フル

50

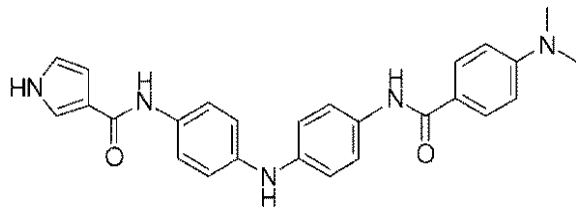
オロベンゼン-1, 4-ジアミン、1H-インドール-5-カルボン酸、および1H-ピロール-3-カルボン酸から化合物862を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₀FN₅O₂ についての計算値：454.16；実測値453.91。

【1050】

実施例763

N-(4-((4-(4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピロール-3-カルボキサミド(化合物863)

【化899】



10

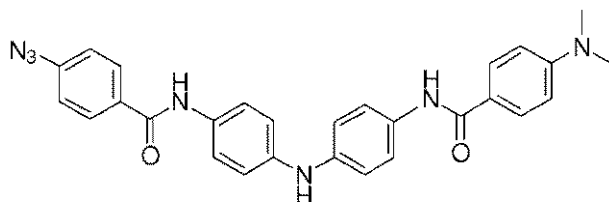
スキームIVに表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、4-ジメチルアミノ安息香酸、および1H-ピロール-3-カルボン酸から化合物863を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₅N₅O₂ についての計算値：440.20；実測値439.94。

【1051】

実施例764

4-アジド-N-(4-((4-(4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)ベンズアミド(化合物864)

【化900】



30

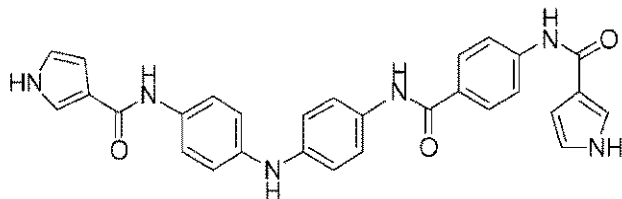
スキームIVに表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、4-ジメチルアミノ安息香酸、および4-アジド安息香酸から化合物864を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₅N₇O₂ についての計算値：492.21；実測値491.97。

【1052】

実施例765

N-(4-((4-(4-(1H-ピロール-3-カルボキサミド)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピロール-3-カルボキサミド(化合物865)

【化901】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、4-アミノ安息香酸、および1H-ピロール-3-カルボン酸から化合物865を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₄N₆O₃ についての計算値：505.19；実測値504

50

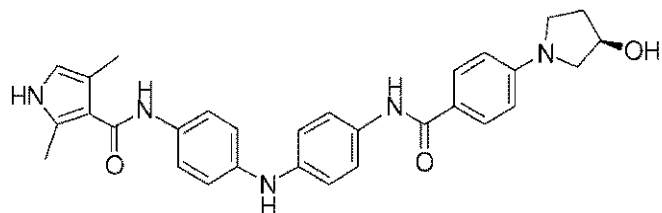
. 93。

【1053】

実施例766

(R)-N-(4-((4-(4-(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-2,4-ジメチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物866)

【化902】



10

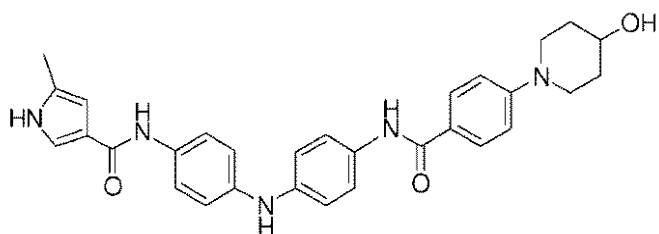
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、2,4-ジメチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および(R)-4-(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)安息香酸から化合物866を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{30}H_{31}N_5O_3$ についての計算値: 510.24; 実測値: 509.99。

【1054】

実施例767

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-5-メチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物867)

【化903】



30

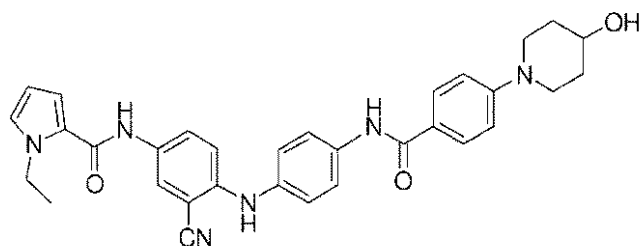
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、5-メチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物867を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{30}H_{31}N_5O_3$ についての計算値: 510.24; 実測値: 509.99。

【1055】

実施例768

N-(3-シアノ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-エチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物868)

【化904】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-シア

50

ノベンゼン-1, 4-ジアミン、1-エチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 868 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₂N₆O₃ についての計算値：549.25；実測値：549.08。

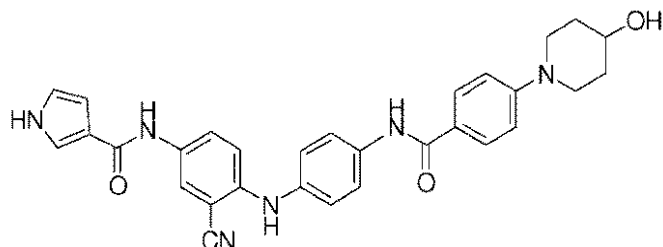
【1056】

実施例 769

N-(3-シアノ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 869)

【化905】

10



スキーム IV に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-シアノベンゼン-1, 4-ジアミン、1H-ピロール-3-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 869 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₈N₆O₃ についての計算値：521.22；実測値：521.00。

20

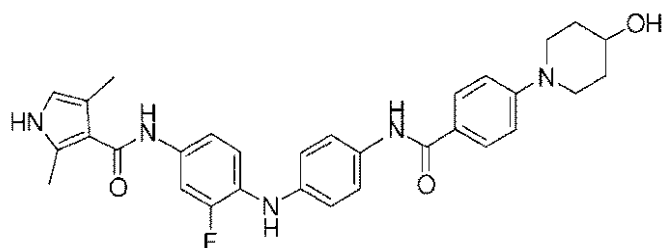
【1057】

実施例 770

N-(3-フルオロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-2, 4-ジメチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 870)

【化906】

30



スキーム IV に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1, 4-ジアミン、2, 4-ジメチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 870 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₂FN₅O₃ についての計算値：542.25；実測値 542.06。

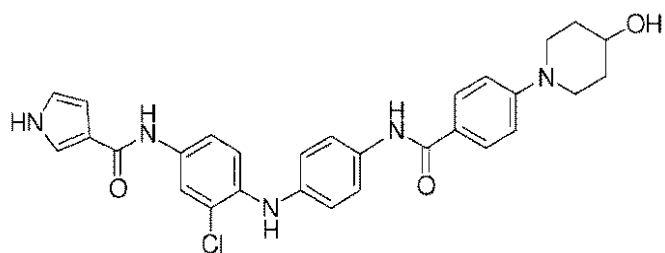
40

【1058】

実施例 771

N-(3-クロロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 871)

【化 9 0 7】



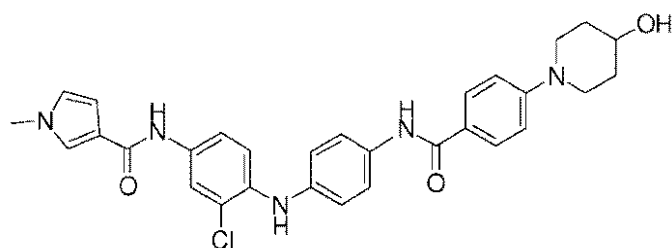
スキーム I V に表される手順にしたがって、 N^1 - (4-アミノフェニル) - 2-クロロベンゼン-1, 4-ジアミン、1H-ピロール-3-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 871 を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{29}H_{28}ClN_5O_3$ についての計算値：530.19；実測値 529.97。

【1059】

実施例 772

N-(3-クロロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 872)

【化 9 0 8】



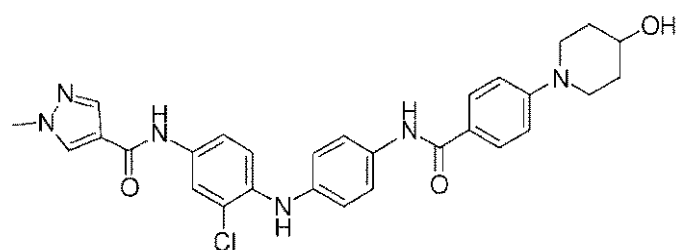
スキーム I V に表される手順にしたがって、 N^1 - (4-アミノフェニル) - 2-クロロベンゼン-1, 4-ジアミン、1-メチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 872 を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{30}H_{30}ClN_5O_3$ についての計算値：544.20；実測値 544.02。

【1060】

実施例 773

N-(3-クロロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド (化合物 873)

【化 9 0 9】



スキーム I V に表される手順にしたがって、 N^1 - (4-アミノフェニル) - 2-クロロベンゼン-1, 4-ジアミン、1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 873 を調製した。

$[M+H]^+$ $C_{29}H_{29}ClN_6O_3$ についての計算値：545.20；実測値 54

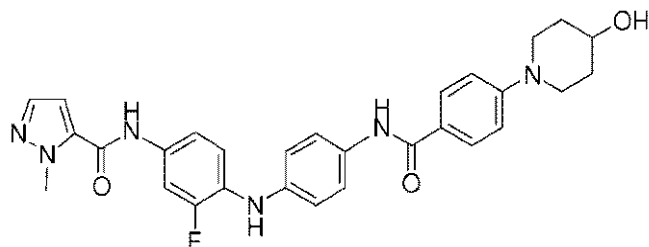
4. 96。

【1061】

実施例774

N-(3-フルオロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (化合物874)

【化910】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1,4-ジアミン、1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸、および4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物874を調製した。
[M+H]⁺ C₂₉H₂₉FN₆O₃ についての計算値: 529.23; 実測値 529.03。

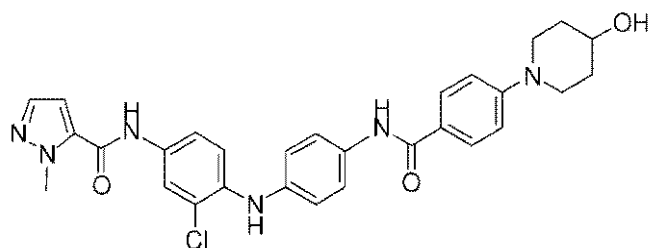
20

【1062】

実施例775

N-(3-クロロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (化合物875)

【化911】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-クロロベンゼン-1,4-ジアミン、1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸、および4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物875を調製した。

[M+H]⁺ C₂₉H₂₉ClN₆O₃ についての計算値: 545.20; 実測値 544.96。

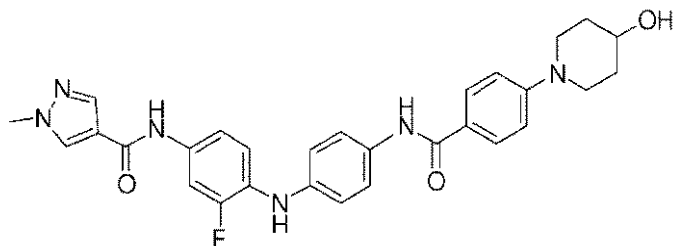
【1063】

実施例776

N-(3-フルオロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド (化合物876)

40

【化 9 1 2】



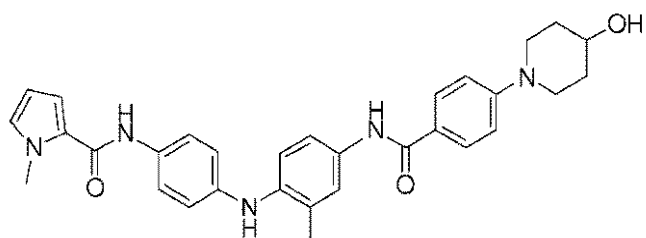
スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フル
オロベンゼン-1, 4-ジアミン、1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸、お
よび 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 876 を調製した。
[M+H]⁺ C₂₉H₂₉FN₆O₃ についての計算値：529.23；実測値 529.03。

【1064】

実施例 777

N-(4-((4-((4-((4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-2-
メチルフェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサ
ミド(化合物 877)

【化 9 1 3】



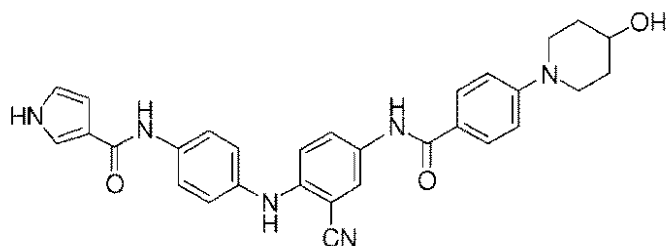
スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-メチ
ルベンゼン-1, 4-ジアミン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および
4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 877 を調製した。
[M+H]⁺ C₃₁H₃₃N₅O₃ についての計算値：524.26；実測値 524.03。

【1065】

実施例 778

N-(4-((2-シアノ-4-((4-((4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズ
アミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピロール-3-カルボキサミド(化合物
878)

【化 9 1 4】



スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-シア
ノベンゼン-1, 4-ジアミン、1H-ピロール-3-カルボン酸、および 4-(4-ヒ
ドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 878 を調製した。
[M+H]⁺

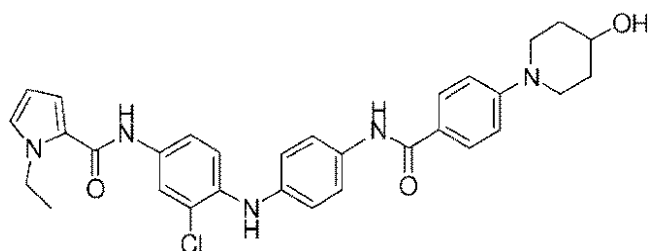
$C_{30}H_{28}N_6O_3$ についての計算値：521.22；実測値：521.00。

【1066】

実施例779

N-(3-クロロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-エチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド(化合物879)

【化915】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-クロロベンゼン-1,4-ジアミン、1-エチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物879を調製した。[M+H]⁺ $C_{31}H_{32}ClN_5O_3$ についての計算値：558.22；実測値558.06。

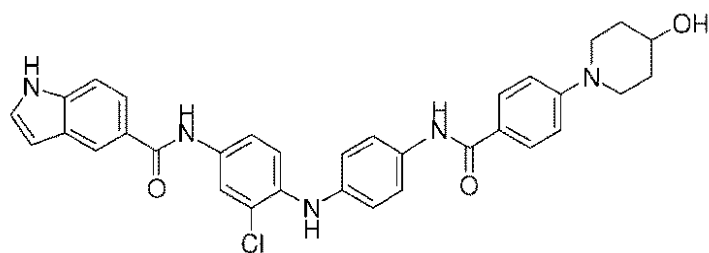
20

【1067】

実施例780

N-(3-クロロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-インドール-5-カルボキサミド(化合物880)

【化916】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-クロロベンゼン-1,4-ジアミン、1H-インドール-5-カルボン酸、および4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物880を調製した。[M+H]⁺ $C_{33}H_{30}ClN_5O_3$ についての計算値：580.20；実測値580.00。

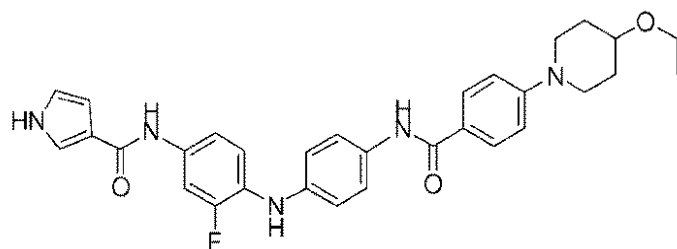
【1068】

実施例781

N-(3-フルオロ-4-((4-(4-(4-エトキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピロール-3-カルボキサミド(化合物881)

40

【化 9 1 7】



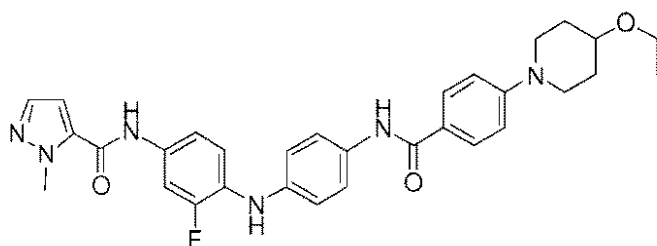
スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹ - (4 - アミノフェニル) - 2 - フル
 オロベンゼン - 1, 4 - ジアミン、1 H - ピロール - 3 - カルボン酸、および 4 - (4 -
 エトキシピペリジン - 1 - イル) 安息香酸から化合物 8 8 1 を調製した。[M + H]⁺
 C₃₁H₃₂FN₅O₃ についての計算値：542.25；実測値：542.06。

【1069】

実施例 782

N - (3 - フルオロ - 4 - ((4 - (4 - (4 - エトキシピペリジン - 1 - イル) ベンズ
 アミド) フェニル) アミノ) フェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキ
 サミド (化合物 8 8 2)

【化 9 1 8】



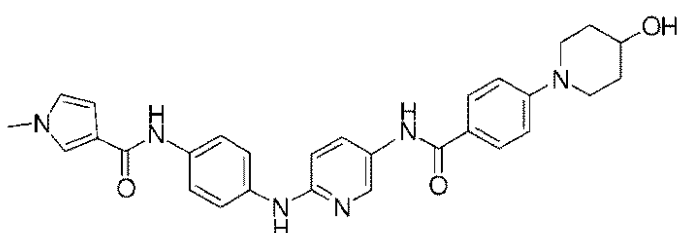
スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹ - (4 - アミノフェニル) - 2 - フル
 オロベンゼン - 1, 4 - ジアミン、1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸、お
 よび 4 - (4 - エトキシピペリジン - 1 - イル) 安息香酸から化合物 8 8 2 を調製した。
 [M + H]⁺ C₃₁H₃₃FN₆O₃ についての計算値：557.26；実測値：55
 7.11。

【1070】

実施例 783

N - (4 - ((5 - (4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) ベンズアミド) ピリ
 ジン - 2 - イル) アミノ) フェニル) - 1 - メチル - 1 H - ピロール - 3 - カルボキサミ
 ド (化合物 8 8 3)

【化 9 1 9】



スキーム I V に表される手順にしたがって、N² - (4 - アミノフェニル) ピリジン -
 2, 5 - ジアミン、1 - メチル - 1 H - ピロール - 3 - カルボン酸、および 4 - (4 - ヒ
 ドロキシピペリジン - 1 - イル) 安息香酸から化合物 8 8 3 を調製した。[M + H]⁺
 C₂₉H₃₀N₆O₃ についての計算値：511.24；実測値 511.01。

【1071】

10

20

30

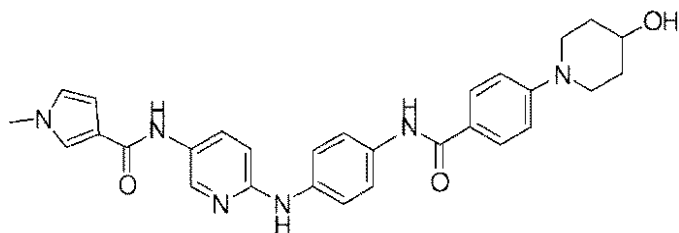
40

50

実施例 784

N- (6- ((4- (4- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) ベンズアミド) フェニル) アミノ) ピリジン-3-イル) -1-メチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 884)

【化 920】



10

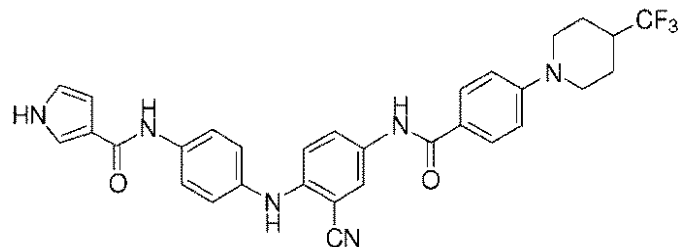
スキーム IV に表される手順にしたがって、N²- (4-アミノフェニル) ピリジン-2, 5-ジアミン、1-メチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および 4- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) 安息香酸から化合物 884 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₀N₆O₃ についての計算値: 511.24; 実測値 511.01。

【1072】

実施例 785

N- (4- ((2-シアノ-4- (4- (4-トリフルオロメチルピペリジン-1-イル) ベンズアミド) フェニル) アミノ) フェニル) -1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 885)

【化 921】



30

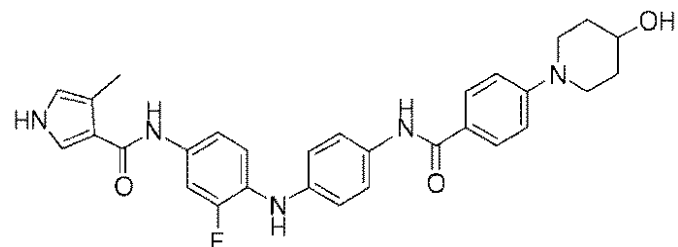
スキーム IV に表される手順にしたがって、N¹- (4-アミノフェニル) -2-シアノベンゼン-1, 4-ジアミン、1H-ピロール-3-カルボン酸、および 4- (4-トリフルオロメチルピペリジン-1-イル) 安息香酸から化合物 885 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₇F₃N₆O₂ についての計算値: 573.21; 実測値: 573.05。

【1073】

実施例 786

N- (3-フルオロ-4- ((4- (4- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) ベンズアミド) フェニル) アミノ) フェニル) -4-メチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 886)

【化 922】



50

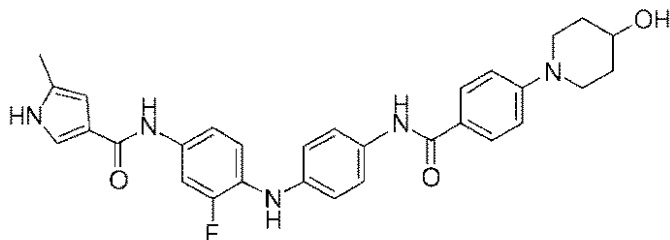
スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹ - (4-アミノフェニル) - 2-フルオロベンゼン-1, 4-ジアミン、4-メチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 886 を調製した。
 $[M+H]^+$ C₃₀H₃₀FN₅O₃ についての計算値：528.24；実測値：528.02。

【1074】

実施例 787

N-(3-フルオロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-5-メチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 887)

【化 923】



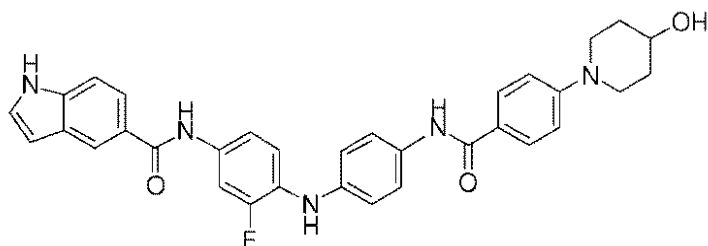
スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹ - (4-アミノフェニル) - 2-フルオロベンゼン-1, 4-ジアミン、5-メチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 887 を調製した。
 $[M+H]^+$ C₃₀H₃₀FN₅O₃ についての計算値：528.24；実測値：528.08。

【1075】

実施例 788

N-(3-フルオロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 888)

【化 924】



スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹ - (4-アミノフェニル) - 2-フルオロベンゼン-1, 4-ジアミン、1H-インドール-5-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 888 を調製した。
 $[M+H]^+$ C₃₃H₃₀FN₅O₃ についての計算値：564.23；実測値 564.07。

【1076】

実施例 789

N-(4-((2-シアノ-4-((4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 889)

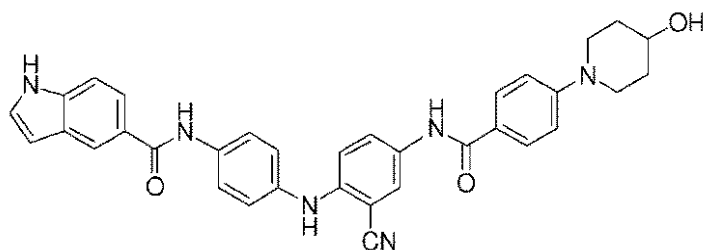
10

20

30

40

【化 9 2 5】



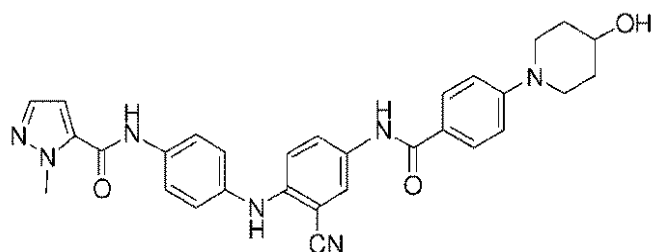
スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-シアノベンゼン-1, 4-ジアミン、1H-インドール-5-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物889を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₀N₆O₃ についての計算値：571.25；実測値：571.02。

【1077】

実施例790

N-(4-((2-シアノ-4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (化合物890)

【化 9 2 6】



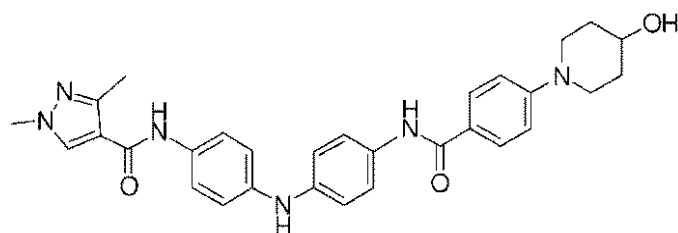
スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-シアノベンゼン-1, 4-ジアミン、1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物890を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₉N₇O₃ についての計算値：536.24；実測値：536.05。

【1078】

実施例791

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド (化合物891)

【化 9 2 7】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物891を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₂N₆O₃ についての計算値：525.25；実測値525.05。

【1079】

10

20

30

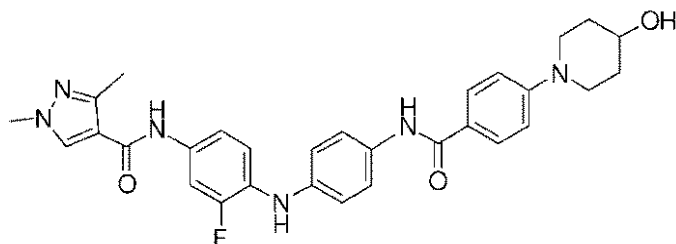
40

50

実施例 792

N-（3-フルオロ-4-（（4-（4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド）フェニル）アミノ）フェニル）-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド（化合物 892）

【化 928】



10

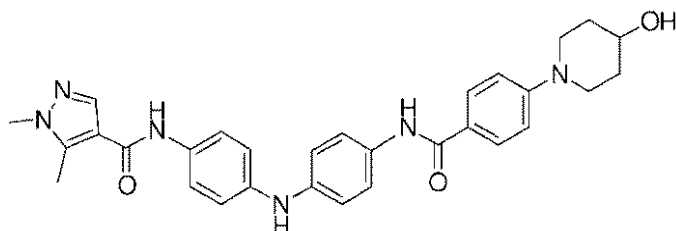
スキーム IV に表される手順にしたがって、N¹-（4-アミノフェニル）-2-フルオロベンゼン-1, 4-ジアミン、1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸、および 4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物 892 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₁FN₆O₃ についての計算値：543.24；実測値 543.07。

【1080】

実施例 793

N-（4-（（4-（4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド）フェニル）アミノ）フェニル）-1, 5-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド（化合物 893）

【化 929】



30

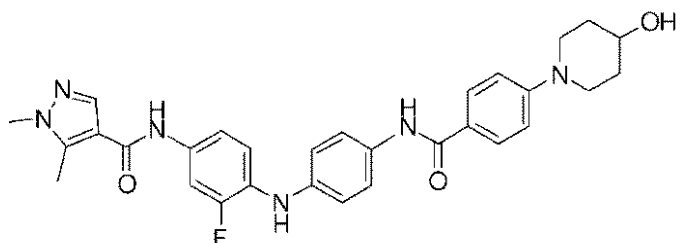
スキーム IV に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1, 5-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸、および 4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物 893 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₂N₆O₃ についての計算値：525.25；実測値 525.05。

【1081】

実施例 794

N-（3-フルオロ-4-（（4-（4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド）フェニル）アミノ）フェニル）-1, 5-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド（化合物 894）

【化 930】



50

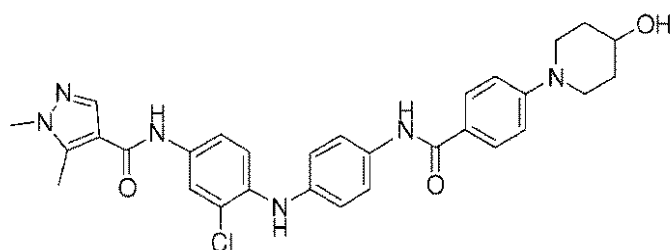
スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1, 4-ジアミン、1, 5-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物894を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₁FN₆O₃ についての計算値: 543.24; 実測値 543.07。

【1082】

実施例795

N-(3-クロロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1, 5-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド (化合物895)

【化931】



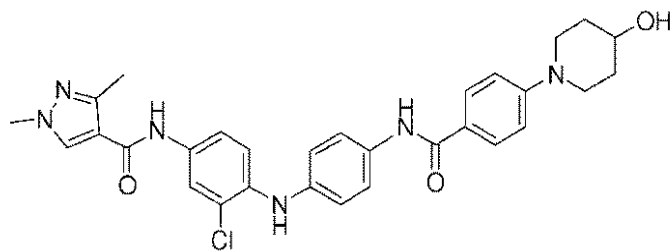
スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-クロロベンゼン-1, 4-ジアミン、1, 5-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物895を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₁ClN₆O₃ についての計算値: 559.21; 実測値 559.00。

【1083】

実施例796

N-(3-クロロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド (化合物896)

【化932】



スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-クロロベンゼン-1, 4-ジアミン、1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物896を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₁ClN₆O₃ についての計算値: 559.21; 実測値 559.00。

【1084】

実施例797

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-3, 5-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド (化合物897)

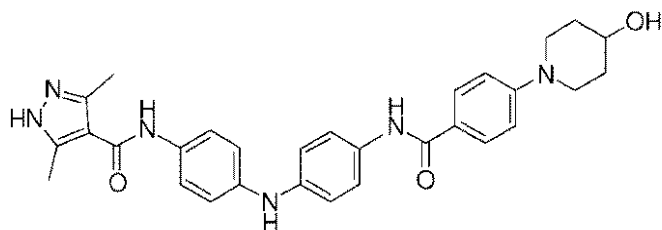
10

20

30

40

【化 9 3 3】



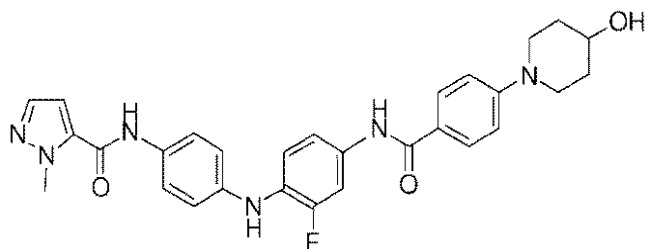
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、3, 5-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物897を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₂N₆O₃ についての計算値：525.25；実測値525.05。

【1085】

実施例798

N-(4-((2-フルオロ-4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (化合物898)

【化 9 3 4】



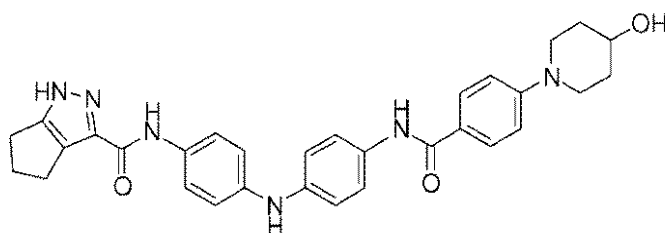
スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1, 4-ジアミン、1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物898を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₉FN₆O₃ についての計算値：529.23；実測値：529.03。

【1086】

実施例799

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1, 4, 5, 6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピラゾール-3-カルボキサミド (化合物899)

【化 9 3 5】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、1, 4, 5, 6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピラゾール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物899を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₂N₆O₃ についての計算値：537.25；実測値537.06

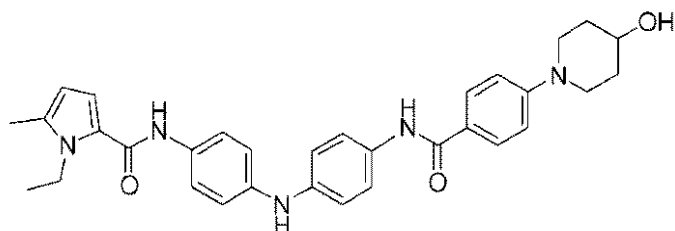
。

【1087】

実施例800

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-エチル-5-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物900)

【化936】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、1-エチル-5-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物900を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₅N₅O₃ についての計算値: 538.27; 実測値: 538.08。

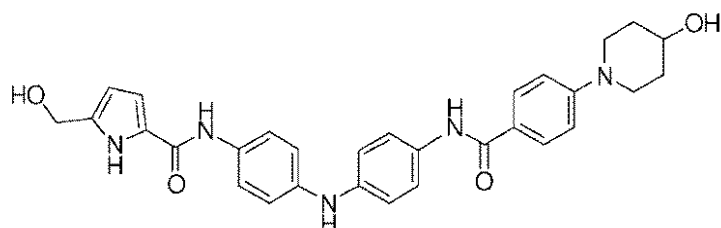
【1088】

20

実施例801

N-(4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-5-ヒドロキシメチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物901)

【化937】



30

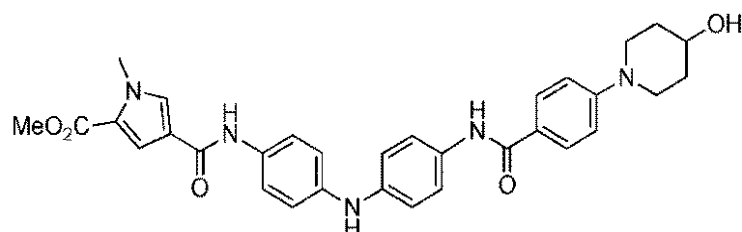
スキームIVに表される手順にしたがって、4,4'-ジアミノジフェニルアミン、5-ヒドロキシメチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物901を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₃N₅O₅ についての計算値: 568.16; 実測値: 568.05。

【1089】

実施例802

メチル4-((4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)カルバモイル)-1H-ピロール-2-カルボキシレート (化合物902)

【化938】



50

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノジフェニルアミン、5-メトキシカルボニル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物902を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{30}H_{31}N_5O_4$ についての計算値: 526.12; 実測値: 526.06。

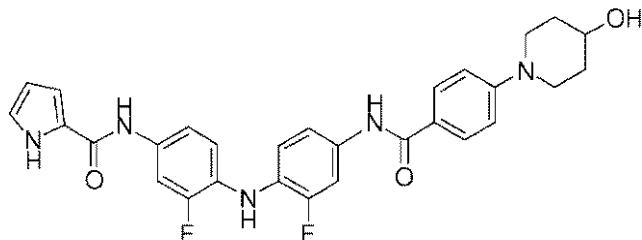
【1090】

実施例803

N-(3-フルオロ-4-((2-フルオロ-4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物903)

【化939】

10



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノ-2, 2'-ジフルオロジフェニルアミン、1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物903を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{29}H_{27}F_2N_5O_3$ についての計算値: 532.21; 実測値: 532.00。

20

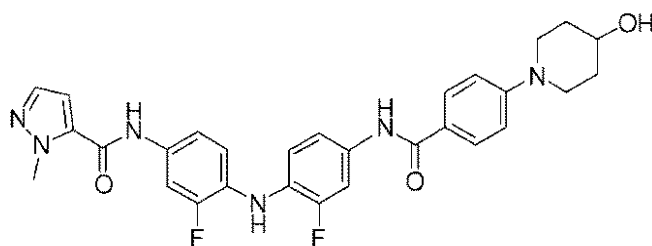
【1091】

実施例804

N-(3-フルオロ-4-((2-フルオロ-4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (化合物904)

【化940】

30



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノ-2, 2'-ジフルオロジフェニルアミン、1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物904を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{29}H_{28}F_2N_6O_3$ についての計算値: 547.22; 実測値: 547.05。

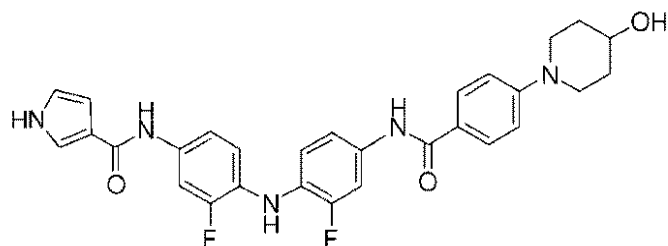
40

【1092】

実施例805

N-(3-フルオロ-4-((2-フルオロ-4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物905)

【化 9 4 1】



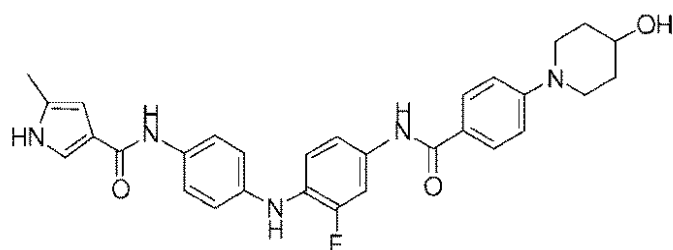
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノ-2, 2'-ジフルオロジフェニルアミン、1H-ピロール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物905を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{29}H_{27}F_2N_5O_3$ についての計算値: 532.21; 実測値 532.00。

【1093】

実施例 806

N-(4-((2-フルオロ-4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-5-メチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物906)

【化 9 4 2】



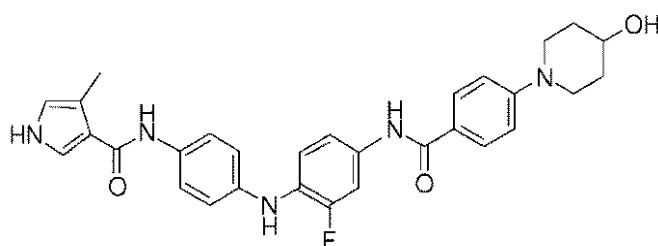
スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1, 4-ジアミン、5-メチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物906を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{30}H_{30}FN_5O_3$ についての計算値: 528.23; 実測値: 528.02。

【1094】

実施例 807

N-(4-((2-フルオロ-4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-4-メチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物907)

【化 9 4 3】



スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1, 4-ジアミン、4-メチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物907を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{30}H_{30}FN_5O_3$ についての計算値: 528.23; 実測値: 52

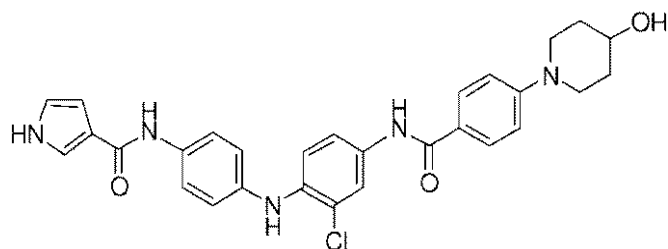
8. 02。

【1095】

実施例808

N-(4-((2-クロロ-4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピロール-3-カルボキサミド(化合物908)

【化944】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-クロロベンゼン-1,4-ジアミン、1H-ピロール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物908を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₈ClN₅O₃についての計算値: 530.19; 実測値 529.97。

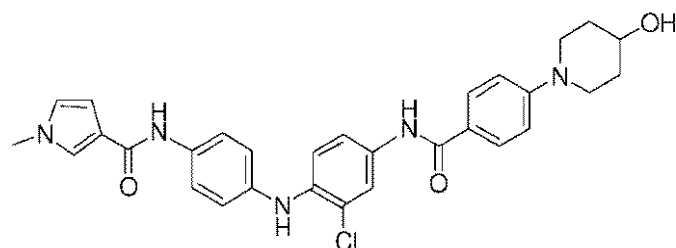
【1096】

20

実施例809

N-(4-((2-クロロ-4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド(化合物909)

【化945】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-クロロベンゼン-1,4-ジアミン、1-メチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物909を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₀ClN₅O₃についての計算値: 544.20; 実測値 544.02。

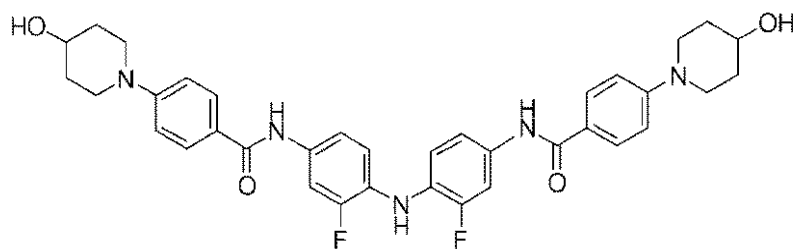
【1097】

実施例810

40

N, N'-(アザンジイルビス(3-フルオロ-4,1-フェニレン))ビス(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)(化合物910)

【化 9 4 6】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-ジアミノ-2, 2'-ジフルオロジフェニルアミンおよび 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 910 を調製した。[M+H]⁺ C₃₆H₃₇F₂N₅O₄ についての計算値：642.28；実測値 642.12。

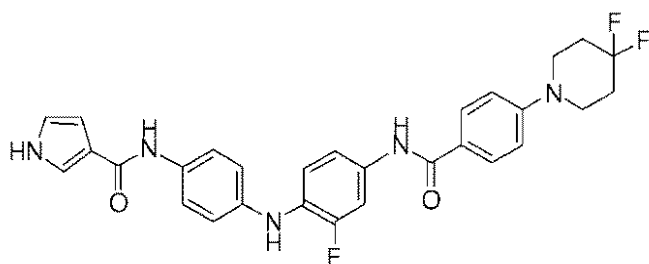
10

【1098】

実施例 811

N-(4-(2-フルオロ-4-(4-(4, 4-ジフルオロピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物 911)

【化 9 4 7】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹-(4-アミノフェニル)-2-フルオロベンゼン-1, 4-ジアミン、1H-ピロール-3-カルボン酸、および 4-(4, 4-ジフルオロピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 911 を調製した。¹H NMR (400 MHz、アセトン-d₆) δ 10.54 (s, 1H)、9.39 (s, 1H)、8.88 (s, 1H)、7.92 (m, 3H)、7.69 (d, J=8.8 Hz、2H)、7.54 (m, 1H)、7.43 (d, J=8.8 Hz、1H)、7.25 (t, J=9.2 Hz、1H)、7.07 (t, J=8.8 Hz、4H)、6.91 (s, 1H)、6.85 (q, J=2.3 Hz、1H)、6.71 (q, J=1.6 Hz、1H)、3.55 (t, J=5.8 Hz、4H)、2.11 (m, 4H)。

30

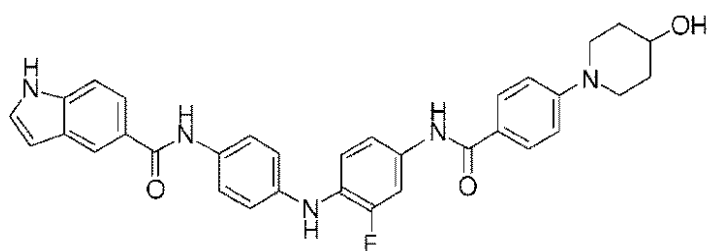
【1099】

実施例 812

N-(4-(2-フルオロ-4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 912)

40

【化 9 4 8】



50

スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹ - (4-アミノフェニル) - 2-フルオロベンゼン-1, 4-ジアミン、1H-インドール-5-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物912を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₀FN₅O₃ についての計算値：564.23；実測値564.07。

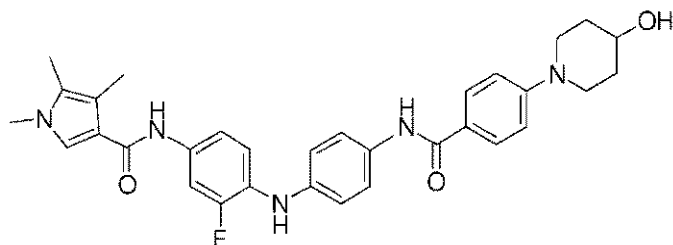
【1100】

実施例813

N-(3-フルオロ-4-((4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)アミノ)フェニル)-1, 4, 5-トリメチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド (化合物913)

【化949】

10



スキーム I V に表される手順にしたがって、N¹ - (4-アミノフェニル) - 2-フルオロベンゼン-1, 4-ジアミン、1, 4, 5-トリメチル-1H-ピロール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物913を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₄FN₅O₃ についての計算値：556.26；実測値：556.03。

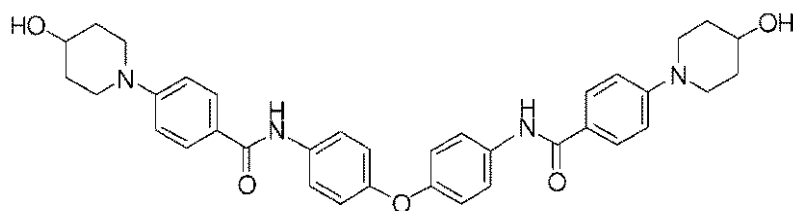
20

【1101】

実施例814

N, N'-(オキシビス(4, 1-フェニレン))ビス(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド) (化合物914)

【化950】



30

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-オキシジアニリンおよび4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物914を調製した。[M+H]⁺ C₃₆H₃₈N₄O₅ についての計算値：607.28；実測値607.21。

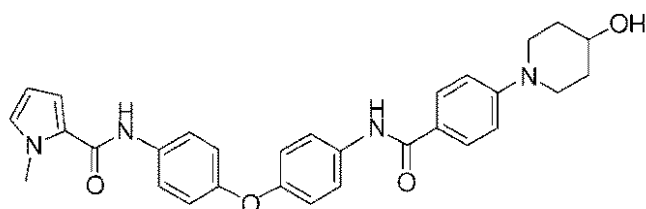
【1102】

実施例815

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェノキシ)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物915)

【化951】

40



50

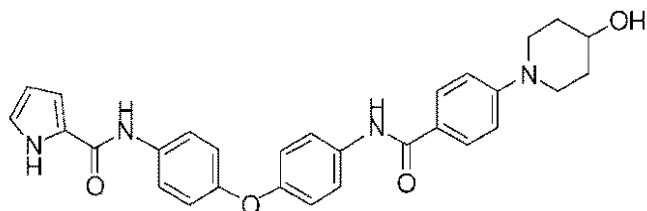
スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-オキシジアニリン、1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 915 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₀N₄O₄ についての計算値：511.23；実測値511.01。

【1103】

実施例 816

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェノキシ)フェニル)-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 916)

【化952】



10

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-オキシジアニリン、1H-ピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 916 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₈N₄O₄ についての計算値：497.21；実測値496.97。

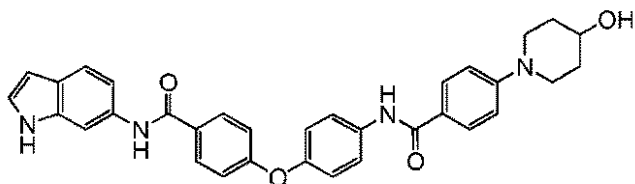
20

【1104】

実施例 817

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェノキシ)フェニル)-1H-インドール-6-カルボキサミド (化合物 917)

【化953】



30

スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-オキシジアニリン、1H-インドール-6-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 917 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₀N₄O₄ についての計算値：547.23；実測値547.05。

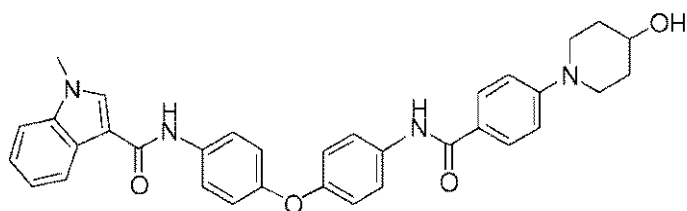
【1105】

実施例 818

N-(4-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェノキシ)フェニル)-1-メチル-1H-インドール-3-カルボキサミド (化合物 918)

40

【化954】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4, 4'-オキシジアニリン、1-メチル-1H-インドール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イ

50

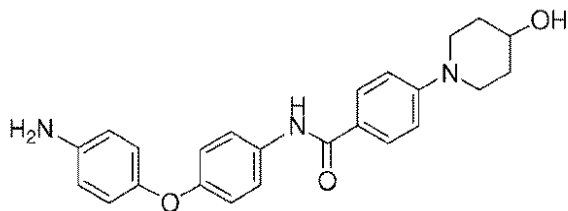
ル)安息香酸から化合物 918 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₂N₄O₄ についての計算値: 561.24; 実測値 561.10。

【1106】

実施例 819

N-(4-(4-アミノフェノキシ)フェニル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 919)

【化 955】



10

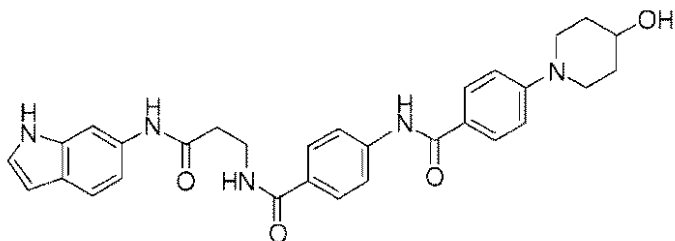
スキーム IV に表される手順にしたがって、4,4'-オキシジアニリンおよび 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 919 を調製した。[M+H]⁺ C₂₄H₂₅N₃O₃ についての計算値: 404.19; 実測値 404.05。

【1107】

実施例 820

N-(3-((1H-インドール-6-イル)アミノ)-3-オキソプロピル)-4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)ベンズアミド (化合物 920)

【化 956】



30

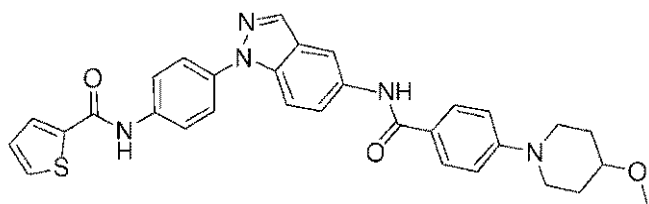
スキーム IV に表される手順にしたがって、6-アミノインドール、3-アミノプロパン酸、4-アミノ安息香酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 920 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₁N₅O₄ についての計算値: 526.24; 実測値 525.99。

【1108】

実施例 821

N-(4-(5-(4-(4-メトキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チオフェン-2-カルボキサミド (化合物 921)

【化 957】



40

スキーム IV に表される一般的な手順にしたがって、化合物 921 を調製した。4-フルオロ-N-(1H-インダゾール-5-イル)ベンズアミドの調製: 1H-インダゾール-5-アミン (5.5 g, 41 mmol)、ヒドロキシベンゾトリアゾール (558 m

50

g、4.13 mmol)、トリエチルアミン(6.3 mL、45 mmol)、および4-フルオロ安息香酸(6.36 g、45 mmol)をDMF(207 mL)中に取り、撹拌した。EDC(8.7 g、45 mmol)を溶液に最後に添加した。添加した後、溶液を室温で4時間撹拌した。次に、水を溶液に添加し、10分間撹拌した。形成された沈殿物をろ過し、水で、その後ヘキサンでよく洗浄した。固体を減圧下で乾燥させて、10.3 g(98%)の生成物を薄紫色の固体として得た。

【1109】

N-(1-(4-アミノフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-フルオロベンズアミドの調製：4-フルオロ-N-(1H-インダゾール-5-イル)ベンズアミド(10.3 g、40 mmol)、4-フルオロニトロベンゼン(4.3 mL、40 mmol)および炭酸セシウム(13 g、40 mmol)をDMSO(400 mL)中にとった。溶液を100℃まで加熱し、24時間撹拌した。溶液を冷ました後、沈殿物が形成されるまで水で希釈し、5分間、よく撹拌した。ろ過により黄色の固体を得て、次に、それを水で、その後ヘキサンでよく洗浄した。固体を減圧下で乾燥させた後、それをエタノール中に取り、窒素下で室温で撹拌した。溶液をPd(OH)₂(100 mg)で処理し、H₂ガスのバルーン下に置いた。室温で24時間撹拌した後、セライトを通したろ過によって触媒を除去した。ろ液を減圧下で濃縮して、9.36 g(67%)の粗生成物を黄色の固体として得た。

【1110】

N-(4-(5-(4-フルオロベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チオフェン-2-カルボキサミドの調製：N-(1-(4-アミノフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-フルオロベンズアミド(400 mg、1.15 mmol)を無水ピリジン(5.8 mL)中に取り、室温で撹拌した。次に、チオフェン-2-カルボニルクロリド(0.15 mL、1.44 mmol)を滴下して添加し、溶液を室温で4時間撹拌した。水、EtOAcおよびヘキサンを溶液に添加し、1時間激しく撹拌して、沈殿物を形成した。固体をろ過して取り除き、減圧下で乾燥させて、539 mg(94%)の生成物をオフホワイトの固体として得た。

【1111】

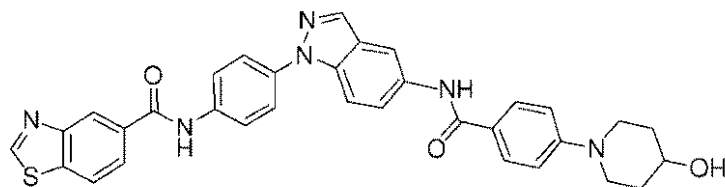
化合物921の調製：N-(4-(5-(4-フルオロベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チオフェン-2-カルボキサミド(25 mg、0.05 mmol)、4-メトキシピペリジン(165 mg、1.09 mmol)、炭酸セシウム(357 mg、1.09 mmol)およびDMSO(1 mL)をマイクロ波バイアルに添加した。混合物を130℃で5時間、マイクロ波で加熱した。冷ました溶液に水を添加し、激しく振とうすると、沈殿物が形成された。固体をろ過し、水で、その後ヘキサンで洗浄した。CH₂Cl₂/MeOH混合物を用いて固体を捕集し、減圧下でシリカ上に濃縮した。フラッシュクロマトグラフィー(0~10%のMeOH/CH₂Cl₂)による精製により、18.6 mg(61%)の化合物921を生成した。¹H NMR(500 MHz、DMSO-d₆) 10.41(s, 1H)、10.06(s, 1H)、8.37(s, 1H)、8.32(s, 1H)、8.05(d, J=5 Hz, 1H)、7.94(d, J=9 Hz, 2H)、7.88(d, J=9 Hz, 2H)、7.86(d, J=1 Hz, 1H)、7.83(d, J=9 Hz, 2H)、7.77(d, J=9.5 Hz, 1H)、7.77(d, J=9 Hz, 2H)、7.24(dd, J=4, 5 Hz, 1H)、7.00(d, J=9 Hz, 2H)、5.75(s, 3H)、3.66~3.63(m, 2H)、3.07~3.02(m, 2H)、1.94~1.88(m, 2H)、1.52~1.45(m, 2H)。

【1112】

実施例822

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)ベンゾ[d]チアゾール-5-カルボキサミド(化合物922)

【化 9 5 8】



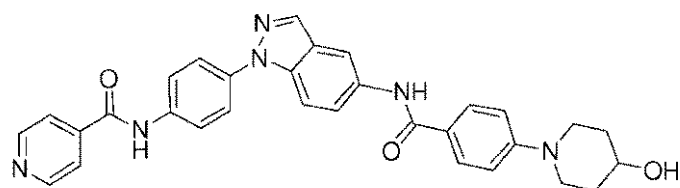
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、ベンゾ[d]チアゾール-5-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 9 2 2 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₂₈N₆O₃S についての計算値：589.19；実測値：589.12。

【1113】

実施例 8 2 3

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)イソニコチンアミド (化合物 9 2 3)

【化 9 5 9】



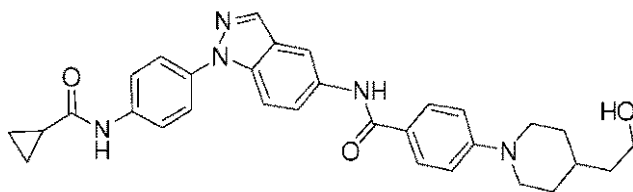
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、イソニコチン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 9 2 3 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₈N₆O₃ についての計算値：533.22；実測値：533.14。

【1114】

実施例 8 2 4

N-(1-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(4-(2-ヒドロキシエチル)ピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 9 2 4)

【化 9 6 0】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および4-(4-(2-ヒドロキシエチル)ピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 9 2 4 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₃N₅O₃ についての計算値：524.26；実測値：524.10。

【1115】

実施例 8 2 5

(±)-N-(1-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(3-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 9 2 5)

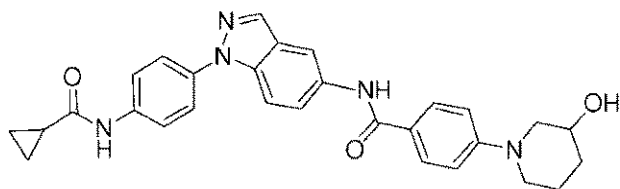
10

20

30

40

【化 9 6 1】



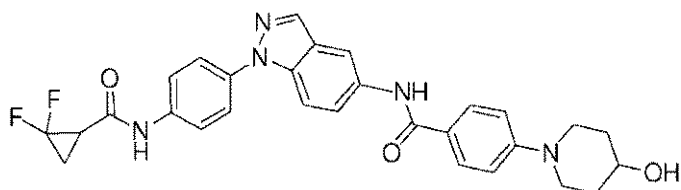
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および4-(3-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 9 2 5 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₉N₅O₃ 10
 についての計算値：496.23；実測値：496.14。

【1116】

実施例 8 2 6

N-(1-(4-(2,2-ジフルオロシクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 9 2 6)

【化 9 6 2】



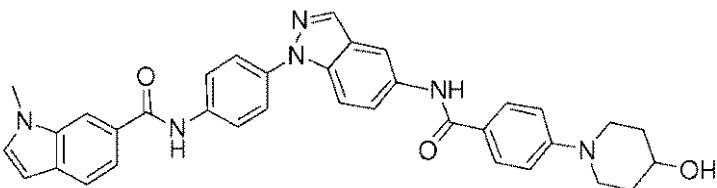
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、2,2-ジフルオロシクロプロパンカルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 9 2 6 を調製した。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 7.38 (s, 1H)、7.37 (m, 1H)、7.04 (d, J=5 Hz, 1H)、7.94 (d, J=8.5 Hz, 2H)、6.98 (d, J=9 Hz, 2H)、6.87 (d, J=11 Hz, 2H)、6.85 (d, J=9 Hz, 2H)、6.19 (d, J=9 Hz, 2H)、3.01~2.93 (m, 3H)、2.22 (ddd, J=3, 10.5, 13 Hz, 2H)、1.94~1.88 (m, 1H)、1.32~1.27 (m, 1H)、1.16~1.12 (m, 2H)、1.07~1.00 (m, 1H)、0.82~0.74 (m, 2H)。 30

【1117】

実施例 8 2 7

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-1-メチル-1H-インドール-6-カルボキサミド (化合物 9 2 7)

【化 9 6 3】



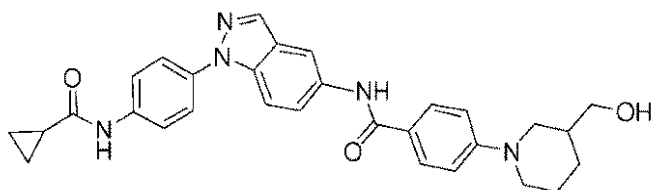
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、1-メチル-1H-インドール-6-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 9 2 7 を調製した。[M+H]⁺ C₃₅H₃₂N₆O₃ 50
 についての計算値：585.25；実測値：585.15。

【1118】

実施例 8 2 8

(±)-N-(1-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(3-ヒドロキシメチルピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 9 2 8)

【化 9 6 4】



10

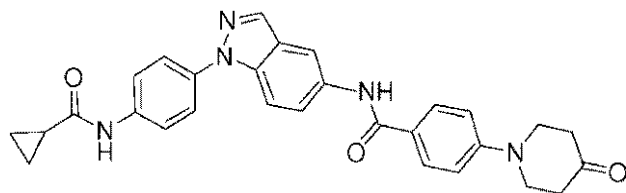
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および 4-(3-ヒドロキシメチルピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 9 2 8 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₁N₅O₃ についての計算値：510.24；実測値：510.12。

【1119】

実施例 8 2 9

N-(1-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(4-オキソピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 9 2 9)

【化 9 6 5】



20

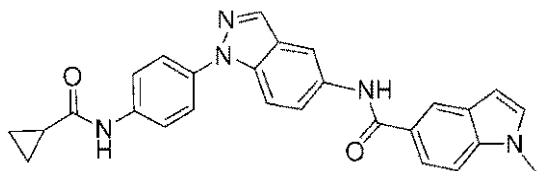
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および 4-(4-オキソピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 9 2 9 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₇N₅O₃ についての計算値：494.21；実測値：494.06。

【1120】

実施例 8 3 0

N-(1-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-1-メチル-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 9 3 0)

【化 9 6 6】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および 1-メチル-1H-インドール-5-カルボン酸から化合物 9 3 0 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₃N₅O₂ についての計算値：450.19；実測値：450.06。

【1121】

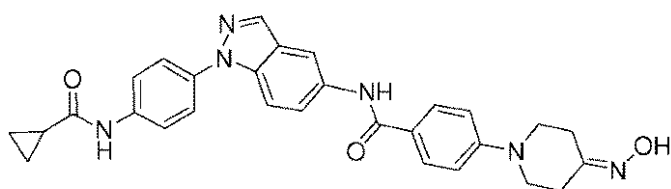
実施例 8 3 1

N-(1-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(4-(ヒドロキシイミノ)ピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化

50

化合物 931)

【化 967】



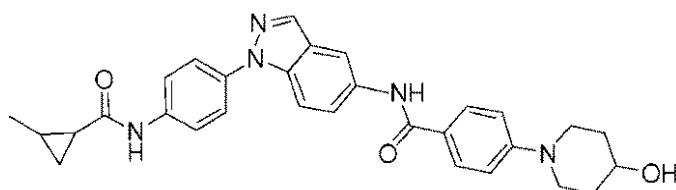
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および 4-(4-(ヒドロキシイミノ)ピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 931 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₈N₆O₃ についての計算値：509.22；実測値：509.10。

【1122】

実施例 832

(±)-N-(1-(4-(2-メチルシクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 932)

【化 968】



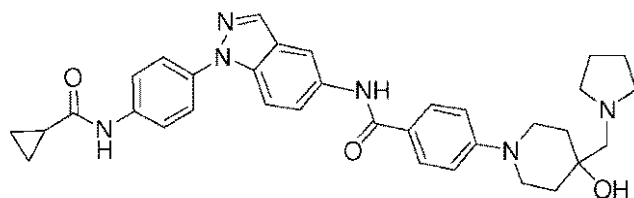
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、2-メチルシクロプロパンカルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 932 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₁N₅O₃ についての計算値：510.24；実測値：510.13。

【1123】

実施例 833

N-(1-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(4-ヒドロキシ-4-(ピロリジン-1-イルメチル)ピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 933)

【化 969】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシ-4-(ピロリジン-1-イルメチル)ピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 933 を調製した。

【1124】

実施例 834

N-(1-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ベンズアミド (化合物 934)

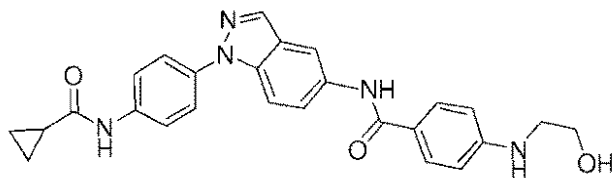
10

20

30

40

【化 9 7 0】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および4-(2-ヒドロキシエチルアミノ)安息香酸から化合物 9 3 4 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₅N₅O₃ についての計算値：456.20；実測値456.03。

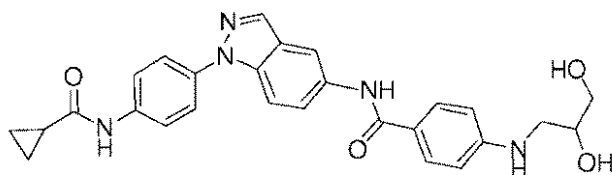
10

【1125】

実施例 8 3 5

(±)-N-(1-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-((2,3-ジヒドロキシプロピル)アミノ)ベンズアミド (化合物 9 3 5)

【化 9 7 1】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および4-(2,3-ジヒドロキシプロピルアミノ)安息香酸から化合物 9 3 5 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₇N₅O₄ についての計算値：486.21；実測値486.03。

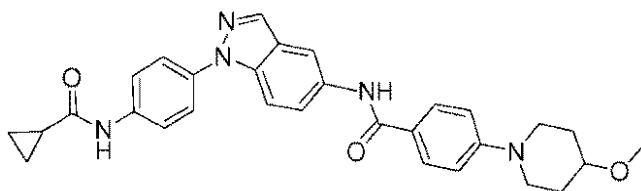
【1126】

実施例 8 3 6

N-(1-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(4-メトキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 9 3 6)

30

【化 9 7 2】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および4-(4-メトキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 9 3 6 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₁N₅O₃ についての計算値：510.24；実測値：510.12。

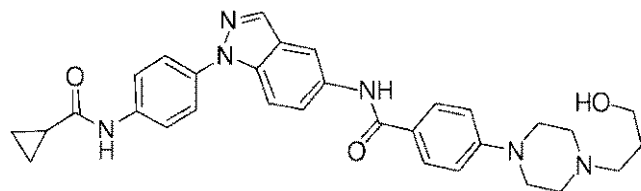
40

【1127】

実施例 8 3 7

N-(1-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(4-(3-ヒドロキシプロピル)ピペラジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 9 3 7)

【化 9 7 3】



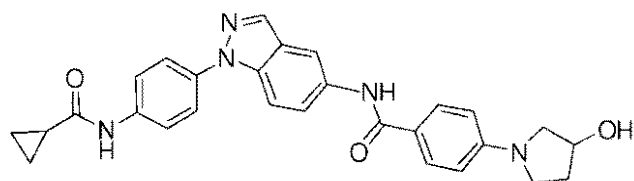
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および4-(4-(3-ヒドロキシプロピル)ピペラジン-1-イル)安息香酸から化合物 937 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₄N₆O₃ 10

【1128】

実施例 838

(±)-N-(1-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 938)

【化 9 7 4】



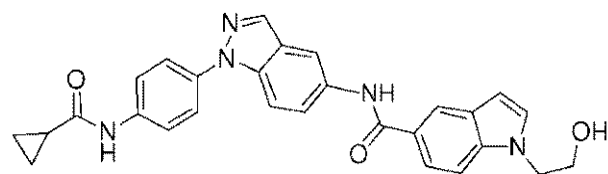
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および4-(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)安息香酸から化合物 938 を調製した。¹H NMR (500 MHz, CD₃OD) δ 8.19 (s, 1H)、8.17 (s, 1H)、7.86 (d, J=8.5 Hz、2H)、7.77 (d, J=8.5 Hz、2H)、7.70~7.63 (m, 4H)、6.62 (d, J=8.5 Hz、2H)、4.55 (s, 1H)、3.56~3.50 (m, 2H)、3.43 (dd, J=3.9 Hz、1H)、2.20~2.13 (m, 1H) 30
、2.08~2.04 (m, 1H)、1.83~1.78 (m, 1H)、1.28 (s, 1H)、1.00~0.97 (m, 2H)、0.90~0.86 (m, 2H)。

【1129】

実施例 839

N-(1-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 939)

【化 9 7 5】



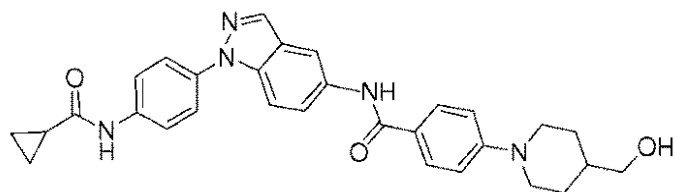
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-カルボン酸から化合物 939 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₅N₅O₃ 40
5 についての計算値：480.20；実測値 480.03。

【1130】

実施例 840

N-（1-（4-（シクロプロパンカルボキサミド）フェニル）-1H-インダゾール-5-イル）-4-（4-ヒドロキシメチルピペリジン-1-イル）ベンズアミド（化合物940）

【化976】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-（4-アミノフェニル）インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および4-（4-ヒドロキシメチルピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物940を調製した。¹H NMR（500MHz、DMSO-d₆）δ10.38（s、1H）、10.04（s、1H）、8.36（s、1H）、8.31（s、1H）、7.88（d、J=9Hz、2H）、7.81~7.75（m、6H）、7.69（d、J=8.5Hz、2H）、7.01（d、J=9.5Hz、2H）、4.72（d、J=4Hz、2H）、1.85~1.79（m、2H）、1.46~1.42（m、2H）、0.86~0.81（m、4H）。

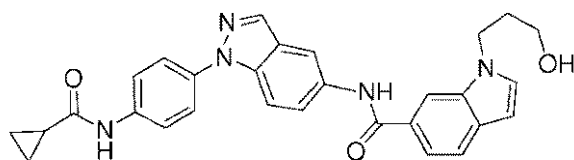
【1131】

20

実施例841

N-（1-（4-（シクロプロパンカルボキサミド）フェニル）-1H-インダゾール-5-イル）-1-（3-ヒドロキシプロピル）-1H-インドール-6-カルボキサミド（化合物941）

【化977】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-（4-アミノフェニル）インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および1-（3-ヒドロキシプロピル）-1H-インドール-6-カルボン酸から化合物941を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₇N₅O₃についての計算値：494.21；実測値：494.00。

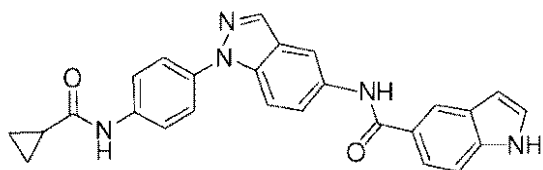
【1132】

実施例842

N-（1-（4-（シクロプロパンカルボキサミド）フェニル）-1H-インダゾール-5-イル）-1H-インドール-5-カルボキサミド（化合物942）

【化978】

40



スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-（4-アミノフェニル）インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および1H-インドール-5-カルボン酸から化合物942を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₁N₅O₂についての計算値：436.17；実測値：436.02。

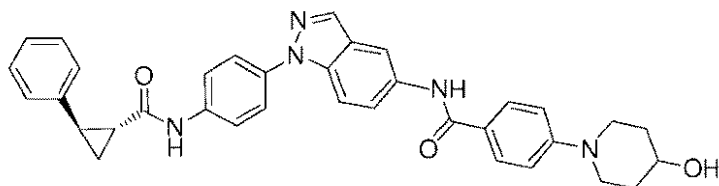
50

【 1 1 3 3 】

实施例 843

(±) - 4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) - N - (1 - (4 - ((トランス) - 2 - フェニルシクロプロパンカルボキサミド) フェニル) - 1 H - インダゾール - 5 - イル) ベンズアミド (化合物 943)

【化 9 7 9】



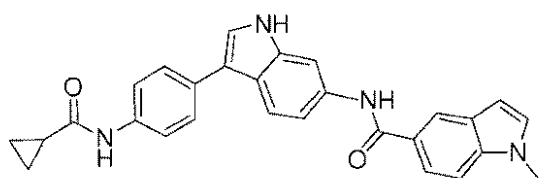
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、2-トランス-フェニルシクロプロパンカルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 943 を調製した。[M+H]⁺ C₃₅H₃₃N₅O₃ についての計算値：572.26；実測値 572.17。

【 1 1 3 4 】

实施例 844

N-（3-（4-（シクロプロパンカルボキサミド）フェニル）-1H-インドール-6-イル）-1-メチル-1H-インドール-5-カルボキサミド（化合物944）

【化 9 8 0】



スキーム I V に表される一般的な手順にしたがって、化合物 9 4 4 を調製した。3-ブロモ-6-ニトロ-1H-インドールの調製：塩化メチレン（100 mL）中の 6-ニトロ-1H-インドール（3.00 g、18.5 mmol）の溶液に、N-ブロモスクシンイミド（3.29 g、18.5 mmol）を同じ分量で 4 回に分けて 2 時間にわたって添加した。反応物を一晩攪拌し、形成された沈殿物をろ過して取り除き、水ですすいだ。有機相を除去し、水相を塩化メチレン（3×200 mL）で抽出することによって収集された二相のろ液を分けた。組み合わされた有機相を濃縮して、粗固体を得た。ろ液および抽出物から収集された固体を、メタノール／水を用いて再結晶化させ、ろ過した後、3-ブロモ-6-ニトロ-1H-インドール（3.95 g、16.4 mmol、89%）を黄色の固体として得た。

【 1 1 3 5 】

3-ブロモ-6-ニトロ-1-(フェニルスルホニル)-1H-インドールの調製：水素化ナトリウム(4.61g、11.5mmol)を、テトラヒドロフラン(10.0mL)中の3-ブロモ-6-ニトロ-1H-インドール(2.32g、9.61mmol)の溶液にゆっくりと添加した。5分間攪拌した後、塩化ベンゼンスルホニル(1.47mL、11.5mmol)を10分間かけて滴下して添加した。反応物をさらに1.5時間攪拌してから、5.0mLのメタノールで、その後10.0mLの水および20.0mLの塩化メチレンで急冷した。沈殿物をろ過して取り除き、過剰な塩化メチレンおよびメタノールで洗浄して、3-ブロモ-6-ニトロ-1-(フェニルスルホニル)-1H-インドールのクリーム色の粉末(2.80g、7.35mmol、76%)を得た。

【 1 1 3 6 】

3-ブロモ-1-(フェニルスルホニル)-1H-インドール-6-アミンの調製：エタノール(73.5 mL)中の3-ブロモ-6-ニトロ-1-(フェニルスルホニル)-

1H-インドール (2.80 g、7.35 mmol) のスラリーに、水 (11.0 mL) 中の塩化スズ (II) 一水和物 (6.63 g、29.4 mmol) の溶液を 30℃で添加した。添加が完了したら、反応物を 3.5 時間、加熱して還流させ、次に、pH 8 になるまで 2.0 N の水酸化ナトリウムで急冷した。残りのスラリーを酢酸エチル (100 mL) で希釈し、水層を除去し、ろ過した。有機相を 2.0 N の水酸化ナトリウム (2×100 mL) で洗浄し、組み合わされた水層を酢酸エチル (3×200 mL) で抽出した。組み合わされた有機相を濃縮して、3-ブロモ-1-(フェニルスルホニル)-1H-インドール-6-アミンの粘着性のオレンジ色の固体 (2.35 g、6.69 mmol、91%) を得た。

【1137】

3-(4-ニトロフェニル)-1H-インドール-6-アミンの調製：1.0 M の炭酸カリウム水溶液 (9.96 mL、9.96 mmol) を、テトラヒドロフラン (13.7 mL) 中の、3-ブロモ-1-(フェニルスルホニル)-1H-インドール-6-アミン (1.00 g、2.84 mmol) と、(4-ニトロフェニル) ボロン酸 (1.19 g、7.12 mmol) と、パラジウムテトラキス(トリフェニルホスフィン) (164 mg、0.14 mmol) との混合物に添加した。二相の混合物を 130℃で 10 分間、マイクロ波で加熱し、次に、炭酸水素ナトリウム (10.0 mL) および酢酸エチル (10.0 mL) の飽和溶液で希釈した。有機層を炭酸水素ナトリウム (2×10.0 mL) の飽和溶液で洗浄し、組み合わされた水層を酢酸エチル (3×30.0 mL) で抽出した。組み合わされた有機相を、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。粗残渣をフラッシュクロマトグラフィー (10-25-50-71% の酢酸エチル/ヘキサン) によって精製して、3-(4-ニトロフェニル)-1-(フェニルスルホニル)-1H-インドール-6-アミンのオレンジ色の固体 (726 mg、1.85 mmol、65%) を得た。3-(4-ニトロフェニル)-1H-インドール-6-アミン。メタノール (9.00 mL) 中の保護されたインドール-6-アミン (300 mg、0.76 mmol) の溶液に、水酸化カリウム (941 mg、16.8 mmol) を添加した。反応物を 4 時間にわたって 70℃まで温めた。その後、反応物を水 (10.0 mL) および塩化メチレン (15.0 mL) で希釈し、有機相を除去した。水層を塩化メチレン (3×15.0 mL) で抽出し、組み合わされた有機相を濃縮した。残った粗残渣をフラッシュクロマトグラフィー (10-25-50% の酢酸エチル/ヘキサン) によって精製して、3-(4-ニトロフェニル)-1H-インドール-6-アミンの赤ワイン色の固体 (66.3 mg、0.26 mmol、34%) を得た。

【1138】

1-メチル-N-(3-(4-ニトロフェニル)-1H-インドール-6-イル)-1H-インドール-5-カルボキサミドの調製：DMF (1.00 mL) 中の、3-(4-ニトロフェニル)-1H-インドール-6-アミン (66.3 mg、0.26 mmol) と、1-メチル-1H-インドール-5-カルボン酸 (50.4 mg、0.29 mmol) と、ヒドロキシベンゾトリアゾール (3.5 mg、0.03 mmol) と、トリエチルアミン (40.1 μL、0.29 mmol) との混合物を、5 分間攪拌してから、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド塩酸塩 (55.2 mg、0.29 mmol) を添加した。反応物を室温で一晩攪拌し、次に、水 (5.0 mL) で希釈した。形成された沈殿物をろ過して取り除き、続いて、過剰な塩化メチレンおよびメタノールで洗浄した。高温メタノールを用いて固体を再結晶化させ、ろ過した後、1-メチル-N-(3-(4-ニトロフェニル)-1H-インドール-6-イル)-1H-インドール-5-カルボキサミドの鮮黄色の固体 (59.8 mg、0.15 mmol、56%) を得た。

【1139】

N-(3-(4-アミノフェニル)-1H-インドール-6-イル)-1-メチル-1H-インドール-5-カルボキサミドの調製：窒素雰囲気下のエタノール (1.50 mL) 中の 1-メチル-N-(3-(4-ニトロフェニル)-1H-インドール-6-イル)

10

20

30

40

50

ー1H-インドール-5-カルボキサミド (59.0 mg, 0.14 mmol) のスラリーに、20重量%の水酸化パラジウム／炭素 (5.9 mg, 10重量%) を添加し、その後水素のバルーンを添加した。反応物を室温で一晩攪拌し、次に、セライトパッドを通してろ過し、過剰なメタノールおよび塩化メチレンですすいだ。ろ液を濃縮して、N-(3-(4-アミノフェニル)-1H-インドール-6-イル)-1-メチル-1H-インドール-5-カルボキサミドの桃灰色の固体 (56.9 mg, 0.14 mmol, 100%) を得た。

【1140】

化合物944の調製：N,N-ジメチルホルムアミド (1.00 mL) 中の、N-(3-(4-アミノフェニル)-1H-インドール-6-イル)-1-メチル-1H-インドール-5-カルボキサミド (55.8 mg, 0.15 mmol) と、シクロプロパンカルボン酸 (12.8 μ L, 0.16 mmol) と、ヒドロキシベンゾトリアゾール (1.9 mg, 0.02 mmol) と、トリエチルアミン (22.5 μ L, 0.16 mmol) との混合物を、5分間攪拌してから、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (30.9 mg, 0.16 mmol) を添加した。反応物を室温で一晩攪拌し、次に、水 (5.0 mL) で希釈した。

【1141】

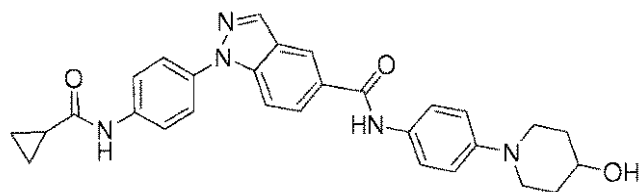
形成された沈殿物をろ過して取り除き、続いて、過剰な塩化メチレンおよびメタノールで洗浄した。高温メタノールを用いて固体を再結晶化させ、ろ過した後、N-(3-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インドール-6-イル)-1-メチル-1H-インドール-5-カルボキサミドの黄色の固体 (46.8 mg, 0.10 mmol, 70%) を得た。MS $[M+H]^+$ $C_{28}H_{24}N_4O_2$ についての計算値：449.04；実測値：449.05。

【1142】

実施例845

1-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-N-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)フェニル)-1H-インダゾール-5-カルボキサミド (化合物945)

【化981】



スキームIVに表される一般的な手順にしたがって、化合物945を調製した。N-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)フェニル)-1H-インダゾール-5-カルボキサミドの調製：1H-インダゾール-5-カルボン酸塩酸塩 (100 mg, 0.50 mmol)、ヒドロキシベンゾトリアゾール (7 mg, 0.05 mmol)、トリエチルアミン (0.2 mL, 1.3 mmol)、および1-(4-アミノフェニル)ピペリジン-4-オール (193 mg, 1.00 mmol) をDMF (2.51 mL) 中に取り、攪拌した。EDC (106 mg, 0.05 mmol) を溶液に最後に添加した。添加した後、溶液を室温で24時間攪拌した。溶液を水とEtOAcとに分液した。水層をEtOAcで抽出した。組み合わせられた有機層を塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 上で乾燥させた。ろ過および濃縮により、粗製アミドを得た。フラッシュクロマトグラフィー (0~10%のMeOH/ CH_2Cl_2) による精製により、55 mg (32%) の生成物を白色の固体として得た。

【1143】

1-(4-アミノフェニル)-N-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)フ

フェニル) - 1H-インダゾール-5-カルボキサミドの調製: N-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)フェニル)-1H-インダゾール-5-カルボキサミド (10 mg、0.03 mmol)、4-フルオロニトロベンゼン (3.1 μ L、0.03 mmol) および炭酸カリウム (4 mg、0.03 mmol) を DMSO (0.3 mL) 中にとった。溶液を 120℃まで加熱し、24時間撹拌した。溶液を冷ました後、沈殿物が形成されるまで水で希釈し、5分間よく撹拌した。ろ過により黄色の固体を得て、次にそれを水で、その後ヘキサンでよく洗浄した。固体を減圧下で乾燥させた後、それをメタノール中に取り、窒素下で室温で撹拌した。溶液を Pd(OH)₂ (3 mg) で処理し、H₂ ガスのバルーン下に置いた。室温で24時間撹拌した後、セライトを通したろ過によって触媒を除去した。ろ液を減圧下で濃縮して、10.23 mg (80%) の粗生成物を得た。

10

【1144】

化合物945の調製: 1-(4-アミノフェニル)-N-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)フェニル)-1H-インダゾール-5-カルボキサミド (10 mg、0.02 mmol)、EDC (6.7 mg、0.03 mmol) およびシクロプロパンカルボン酸 (2.1 mg、0.02 mmol) をピリジン (0.23 mL) 中にとった。溶液を60℃まで加熱し、1時間撹拌した。溶液をCH₂Cl₂と水とに分液した。水層をCH₂Cl₂で抽出した。組み合わされた有機層を塩水で洗浄し、Na₂SO₄上で乾燥させた。ろ過および濃縮により、粗製シクロプロピルアミドを得た。フラッシュクロマトグラフィー (0~10%のMeOH/CH₂Cl₂) による精製により、8.8 mg (76%) の化合物945を得た。[M+H]⁺ C₂₉H₂₉N₅O₃ についての計算値: 496.23; 実測値: 496.02。

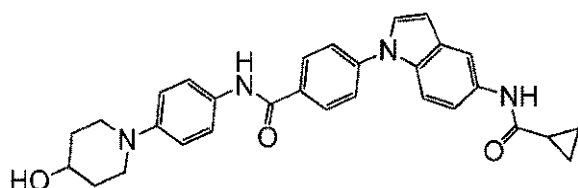
20

【1145】

実施例846

4-(5-(シクロプロパンカルボキサミド)-1H-インドール-1-イル)-N-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)フェニル)ベンズアミド (化合物946)

【化982】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、1-(4-アミノフェニル)-1H-インドール-5-カルボン酸、シクロプロパンカルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)アニリンから化合物946を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₀N₄O₃ についての計算値: 495.23; 実測値: 495.08。

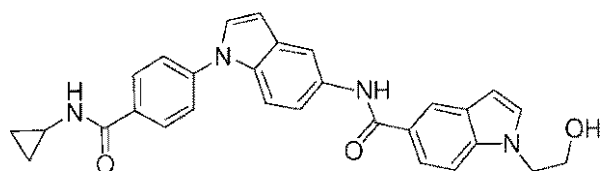
【1146】

実施例847

N-(1-(4-(シクロプロピルカルバモイル)フェニル)-1H-インドール-5-イル)-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物947)

40

【化983】



スキームIVに表される手順にしたがって、4-(5-アミノ-1H-インドール-1

50

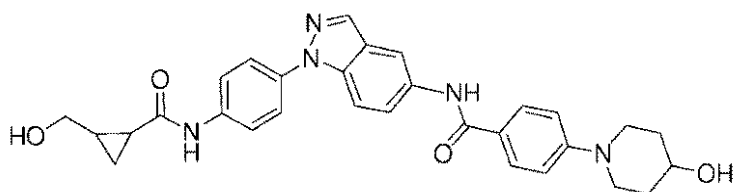
－イル)安息香酸、シクロプロパンアミン、および1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－カルボン酸から化合物947を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{29}H_{26}N_4O_3$ についての計算値：479.20；実測値：479.01。

【1147】

実施例848

(±)－4－(4－ヒドロキシピペリジン－1－イル)－N－(1－(4－(2－ヒドロキシメチルシクロプロパンカルボキサミド)フェニル)－1H－インダゾール－5－イル)ベンズアミド(化合物948)

【化984】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、5－アミノ－1－(4－アミノフェニル)インダゾール、2－ヒドロキシメチルシクロプロパンカルボン酸、および4－(4－ヒドロキシピペリジン－1－イル)安息香酸から化合物948を調製した。 ^1H NMR (500 MHz, CD_3OD) δ 8.21 (m, 2H)、7.88 (d, $J=9.1$ Hz, 2H)、7.79 (d, $J=8.8$ Hz, 2H)、7.74～7.65 (m, 4)、7.04 (d, $J=8.8$ Hz, 2H)、3.84～3.77 (m, 3H)、3.09～3.04 (m, 2H)、1.98～1.96 (m, 1H)、1.65～1.58 (m, 4H)、1.22～1.19 (m, 1H)、0.94～0.88 (m, 2H)。

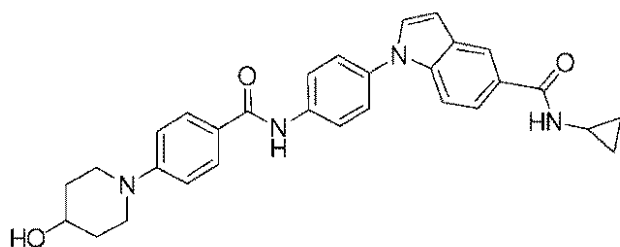
20

【1148】

実施例849

N－シクロプロピル－1－(4－(4－(4－ヒドロキシピペリジン－1－イル)ベンズアミド)フェニル)－1H－インドール－5－カルボキサミド(化合物949)

【化985】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、シクロプロピルアミン、1－(4－アミノフェニル)－1H－インドール－5－カルボン酸、および4－(4－ヒドロキシピペリジン－1－イル)安息香酸から化合物949を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{30}H_{31}N_4O_3$ についての計算値：495.24；実測値：495.08。

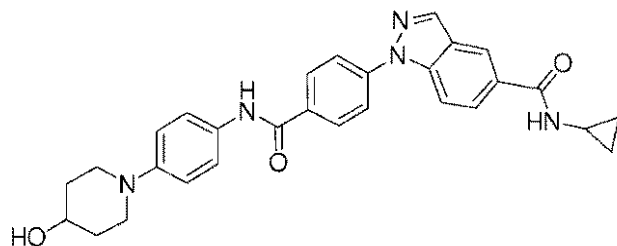
40

【1149】

実施例850

N－シクロプロピル－1－(4－((4－(4－ヒドロキシピペリジン－1－イル)フェニル)カルバモイル)フェニル)－1H－インダゾール－5－カルボキサミド(化合物950)

【化 9 8 6】



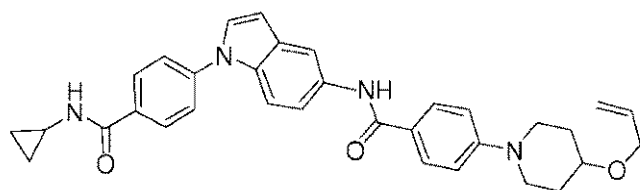
スキーム I V に表される手順にしたがって、シクロプロピルアミン、1-(4-カルボキシフェニル)-1H-インダゾール-5-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)アニリンから化合物 950 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₉N₅O₃ についての計算値：496.23；実測値：496.02。

【1150】

実施例 851

4-(4-(4-(アリルオキシ)ピペリジン-1-イル)-N-(1-(4-(シクロプロピルカルバモイル)フェニル)-1H-インドール-5-イル)ベンズアミド (化合物 951)

【化 9 8 7】



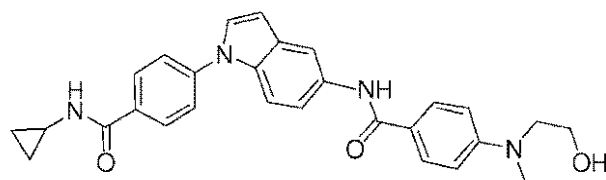
スキーム I V に表される手順にしたがって、4-(5-アミノ-1H-インドール-1-イル)安息香酸、シクロプロパンアミン、および4-(4-アリルオキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 951 を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₄N₄O₃ についての計算値：535.26；実測値 535.10。

【1151】

実施例 852

N-シクロプロピル-4-(5-(4-(2-ヒドロキシエチル)(メチル)アミノ)ベンズアミド)-1H-インドール-1-イル)ベンズアミド (化合物 952)

【化 9 8 8】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4-(5-アミノ-1H-インドール-1-イル)安息香酸、シクロプロパンアミン、および4-(N-(2-ヒドロキシエチル)-N-メチルアミノ)安息香酸から化合物 952 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₈N₄O₃ についての計算値：469.22；実測値 468.96。

【1152】

実施例 853

4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(1-(4-(チアゾール-2-イルカルバモイル)フェニル)-1H-インドール-5-イル)ベンズアミド (化合物 953)

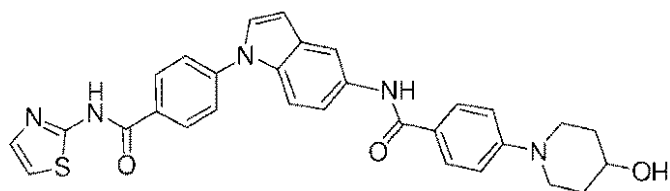
10

20

30

40

【化 9 8 9】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4-（5-アミノ-1H-インドール-1-イル）安息香酸、2-アミノチアゾール、および4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物 9 5 3 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₇N₅O₃S についての計算値：538.18；実測値：539.02。

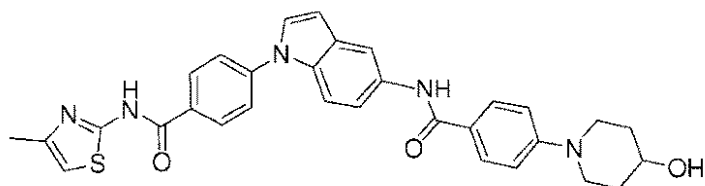
10

【1153】

実施例 8 5 4

4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）-N-（1-（4-（4-メチルチアゾール-2-イルカルバモイル）フェニル）-1H-インドール-5-イル）ベンズアミド（化合物 9 5 4）

【化 9 9 0】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、4-（5-アミノ-1H-インドール-1-イル）安息香酸、2-アミノ-4-メチルチアゾール、および4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物 9 5 4 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₉N₅O₃S についての計算値：552.10；実測値：552.05。

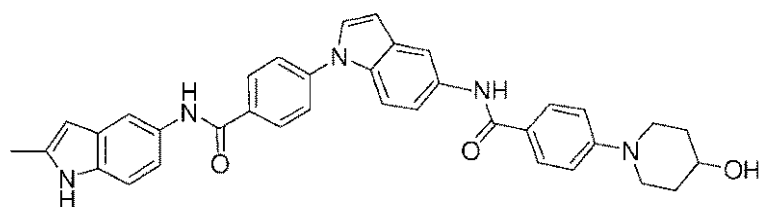
【1154】

実施例 8 5 5

4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）-N-（1-（4-（2-メチル-1H-インドール-5-イルカルバモイル）フェニル）-1H-インドール-5-イル）ベンズアミド（化合物 9 5 5）

30

【化 9 9 1】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-2メチルインドール、4-（5-アミノ-1H-インドール-1-イル）安息香酸、および4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物 9 5 5 を調製した。¹H NMR（500MHz、DMSO-d₆）δ 10.85（s, 1H）、10.11（s, 1H）、9.90（s, 1H）、8.17（d, J=8.5Hz、2H）、8.14（d, J=2Hz、1H）、7.88（d, J=9Hz、2H）、7.86（d, J=2Hz、1H）、7.77（d, J=8.5Hz、2H）、7.75（d, J=3Hz、1H）、7.65（d, J=9Hz、1H）、7.56（dd, J=2、9Hz、1H）、7.33（dd, J=1.5、8.5Hz、1H）、7.23（d, J=8.5Hz、1H）、7.00（d, J=

50

9 Hz、2 H)、6.74 (d, J = 3.5 Hz、1 H)、6.11 (t, J = 1 Hz、1 H)、4.71 (d, J = 4 Hz、1 H)、3.72 ~ 3.66 (m, 3 H)、3.00 (dd, J = 3、10 Hz、2 H)、2.37 (s, 3 H)、1.83 ~ 1.80 (m, 2 H)、1.47 ~ 1.40 (m, 2 H)。

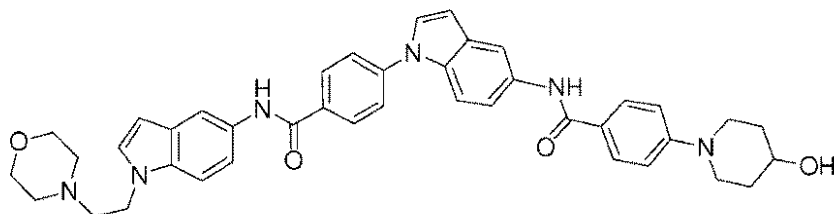
【1155】

実施例 856

4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(1-(4-((1-(2-モルホリノエチル)-1H-インドール-5-イル)カルバモイル)フェニル)-1H-インドール-5-イル)ベンズアミド(化合物 956)

【化992】

10



スキーム IV に表される手順にしたがって、1-(2-モルホリノエチル)-5-アミノ-1H-インドール、4-(5-アミノ-1H-インドール-1-イル)安息香酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 956 を調製した。[M+H]⁺ C₄₁H₄₂N₆O₄ についての計算値：683.33；実測値：683.31。

20

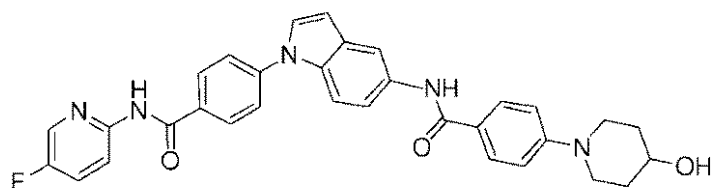
【1156】

実施例 857

N-(5-フルオロピリジン-2-イル)-4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インドール-1-イル)ベンズアミド(化合物 957)

【化993】

30



スキーム IV に表される手順にしたがって、2-アミノ-5-フルオロピリジン、4-(5-アミノ-1H-インドール-1-イル)安息香酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 957 を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 11.01 (s, 1 H)、9.90 (s, 1 H)、8.42 (d, J = 3.5 Hz、1 H)、8.27 (d, J = 4 Hz、1 H)、8.24 (dd, J = 1.5、6.5 Hz、2 H)、8.14 (d, J = 2 Hz、1 H)、7.88 (d, J = 9 Hz、2 H)、7.84 ~ 7.80 (m, 1 H)、7.78 ~ 7.77 (m, 1 H)、7.76 (t, J = 3.5 Hz、2 H)、7.66 (d, J = 9 Hz、1 H)、7.56 (dd, J = 2、9 Hz、1 H)、7.00 (d, J = 9 Hz、2 H)、6.75 (d, J = 3.5 Hz、1 H)、4.70 (d, J = 4 Hz、1 H)、3.71 ~ 3.66 (m, 3 H)、3.03 ~ 2.98 (m, 1 H)、1.83 ~ 1.79 (m, 2 H)、1.47 ~ 1.40 (m, 2 H)。

40

【1157】

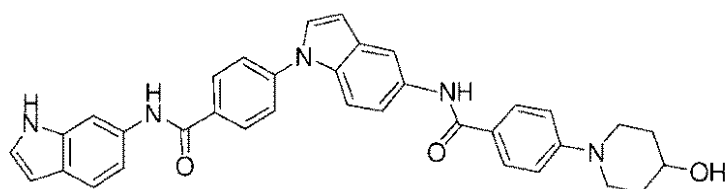
実施例 858

4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(1-(4-((1H-インドール-6-イル)カルバモイル)フェニル)-1H-インドール-5-イル)ベンズアミド(

50

化合物 958)

【化 994】



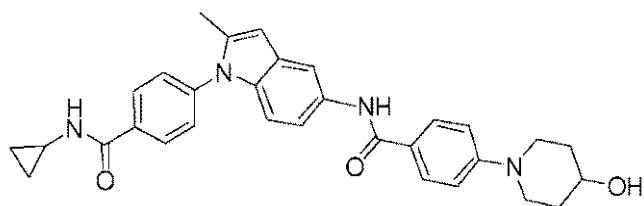
スキーム IV に表される手順にしたがって、6-アミノインドール、4-(5-アミノ-1H-インドール-1-イル)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 958 を調製した。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 11.05 (s, 1H)、10.23 (s, 1H)、9.90 (s, 1H)、8.18 (d, J = 8.5 Hz, 2H)、8.13 (d, J = 2 Hz, 1H)、8.10 (s, 1H)、7.87 (d, J = 10 Hz, 2H)、7.77 (d, J = 9 Hz, 2H)、7.74 (d, J = 3.5 Hz, 1H)、7.65 (d, J = 9 Hz, 1H)、7.56 (dd, J = 2, 9.5 Hz, 1H)、7.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H)、7.29 (m, 2H)、6.99 (d, J = 9 Hz, 2H)、6.74 (d, J = 3 Hz, 1H)、6.38 (m, 1H)、4.70 (d, J = 4.5 Hz, 1H)、3.69 (m, 3H)、1.80 (m, 2H)、1.44 (m, 2H)。

【1158】

実施例 859

4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(1-(4-(シクロプロピルカルバモイル)フェニル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル)ベンズアミド (化合物 959)

【化 995】



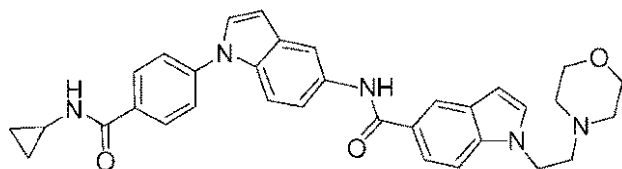
スキーム IV に表される手順にしたがって、4-(5-アミノ-2-メチル-1H-インドール-1-イル)安息香酸、シクロプロパンアミン、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 959 を調製した。 $[M+H]^+$ C₃₁H₃₂N₄O₃ についての計算値: 509.25; 実測値: 509.12。

【1159】

実施例 860

N-(1-(4-(シクロプロピルカルバモイル)フェニル)-1H-インドール-5-イル)-1-(2-モルホリノエチル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 960)

【化 996】



スキーム IV に表される手順にしたがって、4-(5-アミノ-1H-インドール-1-イル)安息香酸、シクロプロパンアミン、および1-(2-モルホリノエチル)-1H

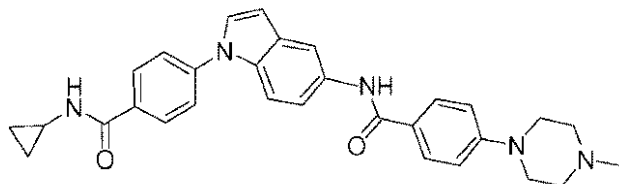
ーインドールー5ーカルボン酸から化合物960を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₃N₅O₃についての計算値：548.26；実測値548.13。

【1160】

実施例861

Nーシクロプロピルー4ー(5ー(4ー(4ーメチルピペラジンー1ーイル)ベンズアミド)ー1Hーインドールー1ーイル)ベンズアミド(化合物961)

【化997】



10

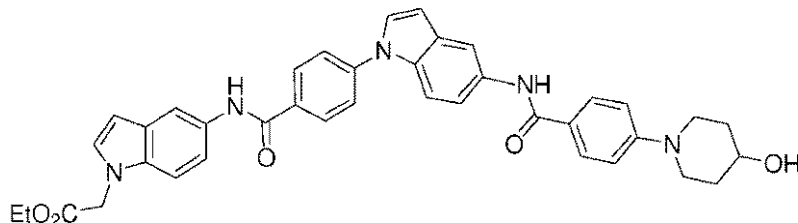
スキームIVに表される手順にしたがって、4ー(5ーアミノー1Hーインドールー1ーイル)安息香酸、シクロプロパンアミン、および4ー(4ーメチルピペラジンー1ーイル)安息香酸から化合物961を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₁N₅O₂についての計算値：494.25；実測値494.06。

【1161】

実施例862

エチル2ー(5ー(4ー(5ー(4ー(4ーヒドロキシピペリジンー1ーイル)ベンズアミド)ー1Hーインドールー1ーイル)ベンズアミド)ー1Hーインドールー1ーイル)アセテート(化合物962)

【化998】



30

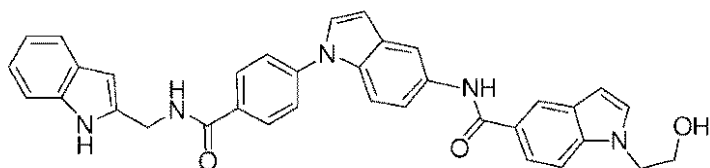
スキームIVに表される手順にしたがって、エチル5ーアミノー1Hーインドールー1ーアセテート、4ー(5ーアミノー1Hーインドールー1ーイル)安息香酸、および4ー(4ーヒドロキシピペリジンー1ーイル)安息香酸から化合物962を調製した。[M+H]⁺ C₃₉H₃₇N₅O₅についての計算値：656.28；実測値656.23。

【1162】

実施例863

Nー(1ー(4ー((1Hーインドールー2ーイル)メチル)カルバモイル)フェニル)ー1Hーインドールー5ーイル)ー1ー(2ーヒドロキシエチル)ー1Hーインドールー5ーカルボキサミド(化合物963)

【化999】



スキームIVに表される手順にしたがって、4ー(5ーアミノー1Hーインドールー1ーイル)安息香酸、2ーアミノメチルインドール、および1ー(2ーヒドロキシエチル)ー1Hーインドールー5ーカルボン酸から化合物963を調製した。¹H NMR (50

50

0 MHz、DMSO- d_6) δ 10.14 (s, 1H)、9.42 (s, 1H)、8.31 (dd, $J=1.0$ 、5.5 Hz、2H)、8.14 (d, $J=8.5$ Hz、2H)、8.06 (t, $J=5.5$ Hz、1H)、7.87 (dd, $J=1.5$ 、9 Hz、1H)、7.74 (d, $J=8$ Hz、1H)、7.66 (d, $J=9$ Hz、2H)、7.62 (d, $J=2$ Hz、1H)、7.61 (s, 1H)、7.57 (d, $J=3$ Hz、1H)、7.55 (d, $J=9$ Hz、1H)、7.37 (d, $J=2.5$ Hz、1H)、7.11 (ddd, $J=1$ 、7、9 Hz、1H) 7.03 (ddd, $J=1$ 、7、8.5 Hz、1H)、6.70 (d, $J=3.5$ Hz、1H)、6.56 (d, $J=3.5$ Hz、1H)、4.82 (d, $J=5.5$ Hz、2H)、4.35 (t, $J=5.5$ Hz、2H)、3.92 (q, $J=5$ Hz、2H)、3.31 (d, $J=5$ Hz、1H)。

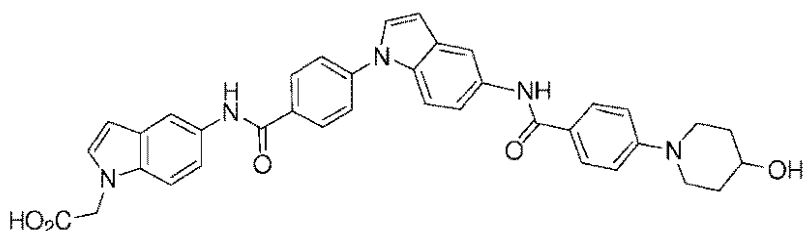
10

【1163】

実施例 864

2-(5-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インドール-1-イル)ベンズアミド)-1H-インドール-1-イル)酢酸(化合物 964)

【化1000】



20

化合物 962 の加水分解によって、化合物 964 を調製した。[M+H]⁺ C₃₇H₃₃N₅O₅ についての計算値：628.25；実測値 628.14。

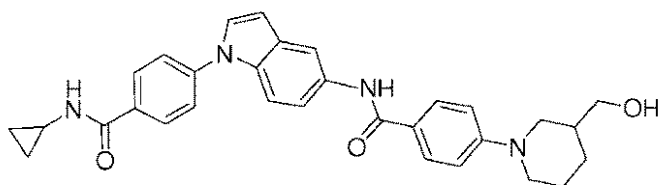
【1164】

実施例 865

(±)-N-シクロプロピル-4-(5-(4-(3-(ヒドロキシメチル)ピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インドール-1-イル)ベンズアミド(化合物 965)

30

【化1001】



スキーム IV に表される手順にしたがって、4-(5-アミノ-1H-インドール-1-イル)安息香酸、シクロプロパンアミン、および 4-(3-(ヒドロキシメチル)ピペラジン-1-イル)安息香酸から化合物 965 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₂N₄O₃ についての計算値：509.25；実測値：509.05。

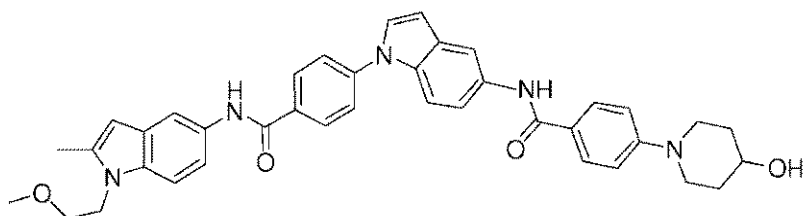
40

【1165】

実施例 866

4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(1-(4-(1-(2-メトキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル)カルバモイル)フェニル)-1H-インドール-5-イル)ベンズアミド(化合物 966)

【化1002】



スキームIVに表される手順にしたがって、エチル5-アミノ-2-メチル-1-(2-メトキシエチル)-1H-インドール、4-(5-アミノ-1H-インドール-1-イル)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物966を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{39}H_{39}N_5O_4$ についての計算値: 642.31; 実測値: 642.26。

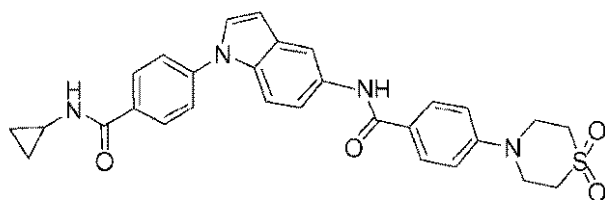
10

【1166】

実施例867

N-シクロプロピル-4-(5-(4-(1,1-ジオキシドチオモルホリノ)ベンズアミド)-1H-インドール-1-イル)ベンズアミド(化合物967)

【化1003】



20

スキームIVに表される手順にしたがって、4-(5-アミノ-1H-インドール-1-イル)安息香酸、シクロプロパンアミン、および4-(1,1-ジオキシドチオモルホリノ)ピペラジン-1-イル)安息香酸から化合物967を調製した。 ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 9.98 (s, 1H)、8.53 (d, $J=4$ Hz, 1H)、8.13 (d, $J=1.5$ Hz, 1H)、8.02 (d, $J=8.5$ Hz, 2H)、7.94 (d, $J=9$ Hz, 2H)、7.72 (m, 3H)、7.62 (d, $J=9$ Hz, 1H)、7.55 (dd, $J=2, 9$ Hz, 1H)、7.14 (d, $J=9$ Hz, 2H)、6.73 (d, $J=3$ Hz, 1H)、3.93 (bs, 4H)、3.14 (bs, 4H)、2.89 (m, 1H)、0.72 (m, 2H)、0.61 (m, 2H)。

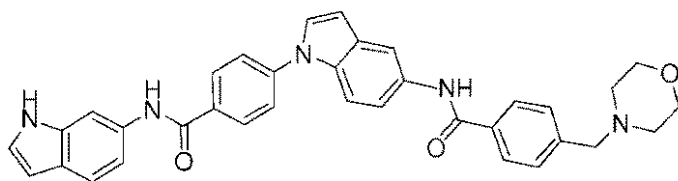
30

【1167】

実施例868

N-(1-(4-(1H-インドール-6-イル)カルバモイル)フェニル)-1H-インドール-5-イル)-4-(モルホリノメチル)ベンズアミド(化合物968)

【化1004】



40

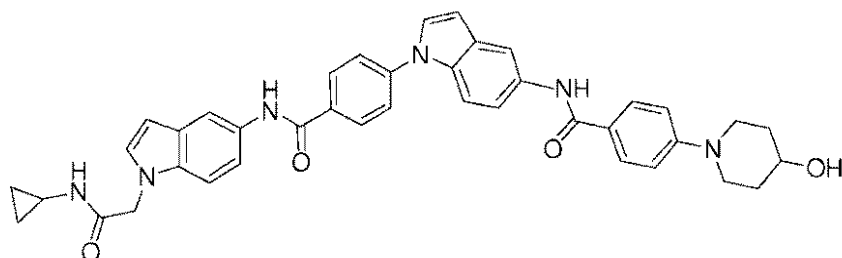
スキームIVに表される手順にしたがって、6-アミノインドール、4-(5-アミノ-1H-インドール-1-イル)安息香酸、および4-(モルホリノメチル)安息香酸から化合物968を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{35}H_{31}N_5O_3$ についての計算値: 570.24; 実測値: 570.14。

【1168】

50

実施例 869

N-(1-(2-(シクロプロピルアミノ)-2-オキソエチル)-1H-インドール-5-イル)-4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インドール-1-イル)ベンズアミド (化合物 969)
【化1005】



10

シクロプロピルアミンで化合物 962 を処理することによって、化合物 969 を調製した。[M+H]⁺ C₄₀H₃₈N₆O₄ についての計算値：667.30；実測値 667.31。

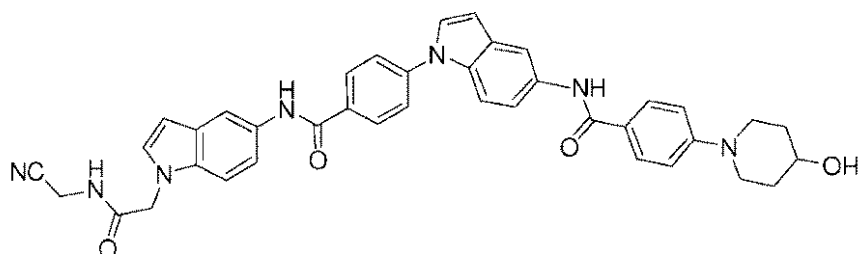
【1169】

実施例 870

N-(1-(2-(シアノメチル)アミノ)-2-オキソエチル)-1H-インドール-5-イル)-4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インドール-1-イル)ベンズアミド (化合物 970)

20

【化1006】



30

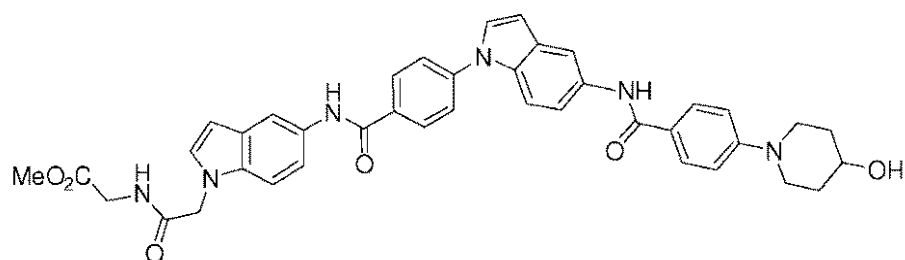
シアノエチルアミンで化合物 962 を処理することによって、化合物 970 を調製した。[M+H]⁺ C₃₉H₃₅N₇O₄ についての計算値：666.28；実測値 666.23。

【1170】

実施例 871

メチル 2-(2-(5-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インドール-1-イル)ベンズアミド)-1H-インドール-1-イル)アセトアミド)アセテート (化合物 971)

【化1007】



40

メチルアミノアセテートで化合物 962 を処理することによって、化合物 971 を調製した。[M+H]⁺ C₄₀H₃₈N₆O₆ についての計算値：699.29；実測値 699.25。

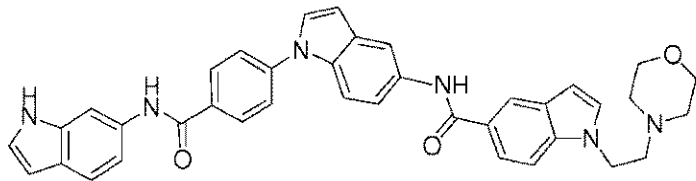
50

【1171】

実施例 872

N-(1-(4-(1H-インドール-6-イル)カルバモイル)フェニル)-1H-インドール-5-イル)-1-(2-モルホリノエチル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 972)

【化1008】



10

スキーム I V に表される手順にしたがって、4-(5-アミノ-1H-インドール-1-イル)安息香酸、6-アミノインドール、および 1-(2-モルホリノエチル)-1H-インドール-5-カルボン酸から化合物 972 を調製した。[M+H]⁺ C₃₈H₃₄N₆O₃ についての計算値: 623.27; 実測値 623.15。

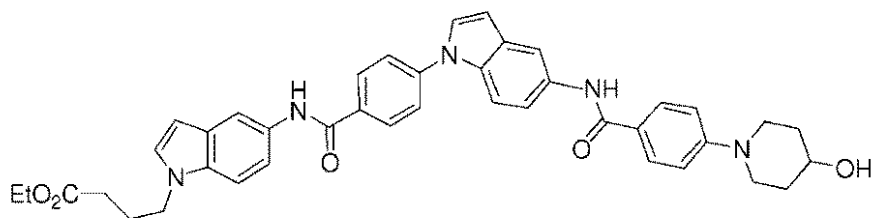
【1172】

実施例 873

エチル 4-(5-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インドール-1-イル)ベンズアミド)-1H-インドール-1-イル)ブタノエート (化合物 973)

20

【化1009】



スキーム I V に表される手順にしたがって、エチル 4-(5-アミノ-1H-インドール-1-イル)ブタノエート、4-(5-アミノ-1H-インドール-1-イル)安息香酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 973 を調製した。[M+H]⁺ C₄₁H₄₁N₅O₅ についての計算値: 684.31; 実測値 684.19。

30

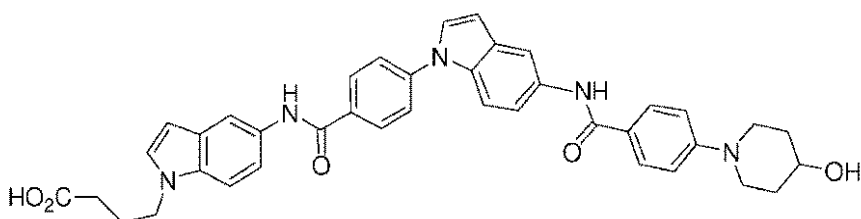
【1173】

実施例 874

4-(5-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インドール-1-イル)ベンズアミド)-1H-インドール-1-イル)ブタン酸 (化合物 974)

【化1010】

40



化合物 973 の加水分解によって、化合物 974 を調製した。[M+H]⁺ C₃₉H₃₇N₅O₅ についての計算値: 656.28; 実測値 656.17。

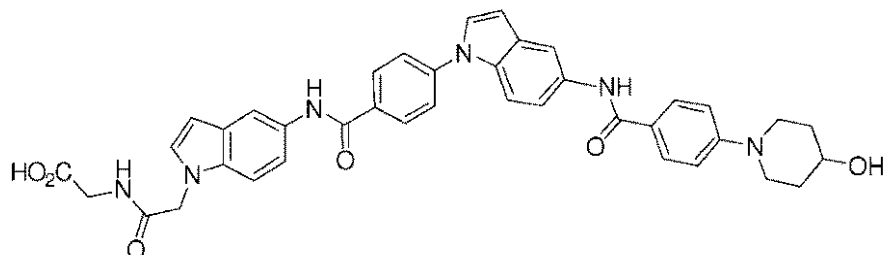
【1174】

50

実施例 875

メチル 2- (2- (5- (4- (5- (4- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) ベンズアミド) -1H-インドール-1-イル) ベンズアミド) -1H-インドール-1-イル) アセトアミド) アセテート (化合物 975)

【化 1011】



10

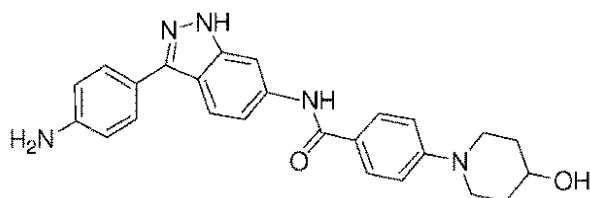
化合物 971 の加水分解によって、化合物 975 を調製した。[M+H]⁺ C₃₉H₃₆N₆O₆ についての計算値：685.27；実測値 685.14。

【1175】

実施例 876

N- (3- (4-アミノフェニル) -1H-インダゾール-6-イル) -4- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) ベンズアミド (化合物 976)

【化 1012】



20

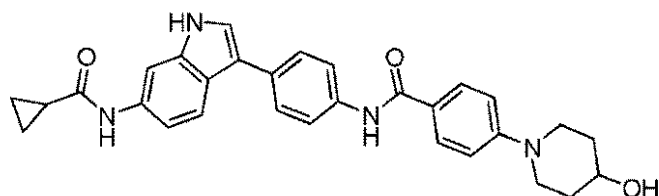
スキーム IV に表される手順にしたがって、6-アミノ-3- (4-アミノフェニル) -1H-インダゾール、および 4- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) 安息香酸から化合物 976 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₅N₅O₂ についての計算値：428.20；実測値 428.07。

【1176】

実施例 877

N- (3- (4- (シクロプロパンカルボキサミド) フェニル) -1H-インダゾール-6-イル) -4- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) ベンズアミド (化合物 977)

【化 1013】



40

スキーム IV に表される手順にしたがって、6-アミノ-3- (4-アミノフェニル) -1H-インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および 4- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) 安息香酸から化合物 977 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₀N₄O₃ についての計算値：495.11；実測値：495.08。

【1177】

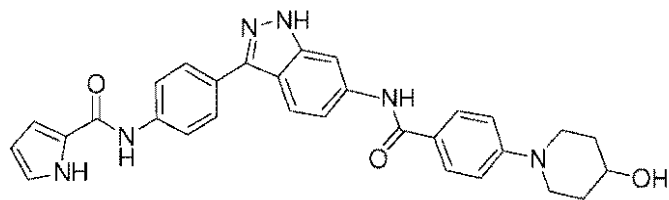
実施例 878

N- (4- (6- (4- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) ベンズアミド) -1H

50

ーインドゾールー 3-イル) フェニル) - 1H-ピロールー 2-カルボキサミド (化合物 978)

【化1014】



10

スキーム I V に表される手順にしたがって、6-アミノ-3-(4-アミノフェニル)-1H-インドゾール、ピロールー 2-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 978 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₈N₆O₃ についての計算値: 521.22; 実測値 521.07。

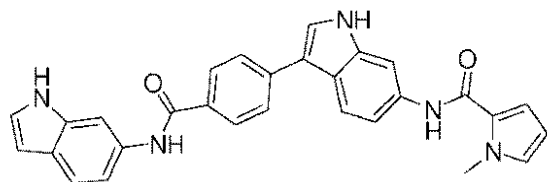
【1178】

実施例 879

N-(3-(4-((1H-インドール-6-イル)カルバモイル)フェニル)-1H-インドール-6-イル)-1-メチル-1H-ピロールー 2-カルボキサミド (化合物 979)

【化1015】

20



スキーム I V に表される手順にしたがって、4-(6-アミノ-1H-インドール-3-イル)安息香酸、1-メチルピロールー 2-カルボン酸、および 6-アミノインドールから化合物 979 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₃N₅O₂ についての計算値: 474.05; 実測値: 474.02。

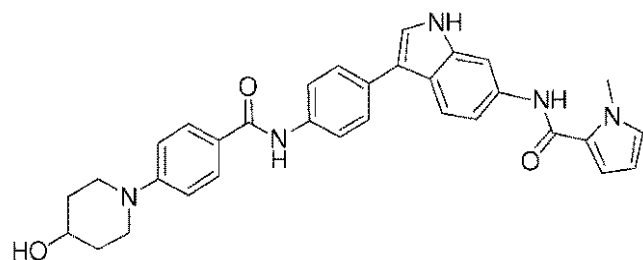
30

【1179】

実施例 880

N-(3-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)フェニル)-1H-インドール-6-イル)-1-メチル-1H-ピロールー 2-カルボキサミド (化合物 980)

【化1016】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、6-アミノ-3-(4-アミノフェニル)インドール、1-メチルピロールー 2-カルボン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 980 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₁N₅O₃ についての計算値: 534.15; 実測値: 534.09。

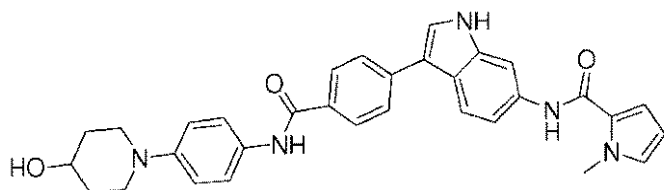
【1180】

実施例 881

50

N-(3-(4-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)フェニル)カルバモイル)フェニル)-1H-インドール-6-イル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 981)

【化1017】



10

スキーム I V に表される手順にしたがって、4-(6-アミノ-1H-インドール-3-イル)安息香酸、1-メチルピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)アニリンから化合物 981 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₁N₅O₃ についての計算値: 534.15; 実測値: 534.09。

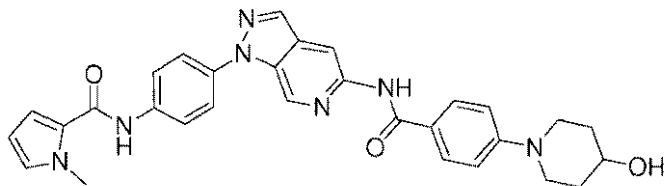
【1181】

実施例 882

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-1-イル)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド (化合物 982)

【化1018】

20



スキーム I V に表される手順にしたがって、1-(4-アミノフェニル)-1H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-5-アミン、1-メチルピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 982 を調製した。

[M+H]⁺ C₃₀H₂₉N₇O₃ についての計算値: 536.23; 実測値 536.05。

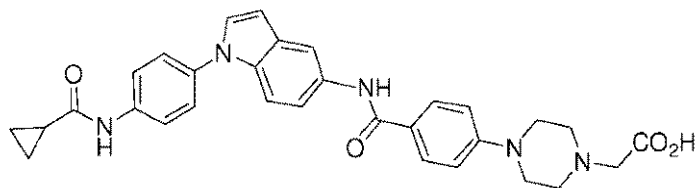
30

【1182】

実施例 883

2-(4-(4-(1-(4-(シクロプロパンカルボキサミド)フェニル)-1H-インドール-5-イル)カルバモイル)フェニル)ピペラジン-1-イル)酢酸 (化合物 983)

【化1019】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インドール、シクロプロパンカルボン酸、および4-(4-(ヒドロシカルボニルメチル)ピペラジン-1-イル)安息香酸エステルから化合物 983 を調製した。¹H NMR (500 MHz、アセトン-d₆) δ 9.27 (s, 1H)、8.25 (s, 1H)、8.07 (dd, J=2, 6.5 Hz, 2H)、7.95 (d, J=9 Hz, 2H)、7.82 (s, 1H)、7.60 (dd, J=2, 6.5 Hz, 2H)、7.59~7.58 (m, 3H)、7.04 (d, J=9 Hz, 2H)、6.70 (d, J=3 Hz, 1H)

50

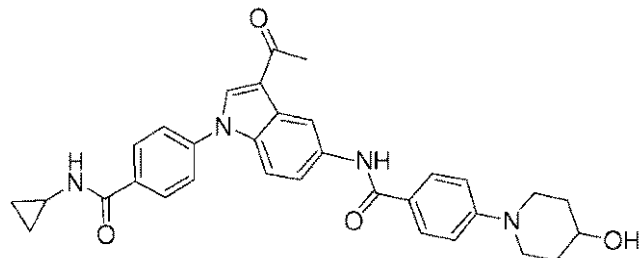
)、3.39 (m, 3H)、2.17 (m, 1H)、1.29 (m, 8H)、0.77～0.74 (m, 2H)、0.65～0.64 (m, 2H)。

【1183】

実施例884

4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(1-(4-(シクロプロピルカルバモイル)フェニル)-3-アセチル-1H-インドール-5-イル)ベンズアミド(化合物984)

【化1020】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、4-(5-アミノ-3-アセチル-1H-インドール-1-イル)安息香酸、シクロプロパンアミン、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物984を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₂N₄O₄についての計算値: 537.24; 実測値: 537.06。

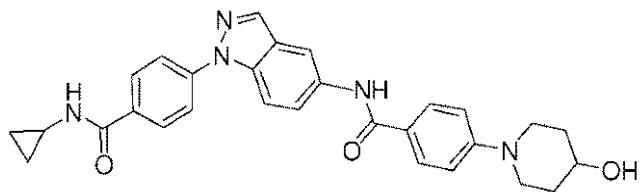
20

【1184】

実施例885

4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(1-(4-(シクロプロピルカルバモイル)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物985)

【化1021】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、4-(5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル)安息香酸、シクロプロパンアミン、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物985を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₉N₅O₃についての計算値: 496.23; 実測値: 496.09。

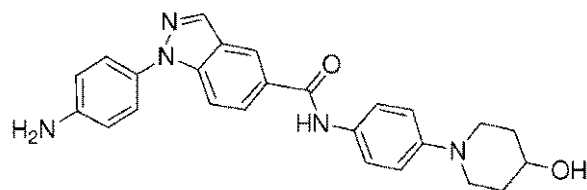
【1185】

実施例886

1-(4-アミノフェニル)-N-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)フェニル)-1H-インダゾール-5-カルボキサミド(化合物986)

40

【化1022】



スキームIVに表される手順にしたがって、1-(4-アミノフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)アニリンから化合物986を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₅N₅O₂についての計

50

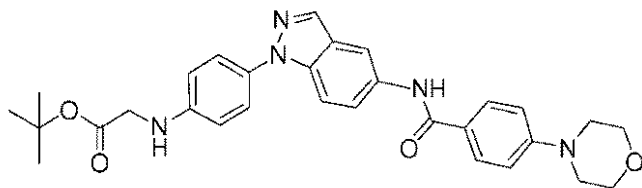
算値：428.20；実測値：428.00。

【1186】

実施例887

tert-ブチル2-((4-(5-(4-モルホリノベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)アミノ)アセテート(化合物987)

【化1023】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、tert-ブチルプロモアセテート、および4-モルホリノ安息香酸から化合物987を調製した。¹H NMR(500MHz, CDCl₃) δ 8.15(s, 1H)、8.09(s, 1H)、7.98(s, 1H)、7.84(d, J=7.5Hz, 2H)、7.55(d, J=9Hz, 1H)、7.48(d, J=10Hz, 1H)、7.46(d, J=7Hz, 2H)、7.26(s, 1H)、6.90(d, J=7.5Hz, 2H)、6.71(d, J=7Hz, 2H)、4.45(s, 1H)、3.87~3.83(m, 6H)、3.27~3.25(m, 4H)、1.51(m, 9H)。

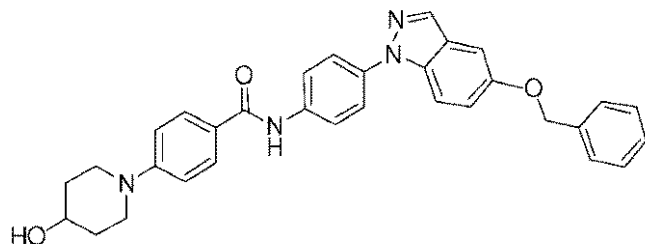
20

【1187】

実施例888

N-(4-(5-(ベンジルオキシ)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド(化合物988)

【化1024】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、5-ベンジルオキシ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物988を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₀N₄O₃についての計算値：519.23；実測値：519.11。

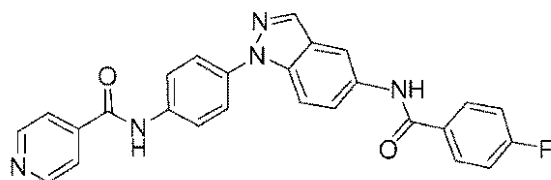
【1188】

実施例889

N-(4-(5-(4-フルオロベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)イソニコチンアミド(化合物989)

40

【化1025】



スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、イソニコチン酸、および4-フルオロ安息香酸から化合物989を調製し

50

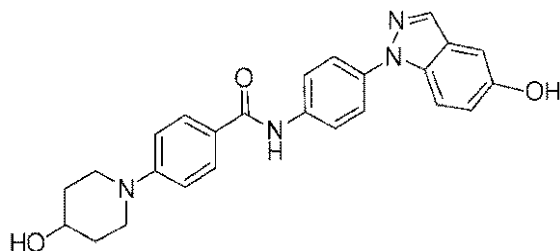
た。[M+H]⁺ C₂₆H₁₈FN₅O₂ についての計算値：452.14；実測値：451.95。

【1189】

実施例 890

N-(4-(5-(ヒドロキシ)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 990)

【化1026】



10

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-ヒドロキシ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 990 を調製した。[M+H]⁺ C₂₅H₂₄N₄O₃ についての計算値：429.18；実測値：429.07。

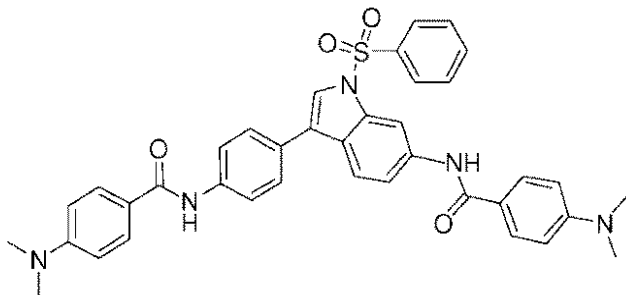
【1190】

20

実施例 891

4-(ジメチルアミノ)-N-(4-(6-(4-(ジメチルアミノ)ベンズアミド)-1-(フェニルスルホニル)-1H-インドール-3-イル)フェニル)ベンズアミド (化合物 991)

【化1027】



30

スキーム I V に表される手順にしたがって、6-アミノ-3-(4-アミノフェニル)-1-(フェニルスルホニル)インドールおよび4-ジメチルアミノ安息香酸から化合物 991 を調製した。[M+H]⁺ C₃₈H₃₅N₅O₄S についての計算値：658.31；実測値：658.19。

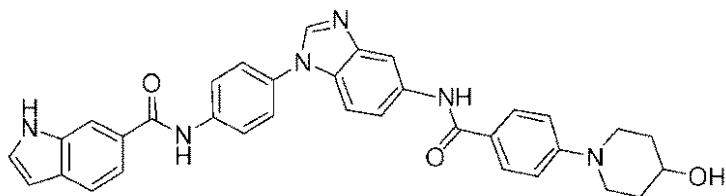
【1191】

実施例 892

40

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-1-イル)フェニル)-1H-インドール-6-カルボキサミド (化合物 992)

【化 1028】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)ベンズイミダゾール、6-インドールカルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 992 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₀N₆O₃ についての計算値：571.25；実測値：571.15。

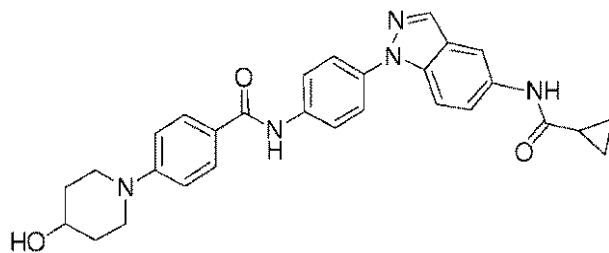
10

【1192】

実施例 893

N-(4-(5-(シクロプロパンカルボキサミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 993)

【化 1029】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 993 を調製した。¹H NMR (500 MHz、アセトン-d₆) δ 9.55 (s, 1H)、9.48 (s, 1H)、8.34 (m, 1H)、8.19 (m, 1H)、8.07 (d, J=8.5 Hz, 1H)、7.94 (d, J=9 Hz, 1H)、7.86 (d, J=9 Hz, 1H)、7.80~7.69 (m, 4H)、7.61 (m, 1H)、7.04 (d, J=9 Hz, 2H)、3.80 (m, 3H)、3.11 (m, 1H)、2.09 (m, 2H)、1.94 (m, 1H)、1.80 (m, 1H)、1.60 (m, 1H)、0.93 (m, 2H)、0.80 (m, 2H)。

30

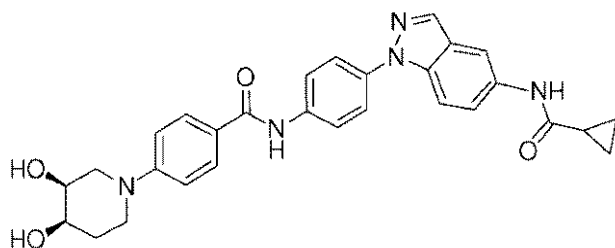
【1193】

実施例 894

(±)-N-(4-(5-(シクロプロパンカルボキサミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-4-(3,4-シス-ジヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 994)

40

【化 1030】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)

50

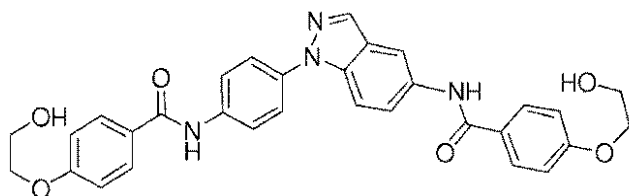
インダゾール、シクロプロパンカルボン酸、および 4-(3, 4-シス-ジヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 994 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₉N₅O₄ についての計算値：512.22；実測値 512.09。

【1194】

実施例 895

4-(2-ヒドロキシエトキシ)-N-(4-(5-(4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)ベンズアミド (化合物 995)

【化1031】



10

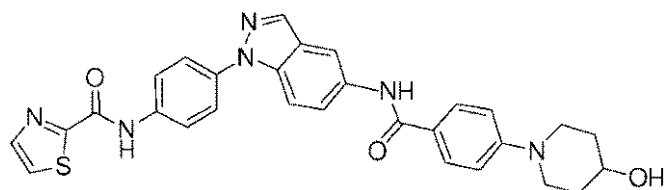
スキーム IV に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび 4-(2-ヒドロキシエトキシ)安息香酸から化合物 995 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₉N₄O₆ についての計算値：553.21；実測値：553.10。

【1195】

実施例 896

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)チアゾール-2-カルボキサミド (化合物 996)

【化1032】



30

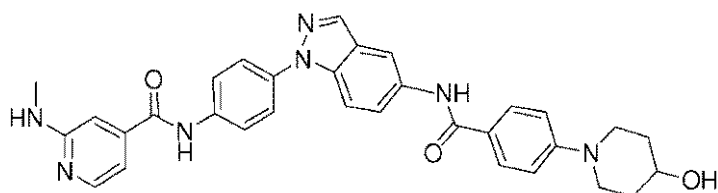
スキーム IV に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、チオゾール (thiazole)-2-カルボン酸および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 996 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₆N₆O₃S についての計算値：539.19；実測値：539.02。

【1196】

実施例 897

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-2-(メチルアミノ)イソニコチンアミド (化合物 997)

【化1033】



50

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、2-(メチルアミノ)イソニコチン酸および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 997 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₁N₇O₃ についての計算値：562.26；実測値：562.13。

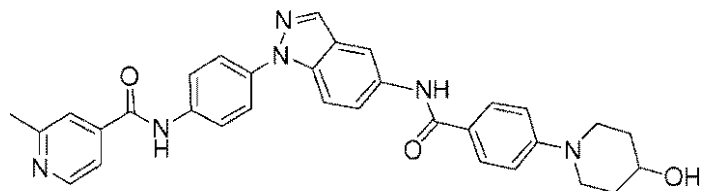
【1197】

実施例 898

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-2-(メチル)イソニコチンアミド (化合物 998)

【化1034】

10



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、2-メチルイソニコチン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 998 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₀N₆O₃ についての計算値：547.14；実測値：547.12。

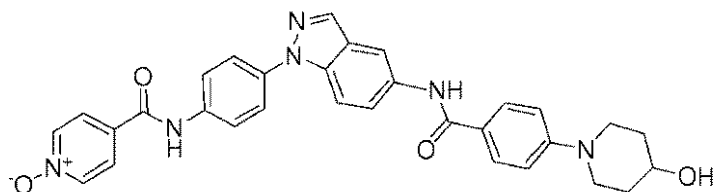
【1198】

実施例 899

4-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)カルバモイル)ピリジン1-オキシド (化合物 999)

【化1035】

30



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、4-カルボキシピリジン1-オキシド、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 999 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₈N₆O₄ についての計算値：549.12；実測値：549.08。

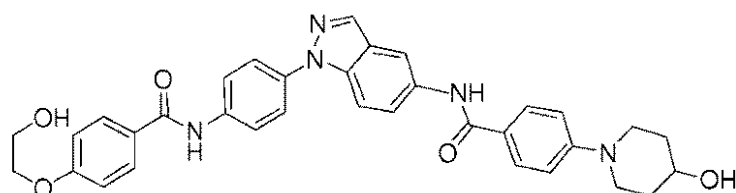
【1199】

実施例 900

4-(2-ヒドロキシエトキシ)-N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)ベンズアミド (化合物 1000)

【化1036】

40



50

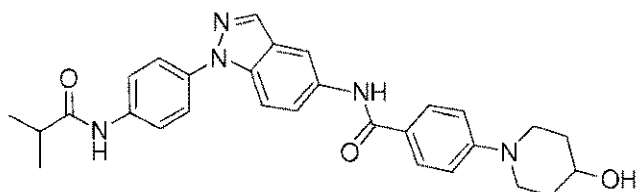
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、4-(2-ヒドロキシエトキシ)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 1000 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₃N₅O₅ についての計算値：592.18；実測値：592.15。

【1200】

実施例 901

4-(2-ヒドロキシエトキシ)-N-(1-(4-イソブチルアミドフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物 1001)

【化1037】



10

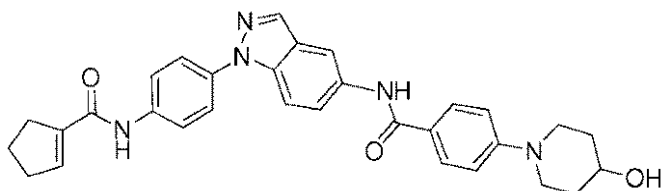
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、イソ酪酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 1001 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₁N₅O₃ についての計算値：498.24；実測値 498.11。

【1201】

実施例 902

N-(1-(4-(シクロペンター-1-エンカルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 1002)

【化1038】



30

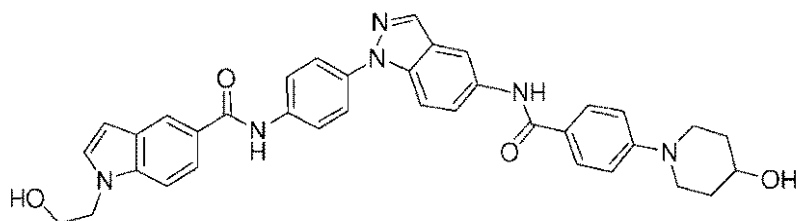
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、シクロペンテンカルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 1002 を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₁N₅O₃ についての計算値：522.24；実測値 522.14。

【1202】

実施例 903

1-(2-ヒドロキシエチル)-N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 1003)

【化1039】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)

50

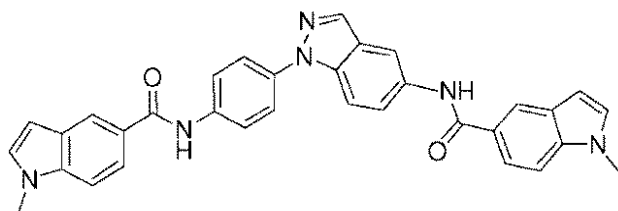
インダゾール、1-(ヒドロキシエチル)インドール-5-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1003を調製した。[M+H]⁺ C₃₆H₃₄N₆O₄ についての計算値: 615.26; 実測値 615.20。

【1203】

実施例904

1-メチル-N-(4-(5-(1-メチル-1H-インドール-5-カルボキサミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物1004)

【化1040】



10

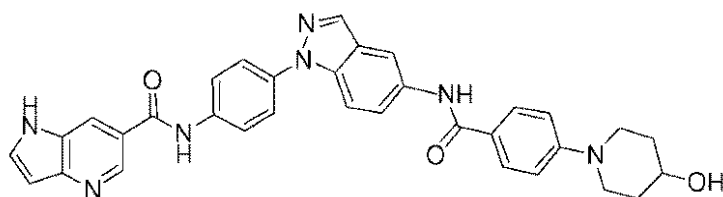
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび1-メチルインドール-5-カルボン酸から化合物1004を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₂₆N₆O₂ についての計算値: 539.21; 実測値: 539.11。

【1204】

実施例905

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-1H-ピロロ[3,2-b]ピリジン-6-カルボキサミド (化合物1005)

【化1041】



30

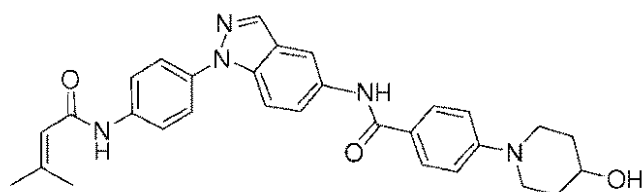
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、1H-ピロロ[3,2-b]ピリジン-6-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1005を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₂₉N₇O₃ についての計算値: 572.24; 実測値: 572.16。

【1205】

実施例906

4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(1-(4-(3-メチルブタ-2-エンアミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物1006)

【化1042】



スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)

50

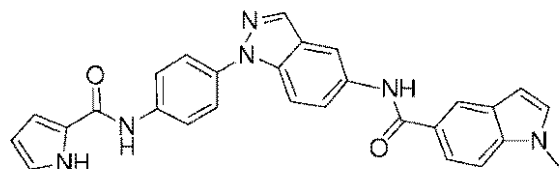
インダゾール、3-メチル-2-ブテン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1006を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₁N₅O₃ についての計算値：510.24；実測値510.13。

【1206】

実施例907

N-(1-(4-(1H-ピロール-2-カルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-1-メチル-1H-インドール-5-カルボキサミド(化合物1007)

【化1043】



10

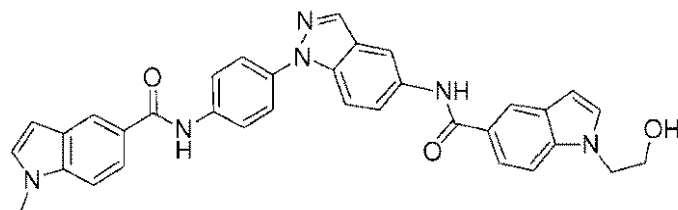
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、2-ピロールカルボン酸、および1-メチルインドール-5-カルボン酸から化合物1007を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₂N₆O₂ についての計算値：475.18；実測値：474.97。

【1207】

実施例908

1-(2-ヒドロキシエチル)-N-(1-(4-(1-メチル-1H-インドール-5-カルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-1H-インドール-5-カルボキサミド(化合物1008)

【化1044】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、1-(2-ヒドロキシエチル)インドール-5-カルボン酸、および1-メチルインドール-5-カルボン酸から化合物1008を調製した。¹H NMR(500 MHz、アセトン-d₆) δ 9.67(s, 1H)、9.59(s, 1H)、8.55(s, 1H)、8.35(m, 2H)、8.26(s, 1H)、8.14(d, J=8 Hz, 2H)、7.90(m, 4H)、7.81(d, J=8.5 Hz, 2H)、7.59(d, J=8.5 Hz, 1H)、7.53(d, J=9 Hz, 1H)、7.44(d, J=2.5 Hz, 1H)、7.36(d, J=3 Hz, 1H)、6.60(m, 2H)、4.37(t, J=5.5 Hz, 2H)、3.94(t, J=3.5 Hz, 2H)、3.91(s, 3H)。

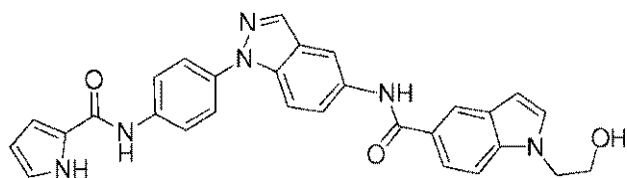
40

【1208】

実施例909

N-(1-(4-(1H-ピロール-2-カルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-カルボキサミド(化合物1009)

【化 1 0 4 5】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、2-ピロールカルボン酸、および1-(2-ヒドロキシエチル)インドール-5-カルボン酸から化合物 1 0 0 9 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₄N₆O₃ についての計算値：505.19；実測値505.10。

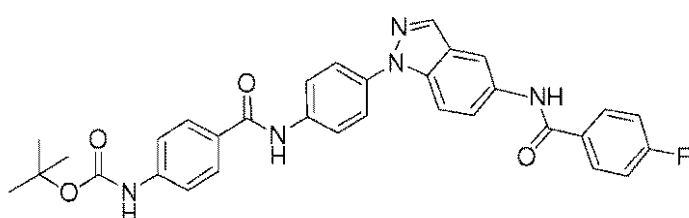
10

【1 2 0 9】

実施例 9 1 0

tert-ブチル(4-(4-(5-(4-フルオロベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)カルバモイル)フェニル)カルバメート(化合物 1 0 1 0)

【化 1 0 4 6】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、4-(tert-ブトキシカルバモイル)安息香酸、および4-フルオロ安息香酸から化合物 1 0 1 0 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₂₈FN₅O₄ についての計算値：566.21；実測値566.02。

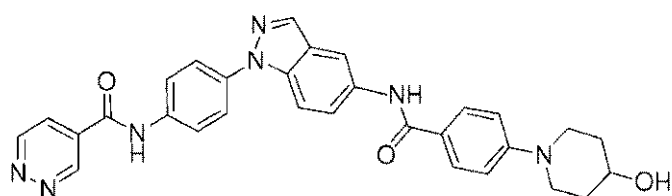
【1 2 1 0】

実施例 9 1 1

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)ピリダジン-4-カルボキサミド(化合物 1 0 1 1)

30

【化 1 0 4 7】



40

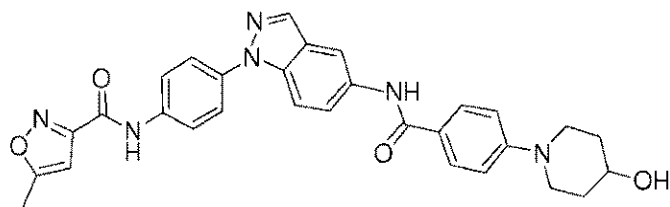
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、ピリダジン-4-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 1 0 1 1 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₇N₇O₃ についての計算値：534.23；実測値：534.09。

【1 2 1 1】

実施例 9 1 2

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-5-メチルイソオキサゾール-3-カルボキサミド(化合物 1 0 1 2)

【化 1 0 4 8】



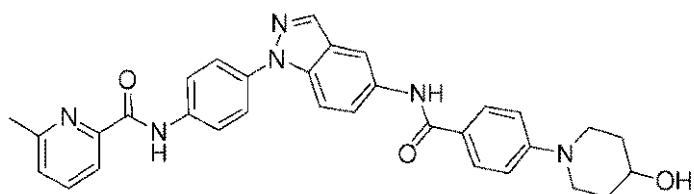
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、5-メチルイソオキサゾール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 1 0 1 2 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₆N₆O₄ についての計算値：537.33；実測値：537.12。

【1 2 1 2】

実施例 9 1 3

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-6-メチルピコリンアミド (化合物 1 0 1 3)

【化 1 0 4 9】



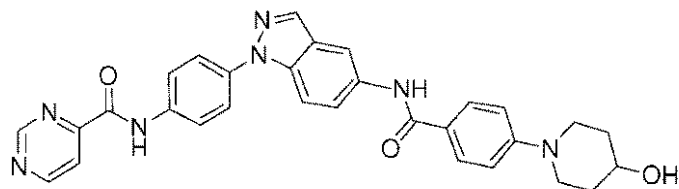
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、6-メチルピコリン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 1 0 1 3 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₀N₆O₃ についての計算値：547.14；実測値：547.12。

【1 2 1 3】

実施例 9 1 4

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)ピリミジン-4-カルボキサミド (化合物 1 0 1 4)

【化 1 0 5 0】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、ピリミジン-4-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 1 0 1 4 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₇N₇O₃ についての計算値：534.10；実測値：534.16。

【1 2 1 4】

実施例 9 1 5

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-1-メチル-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 1 0 1 5)

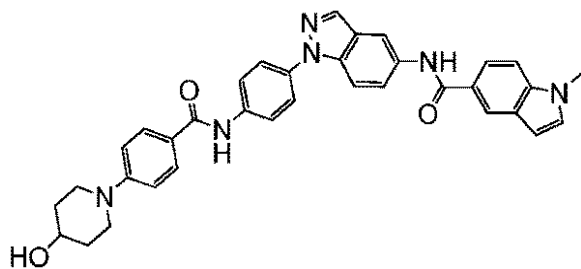
10

20

30

40

【化 1051】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、1-メチルインドール-5-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1015を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{35}H_{32}N_6O_3$ についての計算値：585.25；実測値：585.20。

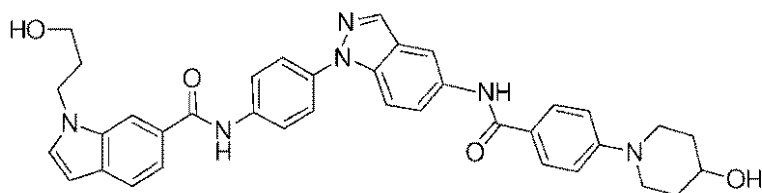
10

【1215】

実施例 916

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-1-(3-ヒドロキシプロピル)-1H-インドール-6-カルボキサミド (化合物1016)

【化 1052】



20

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、1-(3-ヒドロキシプロピル)-1H-インドール-6-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1016を調製した。 ^1H NMR (500 MHz, CD_3OD) δ 8.23 (s, 1H)、8.21 (s, 1H)、8.16 (s, 1H)、7.98 (d, $J=8.5$ Hz, 2H)、7.88 (d, $J=8.5$ Hz, 2H)、7.77~7.65 (m, 7H)、7.44 (d, $J=3$ Hz, 1H)、7.03 (d, $J=9$ Hz, 2H)、6.55 (d, $J=3$ Hz, 1H)、4.40 (t, $J=6.5$ Hz, 2H)、3.83~3.76 (m, 3H)、3.56 (t, $J=6.5$ Hz, 2H)、3.05 (t, $J=10$ Hz, 2H)、2.12~2.07 (m, 2H)、1.98~1.94 (m, 2H)、1.64~1.57 (m, 2H)。

30

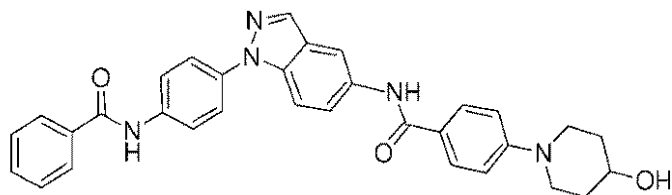
【1216】

実施例 917

N-(1-(4-ベンズアミドフェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物1017)

40

【化 1053】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)

50

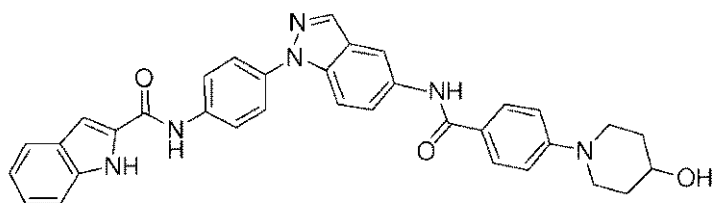
インダゾール、安息香酸、および 4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物 1017 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₀N₅O₃ についての計算値：532.23；実測値：532.13。

【1217】

実施例 918

N-（4-（5-（4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド）-1H-インダゾール-1-イル）フェニル）-1H-インドール-2-カルボキサミド（化合物 1018）

【化1054】



10

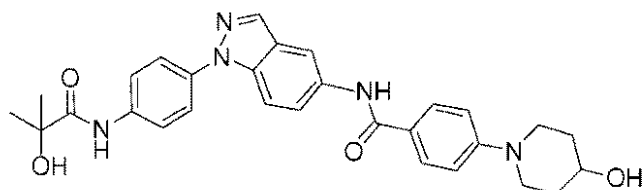
スキーム IV に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-（4-アミノフェニル）インダゾール、インドール-2-カルボン酸、および 4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物 1018 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₀N₆O₃ についての計算値：571.25；実測値：571.16。

【1218】

実施例 919

N-（1-（4-（2-ヒドロキシ-2-メチルプロパンアミド）フェニル）-1H-インダゾール-5-イル）-4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド（化合物 1019）

【化1055】



30

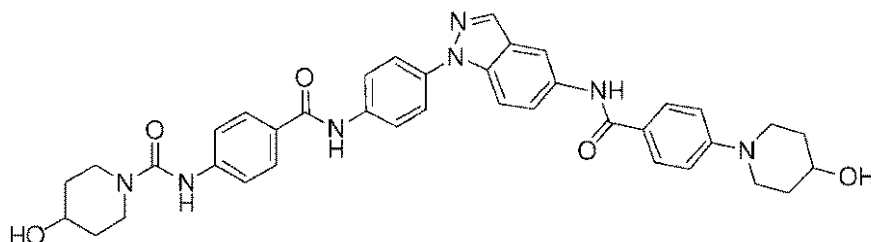
スキーム IV に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-（4-アミノフェニル）インダゾール、2-ヒドロキシ-2-メチルプロパン酸、および 4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物 1019 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₃₁N₅O₄ についての計算値：514.24；実測値 514.11。

【1219】

実施例 920

4-ヒドロキシ-N-（4-（（4-（5-（4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド）-1H-インダゾール-1-イル）フェニル）カルバモイル）フェニル）ピペリジン-1-カルボキサミド（化合物 1020）

【化1056】



50

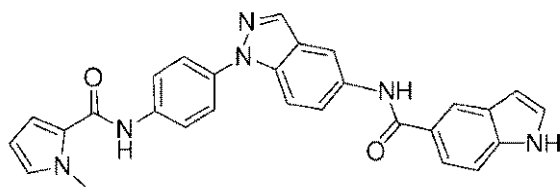
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)カルバモイル安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 1020 を調製した。[M+H]⁺ C₃₈H₃₉N₇O₅ についての計算値：674.30；実測値 674.33。

【1220】

実施例 921

N-(1-(4-(1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 1021)

【化1057】



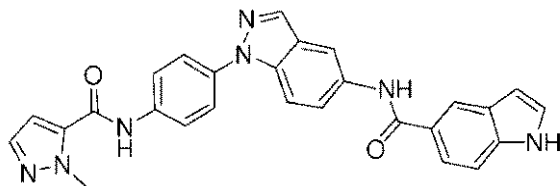
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、1-メチル-2-ピロールカルボン酸、およびインドール-5-カルボン酸から化合物 1021 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₂N₆O₂ についての計算値：475.04；実測値：475.03。

【1221】

実施例 922

N-(1-(4-(1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 1022)

【化1058】



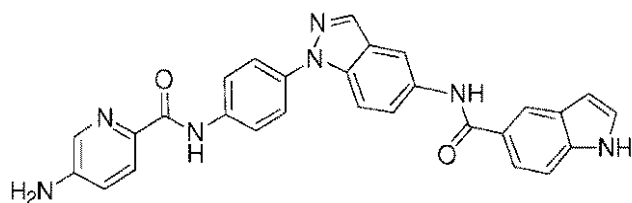
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、1-メチル-5-ピラゾールカルボン酸、およびインドール-5-カルボン酸から化合物 1022 を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₁N₇O₂ についての計算値：476.02；実測値：476.11。

【1222】

実施例 923

N-(1-(4-(5-アミノピコリンアミド)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 1023)

【化1059】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)

10

20

30

40

50

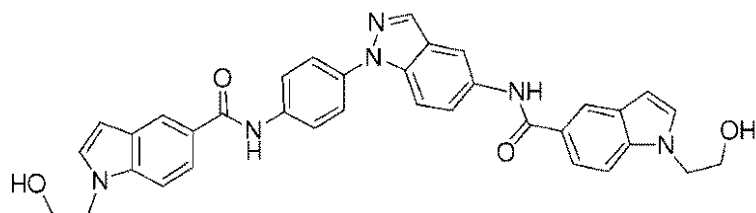
インダゾール、5-アミノピコリン酸、およびインドール-5-カルボン酸から化合物 1023 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₁N₇O₂ についての計算値：488.04；実測値：488.06。

【1223】

実施例 924

1-(2-ヒドロキシエチル)-N-(4-(5-(1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-カルボキサミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物 1024)

【化1060】



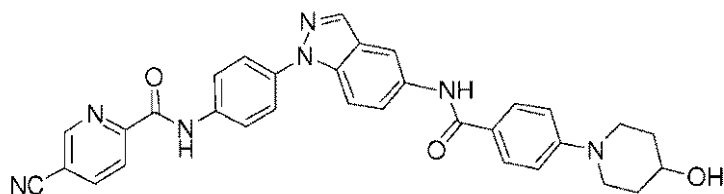
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾールおよび 1-(2-ヒドロキシエチル)インドール-5-カルボン酸から化合物 1024 を調製した。[M+H]⁺ C₃₅H₃₁N₆O₄ についての計算値：599.24；実測値：599.08。

【1224】

実施例 925

5-シアノ-N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)ピコリンアミド (化合物 1025)

【化1061】



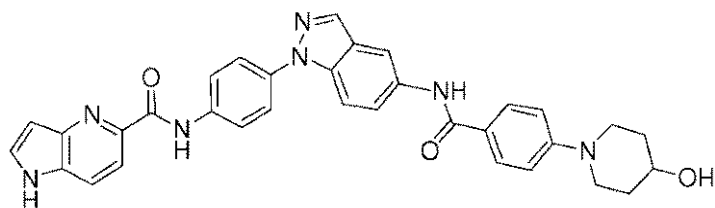
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、5-シアノピコリン酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 1025 を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₂₇N₇O₃ についての計算値：558.13；実測値：558.13。

【1225】

実施例 926

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-1H-ピロロ[3,2-b]ピリジン-5-カルボキサミド (化合物 1026)

【化1062】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、1H-ピロロ[3,2-b]ピリジン-5-カルボン酸、および 4-(4-

10

20

30

40

50

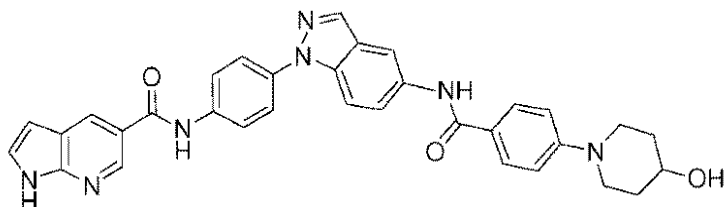
ーヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1026を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₂₉N₇O₃についての計算値: 572.24; 実測値: 572.16。

【1226】

実施例927

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-カルボキサミド(化合物1027)

【化1063】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1027を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₂₉N₇O₃についての計算値: 572.24; 実測値: 572.17。

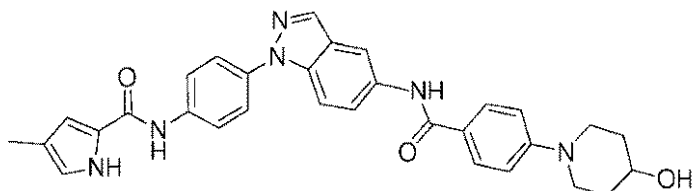
【1227】

20

実施例928

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-4-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド(化合物1028)

【化1064】



30

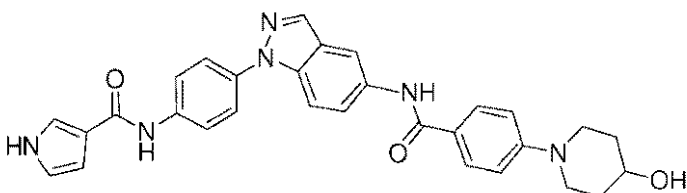
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、4-メチルピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1028を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀N₆O₃についての計算値: 535.13; 実測値: 535.10。

【1228】

実施例929

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-1H-ピロール-3-カルボキサミド(化合物1029)

【化1065】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、ピロール-3-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1

50

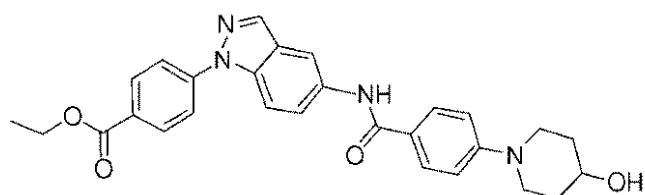
ーイル)安息香酸から化合物1029を調製した。 $[M+H]^+ \quad C_{30}H_{28}N_6O_3$ についての計算値: 521.11; 実測値: 521.13。

【1229】

実施例930

エチル4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)ベンゾエート(化合物1030)

【化1066】



10

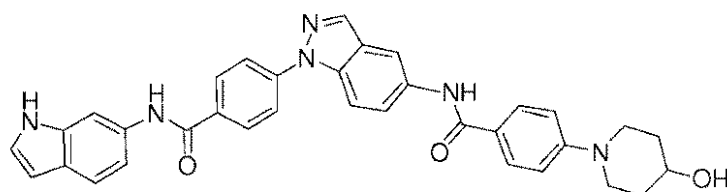
スキームIVに表される手順にしたがって、エチル4-(5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル)ベンゾエートおよび4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1030を調製した。 $[M+H]^+ \quad C_{28}H_{28}N_4O_4$ についての計算値: 485.21; 実測値: 485.09。

【1230】

実施例931

N-(1-(4-((1H-インドール-6-イル)カルバモイル)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド(化合物1031)

【化1067】



30

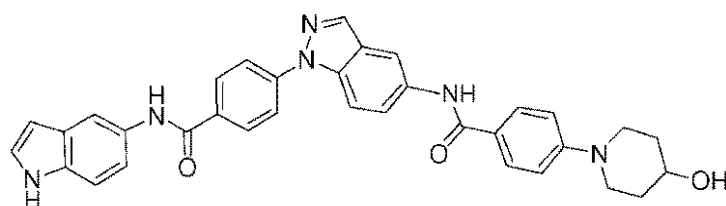
スキームIVに表される手順にしたがって、6-アミノインドール、4-(5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1031を調製した。 $[M+H]^+ \quad C_{34}H_{30}N_6O_3$ についての計算値: 571.24; 実測値: 571.16。

【1231】

実施例932

N-(1-(4-((1H-インドール-5-イル)カルバモイル)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド(化合物1032)

【化1068】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノインドール、4-(5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1032を調製した。 $[M+H]^+ \quad C_{34}H_{30}N_6O$

50

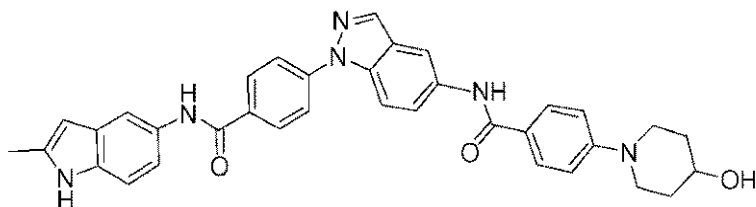
3 についての計算値：571.24；実測値571.17。

【1232】

実施例933

4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(1-(4-(2-メチル-1H-インドール-5-イル)カルバモイル)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物1033)

【化1069】



10

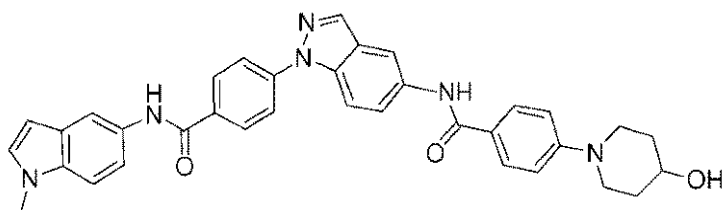
スキームIVに表される手順にしたがって、2-メチル-5-アミノインドール、4-(5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1033を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{35}H_{32}N_6O_3$ についての計算値：585.25；実測値585.20。

【1233】

実施例934

4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(1-(4-(1-メチル-1H-インドール-5-イル)カルバモイル)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物1034)

【化1070】



30

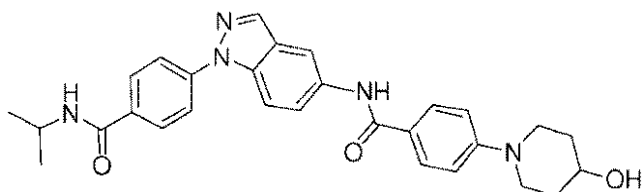
スキームIVに表される手順にしたがって、1-メチル-5-アミノインドール、4-(5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1034を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{35}H_{32}N_6O_3$ についての計算値：585.25；実測値585.20。

【1234】

実施例935

4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(1-(4-(イソプロピルカルバモイル)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)ベンズアミド(化合物1035)

【化1071】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、イソプロピルアミン、4-(5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1035を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{29}H_{31}N_5O_3$

50

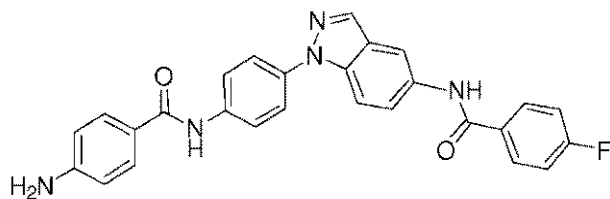
についての計算値：498.24；実測値498.11。

【1235】

実施例936

4-アミノ-N-(4-(5-(4-フルオロベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)ベンズアミド(化合物1036)

【化1072】



10

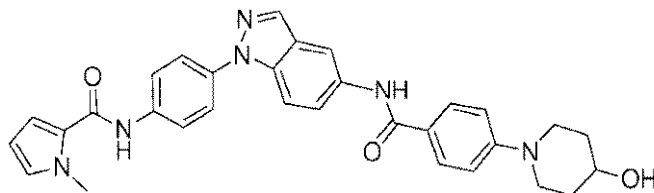
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、4-アミノ安息香酸、および4-フルオロ安息香酸から化合物1036を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₀FN₅O₂についての計算値：466.16；実測値465.99。

【1236】

実施例937

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド(化合物1037)

【化1073】



30

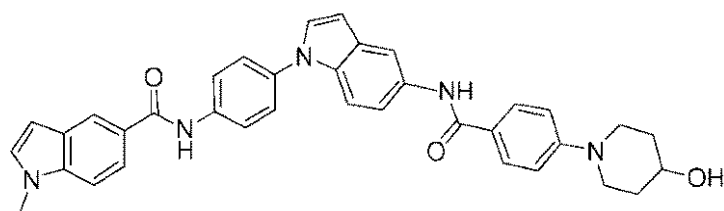
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インダゾール、1-メチルピロール-2-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1037を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₀N₆O₃についての計算値：535.13；実測値：535.10。

【1237】

実施例938

N-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インドール-1-イル)フェニル)-1-メチル-1H-インドール-5-カルボキサミド(化合物1038)

【化1074】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(4-アミノフェニル)インドール、1-メチル-1H-インドール-5-カルボン酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1038を調製した。[M+H]⁺ C

50

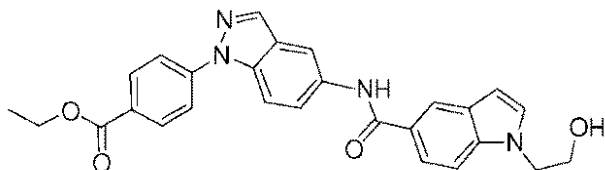
$C_{27}H_{24}N_4O_4$ についての計算値：584.26；実測値：584.12。

【1238】

実施例939

エチル 4-（5-（1-（2-ヒドロキシエチル）-1H-インドール-5-カルボキサミド）-1H-インダゾール-1-イル）ベンゾエート（化合物1039）

【化1075】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、エチル 4-（5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル）ベンゾエートおよび1-（2-ヒドロキシエチル）インドール-5-カルボン酸から化合物1039を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{27}H_{24}N_4O_4$ についての計算値：469.18；実測値469.03。

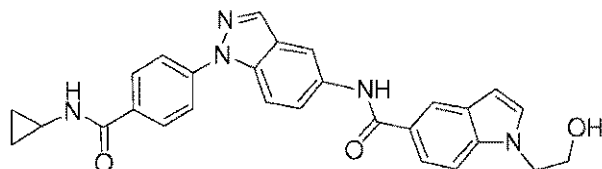
【1239】

実施例940

N-（1-（4-（シクロプロピルカルバモイル）フェニル）-1H-インダゾール-5-イル）-1-（2-ヒドロキシエチル）-1H-インドール-5-カルボキサミド（化合物1040）

20

【化1076】



スキームIVに表される手順にしたがって、シクロプロピルアミン、4-（5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル）安息香酸、および1-（2-ヒドロキシエチル）インドール-5-カルボン酸から化合物1040を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{28}H_{25}N_5O_3$ についての計算値：480.20；実測値480.03。

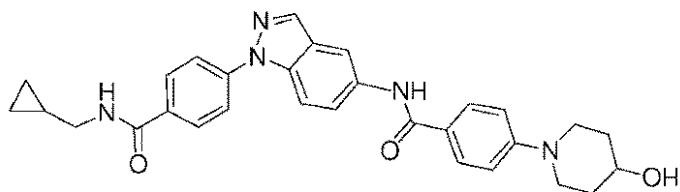
30

【1240】

実施例941

N-（シクロプロピルメチル）-4-（5-（4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド）-1H-インダゾール-1-イル）ベンズアミド（化合物1041）

【化1077】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、シクロプロピルメチルアミン、4-（5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル）安息香酸、および4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物1041を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{30}H_{31}N_5O_3$ についての計算値：510.24；実測値510.06。

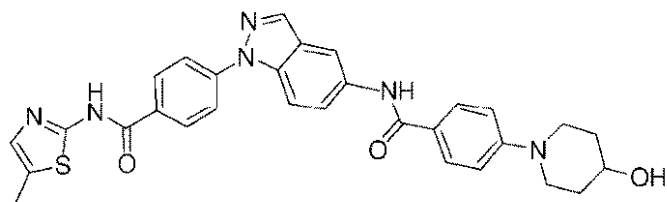
【1241】

実施例942

50

4-((4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(1-(4-((5-メチルチアゾール-2-イル)カルバモイル)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物1042)

【化1078】



10

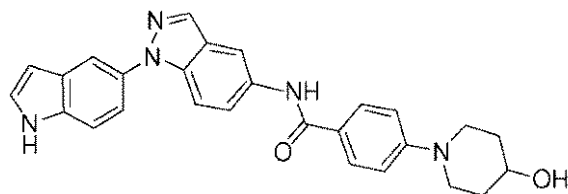
スキームIVに表される手順にしたがって、5-メチルチアゾール-2-イルアミン、4-(5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1042を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₈N₆O₃Sについての計算値: 553.19; 実測値 553.06。

【1242】

実施例943

N-(1-(1H-インドール-5-イル)-1H-インダゾール-5-イル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物1043)

【化1079】



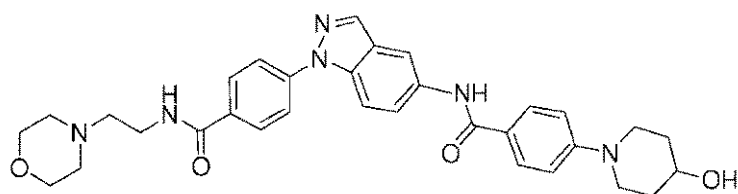
スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-(インドール-5-イル)インダゾールおよび4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1043を調製した。[M+H]⁺ C₂₇H₂₆N₅O₂についての計算値: 452.21; 実測値: 452.02。

【1243】

実施例944

4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(1-(4-((2-モルホリノエチル)カルバモイル)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物1044)

【化1080】



40

スキームIVに表される手順にしたがって、2-モルホリノエチルアミン、4-(5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1044を調製した。[M+H]⁺ C₃₂H₃₆N₆O₄についての計算値: 569.28; 実測値: 569.33。

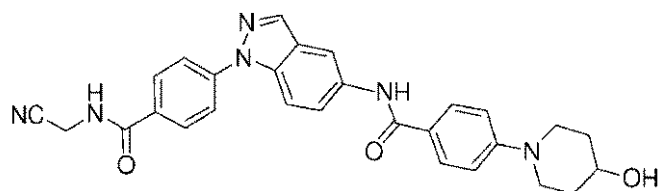
【1244】

実施例945

N-(シアノメチル)-4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)ベンズアミド (化合物1045)

50

【化 1 0 8 1】



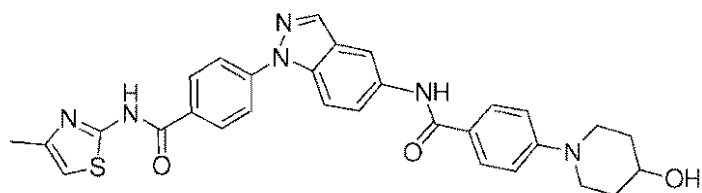
スキーム I V に表される手順にしたがって、シアノメチルアミン、4-（5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル）安息香酸、および4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物 1 0 4 5 を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₆N₆O₃ についての計算値：495.21；実測値495.01。

【1 2 4 5】

実施例 9 4 6

4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）-N-（1-（4-（4-メチルチアゾール-2-イル）カルバモイル）フェニル）-1H-インダゾール-5-イル）ベンズアミド（化合物 1 0 4 6）

【化 1 0 8 2】



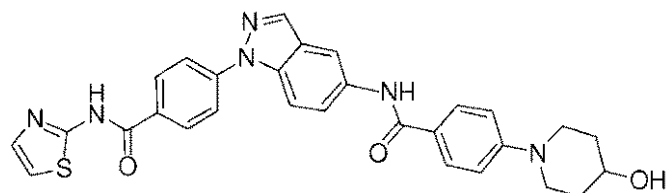
スキーム I V に表される手順にしたがって、4-メチルチアゾール-2-イルアミン、4-（5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル）安息香酸、および4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物 1 0 4 6 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₂₈N₆O₃S についての計算値：553.29；実測値553.06。

【1 2 4 6】

実施例 9 4 7

4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）-N-（1-（4-（チアゾール-2-イル）カルバモイル）フェニル）-1H-インダゾール-5-イル）ベンズアミド（化合物 1 0 4 7）

【化 1 0 8 3】



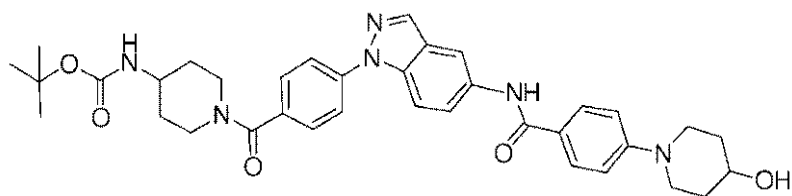
スキーム I V に表される手順にしたがって、チアゾール-2-イルアミン、4-（5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル）安息香酸、および4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物 1 0 4 7 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₆N₆O₃S についての計算値：539.18；実測値539.02。

【1 2 4 7】

実施例 9 4 8

tert-ブチル（1-（4-（5-（4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド）-1H-インダゾール-1-イル）ベンゾイル）ピペリジン-4-イル）カルバメート（化合物 1 0 4 8）

【化 1084】



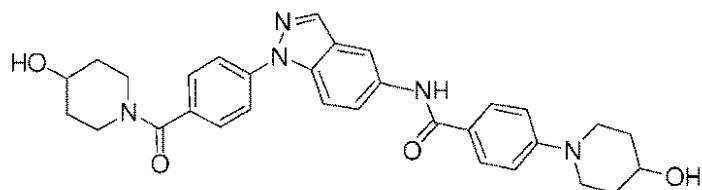
スキーム I V に表される手順にしたがって、tert-ブチルピペリジン-4-イルカルバメート、4-(5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1048を調製した。¹H NMR (500 MHz、DMSO-d₆) δ 10.07 (s, 1H)、8.39 (d, J=0.5 Hz、2H)、7.92 (d, J=9 Hz、1H)、7.87 (m, 4H)、7.80 (dd, J=2、9 Hz、1H)、7.57 (d, J=6.5 Hz、2H)、7.00 (d, J=9 Hz、2H)、6.90 (d, J=7.5 Hz、1H)、4.70 (d, J=4 Hz、1H)、4.30 (bs, 1H)、3.70 (m, 4H)、3.52 (m, 2H)、3.00 (m, 4H)、1.80 (m, 4H)、1.44 (m, 2H)、1.37 (s, 9H)。

【1248】

実施例949

4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(1-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボニル)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)ベンズアミド (化合物1049)

【化 1085】



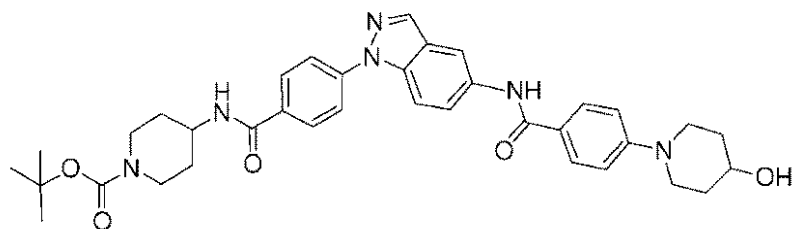
スキーム I V に表される手順にしたがって、4-ヒドロキシピペリジン、4-(5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1049を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₃₃N₅O₄ についての計算値：540.25；実測値：540.10。

【1249】

実施例950

tert-ブチル4-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)ベンズアミド)ピペリジン-1-カルボキシレート (化合物1050)

【化 1086】



スキーム I V に表される手順にしたがって、4-アミノ-1-tert-ブトキシカルボニルピペリジン、4-(5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1050を調製した

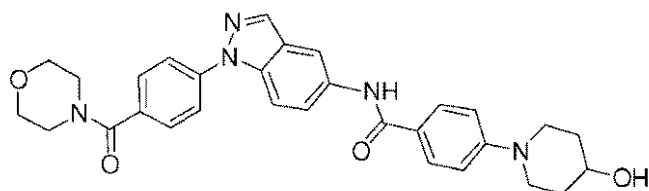
。 $[M+H]^+ \text{ C}_{36}\text{H}_{42}\text{N}_6\text{O}_5$ についての計算値：639.32；実測値583.24（-t-ブチル基）。

【1250】

実施例951

4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）-N-（1-（4-（モルホリン-4-カルボニル）フェニル）-1H-インダゾール-5-イル）ベンズアミド（化合物1051）

【化1087】



10

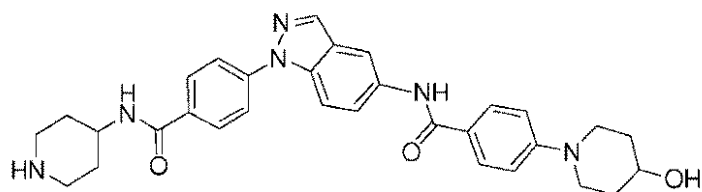
スキームIVに表される手順にしたがって、モルホリン、4-（5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル）安息香酸、および4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物1051を調製した。 $[M+H]^+ \text{ C}_{30}\text{H}_{31}\text{N}_5\text{O}_4$ についての計算値：526.24；実測値526.13。

【1251】

実施例952

4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）-N-（1-（4-（ピペリジン-4-イルカルバモイル）フェニル）-1H-インダゾール-5-イル）ベンズアミド（化合物1052）

【化1088】



30

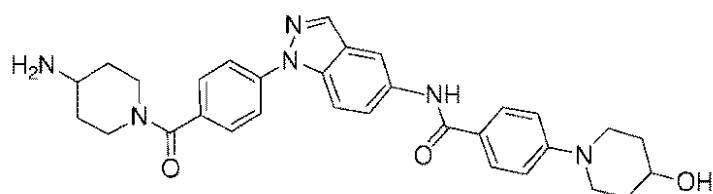
化合物1050の加水分解によって、化合物1052を調製した。 $[M+H]^+ \text{ C}_{31}\text{H}_{34}\text{N}_6\text{O}_3$ についての計算値：539.27；実測値539.16。

【1252】

実施例953

N-（1-（4-（4-アミノピペリジン-1-カルボニル）フェニル）-1H-インダゾール-5-イル）-4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド（化合物1053）

【化1089】



40

化合物1048の加水分解によって、化合物1053を調製した。 $[M+H]^+ \text{ C}_{31}\text{H}_{34}\text{N}_6\text{O}_3$ についての計算値：539.27；実測値539.16。

【1253】

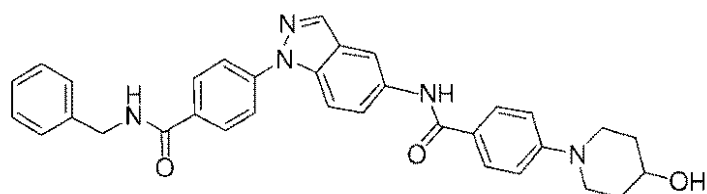
実施例954

N-ベンジル-4-（5-（4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド

50

) - 1H-インダゾール-1-イル) ベンズアミド (化合物 1054)

【化1090】



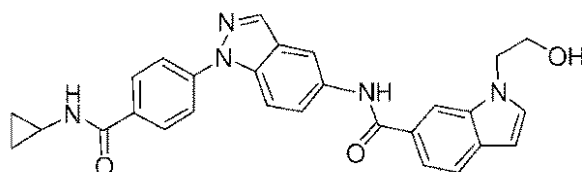
スキームIVに表される手順にしたがって、ベンジルアミン、4-(5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1054を調製した。[M+H]⁺ C₃₃H₃₁N₅O₃についての計算値: 546.24; 実測値546.11。

【1254】

実施例955

N-(1-(4-(シクロプロピルカルバモイル)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-6-カルボキサミド (化合物1055)

【化1091】



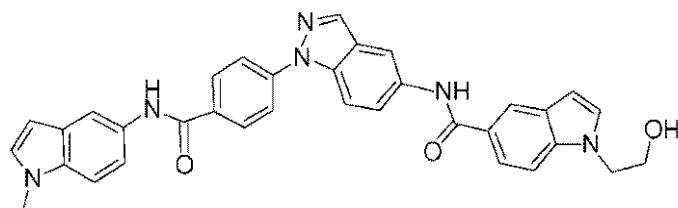
スキームIVに表される手順にしたがって、シクロプロピルアミン、4-(5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル)安息香酸、および1-(2-ヒドロキシエチル)インドール-6-カルボン酸から化合物1055を調製した。[M+H]⁺ C₂₈H₂₅N₅O₃についての計算値: 480.20; 実測値: 480.03。

【1255】

実施例956

1-(2-ヒドロキシエチル)-N-(1-(4-(1-メチル-1H-インドール-5-イル)カルバモイル)フェニル)-1H-インダゾール-5-イル)-1H-インドール-5-カルボキサミド (化合物1056)

【化1092】



スキームIVに表される手順にしたがって、5-アミノ-1-メチルインドール、4-(5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル)安息香酸、および1-(2-ヒドロキシエチル)インドール-5-カルボン酸から化合物1056を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₂₈N₆O₃についての計算値: 569.22; 実測値569.13。

【1256】

実施例957

N-シクロプロピル-4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-1-イル)ベンズアミド (化合物1057)

10

20

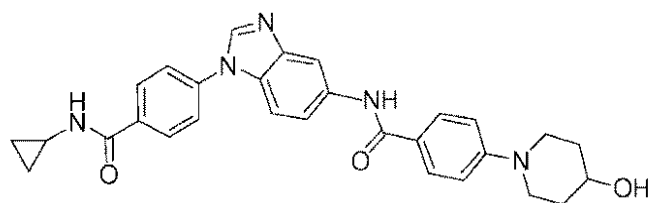
30

40

50

)

【化 1 0 9 3】



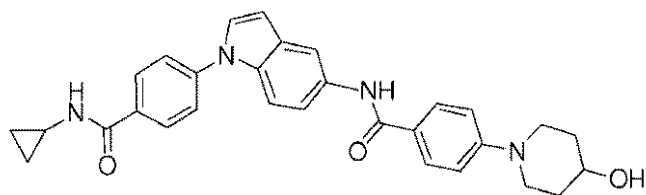
スキーム I V に表される手順にしたがって、シクロプロピルアミン、4-(5-アミノ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-1-イル)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 1 0 5 7 を調製した。[M+H]⁺ C₂₉H₂₉N₅O₃ についての計算値：496.24；実測値：496.09。

【1 2 5 7】

実施例 9 5 8

N-シクロプロピル-4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インドール-1-イル)ベンズアミド (化合物 1 0 5 8)

【化 1 0 9 4】



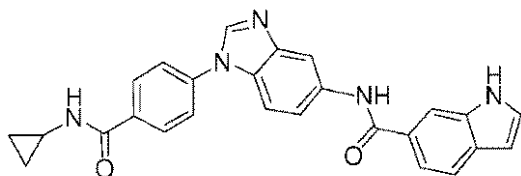
スキーム I V に表される手順にしたがって、シクロプロピルアミン、4-(5-アミノ-1H-インドール-1-イル)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 1 0 5 8 を調製した。[M+H]⁺ C₃₀H₃₀N₄O₃ についての計算値：495.23；実測値：495.14。

【1 2 5 8】

実施例 9 5 9

N-(1-(4-(シクロプロピルカルバモイル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-1H-インドール-6-カルボキサミド (化合物 1 0 5 9)

【化 1 0 9 5】



スキーム I V に表される手順にしたがって、シクロプロピルアミン、4-(5-アミノ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-1-イル)安息香酸、および6-インドールカルボン酸から化合物 1 0 5 9 を調製した。[M+H]⁺ C₂₆H₂₁N₅O₂ についての計算値：436.18；実測値：436.03。

【1 2 5 9】

実施例 9 6 0

N-(1-(4-(シクロプロピルカルバモイル)フェニル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-1H-インドール-2-カルボキサミド (化合物 1 0 6 0)

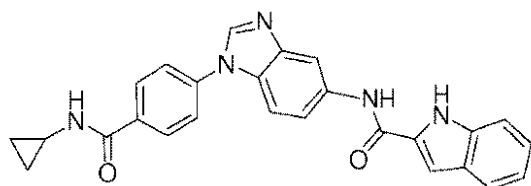
10

20

30

40

【化 1 0 9 6】



スキーム I V に表される手順にしたがって、シクロプロピルアミン、4-（5-アミノ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-1-イル）安息香酸、および2-インドールカルボン酸から化合物1060を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{26}H_{21}N_5O_2$ についての計算値：436.18；実測値：436.03。

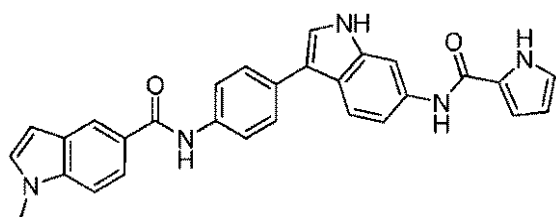
10

【1260】

実施例961

N-（3-（4-（1H-ピロール-2-カルボキサミド）フェニル）-1H-インドール-6-イル）-1-メチル-1H-インドール-5-カルボキサミド（化合物1061）

【化 1 0 9 7】



20

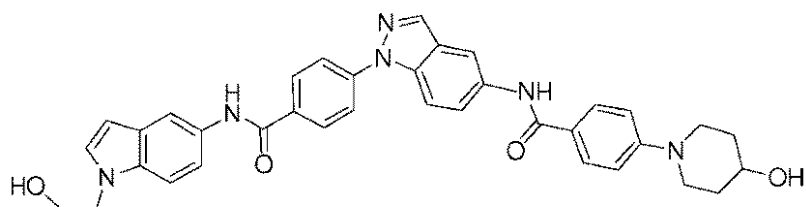
スキーム I V に表される手順にしたがって、6-アミノ-3-（4-アミノフェニル）インドール、2-ピロールカルボン酸、および1-メチルインドール-5-カルボン酸から化合物1061を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{29}H_{23}N_5O_2$ についての計算値：474.05；実測値：474.09。

【1261】

実施例962

N-（1-（2-ヒドロキシエチル）-1H-インドール-5-イル）-4-（5-（4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド）-1H-インダゾール-1-イル）ベンズアミド（化合物1062）

【化 1 0 9 8】



40

スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-（2-ヒドロキシエチル）インドール、4-（5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル）安息香酸、および4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物1062を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{36}H_{34}N_6O_4$ についての計算値：615.26；実測値615.18。

【1262】

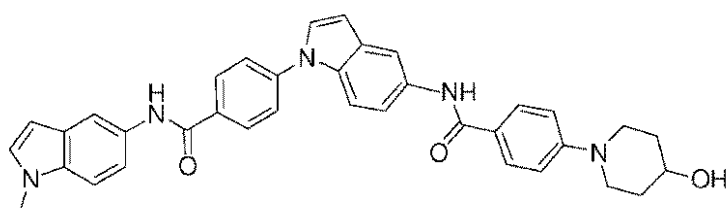
実施例963

4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）-N-（1-（4-（（1-メチル-1H-インドール-5-イル）カルバモイル）フェニル）-1H-インドール-5-イル）ベ

50

ンズアミド（化合物 1063）

【化 1099】



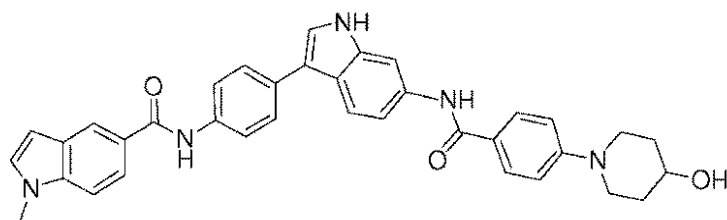
スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-メチルインドール、4-（5-アミノ-1H-インドール-1-イル）安息香酸、および4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物 1063 を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{36}H_{33}N_5O_3$ についての計算値：584.27；実測値：584.19。

【1263】

実施例 964

N-（4-（6-（4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）ベンズアミド）-1H-インドール-3-イル）フェニル）-1-メチル-1H-インドール-5-カルボキサミド（化合物 1064）

【化 1100】



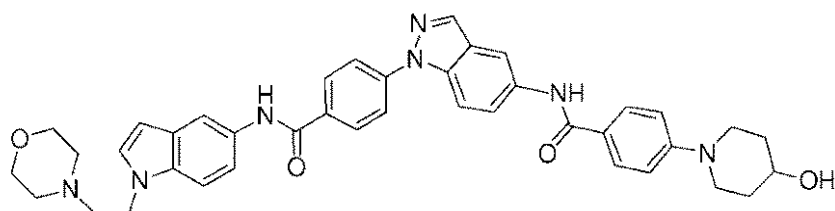
スキーム I V に表される手順にしたがって、6-アミノ-3-（4-アミノフェニル）インドール、1-メチルインドール-5-カルボン酸、および4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物 1064 を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{36}H_{33}N_5O_3$ についての計算値：584.21；実測値：584.19。

【1264】

実施例 965

4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）-N-（1-（4-（（1-（2-モルホリノエチル）-1H-インドール-5-イル）カルバモイル）フェニル）-1H-インダゾール-5-イル）ベンズアミド（化合物 1065）

【化 1101】



スキーム I V に表される手順にしたがって、5-アミノ-1-（2-モルホリノエチル）インドール、4-（5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル）安息香酸、および4-（4-ヒドロキシピペリジン-1-イル）安息香酸から化合物 1065 を調製した。 $[M+H]^+$ $C_{40}H_{41}N_7O_4$ についての計算値：684.32；実測値 684.32。

【1265】

実施例 966

10

20

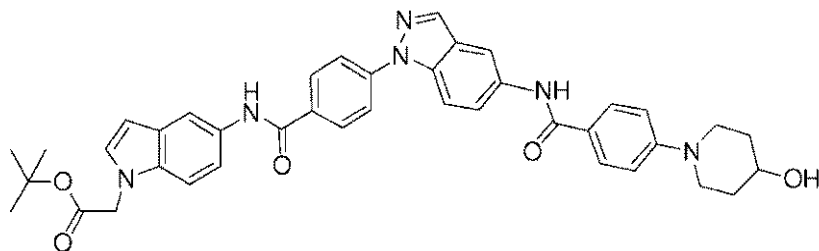
30

40

50

tert-ブチル 2-(5-(4-(5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インダゾール-1-イル)ベンズアミド)-1H-インドール-1-イル)アセテート (化合物 1066)

【化 1102】



10

スキーム IV に表される手順にしたがって、tert-ブチル 5-アミノインドール-1-イルアセテート、4-(5-アミノ-1H-インダゾール-1-イル)安息香酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 1066 を調製した。[M+H]⁺ C₄₀H₄₀N₆O₅ についての計算値：685.31；実測値 685.27。

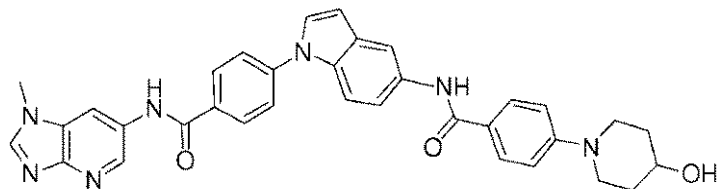
【1266】

実施例 967

4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(1-(4-((1-メチル-1H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-6-イル)カルバモイル)フェニル)-1H-インドール-5-イル)ベンズアミド (化合物 1067)

20

【化 1103】



30

スキーム IV に表される手順にしたがって、1-メチル-1H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-6-イルアミン、4-(5-アミノ-1H-インドール-1-イル)安息香酸、および 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物 1067 を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₁N₇O₃ についての計算値：586.26；実測値：586.14。

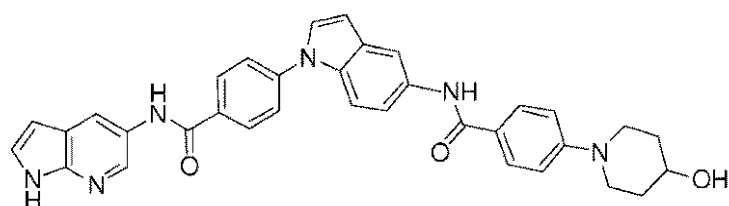
【1267】

実施例 968

N-(1-(4-((1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)カルバモイル)フェニル)-1H-インドール-5-イル)-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド (化合物 1068)

40

【化 1104】



スキーム IV に表される手順にしたがって、5-アミノ-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン、4-(5-アミノ-1H-インドール-1-イル)安息香酸、および 4-(4

50

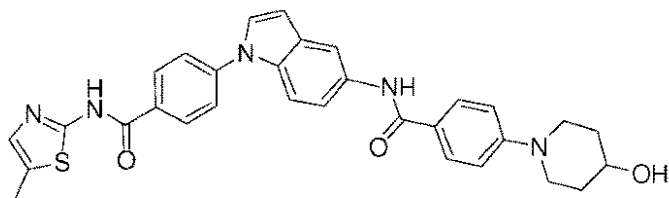
ーヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1068を調製した。[M+H]⁺ C₃₄H₃₀N₆O₃ についての計算値: 571.25; 実測値: 571.16。

【1268】

実施例969

4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)-N-(1-(4-(5-メチルチアゾール-2-イル)カルバモイル)フェニル)-1H-インドール-5-イル)ベンズアミド(化合物1069)

【化1105】



10

スキームIVに表される手順にしたがって、2-アミノ-5-メチルチアゾール、4-(5-アミノ-1H-インドール-1-イル)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1069を調製した。[M+H]⁺ C₃₁H₂₉N₅O₃ についての計算値: 552.09; 実測値: 552.12。

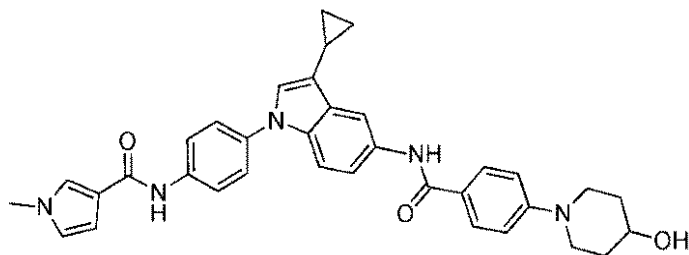
【1269】

20

実施例970

N-(4-(3-シクロプロピル-5-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンズアミド)-1H-インドール-1-イル)フェニル)-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボキサミド(化合物1070)

【化1106】



30

スキームIVに表される手順にしたがって、3-アミノ-1-メチルピロール、4-(5-アミノ-3-シクロプロピル-1H-インドール-1-イル)安息香酸、および4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)安息香酸から化合物1070を調製した。¹H

NMR(400MHz、アセトン-d₆) δ 9.13(s, 1H)、9.12(s, 1H)、8.08(d, J=1.8Hz, 1H)、8.04(d, J=8.8Hz, 2H)、7.93(d, J=9Hz, 2H)、7.45(m, 3H)、7.40(dd, J=1.8、8.8Hz, 1H)、7.02(d, J=9Hz, 1H)、7.02(d, J=9Hz, 2H)、6.75(t, J=2.6Hz, 1H)、6.68(dd, J=1.8、2.8Hz, 1H)、6.20(s, 1H)、3.84(m, 2H)、3.77(s, 3H)、3.74(m, 2H)、3.08(ddd, J=3.2、9.8、13Hz, 2H)、1.95(m, 2H)、1.75(m, 1H)、1.61(m, 2H)、0.90(m, 2H)、0.80(m, 2H)。

40

【1270】

実施例971

以下のさらなる化合物が公知であり、標準的な文献の手順にしたがって調製され、これらの化合物の構造および名称が表1にまとめられている。

【1271】

50

【表 1 5】

表 1

化合物 番号	構造	名称
1700		4-ジメチルアミノ-N-(4-(5-(4-ジメチルアミノベンズアミド)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)フェニル)ベンズアミド
1701		4-(アセトアミド)-N-(4-(5-(4-アセトアミドベンズアミド)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)フェニル)ベンズアミド
1702		4-(ベンジリデンアミノ)-N-(4-(5-(4-ベンジリデンアミノ-ベンズアミド)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)フェニル)ベンズアミド
1703		4-アミノ-N-(4-(5-(4-アミノベンズアミド)-4-クロロ-1H-ベンズイミダゾール-2-イル)-2-クロロフェニル)ベンズアミド
1704		N-(4-(6-アセトアミド-1H,1'H-2,5'-ビベンズアミダゾール (bibenzamidazol)-2-イル)フェニル)アセトアミド

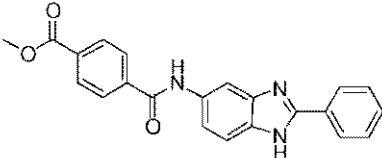
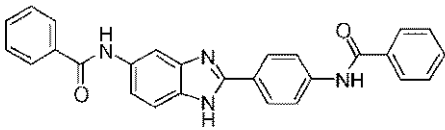
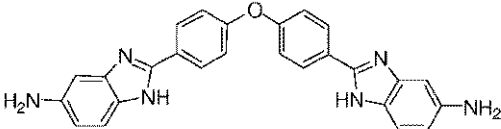
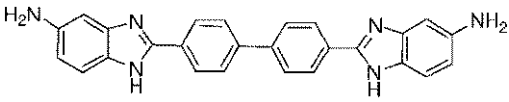
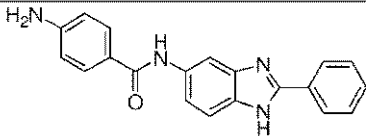
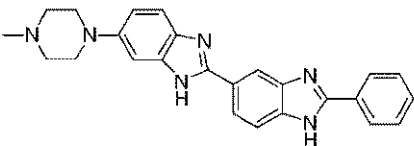
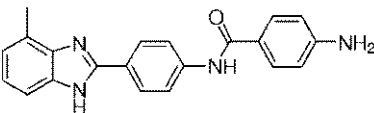
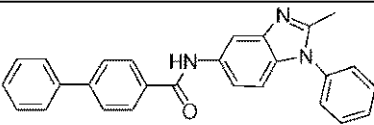
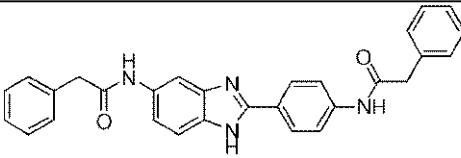
【 1 2 7 2 】

10

20

30

【表 16】

1705		メチル 4-(2-フェニル-1 <i>H</i> -ベンズ イミダゾール-5-イルカルバモイル)- ベンゾエート
1706		<i>N</i> -(4-(5-ベンズアミド-1 <i>H</i> -ベンズ イミダゾール-2-イル)フェニル) ベンズアミド
1707		2,2'-(4,4'-オキシビス(4,1- フェニレン))ビス(1 <i>H</i> -ベンズイミダ ゾール-5-アミン)
1708		2,2'-(ビフェニル-4,4'-ジイル)ビス (1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-アミン)
1709		4-アミノ- <i>N</i> -(2-フェニル-1 <i>H</i> -ベンズ イミダゾール-5-イル)ベンズアミド
1710		5-(6-(4-メチルピペラジノ)-1 <i>H</i> -ベン ズイミダゾール-2-イル)-2-フェニル- 1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール
1711		4-アミノ- <i>N</i> -(4-(4-メチル-1 <i>H</i> -ベンズ イミダゾール-2-イル)フェニル)ベン ズアミド
1712		<i>N</i> -(2-メチル-1-フェニル-1 <i>H</i> -ベンズ イミダゾール-5-イル)ビフェニル-4- カルボキサミド
1713		2-フェニル- <i>N</i> -(4-(5-(2-フェニルア セトアミド)-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール- 2-イル)フェニル)アセトアミド

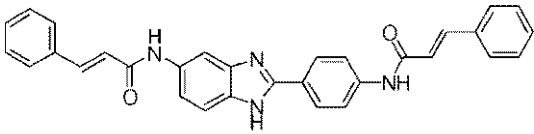
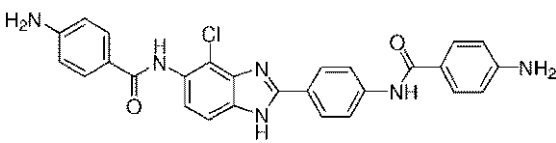
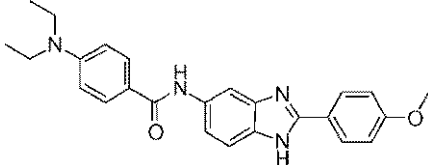
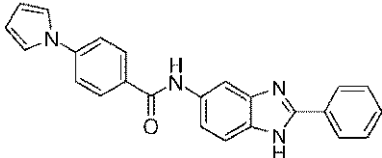
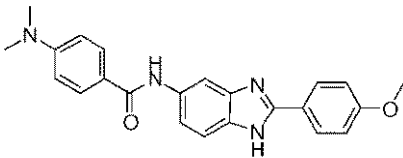
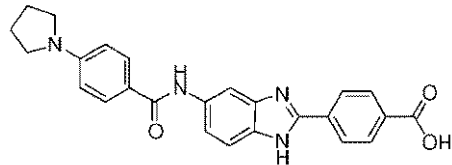
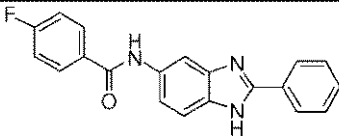
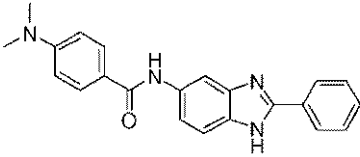
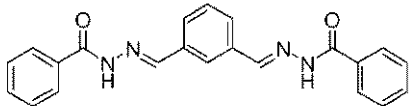
10

20

30

【 1 2 7 3 】

【表 17】

1714		<i>N</i> -(2-(4-(3(<i>E</i>)-フェニルアクリルアミド)フェニル)-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イル)-3(<i>E</i>)-フェニルアクリルアミド
1715		4-アミノ- <i>N</i> -(4-(5-(4-アミノベンズアミド)-4-クロロ-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-2-イル)フェニル)ベンズアミド
1716		4-ジエチルアミノ- <i>N</i> -(2-(4-メトキシフェニル)-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イル)ベンズアミド
1717		<i>N</i> -(2-フェニル-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イル)-4-ピロリルベンズアミド
1718		4-ジメチルアミノ- <i>N</i> -(2-(4-メトキシフェニル)-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イル)ベンズアミド
1719		(4-(5-(4-ピロリジノベンズアミド)-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-2-イル)安息香酸
1720		4-フルオロ- <i>N</i> -(2-フェニル-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イル)ベンズアミド
1721		4-ジメチルアミノ- <i>N</i> -(2-フェニル-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イル)ベンズアミド
1722		2,2'-(1,3-フェニレンビス(メチリデン)ジベンゾヒドラジド

【1274】

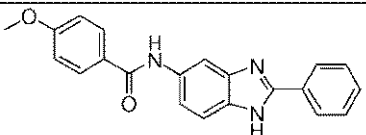
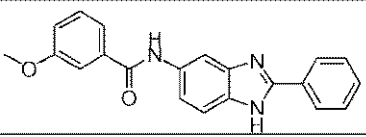
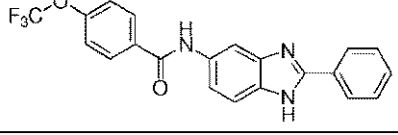
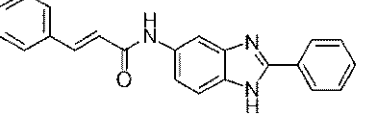
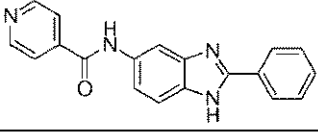
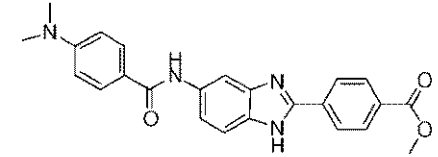
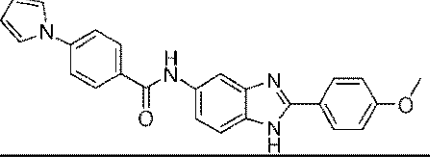
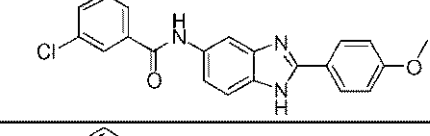
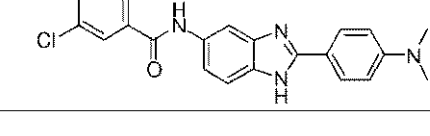
10

20

30

40

【表 18】

1723		4-メトキシ-N-(2-フェニル-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イル)ベンズアミド
1724		3-メトキシ-N-(2-フェニル-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イル)ベンズアミド
1725		4-トリフルオロメトキシ-N-(2-フェニル-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イル)ベンズアミド
1726		<i>N</i> -(2-フェニル-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イル)-3(<i>E</i>)-フェニルアクリルアミド
1727		<i>N</i> -(2-フェニル-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イル)イソニコチンアミド
1728		メチル(4-(5-(4-ジメチルアミノベンズアミド)-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-2-イル)ベンゾエート
1729		<i>N</i> -(2-(4-メトキシフェニル)-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イル)-4-ピロリルベンズアミド
1730		<i>N</i> -(2-(4-メトキシフェニル)-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イル)-3-クロロベンズアミド
1731		<i>N</i> -(2-(4-ジメチルアミノフェニル)-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イル)-3-クロロベンズアミド

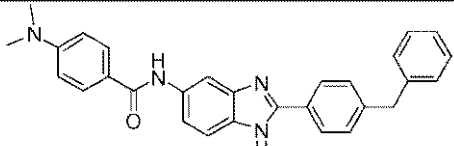
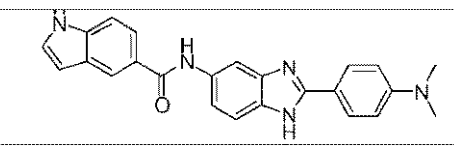
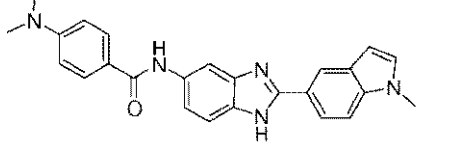
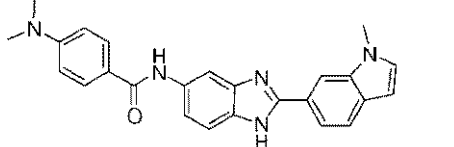
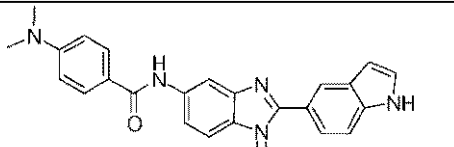
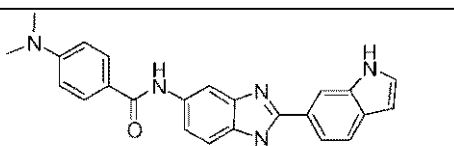
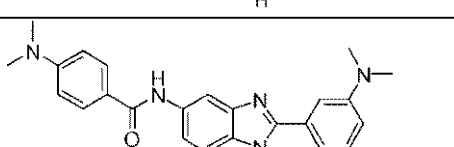
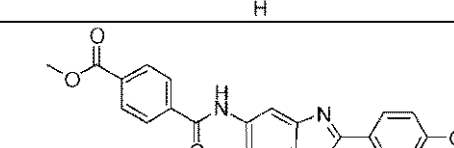
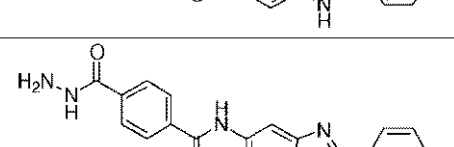
10

20

30

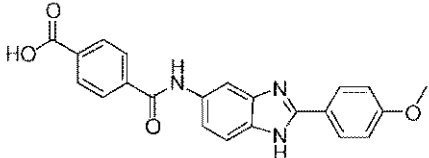
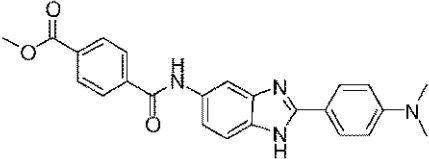
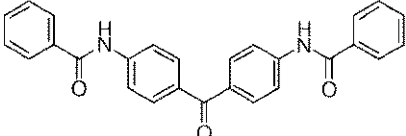
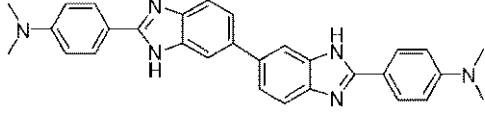
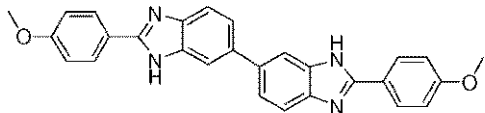
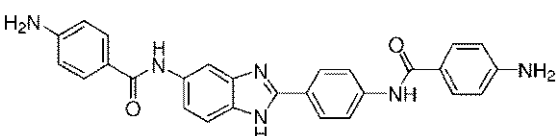
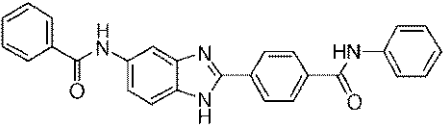
【1275】

【表 19】

1732		<i>N</i> -(2-(4-ベンジルフェニル)-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イル)-4-ジメチルアミノベンズアミド
1733		<i>N</i> -(2-(4-ジメチルアミノフェニル)-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イル)-1 <i>H</i> -インドール-5-カルボキサミド
1734		<i>N</i> -(2-(1-メチル-1 <i>H</i> -インドール-5-イル)ベンズイミダゾール-5-イル)-4-ジメチルアミノベンズアミド
1735		<i>N</i> -(2-(1-メチル-1 <i>H</i> -インドール-6-イル)ベンズイミダゾール-5-イル)-4-ジメチルアミノベンズアミド
1736		<i>N</i> -(2-(1 <i>H</i> -インドール-5-イル)ベンズイミダゾール-5-イル)-4-ジメチルアミノベンズアミド
1737		<i>N</i> -(2-(1 <i>H</i> -インドール-6-イル)ベンズイミダゾール-5-イル)-4-ジメチルアミノベンズアミド
1738		4-ジメチルアミノ- <i>N</i> -(2-(3-ジメチルアミノフェニル)-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イル)ベンズアミド
1739		メチル 4-(2-(4-メトキシフェニル)-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イルカルバモイル)-ベンゾエート
1740		4-(2-(4-メトキシフェニル)-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イルカルバモイル)-ベンゾヒドラジド

【 1 2 7 6 】

【表 20】

1741		4-(2-(4-メトキシフェニル)-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イルカルバモイル)-安息香酸
1742		メチル 4-(2-(4-ジメチルアミノフェニル)-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-5-イルカルバモイル)-ベンゾエート
1743		<i>N,N'</i> -(4,4'-カルボニルビス(4,1-フェニレン))ジベンズアミド
1744		4,4'-(5,5'-ビベンズイミダゾール-2,2'-ジイル)ビス(<i>N,N</i> -ジメチルアニリン)
1745		4,4'-(5,5'-ビベンズイミダゾール-2,2'-ジイル)ビス(アニソール)
1746		4-アミノ- <i>N</i> -(4-(5-(4-アミノベンズアミド)-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-2-イル)フェニル)ベンズアミド
1747		<i>N</i> -フェニル-4-(5-ベンズアミド-1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-2-イル)ベンズアミド

【1277】

実施例 972

細胞増殖アッセイ

例示される化合物の主な試験を、UT7/EPO細胞株で行った。UT7/EPOは、小松則夫博士(Dr. Norio Komatsu)(Blood, Vol 82(2)、pp 456-464、1993)から入手されるヒト白血病細胞株である。これらの細胞は、内因性EPO受容体を発現し、成長および増殖をEPOに依存している。簡潔に言えば、細胞を一晩EPO欠乏状態にし、96または384ウェルプレートに播種した。化合物を10μMの濃度で細胞に添加した。次に、プレートを37℃で72時間培養した。化合物の増殖促進効果をLonza(ViaLight Plus)から市販されているキットによって測定した。選択された化合物の活性を以下の表に列挙する。

【1278】

10

20

30

40

【表 2 1】

表 2

化合物	活性 (%)	化合物	活性 (%)	化合物	活性 (%)
103	16	106	14	107	17
113	17	115	22	125	15
128	20	135	16	141	19
146	19	149	22	151	20
156	21	160	22	165	19
172	12	177	15	181	20
186	15	191	18	197	20
202	17	206	18	210	17
215	16	220	19	225	20
230	21	235	15	240	15
246	21	251	14	256	12
262	20	268	15	273	16
278	23	283	19	288	17
294	11	299	15	305	18
310	22	315	16	322	20
327	17	332	18	338	19
345	19	349	11	354	20
359	19	364	16	370	18
375	11	381	15	384	11
392	16	404	14	408	13
413	19	418	11	423	15
427	15	434	15	439	18
444	19	449	16	454	16
458	10	465	18	473	11

【1 2 7 9】

【表 2 2】

479	15	484	16	490	15
500	19	510	17	520	13
530	11	540	17	550	9
560	14	570	11	580	16
590	12	600	11	610	14
620	18	639	15	650	13
660	14	670	8	680	10
690	16	700	14	720	16
730	18	745	17	760	21
775	22	790	18	800	23
815	17	830	15	845	18
860	17	885	21	900	24
915	17	930	12	945	10
960	17	975	17	990	10
1005	13	1030	10	1045	15
1060	18	1070	15	1700	17
1705	12	1710	11	1715	10
1719	17	1724	13	1729	14
1734	20	1739	19	1744	11
1747	19				

10

20

フロントページの続き

(51)Int.Cl.

F I

C 0 7 D 409/12	(2006.01)	C 0 7 D 409/12	
C 0 7 D 401/12	(2006.01)	C 0 7 D 401/12	
C 0 7 D 307/68	(2006.01)	C 0 7 D 307/68	
C 0 7 D 213/81	(2006.01)	C 0 7 D 213/81	
C 0 7 D 213/82	(2006.01)	C 0 7 D 213/82	
C 0 7 D 261/18	(2006.01)	C 0 7 D 261/18	
C 0 7 D 249/10	(2006.01)	C 0 7 D 249/10	
C 0 7 D 237/24	(2006.01)	C 0 7 D 237/24	
C 0 7 D 285/06	(2006.01)	C 0 7 D 285/06	
C 0 7 D 277/56	(2006.01)	C 0 7 D 277/56	
C 0 7 D 233/90	(2006.01)	C 0 7 D 233/90	A
C 0 7 D 263/34	(2006.01)	C 0 7 D 263/34	
C 0 7 D 249/04	(2006.01)	C 0 7 D 249/04	5 0 6
C 0 7 D 241/24	(2006.01)	C 0 7 D 241/24	
C 0 7 D 413/12	(2006.01)	C 0 7 D 413/12	
A 6 1 K 31/5377	(2006.01)	A 6 1 K 31/5377	
A 6 1 K 31/381	(2006.01)	A 6 1 K 31/381	
A 6 1 K 31/496	(2006.01)	A 6 1 K 31/496	
A 6 1 K 31/4535	(2006.01)	A 6 1 K 31/4535	
A 6 1 K 31/4545	(2006.01)	A 6 1 K 31/4545	
A 6 1 K 31/454	(2006.01)	A 6 1 K 31/454	
A 6 1 K 31/4025	(2006.01)	A 6 1 K 31/4025	
A 6 1 P 43/00	(2006.01)	A 6 1 P 43/00	1 1 1
A 6 1 P 7/06	(2006.01)	A 6 1 P 7/06	
A 6 1 P 9/00	(2006.01)	A 6 1 P 9/00	
A 6 1 P 37/02	(2006.01)	A 6 1 P 37/02	
A 6 1 P 25/00	(2006.01)	A 6 1 P 25/00	

(72)発明者 リン・ジ

アメリカ合衆国 9 2 1 3 0 カリフォルニア州サンディエゴ、ピア・カンブレホ 3 9 8 8 番

(72)発明者 アンドリュウ・アール・ハドソン

アメリカ合衆国 9 2 1 0 4 カリフォルニア州サンディエゴ、ローレル・ストリート 3 1 1 0 番

(72)発明者 コルネリス・アー・ファン・ウーフェレン

アメリカ合衆国 9 2 1 2 2 カリフォルニア州サンディエゴ、エドモントン・アベニュー 6 5 9 0 番

(72)発明者 スティーブン・エル・ローチ

アメリカ合衆国 9 2 1 2 2 カリフォルニア州サンディエゴ、フィオーレ・テラス 5 2 1 0 番、ナンバー・エル 4 0 5

(72)発明者 ビジャン・ペドラム

アメリカ合衆国 9 2 1 3 0 カリフォルニア州サンディエゴ、シルバークッシュ・クリーク・ストリート 6 2 0 3 番

(72)発明者 シェン・イシン

アメリカ合衆国 9 2 0 2 4 カリフォルニア州エンシニタス、シャドー・マウンテン・ドライブ 1 7 9 0 番

(72)発明者 リノ・ファン・ヴァルデス

アメリカ合衆国 9 2 1 1 7 カリフォルニア州サンディエゴ、マックロー・ストリート 3 3 5 0 番

(72)発明者 ジュリアン・ベインシガー

アメリカ合衆国 9 2 1 1 0 カリフォルニア州サンディエゴ、アッシャー・ストリート 4 2 3 5 番、

ユニット43

- (72)発明者 バージニア・ヘザー・シャロン・グラント
アメリカ合衆国92122カリフォルニア州サンディエゴ、マハイラ・アベニュー3950番、ナンバー・イー23
- (72)発明者 ジェイソン・シー・ピッケンズ
アメリカ合衆国91913カリフォルニア州チュラ・ビスタ、サンタ・オリビア・ロード1203番

審査官 福山 則明

- (56)参考文献 特開平04-297446 (JP, A)
国際公開第01/092211 (WO, A1)
国際公開第2009/155362 (WO, A1)
中国特許出願公開第101215379 (CN, A)
特表2002-527438 (JP, A)
米国特許第03245995 (US, A)
英国特許出願公開第01236282 (GB, A)
国際公開第98/016498 (WO, A1)
米国特許第02777855 (US, A)
特開昭49-042799 (JP, A)
特表2000-500464 (JP, A)
特表2008-539180 (JP, A)
米国特許出願公開第2009/0239876 (US, A1)
Barashkov, N. N., Vysokomolekulyarnye Soedineniya, Seriya B: Kratkie Soobshcheniya, 1984年, 26(5), 356-361
Sek, D. et al., New semiladder polymers. Part II: synthesis and properties of new poly(amideimidazopyrrolones), Polymer, 1999年, 40(9), 2419-2428
Eur. J. Org. Chem., 2006年, 3395-3404
Trostyanskaya, E. B., Plasticheskie Massy, 1968年, 9, 20-23

- (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
IPC C07C、C07D、A61K、A61P
DB名 CAPLUS/REGISTRY (STN)